

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 公開特許公報(A)

(11) 特許出願公開番号

特開2017-1954

(P2017-1954A)

(43) 公開日 平成29年1月5日(2017.1.5)

(51) Int.Cl.	F I	テーマコード (参考)
C O 7 D 401/12 (2006.01)	C O 7 D 401/12 C S P	4 C O 6 3
C O 7 D 401/14 (2006.01)	C O 7 D 401/14	4 C O 6 4
C O 7 D 409/14 (2006.01)	C O 7 D 409/14	4 H O 1 1
C O 7 D 405/14 (2006.01)	C O 7 D 405/14	
C O 7 D 451/02 (2006.01)	C O 7 D 451/02	
審査請求 未請求 請求項の数 8 O L (全 49 頁) 最終頁に続く		

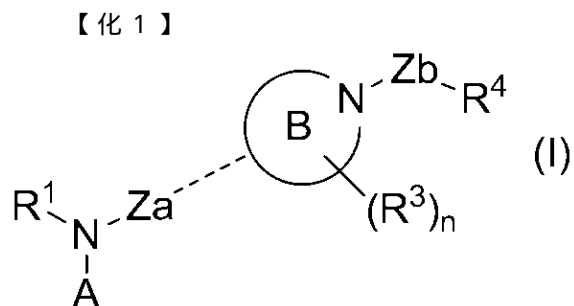
(21) 出願番号	特願2013-232450 (P2013-232450)	(71) 出願人	000000354
(22) 出願日	平成25年11月8日 (2013.11.8)		石原産業株式会社
			大阪府大阪市西区江戸堀一丁目3番15号
		(72) 発明者	岡本 智裕
			滋賀県草津市西洪川二丁目3番1号 石原
			産業株式会社 中央研究所内
		(72) 発明者	佃 晋太郎
			滋賀県草津市西洪川二丁目3番1号 石原
			産業株式会社 中央研究所内
		(72) 発明者	河合 ゆずか
			滋賀県草津市西洪川二丁目3番1号 石原
			産業株式会社 中央研究所内
		(72) 発明者	大野 将也
			滋賀県草津市西洪川二丁目3番1号 石原
			産業株式会社 中央研究所内
			最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 含窒素飽和複素環化合物

(57) 【要約】

【課題】 幅広い植物病原菌に対する高い防除効果を発揮する農園芸用殺菌剤を提供する。

【解決手段】 本発明は、式 (I) :



[式中、各記号は明細書中と同義である] で表される化合物又はその塩、本発明化合物を有効成分として含有する農園芸用殺菌剤、並びに本発明化合物を施用する、植物病原菌の防除方法及び植物病害の防除方法を提供する。

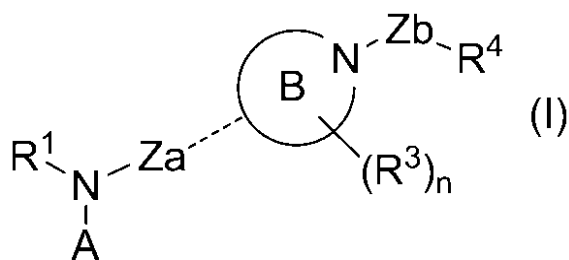
【選択図】 なし

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I) :

【化 1】

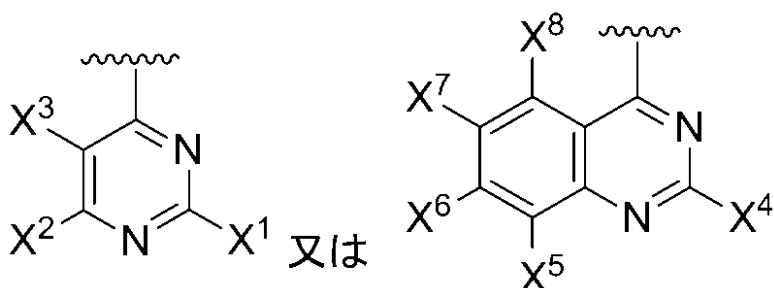


10

[式中、

A は、式 :

【化 2】



20

(式中、 $X^1 \sim X^8$ は、それぞれ同一又は異なって、水素、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルケニル、ハロアルケニル、ヒドロキシ、アルコキシ、ハロアルコキシ、ニトロ、シアノ、アルコキシカルボニル、アルキルチオ及びハロアルキルチオからなる群から選択される) で表される基であり ;

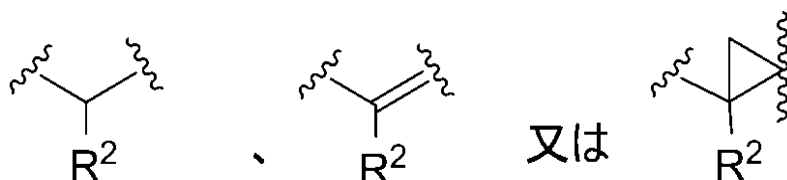
R^1 は、水素、アルキル、シクロアルキル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、又はアルコキシカルボニルであり ;

Za は、結合手又はアルキレンであり ;

破線は、

30

【化 3】



を表し ;

R^2 は、水素、アルキル又はハロアルキルであり ;

B は、ピロリジン、ピペリジン又はアゼパンであって、アルキレンで架橋されていてもよく ;

40

R^3 は、ハロゲン又はアルキルであり ;

n は、0 ~ 4 の整数であり ;

Zb は、結合手又は $-Zb^1-Zb^2-$ で表される基であって、

Zb^1 は、カルボニル、チオカルボニル、スルホニル、スルフィニル、アルキレン又はハロアルキレンであり、 Zb^2 は、結合手、カルボニル、チオカルボニル、スルホニル、スルフィニル、アルキレン、ハロアルキレン又は $-NR^a-$ (R^a は水素またはアルキルである) であり、 Zb^1 及び Zb^2 は同一ではなく ;

R^4 は、 Y^1 で置換されてもよいアルキル、 Y^1 で置換されてもよいアルケニル、 Y^2 で置換されてもよいシクロアルキル、ヒドロキシ、 Y^1 で置換されてもよいアルコキシ、 Y^2 で置換されてもよいアリーロキシ、 Y^2 で置換されてもよいヘテロシリルオキシ、

50

Y^1 で置換されてもよいアルキルチオ、 Y^2 で置換されてもよいアミノ、 Y^2 で置換されてもよいアリール、又は Y^2 で置換されてもよいヘテロシクリルであり；

Y^1 は、ハロゲン、シクロアルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、ハロアルコキシ、ニトロ、シアノ、アルコキシカルボニル、アルキルチオ、ハロアルキルチオ、アリール及びヘテロシクリルからなる群から選択され、

Y^2 は、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、シクロアルキル、アルケニル、ハロアルケニル、ヒドロキシ、アルコキシ、ハロアルコキシ、ニトロ、シアノ、アルコキシカルボニル、アルキルカルボニル、アルキルチオ、ハロアルキルチオ、アリール及びヘテロシクリルからなる群から選択される；

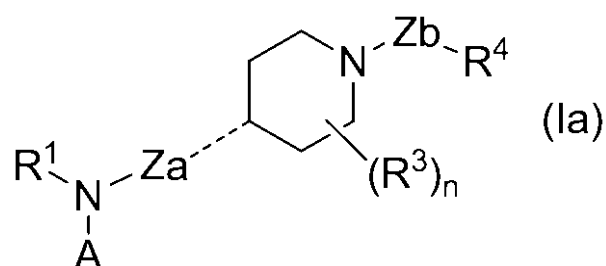
ただし、 X^3 がハロゲンである場合、 X^2 は水素ではない]

で表される化合物又はその塩。

【請求項 2】

式 (I a) :

【化 4】

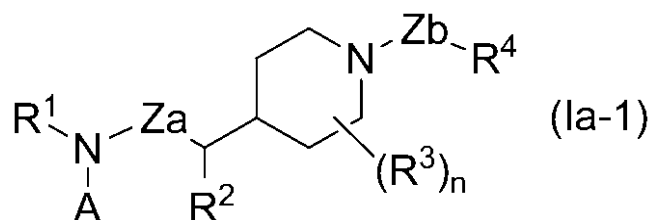


[式中、各記号は、請求項 1 と同義である] で表される、請求項 1 に記載の化合物又はその塩。

【請求項 3】

式 (I a - 1) :

【化 5】

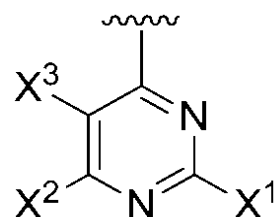


[式中、各記号は、請求項 1 と同義である] で表される、請求項 1 に記載の化合物又はその塩。

【請求項 4】

A が、式：

【化 6】



(式中、各記号は、請求項 1 と同義である) で表される基である、請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の化合物又はその塩。

【請求項 5】

A が、式：

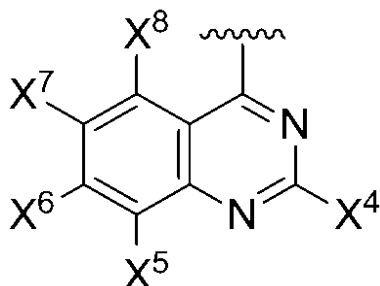
10

20

30

40

【化 7】



(式中、各記号は、請求項 1 に記載の定義と同義である) で表される基である、請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の化合物又はその塩。 10

【請求項 6】

請求項 1 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 7】

請求項 1 に記載の化合物又はその塩の有効量を施用して、植物病原菌を防除する方法。

【請求項 8】

請求項 1 に記載の化合物又はその塩の有効量を施用して、植物病害を防除する方法。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

20

本発明は、新規な含窒素飽和複素環を有する化合物又はその塩、当該化合物又はその塩を有効成分とする農園芸用殺菌剤、並びに当該化合物又はその塩を施用する、植物病原菌の防除方法及び植物病害の防除方法に関する。

【背景技術】

【0002】

医薬として有用なアミノキナゾリン化合物及びアミノピリミジン化合物が知られている。含窒素飽和複素環を有するアミノキナゾリン化合物としては、抗細菌剤として有用な 3 位がエテニル基で置換されたピペリジン環を有するアミノキナゾリン化合物が特許文献 1 に記載されている。含窒素飽和複素環を有するアミノピリミジン化合物としては、BTK (Bruton's tyrosine kinase) 阻害剤として有用なピリミジン環上の置換基に特徴を有するアミノピリミジン化合物が特許文献 2 に記載されている。 30

【0003】

また、アミノピリミジン化合物であるジフルメトリム(一般名)が農園芸用殺菌剤として使用されているが、含窒素飽和複素環は有していない(非特許文献 1)。

このように、農園芸用殺菌剤として有用な、含窒素飽和複素環を有するアミノキナゾリン化合物又はアミノピリミジン化合物は知られていない。

【先行技術文献】

【特許文献】

【0004】

40

【特許文献 1】国際公開公報 WO 00 / 021948

【特許文献 2】国際公開公報 WO 2012 / 170976

【非特許文献】

【0005】

【非特許文献 1】The Pesticide Manual (第 16 版; BRITISH CROP PROTECTION COUNCIL) 358 ~ 359 頁

【発明の概要】

【発明が解決しようとする課題】

【0006】

従来から、植物病害を防除するために提供された多くの薬剤は、各々そのスペクトラムや植物病原菌防除効果において特徴を有している。例えば、特定の植物病害に対して効果 50

が十分でなかったり、予防効果に比べて治療効果がやや劣ったり、或いは耐雨性が劣ったり残効性が比較的短かったりして、施用場面によっては、植物病原菌に対し実用上不十分な防除効果しか示さないことがある。従って、施用場面によらず、幅広い植物病原菌に対する高い防除効果を発揮する農園芸用殺菌剤の創製が希求されている。

