

(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3月20日(20.03.2025)



(10) 国際公開番号

WO 2025/057723 A1

(51) 国際特許分類:

C07D 277/56 (2006.01) A01P 3/00 (2006.01)  
A01N 43/78 (2006.01)

(21) 国際出願番号: PCT/JP2024/030537

(22) 国際出願日: 2024年8月27日(27.08.2024)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:

特願 2023-148047 2023年9月13日(13.09.2023) JP  
特願 2023-148050 2023年9月13日(13.09.2023) JP

(71) 出願人: 石原産業株式会社(ISHIHARA SANGYO KAISHA, LTD.) [JP/JP]; 〒5500002 大阪府大阪市西区江戸堀一丁目3番15号 Osaka (JP).

(72) 発明者: 伏木 田地 (FUSHIKIDA Kuni); 〒5500002 大阪府大阪市西区江戸堀一丁目3番15号 石原産業株式会社内 Osaka (JP). 岩本 拓也(IWAMOTO Takuya); 〒5500002 大阪府大阪市西区江戸堀一丁目3番15号 石原産業株式会社内 Osaka (JP). 林 博之(HAYASHI Hiroyuki); 〒5500002 大阪府大阪市西区江戸堀一丁目3番15号 石原産業株式会社内 Osaka (JP). 戸▲崎▼ 龍彦(TOSAKI Tatsuhiko); 〒5500002 大阪府大阪市西区江戸堀一丁目3番15号 石原産業株式会社内 Osaka (JP). 大野 将也(OHNO Masanari); 〒5500002 大阪府大阪市西区江戸堀一丁目3番15号 石原産業株式会社内 Osaka (JP). 加藤 康介(KATO Kohsuke); 〒5500002 大阪府大阪市西区江戸堀一丁目3番15号 石原産業株式会社内 Osaka (JP). ▲瀬▼ 沼 和香奈(SENUMA Wakana); 〒5500002 大阪府大阪市西区江戸堀一丁目3番15号 石原産業株式会社内 Osaka (JP). 牧野 辰昭(MAKINO Tatsuaki);

〒5500002 大阪府大阪市西区江戸堀一丁目3番15号 石原産業株式会社内 Osaka (JP).

(74) 代理人: 弁理士法人 T. S. パートナーズ (T.S. PARTNERS); 〒1010047 東京都千代田区内神田一丁目18番13号 内神田中央ビル7階 Tokyo (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.

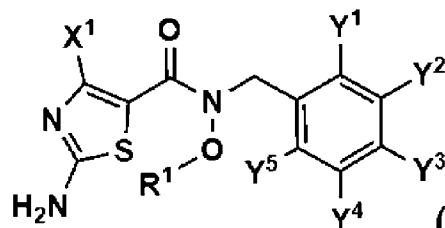
(84) 指定国(表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, CV, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SC, SD, SL, ST, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, ME, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, RS, SE,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

(54) Title: N-SUBSTITUTED OXYAMIDE COMPOUND OR SALT THEREOF

(54) 発明の名称: N-置換オキシアミド化合物又はその塩



(57) Abstract: Provided is a novel compound exhibiting an excellent controlling effect on harmful plant diseases. A compound represented by formula (I) (wherein each symbol is as defined in the description) or a salt thereof exhibits an excellent controlling effect on harmful plant diseases.

(57) 要約: 有害な植物病害に対して優れた防除効果を発揮する新規な化合物を提供する。〔式中、各記号は明細書に記載の通りである〕で表される化合物又はその塩が有害な植物病害に対して優れた防除効果を発揮する。

WO 2025/057723 A1

## 明 細 書

発明の名称： N－置換オキシアミド化合物又はその塩

### 技術分野

[0001] 本発明は新規N－置換オキシアミド化合物又はその塩、及びそれらを有効成分として含有する農園芸用殺菌剤に関する。

### 背景技術

[0002] 既存の農園芸用殺菌剤において、施用場面によっては有害な植物病害に対する実用上不十分な防除効果、薬剤耐性菌の出現及び環境負荷（周辺の植物や生態系への影響）などの問題より、新規な農園芸用殺菌剤が切望されている。また、環境汚染の防止等の観点から、有害な植物病害に対して可能な限り低薬量で優れた防除効果を示す農園芸用殺菌剤が望まれている。

[0003] 特許文献1には、アミド化合物とその植物病害防除用途が開示されている。しかしながら、特許文献1には、下記式（1）で表される化合物の具体的な記載は一切ない。

殺微生物剤として使用することができる化合物は、例えばN－アルコキシカルボキサミドが知られている（特許文献2）。しかしながら、特許文献2には、下記式（1）で表される化合物の具体的な記載は一切ない。

非特許文献1には、Table 1のNo. 15より、N-Benzoyl-N-benzyl-O-2-propynylhydroxylamineの5－ヒドロキシトリプトファンデカルボキシラーゼ阻害活性試験及びモノアミノオキシダーゼ阻害活性試験が開示されている。しかしながら、非特許文献1に記載された化合物の有害な植物病害に対する防除効果に関する記載は一切ない。さらに、非特許文献1には、下記式（1）で表される化合物の記載も一切ない。

一方で、2-amino-N-benzyl-N-methoxy-1,3-thiazole-5-carboxamide（CAS登録番号：2301497-10-7）及び2-amino-N-benzyl-N-m

ethoxy-4-methyl-1,3-thiazole-5-carboxamide (CAS登録番号：2299658-69-6) の化合物が知られている。しかしながら、その用途は不明であり、当然ながら、これらの化合物が有する植物病害への効果については一切知られていない。

## 先行技術文献

## 特許文献

[0004] 特許文献1：国際公報第2010/134634号

特許文献2：国際公報第2011/023645号

## 非特許文献

[0005] 非特許文献1：Journal of Medicinal Chemistry 1969, 12 (1), 45-48

## 発明の概要

## 発明が解決しようとする課題

[0006] 本発明の課題は、有害な植物病害に対して優れた防除効果を発揮する新規な化合物を提供することである。

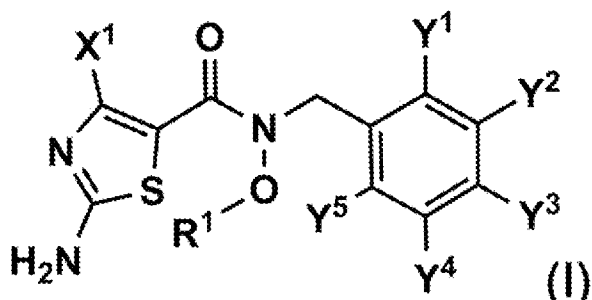
## 課題を解決するための手段

[0007] 本発明者らは上記の課題を解決すべく鋭意検討した結果、下記式 (I) で表される化合物又はその塩が有害な植物病害に対して優れた防除効果を発揮することを見出した。

すなわち、本発明は以下の通りである。

[1] 式 (I)：

[0008] [化1]



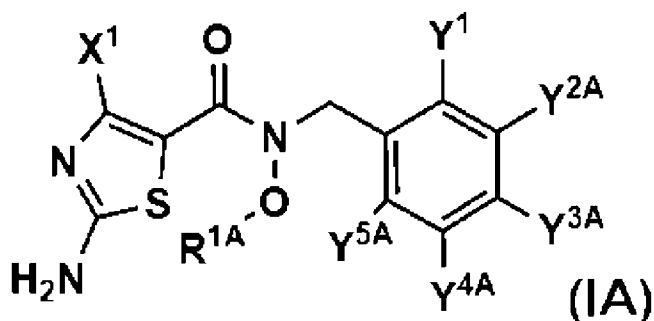
[式中、 $R^1$ は、 $(C_1-C_5)$  - 鎖式炭化水素、又は  $(C_3-C_4)$  - シクロアルキルであり {ここで、該  $(C_1-C_5)$  - 鎖式炭化水素及び該  $(C_3-C_4)$  - シクロアルキルは、少なくとも1個の  $T^1$  で置換されていてもよい}、  
 $T^1$  は、ハロゲン、シアノ、又は  $-U^1-R^2$  であり、  
 $U^1$  は、O、S、又は  $C(=O)O$  であり、  
 $R^2$  は、 $(C_1-C_3)$  - アルキルであり、  
 $X^1$  は、ハロゲンであり、  
 $Y^1$ 、 $Y^2$ 、 $Y^3$ 、 $Y^4$  及び  $Y^5$  は、それぞれ独立に、ハロゲン、 $(C_1-C_6)$  - アルキル、 $(C_1-C_6)$  - ハロアルキル、ニトロ、シアノ、又は水素原子である。ただし、 $R^1$  が  $(C_1-C_4)$  - アルキル又は  $(C_3-C_4)$  - シクロアルキルである場合は、 $Y^1$ 、 $Y^2$ 、 $Y^3$ 、 $Y^4$  及び  $Y^5$  の全てが同時に水素原子になることはない。] で表される化合物又はその塩（以下、化合物（I）ともいう）。

[0009] [2]  $R^1$  が、 $(C_1-C_4)$  - アルキル、 $(C_3-C_4)$  - シクロアルキル、又は  $(C_3-C_5)$  - アルキニルである、前記 [1] に記載の化合物又はその塩。

[0010] [3] 式（I）の化合物が、

式（IA）：

[0011] [化2]



[式中、 $R^{1A}$ は、 $(C_1-C_4)$  - アルキル、又は  $(C_3-C_4)$  - シクロアルキルであり、

$X^1$  は、ハロゲンであり、

$Y^1$ は、ハロゲン、 $(C_1-C_6)$ -アルキル、 $(C_1-C_6)$ -ハロアルキル、ニトロ、シアノ、又は水素原子であり、

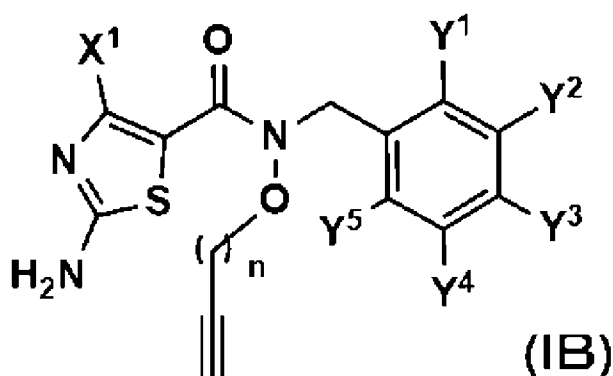
$Y^{2A}$ 、 $Y^{3A}$ 及び $Y^{4A}$ は、それぞれ独立に、水素原子、又はハロゲンであり、

$Y^{5A}$ は、水素原子である。ただし、 $Y^1$ が水素原子である場合は、 $Y^{2A}$ 、 $Y^{3A}$ 及び $Y^{4A}$ の全てが同時に水素原子になることはない。]で表されるN-(シクロ)アルコキシアミド化合物である、前記[1]に記載の化合物又はその塩(以下、化合物(IA)ともいう)。

[0012] [4] 式(1)の化合物が、

式(1B)：

[0013] [化3]



[式中、 $n$ は、1、2、又は3であり、

$X^1$ は、ハロゲンであり、

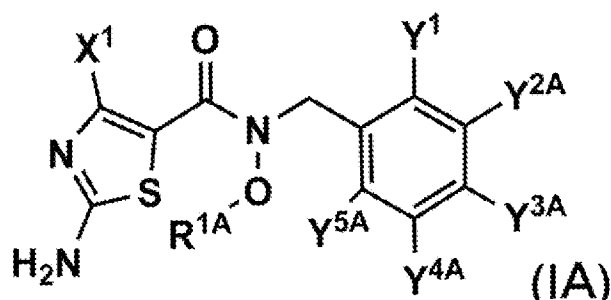
$Y^1$ 、 $Y^2$ 、 $Y^3$ 、 $Y^4$ 及び $Y^5$ は、それぞれ独立に、水素原子、ハロゲン、 $(C_1-C_6)$ -アルキル、 $(C_1-C_6)$ -ハロアルキル、ニトロ、又はシアノである。]で表されるN-アルキニルオキシアミド化合物である、前記[1]に記載の化合物又はその塩(以下、化合物(1B)ともいう)。

[0014] [5] 式(1)の化合物が、

式(1A)：

[0015]

[化4]



[式中、 $R^{1A}$ は、 $(C_1-C_4)$ －アルキル、又は $(C_3-C_4)$ －シクロアルキルであり、

$X^1$ は、ハロゲンであり、

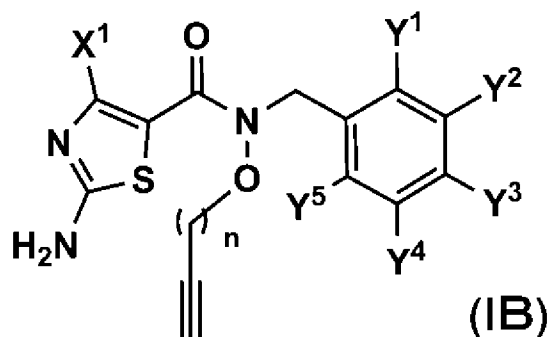
$Y^1$ は、ハロゲン、 $(C_1-C_6)$ －アルキル、 $(C_1-C_6)$ －ハロアルキル、ニトロ、シアノ、又は水素原子であり、

$Y^{2A}$ 、 $Y^{3A}$ 及び $Y^{4A}$ は、それぞれ独立に、水素原子、又はハロゲンであり、

$Y^{5A}$ は、水素原子である。ただし、 $Y^1$ が水素原子である場合は、 $Y^{2A}$ 、 $Y^{3A}$ 及び $Y^{4A}$ の全てが同時に水素原子になることはない。]で表されるN－（シクロ）アルコキシアミド化合物、又は

式（IB）：

[0016] [化5]



[式中、 $n$ は、1、2、又は3であり、

$X^1$ は、ハロゲンであり、

$Y^1$ 、 $Y^2$ 、 $Y^3$ 、 $Y^4$ 及び $Y^5$ は、それぞれ独立に、水素原子、ハロゲン、 $(C_1-C_6)$ －アルキル、 $(C_1-C_6)$ －ハロアルキル、ニトロ、又はシアノである。]で表されるN－アルキニルオキシアミド化合物である、前記[1]

に記載の化合物又はその塩。

[0017] [6]  $Y^1$ が、ハロゲン、 $(C_1-C_6)$ -アルキル、 $(C_1-C_6)$ -ハロアルキル、ニトロ、又はシアノである、前記[1]～前記[5]のいずれか1つに記載の化合物又はその塩。

[0018] [7]  $R^{1A}$ が、メチル、エチル又はシクロプロピルである、前記[3]又は前記[5]に記載の化合物又はその塩。

[0019] [8]  $Y^5$ が、水素原子である前記[1]、前記[2]、及び前記[4]～前記[6]のいずれか1つに記載の化合物又はその塩。

[0020] [9] 前記[1]～前記[8]のいずれか1つに記載の化合物又はその塩を有効成分として含有する農園芸用殺菌剤。

[0021] [10] 前記[1]～前記[8]のいずれか1つに記載の化合物又はその塩の有効量を、植物体、植物病原菌又は土壤に施用し、有害な植物病害を防除する方法。

## 発明の効果

[0022] 本発明の化合物(1)は、有害な植物病害に対して優れた防除効果を発揮し、農園芸用殺菌剤として有用である。

## 発明を実施するための形態

[0023] 本明細書に記載された種々の置換基及び化学構造について説明する。なお、化合物(1)は、化合物(1A)及び化合物(1B)を包含し、それらをまとめて本発明化合物とも記す。

[0024] ハロゲン又は置換基としてのハロゲンは、フッ素、塩素、臭素、又はヨウ素の各原子が挙げられる。置換基としてのハロゲンの数は1個又は2個以上であってもよく、2個以上の場合、各ハロゲン原子は各々同一でも相異なってもよい。また、置換基としてのハロゲンの置換位置は何れの位置でもよい。

[0025] 「 $C_P-C_T$ 」は、炭素原子数がP乃至Tであることを意味する。例えば「 $C_1-C_4$ 」は、炭素原子数が1乃至4であることを意味する。また、「置換されていてもよい」との表記は、置換基を有すること又は無置換であること

を意味する。

[0026]  $(C_1-C_5)$  -鎖式炭化水素は、 $(C_1-C_4)$  -アルキル、 $(C_3-C_5)$  -アルキニル、又は $(C_3-C_5)$  -アルケニルのことを意味する。

$(C_1-C_4)$  -アルキルは、例えば、メチル、エチル、ノルマルプロピル、イソプロピル、ノルマルブチル、イソブチル、セカンダリーブチル、又はターシャリーブチルのような炭素原子数1～4個の直鎖又は分岐鎖状のアルキル基が挙げられる。

[0027]  $(C_3-C_5)$  -アルキニルは、例えば、1-プロピニル、プロパルギル（単に2-プロピニルともいう）、1-ブチニル、2-ブチニル、3-ブチニル、3-ブチン-2-イル、ブター1, 3-ジイニル、1-ペンチニル、2-ペンチニル、3-ペンチニル、4-ペンチニル、3-メチル-1-ブチニル、3-ペンチン-2-イル、1-ペンチン-3-イル、4-ペンチン-2-イル、2-メチル-3-ブチニル、ペンター1, 3-ジイニル、ペンター1, 4-ジイニル又はペンター2, 4-ジイニル等の任意の位置に少なくとも1つの三重結合を有する、炭素原子数3～5個の直鎖又は分岐鎖状のアルキニル基が挙げられる。

[0028]  $(C_3-C_5)$  -アルケニルは、例えば、アリル（単に2-プロペニルともいう）、1-プロペニル、イソプロペニル、1-ブテニル、2-ブテニル、3-ブテニル、ブター1, 3-ジエニル、ブター1, 3-ジエン-2-イル、2-メチル-1-プロペニル、2-ブテン-2-イル、3-ブテン-2-イル、2-メチル-2-プロペニル、3-ブテン-3-イル、1-ペンテニル、2-ペンテニル、3-ペンテニル、4-ペンテニル、2-ペンテン-2-イル、3-メチル-2-ブテン-2-イル、3-メチル-2-ブテニル、ペンター1, 3-ジエニル、ペンター2, 4-ジエニル、又はペンター2, 4-ジエン-2-イル等の任意の位置に少なくとも1つの二重結合を有する、炭素原子数3～5個の直鎖又は分岐鎖状のアルケニル基が挙げられる。また、幾何異性体がある場合、E体又はZ体のどちらか一方のみ、或いはE体とZ体との任意の割合の混合物であり、指定される炭素数の範囲であれば、

特に限定されることはない。

[0029] ( $C_1-C_6$ )-アルキルは、例えば、メチル、エチル、ノルマルプロピル、イソプロピル、ノルマルブチル、イソブチル、セカンダリーブチル、ターシャリーブチル、ノルマルペンチル、イソペンチル、ネオペンチル、セカンダリーペンチル、1-エチルプロピル、ターシャリーペンチル、ノルマルヘキシル、イソヘキシル、セカンダリーヘキシル、2-メチルペンチル、3-メチルペンチル、1-エチルブチル、2-エチルブチル、1, 2-ジメチルブチル、1, 3-ジメチルブチル、2, 3-ジメチルブチル、ターシャリーヘキシル、2, 2-ジメチルブチル、ネオヘキシル、1-エチル-2-メチルプロピル、又は1-エチル-1-メチルプロピルのような炭素原子数1～6個の直鎖又は分岐鎖状のアルキル基が挙げられる。

( $C_1-C_3$ )-アルキルは、炭素原子数1～3個の直鎖又は分岐鎖状のアルキル基を表す。その具体例は、上記の( $C_1-C_6$ )-アルキルの具体例の中で炭素原子数1～3個のアルキル基が該当する。

[0030] ( $C_3-C_4$ )-シクロアルキルは、炭素原子数が3～4個よりなる環状の炭化水素基を表し、3員環から4員環までの単環構造を形成することができる。また、3員環の単環構造を形成する場合は指定の炭素原子数の範囲でメチル基によって任意の位置に置換されていてもよい。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又はシクロブチルのような炭素原子数3～4個のシクロアルキル基が挙げられる。

[0031] 前記( $C_1-C_5$ )-鎖式炭化水素及び前記( $C_3-C_4$ )-シクロアルキルは、少なくとも1個の $T^1$ で置換されていてもよい。前記( $C_1-C_5$ )-鎖式炭化水素が $T^1$ で置換される場合、前記( $C_1-C_5$ )-鎖式炭化水素は1～9個の $T^1$ で置換可能である。前記( $C_3-C_4$ )-シクロアルキルが $T^1$ で置換される場合、前記( $C_3-C_4$ )-シクロアルキルは1～7個の $T^1$ で置換可能である。

前記( $C_1-C_5$ )-鎖式炭化水素又は前記( $C_3-C_4$ )-シクロアルキルが少なくとも1個の $T^1$ で置換された場合、 $T^1$ の置換位置は、前記( $C_1-C$

5) ー鎖式炭化水素又は前記 (C<sub>3</sub>ーC<sub>4</sub>) ーシクロアルキル上の何れの置換位置でもよい。

前記 (C<sub>1</sub>ーC<sub>5</sub>) ー鎖式炭化水素又は前記 (C<sub>3</sub>ーC<sub>4</sub>) ーシクロアルキルが2個以上のT<sup>1</sup>で置換された場合、各T<sup>1</sup>は各々同一でも相異なってもよい。

例えば、化合物(1)のR<sup>1</sup>が少なくとも1個のT<sup>1</sup>で置換された(C<sub>1</sub>ーC<sub>4</sub>) ーアルキルである場合、具体的には、下記の置換基が含まれる。例えば、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロメチル、ジクロロメチル、トリクロロメチル、ブロモメチル、ジブロモメチル、トリブロモメチル、クロロジフルオロメチル、1 ーフルオロエチル、2 ーフルオロエチル、1, 1 ージフルオロエチル、2, 2 ージフルオロエチル、2, 2, 2 ートリフルオロエチル、パーフルオロエチル、3, 3 ージフルオロプロピル、3, 3, 3 ートリフルオロプロピル、パーフルオロプロピル、パーフルオロイソプロピル、4 ーフルオロブチル、4, 4 ージフルオロブチル、4, 4, 4 ートリフルオロブチル、シアノメチル、2 ーシアノエチル、3 ーシアノプロピル、メトキシメチル、エトキシメチル、プロポキシメチル、2 ーメトキシエチル、メチルチオメチル、エチルチオメチル、プロピルチオメチル、2 ーメチルチオエチル、メトキシカルボニルメチル、エトキシカルボニルメチル、プロポキシカルボニルメチル、2 ー(メトキシカルボニル)エチル、又はイソプロポキシカルボニルメチル等が挙げられる。

[0032] 例えば、化合物(1)のR<sup>1</sup>が少なくとも1個のT<sup>1</sup>で置換された(C<sub>3</sub>ーC<sub>4</sub>) ーシクロアルキルである場合、具体的には、下記の置換基が含まれる。例えば、1 ーフルオロシクロプロピル、2 ーフルオロシクロプロピル、2, 2 ージフルオロシクロプロピル、1 ーシアノシクロプロピル、2 ーシアノシクロプロピル、1 ーメトキシシクロプロピル、2 ーメトキシシクロプロピル、1 ーメチルチオシクロプロピル、2 ーメチルチオシクロプロピル、1 ーメトキシカルボニルシクロプロピル、2 ーメトキシカルボニルシクロプロピル、1 ーフルオロシクロブチル、2 ーフルオロシクロブチル、3 ーフルオロシク

ロブチル、2, 2-ジフルオロシクロブチル、3, 3-ジフルオロシクロブチル、1-シアノシクロブチル、2-シアノシクロブチル、3-シアノシクロブチル、1-メトキシシクロブチル、2-メトキシシクロブチル、3-メトキシシクロブチル、1-メチルチオシクロブチル、2-メチルチオシクロブチル、3-メチルチオシクロブチル、1-メトキシカルボニルシクロブチル、2-メトキシカルボニルシクロブチル、又は3-メトキシカルボニルシクロブチル等が挙げられる。

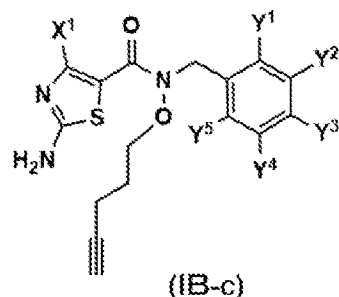
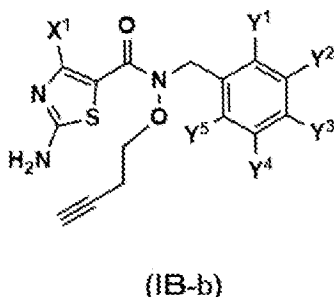
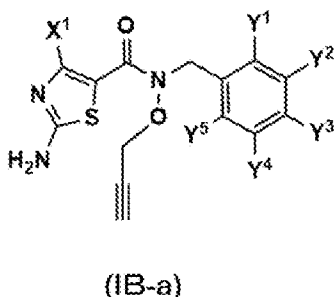
[0033] ( $C_1-C_6$ )-ハロアルキルは、例えば、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロメチル、ジクロロメチル、トリクロロメチル、ブromoメチル、ジブromoメチル、トリブromoメチル、クロロジフルオロメチル、ジクロロフルオロメチル、クロロフルオロメチル、1-フルオロエチル、2-フルオロエチル、1, 1-ジフルオロエチル、2, 2-ジフルオロエチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、パーフルオロエチル、1-クロロエチル、2-クロロエチル、1, 1-ジクロロエチル、2, 2-ジクロロエチル、2, 2, 2-トリクロロエチル、1-クロロ-1-フルオロエチル、2-クロロ-2-フルオロエチル、1-フルオロプロピル、2-フルオロプロピル、1-フルオロ-2-プロピル、3-フルオロプロピル、2-フルオロ-2-プロピル、1, 1-ジフルオロプロピル、2, 2-ジフルオロプロピル、3, 3-ジフルオロプロピル、3, 3, 3-トリフルオロプロピル、パーフルオロプロピル、パーフルオロイソプロピル、2, 2, 3, 3, 3-ペンタフルオロプロピル、1, 1, 1, 3, 3, 3-ヘキサフルオロイソプロピル、1-フルオロブチル、2-フルオロブチル、3-フルオロブチル、4-フルオロブチル、1, 1-ジフルオロブチル、2, 2-ジフルオロブチル、3, 3-ジフルオロブチル、4, 4-ジフルオロブチル、4, 4, 4-トリフルオロブチル、3, 3, 4, 4, 4-ペンタフルオロブチル、2, 2, 3, 3, 4, 4, 4-ヘプタフルオロブチル、パーフルオロブチル、2, 3, 3, 3, 4, 4, 4-ヘプタフルオロイソブチル、1-フルオロペンチル、2-フルオロペンチル、3-フルオロペンチル、4-フルオロペ

ンチル、5-フルオロペンチル、1, 1-ジフルオロペンチル、2, 2-ジフルオロペンチル、3, 3-ジフルオロペンチル、4, 4-ジフルオロペンチル、5, 5-ジフルオロペンチル、5, 5, 5-トリフルオロペンチル、4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチル、3, 3, 4, 4, 5, 5, 5-ヘプタフルオロペンチル、2, 2, 3, 3, 4, 4, 5, 5, 5-ノナフルオロペンチル、パーフルオロペンチル、1-フルオロヘキシル、2-フルオロヘキシル、3-フルオロヘキシル、4-フルオロヘキシル、5-フルオロヘキシル、6-フルオロヘキシル、1, 1-ジフルオロヘキシル、2, 2-ジフルオロヘキシル、3, 3-ジフルオロヘキシル、4, 4-ジフルオロヘキシル、5, 5-ジフルオロヘキシル、6, 6-ジフルオロヘキシル、6, 6, 6-トリフルオロヘキシル、5, 5, 6, 6, 6-ペンタフルオロヘキシル、4, 4, 5, 5, 6, 6, 6-ヘプタフルオロヘキシル、3, 3, 4, 4, 5, 5, 6, 6, 6-ノナフルオロヘキシル、2, 2, 3, 3, 4, 4, 5, 5, 6, 6, 6-ウンデカフルオロヘキシル、又はパーフルオロヘキシル等の1～13個の同一のまたは異なるハロゲン原子により部分的または完全に置換された炭素原子数1～6個の直鎖状又は分岐鎖状のアルキル基が挙げられる。

[0034] (C<sub>1</sub>–C<sub>3</sub>)-ハロアルキルは、炭素原子数1～3個の直鎖又は分岐鎖状のハロアルキル基を表す。その具体例は、上記の(C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>)-ハロアルキルの具体例の中で炭素原子数1～3個のハロアルキル基が該当する。

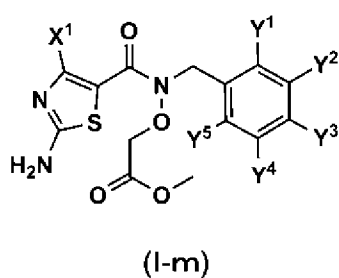
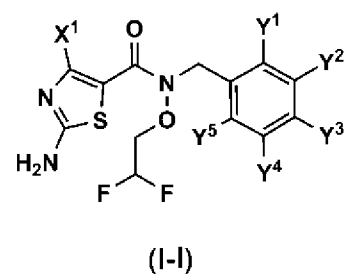
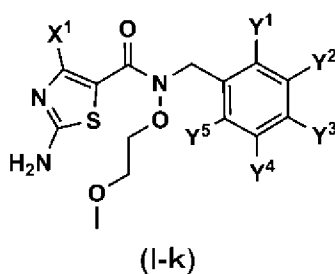
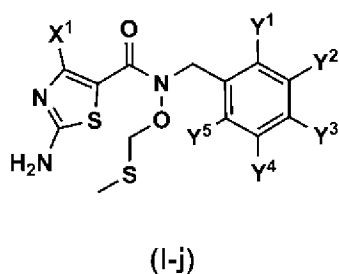
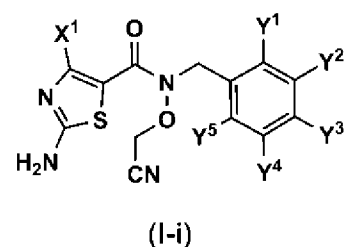
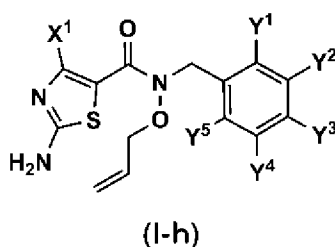
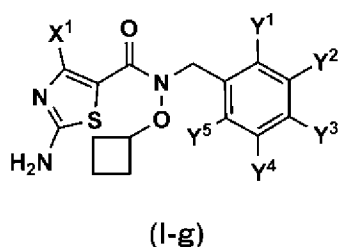
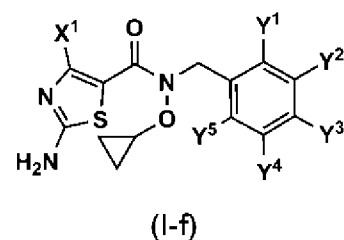
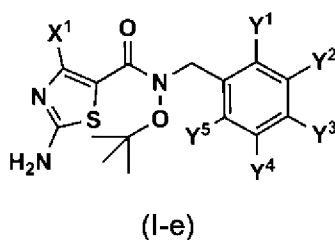
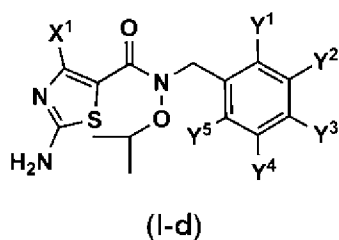
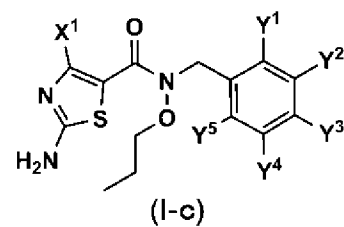
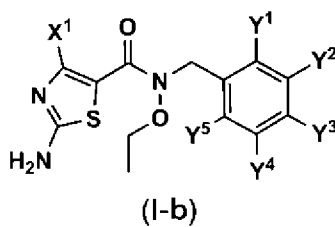
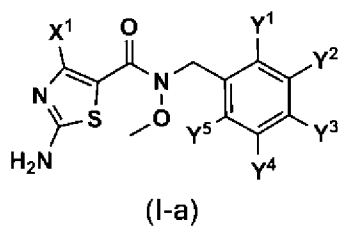
[0035] 前記式(1B)中、nは1、2、又は3で表されることから、化合物(1B)は具体的には、下記式(1B-a)～式(1B-c)で表される。

