

(12) 特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局

(43) 国際公開日
2025年5月30日(30.05.2025)



(10) 国際公開番号

WO 2025/110227 A1

(51) 国際特許分類:

C07D 231/18 (2006.01) A61K 31/4245 (2006.01)
A01N 43/56 (2006.01) A61K 31/427 (2006.01)
A01N 43/78 (2006.01) A61K 31/428 (2006.01)
A01N 43/80 (2006.01) A61K 31/433 (2006.01)
A01N 43/824 (2006.01) A61K 31/4439 (2006.01)
A01N 43/836 (2006.01) A61P 31/10 (2006.01)
A01N 43/84 (2006.01) A61P 33/00 (2006.01)
A01P 3/00 (2006.01) C07D 403/12 (2006.01)
A61K 31/415 (2006.01) C07D 413/12 (2006.01)
A61K 31/4192 (2006.01) C07D 413/14 (2006.01)
A61K 31/4196 (2006.01) C07D 417/12 (2006.01)
A61K 31/422 (2006.01)

(26) 国際公開の言語:

日本語

(30) 優先権データ:

特願 2023-198478 2023年11月22日(22.11.2023) JP
特願 2024-020652 2024年2月14日(14.02.2024) JP
特願 2024-135713 2024年8月15日(15.08.2024) JP

(71) 出願人: 日産化学株式会社(NISSAN CHEMICAL CORPORATION) [JP/JP]; 〒1036119 東京都中央区日本橋二丁目5番1号 (JP).

(72) 発明者: 中村 有優 (NAKAMURA, Ayu); 〒2748507 千葉県船橋市坪井西2丁目10番1号 日産化学株式会社 物質科学研究所内 (JP). 鈴木大貴(SUZUKI, Daiki); 〒2748507 千葉県船橋市坪井西2丁目10番1号 日産化学株式会社 物質科学研究所内 (JP). 河合賢太郎(KAWAI, Kentaro); 〒2748507 千葉県船橋市坪井西2丁目10番1号 日産化学株式会社 物質科学研究所内 (JP).

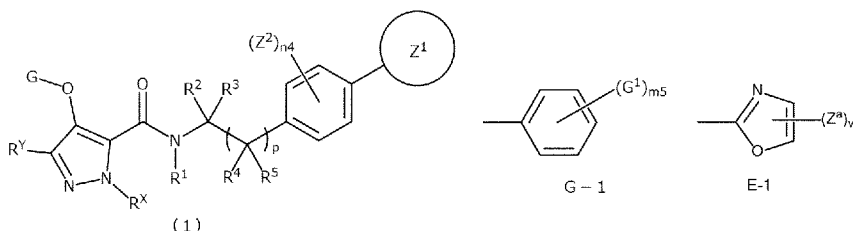
(21) 国際出願番号: PCT/JP2024/041387

(22) 国際出願日: 2024年11月22日(22.11.2024)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(54) Title: PYRAZOLE COMPOUND AND HARMFUL ORGANISM CONTROL AGENT

(54) 発明の名称: ピラゾール化合物及び有害生物防除剤



(57) Abstract: The present invention provides a pyrazole compound represented by formula (1) or a salt thereof, and a novel bactericide, particularly, a bactericide for agricultural and horticultural use, containing the compound as an active ingredient. The formula describes a structure in which: G represents G-1; G¹ represents C₁-C₆ alkyl or the like; R^X represents C₁-C₆ alkyl or the like; R^Y represents a hydrogen atom or the like; R¹ represents a hydrogen atom or the like; R² represents a hydrogen atom or the like; R³ represents a hydrogen atom or the like; R⁴ represents a hydrogen atom or the like; R⁵ represents a hydrogen atom or the like; Z¹ represents E-1 or the like; Z^a represents C₁-C₆ alkyl or the like; Z² represents C₁-C₆ alkyl or the like; m5 represents an integer of 0, 1, 2, 3, 4 or 5; n4 represents an integer of 0, 1, 2, 3 or 4; p represents an integer of 0 or 1; and v2 represents an integer of 0, 1 or 2.

(57) 要約: 本発明は式(1)で表されるピラゾール化合物又はその塩およびそれを有効成分として含有する新規な殺菌剤、特に農園芸用殺菌剤を提供する。式中、GはG-1を表し、G¹はC₁~C₆アルキル等を表し、R^XはC₁~C₆アルキル等を表し、R^Yは水素原子等を表し、R¹は水素原子等を表し、R²は水素原子等を表し、R³は水素原子等を表し、R⁴は水素原子等を表し、R⁵は水素原子等を表し、Z¹はE-1等を表し、Z^aはC₁~C₆アルキル等を表し、Z²はC₁~C₆アルキル等を表し、m5は、0、1、2、3、4又は5の整数を表し、n4は0、1、2、3又は4の整数を表し、pは0又は1の整数を表し、v2は0、1又は2の整数で表される構造を表す。

WO 2025/110227 A1



所内 (JP). 佐藤 悠樹(SATO, Yuki); 〒2748507 千葉県船橋市坪井西2丁目10番1号 日産化学株式会社 物質科学研究所内 (JP). 岡田 拓也(OKADA, Takuya); 〒2748507 千葉県船橋市坪井西2丁目10番1号 日産化学株式会社 物質科学研究所内 (JP). 梶 基浩(KAJI, Motohiro); 〒2748507 千葉県船橋市坪井西2丁目10番1号 日産化学株式会社 物質科学研究所内 (JP). 西村 隆史(NISHIMURA, Takafumi); 〒3490294 埼玉県白岡市白岡1470 日産化学株式会社 生物科学研究所内 (JP). 大谷 征史(OTANI, Masato); 〒3490294 埼玉県白岡市白岡1470 日産化学株式会社 生物科学研究所内 (JP).

(74) 代理人: 弁理士法人 H A R A K E N Z O W O R L D P A T E N T & T R A D E M A R K(HARAKENZO WORLD PATENT & TRADEMARK); 〒5300041 大阪府大阪市北区天神橋2丁目北2番6号 大和南森町ビル (JP).

(81) 指定国(表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BN, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CV, CZ, DE, DJ, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IQ, IR, IS, IT, JM, JO, JP, KE, KG, KH, KN, KP, KR, KW, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LU, LY, MA, MD, MG, MK, MN, MU, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PA, PE, PG, PH, PL, PT, QA, RO, RS, RU, RW, SA, SC, SD, SE, SG, SK, SL, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, WS, ZA, ZM, ZW.

(84) 指定国(表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, CV, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SC, SD, SL, ST, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, ME, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, RS, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, KM, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:

一 国際調査報告 (条約第21条(3))

明 細 書

発明の名称：ピラゾール化合物及び有害生物防除剤

技術分野

[0001] 本発明は新規なピラゾール化合物及びそれらの塩、並びに該化合物及びその塩を有効成分として含有する有害生物防除剤に関する。

背景技術

[0002] 特許文献1及び2には、ある種のピラゾール化合物が開示されているが、本発明に係るピラゾール化合物に関しては何ら開示されていない。

[0003] また、特許文献3及び4には、ある種のピラゾール化合物が殺菌剤として有用であることが開示されているが、本発明に係るピラゾール化合物については何ら開示されていない。

[0004] また、特許文献5～8には、ある種の複素環化合物が殺菌剤として有用であることが開示されているが、本発明に係るピラゾール化合物については何ら開示されていない。

先行技術文献

特許文献

[0005] 特許文献1：国際公開第2002/085860号
特許文献2：国際公開第2006/132197号
特許文献3：国際公開第2009/028280号
特許文献4：国際公開第1996/038419号
特許文献5：国際公開第2020/109391号
特許文献6：国際公開第2021/224220号
特許文献7：国際公開第2021/228734号
特許文献8：国際公開第2021/233861号

発明の概要

発明が解決しようとする課題

[0006] しかしながら、薬剤の長年にわたる使用は、病原菌における薬剤抵抗性獲

得を引き起こし得る。そのため、優れた防除効果を有する新規な薬剤の開発が常に期待されている。

課題を解決するための手段

[0007] 本発明者らは、上記の課題解決を目標に鋭意研究を重ねた結果、本発明に係る下記式（１）で表される新規なピラゾール化合物が、殺菌剤、特に農園芸用殺菌剤として優れた防除活性を示すことを見出し、本発明を完成した。

。

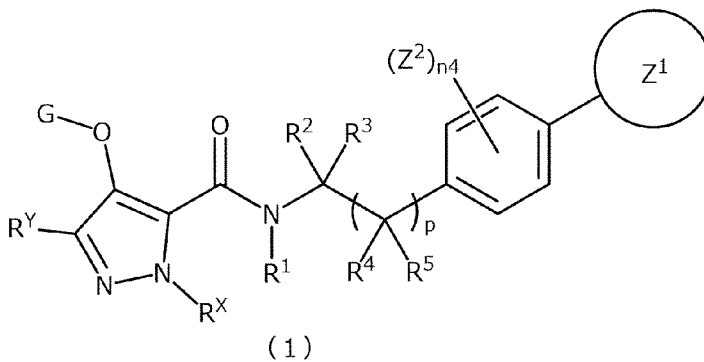
[0008] 本発明に係るピラゾール化合物に関しては何れの文献にも開示されておらず、また、それらの有害生物防除剤としての有用性は知られていない。

[0009] すなわち、本発明は下記〔１〕に関する。

[0010] 〔１〕

式（１）：

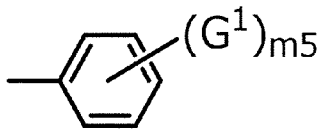
[0011] [化1]



[式中、Gは、G-1を表し、

G-1は、下記の構造式で表される構造を表し、

[0012] [化2]



G-1

G¹は、ヒドロキシ、ニトロ、シアノ、ハロゲン原子、C₁～C₆アルキル、C₃～C₁₀シクロアルキル、C₁～C₆ハロアルキル、C₁～C₆アルコキシ、

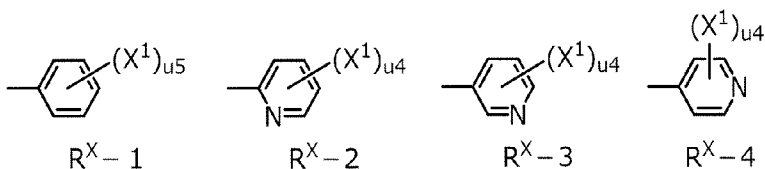
C₁~C₆ハロアルコキシ、C₁~C₆アルキルチオ、C₁~C₆アルキルスルフィニル、C₁~C₆アルキルスルホニル、ジ(C₁~C₆アルキル)アミノ、C₁~C₆アルキルカルボニル、C₁~C₆アルコキシカルボニル、C₁~C₆アルキルアミノカルボニル、C₃~C₁₀シクロアルキルアミノカルボニル又はジ(C₁~C₆アルキル)アミノカルボニルを表し、

G¹との関係において、m₅が2、3、4又は5の整数を示す場合には、各々のG¹は互いに同一であっても、又は互いに相異なってもよく、

R^xは、C₁~C₆アルキル、C₃~C₁₀シクロアルキル、C₁~C₆ハロアルキル、ベンジル、R^{x-1}、R^{x-2}、R^{x-3}又はR^{x-4}を表し、

R^{x-1}~R^{x-4}は、それぞれ下記の構造式で表される構造を表し、

[0013] [化3]



X¹は、ハロゲン原子、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆ハロアルキル又はC₁~C₆アルコキシを表し、

X¹との関係において、u₅が2、3、4又は5の整数を示す場合には、各々のX¹は互いに同一であっても、又は互いに相異なってもよく、

X¹との関係において、u₄が2、3又は4の整数を示す場合には、各々のX¹は互いに同一であっても、又は互いに相異なってもよく、

R^yは、水素原子、ハロゲン原子又はC₁~C₆アルキルを表し、

R¹は、水素原子又はC₁~C₆アルキルを表し、

R²は、水素原子又はC₁~C₆アルキルを表し、

R³は、水素原子又はC₁~C₆アルキルを表し、

R⁴は、水素原子、ハロゲン原子、C₁~C₆アルキル又はC₁~C₆アルコキシを表し、

R⁵は、水素原子、ハロゲン原子又はC₁~C₆アルキルを表し、

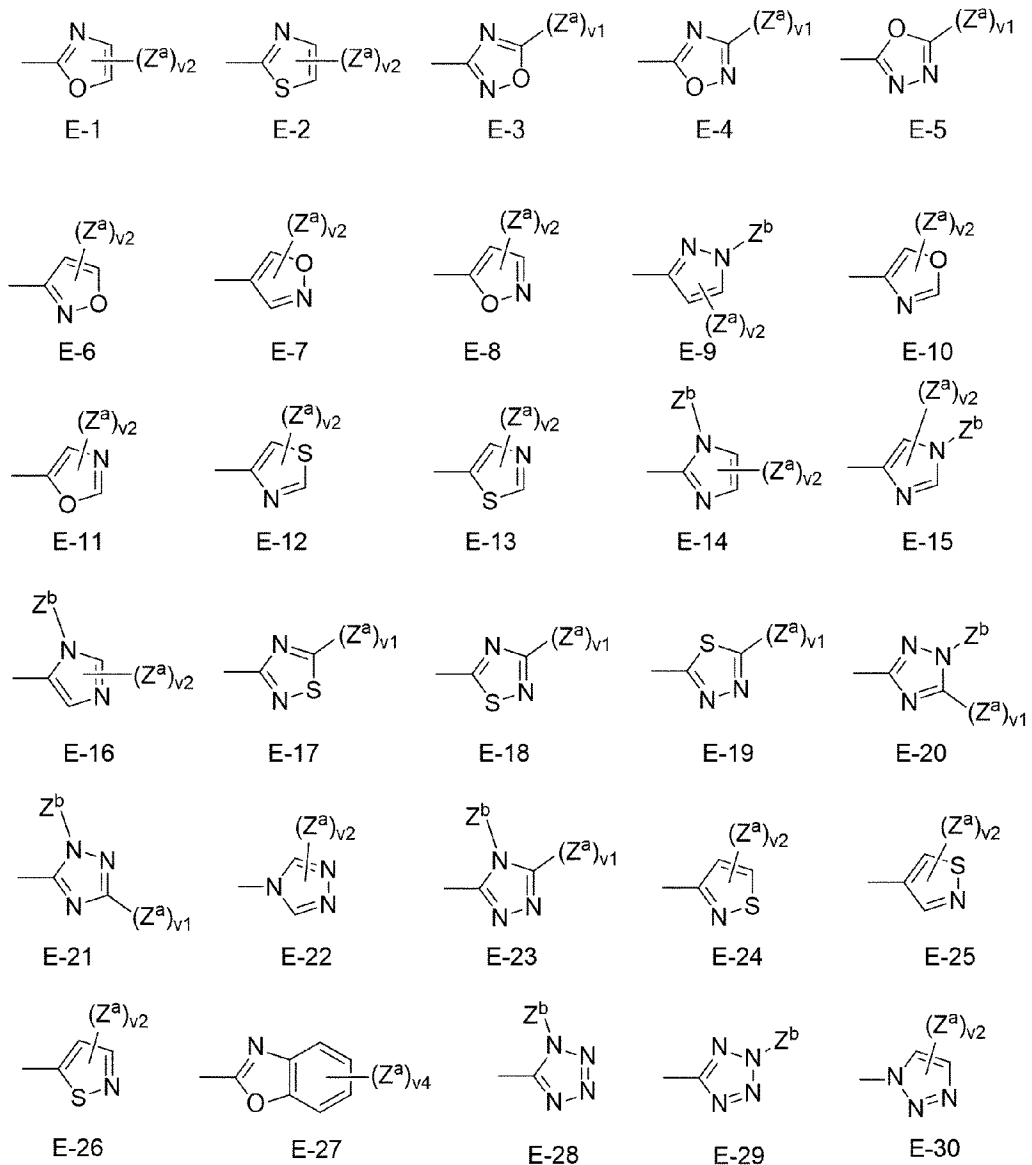
Z¹は、E-1~E-29、又はE-30を表し、

Z²は、ヒドロキシ、カルボキシ、アミノ、ニトロ、シアノ、ハロゲン原子、C₁~C₆アルキル、C₃~C₁₀シクロアルキル、C₁~C₆ハロアルキル、C₃~C₁₀ハロシクロアルキル、C₂~C₆アルケニル、C₂~C₆アルキニル、C₁~C₆アルコキシ、C₁~C₆アルキルチオ、C₁~C₆アルキルスルフィニル又はC₁~C₆アルキルスルホニルを表し、

Z²との関係において、n₄が2、3又は4の整数を示す場合には、各々のZ¹は互いに同一であっても、又は互いに相異なってもよく、

E-1~E-30は、それぞれ下記の構造式で表される構造を表し、

[0014] [化4]



Z^aは、ヒドロキシ、チオール、ハロゲン原子、シアノ、C₁~C₆アルキル、R^aで置換されたC₁~C₆アルキル、C₃~C₁₀シクロアルキル、C₁~C₆ハロアルキル、C₁~C₆アルコキシ、C₁~C₆ハロアルコキシ、C₁~C₆アルキルチオ、C₁~C₆ハロアルキルチオ、C₁~C₆アルキルカルボニル、C₁~C₆アルコキシカルボニル、-C(=NOR^b)R^c、-C(O)R^d、-NR^eR^f、フェニル、ピロリジン-1-イル、モルホリン-1-イル又はピペリジン-1-イルを表し、

Z^aとの関係において、v₂が2の整数を示す場合には、各々のZ^aは互いに同一であっても、又は互いに相異なってもよく、

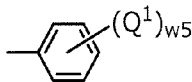
Z^aとの関係において、v₄が2、3又は4の整数を示す場合には、各々のZ^aは互いに同一であっても、又は互いに相異なってもよく、

Z^bは、C₁~C₆アルキルを表し、

R^aは、ヒドロキシ、シアノ、C₁~C₆アルコキシ、C₁~C₆アルキルチオ、C₁~C₆アルキルスルフィニル、C₁~C₆アルキルスルホニル、C₁~C₆アルキルカルボニルオキシ、C₁~C₆アルキルカルボニルアミノ、フェニルカルボニルアミノ、-OR^g、-C(O)R^g、-NR^hSO₂Rⁱ又はQ-1を表し、

Q-1は、下記の構造式で表される構造を表し、

[0015] [化5]



Q-1

Q¹は、ハロゲン原子、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆ハロアルキル又はC₁~C₆アルコキシを表し、

Q¹との関係において、w₅が2、3、4又は5の整数を示す場合には、各々のQ¹は互いに同一であっても、又は互いに相異なってもよく、

R^bは、水素原子又はC₁~C₆アルキルを表し、

R^cは、水素原子又はC₁~C₆アルキルを表し、

R^dは、アミノ、ヒドロキシアミノ、C₁~C₆アルキルアミノ、C₃~C₁₀シクロアルキルアミノ、ジ(C₁~C₆アルキル)アミノ、ピロリジン-1-イル、モルホリン-1-イル又はピペリジン-1-イルを表し、

R^eは、水素原子、C₁~C₆アルキル、C₃~C₁₀シクロアルキル、C₂~C₆アルケニル、C₂~C₆アルキニル又はC₁~C₆アルコキシを表し、

R^fは、水素原子、ヒドロキシ、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆アルキルカルボニル、C₁~C₆アルコキシカルボニル、C₁~C₆アルキルアミノカルボニル、ジ(C₁~C₆アルキル)アミノカルボニル、C₁~C₆アルキルスルホニル又はC₁~C₆ハロアルキルスルホニルを表し、

R^gは、Q-1を表し、

R^hは、水素原子又はC₁~C₆アルキルを表し、

Rⁱは、C₁~C₆アルキルを表し、

m₅は、0、1、2、3、4又は5の整数を表し、

n₄は、0、1、2、3又は4の整数を表し、

u₅は、0、1、2、3、4又は5の整数を表し、

u₄は、0、1、2、3又は4の整数を表し、

pは、0又は1の整数を表し、

v₄は、0、1、2、3又は4の整数を表し、

v₂は、0、1又は2の整数を表し、

v₁は、0又は1の整数を表し、

w₅は、0、1、2、3、4又は5の整数を表す。]

で表されるピラゾール化合物又はその塩。

発明の効果

[0016] 式(1)で表される本発明の化合物は多くの病原菌に対して優れた防除活性を発揮する。

[0017] 従って、本発明は有用な殺菌剤、特に農園芸用殺菌剤を提供することができる。

発明を実施するための形態

- [0018] 以下、本発明について詳細に説明する。
- [0019] 本発明の化合物には、置換基の種類によってはE-体及びZ-体の幾何異性体が存在する場合があるが、本発明の化合物はこれらE-体、Z-体又はE-体及びZ-体を任意の割合で含む混合物を包含する。
- [0020] また、本発明の化合物には、1個又は2個以上の不斉炭素原子又は不斉硫黄原子の存在に起因する光学活性体が存在する場合があるが、本発明の化合物は全ての光学活性体又はラセミ体を包含する。
- [0021] また、本発明の化合物には、置換基の種類によって互変異性体が存在する場合があるが、本発明の化合物は全ての互変異性体又は任意の割合で含む互変異性体の混合物を包含する。
- [0022] また、本発明の化合物は、置換基同士の立体障害を原因とする制限された結合回転により、1種又は2種以上の回転異性体として存在する場合があるが、本発明の化合物は全ての回転異性体又は任意の割合で含むジアステロマーの混合物を包含する。
- [0023] 次に、本明細書において示した各置換基の具体例を以下に示す。ここで、*n*-はノルマル、*i*-はイソ、*s*-はセカンダリー、*tert*-はターシャリーを各々意味し、Phはフェニルを意味する。
- [0024] 本明細書における「ハロゲン原子」としては、フッ素原子、塩素原子、臭素原子及びヨウ素原子が挙げられる。尚、本明細書中「ハロ」の表記もこれらのハロゲン原子を表す。
- [0025] 本明細書における「C_a~C_bアルキル」の表記は、炭素原子数がa~b個よりなる直鎖状又は分岐鎖状の飽和炭化水素基を表す。「C_a~C_bアルキル」としては、例えばメチル、エチル、*n*-プロピル、*i*-プロピル、*n*-ブチル、*i*-ブチル、*s*-ブチル、*tert*-ブチル、*n*-ペンチル、1,1-ジメチルプロピル及び*n*-ヘキシル等が具体例として挙げられる。「C_a~C_bアルキル」は、指定の炭素原子数の範囲で選択される。
- [0026] 本明細書における「C_a~C_bハロアルキル」の表記は、炭素原子に結合した水素原子がハロゲン原子によって任意に置換された、炭素原子数がa~b

個よりなる直鎖状又は分岐鎖状の飽和炭化水素基を表す。2個以上のハロゲン原子によって置換されている場合、それらのハロゲン原子は互いに同一でも、または互いに相異なってもよい。「C_a~C_bハロアルキル」としては、例えばフルオロメチル、クロロメチル、ブロモメチル、ヨードメチル、ジフルオロメチル、ジクロロメチル、トリフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、トリクロロメチル、ブロモジフルオロメチル、1-フルオロエチル、2-フルオロエチル、2-クロロエチル、2-ブロモエチル、2, 2-ジフルオロエチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエチル及び2, 2, 2-トリクロロエチル等が具体例として挙げられる。「C_a~C_bハロアルキル」は、指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0027] 本明細書における「C_a~C_bアルケニル」の表記は、炭素原子数がa~b個よりなる直鎖状又は分岐鎖状で、且つ分子内に1個又は2個以上の二重結合を有する不飽和炭化水素を表す。「C_a~C_bアルケニル」としては、例えばビニル、1-プロペニル、2-プロペニル（以下、アリルとも記載する。）、1-メチルエテニル、2-ブテニル、2-メチル-2-プロペニル、3-メチル-2-ブテニル及び1, 1-ジメチル-2-プロペニル等が具体例として挙げられる。「C_a~C_bアルケニル」は、指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0028] 本明細書における「C_a~C_bアルキニル」の表記は、炭素原子数がa~b個よりなる直鎖状又は分岐鎖状で、且つ分子内に1個又は2個以上の三重結合を有する不飽和炭化水素を表す。「C_a~C_bアルキニル」としては、例えばエチニル、プロパルギル、2-ブチニル、3-ブチニル、1-ペンチニル及び1-ヘキシニル等が具体例として挙げられる。「C_a~C_bアルキニル」は、指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0029] 本明細書における「C_a~C_bアルコキシ」の表記は、炭素原子数がa~b個よりなる前記の意味であるアルキル-O-を表す。「C_a~C_bアルコキシ」としては、例えばメトキシ、エトキシ、n-プロピルオキシ、i-プロピ

ルオキシ、*n*-ブチルオキシ、*i*-ブチルオキシ、*s*-ブチルオキシ、*tert*-ブチルオキシ及び2-エチルヘキシルオキシ等が具体例として挙げられる。「C_a~C_bアルコキシ」は、指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0030] 本明細書における「C_a~C_bハロアルコキシ」の表記は、炭素原子数が *a* ~ *b* 個よりなる前記の意味であるハロアルキル-O-を表す。「C_a~C_bハロアルコキシ」としては、例えばジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、ブロモジフルオロメトキシ、2-フルオロエトキシ、2-クロロエトキシ、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ、1, 1, 2, 2, -テトラフルオロエトキシ、2-クロロ-1, 1, 2-トリフルオロエトキシ及び1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘキサフルオロプロピルオキシ等が具体例として挙げられる。「C_a~C_bハロアルコキシ」は、指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0031] 本明細書における「C_a~C_bアルキルチオ」の表記は、炭素原子数が *a* ~ *b* 個よりなる前記の意味であるアルキル-S-を表す。「C_a~C_bアルキルチオ」としては、例えばメチルチオ、エチルチオ、*n*-プロピルチオ、*i*-プロピルチオ、*n*-ブチルチオ、*i*-ブチルチオ、*s*-ブチルチオ及び *tert*-ブチルチオ等が具体例として挙げられる。「C_a~C_bアルキルチオ」は、指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0032] 本明細書における「C_a~C_bハロアルキルチオ」の表記は、炭素原子数が *a* ~ *b* 個よりなる前記の意味であるハロアルキル-S-を表す。「C_a~C_bハロアルキルチオ」としては、例えばジフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、クロロジフルオロメチルチオ、ブロモジフルオロメチルチオ、2-フルオロエチルチオ、2-クロロエチルチオ、2, 2, 2-トリフルオロエチルチオ、1, 1, 2, 2, -テトラフルオロエチルチオ、2-クロロ-1, 1, 2-トリフルオロエチルチオ及び1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘキサフルオロプロピルチオ等が具体例として挙げられる。「C_a~C_bハロアルキルチオ」は、指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0033] 本明細書における「C_a~C_bアルキルスルフィニル」の表記は、炭素原子

数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルキル-S(O)-を表す。なお、-S(O)-は、単に-SO-とも表記し得る。「 $C_a \sim C_b$ アルキルスルフィニル」としては、例えばメチルスルフィニル、エチルスルフィニル、 n -プロピルスルフィニル、 i -プロピルスルフィニル、 n -ブチルスルフィニル、 i -ブチルスルフィニル、 S -ブチルスルフィニル及びtert-ブチルスルフィニル等が具体例として挙げられる。「 $C_a \sim C_b$ アルキルスルフィニル」は、指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0034] 本明細書における「 $C_a \sim C_b$ アルキルスルホニル」の表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルキル-SO₂-を表す。「 $C_a \sim C_b$ アルキルスルホニル」としては、例えばメチルスルホニル、エチルスルホニル、 n -プロピルスルホニル、 i -プロピルスルホニル、 n -ブチルスルホニル、 i -ブチルスルホニル、 s -ブチルスルホニル及びtert-ブチルスルホニル等が具体例として挙げられる。「 $C_a \sim C_b$ アルキルスルホニル」は、指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0035] 本明細書における「 $C_a \sim C_b$ ハロアルキルスルホニル」の表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるハロアルキル-SO₂-を表す。「 $C_a \sim C_b$ ハロアルキルスルホニル」としては、例えばジフルオロメチルスルホニル、トリフルオロメチルスルホニル、クロロジフルオロメチルスルホニル、ブromोजフルオロメチルスルホニル、2-フルオロエチルスルホニル、2-クロロエチルスルホニル、2, 2, 2-トリフルオロエチルスルホニル、1, 1, 2, 2, -テトラフルオロエチルスルホニル、2-クロロ-1, 1, 2-トリフルオロエチルスルホニル及び1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘキサフルオロプロピルスルホニル等が具体例として挙げられる。「 $C_a \sim C_b$ ハロアルキルスルホニル」は、指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0036] 本明細書における「 $C_a \sim C_b$ シクロアルキル」の表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる環状の炭化水素基を表す。「 $C_a \sim C_b$ シクロアルキル」は、例えば3員環から10員環までの単環又は複合環構造を形成することが出来る。また、各々の環における水素は指定の炭素原子数の範囲でアルキルによ

って任意に置換されていてもよい。「C_a~C_bシクロアルキル」としては、例えばシクロプロピル、1-メチルシクロプロピル、2-メチルシクロプロピル、2, 2-ジメチルシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル及びシクロヘキシル等が具体例として挙げられる。「C_a~C_bシクロアルキル」は、指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0037] 本明細書における「C_a~C_bハロシクロアルキル」の表記は、炭素原子に結合した水素原子がハロゲン原子によって任意に置換された、炭素原子数がa~b個よりなる環状の炭化水素基を表す。2個以上のハロゲン原子によって置換されている場合、それらのハロゲン原子は互いに同一でも、または互いに相異なってもよい。「C_a~C_bハロシクロアルキル」としては、例えば2, 2-ジフルオロシクロプロピル、2, 2-ジクロロシクロプロピル、2, 2-ジブromoシクロプロピル、2, 2-ジフルオロ-1-メチルシクロプロピル、2, 2-ジクロロ-1-メチルシクロプロピル、2, 2-ジブromo-1-メチルシクロプロピル及び2, 2, 3, 3-テトラフルオロシクロブチル等が具体例として挙げられる。「C_a~C_bハロシクロアルキル」は、指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0038] 本明細書における「C_a~C_bアルキルアミノ」の表記は、水素原子の一方が、炭素原子数がa~b個よりなる前記の意味であるアルキルによって置換されたアミノを表す。「C_a~C_bアルキルアミノ」としては、例えば、メチルアミノ、エチルアミノ、n-プロピルアミノ、i-プロピルアミノ、n-ブチルアミノ、i-ブチルアミノ及びtert-ブチルアミノ等が具体例として挙げられる。「C_a~C_bアルキルアミノ」は、指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0039] 本明細書における「C_a~C_bシクロアルキルアミノ」の表記は、水素原子の一方が、炭素原子数がa~b個よりなる前記の意味であるシクロアルキルによって置換されたアミノを表す。「C_a~C_bシクロアルキルアミノ」としては、例えば、シクロプロピルアミノ、シクロブチルアミノ、シクロペンチルアミノ及びシクロヘキシルアミノ等が具体例として挙げられる。「C_a~C

b シクロアルキルアミノ」は、指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0040] 本明細書における「ジ ($C_a \sim C_b$ アルキル) アミノ」の表記は、水素原子が両方とも、それぞれ同一でも又は互いに相異なってもよい炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルキルによって置換されたアミノを表す。「ジ ($C_a \sim C_b$ アルキル) アミノ」としては、例えば、ジメチルアミノ、エチル (メチル) アミノ、ジエチルアミノ、 n -プロピル (メチル) アミノ、 i -プロピル (メチル) アミノ、ジ (n -プロピル) アミノ及びジ (n -ブチル) アミノ等が具体例として挙げられる。「ジ ($C_a \sim C_b$ アルキル) アミノ」の各々のアルキルは、指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0041] 本明細書における「 $C_a \sim C_b$ アルキルカルボニル」の表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルキル-C(O)-を表す。「 $C_a \sim C_b$ アルキルカルボニル」としては、例えば、アセチル、プロピオニル、ブチリル、イソブチリル、バレリル、イソバレリル、2-メチルブタノイル、ピバロイル、ヘキサノイル及びヘプタノイル等が具体例として挙げられる。「 $C_a \sim C_b$ アルキルカルボニル」は、指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0042] 本明細書における「 $C_a \sim C_b$ アルコキシカルボニル」の表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルキル-O-C(O)-を表す。「 $C_a \sim C_b$ アルコキシカルボニル」としては、例えばメトキシカルボニル、エトキシカルボニル、 n -プロピルオキシカルボニル、 i -プロピルオキシカルボニル、 n -ブトキシカルボニル、 i -ブトキシカルボニル、 s -ブトキシカルボニル、 $t e r t$ -ブトキシカルボニル及び2-エチルヘキシルオキシカルボニル等が具体例として挙げられる。「 $C_a \sim C_b$ アルコキシカルボニル」は、指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0043] 本明細書における「 $C_a \sim C_b$ アルキルアミノカルボニル」の表記は、水素原子の一方が、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルキルによって置換されたカルバモイルを表す。「 $C_a \sim C_b$ アルキルアミノカルボニル」としては、例えば、メチルカルバモイル、エチルカルバモイル、 n -プロピルカルバモイル、 i -プロピルカルバモイル、 n -ブチルカルバモイル

、*i*-ブチルカルバモイル、*s*-ブチルカルバモイル及び*tert*-ブチルカルバモイル等が具体例として挙げられる。「C_a~C_bアルキルアミノカルボニル」は、指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0044] 本明細書における「C_a~C_bシクロアルキルアミノカルボニル」の表記は、水素原子の一方が、炭素原子数が*a*~*b*個よりなる前記の意味であるシクロアルキルによって置換されたカルバモイルを表す。「C_a~C_bシクロアルキルアミノカルボニル」としては、例えば、シクロプロピルカルバモイル、シクロブチルカルバモイル、シクロペンチルカルバモイル及びシクロヘキシルカルバモイル等が具体例として挙げられる。「C_a~C_bシクロアルキルアミノカルボニル」は、指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0045] 本明細書における「ジ(C_a~C_b)アルキルアミノカルボニル」の表記は、水素原子が両方とも、それぞれ同一でも又は互いに相異なってもよい炭素原子数が*a*~*b*個よりなる前記の意味であるアルキルによって置換されたカルバモイルを表す。「ジ(C_a~C_b)アルキルアミノカルボニル」の具体例としては、N, N-ジメチルカルバモイル、N-エチル-N-メチルカルバモイル、N, N-ジエチルカルバモイル、N, N-ジ(*n*-プロピル)カルバモイル及びN, N-ジ(*n*-ブチル)カルバモイル等が挙げられる。「ジ(C_a~C_b)アルキルアミノカルボニル」の各々のアルキルは、指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0046] 本明細書における「C_a~C_bアルキルカルボニルオキシ」の表記は、炭素原子数が*a*~*b*個よりなる前記の意味であるアルキル-C(O)O-を表す。「C_a~C_bアルキルカルボニルオキシ」としては、例えば、アセトキシ、プロピオニルオキシ、ブチリルオキシ、イソブチリルオキシ、バレリルオキシ、イソバレリルオキシ、2-メチルブタノイルオキシ、ピバロイルオキシ、ヘキサノイルオキシ及びヘプタノイルオキシ等が具体例として挙げられる。「C_a~C_bアルキルカルボニルオキシ」は、指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0047] 本明細書における「C_a~C_bアルキルカルボニルアミノ」の表記は、炭素

原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルキル-C(O)NH-を表す。「 $C_a \sim C_b$ アルキルカルボニルアミノ」としては、例えば、アセトキシアミノ、プロピオニルオキシアミノ、ブチリルオキシアミノ等が具体例として挙げられる。「 $C_a \sim C_b$ アルキルカルボニルアミノ」は、指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0048] 本明細書における「フェニルカルボニルアミノ」の表記は、 $C_6H_5-C(O)NH-$ を表す。

[0049] 本明細書における「ハロスルホニルオキシ」の表記は、前記の意味であるハロゲン原子-SO₂-O-を表す。「ハロスルホニルオキシ」としては、例えば、フルオロスルホニルオキシ、クロロスルホニルオキシ等が具体例として挙げられる。

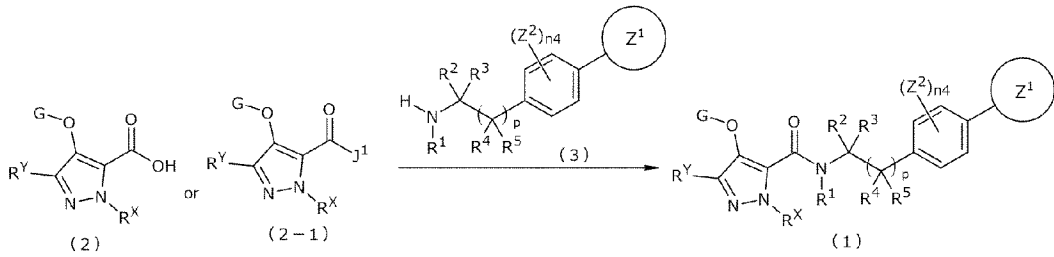
[0050] 本明細書における「 $C_a \sim C_b$ アルコキシカルボニルオキシ」の表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルコキシ-C(O)O-を表す。「 $C_a \sim C_b$ アルコキシカルボニルオキシ」としては、例えば、メトキシカルボニルオキシ、エトキシカルボニルオキシ等が具体例として挙げられる。「 $C_a \sim C_b$ アルコキシカルボニルオキシ」は、指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0051] 本明細書における「 $C_a \sim C_b$ アルキルスルホニルオキシ」の表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルキル-SO₂-O-を表す。「 $C_a \sim C_b$ アルキルスルホニルオキシ」としては、例えば、メタンスルホニルオキシ、エタンスルホニルオキシ等が具体例として挙げられる。「 $C_a \sim C_b$ アルキルスルホニルオキシ」は、指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0052] 本明細書における「 $C_a \sim C_b$ ハロアルキルスルホニルオキシ」の表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるハロアルキル-SO₂-O-を表す。「 $C_a \sim C_b$ ハロアルキルスルホニルオキシ」としては、例えば、トリフルオロメタンスルホニルオキシ、クロロメチルスルホニルオキシ等が具体例として挙げられる。「 $C_a \sim C_b$ ハロアルキルスルホニルオキシ」は、指定の炭素原子数の範囲で選択される。

- [0053] 本明細書における「アリール」の表記は、炭素数6～10の芳香族環を意味する。具体的には、例えば、フェニル、 α -ナフチル、 β -ナフチルが挙げられ、好ましくは、フェニルである。前記アリールは、例えば、ハロゲン原子、アルキル、アルコキシ、シアノ、ニトロ等が、1～3個置換されていてもよい。
- [0054] 本明細書における「アリールスルホニルオキシ」の表記は、前記の意味であるアリール-SO₂-O-を表す。「アリールスルホニルオキシ」としては、例えば、フェニルスルホニルオキシ、パラトルエンスルホニルオキシ等が具体例として挙げられる。
- [0055] 本明細書における「ヒドロキシアミノ」の表記は、HO-NH-を表す。
- [0056] 本明細書における「チオール」の表記は、HS-を表す。
- [0057] 本明細書における「R^aで置換されたC_a～C_bアルキル」の表記は、アルキルの炭素原子に結合した何れかの水素原子が、1個以上の置換基R^aによって部分的に又は全て置換された炭素原子数がa～b個よりなる前記の意味であるアルキルを表す。これらは、各々、指定の炭素原子数の範囲で選択される。置換基R^aが2個以上存在するとき、置換基R^aは互いに同一でも異なってもよい。
- [0058] 本明細書における「ベンジル」の表記は、-CH₂C₆H₅を表す。
- [0059] 次に、式(1)で表される本発明の化合物の製造方法について説明する。式(1)で表される本発明の化合物は、例えば、以下の方法により製造することができる。なお、以下の説明はあくまで例示に過ぎず、式(1)で表される本発明の化合物は、他の方法により製造されてもよい。以下、「式(1)で表される本発明の化合物」は、「化合物(1)」とも記載され、また、「式(2)で表される化合物」は、「化合物(2)」とも記載される。他の化合物についてもこれに準じて同様に記載される。
- [0060] (製造例1)
- 本発明の化合物(1)は、例えば、下記の製造法により製造することができる。

[0061] [化6]



[式中、 J^1 は塩素原子、臭素原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキルカルボニルオキシ又は $C_1 \sim C_4$ アルコシカルボニルオキシ（例えば、メトキシカルボニルオキシなど）を表し、 G 、 R^X 、 R^Y 、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 Z^1 、 Z^2 、 n_4 及び p は前記と同じ意味を表す。]

化合物（１）は、化合物（２）と、化合物（３）又はその塩（例えば、塩酸塩、臭化水素酸塩、ヨウ化水素酸塩、硫酸塩、トリフルオロ酢酸塩、シュウ酸塩、パラートルエンスルホン酸塩等）と脱水縮合剤とを、溶媒中又は無溶媒で、場合によっては塩基及び添加物のうち何れか一方、或いは両方の存在下で、反応させることで製造することができる。

[0062] 或いは、化合物（１）は、化合物（２－１）と、化合物（３）又はその塩（例えば、塩酸塩、臭化水素酸塩、ヨウ化水素酸塩、硫酸塩、トリフルオロ酢酸塩、シュウ酸塩、パラートルエンスルホン酸塩等）とを、溶媒中又は無溶媒で、場合によっては塩基及び添加物のうち何れか一方、或いは両方の存在下で、反応させることでも製造することができる。

[0063] 用いる化合物（３）又はその塩、及び脱水縮合剤の使用量は、化合物（２）又は化合物（２－１）１当量に対して、０．５～５０当量であり得る。

[0064] 化合物（３）で表される化合物の一部は公知化合物であり、市販品として入手できる。また、化合物（３）で表されるそれ以外の化合物も文献記載の一般的な公知化合物の合成方法に準じて製造することができる。

[0065] 脱水縮合剤は、例えば、１Ｈ－ベンゾトリアゾール－１－イルオキシトリス（ジメチルアミノ）ホスホニウムヘキサフルオロホスファート、 N 、 N' －ジシクロヘキシルカルボジイミド、１－エチル－３－（３－ジメチルアミ

ノプロピル)カルボジイミド塩酸塩、及び、1-[ビス(ジメチルアミノ)メチレン]-1H-1,2,3-トリアゾロ[4,5-b]ピリジニウム3-オキシドヘキサフルオロホスファート等が挙げられる。

[0066] 溶媒を用いる場合、用いられる溶媒は反応に不活性であればよく、当該溶媒としては、例えば、水；メタノール、エタノール又はtert-ブチルアルコール等のアルコール溶媒；ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、1,4-ジオキサン、1,2-ジメトキシエタン又はジグリム等のエーテル溶媒；ベンゼン、キシレン又はトルエン等の芳香族炭化水素溶媒；n-ペンタン、n-ヘキサン又はシクロヘキサン等の脂肪族炭化水素溶媒；ジクロロメタン、クロロホルム又は1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素溶媒；アセトニトリル又はプロピオニトリル等のニトリル溶媒；N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン又はN,N'-ジメチルイミダゾリジノン等のアミド溶媒；ジメチルスルホキシド；ピリジン；或いはこれらの混合溶媒；等が挙げられる。

[0067] 該反応は塩基の存在下に行うことができる。用いることのできる塩基としては、例えば、ピリジン、2,6-ルチジン、4-ジメチルアミノピリジン、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、トリブチルアミン、N,N-ジメチルアニリン、1,4-ジアザビシクロ[2.2.2]オクタン(DABCO)、1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]-7-ウンデセン(DBU)又は1,5-ジアザビシクロ[4.3.0]-5-ノネン(DBN)等の有機塩基；水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウム又はリン酸カリウム等の無機塩基；ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド又はカリウムtert-ブトキシド等の金属アルコキシド；が挙げられる。塩基の使用量は、化合物(2)又は化合物(2-1)1当量に対して、0.1~100当量であり得る。

[0068] 該反応は添加物の存在下で行うことができる。用いることのできる添加物としては、例えば、1-ヒドロキシベンゾトリアゾール、1-ヒドロキシ-

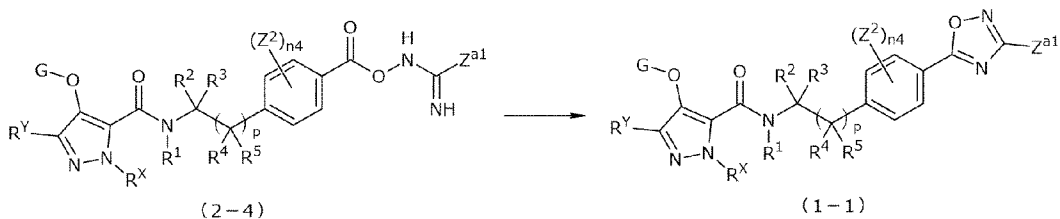
7-アザベンゾトリアゾール又は4-(ジメチルアミノ)ピリジン等が挙げられる。添加物の使用量は、化合物(2)又は化合物(2-1)1当量に対して、0.005~100当量であり得る。

[0069] 反応温度は-78℃から反応混合物の還流温度までの任意の温度を設定することができ、反応時間は、反応基質の濃度又は反応温度によって変化するが、通常5分から100時間の範囲で任意に設定できる。

[0070] (製造例2)

本発明の化合物(1-1)は、例えば、下記の製造法により製造することができる。

[0071] [化7]



[式中、 Z^{a1} は $C_1\sim C_6$ アルキル、 R^a で置換された $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_3\sim C_{10}$ シクロアルキル又は $C_1\sim C_6$ ハロアルキルを表し、 G 、 R^a 、 R^x 、 R^y 、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 Z^2 、 n_4 及び p は前記と同じ意味を表す。]

化合物(1-1)は、化合物(2-4)を、溶媒中又は無溶媒で、場合によっては塩基の存在下で、反応させることで製造することができる。

[0072] 溶媒を用いる場合、用いられる溶媒は反応に不活性であればよく、当該溶媒としては、例えば製造例1で例示した溶媒が挙げられる。

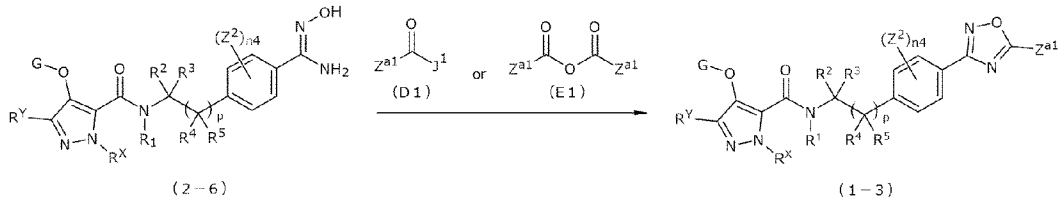
[0073] 該反応で用いることのできる塩基としては、例えば、製造例1で例示の塩基が挙げられる。塩基の使用量は、化合物(2-4)1当量に対して、0.1~100当量であり得る。

[0074] 反応温度及び反応時間は、製造例1に記載の温度範囲及び時間範囲で任意に設定できる。

[0075] (製造例3)

本発明の化合物（１－３）は、例えば、下記の製造法により製造することができる。

[0076] [化8]



[式中、G、J¹、R^x、R^y、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、Z²、Z^{a1}、n₄及びpは前記と同じ意味を表す。]

化合物（１－３）は、化合物（２－６）と化合物（D 1）又は化合物（E 1）とを、溶媒中又は無溶媒で、場合によっては塩基の存在下で、反応させることで製造することができる。

[0077] 用いる化合物（D 1）又は化合物（E 1）の使用量としては、化合物（２－６）１当量に対して、０．５～５０当量であり得る。

[0078] 化合物（D 1）で表される化合物の一部は公知化合物であり、市販品として入手できる。また、化合物（D 1）で表されるそれ以外の化合物も文献記載の一般的な公知化合物の合成方法に準じて製造することができる。

[0079] 化合物（E 1）で表される化合物の一部は公知化合物であり、市販品として入手できる。また、化合物（E 1）で表されるそれ以外の化合物も文献記載の一般的な公知化合物の合成方法に準じて製造することができる。

[0080] 溶媒を用いる場合、用いられる溶媒は反応に不活性であればよく、当該溶媒としては、例えば製造例１で例示した溶媒が挙げられる。

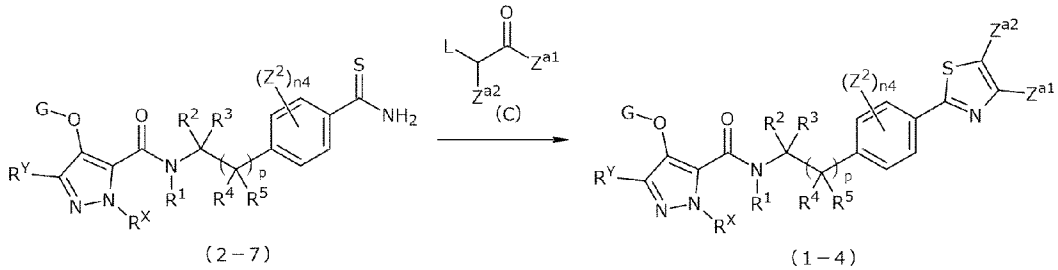
[0081] 該反応で用いることのできる塩基としては、例えば、製造例１で例示の塩基が挙げられる。塩基の使用量は、化合物（２－６）１当量に対して、０．１～１００当量であり得る。

[0082] 反応温度及び反応時間は、製造例１に記載の温度範囲及び時間範囲で任意に設定できる。

[0083] （製造例４）

本発明の化合物（１－４）は、例えば、下記の製造法により製造することができる。

[0084] [化9]



[式中、Lは塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニルオキシ（例えば、メタンスルホニルオキシなど）、ハロスルホニルオキシ（例えば、フルオロスルホニルオキシなど）、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニルオキシ（例えば、トリフルオロメタンスルホニルオキシなど）又はアリールスルホニルオキシ（例えば、パラトルエンスルホニルオキシなど）等の脱離基を表し、 Z^{a2} は水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルを表し、G、 R^X 、 R^Y 、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 Z^2 、 Z^{a1} 、 n_4 及びpは前記と同じ意味を表す。

[0085] 化合物（１－４）は、化合物（２－７）と化合物（C）とを、溶媒中又は無溶媒で、場合によっては塩基の存在下で、反応させることで製造することができる。

[0086] 用いる化合物（C）の使用量は、化合物（２－７）１当量に対して、０．５～５０当量であり得る。

[0087] 化合物（C）で表される化合物の一部は公知化合物であり、市販品として入手できる。また、化合物（C）で表されるそれ以外の化合物も文献記載の一般的な公知化合物の合成方法に準じて製造することができる。

[0088] 溶媒を用いる場合、用いられる溶媒は反応に不活性であればよく、当該溶媒としては、例えば製造例１で例示した溶媒が挙げられる。

[0089] 該反応で用いることのできる塩基としては、例えば、製造例１で例示の塩基が挙げられる。塩基の使用量は、化合物（２－７）１当量に対して、０．

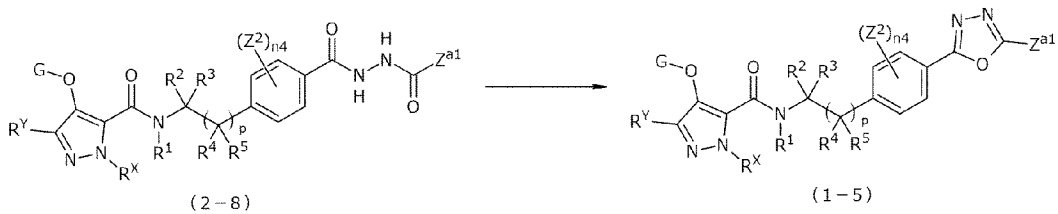
1～100当量であり得る。

[0090] 反応温度及び反応時間は、製造例1に記載の温度範囲及び時間範囲で任意に設定できる。

[0091] (製造例5)

本発明の化合物(1-5)は、例えば、下記の製造法により製造することができる。

[0092] [化10]



[式中、G、R^X、R^Y、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、Z²、Z^{a1}、n₄及びpは前記と同じ意味を表す。]

化合物(1-5)は、化合物(2-8)と脱水剤とを、溶媒中又は無溶媒で、反応させることで製造することができる。

[0093] 用いる脱水剤の使用量は、化合物(2-8)1当量に対して、0.5～50当量であり得る。

[0094] 脱水剤は、例えば、N-(トリエチルアンモニオスルホニル)カルバミン酸メチル等が挙げられる。

[0095] 溶媒を用いる場合、用いられる溶媒は反応に不活性であればよく、当該溶媒としては、例えば製造例1で例示した溶媒が挙げられる。

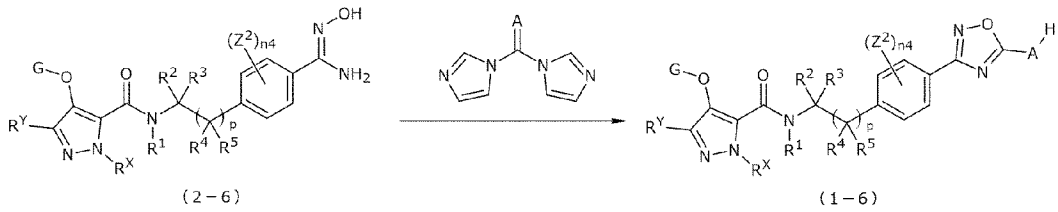
[0096] 反応温度及び反応時間は、製造例1に記載の温度範囲及び時間範囲で任意に設定できる。

[0097] (製造例6)

本発明の化合物(1-6)は、例えば、下記の製造法により製造することができる。

[0098]

[化11]



[式中、Aは酸素原子又は硫黄原子を表し、G、R^x、R^y、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、Z²、n₄及びpは前記と同じ意味を表す。]

化合物(1-6)は、化合物(2-6)と1, 1'-カルボニルジイミダゾール又は1, 1'-チオカルボニルジイミダゾールとを、溶媒中又は無溶媒で、場合によっては塩基の存在下で、反応させることで製造することができる。

[0099] 用いる1, 1'-カルボニルジイミダゾール又は1, 1'-チオカルボニルジイミダゾールの使用量は、化合物(2-6)1当量に対して、0.5~50当量であり得る。

[0100] 溶媒を用いる場合、用いられる溶媒は反応に不活性であればよく、当該溶媒としては、例えば製造例1で例示した溶媒が挙げられる。

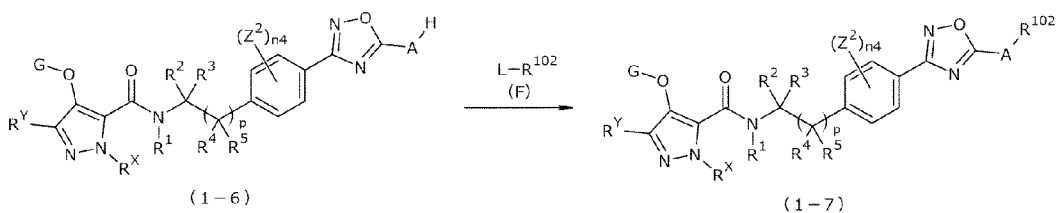
[0101] 該反応で用いることのできる塩基としては、例えば、製造例1で例示の塩基が挙げられる。塩基の使用量は、化合物(2-6)1当量に対して、0.1~100当量であり得る。

[0102] 反応温度及び反応時間は、製造例1に記載の温度範囲及び時間範囲で任意に設定できる。

[0103] (製造例7)

本発明の化合物(1-7)は、例えば、下記の製造法により製造することができる。

[0104] [化12]



[式中、 R^{102} は $C_1\sim C_6$ アルキル又は $C_1\sim C_6$ ハロアルキルを表し、 A 、 G 、 L 、 R^X 、 R^Y 、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 Z^2 、 n_4 及び p は前記と同じ意味を表す。]

化合物(1-7)は、本発明の化合物(1-6)と化合物(F)とを、溶媒中又は無溶媒で、場合によっては塩基の存在下で、反応させることで製造することができる。

[0105] 用いる化合物(F)の使用量は、化合物(1-6)1当量に対して、0.5~50当量であり得る。

[0106] 化合物(F)で表される化合物の一部は公知化合物であり、市販品として入手できる。また、化合物(F)で表されるそれ以外の化合物も文献記載の一般的な公知化合物の合成方法に準じて製造することができる。