【課題を解決するための手段】

【0007】

本発明者らは、前述の問題点を解決すべく研究した結果、式(I)で表される化合物又はその塩が農園芸用殺菌剤としての有用な性質を有し、種々の植物病害に対して優れた防除効果を発現するとの知見を得て、本発明を完成した。

【0008】

10

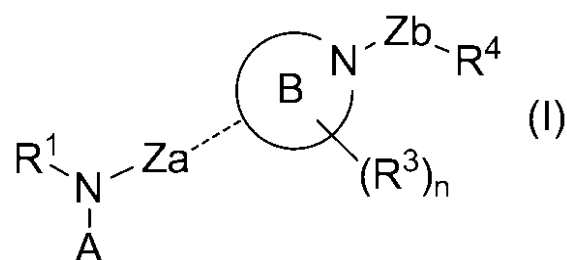
すなわち本発明は、式(I)：

【0009】

式(I)：

【0010】

【化1】



20

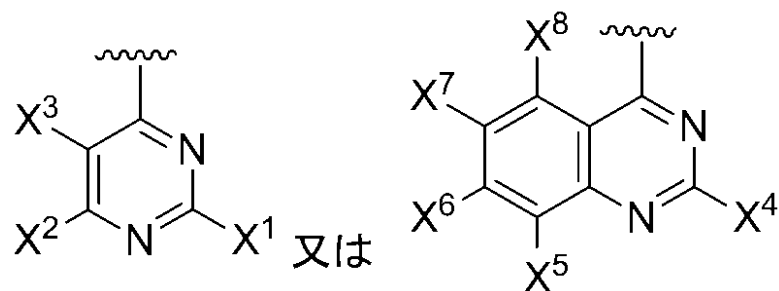
【0011】

[式中、

Aは、式：

【0012】

【化2】



30

【0013】

(式中、 $X^1 \sim X^8$ は、それぞれ同一又は異なって、水素、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルケニル、ハロアルケニル、ヒドロキシ、アルコキシ、ハロアルコキシ、ニトロ、シアノ、アルコキシカルボニル、アルキルチオ及びハロアルキルチオからなる群から選択される)で表される基であり；

40

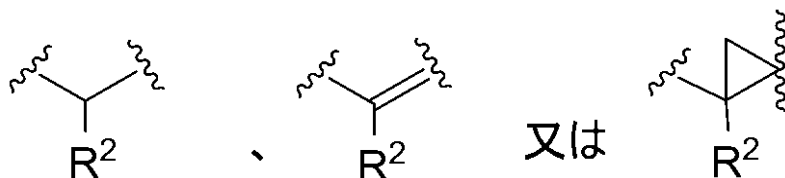
R^1 は、水素、アルキル、シクロアルキル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、又はアルコキシカルボニルであり；

Za は、結合手又はアルキレンであり；

破線は、

【0014】

【化 3】



【0015】

を表し；

R^2 は、水素、アルキル又はハロアルキルであり；

B は、ピロリジン、ピペリジン又はアゼパンであって、アルキレンで架橋されていてもよ

10

く；

R^3 は、ハロゲン又はアルキルであり；

n は、0 ~ 4 の整数であり；

Zb は、結合手又は $-Zb^1-Zb^2-$ で表される基であって、

Zb^1 は、カルボニル、チオカルボニル、スルホニル、スルフィニル、アルキレン又はハロアルキレンであり、 Zb^2 は、結合手、カルボニル、チオカルボニル、スルホニル、スルフィニル、アルキレン、ハロアルキレン又は $-NR^a-$ (R^a は水素またはアルキルである) であり、 Zb^1 及び Zb^2 は同一ではなく；

R^4 は、 Y^1 で置換されてもよいアルキル、 Y^1 で置換されてもよいアルケニル、 Y^2 で置換されてもよいシクロアルキル、ヒドロキシ、 Y^1 で置換されてもよいアルコキシ、 Y^2 で置換されてもよいアリールオキシ、 Y^2 で置換されてもよいヘテロシクリルオキシ、 Y^1 で置換されてもよいアルキルチオ、 Y^2 で置換されてもよいアミノ、 Y^2 で置換されてもよいアリール、又は Y^2 で置換されてもよいヘテロシクリルであり；

20

Y^1 は、ハロゲン、シクロアルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、ハロアルコキシ、ニトロ、シアノ、アルコキシカルボニル、アルキルカルボニル、アルキルチオ、ハロアルキルチオ、アリール及びヘテロシクリルからなる群から選択され、

Y^2 は、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、シクロアルキル、アルケニル、ハロアルケニル、ヒドロキシ、アルコキシ、ハロアルコキシ、ニトロ、シアノ、アルコキシカルボニル、アルキルカルボニル、アルキルチオ、ハロアルキルチオ、アリール及びヘテロシクリルからなる群から選択される；

30

ただし、 X^3 がハロゲンである場合、 X^2 は水素ではない]

で表される化合物又はその塩(以下、本発明化合物ともいう)、本発明化合物を有効成分として含有する農園芸用殺菌剤、並びに本発明化合物を施用する、植物病原菌の防除方法及び植物病害の防除方法を提供する。

【発明の効果】

【0016】

本発明化合物は、幅広い植物病原菌に対する高い防除効果を有する。

【発明を実施するための形態】

【0017】

本明細書において、特に言及しない限り、ハロゲン又は置換基としてのハロゲンとしては、フッ素、塩素、臭素又はヨウ素が挙げられる。置換基としてのハロゲンの数は1又は2以上であってよく、2以上の場合、各ハロゲンは同一でもよく相異なってもよい。また、ハロゲンの置換位置はいずれの位置でもよい。

40

【0018】

本明細書において、特に言及しない限り、アルキル又はアルキル部分としては、直鎖状又は分枝鎖状のいずれでもよく、その具体例としては、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、t-ブチル、ペンチル、イソペンチル、ネオペンチル、ヘキシルのような $C_1 - C_6$ のものなどが挙げられる。

【0019】

本明細書において、特に言及しない限り、アルケニル又はアルケニル部分としては、直

50

鎖状又は分枝鎖状のいずれでもよく、その具体例としては、ビニル、1 - プロペニル、アリル、イソプロペニル、1 - ブテニル、1, 3 - ブタジエニル、1 - ヘキセニルのような C_{2-6} のものなどが挙げられる。

【0020】

本明細書において、特に言及しない限り、シクロアルキルとしては、架橋していてもよく、その具体例としては、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、ノルボルナニル、アダマンチルのような C_{3-10} のものなどが挙げられる。

【0021】

本明細書において、特に言及しない限り、アリール又はアリール部分としては、フェニル、ナフチル、インデニルのような C_{6-10} のものなどが挙げられる。

10

【0022】

本明細書において、特に言及しない限り、ヘテロシクリル又はヘテロシクリル部分としては、窒素原子、酸素原子及び硫黄原子から選ばれる1～4個のヘテロ原子を環構成原子として含む飽和又は不飽和の環から誘導される基が挙げられる。ヘテロシクリル又はヘテロシクリル部分は、単環であってもよいし、多環であってもよく、オキシ基(=O)で置換されていてもよい。

その具体例としては、オキシラニルのような3員環；フリル、ジヒドロフリル、テトラヒドロフリル、チエニル、ピロリル、ピロリニル、ピロリジニル、ジオキサラニル、オキサゾリル、イソキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、イミダゾリル、イミダゾリニル、イミダゾリジニル、ピラゾリル、ピラゾリニル、ピラゾリジニル、トリアゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、テトラゾリルなどの5員環；ピラニル、ピリジル、ペリジニル、ジオキサニル、オキサジニル、モルホリニル、チアジニル、ピリダジニル、ピリミジニル、ピラジニル、ピペラジニル、トリアジニルなどの6員環；ベンゾフラニル、イソベンゾフラニル、ジヒドロベンゾフラニル、ジヒドロイソベンゾフラニル、ベンゾチエニル、イソベンゾチエニル、ジヒドロベンゾチエニル、ジヒドロイソベンゾチエニル、テトラヒドロベンゾチエニル、インドリル、イソインドリル、ベンゾオキサゾリル、ベンゾチアゾリル、インダゾリル、ベンズイミダゾリル、ベンゾジオキサラニル、ベンゾジオキサニル、クロメニル、クロマニル、イソクロマニル、クロモニル、クロマノニル、キノリル、イソキノリル、シンノリニル、フタラジニル、キナゾリニル、キノキサリニル、インドリジニル、キノリジニル、イミダゾピリジル、ナフチリジニル、プテリジニル、ジヒドロベンゾオキサジニル、ジヒドロベンゾオキサゾリノニル、ジヒドロベンゾオキサジノニル、ベンゾチオキサニルのような8～10員縮合環；や、これらにオキシ基が置換したものが挙げられる。

20

30

【0023】

本明細書において、特に言及しない限り、アルキレンとしては、直鎖状又は分枝鎖状のいずれでもよく、その具体例としては、メチレン、エチレン、トリメチレン、テトラメチレン、ペンタメチレン、ヘキサメチレン、(メチル)メチレン、(エチル)メチレン、(プロピル)メチレン、(イソプロピル)メチレン、ジ(メチル)メチレン、(メチル)(エチル)メチレン、1 - メチルエチレン、2 - メチルエチレンのような C_{1-6} のものが挙げられる。

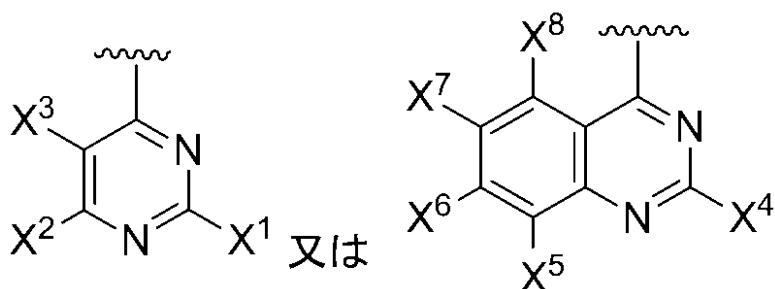
40

【0024】

Aは、式：

【0025】

【化 4】



【0026】

10

(式中、 $X^1 \sim X^8$ は、それぞれ同一又は異なって、水素、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルケニル、ハロアルケニル、ヒドロキシ、アルコキシ、ハロアルコキシ、ニトロ、シアノ、アルコキシカルボニル、アルキルチオ及びハロアルキルチオからなる群から選択され、 X^3 がハロゲンである場合、 X^2 は水素ではない) で表される基である。

【0027】

X^1 は、好ましくは、水素、アルキル、ハロアルキル、アルケニル、ハロアルケニル、ヒドロキシ、アルコキシ、ハロアルコキシ、ニトロ及びアルコキシカルボニルからなる群から選択され、より好ましくは水素、アルキルである。

X^2 は、好ましくは、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルケニル、ハロアルケニル、ヒドロキシ、アルコキシ、ハロアルコキシ、ニトロ、シアノ、アルコキシカルボニル、アルキルチオ及びハロアルキルチオからなる群から選択され、より好ましくは、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルコキシカルボニルである。

20

X^3 は、好ましくは、水素、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルケニル、ハロアルケニル、ヒドロキシ、アルコキシ、ハロアルコキシ、シアノ、アルコキシカルボニル、アルキルチオ及びハロアルキルチオからなる群から選択され、より好ましくは、水素、ハロゲン、アルコキシ、アルコキシカルボニルである。

また、 X^2 及び X^3 の両方が水素ではないものが好ましい。

【0028】

X^4 は、より好ましくは水素である。

X^5 は、より好ましくは水素、ハロゲン (特に、フッ素) である。

30

X^6 は、より好ましくは水素である。

X^7 は、好ましくは、水素、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルケニル、ハロアルケニル、ヒドロキシ、ニトロ、シアノ、アルコキシカルボニル、アルキルチオ及びハロアルキルチオからなる群から選択され、より好ましくは水素である。