[0036] [化6]



[0037] 式(Ⅰ)で表さる化合物の中で、好ましい化合物としては、式(ⅠA)のN-(シクロ)アルコキシアミド化合物、式(ⅠB)のN-アルキニルオキシアミド化合物、及び下記式(Ⅰ-a)～(Ⅰ-m)で表される化合物が挙げられる。

[化7]



[0038] 化合物（１）の塩としては、農業上許容されるものであればあらゆるものが含まれるが、例えば、アルカリ金属塩（例えば、ナトリウム塩、カリウム塩など）、アルカリ土類金属塩（例えば、マグネシウム塩、カルシウム塩など）、アミン塩（ジメチルアミン塩、トリエチルアミン塩など）、無機酸塩（例えば、塩酸塩、過塩素酸塩、硫酸塩、硝酸塩など）又は有機酸塩（例えば酢酸塩、メタンスルホン酸塩、パラトルエンスルホン酸塩、シュウ酸塩など）などが挙げられる。

[0039] 化合物（１）は、各種異性体、例えば光学異性体、幾何異性体などが存在するが、本発明には各異性体及び異性体混合物の双方が含まれることがある。なお、化合物（１）には、当該技術分野における技術常識の範囲内において、前記したもの以外の各種異性体も含まれる。さらに、当該技術分野における技術常識及び一般的な実験手法を用いて、各種異性体を作り分けることができる。

[0040] また、異性体の種類によっては、記載した構造式と異なる化学構造となる場合があるが、当業者であればそれらが異性体の関係にあることが十分認識できる為、本発明の範囲内であることは明らかである。

[0041] 次に化合物（１）の製造方法について説明する。

化合物（１）は、以下に示す反応Ａ～反応Ｅ、及び通常の前記の製造方法に従って製造することができるが、当該化合物を得る方法は、これらの方法に限定されるものではない。例えば、本発明の化合物（１）は、フェニル基上の置換基に、本分野において周知の種々の置換基変換反応（例えば、アルキル化反応、ハロアルキル化反応、鈴木カップリング反応などのクロスカップリング反応、ザンドマイヤー型反応、ハロゲン化反応、酸化反応、還元反応等）を、適用することによって製造することも可能である。また、必要に応じて、本発明化合物の製造において、本分野において通常使用される保護及び脱保護反応を適用してもよい。反応を実施するにあたり、必要な場合は窒素やアルゴンなどの不活性ガス雰囲気下で実施してもよく、塩の試薬を用いてもよい。

## [0042] [反応A]

反応Aは、脱保護反応であり、式(X X-a)の化合物よりBoc基を除くことにより、式(I)の化合物を得る方法である。ここで、Boc基は、tert-ブトキシカルボニル基である。

## [0043] [化8]



[0044] 式中の記号は前述の通りである。

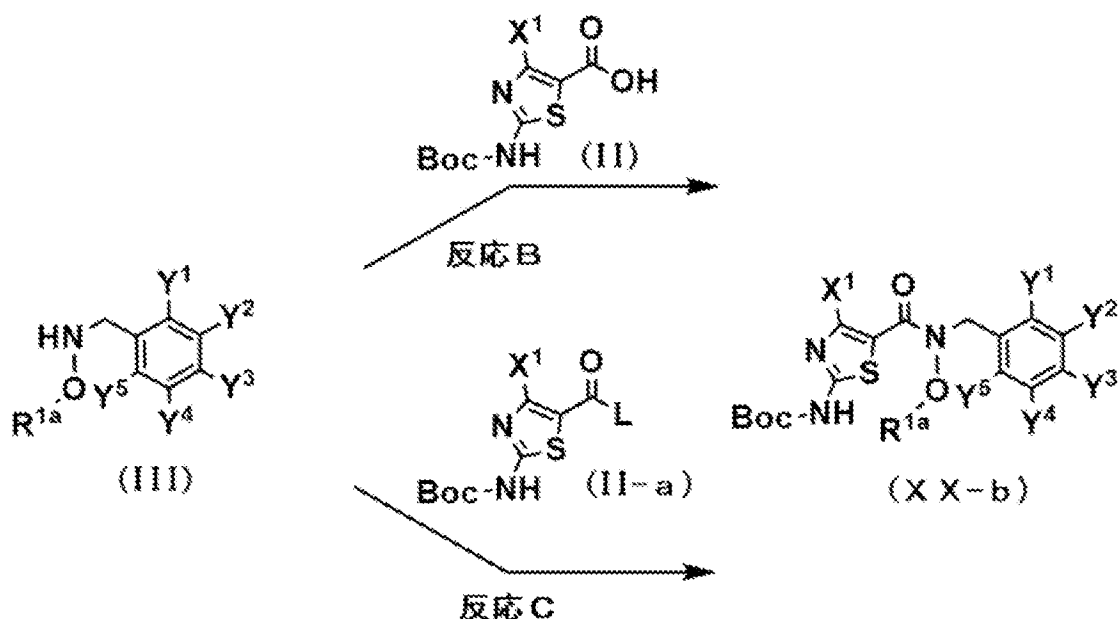
[0045] 反応Aは、Boc基を除くために用いられる公知の条件、例えば、Greene's PROTECTIVE GROUPS in ORGANIC SYNTHESIS (John Wiley and Sons、2007年、Peter G. M. Wuts、Theodora W. Greene)に記載の方法によって行うことができる。より具体的には、例えば、溶媒存在下、式(X X-a)の化合物をトリフルオロ酢酸や塩化水素などの酸と反応させる、あるいは溶媒及び2, 6-ルチジンのような塩基存在下、トリメチルシリルトリフラートと反応させることによって行うことができる。

## [0046] [反応B] 及び [反応C]

反応Bは、式(I I)の化合物と式(I I I)の化合物を反応させ式(X X-b)の化合物を得る方法である。反応Cは、式(I I-a)の化合物と式(I I I)の化合物を反応させ式(X X-b)の化合物を得る方法である。

## [0047]

[化9]



[0048] 式中、R<sup>1a</sup>はH、(C<sub>1</sub>–C<sub>5</sub>)–鎖式炭化水素、又は(C<sub>3</sub>–C<sub>4</sub>)–シクロアルキル{ここで、該(C<sub>1</sub>–C<sub>5</sub>)–鎖式炭化水素及び該(C<sub>3</sub>–C<sub>4</sub>)–シクロアルキルは、少なくとも1個のT<sup>1</sup>で置換されていてもよい}である。Lは脱離基であり、例えば、ハロゲン、アルコキシ、アリールオキシ、アルキルカルボニルオキシ、アリールカルボニルオキシなどが挙げられる。その他の記号は前述の通りである。

[0049] 反応Bは、通常、脱水縮合剤及び溶媒の存在下、必要に応じて塩基を加えて行うことができる。反応Bにおける式(III)の化合物は、式(II)の化合物1当量に対して、0.5～3当量、望ましくは0.8～1.5当量使用できる(当量はモル当量であり、以下も同様である)。

[0050] 反応Bにおける脱水縮合剤は、N, N'–ジシクロヘキシルカルボジイミド(DCC)、1–[3–(ジメチルアミノ)プロピル]–3–エチルカルボジイミド(EDC)又はその塩酸塩のようなカルボジイミド系縮合剤；1, 1'–カルボニルジイミダゾール(CDI)のようなイミダゾール系縮合剤；4–(4, 6–ジメトキシ–1, 3, 5–トリアジン–2–イル)–4–メチルモルホリニウムクロリド(DMT–MM)のようなトリアジン系縮合剤；1H–ベンゾトリアゾール–1–イルオキシトリピロリジノホスホニウム

ヘキサフルオロホスファート（PyBOP）のようなホスホニウム系縮合剤；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（HATU）のようなウロニウム系縮合剤；2-メチル-6-ニトロ安息香酸無水物（MNBA）のような酸無水物；2-クロロ-1-メチルピリジニウム p-トルエンスルホナートのような2-ハロピリジニウム塩；プロピルホスホン酸無水物（環状トリマー）（T3P）；ジフェニルリン酸アジド（DPPA）；などが挙げられるが、これらに限定されるものではない。必要に応じて1-ヒドロキシベンゾトリアゾール（HOBt）などの脱水縮合剤とともに使用される一般的な添加剤を添加してもよい。前記脱水縮合剤は、式（11）の化合物1当量に対して、0.5～5当量、望ましくは1～2当量使用でき、前記添加剤は式（11）の化合物1当量に対して、0.2～5当量、望ましくは1～2当量使用できる。

[0051] 反応Bにおける塩基は、例えば、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウムのような炭酸塩；炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウムのような炭酸水素塩；水酸化ナトリウム、水酸化カリウムのような金属水酸化物；水素化ナトリウム、水素化カリウムのような金属水素化物；トリエチルアミン、N,N-ジイソプロピルエチルアミンのようなアミン類；ピリジン、4-ジメチルアミノピリジン、2,6-ルチジンのようなピリジン類；酢酸ナトリウム、酢酸カリウムなどのアルカリ金属カルボン酸塩；などから1種又は2種以上を適宜選択、混合して使用することができる。前記塩基は、式（11）の化合物1当量に対して、0.5～10当量、望ましくは1～5当量使用できる。

[0052] 反応Bにおける溶媒は、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン、クロロベンゼンのような芳香族炭化水素類；四塩化炭素、塩化メチル、クロロホルム、ジクロロメタン、ジクロロエタン、トリクロロエタン、ヘキサン、シクロヘキサンのような脂肪族炭化水素類；ジオキサン、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、ジ

メトキシエタンのようなエーテル類；酢酸メチル、酢酸エチルのようなエステル類；ジメチルスルホキシド、スルホラン、N，N-ジメチルアセトアミド、N，N-ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン、ピリジン、アセトニトリル、プロピオニトリルのような非プロトン性極性溶媒；アセトン、メチルエチルケトンのようなケトン類；メタノール、エタノールのようなプロトン性極性溶媒；水；などから1種又は2種以上を適宜選択できる。

[0053] 反応Bの反応温度は、通常-20℃～150℃程度、望ましくは0℃～100℃程度であり、反応時間は、通常0.5～48時間程度、望ましくは1～24時間程度である。

[0054] 反応Cは、溶媒の存在下、必要に応じて塩基を加えて行うことができる。反応Cにおける式(111)の化合物は、式(11-a)の化合物1当量に対して、0.5～3当量、望ましくは0.8～1.5当量使用できる。

[0055] 反応Cにおける塩基は、例えば、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウムのような炭酸塩；炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウムのような炭酸水素塩；水酸化ナトリウム、水酸化カリウムのような金属水酸化物；水素化ナトリウム、水素化カリウムのような金属水素化物；トリエチルアミン、N，N-ジイソプロピルエチルアミンのようなアミン類；ピリジン、4-ジメチルアミノピリジン、2，6-ルチジンのようなピリジン類；酢酸ナトリウム、酢酸カリウムなどのアルカリ金属カルボン酸塩；などから1種又は2種以上を適宜選択、混合して使用することができる。前記塩基は、式(11-a)の化合物1当量に対して、0.1～10当量、望ましくは0.5～5当量使用できる。

[0056] 反応Cにおける溶媒は、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン、クロロベンゼンのような芳香族炭化水素類；四塩化炭素、塩化メチル、クロロホルム、ジクロロメタン、ジクロロエタン、トリクロロエタン、ヘキサン、シクロヘキサンのような脂肪族炭化水素類；ジオキサン、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、ジメトキシエタンのようなエーテル類；酢酸メチル、酢酸エチルのようなエス

テル類；ジメチルスルホキシド、スルホラン、N，N－ジメチルアセトアミド、N，N－ジメチルホルムアミド、N－メチルピロリドン、ピリジン、アセトニトリル、プロピオニトリルのような非プロトン性極性溶媒；アセトン、メチルエチルケトンのようなケトン類；メタノール、エタノールのようなプロトン性極性溶媒；水；などから1種又は2種以上を適宜選択できる。

[0057] 反応Cの反応温度は、通常－20℃～150℃程度、望ましくは0℃～100℃程度であり、反応時間は、通常0.5～48時間程度、望ましくは1～24時間程度である。

[0058] 反応B及び反応Cで使用される式(III)の化合物は、後述の反応2－2又は反応2－4に従って製造することができる。

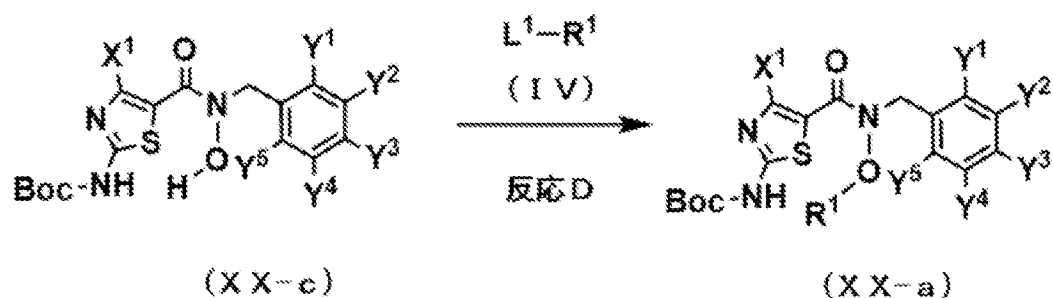
反応Bで使用される式(II)の化合物は、後述の反応1－1、反応1－2又は公知の方法に準じて製造することができ、又は市販品を使用しても良い。

反応Cで使用される式(III－a)の化合物は、式(III)の化合物より下記反応1－4又は公知の方法に準じて製造することができる。式(III－a)の化合物は市販品を使用しても良い。

[0059] [反応D]

反応Dは、式(XX－c)の化合物を式(IV)の化合物と反応させることにより、式(XX－a)の化合物を得る方法である。

[0060] [化10]



[0061] 式中、L<sup>1</sup>は脱離基であり、例えば、ハロゲン、トリフルオロメタンスルホニルオキシ、メタンスルホニルオキシ、パラトルエンスルホニルオキシなどが挙げられ、その他の記号は前述の通りである。

- [0062] 反応Dは、通常、塩基及び溶媒の存在下で、必要に応じて相間移動触媒を添加して行うことができる。反応Dにおける式(IV)の化合物は、式(XX-c)化合物1当量に対して、1～5当量、望ましくは1～3当量使用できる。
- [0063] 反応Dにおける塩基は、例えば、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウムtert-ブトキシドのようなアルカリ金属アルコキシド；炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウムのような炭酸塩；炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウムのような炭酸水素塩；水酸化ナトリウム、水酸化カリウムのような金属水酸化物；水素化ナトリウム、水素化カリウムのような金属水素化物；トリエチルアミン、N,N-ジイソプロピルエチルアミンのようなアミン類；ピリジン、4-ジメチルアミノピリジン、2,6-ルチジンのようなピリジン類；n-ブチルリチウム、リチウムジイソプロピルアミドのような有機リチウム化合物；酢酸ナトリウム、酢酸カリウムなどのアルカリ金属カルボン酸塩；などから1種又は2種以上を適宜選択、混合して使用することができる。前記塩基は、式(XX-c)の化合物1当量に対して1～10当量、望ましくは1～5当量使用できる。
- [0064] 反応Dにおける溶媒は、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン、クロロベンゼンのような芳香族炭化水素類；四塩化炭素、塩化メチル、クロロホルム、ジクロロメタン、ジクロロエタン、トリクロロエタン、ヘキサン、シクロヘキサンのような脂肪族炭化水素類；ジオキサン、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、ジメトキシエタンのようなエーテル類；酢酸メチル、酢酸エチルのようなエステル類；メタノール、エタノール、プロパノール、tert-ブタノールのようなアルコール類；ジメチルスルホキシド、スルホラン、N,N-ジメチルアセトアミド、N,N-ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン、ピリジン、アセトニトリル、プロピオニトリルのような非プロトン性極性溶媒；アセトン、メチルエチルケトンのようなケトン類；水；などから1種又は2種以上を適宜選択できる。

[0065] 反応Dにおける相間移動触媒は、例えば、テトラブチルアンモニウムブロミド、ベンジルトリエチルアンモニウムクロリド、硫酸水素テトラブチルアンモニウムのような第四級アンモニウム塩；18-クラウン-6-エーテルのようなクラウンエーテル類；などが挙げられる。前記相間移動触媒は、式(X X-c)の化合物1当量に対して0.1～3当量使用できる。

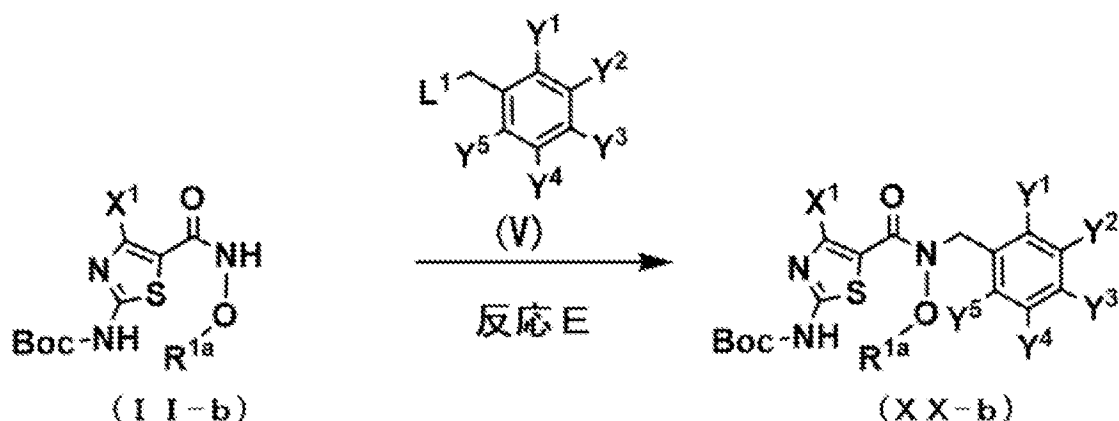
[0066] 反応Dの反応温度は、通常-20℃～150℃程度、望ましくは0℃～100℃程度であり、反応時間は、通常10分～48時間程度、望ましくは1～24時間程度である。

[0067] 反応Dで使用される式(ⅠV)の化合物は、公知の方法に準じて製造することができ、又は市販品を使用しても良い。

[0068] [反応E]

反応Eは、式(ⅠⅠ-b)の化合物を式(V)の化合物と反応させることにより、式(X X-b)の化合物を得る方法である。

[0069] [化11]



[0070] 式中の記号は前述の通りである。

[0071] 反応Eは、上記反応Dに準じて行うことができる。反応Eにおける式(V)の化合物は、式(ⅠⅠ-b)の化合物1当量に対して、1～5当量、望ましくは1～2当量使用できる。反応Eにおける塩基は、式(ⅠⅠ-b)の化合物1当量に対して1～10当量、望ましくは1～5当量使用できる。反応Eにおける相間移動触媒は、式(ⅠⅠ-b)の化合物1当量に対して0.1～3当量使用できる。

[0072] 反応Eで使用される式(ⅠⅠ-b)の化合物は、下記反応1-3又は公知の方法に準じて製造することができ、又は市販品を使用しても良い。反応Eで使用される式(V)の化合物は、公知の方法に準じて製造することができ、又は市販品を使用しても良い。

[0073] 反応A～反応Eで利用した化合物は、下記の各中間体の製造方法(反応1-1～反応1-4及び反応2-1～反応2-4)及び通常の方法の塩の製造方法に従って製造することができるが、これらの方法に限定されるものではなく、これらの化合物は、公知の方法に準じて製造しても良く、又は市販品を使用しても良い。

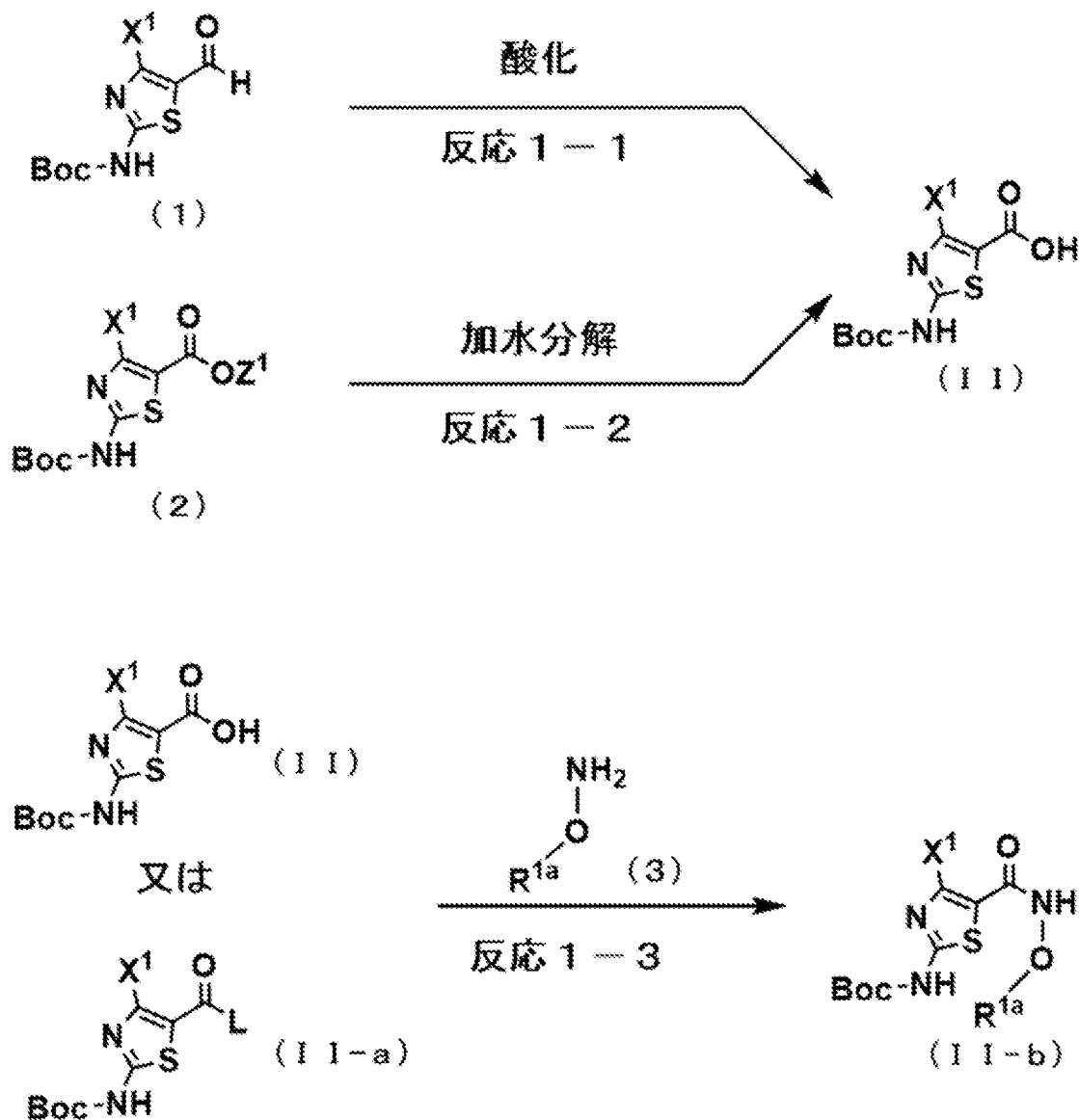
[0074] 各中間体の製造方法

[反応1-1]、[反応1-2]及び[反応1-3]

反応1-1は、式(1)の化合物を酸化し式(ⅠⅠ)の化合物を得る方法である。反応1-2は、式(2)の化合物を加水分解し式(ⅠⅠ)の化合物を得る方法である。反応1-3は式(ⅠⅠ)の化合物又は式(ⅠⅠ-a)の化合物を式(3)の化合物と反応させて式(ⅠⅠ-b)の化合物を得る方法である。

[0075]

[化12]



[0076] 式中 Z<sup>1</sup> はアルキルであり、その他の記号は前述の通りである。

反応 1-1 は、一般的なピニック酸化の条件、例えば、Bioorganic & Medicinal Chemistry、2004、12、6171-6182 に記載の方法に準じて行うことができる。

[0077] 反応 1-1 で使用される式 (1) の化合物は、公知の方法、例えば、Bioorganic & Medicinal Chemistry、2004、12、6171-6182、Journal of Organic Chemistry、2005、70、567-574、国際公開第 202

0/028141号、又はOrganic Process Research and Development, 2021, 25, 1167-1175に記載の方法に準じて製造することができ、又は市販品を使用しても良い。

[0078] 反応1-2は、一般的なエステルの加水分解の条件、例えば、国際公開第2009/100171号に記載の方法に準じて行うことができる。

[0079] 反応1-2で使用される式(2)の化合物は、公知の方法、例えば、国際公開第2012/006760号に記載の方法に準じて製造することができ、又は市販品を使用しても良い。

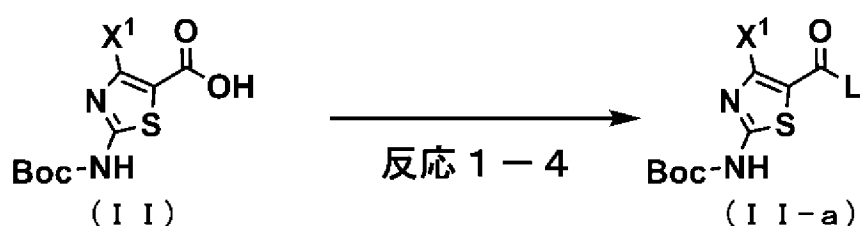
[0080] 反応1-3は、上記反応B又は反応Cに準じて行うことができる。反応1-3における式(3)の化合物は、式(II)の化合物又は式(II-a)の化合物の各1当量に対して、0.5~10当量、望ましくは0.7~5当量使用できる。

[0081] 反応1-3で使用される式(3)の化合物は、公知の方法に準じて、例えば、国際公開第2006/138350号、米国特許出願公開第2014/0378399号、Organic & Biomolecular Chemistry, 2020, 18, 3281-3287、The Journal of Antibiotics, 2000, 53, 1071-1085に記載の方法に準じて製造することができ、又は市販品を使用しても良い。

[0082] [反応1-4]

反応1-4は、ハロゲン化、エステル化又はカルボニル化により式(II)の化合物から式(II-a)の化合物を得る方法である。

[0083] [化13]



[0084] 式中の記号は前述の通りである。

[0085] 反応 1-4 がハロゲン化である場合の反応条件を下記する。

[0086] 反応 1-4 において、式 (I I-a) の化合物の L がハロゲンである場合、通常、溶媒の存在下で式 (I I) の化合物とハロゲン化剤を反応させてハロゲン化を行うことができ、必要に応じて N, N-ジメチルホルムアミドを添加してもよい。

反応 1-4 におけるハロゲン化剤としては、例えば塩化オキサリル、塩化チオニル、オキシ塩化リン、オキシ臭化リン、三塩化リン、三臭化リン、五塩化リン、塩化スルフリル等が挙げられる。前記ハロゲン化剤は、式 (I I) の化合物 1 当量に対して 1 ~ 10 当量、望ましくは 1 ~ 3 当量使用でき、反応に問題がなければ過剰量を使用してもよい。

反応 1-4 で、N, N-ジメチルホルムアミドを使用する場合は、N, N-ジメチルホルムアミドの使用量は触媒量であり、例えば式 (I I) の化合物 1 当量に対して 0.01 ~ 0.3 当量使用できる。

[0087] 反応 1-4 がエステル化である場合の反応条件を下記する。

[0088] 反応 1-4 において、式 (I I-a) の化合物の L がアルコキシ又はアリアルコキシである場合、通常、溶媒及び脱水縮合剤の存在下で、必要に応じて塩基を加えて、式 (I I) の化合物とアルコール類又はアリアルヒドロキシ類を反応させエステル化を行うことができる。

反応 1-4 におけるアルコール類としては、例えばメタノール、エタノールなどが挙げられる。反応 1-4 におけるアリアルヒドロキシ類としては、フェノールなどが挙げられる。前記アルコール類又は前記アリアルヒドロキシ類は、式 (I I) の化合物 1 当量に対して 0.5 ~ 5 当量、望ましくは 0.8 ~ 1.5 当量使用でき、反応に問題がなければ過剰量を使用してもよい。

反応 1-4 における脱水縮合剤としては、上記反応 B に挙げたものが使用できる。反応 1-4 において前記脱水縮合剤を使用する場合は、必要に応じて脱水縮合剤と一緒に使用される一般的な添加剤（例えば、1-ヒドロキシ

ベンゾトリアゾール（HOBt）などを添加してもよい。前記脱水縮合剤は、式（ⅠⅠ）の化合物1当量に対して、0.5～5当量、望ましくは1～2当量使用でき、前記添加剤は式（ⅠⅠ）の化合物1当量に対して、0.2～5当量、望ましくは1～2当量使用できる。

反応1-4において前記脱水縮合剤と一緒に塩基を使用する場合は、前記塩基は上記反応Bに挙げたものが使用できる。前記塩基は、式（ⅠⅠ）の化合物1当量に対して、0.5～10当量、望ましくは1～5当量使用できる。

[0089] また、反応1-4において、式（ⅠⅠ-a）の化合物のLがアルコキシである場合、通常、溶媒及び塩基を加えて、式（ⅠⅠ）の化合物とアルキルハライド類と反応させ、エステル化を行うことができる。

反応1-4におけるアルキルハライド類としては、例えばヨウ化メチル、ヨウ化エチルなどが挙げられる。前記アルキルハライドは、式（ⅠⅠ）の化合物1当量に対して0.5～5当量、望ましくは0.8～1.5当量使用できる。

反応1-4のアルキルハライド類と反応で使用できる塩基としては、上記反応Dに挙げたものが使用できる。前記塩基は、式（ⅠⅠ）の化合物1当量に対して、0.5～10当量、望ましくは1～5当量使用できる。

[0090] 反応1-4がカルボニル化である場合の反応条件を下記する。

[0091] 反応1-4において、式（ⅠⅠ-a）の化合物のLがアルキルカルボニルオキシ又はアリールカルボニルオキシである場合、通常、溶媒及び塩基の存在下で、式（ⅠⅠ）の化合物とカルボニル化剤と反応させ、カルボニル化を行うことができる。

反応1-4におけるカルボニル化剤としては、例えばアセチルクロリド、ピバロイルクロリド、ベンゾイルクロリド、無水酢酸、無水安息香酸などが挙げられる。前記カルボニル化剤は、式（ⅠⅠ）の化合物1当量に対して0.5～10当量、望ましくは1～5当量使用でき、反応に問題がなければ過剰量を使用してもよい。

反応 1-4 がカルボニル化の場合に使用する塩基としては、上記反応 B に挙げたものが使用できる。前記塩基は、式 (11) の化合物 1 当量に対して、0.5~10 当量、望ましくは 1~5 当量使用できる。

[0092] 反応 1-4 における溶媒は、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン、クロロベンゼンのような芳香族炭化水素類；四塩化炭素、塩化メチル、クロロホルム、ジクロロメタン、ジクロロエタン、トリクロロエタン、ヘキサン、シクロヘキサンのような脂肪族炭化水素類；ジオキサン、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、ジメトキシエタンのようなエーテル類；酢酸メチル、酢酸エチルのようなエステル類；ジメチルスルホキシド、スルホラン、N, N-ジメチルアセトアミド、N, N-ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン、ピリジン、アセトニトリル、プロピオニトリルのような非プロトン性極性溶媒；アセトン、メチルエチルケトンのようなケトン類；メタノール、エタノールのようなプロトン性極性溶媒；水；などから 1 種又は 2 種以上を適宜選択できる。