[0107] 溶媒を用いる場合、用いられる溶媒は反応に不活性であればよく、当該溶媒としては、例えば製造例1で例示した溶媒が挙げられる。

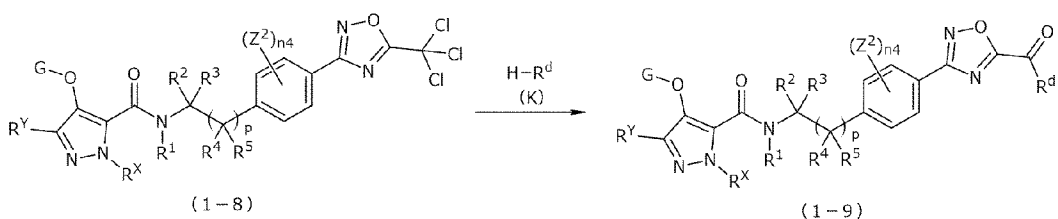
[0108] 該反応で用いることのできる塩基としては、例えば、製造例1で例示の塩基が挙げられる。塩基の使用量は、化合物(1-6)1当量に対して、0.1~100当量であり得る。

[0109] 反応温度及び反応時間は、製造例1に記載の温度範囲及び時間範囲で任意に設定できる。

[0110] (製造例8)

本発明の化合物(1-9)は、例えば、下記の製造法により製造することができる。

[0111] [化13]



[式中、 G 、 R^X 、 R^Y 、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^d 、 Z^2 、 n_4 及び p は前記と同じ意味を表す。]

化合物（１－９）は、文献記載の公知の方法、例えば、シンセシス [Synthesis] 2019年, 51巻, 530~537項等に記載の方法に準じて、化合物（１－８）と化合物（K）又はその塩（例えば、塩酸塩、臭化水素酸塩、ヨウ化水素酸塩、硫酸塩、トリフルオロ酢酸塩、シュウ酸塩、パラートルエンスルホン酸塩等）とを、溶媒中又は無溶媒で、場合によっては塩基の存在下で、反応させることで製造することができる。

[0112] 用いる化合物（K）の使用量は、化合物（１－８）１当量に対して、0.5~50当量であり得る。

[0113] 化合物（K）で表される化合物の一部は公知化合物であり、市販品として入手できる。また、化合物（K）で表されるそれ以外の化合物も文献記載の一般的な公知化合物の合成方法に準じて製造することができる。

[0114] 溶媒を用いる場合、用いられる溶媒は反応に不活性であればよく、当該溶媒としては、例えば製造例１で例示した溶媒が挙げられる。

[0115] 該反応で用いることのできる塩基としては、例えば、製造例１で例示の塩基が挙げられる。塩基の使用量は、化合物（１－８）１当量に対して、0.1~100当量であり得る。

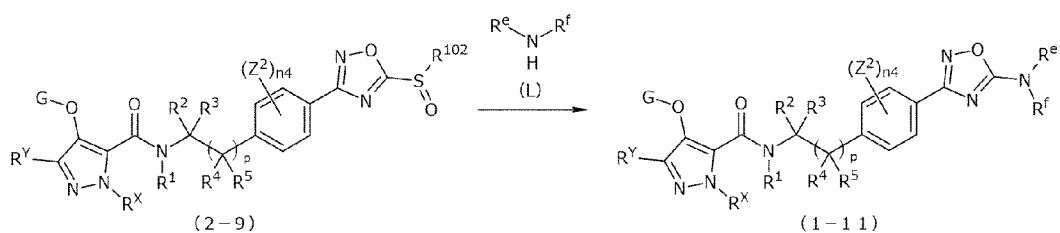
[0116] 反応温度及び反応時間は、製造例１に記載の温度範囲及び時間範囲で任意に設定できる。

[0117] 本発明の化合物（１－８）は製造例３の方法に準じて合成することができる。

[0118] （製造例９）

本発明の化合物（１－１１）は、例えば、下記の製造法により製造することができる。

[0119] [化14]



[式中、G、R^x、R^y、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R¹⁰²、R^e、R^f、Z²、n⁴及びpは前記と同じ意味を表す。]

化合物(1-11)は、化合物(2-9)と化合物(L)又はその塩(例えば、塩酸塩、臭化水素酸塩、ヨウ化水素酸塩、硫酸塩、トリフルオロ酢酸塩、シュウ酸塩、パラトルエンスルホン酸塩等)とを、溶媒中又は無溶媒で、場合によっては塩基の存在下で、反応させることで製造することができる。

[0120] 用いる化合物(L)の使用量は、化合物(2-9)1当量に対して、0.5~50当量であり得る。

[0121] 化合物(L)で表される化合物の一部は公知化合物であり、市販品として入手できる。また、化合物(L)で表されるそれ以外の化合物も文献記載の一般的な公知化合物の合成方法に準じて製造することができる。

[0122] 溶媒を用いる場合、用いられる溶媒は反応に不活性であればよく、当該溶媒としては、例えば製造例1で例示した溶媒が挙げられる。

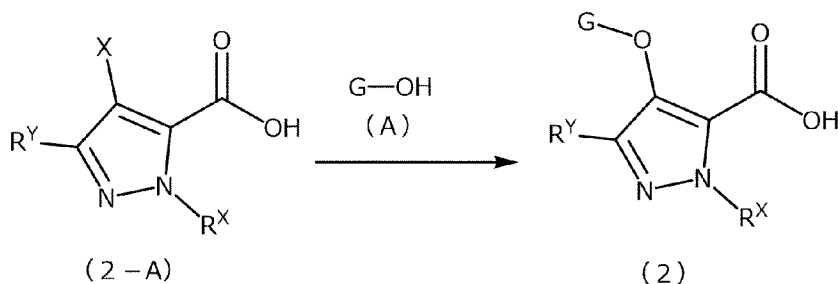
[0123] 該反応で用いることのできる塩基としては、例えば、製造例1で例示の塩基が挙げられる。塩基の使用量は、化合物(2-9)1当量に対して、0.1~100当量であり得る。

[0124] 反応温度及び反応時間は、製造例1に記載の温度範囲及び時間範囲で任意に設定できる。

[0125] 製造例1で用いられる化合物(2)は、例えば、下記の反応式1で示される製造ルート(反応経路)にしたがって製造することができる。

[0126] [反応式1]

[0127] [化15]



[式中、Xはハロゲン原子を表し、G、R^x及びR^yは前記と同じ意味を表す。]

化合物(2)は、化合物(2-A)と、化合物(A)とを、溶媒中又は無溶媒で、塩基存在下、必要に応じて銅触媒及び添加剤のうち何れか一方、或いは両方の存在下で反応させることにより得ることができる。或いは、化合物(2)は、化合物(2-A)と、化合物(A)とを、塩基存在下、必要に応じてパラジウム触媒及び配位子の存在下で反応させることにより得ることができる。

[0128] 化合物(2-A)で表される化合物の一部は公知化合物であり、市販品として入手できる。また、化合物(2-A)で表されるそれ以外の化合物も文献記載の一般的な公知化合物の合成方法に準じて製造することができる。

[0129] 用いる化合物(A)の使用量は、化合物(2-A)1当量に対して、0.5~50当量であり得る。

[0130] 化合物(A)で表される化合物の一部は公知化合物であり、市販品として入手できる。また、化合物(A)で表されるそれ以外の化合物も文献記載の一般的な公知化合物の合成方法に準じて製造することができる。

[0131] 溶媒を用いる場合、用いられる溶媒は反応に不活性であればよく、当該溶媒としては、例えば製造例1で例示した溶媒が挙げられる。

[0132] 該反応は塩基の存在下に行うことができる。用いることのできる塩基としては、例えば、製造例1で例示の塩基が挙げられる。塩基の使用量は、化合物(2-A)1当量に対して、0.1~100当量であり得る。

[0133] 該反応は銅触媒の存在下に行うことができる。用いることのできる銅触媒としては、例えば、ヨウ化銅(1価)、トリフルオロメタンスルホン酸銅(1価)ベンゼン錯体又はトリフルオロメタンスルホン酸銅(1価)トルエン錯体等が挙げられる。銅触媒の使用量は、化合物(2-A)1当量に対して、0.001~50当量であり得る。

[0134] 該反応は添加剤の存在下に行うことができる。用いることのできる添加剤としては、例えば、N,N-ジメチルグリシン又は4-(ジメチルアミノ)

ピリジン等が挙げられる。添加剤の使用量は、化合物(2-A) 1当量に対して、0.001~100当量であり得る。

[0135] 該反応はパラジウム触媒の存在下に行うことができる。用いることのできるパラジウム触媒としては、例えば、パラジウム(2価)(π -シンナミル)クロリド(ダイマー)又はアリルパラジウム(2価)クロリド(ダイマー)等が挙げられる。パラジウム触媒の使用量は、化合物(2-A) 1当量に対して、0.001~50当量であり得る。

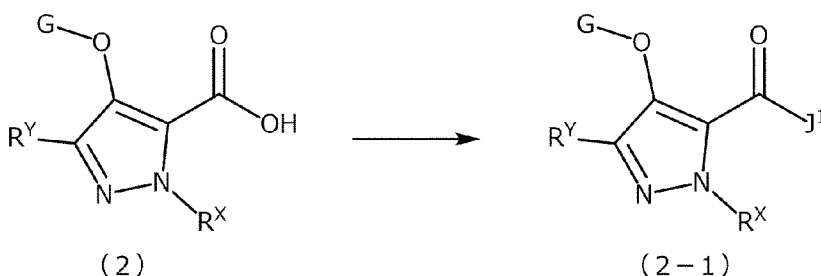
[0136] 該反応は配位子の存在下に行うことができる。用いることのできる配位子としては、例えば、2-ジ-tert-ブチルホスフィノ-2', 4', 6'-トリイソプロピルビフェニル(tert-ブチル-XPhos)、テトラメチル-ジ-tert-ブチルホスフィノ-2', 4', 6'-トリイソプロピルビフェニル(テトラメチル-ジ-tert-ブチル-XPhos)、2-ジ-(tert-ブチル)ホスフィノ-2', 4', 6'-トリイソプロピル-3-メトキシ-6-メチルビフェニル(RockPhos)又は2-(ジシクロヘキシルホスフィノ)-3, 6-ジメトキシ-2', 4', 6'-トリイソプロピル-1, 1'-ビフェニル(BrettPhos)等が挙げられる。配位子の使用量は、化合物(2-A) 1当量に対して、0.001~50当量であり得る。

[0137] 反応温度及び反応時間は、製造例1に記載の温度範囲及び時間範囲で任意に設定できる。

[0138] 製造例1で用いられる化合物(2-1)は、例えば、下記の反応式2で示される製造ルート(反応経路)にしたがって製造することができる。

[0139] [反応式2]

[0140] [化16]



[J¹、G、R^x、及びR^yは前記と同じ意味を表す。]

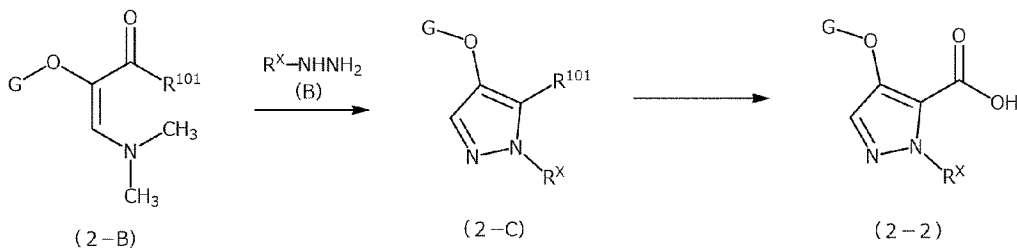
化合物(2-1)は、化合物(2)を文献記載の公知の方法、例えば、ジャーナル・オブ・メディシナル・ケミストリー [J. Med. Chem.] 1991年、34巻、1630頁等に記載の方法に準じて、塩化チオニル、五塩化リン又は塩化オキサリル等のハロゲン化剤と反応させる方法等を用いて反応させることにより得ることができる。

[0141] 或いは、テトラヘドロン・レターズ [Tetrahedron Lett.] 2003年、44巻、4819頁、ジャーナル・オブ・メディシナル・ケミストリー [J. Med. Chem.] 1991年、34巻、222頁等に記載の方法に準じて、塩化ピバロイル又はクロロギ酸イソブチル等の有機酸ハロゲン化物と、必要ならば塩基の存在下、反応させる方法等を用いて反応させることにより得ることができる。

[0142] 化合物(2)のうち、R^yが水素原子である化合物(2-2)は、例えば、下記の反応式で示される製造ルート(反応経路)にしたがって製造することができる。

[0143] [反応式3]

[0144] [化17]



[式中、R¹⁰¹はC₁~C₆アルキルを表し、G及びR^xは前記と同じ意味を表す。]

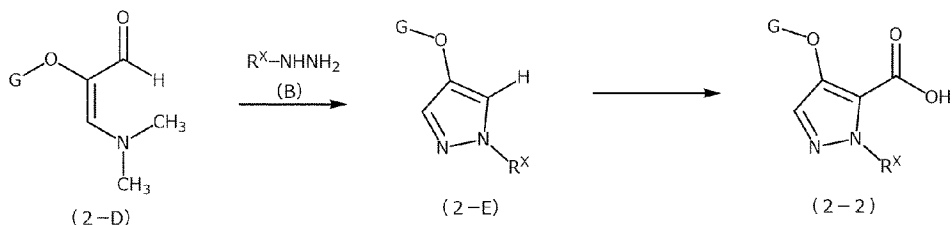
工程1：化合物(2-C)は化合物(2-B)と化合物(B)又はその塩(例えば、塩酸塩、臭化水素酸塩、ヨウ化水素酸塩、硫酸塩、トリフルオロ酢酸塩、シュウ酸塩又はパラートルエンスルホン酸塩等)を、溶媒中又は無溶媒で、場合によっては塩基の存在下で、反応させることにより得ることができる。

- [0145] 化合物（B）で表される化合物の一部は公知化合物であり、市販品として入手できる。また、化合物（B）で表されるそれ以外の化合物も文献記載の一般的な公知化合物の合成方法に準じて製造することができる。
- [0146] 用いる化合物（B）又はその塩の使用量は、化合物（2-B）1当量に対して、0.5～50当量であり得る。
- [0147] 化合物（2-B）で表される化合物の一部はバイオオーガニック&メディシナルケミストリーレターズ [Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters] 2015年、25巻、4481頁に記載の公知化合物であり、また、化合物（2-B）で表されるそれ以外の化合物も当該文献記載の方法に準じて公知の化合物と同様に合成することができる。
- [0148] 溶媒を用いる場合、用いられる溶媒は反応に不活性であればよく、当該溶媒としては、例えば製造例1で例示の溶媒が挙げられる。
- [0149] 該反応は塩基の存在下に行うことができる。用いることのできる塩基としては、例えば、製造例1で例示の塩基が挙げられる。塩基の使用量は、化合物（2-B）1当量に対して、0.1～100当量であり得る。
- [0150] 反応温度及び反応時間は、製造例1に記載の温度範囲及び時間範囲で任意に設定できる。
- [0151] 工程2：化合物（2-2）は、化合物（2-C）と酸化剤とを、溶媒中又は無溶媒で反応させることにより得ることができる。
- [0152] 用いることのできる酸化剤としては、例えば、過マンガン酸カリウム等が挙げられる。酸化剤の使用量は、化合物（2-C）1当量に対して、0.1～100当量であり得る。
- [0153] 溶媒を用いる場合、用いられる溶媒は反応に不活性であればよく、当該溶媒としては、例えば製造例1で例示の溶媒が挙げられる。
- [0154] 反応温度及び反応時間は、製造例1に記載の温度範囲及び時間範囲で任意に設定できる。
- [0155] 化合物（2）のうち、R^Yが水素原子である化合物（2-2）は、例えば、

下記の反応式で示される製造ルート（反応経路）にしたがって製造することができる。

[0156] [反応式 4]

[0157] [化18]



[式中、G及びR^xは前記と同じ意味を表す。]

工程1：化合物(2-E)は、化合物(2-D)と化合物(B)とを、反応式3における工程1と同じ条件にて反応させることにより得ることができる。

[0158] 化合物(2-D)で表される化合物の一部は国際公開第2003/016275号に記載の公知化合物であり、また、化合物(2-D)で表されるそれ以外の化合物も当該文献記載の方法に準じて公知の化合物と同様に合成することができる。

[0159] 工程2：化合物(2-2)は、化合物(2-E)と二酸化炭素とを、溶媒中又は無溶媒で、塩基存在下で反応させることにより得ることができる。

[0160] 用いることのできる塩基としては、例えば、n-ブチルリチウム等が挙げられる。塩基の使用量は、化合物(2-E)1当量に対して、0.1~100当量であり得る。

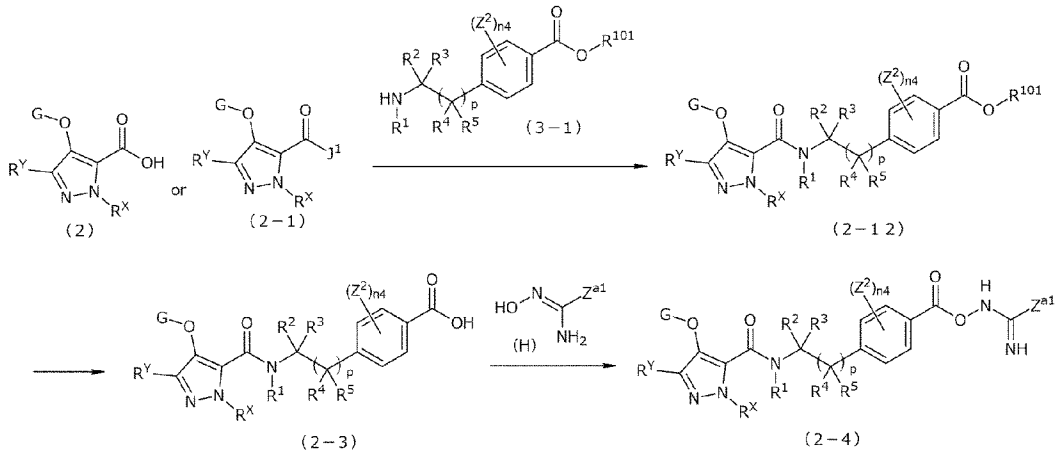
[0161] 溶媒を用いる場合、用いられる溶媒は反応に不活性であればよく、当該溶媒としては、例えば製造例1で例示の溶媒が挙げられる。

[0162] 反応温度及び反応時間は、製造例1に記載の温度範囲及び時間範囲で任意に設定できる。

[0163] 製造例2で用いられる化合物(2-4)は、例えば、下記の反応式5で示される製造ルート（反応経路）にしたがって製造することができる。

[0164] [反応式 5]

[0165] [化19]



[式中、G、R^X、R^Y、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R¹⁰¹、Z²、Z^{a1}、n₄及びpは前記と同じ意味を表す。]

工程1：化合物(2-12)は、化合物(2)又は化合物(2-1)と、化合物(3-1)とを、製造例1と同じ条件にて反応させることにより得ることができる。

[0166] 化合物(3-1)で表される化合物の一部は公知化合物であり、市販品として入手できる。また、化合物(3-1)で表されるそれ以外の化合物も文献記載の一般的な公知化合物の合成方法に準じて製造することができる。

[0167] 工程2：化合物(2-3)は、化合物(2-12)を文献既知の公知の方法、例えば、ザ・ジャーナル・オブ・オーガニック・ケミストリー [The Journal of Organic Chemistry] 2006年、24巻、9045～9050項に記載の方法に準じて反応させることにより得ることができる。

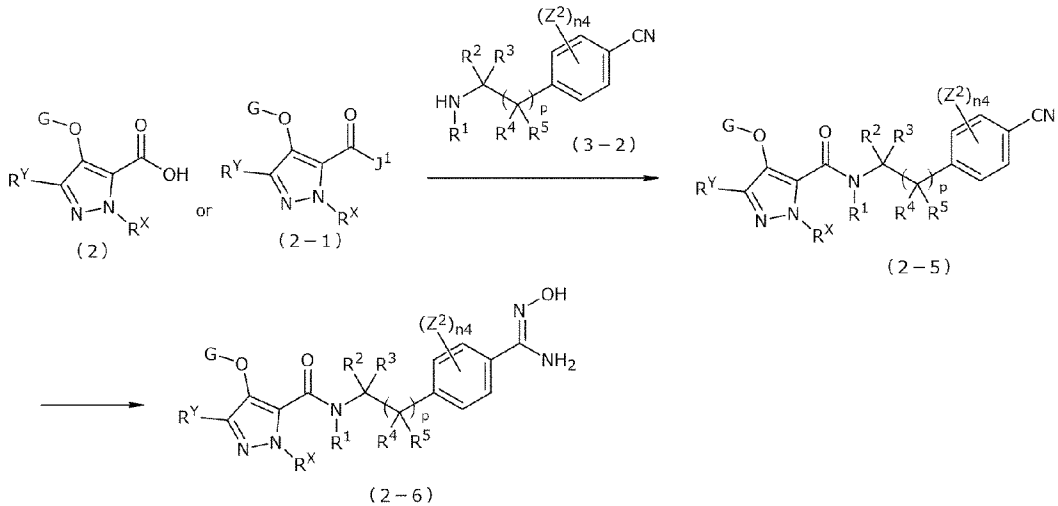
[0168] 工程3：化合物(2-4)は、化合物(2-3)と化合物(H)とを、文献記載の公知の方法、例えば国際公開第2008/156721号に記載の方法に準じて反応させることにより得ることができる。

[0169] 化合物(H)のあるものは公知化合物であり、一部は市販品として入手できる。また、それ以外のものも文献記載の一般的な公知化合物の合成方法に準じて製造することができる。

[0170] 製造例3で用いられる化合物(2-6)は、例えば、下記の反応式6で示される製造ルート(反応経路)にしたがって製造することができる。

[0171] [反応式6]

[0172] [化20]



[式中、G、R^X、R^Y、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、Z²、n₄及びpは前記と同じ意味を表す。]

工程1：化合物(2-5)は、化合物(2)又は化合物(2-1)と、化合物(3-2)とを、製造例1と同じ条件にて反応させることにより得ることができる。

[0173] 化合物(3-2)で表される化合物の一部は公知化合物であり、市販品として入手できる。また、化合物(3-2)で表されるそれ以外の化合物も文献記載の一般的な公知化合物の合成方法に準じて製造することができる。

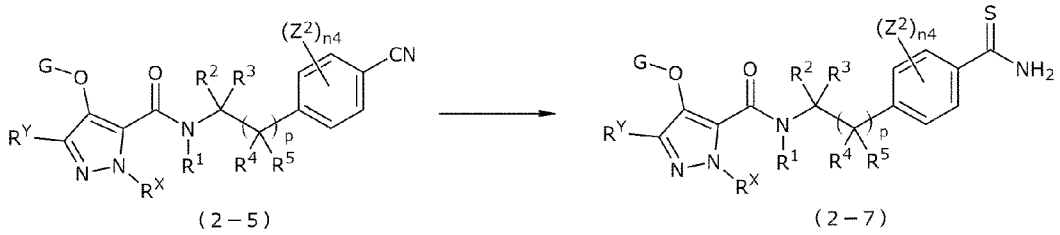
[0174] 工程2：化合物(2-6)は、化合物(2-5)を文献既知の公知の方法、例えば、国際公開第2009/082398号に記載の方法に準じて反応させることにより得ることができる。

[0175] 製造例4で用いられる化合物(2-7)は、例えば、下記の反応式7で示される製造ルート(反応経路)にしたがって製造することができる。

[0176] [反応式7]

[0177]

[化21]



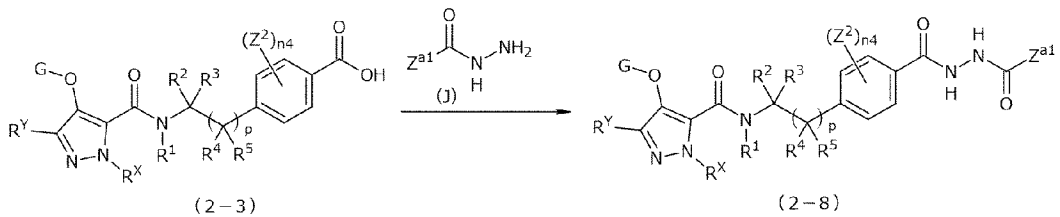
[式中、G、R^X、R^Y、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、Z²、n₄及びpは前記と同じ意味を表す。]

化合物(2-7)は、化合物(2-5)を文献既知の公知の方法、例えば、国際公開第2011/109799号に記載の方法に準じて反応させることにより得ることができる。

[0178] 製造例5で用いられる化合物(2-8)は、例えば、下記の反応式8で示される製造ルート(反応経路)にしたがって製造することができる。

[0179] [反応式8]

[0180] [化22]



[式中、G、R^X、R^Y、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、Z²、Z^{a1}、n₄及びpは前記と同じ意味を表す。]

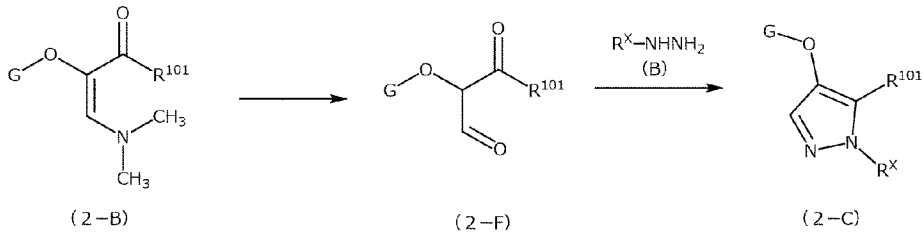
化合物(2-8)は、化合物(2-3)と化合物(J)とを、文献既知の公知の方法、例えば、国際公開第2008/016123号に記載の方法に準じて反応させることにより得ることができる。

[0181] 化合物(J)のあるものは公知化合物であり、一部は市販品として入手できる。また、それ以外のものも文献記載の一般的な公知化合物の合成方法に準じて製造することができる。

[0182] 化合物(2-C)は、例えば、下記の反応式で示される製造ルート(反応経路)にしたがって製造することができる。

[0183] [反応式 9]

[0184] [化23]



[式中、G、R^X及びR¹⁰¹は前記と同じ意味を表す。]

工程 1：化合物 (2-F) は、化合物 (2-B) を、水及び酸の存在下、加水分解することにより得ることができる。

[0185] 用いることのできる酸としては、例えば、塩酸、酢酸等が挙げられる。酸の使用量は、化合物 (2-B) 1 当量に対して、0.1～100 当量であり得る。

[0186] 溶媒を用いる場合、用いられる溶媒は反応に不活性であればよく、当該溶媒としては、例えば製造例 1 で例示の溶媒が挙げられる。

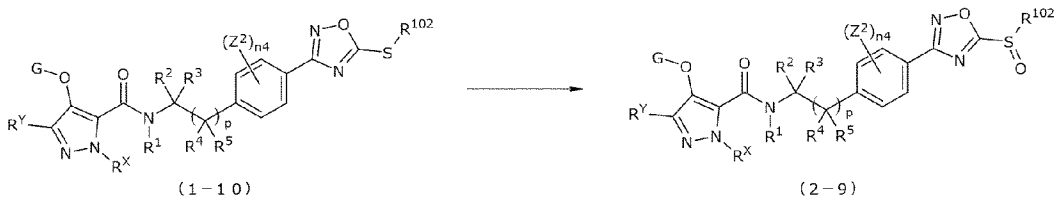
[0187] 反応温度及び反応時間は、製造例 1 に記載の温度範囲及び時間範囲で任意に設定できる。

[0188] 工程 2：化合物 (2-C) は、化合物 (2-F) と化合物 (B) 又はその塩（例えば、塩酸塩、臭化水素酸塩、ヨウ化水素酸塩、硫酸塩、トリフルオロ酢酸塩、シュウ酸塩又はパラートルエンスルホン酸塩等）とを、反応式 2 における工程 1 と同じ条件にて反応させることにより得ることができる。

[0189] 化合物 (2-9) は、例えば、下記の反応式で示される製造ルート（反応経路）にしたがって製造することができる。

[0190] [反応式 10]

[0191] [化24]



[G、R^X、R^Y、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R¹⁰²、Z²、n₄及びpは前記と同じ意味を表す。]

化合物(2-9)は、本発明の化合物(1-10)と酸化剤とを、溶媒中又は無溶媒で、反応させることで製造することができる。

[0192] 用いることのできる酸化剤としては、例えば、過酸化水素又はメタクロロ過安息香酸等が挙げられる。酸化剤の使用量は、化合物(1-10)1当量に対して、0.1~100当量であり得る。

[0193] 溶媒を用いる場合、用いられる溶媒は反応に不活性であればよく、当該溶媒としては、例えば製造例1で例示した溶媒が挙げられる。

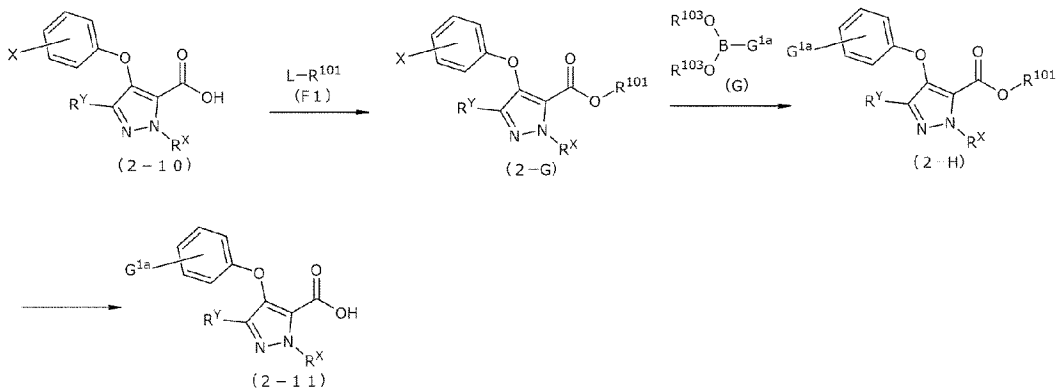
[0194] 反応温度及び反応時間は、製造例1に記載の温度範囲及び時間範囲で任意に設定できる。

[0195] 本発明の化合物(1-10)は製造例7の方法に準じて合成することができる。

[0196] 化合物(2-11)は、例えば下記の反応式11で示される製造ルートにしたがって製造することができる。

[0197] [反応式11]

[0198] [化25]



[式中、R¹⁰³は水素原子又はC₁~C₆アルキルを表し、G^{1a}はC₁~C₆アルキル又はC₃~C₆シクロアルキルを表し、L、X、R^X、R^Y及びR¹⁰¹は前記と同じ意味を表す。]

工程1：化合物(2-G)は、化合物(2-10)と、化合物(F1)と

を、溶媒中又は無溶媒で、塩基存在下で反応させることにより得ることができる。

[0199] 化合物（F 1）のあるものは公知化合物であり、一部は市販品として入手できる。また、それ以外のものも文献記載の一般的な公知化合物の合成方法に準じて製造することができる。

[0200] 化合物（F 1）の使用量としては、化合物（2-10）1当量に対して、0.5～50当量であり得る。

[0201] 溶媒を用いる場合、用いられる溶媒は反応に不活性であればよく、例えば製造例1で例示した溶媒が挙げられる。

[0202] 該反応で用いることのできる塩基としては、例えば、製造例1で例示の塩基が挙げられる。塩基の使用量は、化合物（2-10）1当量に対して、0.1～100当量であり得る。

[0203] 反応温度及び反応時間は、製造例1に記載の温度範囲、時間範囲である。

[0204] 化合物（2-10）は反応式1の方法に準じて合成することができる。

[0205] 工程2：化合物（2-H）は、化合物（2-G）と、化合物（G）とを、溶媒中又は無溶媒で、塩基存在下、必要に応じてパラジウム触媒及び配位子の存在下で反応させることにより得ることができる。

[0206] 化合物（G）のあるものは公知化合物であり、一部は市販品として入手できる。また、それ以外のものも文献記載の一般的な公知化合物の合成方法に準じて製造することができる。

[0207] 化合物（G）の使用量としては、化合物（2-G）1当量に対して、0.5～50当量であり得る。

[0208] 溶媒を用いる場合、用いられる溶媒は反応に不活性であればよく、例えば製造例1で例示した溶媒が挙げられる。

[0209] 該反応で用いることのできる塩基としては、例えば、製造例1で例示の塩基が挙げられる。塩基の使用量は、化合物（2-G）1当量に対して、0.1～100当量であり得る。

[0210] 該反応で用いることのできるパラジウム触媒としては、例えば、反応式1

で例示のパラジウム触媒が挙げられる。パラジウム触媒の使用量は、化合物(2-G) 1当量に対して、0.001~50当量であり得る。

[0211] 該反応で用いることのできる配位子としては、例えば、反応式1で例示の配位子が挙げられる。配位子の使用量は、化合物(2-G) 1当量に対して、0.001~50当量であり得る。

[0212] 反応温度及び反応時間は、製造例1に記載の温度範囲、時間範囲である。

[0213] 工程3：化合物(2-11)は、化合物(2-H)を溶媒中又は無溶媒で、場合によっては塩基存在下で反応させることにより得ることができる。

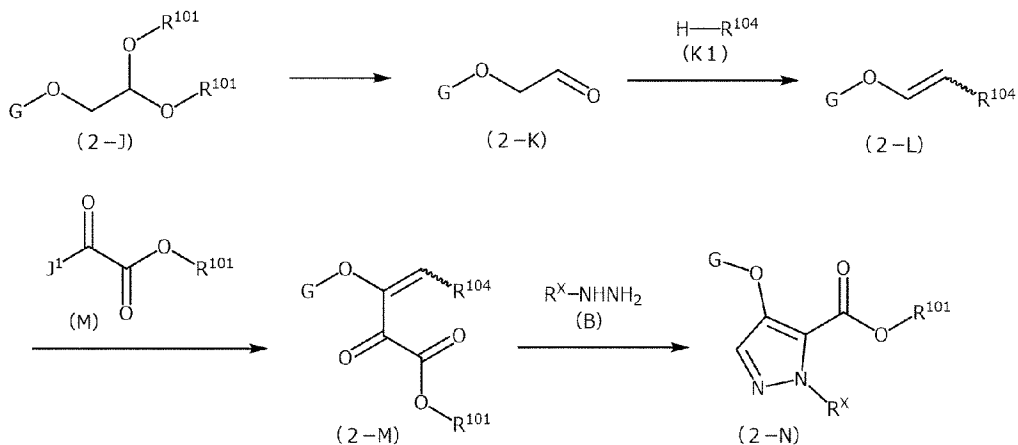
[0214] 該反応で用いることのできる塩基としては、例えば、製造例1で例示の塩基が挙げられる。塩基の使用量は、化合物(2-H) 1当量に対して、0.1~100当量であり得る。

[0215] 反応温度及び反応時間は、製造例1に記載の温度範囲、時間範囲である。

[0216] 化合物(2-N)は、例えば、下記の反応式12で示される製造ルート(反応経路)にしたがって製造することができる。

[0217] [反応式12]

[0218] [化26]



[式中、R¹⁰⁴はジ(C₁~C₆アルキル)アミノ、ピロリジン-1-イル、ピペリジン-1-イル又はモルホリン-1-イルを表し、G、J¹、R^X及びR¹⁰¹は前記と同じ意味を表す。]

工程1：化合物(2-K)は、化合物(2-J)を、溶媒中又は無溶媒で、酸存在下で加水分解させることにより得ることができる。

- [0219] 化合物（2-J）で表される化合物の一部は公知化合物であり、市販品として入手できる。また、化合物（2-J）で表されるそれ以外の化合物も文献記載の一般的な公知化合物の合成方法に準じて製造することができる。
- [0220] 用いることのできる酸としては、例えば、塩酸、酢酸、ギ酸、硫酸等が挙げられる。酸の使用量は、化合物（2-J）1当量に対して、0.1～100当量であり得る。
- [0221] 溶媒を用いる場合、用いられる溶媒は反応に不活性であればよく、当該溶媒としては、例えば製造例1で例示した溶媒が挙げられる。
- [0222] 反応温度及び反応時間は、製造例1に記載の温度範囲及び時間範囲で任意に設定できる。
- [0223] 工程2：化合物（2-L）は、化合物（2-K）と、化合物（K1）とを、溶媒中又は無溶媒で反応させることにより得ることができる。
- [0224] 化合物（K1）で表される化合物の一部は公知化合物であり、市販品として入手できる。また、化合物（K1）で表されるそれ以外の化合物も文献記載の一般的な公知化合物の合成方法に準じて製造することができる。
- [0225] 化合物（K1）の使用量としては、化合物（2-K）1当量に対して、0.5～50当量であり得る。
- [0226] 溶媒を用いる場合、用いられる溶媒は反応に不活性であればよく、当該溶媒としては、例えば製造例1で例示した溶媒が挙げられる。
- [0227] 反応温度及び反応時間は、製造例1に記載の温度範囲及び時間範囲で任意に設定できる。
- [0228] 工程3：化合物（2-M）は、化合物（2-L）と、化合物（M）とを、溶媒中又は無溶媒で、塩基存在下で反応させることにより得ることができる。
- [0229] 化合物（M）で表される化合物の一部は公知化合物であり、市販品として入手できる。また、化合物（M）で表されるそれ以外の化合物も文献記載の一般的な公知化合物の合成方法に準じて製造することができる。
- [0230] 化合物（M）の使用量としては、化合物（2-L）1当量に対して、0.

5～50当量であり得る。

[0231] 溶媒を用いる場合、用いられる溶媒は反応に不活性であればよく、当該溶媒としては、例えば製造例1で例示した溶媒が挙げられる。

[0232] 該反応で用いることのできる塩基としては、例えば、製造例1で例示の塩基が挙げられる。塩基の使用量は、化合物(2-L)1当量に対して、0.1～100当量であり得る。

[0233] 反応温度及び反応時間は、製造例1に記載の温度範囲及び時間範囲で任意に設定できる。

[0234] 工程4：化合物(2-N)は、化合物(2-M)と、化合物(B)又はその塩(例えば、塩酸塩、臭化水素酸塩、ヨウ化水素酸塩、硫酸塩、トリフルオロ酢酸塩、シュウ酸塩又はパラートルエンスルホン酸塩等)とを、溶媒中又は無溶媒で、場合によって酸存在下で反応させることにより得ることができる。

[0235] 化合物(B)又はその塩の使用量としては、化合物(2-M)1当量に対して、0.5～50当量であり得る。

[0236] 溶媒を用いる場合、用いられる溶媒は反応に不活性であればよく、当該溶媒としては、例えば製造例1で例示した溶媒が挙げられる。

[0237] 該反応で用いることのできる酸としては、例えば、反応式12における工程1で例示の酸が挙げられる。塩基の使用量は、化合物(2-M)1当量に対して、0.1～100当量であり得る。

[0238] 反応温度及び反応時間は、製造例1に記載の温度範囲及び時間範囲で任意に設定できる。

[0239] 本発明の化合物は、一般的には農園芸用の殺菌・殺かび剤として、ネコブカビ類、卵菌類、接合菌類、子囊菌類、担子菌類、不完全菌類、細菌類又はウイルスによる種々の病害に対し使用することができる。

[0240] 「病原菌」とは、植物の病害の病原となる微生物を意味し、具体的には、以下の微生物が挙げられるが、これらに限定されない。

Taphrina spp. (例えば、*Taphrina deformans*、*T. pruni*等)、*Pneumocystis*

spp., *Geotrichum* spp., *Candida* spp. (例えば、*Candida albicans*, *C. sobriosa*等)、*Pichia* spp. (例えば、*Pichia kluyveri*等)、*Capnodium* spp., *Fumago* spp., *Hypocapnodium* spp., *Cercospora* spp. (例えば、*Cercospora apii*, *C. asparagi*, *C. beticola*, *C. capsici*, *C. carotae*, *C. kaki*, *C. kikuchii*, *C. zonata*等)、*Cercosporidium* spp., *Cladosporium* spp. (例えば、*Cladosporium colocasiae*, *C. cucumerinum*, *C. variabile*等)、*Davidiella* spp., *Didymosporium* spp., *Heterosporium* spp. (例えば、*Heterosporium allii*等)、*Mycosphaerella* spp. (例えば、*Mycosphaerella arachidis*, *M. berkeleyi*, *M. cerasella*, *M. fijiensis*, *M. fragariae*, *M. graminicola*, *M. nawae*, *M. pinodes*, *M. pomi*, *M. zingiberis*等)、*Mycovellosiella* spp. (例えば、*Mycovellosiella fulva*, *M. natrassii*等)、*Paracercospora* spp. (例えば、*Paracercospora egenula*等)、*Phaeoisariopsis* spp., *Phaeoramularia* spp., *Pseudocercospora* spp. (例えば、*Pseudocercospora abelmoschi*, *P. fuligena*, *P. vitis*等)、*Pseudocercosporella* spp. (例えば、*Pseudocercosporella capsellae*等)、*Ramichloridium* spp., *Ramularia* spp., *Septogloeum* spp., *Septoria* spp. (例えば、*Septoria albopunctata*, *S. apiicola*, *S. chrysanthemella*, *S. helianthi*, *S. obesa*等)、*Sphaerulina* spp., *Aureobasidium* spp., *Kabatiella* spp., *Plowrightia* spp., *Stigmina* spp., *Elsinoe* spp. (例えば、*Elsinoe ampelina*, *E. araliae*, *E. fawcettii*等)、*Sphaceloma* spp. (例えば、*Sphaceloma caricae*等)、*Ascochyta* spp. (例えば、*Ascochyta pisi*等)、*Corynespora* spp. (例えば、*Corynespora cassiicola*等)、*Leptosphaeria* spp. (例えば、*Leptosphaeria coniothyrium*, *L. maculans*等)、*Saccharicola* spp., *Phaeosphaeria* spp. (例えば、*Phaeosphaeria nodorum*等)、*Ophiosphaerella* spp., *Setophoma* spp., *Helminthosporium* spp., *Alternaria* spp. (例えば、*Alternaria alternata*, *A. brassicae*, *A. brassicicola*, *A. citri*, *A. dauci*, *A. helianthi*, *A. japonica*, *A. kikuchiana*, *A. mali*, *A. panax*, *A. porri*, *A. radicina*, *A. solani*等)、*Bipolaris* spp. (例えば、*Bipolaris sorghicola*等)、*Coch*

liobolus spp. (例えば、Cochliobolus heterostrophus、C. lunatus、C. miyabeanus等)、Curvularia spp. (例えば、Curvularia geniculata、C. verruculosa等)、Drechslera spp.、Pleospora spp. (例えば、Pleospora herbarum等)、Pyrenophora spp. (例えば、Pyrenophora graminea、P. teres等)、Setosphaeria spp. (例えば、Setosphaeria turcica等)、Stemphylium spp. (例えば、Stemphylium botryosum、S. lycopersici、S. solani、S. vesicarium等)、Fusicladium spp.、Venturia spp. (例えば、Venturia carpophila、V. inaequalis、V. nashicola、V. pirina等)、Didymella spp. (例えば、Didymella bryoniae、D. fabae等)、Hendersonia spp.、Phoma spp. (例えば、Phoma erratica var. mikan、P. exigua var. exigua、P. wasabiae等)、Pyrenochaeta spp. (例えば、Pyrenochaeta lycopersici等)、Stagonospora spp. (例えば、Stagonospora sacchari等)、Botryosphaeria spp. (例えば、Botryosphaeria berengeriana f. sp. piricola、B. dothidea等)、Dothiorella spp.、Fusicoccum spp.、Guignardia spp.、Lasiodiplodia spp. (例えば、Lasiodiplodia theobromae等)、Macrophoma spp.、Macrophomina spp.、Neofusicoccum spp.、Phyllosticta spp. (例えば、Phyllosticta zingiberis等)、Schizothyrium spp. (例えば、Schizothyrium pomi等)、Acrospermum spp.、Leptosphaerulina spp.、Aspergillus spp.、Penicillium spp. (例えば、Penicillium digitatum、P. italicum、P. sclerotigenum等)、Microsporum spp.、Trichophyton spp. (例えば、Trichophyton mentagrophytes、T. rubrum等)、Histoplasma spp.、Blumeria spp. (例えば、Blumeria graminis f. sp. hordei、B. g. f. sp. tritici等)、Erysiphe spp. (例えば、Erysiphe betae、E. cichoracearum、E. c. var. cichoracearum、E. heraclei、E. pisi等)、Golovinomyces spp. (例えば、Golovinomyces cichoracearum var. latisporus等)、Leveillula spp. (例えば、Leveillula taurica等)、Microsphaera spp.、Oidium spp. (例えば、Oidium neolycopersici等)、Phyllactinia spp. (例えば、Phyllactinia kakicola、P. mali、P. moricola等)、Podosphaera spp. (例えば、Podosphaera fusca、P.

leucotricha, *P. pannosa*, *P. tridactyla* var. *tridactyla*, *P. xanthii*等)、*Sphaerotheca* spp. (例えば、*Sphaerotheca aphanis* var. *aphanis*, *S. fuliginea*等)、*Uncinula* spp. (例えば、*Uncinula necator*, *U. n.* var. *necator*等)、*Uncinuliella* spp. (例えば、*Uncinuliella simulans* var. *simulans*, *U. s.* var. *tandae*等)、*Blumeriella* spp. (例えば、*Blumeriella japii*等)、*Cylindrosporium* spp., *Diplocarpon* spp. (例えば、*Diplocarpon mali*, *D. mespili*, *D. rosae*等)、*Gloeosporium* spp. (例えば、*Gloeosporium minus*等)、*Marssonina* spp., *Tapesia* spp. (例えば、*Tapesia acuformis*, *T. yallundae*等)、*Lachnum* spp., *Scleromitrella* spp., *Botryotinia* spp. (例えば、*Botryotinia fuckeliana*等)、*Botrytis* spp. (例えば、*Botrytis allii*, *B. byssoidea*, *B. cinerea*, *B. elliptica*, *B. fabae*, *B. squamosa*等)、*Ciborinia* spp., *Grovesinia* spp., *Monilia mumeicola*, *Monilinia* spp. (例えば、*Monilinia fructicola*, *M. fructigena*, *M. laxa*, *M. mali*, *M. vaccinii-corymbosi*等)、*Sclerotinia* spp. (例えば、*Sclerotinia borealis*, *S. homoeocarpa*, *S. minor*, *S. sclerotiorum*等)、*Valdensia* spp. (例えば、*Valdensia heterodoxa*等)、*Claviceps* spp. (例えば、*Claviceps sorghi*, *C. sorghicola*等)、*Epichloe* spp., *Ephelis japonica*, *Villosiclava virens*, *Hypomyces* spp. (例えば、*Hypomyces solani* f. sp. *mori*, *H. s.* f. sp. *pisi*等)、*Trichoderma* spp. (例えば、*Trichoderma viride*等)、*Calonectria* spp. (例えば、*Calonectria ilicicola*等)、*Candelospora* spp., *Cylindrocarpon* spp., *Cylindrocladium* spp., *Fusarium* spp. (例えば、*Fusarium arthrosporioides*, *F. crookwellense*, *F. culmorum*, *F. cuneirostrum*, *F. oxysporum*, *F. o. f.* sp. *adzukicola*, *F. o. f.* sp. *allii*, *F. o. f.* sp. *asparagi*, *F. o. f.* sp. *batatas*, *F. o. f.* sp. *cepa*, *F. o. f.* sp. *colocasiae*, *F. o. f.* sp. *conglutinans*, *F. o. f.* sp. *cubense*, *F. o. f.* sp. *cucumerinum*, *F. o. f.* sp. *fabae*, *F. o. f.* sp. *fragariae*, *F. o. f.* sp. *lactucae*, *F. o. f.* sp. *lagenariae*, *F. o. f.* sp. *lycopersici*, *F. o. f.* sp. *melongenae*, *F. o. f.* sp. *melonis*, *F. o. f.* sp. *ne*

lumbinicola, *F. o. f. sp. niveum*, *F. o. f. sp. radialis-lycopersici*, *F. o. f. sp. raphani*, *F. o. f. sp. spinaciae*, *F. sporotrichioides*, *F. solani*, *F. s. f. sp. cucurbitae*, *F. s. f. sp. eumartii*, *F. s. f. sp. glycines*, *F. s. f. sp. pisi*, *F. s. f. sp. Radicicola*, *F. virguliforme* 等)、*Gibberella* spp. (例えば、*Gibberella avenacea*, *G. baccata*, *G. fujikuroi*, *G. zeae*等)、*Haematonectria* spp., *Nectria* spp., *Ophionectria* spp., *Caldariomyces* spp., *Myrothecium* spp., *Trichothecium* spp., *Verticillium* spp. (例えば、*Verticillium albo-atrum*, *V. dahliae*, *V. longisporum*等)、*Ceratocystis* spp. (例えば、*Ceratocystis ficicola*, *C. fimbriata*等)、*Thielaviopsis* spp. (例えば、*Thielaviopsis basicola*等)、*Adisciso* spp., *Monochaetia* spp., *Pestalotia* spp. (例えば、*Pestalotia eriobotrifolia*等)、*Pestalotiopsis* spp. (例えば、*Pestalotiopsis funerea*, *P. longiseta*, *P. neglecta*, *P. theae*等)、*Physalospora* spp., *Nemania* spp., *Nodulisporium* spp., *Rosellinia* spp. (例えば、*Rosellinia necatrix*等)、*Monographella* spp. (例えば、*Monographella nivalis*等)、*Ophiostoma* spp., *Cryphonectria* spp. (例えば、*Cryphonectria parasitica*等)、*Diaporthe* spp. (例えば、*Diaporthe citri*, *D. kyushuensis*, *D. nomurai*, *D. tanakae*等)、*Diaporthopsis* spp., *Phomopsis* spp. (例えば、*Phomopsis asparagi*, *P. fukushii*, *P. obscurans*, *P. vexans*等)、*Cryptosporella* spp., *Discula* spp. (例えば、*Discula theae-sinensis*等)、*Gnomonia* spp., *Coniella* spp., *Coryneum* spp., *Greeneria* spp., *Melanconis* spp., *Cytospora* spp., *Leucostoma* spp., *Valsa* spp. (例えば、*Valsa ceratosperma*等)、*Tubakia* spp., *Monosporascus* spp., *Clasterosporium* spp., *Gaeumannomyces* spp. (例えば、*Gaeumannomyces graminis*等)、*Magnaporthe* spp. (例えば、*Magnaporthe grisea*等)、*Pyricularia* spp. (例えば、*Pyricularia zingiberis*等)、*Monilochaetes infuscans*, *Colletotrichum* spp. (例えば、*Colletotrichum acutatum*, *C. capsici*, *C. cereale*, *C. destructivum*, *C. fragariae*, *C. lindemuthianum*, *C. nigrum*, *C. orbiculare*, *C. spinaciae*

等)、*Glomerella* spp. (例えば、*Glomerella cingulata*等)、*Khuskia oryzae*、*Phyllachora* spp. (例えば、*Phyllachora pomigena*等)、*Ellisembia* spp.、*Briosia* spp.、*Cephalosporium* spp. (例えば、*Cephalosporium gramineum*等)、*Epicoccum* spp.、*Gloeocercospora sorghi*、*Mycocentrospora* spp.、*Peltaster* spp. (例えば、*Peltaster fructicola*等)、*Phaeocystostroma* spp.、*Phialophora* spp. (例えば、*Phialophora gregata*等)、*Pseudophloeospora dioscoreae*、*Pseudoseptoria* spp.、*Rhynchosporium* spp. (例えば、*Rhynchosporium secalis*等)、*Sarocladium* spp.、*Coleophoma* spp.、*Helicoceras oryzae*等の子囊菌門 (Ascomycota) の菌類。*Septobasidium* spp. (例えば、*Septobasidium bogoriense*、*S. tanakae*等)、*Helicobasidium* spp. (例えば、*Helicobasidium longisporum*等)、*Coleosporium* spp. (例えば、*Coleosporium plectranthi*等)、*Cronartium* spp.、*Phakopsora* spp. (例えば、*Phakopsora artemisiae*、*P. nishidana*、*P. pachyrhizi*等)、*Physopella* spp. (例えば、*Physopella ampelopsidis*等)、*Kuehneola* spp. (例えば、*Kuehneola japonica*等)、*Phragmidium* spp. (例えば、*Phragmidium fusiforme*、*P. mucronatum*、*P. rosae-multiflorae*等)、*Gymnosporangium* spp. (例えば、*Gymnosporangium asiaticum*、*G. yamadae*等)、*Puccinia* spp. (例えば、*Puccinia allii*、*P. brachypodii* var. *poae-nemoralis*、*P. coronata*、*P. c.* var. *coronata*、*P. cynodontis*、*P. graminis*、*P. g.* subsp. *graminicola*、*P. hordei*、*P. horiana*、*P. kuehnii*、*P. melanocephala*、*P. recondita*、*P. striiformis* var. *striiformis*、*P. tanacetii* var. *tanacetii*、*P. tokyensis*、*P. zoysiae*等)、*Uromyces* spp. (例えば、*Uromyces phaseoli* var. *azukicola*、*U. p.* var. *phaseoli*、*Uromyces viciae-fabae* var. *viciae-fabae*等)、*Naohidemycetes vaccinii*、*Nyssopsora* spp.、*Leucotelium* spp.、*Tranzschelia* spp. (例えば、*Tranzschelia discolor*等)、*Aecidium* spp.、*Blastospora* spp. (例えば、*Blastospora smilacis*等)、*Uredo* spp.、*Sphaerolotheca* spp.、*Urocystis* spp.、*Sporisorium* spp. (例えば、*Sporisorium scitamineum*等)、*Ustilago* spp. (例えば、*Ustilago maydis*、*U. nuda*等)、