X^8 は、好ましくは、水素、フッ素、塩素、ヨウ素、アルキル、ハロアルキル、アルケニル、ハロアルケニル、ヒドロキシ、アルコキシ、ハロアルコキシ、ニトロ、シアノ、アルコキシカルボニル、アルキルチオ及びハロアルキルチオからなる群から選択され、より好ましくは水素、フッ素である。

また、 X^8 がハロゲンである場合、 X^5 がハロゲンであることが好ましい。

40

【0029】

R^1 は、水素、アルキル、シクロアルキル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、又はアルコキシカルボニルであり、好ましくは、水素、アルキル、ハロアルキルである。

【0030】

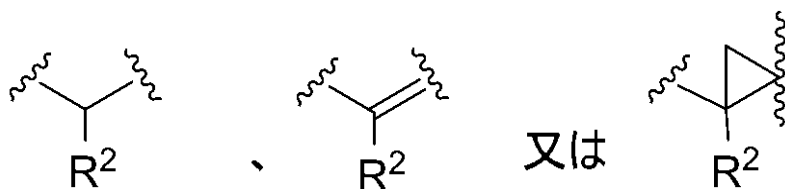
Za は、結合手又はアルキレンであり、より好ましくは、結合手、メチレン、エチレン、(メチル)メチレン、(エチル)メチレンである。

【0031】

破線は、

【0032】

【化 5】



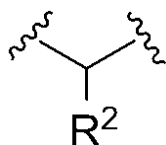
【0033】

を表し、好ましくは、

【0034】

10

【化 6】



【0035】

である。ここで、波線の左側は Z a 基に結合し、右側は B 環に結合することを表し、シクロプロピレン環を構成する 3 つの炭素原子の内、波線と重なっている 1 つの炭素原子は B 環の一部でもあることを示している。

【0036】

20

R² は、水素、アルキル又はハロアルキルであり、好ましくは、水素、アルキルである。

【0037】

式 (I) 中の B で表される環は、ピロリジン、ピペリジン又はアゼパンであって、アルキレンで架橋されていてもよい。架橋するアルキレンはメチレン、エチレンのような C₁₋₃ のものが好ましく、架橋位置は特に限定されない。式 (I) 中の B で表される環は、好ましくはピペリジンである。

【0038】

B で表される環は R³ で置換されていてもよく、n が 2 以上の場合、2 以上の R³ は同一であっても相異なってもよい。また、R³ の置換位置はいずれの位置でもよい。

30

R³ は、ハロゲン又はアルキルであり、好ましくはハロゲンである。

【0039】

Z b は、結合手又は - Z b¹ - Z b² - で表される基である。

ここで、Z b¹ 及び Z b² は同一ではなく、Z b¹ は、カルボニル、チオカルボニル、スルホニル、スルフィニル、アルキレン又はハロアルキレンであり、Z b² は、結合手、カルボニル、チオカルボニル、スルホニル、スルフィニル、アルキレン、ハロアルキレン又は - N R^a - (R^a は水素またはアルキルである) である。

Z b¹ は、好ましくは、カルボニル、チオカルボニル、スルホニル、アルキレンであり、Z b² は、好ましくは、結合手、カルボニル、アルキレン、ハロアルキレン、- N R^a - (R^a は前記と同義) である。

40

【0040】

Z b の具体例としては、結合手、カルボニル、スルホニル、アルキレン、カルボニル - アルキレン、カルボニル - ハロアルキレン、チオカルボニル - アルキレン、アルキレン - カルボニル、カルボニル - N R^a - (R^a は前記と同義)、チオカルボニル - N R^a - (R^a は前記と同義) が挙げられる。

【0041】

R⁴ は、Y¹ で置換されてもよいアルキル、Y¹ で置換されてもよいアルケニル、Y² で置換されてもよいシクロアルキル、ヒドロキシ、Y¹ で置換されてもよいアルコキシ、Y² で置換されてもよいアリーロキシ、Y² で置換されてもよいヘテロシクリルオキシ、Y¹ で置換されてもよいアルキルチオ、Y² で置換されてもよいアミノ、Y² で置換さ

50

れてもよいアリール、又は Y^2 で置換されてもよいヘテロシクリルであり、好ましくは、 Y^1 で置換されてもよいアルキル、 Y^2 で置換されてもよいシクロアルキル、 Y^1 で置換されてもよいアルコキシ、 Y^2 で置換されてもよいアリールオキシ、 Y^2 で置換されてもよいヘテロシクリルオキシ、 Y^2 で置換されてもよいアリール、又は Y^2 で置換されてもよいヘテロシクリルである。

Y^1 及び Y^2 の置換数は 1 又は 2 以上であってよく、2 以上の場合、これら置換基は同一でも相異なっていてよい。また、 Y^1 及び Y^2 の置換位置はいずれの位置でもよい。

【0042】

Y^1 の具体例としては、ハロゲン、アリールが挙げられ、 Y^2 の具体例としては、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ニトロ、アルコキシカルボニル、アルキルカルボニルが挙げられる。

【0043】

本発明化合物の塩としては、当該技術分野で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、塩酸、臭化水素酸、硫酸、リン酸などの無機酸との塩；酒石酸、ギ酸、酢酸、クエン酸、フマル酸、マレイン酸、トリクロロ酢酸及びトリフルオロ酢酸などの有機カルボン酸との塩；メタンスルホン酸、ベンゼンスルホン酸、p-トルエンスルホン酸、メシチレンスルホン酸及びナフタレンスルホン酸などのスルホン酸との塩；などが挙げられる。

【0044】

また、本発明化合物には、幾何異性体、互変異性体、光学異性体のような異性体が存在する場合があるが、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。本願明細書においては、特に言及しない限り、異性体は混合物として記載する。尚、本発明には、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。

【0045】

また、異性体の種類によっては、記載した構造式とは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。

【0046】

本発明化合物の望ましい態様としては、以下の化合物などが挙げられるが、本発明化合物はこれらに限定されるものではない。

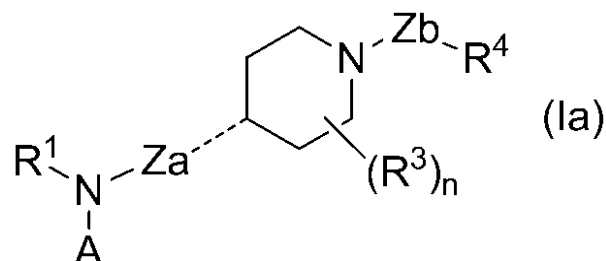
【0047】

(1) 前記式 (I) で表される化合物又はその塩。

(2) 式 (Ia) :

【0048】

【化7】



【0049】

[式中、各記号は前記と同義である] で表される化合物又はその塩。

【0050】

(3) 式 (Ia-1) :

【0051】

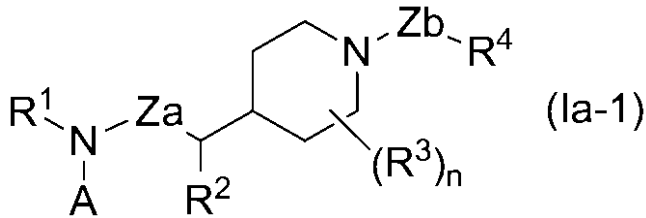
10

20

30

40

【化 8】



【 0 0 5 2 】

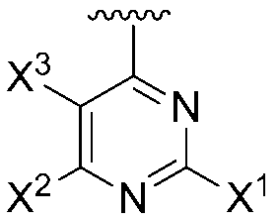
[式中、各記号は前記と同義である] で表される化合物又はその塩。

【 0 0 5 3 】

(4) A が、式：

【 0 0 5 4 】

【化 9】



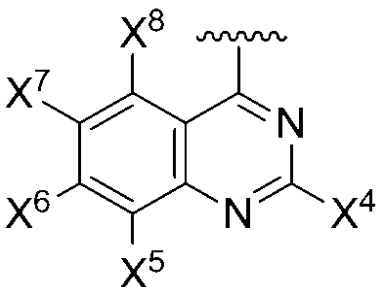
【 0 0 5 5 】

(式中、各記号は前記と同義である) で表される基である、前記 (1) ~ (3) の化合物又はその塩。

(5) A が、式：

【 0 0 5 6 】

【化 10】



【 0 0 5 7 】

(式中、各記号は前記と同義である) で表される基である、前記 (1) ~ (3) の化合物又はその塩。

【 0 0 5 8 】

(6) X¹ が、水素、アルキル、ハロアルキル、アルケニル、ハロアルケニル、ヒドロキシ、アルコキシ、ハロアルコキシ、ニトロ及びアルコキシカルボニルからなる群から選択される、前記 (4) の化合物又はその塩。(7) X² が、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルケニル、ハロアルケニル、ヒドロキシ、アルコキシ、ハロアルコキシ、ニトロ、シアノ、アルコキシカルボニル、アルキルチオ及びハロアルキルチオからなる群から選択される、前記 (4) の化合物又はその塩。(8) X³ が、水素、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルケニル、ハロアルケニル、ヒドロキシ、アルコキシ、ハロアルコキシ、シアノ、アルコキシカルボニル、アルキルチオ及びハロアルキルチオからなる群から選択される、前記 (4) の化合物又はその塩。

【 0 0 5 9 】

(9) X⁷ が、水素、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルケニル、ハロアルケニル、ヒドロキシ、ニトロ、シアノ、アルコキシカルボニル、アルキルチオ及びハロアルキル

10

20

30

40

50

チオからなる群から選択される、前記(5)の化合物又はその塩。

(10) X^8 が、水素、フッ素、塩素、ヨウ素、アルキル、ハロアルキル、アルケニル、ハロアルケニル、ヒドロキシ、アルコキシ、ハロアルコキシ、ニトロ、シアノ、アルコキシカルボニル、アルキルチオ及びハロアルキルチオからなる群から選択される、前記(5)の化合物又はその塩。

【0060】

本発明化合物は、以下の製法及び通常の塩の製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い。

【0061】

本発明化合物は、以下の製法〔1〕～〔4〕により製造することができる。

10

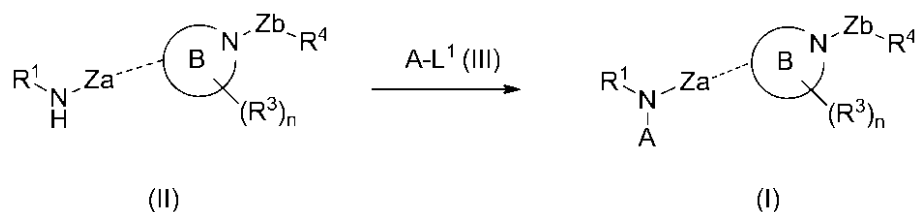
以下の製法〔1〕～〔4〕で使用される式(II)～式(VII)の化合物は、市販の化合物を使用するか、或いは市販の化合物から公知の方法によって製造したものを使用することができる。

【0062】

製法〔1〕

【0063】

【化11】



20

【0064】

製法〔1〕中、 L^1 はハロゲン（塩素、臭素、ヨウ素など）であり、その他の記号は前記と同義である。

【0065】

製法〔1〕では、式(II)の化合物と式(VII)の化合物とを反応させることにより、式(I)の化合物を製造することができる。式(II)の化合物はその酸付加塩（例えば、塩酸塩、臭化水素塩、メタンスルホン酸塩、トリフルオロ酢酸塩等）1-を使用して

30

【0066】

式(VII)の化合物は、式(II)の化合物1当量に対して1～50当量、望ましくは1～5当量の割合で使用できる。

【0067】

本反応は、通常、塩基の存在下で行うことができる。塩基としては、反応が進行すれば特に限定はなく、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アルカリ金属炭酸塩；炭酸水素ナトリウムのようなアルカリ金属の炭酸水素塩；炭酸カルシウムのようなアルカリ土類金属の炭酸塩；トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、ピリジン、4-(N,N-ジメチルアミノ)ピリジンのような有機アミン類；などを挙げる