[0093] 反応 1-4 における反応温度は、通常-50℃~200℃程度、望ましくは-20℃~100℃程度であり、反応時間は、通常0.1~12時間程度である。

[0094] [反応 2-1] ~ [反応 2-4]

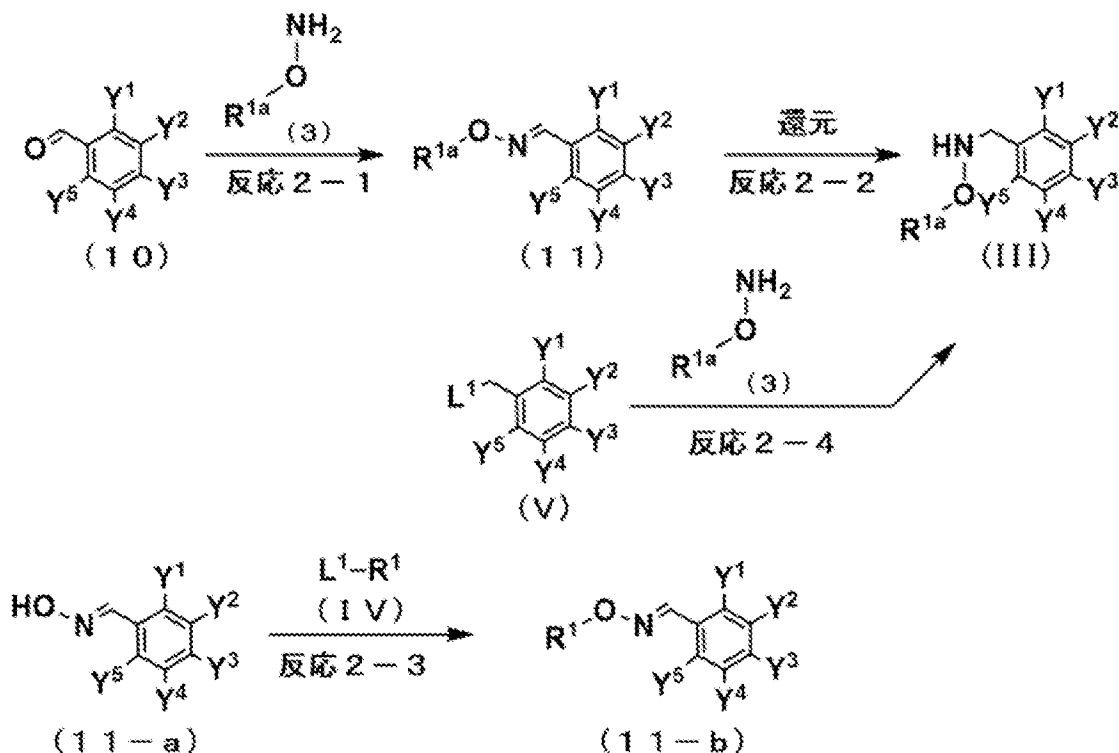
反応 2-1 は式 (10) の化合物を式 (3) の化合物と反応させ式 (11) の化合物を得る方法である。反応 2-2 は式 (11) の化合物を還元し、式 (111) の化合物を得る方法である。反応 2-1 と反応 2-2 は式 (11) の化合物を単離することなく、連続して行うこともできる。

反応 2-3 は、式 (11-a) の化合物を式 (IV) の化合物と反応させることにより、式 (11-b) の化合物を得る方法である。

反応 2-4 は、式 (V) の化合物を式 (3) の化合物と反応させることにより、式 (111) の化合物を得る方法である。

[0095]

[化14]



[0096] 式中の記号は前述の通りである。

[0097] 反応 2-1 は、必要に応じて酸、塩基又は脱水剤を添加して行うことができる。また、溶媒の存在下で反応 2-1 を行うこともできる。そのような場合、反応 2-1 における式 (3) の化合物は、式 (10) の化合物 1 当量に対して、1～5 当量使用でき、反応に問題がなければ過剰に用いてもよい。

[0098] 反応 2-1 における酸は、無機酸、有機酸のいずれでもよく、無機酸は塩酸、硫酸など、有機酸は酢酸、メタンスルホン酸、パラトルエンスルホン酸などが挙げられる。前記酸は式 (10) の化合物の 1 当量に対して、0.1～10 当量、反応に問題がなければ過剰に用いてもよい。

反応 2-1 における塩基は、例えば、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウム *tert*-ブトキシドのようなアルカリ金属アルコキシド；炭酸ナトリウム、炭酸カリウムのような炭酸塩；炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウムのような炭酸水素塩；水酸化ナトリウム、水酸化カリウムのような金属水酸化物；水素化ナトリウム、水素化カリウムのような金属水素化物；トリエチルアミン、N，N-ジイソプロピルエチルアミンのよう

なアミン類；ピリジン、4-ジメチルアミノピリジン、2,6-ルチジンのようなピリジン類；酢酸ナトリウム、酢酸カリウムなどのアルカリ金属カルボン酸塩；などが挙げられる。前記塩基は式（3）の化合物の1当量に対して、0.5～5当量使用できる。

[0099] 反応2-1における脱水剤は、例えば、無水硫酸マグネシウム、無水硫酸ナトリウム、モレキュラーシーブスなどが挙げられる。

反応2-1における溶媒は、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでよく、例えば、ジクロロメタン、クロロホルムのような脂肪族ハロゲン化炭化水素類；トルエン、キシレンのような芳香族炭化水素類；ジオキサン、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、ジメトキシエタンのようなエーテル類；酢酸メチル、酢酸エチルのようなエステル類；アセトニトリルのような非プロトン性極性溶媒；メタノール、エタノールのようなプロトン性極性溶媒；水；などから1種又は2種以上を適宜選択することができる。

[0100] 反応2-1の反応温度は、通常-20℃～200℃程度、望ましくは0℃～150℃程度であり、反応時間は、通常0.5～48時間程度、望ましくは1～24時間程度である。

[0101] 反応2-1は、その他、一般的なアルデヒドとヒドロキシルアミン又はアルコキシアミンによる脱水縮合の条件、例えば、HETEROCYCLES, 2009, 78, 463-470などに記載の方法に準じて行うことができる。反応2-1が、一般的な脱水縮合条件の場合、反応2-1における式（3）の化合物は、式（10）の化合物1当量に対して、0.7～5当量、望ましくは1～2当量使用できる。

[0102] 反応2-1で使用される式（10）の化合物及び式（3）の化合物は、公知の方法に準じて製造でき、又は市販品を使用しても良い。

[0103] 反応2-2は、通常、還元剤及び溶媒の存在下で、必要に応じて酸を添加して行うことができる。

[0104] 反応2-2における還元剤は、例えば、水素化ホウ素ナトリウム、水素化シアノホウ素ナトリウム、水素化トリアセトキシホウ素ナトリウム、2-ピ

コリン・ボラン錯体などが挙げられる。還元剤は式(11)の化合物1当量に対して、0.5～10当量、望ましくは1～5当量使用できる。添加する酸としては、無機酸、有機酸いずれでもよく、無機酸としては塩酸など、有機酸としては酢酸、トリフルオロ酢酸などが挙げられる。前記酸は式(11)の化合物1当量に対して、1～10当量使用できる。

[0105] 反応2-2における溶媒は、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでよく、例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン、クロロベンゼンのような芳香族炭化水素類；四塩化炭素、塩化メチル、クロロホルム、ジクロロメタン、ジクロロエタン、トリクロロエタン、ヘキサン、シクロヘキサンのような脂肪族炭化水素類；ジオキサン、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、ジメトキシエタンのようなエーテル類；酢酸メチル、酢酸エチルのようなエステル類；メタノール、エタノールのようなプロトン性極性溶媒；水；などから1種又は2種以上を適宜選択できる。

[0106] 反応2-2の反応温度は、通常-20℃～150℃程度、望ましくは0℃～100℃程度であり、反応時間は、通常0.5～48時間程度、望ましくは1～24時間程度である。

[0107] 反応2-2は、その他、一般的なオキシム又はオキシムエーテルを還元する条件、例えば、HETEROCYCLES, 2009, 78, 463-470などに記載の方法に準じて行うことができる。

[0108] 反応2-2で使用される式(11)の化合物は、上記反応2-1又は公知の方法に準じて製造でき、又は市販品を使用しても良い。

[0109] 反応2-3は、反応Dに準じて行うことができる。式(IV)の化合物は、式(11-a)の化合物1当量に対して、1～5当量、望ましくは1～2当量使用できる。反応2-3における塩基は、式(11-a)の化合物1当量に対して1～10当量、望ましくは1～5当量使用できる。反応2-3における相間移動触媒は、式(11-a)の化合物1当量に対して、0.1～3当量使用できる。

[0110] 反応2-3は、その他、公知のオキシムのアルキル化条件、例えば、国際

公開第2010/049946号などに記載の方法に準じて行うことができる。

[0111] 反応2-3で使用される式(11-a)の化合物は、上記反応2-1又は公知の方法に準じて製造することができ、或いは市販品を使用しても良い。反応2-3で使用される式(IV)の化合物は、公知の方法に準じて製造することができ、又は市販品を使用しても良い。

[0112] 反応2-4は、通常、塩基及び溶媒の存在下で、必要に応じて相間移動触媒を添加して行うことができる。反応2-4における式(3)の化合物は、式(V)の化合物1当量に対して、1~5当量、望ましくは1~3当量使用できる。

[0113] 反応2-4における塩基は、例えば、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウムtert-ブトキシドのようなアルカリ金属アルコキシド；炭酸ナトリウム、炭酸カリウムのような炭酸塩；炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウムのような炭酸水素塩；水酸化ナトリウム、水酸化カリウムのような金属水酸化物；水素化ナトリウム、水素化カリウムのような金属水素化物；トリエチルアミン、N,N-ジイソプロピルエチルアミンのようなアミン類；ピリジン、4-ジメチルアミノピリジン、2,6-ルチジンのようなピリジン類；n-ブチルリチウム、リチウムジイソプロピルアミドのような有機リチウム化合物；酢酸ナトリウム、酢酸カリウムなどのアルカリ金属カルボン酸塩；などから1種又は2種以上を適宜選択、混合して使用することができる。前記塩基は、式(V)の化合物の1当量に対して1~10当量、望ましくは1~5当量使用できる。

[0114] 反応2-4における溶媒は、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでよく、例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン、クロロベンゼンのような芳香族炭化水素類；四塩化炭素、塩化メチル、クロロホルム、ジクロロメタン、ジクロロエタン、トリクロロエタン、ヘキサン、シクロヘキサンのような脂肪族炭化水素類；ジオキサン、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、ジメトキシエタンのようなエーテル類；酢酸メチル、酢酸エチルのような

エステル類；メタノール、エタノール、プロパノール、*tert*-ブタノールのようなアルコール類；ジメチルスルホキシド、スルホラン、*N,N*-ジメチルアセトアミド、*N,N*-ジメチルホルムアミド、*N*-メチルピロリドン、ピリジン、アセトニトリル、プロピオニトリルのような極性非プロトン性溶媒；アセトン、メチルエチルケトンのようなケトン類；水；などから1種又は2種以上を適宜選択できる。

[0115] 反応2-4における相間移動触媒は、例えば、テトラブチルアンモニウムブロミド、ベンジルトリエチルアンモニウムクロリド、硫酸水素テトラブチルアンモニウムのような第四級アンモニウム塩；18-クラウン-6-エーテルのようなクラウンエーテル類；などが挙げられる。前記相間移動触媒は、式(V)の化合物1当量に対して0.1~3当量使用できる。

[0116] 反応2-4の反応温度は、通常-20℃~150℃程度、望ましくは0℃~100℃程度であり、反応時間は、通常10分~48時間程度、望ましくは1~24時間程度である。

[0117] 反応2-4は、その他、公知のアルコキシアミンのアルキル化条件、例えば、*Organic Letters*, 2004, 6, 2361-2364などに記載の方法に準じて行うことができる。

[0118] 反応2-4で使用される式(V)の化合物及び式(3)の化合物は、公知の方法に準じて製造でき、又は市販品を使用しても良い。

[0119] 化合物(1)は、有害な植物病害を低薬量で防除できる農園芸用殺菌剤の有効成分として有用である。

化合物(1)は、例えば卵菌門(*Oomycota*)、エンドミクサ門(*Endomyxa*)、フクロカビ門(*Olpidiomycota*)、子囊菌門(*Ascomycota*)、担子菌門(*Basidiomycota*)、及びコウマクノウキン門(*Blastocladiomycota*)などに属する植物病原菌に由来する植物病害を防除できる。その中で、卵菌門(*Oomycota*)、エンドミクサ門(*Endomyxa*)、及びフクロカビ門(*Olpidiomycota*)に属する植物病原菌に由来する植物病害の防除に特に有効である。

[0120] 上記に属する植物病原菌としては、以下のものが挙げられる。

卵菌門 (Oomycota) : Albuginales、Anisopidiiales、Lagenidiales、Leptomitales、Myzocytiopsidales、Olpidiopsidales、Peronosporales、Pythiales、Rhipidiales、Saprolegniales、及びSclerosporales等の各分類に属する植物病原菌。

エンドミクサ門 (Endomyxa) : Haplosporida、Paradiniida、Paramyxida、Gromiida、Phagomyxida、Plasmodiophorida、及びVampyrellida等の各分類に属する植物病原菌。

フクロカビ門 (Olpidiomyxota) : Olpidiales等の分類に属する植物病原菌。

子囊菌門 (Ascomycota) : Cladosporiales、Diaporthales、Erysiphales、Glomerellales、Helotiales、Hypocreales、Magnaporthales、Mycosphaerellales、Myriangiales、Pleosporales、及びVenturiales等の各分類に属する植物病原菌。

担子菌門 (Basidiomycota) : Agaricales、Cantharellales、Pucciniales、及びUstilaginales等の各分類に属する植物病原菌。

コウマクノウキン門 (Blastocladiomycota) : Physodermatales等の分類に属するものなどが挙げられる。

[0121] 前記植物病原菌類の具体例としては、例えば以下のものが挙げられる。

バレイショ又はトマト疫病菌 (*Phytophthora infestans*)、イチジク疫病菌 (*Phytophthora palmivora*)、ナシ又はイチゴ疫病菌 (*Phytophthora cactorum*)、トウガン、カボチャ、ピーマン又はトウガラシ疫病菌 (*Phytophthora capsici*)、トマト灰色疫病菌 (*Phytophthora capsici*)、ナス又はスイカ褐色腐敗病菌 (*Phytophthora capsici*)、カンキツ褐色腐敗病菌 (*Phytophthora citricola*)、アズキ茎疫病菌 (*Phytophthora vignae* f. sp. *adzukicola*)、エダマメ茎疫病菌 (*Phytophthora megasperma* var. *sojae*)、タマネギ又はラッキョウ白色疫病 (*Phytophthora porri*) のようなフィトフトラ (*Phytophthora*) 属菌；キュウリ、カボチャ、メロン、ズッキーニと病菌 (*Pseudoperonospora cubensis*)、ホップと病菌 (*Pseudoperonospora humuli*) のようなシュードペロノスポラ (*Pseudoperonospora*) 属菌；ブドウと病菌

(*Plasmopara viticola*)、ミツバベと病菌 (*Plasmopara nivea*) のようなプラズモパラ (*Plasmopara*) 属菌；キャベツ又はハクサイベと病菌 (*Hyaloperonospora brassicae*) のようなヒアロペロノスポラ (*Hyaloperonospora*) 属菌；レタスベと病菌 (*Bremia lactucae*) のようなブレミア (*Bremia*) 属菌；イネ苗立枯病菌 (*Pythium graminicola*)、コムギ褐色雪腐病菌 (*Pythium iwayamai*)、ハクサイピシウム腐敗病菌 (*Pythium aphanidermatum*)、ミョウガ根茎腐敗病菌 (*Pythium zingiberis*)、ショウガ根茎腐敗病菌 (*Pythium ultimum* var. *ultimum*) のようなピシウム (*Pythium*) 属菌；ダイコン根くびれ病菌 (*Aphanomyces raphani*)、ハウレンソウ根腐病菌 (*Aphanomyces cochlioides*) のようなアフアノミセス (*Aphanomyces*) 属菌；ハウレンソウ、カブ、ダイコン又はナバナ白さび病菌 (*Albugo macrospora*)、ワサビ白さび病菌 (*Albugo wasabiae*)、エンサイ白さび病菌 (*Albugo ipomoeae-aquaticae*) のようなアルブゴ (*Albugo*) 属菌；ダイズ又はエダマメベと病菌 (*Peronospora manshurica*)、ブロッコリー又はカブベと病菌 (*Peronospora parasitica*)、ネギ、ワケギ又はタマネギベと病菌 (*Peronospora destructor*)、ハウレンソウベと病菌 (*Peronospora farinosa* f. sp. *Spinaciae*)、バジルベと病菌 (*Peronospora belbahrii*) のようなペロノスポラ (*Peronospora*) 属菌。

[0122] ハクサイ、キャベツ、カリフラワー、ナバナ、ブロッコリー又はカブ根こぶ病菌 (*Plasmodiophora brassicae*) のようなネコブカビ (*Plasmodiophora*) 属菌；テンサイそう根病ウイルス (*Beet necrotic yellow vein virus*) を媒介するポリミキサ ベタエ (*Polymyxa betae*) のようなポリミキサ (*Polymyxa*) 属菌；バレイシヨ粉状そうか病菌 (*Spongospora subterranea*) のようなスポンゴスポラ (*Spongospora*) 属菌；レタスビッグベイン病ウイルス (*Mirafiori lettuce bigvein virus*) を媒介する *Olpidium virulentus* のようなオルピディウム (*Olpidium*) 属菌。

[0123] コムギうどんこ病菌 (*Erysiphe graminis*) のようなエリシフェ (*Erysiphe*) 属菌；トウモロコシすす紋病菌 (*Setosphaeria turcica*) のようなセトスフェリア (*Setosphaeria*) 属菌；キュウリうどんこ病菌 (*Sphaerotheca fuli*

ginea)、イチゴうどんこ病菌 (*Sphaerotheca humuli*) のようなスファエロテカ (*Sphaerotheca*) 属菌; ブドウうどんこ病菌 (*Uncinula necator*) のようなウンシニユラ (*Uncinula*) 属菌; リンゴうどんこ病菌 (*Podosphaera leucotricha*) のようなポドスファエラ (*Podosphaera*) 属菌; エンドウ褐紋病菌 (*Mycosphaerella pinodes*)、リンゴ黒点病菌 (*Mycosphaerella pomi*)、バナナブラックスガトカ病菌 (*Mycosphaerella musicola*)、カキ円星落葉病菌 (*Mycosphaerella nawae*)、イチゴ蛇の目病菌 (*Mycosphaerella fragariae*) のようなミコスファエレラ (*Mycosphaerella*) 属菌; リンゴ黒星病菌 (*Venturia inaequalis*)、ナシ黒星病菌 (*Venturia nashicola*) のようなヴェンチュリア (*Venturia*) 属菌; オオムギ網斑病菌 (*Pyrenophora teres*)、オオムギ斑葉病菌 (*Pyrenophora graminea*) のようなピレノホラ (*Pyrenophora*) 属菌; インゲン、キュウリ、キャベツ、ハクサイ、トウガラシ、ピーマン又はタマネギ菌核病菌 (*Sclerotinia sclerotiorum*)、コムギ雪腐大粒菌核病菌 (*Sclerotinia borealis*)、トマト小粒菌核病菌 (*Sclerotinia minor*)、アルファルファ菌核病菌 (*Sclerotinia trifoliorum*) のようなスクレロティニア (*Sclerotinia*) 属菌。

- [0124] ラッカセイ小菌核病菌 (*Botryotinia arachidis*) のようなボトリオチニア (*Botryotinia*) 属菌; イネごま葉枯病菌 (*Cochliobolus miyabeanus*) のようなコクリオボラス (*Cochliobolus*) 属菌; キュウリつる枯病菌 (*Didymella bryoniae*) のようなディディメラ (*Didymella*) 属菌; イネ馬鹿苗病菌 (*Gibberella fujikuroi*) のようなジベレラ (*Gibberella*) 属菌; ブドウ黒痘病菌 (*Elsinoe ampelina*)、カンキツそうか病菌 (*Elsinoe fawcettii*) のようなエルシノエ (*Elsinoe*) 属菌; カンキツ黒点病菌 (*Diaporthe citri*)、ブドウ枝膨病菌 (*Diaporthe* sp.) のようなディアポルテ (*Diaporthe*) 属菌; リンゴモニリア病菌 (*Monilinia mali*)、モモ灰星病菌 (*Monilinia fructicola*) のようなモニリニア (*Monilinia*) 属菌; ブドウ晩腐病菌 (*Glomerella cingulata*) のようなグロメレラ (*Glomerella*) 属菌。

イネ紋枯病菌 (*Rhizoctonia solani*) のようなリゾクトニア (*Rhizoctonia*

）属菌；コムギ裸黒穂病菌 (*Ustilago nuda*) のようなウスチラゴ (*Ustilago*) 属菌；エンバク冠さび病菌 (*Puccinia coronata*)、コムギ赤さび病菌 (*Puccinia recondita*)、コムギ黄さび病菌 (*Puccinia striiformis*) のようなプクシニア (*Puccinia*) 属菌；ダイズさび病菌 (*Phakopsora pachyrhizi*) のようなファコプソラ (*Phakopsora*) 属菌；コムギ又はオオムギ雪腐小粒菌核病菌 (*Typhula incarnata*又は*Typhula ishikariensis*) のようなティフラ (*Typhula*) 属菌。

[0125] コムギふ枯病菌 (*Septoria nodorum*)、コムギ葉枯病菌 (*Septoria tritici*) のようなセプトリア (*Septoria*) 属菌；ブドウ、カンキツ、キュウリ、トマト、イチゴ、ナス、インゲン、アズキ、エンドウ、ラッカセイ、トウガラシ、ピーマン、レタス、タマネギ、スターチス、カーネーション、バラ、パンジー又はヒマワリ灰色かび病菌 (*Botrytis cinerea*)、タマネギ灰色腐敗病菌 (*Botrytis allii*)、タマネギのボトリティス属菌による葉枯れ症を引き起こす病原菌 (*Botrytis squamosa*、*Botrytis byssoidea*又は*Botrytis tulipae*) のようなボトリティス (*Botrytis*) 属菌；コムギ赤かび病菌 (*Fusarium graminearum*)、キュウリつる割病菌 (*Fusarium oxysporum*) のようなフザリウム (*Fusarium*) 属菌；イネいもち病菌 (*Pyricularia oryzae*) のようなピリキュラリア (*Pyricularia*) 属菌；テンサイ褐斑病菌 (*Cercospora beticola*)、カキ角斑病菌 (*Cercospora kakivora*) のようなサーコスポラ (*Cercospora*) 属菌；キュウリ炭そ病菌 (*Colletotrichum orbiculare*)、コーヒーノキ (*Colletotrichum coffeanum*) のようなコレトトリカム (*Colletotrichum*) 属菌；リンゴ斑点落葉病菌 (*Alternaria alternata* apple pathotype)、ナシ黒斑病菌 (*Alternaria alternata* Japanese pear pathotype)、バレイショ夏疫またはトマト輪紋病菌 (*Alternaria solani*)、キャベツ又はハクサイ黒斑病菌 (*Alternaria brassicae*)、キャベツ黒すす病菌 (*Alternaria brassicicola*)、タマネギ又はネギ黒斑病菌 (*Alternaria porri*) のようなアルタナリア (*Alternaria*) 属菌；キャベツ根朽病菌 (*Phoma lingam*) のようなフォーマ (*Phoma*) 属菌；コムギ眼紋病菌 (*Pseudocercospora herpotri*

choides) のようなシュードサーコスポレラ (*Pseudocercospora*) 属菌 ; ブドウ褐斑病菌 (*Pseudocercospora vitis*) のようなシュードサーコスポラ (*Pseudocercospora*) 属菌 ; オオムギ雲形病菌 (*Rhynchosporium secalis*) のようなリンコスפורウム (*Rhynchosporium*) 属菌 ; モモ黒星病菌 (*Cladosporium carpophilum*) のようなクラドスפורウム (*Cladosporium*) 属菌 ; モモホモプシス腐敗病菌 (*Phomopsis* sp.) のようなホモプシス (*Phomopsis*) 属菌。カキ炭そ病菌 (*Gloeosporium kaki*) のようなグロエオスפורウム (*Gloeosporium*) 属菌 ; トマト葉かび病菌 (*Fulvia fulva*) のようなフルビア (*Fulvia*) 属菌 ; キュウリ褐斑病菌 (*Corynespora cassiicola*) のようなコリネスポラ (*Corynespora*) 属菌 ; ウモロコシ斑点病菌 (*Physoderma maydis*) のような *Physoderma* 属菌類。

[0126] 化合物 (I) は前述した各種の植物病原菌類を防除できることから、各種病害を予防的又は治療的に防除することができる。特に化合物 (I) は、農園芸分野で問題となる各種病害、例えば、ピシウム菌による苗立枯病、ピリキュラリア菌によるいもち病、フザリウム菌による馬鹿苗病、コクリオボラス菌によるごま葉枯病、リゾクトニア菌による紋枯病等のイネの病害 ; エリシフェ菌によるうどんこ病、フザリウム菌による赤かび病又はクラウンロット病、プクシニア菌によるさび病、ピシウム菌による褐色雪腐病、ウスチラゴ菌による裸黒穂病、シュードサーコスポラ菌による眼紋病、セプトリア菌による葉枯病又はふ枯病等のムギ類の病害 ; フザリウム菌による赤かび病、フィソデルマ菌による斑点病、プクシニア菌によるさび病、セトスフェリア菌によるすす紋病、コクリオボラス菌によるごま葉枯病、ピシウム菌による根腐病、ウスチラゴ菌による黒穂病等のトウモロコシの病害 ; ウスチラゴ菌による黒穂病、スタゴノスポラ菌による葉焼病、プクシニア菌によるさび病、ジベレラ菌による梢頭腐敗病、カルダリオミセス菌によるすす病、シュードサーコスポラ菌による葉枯病等のサトウキビの病害等のイネ科作物の病害 ; オイディウム菌によるうどんこ病、ファコプソラ菌によるさび病、ペロノスポラ菌によるべと病、フィトフトラ菌による疫病又は茎疫病、コレトリ

カム菌による炭そ病、スクレロティニア菌による菌核病、ボトリティス菌による灰色かび病、フザリウム菌による根腐病又は立枯病等のマメ科作物の病害；フザリウム菌による萎黄病、ペロノスポラ菌又はヒアロペロノスポラ菌によるべと病、アルタナリア菌による黒斑病、フォーマ菌による根朽病、プラスモディオフォラ菌による根こぶ病、アフアノミセス菌による根くびれ病、ピシウム菌によるピシウム腐敗病等のアブラナ科作物の病害；ブレミア菌によるべと病、フィトフトラ菌による疫病、ボトリティス菌による灰色かび病、スクレロティニア菌による菌核病、アエシジウム菌によるさび病等のキク科作物の病害；アルタナリア菌による輪紋病、フルビア菌による葉かび病、フィトフトラ菌による疫病又は灰色疫病、ボトリティス菌による灰色かび病、オイディウム菌によるうどんこ病、フザリウム菌による萎凋病、シュードサーコスポラ菌によるすすかび病等のトマトの病害；アルタナリア菌による夏疫病、フィトフトラ菌による疫病又は褐色腐敗病、スクレロティニア菌による菌核病、フザリウム菌による乾腐病等のバレイショの病害等のナス科作物の病害；コレトリカム菌による炭そ病、スファエロテカ菌によるうどんこ病、ディディメラ菌によるつる枯病、シュードペロノスポラ菌によるべと病、フィトフトラ菌による疫病又は褐色腐敗病、コリネスポラ菌による褐斑病、フザリウム菌によるつる割病等のウリ科作物の病害；ペロノスポラ菌によるべと病、フィトフトラ菌による疫病、ボトリティス菌による灰色かび病、スクレロティニア菌による菌核病、プクシニア菌によるさび病等のヒガンバナ科ネギ属作物の病害；プラズモパラ菌によるべと病、アルタナリア菌による黒葉枯病又は黒斑病、ボトリティス菌による灰色かび病、スクレロティニア菌による菌核病、エリシフェ菌によるうどんこ病、サーコスポラ菌による斑点病等のセリ科作物の病害；ボトリティス菌による葉枯病、フィトフトラ菌による疫病、ホモプシス菌による茎枯病等のユリ科作物の病害；ペロノスポラ菌によるべと病、エリシフェ菌によるうどんこ病、リゾクトニア菌による立枯病等のタデ科作物の病害；アルブゴ菌による白さび病、フザリウム菌によるつる割病、セラトシスティス菌による黒斑病、ストレプトマイセ

ス菌による立枯病等のヒルガオ科作物の病害；アフアノミセス菌による根腐病、アルブゴ菌による白さび病、ペロノスポラ菌によるべと病、フィトフトラ菌による疫病、ボトリティス菌による灰色かび病、スクレロティニア菌による菌核病、オイディウム菌によるうどんこ病、サーコスポラ菌による褐斑病等のアカザ科作物の病害；エルシノエ菌による黒とう病、コレトリカム菌による晩腐病、エリシフェ菌によるうどんこ病、プラズモパラ菌によるべと病、ボトリティス菌による灰色かび病、シュードサーコスポラ菌による褐斑病、ディアポルテ菌による枝膨病等のブドウ科作物の病害；スファエロテカ菌によるうどんこ病、ボトリティス菌による灰色かび病、グロメラ菌による炭そ病、フザリウム菌による乾腐病等のイチゴの病害；モニリニア菌によるモニリア病、ポドスファエラ菌によるうどんこ病、アルタナリア菌による斑点落葉病、ヴェンチュリア菌による黒星病、グロメラ菌による炭そ病、ディプロカーポン菌による褐斑病、ボトリオスファエリア菌による輪紋病、ジゴフィアラ菌によるすす点病、グロエオデス菌によるすす斑病、ミコスファエレラ菌による黒点病等のリンゴの病害；ヴェンチュリア菌による黒星病、アルタナリア菌による黒斑病、フィラクティニア菌によるうどんこ病、フィトフトラ菌による疫病、フザリウム菌による果実腐敗病等のナシ類の病害；モニリニア菌による灰星病、クラドスポリウム菌による黒星病、ホモプシス菌によるホモプシス腐敗病等のモモの病害等のバラ科作物の病害；ディアポルテ菌による黒点病、エルシノエ菌によるそうか病、フザリウム菌によるフザリウム立枯病等のカンキツの病害等のミカン科作物の病害；グロエオスポリウム菌による炭そ病、サーコスポラ菌による落葉病、フィラクティニア菌によるうどんこ病、ジゴフィアラ菌によるすす点病等のカキノキ科作物の病害；コレトリカム菌による炭そ病、ペスタロオチオプシス菌による輪斑病、シュードモナス菌による赤焼病、エクソバシディウム菌によるもち病等のツバキ科作物の病害；ピシウム菌による根茎腐敗病等のショウガ科作物の病害；シュードペロノスポラ菌によるべと病等のアサ科作物の病害；ペロノスポラ菌によるべと病等シソ科作物の病害などの植物病害の防除に有効で