Entyloma spp., Exobasidium spp. (例えば、Exobasidium reticulatum, E. vexans等)、Microstroma spp., Tilletia spp. (例えば、Tilletia caries、T. controversa、T. laevis等)、Itersonilia spp. (例えば、Itersonilia perplexans等)、Cryptococcus spp., Bovista spp. (例えば、Bovista demoxantha等)、Lycoperdon spp. (例えば、Lycoperdon curtisii、L. perlatum等)、Conocybe spp. (例えば、Conocybe apala等)、Marasmius spp. (例えば、Marasmius oreades等)、Armillaria spp., Helotium spp., Lepista spp. (例えば、Lepista subnuda等)、Sclerotium spp. (例えば、Sclerotium cepivorum等)、Typhula spp. (例えば、Typhula incarnata、T. ishikariensis var. ishikariensis等)、Athelia spp. (例えば、Athelia rolfsii等)、Ceratobasidium spp. (例えば、Ceratobasidium cornigerum等)、Ceratohiza spp., Rhizoctonia spp. (例えば、Rhizoctonia solani等)、Thanatephorus spp. (例えば、Thanatephorus cucumeris等)、Laetisaria spp., Waitea spp., Fomitiporia spp., Ganoderma spp., Chondrostereum purpureum, Phanerochaete spp.等の担子菌門 (Basidiomycota) の菌類。Olpidium spp.等のツボカビ門 (Chitridiomycota) の菌類。Physoderma spp.等のコウマクノウキン門 (Blastocladiomycota) の菌類。Choanephora spp., Choanephoroidea cucurbitae, Mucor spp. (例えば、Mucor fragilis等)、Rhizopus spp. (例えば、Rhizopus arrhizus、R. chinensis、R. oryzae、R. stolonifer var. stolonifer等)等のケカビ亜門 (Mucoromycotina) の菌類。Plasmodiophora spp. (例えば、Plasmodiophora brassicae等)、Spongospora subterranea f. sp. Subterranea等のケルコゾア門 (Cercozoa) の原生生物。Aphanomyces spp. (例えば、Aphanomyces cochlioides、A. raphani等)、Albugo spp. (例えば、Albugo macrospora、A. wasabiae等)、Bremia spp. (例えば、Bremia lactucae等)、Hyaloperonospora spp., Peronosclerospora spp., Peronospora spp. (例えば、Peronospora alliariae-wasabi、P. chrysanthemi-coronarii、P. destructor、P. farinosa f. sp. spinaciae、P. manshurica、P. parasitica、P. sparsa等)、Plasmopara spp. (例えば、Plasmo

para halstedii、P. nivea、P. viticola等)、Pseudoperonospora spp. (例えば、Pseudoperonospora cubensis等)、Sclerophthora spp.、Phytophthora spp. (例えば、Phytophthora cactorum、P. capsici、P. citricola、P. citrophthora、P. cryptogea、P. fragariae、P. infestans、P. melonis、P. nicotianae、P. palmivora、P. porri、P. sojae、P. syringae、P. vignae f. sp. adzukicola等)、Pythium spp. (例えば、Pythium afertile、P. aphanidermatum、P. aploveroticum、P. aristosporum、P. arrhenomanes、P. buismaniae、P. debaryanum、P. graminicola、P. horinouchiense、P. irregulare、P. iwayamai、P. myriotylum、P. okanoganense、P. paddicum、P. paroecandrum、P. periplocum、P. spinosum、P. sulcatum、P. sylvaticum、P. ultimum var. ultimum、P. vanterpoolii、P. vexans、P. volutum等)等の不等毛植物門 (Heterokontophyta) の卵菌類 (Oomycetes)。Clavibacter spp. (例えば、Clavibacter michiganensis subsp. michiganensis等)、Curtobacterium spp.、Leifsonia spp. (例えば、Leifsonia xyli subsp. xyli等)、Streptomyces spp. (例えば、Streptomyces ipomoeae等)等の放線菌門 (Actinobacteria) のグラム陽性菌類。Clostridium sp.等のフィルミクテス門 (Firmicutes) のグラム陽性菌類。Phytoplasma等のテネリクテス門 (Tenericutes) のグラム陽性菌類。Rhizobium spp. (例えば、Rhizobium radiobacter等)、Acetobacter spp.、Burkholderia spp. (例えば、Burkholderia andropogonis、B. cepacia、B. gladioli、B. glumae、B. plantarii等)、Acidovorax spp. (例えば、Acidovorax avenae subsp. avenae、A. a. subsp. citrulli、A. konjacii等)、Herbaspirillum spp.、Ralstonia spp. (例えば、Ralstonia solanacearum等)、Xanthomonas spp. (例えば、Xanthomonas albilineans、X. arboricola pv. pruni、X. axonopodis pv. vitians、X. campestris pv. campestris、X. c. pv. cucurbitae、X. c. pv. glycines、X. c. pv. mangiferaeindicae、X. c. pv. nigromaculans、X. c. pv. vesicatoria、X. citri subsp. citri、X. oryzae pv. oryzae等)、Pseudomonas spp. (例えば、Pseudomonas cichorii、P. fluorescens、P. marginalis、P.

m. pv. marginalis、P. savastanoi pv. glycinea、P. syringae、P. s. pv. actinidiae、P. s. pv. eriobotryae、P. s. pv. helianthi、P. s. pv. lachrymans、P. s. pv. maculicola、P. s. pv. mori、P. s. pv. morsprunorum、P. s. pv. spinaciae、P. s. pv. syringae、P. s. pv. theae、P. viridiflava等)、Rhizobacter spp.、Brenneria spp. (例えば、Brenneria nigrifluens等)、Dickeya spp. (例えば、Dickeya dianthicola、D. zeae等)、Erwinia spp. (例えば、Erwinia amylovora、E. rhapontici等)、Pantoea spp.、Pectobacterium spp. (例えば、Pectobacterium atrosepticum、P. carotovorum、P. wasabiae等)等のプロテオバクテリア門 (Proteobacteria) のグラム陰性菌類。

[0241] これら病原菌の感染・増殖によって引き起こされる植物病害の具体例としては、以下の植物病害が挙げられるが、これらに限定されない。

[0242] モモ縮葉病Leaf curl (Taphrina deformans)、スモモふくろ実病Plum pockets (Taphrina pruni)、アスパラガス褐斑病Leaf spot (Cercospora asparagi)、テンサイ褐斑病Cercospora leaf spot (Cercospora beticola)、ピーマン斑点病Frogeye leaf spot (Cercospora capsici)、カキ角斑落葉病Angular leaf spot (Cercospora kaki)、ダイズ紫斑病Purple stain (Cercospora kikuchii)、ラッカセイ褐斑病Brown Leaf spot (Mycosphaerella arachidis)、オウトウ褐色せん孔病Cylindrosporium leaf spot (Mycosphaerella cerasella, Blumeriella jaapii)、ブラックシガトカ病Black sigatoka (Mycosphaerella fijiensis)、イエローシガトカ病Yellow sigatoka (Mycosphaerella musicola)、コムギ葉枯病Speckled leaf blotch (Mycosphaerella graminicola)、カキ円星落葉病Circular leaf spot (Mycosphaerella nawae)、エンドウ褐紋病Mycosphaerella blight (Mycosphaerella pinodes)、ミョウガ葉枯病Leaf spot (Mycosphaerella zingiberis)、トマト葉かび病Leaf mold (Mycovellosiella fulva)、ナスすすかび病Leaf mold (Mycovellosiella natrassii)、トマトすすかび病Cercospora leaf mold (Pseudocercospora fuligena)、ブドウ褐斑病Isariopsis leaf spot (Pseudocercospora v

itis)、ハクサイ白斑病Leaf spot (*Pseudocercospora capsellae*)、キク黒斑病Leaf spot (*Septoria chrysanthemella*)、キク褐斑病Leaf blight (*Septoria obesa*)、ブドウ黒とう病Anthracnose (*Elsinoe ampelina*)、タラノキそうか病Spot anthracnose (*Elsinoe araliae*)、カンキツそうか病Scab (*Elsinoe fawcettii*)、エンドウ褐斑病Leaf spot (*Ascochyta pisi*)、キュウリ褐斑病Corynespora leaf spot (*Corynespora cassiicola*)、バラ枝枯病Stem canker (*Leptosphaeria coniothyrium*)、コムギふ枯病Glume blotch (*Leptosphaeria nodorum*)、バラ黒斑病Leaf spot (*Alternaria alternata*)、キャベツ黒斑病Alternaria leaf spot (*Alternaria brassicae*)、ニンジン黒葉枯病Leaf blight (*Alternaria dauci*)、ナシ黒斑病Black spot (*Alternaria kikuchiana*)、リンゴ斑点落葉病Alternaria blotch (*Alternaria mali*)、ネギ黒斑病Alternaria leaf spot (*Alternaria porri*)、ソルガム紫斑点病Target spot (*Bipolaris sorghicola*)、トウモロコシごま葉枯病Southern leaf blight (*Cochliobolus heterostrophus*)、イネごま葉枯病Brown spot (*Cochliobolus miyabeanus*)、ニンニク葉枯病Tip blight (*Pleospora herbarum*)、オオムギ斑葉病Stripe (*Pyrenophora graminea*)、オオムギ網斑病Net blotch (*Pyrenophora teres*)、ソルガムすす紋病Leaf blight (*Setosphaeria turcica*)、トウモロコシすす紋病Northern leaf blight (*Setosphaeria turcica*)、アスパラガス斑点病Leaf spot (*Stemphylium botryosum*)、バラ科サクラ亜科の黒星病Scab (*Venturia carpophila*)、リンゴ黒星病Scab (*Venturia Inaequalis*)、ナシ黒星病Scab (*Venturia nashicola*)、ウリ科のつる枯病Gummy stem blight (*Didymella bryoniae*)、ゴボウ黒斑病Leaf spot (*Phoma exigua* var. *exigua*)、ワサビ墨入病Streak (*Phoma wasabiae*)、バラ科ナシ亜科の輪紋病Ring rot (*Botryosphaeria berengeriana* f. sp. *piricola*)、キウイフルーツ果実軟腐病Soft rot (*Botryosphaeria dothidea*, *Lasiodiplodia theobromae*, *Diaporthe* sp.)、カンキツ緑かび病Common green mold (*Penicillium digitatum*)、カンキツ青かび病Blue mold (*Penicillium italicum*)、各種作物に発生するうどんこ病Powdery mildew、

オオムギうどんこ病 (*Blumeria graminis* f. sp. *hordei*)、コムギうどんこ病 (*Blumeria graminis* f. sp. *tritici*)、キュウリうどんこ病 (*Erysiphe betae*, *Leveillula taurica*, *Oidium* sp., *Podosphaera xanthii*)、ナスうどんこ病 (*Erysiphe cichoracearum*, *Leveillula taurica*, *Sphaerotheca fuliginea*)、ニンジン、パセリのうどんこ病 (*Erysiphe heraclei*)、エンドウうどんこ病 (*Erysiphe pisi*)、トマトうどんこ病 (*Leveillula taurica*, *Oidium neolycopersici*, *Oidium* sp.)、ピーマンうどんこ病 (*Leveillula taurica*)、カボチャうどんこ病 (*Oidium* sp., *Podosphaera xanthii*)、ニガウリうどんこ病 (*Oidium* sp.)、カキうどんこ病 (*Phyllactinia kakicola*)、ゴボウうどんこ病 (*Podosphaera fusca*)、リンゴうどんこ病 (*Podosphaera leucotricha*)、バラうどんこ病 (*Podosphaera pannosa*, *Uncinuliella simulans* var. *simulans*, *U. s.* var. *tandae*)、ズッキーニ、マクワウリのうどんこ病 (*Podosphaera xanthii*)、イチゴうどんこ病 (*Sphaerotheca aphanis* var. *aphanis*)、スイカ、メロンのうどんこ病 (*Sphaerotheca fuliginea*)、ブドウうどんこ病 (*Uncinula necator*, *U. n.* var. *necator*)、リンゴ褐斑病Blotch (*Diplocarpon mali*)、バラ黒星病Black spot (*Diplocarpon rosae*)、タマネギ灰色腐敗病Gray mold neck rot (*Botrytis allii*)、灰色かび病Gray mold、*Botrytis blight* (*Botrytis cinerea*)、ニラ白斑葉枯病Leaf blight (*Botrytis cinerea*, *B. byssoidea*, *B. squamosa*)、ソラマメ赤色斑点病Chocolate spot (*Botrytis cinerea*, *B. elliptica*, *B. fabae*)、バラ科の灰星病Brown rot (*Monilinia fructicola*, *M. fructigena*, *M. laxa*)、リンゴモニリア病Blossom blight (*Monilinia mali*)、シバダラースポット病Dollar spot (*Sclerotinia homoeocarpa*)、菌核病Cottony rot、*Sclerotinia rot*、Stem rot (*Sclerotinia sclerotiorum*)、稲こうじ病False smut (*Villosiclava virens*)、ダイズ黒根腐病Root necrosis (*Calonectria illicicola*)、コムギ赤かび病Fusarium blight (*Fusarium crookwellense*, *F. culmorum*, *Gibberella avenacea*, *G. zeae*, *Monographella nivalis*)、オオムギ赤かび病Fusarium blight (*Fusarium culmorum*, *Gibberella avenacea*)

, *G. zeae*)、コンニャク乾腐病Dry rot (*Fusarium oxysporum*, *F. solani* f. sp. *radicicola*)、ヤマノイモ褐色腐敗病Brown rot (*Fusarium oxysporum*, *F. solani* f. sp. *pisi*, *F. s. f. sp. radicicola*)、アズキ萎凋病*Fusarium wilt* (*Fusarium oxysporum* f. sp. *adzukicola*)、ラッキョウ乾腐病*Fusarium basal rot* (*Fusarium oxysporum* f. sp. *allii*, *F. solani* f. sp. *radicicola*)、サツマイモつる割病Stem rot (*Fusarium oxysporum* f. sp. *batatas*, *F. solani*)、サトイモ乾腐病Dry rot (*Fusarium oxysporum* f. sp. *colocasiae*)、キャベツ、コマツナの萎黄病Yellows (*Fusarium oxysporum* f. sp. *conglutinans*)、バナナパナマ病Panama disease (*Fusarium oxysporum* f. sp. *cubense*)、イチゴ萎黄病*Fusarium wilt* (*Fusarium oxysporum* f. sp. *fragariae*)、レタス根腐病Root rot (*Fusarium oxysporum* f. sp. *lactucae*)、スイカつる割病*Fusarium wilt* (*Fusarium oxysporum* f. sp. *lagenariae*, *F. o. f. sp. niveum*)、トマト萎凋病*Fusarium wilt* (*Fusarium oxysporum* f. sp. *lycopersici*)、メロンつる割病*Fusarium wilt* (*Fusarium oxysporum* f. sp. *melonis*)、ダイコン萎黄病Yellows (*Fusarium oxysporum* f. sp. *raphani*)、ハウレンソウ萎凋病*Fusarium wilt* (*Fusarium oxysporum* f. sp. *spinaciae*)、ダイズ急性枯死症Soybean Sudden Death Syndrome (*Fusarium solani* f. sp. *Glycines*, *Fusarium virguliforme*)、イネばか苗病 “Bakanae” disease (*Gibberella fujikuroi*)、ダイコンバーティシリウム黒点病*Verticillium black spot* (*Verticillium albo-atrum*, *V. dahliae*)、トマト、ナス、フキの半身萎凋病*Verticillium wilt* (*Verticillium dahliae*)、イチジク株枯病*Ceratocystis canker* (*Ceratocystis ficicola*)、サツマイモ黒斑病Black rot (*Ceratocystis fimbriata*)、チャ輪斑病Gray blight (*Pestalotiopsis longiseta*, *P. theae*)、クリ胴枯病*Endothia canker* (*Cryphonectria parasitica*)、カンキツ黒点病Melanose (*Diaporthe citri*)、アスパラガス茎枯病Stem blight (*Phomopsis asparagi*)、ナシ胴枯病*Phomopsis canker* (*Phomopsis fukushii*)、ナス褐紋病Brown spot (*Phomopsis vexans*)、チャ炭疽病Anthracnose (*Discula theae-sinensis*)、リンゴ腐らん

病Valsa canker (*Valsa ceratosperma*)、イネいもち病Blast (*Magnaporthe grisea*)、イチゴ炭疽病Crown rot (*Colletotrichum acutatum*, *C. fragariae*, *Glomerella cingulata*)、リンゴ炭疽病Bitter rot (*Colletotrichum acutatum*, *Glomerella cingulata*)、オウトウ炭疽病Anthracnose (*Colletotrichum acutatum*, *Glomerella cingulata*)、スモモ炭疽病Anthracnose (*Colletotrichum acutatum*)、ブドウ晩腐病Ripe rot (*Colletotrichum acutatum*, *Glomerella cingulata*)、シュンギク炭疽病Anthracnose (*Colletotrichum acutatum*)、インゲンマメ炭疽病Anthracnose (*Colletotrichum lindemuthianum*)、ウリ科の炭疽病Anthracnose (*Colletotrichum orbiculare*)、ヤマノイモ炭疽病Anthracnose (*Glomerella cingulata*)、クリ炭疽病Anthracnose (*Glomerella cingulata*)、カキ炭疽病Anthracnose (*Glomerella cingulata*)、アズキ落葉病Brown stem rot (*Phialophora gregata*)、ナガイモ葉渋病Leaf spot (*Pseudophloeospora dioscoreae*)、オオムギ雲形病Scald (*Rhynchosporium secalis*)、コムギ赤さび病Brown rust (*Puccinia recondita*)、コムギ黄さび病Stripe rust (*Puccinia striiformis*)、各種作物に発生するさび病Rust、イチジクさび病 (*Phakopsora nishidana*)、ダイズさび病 (*Phakopsora pachyrhizi*)、バラさび病 (*Kuehneola japonica*, *Phragmidium fusiforme*, *P. mucronatum*, *P. rosae-multiflorae*)、ナシ赤星病 (*Gymnosporangium asiaticum*)、リンゴ赤星病 (*Gymnosporangium yamadae*)、ネギ科のさび病 (*Puccinia allii*)、キク白さび病 (*Puccinia horiana*)、キク黒さび病 (*Puccinia tanacetii* var. *tanacetii*)、ソラマメさび病 (*Uromyces viciae-fabae* var. *viciae-fabae*)、サトウキビ黒穂病 (*Sporisorium scitamineum*)、トウモロコシ黒穂病 (*Ustilago maydis*)、オオムギ裸黒穂病Loose smut (*Ustilago nuda*)、チャ網もち病Net blister blight (*Exobasidium reticulatum*)、チャもち病Blister blight (*Exobasidium vexans*)、白絹病Stem rot、Southern blight (*Athelia rolfsii*)、キク立枯病Root and stem rot (*Ceratobasidium cornigerum*, *Rhizoctonia solani*)、ショウガ紋枯病 (*Rhizoctonia solani*)、キャベツ苗立枯病Damping-off (*Rhizoctonia so*

lani)、ミツバ立枯病Damping-off (*Rhizoctonia solani*)、レタスすそ枯病 Bottom rot (*Rhizoctonia solani*)、シバ葉腐病Brown patch、Large patch (*Rhizoctonia solani*)、イネ紋枯病Sheath blight (*Thanatephorus cucumeris*)、テンサイ根腐病Root rot (*Thanatephorus cucumeris*)、テンサイ葉腐病Leaf blight (*Thanatephorus cucumeris*)、イチジク黒かび病Rhizopus rot (*Rhizopus stolonifer* var. *stolonifer*)、アブラナ科野菜根こぶ病Clu broot (*Plasmodiophora brassicae*)、テンサイ黒根病Aphanomyces root rot (*Aphanomyces cochlioides*)、アブラナ科の白さび病White rust (*Albugo macrospora*)、各種の作物に発生するべと病Downy mildew、レタスべと病 (*Bremia lactucae*)、シュンギクべと病 (*Peronospora chrysanthemi-coronarii*)、タマネギ、ネギのべと病 (*Peronospora destructor*)、ホウレンソウべと病 (*Peronospora farinosa* f. sp. *spinaciae*)、ダイズべと病 (*Peronospora manshurica*)、アブラナ科のべと病 (*Peronospora parasitica*)、バラべと病 (*Peronospora sparsa*)、ヒマワリべと病 (*Plasmopara halstedii*)、ミツバべと病 (*Plasmopara nivea*)、ブドウべと病 (*Plasmopara viticola*)、ウリ科のべと病 (*Pseudoperonospora cubensis*)、タラノキ立枯疫病Phytophthora root rot (*Phytophthora cactorum*)、スイカ褐色腐敗病Brown rot (*Phytophthora capsici*)、カボチャ疫病Phytophthora rot (*Phytophthora capsici*)、ピーマン疫病Phytophthora blight (*Phytophthora capsici*)、スイカ疫病Phytophthora rot (*Phytophthora cryptogea*)、トマト、ジャガイモの疫病Late blight (*Phytophthora infestans*)、イチジク疫病White powdery rot (*Phytophthora palmivora*)、ネギ科の白色疫病Leaf blight (*Phytophthora porri*)、ダイズ茎疫病Phytophthora root and stem rot (*Phytophthora sojae*)、アズキ茎疫病Phytophthora stem rot (*Phytophthora vignae* f. sp. *adzukicola*)、ホウレンソウ立枯病Damping-off (*Pythium aphanidermatum*, *P. myriotylum*, *P. paroecandrum*, *P. ultimum* var. *ultimum*)、コンニャク根腐病Root rot (*Pythium aristosporum*)、トウモロコシ根腐病Browning root rot (*Pythium arrhenomanes*, *P. graminicola*)、キャベツ苗

立枯病Damping-off (*Pythium buismaniae*, *P. myriotylum*)、ミョウガ根茎腐敗病Root rot (*Pythium myriotylum*)、ショウガ根茎腐敗病Root rot (*Pythium myriotylum*, *P. ultimum* var. *ultimum*)、ニンジンしみ腐病Brown blotched root rot (*Pythium sulcatum*)、トマトかいよう病Bacterial canker (*Clavibacter michiganensis* subsp. *michiganensis*)、ジャガイモそうか病Scab (*Streptomyces* spp.)、バラ根頭がんしゅ病Crown gall (*Rhizobium radiobacter*)、ソルガム条斑細菌病Bacterial stripe (*Burkholderia andropogonis*)、タマネギ腐敗病Soft rot (*Burkholderia cepacia*, *Pseudomonas marginalis* pv. *marginalis*, *Erwinia rhapontici*)、イネもみ枯細菌病Bacterial grain rot (*Burkholderia gladioli*, *B. glumae*)、スイカ果実汚斑細菌病Bacterial fruit blotch (*Acidovorax avenae* subsp. *citrulli*)、コンニャク葉枯病Bacterial leaf blight (*Acidovorax konjaci*)、青枯病Bacterial wilt (*Ralstonia solanacearum*)、モモせん孔細菌病Bacterial shot hole (*Xanthomonas arboricola* pv. *pruni*, *Pseudomonas syringae* pv. *syringae*, *Brenneria nigrifluens*)、スモモ黒斑病Bacterial leaf spot (*Xanthomonas arboricola* pv. *pruni*)、レタス斑点細菌病Bacterial spot (*Xanthomonas axonopodis* pv. *vitians*)、アブラナ科の黒腐病Black rot (*Xanthomonas campestris* pv. *campestris*)、ダイズ葉焼病Bacterial pustule (*Xanthomonas campestris* pv. *glycines*)、ゴボウ黒斑細菌病Bacterial spot (*Xanthomonas campestris* pv. *nigromaculans*)、ピーマン斑点細菌病Bacterial spot (*Xanthomonas campestris* pv. *vesicatoria*)、カンキツかいよう病Citrus canker (*Xanthomonas citri* subsp. *citri*)、ニンニク春腐病 (*Pseudomonas cichorii*, *P. marginalis* pv. *marginalis*, *Erwinia* sp.)、レタス腐敗病Bacterial rot (*Pseudomonas cichorii*, *P. marginalis* pv. *marginalis*, *P. viridiflava*)、キウイフルーツ花腐細菌病Bacterial blossom blight (*Pseudomonas marginalis* pv. *marginalis*, *P. syringae* pv. *syringae*, *P. viridiflava*)、キウイフルーツかいよう病Bacterial canker (*Pseudomonas syringae* pv. *actinidiae*)、ビワがんしゅ病Canker (*Pseudomonas syringae* pv.

eriobotryae)、ウリ科の斑点細菌病Bacterial spot (*Pseudomonas syringae* pv. *lachrymans*)、アブラナ科の黒斑細菌病Bacterial black spot (*Pseudomonas syringae* pv. *maculicola*)、ウメかいよう病Bacterial canker (*Pseudomonas syringae* pv. *morsprunorum*, *Erwinia* sp.)、チャ赤焼病Bacterial shoot blight (*Pseudomonas syringae* pv. *theae*)、ネギ軟腐病Bacterial soft rot (*Dickeya* sp., *Pectobacterium carotovorum*)、バラ科ナシ亜科の火傷病Fire blight (*Erwinia amylovora*)、コンニャク腐敗病Soft rot (*Pectobacterium carotovorum*)、軟腐病Bacterial soft rot (*Pectobacterium carotovorum*)。

[0243] 農園芸作物の病害に対する防除剤の開発が進み、多種多様な薬剤が今日まで実用に供されてきた。しかしながら、こうした薬剤の長年にわたる使用により、近年、病原菌が薬剤抵抗性を獲得し、従来用いられてきた既存の殺菌剤による防除が困難となる場面が増えてきている。また、既存の薬剤の一部のものは毒性が高く、あるものは環境中に長期間残留することにより、生態系を攪乱するという問題も顕在化しつつある。このような状況下、本発明の化合物は、多くの病原菌に対して優れた防除活性を有し、かつ、対象となる作物に対する高い安全性を有する。また、本発明の化合物は、既存の殺菌剤に対して抵抗性を獲得した病原菌に対しても、十分な防除効果を発揮し得る。さらに、本発明の化合物は、対象となる作物に薬害を生じることがなく、ホ乳類、魚類及び益虫に対してほとんど悪影響を及ぼさず、低残留性で環境に対する負荷も軽い。

[0244] 本発明の化合物は、農園芸用殺菌剤としての使用以外に、抗真菌剤又は内部寄生虫防除剤として利用される医療用抗菌剤及び動物用抗菌剤、木材、紙・パルプ、接着剤・塗料、繊維及び皮革等の防菌・防かび剤、並びに製造工場の冷却水路等の工業用殺菌剤としても使用できる。

[0245] 医療用抗菌剤又は動物用抗菌剤として対象となる病原菌としては、例えば、*Trichophyton rubrum*及び*Trichophyton mentagrophytes*等の白癬菌類、*Candida albicans*等のカンジダ菌類、*Aspergillus fumigatus*等のアスペルギル

ス菌類、*Cryptococcus neoformas*等のクリプトコックス菌類、大腸菌 (*Escherichia coli*)、緑膿菌 (*Pseudomonas aeruginosa*) 及びインフルエンザ菌 (*Haemophilus influenzae*) 等のグラム陰性細菌類、黄色ブドウ球菌 (*Staphylococcus aureus*) 及び化膿レンサ球菌 (*Streptococcus pyogenes*) 等のグラム陽性細菌類等が挙げられるが、これらのみに限定されない。

[0246] 防菌・防かび剤として対象となる菌株としては、例えば、*Tyromyces palustris*及び*Coriolus versicolor*等の木材腐朽菌類、*Aspergillus niger*、*Aspergillus terreus*、*Eurotium tonophilum*、*Penicillium citrinum*、*Penicillium funiculosum*、*Rhizopus oryzae*、*Cladosporium cladosporioides*、*Aureobasidium pullulans*、*Gliocladium virens*、*Chaetomium globosum*、*Fusarium moniliforme*及び*Myrothecium verrucaria*等の資材の劣化微生物類等が挙げられるが、これらのみに限定されない。

[0247] 工業用殺菌剤として対象となる菌株としては、例えば、*Sphaerotilis natans*及び*Zoogloea ramigera*等のスライム菌類等が挙げられるが、これらのみに限定されない。

[0248] 本発明の化合物は、農園芸用殺菌剤としての使用以外に、家畜、家禽又は愛玩動物等の内部寄生虫防除剤としても使用できる。

[0249] 対象となる内部寄生虫としては、以下の具体例が挙げられるが、これらのみに限定されない。

[0250] ヘモンクス属 (*Haemonchus*)、トリコストロンギルス属 (*Trichostrongylus*)、オステルターギヤ属 (*Ostertagia*)、ネマトディルス属 (*Nematodirus*)、クーペリア属 (*Cooperia*)、アスカリス属 (*Ascaris*)、ブノストムーム属 (*Bunostomum*)、エスファゴストムーム属 (*Oesophagostomum*)、チャベルチア属 (*Chabertia*)、トリキュリス属 (*Trichuris*)、ストロンギルス属 (*Stongylus*)、トリコネマ属 (*Trichonema*)、ディクチオカウルス属 (*Dictyocaulus*)、キャピラリア属 (*Capillaria*)、ヘテラキス属 (*Heterakis*)、トキシカラ属 (*Toxocara*)、アスカリディア属 (*Ascaridia*)、オキシウリス属 (*Oxyuris*)、アンキロストーマ属 (*Ancylostoma*)、ウンシナリア属 (*Uncinaria*)、

inaria)、トキサスカリス属 (*Toxascaris*)、パラスカリス属 (*Parascaris*) 等の線虫類；

ブツヘレリア属 (*Wuchereria*)、ブルージャ属 (*Brugia*)、オンコセルカ属 (*Onchoceca*)、ディロフィラリア属 (*Dirofilaria*)、ロア糸状虫属 (*Loa*) 等のフィラリア科 (*Filariidae*) 線虫類；

ドラクンクルス属 (*Dracunculus*) 等の蛇状線虫科 (*Dracunculidae*) 線虫類；

犬条虫 (*Dipylidium caninum*)、猫条虫 (*Taenia taeniaeformis*)、有鉤条虫 (*Taenia solium*)、無鉤条虫 (*Taenia saginata*)、縮小条虫 (*Hymenolepis diminuta*)、ベネデン条虫 (*Moniezia benedeni*)、広節裂頭条虫 (*Diphyllobothrium latum*)、マンソン裂頭条虫 (*Diphyllobothrium erinacei*)、単包条虫 (*Echinococcus granulosus*)、多包条虫 (*Echinococcus multilocularis*) 等の条虫類；

肝蛭 (*Fasciola hepatica*, *F. gigantica*)、ウエステルマン肺吸虫 (*Paragonimus westermanii*)、肥大吸虫 (*Fasciolopsis buski*)、臍吸虫 (*Eurytrema pancreaticum*, *E. coelomaticum*)、肝吸虫 (*Clonorchis sinensis*)、日本住血吸虫 (*Schistosoma japonicum*)、ビルハルツ住血吸虫 (*Schistosoma haematobium*)、マンソン住血吸虫 (*Schistosoma mansoni*) 等の吸虫類；

エイメリア・テネラ (*Eimeria tenella*)、エイメリア・アセルブリナ (*Eimeria acervulina*)、エイメリア・ブルネッチ (*Eimeria brunetti*)、エイメリア・マクシマ (*Eimeria maxima*)、エイメリア・ネカトリクス (*Eimeria necatrix*)、エイメリア・ボビス (*Eimeria bovis*)、エイメリア・オビノイダリス (*Eimeria ovinoidalis*) のようなエイメリア類 (*Eimeria* spp.)；

クルーズトリパノソーマ (*Trypanosoma cruzi*)、リーシュマニア類 (*Leishmania* spp.)、マラリア原虫 (*Plasmodium* spp.)、バベシア類 (*Babesia* spp.)、トリコモナス類 (*Trichomonadidae* spp.)、ヒストモナス類 (*Histomonas* spp.)、ジアルディア類 (*Giardia* spp.)、トキソプラズマ類 (*Toxoplasma* spp.)、赤痢アメーバ (*Entamoeba histolytica*)

a)、タイレリア類 (*Theileria* spp.) 等。

[0251] 本発明の化合物は、農園芸用殺菌剤としての使用以外に、抗真菌剤としても使用できる。

[0252] 抗真菌剤として対象となる病原菌としては、以下の具体例が挙げられるが、これらのみ限定されない。

[0253] *Trichophyton rubrum*及び*Trichophyton mentagrophytes*等の白癬菌類、*Candida albicans*等のカンジダ菌類、*Aspergillus fumigatus*等のアスペルギルス菌類、*Cryptococcus neoformans*等のクリプトコックス菌類等。

[0254] 本発明の化合物を植物病害及び植物害虫防除剤として施用するにあたっては、通常は、本発明の化合物を、適当な固体担体又は液体担体と混合し、更に所望により、界面活性剤、浸透剤、展着剤、増粘剤、凍結防止剤、結合剤、固結防止剤、崩壊剤又は分解防止剤等を添加して、液剤 (Soluble concentrate)、乳剤 (emulsifiable concentrate)、水和剤 (wetable powder)、水溶剤 (water soluble powder)、顆粒水和剤 (water dispersible granule)、顆粒水溶剤 (water soluble granule)、懸濁剤 (suspension concentrate)、乳濁剤 (concentrated emulsion)、サスポエマルジョン (suspoemulsion)、マイクロエマルジョン (microemulsion)、粉剤 (dustable powder)、粒剤 (granule) 又はゲル剤 (gel) 等の任意の剤型の製剤にて実用に供することができる。また、省力化及び安全性向上の観点から、上記任意の剤型の製剤を水溶性包装体に封入して供することもできる。

[0255] 固体担体としては、例えば、石英、カオリナイト、パイロフィライト、セリサイト、タルク、ベントナイト、酸性白土、アタパルジャイト、ゼオライト又は珪藻土等の天然鉱物質類；炭酸カルシウム、硫酸アンモニウム、硫酸ナトリウム又は塩化カリウム等の無機塩類；合成珪酸；あるいは合成珪酸塩；等が挙げられる。

[0256] 液体担体としては、例えば、エチレングリコール、プロピレングリコール又はイソプロパノール等のアルコール類；キシレン、アルキルベンゼン又はアルキルナフタレン等の芳香族炭化水素類；ブチルセロソルブ等のエーテル

類；シクロヘキサノン等のケトン類； γ -ブチロラクトン等のエステル類；N-メチルピロリドン又はN-オクチルピロリドン等の酸アミド類；大豆油、ナタネ油、綿実油又はヒマシ油等の植物油；あるいは水；等が挙げられる。これら固体及び液体担体は単独でも2種以上を併用してもよい。

[0257] 界面活性剤としては、例えば、ポリオキシエチレンアルキルエーテル、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル、ポリオキシエチレンスチリルフェニルエーテル、ポリオキシエチレンポリオキシプロピレンブロックコポリマー、ポリオキシエチレン脂肪酸エステル、ソルビタン脂肪酸エステル又はポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル等のノニオン性界面活性剤；アルキル硫酸塩、アルキルベンゼンスルホン酸塩、リグニンスルホン酸塩、アルキルスルホコハク酸塩、ナフタレンスルホン酸塩、アルキルナフタレンスルホン酸塩、ナフタレンスルホン酸のホルマリン縮合物の塩、アルキルナフタレンスルホン酸のホルマリン縮合物の塩、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル硫酸塩又は燐酸塩、ポリオキシエチレンスチリルフェニルエーテル硫酸塩又は燐酸塩、ポリカルボン酸塩又はポリスチレンスルホン酸塩等のアニオン性界面活性剤；アルキルアミン塩又はアルキル4級アンモニウム塩等のカチオン性界面活性剤；あるいは、アミノ酸型又はベタイン型等の両性界面活性剤；等が挙げられる。

[0258] これら界面活性剤の含有量は、特に限定されないが、本発明の製剤100重量部に対し、通常、0.05～20重量部の範囲が望ましい。また、これら界面活性剤は、単独で用いても2種以上を併用してもよい。

[0259] 本発明の化合物を農薬として使用する場合には、必要に応じて、製剤時又は散布時に、他種の除草剤、各種殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤、植物生長調節剤、共力剤、肥料又は土壌改良剤等と混合施用してもよい。

[0260] 特に他の農薬或いは植物ホルモンと混合施用することにより、施用薬量の減少による低コスト化、混合薬剤の相乗作用による殺菌殺虫スペクトラムの拡大、又はより高い有害生物防除効果、が期待できる。この際、同時に複数の公知農薬との組み合わせも可能である。

[0261] 一態様において本発明の化合物と混合使用する農薬の種類としては、例えば、ザ・ペスティサイド・マニュアル (The Pesticide Manual) 18版、2018年に記載されている化合物等がある。具体的にその一般名を例示すれば、次の通りである。但し、混合使用する農薬は、必ずしもこれらのみに限定されない。

[0262] 殺菌剤：アシベンゾラルーS-メチル (acibenzolar-S-methyl)、アシペタックス (acypetacs)、アルジモルフ (aldimorph)、アリルアルコール (allyl alcohol)、アメトクトラジン (ametoctradin)、アミノピリフェン (aminopyrifen)、アミスルブロム (amisulbrom)、アンバム (amobam)、アムプロピルホス (ampropylfos)、アニラジン (anilazine)、アザコナゾール (azaconazole)、アジチラム (azithiram)、アゾキシストロビン (azoxystrobin)、バリウムポリサルファイド (barium polysulfide)、ベナラキシール (benalaxyl)、ベナラキシール-M (benalaxyl-M)、ベノダニル (benodanil)、ベノミル (benomyl)、ベンキノックス (benquinox)、ベントルロン (bentaluron)、ベンチアバリカルブ-イソプロピル (benthiavalicarb-isopropyl)、ベンチアゾール (benthiazole)、ベンザマクリル (benzamacril)、ベンザモルフ (benzamorf)、ベンゾビンディフルピル (benzovindiflupyr)、ビナパクリル (binapacryl)、ビフェニル (biphenyl)、ビテルタノール (bitertanol)、ビキサフェン (bixafen)、ブラストサイジン-S (blastocidin-S)、ボルドー液 (bordeaux mixture)、ボスカリド (boscalid)、ブロムコナゾール (bromoconazole)、ブピリメート (bupirimate)、ブチオベート (buthiobate)、ブチルアミン (butylamine)、石灰硫黄合剤 (calcium polysulfide)、キャプタフォル (captafol)、キャプタン (captan)、カルバモルフ (carbamorh)、カルベンダジム (carbendazim)、カルボキシ (carboxin)、カルプロパミド (carpropamid)、カルボン (carvone)、チェシュントミクスチャ (cheshunt mixture)、キノメチオネート (chinomethionat)、クロベンチアゾン (chlobenthiazone)、クロラニフォルメタン (chloraniformethane)、クロラニル (chloranil)、クロルフエナゾール (

chlorfenazole)、クロロネブ (chloroneb)、クロロピクリン (chloropicrin)、クロロタロニル (chlorothalonil)、クロルキノックス (chlorquinox)、クロゾリネート (chlozolate)、クリムバゾール (climbazole)、カップーアセテイト (copper acetate)、塩基性炭酸銅 (copper carbonate, basic)、水酸化第二銅 (copper hydroxide)、カップーナフテネート (copper naphthenate)、カップーオレエート (copper oleate)、塩基性塩化銅 (copper oxychloride)、硫酸銅 (copper sulfate)、塩基性硫酸銅 (copper sulfate, basic)、カップージンククロメイト (copper zinc chromate)、クモキシストロビン (coumoxystrobin)、クレゾール (cresol)、クフラネブ (cufraneb)、クプロバム (cuprobam)、シアゾファミド (cyazofamid)、シクラフラミド (cyclafuramid)、シクロヘキシミド (cycloheximide)、シフルフェナミド (cyflufenamid)、シモキサニル (cymoxanil)、シペンダゾール (cypendazole)、シプロコナゾール (cyproconazole)、シプロジニル (cyprodinil)、シプロフラム (cyprofuram)、ダゾメット (dazomet)、デバカルブ (debacarb)、デカフェンチン (decafentin)、デハイドロアセテイト (dehydroacetic acid)、ジクロベンチアゾクス (dichlobentiazox)、ジクロフルアニド (dichlofluanid)、ジクロロン (dichlone)、ジクロロフェン (dichlorophen)、ジクロゾリン (dichlozoline)、ジクロブトラゾール (diclobutrazol)、ジクロシメット (diclocymet)、ジクロメジン (diclomazine)、ジクロラン (dicloran)、ジエトフェンカルブ (diethofencarb)、ジフェノコナゾール (difenoconazole)、ジフルメトリム (diflumetorim)、ジメチリモール (dimethirimol)、ジメトモルフ (dimethomorph)、ジモキシストロビン (dimoxystrobin)、ジニコナゾール (diniconazole)、ジニコナゾール-M (diniconazole-M)、ジノブトン (dinobuton)、ジノカップ (dinocap)、ジノカップ-4 (dinocap-4)、ジノカップ-6 (dinocap-6)、ジノクトン (dinocton)、ジノスルフォン (dinosulfon)、ジノテルボン (dinoterbon)、ジフェニルアミン (diphenylamine)、ジピメチトロン (dipymetitrone)、ジピリチオン (dipyrrithione)、ジスルフィラム (disulf

iram)、ジタリムホス (ditalimfos)、ジチアノン (dithianon)、デーエヌ
オーシー (DNOC)、ドデモルフ (dodemorph)、ドジン (dodine)、ドラゾキ
ソロン (drazoxolon)、エディフェンホス (edifenphos)、エネストロビン
(enestrobin)、エノキサストロビン (enoxastrobin)、エポキシコナゾー
ル (epoxiconazole)、エタボキサム (ethaboxam)、エタコナゾール (etaco
nazole)、エテム (etem)、エチリモール (ethirimol)、エトキシキン (et
hoxyquin)、エトリジアゾール (etridiazole)、ファモキサドン (famoxado
ne)、フェナミドン (fenamidone)、フェナミノスルフ (fenaminosulf)、
フェナミンストロビン (fenaminstrobin)、フェナパニル (fenapanil)、フ
ェナリモル (fenarimol)、フェンブコナゾール (fenbuconazole)、フェン
フラム (fenfuram)、フェンヘキサミド (fenhexamid)、フェニトロパン (f
enitropan)、フェノキサニル (fenoxanil)、フェンピクロニル (fepiclon
il)、フェンピコキサミド (fepicoxamid)、フェンプロピジン (fenpropid
in)、フェンプロピモルフ (fenpropimorph)、フェンピラザミン (fenpyraz
amine)、フェンチン (fentin)、ファーバム (ferbam)、フェリムゾン (fe
rimzone)、フロリルピコキサミド (florylpicoxamid)、フルアジナム (flu
azinam)、フルジオキサニル (fludioxonil)、フルフェノキシストロビン (f
lufenoxystrobin)、フルインダピル (fluindapyr)、フルメトベル (flume
tover)、フルモルフ (flumorph)、フルオピコリド (fluopicolide)、フル
オピモミド (fluopimomide)、フルオピラム (fluopyram)、フルオルイミド
(fluoroimide)、フルオトリマゾール (fluotrimazole)、フルオキサピプ
ロリン (fluoxapiprolin)、フルオキサストロビン (fluoxastrobin)、フル
キンコナゾール (fluquinconazole)、フルシラゾール (flusilazole)、フ
ルスルファミド (flusulfamide)、フルトラニル (flutolanil)、フルチア
ニル (flutianil)、フルトリアホール (flutriafol)、フルキサピロキサド
(fluxapyroxad)、フォルペット (folpet)、ホセチルーアルミニウム (fos
etyl-aluminium)、フサライド (fthalide)、フベリダゾール (fuberidazol
e)、フララキシル (furalaxyl)、フラメトピル (furametpyr)、フルカル

バニル (furcarbanil)、フルコナゾール (furconazole)、フルコナゾール
-シス (furconazole-cis)、フルメシクロックス (furmecyclox)、フロフ
ァネート (furophanate)、グリジン (glyodin)、グリセオフルビン (grise
ofulvin)、グアザチン (guazatine)、ハラクリネート (halacrinatate)、ヘ
キサクロロベンゼン (hexachlorobenzene)、ヘキサコナゾール (hexaconazo
le)、ヘキシルチオフォス (hexylthiofos)、硫酸オキシキノリン (8-hydro
xyquinoline sulfate)、ヒメキサゾール (hymexazol)、イマザリル (imaza
lil)、イミベンコナゾール (imibenconazole)、イミノクタジン-アルベシ
ル酸塩 (iminooctadine-albesilate)、イミノクタジン酢酸塩 (iminooctadine
-triacetate)、インピルフルキサム (inpyrfluxam)、イオドカルブ (iodoc
arb)、イプコナゾール (ipconazole)、イプフェントリフルコナゾール (ip
fentrifluconazole)、イプフルフェノキン (ipflufenquin)、イプロベン
ホス (iprobenfos)、イプロジオン (iprodone)、イプロバリカルブ (ipro
valicarb)、イソフェタミド (isofetamid)、イソフルシプラム (isoflucyp
ram)、イソチアニル (isotianil)、イソプロチオラン (isoprothiolane)
、イソピラザム (isopyrazam)、イソバレジオン (isovalledione)、カスガ
マイシン (kasugamycin)、クレソキシム-メチル (kresoxim-methyl)、ラ
ミナリン (laminarin)、マンカッパー (mancopper)、マンコゼブ (mancoze
b)、マンデストロビン (mandestrobin)、マンジプロパミド (mandipropami
d)、マンネブ (maneb)、メベニル (mebenil)、メカルビンジッド (mecarb
inzid)、メフェントリフルコナゾール (mefentrifluconazole)、メパニピ
リム (mepanipyrim)、メプロニル (mepronil)、メプチルジノカップ (mept
yldinocap)、メタラキシル (metalaxyl)、メタラキシル-M (metalaxyl-M
)、メタム (metam)、メタゾキサロン (metazoxolon)、メトコナゾール (m
etconazole)、メタスルホカルブ (methasulfocarb)、メトフロキサム (met
hfuroxam)、メチルテトラプロール (metyltetraprole)、メチラム (metira
m)、メトミノストロビン (metominostrobin)、メトラフェノン (metrafeno
ne)、メトスルフォバックス (metsulfovax)、ミルネブ (milneb)、ミクロ

ブタニル (myclobutanil)、ミクロゾリン (myclozolin)、ナーバム (nabam)、ナフティフィン (naftifine)、ナタマイシン (natamycin)、有機ニッケル (nickel bis (dimethyldithiocarbamate))、ニトロスチレン (nitrostyrene)、ニトロタルーイソプロピル (nitrothal-isopropyl)、ヌアリモール (nuarimol)、オクチノリン (octhilinone)、オフレース (ofurace)、オリサストロビン (orysastrobin)、オキサジキシル (oxadixyl)、オキサチアピプロリン (oxathiapiprolin)、オキシキノリン銅 (oxine copper)、オキスポコナゾールフマル酸塩 (oxpoconazole fumarate)、オキシカルボキシシン (oxycarboxin)、ペフラゾエート (pefurazoate)、ペンコナゾール (penconazole)、ペンシクロン (pencycuron)、ペンフルフェン (penflufen)、ペンタクロロフェノール (pentachlorophenol)、ペンチオピラド (penthiopyrad)、オルソフェニルフェノール (2-phenylphenol)、ホスダイフェン (phosdiphen)、フサライド (phthalide)、ピカルブトラゾクス (picarbutrazox)、ピコキシストロビン (picoxystrobin)、ピペラリン (piperalin)、ポリカーバメート (polycarbamate)、ポリオキシシン (polyoxins)、ポリオキシノーD (polyoxorim)、ポタシウムアジド (potassium azide)、炭酸水素カリウム (potassium hydrogen carbonate)、プロベナゾール (probenazole)、プロクロラズ (prochloraz)、プロシミドン (procymidone)、プロパモカルブ塩酸塩 (propamocarb hydrochloride)、プロピコナゾール (propiconazole)、プロピネブ (propineb)、プロキナジド (proquinazid)、プロチオカルブ (prothiocarb)、ピラゾホス (pyrazophos)、ピリベンカルブ (pyribencarb)、ピリフェノックス (pyrifenox)、ピリメタニル (pyrimethanil)、ピリミノストロビン (pyriminostrobin)、ピロキロン (pyroquinolon)、プロチオカルブ (prothiocarb)、プロチオコナゾール (prothioconazole)、ピジフルメトフェン (pydiflumetofen)、ピラカルボリド (pyracarbolid)、ピラクロストロビン (pyraclostrobin)、ピラメトストロビン (pyrametostrobin)、ピラオキシストロビン (pyraoxystrobin)、ピラプロポイン (pyrapropoyne)、ピラジフルミド (pyraziflumid)、ピリダクロメチル (p

yridachlometyl)、ピリジニトリル (pyridinitril)、ピリオフェノン (pyriofenone)、ピリソキサゾール (pyrisoxazole)、ピロキシクロル (pyroxychlor)、ピロキシフル (pyroxyfur)、キナセトールスルフェート (quinacetol-sulfate)、キナザミド (quinazamid)、キンコナゾール (quinconazole)、キノキシフェン (quinoxifen)、キノフメリン (quinofumelin)、キントゼン (quintozene)、ラベンザゾール (rabenzazole)、サリチルアニリド (salicylanilide)、セダキサネ (sedaxane)、シルチオファム (silthiofam)、シメコナゾール (simeconazole)、炭酸水素ナトリウム (sodium hydrogen carbonate)、次亜塩素酸ナトリウム (sodium hypochlorite)、スピロキサミン (spiroxamine)、硫黄 (sulfur)、テブコナゾール (tebuconazole)、テブフロキン (tebufloquin)、テフロクタラム (tecloftalam)、テクナゼン (tecnazene)、テコラム (tecoram)、テトラコナゾール (tetraconazole)、チアベンダゾール (thiabendazole)、チアジフルオール (thiadifluor)、チシオフェン (thicyofen)、チフルザミド (thifluzamide)、チオクロルフェンヒム (thiochlorfenphim)、チオファネート (thiophanate)、チオファネートメチル (thiophanate-methyl)、チウラム (thiram)、チアジニル (tiadinil)、チオキシミド (tioxymid)、トルクロホスメチル (tolclofos-methyl)、トルプロカルブ (tolprocarb)、トリルフルアニド (tolylfluaniid)、トリアジメホン (triadimefon)、トリアジメノール (triadimenol)、トリアミホス (triamiphos)、トリアリモール (triarimol)、トリアズブチル (triazbutil)、トリアゾキシド (triazoxide)、トリブチル錫オキシド (tributyltin oxide)、トリクラミド (trichlamide)、トリクロピリカルブ (tricyclopyricarb)、トリシクラゾール (tricyclazole)、トリデモルフ (tridemorph)、トリフロキシストロビン (trifloxystrobin)、トリフルミゾール (triflumizole)、トリホリン (triforine)、トリチコナゾール (triticonazole)、バリダマイシン (validamycin)、バリフェナレート (valifenalate)、ビンクロゾリン (vinclozolin)、ザリラミド (zarilamid)、ジンクナフテネート (zinc naphthenate)、硫酸亜鉛 (zinc s

ulfate)、ジネブ (zineb)、ジラム (ziram)、ゾキサミド (zoxamide)、シイタケ菌糸体抽出物 (shiitake mycelium extract) 及びシイタケ子実体抽出物 (shiitake fruiting body extract) 等。

[0263] 殺虫剤：アバメクチン (abamectin)、アセフェート (acephate)、アセキノシル (acequinocyl)、アセタミプリド (acetamiprid)、アクリナトリン (acrinathrin)、アシノナピル (acynonapyr)、アフィドピロペン (afidopyropen)、アフォクソラネル (afoxolaner)、アラニカルブ (alanycarb)、アルジカルブ (aldicarb)、アレスリン (allethrin)、アルファーシペルメトリン (alpha-cypermethrin)、アルファーエンドスルファン (alpha-endosulfan)、アミドフルメット (amidoflumet)、アミトラズ (amitraz)、アザメチホス (azamethiphos)、アジンホスーエチル (azinphos-ethyl)、アジンホスーメチル (azinphos-methyl)、アゾシクロチン (azocyclotin)、バチルスチューリンゲンシス (bacillus thuringiensis)、ベンダイオカルブ (bendiocarb)、ベンフルトリン (benfluthrin)、ベンフラカルブ (benfuracarb)、ベンスルタップ (bensultap)、ベンゾキシメート (benzoximate)、ベンズピリモキサン (benzpyrimoxan)、ベーターシフルトリン (beta-cyfluthrin)、ベーターシペルメトリン (beta-cypermethrin)、ビフェナゼート (bifenazate)、ビフェントリン (bifenthrin)、ビオアレスリン (bioallethrin)、ビオレスメトリン (bioresmethrin)、ビストリフルロン (bistrifluron)、ブロフラニリド (broflanilide)、ブロモプロピレート (bromopropylate)、ブプロフェジン (buprofezin)、ブトカルボキシム (butocarboxim)、カルバリル (carbaryl)、カルボフラン (carbofuran)、カルボスルファン (carbosulfan)、カルタップ (cartap)、チノメチオネート (chinomethionat)、クロルアントラニリプロール (chlorantraniliprole)、クロルエトキシホス (chlorethoxyfos)、クロルフェナピル (chlorfenapyr)、クロルフェンビンホス (chlorfenvinphos)、クロルフルアズロン (chlorfluazuron)、クロルメホス (chlormephos)、クロロベンジラート (chlorobezilate)、クロロプラレスリン (chloroprallethrin)、クロルピリホス (chlorpyr

ifos)、クロピリホスーメチル (chlorpyrifos-methyl)、クロマフェノジド (chromafenozide)、クロフェンテジン (clofentezine)、クロチアニジン (clothianidin)、シアノホス (cyanophos)、シアントラニリプロール (cy antraniliprole)、シクラニリプロール (cyclaniliprole)、シクロプロトリン (cycloprothrin)、シエノピラフェン (cyenopyrafen)、cyetpyrafen (cyetpyrafen)、シフルメトフェン (cyflumetofen)、シフルトリン (cyfl uthrin)、シハロジアミド (cyhalodiamide)、シハロトリン (cyhalothrin)、サイヘキサチン (cyhexatine)、シペルメトリン (cypermethrin)、シ フェノトリン (cyphenothrin)、cyproflanilide (cyproflanilide)、シロ マジン (cyromazine)、デルタメトリン (deltamethrin)、ジアクロデン (d iacloden)、ジアフェンチウロン (diafenthion)、ダイアジノン (diazin on)、ジクロルボス (dichlorvos)、ジクロロメゾチアズ (dicloromezotiaz)、ジコホール (dicofol)、ジエノクロル (dienochlor)、ジフロビダジン (diflovidazin)、ジフルベンズロン (diflubenzuron)、ジメフルトリン (dimefluthrin)、ジメトエート (dimethoate)、ジメチルビンホス (dimethy lvinphos)、ジンプロピリダズ (dimpropyridaz)、ジノテフラン (dinotefu ran)、ジオフェノラン (diofenolan)、ジスルフォトン (disulfoton)、デーエヌオーシー (DNOC)、d-T-80-フタルスリン (d-tetramethrin)、エマメクチンベンゾエート (emamectin-benzoate)、エンペントリン (emp enthrin)、エンドスルファン (endosulfan)、イーピーエヌ (EPN)、イプ シロンーメトフルトリン (epsilon-metofluthrin)、イプシロンーモムフル オロトリン (epsilon-momfluorothrin)、エスフェンバレレート (esfenvalerate)、エチオフェンカルブ (ethiofencarb)、エチプロール (ethiprole)、エトフェンプロックス (etofenprox)、エトキサゾール (etoxazole)、エ トリムホス (etrimfos)、フェバンテル (Fenbenthiolone)、フェナザキン (fenaz aquin)、フェンブタチンオキシド (fenbutatin oxide)、フェニトロチオン (fenitrothion)、フェンメゾジチアズ (fenmezodithiaz)、フェノブカルブ (fenobucarb)、フェノチオカルブ (fenothiocarb)、フェノキシカルブ (f

enoxycarb)、フェンプロパトリン (fenpropathrin)、フェンピロキシメート (fenpyroximate)、フェンチオン (fenthion)、フェンバレレート (fenvalerate)、フィプロニル (fipronil)、フロメトキン (flometoquin)、フロニカミド (flonicamid)、フルアクリピリム (fluacrypyrim)、フルアズロン (fluazuron)、フルベンジアミド (flubendiamide)、fluchlordiniliprole (fluchlorodiniliprole)、フルシクロクスロン (flucycloxuron)、フルシトリネート (flucythrinate)、フルフェネリム (flufenerim)、フルフェノクスロン (flufenoxuron)、フルフェンプロックス (flufenprox)、フルフィプロール (flufiprole)、フルヘキサホン (fluhexafon)、フルメトリン (flumethrin)、フルペンチオフェノックス (flupentiofenox)、フルピラジフロン (flupyradifurone)、フルピリミン (flupyrimin)、フルララネル (fluralaner)、フルバリネート (fluvalinate)、フルキサメタミド (fluxametamide)、ホノホス (fonophos)、ホルメタネート (formetanate)、フォルモチオン (formothion)、フラチオカルブ (furathiocarb)、ガンマーシハロトリン (gamma-cyhalothrin)、ハルフェンプロックス (halfenprox)、ハロフェノジド (halofenozide)、ヘプタフルトリン (heptafluthrin)、ヘキサフルムロン (hexaflumuron)、ヘキシチアゾクス (hexythiazox)、ヒドラメチルノン (hydramethylnon)、イミダクロプリド (imidacloprid)、イミプロトリン (imiprothrin)、indazapyroxamet (indazapyroxamet)、インドキサカルブ (indoxacarb)、インドキサカルブ-MP (indoxacarb-MP)、イソシクロセラム (isocycloseram)、イソフェンホス (isofenphos)、イソプロカルブ (isoprocab)、イソキサチオン (isoxathion)、カッパービフェントリン (kappa-bifenthrin)、カッパーテフルトリン (kappa-tefluthrin)、ラムダーシハロトリン (lambda-cyhalothrin)、レピメクチン (lepimectin)、ルフエヌロン (lufenuron)、マラチオン (malathion)、メペルフルスリン (meperfluthrin)、メタフルミゾン (metaflumizone)、メタルカルブ (metacarb)、メタルデヒド (metaldehyde)、メタクリホス (methacrifos)、メタミドホス (methamidophos)、メチダチオン (methidathi

on)、メソミル (methomyl)、メソプレン (methoprene)、メトキシクロル (methoxychlor)、メトキシフェノジド (methoxyfenozide)、臭化メチル (methyl bromide)、メトフルトリン (metofluthrin)、ミルベメクチン (milbemectin)、モムフルオロトリン (momfluorothrin)、モノクロトホス (monocrotophos)、ムスカルア (muscalure)、nicofluprole (nicofluprole)、ニテンピラム (nitenpyram)、ノバルロン (novaluron)、ノビフルムロン (noviflumuron)、オメトエート (omethoate)、オキサゾスルフィル (oxazosulfyl)、オキシデメトン-メチル (oxydemeton-methyl)、オキシデプロホス (oxydeprofos)、パラチオン (parathion)、パラチオン-メチル (parathion-methyl)、ペンタクロロフェノール (pentachlorophenol)、ペルメトリン (permethrin)、フェノトリン (phenothrin)、フェントエート (phenthoate)、ホレート (phorate)、ホサロン (phosalone)、ホスメット (phosmet)、ホスファミドン (phosphamidon)、ホキシム (phoxim)、ピリミカーブ (pirimicarb)、ピリミホス-メチル (pirimiphos-methyl)、プラジクアンテル (Praziquantel)、プロフェノホス (profenofos)、プロフルトリン (profluthrin)、プロパホス (propaphos)、プロパルギット (propargite)、プロチオホス (prothiofos)、プロトリフェンブト (protrifenbute)、ピフルブミド (pyflubumide)、ピメトロジン (pymetrozine)、ピラクロホス (pyraclofos)、ピラフルプロール (pyrafluprole)、ピレトリン (pyrethrins)、ピリダベン (pyridaben)、ピリダリル (pyridalyl)、ピリフルキナゾン (pyrifluquinazon)、ピリミジフェン (pyrimidifen)、ピリプロール (pyriprole)、ピリプロキシフェン (pyriproxyfen)、レスメトリン (resmethrin)、ロテノン (rotenone)、シラフルオフエン (silaflluofen)、spidoxamat (spidoxamat)、スピネトラム (spinetoram)、スピノサド (spinosad)、スピロジクロフェン (spirodiclofen)、スピロメシフェン (spiromesifen)、スピロピジオン (spiropidion)、スピロテトラマート (spirotetramat)、スピロメシフェン (spyromesifen)、スルホテップ (sulfotep)、スルホキサフロル (sulfoxafloer)、スルプロホス (sulprofos)、タウーフ