40

ことができる。

塩基は、式(II)の化合物1当量に対して1～20当量、望ましくは1～5当量の割合で使用できる。

【0068】

本反応は、通常、溶媒の存在下で行うことができる。溶媒としては、反応が進行すれば特に限定はなく、例えばメタノール、エタノール、プロパノール、ブタノールのようなアルコール類；ベンゼン、トルエン、キシレンのような芳香族炭化水素類；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、ジブチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、エチレングリコールジメチルエーテルのようなエーテル類；アセトニトリル、プロピオニトリルのようなニトリル類；クロロホルム、ジクロロメタン、四塩化炭素、1,2-ジクロ

50

ロエタンのようなハロゲン化炭化水素類；N,N - ジメチルホルムアミド、N,N - ジメチルアセトアミド、N - メチルピロリジノンのような酸アミド類；ジメチルスルホキシドのようなスルホキシド類；スルホランのようなスルホン類；ヘキサメチルホスホルアミドのようなリン酸アミド類；及びこれらの混合溶媒などから1種又は2種以上が適宜選択されるが、中でも酸アミド類が望ましい。

【0069】

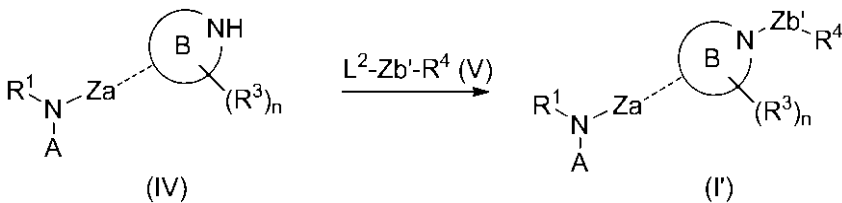
反応温度は、通常0 ~ 200、望ましくは70 ~ 120 である。反応時間は、通常1 ~ 48時間である。

【0070】

製法〔2〕

【0071】

【化12】



【0072】

製法〔2〕中、 L^2 はハロゲン（塩素、臭素、ヨウ素など）又はヒドロキシであり、 Zb' は結合手又はカルボニルであり、その他の記号は前記と同義である。

【0073】

製法〔2〕では、式（IV）の化合物と式（V）の化合物とを反応させることにより、式（I'）の化合物を得ることができる。式（IV）の化合物はその酸付加塩（例えば、塩酸塩、臭化水素塩、メタンスルホン酸塩、トリフルオロ酢酸塩等）を使用してもよい。

【0074】

式（V）の化合物は、式（IV）の化合物1当量に対して1 ~ 50当量、望ましくは2 ~ 10当量の割合で使用される。

【0075】

L^2 がハロゲンである式（V）の化合物を使用する場合、通常、塩基の存在下で本反応を行うことができる。塩基としては、反応が進行すれば特に限定はなく、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アルカリ金属炭酸塩；炭酸水素ナトリウムのようなアルカリ金属の炭酸水素塩；炭酸カルシウムのようなアルカリ土類金属の炭酸塩；トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、ピリジン、4 - (N,N - ジメチルアミノ)ピリジンのような有機アミン類；などを挙げることができる。

塩基は、式（IV）の化合物1当量に対して1 ~ 20当量、望ましくは1 ~ 5当量の割合で使用される。式（IV）の化合物が酸付加物である場合、塩基は、当該酸付加塩1当量に対して2 ~ 6当量の割合で使用される。

【0076】

本反応は、通常、溶媒の存在下で行うことができる。溶媒としては、反応が進行すれば特に限定はなく、例えばベンゼン、トルエン、キシレンのような芳香族炭化水素類；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、ジブチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、エチレングリコールジメチルエーテルのようなエーテル類；アセトニトリル、プロピオニトリルのようなニトリル類；クロロホルム、ジクロロメタン、四塩化炭素、1, 2 - ジクロロエタンのようなハロゲン化炭化水素類；N,N - ジメチルホルムアミド、N,N - ジメチルアセトアミド、N - メチルピロリジノンのような酸アミド類；ジメチルスルホキシドのようなスルホキシド類；スルホランのようなスルホン類；ヘキサメチルホスホルアミドのようなリン酸アミド類；及びこれらの混合溶媒などから1種又は2種以上が適宜選択されるが、中でも酸アミド類が望ましい。

【0077】

10

20

30

40

50

反応温度は、通常 0 ~ 200、望ましくは 70 ~ 120 である。反応時間は、通常 1 ~ 48 時間である。

【0078】

L² がヒドロキシである式 (V) の化合物を使用する場合、通常、縮合剤の存在下、必要に応じて塩基の存在下で本反応を行うことができる。縮合剤としては、反応が進行すれば特に限定はなく、例えば N, N'-ジシクロヘキシルカルボジイミドなどのようなカルボジイミド類；ベンゾトリアゾール-1-イルオキシ-トリスジメチルアミノホスホニウム塩、O-(ベンゾトリアゾール-1-イル)-N, N, N', N'-テトラメチルウロニウム テトラフルオロボラートのような BOP 試薬；などを挙げることができる。

縮合剤は、式 (IV) の化合物 1 当量に対して 1 ~ 20 当量、望ましくは 1 ~ 5 当量の割合で使用される。

10

塩基としては、反応が進行すれば特に限定はなく、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アルカリ金属炭酸塩；炭酸水素ナトリウムのようなアルカリ金属の炭酸水素塩；炭酸カルシウムのようなアルカリ土類金属の炭酸塩；トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、ピリジン、4-(N, N-ジメチルアミノ)ピリジンのような有機アミン類；などを挙げることができる。

塩基は、式 (IV) の化合物 1 当量に対して 1 ~ 20 当量、望ましくは 2 ~ 5 当量の割合で使用される。

【0079】

本反応は、通常、溶媒の存在下で行うことができる。溶媒としては、反応が進行すれば特に限定はなく、例えばベンゼン、トルエン、キシレンのような芳香族炭化水素類；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、ジブチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、エチレングリコールジメチルエーテルのようなエーテル類；アセトニトリル、プロピオニトリルのようなニトリル類；N, N-ジメチルホルムアミド、N, N-ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリジノンのような酸アミド類；ジメチルスルホキシドのようなスルホキシド類；スルホランのようなスルホン類；ヘキサメチルホスホルアミドのようなリン酸アミド類；及びこれらの混合溶媒などから 1 種又は 2 種以上が適宜選択されるが、中でもエーテル類、酸アミド類が望ましい。

20

【0080】

反応温度は、通常 0 ~ 200、望ましくは 70 ~ 120 である。反応時間は、通常 1 ~ 48 時間である。

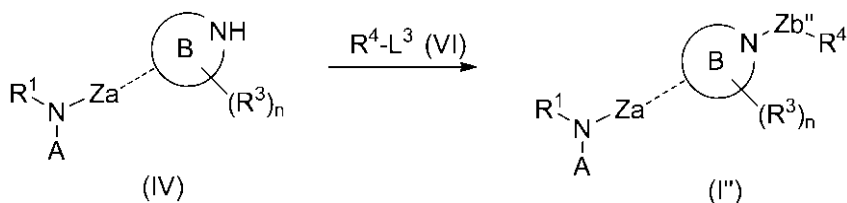
30

【0081】

製法〔3〕

【0082】

【化 13】



40

【0083】

製法〔3〕中、L³ はイソシアナト又はイソチオシアナトであり、Zb'' は -(C=O)-NH- 又は -(C=S)-NH- であり、その他の記号は前記と同義である。

【0084】

製法〔3〕では、式 (IV) の化合物と式 (VI) の化合物とを反応させることにより、式 (I') の化合物を製造することができる。式 (IV) の化合物はその酸付加塩（例えば、塩酸塩、臭化水素塩、メタンスルホン酸塩、トリフルオロ酢酸塩等）を使用してよい。

【0085】

50

式(VI)の化合物は、式(IV)の化合物1当量に対して1～50当量、望ましくは1～10当量の割合で使用される。

【0086】

式(IV)の酸付加塩を使用する場合、通常、塩基の存在下で本反応を行うことができる。塩基としては、反応が進行すれば特に限定はなく、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アルカリ金属炭酸塩；炭酸水素ナトリウムのようなアルカリ金属の炭酸水素塩；炭酸カルシウムのようなアルカリ土類金属の炭酸塩；トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、ピリジン、4-(N,N-ジメチルアミノ)ピリジンのような有機アミン類；などを挙げることができる。

塩基は、式(IV)の酸付加塩1当量に対して1～20当量、望ましくは2～5当量の割合で使用される。

10

【0087】

本反応は、通常、溶媒の存在下で行うことができる。溶媒としては、反応が進行すれば特に限定はなく、例えばメタノール、エタノール、プロパノール、ブタノールのようなアルコール類；アセトン、メチルエチルケトンなどのケトン類；ベンゼン、トルエン、キシレンのような芳香族炭化水素類；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、ジブチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、エチレングリコールジメチルエーテルのようなエーテル類；アセトニトリル、プロピオニトリルのようなニトリル類；クロロホルム、ジクロロメタン、四塩化炭素、1,2-ジクロロエタンのようなハロゲン化炭化水素類；N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリジノンのような酸アミド類；ジメチルスルホキシドのようなスルホキシド類；スルホランのようなスルホン類；ヘキサメチルホスホルアミドのようなリン酸アミド類；及びこれらの混合溶媒などから1種又は2種以上が適宜選択されるが、中でもケトン類が望ましい。

20

【0088】

反応温度は、通常0～200、望ましくは70～120である。反応時間は、通常1～48時間である。

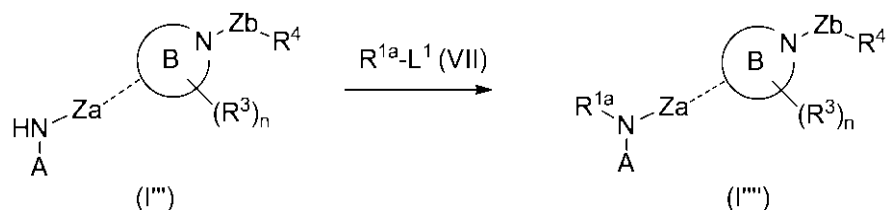
【0089】

製法〔4〕

【0090】

【化14】

30



【0091】

製法〔4〕中、R^{1a}はアルキル、シクロアルキル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、又はアルコキシカルボニルであり、その他の記号は前記と同義である。

【0092】

40

製法〔4〕では、式(I'')の化合物と式(VII)の化合物とを反応させることにより、式(I'')の化合物を製造できる。

式(I'')の化合物は、前記製法〔1〕～〔3〕により製造することができる。

【0093】

式(VII)の化合物は、式(I'')の化合物1当量に対して1～50当量、望ましくは1～5当量の割合で使用できる。

【0094】

本反応は、通常、塩基の存在下で行うことができる。塩基としては、反応が進行すれば特に限定はなく、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アルカリ金属炭酸塩；炭酸水素ナトリウムのようなアルカリ金属の炭酸水素塩；炭酸カルシウムの

50

ようなアルカリ土類金属の炭酸塩；トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、ピリジン、4 - (N , N - ジメチルアミノ) ピリジンのような有機アミン類；などを挙げる
ことができる。