ある。

[0127] また、フザリウム菌による赤かび病又はクラウンロット病、コレトリカム菌による炭そ病、チレチア菌によるなまぐさ黒穂病、ウスチラゴ菌による裸黒穂病、セファロスポリウム菌による条斑病、セプトリア菌によるふ枯病等のムギ類の病害；ビボラリス菌によるごま葉枯病、コレトリカム菌による炭そ病、フザリウム菌による苗立枯病等のトウモロコシの病害；グロメラ菌による赤腐病、セラトシスティス菌による黒腐病、スクレロスポラ菌によるべと病等のサトウキビの病害等のイネ科作物の病害；サーコスポラ菌による紫斑病、ペロノスポラ菌によるべと病、フザリウム菌による立枯病、セプトリア菌による褐紋病、ディアポルテ菌による黒点病、コレトリカム菌による炭そ病、セプトグロエウム菌によるねむり病等のダイズの病害等のマメ科作物の病害；アルタナリア菌による黒斑病または黒すす病、ペロノスポラ菌によるべと病、シュードモナス菌による黒斑細菌病、ザントモナス菌による黒腐病、フォーマ菌による根朽病等のキャベツの病害；アルタナリア菌による黒斑病、フザリウム菌による萎黄病、ザントモナス菌による黒腐病等のダイコンの病害；アルタナリア菌による黒斑病、ザントモナス菌による黒腐病、バーティシリウム菌による黄化病等のハクサイの病害等のアブラナ科作物の病害；アルタナリア菌による輪紋病、クラビバクター菌によるかいよう病、ザントモナス菌による斑点細菌病等のトマトの病害；アルタナリア菌による褐斑病、ホモプシス菌による褐紋病等のナスの病害；ストレプトマイセス菌によるそうか病、ヘルミントスポリウム菌による銀か病、スポンゴスポラ菌による粉状そうか病等のバレイショの病害等ナス科作物の病害；アルタナリア菌による黒斑病、シュードモナス菌による斑点細菌病、ザントモナス菌による褐斑細菌病等のキュウリの病害等のウリ科作物の病害；アルタナリア菌による黒斑病、ボトリティス菌による灰色腐敗病又は菌糸性腐敗病、フザリウム菌による乾腐病、ペロノスポラ菌によるべと病、フィトフトラ菌による白色疫病又は茎疫病等のヒガンバナ科ネギ属作物の病害；アルタナリア菌による黒葉枯病又は黒斑病、ザントモナス菌による斑点細菌病等のニン

ジンの病害；セプトリア菌による葉枯病、スクレロティニア菌による菌核病、シュードモナス菌による葉枯細菌病等のセルリーの病害等のセリ科作物の病害；ペロノスポラ菌によるべと病、フザリウム菌による萎凋病、コレトリカム菌による炭そ病等のハウレンソウの病害等のアカザ科作物の病害；などの種子伝染性病害にも有効である。

[0128] さらに、フザリウム菌、ピシウム菌、リゾクトニア菌、バーティシリウム菌、プラズモディオホーラ菌、チエラビオプシス菌などの植物病原菌によって引き起こされる土壌病害の防除にも有効である。

[0129] 化合物（Ⅰ）は、上述の各種病害を予防的又は治療的に防除することができる。下記の実施例に記載された試験方法を用いて、一定の本発明化合物は、低薬量（例えば、100ppm、25ppm、12.5ppm、6.3ppm、3.1ppm、1.6ppm、0.8ppm、0.4ppm、0.2ppm又は0.1ppm）で、優れた予防的又は治療的な防除効果を発揮することができる。

[0130] 化合物（Ⅰ）は、優れた耐雨性、残効性、浸達性を有していることから、化合物（Ⅰ）を植物体に施用することによって植物の地上部の有害菌類を一定の期間防除することができる。

[0131] 種々の有害な植物病害を防除するために、有効量の化合物（Ⅰ）を植物体、植物病原菌又は土壌に施用することができる。

前記有効量とは、化合物（Ⅰ）が種々の有害な植物病害に対して防除効果を発揮する、化合物（Ⅰ）の施用量を意味する。

前記植物体とは、樹幹、茎、葉、花、穂、果実のような植物の地上部、塊茎、根茎、根のような植物の地下部及び植物の種子、実生、移植苗等を意味する。

前記土壌とは、畑、水田、果樹園等の農耕地、及び芝生、森林等の非農耕地などの植物の栽培地を意味する。

[0132] 化合物（Ⅰ）が施用される植物は農園芸上有用なものであれば特に制限は無いが、例えば、イネ科作物（イネ、コムギ、オオムギ、エンバク、ライム

ギ、トウモロコシ、サトウキビ等)、マメ科作物(ダイズ、インゲンマメ、アズキ、エンドウ、ラッカセイ、エダマメ、アルファルファ等)、アブラナ科作物(キャベツ、ハクサイ、ダイコン、カブ、ブロッコリー、カリフラワー、ナバナ、セイヨウアブラナ、ワサビ等)、キク科作物(レタス、ゴボウ、シュンギク、ヒマワリ等)、ナス科作物(バレイショ、ナス、トマト、ピーマン、タバコ、トウガラシ等)、ウリ科作物(キュウリ、カボチャ、メロン、スイカ、トウガン、ズッキーニ等)、ヒガンバナ科ネギ属作物(ネギ、ニラ、ラッキョウ、ニンニク、タマネギ、ワケギ等)、セリ科作物(セルリー、ニンジン、パセリ、ミツバ等)、ユリ科作物(ユリ、チューリップ、アスパラガス等)、タデ科作物(ソバ等)、ヒルガオ科作物(サツマイモ、エンサイ等)、アカザ科作物(ハウレンソウ、テンサイ等)、ブドウ科作物(ブドウ等)、バラ科作物(バラ、イチゴ、リンゴ、ナシ、モモ、ビワ、アーモンド等)、ミカン科作物(ミカン、レモン、オレンジ、カンキツ等)、カキノキ科作物(カキ等)、クワ科作物(イチジク等)、ツバキ科作物(チャ等)、モクセイ科作物(オリーブ、ジャスミン等)、アオイ科作物(ワタ、カカオ、オクラ等)、バショウ科作物(バナナ等)、ショウガ科作物(ショウガ、ミョウガ等)、アサ科作物(ホップ等)、シソ科作物(バジル等)、アカネ科作物(コーヒーノキ等)、パイナップル科作物(パイナップル、アナナス等)、イソマツ科作物(スターチス等)、ナデシコ科作物(カーネーション等)、スミレ科作物(パンジー等)が挙げられる。

[0133] 前記植物には、遺伝子組み換え技術や遺伝子編集技術を用いて育成された植物、例えば、環境ストレス耐性、除草剤耐性、害虫耐性、病害耐性などを付与された植物、又は、成長、稔性形質、生産物の品質や収量などを改変された植物を含む。

[0134] 化合物(1)は、通常、化合物(1)と補助剤とを混合して粉剤、粒剤、顆粒水和剤、水和剤、水性懸濁剤、油性懸濁剤、水溶剤、乳剤、液剤、ペースト剤、エアゾール剤、微量散布剤、マイクロカプセル剤などの種々の形態に製剤し使用されるが、本発明の目的に適合するかぎり、通常の当該分野に

用いられているあらゆる製剤形態にすることができる。製剤に使用する前記補助剤としては、固体担体、液体担体が挙げられるが、必要に応じて、界面活性剤、その他の製剤用補助剤を添加することもできる。

[0135] 前記固体担体の具体例としては、珪藻土、消石灰、炭酸カルシウム、タルク、ホワイトカーボン、カオリン、ベントナイト、カオリナイト、セリサイト、クレイ、炭酸ナトリウム、重曹、芒硝、ゼオライト、澱粉、微粉シリカが挙げられる。

[0136] 前記液体担体の具体例としては、水、トルエン、キシレン、ソルベントナフサ、ジオキサン、アセトン、イソホロン、メチルイソブチルケトン、クロロベンゼン、シクロヘキサン、ジメチルスルホキシド、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-2-ピロリドン、アルコールが挙げられる。

[0137] 前記界面活性剤としては、脂肪酸塩、安息香酸塩、アルキルスルホコハク酸塩、ジアルキルスルホコハク酸塩、ポリカルボン酸塩、アルキル硫酸エステル塩、アルキル硫酸塩、アルキルアリール硫酸塩、アルキルジグリコールエーテル硫酸塩、アルコール硫酸エステル塩、アルキルスルホン酸塩、アルキルアリールスルホン酸塩、アリールスルホン酸塩、リグニンスルホン酸塩、アルキルジフェニルエーテルジスルホン酸塩、ポリスチレンスルホン酸塩、アルキルリン酸エステル塩、アルキルアリールリン酸塩、スチリルアリールリン酸塩、ポリオキシエチレンアルキルエーテル硫酸エステル塩、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテルリン酸塩、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル硫酸塩、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテルリン酸塩、ポリオキシエチレンアルキルアリールリン酸エステル塩、ナフタレンスルホン酸ホルマリン縮合物の塩のような陰イオン系の界面活性剤や展着剤；ソルビタン脂肪酸エステル、グリセリン脂肪酸エステル、脂肪酸ポリグリセライド、脂肪酸アルコールポリグリコールエーテル、アセチレングリコール、アセチレンアルコール、オキシアルキレンブロックポリマー、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アリールエーテル、ポリオキシエチレングリコールアルキルエーテル、ポリエチレングリコール、ポリオキシエチレン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレングリセリン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレン硬化ヒマシ油、ポリオキシプロピレン脂肪酸エステルのような非イオン系の界面活性剤や展着剤が挙げられる。

[0138] その他の製剤用補助剤の具体例としては、オリーブ油、カポック油、ひまし油、シュロ油、椿油、ヤシ油、ごま油、トウモロコシ油、米ぬか油、落花生油、綿実油、大豆油、菜種油、亜麻仁油、きり油、液状パラフィンなどの植物油や鉱物油；シリコーン；ザンサンガムなどが挙げられる。

[0139] これら補助剤の各成分は、本発明の目的から逸脱しないかぎり、1種又は2種以上を適宜選択して使用することができる。また、前記した補助剤以外にも当該分野で知られたものの中から適宜選んで使用することもでき、例えば、増量剤、増粘剤、沈降防止剤、凍結防止剤、分散安定剤、薬害軽減剤、防黴剤など通常使用される各種補助剤も使用することができる。化合物（1）と各種補助剤との配合割合は、重量比で、一般に0.001：99.999～95：5、望ましくは0.005：99.995～90：10である。これら製剤の実際の使用に際しては、そのまま使用するか、または水等の希釈剤を用いて所定濃度に希釈し、必要に応じて各種展着剤（界面活性剤、植物油、鉱物油など）を添加して使用することができる。

[0140] 化合物（1）の施用は、気象条件、製剤形態、対象作物、施用時期、施用場所、有害な植物病害の種類や発生状況などの相違により一概に規定できないが、通常、一般に行なわれている施用方法、すなわち、散布処理、土壌処理、種子処理等により、有効量の化合物（1）を施用することができる。一般に行われている施用方法で有効量の化合物（1）を施用する場合、0.1～10,000ppm、好ましくは1～2,000ppm、より好ましくは1～1,000ppmの有効成分濃度で化合物（1）を施用することができる。

る。

一般に行われている施用方法において、有効成分として化合物（Ⅰ）を含む組成物（以下、本組成物ともいう）又はその希釈物の施用を行うこともできる。一般に散布処理の場合、その施用適量としては、１ヘクタールあたり本組成物が、１０～１００，０００ｇ程度とすることができる。土壌処理の場合、その施用適量としては、１ヘクタールあたり本組成物が０．０１～１，０００ｇ程度とすることができる。種子処理の場合、その施用適量としては、種子１ｋｇあたり本組成物が０．００１～１００ｇ、望ましくは０．０１～１ｇ程度とすることができる。

[0141] 前記散布処理とは、植物の樹幹、芽、茎葉、花、穂、果実の表面或いは植物病原菌に、本組成物の有効量を散布することにより、植物病原菌を防除する処理方法である。例えば、茎葉散布、樹幹散布等が挙げられる。

前記土壌処理とは、植物病原菌による被害から作物を保護するため、化合物（Ⅰ）の有効量を植物の根部等から植物の内部に浸透移行させるために、土壌に本組成物を処理する方法である。例えば、灌注処理（本組成物を植物の栽培土壌に灌注する）、土壌混和处理（植物の栽培土壌と本組成物を混和する）、植穴処理、株元又は株間への処理（散布又は灌注）、培土、育苗箱、育苗トレイ、ペーパーポット又は苗床等に使用する土壌への混和处理等が挙げられる。

前記種子処理とは、植物病原菌による被害から作物を保護するため、作物の種子、球根等に直接或いは近傍に本組成物を処理することにより、植物病原菌を防除する処理方法である。例えば、塗布処理、粉衣処理、浸漬処理等が挙げられる。

その他、苗処理（灌注又は浸漬）、球根、塊茎、鱗茎、根等への浸漬処理、さらに、水耕栽培液に混合するような水耕処理が挙げられる。処理は植物の全体であっても一部分（茎葉、芽、花、穂、果実、樹幹、種子、球根、塊茎、鱗茎、根等）であっても良い。

[0142] 本組成物は、他の農園芸用薬剤、肥料、薬害軽減剤などから選ばれる他の

成分と混用又は併用することができ、この場合に一層優れた効果、作用性を示すことがある。

前記混用又は併用とは、本組成物と他の成分とを、同時に、別々に又は時間間隔をおいて使用することを意味する。

他の農園芸用薬剤は、除草剤、殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺土壌害虫剤、殺菌剤、抗ウイルス剤、誘引剤、抗生物質、植物ホルモン、植物成長調整剤などが挙げられる。特に、本組成物、並びに他の殺菌剤の有効成分化合物の1種又は2種以上と混用或いは併用した混合殺菌組成物は、適用範囲、薬剤処理の時期、防除活性等を好ましい方向へ改良することがある。尚、本組成物、並びに他の殺菌剤の有効成分化合物は、各々別々に製剤したものを散布時に混合して使用しても、両者を一緒に製剤して使用してもよい。本発明には、このような混合殺菌剤も含まれる。

[0143] 化合物(1)、並びに他の殺菌剤の有効成分化合物との混合比は、気象条件、製剤形態、対象作物、施用時期、施用場所、有害な植物病害の種類や発生状況、などの相違により一概に規定できないが、重量比で、一般に1:300~300:1、望ましくは1:100~100:1とすることができる。また、施用適量としては、1ヘクタール当りの総有効成分化合物量は0.1~70,000g、望ましくは1~30,000gとすることができる。本発明には、このような混合殺菌組成物の施用による有害な植物病害の防除方法も含まれる。

[0144] 本組成物の施用にあたっては、他の農園芸用薬剤、例えば殺菌剤、殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺土壌害虫剤、抗ウイルス剤、誘引剤、除草剤、植物成長調整剤等をさらに併せて処理することもできる。

[0145] 上記他の農園芸用薬剤中の、殺菌剤の有効成分化合物(一般名)とは、例えば、下記の化合物群から適宜選択することができる。特に記載がない場合であっても、これら化合物に、塩、アルキルエステル、光学異性体のような各種構造異性体などが存在する場合は、当然それらも含まれる。

[0146] メパニピリム(mepanipirim)、ピリメタニル(pyrimethanil)、シプロジ

ニル (cyprodinil) のようなアニリノピリミジン系化合物；

アメトクトラジン (ametoctradin) のようなトリアゾロピリミジン系化合物；

トリシクラゾール (tricyclazole) のようなトリアゾロベンゾチアゾール系化合物；

フルアジナム (fluazinam) のようなピリジナミン系化合物；

トリアジメホン (triadimefon)、ビテルタノール (bitertanol)、トリフルミゾール (triflumizole)、エタコナゾール (etaconazole)、プロピコナゾール (propiconazole)、ペンコナゾール (penconazole)、フルシラゾール (flusilazole)、ミクロブタニル (myclobutanil)、シプロコナゾール (cyproconazole)、テブコナゾール (tebuconazole)、ヘキサコナゾール (hexaconazole)、フルコナゾール・シス (furconazole-cis)、プロクロラズ (prochloraz)、メトコナゾール (metconazole)、エポキシコナゾール (epoxiconazole)、テトラコナゾール (tetraconazole)、オキシポコナゾールフマル酸塩 (oxpoconazole fumarate)、プロチオコナゾール (prothioconazole)、トリアジメノール (triadimenol)、フルトリアホル (flutriafol)、ジフェノコナゾール (difenoconazole)、フルキンコナゾール (fluquinconazole)、フェンブコナゾール (fenbuconazole)、ブロムコナゾール (bromuconazole)、ジニコナゾール (diniconazole)、シメコナゾール (simeconazole)、ペフラゾエート (pefurazoate)、イプコナゾール (ipconazole)、イミベンコナゾール (imibenconazole)、アザコナゾール (azaconazole)、トリチコナゾール (triticonazole)、イマザリル (imazalil)、イプフェントリフルコナゾール (ipfentrifluconazole)、メフェントリフルコナゾール (mefentrifluconazole) のようなアゾール系化合物；

[0147] キノメチオナート (chinomethionat) のようなキノキサリン系化合物；

マンネブ (maneb)、ジネブ (zineb)、マンゼブ (mancozeb)、ポリカーバメート (polycarbamate)、メチラム (metiram)、プロピネブ (propineb)、チラム (thiram) のようなジチオカーバメート系化合物；

フサライド (phthalide)、クロロタロニル (chlorothalonil)、キントゼン (quintozene) のような有機塩素系化合物；

ベノミル (benomyl)、チオファネートメチル (thiophanate-methyl)、カルベンダジム (carbendazim)、チアベンダゾール (thiabendazole)、フベリアゾール (fuberiazole) のようなイミダゾール系化合物；

シモキサニル (cymoxanil) のようなシアノアセトアミド系化合物；

メタラキシル (metalaxyl)、メタラキシルーM (metalaxyl-M；別名メフェノキサム (mefenoxam))、オキサジキシル (oxadixyl)、オフレース (ofurace)、ベナラキシル (benalaxyl)、ベナラキシルーM (benalaxyl-M、別名キララキシル (kiralaxyl、chiralaxyl))、フララキシル (furalaxyl)、バリフェナレート (valifenalate) のようなアシルアミノ酸系化合物；

シプロフラム (cyprofuram)、カルボキシシン (carboxin)、オキシカルボキシシン (oxycarboxin)、チフルザミド (thifluzamide)、ボスカリド (boscalid)、フェンヘキサミド (fenhexamid)、イソチアニル (isotianil)、チアジニル (tiadinil)、ピラジフルミド (pyraziflumid) のようなアニリド系化合物；

[0148] ジクロフルアニド (dichlofluanid) のようなスルファミド系化合物；

水酸化第二銅 (cupric hydroxide)、有機銅 (oxine copper)、無水硫酸銅、ノニルフェノールスルホン酸銅、8-ヒドロキシキノリン銅、ドデシルベンゼンスルホン酸ビスエチレンジアミン銅錯塩(II) (別名DBEDC) のような銅系化合物；

ホセチルアルミニウム (fosetyl-Al)、トルクロホスメチル (tolclofos-Methyl)、エジフェンホス (edifenphos)、イプロベンホス (iprobenfos) のような有機リン系化合物；

キャプタン (captan)、カプタホール (captafol)、フォルペット (folpet) のようなフタルイミド系化合物；

プロシミドン (procymidone)、イプロジオン (iprodione)、ビンクロゾリン (vinclozolin) のようなジカルボキシイミド系化合物；

フルトラニル (flutolanil)、メプロニル (mepronil)、ベノダニル (benodanil)、フルフェノキサジアザム (flufenoxadiazam) のようなベンズアニリド系化合物；

カルプロパミド (carpropamid)、ジクロシメット (diclocymet)、シルチオフアム (silthiofam)、フェノキサニル (fenoxanil) のようなアミド系化合物；

ベンゾビンジフルピル (benzovindiflupyr)、ビキサフェン (bixafen)、フルーインダピル (fluindapyr)、フルキサピロキサド (fluxapyroxad)、フラメトピル (furametpyr)、イソピラザム (isopyrazam)、ペンフルフェン (penflufen)、ペンチオピラド (penthioapyrad)、ピジフルメトフェン (pydiflumetofen)、セダキサン (sedaxane)、イソフルーシプラム (isoflucypram)、インピルフルキサム (inpyrfluxam)、ピラプロポイン (pyrapropoyne)、フェノピラミド (fenopyramid) のようなピラゾールカルボキサミド系化合物；

[0149] フルオピコリド (fluopicolide)、フルオピラム (fluopyram)、ゾキサミド (zoxamide)、フルーオピモミド (fluopimomide) のようなベンズアミド系化合物；

フェンフラム (fenfuram) のようなフラニリド系化合物；

イソフェタミド (isofetamid) のようなチオフエンアミド系化合物；

トリホリン (triforine) のようなピペラジン系化合物；

ピリフェノックス (pyrifenox)、ピリソキサゾール (pyrisoxazole)、アミノピリフェン (aminopyrifen) のようなピリジン系化合物；

フェナリモル (fenarimol)、フェリムゾン (ferimzone)、ヌアリモール (nuarimol)、フルメチルスルホリム (flumetylsulforim) のようなピリミジン系化合物；

フェンプロピディン (fenpropidin) のようなピペリジン系化合物；

フェンプロピモルフ (fenpropimorph)、トリデモルフ (tridemorph) のようなモルホリン系化合物；

水酸化トリフェニルスズ (fentin hydroxide)、酢酸トリフェニルスズ (fentin acetate) のような有機スズ系化合物；

ペンシキュロン (pencycuron) のような尿素系化合物；

ジメトモルフ (dimethomorph)、フルモルフ (flumorph)、ピリモルフ (pyrimorph)、イプロバリカルブ (iprovalicarb)、ベンチアバリカルブーイソプロピル (benthiavalicarb-isopropyl)、マンジプロパミド (mandipropamid) のようなカルボン酸アミド系化合物；

ジエトフェンカルブ (diethofencarb) のようなフェニルカーバメート系化合物；

フルジオキサニル (fludioxonil)、フェンピクロニル (fenpiclonil) のようなシアノピロール系化合物；

[0150] アゾキシストロビン (azoxystrobin)、クレソキシムメチル (kresoxim-methyl)、メトミノストロビン (metominostrobin)、トリフロキシストロビン (trifloxystrobin)、ピコキシストロビン (picoxystrobin)、オリザストロビン (oryzastrobin)、ジモキシストロビン (dimoxystrobin)、ピラクロストロビン (pyraclostrobin)、フルオキサストロビン (fluoxastrobin)、ピラオキシストロビン (Pyraoxystrobin)、ピラメトストロビン (Pyrametostrobin)、クモキシストロビン (coumoxystrobin)、エノキサストロビン (enoxastrobin)、フェナミンストロビン (fenaminstrobin)、フルフェノキシストロビン (flufenoxystrobin)、トリクロピリカルブ (triclopyricarb)、マンデストロビン (mandestrobin) のようなストロビルリン系化合物；

ファミキサドン (famoxadone)、オキサチアピプロリン (oxathiapiprolin) のようなオキサゾール系化合物；

エタボキサム (ethaboxam) のようなチアゾールカルボキサミド系化合物；

フェンアミドン (フェナミドン、fenamidone) のようなイミダゾリノン系化合物；

フルスルファミド (flusulfamide) のようなベンゼンスルホンアミド系化合物；

シフルフェナミド (cyflufenamid) のようなオキシムエーテル系化合物 ;

ジチアノン (dithianon) のようなアントラキノ系化合物 ;

メプチルジノカップ (meptyldinocap) のようなクロトン酸系化合物 ;

バリダマイシン (validamycin) 、カスガマイシン (kasugamycin) 、ストレプトマイシン (streptomycin) 、ポリオキシン (polyoxins) のような抗生物質 ;

[0151] イミノクタジン (iminooctadine) 、ドジン (dodine) 、グアザチン (guazatine) のようなグアニジン系化合物 ;

ブチルアミン (butylamine) 、セボクチラミン (seboctylamine) のような脂肪族窒素系化合物 ;

テブフロキン (tebufloquin) 、キノキシフェン (quinoxifen) 、キノフメリン (quinofumelin) 、イプフルフェノキン (ipflufenquin) 、フェネプタミドキン (feneptamidoquin) のようなキノリン系化合物 ;

フルチアニル (flutianil) のようなチアゾリジン系化合物 ;

プロパモカルブ塩酸塩 (propamocarb hydrochloride) 、ピリベンカルブ (pyribencarb) 、トルプロカルブ (tolprocarb) のようなカーバメート系化合物 ;

ピカルブトラゾクス (picarbutrazox) 、メチルテトラプロール (metyltetraprole) のようなテトラゾール系化合物 ;

アミスルブロム (amisulbrom) 、シアゾファミド (cyazofamid) のようなスルホンアミド系化合物 ;

メトラフェノン (metrafenone) 、ピリオフェノン (pyriofenone) のようなアリルフェニルケトン系化合物 ;

プロベナゾール (probenazole) 、ジクロベンチアゾクス (dichlobentiazo x) のようなベンゾチアゾール系化合物 ;

フェンピラザミン (fenpyrazamine) のようなフェニルピラゾール系化合物 ;

イソプロチオラン (isoprothiolane) のようなジチオラン系化合物 ;

フェンピコキサミド (fenpicoxamid)、フロリルピコキサミド (florylpic oxamid) のようなピコリンアミド系化合物；

[0152] 硫黄 (Sulfur)、石灰硫黄剤のような硫黄系化合物；

その他の化合物として、ピロキロン (pyroquilon)、ジクロメジン (diclo mezine)、クロルピクリン (chloropicrin)、ダゾメット (dazomet)、メタムナトリウム塩 (metam-sodium)、プロキナジド (proquinazid)、スピロキサミン (spiroxamine)、ジピメチトロン (dipymetitrone) など；

Bacillus amyloliquefaciens strain QST713、Bacillus amyloliquefaciens strain FZB24、Bacillus amyloliquefaciens strain MBI600、Bacillus amylo liquefaciens strain D747、Pseudomonas fluorescens、Bacillus subtilis、Trichoderma atroviride SKT-1のような微生物殺菌剤；及び

ティーツリー油 (Tea tree oil) のような植物抽出物。

[0153] 上記他の農園芸用薬剤中の、殺虫剤、殺線虫剤、殺ダニ剤、又は殺土壌害虫剤の有効成分化合物（一般名）とは、例えば、下記の化合物群から適宜選択することができる。特に記載がない場合であっても、これら化合物に、塩、アルキルエステル、光学異性体のような各種構造異性体などが存在する場合は、当然それらも含まれる。

[0154] プロフェノホス (profenofos)、ジクロルボス (dichlorvos)、フェナミホス (fenamiphos)、フェニトロチオン (fenitrothion)、E P N ((RS)-(O-ethyl 0-4-nitrophenyl phenylphosphonothioate))、ダイアジノン (diazinon)、クロルピリホス (chlorpyrifos)、クロルピリホスメチル (chlorpyrifos-methyl)、アセフェート (acephate)、プロチオホス (prothiofos)、ホスチアゼート (fosthiazate)、カズサホス (cadusafos)、ジスルホトン (disulfoton)、イソキサチオン (isoxathion)、イソフェンホス (isofenphos)、エチオン (ethion)、エトリムホス (etrimfos)、キナルホス (quinalphos)、ジメチルビンホス (dimethylvinphos)、ジメトエート (dimethoate)、スルプロホス (sulprofos)、チオメトン (thiometon)、バミドチオン (vamidothion)、ピラクロホス (pyraclofos)、ピリダフェンチオン (py

ridaphenthion)、ピリミホスメチル (pirimiphos-methyl)、プロパホス (propaphos)、ホサロン (phosalone)、ホルモチオン (formothion)、馬拉チオン (malathion)、テトラクロルビンホス (tetrachlorvinphos)、クロルフェンビンホス (chlorfenvinphos)、シアノホス (cyanophos)、トリクロルホン (trichlorfon)、メチダチオン (methidathion)、フェントエート (phenthoate)、オキシデプロホス (oxydeprofos、別名ESP)、アジンホスメチル (azinphos-methyl)、フェンチオン (fenthion)、ヘプテノホス (heptenophos)、パラチオン (parathion)、ホスホカルブ (phosphocarb)、デメトン-S-メチル (demeton-S-methyl)、モノクロトホス (monocrotophos)、メタミドホス (methamidophos)、イミシアホス (imicyafos)、パラチオン-メチル (parathion-methyl)、テルブホス (terbufos)、ホスファミドン (phosphamidon)、ホスメット (phosmet)、ホレート (phorate) のような有機リン酸エステル系化合物；

[0155] カルバリル (carbaryl)、プロポキスル (propoxur)、アルジカルブ (aldicarb)、カルボフラン (carbofuran)、チオジカルブ (thiodicarb)、メソミル (methomyl)、オキサミル (oxamyl)、エチオフエンカルブ (ethiofencarb)、ピリミカルブ (pirimicarb)、フェノブカルブ (fenobucarb)、カルボスルファン (carbosulfan)、ベンフラカルブ (benfuracarb)、ベンダイオカルブ (bendiocarb)、フラチオカルブ (furathiocarb)、イソプロカルブ (isoprocab)、メトルカルブ (metolcarb)、キシリルカルブ (xylylcarb)、XMC (3,5-xylyl methylcarbamate)、フェノチオカルブ (fenothiocarb) のようなカーバメート系化合物；

カルタップ (cartap)、チオシクラム (thiocyclam)、シュウ酸水素チオシクラム (thiocyclam oxalate)、チオシクラム塩酸塩 (thiocyclam hydrochloride)、ベンスルタップ (bensultap)、チオスルタップ (thiosultap)、モノスルタップ (monosultap；別名チオスルタップモノナトリウム (thiosultap-monosodium)、ビスルタップ (bisultap；別名チオスルタップジナトリウム (thiosultap-disodium)、ポリチアラン (polythialan) のようなネ

ライストキシン誘導体；

ジコホル (dicofol)、テトラジホン (tetradifon)、エンドスルフアン (endosulfan)、ジエノクロル (dienochlor)、ディルドリン (dieldrin)、メトキシクロル (methoxychlor) のような有機塩素系化合物；

酸化フェンブタスズ (fenbutatin oxide)、シヘキサチン (cyhexatin) のような有機金属系化合物；

[0156] フェンバレレート (fenvalerate)、ペルメトリン (permethrin)、シペルメトリン (cypermethrin)、アルファ-シペルメトリン (alpha-cypermethrin)、ゼータ-シペルメトリン (zeta-cypermethrin)、シーター-シペルメトリン (theta-cypermethrin)、ベータ-シペルメトリン (beta-cypermethrin)、デルタメトリン (deltamethrin)、シハロトリン (cyhalothrin)、ガンマ-シハロトリン (gamma-cyhalothrin)、ラムダ-シハロトリン (lambda-cyhalothrin)、テフルトリン (tefluthrin)、カップ-テフルトリン (kappa-tefluthrin)、エトフェンプロックス (ethofenprox)、フルフェンプロックス (flufenprox)、シフルトリン (cyfluthrin)、ベータ-シフルトリン (beta-cyfluthrin)、フェンプロパトリン (fenpropathrin)、フルシトリネート (flucythrinate)、フルバリネート (fluvalinate)、シクロプロトリン (cycloprothrin)、ピレスリン (pyrethrins)、エスフェンバレレート (esfenvalerate)、テトラメスリン (tetramethrin)、レスメスリン (resmethrin)、プロトリフェンブト (protrifenbute)、ビフェントリン (bifenthrin)、カップ-ビフェントリン (kappa-bifenthrin)、アクリナトリン (acrinathrin)、アレスリン (allethrin)、タウ-フルバリネート (tau-fluvalinate)、トラロメトリン (tralomethrin)、プロフルトリン (profluthrin)、メトフルトリン (metofluthrin)、イプシロンメトフルトリン (epsilon-metofluthrin)、ヘプタフルトリン (heptafluthrin)、フェノトリン (phenothrin)、フルメトリン (flumethrin)、モムフルオロトリン (momfluorothrin)、イプシロンモムフルオロトリン (epsilon-momfluorothrin)、シラフルオフエン (silafluofen)、クロロプラレトリン (chloroprallethrin) のような

ピレスロイド系化合物；

[0157] ジフルベンズロン (diflubenzuron)、クロルフルアズロン (chlorfluazuron)、テフルベンズロン (teflubenzuron)、フルフェノクスロン (flufenoxuron)、ルフェヌロン (lufenuron)、ノバルロン (novaluron)、トリフルムロン (triflumuron)、ヘキサフルムロン (hexaflumuron)、ビストリフルロン (bistrifluron)、ノビフルムロン (noviflumuron)、フルアズロン (fluazuron)、フルフェノクスロン (flufenoxuron) のようなベンゾイルウレア系化合物；