ルバリネート (tau-fluvalinate)、テブフェノジド (tebfenozide)、テブフェンピラド (tebufenpyrad)、テフルベンズロン (teflubenzuron)、テフルトリン (tefluthorin)、テルブホス (terbufos)、テトラクロラントラニリプロール (tetrachlorantraniliprole)、テトラクロロビンホス (tetrachlorvinphos)、テトラメトリン (tetramethrin)、テトラメチルフルスリン (tetramethylfluthrin)、テトラニリプロール (tetraniliprole)、チアクロプリド (thiacloprid)、チアメトキサム (thiamethoxam)、チオシクラム (thiocyclam)、チオジカルブ (thiodicarb)、チオファノックス (thiofanox)、チオメトン (thiometon)、トルフェンピラド (tolfenpyrad)、トラロメトリン (tralomethrin)、トランスフルトリン (transfluthrin)、トリアザメート (triazamate)、トリアズロン (triazuron)、トリクロルホン (trichlorfon)、トリフルメゾピリム (triflumezopyrim)、トリフルムロン (triflumuron)、チクロピラゾフロル (tyclopiazoflor)、バミドチオン (vamidothion) 及びゼターシペルメトリン (zeta-cypermethrin) 等。

[0264] 寄生虫薬：エスフェンバレレート (esfenvalerate)、フェンプロパトリン (fenpropathrin)、フェンバレレート (fenvalerate)、アルファシペルメトリン (cypermethrin)、ピフェントリン (bifenthrin)、シペルメトリン (cypermethrin)、デルタメトリン (deltamethrin)、エトフェンプロックス (etofenprox)、ラムダシハロトリン (lambda-cyhalothrin)、ペルメトリン (permethrin)、テフルトリン (tefluthrin)、ゼータシペルメトリン (zeta-cypermethrin)、アセタミプリド (acetamiprid)、クロチアニジン (clothianidin)、ジノテフラン (dinotefuran)、イミダクロプリド (imidacloprid)、ニテンピラム (nitenpyram)、チアメトキサム (thiamethoxam)、クロマフェノジド (chromafenozide)、フェノキシカルブ (fenoxycarb)、ルフエヌロン (lufenuron)、メトプレン (methoprene)、ピリプロキシフェン (pyriproxyfen)、トリフルムロン (triflumuron)、クロルピリホス (chlorpyrifos)、クロルピリホスメチル (chlorpyrifos-methyl)、ダイアジノン (diazinon)、ジクロルボス (dichlorvos)、フェニトロチオン (fen

itrothion)、フェンチオン (fenthion)、マラチオン (malathion)、ピリミホスメチル (pirimiphos-methyl)、テトラクロロビンホス (tetrachlorvinphos)、エチプロール (ethiprole)、フィプロニル (fipronil)、プロポキスル (propoxur)、カルバリル (carbaryl)、ベンジオカルブ (bendiocarb)、メトキサジアゾン (metoxadiazone)、フェノカルブ (fenobucarb)、カルボフラン (carbofuran)、アフォキサネール (afoxolaner)、フルララネール (fluralaner)、フルキサメタミド (fluxametamide)、サロラネール (sarolaner)、ロティラネール (lotilaner)、チゴラネール (tigolaner)、esafoxolaner (esafoxolaner)、modoflaner (modoflaner)、umifoxolaner (umifoxolaner)、mivorilaner (mivorilaner)、アベルメクチン (avermectin)、イベルメクチン (ivermectin)、ドラメクチン (doramectin)、エプリノメクチン (eprinomectin)、マデュラマイシン (maduramycin)、ミルベマイシン (milbemycin)、ミルベマイシンオキシム (milbemycin oxime)、モキシデクチン (moxidectin)、セラメクチン (selamectin)、インドキサカルブ (indoxacarb)、アミトラズ (amitraz)、ビストリフルロン (bistrifluron)、スピノサド (spinosad)、アルベンダゾール (albendazole)、アトバコン (atovaquone)、ピチオノール (bithionol)、カンベンダゾール (cambendazole)、カルニダゾール (carnidazole)、クロロキン (chloroquine)、クラズリル (clazuril)、クオルスロン (clorsulon)、クロサンテル (closantel)、クマホス (coumaphos)、ジクロロフェン (dichlorophen)、ジエチルカルバマジン (diethylcarbamazine)、ジミナゼン (diminazene)、ジニトルミド (dinitolmide)、ヨウ化ジチアザニン (dithiazanine iodide)、エモデプシド (emodepside)、エプシプランテル (epsiprantel)、フェバンテル (febantel)、フェンベンダゾール (fenbendazole)、フルベンダゾール (flubendazole)、グリカルピラミド (glycalpyramide)、イミドカルブ (imidocarb)、レバミゾール (levamisole)、メベンダゾール (mebendazole)、メフロキン塩酸塩 (mefloquine hydrochloride)、メラルソミン二塩酸塩 (melarsamine hydrochloride)、メトロニダゾール (metronidazole)

、メチリジン (metyridine)、モネパンテル (monepantel)、酒石酸モランテル (morantel tartrate)、ニコロサミド (niclosamide)、パモ酸オキサントル (oxantel pamoate)、酒石酸オキサントル (oxantel tartrate)、オキシベンダゾール (oxibendazole)、オキシクロザニド (oxyclozanide)、アジピン酸ピペラジン (piperazine adipate)、クエン酸ピペラジン (piperazine citrate)、リン酸ピペラジン (piperazine phosphate)、プラジカンテル (praziquantel)、パモ酸ピランテル (pyrantel pamoate)、ラフォキサニド (rafoxanide)、テトラミソール塩酸塩 (tetramisole hydrochloride)、チアベンダゾール (thiabendazole) 及びトリクラベンダゾール (triclabendazole) 等。

[0265] 抗真菌剤：ケトコナゾール (ketoconazole) 及びミコナゾール硝酸塩 (miconazole nitrate) 等。

[0266] 抗菌剤：アモキシシリン (amoxicillin)、アンピシリン (ampicillin)、ベトキサジン (bethoxazin)、ピチオノール (bithionol)、ブロンポール (bronopol)、セファピリン (cefapirin)、セファゾリン (cefazolin)、セフキノム (cefquinome)、セフチオフル (ceftiofur)、クロルテトラサイクリン (chlortetracycline)、クラブラン酸 (clavulanic acid)、ダノフロキサシン (danofloxacin)、ジフロキサシン (difloxacin)、ジニトルミド (dinitolmide)、エンロフロキサシン (enrofloxacin)、フロルフエニコール (florfenicol)、リンコマイシン (lincomycin)、ロメフロキサシン (lomefloxacin)、マルボフロキサシン (marbofloxacin)、ミロキサシン (mioxacin)、ミロサマイシン (mirosamycin)、ニトラピリン (nitrapyrin)、ノルフロキサシン (norfloxacin)、オクチリノン (octhilinone)、オフロキサシン (ofloxacin)、オルビフロキサシン (orbifloxacin)、オキシリニック酸 (oxolinic acid)、オキシテトラサイクリン (oxytetracycline)、ペニシリン (penicillin)、ストレプトマイシン (streptomycin)、チアンフェニコール (thiamphenicol)、フマル酸チアムリン (tiamulin fumarate)、リン酸チルミコシン (tilmicosin phosphate)、酢酸イソ吉草酸タイロ

シン (acetylisovaleryltylosin)、リン酸タイロシン (tylosin phosphate)、ツラスロマイシン (tulathromycin)、バルネムリン (valnemulin)、貝殻焼成カルシウム (酸化カルシウム)、タラロマイセス属菌、トリコデルマ属菌及びユニオチリウム属菌等。

[0267] 本発明の化合物の施用薬量は、適用場面、施用時期、施用方法又は栽培作物等により差異はあるが、一般的には、有効成分量としてヘクタール (ha) 当たり 0.005~50kg が適当であり、0.01~1kg が好ましい。

[0268] 次に、本発明の化合物を用いる場合の製剤の配合例を示す。但し、本発明の配合例は、これらのみに限定されない。なお、以下の配合例において「部」は重量部を意味する。

[0269] [水和剤]

本発明の化合物	0.1~80部
固体担体	5~98.9部
界面活性剤	1~10部
その他	0~5部

その他として、例えば、固結防止剤又は分解防止剤等が挙げられる。

[0270] [乳剤]

本発明の化合物	0.1~30部
液体担体	45~95部
界面活性剤	4.9~15部
その他	0~10部

その他として、例えば、展着剤又は分解防止剤等が挙げられる。

[0271] [懸濁剤]

本発明の化合物	0.1~70部
液体担体	15~98.89部
界面活性剤	1~12部
その他	0.01~30部

その他として、例えば、凍結防止剤又は増粘剤等が挙げられる。

[0272] 〔顆粒水和剤〕

本発明の化合物 0.1～90部

固体担体 0～98.9部

界面活性剤 1～20部

その他 0～10部

その他として、例えば、結合剤又は分解防止剤等が挙げられる。

[0273] 〔液剤〕

本発明の化合物 0.01～70部

液体担体 20～99.99部

その他 0～10部

その他として、例えば、凍結防止剤又は展着剤等が挙げられる。

[0274] 〔粒剤〕

本発明の化合物 0.01～80部

固体担体 10～99.99部

その他 0～10部

その他として、例えば、結合剤又は分解防止剤等が挙げられる。

[0275] 〔粉剤〕

本発明の化合物 0.01～30部

固体担体 65～99.99部

その他 0～5部

その他として、例えばドリフト防止剤又は分解防止剤等が挙げられる。

[0276] 使用に際しては、上記製剤を水で1～10000倍、好ましくは100～10000倍に希釈して、又は希釈せずに散布する。

[0277] 次に、本発明の化合物を有効成分とする農園芸用殺菌剤の製剤例を具体的に示すが、本発明の製剤は、本発明の化合物も含めて、これらのみに限定されない。なお、以下の製剤例において「部」は重量部を意味する。

[0278] 〔製剤例1〕乳剤

本発明の化合物No. 1-001	20部
メチルナフタレン	55部
シクロヘキサノン	20部
ソルポール2680	5部

(非イオン性界面活性剤とアニオン性界面活性剤との混合物：東邦化学工業社製、商品名)

上記成分を均一に混合して乳剤とする。使用に際しては、上記乳剤を水により50～20000倍に希釈して、有効成分量がヘクタール当たり0.005～50kgになるように散布する。

[0279] 〔製剤例2〕水和剤

本発明の化合物No. 1-001	25部
パイロフィライト	66部
ソルポール5039	4部

(アニオン性界面活性剤：東邦化学工業社製、商品名)

カープレックス#80D	3部
-------------	----

(ホワイトカーボン：塩野義製薬社製、商品名)

リグニンスルホン酸カルシウム	2部
----------------	----

上記成分を均一に混合粉砕して水和剤とする。使用に際しては、上記水和剤を水により50～20000倍に希釈して、有効成分量がヘクタール当たり0.005～50kgになるように散布する。

[0280] 〔製剤例3〕粉剤

本発明の化合物No. 1-001	3部
カープレックス#80D	0.5部
(ホワイトカーボン：塩野義製薬社製、商品名)	
カオリナイト	95部
リン酸ジイソプロピル	1.5部

上記成分を均一に混合粉砕して粉剤とする。使用に際しては、上記粉剤の有効成分量が、ヘクタール当たり0.005～50kgになるように散布す

る。

[0281] 〔製剤例4〕粒剤

本発明の化合物No. 1-001	5部
ベントナイト	30部
タルク	64部
リグニンスルホン酸カルシウム	1部

上記成分を均一に混合粉碎して、少量の水を加えて攪拌混合し、押出式造粒機で造粒し、乾燥して粒剤とする。使用に際しては、上記粒剤の有効成分量が、ヘクタール当たり0.005~50kgになるように散布する。

[0282] 〔製剤例5〕懸濁剤

本発明の化合物No. 1-001	25部
ソルポール3353	5部
(非イオン性界面活性剤：東邦化学工業社製、商品名)	
ルノックス1000C	0.5部
(陰イオン界面活性剤：東邦化学工業社製、商品名)	
ザンサンガム(天然高分子)	0.2部
安息香酸ソーダ	0.4部
プロピレングリコール	10部
水	58.9部

有効成分(本発明の化合物)を除く上記の成分を均一に溶解し、次いで、本発明の化合物を加えてよく攪拌した後、サンドミルにて湿式粉碎してフロアブル剤を得る。使用に際しては、前記フロアブル剤を水により50~20000倍に希釈して、有効成分量がヘクタール当たり0.005~50kgになるように散布する。

[0283] 〔製剤例6〕粒状水和剤

本発明の化合物No. 1-001	75部
ハイテノールNE-15	5部
(アニオン性界面活性剤：第一工業製薬社製、商品名)	

バニレックスN 10部

(アニオン性界面活性剤：日本製紙社製、商品名)

カープレックス#80D 10部

(ホワイトカーボン：塩野義製薬社製、商品名)

上記成分を均一に混合微粉碎して、少量の水を加えて攪拌混合し、押出式造粒機で造粒し、乾燥してドライフロアブル剤とする。使用に際しては、水で50～20000倍に希釈して、有効成分が1ヘクタール当たり0.005～50kgになるように散布する。

[0284] 本発明の化合物の施用方法としては、茎葉散布、土壌処理又は種子消毒等が挙げられるが、当業者が通常利用する一般的な方法においても有効である。

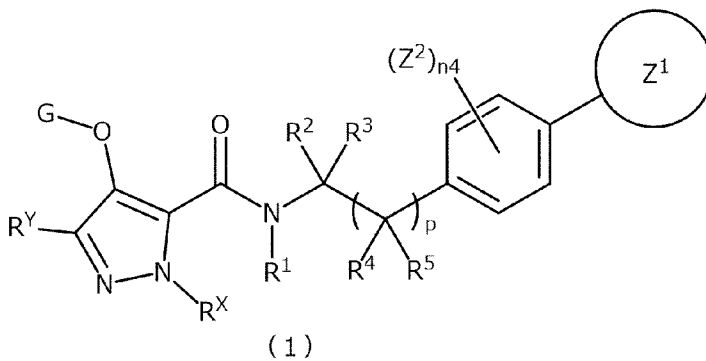
[0285] [まとめ]

以上の通り、本発明は下記〔1〕～〔78〕に関する。

[0286] [1]

式(1)：

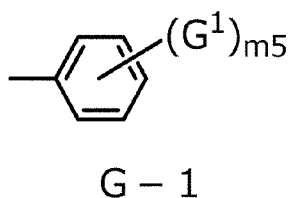
[0287] [化27]



[式中、Gは、G-1を表し、

G-1は、下記の構造式で表される構造を表し、

[0288] [化28]



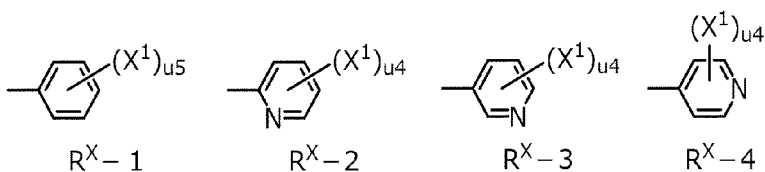
G¹は、ヒドロキシ、ニトロ、シアノ、ハロゲン原子、C₁~C₆アルキル、C₃~C₁₀シクロアルキル、C₁~C₆ハロアルキル、C₁~C₆アルコキシ、C₁~C₆ハロアルコキシ、C₁~C₆アルキルチオ、C₁~C₆アルキルスルフィニル、C₁~C₆アルキルスルホニル、ジ(C₁~C₆アルキル)アミノ、C₁~C₆アルキルカルボニル、C₁~C₆アルコキシカルボニル、C₁~C₆アルキルアミノカルボニル、C₃~C₁₀シクロアルキルアミノカルボニル又はジ(C₁~C₆アルキル)アミノカルボニルを表し、

G¹との関係において、m₅が2、3、4又は5の整数を示す場合には、各々のG¹は互いに同一であっても、又は互いに相異なってもよく、

R^xは、C₁~C₆アルキル、C₃~C₁₀シクロアルキル、C₁~C₆ハロアルキル、ベンジル、R^{x-1}、R^{x-2}、R^{x-3}又はR^{x-4}を表し、

R^{x-1}~R^{x-4}は、それぞれ下記の構造式で表される構造を表し、

[0289] [化29]



X¹は、ハロゲン原子、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆ハロアルキル又はC₁~C₆アルコキシを表し、

X¹との関係において、u₅が2、3、4又は5の整数を示す場合には、各々のX¹は互いに同一であっても、又は互いに相異なってもよく、

X¹との関係において、u₄が2、3又は4の整数を示す場合には、各々のX¹は互いに同一であっても、又は互いに相異なってもよく、

R^yは、水素原子、ハロゲン原子又はC₁~C₆アルキルを表し、

R¹は、水素原子又はC₁~C₆アルキルを表し、

R²は、水素原子又はC₁~C₆アルキルを表し、

R³は、水素原子又はC₁~C₆アルキルを表し、

R⁴は、水素原子、ハロゲン原子、C₁~C₆アルキル又はC₁~C₆アルコキシを表し、

R^5 は、水素原子、ハロゲン原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

Z^1 は、E-1～E-29又はE-30を表し、

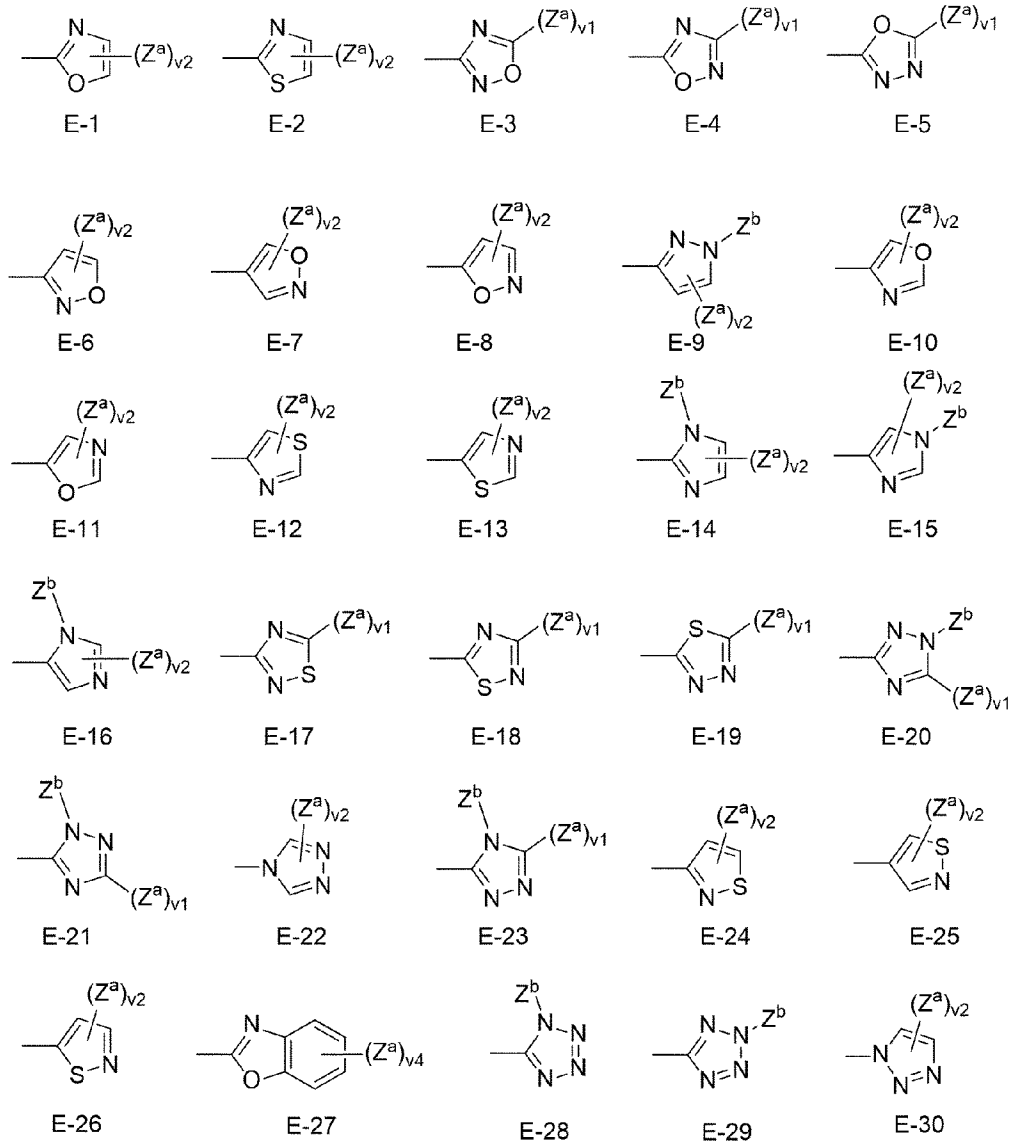
Z^2 は、ヒドロキシ、カルボキシ、アミノ、ニトロ、シアノ、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ ハロシクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケンイル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル又は $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニルを表し、

Z^2 との関係において、 n_4 が2、3又は4の整数を示す場合には、各々の Z^1 は互いに同一であっても、又は互いに相異なってもよく、

E-1～E-30は、それぞれ下記の構造式で表される構造を表し、

[0290]

[化30]



Z^a は、ヒドロキシ、チオール、ハロゲン原子、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^a で置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $-C(=NOR^b)R^c$ 、 $-C(O)R^d$ 、 $-NR^eR^f$ 、フェニル、ピロリジン-1-イル、モルホリン-1-イル又はピペリジン-1-イルを表し、

Z^a との関係において、 v_2 が2の整数を示す場合には、各々の Z^a は互いに同一であっても、又は互いに相異なってもよく、

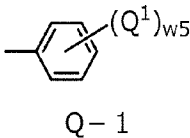
Z^aとの関係において、v 4 が 2、3 又は 4 の整数を示す場合には、各々の Z^aは互いに同一であっても、又は互いに相異なってもよく、

Z^bは、C₁~C₆アルキルを表し、

R^aは、ヒドロキシ、シアノ、C₁~C₆アルコキシ、C₁~C₆アルキルチオ、C₁~C₆アルキルスルフィニル、C₁~C₆アルキルスルホニル、C₁~C₆アルキルカルボニルオキシ、C₁~C₆アルキルカルボニルアミノ、フェニルカルボニルアミノ、-OR^g、-C(O)R^g、-NR^hSO₂Rⁱ又はQ-1を表し、

Q-1は、下記の構造式で表される構造を表し、

[0291] [化31]



Q¹は、ハロゲン原子、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆ハロアルキル又はC₁~C₆アルコキシを表し、

Q¹との関係において、w 5 が 2、3、4 又は 5 の整数を示す場合には、各々のQ¹は互いに同一であっても、又は互いに相異なってもよく、

R^bは、水素原子又はC₁~C₆アルキルを表し、

R^cは、水素原子又はC₁~C₆アルキルを表し、

R^dは、アミノ、ヒドロキシアミノ、C₁~C₆アルキルアミノ、C₃~C₁₀シクロアルキルアミノ、ジ(C₁~C₆アルキル)アミノ、ピロリジン-1-イル、モルホリン-1-イル又はピペリジン-1-イルを表し、

R^eは、水素原子、C₁~C₆アルキル、C₃~C₁₀シクロアルキル、C₂~C₆アルケニル、C₂~C₆アルキニル又はC₁~C₆アルコキシを表し、

R^fは、水素原子、ヒドロキシ、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆アルキルカルボニル、C₁~C₆アルコキシカルボニル、C₁~C₆アルキルアミノカルボニル、ジ(C₁~C₆アルキル)アミノカルボニル、C₁~C₆アルキルスルホニル又はC₁~C₆ハロアルキルスルホニルを表し、

R^g は、 $Q-1$ を表し、
 R^h は、水素原子又は $C_1\sim C_6$ アルキルを表し、
 R^i は、 $C_1\sim C_6$ アルキルを表し、
 m_5 は、0、1、2、3、4又は5の整数を表し、
 n_4 は、0、1、2、3又は4の整数を表し、
 u_5 は、0、1、2、3、4又は5の整数を表し、
 u_4 は、0、1、2、3又は4の整数を表し、
 p は、0又は1の整数を表し、
 v_4 は、0、1、2、3又は4の整数を表し、
 v_2 は、0、1又は2の整数を表し、
 v_1 は、0又は1の整数を表し、
 w_5 は、0、1、2、3、4又は5の整数を表す。]
で表されるピラゾール化合物又はその塩。

[0292] [2]

G^1 は、ハロゲン原子、 $C_1\sim C_6$ アルキル又は $C_1\sim C_6$ ハロアルキルを表し、
、
 R^x は、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 R^{x-1} 又は R^{x-2} を表し、
 R^y は、水素原子を表し、
 R^1 は、水素原子を表し、
 R^2 は、水素原子を表し、
 R^3 は、水素原子を表し、
 R^4 は、水素原子を表し、
 R^5 は、水素原子を表し、
 Z^1 は、E-2、E-3、E-4、E-5、E-6、E-7、E-8、E-9、E-10、E-11、E-12、E-13、E-16、E-17、E-18、E-19、E-20、E-21、E-24、E-25、E-26、E-27、E-29又はE-30を表し、
 Z^2 は、 $C_1\sim C_6$ アルコキシを表し、

Z^aは、ヒドロキシ、チオール、ハロゲン原子、C₁~C₆アルキル、R^aで置換されたC₁~C₆アルキル、C₃~C₁₀シクロアルキル、C₁~C₆ハロアルキル、C₁~C₆アルコキシ、C₁~C₆アルキルチオ、-C(=NOR^b)R^c、-C(O)R^d、-NR^eR^f、フェニル、ピロリジン-1-イル、モルホリン-1-イル又はピペリジン-1-イルを表し、

Q¹は、ハロゲン原子を表し、

R^bは、C₁~C₆アルキルを表し、

R^cは、C₁~C₆アルキルを表し、

R^eは、水素原子、C₁~C₆アルキル、C₃~C₁₀シクロアルキル又はC₁~C₆アルコキシを表し、

R^hは、C₁~C₆アルキルを表し、

m₅は、0又は1の整数を表し、

n₄は、0又は1の整数を表し、

u₅は、0の整数を表し、

u₄は、0の整数を表し、

pは、1の整数を表し、

v₄は、0の整数を表し、

w₅は、0又は1の整数を表す上記〔1〕に記載のピラゾール化合物又はその塩。

[0293] [3]

Z¹は、E-3、E-4、E-5、E-6、E-8、E-9、E-12、E-13、又はE-29を表す上記〔2〕に記載のピラゾール化合物又はその塩。

[0294] [4]

Z^aは、C₁~C₆アルキル、R^aで置換されたC₁~C₆アルキル、C₃~C₁₀シクロアルキル、C₁~C₆ハロアルキル、-C(=NOR^b)R^c、-NR^eR^f、フェニル、ピロリジン-1-イル、モルホリン-1-イル又はピペリジン-1-イルを表し、

R^aは、C₁~C₆アルコキシ又はC₁~C₆アルキルチオを表す上記〔3〕に記載のピラゾール化合物又はその塩。

[0295] 〔5〕

Z¹は、E-3、E-4、E-5又はE-29を表す上記〔3〕又は〔4〕に記載のピラゾール化合物又はその塩。

[0296] 〔6〕

G¹は、ヒドロキシ、ニトロ、シアノ、ハロゲン原子、C₁~C₆アルキル、C₃~C₁₀シクロアルキル、C₁~C₆ハロアルキル、C₁~C₆アルコキシ、C₁~C₆ハロアルコキシ、C₁~C₆アルキルチオ、C₁~C₆アルキルスルフィニル又はC₁~C₆アルキルスルホニルを表す上記〔1〕に記載のピラゾール化合物又はその塩。

[0297] 〔7〕

G¹は、ヒドロキシ、ニトロ、シアノ、ハロゲン原子、C₁~C₆アルキル、C₃~C₁₀シクロアルキル、C₁~C₆ハロアルキル、C₁~C₆アルコキシ又はC₁~C₆ハロアルコキシを表す上記〔1〕に記載のピラゾール化合物又はその塩。

[0298] 〔8〕

G¹は、ヒドロキシ、ニトロ、シアノ、ハロゲン原子、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆ハロアルキル、C₁~C₆アルコキシ又はC₁~C₆ハロアルコキシを表す上記〔1〕に記載のピラゾール化合物又はその塩。

[0299] 〔9〕

G¹は、ニトロ、シアノ、ハロゲン原子、C₁~C₆アルキル又はC₁~C₆ハロアルキルを表す上記〔1〕に記載のピラゾール化合物又はその塩。

[0300] 〔10〕

G¹は、ハロゲン原子、C₁~C₆アルキル又はC₁~C₆ハロアルキルを表し、
m₅は、0又は1の整数を表す上記〔1〕に記載のピラゾール化合物又はその塩。

[0301] [1 1]

G¹は、C₁~C₆アルキル又はC₁~C₆ハロアルキルを表す上記〔3〕~〔10〕のいずれか1つに記載のピラゾール化合物又はその塩。

[0302] [1 2]

G¹は、C₁~C₆アルキルを表す上記〔1 1〕に記載のピラゾール化合物又はその塩。

[0303] [1 3]

G¹は、C₁~C₆ハロアルキルを表す上記〔1 1〕に記載のピラゾール化合物又はその塩。

[0304] [1 4]

G¹は、ハロゲン原子を表す上記〔1 1〕に記載のピラゾール化合物又はその塩。

[0305] [1 5]

m₅は、0又は1の整数を表す上記〔1〕~〔1 4〕のいずれか1つに記載のピラゾール化合物又はその塩。

[0306] [1 6]

m₅は、1の整数を表す上記〔1〕~〔1 4〕のいずれか1つに記載のピラゾール化合物又はその塩。

[0307] [1 7]

m₅は、0の整数を表す上記〔1〕~〔5〕のいずれか1つに記載のピラゾール化合物又はその塩。

[0308] [1 8]

R^xは、C₁~C₆アルキル、R^{x-1}又はR^{x-2}を表す上記〔1〕及び〔6〕~〔1 7〕のいずれか1つに記載のピラゾール化合物又はその塩。

[0309] [1 9]

R^xは、C₁~C₆アルキルを表す上記〔1〕~〔1 7〕のいずれか1つに記載のピラゾール化合物又はその塩。

[0310] [2 0]

R^x は、tert-ブチルを表す上記〔19〕に記載のピラゾール化合物又はその塩。

[0311]〔21〕

R^x は、 R^{x-1} 又は R^{x-2} を表し、

u_5 は、0の整数を表し、

u_4 は、0の整数を表す上記〔1〕～〔17〕のいずれか1つに記載のピラゾール化合物又はその塩。

[0312]〔22〕

R^x は、 R^{x-1} を表す上記〔21〕に記載のピラゾール化合物又はその塩

。

[0313]〔23〕

R^x は、 R^{x-2} を表す上記〔21〕に記載のピラゾール化合物又はその塩

。

[0314]〔24〕

R^y は、水素原子、ハロゲン原子又は $C_1\sim C_6$ アルキルを表す上記〔1〕及び〔6〕～〔23〕のいずれか1つに記載のピラゾール化合物又はその塩。

[0315]〔25〕

R^y は、水素原子を表す上記〔1〕～〔23〕のいずれか1つに記載のピラゾール化合物又はその塩。

[0316]〔26〕

R^y は、ハロゲン原子を表す上記〔1〕～〔23〕のいずれか1つに記載のピラゾール化合物又はその塩。

[0317]〔27〕

R^y は、 $C_1\sim C_6$ アルキルを表す上記〔1〕～〔23〕のいずれか1つに記載のピラゾール化合物又はその塩。

[0318]〔28〕

R^1 は、水素原子を表し、

R^2 は、水素原子を表し、

R³は、水素原子を表し、

R⁴は、水素原子を表し、

R⁵は、水素原子を表し、

pは、1の整数を表す上記〔1〕及び〔6〕～〔27〕に記載のピラゾール化合物又はその塩。

[0319] 〔29〕

Z¹は、E-2、E-3、E-4、E-5、E-6、E-7、E-8、E-9、E-10、E-11、E-12、E-13、E-16、E-17、E-18、E-19、E-20、E-21、E-24、E-25、E-26、E-27、E-29又はE-30を表し、

Z²は、C₁～C₆アルコキシを表し、

n₄は、0又は1の整数を表す上記〔1〕及び〔6〕～〔28〕のいずれか1つに記載のピラゾール化合物又はその塩。

[0320] 〔30〕

Z¹は、E-3、E-4、E-5、E-6、E-7、E-8、E-9、E-12、E-13、E-21又はE-29を表す上記〔1〕～〔28〕のいずれか1つに記載のピラゾール化合物又はその塩。

[0321] 〔31〕

Z¹は、E-3、E-4、E-5、E-6、E-8、E-9、E-12、E-13、又はE-29を表す上記〔30〕に記載のピラゾール化合物又はその塩。

[0322] 〔32〕

Z¹は、E-3、E-4、E-5、E-6、E-12又はE-29を表す上記〔30〕に記載のピラゾール化合物又はその塩。

[0323] 〔33〕

Z¹は、E-3、E-4、E-5又はE-29を表す上記〔30〕に記載のピラゾール化合物又はその塩。

[0324] 〔34〕

Z¹は、E-3、E-4又はE-5を表す上記〔30〕に記載のピラゾール化合物又はその塩。

[0325] 〔35〕

Z¹は、E-3を表す上記〔30〕に記載のピラゾール化合物又はその塩。

[0326] 〔36〕

Z¹は、E-4を表す上記〔30〕に記載のピラゾール化合物又はその塩。

[0327] 〔37〕

Z¹は、E-5を表す上記〔30〕に記載のピラゾール化合物又はその塩。

[0328] 〔38〕

Z¹は、E-29を表す上記〔30〕に記載のピラゾール化合物又はその塩

。

[0329] 〔39〕

Z^aは、C₁~C₆アルキル、R^aで置換されたC₁~C₆アルキル、C₃~C₁₀シクロアルキル、C₁~C₆ハロアルキル、-C(=NOR^b)R^c、-NR^eR^f、フェニル、ピロリジン-1-イル、モルホリン-1-イル又はピペリジン-1-イルを表し、

R^bは、C₁~C₆アルキルを表し、

R^cは、水素原子又はC₁~C₆アルキルを表し、

R^eは、水素原子、C₁~C₆アルキル、C₃~C₁₀シクロアルキル又はC₁~C₆アルコキシを表し、

R^fは、水素原子、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆アルキルカルボニル、C₁~C₆アルコキシカルボニル、C₁~C₆アルキルアミノカルボニル、ジ(C₁~C₆アルキル)アミノカルボニルを表す上記〔1〕~〔38〕のいずれか1つに記載のピラゾール化合物又はその塩。

[0330] 〔40〕

R^eは、水素原子、C₁~C₆アルキル又はC₃~C₁₀シクロアルキルを表し、

、

R^fは、水素原子、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆アルキルカルボニル、C₁

～C₆アルコキシカルボニル、C₁～C₆アルキルアミノカルボニル、ジ(C₁～C₆アルキル)アミノカルボニルを表す上記〔39〕に記載のピラゾール化合物又はその塩。

[0331] [41]

R^eは、水素原子又はC₁～C₆アルキルを表し、

R^fは、水素原子、C₁～C₆アルキル又はC₁～C₆アルキルカルボニルを表す上記〔39〕に記載のピラゾール化合物又はその塩。

[0332] [42]

Z^aは、C₁～C₆アルキル、R^aで置換されたC₁～C₆アルキル、C₃～C₁₀シクロアルキル又はC₁～C₆ハロアルキルを表し、

R^aは、C₁～C₆アルコキシ又はC₁～C₆アルキルチオを表す上記〔1〕～〔39〕のいずれか1つに記載のピラゾール化合物又はその塩。

[0333] [43]

Z^aは、C₁～C₆アルキル、R^aで置換されたC₁～C₆アルキル又はC₁～C₆ハロアルキルを表し、

R^aは、C₁～C₆アルコキシ又はC₁～C₆アルキルチオを表す上記〔1〕～〔42〕のいずれか1つに記載のピラゾール化合物又はその塩。

[0334] [44]

Z^aは、C₁～C₆アルキル又はR^aで置換されたC₁～C₆アルキルを表し、

R^aは、C₁～C₆アルコキシを表す上記〔43〕に記載のピラゾール化合物又はその塩。

[0335] [45]

Z^aは、C₁～C₆アルキル又はC₁～C₆ハロアルキルを表す上記〔1〕～〔39〕のいずれか1つに記載のピラゾール化合物又はその塩。

[0336] [46]

Z^aは、C₁～C₆アルキルを表す上記〔1〕～〔39〕のいずれか1つに記載のピラゾール化合物又はその塩。

[0337] [47]

Z^aは、C₁～C₆ハロアルキルを表す上記〔1〕～〔39〕のいずれか1つに記載のピラゾール化合物又はその塩。

[0338] 〔48〕

Z^aは、R^aで置換されたC₁～C₆アルキルを表し、

R^aは、C₁～C₆アルコキシを表す上記〔1〕～〔39〕のいずれか1つに記載のピラゾール化合物又はその塩。

[0339] 〔49〕

Z¹は、E-3を表し、

Z^aは、C₁～C₆アルキル又はR^aで置換されたC₁～C₆アルキルを表し、

R^aは、C₁～C₆アルコキシを表す上記〔1〕～〔39〕のいずれか1つに記載のピラゾール化合物又はその塩。

[0340] 〔50〕

Z^aは、-C(=NOR^b)R^c、-NR^eR^f、フェニル、ピロリジン-1-イル、モルホリン-1-イル又はピペリジン-1-イルを表す上記〔1〕～〔39〕のいずれか1つに記載のピラゾール化合物又はその塩。

[0341] 〔51〕

Z^aは、-C(=NOR^b)R^c又は-C(O)R^dを表し、

R^bは、C₁～C₆アルキルを表し、

R^cは、水素原子又はC₁～C₆アルキルを表し、

R^eは、水素原子又はC₁～C₆アルキルを表し、

R^fは、水素原子又はC₁～C₆アルキルを表す上記〔1〕～〔38〕のいずれか1つに記載のピラゾール化合物又はその塩。

[0342] 〔52〕

R^aは、C₁～C₆アルコキシ、C₁～C₆アルキルチオ、C₁～C₆アルキルスルフィニル、C₁～C₆アルキルスルホニル、C₁～C₆アルキルカルボニルオキシ、C₁～C₆アルキルカルボニルアミノ、フェニルカルボニルアミノ、-OR^g、-C(O)R^g、-NR^hSO₂Rⁱ又はQ-1を表す上記〔1〕～〔41〕のいずれか1つに記載のピラゾール化合物又はその塩。

[0343] [53]

R^a は、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニルアミノ又はフェニルカルボニルアミノを表す上記〔1〕～〔4

1〕のいずれか1つに記載のピラゾール化合物又はその塩。

[0344] [54]

R^a は、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニルアミノ、 $-OR^g$ 、 $-C(O)R^g$ 又は $-NR^hSO_2R^i$ を表し、

R^g は、 $Q-1$ を表し、

Q^1 は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル又は $C_1 \sim C_6$ アルコキシを表し、

R^h は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^i は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

w_5 は、0又は1の整数を表す上記〔1〕～〔41〕のいずれか1つに記載のピラゾール化合物又はその塩。

[0345] [55]

Q^1 は、ハロゲン原子を表し、

w_5 は、1の整数を表す上記〔54〕に記載のピラゾール化合物又はその塩。

[0346] [56]

w_5 は、0の整数を表す上記〔54〕に記載のピラゾール化合物又はその塩。

[0347] [57]

R^a は、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ又は $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニルアミノを表す上記〔1〕～〔41〕に記載のピラゾール化合物又はその塩。

〔58〕

R^a は、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル又は $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニルを表す上記〔1〕～〔41〕に記載のピラゾール化合物又はその塩。

〔0348〕 〔59〕

R^a は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル又は $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニルを表す上記〔1〕～〔41〕に記載のピラゾール化合物又はその塩。

〔0349〕 〔60〕

R^a は、 $-OR^g$ 、 $-C(O)R^g$ 、 $-NR^hSO_2R^j$ 又は $Q-1$ を表し、

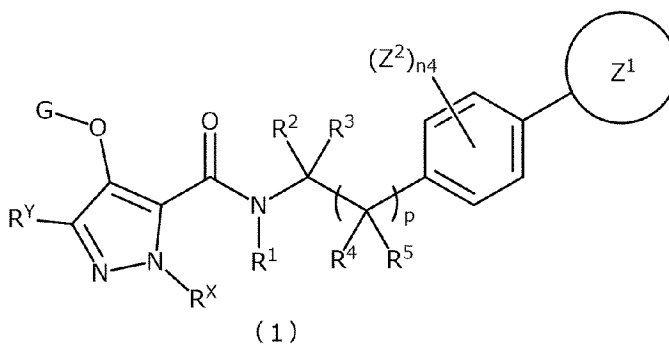
Q^1 は、ハロゲン原子を表し、

w_5 は、0又は1の整数を表す上記〔1〕～〔41〕に記載のピラゾール化合物又はその塩。

〔0350〕 〔61〕

式(1)：

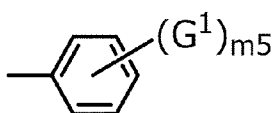
〔0351〕〔化32〕



[式中、 G は、 $G-1$ を表し、

$G-1$ は、下記の構造式で表される構造を表し、

〔0352〕〔化33〕



$G-1$

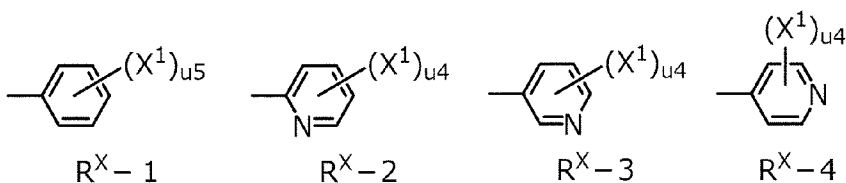
G¹は、ヒドロキシ、ニトロ、シアノ、ハロゲン原子、C₁～C₆アルキル、C₃～C₁₀シクロアルキル、C₁～C₆ハロアルキル、C₁～C₆アルコキシ、C₁～C₆ハロアルコキシ、C₁～C₆アルキルチオ、C₁～C₆アルキルスルフィニル、C₁～C₆アルキルスルホニル、ジ(C₁～C₆アルキル)アミノ、C₁～C₆アルキルカルボニル、C₁～C₆アルコキシカルボニル、C₁～C₆アルキルアミノカルボニル、C₃～C₁₀シクロアルキルアミノカルボニル又はジ(C₁～C₆アルキル)アミノカルボニルを表し、

G¹との関係において、m₅が2、3、4又は5の整数を示す場合には、各々のG¹は互いに同一であっても、又は互いに相異なってもよく、

R^xは、C₁～C₆アルキル、C₃～C₁₀シクロアルキル、C₁～C₆ハロアルキル、ベンジル、R^{x-1}、R^{x-2}、R^{x-3}又はR^{x-4}を表し、

R^{x-1}～R^{x-4}は、それぞれ下記の構造式で表される構造を表し、

[0353] [化34]



X¹は、ハロゲン原子、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆ハロアルキル又はC₁～C₆アルコキシを表し、

X¹との関係において、u₅が2、3、4又は5の整数を示す場合には、各々のX¹は互いに同一であっても、又は互いに相異なってもよく、

X¹との関係において、u₄が2、3又は4の整数を示す場合には、各々のX¹は互いに同一であっても、又は互いに相異なってもよく、

R^yは、水素原子、ハロゲン原子又はC₁～C₆アルキルを表し、

R¹は、水素原子又はC₁～C₆アルキルを表し、

R²は、水素原子又はC₁～C₆アルキルを表し、

R³は、水素原子又はC₁～C₆アルキルを表し、

R⁴は、水素原子、ハロゲン原子、C₁～C₆アルキル又はC₁～C₆アルコキシを表し、

R⁵は、水素原子、ハロゲン原子又はC₁～C₆アルキルを表し、

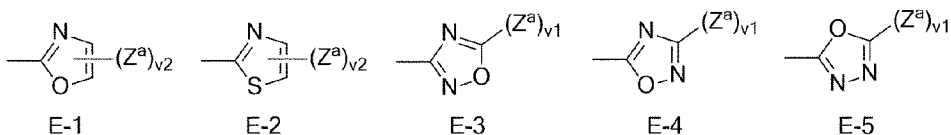
Z¹は、E-1～E-4、又はE-5を表し、

Z²は、ヒドロキシ、カルボキシ、アミノ、ニトロ、シアノ、ハロゲン原子、C₁～C₆アルキル、C₃～C₁₀シクロアルキル、C₁～C₆ハロアルキル、C₃～C₁₀ハロシクロアルキル、C₂～C₆アルケニル、C₂～C₆アルキニル、C₁～C₆アルコキシ、C₁～C₆アルキルチオ、C₁～C₆アルキルスルフィニル又はC₁～C₆アルキルスルホニルを表し、

Z²との関係において、n₄が2、3又は4の整数を示す場合には、各々のZ¹は互いに同一であっても、又は互いに相異なってもよく、

E-1～E-5は、それぞれ下記の構造式で表される構造を表し、

[0354] [化35]



Z^aは、ヒドロキシ、チオール、ハロゲン原子、シアノ、C₁～C₆アルキル、R^aで置換されたC₁～C₆アルキル、C₃～C₁₀シクロアルキル、C₁～C₆ハロアルキル、C₁～C₆アルコキシ、C₁～C₆ハロアルコキシ、C₁～C₆アルキルチオ、C₁～C₆ハロアルキルチオ、C₁～C₆アルキルカルボニル又はC₁～C₆アルコキシカルボニルを表し、

Z^aとの関係において、v₂が2の整数を示す場合には、各々のZ^aは互いに同一であっても、又は互いに相異なってもよく、

R^aは、シアノ又はC₁～C₆アルコキシを表し、

m₅は、それぞれ0、1、2、3、4又は5の整数を表し、

n₄は、0、1、2、3又は4の整数を表し、

u₅は、0、1、2、3、4又は5の整数を表し、

u₄は、0、1、2、3又は4の整数を表し、

pは、0又は1の整数を表し、

v₂は、0、1又は2の整数を表し、

v_1 は、0又は1の整数を表す。] で表されるピラゾール化合物又はその塩。

[0355] [62]

G^1 は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルを表し、

R^x は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^y は、水素原子を表し、

R^1 は、水素原子を表し、

R^2 は、水素原子を表し、

R^3 は、水素原子を表し、

R^4 は、水素原子を表し、

R^5 は、水素原子を表し、

Z^1 は、E-2～E-4、又はE-5を表し、

Z^2 は、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシを表し、

Z^a は、ヒドロキシ、チオール、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^a で置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ又は $C_1 \sim C_6$ アルキルチオを表し、

R^a は、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシを表し、

m_5 は、1の整数を表し、

n_4 は、0の整数を表し、

p は、1の整数を表し、

v_2 は、1の整数を表し、

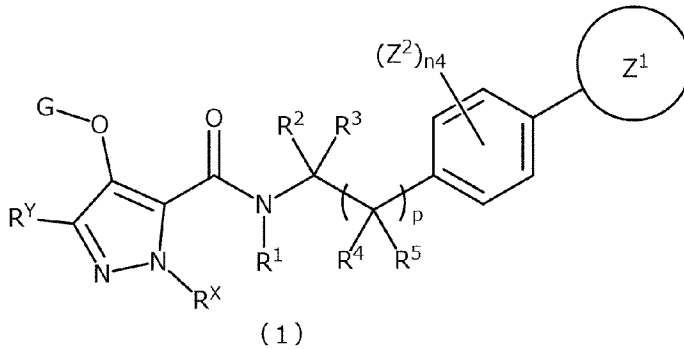
v_1 は、1の整数を表す上記 [62] に記載のピラゾール化合物又はその塩。

[0356] [63]

式(1) :

[0357]

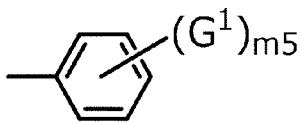
[化36]



[式中、Gは、G-1を表し、

G-1は、下記の構造式で表される構造を表し、

[0358] [化37]



G-1

G¹は、ヒドロキシ、ニトロ、シアノ、ハロゲン原子、C₁~C₆アルキル、C₃~C₁₀シクロアルキル、C₁~C₆ハロアルキル、C₁~C₆アルコキシ、C₁~C₆ハロアルコキシ、C₁~C₆アルキルチオ、C₁~C₆アルキルスルフィニル、C₁~C₆アルキルスルホニル、ジ(C₁~C₆アルキル)アミノ、C₁~C₆アルキルカルボニル、C₁~C₆アルコキシカルボニル、C₁~C₆アルキルアミノカルボニル、C₃~C₁₀シクロアルキルアミノカルボニル又はジ(C₁~C₆アルキル)アミノカルボニルを表し、

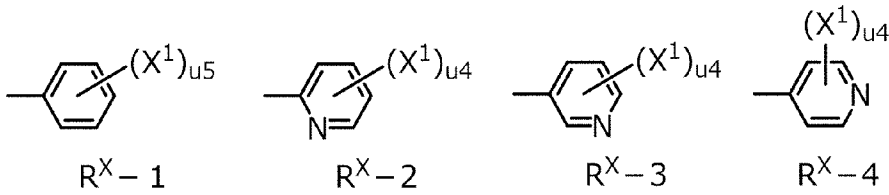
G¹との関係において、m5が2、3、4又は5の整数を示す場合には、各々のG¹は互いに同一であっても、又は互いに相異なってもよく、

R^xは、C₁~C₆アルキル、C₃~C₁₀シクロアルキル、C₁~C₆ハロアルキル、ベンジル、R^{x-1}、R^{x-2}、R^{x-3}又はR^{x-4}を表し、

R^{x-1}~R^{x-4}は、それぞれ下記の構造式で表される構造を表し、

[0359]

[化38]



X^1 は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル又は $C_1 \sim C_6$ アルコキシを表し、

X^1 との関係において、 u_5 が2、3、4又は5の整数を示す場合には、各々の X^1 は互いに同一であっても、又は互いに相異なってもよく、

X^1 との関係において、 u_4 が2、3又は4の整数を示す場合には、各々の X^1 は互いに同一であっても、又は互いに相異なってもよく、

R^Y は、水素原子、ハロゲン原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^1 は、水素原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^2 は、水素原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^3 は、水素原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^4 は、水素原子、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $C_1 \sim C_6$ アルコキシを表し、

R^5 は、水素原子、ハロゲン原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

Z^1 は、E-1～E-4、又はE-5を表し、

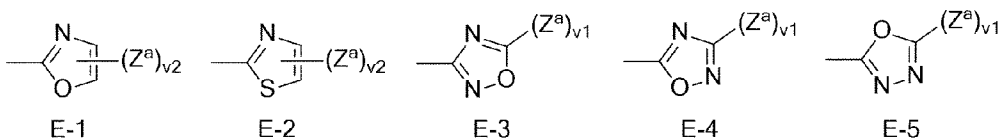
Z^2 は、ヒドロキシ、カルボキシ、アミノ、ニトロ、シアノ、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ ハロシクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル又は $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニルを表し、

Z^2 との関係において、 n_4 が2、3又は4の整数を示す場合には、各々の Z^1 は互いに同一であっても、又は互いに相異なってもよく、

E-1～E-5は、それぞれ下記の構造式で表される構造を表し、

[0360]

[化39]



Z^a は、ヒドロキシ、チオール、ハロゲン原子、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^a で置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル又は $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニルを表し、

Z^a との関係において、 v_2 が2の整数を示す場合には、各々の Z^a は互いに同一であっても、又は互いに相異なってもよく、

R^a は、シアノ又は $C_1 \sim C_6$ アルコキシを表し、

m_5 は、それぞれ0、1、2、3、4又は5の整数を表し、

n_4 は、0、1、2、3又は4の整数を表し、

u_5 は、0、1、2、3、4又は5の整数を表し、

u_4 は、0、1、2、3又は4の整数を表し、

p は、0又は1の整数を表し、

v_2 は、0、1又は2の整数を表し、

v_1 は、0又は1の整数を表す。] で表されるピラゾール化合物又はその塩。

[0361] [64]

G^1 は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルを表し、

R^x は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^y は、水素原子を表し、

R^1 は、水素原子を表し、

R^2 は、水素原子を表し、

R^3 は、水素原子を表し、

R^4 は、水素原子を表し、

R^5 は、水素原子を表し、

Z^1 は、E-2～E-4、又はE-5を表し、

Z^2 は、 $C_1\sim C_6$ アルコキシを表し、

Z^a は、ヒドロキシ、チオール、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 R^a で置換された $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_3\sim C_{10}$ シクロアルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ又は $C_1\sim C_6$ アルキルチオを表し、

R^a は、 $C_1\sim C_6$ アルコキシを表し、

m_5 は、1の整数を表し、

n_4 は、0の整数を表し、

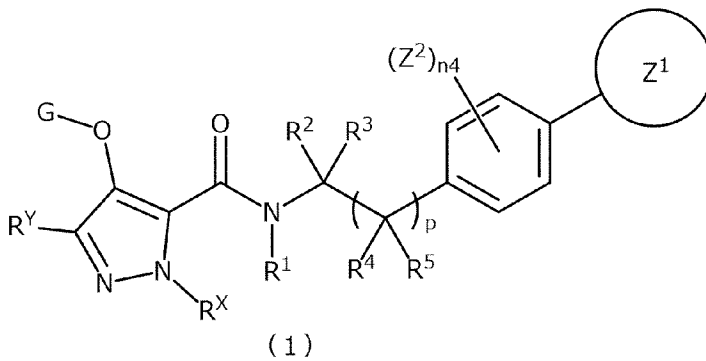
p は、1の整数を表し、

v_2 は、1の整数を表す上記〔63〕に記載のピラゾール化合物又はその塩。

[0362] [65]