塩基は、(V I I) の化合物 1 当量に対して 1 ~ 2 0 当量、望ましくは 1 ~ 5 当量の割合で使用される。

【 0 0 9 5 】

本反応は、通常、溶媒の存在下で行うことができる。溶媒としては、反応が進行すれば特に限定はなく、例えばメタノール、エタノール、プロパノール、ブタノールのようなアルコール類；ベンゼン、トルエン、キシレンのような芳香族炭化水素類；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、ジブチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、エチレングリコールジメチルエーテルのようなエーテル類；アセトニトリル、プロピオニトリルのようなニトリル類；クロロホルム、ジクロロメタン、四塩化炭素、1, 2 - ジクロロエタンのようなハロゲン化炭化水素類；N, N - ジメチルホルムアミド、N, N - ジメチルアセトアミド、N - メチルピロリジノンのような酸アミド類；ジメチルスルホキシドのようなスルホキシド類；スルホランのようなスルホン類；ヘキサメチルホスホルアミドのようなリン酸アミド類；及びこれらの混合溶媒などから 1 種又は 2 種以上が適宜選択されるが、中でも酸アミド類が望ましい。

10

【 0 0 9 6 】

反応温度は、通常 0 ~ 2 0 0 、望ましくは 7 0 ~ 1 2 0 である。反応時間は、通常 1 ~ 4 8 時間である。

20

【 0 0 9 7 】

本発明化合物は、例えば鞭毛菌亜門 (Mastigomycotina)、子のう菌亜門 (Ascomycotina)、担子菌亜門 (Basidiomycotina)、不完全菌亜門 (Deuteromycotina)、接合菌亜門 (Zygomycotina) などに属する植物病原菌を防除できる。

【 0 0 9 8 】

前記植物病原菌のより具体的な例としては、例えば以下のようなものなどが挙げられる。

【 0 0 9 9 】

鞭毛菌亜門として、ジャガイモまたはトマト疫病菌 (*Phytophthora infestans*)、トマト灰色疫病菌 (*Phytophthora capsici*) のようなファイトフィトラ (*Phytophthora*) 属；キュウリべと病菌 (*Pseudoperonospora cubensis*) のようなシュウドペロノスポーラ (*Pseudoperonospora*) 属；ブドウべと病菌 (*Plasmopara viticola*) のようなプラズモパラ (*Plasmopara*) 属；イネ苗立枯病菌 (*Pythium graminicola*)、コムギ褐色雪腐病菌 (*Pythium iwayamai*) のようなピシウム (*Pythium*) 属；などが挙げられる。

30

【 0 1 0 0 】

子のう菌亜門として、コムギうどんこ病菌 (*Erysiphe graminis*) のようなエリシフェ (*Erysiphe*) 属；キュウリうどんこ病菌 (*Sphaerotheca fuliginea*)、イチゴうどんこ病菌 (*Sphaerotheca humuli*) のようなスファエロテカ (*Sphaerotheca*) 属；ブドウうどんこ病菌 (*Uncinula necator*) のようなウンシニユラ (*Uncinula*) 属；リンゴうどんこ病菌 (*Podosphaera leucotricha*) のようなポドスファエラ (*Podosphaera*) 属；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；リンゴ黒星病菌 (*Venturia inaequalis*)、ナシ黒星病菌 (*Venturia nashicola*) のようなベンチュリア (*Venturia*) 属；オオムギ網斑病菌 (*Pyrenophora teres*)、オオムギ斑葉病菌 (*Pyrenophora graminea*) のようなピレノホーラ (*Pyrenophora*) 属；インゲン菌核病菌 (*Sclerotinia sclerotiorum*) のようなスクレロティニア (*Sclerotinia*) 属；イネごま葉枯病菌 (*Cochliobolus miyabeanus*) のようなコクリオボラス (*Cochliobolus*) 属；キュウリつる枯病菌 (*Didymella bryoniae*) のようなディディメラ (*Didymella*) 属；コムギ赤かび病菌 (*Gibberella zeae*) のようなジベレラ (*Gibberella*) 属

40

50

；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；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セ (*Diaporthe*) 属；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；ブドウ晩腐病菌 (*Glomerella cingulata*) のようなグロメラ (*Glomerella*) 属；などが挙げられる。

【0101】

担子菌亜門として、イネ紋枯病菌 (*Rhizoctonia solani*) のようなリゾクトニア (*Rhizoctonia*) 属；コムギ裸黒穂病菌 (*Ustilago nuda*) のようなウスティラゴ (*Ustilago*) 属；エンパク冠さび病菌 (*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；などが挙げられる。

10

【0102】

不完全菌亜門として、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；ブドウ灰色かび病菌 (*Botrytis cinerea*) のようなボトリティス (*Botrytis*) 属；イネいもち病菌 (*Pyricularia oryzae*) のようなピリキュラリア (*Pyricularia*) 属；テンサイ褐斑病菌 (*Cercospora beticola*)、カキ角斑病菌 (*Cercospora kakivola*) のようなサーコスポーラ (*Cercospora*) 属；キュウリ炭そ病菌 (*Colletotrichum orbiculare*) のようなコレトトリカム (*Colletotrichum*) 属；リンゴ斑点落葉病菌 (*Alternaria alternata* apple pathotype)、ナシ黒斑病菌 (*Alternaria alternata* Japanese pear pathotype)、ジャガイモ夏疫またはトマト輪紋病菌 (*Alternaria solani*)、キャベツ黒斑病菌 (*Alternaria brassicae*) のようなアルタナリア (*Alternaria*) 属；コムギ眼紋病菌 (*Pseudocercospora herpotrichoides*) のようなシュウドサーコスポレラ (*Pseudocercospora*) 属；ブドウ褐斑病菌 (*Pseudocercospora vitis*) のようなシュウドサーコスポーラ (*Pseudocercospora*) 属；オオムギ雲形病菌 (*Rhynchosporium secalis*) のようなリンコスボリウム (*Rhynchosporium*) 属；モモ黒星病菌 (*Cladosporium carpophilum*) のようなクラドスポリウム (*Cladosporium*) 属；モモホモブシス腐敗病菌 (*Phomopsis* sp.) のようなホモブシス (*Phomopsis*) 属；カキ炭そ病菌 (*Gloeosporium kaki*) のようなグロエオスポリウム (*Gloeosporium*) 属；トマト葉かび病菌 (*Fulvia fulva*) のようなフルビア (*Fulvia*) 属；キュウリ褐斑病菌 (*Corynespora cassiicola*) のようなコリネスポーラ (*Corynespora*) 属；などが挙げられる。

20

30

【0103】

接合菌亜門として、イチゴ軟腐病菌 (*Rhizopus stromboli*)、モモ黒かび病菌 (*Rhizopus nigricans*) のようなリゾプス (*Rhizopus*) 属；などが挙げられる。

【0104】

本発明化合物は、農園芸用殺菌剤の有効成分として有用であり、例えばイネのいもち病、ごま葉枯病、紋枯病；ムギ類のうどんこ病、赤かび病、さび病、雪腐病、裸黒穂病、眼紋病、葉枯病、ふ枯病；カンキツの黒点病、そうか病；リンゴのモニリア病、うどんこ病、斑点落葉病、黒星病、炭そ病、褐斑病、輪紋病、すす点病、すす斑病、黒点病；ナシの黒星病、黒斑病、うどんこ病、疫病；洋ナシの輪紋病、うどんこ病；モモの灰星病、黒星病、ホモブシス腐敗病；ブドウの黒とう病、晩腐病、うどんこ病、べと病、灰色かび病、褐斑病、枝膨病；カキの炭そ病、落葉病、うどんこ病、すす点病；ウリ類の炭そ病、うどんこ病、つる枯病、べと病、疫病、褐斑病；トマトの輪紋病、葉かび病、疫病、灰色かび病、うどんこ病；アブラナ科野菜のべと病、黒斑病；パレイショの夏疫病、疫病；イチゴのうどんこ病、灰色かび病、炭そ病；種々の作物のべと病、疫病、灰色かび病、菌核病、うどんこ病などの植物病害の防除に有効であるが、特に果樹類、野菜類の疫病、べと病、ムギ類のふ枯病に優れた防除効果を示す。また、フザリウム菌、ピシウム菌、リゾクトニア菌、パーティシリウム菌、プラズモディオホーラ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。

40

【0105】

50

本発明化合物は、通常、該化合物と各種農業上の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、微量散布剤などの種々の形態に製剤して使用されるが、本発明の目的に適合するかぎり、通常の当該分野で用いられているあらゆる製剤形態にすることができる。製剤に使用する補助剤としては、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、クレー、炭酸ナトリウム、重曹、芒硝、ゼオライト、澱粉などの固型担体；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、アルコールなどの溶剤；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硫酸エステル塩、ポリオキシエチレンアルキ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；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；オリブ油、カボック油、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；などが挙げられる。

【0106】

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、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。

【0107】

本発明化合物と各種補助剤との配合割合は、一般に0.005:99.995~95:5、望ましくは0.2:99.8~90:10である。従って、農園芸用殺菌剤に占める本発明化合物の含有量は、0.005重量%~95重量%、望ましくは0.2重量%~90重量%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、又は水などの希釈剤で所定濃度に希釈し、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。

【0108】

本発明化合物の使用濃度は、対象作物、使用方法、製剤形態、施用量などの違いによって異なり、一概に規定できないが、茎葉処理の場合、有効成分当たり、通常、0.1~10,000ppm、望ましくは、1~2,000ppmである。土壌処理の場合には、通常、10~100,000g/ha、望ましくは、200~20,000g/haである。種子処理の場合、通常、0.01~100g/Kg種子、望ましくは、0.02~20g/Kg種子である。

10

20

30

40

50

【 0 1 0 9 】

本発明化合物は、その種々の製剤又はその希釈物の施用に関して、通常一般に行なわれている施用方法、すなわち、散布（例えば散布、噴霧、ミスティング、アトマイジング、散粒、水面施用など）、土壌施用（混入、灌注など）、表面施用（塗布、粉衣、被覆など）などにより行うことができる。また、いわゆる超高濃度少量散布法（ultra low volume application method）により施用することもできる。この方法においては、活性成分を 1 0 0 % 含有することが可能である。

【 0 1 1 0 】

本発明化合物は、必要に応じて他の農薬、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、植物成長調製剤などと、混用、併用することができる。

10

【 0 1 1 1 】

上記他の農薬中の、殺菌剤の有効成分化合物（一般名；一部申請中を含む、又は日本植物防疫協会試験コード）としては、例えば、

メパニピリム（mepanipirim）、ピリメサニル（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；

5-クロロ-7-(4-メチルピペリジン-1-イル)-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル) [1,2,4] トリアゾロ [1,5-a] ピリミジンのようなトリアゾロピリミジン系化合物；

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）、ピテルタノール（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）、マイクロブタニル（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）、ファーコナゾールシス（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）、オキシボ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（difenconazole）、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）、トリシクラゾール（tricyclazole）、プロベナゾール（probenazole）、シメコナゾール（simeconazole）、ペフラゾエート（pefurazoate）、イブコナゾール（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）のようなアゾール系化合物；

20

30

キノメチオネート（quinomethionate）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（fthalide）、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；

40

ベノミル（benomyl）、チオファネートメチル（thiophanate-methyl）、カーベンダジム（carbendazim）、チアベンダゾール（thiabendazole）、フベリアゾール（fuberiazole）、シアゾファミド（cyazofamid）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 - 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 - M（benalaxyl-M、別名キララキシル（kiralaxyl、chiralaxyl））、フララキシル（furalaxyl）、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）、ビキサフェン（bixafen）、イソチアニル（isotianil）、チアジニル