メトプレン (methoprene)、ピリプロキシフェン (pyriproxyfen)、フェノキシカルブ (fenoxycarb)、ジオフェノラン (diofenolan) のような幼若ホルモン様化合物；

ピリダベン (pyridaben) のようなピリダジノン系化合物；

フェンピロキシメート (fenpyroximate)、フィプロニル (fipronil)、エチピロール (ethiprole)、アセトプロール (acetoprole)、ピラフルプロール (pyrafluprole)、ピリプロール (pyriprole)、シエノピラフェン (cyenopyrafen)、フルフィプロール (flufiprole) のようなピラゾール系化合物；

ピフルブミド (pyflubumide)、テブフェンピラド (tebufenpyrad)、トルフェンピラド (tolfenpyrad)、ジンプロピリダズ (dimpropyridaz) のようなピラゾールカルボキサミド系化合物；

クロラントラニリプロール (chlorantraniliprole)、シアントラニリプロール (cyantraniliprole)、シクラニリプロール (cyclaniliprole)、テトラニリプロール (tetraniliprole)、チクロピラゾフロル (tyclopiazoflor)、フルクロルジニリプロール (fluchlordiniliprole)、チオラントラニリプロール (tiorantraniliprole) のようなピリジルピラゾール系化合物；

[0158] イミダクロプリド (imidacloprid)、ニテンピラム (nitenpyram)、アセタミプリド (acetamiprid)、チアクロプリド (thiacloprid)、チアメトキサム (thiamethoxam)、クロチアニジン (clothianidin)、ニジノテフラン

(nidinotefuran)、ジノテフラン (dinotefuran)、ニチアジン (nithiazine) のようなネオニコチノイド系化合物；

テブフェノジド (tebufenozide)、メトキシフェノジド (methoxyfenozide)、クロマフェノジド (chromafenozide)、ハロフェノジド (halofenozide) のようなヒドラジン系化合物；

ピリダリル (pyridalyl)、フロニカミド (flonicamid) のようなピリジン系化合物；

スピロジクロフェン (spirodiclofen)、スピロメシフェン (spiromesifen)、スピロブジフェン (spirotetramat) のようなテトラミン酸系化合物；

スピロテトラマト (spirotetramat)、スピロピジオン (spiropidion) のようなテトラミン酸系化合物；

フルアクリピリム (fluacrypyrim)、ピリミノストロビン (pyriminostrobilin)、フルピロキシストロビン (flupyroxystrobin) のようなストロビルリン系化合物；

フルフェネリム (flufenoxim)、ピリミジフェン (pyrimidifen) のようなピリミジナミン系化合物；

マラチオン (malathion) のような有機硫黄化合物；

シロマジン (cyromazine) のようなトリアジン系化合物；

ヒドラメチルノン (hydramethylnon) のようなヒドラゾン系化合物；

フルベンジアミド (flubendiamide)、ブロフラニリド (broflanilide)、シハロジアミド (cyhalodiamide)、ピオキサニリプロール (pioxaniliprole)、ピペルフラニリド (piperflanilide) のようなジアミド系化合物；

[0159] ジアフェンチウロン (diafenthiuron)、クロロメチウロン (chloromethiuron) のようなチオウレア系化合物；

アミトラズ (amitraz)、クロルジメホルム (chlordimeform)、クロロメブホルム (chloromebuform) のようなホルムアミジン系化合物；

ピメトロジン (pymetrozine)、ピリフルキナゾン (pyrifluquinazone) のようなピリジンアゾメチン系化合物；

アフォキサネル (afoxolaner)、フルアラネル (fluralaner)、フルキサメタミド (fluxametamide)、サロラネル (sarolaner)、イソフルアラナム (isoflualanam) のようなイソキサゾリン系化合物；

また、その他の化合物として、ブプロフェジン (buprofezin)、ヘキシチアゾクス (hexythiazox)、トリアザメート (triazamate)、クロルフェナピル (chlorfenapyr)、インドキサカルブ (indoxacarb)、アセキノシル (acequinocyl)、エトキサゾール (etoxazole)、1, 3-ジクロロプロペン (1, 3-dichloropropene)、ベンクロチアズ (benclothiaz)、ビフェナゼート (bifenazate)、プロパルギット (propargite)、クロフェンテジン (clofentezine)、メタフルミゾン (metaflumizone)、シフルメトフェン (cyflumetofen)、フェナザキン (fenazaquin)、アミドフルメト (amidoflumet)、スルフルラミド (sulfluramid)、ヒドラメチルノン (hydramethylnon)、メタアルデヒド (metaldehyde)、スルホキサフロル (sulfoxaflor)、フルエンスルホン (fluensulfone)、ベルブチン (verbutin)、ジクロロメゾチアズ (dicloromezotiaz)、トリフルメゾピリム (triflumezopyrim)、フルヘキサホン (fluhexafon)、チオキサザフェン (tioxazafen)、アフィドピロペン (afidopyropen)、フロメトキン (flometoquin)、フルピラジフロン (flupyradifurone)、フルアザインドリジン (fluazaindolizine)、アシノナピル (acynonapyr)、ベンツピリモキサン (benzpyrimoxan)、フルーピリミン (flupyrimin)、オキサゾスルフィル (oxazosulfyl)、スルフィフルミン (sulflumin)、ビスルフルフェン (bisulflufen)、サイベンゾキサスルフィル (cybenzoxasulfyl)、ガルキン (galquin)、ベデスカーナ (vedescana)、チアピラクロール (tiapyrachlor)、ベンチオフルミン (bentioflumin) のような化合物など。

[0160] また、本組成物は下記化合物と組み合わせて施用してもよい。

*Bacillus thuringiensis aizawai*、*Bacillus thuringiensis kurstaki*、*Bacillus thuringiensis israelensis*、*Bacillus thuringiensis japonensis*、*Bacillus thuringiensis tenebrionis*などの*Bacillus thuringiensis*が生成

する結晶タンパク毒素、昆虫病原ウイルス剤、昆虫病原糸状菌剤、線虫病原糸状菌剤などのような微生物農薬；

アバメクチン (abamectin)、エマメクチン安息香酸塩 (emamectin benzoate)、イベルメクチン (ivermectin)、ミルベメクチン (milbemectin)、ミルベマイシンオキシム (milbemycin oxime)、レピメクチン (lepimectin)、スピノサド (spinosad)、スピネトラム (spinetoram) のような抗生物質及び半合成抗生物質；

アザディラクチン (azadirachtin)、ロテノン (rotenone)、リアノジン (ryanodine) のような天然物；

ディート (deet) のような忌避剤；

パラフィン油、鉱物油 (mineral oil) のような物理的防除剤；

レドプロナ (ledprona)、ヴァデスカナ (vadescana) のようなRNAi農薬。

[0161] 本発明の望ましい態様は以下の通りである。但し、本発明はこれらに限定されるものではない。

〔1〕 式 (1) で表される化合物又はその塩。

〔2〕 式 (1) の化合物が式 (1A) のN-(シクロ) アルコキシアミド化合物又は式 (1B) のN-アルキニルオキシアミド化合物である、前記〔1〕に記載の化合物又はその塩。

〔3〕 式 (1) の化合物が式 (1A) のN-(シクロ) アルコキシアミド化合物である、前記〔1〕に記載の化合物又はその塩。

〔4〕 式 (1) の化合物が式 (1B) のN-アルキニルオキシアミド化合物である、前記〔1〕に記載の化合物又はその塩。

[0162] 〔5〕  $X^1$  が、フッ素原子、塩素原子又は臭素原子である、前記〔1〕に記載の化合物又はその塩。

〔6〕  $X^1$  が、フッ素原子又は塩素原子である、前記〔1〕に記載の化合物又はその塩。

〔7〕  $X^1$  が、フッ素原子又は臭素原子である、前記〔1〕に記載の化合物又はその塩。

〔 8 〕  $X^1$  が、塩素原子又は臭素原子である、前記〔 1 〕に記載の化合物又はその塩。

〔 9 〕  $X^1$  が、フッ素原子である、前記〔 1 〕に記載の化合物又はその塩。

〔 1 0 〕  $X^1$  が、塩素原子である、前記〔 1 〕に記載の化合物又はその塩。

〔 1 1 〕  $X^1$  が、臭素原子である、前記〔 1 〕に記載の化合物又はその塩。

[0163] 〔 1 2 〕  $R^1$  が、 $T^1$  で置換されていてもよい  $(C_1-C_4)$  -アルキル、 $(C_3-C_4)$  -シクロアルキル、 $(C_3-C_5)$  -アルケニル、又は  $(C_3-C_5)$  -アルキニルである、前記〔 1 〕、前記〔 5 〕～前記〔 1 1 〕のいずれか一つに記載の化合物又はその塩。

〔 1 3 〕  $R^1$  が、 $(C_1-C_4)$  -アルキル、 $(C_3-C_4)$  -シクロアルキル、又は  $(C_3-C_5)$  -アルキニルである、前記〔 1 〕、前記〔 5 〕～前記〔 1 1 〕のいずれか一つに記載の化合物又はその塩。

〔 1 4 〕  $R^1$  が、メチル、エチル、ノルマルプロピル、イソプロピル、ターシャリーブチル、シクロプロピル、シクロブチル、プロパルギル、アリル、メチルチオメチル、シアノメチル、2-メトキシエチル、2, 2-ジフルオロエチル、又はメトキシカルボニルメチルである、前記〔 1 〕、前記〔 5 〕～前記〔 1 1 〕のいずれか一つに記載の化合物又はその塩。

〔 1 5 〕  $R^1$  が、メチル、エチル、シクロプロピル、又はプロパルギルである、前記〔 1 〕、前記〔 5 〕～前記〔 1 1 〕のいずれか一つに記載の化合物又はその塩。

〔 1 6 〕  $R^1$  が、メチル、エチル、又はシクロプロピルである、前記〔 1 〕、前記〔 5 〕～前記〔 1 1 〕のいずれか一つに記載の化合物又はその塩。

〔 1 7 〕  $R^1$  が、メチル、エチル、又はプロパルギルである、前記〔 1 〕、前記〔 5 〕～前記〔 1 1 〕のいずれか一つに記載の化合物又はその塩。

〔 1 8 〕  $R^1$  が、メチル、又はエチルである、前記〔 1 〕、前記〔 5 〕～前記〔 1 1 〕のいずれか一つに記載の化合物又はその塩。

〔 1 9 〕  $R^1$  が、メチル、又はシクロプロピルである、前記〔 1 〕、前記〔 5 〕～前記〔 1 1 〕のいずれか一つに記載の化合物又はその塩。

〔20〕 $R^1$ が、メチル、又はプロパルギルである、前記〔1〕、前記〔5〕～前記〔11〕のいずれか一つに記載の化合物又はその塩。

〔21〕 $R^1$ が、メチルである、前記〔1〕、前記〔5〕～前記〔11〕のいずれか一つに記載の化合物又はその塩。

〔22〕 $R^1$ が、エチルである、前記〔1〕、前記〔5〕～前記〔11〕のいずれか一つに記載の化合物又はその塩。

〔23〕 $R^1$ が、シクロプロピルである、前記〔1〕、前記〔5〕～前記〔11〕のいずれか一つに記載の化合物又はその塩。

〔24〕 $R^1$ が、プロパルギルである、前記〔1〕、前記〔5〕～前記〔11〕のいずれか一つに記載の化合物又はその塩。

[0164] 〔25〕 $Y^1$ が、水素原子、ハロゲン、 $(C_1-C_6)$ -アルキル、 $(C_1-C_6)$ -ハロアルキル、ニトロ、又はシアノである、前記〔1〕、前記〔5〕～前記〔24〕のいずれか一つに記載の化合物又はその塩。

〔26〕 $Y^1$ が、ハロゲン、 $(C_1-C_3)$ -アルキル、 $(C_1-C_3)$ -ハロアルキル、ニトロ、又はシアノである、前記〔1〕、前記〔5〕～前記〔24〕のいずれか一つに記載の化合物又はその塩。

〔27〕 $Y^1$ が、水素原子、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、メチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、ニトロ、又はシアノである、前記〔1〕、前記〔5〕～前記〔24〕のいずれか一つに記載の化合物又はその塩。

〔28〕 $Y^1$ が、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、メチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、ニトロ、又はシアノである、前記〔1〕、前記〔5〕～前記〔24〕のいずれか一つに記載の化合物又はその塩。

〔29〕 $Y^1$ が、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、又はメチルである、前記〔1〕、前記〔5〕～前記〔24〕のいずれか一つに記載の化合物又はその塩。

〔30〕 $Y^1$ が、フッ素原子である、前記〔1〕、前記〔5〕～前記〔24〕のいずれか一つに記載の化合物又はその塩。

〔31〕 $Y^1$ が、塩素原子である、前記〔1〕、前記〔5〕～前記〔24〕の

いずれか一つに記載の化合物又はその塩。

〔32〕 $Y^1$ が、臭素原子である、前記〔1〕、前記〔5〕～前記〔24〕のいずれか一つに記載の化合物又はその塩。

〔33〕 $Y^1$ が、メチルである、前記〔1〕、前記〔5〕～前記〔24〕のいずれか一つに記載の化合物又はその塩。

[0165] 〔34〕 $Y^2$ が、ハロゲン、 $(C_1-C_6)$ -アルキル、又は水素原子である、前記〔1〕、前記〔5〕～前記〔33〕のいずれか一つに記載の化合物又はその塩。

〔35〕 $Y^2$ が、フッ素原子、塩素原子、 $(C_1-C_3)$ -アルキル、又は水素原子である、前記〔1〕、前記〔5〕～前記〔33〕のいずれか一つに記載の化合物又はその塩。

〔36〕 $Y^2$ が、フッ素原子、塩素原子、メチル、又は水素原子である、前記〔1〕、前記〔5〕～前記〔33〕のいずれか一つに記載の化合物又はその塩。

〔37〕 $Y^2$ が、フッ素原子、又は水素原子である、前記〔1〕、前記〔5〕～前記〔33〕のいずれか一つに記載の化合物又はその塩。

〔38〕 $Y^3$ が、ハロゲン、 $(C_1-C_6)$ -アルキル、又は水素原子である、前記〔1〕、前記〔5〕～前記〔37〕のいずれか一つに記載の化合物又はその塩。

〔39〕 $Y^3$ が、フッ素原子、塩素原子、 $(C_1-C_3)$ -アルキル、又は水素原子である、前記〔1〕、前記〔5〕～前記〔37〕のいずれか一つに記載の化合物又はその塩。

〔40〕 $Y^3$ が、フッ素原子、塩素原子、メチル、又は水素原子である、前記〔1〕、前記〔5〕～前記〔37〕のいずれか一つに記載の化合物又はその塩。

〔41〕 $Y^3$ が、フッ素原子、又は水素原子である、前記〔1〕、前記〔5〕～前記〔37〕のいずれか一つに記載の化合物又はその塩。

[0166] 〔42〕 $Y^4$ が、ハロゲン、又は水素原子である、前記〔1〕、前記〔5〕～

前記〔4 1〕のいずれか一つに記載の化合物又はその塩。

〔4 3〕 $Y^4$ が、フッ素原子、塩素原子、又は水素原子である、前記〔1〕、前記〔5〕～前記〔4 1〕のいずれか一つに記載の化合物又はその塩。

〔4 4〕 $Y^4$ が、フッ素原子、又は水素原子である、前記〔1〕、前記〔5〕～前記〔4 1〕のいずれか一つに記載の化合物又はその塩。

〔4 5〕 $Y^5$ がハロゲン、又は水素原子である前記〔1〕、前記〔5〕～前記〔4 4〕のいずれか一つに記載の化合物又はその塩。

〔4 6〕 $Y^5$ がフッ素原子、塩素原子、又は水素原子である前記〔1〕、前記〔5〕～前記〔4 4〕のいずれか一つに記載の化合物又はその塩。

〔4 7〕 $Y^5$ がフッ素原子、又は水素原子である前記〔1〕、前記〔5〕～前記〔4 4〕のいずれか一つに記載の化合物又はその塩。

〔4 8〕 $Y^5$ が水素原子である前記〔1〕、前記〔5〕～前記〔4 4〕のいずれか一つに記載の化合物又はその塩。

[0167] 〔4 9〕式（I A）で表されるN－（シクロ）アルコキシアミド化合物又はその塩。

〔5 0〕 $Y^1$ が、ハロゲン、 $(C_1-C_6)$ －アルキル、 $(C_1-C_6)$ －ハロアルキル、ニトロ、又はシアノである、前記〔4 9〕に記載のN－（シクロ）アルコキシアミド化合物又はその塩。

〔5 1〕 $Y^1$ が、水素原子、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、メチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、ニトロ、又はシアノである、前記〔4 9〕に記載のN－（シクロ）アルコキシアミド化合物又はその塩。

〔5 2〕 $Y^1$ が、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、メチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、ニトロ、又はシアノである、前記〔4 9〕に記載のN－（シクロ）アルコキシアミド化合物又はその塩。

〔5 3〕 $Y^{2A}$ が、水素原子、フッ素原子又は塩素原子である、前記〔4 9〕～〔5 2〕のいずれか1つに記載のN－（シクロ）アルコキシアミド化合物又はその塩。

[0168] 〔5 4〕 $Y^{2A}$ が、水素原子、又はフッ素原子である、前記〔4 9〕～〔5 2〕

〕のいずれか1つに記載のN－（シクロ）アルコキシアミド化合物又はその塩。

〔55〕 $Y^{3A}$ が、水素原子、フッ素原子、又は塩素原子である、前記〔49〕～〔54〕のいずれか1つに記載のN－（シクロ）アルコキシアミド化合物又はその塩。

〔56〕 $Y^{3A}$ が、水素原子、又はフッ素原子である、前記〔49〕～〔54〕のいずれか1つに記載のN－（シクロ）アルコキシアミド化合物又はその塩。

〔57〕 $Y^{4A}$ が、水素原子、又はフッ素原子である、前記〔49〕～〔56〕のいずれか1つに記載のN－（シクロ）アルコキシアミド化合物又はその塩。

〔58〕 $R^{1A}$ が、メチル、エチル、ノルマルプロピル、イソプロピル、ターシャリーブチル、シクロプロピル又はシクロブチルである、前記〔49〕～〔57〕のいずれか1つに記載のN－（シクロ）アルコキシアミド化合物又はその塩。

〔59〕 $R^{1A}$ が、メチル、エチル、又はシクロプロピルである、前記〔49〕～〔57〕のいずれか1つに記載のN－（シクロ）アルコキシアミド化合物又はその塩。

[0169] 〔60〕式（1B）で表されるN－アルキニルオキシアミド化合物又はその塩。

〔61〕 $Y^5$ が、水素原子である前記〔60〕に記載のN－アルキニルオキシアミド化合物又はその塩。

〔62〕 $Y^1$ が、ハロゲン、 $(C_1-C_6)$ －アルキル、 $(C_1-C_6)$ －ハロアルキル、ニトロ、又はシアノである前記〔60〕又は前記〔61〕に記載のN－アルキニルオキシアミド化合物又はその塩。

〔63〕 $Y^1$ が、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、メチル、ジフルオロメチル、ニトロ、又はシアノである前記〔60〕又は前記〔61〕に記載のN－アルキニルオキシアミド化合物又はその塩。

〔64〕 $Y^2$ が、水素原子、又はハロゲンである前記〔60〕～〔63〕のいずれか1つに記載のN-アルキニルオキシアミド化合物又はその塩。

[0170] 〔65〕 $Y^2$ が、水素原子、又はフッ素原子である〔60〕～〔63〕のいずれか1つに記載のN-アルキニルオキシアミド化合物又はその塩。

〔66〕 $Y^3$ が、水素原子、又はハロゲンである前記〔60〕～〔65〕のいずれか1つに記載のN-アルキニルオキシアミド化合物又はその塩。

〔67〕 $Y^3$ が、水素原子、又はフッ素原子である前記〔60〕～〔65〕のいずれか1つに記載のN-アルキニルオキシアミド化合物又はその塩。

〔68〕 $Y^4$ が、水素原子、又はハロゲンである前記〔60〕～〔67〕のいずれか1つに記載のN-アルキニルオキシアミド化合物又はその塩。

〔69〕 $Y^4$ が、水素原子、又はフッ素原子である前記〔60〕～〔67〕のいずれか1つに記載のN-アルキニルオキシアミド化合物又はその塩。

〔70〕 $X^1$ が、フッ素原子、塩素原子、又は臭素原子である前記〔60〕～〔69〕のいずれか1つに記載のN-アルキニルオキシアミド化合物又はその塩。

[0171] 〔71〕前記〔1〕～〔70〕のいずれか1つに記載の化合物又はその塩を有効成分として含有する農園芸用殺菌剤。

〔72〕前記〔1〕～〔70〕のいずれか1つに記載の化合物又はその塩の有効量を、植物体、植物病原菌又は土壤に施用し、有害な植物病害を防除する方法。

## 実施例 1

[0172] 次に本発明の実施例を記載するが、本発明はこれらに限定されるものではない。本発明化合物の物性値である融点は、B u c h i M-565で測定した。 $^1H$ -NMRスペクトルデータは、測定溶媒中で、J E O L J N M - E C X (500MHz)又はB r u k e r A V A N C E I I I H D (300MHz)にて測定した( $^1H$ -核磁気共鳴分光法)。なお、測定溶媒は内部標準としてテトラメチルシラン(TMS)を含む場合もある。

また、本明細書において、室温は10～30℃程度を意味する。

## [0173] [合成例]

合成例 1 : 2-アミノ-4-ブロモ-N-(2-クロロベンジル)-N-メトキシチアゾール-5-カルボキサミド (化合物 No. A-94) の合成

(1) 2-クロロベンジルブロミド (543 mg)、及びO-メチルヒドロキシルアミン塩酸塩 (662 mg) をN, N-ジメチルホルムアミド (10 mL) に混合し、得られた混合物へジイソプロピルエチルアミン (2.31 mL) を室温に加え、50℃にて5時間攪拌した。室温へ放冷後、反応溶液に水を加えてクエンチした。クエンチした反応溶液に酢酸エチル、及びヘプタンを順次加え、水層を酢酸エチル-ヘプタン混合溶液を用いて抽出した。抽出により得られた有機層を水及び飽和食塩水で順次洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥、ろ過した後、減圧下濃縮した。得られた残渣をカラムクロマトグラフィー (溶離液: 酢酸エチル/ヘプタン) で精製して、油状のN-(2-クロロベンジル)-O-メチルヒドロキシルアミン (266 mg) を得た。このものの<sup>1</sup>H-NMRスペクトラムデータは以下の通りである。

<sup>1</sup>H NMR (CDCl<sub>3</sub>/300MHz): δ (ppm) = 7.42-7.36 (m, 2H), 7.27-7.22 (m, 2H), 5.91 (brs, 1H), 4.18 (s, 2H), 3.54 (s, 3H).

[0174] (2) 国際公開公報2012/008999号の56頁に記載のExample 18、Step Fに基づき合成したtert-ブチル(4-ブロモ-5-ホルミルチアゾール-2-イル)カーバメート (9.7 g) のtert-ブタノール (310 mL) 溶液にリン酸二水素ナトリウム (11.3 g) の水溶液 (20 mL) を室温に加え、攪拌し混合物を得た。得られた混合物に2-メチル-2-ブテン (43 mL) を加えた。15分後、亜塩素酸ナトリウム (21.4 g、80%) の水溶液 (50 mL) を加え、3.5時間攪拌した。反応溶液に塩酸を加え酸性とし、さらに酢酸エチルを加え抽出した。抽出した有機層を水及び飽和食塩水で順次洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥、ろ過した後、減圧下濃縮した。得られた固体を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液に溶解させ、水層を酢酸エチルで洗浄した。酢酸エチルで洗浄した水層に塩酸を加え酸性に調節した。酸性に調節した水層に酢酸エチルを加え、

水層を酢酸エチルで抽出した。抽出により得られた有機層を水及び飽和食塩水で順次洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥、ろ過した後、減圧下濃縮し、白色固体の2-[(tert-ブトキシカルボニル)アミノ]-4-ブロモチアゾール-5-カルボン酸(9.2g)を得た。このものの<sup>1</sup>H-NMRスペクトラムデータは以下の通りである。

<sup>1</sup>H NMR (DMSO-d<sub>6</sub>/300MHz): δ (ppm)= 13.36 (brs, 1H), 12.18 (s, 1H), 1.49 (s, 9H).

[0175] (3) 2-[(tert-ブトキシカルボニル)アミノ]-4-ブロモチアゾール-5-カルボン酸(339mg)のテトラヒドロフラン(10mL)溶液に、氷冷下、塩化オキサリル(166mg)、触媒量のN,N-ジメチルホルムアミドを加えて、窒素雰囲気下で撹拌した。10分後室温に昇温し、さらに40分撹拌した。反応溶液を減圧下濃縮し、2-[(tert-ブトキシカルボニル)アミノ]-4-ブロモチアゾール-5-カルボン酸クロリドを得た。得られた酸クロリドにテトラヒドロフラン(5mL)を加えて溶解させ、次に、N-(2-クロロベンジル)-O-メチルヒドロキシルアミン(150mg)のテトラヒドロフラン(5mL)溶液、及びジイソプロピルエチルアミン(0.31mL)を室温で順次加え、50℃で1時間45分撹拌した。室温へ放冷後、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を用いて反応溶液をクエンチした。クエンチした反応溶液に酢酸エチルを加え、水層を酢酸エチルを用いて抽出した。抽出により得られた有機層を水、及び飽和食塩水で順次洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥、ろ過した後、減圧下濃縮した。得られた残渣をカラムクロマトグラフィー(溶離液:酢酸エチル/ヘプタン)で精製して、非晶質のtert-ブチル{4-ブロモ-5-[(2-クロロベンジル)(メトキシ)カルバモイル]チアゾール-2-イル}カーバメート(376mg)を得た。このものの<sup>1</sup>H-NMRスペクトラムデータは以下の通りである。

<sup>1</sup>H NMR (DMSO-d<sub>6</sub>/300MHz): δ (ppm)= 12.12 (brs, 1H), 7.51-7.49 (m, 1H), 7.37-7.35 (m, 3H), 5.02 (s, 2H), 3.67 (s, 3H), 1.48 (s, 9H).

[0176] (4) *tert*-ブチル {4-ブロモ-5-[(2-クロロベンジル) (メトキシ) カルバモイル] チアゾール-2-イル} カーバメート (376 mg) のジクロロメタン (6 mL) 溶液にトリフルオロ酢酸 (1.2 mL) を加え、加熱還流下で一晩攪拌した。室温へ放冷後、反応溶液に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液をゆっくり加え、反応溶液を塩基性に調節した。塩基性に調節した反応溶液の水層を酢酸エチルを用いて抽出した。抽出により得られた有機層を水、及び飽和食塩水で順次洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥、ろ過した後、減圧下濃縮した。得られた残渣をカラムクロマトグラフィー (溶離液: 酢酸エチル/ヘプタン) で精製して、固体の目的物 (208 mg) を得た。このものの<sup>1</sup>H-NMR スペクトラムデータと融点は以下の通りである。

<sup>1</sup>H NMR (DMSO-d<sub>6</sub>/300MHz): δ (ppm) = 7.96 (brs, 2H), 7.49–7.46 (m, 1H), 7.36–7.29 (m, 3H), 4.96 (s, 2H), 3.65 (s, 3H).

融点: 184.8°C

[0177] 合成例 2: 2-アミノ-4-ブロモ-N-(4-フルオロ-2-メチルベンジル)-N-メトキシチアゾール-5-カルボキサミド (化合物 No. A-105) の合成

(1) O-メチルヒドロキシルアミン塩酸塩 (302 mg) のメタノール (4 mL) 溶液に、トリエチルアミン (0.5 mL) を 0°C で加え、攪拌し混合物を得た。得られた混合物に 4-フルオロ-2-メチルベンズアルデヒド (500 mg) のメタノール (6 mL) 溶液、及び酢酸 (1 mL) を順次加え、30 分後に室温へ昇温した。3.5 時間後、0°C にて 2-ピコリンボラン (774 mg) を加え、さらに 15 分後、3 N 塩酸水溶液 (6 mL) を加え、2.5 時間攪拌し反応溶液を得た。飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を前記反応溶液に加え塩基性に調節した後、メタノールを留去した。残渣に酢酸エチルを加え、抽出した。抽出により得られた有機層を水、及び飽和食塩水で順次洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥、ろ過した後、減圧下濃縮した。得られた残渣をカラムクロマトグラフィー (溶離液: 酢酸エチル/ヘプタン)

）で精製して、油状のN-（4-フルオロ-2-メチルベンジル）-O-メチルヒドロキシルアミン（392mg）を得た。このものの<sup>1</sup>H-NMRスペクトラムデータは以下の通りである。

<sup>1</sup>H NMR (CDCl<sub>3</sub>/300MHz): δ (ppm)= 7.26-7.21 (m, 1H), 6.90-6.82 (m, 2H), 5.59 (brs, 1H), 4.03 (s, 2H), 2.35 (s, 3H), 2.39 (s, 3H).

[0178] (2) 2-[(tert-ブトキシカルボニル)アミノ]-4-ブロモチアゾール-5-カルボン酸（339mg）のテトラヒドロフラン（10mL）溶液に、氷冷下、塩化オキサリル（0.11mL）、触媒量のN,N-ジメチルホルムアミドを加えて、窒素雰囲気下で攪拌した。10分後室温に昇温し、さらに40分攪拌した。反応溶液を減圧下濃縮し、2-[(tert-ブトキシカルボニル)アミノ]-4-ブロモチアゾール-5-カルボン酸クロリドを得た。得られた酸クロリドにテトラヒドロフラン（5mL）を加えて溶解させ、次に、N-（4-フルオロ-2-メチルベンジル）-O-メチルヒドロキシルアミン（148mg）のテトラヒドロフラン（5mL）溶液、ジイソプロピルエチルアミン（0.31mL）を室温に加え、50℃で1時間45分攪拌した。室温へ放冷後、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を用いて反応溶液をクエンチした。クエンチした反応溶液に酢酸エチルを加え、水層を酢酸エチルを用いて抽出した。抽出により得られた有機層を水、及び飽和食塩水で順次洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥、ろ過した後、減圧下濃縮した。得られた残渣をカラムクロマトグラフィー（溶離液：酢酸エチル／ヘプタン）で精製して、非晶質のtert-ブチル{4-ブロモ-5-[(4-フルオロ-2-メチルベンジル)(メトキシ)カルバモイル]チアゾール-2-イル}カーバメート（370mg）を得た。このものの<sup>1</sup>H-NMRスペクトラムデータは以下の通りである。

<sup>1</sup>H NMR (DMSO-d<sub>6</sub>/300MHz): δ (ppm)= 12.10 (brs, 1H), 7.24 (dd, 1H), 7.10-6.99 (m, 2H), 4.90 (s, 2H), 3.62 (s, 3H), 2.31 (s, 3H), 1.48 (s, 9H).

[0179] (3) tert-ブチル{4-ブロモ-5-[(4-フルオロ-2-メチルベンジル)(メトキシ)カルバモイル]チアゾール-2-イル}カーバメー

ト (370 mg) のジクロロメタン (6 mL) 溶液にトリフルオロ酢酸 (1.2 mL) を加え、加熱還流下で一晩攪拌した。室温へ放冷後、反応溶液に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液をゆっくり加え、反応溶液を塩基性に調節した。塩基性に調節した反応溶液の水層を酢酸エチルを用いて抽出した。抽出により得られた有機層を水、及び飽和食塩水で順次洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥、ろ過した後、減圧下濃縮した。得られた残渣をカラムクロマトグラフィー (溶離液: 酢酸エチル/ヘプタン) で精製して、固体の目的物 (262 mg) を得た。このものの<sup>1</sup>H-NMRスペクトラムデータと融点は以下の通りである。

<sup>1</sup>H NMR (DMSO-d<sub>6</sub>/300MHz): δ (ppm)= 7.93 (brs, 2H), 7.21 (dd, 1H), 7.08–6.97 (m, 2H), 4.84 (s, 2H), 3.59 (s, 3H), 2.29 (s, 3H).