式(1)：

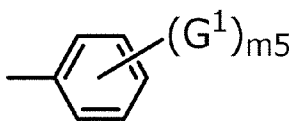
[0363] [化40]



[式中、 G は、 $G-1$ を表し、

$G-1$ は、下記の構造式で表される構造を表し、

[0364] [化41]



$G-1$

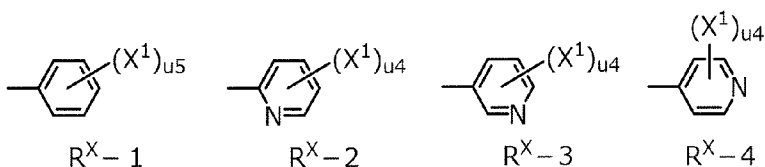
G¹は、ヒドロキシ、ニトロ、シアノ、ハロゲン原子、C₁~C₆アルキル、C₃~C₁₀シクロアルキル、C₁~C₆ハロアルキル、C₁~C₆アルコキシ、C₁~C₆ハロアルコキシ、C₁~C₆アルキルチオ、C₁~C₆アルキルスルフィニル、C₁~C₆アルキルスルホニル、ジ(C₁~C₆アルキル)アミノ、C₁~C₆アルキルカルボニル、C₁~C₆アルコキシカルボニル、C₁~C₆アルキルアミノカルボニル、C₃~C₁₀シクロアルキルアミノカルボニル又はジ(C₁~C₆アルキル)アミノカルボニルを表し、

G¹との関係において、m₅が2、3、4又は5の整数を示す場合には、各々のG¹は互いに同一であっても、又は互いに相異なってもよく、

R^xは、C₁~C₆アルキル、C₃~C₁₀シクロアルキル、C₁~C₆ハロアルキル、ベンジル、R^{x-1}、R^{x-2}、R^{x-3}又はR^{x-4}を表し、

R^{x-1}~R^{x-4}は、それぞれ下記の構造式で表される構造を表し、

[0365] [化42]



X¹は、ハロゲン原子、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆ハロアルキル又はC₁~C₆アルコキシを表し、

X¹との関係において、u₅が2、3、4又は5の整数を示す場合には、各々のX¹は互いに同一であっても、又は互いに相異なってもよく、

X¹との関係において、u₄が2、3又は4の整数を示す場合には、各々のX¹は互いに同一であっても、又は互いに相異なってもよく、

R^yは、水素原子、ハロゲン原子又はC₁~C₆アルキルを表し、

R¹は、水素原子又はC₁~C₆アルキルを表し、

R²は、水素原子又はC₁~C₆アルキルを表し、

R³は、水素原子又はC₁~C₆アルキルを表し、

R⁴は、水素原子、ハロゲン原子、C₁~C₆アルキル又はC₁~C₆アルコキシを表し、

R⁵は、水素原子、ハロゲン原子又はC₁～C₆アルキルを表し、

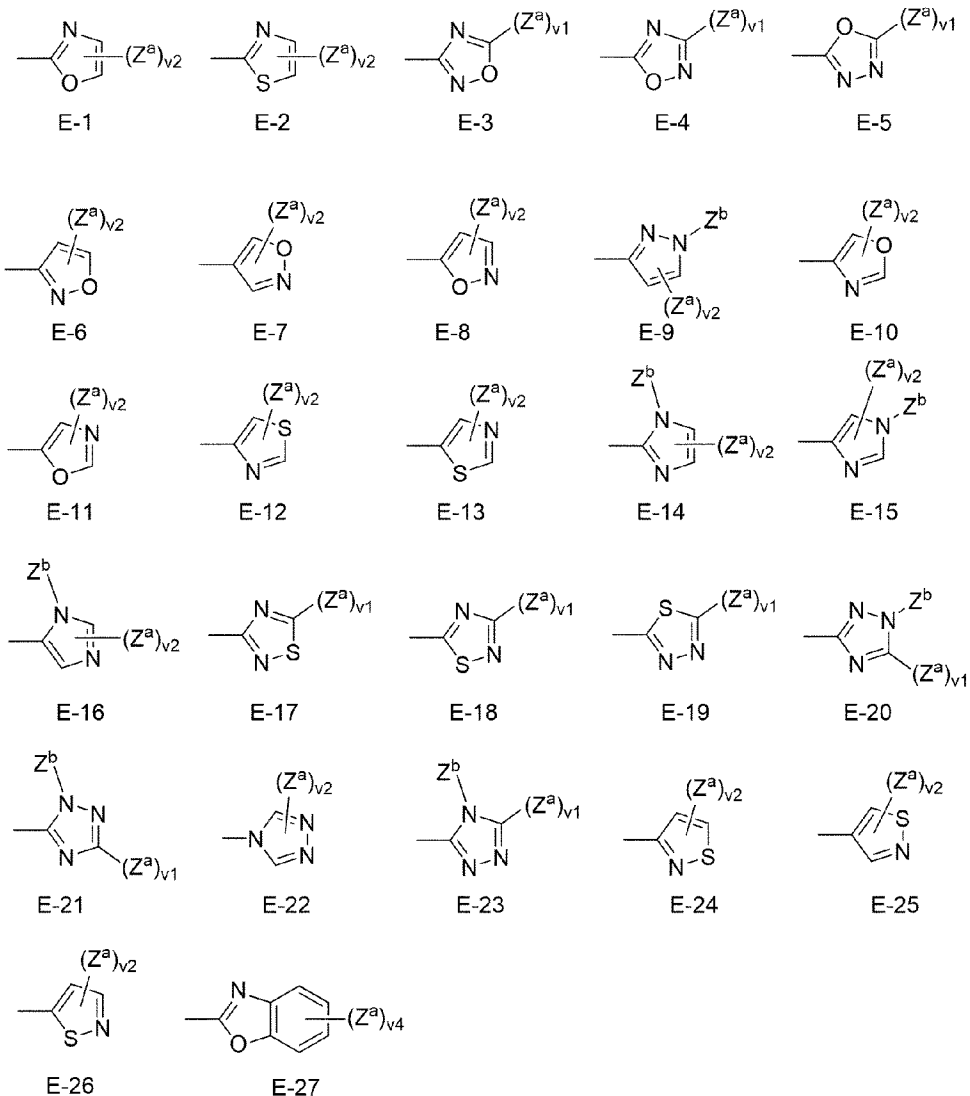
Z¹は、E-1～E-26、又はE-27を表し、

Z²は、ヒドロキシ、カルボキシ、アミノ、ニトロ、シアノ、ハロゲン原子、C₁～C₆アルキル、C₃～C₁₀シクロアルキル、C₁～C₆ハロアルキル、C₃～C₁₀ハロシクロアルキル、C₂～C₆アルケニル、C₂～C₆アルキニル、C₁～C₆アルコキシ、C₁～C₆アルキルチオ、C₁～C₆アルキルスルフィニル又はC₁～C₆アルキルスルホニルを表し、

Z²との関係において、n₄が2、3又は4の整数を示す場合には、各々のZ¹は互いに同一であっても、又は互いに相異なってもよく、

E-1～E-27は、それぞれ下記の構造式で表される構造を表し、

[0366] [化43]



Z^aは、ヒドロキシ、チオール、ハロゲン原子、シアノ、C₁~C₆アルキル、R^aで置換されたC₁~C₆アルキル、C₃~C₁₀シクロアルキル、C₁~C₆ハロアルキル、C₁~C₆アルコキシ、C₁~C₆ハロアルコキシ、C₁~C₆アルキルチオ、C₁~C₆ハロアルキルチオ、C₁~C₆アルキルカルボニル、C₁~C₆アルコキシカルボニル、-C(=NOR^b)R^c、-C(O)R^d、-NR^eR^f、フェニル、ピロリジン-1-イル、モルホリン-1-イル又はピペリジン-1-イルを表し、

Z^aとの関係において、v₂が2の整数を示す場合には、各々のZ^aは互いに同一であっても、又は互いに相異なってもよく、

Z^aとの関係において、v₄が2、3又は4の整数を示す場合には、各々のZ^aは互いに同一であっても、又は互いに相異なってもよく、

Z^bは、C₁~C₆アルキルを表し、

R^aは、ヒドロキシ、シアノ、C₁~C₆アルコキシ、C₁~C₆アルキルチオ、C₁~C₆アルキルスルフィニル、C₁~C₆アルキルスルホニル、C₁~C₆アルキルカルボニルオキシ又はC₁~C₆アルキルカルボニルアミノを表し、

R^bは、水素原子又はC₁~C₆アルキルを表し、

R^cは、水素原子又はC₁~C₆アルキルを表し、

R^dは、アミノ、C₁~C₆アルキルアミノ、C₃~C₁₀シクロアルキルアミノ、ジ(C₁~C₆アルキル)アミノ、ピロリジン-1-イル、モルホリン-1-イル又はピペリジン-1-イルを表し、

R^eは、水素原子、C₁~C₆アルキル、C₃~C₁₀シクロアルキル、C₂~C₆アルケニル、C₂~C₆アルキニル又はC₁~C₆アルコキシを表し、

R^fは、水素原子、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆アルキルカルボニル、C₁~C₆アルコキシカルボニル、C₁~C₆アルキルアミノカルボニル、ジ(C₁~C₆アルキル)アミノカルボニル又はC₁~C₆アルキルスルホニルを表し、

m₅は、それぞれ0、1、2、3、4又は5の整数を表し、

n₄は、0、1、2、3又は4の整数を表し、

u₅は、0、1、2、3、4又は5の整数を表し、

u_4 は、0、1、2、3又は4の整数を表し、
 p は、0又は1の整数を表し、
 v_4 は、0、1、2、3又は4の整数を表し、
 v_2 は、0、1又は2の整数を表し、
 v_1 は、0又は1の整数を表す。] で表されるピラゾール化合物又はその塩。

[0367] [66]

G^1 は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルを表し、
 R^x は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、
 R^y は、水素原子を表し、
 R^1 は、水素原子を表し、
 R^2 は、水素原子を表し、
 R^3 は、水素原子を表し、
 R^4 は、水素原子を表し、
 R^5 は、水素原子を表し、
 Z^1 は、E-2~E-4、E-5、E-7、E-9~E-13、E-16~E-19、E-21、E-24~E-26又はE-27を表し、
 Z^2 は、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシを表し、
 Z^a は、ヒドロキシ、チオール、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^a で置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $-C(=NOR^b)R^c$ 、 $-C(O)R^d$ 、 $-NR^eR^f$ 、ピロリジン-1-イル、モルホリン-1-イル又はピペリジン-1-イルを表し、
 R^a は、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ又は $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニルオキシを表し、
 R^b は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、
 R^c は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^eは、水素原子、C₁~C₆アルキル、C₃~C₁₀シクロアルキル又はC₁~C₆アルコキシを表し、

R^fは、水素原子、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆アルキルカルボニル、C₁~C₆アルコキシカルボニル、ジ(C₁~C₆アルキル)アミノカルボニル又はC₁~C₆アルキルスルホニルを表し、

m₅は、1の整数を表し、

n₄は、0の整数を表し、

pは、1の整数を表し、

v₄は、0の整数を表す上記〔65〕に記載のピラゾール化合物又はその塩。

[0368] 〔67〕

n₄は、1の整数を表す上記〔1〕~〔66〕のいずれか1つに記載のピラゾール化合物又はその塩。

[0369] 〔68〕

n₄は、0の整数を表す上記〔1〕~〔66〕のいずれか1つに記載のピラゾール化合物又はその塩。

[0370] 〔69〕

v₂は、0又は1の整数を表す上記〔1〕~〔66〕のいずれか1つに記載のピラゾール化合物又はその塩。

[0371] 〔70〕

v₂は、0の整数を表す上記〔1〕~〔66〕のいずれか1つに記載のピラゾール化合物又はその塩。

[0372] 〔71〕

v₂は、1の整数を表す上記〔1〕~〔66〕のいずれか1つに記載のピラゾール化合物又はその塩。

[0373] 〔72〕

v₁は、0の整数を表す上記〔1〕~〔66〕のいずれか1つに記載のピラゾール化合物又はその塩。

[0374] [73]

v 1 は、1 の整数を表す上記 [1] ~ [66] のいずれか 1 つに記載のピラゾール化合物又はその塩。

[0375] [74]

上記 [1] ~ [73] の何れか 1 つに記載のピラゾール化合物及びその塩から選ばれる 1 種以上を有効成分として含有する、農薬。

[0376] [75]

上記 [1] ~ [73] の何れか 1 つに記載のピラゾール化合物及びその塩から選ばれる 1 種以上を有効成分として含有する、殺菌剤。

[0377] [76]

上記 [1] ~ [73] の何れか 1 つに記載のピラゾール化合物及びその塩から選ばれる 1 種以上を有効成分として含有する、農園芸用殺菌剤。

[0378] [77]

上記 [1] ~ [73] の何れか 1 つに記載のピラゾール化合物及びその塩から選ばれる 1 種以上を有効成分として含有する、抗真菌剤。

[0379] [78]

上記 [1] ~ [73] の何れか 1 つに記載のピラゾール化合物及びその塩から選ばれる 1 種以上を有効成分として含有する、内部寄生虫防除剤。

[0380] [実施例]

以下に、本発明の化合物の合成例、試験例を実施例として述べることにより、本発明をさらに詳しく説明するが、本発明はこれらによって限定されない。

[0381] 合成例に記載した中圧分取液体クロマトグラフィーには、山善株式会社中圧分取装置；YFLC-Wprep（流速18ml/min、シリカゲル40μmのカラム）を使用した。

[0382] また、以下に記載のプロトン核磁気共鳴スペクトル（以下、¹H-NMRと記載する。）のケミカルシフト値は、基準物質としてMe₄Si（テトラメチルシラン）を用い、300MHz（機種；JNM-ECX300又はJNM

—ECP300、JEOL社製)又は、400MHz(機種;JNM—ECZ400S、JEOL社製)にて測定した。尚、¹H—NMRのケミカルシフト値における記号は、下記の意味を表す。

[0383] s : シングレット、d : ダブルレット、dd : ダブルダブルレット、t : トリプレット、dt : ダブルトリプレット、q : カルテット、sep : セプテット、m : マルチプレット、br : ブロードシングレット。

[0384] [合成例]

合成例1 : 1—(tert—ブチル)—N—(4—(3—(トリフルオロメチル)—1, 2, 4—オキサジアゾール—5—イル)フェネチル)—4—(3—(トリフルオロメチル)フェノキシ)—1H—ピラゾール—5—カルボキサミド(化合物No. 1—013)の合成

工程1 : 1—(tert—ブチル)—N—(4—((2, 2, 2—トリフルオロアセトイミダミド)オキシ)カルボニル)フェネチル)—4—(3—(トリフルオロメチル)フェノキシ)—1H—ピラゾール—5—カルボキサミドの合成

4—(2—(1—(tert—ブチル)—4—(3—(トリフルオロメチル)フェノキシ)—1H—ピラゾール—5—カルボキサミド)エチル)安息香酸150mg及びジクロロメタン3mlの混合溶液に、室温にて1—エチル—3—(3—ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩92mg、2, 2, 2—トリフルオロ—N′—ヒドロキシアセトイミダミド49mg、トリエチルアミン49mg及び1—ヒドロキシ—7—アザベンゾトリアゾール4mgを順次添加し、同温度にて16時間攪拌した。反応終了後、該反応混合物に水3mlを添加し、クロロホルム(3ml×1回)にて抽出した。得られた有機層を無水硫酸ナトリウムにて脱水・乾燥し、減圧下にて溶媒を留去し、目的物220mgを油状物として得た。

[0385] 工程2 : 1—(tert—ブチル)—N—(4—(3—(トリフルオロメチル)—1, 2, 4—オキサジアゾール—5—イル)フェネチル)—4—(3—(トリフルオロメチル)フェノキシ)—1H—ピラゾール—5—カルボ

キサミドの合成

工程1で得られた1-(tert-ブチル)-N-(4-(2,2,2-トリフルオロアセトイミダミド)オキシ)カルボニル)フェネチル)-4-(3-(トリフルオロメチル)フェノキシ)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド220mg及びピリジン3mlの混合溶液を、80℃にて6時間攪拌した。反応終了後、該反応混合物に1mol/l塩酸を添加し、酢酸エチル(3ml×1回)にて抽出した。得られた有機層を無水硫酸ナトリウムにて脱水・乾燥し、減圧下にて溶媒を留去した。得られた残渣を、溶離液として酢酸エチルを使用するシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し、目的物108mgを白色固体として得た。

融点125-127℃。

[0386] 合成例2: 1-(tert-ブチル)-N-(4-(5-メチル-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)フェネチル)-4-(3-(トリフルオロメチル)フェノキシ)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド(化合物No. 1-003)の合成

1-(tert-ブチル)-N-(4-(N'-ヒドロキシカルバムイミドイル)フェネチル)-4-(3-(トリフルオロメチル)フェノキシ)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド150mg及びN,N-ジメチルホルムアミド3mlの混合溶液に、室温にて炭酸カリウム171mg及び無水酢酸63mgを添加し、50℃にて3時間攪拌した。反応終了後、該反応混合物に水6mlを添加し、n-ヘキサン:酢酸エチル=1:2(体積比、以下同じ)の混合溶液(5ml×1回)にて抽出した。得られた有機層を無水硫酸ナトリウムにて脱水・乾燥し、減圧下にて溶媒を留去した。得られた残渣を、溶離液としてn-ヘキサン:酢酸エチル[9:1から1:9へのグラジエント(体積比、以下同じ。)]を使用するシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し、目的111mgを白色固体として得た。

融点119-121℃。

[0387] 合成例3: 1-(tert-ブチル)-N-(4-(4-メチル-チアゾ

ール-2-イル)フェネチル)-4-(3-(トリフルオロメチル)フェノキシ)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド(化合物No. 1-011)の合成

1-(tert-ブチル)-N-(4-カルバモチオイルフェネチル)-4-(3-(トリフルオロメチル)フェノキシ)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド100mg及びN,N-ジメチルホルムアミド2mlの混合溶液に、室温にて1-クロロプロパン-2-オン19mgを添加し、60℃にて20時間攪拌した。反応終了後、該反応混合物に水6mlを添加し、n-ヘキサン:酢酸エチル=1:1の混合溶液(3ml×1回)にて抽出した。得られた有機層を無水硫酸ナトリウムにて脱水・乾燥し、減圧下にて溶媒を留去した。得られた残渣を、溶離液としてn-ヘキサン:酢酸エチル(9:1から1:9へのグラジエント)を使用するシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し、目的物111mgを油状物として得た。

¹H-NMR (CDCl₃, Me₄Si, 300MHz): δ 7.76 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.40-7.27 (m, 2H), 7.25-7.13 (m, 4H), 7.08-7.01 (m, 1H), 6.85 (s, 1H), 6.50-6.40 (m, 1H), 3.66 (q, J = 6.7 Hz, 2H), 2.83 (t, J = 6.9 Hz, 2H), 2.98 (s, 3H), 1.72 (s, 9H)。

[0388] 合成例4: 1-(tert-ブチル)-N-(4-(5-プロピル-1,3,4-オキサジアゾール-2-イル)フェネチル)-4-(3-(トリフルオロメチル)フェノキシ)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド(化合物No. 1-027の合成)

工程1: 1-(tert-ブチル)-N-(4-(2-ブチリルヒドラジン-1-カルボニル)フェネチル)-4-(3-(トリフルオロメチル)フェノキシ)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミドの合成

4-(2-(1-(tert-ブチル)-4-(3-(トリフルオロメチル)フェノキシ)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド)エチル)安息香酸100mg及びテトラヒドロフラン3mlの混合溶液に、氷冷下にて1,1'-カルボニルジイミダゾール68mg及びブチロヒドラジド107m

gを添加し、室温にて4時間攪拌した。攪拌終了後、該反応混合物を60℃にて4時間攪拌し、還流条件下にて2時間攪拌した。反応終了後、該反応混合物に水5mlを添加し、酢酸エチル(5ml×1回)にて抽出した。得られた有機層を1mol/l塩酸で洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて脱水・乾燥し、減圧下にて溶媒を留去し、目的物138mgを油状物として得た。

[0389] 工程2: 1-(tert-ブチル)-N-(4-(5-プロピル-1,3,4-オキサジアゾール-2-イル)フェネチル)-4-(3-(トリフルオロメチル)フェノキシ)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミドの合成
1-(tert-ブチル)-N-(4-(2-ブチリルヒドラジン-1-カルボニル)フェネチル)-4-(3-(トリフルオロメチル)フェノキシ)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド138mg及び1,2-ジクロロエタン4mlの混合溶液に、室温にてN-(トリエチルアンモニオスルホニル)カルバミン酸メチル100mgを添加し、還流条件下にて3時間攪拌した。攪拌終了後、該反応混合物に還流条件下にてN-(トリエチルアンモニオスルホニル)カルバミン酸メチル20mgを添加し、同温度にて1時間攪拌した。反応終了後、該反応混合物に水5mlを添加し、クロロホルム(3ml×1回)にて抽出した。得られた有機層を無水硫酸ナトリウムにて脱水・乾燥し、減圧下にて溶媒を留去した。得られた残渣を、溶離液として酢酸エチルを使用するシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し、目的42mgを白色固体として得た。

融点83-86℃。

[0390] 合成例5: 1-(tert-ブチル)-N-(4-(5-ヒドロキシ-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)フェネチル)-4-(3-(トリフルオロメチル)フェノキシ)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド(化合物No. 1-002)の合成
1-(tert-ブチル)-N-(4-(N'-ヒドロキシカルバムイミドイル)フェネチル)-4-(3-(トリフルオロメチル)フェノキシ)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド100mg及びテトラヒドロフラン

2 ml の混合溶液に、室温にて 1, 1' -カルボニルジイミダゾール 65 mg を添加し、50℃にて 20 時間攪拌した。反応終了後、減圧下にて溶媒を留去した。得られた残渣に 1 mol/l 塩酸 5 ml を添加し、酢酸エチル (5 ml × 1 回) にて抽出した。得られた有機層を無水硫酸ナトリウムにて脱水・乾燥し、減圧下にて溶媒を留去した。得られた固体をジイソプロピルエーテル 2 ml で洗浄し、目的物 90 mg を白色固体として得た。

融点 197 - 199℃。

[0391] 合成例 6 : 1 - (tert-ブチル) - N - (4 - (5 -メトキシ - 1, 2, 4 -オキサジアゾール - 3 -イル) フェネチル) - 4 - (3 - (トリフルオロメチル) フェノキシ) - 1H -ピラゾール - 5 -カルボキサミド (化合物 No. 1 - 009) の合成

1 - (tert-ブチル) - N - (4 - (5 -ヒドロキシ - 1, 2, 4 -オキサジアゾール - 3 -イル) フェネチル) - 4 - (3 - (トリフルオロメチル) フェノキシ) - 1H -ピラゾール - 5 -カルボキサミド 100 mg、炭酸カリウム 40 mg 及びアセトニトリル 2 ml の混合溶液に、室温にてヨウ化メチル 33 mg を添加し、50℃にて 14 時間攪拌した。攪拌終了後、該反応混合物に同温度にてヨウ化メチル 73 mg を添加し、60℃にて 1 時間攪拌した。反応終了後、減圧下にて溶媒を留去した。得られた残渣に水 3 ml を添加し、酢酸エチル (3 ml × 1 回) にて抽出した。得られた有機層を無水硫酸ナトリウムにて脱水・乾燥し、減圧下にて溶媒を留去した。得られた残渣を、溶離液として n -ヘキサン : 酢酸エチル (9 : 1 から 1 : 9 へのグラジエント) を使用するシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し、目的物 83 mg を油状物として得た。

¹H-NMR (CDCl₃, Me₄Si, 300MHz): δ 7.44-7.40 (m, 3H), 7.39-7.30 (m, 3H), 7.26-7.22 (m, 1H), 7.16 (s, 1H), 7.14-7.07 (m, 1H), 6.60-6.50 (m, 1H), 3.67 (q, J = 6.8 Hz, 2H), 2.88 (t, J = 7.1 Hz, 2H), 3.27 (s, 3H), 1.72 (s, 9H)。

[0392] 合成例 7 : N - (4 - (5 -アミノ - 1, 2, 4 -オキサジアゾール - 3

－イル) フェネチル) －1－ (t e r t－ブチル) －4－ (3－メチルフェノキシ) －1H－ピラゾール－5－カルボキサミド (化合物No. 1－145) の合成

工程1 : 1－ (t e r t－ブチル) －N－ (4－ (5－ (メチルスルフィニル) －1, 2, 4－オキサジアゾール－3－イル) フェネチル) －4－ (3－メチルフェノキシ) －1H－ピラゾール－5－カルボキサミドの合成

1－ (t e r t－ブチル) －N－ (4－ (5－ (メチルチオ) －1, 2, 4－オキサジアゾール－3－イル) フェネチル) －4－ (3－メチルフェノキシ) －1H－ピラゾール－5－カルボキサミド 1. 19 g 及びジクロロメタン 30 ml の混合溶液に、氷冷下にてメタクロロ過安息香酸 (30 質量%の水を含む) 1. 00 g を添加し、室温にて5時間攪拌した。反応終了後、室温にて飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 30 ml 及び飽和チオ硫酸ナトリウム水溶液 30 ml を添加し、ジクロロメタン (50 ml × 3回) にて抽出した。得られた有機層を無水硫酸ナトリウムにて脱水・乾燥し、減圧下にて溶媒を留去し、目的物 1. 20 g を樹脂状物として得た。

[0393] 工程2 : N－ (4－ (5－アミノ－1, 2, 4－オキサジアゾール－3－イル) フェネチル) －1－ (t e r t－ブチル) －4－ (3－メチルフェノキシ) －1H－ピラゾール－5－カルボキサミドの合成

1－ (t e r t－ブチル) －N－ (4－ (5－ (メチルスルフィニル) －1, 2, 4－オキサジアゾール－3－イル) フェネチル) －4－ (3－メチルフェノキシ) －1H－ピラゾール－5－カルボキサミド 520 mg、30 質量%アンモニア水 8 ml 及びテトラヒドロフラン 4 ml の混合溶液を室温にて5時間攪拌した。反応終了後、室温にて水 50 ml を添加し、酢酸エチル (50 ml × 3回) にて抽出した。得られた有機層を無水硫酸ナトリウムにて脱水・乾燥し、減圧下にて溶媒を留去した。得られた残渣を、溶離液としてn－ヘキサン : 酢酸エチル (9 : 1から0 : 10へのグラジエント) を使用するシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し、目的物 380 mg を白色固体として得た。

融点 174 – 176 °C。

[0394] 合成例 8 : 3 – (4 – (2 – (1 – (tert – ブチル) – 4 – (3 – メチルフェノキシ) – 1H – ピラゾール – 5 – カルボキサミド) エチル) フェニル) – N – イソプロピル – 1, 2, 4 – オキサジアゾール – 5 – カルボキサミド (化合物 No. 1 – 147) の合成

1 – (tert – ブチル) – 4 – (3 – メチルフェノキシ) – N – (4 – (5 – (トリクロロメチル) – 1, 2, 4 – オキサジアゾール – 3 – イル) フェネチル) – 1H – ピラゾール – 5 – カルボキサミド 50 mg 及びテトラヒドロフラン 1 ml の混合溶液に、室温にてイソプロピルアミン 90 μl を添加し、同温度にて 16 時間攪拌した。反応終了後、室温にて水 10 ml を添加し、クロロホルム (15 ml × 3 回) にて抽出した。得られた有機層を無水硫酸ナトリウムにて脱水・乾燥し、減圧下にて溶媒を留去した。得られた残渣を、溶離液として n – ヘキサン : 酢酸エチル (9 : 1 から 1 : 9 へのグラジエント) を使用するシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し、目的物 35 mg を油状物として得た。

¹H-NMR (CDCl₃, Me₄Si, 400MHz): δ 7.94–7.90 (m, 1H), 7.42–7.40 (m, 1H), 7.29–7.12 (m, 3H), 7.10 (s, 1H), 7.00–6.87 (m, 2H), 6.76–6.72 (m, 3H), 4.37–4.27 (m, 1H), 3.71–3.63 (m, 2H), 2.91–2.84 (m, 2H), 2.35–2.25 (m, 3H), 1.76–1.66 (m, 9H), 1.35–1.30 (m, 3H), 1.28–1.19 (m, 3H)。

[0395] 合成例 9 : 1 – (tert – ブチル) – N – (4 – (2 – メチル – 2H – テトラゾール – 5 – イル) フェネチル) – 4 – (3 – (トリフルオロメチル) フェノキシ) – 1H – ピ (化合物 No. 1 – 322) の合成

1 – (tert – ブチル) – 4 – (3 – (トリフルオロメチル) フェノキシ) – 1H – ピラゾール – 5 – カルボン酸 38 mg 及び N, N – ジメチルホルムアミド 1 ml の混合溶液に、室温にて 1 – [ビス (ジメチルアミノ) メチレン] – 1H – 1, 2, 3 – トリアゾロ [4, 5 – b] ピリジニウム 3 – オキシドヘキサフルオロホスファート 44 mg、N, N – ジイソプロピルエチルアミン 40 mg 及び 2 – (4 – (2 – メチル – 2H – テトラゾール –

5-イル) フェニルエタン-1-アミン塩酸塩 25 mg を添加し、同温度で 2 時間攪拌した。反応終了後、該反応混合物に飽和塩化アンモニウム水溶液 2 ml を添加し、n-ヘキサン：酢酸エチル=1：1の混合溶液(2 ml × 1 回)にて抽出した。得られた有機層を、無水硫酸ナトリウムにて脱水・乾燥した後、減圧下にて溶媒を留去した。得られた残渣を、溶離液として n-ヘキサン：酢酸エチル(9：1から1：9へのグラジエント)を使用するシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し、目的物 28 mg を油状物として得た。

¹H-NMR (CDCl₃, Me₄Si, 300MHz): δ 7.96-7.93 (m, 2H), 7.39-7.03 (m, 8H), 4.38 (s, 3H), 3.70-3.63 (m, 2H), 2.84 (t, J = 6.8 Hz, 2H), 1.66 (s, 9H)。

[0396] [参考例]

以下に、本発明の化合物の製造中間体の製造方法を、参考例として示す。

[0397] 参考例 1：4-ヨード-1-フェニル-1H-ピラゾール-5-カルボン酸の合成

1-フェニル-1H-ピラゾール-5-カルボン酸 2.0 g 及び酢酸 10 ml の混合溶液に、室温にて N-ヨードスクシンイミド 2.5 g を添加し、80℃にて 30 分間攪拌した。反応終了後、室温にて水 50 ml を添加し、析出した固体をろ取した。得られた固体を減圧下にて乾燥し、目的物 2.69 g を桃色固体として得た。

融点 191-193℃。

[0398] 参考例 2：1-(tert-ブチル)-4-(3-(トリフルオロメチル)フェノキシ)-1H-ピラゾール-5-カルボン酸の合成

工程 1：4-(ジメチルアミノ)-3-(3-(トリフルオロメチル)フェノキシ)ブター-3-エン-2-オンの合成

1-(3-(トリフルオロメチル)フェノキシ)プロパン-2-オン 4.7 g 及び N,N-ジメチルホルムアミドジメチルアセタール 2.9 g の混合溶液を 80℃にて 16 時間攪拌した。反応終了後、減圧下にて溶媒を留去し

た。得られた残渣を、溶離液として酢酸エチルを使用するシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製した。得られた油状物にジイソプロピルエーテル10ml及びn-ヘキサン10mlを添加し、析出した固体をろ取した。得られた固体を減圧下にて乾燥し、目的物2.36gを淡褐色固体として得た。

融点112-114℃。

[0399] 工程2：1-(tert-ブチル)-5-メチル-4-(3-(トリフルオロメチル)フェノキシ)-1H-ピラゾールの合成

4-(ジメチルアミノ)-3-(3-(トリフルオロメチル)フェノキシ)ブタ-3-エン-2-オン2.4g、tert-ブチルヒドラジン塩酸塩1.64g及び1,4-ジオキサン25mlの混合溶液を100℃にて3時間攪拌した。反応終了後、減圧下にて溶媒を留去した。得られた残渣に水20mlを添加し、n-ヘキサン(20ml×2回)にて抽出した。得られた有機層を飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムにて脱水・乾燥した後、減圧下にて溶媒を留去した。得られた残渣を、溶離液としてn-ヘキサン：酢酸エチル(5：1)を使用するシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し、目的物2.51gを淡黄色油状物として得た。

¹H-NMR (CDCl₃, Me₄Si, 300MHz): δ 7.42-7.32 (m, 1H), 7.28 (s, 1H), 7.28-7.22 (m, 1H), 7.21-7.14 (m, 1H), 7.12-7.04 (m, 1H), 2.29 (s, 3H), 1.66 (s, 9H)。

[0400] 工程3：1-(tert-ブチル)-4-(3-(トリフルオロメチル)フェノキシ)-1H-ピラゾール-5-カルボン酸の合成

1-(tert-ブチル)-5-メチル-4-(3-(トリフルオロメチル)フェノキシ)-1H-ピラゾール930mg、tert-ブチルアルコール8.5ml及び水4.3mlの混合溶液に、室温にて過マンガン酸カリウム1.48gを添加し、100℃にて2時間攪拌した。攪拌終了後、該反応混合物に、同温度にて過マンガン酸カリウム1.48gを添加し、同温度にて2時間攪拌した。反応終了後、該反応混合物をセライトでろ過し、セラ

イトを水20mlで洗浄した。得られたろ液の水層をクロロホルム（20ml×2回）で洗浄した後、1mol/l塩酸をpHが1になるまで添加し、クロロホルム（20ml×2回）にて抽出した。得られた有機層を水洗した後、飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムにて脱水・乾燥し、減圧下にて溶媒を留去した。得られた固体をn-ヘキサン5mlで洗浄後、減圧下にて乾燥し、目的物209mgを白色固体として得た。

融点120-124℃。

[0401] 参考例3：1-ベンジル-4-(3-(トリフルオロメチル)フェノキシ)-1H-ピラゾール-5-カルボン酸の合成

工程1：3-(ジメチルアミノ)-2-(3-(トリフルオロメチル)フェノキシ)アクリルアルデヒドの合成

N,N-ジメチルホルムアミド15mlに、氷冷下にてオキシ塩化リン5.6mlを添加し、同温度にて15分間攪拌した。攪拌終了後、該反応混合物に、氷冷下にて1-(2,2-ジメトキシエトキシ)-3-(トリフルオロメチル)ベンゼン5.0gのN,N-ジメチルホルムアミド5ml溶液を添加し、70℃にて30分間攪拌した。反応終了後、該反応混合物を炭酸カリウム28g、水50ml及びエタノール5mlの混合溶液に添加し、室温にて1時間攪拌した。攪拌終了後、該反応混合物をトルエン（40ml×2回）にて抽出した。得られた有機層を水洗した後、飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムにて脱水・乾燥し、減圧下にて溶媒を留去し、目的物4.40gを褐色油状物として得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , Me_4Si , 400MHz): δ 8.82 (s, 1H), 7.52-7.03 (m, 3H), 7.03-6.95 (m, 1H), 6.62 (s, 1H), 3.12 (br, 6H)。

[0402] 工程2：1-ベンジル-4-(3-(トリフルオロメチル)フェノキシ)-1H-ピラゾールの合成

3-(ジメチルアミノ)-2-(3-(トリフルオロメチル)フェノキシ)アクリルアルデヒド2.0g、ベンジルヒドラジン塩酸塩2.4g、トリエチルアミン2.1ml及び1,4-ジオキサン25mlの混合溶液を10

0℃にて3時間攪拌した。反応終了後、室温にて該反応混合物に1mol/l塩酸20mlを添加し、クロロホルム(30ml×2回)にて抽出した。得られた有機層を水洗した後、飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムにて脱水・乾燥し、減圧下にて溶媒を留去した。得られた残渣を、溶離液としてn-ヘキサン：酢酸エチル(9：1から1：9へのグラジエント)を使用するシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し、目的物400mgを赤色油状物として得た。

¹H-NMR (CDCl₃, Me₄Si, 400MHz): δ 7.46-7.20 (m, 7H), 7.20-7.14 (m, 2H), 7.10-7.06 (m, 1H), 7.03-6.96 (m, 1H), 5.29 (s, 2H)

工程3：1-ベンジル-4-(3-(トリフルオロメチル)フェノキシ)-1H-ピラゾール-5-カルボン酸の合成

窒素雰囲気下、1-ベンジル-4-(3-(トリフルオロメチル)フェノキシ)-1H-ピラゾール360mgのテトラヒドロフラン10ml溶液に、-78℃にて1.6mol/lのn-ブチルリチウムのn-ヘキサン溶液0.85mlを滴下し、同温度にて10分間攪拌した。攪拌終了後、該反応混合物に、-78℃にてドライアイス1.0gを添加し、同温度で5分間攪拌した。反応終了後、該反応混合物に1mol/l塩酸10mlを添加し、酢酸エチル(10ml×2回)にて抽出した。得られた有機層を無水硫酸ナトリウムにて脱水・乾燥し、減圧下にて溶媒を留去した。得られた残渣を、溶離液としてn-ヘキサン：酢酸エチル：酢酸(74：25：1から39：60：1へのグラジエント)を使用するシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し、目的物45mgを無色固体として得た。

融点124-126℃。

[0403] 参考例4：1-(tert-ブチル)-4-(3-メチルフェノキシ)-1H-ピラゾール-5-カルボン酸(化合物No. i-036)の合成

工程1：4-(3-ブロモフェノキシ)-1-(tert-ブチル)-1H-ピラゾール-5-カルボン酸メチル(化合物No. ii-004)の合成

(4-(3-ブロモフェノキシ)-1-(tert-ブチル)-1H-ピラゾール-5-カルボン酸 1.00 g 及びアセトン 10 ml の混合溶液に、室温にて炭酸カリウム 0.49 g 及び硫酸ジメチル 0.67 g を順次添加し、同温度にて 3 時間攪拌した。反応終了後、減圧下にて溶媒を留去した。得られた残渣に水 20 ml を添加し、酢酸エチル (20 ml × 2 回) にて抽出した。得られた有機層を無水硫酸ナトリウムにて脱水・乾燥した後、減圧下にて溶媒を留去し、目的物 0.90 g を黄色固体として得た。

融点 69–71 °C。

[0404] 工程 2 : 1-(tert-ブチル)-4-(3-メチルフェノキシ)-1H-ピラゾール-5-カルボン酸メチル (化合物 No. ii-005) の合成

窒素雰囲気下、(4-(3-ブロモフェノキシ)-1-(tert-ブチル)-1H-ピラゾール-5-カルボン酸メチル 0.50 g、トリメチルボロキシ 0.89 g、炭酸セシウム 0.92 g、及び 1,4-ジオキサン 10 ml の混合溶液に、室温にて [1,1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセン] パラジウム (2 価) ジクロリド 0.10 g を添加し、100 °C にて 16 時間攪拌した。反応終了後、該反応混合物に水 20 ml を添加し、酢酸エチル (20 ml × 3 回) にて抽出した。飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムにて脱水・乾燥した後、減圧下にて溶媒を留去した。得られた残渣を、溶離液として n-ヘキサン : 酢酸エチル (10 : 0 から 9 : 1 へのグラジエント) を使用するシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し、目的物 0.30 g を黄色油状物として得た。

¹H-NMR (CDCl₃, Me₄Si, 400MHz) δ 7.24 (s, 1H), 7.20–7.13 (m, 1H), 6.90–6.85 (m, 1H), 6.84–6.76 (m, 2H), 3.77 (s, 3H), 2.33 (s, 3H), 1.72 (s, 3H)。

[0405] 工程 3 : 1-(tert-ブチル)-4-(3-メチルフェノキシ)-1H-ピラゾール-5-カルボン酸 (化合物 No. i-036) の合成

(1-(tert-ブチル)-4-(3-メチルフェノキシ)-1H-ピ

ラゾール-5-カルボン酸メチル 39.0 g 及びメタノール 100 ml の混合溶液に、室温にて水酸化ナトリウム 27.1 g 及び水 100 ml の混合溶液を添加し、45℃にて16時間攪拌した。反応終了後、減圧下にて溶媒を留去した。得られた残渣に水 50 ml を添加した後、35質量%塩酸を pH が2になるまで添加し、析出した固体をろ取した。得られた固体を減圧下にて乾燥後、n-ヘキサン 100 ml で洗浄し、目的物 37.0 g を白色固体として得た。

融点 116-118℃。

[0406] 参考例5：4-(2-(1-(tert-ブチル)-4-(3-(トリフルオロメチル)フェノキシ)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド)エチル)安息香酸の合成

工程1：4-(2-(1-(tert-ブチル)-4-(3-(トリフルオロメチル)フェノキシ)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド)エチル)安息香酸メチルの合成

1-(tert-ブチル)-4-(3-(トリフルオロメチル)フェノキシ)-1H-ピラゾール-5-カルボン酸 3.25 g 及びジクロロメタン 20 ml の混合溶液に、室温にてN,N-ジメチルホルムアミド 7 mg 及び塩化オキサリル 1.3 ml を順次添加し、同温度にて1時間攪拌した。反応終了後、減圧下にて溶媒を留去し、得られた残渣にジクロロメタン 25 ml を添加した。該反応混合物を、4-(2-アミノエチル)安息香酸メチル塩酸塩 2.35 g、トリエチルアミン 4.1 ml 及びジクロロメタン 20 ml の混合溶液に、氷冷下にて添加し、室温にて1時間攪拌した。反応終了後、該反応混合物に水 30 ml を添加し、クロロホルム (10 ml × 1回) にて抽出した。得られた有機層を 1 ml / 1塩酸で洗浄し、無水硫酸ナトリウムにて脱水・乾燥した後、減圧下にて溶媒を留去した。得られた残渣を、溶離液としてn-ヘキサン：酢酸エチル (9：1から8：2へのグラジエント) を使用するシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製した。得られた固体をn-ヘキサン 10 ml で洗浄し、目的物 3.19 g を白色固体として得た

。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz): δ 7.88–7.81 (m, 2H), 7.45–7.30 (m, 2H), 7.23–7.16 (m, 3H), 7.13 (s, 1H), 7.10–7.00 (m, 1H), 6.52–6.39 (m, 1H), 3.89 (s, 3H), 3.73–3.61 (m, 2H), 2.86 (t, $J = 6.8$ Hz, 2H), 1.72 (s, 9H)。

。 工程2：4-(2-(1-(tert-ブチル)-4-(3-(トリフルオロメチル)フェノキシ)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド)エチル)安息香酸の合成

4-(2-(1-(tert-ブチル)-4-(3-(トリフルオロメチル)フェノキシ)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド)エチル)安息香酸メチル 1.20 g 及びエタノール 8 ml の混合溶液に、室温にて 1 mol/l 水酸化ナトリウム水溶液 8 ml を添加し、同温度にて 1 時間攪拌した。反応終了後、減圧下にて溶媒を留去した。得られた残渣に 1 mol/l 塩酸 10 ml を添加し、酢酸エチル (20 ml \times 1 回) にて抽出した。得られた有機層を無水硫酸ナトリウムにて脱水・乾燥した後、減圧下にて溶媒を留去した。得られた固体をジイソプロピルエーテル 5 ml で洗浄し、目的物 0.84 g を白色固体として得た。

[0407] 参考例6：1-(tert-ブチル)-N-(4-(N'-ヒドロキシカルバムイミドイル)フェネチル)-4-(3-(トリフルオロメチル)フェノキシ)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミドの合成

工程1：1-(tert-ブチル)-N-(4-シアノフェネチル)-4-(3-(トリフルオロメチル)フェノキシ)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミドの合成

1-(tert-ブチル)-4-(3-(トリフルオロメチル)フェノキシ)-1H-ピラゾール-5-カルボン酸 1.63 g 及びジクロロメタン 10 ml の混合溶液に、室温にて塩化オキサリル 0.95 g 及び N, N-ジメチルホルムアミド 4 mg を順次添加し、同温度にて 1 時間攪拌した。反応終了後、減圧下にて溶媒を留去し、得られた残渣に酢酸エチル 10 ml を添加

した。該反応混合物を、4-(2-アミノエチル)ベンゾニトリル塩酸塩1.00g、炭酸カリウム1.71g及び水10mlの混合溶液に、氷冷下にて添加し、室温にて15時間攪拌した。反応終了後、該反応混合物の有機層を1mol/l塩酸で洗浄し、無水硫酸ナトリウムにて脱水・乾燥した後、減圧下にて溶媒を留去した。得られた残渣を、溶離液として酢酸エチルを使用するシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し、目的物2.26gを橙色固体として得た。

融点：124-125℃。

[0408] 工程2：1-(tert-ブチル)-N-(4-(N'-ヒドロキシカルバムイミドイル)フェネチル)-4-(3-(トリフルオロメチル)フェノキシ)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミドの合成

1-(tert-ブチル)-N-(4-シアノフェネチル)-4-(3-(トリフルオロメチル)フェノキシ)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド1.26g及びエタノール10mlの混合溶液に、室温にてヒドロキシルアミン塩酸塩0.23g及び炭酸カリウム0.46gを順次添加し、80℃にて1時間攪拌した。攪拌終了後、同温度にて50質量%ヒドロキシルアミン水溶液0.36gを添加し、同温度にて3時間攪拌した。反応終了後、該反応混合物に水30mlを添加し、析出した固体をろ取した。得られた固体を減圧下にて乾燥後、ジソプロピルエーテル20mlで洗浄し、目的物1.00gを淡桃色固体として得た。

融点126-128℃。

[0409] 参考例7：1-(tert-ブチル)-N-(4-カルバモチオイルフェネチル)-4-(3-(トリフルオロメチル)フェノキシ)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミドの合成

1-(tert-ブチル)-N-(4-シアノフェネチル)-4-(3-(トリフルオロメチル)フェノキシ)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド0.50g及びN,N-ジメチルホルムアミド5mlの混合溶液に、室温にて塩化マグネシウム0.11g及び水酸化ナトリウム水和物(純度：7

0質量%) 176mgを順次添加し、同温度にて3時間攪拌した。反応終了後、減圧下にて溶媒を留去し、得られた残渣に酢酸エチル10mlを添加した。該反応混合物を、4-(2-アミノエチル)ベンゾニトリル塩酸塩1.00g、炭酸カリウム1.71g及び水10mlの混合溶液に、氷冷下にて添加し、室温にて15時間攪拌した。反応終了後、該反応混合物に水10mlを添加し、酢酸エチル(10ml×1回)にて抽出した。得られた有機層を水洗後、無水硫酸ナトリウムにて脱水・乾燥し、減圧下にて溶媒を留去し、目的物530mgを淡黄色固体として得た。

融点164-166℃。

[0410] 参考例8：1-(tert-ブチル)-5-メチル-4-(3-(トリフルオロメチル)フェノキシ)-1H-ピラゾールの合成

工程1：3-オキソ-2-(3-(トリフルオロメチル)フェノキシ)ブタナールの合成

4-(ジメチルアミノ)-3-(3-(トリフルオロメチル)フェノキシ)ブタ-3-エン-2-オン3.00g及びトルエン30mlの混合溶液に、室温にて1mol/l塩酸を添加し、50℃にて7時間攪拌した。反応終了後、該反応混合物をトルエン(30ml×1回)にて抽出した。得られた有機層を飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムにて脱水・乾燥し、減圧下にて溶媒を留去した。得られた固体をジイソプロピルエーテル10mlで洗浄し、目的物2.34gを淡褐色固体として得た。

融点：115-117℃。

[0411] 工程2：1-(tert-ブチル)-5-メチル-4-(3-(トリフルオロメチル)フェノキシ)-1H-ピラゾールの合成

3-オキソ-2-(3-(トリフルオロメチル)フェノキシ)ブタナール830mg、tert-ブチルヒドラジン塩酸塩500mg及びトルエン8mlの混合溶液を50℃にて4時間攪拌した。反応終了後、該反応混合物を水10ml、次いで1mol/l水酸化ナトリウム水溶液10mlで洗浄した。得られた有機層を無水硫酸ナトリウムにて脱水・乾燥した後、減圧下に

て溶媒を留去し、目的物 970 mg を淡黄色油状物として得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz): δ 7.42-7.32 (m, 1H), 7.28 (s, 1H), 7.28-7.22 (m, 1H), 7.21-7.14 (m, 1H), 7.12-7.04 (m, 1H), 2.29 (s, 3H), 1.66 (s, 9H)。

[0412] 参考例 9 : 1 - (t e r t - ブチル) - 4 - (3 - メチルフェノキシ) - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボン酸の合成

工程 1 : 4 - (3 - ブロモフェノキシ) - 1 - (t e r t - ブチル) - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボン酸メチルの合成

4 - (3 - ブロモフェノキシ) - 1 - (t e r t - ブチル) - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボン酸 1.00 g 及びアセトン 10 ml の混合溶液に、室温にて炭酸カリウム 0.49 g 及び硫酸ジメチル 0.67 g を順次添加し、同温度にて 3 時間攪拌した。反応終了後、減圧下にて溶媒を留去した。得られた残渣に水 20 ml を添加し、酢酸エチル (20 ml \times 2 回) にて抽出した。得られた有機層を無水硫酸ナトリウムにて脱水・乾燥した後、減圧下にて溶媒を留去し、目的物 0.90 g を黄色固体として得た。

融点 69 - 71 $^{\circ}\text{C}$ 。

[0413] 工程 2 : 1 - (t e r t - ブチル) - 4 - (3 - メチルフェノキシ) - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボン酸メチル (化合物 No. i i - 005) の合成

窒素雰囲気下、4 - (3 - ブロモフェノキシ) - 1 - (t e r t - ブチル) - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボン酸メチル 0.50 g、トリメチルボロキシ 0.89 g、炭酸セシウム 0.92 g 及び 1, 4 - ジオキサ ン 10 ml の混合溶液に、室温にて [1, 1' - ビス (ジフェニルホスフィノ) フェロセン] パラジウム (2 価) ジクロリド 0.10 g を添加し、100 $^{\circ}\text{C}$ にて 16 時間攪拌した。反応終了後、該反応混合物に水 20 ml を添加し、酢酸エチル (20 ml \times 3 回) にて抽出した。飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムにて脱水・乾燥した後、減圧下にて溶媒を留去した。得られた残渣を、溶離液として n - ヘキサン : 酢酸エチル (10 : 0 から 9 : 1 へのグラジ

エント) を使用するシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し、目的物 0.30 g を黄色油状物として得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , Me_4Si , 400MHz) δ 7.24 (s, 1H), 7.20–7.13 (m, 1H), 6.90–6.85 (m, 1H), 6.84–6.76 (m, 2H), 3.77 (s, 3H), 2.33 (s, 3H), 1.72 (s, 3H)

工程3: 1-(tert-ブチル)-4-(3-メチルフェノキシ)-1H-ピラゾール-5-カルボン酸の合成

1-(tert-ブチル)-4-(3-メチルフェノキシ)-1H-ピラゾール-5-カルボン酸メチル 39.0 g 及びメタノール 100 ml の混合溶液に、室温にて水酸化ナトリウム 27.1 g 及び水 100 ml の混合溶液を添加し、45℃にて16時間攪拌した。反応終了後、減圧下にて溶媒を留去した。得られた残渣に水 50 ml を添加した後、35質量%塩酸を pH が 2 になるまで添加し、析出した固体をろ取した。得られた固体を減圧下にて乾燥後、n-ヘキサン 100 ml で洗浄し、目的物 37.0 g を白色固体として得た。

融点 116–118℃。

[0414] 参考例10: 1-(tert-ブチル)-4-(3-メチルフェノキシ)-1H-ピラゾール-5-カルボン酸エチルの合成

工程1: 2-(3-メチルフェノキシ)アセトアルデヒドの合成

20質量%塩酸 102 ml 及びアセトン 60 ml の混合溶液に、室温にて 1-(2,2-ジメトキシエトキシ)-3-メチルベンゼン 20 g を 2.5 時間かけて滴下し、同温度にて1時間攪拌した。攪拌終了後、室温にて20質量%塩酸 34 ml を添加し、同温度にて30分攪拌した。反応終了後、該反応混合物にトルエン 6.6 ml 及びヘプタン 13.4 ml を添加し、分液操作によって水層を分離した。得られた有機層に水 40 ml を添加し、水層を抽出した。得られた水層を合わせて、塩化ナトリウム 12 g を添加した後、クロロホルムで抽出 (120 ml × 3回) した。得られた有機層を、飽和食塩水・無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥した後、減圧下にて溶媒約 2

00 ml を留去し、トルエン 200 ml を添加し、再度、減圧下にて溶媒を留去することで、目的物 14.5 g を含有するトルエン溶液 45 g を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ : 9.88-9.86 (m, 1H), 7.20-7.14 (m, 1H), 6.87-6.67 (m, 3H), 4.56 (s, 2H), 2.33 (s, 3H)。

[0415] 工程 2: 4-モルホリノ-2-オキソ-3-(3-メチルフェノキシ)ブター-3-エン酸エチルの合成

モルホリン 12.7 g 及びトルエン 300 ml の混合溶液に、20 kPa、58°C の還流条件下にて、工程 1 で得られた 2-(3-メチルフェニル)アセトアルデヒド 13.8 g を含有するトルエン溶液 42 g を 2 時間かけて滴下した。滴下に伴って、トルエン及び水の混合溶液が蒸留された。滴下終了後、同条件下にて 1 時間攪拌した。攪拌終了後、初留分を合わせて、トルエン及び水の混合溶液 92 g が蒸留された。同減圧下にて、10°C まで氷冷した後、減圧を解除した。該反応混合物に、氷冷下にて、トリエチルアミン 19.6 g 及びクロログリオキシル酸エチル 26.4 g を順次滴下し、同温度にて 1 時間攪拌した。攪拌終了後、室温にて終夜攪拌した。反応終了後、該反応混合物に水 60 ml を添加し、分液操作によって有機層を抽出した。得られた有機層を、飽和食塩水・無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥した後、減圧下にて溶媒を留去した。得られた残渣を、溶離液として n-ヘキサン:酢酸エチル (1:1 から 1:4 へのグラジエント) を使用するシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し、目的物 19 g を油状物として得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ : 7.53-7.51 (m, 1H), 7.17-7.11 (m, 1H), 6.83-6.70 (m, 3H), 4.38-4.25 (m, 2H), 3.75-3.40 (m, 8H), 1.42-1.22 (m, 6H)。

[0416] 工程 3: 1-(tert-ブチル)-4-(3-メチルフェノキシ)-1H-ピラゾール-5-カルボン酸エチルの合成

4-モルホリノ-2-オキソ-3-(3-メチルフェノキシ)ブター-3-エン酸エチル 5.1 g、tert-ブチルヒドラジン塩酸塩 2.2 g 及びトルエン 30 ml の混合溶液に、酢酸 1 ml を添加し、80°C にて 3 時間攪拌

した。攪拌終了後、該反応混合物にエタノール30mlを添加し、氷冷下にて10質量%水酸化ナトリウム水溶液36gを滴下した。滴下終了後、40℃にて3時間攪拌した。反応終了後、反応混合物にトルエン20mlを添加し、分液操作によって有機層を抽出した。得られた有機層を飽和食塩水・無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥した後、減圧下にて溶媒を留去し、目的物1.1gを油状物として得た。

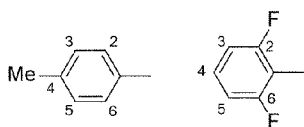
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ : 7.20–7.09 (m, 2H), 6.87–6.61 (m, 3H), 4.24–4.16 (m, 2H), 2.31 (s, 3H), 1.71 (s, 9H), 1.15–1.10 (m, 3H)。