50

- (tiadinil)、セダキサン (sedaxane) のようなアニリド系化合物；
 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) のような銅系化合物；
 ヒメキサゾール (hymexazol) のようなイソキサゾール系化合物；
 ホセチルアルミニウム (fosetyl-Al)、トルクロホスメチル (tolclofos-Methyl)、S - ベンジル O、O - ジイソプロピルホスホロチオエート、O - エチル S、S - ジフェニルホスホロジチオエート、アルミニウムエチルハイドロゲンホスホネート、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)、キャプタホル (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) のようなベンズアニリド系化合物；
 ペンチオピラド (penthioopyrad)、ペンフルフェン (penflufen)、フラメトピル (furametpyr)、イソピラザム (isopyrazam)、シルチオフアム (silthiopham)、フェノキシニル (fenoxanil)、フェンフラム (fenfuram)、フルキサピロキサド (fluxapyroxad)、ベンゾビンジフルピル (benzovindiflupyr) のようなアミド系化合物；
 フルオピラム (fluopyram)、ゾキサミド (zoxamide) のようなベンズアミド系化合物；
 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) のようなピリジン系化合物；
 フェナリモル (fenarimol)、ヌアリモール (nuarimol) のようなカルビノール系化合物；
 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；
 フェンチンヒドロキシド (fentin hydroxide)、フェンチンアセテート (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) のようなシンナミック酸系化合物；
 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；
 フルジオキシニル (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；
 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)、エネストロブリン (Enestroburin)、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 (tricyclopyricarb) のようなストロビルリン系化合物；
 ファモキサドン (famoxadone) のようなオキサゾリジノン系化合物；
 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；
 イプロバリカルブ (iprovalicarb)、ベンチアバリカルブ - イソプロピル (benthiavalicarb-isopropyl) のようなパリンアミド系化合物；
 メチル N-(イソプロポキシカルボニル)-L-バリル-(3RS)-3-(4-クロロフェニル)-β-ア

ラニナート (valiphenalate) のようなアシルアミノアシッド系化合物 ;
 フェナミドン (fenamidone) のようなイミダゾリノン系化合物 ;
 フェンヘキサミド (fenhexamid) のようなヒドロキシアニリド系化合物 ;
 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 ;
 アントラキノ系化合物 ;
 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) 、ポリオキシシン (polyoxins) のような抗生物質 ;
 イミノクタジン (iminooctadine) 、ドディン (dodine) のようなグアニジン系化合物 ; 10
 テブフロキン (tebufloquin) 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 ;
 硫黄 (Sulfur) のような硫黄系化合物 ;
 その他の化合物として、ピリベンカルブ (pyribencarb) 、イソプロチオラン (isoprotiolane) 、ピロキロン (pyroquilon) 、ジクロメジン (diclomezine) 、キノキシフェン (quinoxifen) 、プロパモカルブ塩酸塩 (propamocarb hydrochloride) 、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) 、メトラフェノン (metrafenone) 、ニコピフェン (nicobifen) 、UBF-307、ジクロシメット (diclocymet) 、プロキンアジド (proquinazid) 、アミスルブロム (amisulbrom; 別名アミブロドル (amibromdole)) 、マンジプロパミド (mandipropamid) 、フルオピコリド (fluopicolide) 、カルプロパミド (carpropamid) 、メプチルジノキャップ (meptyldinocap) 、イソフェタミド (isofetamid) 、ピリオフェノン (pyriofenone) 、フェリムゾン (ferimzone) 、スピロキサミン (spiroxamine) 、フェンピラザミン (fenpyrazamine) 、アメトクトラジン (ametoctradin) 、バリフェナレート (valifenalate) 、オキサチアピプロリン (oxathiapiprolin) 、トルプロカルブ (tolprocarb) 、ピカルブトラゾクス (picarbutrazox) 、NK-1001、SB-4303、MIF-1001、MIF-1002、BAF-1107、SYJ-247、NNF-0721などが挙げられる。 20

【 0 1 1 2 】

上記他の農薬中の、殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤或いは殺土壌害虫剤、すなわち殺害虫剤の有効成分化合物 (一般名 ; 一部申請中を含む、又は日本植物防疫協会試験コード) としては、例えば、 30

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、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) 、アセフエート (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 (pyridaphenthion) 、 40
 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) 、マラチオン (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) 、E S P、アジンホスメチル (azinphos-methyl) 、フェンチオン (fenthion) 、ヘプテノホス (heptenophos) 、メトキシクロル (methoxychlor) 、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) 、 50
 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；

カルバリル (carbaryl)、プロボキスル (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)、エチオフェンカルブ (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 (isoprocarb)、メトルカルブ (metolcarb)、キシリルカルブ (xylyl carb)、X M C、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)、ベンスルタップ (bensultap)、チオスルタップナトリウム (thiosultap-sodium) 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)、エンドスルファン (endosulfan)、ジエノクロル (dienochlor)、ディルドリン (dieldrin) 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；

フェンバレレート (fenvalerate)、ペルメトリン (permethrin)、シペルメトリン (cypermethrin)、デルタメトリン (deltamethrin)、シハロトリン (cyhalothrin)、テフルトリン (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)、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)、ラムダ-シハロトリン (lambda-cyhalothrin)、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)、ゼータ-シペルメトリン (zeta-cypermethrin)、アクリナトリン (acrinathrin)、アルファ-シペルメトリン (alpha-cypermethrin)、アレスリン (allethrin)、ガンマ-シハロトリン (gamma-cyhalothrin)、シータ-シペルメトリン (theta-cypermethrin)、タウ-フルバリネート (tau-fluvalinate)、トラロメスリン (tralomethrin)、プロフルトリン (profluthrin)、ベータ-シペルメトリン (beta-cypermethrin)、ベータ-シフルトリン (beta-cyfluthrin)、メトフルトリン (metofluthrin)、フェノトリン (phenothrin)、フルメトリン (flumethrin) のようなピレスロイド系化合物；

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)、ルフエヌロン (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) 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)、テブフェンピラド (tebufenpyrad)、エチピロール (ethiprole)、トルフェンピラド (tolfenpyrad)、アセトプロール (acetoprole)、ピラフルプロール (pyrafluprole)、ピリプロール (pyriprole) のようなピラゾール系化合物；

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；

スピロディクロフェン (spirodiclofen)、スピロメシフェン (spiromesifen)、スピロテトラマト (spirotetramat) のような環状ケトエノール系化合物；

フルアクリピリム (fluacrypyrim) のようなストロビルリン系化合物；

フルフェネリム (flufenimer) のようなピリミジナミン系化合物；

ジニトロ系化合物；

有機硫黄化合物；

尿素系化合物；

トリアジン系化合物；

ヒドラゾン系化合物；

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)、アミトラズ (amitraz)、クロルジメホルム (chlordimeform)、シラフルオフェン (silaflofen)、トリアザメート (triazamate)、ピメトロジン (pymetrozine)、ピリミジフェン (pyrimidifen)、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)、シロマジン (cyromazine)、1,3-ジクロロプロペン (1,3-dichloropropene)、ジアフェンチウロン (diafenthiuron)、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)、フルベンジアミド (flubendiamide)、シフルメトフェン (cyflumetofen)、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)、シエノピラフェン (cyenopyrafen)、ピリフルキナゾン (pyrifluquinazone)、フェナザキン (fenazaquin)、アミドフルメト (amidoflume t)、スルフルアミド (sulfluramid)、ヒドラメチルノン (hydramethylnon)、メタルデヒド (metaldehyde)、スルホキサフロル (sulfoxaflor)、シプロペン (cyclopropene)、フルエンスルホン (fluensulfone)、リアノジン (ryanodine)、ベルブチン (verbutin) のような化合物；などが挙げられる。更に、*Bacillus thuringiensis aizawai*、*Bacillus thuringiensis kurstaki*、*Bacillus thuringiensis israelensis*、*Bacillus thuringiensis japonensis*、*Bacillus thuringiensis tenebrionis* 又は *Bacillus thuringiensis* が生成する結晶タンパク毒素、昆虫病原ウイルス剤、昆虫病原系状菌剤、線虫病原系状菌剤などのような微生物農薬；アベルメクチン (ivermectin)、エマメクチンベンゾエート (emamectin Benzoate)、ミルベメクチン (milbemectin)、ミルベマイシン (milbemycin)、スピノサド (spinosad)、イベルメクチン (ivermectin)、レピメクチン (lepimectin)、DE-175、アバメクチン (abamectin)、エマメクチン (emamectin)、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) のような天然物；ディート (deet) のような忌避剤；などと混用、併用することもできる。

【実施例】

【0113】

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。まず、本発明化合物の合成例を記載する。

【0114】

合成例 1

t-ブチル 4-(2-((5-クロロ-6-エチルピリミジン-4-イル)アミノ)エチルピペリジン-1-カルボキシレート (化合物No.1-96) の合成

【0115】

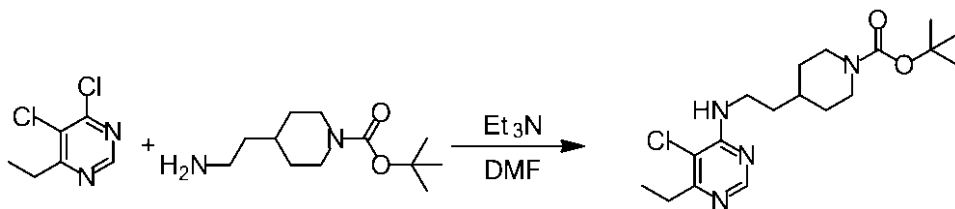
10

20

30

40

【化 1 5】



【 0 1 1 6】

4,5-ジクロロ-6-エチルピリミジン(0.3g)、t-ブチル 4-(2-アミノエチル)ピペリジン-1-カルボキシレート(0.46g)、及びN,N-ジメチルホルムアミド(5mL)の混合溶液に、トリエチルアミン(0.34g)を加え、80℃で13時間撹拌した。反応混合物を室温まで冷却後、水を加え、酢酸エチルで2回抽出した。合わせた有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムを用いて乾燥した後、溶媒を減圧留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶離液：酢酸エチル/ヘプタン=50/50)で精製して、t-ブチル 4-(2-((5-クロロ-6-エチルピリミジン-4-イル)アミノ)エチル)ピペリジン-1-カルボキシレート(0.52g)を得た。

10

^1H NMR(Solvent: CDCl_3 / 300MHz): δ (ppm) = 8.41(1H, d)、5.33(1H, br)、4.15(2H, br)、3.57(2H, q)、2.79(4H, m)、1.74(2H, d)、1.62(12H, m)、1.28(6H, m)

【 0 1 1 7】

合成例 2

20

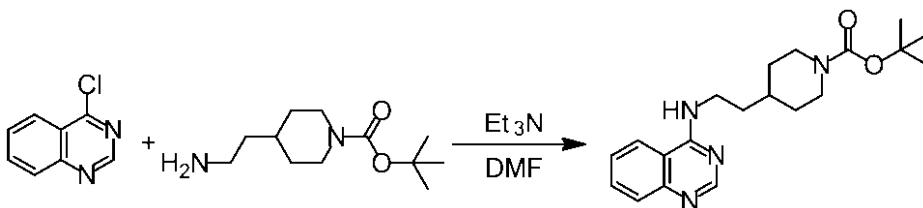
2-フェニル-1-(4-(2-(キナゾリン-4-イルアミノ)エチル)ピペリジン-1-イル)エタノン(化合物No.1-28)の合成

工程 1

t-ブチル 4-(2-(キナゾリン-4-イルアミノ)エチル)ピペリジン-1-カルボキシレート(化合物No.1-18)の合成

【 0 1 1 8】

【化 1 6】



30

【 0 1 1 9】

4-クロロキナゾリン(1.6g)、t-ブチル-4-(2-アミノエチル)ピペリジン-1-カルボキシレート(2.22g)、及びN,N-ジメチルホルムアミド(50mL)の混合溶液に、トリエチルアミン(1.98g)を加え、70℃で12時間撹拌した。反応混合物を室温まで冷却後、水を加え、酢酸エチルで2回抽出した。合わせた有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムを用いて乾燥した後、溶媒を減圧留去した。得られた残渣をアミノシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶離液：酢酸エチル/ヘプタン=40/60)で精製して、t-ブチル 4-(2-(キナゾリン-4-イルアミノ)エチル)ピペリジン-1-カルボキシレート(2.83g)を得た。