融点: 164.0°C

[0180] 合成例3: 2-アミノ-4-クロロ-N-(2-フルオロベンジル)-N-(2-プロピニルオキシ)チアゾール-5-カルボキサミド (化合物No. B-55) の合成

(1) 2-フルオロベンジルブロミド (500 mg)、及び米国特許出願公開第2014/0378399号の16頁に記載のSynthetic Example 1-2に基づき合成したO-2-プロピニルヒドロキシルアミン塩酸塩 (754 mg) をN,N-ジメチルホルムアミド (10 mL) に混合し、得られた混合物ヘジイソプロピルエチルアミン (2.31 mL) を室温に加え、50°Cにて5時間攪拌した。室温へ放冷後、反応溶液に水を加えてクエンチした。クエンチした反応溶液に酢酸エチル及びヘプタンを順次加えて、反応溶液の水層を酢酸エチル-ヘプタン混合溶液を用いて抽出した。抽出により得られた有機層を水及び飽和食塩水で順次洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥、ろ過した後、減圧下濃縮した。得られた残渣をカラムクロマトグラフィー (溶離液: 酢酸エチル/ヘプタン) で精製して、油状のN-(2-フルオロベンジル)-O-(2-プロピニル)ヒドロキシルアミン (69 mg) を得た。このものの<sup>1</sup>H-NMRスペクトラムデータは以下の通りで

ある。

$^1\text{H}$  NMR ( $\text{CDCl}_3/300\text{MHz}$ ):  $\delta$  (ppm) = 7.38 (dt, 1H), 7.31–7.24 (m, 1H), 7.11 (dt, 1H), 7.08–7.02 (m, 1H), 6.02 (t, 1H), 4.29 (d, 2H), 4.18 (d, 2H), 2.41 (t, 1H).

[0181] (2) Bioorganic & Medicinal Chemistry、2004、12、6171–6182の6177頁に記載のExperimental 5. 1. 10に基づき合成した2-[(tert-ブトキシカルボニル)アミノ]-4-クロロチアゾール-5-カルボン酸(128mg)のテトラヒドロフラン(5mL)溶液に、氷冷下、塩化オキサリル(0.05mL)、触媒量のN,N-ジメチルホルムアミドを加えて、窒素雰囲気下で攪拌した。10分後室温に昇温し、さらに1時間攪拌した。反応溶液を減圧下濃縮し、2-[(tert-ブトキシカルボニル)アミノ]-4-クロロチアゾール-5-カルボン酸クロリドを得た。得られた酸クロリドにテトラヒドロフラン(2mL)を加えて溶解させ、次に、N-(2-フルオロベンジル)-O-2-プロピニルヒドロキシルアミン(69mg)のテトラヒドロフラン(3mL)溶液及びジイソプロピルエチルアミン(0.13mL)を室温で順次加え、50℃で2時間攪拌した。室温へ放冷後、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を用いて反応溶液をクエンチした。クエンチした反応溶液に酢酸エチルを加え、水層を酢酸エチルを用いて抽出した。抽出により得られた有機層を水及び飽和食塩水で順次洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥、ろ過した後、減圧下濃縮した。得られた残渣をカラムクロマトグラフィー(溶離液: 酢酸エチル/ヘプタン)で精製して、非晶質のtert-ブチル{4-クロロ-5-[(2-フルオロベンジル)(2-プロピニルオキシ)カルバモイル]チアゾール-2-イル}カーバメート(87mg)を得た。このものの $^1\text{H}$ -NMRスペクトラムデータは以下の通りである。

$^1\text{H}$  NMR ( $\text{DMSO}-d_6/300\text{MHz}$ ):  $\delta$  (ppm) = 12.09 (brs, 1H), 7.41–7.33 (m, 2H), 7.25–7.18 (m, 2H), 5.03 (s, 2H), 4.71 (d, 2H), 3.66 (t, 1H), 1.48 (s, 9H).

[0182] (3) *tert*-ブチル {4-クロロ-5-[ (2-フルオロベンジル) (2-プロピニルオキシ) カルバモイル] チアゾール-2-イル} カーバメート (87 mg) のジクロロメタン (1.5 mL) 溶液にトリフルオロ酢酸 (0.3 mL) を加え、加熱還流下で一晩攪拌した。室温へ放冷後、反応溶液に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液をゆっくり加え、前記反応溶液を塩基性に調節した。塩基性に調節した反応溶液の水層を酢酸エチルを用いて抽出した。抽出により得られた有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥、ろ過した後、減圧下濃縮した。得られた残渣をカラムクロマトグラフィー (溶離液: 酢酸エチル/ヘプタン) で精製して、固体の目的物 (55 mg) を得た。このものの<sup>1</sup>H-NMRスペクトラムデータと融点は以下の通りである。

<sup>1</sup>H NMR (DMSO-d<sub>6</sub>/300MHz): δ (ppm) = 7.98 (brs, 2H), 7.40–7.29 (m, 2H), 7.23–7.16 (m, 2H), 4.97 (s, 2H), 4.64 (d, 2H), 3.68 (t, 1H).

融点: 154.1°C

[0183] 合成例4: 2-アミノ-4-クロロ-N-(2,4-ジフルオロベンジル)-N-(2-プロピニルオキシ) チアゾール-5-カルボキサミド (化合物 No. B-57) の合成

(1) O-2-プロピニルヒドロキシルアミン塩酸塩 (389 mg) のメタノール (4 mL) 溶液に、トリエチルアミン (0.5 mL) を0°Cで加え、攪拌し混合物を得た。得られた混合物に、2,4-ジフルオロベンズアルデヒド (514 mg) のメタノール (6 mL) 溶液及び酢酸 (1 mL) を順次加え、30分後に室温へ昇温した。3.5時間後、0°Cに冷却して2-ピコリンボラン (967 mg) を加え、さらに15分後、3N塩酸水溶液 (7.2 mL) を加え、3時間攪拌し反応溶液を得た。飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を前記反応溶液に加え塩基性とした後、メタノールを留去した。残渣に酢酸エチルを加え、抽出した。抽出により得られた有機層を水及び飽和食塩水で順次洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥、ろ過した後、減圧下濃縮した。得られた残渣をカラムクロマトグラフィー (溶離液: 酢酸エチル/ヘプタ

ン)で精製して、油状のN-(2,4-ジフルオロベンジル)-O-2-プロピニルヒドロキシルアミン(471mg)を得た。このものの<sup>1</sup>H-NMRスペクトラムデータは以下の通りである。

<sup>1</sup>H NMR (CDCl<sub>3</sub>/300MHz): δ (ppm)= 7.40-7.32 (m, 1H), 6.89-6.77 (m, 2H), 5.96 (t, 1H), 4.27 (d, 2H), 4.13 (d, 2H), 2.41 (t, 1H).

[0184] (2) 2-[(tert-ブトキシカルボニル)アミノ]-4-クロロチアゾール-5-カルボン酸(291mg)のテトラヒドロフラン(10mL)溶液に、氷冷下、塩化オキサリル(0.11mL)、触媒量のN,N-ジメチルホルムアミドを加えて、窒素雰囲気下で攪拌した。10分後室温に昇温し、さらに1時間攪拌した。反応溶液を減圧下濃縮し、2-[(tert-ブトキシカルボニル)アミノ]-4-クロロチアゾール-5-カルボン酸クロリドを得た。得られた酸クロリドにテトラヒドロフラン(5mL)を加えて溶解させ、次に、N-(2,4-ジフルオロベンジル)-O-2-プロピニルヒドロキシルアミン(172mg)のテトラヒドロフラン(5mL)溶液、及びジイソプロピルエチルアミン(0.30mL)を室温で順次加え、50℃で2時間攪拌した。室温へ放冷後、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を用いて反応溶液をクエンチした。クエンチした反応溶液に酢酸エチルを加え、水層を酢酸エチルを用いて抽出した。抽出により得られた有機層を水及び飽和食塩水で順次洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥、ろ過した後、減圧下濃縮した。得られた残渣をカラムクロマトグラフィー(溶離液: 酢酸エチル/ヘプタン)で精製して、非晶質のtert-ブチル{4-クロロ-5-[(2,4-ジフルオロベンジル)(2-プロピニルオキシ)カルバモイル]チアゾール-2-イル}カーバメート(204mg)を得た。このものの<sup>1</sup>H-NMRスペクトラムデータは以下の通りである。

<sup>1</sup>H NMR (DMSO-d<sub>6</sub>/300MHz): δ (ppm)= 12.09 (brs, 1H), 7.46-7.38 (m, 1H), 7.31-7.24 (m, 1H), 7.14-7.08 (m, 1H), 5.00 (s, 2H), 4.71 (d, 2H), 3.66 (t, 1H), 1.48 (s, 9H).

[0185] (3) tert-ブチル{4-クロロ-5-[(2,4-ジフルオロベンジ

ル) (2-プロピニルオキシ)カルバモイル]チアゾール-2-イル}カーバメート(204 mg)のジクロロメタン(3.5 mL)溶液にトリフルオロ酢酸(0.69 mL)を加え、加熱還流下で一晩攪拌した。室温へ放冷後、反応溶液に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液をゆっくり加え、前記反応溶液を塩基性に調節した。塩基性に調節した反応溶液の水層を酢酸エチルを用いて抽出した。抽出により得られた有機層を水、及び飽和食塩水で順次洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥、ろ過した後、減圧下濃縮した。得られた残渣をカラムクロマトグラフィー(溶離液:酢酸エチル/ヘプタン)で精製して、固体の目的物(132 mg)を得た。このものの<sup>1</sup>H-NMRスペクトラムデータと融点は以下の通りである。

<sup>1</sup>H NMR (DMSO-d<sub>6</sub>/300MHz): δ (ppm)= 7.98 (brs, 2H), 7.42-7.34 (m, 1H), 7.30-7.22 (m, 1H), 7.13-7.06 (m, 1H), 4.93 (s, 2H), 4.64 (d, 2H), 3.68 (t, 1H).

融点: 171.5°C

[0186] 次に、化合物(1)の代表例を第1-1表及び第1-2表に具体的に挙げる。これらの化合物は前記製造方法及び前記合成例、並びに本技術分野において公知の方法に基づいて合成することができる。

表中、No.は化合物No.を示す。第1-1表及び第1-2表中のR<sup>1</sup>、Y<sup>1</sup>、Y<sup>2</sup>、Y<sup>3</sup>、Y<sup>4</sup>、及びY<sup>5</sup>欄で用いた略語は、各々以下の置換基を示す。Meはメチル基、Etはエチル基、n-Prはノルマルプロピル基、i-Prはイソプロピル基、c-Prはシクロプロピル基、t-Buはターシャリーブチル基、c-Buはシクロブチル基、CNはシアノ基、及びNO<sub>2</sub>はニトロ基である。第1-1表中では、=は二重結合を示す。

[0187] また、化合物(1)の塩である場合は、第1-1表及び第1-2表中の備考欄にその塩の種類を示す。例えば、第1-1表中の備考欄に、HCl塩と記載した化合物は塩酸塩、TsOH塩と記載した化合物はパラトルエンスルホン酸塩、Na塩と記載した化合物はナトリウム塩である。例えば化合物No. A-125は化合物No. A-20の塩酸塩である。化合物No. A-

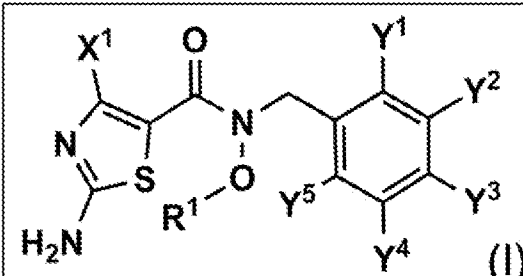
126は化合物No. A-20のパラトルエンスルホン酸塩である。化合物No. A-127は化合物No. A-20のナトリウム塩である。

[0188] 第1-2表中の備考欄に、HCl塩と記載した化合物は塩酸塩、TsOH塩と記載した化合物はパラトルエンスルホン酸塩、Na塩と記載した化合物はナトリウム塩である。例えば化合物No. B-52は化合物No. B-2の塩酸塩である。化合物No. B-53は化合物No. B-2のパラトルエンスルホン酸塩である。化合物No. B-54は化合物No. B-2のナトリウム塩である。

[0189]

[表1]

第 1 − 1 表

| <div><div>(I)</div></div> |                |                |                  |                |                |                |                |    |
|------------------------------------------------------------------------------------------------------------|----------------|----------------|------------------|----------------|----------------|----------------|----------------|----|
| No.                                                                                                        | R <sup>1</sup> | X <sup>1</sup> | Y <sup>1</sup>   | Y <sup>2</sup> | Y <sup>3</sup> | Y <sup>4</sup> | Y <sup>5</sup> | 備考 |
| A-1                                                                                                        | Me             | Cl             | Cl               | H              | F              | F              | H              |    |
| A-2                                                                                                        | Me             | Br             | Cl               | H              | F              | F              | H              |    |
| A-3                                                                                                        | Me             | I              | Cl               | H              | F              | F              | H              |    |
| A-4                                                                                                        | Me             | F              | Cl               | H              | F              | F              | H              |    |
| A-5                                                                                                        | Et             | Cl             | Cl               | H              | F              | F              | H              |    |
| A-6                                                                                                        | Me             | Cl             | Br               | H              | F              | H              | H              |    |
| A-7                                                                                                        | Et             | Cl             | Br               | H              | F              | H              | H              |    |
| A-8                                                                                                        | n-Pr           | Cl             | Cl               | H              | F              | F              | H              |    |
| A-9                                                                                                        | n-Pr           | Cl             | Br               | H              | F              | H              | H              |    |
| A-10                                                                                                       | Me             | Cl             | Cl               | H              | F              | H              | H              |    |
| A-11                                                                                                       | Me             | Cl             | F                | H              | F              | H              | H              |    |
| A-12                                                                                                       | Me             | Cl             | Me               | H              | F              | H              | H              |    |
| A-13                                                                                                       | Me             | Cl             | F                | H              | F              | F              | H              |    |
| A-14                                                                                                       | Me             | Cl             | Br               | H              | F              | F              | H              |    |
| A-15                                                                                                       | Me             | Cl             | CF <sub>3</sub>  | H              | F              | H              | H              |    |
| A-16                                                                                                       | Me             | Cl             | CHF <sub>2</sub> | H              | F              | H              | H              |    |
| A-17                                                                                                       | Me             | Cl             | NO <sub>2</sub>  | H              | F              | H              | H              |    |
| A-18                                                                                                       | Me             | Cl             | NO <sub>2</sub>  | H              | F              | F              | H              |    |
| A-19                                                                                                       | Me             | Cl             | Me               | H              | F              | F              | H              |    |
| A-20                                                                                                       | Me             | Cl             | Cl               | H              | H              | H              | H              |    |
| A-21                                                                                                       | Me             | Cl             | Cl               | F              | H              | H              | H              |    |
| A-22                                                                                                       | Me             | Cl             | Cl               | H              | H              | F              | H              |    |
| A-23                                                                                                       | Me             | Cl             | Cl               | F              | F              | H              | H              |    |
| A-24                                                                                                       | Et             | Cl             | Cl               | H              | H              | H              | H              |    |
| A-25                                                                                                       | Et             | Cl             | Cl               | F              | H              | H              | H              |    |
| A-26                                                                                                       | Et             | Cl             | Cl               | H              | F              | H              | H              |    |
| A-27                                                                                                       | Et             | Cl             | Cl               | H              | H              | F              | H              |    |
| A-28                                                                                                       | Et             | Cl             | Cl               | F              | F              | H              | H              |    |
| A-29                                                                                                       | Me             | Cl             | F                | H              | H              | H              | H              |    |
| A-30                                                                                                       | Et             | Cl             | F                | H              | H              | H              | H              |    |

[0190]

[表2]

第1-1表 (続き)

| No.  | R <sup>1</sup> | X <sup>1</sup> | Y <sup>1</sup> | Y <sup>2</sup> | Y <sup>3</sup> | Y <sup>4</sup> | Y <sup>5</sup> | 備考 |
|------|----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|----|
| A-31 | Me             | Cl             | F              | F              | H              | H              | H              |    |
| A-32 | Et             | Cl             | F              | F              | H              | H              | H              |    |
| A-33 | Et             | Cl             | F              | H              | F              | H              | H              |    |
| A-34 | Me             | Cl             | F              | H              | H              | F              | H              |    |
| A-35 | Et             | Cl             | F              | H              | H              | F              | H              |    |
| A-36 | Me             | Cl             | F              | F              | F              | H              | H              |    |
| A-37 | Et             | Cl             | F              | F              | F              | H              | H              |    |
| A-38 | Me             | Cl             | F              | F              | H              | F              | H              |    |
| A-39 | Et             | Cl             | F              | F              | H              | F              | H              |    |
| A-40 | Et             | Cl             | F              | H              | F              | F              | H              |    |
| A-41 | Me             | Cl             | F              | F              | F              | F              | H              |    |
| A-42 | Et             | Cl             | F              | F              | F              | F              | H              |    |
| A-43 | Me             | Cl             | Me             | H              | H              | H              | H              |    |
| A-44 | Et             | Cl             | Me             | H              | H              | H              | H              |    |
| A-45 | Me             | Cl             | Me             | F              | H              | H              | H              |    |
| A-46 | Et             | Cl             | Me             | F              | H              | H              | H              |    |
| A-47 | Et             | Cl             | Me             | H              | F              | H              | H              |    |
| A-48 | Me             | Cl             | Me             | H              | H              | F              | H              |    |
| A-49 | Et             | Cl             | Me             | H              | H              | F              | H              |    |
| A-50 | Me             | Cl             | Me             | F              | F              | H              | H              |    |
| A-51 | Et             | Cl             | Me             | F              | F              | H              | H              |    |
| A-52 | Me             | Cl             | Me             | F              | H              | F              | H              |    |
| A-53 | Et             | Cl             | Me             | F              | H              | F              | H              |    |
| A-54 | Et             | Cl             | Me             | H              | F              | F              | H              |    |
| A-55 | Me             | Cl             | CN             | H              | H              | H              | H              |    |
| A-56 | Et             | Cl             | CN             | H              | H              | H              | H              |    |
| A-57 | Me             | Cl             | CN             | F              | H              | H              | H              |    |
| A-58 | Me             | Cl             | CN             | H              | F              | H              | H              |    |
| A-59 | Me             | Cl             | CN             | H              | H              | F              | H              |    |
| A-60 | Me             | Cl             | CN             | H              | F              | F              | H              |    |

[0191]

[表3]

第1-1表 (続き)

| No.  | R <sup>1</sup> | X <sup>1</sup> | Y <sup>1</sup>  | Y <sup>2</sup> | Y <sup>3</sup> | Y <sup>4</sup> | Y <sup>5</sup> | 備考 |
|------|----------------|----------------|-----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|----|
| A-61 | Et             | Cl             | CN              | F              | H              | H              | H              |    |
| A-62 | Et             | Cl             | CN              | H              | F              | H              | H              |    |
| A-63 | Et             | Cl             | CN              | H              | H              | F              | H              |    |
| A-64 | Et             | Cl             | CN              | H              | F              | F              | H              |    |
| A-65 | Me             | Cl             | Br              | H              | H              | H              | H              |    |
| A-66 | Et             | Cl             | Br              | H              | H              | H              | H              |    |
| A-67 | Me             | Cl             | Br              | F              | H              | H              | H              |    |
| A-68 | Et             | Cl             | Br              | F              | H              | H              | H              |    |
| A-69 | Me             | Cl             | Br              | H              | H              | F              | H              |    |
| A-70 | Et             | Cl             | Br              | H              | H              | F              | H              |    |
| A-71 | Me             | Cl             | Br              | F              | F              | H              | H              |    |
| A-72 | Et             | Cl             | Br              | F              | F              | H              | H              |    |
| A-73 | Me             | Cl             | Br              | F              | H              | F              | H              |    |
| A-74 | Et             | Cl             | Br              | F              | H              | F              | H              |    |
| A-75 | Et             | Cl             | Br              | H              | F              | F              | H              |    |
| A-76 | Me             | Cl             | H               | Cl             | H              | H              | H              |    |
| A-77 | Me             | Cl             | H               | H              | Cl             | H              | H              |    |
| A-78 | Me             | Cl             | H               | F              | H              | H              | H              |    |
| A-79 | Me             | Cl             | H               | H              | F              | H              | H              |    |
| A-80 | Me             | F              | I               | H              | F              | F              | H              |    |
| A-81 | Me             | F              | I               | F              | H              | F              | H              |    |
| A-82 | Me             | Cl             | CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              |    |
| A-83 | Me             | Cl             | CF <sub>3</sub> | F              | H              | H              | H              |    |
| A-84 | Me             | Cl             | CF <sub>3</sub> | H              | H              | F              | H              |    |
| A-85 | Me             | Cl             | CF <sub>3</sub> | H              | F              | F              | H              |    |
| A-86 | Me             | Cl             | NO <sub>2</sub> | H              | H              | H              | H              |    |
| A-87 | Me             | Cl             | NO <sub>2</sub> | F              | H              | H              | H              |    |
| A-88 | Me             | Cl             | NO <sub>2</sub> | H              | H              | F              | H              |    |
| A-89 | Me             | Cl             | NO <sub>2</sub> | F              | H              | F              | H              |    |
| A-90 | n-Pr           | Cl             | Cl              | H              | F              | H              | H              |    |

[0192]

[表4]

第1-1表 (続き)

| No.   | R <sup>1</sup> | X <sup>1</sup> | Y <sup>1</sup>   | Y <sup>2</sup> | Y <sup>3</sup> | Y <sup>4</sup> | Y <sup>5</sup> | 備考 |
|-------|----------------|----------------|------------------|----------------|----------------|----------------|----------------|----|
| A-91  | Me             | Cl             | H                | F              | H              | F              | H              |    |
| A-92  | Me             | Cl             | H                | F              | F              | H              | H              |    |
| A-93  | Me             | Cl             | H                | F              | F              | F              | H              |    |
| A-94  | Me             | Br             | Cl               | H              | H              | H              | H              |    |
| A-95  | Me             | Br             | Cl               | H              | F              | H              | H              |    |
| A-96  | Me             | Br             | Cl               | F              | H              | H              | H              |    |
| A-97  | Me             | Br             | Cl               | H              | H              | F              | H              |    |
| A-98  | Me             | Br             | Br               | H              | H              | H              | H              |    |
| A-99  | Me             | Br             | Br               | H              | F              | H              | H              |    |
| A-100 | Me             | Br             | Br               | H              | F              | F              | H              |    |
| A-101 | Me             | Cl             | CHF <sub>2</sub> | H              | F              | F              | H              |    |
| A-102 | Me             | Br             | Cl               | F              | F              | H              | H              |    |
| A-103 | Me             | Br             | Cl               | F              | H              | F              | H              |    |
| A-104 | Me             | Br             | Me               | H              | H              | H              | H              |    |
| A-105 | Me             | Br             | Me               | H              | F              | H              | H              |    |
| A-106 | Me             | Br             | Me               | H              | F              | F              | H              |    |
| A-107 | Me             | Br             | CN               | H              | H              | H              | H              |    |
| A-108 | Me             | Br             | CN               | H              | F              | H              | H              |    |
| A-109 | Me             | Br             | CN               | H              | F              | F              | H              |    |
| A-110 | Me             | Br             | NO <sub>2</sub>  | H              | H              | H              | H              |    |
| A-111 | Me             | Br             | NO <sub>2</sub>  | H              | F              | H              | H              |    |
| A-112 | Me             | Br             | NO <sub>2</sub>  | H              | F              | F              | H              |    |
| A-113 | Me             | Cl             | Cl               | F              | H              | F              | H              |    |
| A-114 | Et             | Cl             | Cl               | F              | H              | F              | H              |    |
| A-115 | Me             | F              | Cl               | H              | H              | H              | H              |    |
| A-116 | Me             | F              | Cl               | H              | F              | H              | H              |    |
| A-117 | Me             | F              | Cl               | F              | H              | H              | H              |    |
| A-118 | Me             | F              | Cl               | H              | H              | F              | H              |    |
| A-119 | Me             | F              | Br               | H              | F              | H              | H              |    |
| A-120 | Me             | F              | Me               | H              | F              | H              | H              |    |

[0193]

[表5]

第1-1表 (続き)

| No.   | R <sup>1</sup> | X <sup>1</sup> | Y <sup>1</sup>  | Y <sup>2</sup> | Y <sup>3</sup> | Y <sup>4</sup> | Y <sup>5</sup> | 備考    |
|-------|----------------|----------------|-----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|-------|
| A-121 | Me             | F              | CN              | H              | F              | H              | H              |       |
| A-122 | Me             | F              | NO <sub>2</sub> | H              | F              | H              | H              |       |
| A-123 | <i>o</i> -Pr   | Cl             | Cl              | H              | F              | H              | H              |       |
| A-124 | <i>o</i> -Pr   | Cl             | Cl              | H              | F              | F              | H              |       |
| A-125 | Me             | Cl             | Cl              | H              | H              | H              | H              | HCl塩  |
| A-126 | Me             | Cl             | Cl              | H              | H              | H              | H              | TsOH塩 |
| A-127 | Me             | Cl             | Cl              | H              | H              | H              | H              | Na塩   |
| A-128 | Me             | F              | Br              | H              | H              | H              | H              |       |
| A-129 | Me             | F              | Me              | H              | H              | H              | H              |       |
| A-130 | Me             | F              | CN              | H              | H              | H              | H              |       |
| A-131 | Me             | F              | NO <sub>2</sub> | H              | H              | H              | H              |       |
| A-132 | Me             | F              | Br              | H              | F              | F              | H              |       |
| A-133 | Me             | F              | Me              | H              | F              | F              | H              |       |
| A-134 | Me             | F              | CN              | H              | F              | F              | H              |       |
| A-135 | Me             | F              | NO <sub>2</sub> | H              | F              | F              | H              |       |
| A-136 | <i>i</i> -Pr   | Cl             | Cl              | H              | H              | H              | H              |       |
| A-137 | <i>i</i> -Pr   | Cl             | Cl              | F              | H              | H              | H              |       |
| A-138 | <i>i</i> -Pr   | Cl             | Cl              | H              | F              | H              | H              |       |
| A-139 | <i>i</i> -Pr   | Cl             | Cl              | H              | H              | F              | H              |       |
| A-140 | <i>i</i> -Pr   | Cl             | Cl              | H              | F              | F              | H              |       |
| A-141 | <i>i</i> -Pr   | Cl             | Cl              | F              | F              | H              | H              |       |
| A-142 | <i>i</i> -Pr   | Cl             | Cl              | F              | H              | F              | H              |       |
| A-143 | <i>t</i> -Bu   | Cl             | Cl              | H              | H              | H              | H              |       |
| A-144 | <i>t</i> -Bu   | Cl             | Cl              | F              | H              | H              | H              |       |
| A-145 | <i>t</i> -Bu   | Cl             | Cl              | H              | F              | H              | H              |       |
| A-146 | <i>t</i> -Bu   | Cl             | Cl              | H              | H              | F              | H              |       |
| A-147 | <i>t</i> -Bu   | Cl             | Cl              | H              | F              | F              | H              |       |
| A-148 | <i>t</i> -Bu   | Cl             | Cl              | F              | F              | H              | H              |       |
| A-149 | <i>t</i> -Bu   | Cl             | Cl              | F              | H              | F              | H              |       |
| A-150 | <i>o</i> -Bu   | Cl             | Cl              | H              | H              | H              | H              |       |

[0194]

[表6]

第1-1表 (続き)

| No.   | R <sup>1</sup> | X <sup>1</sup> | Y <sup>1</sup>   | Y <sup>2</sup> | Y <sup>3</sup> | Y <sup>4</sup> | Y <sup>5</sup> | 備考 |
|-------|----------------|----------------|------------------|----------------|----------------|----------------|----------------|----|
| A-151 | c-Bu           | Cl             | Cl               | F              | H              | H              | H              |    |
| A-152 | c-Bu           | Cl             | Cl               | H              | F              | H              | H              |    |
| A-153 | c-Bu           | Cl             | Cl               | H              | H              | F              | H              |    |
| A-154 | c-Bu           | Cl             | Cl               | H              | F              | F              | H              |    |
| A-155 | c-Bu           | Cl             | Cl               | F              | F              | H              | H              |    |
| A-156 | c-Bu           | Cl             | Cl               | F              | H              | F              | H              |    |
| A-157 | c-Pr           | Cl             | Cl               | H              | H              | H              | H              |    |
| A-158 | c-Pr           | Cl             | Cl               | F              | H              | H              | H              |    |
| A-159 | c-Pr           | Cl             | Cl               | H              | H              | F              | H              |    |
| A-160 | c-Pr           | Cl             | Cl               | F              | F              | H              | H              |    |
| A-161 | c-Pr           | Cl             | Cl               | F              | H              | F              | H              |    |
| A-162 | c-Pr           | Cl             | F                | H              | H              | H              | H              |    |
| A-163 | c-Pr           | Cl             | F                | H              | F              | H              | H              |    |
| A-164 | c-Pr           | Cl             | F                | H              | F              | F              | H              |    |
| A-165 | c-Pr           | Br             | Cl               | H              | H              | H              | H              |    |
| A-166 | c-Pr           | Br             | Cl               | F              | H              | H              | H              |    |
| A-167 | c-Pr           | Br             | Cl               | H              | F              | H              | H              |    |
| A-168 | c-Pr           | Br             | Cl               | H              | H              | F              | H              |    |
| A-169 | c-Pr           | Br             | Cl               | H              | F              | F              | H              |    |
| A-170 | c-Pr           | Br             | Cl               | F              | F              | H              | H              |    |
| A-171 | c-Pr           | Br             | Cl               | F              | H              | F              | H              |    |
| A-172 | c-Pr           | F              | Cl               | H              | H              | H              | H              |    |
| A-173 | c-Pr           | F              | Cl               | F              | H              | H              | H              |    |
| A-174 | c-Pr           | F              | Cl               | H              | F              | H              | H              |    |
| A-175 | c-Pr           | F              | Cl               | H              | H              | F              | H              |    |
| A-176 | c-Pr           | F              | Cl               | H              | F              | F              | H              |    |
| A-177 | c-Pr           | F              | Cl               | F              | F              | H              | H              |    |
| A-178 | c-Pr           | F              | Cl               | F              | H              | F              | H              |    |
| A-179 | Me             | Cl             | CHF <sub>2</sub> | H              | H              | H              | H              |    |
| A-180 | Me             | Cl             | CHF <sub>2</sub> | F              | H              | H              | H              |    |

[0195]

[表7]