[0417] 本発明の化合物は、前記合成例及び参考例に準じて合成することができる。合成例1～9と同様に製造した、本発明の化合物の例を、第1表～第2表に、さらに参考例1～10と同様に製造した製造中間体の例を第3表～第5表に示すが、本発明の化合物及び製造中間体はこれらのみ限定されない。

[0418] 表中、「Me」と記載される置換基は「メチル」を表し、以下同様に「Et」は「エチル」を表し、「nPr」は「ノルマルプロピル」を表し、「tBu」は「ターシャリーブチル」を表し、「iPr」は「イソプロピル」を表し、「cPr」は「シクロプロピル」を表し、「cHex」は「シクロヘキシル」を表し、「nBu」は「ノルマルブチル」を表し、「iBu」は「イソブチル」を表し、「Ac」は「アセチル」を表し、「Ph」は「フェニル」を表し、「Bn」は「ベンジル」を表す。また、「*」の表記は、化合物が融点のない油状物又は樹脂状の化合物であることを表し、「m. p.」は融点（単位は℃）を表す。

[0419] また表中、例えば、「4-Me-Ph」中の「4-」の記載は、下記に記載の通りフェニル基上の置換位置を表す。例えば「4-Me-Ph」は4-メチルフェニル、「2,6-F₂-Ph」は2,6-ジフルオロフェニルを表す。

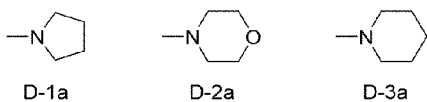
[0420] [化44]



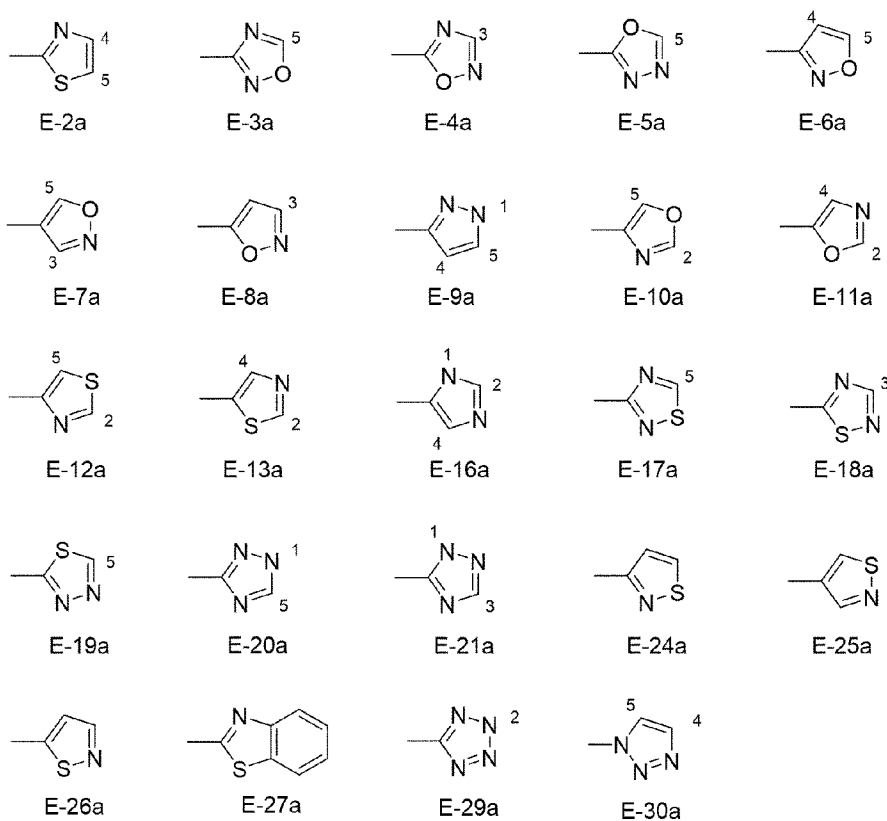
また、D-1a、D-2a、D-3a、E-2a、E-3a、E-4a、

E-5a、E-6a、E-7a、E-8a、E-9a、E-10a、E-11a、E-12a、E-13a、E-16a、E-17a、E-18a、E-19a、E-20a、E-21a、E-24a、E-25a、E-26a、E-27a、E-29a、E-30a、F-2a、F-3a、F-4a、L-1、L-2、L-3、L-4、L-5、L-6、L-7、L-8及びL-9で表される置換基は、それぞれ下記の構造を表す。

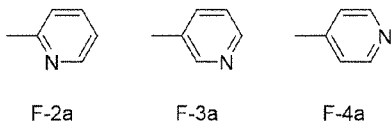
[化45]



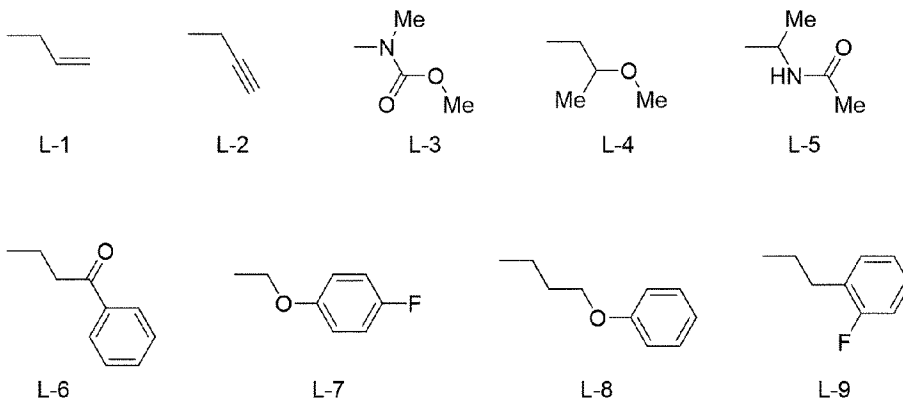
[化46]



[化47]

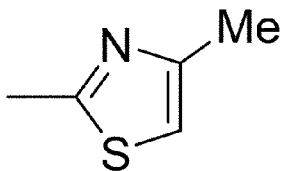


[化48]



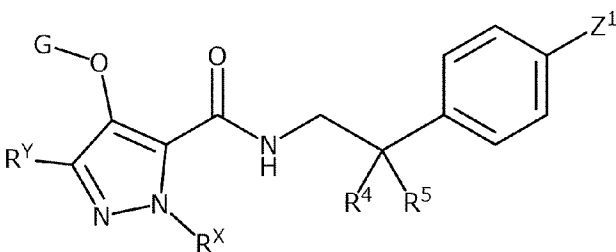
なお、上記の構造式に於いて記された番号は置換位置を表す番号であり、例えば、表中「4-Me-(E-2a)」の記載は、以下の構造を表す。置換基の記載がない構造式は無置換であることを表す。

[0421] [化49]



[第1表]

[化50]



No.	G	Z ¹	R ^X	R ^Y	R ⁴	R ⁵	m. p. (°C)
1-001	3-CF ₃ -Ph	3-Me-(E-4a)	tBu	H	H	H	129-130
1-002	3-CF ₃ -Ph	5-OH-(E-3a)	tBu	H	H	H	197-199

1-003	3-CF ₃ -Ph	5-Me-(E-3a)	tBu	H	H	H	119-121
1-004	3-CF ₃ -Ph	5-cPr-(E-3a)	tBu	H	H	H	114-116
1-005	3-CF ₃ -Ph	5-Et-(E-3a)	tBu	H	H	H	117-119
1-006	3-CF ₃ -Ph	5-iPr-(E-3a)	tBu	H	H	H	116-118
1-007	3-CF ₃ -Ph	5-CF ₃ -(E-3a)	tBu	H	H	H	126-128
1-008	3-CF ₃ -Ph	5-CF ₂ H-(E-3a)	tBu	H	H	H	123-125
1-009	3-CF ₃ -Ph	5-OMe-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-010	3-CF ₃ -Ph	5-OEt-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-011	3-CF ₃ -Ph	4-Me-(E-2a)	tBu	H	H	H	*
1-012	3-CF ₃ -Ph	4-cPr-(E-2a)	tBu	H	H	H	*
1-013	3-CF ₃ -Ph	3-CF ₃ -(E-4a)	tBu	H	H	H	125-127
1-014	3-CF ₃ -Ph	4-CF ₃ -(E-2a)	tBu	H	H	H	118-120
1-015	3-CF ₃ -Ph	3-Et-(E-4a)	tBu	H	H	H	136-138
1-016	3-Me-Ph	3-Me-(E-4a)	tBu	H	H	H	109-111
1-017	3-Me-Ph	3-Et-(E-4a)	tBu	H	H	H	50-53
1-018	3-Me-Ph	5-Me-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-019	3-Me-Ph	5-CF ₃ -(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-020	3-Me-Ph	5-CF ₂ H-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-021	3-Me-Ph	5-Et-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-022	3-Me-Ph	5-nPr-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-023	3-Me-Ph	5-iPr-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-024	3-Me-Ph	5-cPr-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-025	3-Me-Ph	5-CH ₂ OMe-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-026	3-Me-Ph	5-SMe-(E-3a)	tBu	H	H	H	109-111
1-027	3-CF ₃ -Ph	5-nPr-(E-5a)	tBu	H	H	H	83-86
1-028	3-CF ₃ -Ph	5-Me-(E-5a)	tBu	H	H	H	111-113
1-029	3-Me-Ph	5-SH-(E-3a)	tBu	H	H	H	162-164
1-030	Ph	5-Me-(E-3a)	tBu	H	H	H	90-92

1-031	Ph	5-Et-(E-3a)	tBu	H	H	H	94-96
1-032	Ph	5-nPr-(E-3a)	tBu	H	H	H	75-77
1-033	Ph	5-iPr-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-034	Ph	5-cPr-(E-3a)	tBu	H	H	H	117-119
1-035	Ph	5-nBu-(E-3a)	tBu	H	H	H	58-60
1-036	Ph	5-CH ₂ OMe-(E-3a)	tBu	H	H	H	85-87
1-037	Ph	5-CF ₂ H-(E-3a)	tBu	H	H	H	85-87
1-038	Ph	5-CF ₃ -(E-3a)	tBu	H	H	H	116-118
1-039	Ph	5-SH-(E-3a)	tBu	H	H	H	171-173
1-040	Ph	5-SMe-(E-3a)	tBu	H	H	H	110-112
1-041	3-Cl-Ph	5-Me-(E-3a)	tBu	H	H	H	122-124
1-042	3-Cl-Ph	5-Et-(E-3a)	tBu	H	H	H	117-119
1-043	3-Cl-Ph	5-nPr-(E-3a)	tBu	H	H	H	109-111
1-044	3-Cl-Ph	5-iPr-(E-3a)	tBu	H	H	H	80-82
1-045	3-Cl-Ph	5-cPr-(E-3a)	tBu	H	H	H	142-144
1-046	3-Cl-Ph	5-nBu-(E-3a)	tBu	H	H	H	105-107
1-047	3-Cl-Ph	5-CH ₂ OMe-(E-3a)	tBu	H	H	H	97-99
1-048	3-Cl-Ph	5-CF ₂ H-(E-3a)	tBu	H	H	H	117-119
1-049	3-Cl-Ph	5-CF ₃ -(E-3a)	tBu	H	H	H	102-104
1-050	3-Cl-Ph	5-SH-(E-3a)	tBu	H	H	H	169-171
1-051	3-Cl-Ph	5-SMe-(E-3a)	tBu	H	H	H	117-119
1-052	Ph	3-Me-(E-4a)	tBu	H	H	H	100-102
1-053	Ph	3-Et-(E-4a)	tBu	H	H	H	109-111
1-054	Ph	3-nPr-(E-4a)	tBu	H	H	H	77-79
1-055	Ph	3-cPr-(E-4a)	tBu	H	H	H	131-133
1-056	Ph	3-iPr-(E-4a)	tBu	H	H	H	128-130
1-057	Ph	5-Me-(E-5a)	tBu	H	H	H	131-133
1-058	Ph	5-Et-(E-5a)	tBu	H	H	H	128-130

1-059	Ph	5-nPr-(E-5a)	tBu	H	H	H	100-102
1-060	Ph	5-iPr-(E-5a)	tBu	H	H	H	97-99
1-061	Ph	5-cPr-(E-5a)	tBu	H	H	H	127-129
1-062	Ph	5-CH ₂ OMe-(E-5a)	tBu	H	H	H	95-97
1-063	3-Cl-Ph	3-Me-(E-4a)	tBu	H	H	H	115-117
1-064	3-Cl-Ph	3-Et-(E-4a)	tBu	H	H	H	117-119
1-065	3-Cl-Ph	3-nPr-(E-4a)	tBu	H	H	H	97-99
1-066	3-Cl-Ph	3-cPr-(E-4a)	tBu	H	H	H	141-143
1-067	3-Cl-Ph	3-iPr-(E-4a)	tBu	H	H	H	84-86
1-068	3-Cl-Ph	5-Me-(E-5a)	tBu	H	H	H	112-114
1-069	3-Cl-Ph	5-Et-(E-5a)	tBu	H	H	H	149-151
1-070	3-Cl-Ph	5-nPr-(E-5a)	tBu	H	H	H	127-129
1-071	3-Cl-Ph	5-iPr-(E-5a)	tBu	H	H	H	115-117
1-072	3-Cl-Ph	5-cPr-(E-5a)	tBu	H	H	H	169-171
1-073	3-Cl-Ph	5-CH ₂ OMe-(E-5a)	tBu	H	H	H	127-129
1-074	3-CF ₃ -Ph	E-4a	tBu	H	H	H	*
1-075	3-Me-Ph	5-SH-(E-3a)	tBu	H	H	H	162-164
1-076	3-Me-Ph	5-CH ₂ OEt-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-077	3-Me-Ph	3-nPr-(E-4a)	tBu	H	H	H	*
1-078	3-Me-Ph	3-cPr-(E-4a)	tBu	H	H	H	*
1-079	3-Me-Ph	2-Me-(E-12a)	tBu	H	H	H	*
1-080	3-CF ₃ -Ph	3-nPr-(E-4a)	tBu	H	H	H	117-119
1-081	3-CF ₃ -Ph	3-cPr-(E-4a)	tBu	H	H	H	135-137
1-082	3-Me-Ph	E-25a	tBu	H	H	H	*
1-083	3-Me-Ph	5-Me-(E-7a)	tBu	H	H	H	*
1-084	3-Me-Ph	E-12a	tBu	H	H	H	98-99
1-085	3-Me-Ph	E-13a	tBu	H	H	H	*
1-086	3-Me-Ph	2-Me-(E-13a)	tBu	H	H	H	91-93

1-087	3-Me-Ph	3, 5-Me ₂ -(E-7a)	tBu	H	H	H	*
1-088	3-Me-Ph	E-26a	tBu	H	H	H	*
1-089	3-Me-Ph	1-Me-(E-9a)	tBu	H	H	H	113-115
1-090	3-Me-Ph	5-Cl-(E-17a)	tBu	H	H	H	*
1-091	3-Me-Ph	1-iPr-(E-21a)	tBu	H	H	H	*
1-092	3-Me-Ph	2-cPr-(E-11a)	tBu	H	H	H	*
1-093	3-Me-Ph	1, 2-Me ₂ -(E-16a)	tBu	H	H	H	*
1-094	3-CF ₃ -Ph	2-Me-(E-12a)	tBu	H	H	H	*
1-095	3-Me-Ph	5-C(=NOMe)Me-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-096	3-CF ₃ -Ph	5-C(=NOMe)Me-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-097	3-Me-Ph	5-CH(OMe)Me-(E-3a)	tBu	H	H	H	60-62
1-098	3-CF ₃ -Ph	5-CH(OMe)Me-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-099	3-CF ₃ -Ph	2-Et-(E-12a)	tBu	H	H	H	*
1-100	3-CF ₃ -Ph	2-iPr-(E-12a)	tBu	H	H	H	*
1-101	3-CF ₃ -Ph	2-cPr-(E-12a)	tBu	H	H	H	*
1-102	3-CF ₃ -Ph	2-CH ₂ OMe-(E-12a)	tBu	H	H	H	*
1-103	3-Me-Ph	2-Et-(E-12a)	tBu	H	H	H	*
1-104	3-Me-Ph	2-iPr-(E-12a)	tBu	H	H	H	*
1-105	3-Me-Ph	2-cPr-(E-12a)	tBu	H	H	H	*
1-106	3-Me-Ph	2-CH ₂ OMe-(E-12a)	tBu	H	H	H	*
1-107	3-CF ₃ -Ph	5-CCl ₃ -(E-3a)	tBu	H	H	H	149-151
1-108	3-Me-Ph	E-24a	tBu	H	H	H	*
1-109	3-Me-Ph	1-Et-(E-9a)	tBu	H	H	H	*
1-110	3-Me-Ph	1-CH ₂ OMe-(E-9a)	tBu	H	H	H	*
1-111	3-CF ₃ -Ph	1-Me-(E-9a)	tBu	H	H	H	*
1-112	3-CF ₃ -Ph	1-CH ₂ OMe-(E-9a)	tBu	H	H	H	*
1-113	3-CF ₃ -Ph	1-Et-(E-9a)	tBu	H	H	H	*
1-114	3-CF ₃ -Ph	5-CH ₂ OMe-(E-3a)	tBu	H	H	H	*

1-115	3-CF ₃ -Ph	5-SH-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-116	3-CF ₃ -Ph	5-SMe-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-117	3-CF ₃ -Ph	5-Et-(E-5a)	tBu	H	H	H	116-118
1-118	3-CF ₃ -Ph	5-cPr-(E-5a)	tBu	H	H	H	*
1-119	3-CF ₃ -Ph	5-CH ₂ OMe-(E-5a)	tBu	H	H	H	*
1-120	3-CF ₃ -Ph	E-27	tBu	H	H	H	*
1-121	3-CF ₃ -Ph	3-Me-(E-18a)	tBu	H	H	H	*
1-122	3-Me-Ph	3-Me-(E-18a)	tBu	H	H	H	117-119
1-123	3-Me-Ph	5-Et-(E-5a)	tBu	H	H	H	*
1-124	3-Me-Ph	5-cPr-(E-5a)	tBu	H	H	H	*
1-125	3-Me-Ph	5-Me-(E-5a)	tBu	H	H	H	79-81
1-126	3-Me-Ph	5-nPr-(E-5a)	tBu	H	H	H	*
1-127	3-CF ₃ -Ph	2-Me-(E-10a)	tBu	H	H	H	144-146
1-128	3-CF ₃ -Ph	5-NHcHex-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-129	3-CF ₃ -Ph	5-(D-3a)-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-130	3-CF ₃ -Ph	5-C(O)(D-3a)-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-131	3-CF ₃ -Ph	1-iPr-(E-9a)	tBu	H	H	H	*
1-132	3-Me-Ph	1-iPr-(E-9a)	tBu	H	H	H	*
1-133	3-CF ₃ -Ph	5-NH ₂ -(E-3a)	tBu	H	H	H	192-194
1-134	3-CF ₃ -Ph	5-N(Me)C(O)Me-(E-3a)	tBu	H	H	H	169-171
1-135	3-CF ₃ -Ph	5-C(O)NHMe-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-136	3-Me-Ph	5-(D-3a)-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-137	3-Me-Ph	5-C(O)(D-3a)-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-138	3-CF ₃ -Ph	5-N(Me)SO ₂ Me-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-139	3-Me-Ph	5-CH ₂ OMe-(E-5a)	tBu	H	H	H	*
1-140	3-CF ₃ -Ph	5-C(O)NHnBu-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-141	3-CF ₃ -Ph	3-NMe ₂ -(E-4a)	tBu	H	H	H	144-146
1-142	3-CF ₃ -Ph	5-NHC(O)Me-(E-3a)	tBu	H	H	H	171-173

1-143	3-Me-Ph	5-C(0)NHMe-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-144	3-Me-Ph	5-C(0)NHEt-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-145	3-Me-Ph	5-NH ₂ -(E-3a)	tBu	H	H	H	174-176
1-146	3-Me-Ph	5-NHEt-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-147	3-Me-Ph	5-C(0)NH <i>i</i> Pr-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-148	3-CF ₃ -Ph	5-cPr-(E-19a)	tBu	H	H	H	128-130
1-149	3-Me-Ph	5-cPr-(E-19a)	tBu	H	H	H	*
1-150	3-Me-Ph	5-C(0)NH ₂ -(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-151	3-Me-Ph	5-NH <i>i</i> Pr-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-152	3-Me-Ph	5-NHC(0)Me-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-153	3-Me-Ph	5-C(0)NHcHex-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-154	3-Me-Ph	5-C(0)NHtBu-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-155	3-Me-Ph	5-NHcHex-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-156	3-Me-Ph	5-NHMe-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-157	3-Me-Ph	5-(D-1a)-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-158	3-Me-Ph	5-C(0)(D-1a)-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-159	3-Me-Ph	5-CH ₂ OC(0)Me-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-160	3-Me-Ph	5-CH ₂ OH-(E-3a)	tBu	H	H	H	55-57
1-161	3-Me-Ph	5-NHC(0)NEt ₂ -(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-162	3-Me-Ph	5-C(0)N(Me)Et-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-163	3-Me-Ph	5-(D-2a)-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-164	3-Me-Ph	5-NHC(0)OMe-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-165	3-Me-Ph	5-C(0)(D-2a)-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-166	3-Me-Ph	5-N(Me)Et-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-167	3-Me-Ph	5-NHSO ₂ Me-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-168	3-Me-Ph	5-NMe ₂ -(E-3a)	tBu	H	H	H	132-135
1-169	3-Me-Ph	5-N(OMe)Me-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-170	3-Me-Ph	5-NHC(0)NMe ₂ -(E-3a)	tBu	H	H	H	*

1-171	3-Me-Ph	5-C(O)NMe ₂ -(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-172	3-CF ₃ -Ph	5-C(O)NMe ₂ -(E-3a)	tBu	H	H	H	140-142
1-173	Ph	5-CH(SMe)Me-(E-3a)	tBu	H	H	H	
1-174	3-CF ₃ -Ph	5-CH(SMe)Me-(E-3a)	tBu	H	H	H	102-104
1-175	Ph	5-CH(SOMe)Me-(E-3a)	tBu	H	H	H	49-51
1-176	3-CF ₃ -Ph	5-CH(SOMe)Me-(E-3a)	tBu	H	H	H	121-123
1-177	Ph	5-CH(SO ₂ Me)Me-(E-3a)	tBu	H	H	H	52-54
1-178	3-CF ₃ -Ph	5-CH(SO ₂ Me)Me-(E-3a)	tBu	H	H	H	146-148
1-179	Ph	5-CH ₂ SMe-(E-3a)	tBu	H	H	H	74-76
1-180	3-CF ₃ -Ph	5-CH ₂ SMe-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-181	Ph	5-CH ₂ SOMe-(E-3a)	tBu	H	H	H	54-56
1-182	3-CF ₃ -Ph	5-CH ₂ SOMe-(E-3a)	tBu	H	H	H	142-144
1-183	Ph	5-CH ₂ SO ₂ Me-(E-3a)	tBu	H	H	H	151-153
1-184	3-CF ₃ -Ph	5-CH ₂ SO ₂ Me-(E-3a)	tBu	H	H	H	130-132
1-185	Ph	5-CH(SEt)Me-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-186	3-CF ₃ -Ph	5-CH(SEt)Me-(E-3a)	tBu	H	H	H	75-77
1-187	Ph	5-CH(SOEt)Me-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-188	3-CF ₃ -Ph	5-CH(SOEt)Me-(E-3a)	tBu	H	H	H	77-79
1-189	Ph	5-CH(SO ₂ Et)Me-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-190	3-CF ₃ -Ph	5-CH(SO ₂ Et)Me-(E-3a)	tBu	H	H	H	95-97
1-191	Ph	5-CH ₂ SEt-(E-3a)	tBu	H	H	H	80-82
1-192	3-CF ₃ -Ph	5-CH ₂ SEt-(E-3a)	tBu	H	H	H	80-82
1-193	Ph	5-CH ₂ SOEt-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-194	3-CF ₃ -Ph	5-CH ₂ SOEt-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-195	Ph	5-CH ₂ SO ₂ Et-(E-3a)	tBu	H	H	H	115-117
1-196	3-CF ₃ -Ph	5-CH ₂ SO ₂ Et-(E-3a)	tBu	H	H	H	65-67
1-197	Ph	5-CH(SMe)Et-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-198	3-CF ₃ -Ph	5-CH(SMe)Et-(E-3a)	tBu	H	H	H	*

1-199	Ph	5-CH(SOMe)Et-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-200	3-CF ₃ -Ph	5-CH(SOMe)Et-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-201	Ph	5-CH(SO ₂ Me)Et-(E-3a)	tBu	H	H	H	99-101
1-202	3-CF ₃ -Ph	5-CH(SO ₂ Me)Et-(E-3a)	tBu	H	H	H	120-122
1-203	Ph	5-CH(SEt)Et-(E-3a)	tBu	H	H	H	100-102
1-204	3-CF ₃ -Ph	5-CH(SEt)Et-(E-3a)	tBu	H	H	H	72-74
1-205	Ph	5-CH(SOEt)Et-(E-3a)	tBu	H	H	H	130-132
1-206	3-CF ₃ -Ph	5-CH(SOEt)Et-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-207	Ph	5-CH(SO ₂ Et)Et-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-208	3-CF ₃ -Ph	5-CH(SO ₂ Et)Et-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-209	Ph	5-CH ₂ tBu-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-210	3-CF ₃ -Ph	5-CH ₂ tBu-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-211	Ph	5-cHex-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-212	3-CF ₃ -Ph	5-cHex-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-213	Ph	5-Ph-(E-3a)	tBu	H	H	H	137-139
1-214	3-CF ₃ -Ph	5-Ph-(E-3a)	tBu	H	H	H	117-119
1-215	Ph	5-CH(NHAc)Me-(E-3a)	tBu	H	H	H	89-91
1-216	3-CF ₃ -Ph	5-CH(NHAc)Me-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-217	Ph	5-CH ₂ NHAc-(E-3a)	tBu	H	H	H	171-173
1-218	3-CF ₃ -Ph	5-CH ₂ NHAc-(E-3a)	tBu	H	H	H	100-102
1-219	3-Me-Ph	5-CH ₂ tBu-(E-3a)	tBu	H	H	H	70-72
1-220	3-Me-Ph	5-cHex-(E-3a)	tBu	H	H	H	55-57
1-221	3-Me-Ph	5-Ph-(E-3a)	tBu	H	H	H	112-114
1-222	3-Me-Ph	5-CH(NHAc)Me-(E-3a)	tBu	H	H	H	
1-223	3-Me-Ph	5-CH ₂ NHAc-(E-3a)	tBu	H	H	H	
1-224	Ph	5-NMe ₂ -(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-225	3-CF ₃ -Ph	5-NMe ₂ -(E-3a)	tBu	H	H	H	
1-226	Ph	5-N(OMe)Me-(E-3a)	tBu	H	H	H	*

1-227	3-CF ₃ -Ph	5-N(OMe)Me-(E-3a)	tBu	H	H	H	
1-228	Ph	5-NHOMe-(E-3a)	tBu	H	H	H	
1-229	3-CF ₃ -Ph	5-NHOMe-(E-3a)	tBu	H	H	H	
1-230	Ph	5-(D-1a)-(E-3a)	tBu	H	H	H	94-96
1-231	3-CF ₃ -Ph	5-(D-1a)-(E-3a)	tBu	H	H	H	
1-232	Ph	5-(D-2a)-(E-3a)	tBu	H	H	H	130-132
1-233	3-CF ₃ -Ph	5-(D-2a)-(E-3a)	tBu	H	H	H	115-117
1-234	Ph	5-N(Me)SO ₂ Me-(E-3a)	tBu	H	H	H	
1-235	3-CF ₃ -Ph	5-N(Me)SO ₂ Me-(E-3a)	tBu	H	H	H	
1-236	Ph	5-N(Et)SO ₂ Me-(E-3a)	tBu	H	H	H	
1-237	3-CF ₃ -Ph	5-N(Et)SO ₂ Me-(E-3a)	tBu	H	H	H	
1-238	Ph	5-N(L-1)SO ₂ Me-(E-3a)	tBu	H	H	H	
1-239	3-CF ₃ -Ph	5-N(L-1)SO ₂ Me-(E-3a)	tBu	H	H	H	
1-240	Ph	5-N(L-2)SO ₂ Me-(E-3a)	tBu	H	H	H	
1-241	3-CF ₃ -Ph	5-N(L-2)SO ₂ Me-(E-3a)	tBu	H	H	H	
1-242	Ph	5-N(Me)Et-(E-3a)	tBu	H	H	H	82-84
1-243	3-CF ₃ -Ph	5-N(Me)Et-(E-3a)	tBu	H	H	H	
1-244	Ph	5-C(O)NHMe-(E-3a)	tBu	H	H	H	
1-245	3-CF ₃ -Ph	5-C(O)NHMe-(E-3a)	tBu	H	H	H	
1-246	Ph	5-C(O)NHEt-(E-3a)	tBu	H	H	H	
1-247	3-CF ₃ -Ph	5-C(O)NHEt-(E-3a)	tBu	H	H	H	
1-248	Ph	5-C(O)(D-1a)-(E-3a)	tBu	H	H	H	
1-249	3-CF ₃ -Ph	5-C(O)(D-1a)-(E-3a)	tBu	H	H	H	55-57
1-250	Ph	5-C(O)(D-3a)-(E-3a)	tBu	H	H	H	
1-251	3-CF ₃ -Ph	5-C(O)(D-3a)-(E-3a)	tBu	H	H	H	
1-252	Ph	5-C(O)(D-2a)-(E-3a)	tBu	H	H	H	
1-253	3-CF ₃ -Ph	5-C(O)(D-2a)-(E-3a)	tBu	H	H	H	
1-254	Ph	5-C(O)N(Me)Et-(E-3a)	tBu	H	H	H	

1-255	3-CF ₃ -Ph	5-C(O)N(Me)Et-(E-3a)	tBu	H	H	H	
1-256	Ph	5-CCl ₃ -(E-3a)	tBu	H	H	H	
1-257	Ph	5-N(Me)Ac-(E-3a)	tBu	H	H	H	
1-258	3-CF ₃ -Ph	5-N(Me)Ac-(E-3a)	tBu	H	H	H	
1-259	Ph	5-CH(OEt)Me-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-260	3-Me-Ph	5-NHSO ₂ CF ₃ -(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-261	3-Me-Ph	5-CH(OEt)Me-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-262	3-Me-Ph	5-CH(OEt)Et-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-263	3-Me-Ph	5-CH(OH)Et-(E-3a)	tBu	H	H	H	139-141
1-264	3-Me-Ph	5-(L-3)-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-265	3-Me-Ph	5-NHC(O)NHMe-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-266	3-Me-Ph	5-C(O)NHOH-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-267	3-Me-Ph	5-CH(SO ₂ Me)Me-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-268	3-Me-Ph	5-CH(SO ₂ Et)Me-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-269	3-Me-Ph	5-CF ₂ Cl-(E-3a)	tBu	H	H	H	82-84
1-270	Ph	5-CF ₂ Cl-(E-3a)	tBu	H	H	H	112-114
1-271	3-Me-Ph	5-N(Me)C(O)Me-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-272	3-Me-Ph	5-NHOH-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-273	3-Me-Ph	5-CH(SMe)Me-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-274	3-Me-Ph	5-CH(SEt)Me-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-275	3-Me-Ph	5-C(=NOMe)Et-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-276	3-Me-Ph	5-CH ₂ SMe-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-277	3-Me-Ph	5-CH ₂ SEt-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-278	3-Me-Ph	5-CH ₂ SOMe-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-279	3-Me-Ph	5-CH ₂ SOEt-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-280	3-Me-Ph	5-CH ₂ SO ₂ Me-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-281	3-Me-Ph	5-CH ₂ SO ₂ Et-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-282	3-Me-Ph	5-NHOMe-(E-3a)	tBu	H	H	H	*

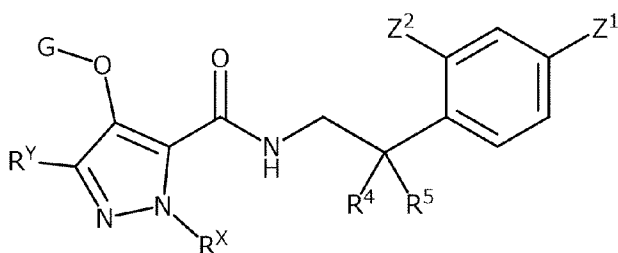
1-283	3-Me-Ph	5-CH(Cl)Me-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-284	3-Me-Ph	5-CH ₂ Br-(E-3a)	tBu	H	H	H	95-97
1-285	3-Me-Ph	5-CH ₂ CN-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-286	3-Me-Ph	5-N(Me)SO ₂ Me-(E-3a)	tBu	H	H	H	132-134
1-287	3-CF ₃ -Ph	5-tBu-(E-3a)	tBu	H	H	H	93-95
1-288	3-Me-Ph	5-tBu-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-289	Ph	5-tBu-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-290	3-CF ₃ -Ph	3-tBu-(E-4a)	tBu	H	H	H	123-124
1-291	3-Me-Ph	3-tBu-(E-4a)	tBu	H	H	H	*
1-292	Ph	3-tBu-(E-4a)	tBu	H	H	H	*
1-293	3-CF ₃ -Ph	3-iBu-(E-4a)	tBu	H	H	H	*
1-294	3-Me-Ph	3-iBu-(E-4a)	tBu	H	H	H	*
1-295	Ph	3-iBu-(E-4a)	tBu	H	H	H	*
1-296	3-CF ₃ -Ph	5-Et-(E-3a)	iPr	H	H	H	*
1-297	Ph	5-Et-(E-3a)	iPr	H	H	H	*
1-298	3-CF ₃ -Ph	5-Et-(E-3a)	F-2a	H	H	H	*
1-299	Ph	5-Et-(E-3a)	F-2a	H	H	H	123-124
1-300	Ph	5-Et-(E-3a)	Ph	H	H	H	139-140
1-301	3-CF ₃ -Ph	5-CH(OMe)Et-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-302	3-CF ₃ -Ph	5-(L-4)-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-303	3-Me-Ph	5-CH(OMe)Et-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-304	3-Me-Ph	5-(L-4)-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-305	Ph	5-CH(OMe)Et-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-306	Ph	5-(L-4)-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-307	3-Me-Ph	5-CH(=NOMe)-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-308	3-CF ₃ -Ph	E-3a	tBu	H	H	H	*
1-309	3-Me-Ph	E-3a	tBu	H	H	H	*
1-310	Ph	E-3a	tBu	H	H	H	112-114

1-311	3-Me-Ph	5-CH ₂ NHC(O)Ph-(E-3a)	tBu	H	H	H	147-149
1-312	3-Me-Ph	5-CH ₂ NHC(O)Me-(E-3a)	tBu	H	H	H	146-148
1-313	3-Me-Ph	5-(L-5)-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-314	3-CF ₃ -Ph	5-Et-(E-3a)	Me	H	H	H	*
1-315	3-Me-Ph	3-Me-(E-8a)	tBu	H	H	H	107-109
1-316	3-CF ₃ -Ph	3-Me-(E-8a)	tBu	H	H	H	139-141
1-317	3-Me-Ph	5-Me-(E-6a)	tBu	H	H	H	121-122
1-318	3-CF ₃ -Ph	5-Me-(E-6a)	tBu	H	H	H	124-125
1-319	Ph	5-Me-(E-6a)	tBu	H	H	H	106-107
1-320	3-Me-Ph	2-Me-(E-29a)	tBu	H	H	H	*
1-321	Ph	2-Me-(E-29a)	tBu	H	H	H	*
1-322	3-CF ₃ -Ph	2-Me-(E-29a)	tBu	H	H	H	*
1-323	3-Me-Ph	2-Et-(E-29a)	tBu	H	H	H	*
1-324	Ph	2-Et-(E-29a)	tBu	H	H	H	*
1-325	3-CF ₃ -Ph	2-Et-(E-29a)	tBu	H	H	H	*
1-326	3-Me-Ph	5-(L-6)-(E-3a)	tBu	H	H	H	113-114
1-327	Ph	4-Me-(E-30a)	tBu	H	H	H	124-126
1-328	3-Me-Ph	4-Me-(E-30a)	tBu	H	H	H	152-154
1-329	3-CF ₃ -Ph	4-Me-(E-30a)	tBu	H	H	H	157-159
1-330	3-Me-Ph	5-CFH ₂ -(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-331	Ph	5-CFH ₂ -(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-332	3-CF ₃ -Ph	5-CFH ₂ -(E-3a)	tBu	H	H	H	120-122
1-333	Ph	5-CH ₂ NMeSO ₂ Me-(E-3a)	tBu	H	H	H	132-134
1-334	3-Me-Ph	5-CH ₂ NMeSO ₂ Me-(E-3a)	tBu	H	H	H	132-134
1-335	3-CF ₃ -Ph	5-CH ₂ NMeSO ₂ Me-(E-3a)	tBu	H	H	H	132-134
1-336	Ph	3-OMe-(E-4a)	tBu	H	H	H	*
1-337	3-Me-Ph	3-OMe-(E-4a)	tBu	H	H	H	*
1-338	3-Me-Ph	5-(L-7)-(E-3a)	tBu	H	H	H	*

1-339	3-Me-Ph	5-CH(Me)Ph-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-340	3-CF ₃ -Ph	3-OMe-(E-4a)	tBu	H	H	H	149-151
1-341	3-Me-Ph	2-nPr-(E-29a)	tBu	H	H	H	*
1-342	Ph	2-nPr-(E-29a)	tBu	H	H	H	*
1-343	3-CF ₃ -Ph	2-nPr-(E-29a)	tBu	H	H	H	*
1-344	3-Me-Ph	2-iPr-(E-29a)	tBu	H	H	H	*
1-345	Ph	2-iPr-(E-29a)	tBu	H	H	H	*
1-346	3-CF ₃ -Ph	2-iPr-(E-29a)	tBu	H	H	H	*
1-347	Ph	5-(D-3a)-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-348	3-CF ₃ -Ph	5-(L-8)-(E-3a)	tBu	H	H	H	*
1-349	3-CF ₃ -Ph	5-(L-9)-(E-3a)	tBu	H	H	H	*

[第2表]

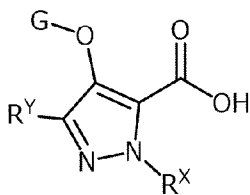
[化51]



No.	G	Z ¹	Z ²	R ^X	R ^Y	R ⁴	R ⁵	m. p. (°C)
2-001	3-CF ₃ -Ph	1-Me-(E-21a)	OMe	tBu	H	H	H	*
2-002	3-CF ₃ -Ph	1-Me-(E-20a)	OMe	tBu	H	H	H	*
2-003	3-Me-Ph	3-Me-(E-4a)	OMe	tBu	H	H	H	*
2-004	3-Me-Ph	3-cPr-(E-4a)	OMe	tBu	H	H	H	*

[第3表]

[化52]

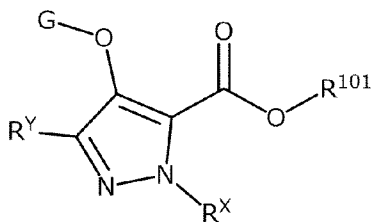


No.	G	R ^X	R ^Y	m. p. (°C)
i-001	3-CF ₃ -Ph	Ph	H	177-179
i-002	3-CF ₃ -Ph	tBu	H	120-124
i-003	3-CF ₃ -Ph	Bn	H	124-126
i-004	3-CF ₃ -Ph	Me	H	
i-005	3-CF ₃ -Ph	2-Cl-Ph	H	
i-006	3-CF ₃ -Ph	3-Cl-Ph	H	177-180
i-007	3-CF ₃ -Ph	4-Cl-Ph	H	
i-008	2-F-3-cPr-Ph	Ph	H	
i-009	3-Br-Ph	tBu	H	95-102
i-010	2-F-3-Cl-Ph	tBu	H	153-155
i-011	Ph	tBu	H	142-144
i-012	2-CF ₃ -Ph	tBu	H	139-141
i-013	4-CF ₃ -Ph	tBu	H	131-133
i-014	3-F-Ph	tBu	H	154-156
i-015	2-Cl-Ph	tBu	H	166-168
i-016	3-Cl-Ph	tBu	H	122-124
i-017	4-Cl-Ph	tBu	H	119-121
i-018	2,3-Cl ₂ -Ph	tBu	H	160-162
i-019	2,4-Cl ₂ -Ph	tBu	H	143-145
i-020	3,4-Cl ₂ -Ph	tBu	H	143-145

i-021	3-I-Ph	tBu	H	121-123
i-022	3-OMe-Ph	tBu	H	145-147
i-023	3-OCF ₃ -Ph	tBu	H	112-114
i-024	3-NMe ₂ -Ph	tBu	H	126-130
i-025	3-CF ₃ -Ph	iPr	H	177-179
i-026	Ph	iPr	H	142-144
i-027	Ph	Ph	H	176-178
i-028	2-F-3-Br-Ph	tBu	H	
i-029	2-F-3-cPr-Ph	tBu	H	
i-030	3-CF ₃ -Ph	F-2a	H	115-117
i-031	3-CF ₃ -Ph	F-3a	H	191-193
i-032	3-CF ₃ -Ph	F-4a	H	166-168
i-033	Ph	F-2a	H	121-123
i-034	Ph	F-3a	H	187-189
i-035	Ph	F-4a	H	153-155
i-036	3-Me-Ph	tBu	H	116-118
i-037	3-SMe-Ph	tBu	H	117-119
i-038	3-CF ₃ -Ph	tBu	Br	126-128
i-039	3-Me-Ph	tBu	Cl	105-107
i-040	2-F-Ph	tBu	H	118-120
i-041	2, 3-F ₂ -Ph	tBu	H	129-131
i-042	2-F-3-OMe-Ph	tBu	H	171-174

[第4表]

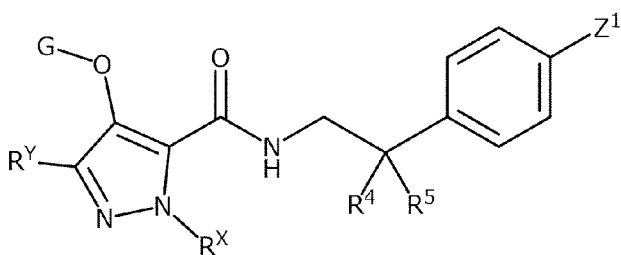
[化53]



No.	G	R ^X	R ^Y	R ¹⁰¹	m. p. (°C)
ii-001	3-CF ₃ -Ph	tBu	H	Me	
ii-002	2-F-3-Br-Ph	tBu	H	Me	
ii-003	2-F-3-cPr-Ph	tBu	H	Me	
ii-004	3-Br-Ph	tBu	H	Me	69-71
ii-005	3-Me-Ph	tBu	H	Me	*

[第5表]

[化54]



No.	G	Z ¹	R ^X	R ^Y	R ⁴	R ⁵	m. p. (°C)
ia-001	Ph	C(=NOH)NH ₂	tBu	H	H	H	142-144
ia-002	3-Cl-Ph	C(=NOH)NH ₂	tBu	H	H	H	169-171
ia-003	Ph	C(O)OMe	tBu	H	H	H	
ia-004	3-Cl-Ph	C(O)OMe	tBu	H	H	H	

ia-005	Ph	C(=O)OH	tBu	H	H	H	73-76
ia-006	3-Cl-Ph	C(=O)OH	tBu	H	H	H	142-144

第1表～第2表に示す本発明の化合物のうち、融点の記載のない化合物の¹H-NMRデータを第6表に示す。尚、下記データは、重クロロホルム中で測定したデータであり、「#1」の表記は、300MHz（機種；JNM-ECX300又はJNM-ECP300、JEOL社製）にて測定したことを表し、同様に「#2」は、400MHz（機種；JNM-ECZ400S、JEOL社製）にて測定したことを表す。

[0422] [第6表]

No. ¹H-NMR (CDCl₃, Me₄Si)

1-009(#1): δ 7.44-7.40 (m, 3H), 7.39-7.30 (m, 3H), 7.26-7.22 (m, 1H), 7.16 (s, 1H), 7.14-7.07 (m, 1H), 6.60-6.50 (m, 1H), 3.67 (q, J = 6.8 Hz, 2H), 2.88 (t, J = 7.1 Hz, 2H), 3.27 (s, 3H), 1.72 (s, 9H)。

1-010(#1): δ 7.48-7.30 (m, 6H), 7.26-7.23 (m, 1H), 7.16 (s, 1H), 7.13-7.07 (m, 1H), 6.55-6.45 (m, 1H), 3.74-3.62 (m, 4H), 2.88 (t, J = 7.1 Hz, 2H), 1.72 (s, 9H), 1.24 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

1-011(#1): δ 7.76 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.40-7.27 (m, 2H), 7.25-7.13 (m, 4H), 7.08-7.01 (m, 1H), 6.85 (s, 1H), 6.50-6.40 (m, 1H), 3.66 (q, J = 6.7 Hz, 2H), 2.83 (t, J = 6.9 Hz, 2H), 2.98 (s, 3H), 1.72 (s, 9H)。

1-012(#1): δ 7.73 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.40-7.28 (m, 2H), 7.24-7.20 (m, 1H), 7.19-7.12 (m, 3H), 7.07-7.01 (m, 1H), 6.80 (s, 1H), 6.48-6.38 (m, 1H), 3.65 (q, J = 6.5 Hz, 2H), 2.82 (t, J = 6.8 Hz, 2H), 2.14-1.95 (m, 1H), 1.72 (s, 9H), 0.99-0.93 (m, 4H)。

1-018(#1): δ 7.89 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.24 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.19-

7.10 (m, 2H), 6.92–6.85 (m, 1H), 6.77–6.68 (m, 3H), 3.66 (q, J = 6.5 Hz, 2H), 2.86 (t, J = 7.1 Hz, 2H), 2.64 (s, 3H), 2.29 (s, 3H), 1.72 (s, 9H)。

1-019(#1): δ 7.90 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.28 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.19–7.11 (m, 1H), 7.09 (s, 1H), 6.90–6.84 (m, 1H), 6.78–6.68 (m, 3H), 3.69 (q, J = 6.5 Hz, 2H), 2.89 (t, J = 6.8 Hz, 2H), 2.29 (s, 3H), 1.73 (s, 9H)。

1-020(#1): δ 7.91 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.27 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.19–7.09 (m, 2H), 6.90–6.84 (m, 1H), 6.86 (t, J = 52.5 Hz, 1H), 6.78–6.68 (m, 3H), 3.68 (q, J = 6.6 Hz, 2H), 2.88 (t, J = 6.9 Hz, 2H), 2.28 (s, 3H), 1.73 (s, 9H)。

1-021(#2): δ 7.91 (d, J = 6.0 Hz, 2H), 7.24 (d, J = 6.3 Hz, 2H), 7.19–7.15 (m, 1H), 7.12 (s, 1H), 6.91–6.86 (m, 1H), 6.78–6.69 (m, 3H), 3.67 (q, J = 4.9 Hz, 2H), 2.98 (q, J = 6.0 Hz, 2H), 2.86 (t, J = 5.3 Hz, 2H), 2.29 (s, 3H), 1.72 (s, 9H), 1.46 (t, J = 5.6 Hz, 3H)。

1-022(#1): δ 7.90 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.23 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.20–7.09 (m, 2H), 6.91–6.84 (m, 1H), 6.78–6.68 (m, 3H), 3.66 (q, J = 6.3 Hz, 2H), 2.96–2.82 (m, 4H), 2.29 (s, 3H), 2.00–1.84 (m, 2H), 1.73 (s, 9H), 1.07 (t, J = 7.5 Hz, 3H)。

1-023(#1): δ 7.90 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.23 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.19–7.09 (m, 2H), 6.91–6.85 (m, 1H), 6.78–6.67 (m, 3H), 3.66 (q, J = 6.5 Hz, 2H), 3.28 (sep, J = 7.1 Hz, 1H), 2.86 (t, J = 6.9 Hz, 2H), 2.29 (s, 3H), 1.73 (s, 9H), 1.46 (d, J = 7.2 Hz, 6H)。

1-024(#1): δ 7.86 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.22 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.19–7.09 (m, 2H), 6.92–6.85 (m, 1H), 6.80–6.66 (m, 3H), 3.66 (q, J = 6.5 Hz, 2H), 2.85 (t, J = 6.9 Hz, 2H), 2.30–2.20 (m, 4H), 1.72 (s, 9H), 1.35–1.20 (m, 4H)。

1-025(#1): δ 7.93 (d, J = 7.8 Hz, 2H), 7.26 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.19–

7.09 (m, 2H), 6.91–6.85 (m, 1H), 6.78–6.68 (m, 3H), 4.74 (s, 2H), 3.67 (q, J = 6.6 Hz, 2H), 3.56 (s, 3H), 2.86 (t, J = 6.9 Hz, 2H), 2.29 (s, 3H), 1.73 (s, 9H)。

1-033(#1): δ 7.93–7.87 (m, 2H), 7.82–7.18 (m, 4H), 7.12 (s, 1H), 7.09–7.03 (m, 1H), 6.95–6.87 (m, 2H), 6.88–6.56 (m, 1H), 3.70–3.62 (m, 2H), 3.34–3.21 (m, 1H), 2.84 (t, J = 7.0 Hz, 2H), 1.73 (s, 9H), 1.47 (d, J = 6.8 Hz, 6H)。

1-074(#1): δ 8.47 (s, 1H), 8.00–7.94 (m, 2H), 7.43–7.36 (m, 1H), 7.35–7.28 (m, 3H), 7.19 (s, 1H), 7.14 (s, 1H), 7.10–7.05 (m, 1H), 6.56–6.48 (m, 1H), 3.75–3.64 (m, 2H), 2.94–2.86 (m, 2H), 1.72 (s, 9H)。

1-076(#2): δ 7.93 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.25 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.16 (t, J = 7.9 Hz, 1H), 7.12 (s, 1H), 6.89 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 6.75–6.71 (m, 3H), 4.79 (s, 2H), 3.72–3.67 (m, 4H), 2.87 (t, J = 7.0 Hz, 2H), 2.29 (s, 3H), 1.74 (d, J = 11.7 Hz, 9H), 1.31 (t, J = 7.0 Hz, 3H)。

1-077(#1): δ 7.96–7.86 (m, 2H), 7.32–7.21 (m, 2H), 7.19–7.07 (m, 2H), 6.91–6.66 (m, 4H), 3.76–3.62 (m, 2H), 2.89 (t, J = 6.8 Hz, 2H), 2.77 (t, J = 7.5 Hz, 2H), 2.28 (s, 3H), 1.93–1.79 (m, 2H), 1.73 (s, 9H), 1.04 (t, J = 7.3 Hz, 3H)。

1-078(#1): δ 7.94–7.78 (m, 2H), 7.32–7.19 (m, 2H), 7.19–7.05 (m, 2H), 6.94–6.82 (m, 1H), 6.81–6.61 (m, 3H), 3.76–3.59 (m, 2H), 2.88 (t, J = 6.8 Hz, 2H), 2.28 (s, 3H), 2.22–2.08 (m, 1H), 1.73 (s, 9H), 1.18–1.02 (m, 4H)。

1-079(#1): δ 7.73–7.68 (m, 2H), 7.23–7.11 (m, 5H), 6.91–6.86 (m, 1H), 6.78–6.64 (m, 3H), 3.69–3.60 (m, 2H), 2.86–2.79 (m, 2H), 2.77 (s, 3H), 2.27 (s, 3H), 1.73 (s, 9H)。

1-082(#1): δ 8.68 (s, 1H), 8.61 (s, 1H), 7.41–7.35 (m, 2H), 7.23–7.07 (m, 4H), 6.93–6.86 (m, 1H), 6.77–6.68 (m, 3H), 3.71–3.61 (m, 2H), 2.90–2.77 (m, 2H), 2.27 (s, 3H), 1.72 (s, 9H)。

1-083(#1): δ 8.34 (s, 1H), 7.19–7.07 (m, 6H), 6.96–6.89 (m, 1H), 6.81–6.67 (m, 3H), 3.70–3.57 (m, 2H), 2.88–2.78 (m, 2H), 2.38 (s, 3H), 2.28 (s, 3H), 1.75 (s, 9H)。

1-085(#1): δ 8.74 (s, 1H), 8.00 (s, 1H), 7.40–7.35 (m, 2H), 7.21–7.09 (m, 4H), 6.93–6.88 (m, 1H), 6.78–6.68 (m, 3H), 3.70–3.62 (m, 2H), 2.87–2.80 (m, 2H), 2.28 (s, 3H), 1.73 (s, 9H)。

1-087(#1): δ 7.25–7.07 (m, 6H), 6.94–6.89 (m, 1H), 6.82–6.70 (m, 3H), 3.70–3.62 (m, 2H), 2.87–2.80 (m, 2H), 2.37 (s, 3H), 2.30 (s, 3H), 2.23 (s, 3H), 1.74 (s, 9H)。

1-088(#1): δ 8.47–8.44 (m, 1H), 7.43–7.37 (m, 2H), 7.34–7.31 (m, 1H), 7.23–7.09 (m, 4H), 6.93–6.88 (m, 1H), 6.78–6.69 (m, 3H), 3.71–3.62 (m, 2H), 2.89–2.81 (m, 2H), 2.28 (s, 3H), 1.73 (s, 9H)。

1-090(#1): δ 7.74–7.68 (m, 2H), 7.30–7.24 (m, 2H), 7.19–7.07 (m, 2H), 6.92–6.87 (m, 1H), 6.78–6.69 (m, 3H), 3.73–3.64 (m, 2H), 2.93–2.86 (m, 2H), 2.29 (s, 3H), 1.73 (s, 9H)。

1-091(#1): δ 7.96 (s, 1H), 7.45–7.40 (m, 2H), 7.32–7.27 (m, 2H), 7.23–7.11 (m, 2H), 6.95–6.88 (m, 1H), 6.82–6.68 (m, 3H), 4.70–4.60 (m, 1H), 3.71–3.62 (m, 2H), 2.91–2.83 (m, 2H), 2.30 (s, 3H), 1.73 (s, 9H), 1.51 (d, J = 6.5 Hz, 6H)。

1-092(#1): δ 7.39–7.34 (m, 2H), 7.19–7.05 (m, 5H), 6.92–6.87 (m, 1H), 6.75–6.67 (m, 3H), 3.69–3.61 (m, 2H), 2.86–2.78 (m, 2H), 2.28 (s, 3H), 2.17–2.06 (m, 1H), 1.73 (s, 9H), 1.18–1.02 (m, 4H)。

1-093(#1): δ 7.22–7.15 (m, 5H), 7.12 (s, 1H), 6.94–6.89 (m, 2H), 6.81–6.69 (m, 3H), 3.70–3.62 (m, 2H), 3.47 (s, 3H), 2.87–2.80 (m, 2H), 2.44 (s, 3H), 2.30 (s, 3H), 1.73 (s, 9H)。

1-094(#1): δ 7.78–7.66 (m, 2H), 7.44–7.00 (m, 8H), 6.51–6.35 (m, 1H), 3.72–3.60 (m, 2H), 2.82 (t, J = 7.0 Hz, 2H), 2.77 (s, 3H), 1.72 (s, 9H)。

1-095(#1): δ 7.98–7.92 (m, 2H), 7.28–7.21 (m, 2H), 7.19–7.10 (m, 2H), 6.90–6.84 (m, 1H), 6.76–6.68 (m, 3H), 4.20–4.15 (m, 3H), 3.74–3.60 (m, 2H), 2.92–2.81 (m, 2H), 2.39 (s, 3H), 2.30 (s, 3H), 1.73 (s, 9H)。

1-096(#1): δ 7.99–7.90 (m, 2H), 7.44–7.29 (m, 2H), 7.28–7.17 (m, 3H), 7.16–7.00 (m, 2H), 6.52–6.43 (m, 1H), 4.17 (s, 3H), 3.74–3.61 (m, 2H), 2.91–2.80 (m, 2H), 2.38 (s, 3H), 1.72 (s, 9H)。