40

^1H NMR(Solvent: CDCl_3 / 300MHz): δ (ppm) = 8.65(1H, s)、7.86(3H, m)、7.49(1H, t)、5.82(1H, br)、4.15(2H, t)、3.75(2H, q)、2.72(2H, t)、1.87(5H, m)、1.46(9H, s)、1.32(2H, m)

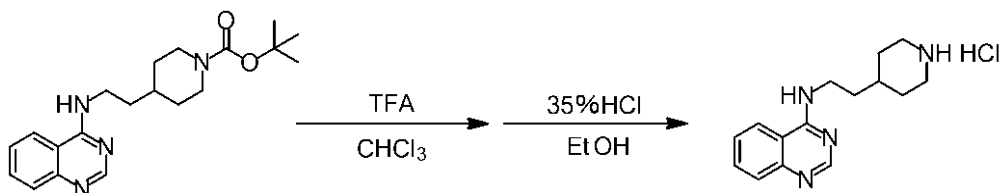
【 0 1 2 0】

工程 2

N-(2-(ピペリジン-4-イル)エチル)キナゾリン-4-アミン塩酸塩の合成

【 0 1 2 1】

【化 17】



【0122】

t-ブチル 4-(2-(キナゾリン-4-イルアミノ)エチル)ピペリジン-1-カルボキシレート(2.83g)をクロロホルム(30ml)に溶解し、トリフルオロ酢酸(5ml)を加え室温で3時間撹拌した。溶液を濃縮した後、残渣をエタノール(25ml)に溶解し、35%塩酸(5ml)を加え、室温下、1時間撹拌した。この溶液を濃縮し、残渣をエタノールを用いて共沸脱水することによってN-(2-(ピペリジン-4-イル)エチル)キナゾリン-4-アミン塩酸塩(2.06g)を得た。

10

^1H NMR (Solvent: DMSO- d_6 / 300MHz): δ (ppm) = 10.08(1H, m)、9.02(1H, br)、8.89(2H, m)、8.06(1H, m)、7.92(1H, m)、7.89(1H, m)、7.82(1H, m)、7.65(1H, m)、3.76(2H, s)、3.23(2H, d)、2.85(2H, q)、1.92(2H, d)、1.65(3H, m)、1.32(2H, m)

【0123】

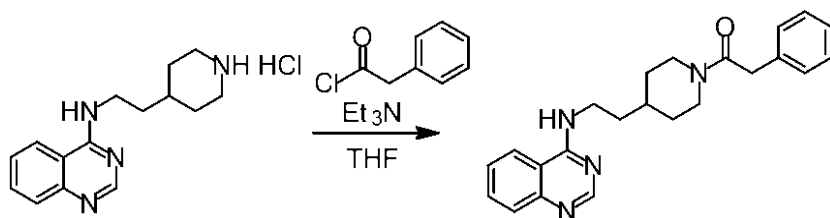
工程 3

2-フェニル-1-(4-(2-(キナゾリン-4-イルアミノ)エチル)ピペリジン-1-イル)エタノン(化合物No.1-28)の合成

20

【0124】

【化 18】



【0125】

N-(2-(ピペリジン-4-イル)エチル)キナゾリン-4-アミン塩酸塩(0.1g)、トリエチルアミン(0.1g)及びテトラヒドロフラン(5mL)の懸濁液に、0℃下、2-フェニルアセチルクロリド(0.08g)を加え、同温下、1時間撹拌した。続いて、室温に昇温し、15時間撹拌した。水を加え、反応を停止した後、酢酸エチルで3回抽出した。合わせた有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムを用いて乾燥した後、溶媒を減圧留去した。得られた残渣をアミノシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶離液: 酢酸エチル)で精製して、2-フェニル-1-(4-(2-(キナゾリン-4-イルアミノ)エチル)ピペリジン-1-イル)エタノン(0.03g)を得た。

30

^1H NMR(Solvent: CD_3OD / 300MHz): δ (ppm) = 8.41(1H, s)、8.09(1H, d)、7.77(2H, m)、7.51(1H, m)、7.49(5H, m)、4.56(1H, m)、3.96(1H, m)、3.66(2H, s)、3.62(2H, m)、2.91(1H, t)、2.54(1H, t)、1.60(5H, m)、1.11(2H, m)

40

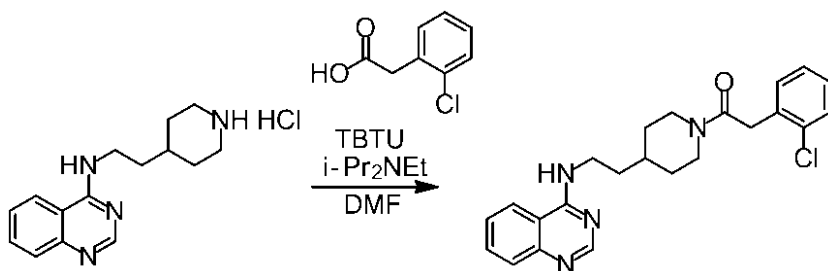
【0126】

合成例 3

2-(2-クロロフェニル)-1-(4-(2-(キナゾリン-4-イルアミノ)エチル)ピペリジン-1-イル)エタノン(化合物No.1-35)の合成

【0127】

【化 19】



【0128】

10

N-(2-(ピペリジン-4-イル)エチル)キナゾリン-4-アミン塩酸塩(0.1g)、2-クロロフェニル酢酸(0.06g)、ジイソプロピルエチルアミン(0.13g)及びN,N-ジメチルホルムアミド(5mL)の溶液に、0℃下、O-(ベンゾトリアゾール-1-イル)-N,N,N',N'-テトラメチルウロニウムテトラフルオロボラート(TBTU)(0.16g)を加え、同温下、1時間撹拌した。続いて、室温に昇温し、17時間撹拌した。水を加え、反応を停止した後、酢酸エチルで3回抽出した。合わせた有機層を飽和食塩水、飽和重曹水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムを用いて乾燥した後、溶媒を減圧留去した。得られた残渣をアミノシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶離液：酢酸エチル)で精製して、2-フェニル-1-(4-(2-(キナゾリン-4-イルアミノ)エチル)ピペリジン-1-イル)エタノン(0.03g)を得た。

¹H NMR(Solvent:CD₃OD / 300MHz): δ (ppm) = 8.42(1H,s)、8.08(1H,d)、7.73(2H,m)、7.50(1H,t)、7.36(1H,d)、7.22(3H,m)、4.53(1H,d)、3.95(3H,m)、3.60(2H,t)、3.05(1H,t)、3.63(1H,t)、1.82(2H,d)、1.62(3H,m)、1.21(2H,m)

20

【0129】

第1～3表中、物性として示した数値は融点()である。これら化合物は、前記合成例或いは前記した本発明化合物の製法に基づいて合成することができる。

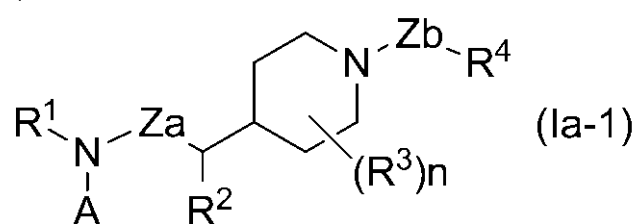
第1～3表中、Meはメチル、Etはエチル、nBuはブチル、iBuはイソブチル、tBuはt-ブチルを各々示す。第1～3表中、Z a 欄及びZ b 欄の「-」は結合手を、(R³) n 欄が空欄の場合はnが0であることを示す。また、第1～3表中、「*」は当該部分で結合することを示す。

【0130】

30

【表 1】

第1表



No.	A	R ¹	Za	R ²	(R ³) _n	Zb	R ⁴	物性
1-1		H	-CH ₂ -	H		—		189.5°C
1-2		H	-CH ₂ -	H		—		143.9°C
1-3		H	-CH ₂ -	H		—		Oil
1-4		H	-CH ₂ -	H		—		91.3°C
1-5		H	-CH ₂ -	H		—		168.9°C
1-6		H	-CH ₂ -	H		—		123.4°C
1-7		H	-CH ₂ -	H		—		126.2°C
1-8		H	-CH ₂ -	H		—		107.5°C
1-9		H	-CH ₂ -	H		—		141.9°C
1-10		H	-CH ₂ -	H		—		200.2°C
1-11		H	-CH ₂ -	H		—		145.9°C
1-12		H	-CH ₂ -	H		—		Oil

10

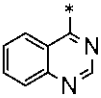
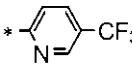
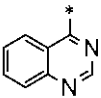
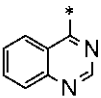
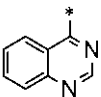
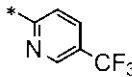
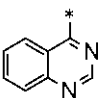
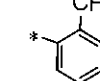
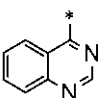
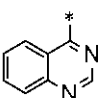
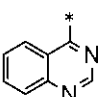
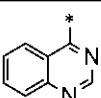
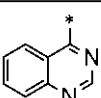
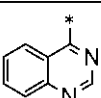
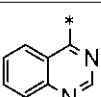
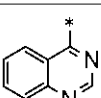
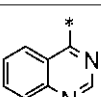
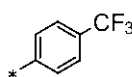
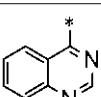
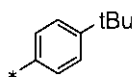
20

30

40

【表 2】

第1表つづき

No.	A	R ¹	Za	R ²	(R ³) _n	Zb	R ⁴	物性
1-13		H	-CH ₂ -	H		-CH ₂ -		106.4°C
1-14		H	-CH ₂ -	H		—	nBu	145.9°C
1-15		H	-CH ₂ -	H		—	*-CH ₂ -iBu	131.6°C
1-16		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-		Oil
1-17		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-		190.7°C
1-18		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-	*-O-tBu	127.3°C
1-19		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-	*-O-CH ₂ -C ₆ H ₅	156.1°C
1-20		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-	*-O-CH ₂ -tBu	147.1°C
1-21		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-	*-O-nBu	117.3°C
1-22		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-	*-CH ₂ -tBu	153.4°C
1-23		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-	tBu	182.3°C
1-24		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-	nBu	184.9°C
1-25		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-	CF ₃	175.9°C
1-26		H	-CH ₂ -	H		—		
1-27		H	-CH ₂ -	H		—		

10

20

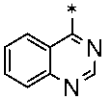
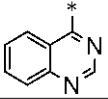
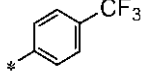
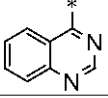
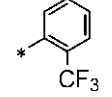
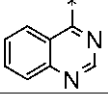
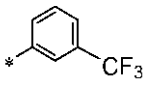
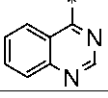
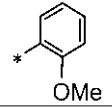
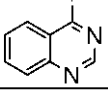
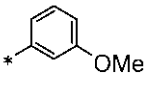
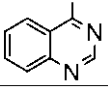
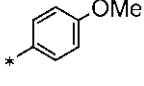
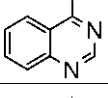
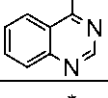
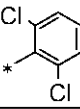
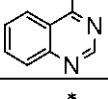
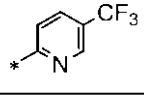
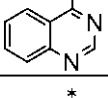
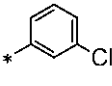
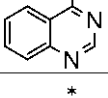
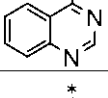
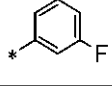
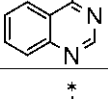
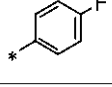
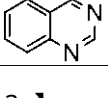
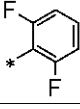
30