第1-1表 (続き)

| No.   | R <sup>1</sup> | X <sup>1</sup> | Y <sup>1</sup>   | Y <sup>2</sup> | Y <sup>3</sup> | Y <sup>4</sup> | Y <sup>5</sup> | 備考 |
|-------|----------------|----------------|------------------|----------------|----------------|----------------|----------------|----|
| A-181 | Me             | Cl             | CHF <sub>2</sub> | H              | H              | F              | H              |    |
| A-182 | Me             | Cl             | CHF <sub>2</sub> | F              | F              | H              | H              |    |
| A-183 | Me             | Cl             | CHF <sub>2</sub> | F              | H              | F              | H              |    |
| A-184 | Me             | F              | CHF <sub>2</sub> | H              | F              | H              | H              |    |
| A-185 | Me             | F              | CHF <sub>2</sub> | H              | F              | F              | H              |    |
| A-186 | Me             | Cl             | I                | H              | H              | H              | H              |    |
| A-187 | Me             | Cl             | I                | F              | H              | H              | H              |    |
| A-188 | Me             | Cl             | I                | H              | F              | H              | H              |    |
| A-189 | Me             | Cl             | I                | H              | H              | F              | H              |    |
| A-190 | Me             | Cl             | I                | F              | F              | H              | H              |    |
| A-191 | Me             | Cl             | I                | H              | F              | F              | H              |    |
| A-192 | Me             | Cl             | I                | F              | H              | F              | H              |    |
| A-193 | Me             | F              | I                | H              | H              | H              | H              |    |
| A-194 | Me             | F              | I                | F              | H              | H              | H              |    |
| A-195 | Me             | F              | I                | H              | F              | H              | H              |    |
| A-196 | Me             | F              | I                | H              | H              | F              | H              |    |
| A-197 | Me             | F              | I                | F              | F              | H              | H              |    |
| A-198 | Me             | F              | Cl               | F              | F              | H              | H              |    |
| A-199 | Me             | F              | Cl               | F              | H              | F              | H              |    |
| A-200 | Me             | F              | F                | H              | F              | F              | H              |    |
| A-201 | Me             | F              | Br               | F              | H              | H              | H              |    |
| A-202 | Me             | F              | Br               | H              | H              | F              | H              |    |
| A-203 | Me             | F              | Br               | F              | F              | H              | H              |    |
| A-204 | Me             | F              | Br               | F              | H              | F              | H              |    |
| A-205 | Et             | F              | Cl               | H              | F              | H              | H              |    |
| A-206 | Et             | F              | Cl               | H              | F              | F              | H              |    |
| A-207 | Me             | F              | Me               | F              | H              | H              | H              |    |
| A-208 | Me             | F              | Me               | H              | H              | F              | H              |    |
| A-209 | Me             | F              | Me               | F              | F              | H              | H              |    |
| A-210 | Me             | F              | Me               | F              | H              | F              | H              |    |

[0196]

[表8]

第1-1表 (続き)

| No.   | R <sup>1</sup>                                   | X <sup>1</sup> | Y <sup>1</sup>  | Y <sup>2</sup> | Y <sup>3</sup> | Y <sup>4</sup> | Y <sup>5</sup> | 備考 |
|-------|--------------------------------------------------|----------------|-----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|----|
| A-211 | Me                                               | F              | F               | H              | H              | H              | H              |    |
| A-212 | Me                                               | F              | F               | F              | H              | H              | H              |    |
| A-213 | Me                                               | F              | F               | H              | F              | H              | H              |    |
| A-214 | Me                                               | F              | F               | H              | H              | F              | H              |    |
| A-215 | Me                                               | F              | F               | F              | F              | H              | H              |    |
| A-216 | Me                                               | F              | F               | F              | H              | F              | H              |    |
| A-217 | Me                                               | F              | F               | F              | F              | F              | H              |    |
| A-218 | Me                                               | F              | NO <sub>2</sub> | F              | H              | H              | H              |    |
| A-219 | Me                                               | F              | NO <sub>2</sub> | H              | H              | F              | H              |    |
| A-220 | Me                                               | F              | NO <sub>2</sub> | F              | H              | F              | H              |    |
| A-221 | CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>                 | Cl             | Cl              | H              | H              | H              | H              |    |
| A-222 | CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>                 | Cl             | Cl              | F              | H              | H              | H              |    |
| A-223 | CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>                 | Cl             | Cl              | H              | F              | H              | H              |    |
| A-224 | CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>                 | Cl             | Cl              | H              | H              | F              | H              |    |
| A-225 | CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>                 | Cl             | Cl              | F              | F              | H              | H              |    |
| A-226 | CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>                 | Cl             | Cl              | H              | F              | F              | H              |    |
| A-227 | Me                                               | Cl             | F               | Cl             | H              | H              | F              |    |
| A-228 | Et                                               | Cl             | F               | Cl             | H              | H              | F              |    |
| A-229 | CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>                 | Cl             | F               | Cl             | H              | H              | F              |    |
| A-230 | Me                                               | Cl             | H               | Me             | H              | H              | H              |    |
| A-231 | Me                                               | Cl             | H               | H              | Me             | H              | H              |    |
| A-232 | CH <sub>2</sub> CN                               | Cl             | Cl              | H              | F              | H              | H              |    |
| A-233 | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>               | Cl             | Cl              | H              | F              | H              | H              |    |
| A-234 | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>               | Cl             | Cl              | H              | F              | F              | H              |    |
| A-235 | CH <sub>2</sub> C(=O)OCH <sub>3</sub>            | Cl             | Cl              | H              | F              | H              | H              |    |
| A-236 | CH <sub>2</sub> C(=O)OCH <sub>3</sub>            | Cl             | Cl              | H              | F              | F              | H              |    |
| A-237 | CH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>                 | Cl             | Cl              | H              | F              | H              | H              |    |
| A-238 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub> | Cl             | Cl              | H              | F              | H              | H              |    |
| A-239 | Me                                               | Cl             | Et              | H              | H              | H              | H              |    |
| A-240 | Me                                               | Cl             | n-Pr            | H              | H              | H              | H              |    |

[0197]

[表9]

第1-1表 (続き)

| No.   | R <sup>1</sup> | X <sup>1</sup> | Y <sup>1</sup>                                  | Y <sup>2</sup> | Y <sup>3</sup> | Y <sup>4</sup> | Y <sup>5</sup> | 備考 |
|-------|----------------|----------------|-------------------------------------------------|----------------|----------------|----------------|----------------|----|
| A-241 | Me             | Cl             | i-Pr                                            | H              | F              | H              | H              |    |
| A-242 | Me             | Cl             | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                 | H              | F              | H              | H              |    |
| A-243 | Me             | Cl             | CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                 | H              | F              | H              | H              |    |
| A-244 | Me             | Cl             | CH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>                | H              | F              | H              | H              |    |
| A-245 | Me             | Cl             | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | H              | F              | H              | H              |    |
| A-246 | Me             | Cl             | Et                                              | F              | H              | H              | H              |    |
| A-247 | Me             | Cl             | Et                                              | H              | H              | F              | H              |    |
| A-248 | Me             | Cl             | Et                                              | F              | F              | H              | H              |    |
| A-249 | Me             | Cl             | Et                                              | F              | H              | F              | H              |    |
| A-250 | Me             | Cl             | Et                                              | H              | F              | F              | H              |    |
| A-251 | Me             | F              | CHF <sub>2</sub>                                | F              | F              | H              | H              |    |
| A-252 | Me             | F              | CHF <sub>2</sub>                                | F              | H              | H              | H              |    |
| A-253 | Me             | F              | CF <sub>3</sub>                                 | H              | H              | H              | H              |    |
| A-254 | Me             | Cl             | Me                                              | H              | Me             | H              | H              |    |
| A-255 | Me             | Br             | H                                               | F              | F              | H              | H              |    |
| A-256 | Me             | Cl             | NO <sub>2</sub>                                 | H              | H              | H              | F              |    |

[0198]



[表11]

第1～2表 (続き)

| No.  | n | X <sup>1</sup> | Y <sup>1</sup>  | Y <sup>2</sup> | Y <sup>3</sup> | Y <sup>4</sup> | Y <sup>5</sup> | 備考    |
|------|---|----------------|-----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|-------|
| B-31 | 1 | Cl             | CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              |       |
| B-32 | 1 | Cl             | CF <sub>3</sub> | F              | H              | H              | H              |       |
| B-33 | 1 | Cl             | CF <sub>3</sub> | H              | F              | H              | H              |       |
| B-34 | 1 | Cl             | CF <sub>3</sub> | H              | H              | F              | H              |       |
| B-35 | 1 | Cl             | CF <sub>3</sub> | F              | F              | H              | H              |       |
| B-36 | 1 | Cl             | CF <sub>3</sub> | H              | F              | F              | H              |       |
| B-37 | 1 | Cl             | CF <sub>3</sub> | F              | H              | F              | H              |       |
| B-38 | 1 | Cl             | NO <sub>2</sub> | H              | H              | H              | H              |       |
| B-39 | 1 | Cl             | NO <sub>2</sub> | F              | H              | H              | H              |       |
| B-40 | 1 | Cl             | NO <sub>2</sub> | H              | F              | H              | H              |       |
| B-41 | 1 | Cl             | NO <sub>2</sub> | H              | H              | F              | H              |       |
| B-42 | 1 | Cl             | NO <sub>2</sub> | F              | F              | H              | H              |       |
| B-43 | 1 | Cl             | NO <sub>2</sub> | H              | F              | F              | H              |       |
| B-44 | 1 | Cl             | NO <sub>2</sub> | F              | H              | F              | H              |       |
| B-45 | 1 | Cl             | CN              | H              | H              | H              | H              |       |
| B-46 | 1 | Cl             | CN              | F              | H              | H              | H              |       |
| B-47 | 1 | Cl             | CN              | H              | F              | H              | H              |       |
| B-48 | 1 | Cl             | CN              | H              | H              | F              | H              |       |
| B-49 | 1 | Cl             | CN              | F              | F              | H              | H              |       |
| B-50 | 1 | Cl             | CN              | H              | F              | F              | H              |       |
| B-51 | 1 | Cl             | CN              | F              | H              | F              | H              |       |
| B-52 | 1 | Cl             | Cl              | H              | H              | H              | H              | HCl塩  |
| B-53 | 1 | Cl             | Cl              | H              | H              | H              | H              | TsOH塩 |
| B-54 | 1 | Cl             | Cl              | H              | H              | H              | H              | Na塩   |
| B-55 | 1 | Cl             | F               | H              | H              | H              | H              |       |
| B-56 | 1 | Cl             | F               | F              | H              | H              | H              |       |
| B-57 | 1 | Cl             | F               | H              | F              | H              | H              |       |
| B-58 | 1 | Cl             | F               | H              | H              | F              | H              |       |
| B-59 | 1 | Cl             | F               | F              | F              | H              | H              |       |
| B-60 | 1 | Cl             | F               | H              | F              | F              | H              |       |

[0200]

[表12]

第1～2表 (続き)

| No.  | n | X <sup>1</sup> | Y <sup>1</sup> | Y <sup>2</sup> | Y <sup>3</sup> | Y <sup>4</sup> | Y <sup>5</sup> | 備考 |
|------|---|----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|----|
| B-61 | 1 | Cl             | F              | F              | H              | F              | H              |    |
| B-62 | 1 | F              | Cl             | H              | H              | H              | H              |    |
| B-63 | 1 | F              | Cl             | F              | H              | H              | H              |    |
| B-64 | 1 | F              | Cl             | H              | F              | H              | H              |    |
| B-65 | 1 | F              | Cl             | H              | H              | F              | H              |    |
| B-66 | 1 | F              | Cl             | F              | F              | H              | H              |    |
| B-67 | 1 | F              | Cl             | H              | F              | F              | H              |    |
| B-68 | 1 | F              | Cl             | F              | H              | F              | H              |    |
| B-69 | 1 | F              | Br             | H              | H              | H              | H              |    |
| B-70 | 1 | F              | Br             | F              | H              | H              | H              |    |
| B-71 | 1 | F              | Br             | H              | F              | H              | H              |    |
| B-72 | 1 | F              | Br             | H              | H              | F              | H              |    |
| B-73 | 1 | F              | Br             | F              | F              | H              | H              |    |
| B-74 | 1 | F              | Br             | H              | F              | F              | H              |    |
| B-75 | 1 | F              | Br             | F              | H              | F              | H              |    |
| B-76 | 1 | F              | F              | H              | H              | H              | H              |    |
| B-77 | 1 | F              | F              | F              | H              | H              | H              |    |
| B-78 | 1 | F              | F              | H              | F              | H              | H              |    |
| B-79 | 1 | F              | F              | H              | H              | F              | H              |    |
| B-80 | 1 | F              | F              | F              | F              | H              | H              |    |
| B-81 | 1 | F              | F              | H              | F              | F              | H              |    |
| B-82 | 1 | F              | F              | F              | H              | F              | H              |    |
| B-83 | 2 | Cl             | Cl             | H              | H              | H              | H              |    |
| B-84 | 2 | Cl             | Cl             | F              | H              | H              | H              |    |
| B-85 | 2 | Cl             | Cl             | H              | H              | F              | H              |    |
| B-86 | 2 | Cl             | Cl             | F              | F              | H              | H              |    |
| B-87 | 2 | Cl             | Cl             | F              | H              | F              | H              |    |
| B-88 | 3 | Cl             | Cl             | H              | H              | H              | H              |    |
| B-89 | 3 | Cl             | Cl             | H              | F              | H              | H              |    |
| B-90 | 3 | Cl             | Cl             | H              | F              | F              | H              |    |

[0201]

[表13]

第1～2表(続き)

| No.   | n | X <sup>1</sup> | Y <sup>1</sup> | Y <sup>2</sup> | Y <sup>3</sup> | Y <sup>4</sup> | Y <sup>5</sup> | 備考 |
|-------|---|----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|----|
| B-91  | 2 | Br             | Cl             | H              | H              | H              | H              |    |
| B-92  | 2 | Br             | Cl             | H              | F              | H              | H              |    |
| B-93  | 2 | Br             | Cl             | H              | F              | F              | H              |    |
| B-94  | 2 | F              | Cl             | H              | H              | H              | H              |    |
| B-95  | 2 | F              | Cl             | H              | F              | H              | H              |    |
| B-96  | 2 | F              | Cl             | H              | F              | F              | H              |    |
| B-97  | 1 | Cl             | Et             | H              | H              | H              | H              |    |
| B-98  | 1 | Cl             | Et             | H              | F              | H              | H              |    |
| B-99  | 1 | Cl             | Et             | H              | F              | F              | H              |    |
| B-100 | 1 | Cl             | I              | H              | H              | H              | H              |    |
| B-101 | 1 | Cl             | I              | F              | H              | H              | H              |    |
| B-102 | 1 | Cl             | I              | H              | F              | H              | H              |    |
| B-103 | 1 | Cl             | I              | H              | H              | F              | H              |    |
| B-104 | 1 | Cl             | I              | F              | F              | H              | H              |    |
| B-105 | 1 | Cl             | I              | H              | F              | F              | H              |    |
| B-106 | 1 | Cl             | I              | F              | H              | F              | H              |    |
| B-107 | 1 | Br             | Cl             | H              | H              | H              | H              |    |
| B-108 | 1 | Br             | Cl             | H              | F              | H              | H              |    |
| B-109 | 1 | Br             | Cl             | H              | F              | F              | H              |    |
| B-110 | 1 | Cl             | F              | Cl             | H              | H              | F              |    |
| B-111 | 1 | F              | Cl             | H              | F              | F              | H              |    |
| B-112 | 1 | F              | Cl             | H              | H              | F              | H              |    |
| B-113 | 1 | F              | Cl             | F              | H              | H              | H              |    |
| B-114 | 1 | F              | Cl             | F              | F              | H              | H              |    |
| B-115 | 1 | F              | Me             | H              | F              | F              | H              |    |
| B-116 | 1 | F              | Me             | H              | F              | H              | H              |    |
| B-117 | 1 | F              | Me             | H              | H              | F              | H              |    |
| B-118 | 1 | F              | Me             | F              | H              | H              | H              |    |
| B-119 | 1 | F              | Me             | F              | F              | H              | H              |    |
| B-120 | 1 | F              | Br             | H              | F              | H              | H              |    |

[0202]

[表14]

第1－2表（続き）

| N o . | n | X <sup>1</sup> | Y <sup>1</sup> | Y <sup>2</sup> | Y <sup>3</sup> | Y <sup>4</sup> | Y <sup>5</sup> | 備考 |
|-------|---|----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|----|
| B－121 | 1 | F              | Br             | H              | H              | F              | H              |    |
| B－122 | 1 | F              | Br             | H              | F              | F              | H              |    |
| B－123 | 1 | F              | Br             | F              | F              | H              | H              |    |
| B－124 | 1 | F              | Br             | F              | H              | H              | H              |    |
| B－125 | 1 | F              | F              | H              | F              | H              | H              |    |
| B－126 | 1 | F              | F              | H              | H              | F              | H              |    |
| B－127 | 1 | F              | F              | F              | H              | H              | H              |    |
| B－128 | 1 | F              | F              | H              | F              | F              | H              |    |

[0203] 前記製造方法及び実施例に準じて合成した化合物（I）の物性値を第2表及び第3表に示す。第2表では、化合物（I）の融点を示す。第3表では、化合物（I）の<sup>1</sup>H－NMRスペクトラムデータ〔<sup>1</sup>H-核磁気共鳴分光法にて測定； $\delta$ は化学シフト値（ppm）である〕を示す。なお、第2表及び第3表中のN o . は、第1－1表及び第1－2表と同様の意味を表す。

第2表中の融点において、\*1は、化合物の融点を測定した時に分解した温度を表す。

第3表中の<sup>1</sup>H－NMRスペクトラムデータにおいて、sはシングレット（一重線）、b r sはブロードしたシングレット、dはダブルット（二重線）、tはトリプレット（三重線）、qはカルテット（四重線）、mはマルチプレット（多重線）である。

[0204]

[表15]

第2表

| No.  | 融点 (°C) |
|------|---------|
| A-3  | 214.9   |
| A-5  | 189.8   |
| A-6  | 169.2   |
| A-7  | 228.6   |
| A-8  | 169.1   |
| A-11 | 162.0   |
| A-12 | 171.6   |
| A-13 | 143.7   |
| A-15 | 182.3   |
| A-16 | 168.0   |
| A-17 | 162.1   |
| A-19 | 186.9   |
| A-21 | 180.0   |
| A-22 | 179.3   |
| A-23 | 198.8   |
| A-24 | 188.8   |
| A-25 | 172.5   |
| A-26 | 208.8   |
| A-27 | 195.1   |
| A-28 | 210.1   |
| A-29 | 153.4   |
| A-30 | 180.2   |

[0205]

[表16]

第2表 (続き)

| No.  | 融点 (°C) |
|------|---------|
| A-31 | 156.4   |
| A-32 | 156.0   |
| A-33 | 178.6   |
| A-34 | 144.2   |
| A-35 | 165.0   |
| A-36 | 169.3   |
| A-37 | 193.6   |
| A-38 | 128.9   |
| A-39 | 182.0   |
| A-40 | 179.0   |
| A-41 | 156.1   |
| A-42 | 195.8   |
| A-43 | 182.5   |
| A-45 | 173.7   |
| A-46 | 189.5   |
| A-47 | 199.6   |
| A-51 | 208.4   |
| A-52 | 177.6   |
| A-54 | 190.8   |
| A-55 | 180.8   |
| A-56 | 168.0   |
| A-57 | 166.7   |
| A-58 | 194.0   |
| A-59 | 188.1   |
| A-60 | 190.2   |
| A-61 | 207.9   |
| A-62 | 188.7   |
| A-64 | 181.7   |

[0206]

[表17]

第2表 (続き)

| No.   | 融点 (°C) |
|-------|---------|
| A-66  | 185.8   |
| A-67  | 187.9   |
| A-68  | 180.8   |
| A-69  | 181.5   |
| A-70  | 197.8   |
| A-71  | 205.0   |
| A-72  | 211.3   |
| A-73  | 188.9   |
| A-74  | 210.1   |
| A-75  | 199.5   |
| A-76  | 138.7   |
| A-77  | 153.4   |
| A-78  | 137.1   |
| A-79  | 148.5   |
| A-82  | 154.2   |
| A-83  | 162.4   |
| A-84  | 156.7   |
| A-86  | 171.7   |
| A-87  | 173.6   |
| A-88  | 183.1   |
| A-89  | 189.0   |
| A-91  | 157.4   |
| A-92  | 158.0   |
| A-93  | 184.0   |
| A-94  | 184.8   |
| A-95  | 170.3   |
| A-96  | 186.8   |
| A-97  | 172.2   |
| A-98  | 196.3   |
| A-99  | 172.4   |
| A-100 | 195.6   |

[0207]

[表18]

第2表 (続き)

| No.   | 融点 (°C)     |
|-------|-------------|
| A-101 | 161.9       |
| A-102 | 194.5       |
| A-103 | 186.8       |
| A-104 | 183.3       |
| A-105 | 164.0       |
| A-106 | 188.7       |
| A-108 | 199.1       |
| A-109 | 193.8       |
| A-110 | 185.4       |
| A-111 | 177.6       |
| A-112 | 195.6       |
| A-113 | 184.8       |
| A-114 | 193.7       |
| A-115 | 242.6 (* 1) |
| A-116 | 238.3 (* 1) |
| A-117 | 251.0 (* 1) |
| A-118 | 246.0 (* 1) |
| A-119 | 248.4 (* 1) |
| A-120 | 244.1 (* 1) |
| A-121 | 248.5 (* 1) |
| A-122 | 223.3 (* 1) |
| A-123 | 176.8       |
| A-124 | 163.5       |
| A-128 | 243.2 (* 1) |
| A-129 | 219.5 (* 1) |
| A-131 | 227.1 (* 1) |
| A-138 | 169.5       |

[0208]

[表19]

第2表 (続き)

| No.   | 融点 (°C)     |
|-------|-------------|
| A-211 | 224.5 (* 1) |
| A-212 | 234.2 (* 1) |
| A-213 | 239.4 (* 1) |
| A-214 | 230.1 (* 1) |
| A-215 | 238.7 (* 1) |
| A-216 | 234.2 (* 1) |
| A-217 | 238.2 (* 1) |
| A-218 | 233.0 (* 1) |
| A-219 | 231.1 (* 1) |
| A-220 | 230.4 (* 1) |
| A-221 | 170.0       |
| A-222 | 142.2       |
| A-223 | 187.3       |
| A-224 | 168.2       |
| A-225 | 181.8       |
| A-226 | 174.9       |
| A-230 | 145.6       |
| A-231 | 160.8       |
| A-234 | 196.3       |
| A-235 | 187.5       |
| A-236 | 141.6       |
| A-237 | 179.2       |
| A-238 | 183.6       |

[0209]

[表20]

第2表 (続き)

| No.   | 融点 (°C) |
|-------|---------|
| B-1   | 210.8   |
| B-2   | 180.5   |
| B-3   | 159.0   |
| B-4   | 209.7   |
| B-5   | 269.3   |
| B-6   | 214.6   |
| B-8   | 187.7   |
| B-9   | 178.9   |
| B-10  | 156.5   |
| B-11  | 154.4   |
| B-12  | 204.1   |
| B-13  | 165.1   |
| B-14  | 188.5   |
| B-15  | 150.4   |
| B-16  | 177.0   |
| B-17  | 184.6   |
| B-18  | 155.1   |
| B-19  | 197.8   |
| B-20  | 195.0   |
| B-22  | 179.4   |
| B-25  | 169.4   |
| B-40  | 174.7   |
| B-47  | 168.2   |
| B-55  | 154.1   |
| B-57  | 171.5   |
| B-89  | 143.0   |
| B-108 | 192.0   |

[0210]

[表21]

第2表 (続き)

| No.   | 融点 (℃)      |
|-------|-------------|
| B-111 | 212.9 (* 1) |
| B-112 | 203.4 (* 1) |
| B-113 | 210.9 (* 1) |
| B-114 | 215.3 (* 1) |
| B-115 | 213.8 (* 1) |
| B-116 | 204.3 (* 1) |
| B-117 | 208.9 (* 1) |
| B-118 | 204.2 (* 1) |
| B-119 | 209.9 (* 1) |
| B-120 | 216.8 (* 1) |
| B-121 | 207.7 (* 1) |
| B-122 | 211.3 (* 1) |
| B-123 | 219.2 (* 1) |
| B-124 | 210.3 (* 1) |
| B-125 | 201.2 (* 1) |
| B-126 | 197.4 (* 1) |
| B-127 | 207.7 (* 1) |
| B-128 | 203.8 (* 1) |

[0211]

[表22]

第3表

| No.   | <sup>1</sup> H-NMR (300 MHz 又は 500 MHz, 測定溶媒) δ 値 (ppm)                                                                                     |
|-------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| A-1   | (300 MHz, DMSO-d <sub>6</sub> ) 8.00 (brs, 2H), 7.79 (dd, 1H), 7.41 (dd, 1H), 4.92 (s, 2H), 3.67 (s, 3H).                                   |
| A-2   | (300 MHz, DMSO-d <sub>6</sub> ) 7.99 (brs, 2H), 7.79 (dd, 1H), 7.42 (dd, 1H), 4.93 (s, 2H), 3.67 (s, 3H).                                   |
| A-4   | (300 MHz, DMSO-d <sub>6</sub> ) 8.16 (brs, 2H), 7.78 (dd, 1H), 7.39 (dd, 1H), 4.88 (s, 2H), 3.67 (s, 3H).                                   |
| A-10  | (300 MHz, DMSO-d <sub>6</sub> ) 7.97 (brs, 2H), 7.48 (dd, 1H), 7.39 (dd, 1H), 7.25 (td, 1H), 4.94 (s, 2H), 3.65 (s, 3H).                    |
| A-14  | (300 MHz, DMSO-d <sub>6</sub> ) 8.00 (brs, 2H), 7.90 (dd, 1H), 7.37 (dd, 1H), 4.89 (s, 2H), 3.66 (s, 3H).                                   |
| A-18  | (300 MHz, DMSO-d <sub>6</sub> ) 8.35 (dd, 1H), 8.02 (brs, 2H), 7.47 (dd, 1H), 5.18 (s, 2H), 3.68 (s, 3H).                                   |
| A-20  | (300 MHz, DMSO-d <sub>6</sub> ) 7.98 (brs, 2H), 7.51-7.45 (m, 1H), 7.38-7.29 (m, 3H), 4.97 (s, 2H), 3.66 (s, 3H).                           |
| A-48  | (500 MHz, acetone-d <sub>6</sub> ) 7.22 (t, 1H), 7.16 (brs, 2H), 7.04 (d, 1H), 6.97-6.94 (m, 1H), 4.92 (s, 2H), 3.67 (d, 3H), 2.33 (s, 3H). |
| A-50  | (500 MHz, acetone-d <sub>6</sub> ) 7.17-7.10 (m, 4H), 4.92 (s, 2H), 3.64 (s, 3H), 2.31 (d, 3H).                                             |
| A-65  | (500 MHz, acetone-d <sub>6</sub> ) 7.62 (d, 1H), 7.38 (d, 2H), 7.27-7.22 (m, 1H), 7.17 (brs, 2H), 5.02 (s, 2H), 3.72 (s, 3H).               |
| A-85  | (500 MHz, acetone-d <sub>6</sub> ) 7.79 (dd, 1H), 7.47 (dd, 1H), 7.24 (brs, 2H), 5.10 (s, 2H), 3.75 (s, 3H).                                |
| A-94  | (300 MHz, DMSO-d <sub>6</sub> ) 7.96 (brs, 2H), 7.49-7.46 (m, 1H), 7.36-7.29 (m, 3H), 4.96 (s, 2H), 3.65 (s, 3H).                           |
| A-105 | (300 MHz, DMSO-d <sub>6</sub> ) 7.93 (brs, 2H), 7.21 (dd, 1H), 7.08-6.97 (m, 2H), 4.84 (s, 2H), 3.59 (s, 3H), 2.29 (s, 3H).                 |

[0212]

[表23]

第3表 (続き)

| No.   | <sup>1</sup> H-NMR (300 MHz 又は 500 MHz, 測定溶媒) δ 値 (ppm)                                                                                                                                |
|-------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| A-120 | (300 MHz, DMSO-d <sub>6</sub> ) 8.10 (brs, 2H), 7.20 (dd, 1H), 7.07-6.96 (m, 2H), 4.80 (s, 2H), 3.56 (s, 3H), 2.29 (s, 3H).                                                            |
| A-132 | (500 MHz, DMSO-d <sub>6</sub> ) 8.16 (brs, 2H), 7.90 (dd, 1H), 7.35 (dd, 1H), 4.85 (s, 2H), 3.67 (s, 3H).                                                                              |
| A-133 | (500 MHz, DMSO-d <sub>6</sub> ) 8.12 (brs, 2H), 7.30 (dd, 1H), 7.18 (dd, 1H), 4.79 (s, 2H), 3.63 (s, 3H), 2.26 (s, 3H).                                                                |
| A-135 | (300 MHz, DMSO-d <sub>6</sub> ) 8.00 (brs, 2H), 7.79 (dd, 1H), 7.41 (dd, 1H), 4.92 (s, 2H), 3.67 (s, 3H).                                                                              |
| A-145 | (300 MHz, DMSO-d <sub>6</sub> ) 7.92 (brs, 2H), 7.45 (dd, 1H), 7.36 (dd, 1H), 7.26 (dt, 1H), 4.89 (brs, 2H), 1.21 (s, 9H).                                                             |
| A-152 | (300 MHz, DMSO-d <sub>6</sub> ) 7.95 (brs, 2H), 7.47 (dd, 1H), 7.33 (dd, 1H), 7.25 (dt, 1H), 4.90 (s, 2H), 4.46-4.41 (m, 1H), 2.11-1.96 (m, 4H), 1.65-1.62 (m, 1H), 1.50-1.43 (m, 1H). |
| A-184 | (500 MHz, DMSO-d <sub>6</sub> ) 8.14 (brs, 2H), 7.45-7.40 (m, 3H), 7.26 (t, 1H), 4.97 (s, 2H), 3.45 (s, 3H).                                                                           |
| A-191 | (500 MHz, acetone-d <sub>6</sub> ) 7.86 (dd, 1H), 7.28 (dd, 1H), 7.20 (brs, 2H), 4.89 (s, 2H), 3.72 (s, 3H).                                                                           |
| A-198 | (500 MHz, DMSO-d <sub>6</sub> ) 8.15 (brs, 2H), 7.48 (q, 1H), 7.23-7.19 (m, 1H), 4.93 (s, 2H), 3.67 (s, 3H).                                                                           |
| A-199 | (500 MHz, DMSO-d <sub>6</sub> ) 8.17 (brs, 2H), 7.51 (dt, 1H), 7.05-7.03 (m, 1H), 4.96 (s, 2H), 3.69 (s, 3H).                                                                          |
| A-200 | (500 MHz, DMSO-d <sub>6</sub> ) 8.13 (brs, 2H), 7.60-7.55 (m, 1H), 7.43-7.38 (m, 1H), 4.84 (s, 2H), 3.68 (s, 3H).                                                                      |
| A-201 | (500 MHz, DMSO-d <sub>6</sub> ) 8.15 (brs, 2H), 7.43 (ddd, 1H), 7.34-7.30 (m, 1H), 7.12 (d, 1H), 4.94 (s, 2H), 3.67 (s, 3H).                                                           |
| A-202 | (500 MHz, DMSO-d <sub>6</sub> ) 8.17 (brs, 2H), 7.69 (dd, 1H), 7.16 (dt, 1H), 7.08 (dd, 1H), 4.88 (s, 2H), 3.68 (s, 3H).                                                               |
| A-203 | (500 MHz, DMSO-d <sub>6</sub> ) 8.15 (brs, 2H), 7.51 (dd, 1H), 7.20-7.17 (m, 1H), 4.91 (s, 2H), 3.66 (s, 3H).                                                                          |
| A-204 | (500 MHz, DMSO-d <sub>6</sub> ) 8.17 (brs, 2H), 7.47 (dt, 1H), 7.00 (d, 1H), 4.93 (s, 2H), 3.69 (t, 3H).                                                                               |

[0213]

[表24]