1-098(#1): δ 7.97–7.89 (m, 2H), 7.44–7.16 (m, 5H), 7.16–7.03 (m, 2H), 6.58–6.44 (m, 1H), 4.77–4.64 (m, 1H), 3.71–3.61 (m, 2H), 3.47 (s, 3H), 2.91–2.79 (m, 2H), 1.72 (s, 9H), 1.69–1.62 (m, 3H)。

1-099(#1): δ 7.79–7.65 (m, 2H), 7.48–6.94 (m, 8H), 6.54–6.33 (m, 1H), 3.72–3.57 (m, 2H), 3.09 (q, J = 7.6 Hz, 2H), 2.82 (t, J = 6.8 Hz, 2H), 1.72 (s, 9H), 1.44 (t, J = 7.6 Hz, 3H)。

1-100(#1): δ 7.79–7.67 (m, 2H), 7.53–6.94 (m, 8H), 6.53–6.33 (m, 1H), 3.74–3.56 (m, 2H), 3.44–3.31 (m, 1H), 2.88–2.69 (m, 2H), 1.72 (s, 9H), 1.45 (d, J = 6.8 Hz, 6H)。

1-101(#1): δ 7.77–7.65 (m, 2H), 7.51–6.94 (m, 8H), 6.52–6.35 (m, 1H), 3.72–3.55 (m, 2H), 2.90–2.71 (m, 2H), 2.45–2.29 (m, 1H), 1.72 (s, 9H), 1.22–1.05 (m, 4H)。

1-102(#1): δ 7.77–7.65 (m, 2H), 7.47–6.99 (m, 8H), 6.55–6.36 (m, 1H), 4.79 (s, 2H), 4.27 (s, 3H), 3.74–3.60 (m, 2H), 2.82 (t, J = 6.8 Hz, 2H), 1.72 (s, 9H)。

1-103(#1): δ 7.80–7.63 (m, 2H), 7.33–7.02 (m, 5H), 6.95–6.56 (m, 4H), 3.70–3.58 (m, 2H), 3.09 (q, J = 7.7 Hz, 2H), 2.82 (t, J = 6.8 Hz, 2H), 2.27 (s, 3H), 1.73 (s, 9H), 1.44 (t, J = 7.7 Hz, 3H)。

1-104(#1): δ 7.78–7.66 (m, 2H), 7.33–7.05 (m, 5H), 6.94–6.58 (m, 4H), 3.70–3.59 (m, 2H), 3.44–3.31 (m, 1H), 2.82 (t, J = 6.8 Hz, 2H), 2.26 (s, 3H), 1.73 (s, 9H), 1.45 (d, J = 6.8 Hz, 6H)。

1-105(#1): δ 7.75–7.64 (m, 2H), 7.22–7.06 (m, 5H), 6.92–6.83 (m, 1H),

6.80–6.55 (m, 3H), 3.70–3.57 (m, 2H), 2.81 (t, J = 6.8 Hz, 2H), 2.42–2.30 (m, 1H), 2.27 (s, 3H), 1.73 (s, 9H), 1.21–1.05 (m, 4H)。

1-106(#1): δ 7.77–7.65 (m, 2H), 7.38 (s, 1H), 7.24–7.05 (m, 4H), 6.93–6.83 (m, 1H), 6.80–6.62 (m, 3H), 4.79 (s, 2H), 3.72–3.59 (m, 2H), 3.53 (s, 3H), 2.82 (t, J = 7.0 Hz, 2H), 2.27 (s, 3H), 1.73 (s, 9H)。

1-108(#1): δ 8.72–8.69 (m, 1H), 7.83–7.78 (m, 2H), 7.57–7.53 (m, 1H), 7.25–7.20 (m, 2H), 7.17–7.10 (m, 2H), 6.90–6.85 (m, 1H), 6.78–6.68 (m, 3H), 3.70–3.64 (m, 2H), 2.89–2.82 (m, 2H), 2.26 (s, 3H), 1.73 (s, 9H)。

1-109(#1): δ 7.69–7.60 (m, 2H), 7.25–7.08 (m, 4H), 6.95–6.60 (m, 5H), 6.49–6.43 (m, 1H), 4.21 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 3.73–3.58 (m, 2H), 2.90–2.75 (m, 2H), 2.27 (s, 3H), 1.73 (s, 9H), 1.54 (t, J = 7.3 Hz, 3H)。

1-110(#1): δ 7.73–7.63 (m, 2H), 7.60–7.56 (m, 1H), 7.24–7.08 (m, 4H), 6.93–6.84 (m, 1H), 6.80–6.54 (m, 4H), 5.42 (s, 2H), 3.69–3.58 (m, 2H), 3.37 (s, 3H), 2.81 (t, J = 6.8 Hz, 2H), 2.28 (s, 3H), 1.73 (s, 9H)。

。

1-111(#1): δ 7.69–7.59 (m, 2H), 7.53–6.97 (m, 6H), 6.56–6.37 (m, 3H), 6.28–6.21 (m, 1H), 3.94 (s, 3H), 3.73–3.59 (m, 2H), 2.87–2.75 (m, 2H), 1.72 (s, 9H)。

1-112(#1): δ 7.74–7.62 (m, 2H), 7.61–7.56 (m, 1H), 7.45–7.00 (m, 7H), 6.62–6.54 (m, 1H), 6.53–6.36 (m, 1H), 5.42 (s, 2H), 3.73–3.59 (m, 2H), 3.37 (s, 3H), 2.81 (t, J = 6.8 Hz, 2H), 1.72 (s, 9H)。

1-113(#1): δ 7.69–7.59 (m, 2H), 7.44–7.00 (m, 8H), 6.52–6.35 (m, 2H), 4.21 (q, J = 7.4 Hz, 2H), 3.72–3.58 (m, 2H), 2.80 (t, J = 7.0 Hz, 2H), 1.72 (s, 9H), 1.53 (t, J = 7.4 Hz, 3H)。

1-114(#1): δ 7.99–7.89 (m, 2H), 7.76–7.66 (m, 1H), 7.57–7.50 (m, 1H), 7.43–7.17 (m, 3H), 7.14 (s, 1H), 7.11–7.02 (m, 1H), 6.53–6.40 (m, 1H), 4.75 (s, 2H), 4.18–4.07 (m, 2H), 3.57 (s, 3H), 2.87 (t, J = 7.0 Hz,

2H), 1.72 (s, 9H)。

1-115(#2): δ 7.62–7.60 (m, 2H), 7.45–7.41 (m, 1H), 7.37–7.35 (m, 1H), 7.31–7.29 (m, 2H), 7.21 (m, 2H), 7.15 (s, 1H), 7.11–7.08 (m, 1H), 6.54–6.51 (m, 1H), 3.71–3.66 (m, 2H), 2.88 (t, J = 6.8 Hz, 2H), 1.71 (s, 9H)。

1-116(#2): δ 7.89–7.87 (m, 2H), 7.47–7.32 (m, 2H), 7.27–7.21 (m, 3H), 7.14 (s, 1H), 7.08–7.04 (m, 1H), 6.48–6.45 (m, 1H), 3.70–3.65 (m, 2H), 2.88–2.84 (m, 2H) 2.79 (s, 3H), 1.72 (s, 9H)。

1-118(#2): δ 7.81–7.78 (m, 2H), 7.40–7.29 (m, 2H), 7.25–7.23 (m, 2H), 7.19 (m, 1H), 7.13 (s, 1H), 7.07–7.04 (m, 1H), 6.50–6.47 (m, 1H), 3.71–3.61 (m, 2H), 2.87 (t, J = 6.8, 2H), 2.24–2.19 (m, 1H), 1.72 (s, 9H), 1.22–1.18 (m, 4H)。

1-119(#1): δ 7.89–7.86 (m, 2H), 7.40–7.28 (m, 4H), 7.18 (m, 1H), 7.13 (s, 1H), 7.07–7.02 (m, 1H), 6.51 (m, 1H), 4.70 (s, 2H), 3.72–3.65 (m, 2H), 3.50 (s, 3H), 2.90–2.86 (m, 2H), 1.71 (s, 9H)。

1-120(#2): δ 8.13–8.03 (m, 2H), 7.80–7.73 (m, 1H), 7.64–7.55 (m, 1H), 7.39–7.35 (m, 4H), 7.33–7.27 (m, 3H), 7.14 (s, 1H), 7.09–7.03 (m, 1H), 6.53–6.46 (m, 1H), 3.75–3.65 (m, 2H), 2.93–2.84 (m, 2H), 1.72 (s, 9H)。

1-121(#2): δ 7.80–7.73 (m, 2H), 7.45–7.32 (m, 3H), 7.31–7.21 (m, 2H), 7.14 (s, 1H), 7.12–7.03 (m, 1H), 6.54–6.43 (m, 1H), 3.74–3.61 (m, 2H), 2.93–2.81 (m, 2H), 2.71 (s, 3H), 1.71 (s, 9H)。

1-123(#2): δ 7.85–7.83 (m, 2H), 7.27–7.25 (m, 2H), 7.17–7.13 (m, 1H), 7.10 (s, 1H), 6.88–6.87 (m, 1H), 6.73–6.71 (m, 3H), 3.73–3.61 (m, 2H), 2.96 (dd, J = 8.0, 14.4 Hz, 2H), 2.87 (t, J = 6.8 Hz, 2H), 2.29 (s, 3H), 1.73 (s, 9H) 1.45 (t, J = 6.8 Hz, 3H)。

1-124(#2): δ 7.80–7.77 (m, 2H), 7.27–7.23 (m, 2H), 7.17–7.13 (m, 1H), 7.10 (s, 1H), 6.88–6.87 (m, 1H), 6.73–6.67 (m, 3H), 3.70–3.65 (m, 2H)

, 2.88–2.84 (m, 2H), 2.29 (s, 3H), 2.26–2.19 (m, 1H), 1.72 (s, 9H), 1.22–1.18 (m, 4H)。

1-126(#2): δ 7.85–7.82 (m, 2H), 7.27–7.25 (m, 2H), 7.17–7.13 (m, 1H), 7.10 (s, 1H), 6.88–6.87 (m, 1H), 6.73–6.67 (m, 3H), 3.70–3.65 (m, 2H), 2.94–2.86 (m, 4H), 2.29 (s, 3H), 1.92–1.86 (m, 2H), 1.72 (s, 9H), 1.07 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

1-128(#2): δ 7.83–7.81 (m, 2H), 7.41–7.31 (m, 2H), 7.22–7.19 (m, 3H), 7.14 (s, 1H), 7.06–7.03 (m, 1H), 6.47 (m, 1H), 5.17–5.13 (m, 1H), 3.73–3.63 (m, 3H), 2.84 (t, J = 7.2 Hz, 2H), 2.12–2.08 (m, 2H), 1.80–1.75 (m, 2H), 1.71 (s, 9H), 1.50–1.19 (m, 6H)。

1-129(#2): δ 7.86–7.81 (m, 2H), 7.44–7.29 (m, 2H), 7.22–7.18 (m, 3H), 7.15 (s, 1H), 7.06–7.00 (m, 1H), 6.49–6.38 (m, 1H), 3.72–3.63 (m, 6H), 2.99–2.82 (t, J = 6.8 Hz, 2H), 1.79–1.69 (m, 15H)。

1-130(#2): δ 7.95–7.92 (m, 2H), 7.41–7.37 (m, 1H), 7.33–7.30 (m, 1H), 7.29–7.25 (m, 2H), 7.19 (s, 1H), 7.15–7.13 (s, 1H), 7.08–7.05 (m, 1H), 6.50–6.48 (m, 1H), 3.83–3.76 (m, 2H), 3.68 (dd, J = 12.8, 6.8 Hz, 2H), 3.63–3.60 (m, 2H), 2.87 (t, J = 6.8 Hz, 2H), 1.79–1.66 (m, 15H)。

1-131(#2): δ 7.70–7.62 (m, 2H), 7.49–7.09 (m, 7H), 7.08–7.01 (m, 1H), 6.54–6.37 (m, 2H), 4.60–4.49 (m, 1H), 3.71–3.60 (m, 2H), 2.80 (t, J = 6.8 Hz, 2H), 1.72 (s, 9H), 1.54 (d, J = 7.0 Hz, 6H)。

1-132(#2): δ 7.69–7.62 (m, 2H), 7.45–7.40 (m, 1H), 7.26–7.10 (m, 4H), 6.99–6.62 (m, 4H), 6.50–6.44 (m, 1H), 4.60–4.49 (m, 1H), 3.68–3.59 (m, 2H), 2.80 (t, J = 6.8 Hz, 2H), 2.27 (s, 3H), 1.73 (s, 9H), 1.54 (d, J = 7.0 Hz, 6H)。

1-135(#2): δ 7.98–7.68 (m, 2H), 7.50–7.29 (m, 2H), 7.26–7.22 (m, 2H), 7.20–7.12 (m, 2H), 7.11 (s, 1H), 7.06–6.87 (m, 1H), 6.51–6.39 (m, 1H), 3.73–3.46 (m, 2H), 3.13–3.02 (m, 3H), 3.00–2.80 (m, 2H), 1.67 (s, 9H)。

1-136(#1): δ 7.95-7.92 (m, 2H), 7.29-7.25 (m, 2H), 7.14-7.11 (m, 2H), 6.80-6.97 (1H), 6.74 (s, 3H), 3.78-3.63 (m, 6H), 2.90-2.88 (m, 2H), 2.32-2.29 (m, 3H), 1.75-1.73 (m, 15H)。

1-137(#2): δ 8.09-7.90 (m, 2H), 7.37-7.20 (m, 2H), 7.18-7.14 (m, 1H), 7.10 (s, 1H), 7.00-6.84 (m, 1H), 6.74-6.72 (m, 3H), 3.80-3.74 (m, 2H), 3.72-3.60 (m, 4H), 2.88 (t, J = 6.8 Hz, 2H), 2.29 (s, 3H), 1.70 (s, 15H)。

1-138(#2): δ 7.47-7.37 (m, 2H), 7.34-7.17 (m, 2H), 7.15-7.11 (s, 1H), 6.97-6.88 (m, 1H), 6.74-6.60 (m, 3H), 3.67 (m, 3H), 2.90-2.81 (m, 2H), 2.35 (m, 3H), 1.75 (s, 12H)。

1-139(#2): δ 7.95-7.82 (m, 2H), 7.33-7.27 (m, 2H), 7.22-7.05 (m, 2H), 6.94-6.87 (m, 1H), 6.82-6.72 (m, 3H), 4.78-4.67 (s, 2H), 3.78-3.61 (m, 2H), 3.58-3.47 (s, 3H), 2.98-2.81 (m, 2H), 2.33-2.24 (s, 3H), 1.89-1.68 (s, 9H)。

1-140(#1): δ 7.96-7.82 (m, 2H), 7.44-7.28 (m, 3H), 7.22-7.19 (m, 2H), 7.15-7.06 (m, 2H), 6.51-6.44 (m, 1H), 5.16-5.12 (m, 1H), 3.73-3.63 (m, 2H), 3.50 (m, 2H), 2.91-2.82 (m, 2H), 1.83-1.58 (m, 9H), 1.52-1.24 (m, 4H), 1.01-0.95 (m, 3H)。

1-143(#2): δ 7.95-7.93 (m, 1H), 7.45-7.43 (m, 1H), 7.32-7.28 (m, 2H), 7.25-7.22 (m, 1H), 7.20-7.11 (m, 2H), 7.02-6.90 (m, 1H), 6.76-6.70 (m, 3H), 3.73-3.65 (m, 2H), 3.13 (d, J = 4.8 Hz, 3H), 2.94-2.85 (m, 2H), 2.37-2.29 (m, 3H), 1.79-1.68 (m, 9H)。

1-144(#2): δ 7.95-7.93 (m, 1H), 7.43-7.41 (m, 1H), 7.30-7.27 (m, 2H), 7.25-7.21 (m, 1H), 7.19-7.12 (m, 2H), 7.01-6.89 (m, 1H), 6.75-6.73 (m, 3H), 3.71-3.62 (m, 2H), 3.60-3.55 (m, 2H), 2.89 (t, J = 6.8 Hz, 2H), 2.36-2.28 (m, 3H), 1.74 (m, 9H), 1.36-1.22 (m, 3H)。

1-146(#2): δ 7.85-7.81 (m, 1H), 7.41-7.33 (m, 1H), 7.30-7.07 (m, 4H), 6.99-6.87 (m, 1H), 6.73-6.65 (m, 3H), 5.16-5.15 (m, 1H), 3.69-3.62 (m

, 2H), 3.55–3.36 (m, 2H), 2.88–2.81 (m, 2H), 2.45–2.16 (m, 3H), 1.71 (s, 9H), 1.35–1.15 (m, 3H)。

1-147(#2): δ 7.94–7.90 (m, 1H), 7.42–7.40 (m, 1H), 7.29–7.12 (m, 3H), 7.10 (s, 1H), 7.00–6.87 (m, 2H), 6.76–6.72 (m, 3H), 4.37–4.27 (m, 1H), 3.71–3.63 (m, 2H), 2.91–2.84 (m, 2H), 2.35–2.25 (m, 3H), 1.76–1.66 (m, 9H), 1.35–1.30 (m, 3H), 1.28–1.19 (m, 3H)。

1-149(#1): δ 7.74–7.66 (m, 2H), 7.24–7.08 (m, 4H), 6.92–6.84 (m, 1H), 6.78–6.66 (m, 3H), 3.73–3.60 (m, 2H), 2.85 (t, J = 6.8 Hz, 2H), 2.48–2.37 (m, 1H), 2.28 (s, 3H), 1.72 (s, 9H), 1.32–1.13 (m, 4H)。

1-150(#2): δ 7.94–7.91 (m, 2H), 7.35–7.26 (m, 2H), 7.23–7.10 (m, 2H), 7.07–7.03 (m, 1H), 6.94–6.87 (m, 2H), 6.81–6.72 (m, 3H), 3.76–3.63 (dd, J = 12.8, 6.8 Hz, 2H), 2.90–2.83 (t, J = 6.8 Hz, 2H), 2.30 (s, 3H), 1.75 (s, 9H)。

1-151(#2): δ 7.86–7.81 (m, 2H), 7.20–7.12 (m, 4H), 6.98–6.89 (m, 1H), 6.76–6.69 (m, 3H), 5.23 (br, 1H), 4.08–3.97 (m, 1H), 3.70–3.64 (m, 2H), 2.92–2.79 (m, 2H), 2.30 (s, 3H), 1.73 (s, 9H), 1.36–1.32 (m, 6H)。

1-152(#2): δ 7.84–7.79 (m, 2H), 7.38–7.19 (m, 3H), 7.17–7.02 (m, 2H), 6.96–6.84 (m, 1H), 6.74–6.67 (m, 3H), 3.65 (dd, J = 12.8, 6.8 Hz, 2H), 2.89 (t, J = 6.8 Hz, 2H), 2.59–2.36 (m, 3H), 2.30 (s, 3H), 1.71 (s, 9H)。

1-153(#1): δ 7.94–7.81 (m, 2H), 7.32–7.26 (m, 2H), 7.22–7.11 (m, 2H), 6.99–6.87 (m, 2H), 6.74–6.72 (m, 3H), 4.16–3.99 (m, 1H), 3.71–3.62 (m, 2H), 2.90–2.82 (t, J = 6.6 Hz, 2H), 2.35–2.30 (m, 3H), 2.09 (m, 1H), 1.73 (m, 12H), 1.51–1.22 (m, 6H)。

1-154(#1): δ 7.94–7.91 (m, 1H), 7.43–7.40 (m, 1H), 7.29–7.19 (m, 4H), 7.11 (s, 1H), 6.97–6.88 (m, 1H), 6.74–6.71 (m, 3H), 3.71–3.63 (m, 2H), 2.87 (t, J = 6.6 Hz, 2H), 2.35–2.30 (m, 3H), 1.73 (s, 9H), 1.63–1.53 (m, 9H)。

1-155(#1): δ 7.84–7.81 (m, 2H), 7.23–7.11 (m, 4H), 6.91–6.88 (m, 1H), 6.74–6.66 (m, 3H), 5.07–5.05 (m, 1H), 3.76–3.62 (m, 3H), 2.86 (t, J = 6.9 Hz, 2H), 2.33 (s, 3H), 2.13–2.09 (m, 1H), 1.73 (m, 12H), 1.51–1.22 (m, 6H)。

1-156(#1): δ 7.85–7.82 (m, 2H), 7.22–7.12 (m, 4H), 6.91–6.88 (m, 1H), 6.75–6.66 (m, 3H), 5.14 (s, 1H), 3.65 (dd, J = 12.8, 7.0 Hz, 2H), 3.15 (s, 3H), 2.84 (t, J = 7.0 Hz, 2H), 2.31 (s, 3H), 1.76 (s, 9H)。

1-157(#2): δ 7.86–7.84 (m, 1H), 7.42–7.40 (m, 1H), 7.30–7.11 (m, 3H), 7.00–6.89 (m, 2H), 6.75–6.67 (m, 3H), 3.69–3.62 (m, 6H), 3.02 (m, 1H), 2.89–2.82 (m, 2H), 2.33 (m, 3H), 1.66 (s, 12H)。

1-158(#2): δ 7.97–7.95 (m, 2H), 7.33–7.27 (m, 2H), 7.19–7.12 (m, 2H), 6.90–6.89 (m, 1H), 6.75–6.73 (m, 3H), 4.00–3.97 (m, 2H), 3.77–3.66 (m, 4H), 2.97–2.87 (m, 2H), 2.30 (s, 3H), 2.10–2.00 (m, 4H), 1.75 (s, 9H)。

1-159(#2): δ 7.91–7.89 (m, 2H), 7.42–7.11 (m, 4H), 6.90–6.88 (m, 1H), 6.74–6.72 (m, 3H), 3.67 (dd, J = 12.8, 6.8 Hz, 2H), 2.87 (t, J = 6.8 Hz, 2H), 2.35–2.05 (m, 8H), 1.57 (s, 9H)。

1-161(#1): δ 8.06–7.90 (m, 1H), 7.83–7.77 (m, 2H), 7.22–7.04 (m, 4H), 6.92–6.84 (m, 1H), 6.79–6.70 (m, 3H), 3.68–3.61 (m, 2H), 3.48–3.36 (m, 4H), 2.88–2.72 (m, 2H), 2.28 (s, 3H), 1.70 (s, 9H), 1.33–1.18 (m, 6H)。

1-162(#1): δ 7.97–7.93 (m, 2H), 7.29–7.27 (m, 2H), 7.20–7.12 (m, 2H), 6.95–6.89 (m, 1H), 6.75–6.73 (m, 3H), 3.72–3.56 (m, 4H), 3.27–3.18 (m, 3H), 2.90 (t, J = 6.6 Hz, 2H), 2.34 (s, 3H), 1.74 (s, 9H), 1.36–1.25 (m, 3H)。

1-163(#1): δ 7.93–7.81 (m, 2H), 7.35–7.07 (m, 4H), 6.96–6.87 (m, 1H), 6.79–6.61 (m, 3H), 3.91–3.76 (m, 4H), 3.73–3.55 (m, 6H), 2.83 (t, J = 7.0 Hz, 2H), 2.35 (s, 3H), 1.77 (s, 9H)。

1-164(#1): δ 7.86–7.79 (m, 2H), 7.43–7.08 (m, 5H), 6.93–6.87 (m, 1H), 6.79–6.71 (m, 3H), 3.89 (s, 3H), 3.76–3.57 (m, 2H), 2.87 (t, J = 6.9 Hz, 2H), 2.27 (s, 3H), 1.77 (s, 9H)。

1-165(#1): δ 7.92–7.90 (m, 2H), 7.28–7.25 (m, 2H), 7.21–7.06 (m, 2H), 6.93–6.86 (m, 1H), 6.73–6.70 (m, 3H), 3.91–3.76 (m, 8H), 3.66 (dd, J = 12.8, 6.9 Hz, 2H), 2.85 (t, J = 6.9 Hz, 2H), 2.29 (s, 3H), 1.70 (s, 9H)。

1-166(#2): δ 7.84–7.81 (m, 2H), 7.21–7.07 (m, 4H), 6.93–6.87 (m, 1H), 6.73–6.64 (m, 3H), 3.67–3.54 (m, 4H), 3.16 (s, 3H), 2.87–2.79 (t, J = 6.8 Hz, 2H), 2.23 (s, 3H), 1.77 (s, 9H), 1.31–1.23 (m, 3H)。

1-167(#1): δ 7.62–7.60 (m, 2H), 7.20–6.99 (m, 4H), 6.91–6.68 (m, 5H), 3.61–3.46 (m, 2H), 3.07 (s, 3H), 2.63–2.63 (m, 2H), 2.31–2.18 (m, 3H), 1.73–1.65 (m, 9H)。

1-169(#2): δ 7.87–7.85 (m, 1H), 7.44–7.12 (m, 6H), 6.96–6.90 (m, 1H), 6.80–6.64 (m, 2H), 3.91 (s, 3H), 3.77–3.64 (m, 2H), 3.39 (s, 3H), 2.97–2.80 (m, 2H), 2.32 (s, 3H), 1.79 (s, 9H)。

1-170(#2): δ 8.04–7.81 (m, 2H), 7.22–7.10 (m, 5H), 6.90–6.88 (m, 1H), 6.74–6.72 (m, 3H), 3.68–3.63 (m, 2H), 3.06 (s, 6H), 2.85 (t, J = 6.7 Hz, 2H), 2.31 (s, 3H), 1.75 (s, 9H)。

1-171(#1): δ 7.98–7.88 (m, 2H), 7.31–7.23 (m, 2H), 7.21–7.08 (m, 2H), 6.95–6.84 (m, 1H), 6.81–6.67 (m, 3H), 3.75–3.61 (m, 2H), 3.31 (s, 3H), 3.20 (s, 3H), 2.94–2.82 (m, 2H), 2.30 (s, 3H), 1.74 (s, 9H)。

1-173(#2): δ 7.94–7.91 (m, 2H), 7.30–7.24 (m, 4H), 7.13 (s, 1H), 7.12–7.05 (m, 1H), 6.95–6.92 (m, 2H), 6.68–6.65 (m, 1H), 4.16 (q, J = 7.6 Hz, 1H), 3.70–3.64 (m, 2H), 2.86 (t, J = 7.2 Hz, 2H), 2.23 (s, 3H), 1.79 (d, J = 7.6 Hz, 3H), 1.74 (s, 9H)。

1-180(#2): δ 7.94–7.91 (m, 2H), 7.41–7.20 (m, 5H), 7.15 (s, 1H), 7.09–7.05 (m, 1H), 6.50–6.6.45 (m, 1H), 3.90 (s, 2H), 3.72–3.65 (m, 2H), 2

.87 (t, J = 7.2 Hz, 2H), 2.30 (s, 3H), 1.73 (s, 9H)。

1-185(#2): δ 7.94-7.91 (m, 2H), 7.32-7.23 (m, 4H), 7.13 (s, 1H), 7.12-7.05 (m, 1H), 6.95-6.92 (m, 2H), 6.69-6.65 (m, 1H), 4.25 (q, J = 7.2 Hz, 1H), 3.70-3.64 (m, 2H), 2.86 (t, J = 6.8 Hz, 2H), 2.72-2.66 (m, 2H), 1.79 (d, J = 7.2 Hz, 3H), 1.73 (s, 9H), 1.28 (t, J = 7.6 Hz, 3H)

。

1-187(#2): δ 7.94-7.89 (m, 2H), 7.32-7.24 (m, 4H), 7.13 (s, 1H), 7.12-7.07 (m, 1H), 6.95-6.92 (m, 2H), 6.70-6.65 (m, 1H), 4.35-4.26 (m, 1H), 3.69-3.63 (m, 2H), 2.88-2.69 (m, 4H), 1.90 (t, J = 7.4 Hz, 3H), 1.73 (s, 9H), 1.43-1.35 (m, 3H)。

1-189(#2): δ 7.93-7.89 (m, 2H), 7.32-7.25 (m, 4H), 7.13 (s, 1H), 7.12-7.08 (m, 1H), 6.95-6.92 (m, 2H), 6.72-6.66 (m, 1H), 4.67-4.62 (q, J = 7.2 Hz, 1H), 3.71-3.64 (m, 2H), 3.34-3.22 (m, 2H), 2.87 (t, J = 7.2 Hz, 2H), 1.99 (d, J = 7.6 Hz, 3H), 1.74 (s, 9H), 1.49 (t, J = 7.6 Hz, 3H)。

1-193(#2): δ 7.94-7.90 (m, 2H), 7.32-7.24 (m, 4H), 7.13 (s, 1H), 7.14-7.95 (m, 1H), 6.95-6.6.91 (m, 2H), 6.70-6.66 (m, 1H), 4.38-4.26 (m, 2H), 3.71-3.64 (m, 2H), 3.03-2.84 (m, 4H), 1.73 (s, 9H), 1.45 (t, J = 7.6 Hz, 3H)。

1-194(#2): δ 7.94-7.91 (m, 2H), 7.43-7.34 (m, 2H), 7.28-7.06 (m, 5H), 6.51-6.47 (m, 1H), 4.40-4.27 (m, 2H), 3.74-3.68 (m, 2H), 3.03-2.87 (m, 4H), 1.74 (s, 9H), 1.47 (t, J = 7.6 Hz, 3H)。

1-197(#2): δ 7.95-7.91 (m, 2H), 7.30-7.24 (m, 4H), 7.13 (s, 1H), 7.10-7.06 (m, 1H), 6.95-6.91 (m, 2H), 6.69-6.64 (m, 1H), 3.93 (t, J = 7.6 Hz, 1H), 3.71-3.64 (m, 2H), 2.86 (t, J = 7.2 Hz, 2H), 2.24-2.07 (m, 5H), 1.74 (s, 9H), 1.10 (t, J = 7.6 Hz, 3H)。

1-198(#2): δ 7.97-7.93 (m, 2H), 7.42-7.33 (m, 2H), 7.29-7.22 (m, 3H), 7.17 (s, 1H), 7.11-7.07 (m, 1H), 6.50-6.46 (m, 1H), 3.96-3.91 (m, 1H)

, 3.73–3.67 (m, 2H), 2.89 (t, J = 6.8 Hz, 2H), 2.25–2.06 (m, 5H), 1.75 (s, 9H), 1.14–1.08 (m, 3H)。

1-199(#2): δ 7.95–7.90 (m, 2H), 7.32–7.25 (m, 4H), 7.14 (s, 1H), 7.11–7.07 (m, 1H), 6.96–6.6.93 (m, 2H), 6.70–6.66 (m, 1H), 4.20–4.15 (m, 1H), 3.70–3.64 (m, 2H), 2.87 (t, J = 7.2 Hz, 2H), 2.63 (s, 3H), 2.46–2.20 (m, 2H), 1.74 (s, 9H), 1.22–1.07 (m, 3H)。

1-200(#2): δ 7.87–7.83 (m, 2H), 7.34–6.99 (m, 7H), 6.43–6.39 (m, 1H), 4.12–3.95 (m, 1H), 3.640–3.58 (m, 2H), 2.80 (t, J = 6.8 Hz, 2H), 2.56–2.54 (m, 3H), 2.42–2.12 (m, 2H), 1.67 (s, 9H), 1.13–1.02 (m, 3H)。

1-206(#2): δ 7.88–7.83 (m, 2H), 7.34–6.99 (m, 7H), 6.43–6.39 (m, 1H), 4.10–3.95 (m, 1H), 3.64–3.58 (m, 2H), 2.82–2.52 (m, 4H), 2.40–2.15 (m, 2H), 1.66 (s, 9H), 1.35–1.25 (m, 3H), 1.13–0.97 (m, 3H)。

1-207(#2): δ 7.95–7.89 (m, 2H), 7.32–7.25 (m, 4H), 7.13 (s, 1H), 7.11–7.06 (m, 1H), 6.95–6.6.92 (m, 2H), 6.71–6.66 (m, 1H), 4.48–4.41 (m, 1H), 3.72–3.63 (m, 2H), 3.31–3.09 (m, 2H), 2.87 (t, J = 7.2 Hz, 2H), 2.61–2.36 (m, 2H), 1.74 (s, 9H), 1.50–1.43 (m, 3H), 1.15–1.06 (m, 3H)。

1-208(#2): δ 7.86–7.83 (m, 2H), 7.33–6.98 (m, 7H), 6.44–6.39 (m, 1H), 4.40–4.35 (m, 1H), 3.65–3.55 (m, 2H), 3.23–3.01 (m, 2H), 2.81 (t, J = 6.8 Hz, 2H), 2.53–2.30 (m, 2H), 1.66 (s, 9H), 1.43–1.32 (m, 3H), 1.07–0.96 (m, 3H)。

1-209(#2): δ 7.94–7.91 (m, 2H), 7.35–7.22 (m, 5H), 7.13 (s, 1H), 7.10–7.07 (m, 1H), 6.95–6.92 (m, 1H), 6.68–6.65 (m, 1H), 3.70–3.62 (m, 2H), 2.88–2.82 (m, 4H), 1.73 (s, 9H), 1.11 (s, 9H)。

1-210(#2): δ 7.95–7.91 (m, 2H), 7.40–7.34 (m, 2H), 7.28–7.21 (m, 3H), 7.16 (s, 1H), 7.09–7.05 (m, 1H), 6.48–6.45 (m, 1H), 3.72–3.65 (m, 2H), 2.89–2.84 (m, 4H), 1.73 (s, 9H), 1.22 (s, 9H)。

1-211(#2): δ 7.93–7.89 (m, 2H), 7.31–7.22 (m, 4H), 7.13 (s, 1H), 7.10–

7.07 (m, 1H), 6.94–6.91 (m, 2H), 6.69–6.64 (m, 1H), 3.70–3.63 (m, 2H), 3.05–3.01 (m, 1H), 2.88–2.82 (t, J = 6.8 Hz, 2H), 2.14–2.12 (m, 2H), 1.91–1.85 (m, 2H), 1.78–1.67 (m, 11H), 1.61–1.26 (m, 4H)。

1-212(#2): δ 7.95–7.91 (m, 2H), 7.42–7.27 (m, 2H), 7.27–7.21 (m, 3H), 7.17 (s, 1H), 7.10–7.06 (m, 1H), 6.49–6.46 (m, 1H), 3.73–3.68 (m, 2H), 3.07–3.01 (m, 1H), 2.88 (t, J = 6.8 Hz, 2H), 2.16–2.13 (m, 2H), 1.91–1.87 (m, 2H), 1.79–1.26 (m, 15H)。

1-216(#2): δ 7.91–7.87 (m, 2H), 7.40–7.33 (m, 2H), 7.28–7.19 (m, 3H), 7.14 (s, 1H), 7.09–7.05 (m, 1H), 6.51–6.47 (m, 1H), 6.20–6.16 (m, 1H), 5.52–5.45 (m, 1H), 3.72–3.65 (m, 2H), 2.87 (t, J = 7.2 Hz, 2H), 2.11 (s, 3H), 1.73 (s, 9H), 1.67–1.61 (m, 3H)。

1-224(#2): δ 7.82–7.74 (m, 2H), 7.25–7.18 (m, 2H), 7.14–7.11 (m, 2H), 7.07 (s, 1H), 7.02–6.6.97 (m, 1H), 6.87–6.84 (m, 2H), 6.57–6.53 (m, 1H), 3.60–3.54 (m, 2H), 3.14 (s, 6H), 2.75 (t, J = 7.2 Hz, 2H), 1.65 (s, 9H)。

1-226(#2): δ 7.88–7.85 (m, 2H), 7.33–7.20 (m, 4H), 7.14 (s, 1H), 7.11–7.07 (m, 1H), 6.95–6.6.92 (m, 1H), 6.66–6.63 (m, 1H), 6.57–6.53 (m, 1H), 3.92 (s, 3H), 3.69–3.63 (m, 2H), 3.41 (s, 3H), 2.84 (t, J = 7.2 Hz, 2H), 1.73 (s, 9H)。

1-259(#1): δ 7.92 (d, J = 8.2 Hz, 2H), 7.35–7.20 (m, 4H), 7.12 (s, 1H), 7.11–7.02 (m, 1H), 6.98–6.88 (m, 2H), 6.75–6.58 (m, 1H), 4.86–4.74 (m, 1H), 3.74–3.54 (m, 4H), 2.85 (t, J = 7.0 Hz, 2H), 1.72 (s, 9H), 1.67 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 1.27 (t, J = 7.0 Hz, 3H)。

1-260(#2): δ 7.52–6.75 (m, 11H), 3.59 (s, 2H), 2.74 (s, 2H), 2.32–2.26 (m, 3H), 1.90–1.66 (m, 9H)。

1-261(#2): δ 7.93 (d, J = 7.7 Hz, 2H), 7.33–7.10 (m, 4H), 6.94–6.85 (m, 1H), 6.80–6.67 (m, 3H), 4.80 (q, J = 6.6 Hz, 1H), 3.75–3.55 (m, 4H), 2.92–2.82 (m, 2H), 2.29 (s, 3H), 1.77–1.64 (m, 12H), 1.27 (t, J = 7

.0 Hz, 3H)。

1-262(#2): δ 7.94 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.31-7.10 (m, 3H), 6.96-6.84 (m, 2H), 6.78-6.68 (m, 3H), 4.58 (t, J = 6.8 Hz, 1H), 3.72-3.51 (m, 4H), 2.87 (t, J = 7.0 Hz, 2H), 2.29 (s, 3H), 2.08-1.97 (m, 2H), 1.73 (s, 9H), 1.26 (t, J = 7.0 Hz, 3H), 1.02 (t, J = 7.3 Hz, 3H)。

1-264(#2): δ 7.89-7.87 (m, 2H), 7.26-7.08 (m, 4H), 6.94-6.89 (m, 1H), 6.75-6.69 (m, 3H), 3.98 (s, 3H), 3.75-3.66 (m, 2H), 3.59 (s, 3H), 2.88-2.83 (m, 2H), 2.33 (s, 3H), 1.56 (s, 9H)。

1-265(#2): δ 8.02-7.79 (m, 2H), 7.38-7.09 (m, 7H), 6.95-6.89 (m, 1H), 6.78-6.70 (m, 2H), 3.70-3.64 (m, 2H), 3.05-3.00 (m, 2H), 2.90-2.83 (m, 3H), 2.33-2.20 (m, 3H), 1.75 (s, 9H)。

1-266(#2): δ 7.94-7.87 (m, 2H), 7.31-7.10 (m, 6H), 7.00-6.73 (m, 4H), 3.71-3.63 (m, 2H), 2.91-2.82 (m, 2H), 2.35-2.18 (m, 3H), 1.71 (s, 9H)

。

1-267(#1): δ 7.96-7.84 (m, 2H), 7.36-7.21 (m, 2H), 7.21-7.05 (m, 2H), 6.97-6.83 (m, 1H), 6.82-6.61 (m, 3H), 4.70-4.54 (m, 1H), 3.74-3.62 (m, 2H), 3.13 (s, 3H), 2.88 (t, J = 6.8 Hz, 2H), 2.30 (s, 3H), 1.98 (d, J = 7.2 Hz, 3H), 1.73 (s, 9H)。

1-268(#1): δ 7.95-7.86 (m, 2H), 7.31-7.22 (m, 2H), 7.21-7.10 (m, 2H), 6.93-6.85 (m, 1H), 6.79-6.66 (m, 3H), 4.64 (q, J = 7.4 Hz, 1H), 3.74-3.61 (m, 2H), 3.39-3.16 (m, 2H), 2.87 (t, J = 6.8 Hz, 2H), 2.30 (s, 3H), 1.98 (d, J = 7.4 Hz, 3H), 1.73 (s, 9H), 1.48 (t, J = 7.5 Hz, 3H)

。

1-271(#2): δ 7.89-7.86 (m, 1H), 7.52-7.40 (m, 1H), 7.30-7.11 (m, 5H), 7.00-6.89 (m, 1H), 6.76-6.69 (m, 2H), 3.71-3.64 (m, 2H), 3.53 (s, 3H), 2.87 (t, J = 6.7 Hz, 2H), 2.71 (s, 3H), 2.32 (s, 3H), 1.57 (s, 9H)

。

1-272(#2): δ 7.91-7.77 (m, 2H), 7.53-7.07 (m, 6H), 6.93-6.70 (m, 4H),

3.69–3.62 (m, 2H), 2.90–2.81 (m, 2H), 2.25 (s, 3H), 1.77–1.67 (m, 9H)

。

1-273(#1): δ 7.97–7.86 (m, 2H), 7.30–7.09 (m, 4H), 6.93–6.84 (m, 1H), 6.80–6.66 (m, 3H), 4.14 (q, $J = 7.2$ Hz, 1H), 3.74–3.60 (m, 2H), 2.86 (t, $J = 6.8$ Hz, 2H), 2.29 (s, 3H), 2.21 (s, 3H), 1.78 (d, $J = 7.2$ Hz, 3H), 1.73 (s, 9H)。

1-274(#1): δ 7.97–7.88 (m, 2H), 7.30–7.09 (m, 4H), 6.92–6.84 (m, 1H), 6.78–6.65 (m, 3H), 4.23 (q, $J = 7.4$ Hz, 1H), 3.72–3.61 (m, 2H), 2.86 (t, $J = 7.0$ Hz, 2H), 2.76–2.60 (m, 2H), 2.29 (s, 3H), 1.77 (d, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.73 (s, 9H), 1.27 (t, $J = 7.4$ Hz, 3H)。

1-275(#2): δ 7.97–7.94 (m, 2H), 7.26–7.11 (m, 4H), 6.94–6.70 (m, 4H), 4.19 (s, 3H), 3.71–3.64 (m, 2H), 2.93–2.76 (m, 4H), 2.32 (s, 3H), 1.71 (s, 9H), 1.31–1.16 (m, 3H)。

1-276(#2): δ 7.97–7.87 (m, 2H), 7.30–7.22 (m, 2H), 7.21–7.09 (m, 2H), 6.93–6.86 (m, 1H), 6.79–6.67 (m, 3H), 3.89 (s, 2H), 3.73–3.62 (m, 2H), 2.87 (t, $J = 7.0$ Hz, 2H), 2.29 (s, 6H), 1.73 (s, 9H)。

1-277(#2): δ 7.97–7.88 (m, 2H), 7.30–7.22 (m, 2H), 7.21–7.09 (m, 2H), 6.93–6.86 (m, 1H), 6.80–6.68 (m, 3H), 3.93 (s, 2H), 3.71–3.63 (m, 2H), 2.87 (t, $J = 7.0$ Hz, 2H), 2.73 (q, $J = 7.3$ Hz, 2H), 2.30 (s, 3H), 1.73 (s, 9H), 1.33 (t, $J = 7.3$ Hz, 3H)。

1-278(#1): δ 7.97–7.87 (m, 2H), 7.31–7.10 (m, 4H), 6.95–6.85 (m, 1H), 6.82–6.65 (m, 3H), 4.45–4.27 (m, 2H), 3.79–3.60 (m, 2H), 2.96–2.81 (m, 5H), 2.31 (s, 3H), 1.74 (s, 9H)。

1-279(#1): δ 7.96–7.87 (m, 2H), 7.31–7.08 (m, 4H), 6.94–6.85 (m, 1H), 6.80–6.65 (m, 3H), 4.41–4.22 (m, 2H), 3.73–3.59 (m, 2H), 3.06–2.80 (m, 4H), 2.30 (s, 3H), 1.73 (s, 9H), 1.44 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H)。

1-280(#1): δ 7.95–7.86 (m, 2H), 7.34–7.08 (m, 4H), 6.91–6.84 (m, 1H), 6.78–6.66 (m, 3H), 4.64 (s, 2H), 3.74–3.59 (m, 2H), 3.24 (s, 3H), 2.9

3-2.82 (m, 2H), 2.29 (s, 3H), 1.73 (s, 9H)。

1-281(#1): δ 7.93-7.85 (m, 2H), 7.30-7.21 (m, 2H), 7.21-7.08 (m, 2H), 6.93-6.84 (m, 1H), 6.82-6.68 (m, 3H), 4.61 (s, 2H), 3.76-3.60 (m, 2H), 3.34 (q, J = 7.5 Hz, 2H), 2.87 (t, J = 7.0 Hz, 2H), 2.29 (s, 3H), 1.73 (s, 9H), 1.52 (t, J = 7.5 Hz, 3H)。

1-282(#2): δ 7.94-7.92 (m, 1H), 7.84-7.82 (m, 1H), 7.33-7.08 (m, 5H), 6.98-6.86 (m, 1H), 6.80-6.67 (m, 3H), 3.95-3.88 (m, 3H), 3.64 (s, 2H), 2.89-2.78 (m, 2H), 2.26 (s, 3H), 1.71 (s, 9H)。

1-283(#2): δ 7.96-7.88 (m, 2H), 7.29-7.08 (m, 4H), 6.93-6.86 (m, 1H), 6.80-6.67 (m, 3H), 4.20-4.08 (m, 1H), 3.72-3.62 (m, 2H), 2.91-2.82 (m, 2H), 2.30 (s, 3H), 1.73 (s, 9H), 1.36-1.20 (m, 3H)。

1-285(#2): δ 7.95-7.85 (m, 2H), 7.31-7.23 (m, 2H), 7.21-7.08 (m, 2H), 6.94-6.87 (m, 1H), 6.79-6.68 (m, 3H), 4.13 (s, 2H), 3.75-3.62 (m, 2H), 2.88 (t, J = 6.8 Hz, 2H), 2.30 (s, 3H), 1.73 (s, 9H)。

1-288(#1): δ 7.95-7.86 (m, 2H), 7.31-7.08 (m, 3H), 6.94-6.84 (m, 2H), 6.80-6.65 (m, 3H), 3.74-3.60 (m, 2H), 2.86 (t, J = 6.8 Hz, 2H), 2.29 (s, 3H), 1.73 (s, 9H), 1.49 (s, 9H)。

1-289(#1): δ 7.95-7.85 (m, 2H), 7.36-7.17 (m, 4H), 7.15-7.01 (m, 2H), 6.99-6.86 (m, 2H), 6.73-6.59 (m, 1H), 3.73-3.59 (m, 2H), 2.84 (t, J = 7.0 Hz, 2H), 1.72 (s, 9H), 1.50 (s, 9H)。

1-291(#1): δ 7.97-7.86 (m, 2H), 7.30-7.22 (m, 2H), 7.19-7.07 (m, 2H), 6.94-6.83 (m, 1H), 6.80-6.65 (m, 3H), 3.77-3.60 (m, 2H), 2.89 (t, J = 6.8 Hz, 2H), 2.28 (s, 3H), 1.73 (s, 9H), 1.44 (s, 9H)。

1-292(#1): δ 7.96-7.86 (m, 2H), 7.32-7.21 (m, 4H), 7.14-6.99 (m, 2H), 6.96-6.86 (m, 2H), 6.75-6.60 (m, 1H), 3.79-3.59 (m, 2H), 2.87 (t, J = 6.8 Hz, 2H), 1.73 (s, 9H), 1.44 (s, 9H)。

1-293(#1): δ 7.99-7.90 (m, 2H), 7.50-7.25 (m, 5H), 7.24-7.18 (m, 1H), 7.15 (s, 1H), 7.12-7.03 (m, 1H), 3.78-3.63 (m, 2H), 2.90 (t, J = 6.8

Hz, 2H), 2.68 (d, J = 7.2 Hz, 2H), 2.31–2.15 (m, 1H), 1.73 (s, 9H), 1.04 (d, J = 6.5 Hz, 6H)。

1-294(#1): δ 7.96–7.86 (m, 2H), 7.33–7.22 (m, 2H), 7.21–7.06 (m, 2H), 6.94–6.83 (m, 1H), 6.82–6.65 (m, 3H), 3.75–3.63 (m, 2H), 2.89 (t, J = 6.6 Hz, 2H), 2.67 (d, J = 7.2 Hz, 2H), 2.35–2.14 (m, 4H), 1.73 (s, 9H), 1.03 (d, J = 6.5 Hz, 6H)。

1-295(#1): δ 7.97–7.87 (m, 2H), 7.32–7.21 (m, 4H), 7.14–7.01 (m, 2H), 6.96–6.86 (m, 2H), 6.76–6.62 (m, 1H), 3.75–3.61 (m, 2H), 2.88 (t, J = 6.8 Hz, 2H), 2.67 (d, J = 7.2 Hz, 2H), 2.30–2.15 (m, 1H), 1.72 (s, 9H), 1.03 (d, J = 6.8 Hz, 6H)。

1-296(#1): δ 7.93–7.82 (m, 2H), 7.50–7.00 (m, 7H), 6.93–6.76 (m, 1H), 5.83–5.67 (m, 1H), 3.78–3.66 (m, 2H), 3.05–2.85 (m, 4H), 1.57–1.41 (m, 9H)。

1-297(#1): δ 7.95–7.82 (m, 2H), 7.37–6.84 (m, 9H), 5.85–5.67 (m, 1H), 3.79–3.63 (m, 2H), 2.98 (q, J = 7.6 Hz, 2H), 2.89 (t, J = 6.8 Hz, 2H), 1.55–1.43 (m, 9H)。

1-298(#1): δ 8.49–8.39 (m, 1H), 7.96–7.79 (m, 3H), 7.72–7.61 (m, 1H), 7.51–7.12 (m, 8H), 6.96–6.77 (m, 1H), 3.76–3.63 (m, 2H), 2.97 (q, J = 7.6 Hz, 2H), 2.89 (t, J = 6.8 Hz, 2H), 1.46 (t, J = 7.7 Hz, 3H)。

1-301(#2): δ 8.00–7.91 (m, 2H), 7.44–7.18 (m, 5H), 7.15 (s, 1H), 7.11–7.04 (m, 1H), 6.59–6.44 (m, 1H), 4.50 (t, J = 6.6 Hz, 1H), 3.73–3.63 (m, 2H), 3.46 (s, 3H), 2.87 (t, J = 6.8 Hz, 2H), 2.11–1.97 (m, 2H), 1.72 (s, 9H), 1.02 (t, J = 7.5 Hz, 3H)。

1-302(#2): δ 7.96–7.87 (m, 2H), 7.49–7.28 (m, 2H), 7.27–7.18 (m, 3H), 7.15 (s, 1H), 7.11–7.03 (m, 1H), 6.54–6.43 (m, 1H), 3.98–3.88 (m, 1H), 3.72–3.64 (m, 2H), 3.37 (s, 3H), 3.24–3.15 (m, 1H), 3.09–3.00 (m, 1H), 2.86 (t, J = 7.0 Hz, 2H), 1.72 (s, 9H), 1.31 (d, J = 6.2 Hz, 3H)。

1-303(#2): δ 7.98–7.91 (m, 2H), 7.30–7.21 (m, 2H), 7.20–7.10 (m, 2H), 6.92–6.86 (m, 1H), 6.78–6.68 (m, 3H), 4.50 (t, J = 6.6 Hz, 1H), 3.71–3.63 (m, 2H), 3.46 (s, 3H), 2.87 (t, J = 7.0 Hz, 2H), 2.29 (s, 3H), 2.10–1.97 (m, 2H), 1.73 (s, 9H), 1.02 (t, J = 7.5 Hz, 3H)。

1-304(#2): δ 7.96–7.88 (m, 2H), 7.30–7.09 (m, 4H), 6.94–6.86 (m, 1H), 6.78–6.66 (m, 3H), 3.98–3.89 (m, 1H), 3.73–3.62 (m, 2H), 3.37 (s, 3H), 3.24–3.15 (m, 1H), 3.08–3.00 (m, 1H), 2.86 (t, J = 6.8 Hz, 2H), 2.29 (s, 3H), 1.73 (s, 9H), 1.31 (d, J = 6.2 Hz, 3H)。

1-305(#2): δ 7.99–7.90 (m, 2H), 7.35–7.22 (m, 4H), 7.13 (s, 1H), 7.12–7.03 (m, 1H), 6.97–6.89 (m, 2H), 6.73–6.63 (m, 1H), 4.50 (t, J = 6.6 Hz, 1H), 3.72–3.62 (m, 2H), 3.46 (s, 3H), 2.85 (t, J = 7.0 Hz, 2H), 2.11–1.98 (m, 2H), 1.73 (s, 9H), 1.02 (t, J = 7.5 Hz, 3H)。

1-306(#2): δ 7.95–7.87 (m, 2H), 7.34–7.20 (m, 4H), 7.15–7.03 (m, 2H), 6.97–6.87 (m, 2H), 6.75–6.61 (m, 1H), 3.98–3.88 (m, 1H), 3.71–3.61 (m, 2H), 3.37 (s, 3H), 3.24–3.15 (m, 1H), 3.08–2.99 (m, 1H), 2.85 (t, J = 6.8 Hz, 2H), 1.72 (s, 9H), 1.32 (d, J = 6.2 Hz, 3H)。

1-307(#1): δ 8.16 (s, 1H), 7.96–7.93 (m, 2H), 7.28–7.11 (m, 4H), 6.97–6.87 (m, 1H), 6.74–6.72 (m, 3H), 4.26 (s, 3H), 3.71–3.64 (m, 2H), 2.96–2.85 (m, 2H), 2.32 (s, 3H), 1.72 (s, 9H)。

1-308(#1): δ 8.73 (s, 1H), 7.99–7.89 (m, 2H), 7.46–7.00 (m, 7H), 6.58–6.40 (m, 1H), 3.74–3.62 (m, 2H), 2.87 (t, J = 7.0 Hz, 2H), 1.72 (s, 9H)。

1-309(#1): δ 8.73 (s, 1H), 7.99–7.89 (m, 2H), 7.32–7.21 (m, 2H), 7.20–7.06 (m, 2H), 6.94–6.83 (m, 1H), 6.81–6.63 (m, 3H), 3.74–3.62 (m, 2H), 2.87 (t, J = 6.8 Hz, 2H), 2.29 (s, 3H), 1.73 (s, 9H)。

1-313(#2): δ 8.00–7.89 (m, 2H), 7.41–7.06 (m, 4H), 6.94–6.82 (m, 1H), 6.80–6.73 (m, 3H), 6.29 (s, 1H), 5.52–5.45 (m, 1H), 3.74–3.62 (m, 2H), 2.93–2.83 (m, 2H), 2.31 (s, 3H), 2.20–2.02 (m, 3H), 1.85–1.74 (m, 9

H), 1.33–1.11 (m, 3H)。

1-314(#1): δ 7.93–7.80 (m, 2H), 7.49–7.03 (m, 7H), 6.88–6.69 (m, 1H), 4.22 (s, 3H), 3.79–3.65 (m, 2H), 2.98 (q, J = 7.6 Hz, 2H), 2.90 (t, J = 6.8 Hz, 2H), 1.46 (t, J = 7.7 Hz, 3H)。

1-320(#1): δ 7.99–7.96 (m, 2H), 7.27–7.24 (m, 2H), 7.18–7.11 (m, 2H), 6.91–6.86 (m, 1H), 6.74–6.72 (m, 3H), 4.40 (s, 3H), 3.67 (dd, J = 12.8, 7.0 Hz, 2H), 2.86 (t, J = 7.0 Hz, 2H), 2.25 (s, 3H), 1.68 (d, J = 26.2 Hz, 9H)。

1-321(#1): δ 7.99–7.96 (m, 2H), 7.30–7.24 (m, 4H), 7.13–7.00 (m, 2H), 6.94–6.91 (m, 2H), 6.65 (s, 1H), 4.40 (s, 3H), 3.70–3.63 (m, 2H), 2.85 (t, J = 6.8 Hz, 2H), 1.72 (s, 9H)。

1-322(#1): δ 7.96–7.93 (m, 2H), 7.39–7.03 (m, 8H), 4.38 (s, 3H), 3.70–3.63 (m, 2H), 2.84 (t, J = 6.8 Hz, 2H), 1.66 (s, 9H)。