第3表 (続き)

| No.   | <sup>1</sup> H-NMR (300 MHz 又は 500 MHz, 測定溶媒) δ 値 (ppm)                                                                                            |
|-------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| A-205 | (500 MHz, DMSO-d <sub>6</sub> ) 8.11 (brs, 2H), 7.48-7.46 (m, 1H), 7.40-7.37 (m, 1H), 7.27-7.23 (m, 1H), 4.89 (s, 2H), 3.92 (q, 2H), 1.17 (t, 3H). |
| A-206 | (500 MHz, DMSO-d <sub>6</sub> ) 8.13 (brs, 2H), 7.77 (dd, 1H), 7.38 (dd, 1H), 4.88 (s, 2H), 3.93 (q, 2H), 1.18 (t, 3H).                            |
| A-207 | (500 MHz, acetone-d <sub>6</sub> ) 7.31 (brs, 2H), 7.22-7.18 (m, 1H), 7.13 (d, 1H), 7.03 (t, 1H), 4.92 (s, 2H), 3.63 (s, 3H), 2.26 (d, 3H).        |
| A-208 | (500 MHz, acetone-d <sub>6</sub> ) 7.31 (brs, 2H), 7.21 (dd, 1H), 7.02 (dd, 1H), 6.95 (dt, 1H), 4.88 (s, 2H), 3.68 (s, 3H), 2.32 (s, 3H).          |
| A-209 | (500 MHz, acetone-d <sub>6</sub> ) 7.31 (brs, 2H), 7.16-7.10 (m, 2H), 4.89 (s, 2H), 3.64 (s, 3H), 2.31 (d, 3H).                                    |
| A-210 | (500 MHz, acetone-d <sub>6</sub> ) 7.34 (brs, 2H), 6.95-6.89 (m, 2H), 4.93 (s, 2H), 3.69 (s, 3H), 2.23 (s, 3H).                                    |
| A-227 | (300 MHz, DMSO-d <sub>6</sub> ) 7.97 (brs, 2H), 7.66 (dd, 1H), 7.22 (td, 1H), 4.99 (s, 2H), 3.65 (s, 3H).                                          |
| A-232 | (300 MHz, DMSO-d <sub>6</sub> ) 8.11 (brs, 2H), 7.50 (dd, 1H), 7.38 (dd, 1H), 7.27 (td, 1H), 5.04 (s, 2H), 5.02 (s, 2H).                           |

[0214] [表25]

第3表 (続き)

| No.   | <sup>1</sup> H-NMR (300 MHz 又は 500 MHz, 測定溶媒) δ 値 (ppm)                                                                                            |
|-------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| B-7   | (300 MHz, DMSO-d <sub>6</sub> ) 8.01 (brs, 2H), 7.78 (dd, 1H), 7.41 (dd, 1H), 4.96 (s, 2H), 4.66 (d, 2H), 3.69 (t, 1H).                            |
| B-21  | (300 MHz, DMSO-d <sub>6</sub> ) 8.04 (brs, 2H), 7.48 (td, 1H), 7.05-7.01 (m, 1H), 5.01 (s, 2H), 4.69 (d, 2H), 3.71 (t, 1H).                        |
| B-24  | (300 MHz, DMSO-d <sub>6</sub> ) 8.01 (brs, 2H), 7.73 (dd, 1H), 7.41 (dd, 1H), 7.22 (t, 1H), 5.05 (s, 2H), 4.67 (d, 2H), 3.70 (t, 1H).              |
| B-43  | (300 MHz, DMSO-d <sub>6</sub> ) 8.37 (dd, 1H), 8.06 (brs, 2H), 7.46 (dd, 1H), 5.22 (s, 2H), 4.68 (d, 2H), 3.71 (t, 1H).                            |
| B-50  | (300 MHz, DMSO-d <sub>6</sub> ) 8.21 (dd, 1H), 8.04 (brs, 2H), 7.54 (dd, 1H), 5.05 (s, 2H), 4.69 (d, 2H), 3.72 (t, 1H).                            |
| B-55  | (300 MHz, DMSO-d <sub>6</sub> ) 7.98 (brs, 2H), 7.40-7.29 (m, 2H), 7.23-7.16 (m, 2H), 4.97 (s, 2H), 4.64 (d, 2H), 3.68 (t, 1H).                    |
| B-57  | (300 MHz, DMSO-d <sub>6</sub> ) 7.98 (brs, 2H), 7.42-7.34 (m, 1H), 7.30-7.22 (m, 1H), 7.13-7.06 (m, 1H), 4.93 (s, 2H), 4.64 (d, 2H), 3.68 (t, 1H). |
| B-64  | (300 MHz, DMSO-d <sub>6</sub> ) 8.18 (brs, 2H), 7.48 (dd, 1H), 7.35 (dd, 1H), 7.25 (dt, 1H), 4.95 (s, 2H), 4.65 (d, 2H), 3.70 (t, 1H).             |
| B-105 | (500 MHz, acetone-d <sub>6</sub> ) 7.86 (dd, 1H), 7.30 (dd, 1H), 7.22 (brs, 2H), 4.95 (s, 2H), 4.65 (d, 2H), 3.18 (t, 1H).                         |

## [0215] [試験例]

本発明化合物を含む各薬液の調製：

本発明化合物とアセトン又はジメチルスルホキシドとを混合し、本発明化合物を溶解させた。本発明化合物の溶液に水を加えて、有効成分である本発明化合物が所定の濃度（400 ppm）になるように希釈して薬液を得た。

この薬液を、以下の試験例1～試験例3にて利用した。

[0216] 試験例1：トマト疫病（*Phytophthora infestans*）に対する殺菌効果試験（予防効果試験）

直径6 cmのビニールポットでトマトを栽培し、4.5～5.5葉期に達した時に薬液10 mlをスプレーガンにて散布した。薬液が乾燥した後（処理当日）に、トマト疫病菌（*Phytophthora infestans*）の孢子懸濁液を噴霧接種し、温度20℃、湿度95%以上の接種箱に16時間入れた。その後、20℃の恒温室内に置き、接種3日後に病斑面積率を調査し、下記計算式に従って防除率を算出した。その結果、以下の各供試化合物を含む各薬液（有効成分濃度は400 ppm）がトマト疫病に対して90%以上の防除率を示した。

[防除率の計算式]

$$\text{防除率 (\%)} = 100 - (X/Y) \times 100$$

X：供試化合物の病斑面積率（%）、Y：無処理区の病斑面積率（%）

供試化合物：化合物No. A-3、A-5、A-6、A-7、A-8、A-10、A-11、A-12、A-14、A-15、A-16、A-18、A-19、A-20、A-21、A-22、A-23、A-24、A-25、A-26、A-27、A-28、A-29、A-30、A-31、A-32、A-33、A-34、A-35、A-36、A-37、A-38、A-39、A-40、A-41、A-42、A-43、A-45、A-46、A-47、A-48、A-50、A-51、A-52、A-54、A-55、A-56、A-57、A-58、A-59、A-60、A-61、A-62、A-64、A-65、A-66、A-67、A-68、A-69、A-70、

A-71、A-72、A-73、A-74、A-75、A-76、A-77、  
A-78、A-79、A-82、A-83、A-84、A-85、A-86、  
A-87、A-88、A-89、A-91、A-92、A-93、A-94、  
A-95、A-96、A-97、A-98、A-99、A-100、  
A-101、A-102、A-103、A-104、A-105、A-106、  
A-108、A-109、A-110、A-111、A-112、A-113、  
A-114、A-115、A-116、A-117、A-118、A-119、  
A-120、A-121、A-122、A-123、A-124、A-128、  
A-129、A-131、A-132、A-133、A-135、A-138、  
A-152、A-184、A-191、A-198、A-199、A-200、  
A-201、A-202、A-203、A-204、A-205、A-206、  
A-207、A-208、A-209、A-210、A-211、A-212、  
A-213、A-214、A-215、A-216、A-217、A-218、  
A-219、A-220、A-221、A-222、A-224、A-225、  
A-226、A-227、A-230、A-232、A-234、A-235、  
A-236、A-237、A-238、B-1、B-2、B-3、B-4、B-5、  
B-6、B-7、B-8、B-9、B-10、B-11、B-12、B-13、  
B-14、B-15、B-16、B-17、B-18、B-19、B-20、  
B-21、B-22、B-24、B-25、B-40、B-43、B-47、  
B-50、B-55、B-57、B-64、B-89、B-105、B-108、  
B-111、B-112、B-113、B-114、B-115、B-116、  
B-117、B-118、B-119、B-120、B-121、B-122、  
B-123、B-124、B-125、B-126、B-127、B-128

[0217] 試験例2：キュウリべと病 (*Pseudoperonospora cubensis*) に対する殺菌効果試験（予防効果試験）

直径6cmのビニールポットでキュウリを栽培し、1.2～1.5葉期に

達した時に薬液 10ml をスプレーガンにて散布した。薬液が乾燥した後（処理当日）に、キュウリベと病菌（*Pseudoperonospora cubensis*）の孢子懸濁液を噴霧接種し、温度 20℃、湿度 95% 以上の接種箱に 24 時間入れた。その後、20℃の恒温室内に置き、接種 7 日後に病斑面積率を調査し、上記試験例 1 と同じ計算式により防除率を算出した。その結果、以下の各供試化合物を含む各薬液（有効成分濃度が 400 ppm）がキュウリベと病に対して 90% 以上の防除率を示した。

供試化合物：化合物 No. A-3、A-5、A-6、A-10、A-12、A-15、A-16、A-18、A-19、A-20、A-21、A-22、A-23、A-24、A-26、A-28、A-29、A-30、A-31、A-32、A-33、A-35、A-38、A-39、A-40、A-42、A-43、A-45、A-47、A-48、A-50、A-51、A-52、A-54、A-55、A-57、A-58、A-59、A-62、A-64、A-65、A-67、A-68、A-69、A-71、A-72、A-73、A-75、A-76、A-77、A-78、A-79、A-82、A-83、A-85、A-91、A-92、A-94、A-95、A-96、A-97、A-98、A-99、A-100、A-102、A-103、A-106、A-109、A-111、A-112、A-113、A-114、A-115、A-116、A-117、A-118、A-119、A-120、A-121、A-122、A-123、A-124、A-128、A-129、A-131、A-132、A-133、A-135、A-138、A-145、A-152、A-184、A-191、A-198、A-199、A-200、A-201、A-202、A-203、A-204、A-205、A-206、A-207、A-208、A-209、A-210、A-211、A-212、A-213、A-214、A-215、A-216、A-217、A-218、A-219、A-220、A-221、A-222、A-223、A-224、A-225、A-226、A-232、A-234、A-237、A-238、B-2、B-3、B-4、

B-5、B-6、B-7、B-8、B-9、B-10、B-11、B-13、  
B-14、B-15、B-16、B-17、B-18、B-19、B-20、  
B-21、B-22、B-24、B-25、B-40、B-43、B-47、  
B-50、B-55、B-57、B-64、B-105、B-108、  
B-111、B-112、B-113、B-114、B-115、B-116、  
B-117、B-118、B-119、B-120、B-121、B-122、  
B-123、B-124、B-125、B-126、B-127、B-128

[0218] 試験例3：トマト疫病 (*Phytophthora infestans*) に対する殺菌効果試験（治療効果試験）

直径6cmのビニールポットでトマトを栽培し、4.5～5.5葉期に達した時にトマト疫病菌 (*Phytophthora infestans*) の孢子懸濁液を噴霧接種し、温度20℃、湿度95%以上の接種箱に4時間入れた。その後、薬液10mlをスプレーガンにて散布し、薬液が乾燥した後（処理当日）に、20℃の恒温室内に置き、接種3日後に病斑面積率を調査し、上記試験例1と同じ計算式により防除率を算出した。その結果、以下の各供試化合物を含む各薬液（有効成分濃度は400ppm）がトマト疫病に対して90%以上の防除率を示した。

供試化合物：化合物No. A-2、A-5、A-6、A-10、A-11、A-12、A-13、A-14、A-16、A-18、A-19、A-20、A-21、A-22、A-23、A-29、A-31、A-32、A-33、A-34、A-35、A-36、A-38、A-40、A-41、A-43、A-45、A-48、A-50、A-52、A-55、A-57、A-58、A-60、A-64、A-65、A-67、A-69、A-71、A-77、A-78、A-79、A-85、A-86、A-87、A-88、A-89、A-91、A-92、A-93、A-95、A-97、A-99、A-101、A-109、A-111、A-113、A-115、A-116、A-117、A-118、A-119、A-120、A-121、

A-122、A-123、A-124、A-128、A-129、A-132、A-133、A-184、A-191、A-198、A-199、A-200、A-202、A-203、A-204、A-205、A-206、A-207、A-208、A-209、A-210、A-211、A-213、A-214、A-215、A-216、A-217、A-220、A-226、A-230、A-232、A-238、B-7、B-9、B-16、B-22、B-50、B-64、B-111、B-112、B-114、B-115、B-116、B-118、B-119、B-121、B-122、B-123、B-125、B-126、B-128

[0219] [比較試験]

本発明化合物の化合物No. A-10、及び特許文献1の製造例2に記載の化合物（以下、比較化合物1と記す）を有効成分として用い、比較試験を行った。

[0220] 各化合物を含む薬液の調製：下記の第4表に記載の各供試化合物を用いて、上記と同じ調製方法で有効成分が所定の濃度（400ppm、200ppm、100ppm又は50ppm）となるように各薬液を調製した。各所定の濃度に調整した各薬液を以下の比較試験例1にて利用した。

[0221] 比較試験例1：キュウリべと病（Pseudoperonospora cubensis）に対する殺菌効果試験（予防効果試験）

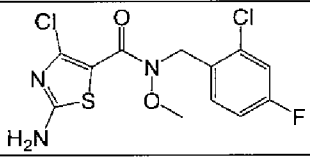
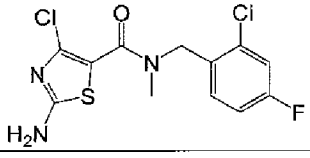
上記の所定の濃度に調整した各薬液を用い、試験例2に記載の方法に従って、キュウリべと病に対する殺菌効果試験を行った。

各供試化合物を含む薬液の各有効成分濃度毎の結果を第4表に示す。Aは100%の防除率、Bは90-99%の防除率、Cは70-89%の防除率、Dは30-69%の防除率、Eは0-29%の防除率をそれぞれ意味する。

[0222]

[表26]

第4表

| 化合物N o.          | 供試化合物                                                                             | 有効成分濃度 (ppm) |     |     |    |
|------------------|-----------------------------------------------------------------------------------|--------------|-----|-----|----|
|                  |                                                                                   | 400          | 200 | 100 | 50 |
| A-10<br>(本発明化合物) |  | A            | A   | A   | A  |
| 比較化合物1           |  | C            | C   | C   | D  |

[0223] 第4表より、本発明のN-置換オキシアミド化合物である化合物N o. A-10は、特許文献1のアミド化合物（比較化合物1）よりも、キュウリベと病への優れた防除率を示した。

従って、実施例より、本発明のN-置換オキシアミド化合物は、有害な植物病害に対して優れた防除効果を発揮することを見出した。さらに、特許文献1のアミド化合物よりも、本発明のN-置換オキシアミド化合物は、有害な植物病害に対して優れた防除効果を発揮することを見出した。

[0224] 次に、化合物（1）を含む製剤例を記載するが、配合割合、剤型などは記載例に限定されるものではない。

#### 製剤例1

- |                  |       |
|------------------|-------|
| (1) 化合物（1）       | 20重量部 |
| (2) クレー          | 72重量部 |
| (3) リグニンスルホン酸ソーダ | 8重量部  |

以上のものを均一に混合して水和剤とする。

#### 製剤例2

- |            |       |
|------------|-------|
| (1) 化合物（1） | 5重量部  |
| (2) タルク    | 95重量部 |

以上のものを均一に混合して粉剤とする。

#### 製剤例3

- |            |       |
|------------|-------|
| (1) 化合物（1） | 20重量部 |
|------------|-------|

- |                           |       |
|---------------------------|-------|
| (2) N, N-ジメチルアセトアミド       | 20重量部 |
| (3) ポリオキシエチレンアルキルフェニルエーテル | 10重量部 |
| (4) キシレン                  | 50重量部 |

以上のものを均一に混合、溶解して乳剤とする。

[0225] 製剤例4

- |                             |       |
|-----------------------------|-------|
| (1) クレー                     | 68重量部 |
| (2) リグニンスルホン酸ソーダ            | 2重量部  |
| (3) ポリオキシエチレンアルキルアリールサルフェート | 5重量部  |
| (4) 微粉シリカ                   | 25重量部 |

以上の各成分の混合物と、化合物(1)とを4:1の重量割合で混合し、水和剤とする。

製剤例5

- |                                         |         |
|-----------------------------------------|---------|
| (1) 化合物(1)                              | 50重量部   |
| (2) ポリオキシエチレンアルキルフェニルエーテルリン酸トリエタノールアミン塩 | 2重量部    |
| (3) シリコーン                               | 0.2重量部  |
| (4) 水                                   | 47.8重量部 |

以上のものを均一に混合、粉碎した原液に更に

- |                  |         |
|------------------|---------|
| (5) ポリカルボン酸ナトリウム | 5重量部    |
| (6) 無水硫酸ナトリウム    | 42.8重量部 |

を加え均一に混合、造粒、乾燥して顆粒水和剤とする。

製剤例6

- |                           |         |
|---------------------------|---------|
| (1) 化合物(1)                | 5重量部    |
| (2) ポリオキシエチレンオクチルフェニルエーテル | 1重量部    |
| (3) ポリオキシエチレンの燐酸エステル      | 0.1重量部  |
| (4) 粒状炭酸カルシウム             | 93.9重量部 |

(1) ~ (3) を予め均一に混合し、適量のアセトンで希釈した後、(4)

に吹付け、アセトンを除去して粒剤とする。

[0226] 製剤例 7

|                   |          |
|-------------------|----------|
| (1) 化合物 (1)       | 2.5 重量部  |
| (2) N-メチル-2-ピロリドン | 2.5 重量部  |
| (3) 大豆油           | 95.0 重量部 |

以上のものを均一に混合、溶解して微量散布剤(ultra low volume formulation)とする。

製剤例 8

|                                             |          |
|---------------------------------------------|----------|
| (1) 化合物 (1)                                 | 20 重量部   |
| (2) ポリオキシエチレンアルキルフェニルエーテルリン酸トリエタノール<br>アミン塩 | 2 重量部    |
| (3) シリコーン                                   | 0.2 重量部  |
| (4) ザンサンガム                                  | 0.1 重量部  |
| (5) エチレングリコール                               | 5 重量部    |
| (6) 水                                       | 72.7 重量部 |

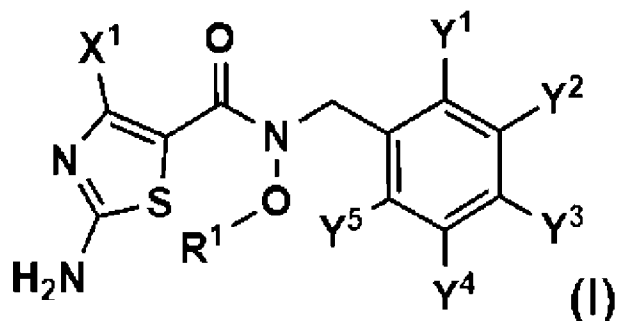
以上のものを均一に混合、粉砕して水性懸濁剤とする。

[0227] なお、2023年9月13日に出願された日本特許出願2023-148047号および日本特許出願2023-148050号の明細書、特許請求の範囲および要約書の全内容をここに引用し、本発明の明細書の開示として、取り入れるものである。

## 請求の範囲

[請求項1] 式 (I) :

[化1]



[式中、 $R^1$ は、 $(C_1-C_5)$  - 鎖式炭化水素、又は  $(C_3-C_4)$  - シクロアルキルであり {ここで、該  $(C_1-C_5)$  - 鎖式炭化水素及び該  $(C_3-C_4)$  - シクロアルキルは、少なくとも 1 個の  $T^1$  で置換されていてもよい}、

$T^1$  は、ハロゲン、シアノ、又は  $-U^1-R^2$  であり、

$U^1$  は、O、S、又は  $C(=O)O$  であり、

$R^2$  は、 $(C_1-C_3)$  - アルキルであり、

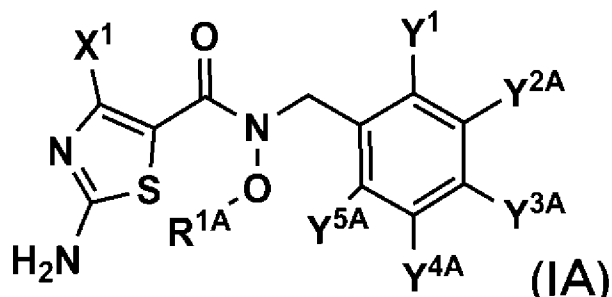
$X^1$  は、ハロゲンであり、

$Y^1$ 、 $Y^2$ 、 $Y^3$ 、 $Y^4$  及び  $Y^5$  は、それぞれ独立に、ハロゲン、 $(C_1-C_6)$  - アルキル、 $(C_1-C_6)$  - ハロアルキル、ニトロ、シアノ、又は水素原子である。ただし、 $R^1$  が  $(C_1-C_4)$  - アルキル又は  $(C_3-C_4)$  - シクロアルキルである場合は、 $Y^1$ 、 $Y^2$ 、 $Y^3$ 、 $Y^4$  及び  $Y^5$  の全てが同時に水素原子になることはない。] で表される化合物又はその塩。

[請求項2]  $R^1$  が、 $(C_1-C_4)$  - アルキル、 $(C_3-C_4)$  - シクロアルキル、又は  $(C_3-C_5)$  - アルキニルである、請求項 1 に記載の化合物又はその塩。

[請求項3] 式 (I) の化合物が、  
式 (IA) ;

[化2]



[式中、 $R^{1A}$ は、 $(C_1-C_4)$  -アルキル、又は $(C_3-C_4)$  -シクロアルキルであり、

$X^1$ は、ハロゲンであり、

$Y^1$ は、ハロゲン、 $(C_1-C_6)$  -アルキル、 $(C_1-C_6)$  -ハロアルキル、ニトロ、シアノ、又は水素原子であり、

$Y^{2A}$ 、 $Y^{3A}$ 及び $Y^{4A}$ は、それぞれ独立に、水素原子、又はハロゲンであり、

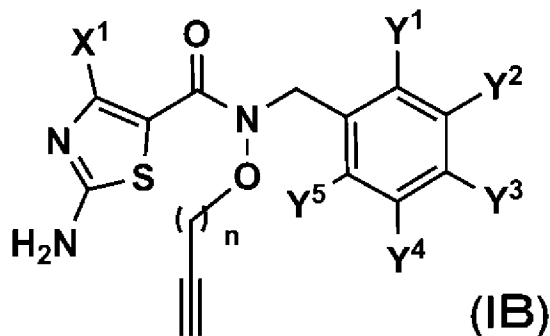
$Y^{5A}$ は、水素原子である。ただし、 $Y^1$ が水素原子である場合は、 $Y^{2A}$ 、 $Y^{3A}$ 及び $Y^{4A}$ の全てが同時に水素原子になることはない。]で表されるN-(シクロ)アルコキシアミド化合物である、請求項1に記載の化合物又はその塩。

[請求項4]

式(1)の化合物が、

式(1B)

[化3]



[式中、 $n$ は、1、2、又は3であり、

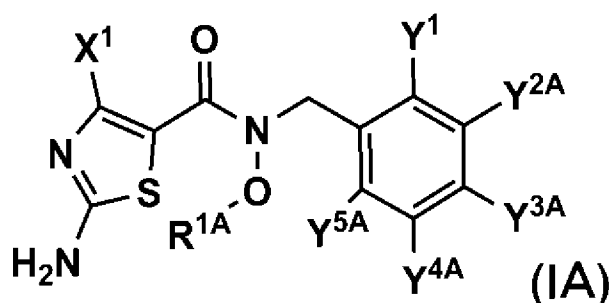
$X^1$ は、ハロゲンであり、

$Y^1$ 、 $Y^2$ 、 $Y^3$ 、 $Y^4$ 及び $Y^5$ は、それぞれ独立に、水素原子、ハロゲン、 $(C_1-C_6)$ -アルキル、 $(C_1-C_6)$ -ハロアルキル、ニトロ、又はシアノである。] で表されるN-アルキニルオキシアミド化合物である、請求項1に記載の化合物又はその塩。

[請求項5] 式(Ⅰ)の化合物が、

式(ⅠA)：

[化4]



[式中、 $R^{1A}$ は、 $(C_1-C_4)$ -アルキル、又は $(C_3-C_4)$ -シクロアルキルであり、

$X^1$ は、ハロゲンであり、

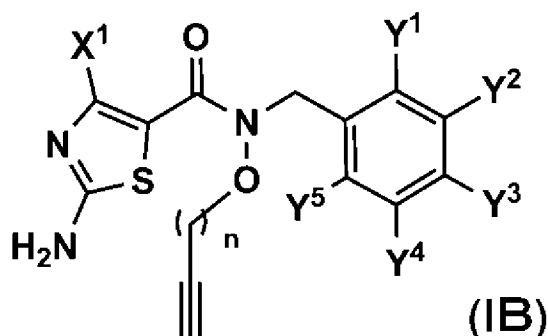
$Y^1$ は、ハロゲン、 $(C_1-C_6)$ -アルキル、 $(C_1-C_6)$ -ハロアルキル、ニトロ、シアノ、又は水素原子であり、

$Y^{2A}$ 、 $Y^{3A}$ 及び $Y^{4A}$ は、それぞれ独立に、水素原子、又はハロゲンであり、

$Y^{5A}$ は、水素原子である。ただし、 $Y^1$ が水素原子である場合は、 $Y^{2A}$ 、 $Y^{3A}$ 及び $Y^{4A}$ の全てが同時に水素原子になることはない。] で表されるN-(シクロ)アルコキシアミド化合物、又は

式(ⅠB)：

[化5]



[式中、 $n$ は、1、2、又は3であり、

$X^1$ は、ハロゲンであり、

$Y^1$ 、 $Y^2$ 、 $Y^3$ 、 $Y^4$ 及び $Y^5$ は、それぞれ独立に、水素原子、ハロゲン、 $(C_1-C_6)$ -アルキル、 $(C_1-C_6)$ -ハロアルキル、ニトロ、又はシアノである。]で表されるN-アルキニルオキシアミド化合物である、請求項1に記載の化合物又はその塩。

[請求項6]  $Y^1$ が、ハロゲン、 $(C_1-C_6)$ -アルキル、 $(C_1-C_6)$ -ハロアルキル、ニトロ、又はシアノである、請求項1～5のいずれか一項に記載の化合物又はその塩。

[請求項7]  $R^{1A}$ が、メチル、エチル又はシクロプロピルである、請求項3又は請求項5に記載の化合物又はその塩。

[請求項8]  $Y^5$ が、水素原子である請求項1、請求項2、請求項4又は請求項5のいずれか一項に記載の化合物又はその塩。

[請求項9] 請求項1から請求項5のいずれか一項に記載の化合物又はその塩を有効成分として含有する農園芸用殺菌剤。

[請求項10] 請求項1から請求項5のいずれか一項に記載の化合物又はその塩の有効量を、植物体、植物病原菌又は土壤に施用し、有害な植物病害を防除する方法。

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2024/030537

|                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                               |                                                                                                                    |                                                                              |
|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|------------------------------------------------------------------------------|
| <b>A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER</b><br><b>C07D 277/56</b> (2006.01)i; <b>A01N 43/78</b> (2006.01)i; <b>A01P 3/00</b> (2006.01)i<br>FI: C07D277/56 CSP; A01N43/78 D; A01P3/00<br><br>According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  |                                                                                                                    |                                                                              |
| <b>B. FIELDS SEARCHED</b><br><br>Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)<br>C07D277/56; A01N43/78; A01P3/00<br><br>Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched<br>Published examined utility model applications of Japan 1922-1996<br>Published unexamined utility model applications of Japan 1971-2024<br>Registered utility model specifications of Japan 1996-2024<br>Published registered utility model applications of Japan 1994-2024<br><br>Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)<br>CAPLUS/REGISTRY (STN)                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                 |                                                                                                                    |                                                                              |
| <b>C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT</b>                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                 |                                                                                                                    |                                                                              |
| Category*                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                     | Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages                                 | Relevant to claim No.                                                        |
| A                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                             | JP 2011-001358 A (SUMITOMO CHEMICAL COMPANY, LIMITED) 06 January 2011<br>(2011-01-06)<br>entire text, all drawings | 1-10                                                                         |
| A                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                             | REGISTRY(STN) [online], 03 April 2019, p. 1, [retrieved on 17 October 2024], CAS:<br>2299658-69-6<br>entire text   | 1-10                                                                         |
| A                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                             | JP 09-031069 A (NISSAN CHEMICAL INDUSTRIES, LTD.) 04 February 1997<br>(1997-02-04)<br>entire text, all drawings    | 1-10                                                                         |
| P, A                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                          | WO 2023/176458 A1 (ISHIHARA SANGYO KAISHA, LTD.) 21 September 2023<br>(2023-09-21)<br>entire text, all drawings    | 1-10                                                                         |
| <input 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>“&amp;” document member of the same patent family</p> |                                                                                                                    |                                                                              |
| Date of the actual completion of the international search<br><b>17 October 2024</b>                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                           |                                                                                                                    | Date of mailing of the international search report<br><b>29 October 2024</b> |
| Name and mailing address of the ISA/JP<br><b>Japan Patent Office (ISA/JP)</b><br><b>3-4-3 Kasumigaseki, Chiyoda-ku, Tokyo 100-8915</b><br><b>Japan</b>                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                        |                                                                                                                    | Authorized officer<br><br>Telephone No.                                      |

**INTERNATIONAL SEARCH REPORT**  
**Information on patent family members**

International application No.

**PCT/JP2024/030537**

| Patent document<br>cited in search report |             |    | Publication date<br>(day/month/year) | Patent family member(s) | Publication date<br>(day/month/year) |
|-------------------------------------------|-------------|----|--------------------------------------|-------------------------|--------------------------------------|
| JP                                        | 2011-001358 | A  | 06 January 2011                      | (Family: none)          |                                      |
| JP                                        | 09-031069   | A  | 04 February 1997                     | (Family: none)          |                                      |
| WO                                        | 2023/176458 | A1 | 21 September 2023                    | (Family: none)          |                                      |

A. 発明の属する分野の分類（国際特許分類（IPC））

C07D 277/56(2006.01)i; A01N 43/78(2006.01)i; A01P 3/00(2006.01)i

FI: C07D277/56 CSP; A01N43/78 D; A01P3/00

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料（国際特許分類（IPC））

C07D277/56; A01N43/78; A01P3/00

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

日本国実用新案公報

1922 - 1996年

日本国公開実用新案公報

1971 - 2024年

日本国実用新案登録公報

1996 - 2024年

日本国登録実用新案公報

1994 - 2024年

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）

CAplus/REGISTRY (STN)

C. 関連すると認められる文献

| 引用文献の<br>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<br>請求項の番号 |
|-----------------|---------------------------------------------------------------------------------------|----------------|
| A               | JP 2011-001358 A（住友化学株式会社）06.01.2011（2011 - 01 - 06）<br>全文，全図                         | 1-10           |
| A               | REGISTRY(STN)[Online]，2019.04.03，p.1，[検索日：2024年10月17日]，CAS登録番<br>号：2299658-69-6<br>全文 | 1-10           |
| A               | JP 09-031069 A（日産化学工業株式会社）04.02.1997（1997 - 02 - 04）<br>全文，全図                         | 1-10           |
| P, A            | WO 2023/176458 A1（石原産業株式会社）21.09.2023（2023 - 09 - 21）<br>全文，全図                        | 1-10           |

☐ C欄の続きにも文献が列挙されている。

☒ パテントファミリーに関する別紙を参照。

\* 引用文献のカテゴリー

“A” 特に関連のある文献ではなく、一般的技术水準を示すもの

“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

国際調査を完了した日

17. 10. 2024

国際調査報告の発送日

29. 10. 2024

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）

▲来▼田 優来 4P 5281

電話番号 03-3581-1101 内線 3492

様式 PCT/ISA/210（第2ページ）（2022年7月）

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/JP2024/030537

| 引用文献 |             |    | 公表日        | パテントファミリー文献 | 公表日 |
|------|-------------|----|------------|-------------|-----|
| JP   | 2011-001358 | A  | 06.01.2011 | (ファミリーなし)   |     |
| JP   | 09-031069   | A  | 04.02.1997 | (ファミリーなし)   |     |
| WO   | 2023/176458 | A1 | 21.09.2023 | (ファミリーなし)   |     |