1-323(#1): δ 7.99–7.97 (m, 2H), 7.33–6.98 (m, 5H), 6.95–6.83 (m, 1H), 6.79–6.72 (m, 2H), 4.74–4.67 (m, 2H), 3.71–3.64 (m, 2H), 2.93–2.80 (m, 2H), 2.27 (s, 3H), 1.79–1.54 (m, 12H)。

1-324(#1): δ 8.04–7.96 (m, 2H), 7.49–6.91 (m, 8H), 6.75–6.65 (m, 1H), 4.74–4.67 (m, 2H), 3.72–3.63 (m, 2H), 2.91–2.82 (m, 2H), 1.69–1.77 (m, 12H)。

1-325(#1): δ 8.12–7.96 (m, 2H), 7.52–7.05 (m, 7H), 6.48 (s, 1H), 4.74–4.66 (m, 2H), 3.76–3.65 (m, 2H), 2.94–2.80 (m, 2H), 1.91–1.54 (m, 12H)。

1-330(#1): δ 7.93–7.91 (m, 2H), 7.27–7.11 (m, 3H), 7.03–6.87 (m, 2H), 6.79–6.72 (m, 3H), 3.71–3.64 (m, 2H), 2.90–2.80 (m, 2H), 2.35–2.33 (m, 1H), 2.29 (s, 3H), 1.94–1.80 (m, 3H), 1.74 (s, 9H)。

1-331(#1): δ 7.98–7.91 (m, 2H), 7.46–7.01 (m, 6H), 6.94–6.91 (m, 2H), 6.67–6.65 (m, 1H), 5.97–5.75 (m, 1H), 3.70–3.63 (m, 2H), 2.88–2.80 (m, 2H), 1.94–1.84 (m, 3H), 1.76 (s, 9H)。

1-336(#1): δ 7.95–7.82 (m, 2H), 7.42–7.00 (m, 6H), 6.97–6.85 (m, 2H), 6.83–6.66 (m, 1H), 4.10 (s, 3H), 3.78–3.59 (m, 2H), 2.87 (t, J = 6.8 Hz, 2H), 1.72 (s, 9H)。

1-337(#1): δ 7.92–7.81 (m, 2H), 7.33–6.66 (m, 8H), 4.10 (s, 3H), 3.76–3.60 (m, 2H), 2.89 (t, J = 6.6 Hz, 2H), 2.29 (s, 3H), 1.72 (s, 9H)。

1-338(#1): δ 7.97–7.86 (m, 2H), 7.32–7.08 (m, 5H), 7.07–6.66 (m, 7H), 5.31 (s, 2H), 3.77–3.58 (m, 2H), 2.87 (t, J = 6.8 Hz, 2H), 2.28 (s, 3H), 1.72 (s, 9H)。

1-339(#1): δ 7.95–7.84 (m, 2H), 7.36–7.05 (m, 7H), 7.04–6.92 (m, 2H), 6.88–6.60 (m, 4H), 5.63 (q, J = 6.6 Hz, 1H), 3.75–3.56 (m, 2H), 2.86 (t, J = 6.6 Hz, 2H), 2.26 (s, 3H), 1.86 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 1.72 (s, 9H)。

1-341(#1): δ 8.00–7.97 (m, 2H), 7.33–7.12 (m, 5H), 6.95–6.86 (m, 1H), 6.79–6.72 (m, 2H), 3.71–3.64 (m, 2H), 2.93–2.84 (m, 2H), 2.28 (s, 3H), 2.20–1.99 (m, 2H), 1.76 (s, 9H), 1.58–1.51 (m, 3H), 1.04–0.91 (m, 2H)。

1-342(#1): δ 7.98 (d, J = 8.2 Hz, 2H), 7.48–7.20 (m, 5H), 7.15–6.91 (m, 4H), 4.64–4.60 (m, 2H), 3.70–3.63 (m, 2H), 2.91–2.83 (m, 2H), 2.17–2.05 (m, 2H), 1.69 (s, 9H), 1.06–0.88 (m, 3H)。

1-343(#1): δ 8.09–7.96 (m, 2H), 7.54–7.05 (m, 7H), 6.47–6.45 (m, 1H), 4.64–4.59 (m, 2H), 3.73–3.63 (m, 2H), 2.91–2.84 (m, 2H), 2.16–2.05 (m, 2H), 1.67 (s, 9H), 1.06–0.94 (m, 3H)。

1-344(#1): δ 8.00–7.97 (m, 2H), 7.46–7.12 (m, 4H), 6.98–6.81 (m, 1H), 6.74–6.72 (m, 3H), 5.16–5.07 (m, 1H), 3.71–3.64 (m, 2H), 3.02–2.84 (m, 2H), 2.31 (s, 3H), 1.82–1.50 (m, 15H)。

1-345(#2): δ 7.99–7.97 (m, 2H), 7.46–7.20 (m, 4H), 7.17–7.03 (m, 2H), 6.98–6.91 (m, 2H), 6.66 (s, 1H), 5.16–5.07 (m, 1H), 3.70–3.63 (m, 2H), 2.91–2.82 (m, 2H), 1.83–1.55 (m, 15H)。

1-346(#1): δ 8.13-7.96 (m, 2H), 7.49-7.05 (m, 7H), 6.47 (s, 1H), 5.16-5.06 (m, 1H), 3.72-3.63 (m, 2H), 3.01-2.81 (m, 2H), 1.77-1.51 (m, 15H)。

1-347(#2): δ 7.81-7.72 (m, 2H), 7.25-7.18 (m, 4H), 7.13 (s, 1H), 7.07-7.00 (m, 1H), 6.87-6.84 (m, 2H), 6.56-6.52 (m, 1H), 3.62-3.53 (m, 6H), 2.75 (t, J = 6.8 Hz, 2H), 1.67-1.60 (m, 15H)。

1-348(#1): δ 7.89 (d, J = 7.8 Hz, 2H), 7.37-7.23 (m, 7H), 7.14 (s, 1H), 7.07-7.04 (m, 1H), 6.97-6.87 (m, 3H), 6.48-6.45 (m, 1H), 4.14-4.10 (m, 2H), 3.70-3.63 (m, 2H), 3.17 (t, J = 7.5 Hz, 2H), 2.92-2.78 (m, 2H), 2.46-2.30 (m, 2H), 1.72 (s, 9H)。

1-349(#1): δ 7.89 (d, J = 17.7 Hz, 2H), 7.38-7.31 (m, 2H), 7.25-7.19 (m, 5H), 7.14 (s, 1H), 7.08-7.02 (m, 3H), 6.48-6.45 (m, 1H), 3.71-3.64 (m, 2H), 3.27-3.23 (m, 4H), 2.90-2.82 (m, 2H), 1.72 (s, 9H)。

2-001(#2): δ 7.93 (s, 1H), 7.42-7.31 (m, 2H), 7.27-7.15 (m, 4H), 7.13-7.06 (m, 1H), 7.03-6.98 (m, 1H), 6.59-6.49 (m, 1H), 3.97 (s, 3H), 3.86 (s, 3H), 3.67-3.58 (m, 2H), 2.87 (t, J = 6.8 Hz, 2H), 1.72 (s, 9H)。

2-002(#2): δ 8.05 (s, 1H), 7.58-7.52 (m, 2H), 7.41-7.27 (m, 2H), 7.23-7.02 (m, 4H), 6.62-6.51 (m, 1H), 3.98 (s, 3H), 3.88 (s, 3H), 3.66-3.56 (m, 2H), 2.85 (t, J = 6.6 Hz, 2H), 1.71 (s, 9H)。

2-003(#1): δ 7.56-7.45 (m, 2H), 7.31-7.22 (m, 3H), 7.20-7.07 (m, 3H), 6.95-6.83 (m, 1H), 3.89 (s, 3H), 3.71-3.60 (m, 2H), 2.91-2.85 (m, 2H), 2.46 (s, 3H), 2.26 (s, 3H), 1.74 (s, 9H)。

2-004(#2): δ 7.56-7.37 (m, 2H), 7.34-7.22 (m, 3H), 7.21-7.08 (m, 3H), 6.96-6.85 (m, 1H), 3.86 (s, 3H), 3.70-3.54 (m, 2H), 3.01-2.83 (m, 2H), 2.29 (s, 3H), 2.21-2.08 (m, 1H), 1.70 (s, 9H), 1.18-0.98 (m, 4H)。

[試験例]

次に、本発明の化合物の有害生物防除剤としての有用性について、以下の試験例において具体的に説明するが、本発明はこれらのみに限定されない。なお、試験例中「RH」とは相対湿度 (relative humidity) を表し、例えば、「湿度100%RH」の記載は、相対湿度が100%であることを表す。

[0423] 試験薬液の調製

本発明の化合物を、乳化白試料 (ソルポール (登録商標) 3005XL (東邦化学工業社製)、N-メチルピロリドン、及びソルベッソ (登録商標) 200 (エクソンモービル社製) [1:5:28 (重量比) の混合物] 中に溶解し、1質量%、5質量%又は20質量%濃度の乳剤をそれぞれ調製した。この乳剤を試験薬液として以下の試験例1~7に供試した。

[0424] 試験例1 コムギふ枯病防除効果試験

90cm³のプラスチックポットに、コムギ (品種: ハルユタカ) を植え、1. 3葉期に、試験薬液を水で希釈して500ppmに調製した薬液を、5ml散布処理した。散布1日後、コムギふ枯病菌 (*Septoria nodorum*) の分生孢子懸濁液を、コムギに噴霧接種し、温度20℃、湿度100%RHの接種箱内に2日間入れた。その後、空調温室 (温度20℃、湿度80%RH) に置き、8日間保持した。形成された病斑の接種葉に占める割合を測定し、下記の計算式に従い、防除価を算出した。

[0425] 防除価 = [1 - (処理区病斑面積率 / 無処理区病斑面積率)] × 100

その結果、供試した化合物の内、以下の化合物が防除価70%以上を示した。

[0426] 化合物; No. 1-001、1-003、1-004、1-005、1-006、1-008、1-009、1-010、1-011、1-012、1-016、1-017、1-018、1-019、1-020、1-021、1-022、1-023、1-024、1-025、1-026、1-028、1-030、1-031、1-032、1-033、1-034、1-035、1-036、1-037、1-038、1-039、1-040、1-041、1-042、1-043、1-044、1-045、1-

046、1-047、1-048、1-049、1-050、1-051、
1-052、1-053、1-055、1-056、1-057、1-05
8、1-059、1-060、1-061、1-062、1-063、1-
064、1-065、1-066、1-067、1-068、1-069、
1-071、1-073、1-075、1-076、1-077、1-07
8、1-079、1-081、1-082、1-083、1-084、1-
085、1-086、1-088、1-089、1-090、1-092、
1-094、1-095、1-096、1-097、1-098、1-09
9、1-100、1-101、1-102、1-103、1-104、1-
105、1-106、1-115、1-116、1-117、1-118、
1-119、1-120、1-121、1-122、1-124、1-12
5、1-126、1-127、1-129、1-132、1-134、1-
135、1-136、1-137、1-138、1-139、1-140、
1-141、1-143、1-145、1-146、1-148、1-14
9、1-150、1-154、1-155、1-156、1-157、1-
158、1-159、1-160、1-163、1-164、1-165、
1-166、1-168、1-169、1-173、1-174、1-17
5、1-176、1-177、1-178、1-179、1-180、1-
181、1-182、1-183、1-184、1-185、1-186、
1-187、1-188、1-189、1-190、1-191、1-19
2、1-193、1-194、1-195、1-196、1-197、1-
198、1-199、1-200、1-201、1-202、1-203、
1-204、1-205、1-206、1-207、1-208、1-21
0、1-212、1-213、1-214、1-215、1-216、1-
217、1-218、1-219、1-220、1-221、1-224、
1-226、1-230、1-232、1-233、1-242、1-24
9、1-259、1-261、1-262、1-263、1-264、1-
265、1-266、1-267、1-268、1-269、1-270、

1-271、1-272、1-273、1-274、1-275、1-276、1-277、1-278、1-279、1-280、1-281、1-282、1-283、1-284、1-285、1-286、1-287、1-288、1-289、1-290、1-291、1-292、1-293、1-294、1-295、1-296、1-297、1-298、1-299、1-300、1-301、1-302、1-303、1-304、1-305、1-306、1-307、1-308、1-309、1-310、1-311、1-312、1-313、1-314、1-315、1-316、1-317、1-318、1-319、1-320、1-321、1-322、1-323、1-324、1-325、1-326、1-330、1-331、1-332、1-333、1-334、1-335、1-336、1-337、1-338、1-339、1-340、1-341、1-342、1-343、1-344、1-345、1-346、1-347、1-348、1-349。

[0427] 試験例2 トマトうどんこ病防除効果試験

90cm³のプラスチックポットに、トマト（品種：桃太郎）を植え、2葉期に、試験薬液を水で希釈して500ppmに調製した薬液を、5ml散布処理した。風乾後、トマトを空調温室（温度20℃、湿度70%RH）に置き、トマトうどんこ病菌（*Leveillula taurica*）の分生孢子懸濁液を、噴霧接種した。14日間置いた後、形成された病斑の接種葉に占める割合を測定し、試験例1と同様の計算式から防除価を算出した。

[0428] その結果、供試した化合物の内、以下の化合物が防除価70%以上を示した。

[0429] 化合物；No. 1-001、1-002、1-003、1-004、1-005、1-006、1-007、1-008、1-009、1-010、1-011、1-012、1-013、1-014、1-015、1-016、1-017、1-018、1-019、1-020、1-021、1-022、1-023、1-024、1-025、1-026、1-027、

1-030、1-031、1-032、1-033、1-034、1-035、1-036、1-037、1-038、1-039、1-040、1-041、1-042、1-043、1-044、1-045、1-046、1-047、1-048、1-049、1-050、1-051、1-052、1-053、1-054、1-055、1-056、1-059、1-060、1-062、1-063、1-064、1-065、1-066、1-067、1-068、1-071、1-074、1-075、1-076、1-077、1-078、1-079、1-080、1-081、1-082、1-083、1-084、1-085、1-086、1-088、1-089、1-090、1-091、1-094、1-095、1-096、1-097、1-098、1-099、1-100、1-101、1-102、1-103、1-104、1-105、1-106、1-107、1-108、1-109、1-110、1-111、1-112、1-113、1-114、1-115、1-116、1-117、1-118、1-119、1-120、1-121、1-122、1-123、1-124、1-125、1-126、1-127、1-128、1-129、1-130、1-131、1-132、1-134、1-135、1-136、1-137、1-138、1-139、1-140、1-141、1-142、1-143、1-144、1-145、1-146、1-147、1-148、1-149、1-150、1-151、1-153、1-154、1-155、1-156、1-157、1-158、1-159、1-160、1-161、1-162、1-163、1-164、1-165、1-166、1-168、1-169、1-170、1-171、1-172、1-173、1-174、1-175、1-176、1-177、1-179、1-180、1-181、1-184、1-185、1-186、1-187、1-188、1-189、1-190、1-191、1-192、1-193、1-194、1-196、1-197、1-198、1-199、1-200、1-201、1-202、1-203、1-204、1-20

5、1-206、1-208、1-209、1-210、1-211、1-212、1-213、1-214、1-215、1-216、1-218、1-219、1-220、1-221、1-259、1-260、1-261、1-262、1-263、1-264、1-265、1-266、1-267、1-268、1-269、1-270、1-271、1-272、1-273、1-274、1-275、1-276、1-277、1-278、1-279、1-280、1-281、1-282、1-283、1-284、1-285、1-286、1-287、1-288、1-289、1-290、1-291、1-292、1-293、1-294、1-298、1-301、1-302、1-303、1-304、1-307、1-308、1-309、1-310、1-313、1-317、1-318、1-319、1-320、1-321、1-322、1-323、1-324、1-325、1-326、1-329、1-330、1-331、1-332、1-333、1-334、1-335、1-336、1-337、1-338、1-339、1-340、1-348、1-349。

[0430] 試験例3 キュウリ灰色かび病防除効果試験

90cm³のプラスチックポットに、キュウリ（品種：相模半白）を植え、子葉期に、試験薬液を水で希釈して500ppmに調製した薬液を、5ml散布処理し、風乾した。その後、処理葉を切り取り、プラスチック容器に入れた。キュウリ灰色かび病菌（*Botrytis cinerea*）の分生孢子懸濁液と溶解させたPDA培地とを、1:1（体積比）の割合で混合し、処理葉に30μlずつ滴下接種した。接種後、20℃、多湿（湿度100%RH）下に3日間置いた。その後、形成された病斑の接種葉に占める割合を測定し、試験例1と同様の計算式から防除価を算出した。

[0431] その結果、供試した化合物の内、以下の化合物が防除価70%以上を示した。

[0432] 化合物；No. 1-001、1-002、1-003、1-004、1-005、1-006、1-007、1-008、1-009、1-010、

1-011、1-012、1-013、1-014、1-015、1-016、1-017、1-018、1-019、1-020、1-021、1-022、1-023、1-024、1-025、1-026、1-027、1-028、1-030、1-031、1-032、1-033、1-034、1-035、1-036、1-037、1-038、1-039、1-040、1-041、1-042、1-043、1-044、1-045、1-046、1-047、1-048、1-049、1-050、1-051、1-052、1-053、1-054、1-055、1-056、1-057、1-058、1-059、1-060、1-061、1-062、1-063、1-064、1-065、1-066、1-067、1-068、1-069、1-070、1-071、1-072、1-073、1-074、1-075、1-076、1-077、1-078、1-079、1-080、1-081、1-082、1-083、1-084、1-085、1-086、1-087、1-088、1-089、1-090、1-091、1-092、1-093、1-094、1-095、1-096、1-097、1-098、1-099、1-100、1-101、1-102、1-103、1-104、1-105、1-106、1-107、1-108、1-109、1-110、1-111、1-112、1-113、1-114、1-115、1-116、1-117、1-118、1-119、1-120、1-121、1-122、1-123、1-124、1-125、1-126、1-127、1-128、1-129、1-130、1-131、1-132、1-133、1-134、1-135、1-136、1-137、1-138、1-139、1-140、1-141、1-142、1-143、1-144、1-145、1-146、1-147、1-148、1-149、1-150、1-151、1-152、1-153、1-154、1-155、1-156、1-157、1-158、1-159、1-160、1-161、1-162、1-163、1-164、1-165、1-166、1-167、1-168、1-169、1-17

0、1-171、1-172、1-173、1-174、1-175、1-176、1-177、1-178、1-179、1-180、1-181、1-182、1-183、1-184、1-185、1-186、1-187、1-188、1-189、1-190、1-191、1-192、1-193、1-194、1-195、1-196、1-197、1-198、1-199、1-200、1-201、1-202、1-203、1-204、1-205、1-206、1-207、1-208、1-209、1-210、1-211、1-212、1-213、1-214、1-215、1-216、1-217、1-218、1-219、1-220、1-221、1-224、1-226、1-230、1-232、1-233、1-242、1-249、1-259、1-260、1-261、1-262、1-263、1-264、1-265、1-266、1-267、1-268、1-269、1-270、1-271、1-272、1-273、1-274、1-275、1-276、1-277、1-278、1-279、1-280、1-281、1-282、1-283、1-284、1-285、1-286、1-287、1-288、1-289、1-290、1-291、1-292、1-293、1-294、1-295、1-296、1-297、1-298、1-299、1-301、1-302、1-303、1-304、1-305、1-306、1-307、1-308、1-309、1-310、1-311、1-312、1-313、1-314、1-315、1-316、1-317、1-318、1-319、1-320、1-321、1-322、1-323、1-324、1-325、1-326、1-327、1-328、1-329、1-330、1-331、1-332、1-333、1-334、1-335、1-336、1-337、1-338、1-339、1-340、1-341、1-342、1-343、1-344、1-345、1-346、1-347、1-348、1-349。

[0433] 試験例4 キュウリ菌核病防除効果試験

90 cm³のプラスチックポットに、キュウリ（品種：相模半白）を植え、子葉期に、試験薬液を水で希釈して500 ppmに調製した薬液5 mlを散布処理し、風乾した。その後、処理葉をプラスチック容器に入れた。予めPDA培地で培養したキュウリ菌核病（*Sclerotinia sclerotiorum*）の含菌寒天片（直径5 mm）を、薬剤処理したキュウリの子葉に接種した。接種後、プラスチック容器をビニールで覆い加湿（湿度100%RH）し、20℃に2日間置いた。その後、形成された病斑の接種葉に占める割合を測定し、試験例1と同様の計算式から防除価を算出した。

[0434] その結果、供試した化合物の内、以下の化合物が防除価70%以上を示した。

[0435] 化合物；No. 1-001、1-003、1-004、1-005、1-006、1-007、1-008、1-009、1-010、1-011、1-012、1-013、1-014、1-015、1-016、1-017、1-018、1-019、1-020、1-021、1-022、1-023、1-024、1-025、1-026、1-027、1-028、1-030、1-031、1-032、1-033、1-034、1-035、1-036、1-037、1-038、1-039、1-040、1-041、1-042、1-043、1-044、1-045、1-046、1-047、1-048、1-049、1-050、1-051、1-052、1-053、1-054、1-055、1-056、1-057、1-058、1-059、1-060、1-061、1-062、1-063、1-064、1-065、1-066、1-067、1-068、1-069、1-070、1-071、1-072、1-073、1-074、1-075、1-076、1-077、1-078、1-079、1-080、1-081、1-082、1-083、1-084、1-085、1-086、1-087、1-088、1-089、1-090、1-091、1-092、1-093、1-094、1-095、1-096、1-097、

1-098、1-099、1-100、1-101、1-102、1-103、1-104、1-105、1-106、1-107、1-108、1-109、1-110、1-111、1-112、1-113、1-114、1-115、1-116、1-117、1-118、1-119、1-120、1-121、1-122、1-123、1-124、1-125、1-126、1-127、1-128、1-129、1-130、1-131、1-132、1-133、1-134、1-135、1-136、1-137、1-138、1-139、1-140、1-141、1-142、1-143、1-144、1-145、1-146、1-147、1-148、1-149、1-150、1-151、1-153、1-154、1-155、1-156、1-157、1-158、1-159、1-160、1-161、1-162、1-163、1-164、1-165、1-166、1-167、1-168、1-169、1-170、1-171、1-172、1-173、1-174、1-175、1-176、1-177、1-178、1-179、1-180、1-181、1-182、1-183、1-184、1-185、1-186、1-187、1-188、1-189、1-190、1-191、1-192、1-193、1-194、1-195、1-196、1-197、1-198、1-199、1-200、1-201、1-202、1-203、1-204、1-205、1-206、1-207、1-208、1-209、1-210、1-211、1-212、1-213、1-214、1-215、1-216、1-217、1-218、1-219、1-220、1-221、1-224、1-226、1-230、1-232、1-233、1-242、1-249、1-259、1-260、1-261、1-262、1-263、1-264、1-265、1-266、1-267、1-268、1-269、1-270、1-271、1-272、1-273、1-274、1-275、1-276、1-277、1-278、1-279、1-280、1-281、1-282、1-283、1-284、1-285、1-286、1-28

7、1-288、1-289、1-291、1-292、1-293、1-294、1-295、1-296、1-297、1-298、1-299、1-301、1-302、1-303、1-304、1-305、1-306、1-307、1-308、1-309、1-310、1-311、1-312、1-313、1-315、1-316、1-317、1-318、1-319、1-320、1-321、1-322、1-323、1-324、1-325、1-326、1-327、1-328、1-329、1-330、1-331、1-332、1-333、1-334、1-335、1-336、1-337、1-338、1-339、1-340、1-341、1-342、1-343、1-344、1-345、1-346、1-347、1-348、1-349。

[0436] 試験例5 キュウリうどんこ病防除効果試験

90cm³のプラスチックポットに、キュウリ（品種：相模半白）を植え、子葉期に、試験薬液を水で希釈して500ppmに調製した薬液を、5ml散布処理した。風乾後、キュウリを空調温室（温度20℃、湿度70%RH）に置き、キュウリうどんこ病菌（*Erysiphe polygoni*）の分生孢子懸濁液を、噴霧接種した。9日間置いた後、形成された病斑の接種葉に占める割合を測定し、試験例1と同様の計算式から防除価を算出した。

[0437] その結果、供試した化合物の内、以下の化合物が防除価70%以上を示した。

[0438] 化合物；No. 1-001、1-003、1-004、1-005、1-006、1-007、1-008、1-009、1-011、1-012、1-013、1-014、1-015、1-016、1-017、1-018、1-019、1-020、1-021、1-022、1-023、1-024、1-025、1-026、1-027、1-028、1-030、1-031、1-032、1-033、1-034、1-035、1-036、1-037、1-038、1-039、1-040、1-041、1-

042、1-043、1-044、1-045、1-046、1-047、
1-048、1-049、1-050、1-051、1-052、1-05
3、1-054、1-055、1-056、1-057、1-058、1-
059、1-060、1-061、1-062、1-063、1-064、
1-065、1-066、1-067、1-068、1-069、1-07
0、1-071、1-073、1-074、1-075、1-076、1-
077、1-078、1-079、1-080、1-081、1-082、
1-083、1-084、1-085、1-086、1-088、1-08
9、1-090、1-091、1-092、1-094、1-095、1-
096、1-097、1-098、1-099、1-100、1-101、
1-102、1-103、1-104、1-105、1-106、1-10
7、1-108、1-109、1-110、1-111、1-112、1-
113、1-114、1-115、1-116、1-117、1-118、
1-119、1-120、1-121、1-122、1-123、1-12
4、1-125、1-126、1-127、1-128、1-129、1-
130、1-131、1-132、1-134、1-135、1-136、
1-137、1-138、1-139、1-140、1-141、1-14
3、1-144、1-145、1-146、1-147、1-148、1-
149、1-150、1-151、1-153、1-154、1-155、
1-156、1-157、1-158、1-159、1-160、1-16
1、1-162、1-163、1-164、1-165、1-166、1-
168、1-169、1-171、1-172、1-173、1-174、
1-175、1-176、1-177、1-178、1-179、1-18
0、1-181、1-182、1-183、1-184、1-185、1-
186、1-187、1-188、1-189、1-190、1-191、
1-192、1-193、1-194、1-195、1-196、1-19
7、1-198、1-199、1-200、1-201、1-202、1-
203、1-204、1-205、1-206、1-207、1-208、

1-209、1-210、1-211、1-212、1-213、1-214、1-215、1-216、1-218、1-219、1-220、1-221、1-224、1-226、1-230、1-232、1-233、1-242、1-249、1-259、1-261、1-262、1-264、1-267、1-268、1-269、1-270、1-271、1-273、1-274、1-275、1-276、1-277、1-278、1-279、1-280、1-281、1-282、1-283、1-284、1-285、1-286、1-287、1-288、1-289、1-290、1-291、1-292、1-293、1-294、1-295、1-298、1-299、1-301、1-302、1-303、1-304、1-305、1-306、1-307、1-308、1-309、1-310、1-313、1-315、1-317、1-318、1-319、1-320、1-321、1-322、1-323、1-324、1-325、1-326、1-327、1-330、1-331、1-332、1-333、1-334、1-335、1-336、1-337、1-338、1-339、1-340、1-341、1-342、1-343、1-344、1-345、1-346、1-347、1-348、1-349。

[0439] 試験例6 キュウリ炭疽病防除効果試験

90cm³のプラスチックポットに、キュウリ（品種：相模半白）を植え、子葉期に、試験薬液を水で希釈して500ppmに調製した薬液を、5ml散布処理した。散布1日後、キュウリ炭疽病菌（*Colletotrichum lagenarium*）の分生孢子懸濁液を、キュウリに噴霧接種し、温度25℃、湿度100%RHの接種箱内に2日間入れた。その後、空調温室（温度23℃、湿度60%RH）に置き、7日間保持した。形成された病斑の接種葉に占める割合を測定し、試験例1と同様の計算式から防除価を算出した。

[0440] その結果、供試した化合物の内、以下の化合物が防除価70%以上を示した。

[0441] 化合物；No. 1-001、1-003、1-004、1-005、1-006、1-007、1-008、1-009、1-010、1-011、1-012、1-013、1-014、1-015、1-016、1-017、1-018、1-019、1-020、1-021、1-022、1-023、1-024、1-025、1-026、1-027、1-028、1-030、1-031、1-032、1-033、1-034、1-035、1-036、1-037、1-038、1-039、1-040、1-041、1-042、1-043、1-044、1-045、1-046、1-047、1-048、1-049、1-050、1-051、1-052、1-053、1-054、1-055、1-056、1-057、1-058、1-059、1-060、1-061、1-062、1-063、1-064、1-065、1-066、1-067、1-068、1-069、1-070、1-071、1-072、1-073、1-074、1-075、1-076、1-077、1-078、1-079、1-080、1-081、1-082、1-083、1-084、1-085、1-086、1-087、1-088、1-089、1-090、1-091、1-092、1-093、1-094、1-095、1-096、1-097、1-098、1-099、1-100、1-101、1-102、1-103、1-104、1-105、1-106、1-107、1-108、1-109、1-110、1-111、1-112、1-113、1-114、1-115、1-116、1-117、1-118、1-119、1-120、1-121、1-122、1-123、1-124、1-125、1-126、1-127、1-128、1-129、1-130、1-131、1-132、1-133、1-134、1-135、1-136、1-137、1-138、1-139、1-140、1-141、1-142、1-143、1-144、1-145、1-146、1-147、1-148、1-149、1-150、1-151、1-153、1-154、1-155、1-156、1-157、1-158、1-159、1-160、1-

161、1-162、1-163、1-164、1-165、1-166、
1-168、1-169、1-171、1-172、1-173、1-17
4、1-175、1-176、1-177、1-178、1-179、1-
180、1-181、1-182、1-184、1-186、1-187、
1-188、1-190、1-191、1-192、1-193、1-19
4、1-195、1-196、1-197、1-198、1-199、1-
200、1-201、1-202、1-204、1-205、1-206、
1-207、1-208、1-209、1-210、1-211、1-21
2、1-213、1-214、1-215、1-216、1-218、1-
219、1-220、1-221、1-259、1-261、1-262、
1-264、1-265、1-267、1-268、1-269、1-27
0、1-271、1-272、1-273、1-274、1-275、1-
276、1-277、1-278、1-279、1-280、1-281、
1-282、1-283、1-284、1-285、1-286、1-28
7、1-288、1-289、1-290、1-291、1-292、1-
293、1-294、1-295、1-296、1-298、1-299、
1-301、1-302、1-303、1-304、1-305、1-30
7、1-308、1-309、1-310、1-311、1-312、1-
313、1-315、1-316、1-317、1-318、1-319、
1-320、1-321、1-322、1-323、1-324、1-32
5、1-326、1-328、1-329、1-330、1-331、1-
332、1-333、1-334、1-335、1-336、1-337、
1-338、1-339、1-340、1-348、1-349。

[0442] 試験例7 ダイズさび病防除効果試験

90cm³のプラスチックポットに、ダイズ（品種：エンレイ）を植え、単
葉期に、試験薬液を水で希釈して500ppmに調製した薬液を、5ml散
布処理した。散布1日後、ダイズさび病菌（*Phakopsora pac
hyrhizi*）の分生孢子懸濁液を、ダイズに噴霧接種し、温度20℃、

湿度100%RHの接種箱内に2日間入れた。その後、空調温室（温度20℃、湿度60%RH）に置き、10日間保持した。形成された病斑の接種葉に占める割合を測定し、試験例1と同様の計算式から防除価を算出した。

[0443] その結果、供試した化合物の内、以下の化合物が防除価70%以上を示した。

[0444] 化合物；No. 1-003、1-012、1-015、1-016、1-022、1-023、1-025、1-026、1-027、1-028、1-032、1-036、1-038、1-040、1-041、1-042、1-043、1-044、1-045、1-046、1-048、1-049、1-050、1-051、1-074、1-080、1-082、1-083、1-085、1-087、1-088、1-114、1-175、1-176、1-178、1-180、1-182、1-183、1-184、1-186、1-215、1-268、1-270、1-272、1-273、1-284、1-314、1-340。

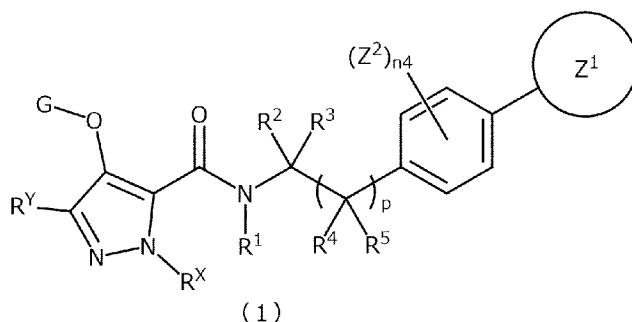
産業上の利用可能性

[0445] 本発明に係るピラゾール化合物は、優れた有害生物防除活性、特に殺菌活性を示し、且つ、ホ乳動物、魚類及び有用昆虫等の非標的生物に対して、ほとんど悪影響の無い、極めて有用な化合物である。

請求の範囲

[請求項1] 式(1) :

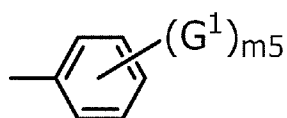
[化1]



[式中、Gは、G-1を表し、

G-1は、下記の構造式で表される構造を表し、

[化2]



G-1

G¹は、ヒドロキシ、ニトロ、シアノ、ハロゲン原子、C₁~C₆アルキル、C₃~C₁₀シクロアルキル、C₁~C₆ハロアルキル、C₁~C₆アルコキシ、C₁~C₆ハロアルコキシ、C₁~C₆アルキルチオ、C₁~C₆アルキルスルフィニル、C₁~C₆アルキルスルホニル、ジ(C₁~C₆アルキル)アミノ、C₁~C₆アルキルカルボニル、C₁~C₆アルコキシカルボニル、C₁~C₆アルキルアミノカルボニル、C₃~C₁₀シクロアルキルアミノカルボニル又はジ(C₁~C₆アルキル)アミノカルボニルを表し、

G¹との関係において、m₅が2、3、4又は5の整数を示す場合には、各々のG¹は互いに同一であっても、又は互いに相異なってもよく、

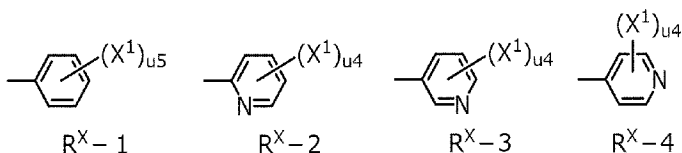
R^xは、C₁~C₆アルキル、C₃~C₁₀シクロアルキル、C₁~C₆ハロアルキル、ベンジル、R^{x-1}、R^{x-2}、R^{x-3}又はR^{x-4}

を表し、

$R^X-1 \sim R^X-4$ は、それぞれ下記の構造式で表される構造を表

し、

[化3]



X^1 は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル又は $C_1 \sim C_6$ アルコキシを表し、

X^1 との関係において、 u_5 が 2、3、4 又は 5 の整数を示す場合には、各々の X^1 は互いに同一であっても、又は互いに相異なってもよく、

X^1 との関係において、 u_4 が 2、3 又は 4 の整数を示す場合には、各々の X^1 は互いに同一であっても、又は互いに相異なってもよく、

R^Y は、水素原子、ハロゲン原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^1 は、水素原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^2 は、水素原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^3 は、水素原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^4 は、水素原子、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $C_1 \sim C_6$ アルコキシを表し、

R^5 は、水素原子、ハロゲン原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

Z^1 は、E-1 ~ E-29、又は E-30 を表し、

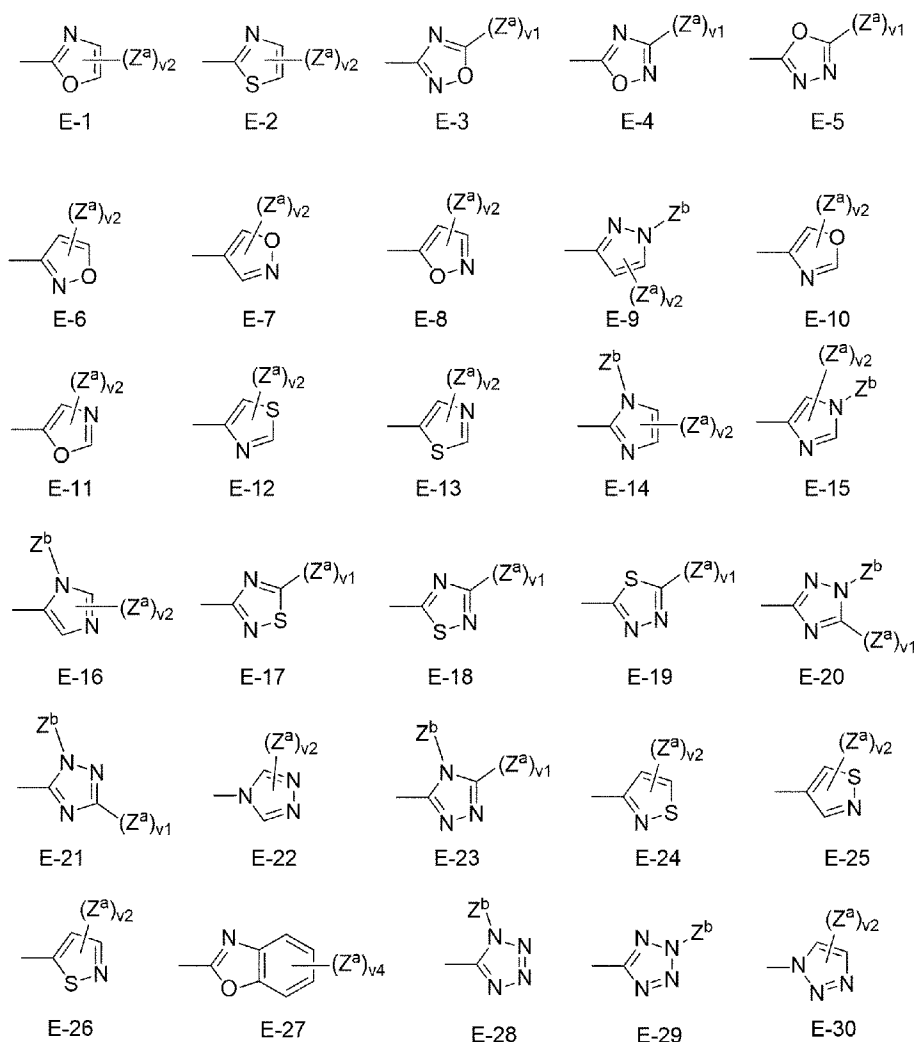
Z^2 は、ヒドロキシ、カルボキシ、アミノ、ニトロ、シアノ、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ ハロシクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル又は $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニ

ルを表し、

Z^2 との関係において、 n_4 が2、3又は4の整数を示す場合には、各々の Z^1 は互いに同一であっても、又は互いに相異なってもよく、

E-1～E-30は、それぞれ下記の構造式で表される構造を表し、

[化4]



Z^a は、ヒドロキシ、チオール、ハロゲン原子、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^a で置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ

、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、
 $-C(=NOR^b)R^c$ 、 $-C(O)R^d$ 、 $-NR^eR^f$ 、フェニル、ピ
 ロリジン-1-イル、モルホリン-1-イル又はピペリジン-1-イ
 ルを表し、

Z^a との関係において、 v_2 が2の整数を示す場合には、各々の Z^a
 Z^a は互いに同一であっても、又は互いに相異なってもよく、

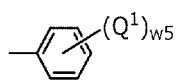
Z^a との関係において、 v_4 が2、3又は4の整数を示す場合には
 、各々の Z^a は互いに同一であっても、又は互いに相異なってもよく
 、

Z^b は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^a は、ヒドロキシ、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アル
 キルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスル
 ホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカ
 ルボニルアミノ、フェニルカルボニルアミノ、 $-OR^g$ 、 $-C(O)$
 R^g 、 $-NR^hSO_2R^j$ 又は $Q-1$ を表し、

$Q-1$ は、下記の構造式で表される構造を表し、

[化5]



$Q-1$

Q^1 は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル
 又は $C_1 \sim C_6$ アルコキシを表し、

Q^1 との関係において、 w_5 が2、3、4又は5の整数を示す場合
 には、各々の Q^1 は互いに同一であっても、又は互いに相異なっても
 よく、

R^b は、水素原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^c は、水素原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^d は、アミノ、ヒドロキシアミノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノ、 C

$C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキルアミノ、ジ ($C_1 \sim C_6$ アルキル) アミノ、ピロリジン-1-イル、モルホリン-1-イル又はピペリジン-1-イルを表し、

R^e は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル又は $C_1 \sim C_6$ アルコキシを表し、

R^f は、水素原子、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル、ジ ($C_1 \sim C_6$ アルキル) アミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニルを表し、

R^g は、 $Q-1$ を表し、

R^h は、水素原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^i は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

m_5 は、0、1、2、3、4又は5の整数を表し、

n_4 は、0、1、2、3又は4の整数を表し、

u_5 は、0、1、2、3、4又は5の整数を表し、

u_4 は、0、1、2、3又は4の整数を表し、

p は、0又は1の整数を表し、

v_4 は、0、1、2、3又は4の整数を表し、

v_2 は、0、1又は2の整数を表し、

v_1 は、0又は1の整数を表し、

w_5 は、0、1、2、3、4又は5の整数を表す。]

で表されるピラゾール化合物又はその塩。

[請求項2]

G^1 は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルを表し、

R^x は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^x-1 又は R^x-2 を表し、

R^y は、水素原子を表し、

R^1 は、水素原子を表し、

R^2 は、水素原子を表し、

R^3 は、水素原子を表し、

R^4 は、水素原子を表し、

R^5 は、水素原子を表し、

Z^1 は、E-2、E-3、E-4、E-5、E-6、E-7、E-8、E-9、E-10、E-11、E-12、E-13、E-16、E-17、E-18、E-19、E-20、E-21、E-24、E-25、E-26、E-27、E-29又はE-30を表し、

Z^2 は、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシを表し、

Z^a は、ヒドロキシ、チオール、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^a で置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $-C(=NOR^b)R^c$ 、 $-C(O)R^d$ 、 $-NR^eR^f$ 、フェニル、ピロリジン-1-イル、モルホリン-1-イル又はピペリジン-1-イルを表し、

Q^1 は、ハロゲン原子を表し、

R^b は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^c は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^e は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル又は $C_1 \sim C_6$ アルコキシを表し、

R^h は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

m_5 は、0又は1の整数を表し、

n_4 は、0又は1の整数を表し、

u_5 は、0の整数を表し、

u_4 は、0の整数を表し、

p は、1の整数を表し、

v_4 は、0の整数を表し、

w 5 は、0 又は 1 の整数を表す請求項 1 に記載のピラゾール化合物又はその塩。

[請求項3] Z¹ は、E-3、E-4、E-5、E-6、E-8、E-9、E-12、E-13、又は E-29 を表す請求項 2 に記載のピラゾール化合物又はその塩。

[請求項4] Z^a は、C₁～C₆アルキル、R^aで置換されたC₁～C₆アルキル、C₃～C₁₀シクロアルキル、C₁～C₆ハロアルキル、-C(=NOR^b)R^c、-NR^eR^f、フェニル、ピロリジン-1-イル、モルホリン-1-イル又はピペリジン-1-イルを表し、

R^a は、C₁～C₆アルコキシ又はC₁～C₆アルキルチオを表す請求項 3 に記載のピラゾール化合物又はその塩。

[請求項5] Z¹ は、E-3、E-4、E-5 又は E-29 を表す請求項 3 又は 4 に記載のピラゾール化合物又はその塩。

[請求項6] 請求項 1～5 の何れか 1 項に記載のピラゾール化合物及びその塩から選ばれる 1 種以上を有効成分として含有する、農薬。

[請求項7] 請求項 1～5 の何れか 1 項に記載のピラゾール化合物及びその塩から選ばれる 1 種以上を有効成分として含有する、殺菌剤。

[請求項8] 請求項 1～5 の何れか 1 項に記載のピラゾール化合物及びその塩から選ばれる 1 種以上を有効成分として含有する、農園芸用殺菌剤。

[請求項9] 請求項 1～5 の何れか 1 項に記載のピラゾール化合物及びその塩から選ばれる 1 種以上を有効成分として含有する、抗真菌剤。

[請求項10] 請求項 1～5 の何れか 1 項に記載のピラゾール化合物及びその塩から選ばれる 1 種以上を有効成分として含有する、内部寄生虫防除剤。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2024/041387

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER		
<p><i>C07D 231/18</i>(2006.01)i; <i>A01N 43/56</i>(2006.01)i; <i>A01N 43/78</i>(2006.01)i; <i>A01N 43/80</i>(2006.01)i; <i>A01N 43/824</i>(2006.01)i; <i>A01N 43/836</i>(2006.01)i; <i>A01N 43/84</i>(2006.01)i; <i>A01P 3/00</i>(2006.01)i; <i>A61K 31/415</i>(2006.01)i; <i>A61K 31/4192</i>(2006.01)i; <i>A61K 31/4196</i>(2006.01)i; <i>A61K 31/422</i>(2006.01)i; <i>A61K 31/4245</i>(2006.01)i; <i>A61K 31/427</i>(2006.01)i; <i>A61K 31/428</i>(2006.01)i; <i>A61K 31/433</i>(2006.01)i; <i>A61K 31/4439</i>(2006.01)i; <i>A61P 31/10</i>(2006.01)i; <i>A61P 33/00</i>(2006.01)i; <i>C07D 403/12</i>(2006.01)i; <i>C07D 413/12</i>(2006.01)i; <i>C07D 413/14</i>(2006.01)i; <i>C07D 417/12</i>(2006.01)i</p> <p>FI: C07D231/18; A01N43/56 B; A01N43/56 D; A01N43/78 A; A01N43/78 B; A01N43/78 101; A01N43/80 101; A01N43/80 102; A01N43/824 Z; A01N43/836; A01N43/84 101; A01P3/00; A61K31/415; A61K31/4192; A61K31/4196; A61K31/422; A61K31/4245; A61K31/427; A61K31/428; A61K31/433; A61K31/4439; A61P31/10; A61P33/00; C07D403/12; C07D413/12 CSP; C07D413/14; C07D417/12</p>		
According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC		
B. FIELDS SEARCHED		
Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)		
<p>C07D231/18; A01N43/56; A01N43/78; A01N43/80; A01N43/824; A01N43/836; A01N43/84; A01P3/00; A61K31/415; A61K31/4192; A61K31/4196; A61K31/422; A61K31/4245; A61K31/427; A61K31/428; A61K31/433; A61K31/4439; A61P31/10; A61P33/00; C07D403/12; C07D413/12; C07D413/14; C07D417/12</p>		
Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched		
<p>Published examined utility model applications of Japan 1922-1996 Published unexamined utility model applications of Japan 1971-2025 Registered utility model specifications of Japan 1996-2025 Published registered utility model applications of Japan 1994-2025</p>		
Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)		
CAplus/REGISTRY (STN)		
C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
P, X	WO 2023/243678 A1 (NISSAN CHEMICAL CORPORATION) 21 December 2023 (2023-12-21) claims, table 4 (no. 4-108, 4-019, 4-023 to 4-026, 4-062, 4-063)	1-4, 6-10
P, A		5
A	JP 2002-348280 A (SAGAMI CHEM RES CENTER) 04 December 2002 (2002-12-04) claims, examples	1-10
<input checked="" type="checkbox"/> Further documents are listed in the continuation of Box C. <input checked="" type="checkbox"/> See patent family annex.		
<p>* Special categories of cited documents:</p> <p>“A” document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance</p> <p>“D” document cited by the applicant in the international application</p> <p>“E” earlier application or patent but published on or after the international filing date</p> <p>“L” document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)</p> <p>“O” document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means</p> <p>“P” document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed</p> <p>“T” later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention</p> <p>“X” document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone</p> <p>“Y” document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art</p> <p>“&” document member of the same patent family</p>		
Date of the actual completion of the international search		Date of mailing of the international search report
06 January 2025		21 January 2025
Name and mailing address of the ISA/JP		Authorized officer
<p>Japan Patent Office (ISA/JP) 3-4-3 Kasumigaseki, Chiyoda-ku, Tokyo 100-8915 Japan</p>		Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2024/041387

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	JP 2022-508277 A (BAYER AKTIENGESELLSCHAFT) 19 January 2022 (2022-01-19) claims, example I-299	1-10
A	JP 2023-538713 A (BAYER AKTIENGESELLSCHAFT) 11 September 2023 (2023-09-11) claims, example I-117	1-10
P, A	WO 2024/204842 A1 (NISSAN CHEMICAL CORPORATION) 03 October 2024 (2024-10-03) claims, examples	1-10

INTERNATIONAL SEARCH REPORT
Information on patent family members

International application No.

PCT/JP2024/041387

Patent document cited in search report			Publication date (day/month/year)	Patent family member(s)	Publication date (day/month/year)
WO	2023/243678	A1	21 December 2023	(Family: none)	
JP	2002-348280	A	04 December 2002	(Family: none)	
JP	2022-508277	A	19 January 2022	US 2023/0054449 A1	
				claims, example I-299	
				WO 2020/109391 A1	
				EP 3887362 A1	
				CN 113490663 A	
JP	2023-538713	A	11 September 2023	US 2023/0348392 A1	
				claims, example I-117	
				WO 2021/224220 A1	
				EP 4146628 A1	
WO	2024/204842	A1	03 October 2024	(Family: none)	

<p>A. 発明の属する分野の分類（国際特許分類（IPC））</p> <p>C07D 231/18(2006.01)i; A01N 43/56(2006.01)i; A01N 43/78(2006.01)i; A01N 43/80(2006.01)i; A01N 43/824(2006.01)i; A01N 43/836(2006.01)i; A01N 43/84(2006.01)i; A01P 3/00(2006.01)i; A61K 31/415(2006.01)i; A61K 31/4192(2006.01)i; A61K 31/4196(2006.01)i; A61K 31/422(2006.01)i; A61K 31/4245(2006.01)i; A61K 31/427(2006.01)i; A61K 31/428(2006.01)i; A61K 31/433(2006.01)i; A61K 31/4439(2006.01)i; A61P 31/10(2006.01)i; A61P 33/00(2006.01)i; C07D 403/12(2006.01)i; C07D 413/12(2006.01)i; C07D 413/14(2006.01)i; C07D 417/12(2006.01)i FI: C07D231/18; A01N43/56 B; A01N43/56 D; A01N43/78 A; A01N43/78 B; A01N43/78 101; A01N43/80 101; A01N43/80 102; A01N43/824 Z; A01N43/836; A01N43/84 101; A01P3/00; A61K31/415; A61K31/4192; A61K31/4196; A61K31/422; A61K31/4245; A61K31/427; A61K31/428; A61K31/433; A61K31/4439; A61P31/10; A61P33/00; C07D403/12; C07D413/12 CSP; C07D413/14; C07D417/12</p>														
<p>B. 調査を行った分野</p> <p>調査を行った最小限資料（国際特許分類（IPC））</p> <p>C07D231/18; A01N43/56; A01N43/78; A01N43/80; A01N43/824; A01N43/836; A01N43/84; A01P3/00; A61K31/415; A61K31/4192; A61K31/4196; A61K31/422; A61K31/4245; A61K31/427; A61K31/428; A61K31/433; A61K31/4439; A61P31/10; A61P33/00; C07D403/12; C07D413/12; C07D413/14; C07D417/12</p> <p>最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの</p> <table border="0"> <tr> <td>日本国実用新案公報</td> <td>1922 - 1996年</td> </tr> <tr> <td>日本国公開実用新案公報</td> <td>1971 - 2025年</td> </tr> <tr> <td>日本国実用新案登録公報</td> <td>1996 - 2025年</td> </tr> <tr> <td>日本国登録実用新案公報</td> <td>1994 - 2025年</td> </tr> </table> <p>国際調査で使用した電子データベース（データベースの名称、調査に使用した用語）</p> <p>CAplus/REGISTRY (STN)</p>			日本国実用新案公報	1922 - 1996年	日本国公開実用新案公報	1971 - 2025年	日本国実用新案登録公報	1996 - 2025年	日本国登録実用新案公報	1994 - 2025年				
日本国実用新案公報	1922 - 1996年													
日本国公開実用新案公報	1971 - 2025年													
日本国実用新案登録公報	1996 - 2025年													
日本国登録実用新案公報	1994 - 2025年													
<p>C. 関連すると認められる文献</p> <table border="1"> <thead> <tr> <th>引用文献の カテゴリー*</th> <th>引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示</th> <th>関連する 請求項の番号</th> </tr> </thead> <tbody> <tr> <td>P, X</td> <td>WO 2023/243678 A1 (日産化学株式会社) 21.12.2023 (2023 - 12 - 21) 請求の範囲、第4表 (No.4-018、4-019、4-023~4-026、4-062、4-063)</td> <td>1-4,6-10</td> </tr> <tr> <td>P, A</td> <td></td> <td>5</td> </tr> <tr> <td>A</td> <td>JP 2002-348280 A (財団法人相模中央化学研究所) 04.12.2002 (2002 - 12 - 04) 特許請求の範囲、実施例</td> <td>1-10</td> </tr> </tbody> </table> <p><input checked="" type="checkbox"/> C欄の続きにも文献が列挙されている。 <input checked="" type="checkbox"/> パテントファミリーに関する別紙を参照。</p> <p>* 引用文献のカテゴリー “A” 特に関連のある文献ではなく、一般的な技術水準を示すもの “D” 国際出願で出願人が先行技術文献として記載した文献 “E” 国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの “L” 優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献（理由を付す） “O” 口頭による開示、使用、展示等に言及する文献 “P” 国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願の日の後に公表された文献 “T” 国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と抵触するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの “X” 特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの “Y” 特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの “&” 同一パテントファミリー文献</p>			引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求項の番号	P, X	WO 2023/243678 A1 (日産化学株式会社) 21.12.2023 (2023 - 12 - 21) 請求の範囲、第4表 (No.4-018、4-019、4-023~4-026、4-062、4-063)	1-4,6-10	P, A		5	A	JP 2002-348280 A (財団法人相模中央化学研究所) 04.12.2002 (2002 - 12 - 04) 特許請求の範囲、実施例	1-10
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求項の番号												
P, X	WO 2023/243678 A1 (日産化学株式会社) 21.12.2023 (2023 - 12 - 21) 請求の範囲、第4表 (No.4-018、4-019、4-023~4-026、4-062、4-063)	1-4,6-10												
P, A		5												
A	JP 2002-348280 A (財団法人相模中央化学研究所) 04.12.2002 (2002 - 12 - 04) 特許請求の範囲、実施例	1-10												
国際調査を完了した日	06.01.2025	国際調査報告の発送日	21.01.2025											
名称及びあて先	日本国特許庁(ISA/JP) 〒100-8915 日本国 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号	権限のある職員（特許庁審査官）	鳥居 福代 4P 3436 電話番号 03-3581-1101 内線 3443											

C. 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリ*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求項の番号
A	JP 2022-508277 A (バイエル、アクチエンゲゼルシャフト) 19.01.2022 (2022 - 01 - 19) 特許請求の範囲、実施例I-299	1-10
A	JP 2023-538713 A (バイエル、アクチエンゲゼルシャフト) 11.09.2023 (2023 - 09 - 11) 特許請求の範囲、実施例I-117	1-10
P, A	WO 2024/204842 A1 (日産化学株式会社) 03.10.2024 (2024 - 10 - 03) 請求の範囲、実施例	1-10

国際調査報告
 パテントファミリーに関する情報

国際出願番号
 PCT/JP2024/041387

引用文献	公表日	パテントファミリー文献	公表日
WO 2023/243678 A1	21.12.2023	(ファミリーなし)	
JP 2002-348280 A	04.12.2002	(ファミリーなし)	
JP 2022-508277 A	19.01.2022	US 2023/0054449 A1 特許請求の範囲、実施例 I-299 WO 2020/109391 A1 EP 3887362 A1 CN 113490663 A	
JP 2023-538713 A	11.09.2023	US 2023/0348392 A1 特許請求の範囲、実施例 I-117 WO 2021/224220 A1 EP 4146628 A1	
WO 2024/204842 A1	03.10.2024	(ファミリーなし)	