40

【 0 1 3 2 】

【表 3】

第1表つづき

No.	A	R ¹	Za	R ²	(R ³) _n	Zb	R ⁴	物性
1-28		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-CH ₂ -		148.7°C
1-29		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-CH ₂ -		215.1°C
1-30		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-CH ₂ -		142.3°C
1-31		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-CH ₂ -		Oil
1-32		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-CH ₂ -		Oil
1-33		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-CH ₂ -		Oil
1-34		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-CH ₂ -		Oil
1-35		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-CH ₂ -		Oil
1-36		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-CH ₂ -		169.8°C
1-37		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-CH ₂ -		140.7°C
1-38		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-CH ₂ -		Oil
1-39		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-CH ₂ -		Oil
1-40		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-CH ₂ -		145.7°C
1-41		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-CH ₂ -		159.2°C
1-42		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-CH ₂ -		200.8°C

10

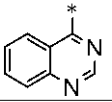
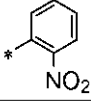
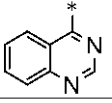
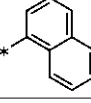
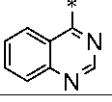
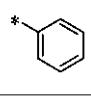
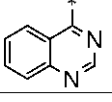
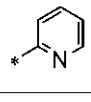
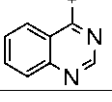
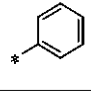
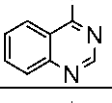
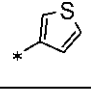
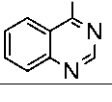
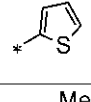
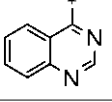
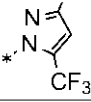
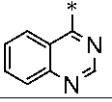
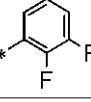
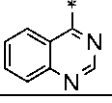
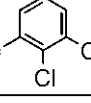
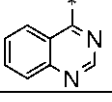
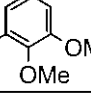
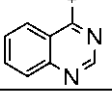
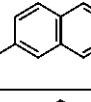
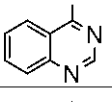
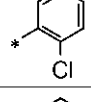
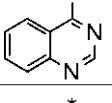
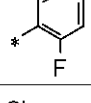
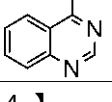
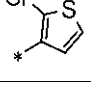
20

30

40

【表 4】

第1表つづき

No.	A	R ¹	Za	R ²	(R ³) _n	Zb	R ⁴	物性
1-43		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-CH ₂ -		Oil
1-44		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-CH ₂ -		123.4°C
1-45		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-(CH ₂) ₂ -		184.5°C
1-46		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-CH ₂ -		142.2°C
1-47		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-CF ₂ -		Oil
1-48		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-CH ₂ -		Oil
1-49		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-CH ₂ -		Oil
1-50		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-CH ₂ -		Oil
1-51		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-CH ₂ -		
1-52		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-CH ₂ -		
1-53		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-CH ₂ -		
1-54		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-CH ₂ -		
1-55		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-CF ₂ -		
1-56		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-CF ₂ -		
1-57		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-CH ₂ -		

10

20

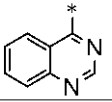
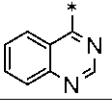
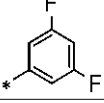
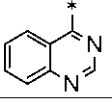
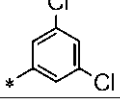
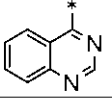
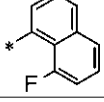
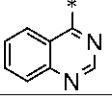
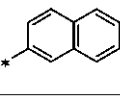
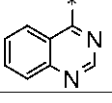
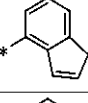
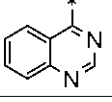
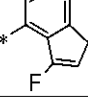
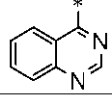
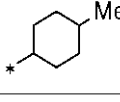
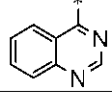
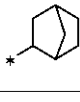
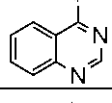
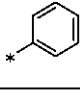
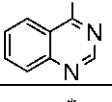
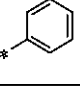
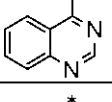
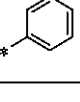
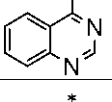
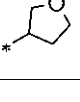
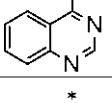
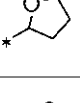
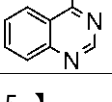
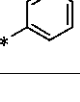
30

40

【 0 1 3 4 】

【表 5】

第1表つづき

No.	A	R ¹	Za	R ²	(R ³) _n	Zb	R ⁴	物性
1-58		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-CH ₂ -		
1-59		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-CH ₂ -		
1-60		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-CH ₂ -		
1-61		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-CH ₂ -		
1-62		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-CH ₂ -		
1-63		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-CH ₂ -		
1-64		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-CH ₂ -		
1-65		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-CH ₂ -		152.2°C
1-66		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-CH ₂ -		184.3°C
1-67		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-CH(CH ₃)-		Oil
1-68		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-C(CH ₃) ₂ -		189.7°C
1-69		H	-CH ₂ -	H		-(C=S)-CH ₂ -		
1-70		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-CH ₂ -		
1-71		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-CH ₂ -		
1-72		H	-CH ₂ -	H		-CH ₂ -(C=O)-		

10

20

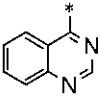
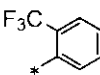
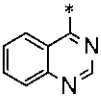
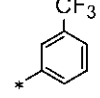
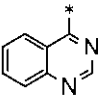
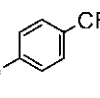
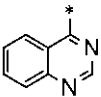
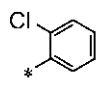
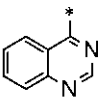
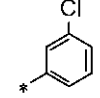
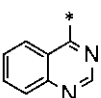
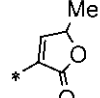
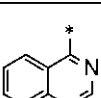
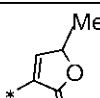
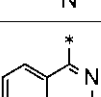
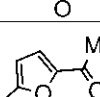
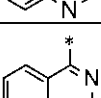
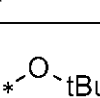
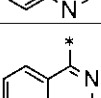
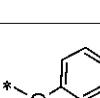
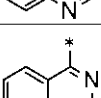
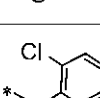
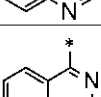
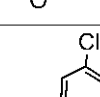
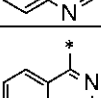
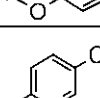
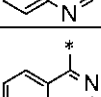
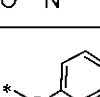
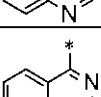
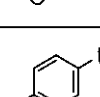
30

40

【 0 1 3 5 】

【表 6】

第1表つづき

No.	A	R ¹	Za	R ²	(R ³) _n	Zb	R ⁴	物性
1-73		H	-CH ₂ -	H		-CH ₂ -(C=O)-		
1-74		H	-CH ₂ -	H		-CH ₂ -(C=O)-		
1-75		H	-CH ₂ -	H		-CH ₂ -(C=O)-		
1-76		H	-CH ₂ -	H		-CH ₂ -(C=O)-		
1-77		H	-CH ₂ -	H		-CH ₂ -(C=O)-		
1-78		H	-CH ₂ -	H		-(CH ₂) ₂ -		
1-79		H	-CH ₂ -	H		-CH ₂ -		
1-80		H	-CH ₂ -	H		—		
1-81		H	-CH ₂ -	H		-CH ₂ -(C=O)-		
1-82		H	-CH ₂ -	H		-CH ₂ -(C=O)-		
1-83		H	-CH ₂ -	H		-CH ₂ -(C=O)-		
1-84		H	-CH ₂ -	H		-CH ₂ -(C=O)-		
1-85		H	-CH ₂ -	H		-CH ₂ -		
1-86		H	-CH ₂ -	H		-CH ₂ -		
1-87		H	-CH ₂ -	H		-CH ₂ -		

10

20

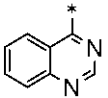
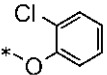
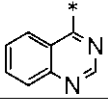
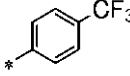
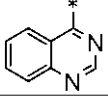
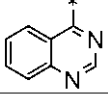
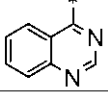
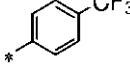
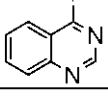
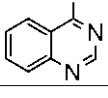
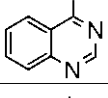
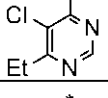
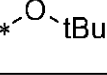
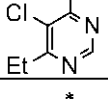
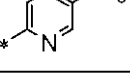
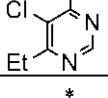
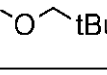
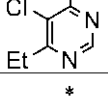
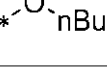
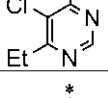
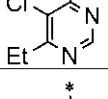
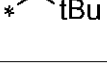
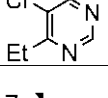
30

40

【 0 1 3 6 】

【表 7】

第1表つづき

No.	A	R ¹	Za	R ²	(R ³) _n	Zb	R ⁴	物性
1-88		H	-CH ₂ -	H		-CH ₂ -		
1-89		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-NH-		232.8°C
1-90		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-NH-		186.4°C
1-91		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-NH-	nBu	187.2°C
1-92		H	-CH ₂ -	H		-(C=S)-NH-		219.4°C
1-93		H	-CH ₂ -	H		-(C=S)-NH-	tBu	105.5°C
1-94		H	-CH ₂ -	H		-(C=S)-NH-	nBu	Oil
1-95		H	-CH ₂ -	H		-SO ₂ -	nBu	168.8°C
1-96		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-		87.2°C
1-97		H	-CH ₂ -	H		—		Oil
1-98		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-		Oil
1-99		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-		Oil
1-100		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-	nBu	Oil
1-101		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-		Oil
1-102		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-CH ₂ -		74.9°C

10

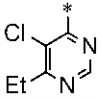
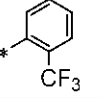
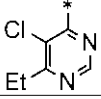
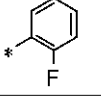
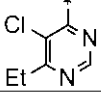
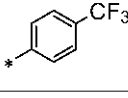
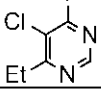
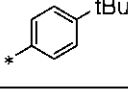
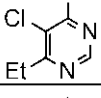
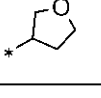
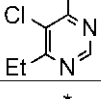
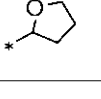
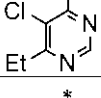
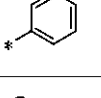
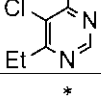
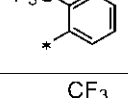
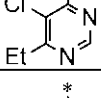
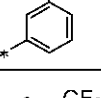
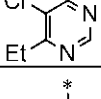
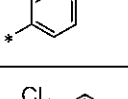
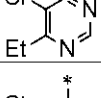
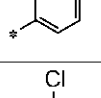
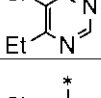
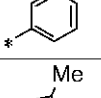
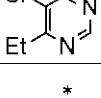
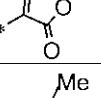
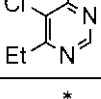
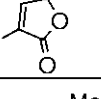
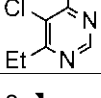
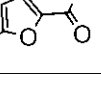
20

30

40

【表 8】

第1表つづき

No.	A	R ¹	Za	R ²	(R ³) _n	Zb	R ⁴	物性
1-103		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-CH ₂ -		Oil
1-104		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-CH ₂ -		Oil
1-105		H	-CH ₂ -	H		—		
1-106		H	-CH ₂ -	H		—		
1-107		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-CH ₂ -		
1-108		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-CH ₂ -		
1-109		H	-CH ₂ -	H		-CH ₂ -(C=O)-		
1-110		H	-CH ₂ -	H		-CH ₂ -(C=O)-		
1-111		H	-CH ₂ -	H		-CH ₂ -(C=O)-		
1-112		H	-CH ₂ -	H		-CH ₂ -(C=O)-		
1-113		H	-CH ₂ -	H		-CH ₂ -(C=O)-		
1-114		H	-CH ₂ -	H		-CH ₂ -(C=O)-		
1-115		H	-CH ₂ -	H		-(CH ₂) ₂ -		
1-116		H	-CH ₂ -	H		-CH ₂ -		
1-117		H	-CH ₂ -	H		—		

10

20

30

40

【 0 1 3 8 】

【表 9】

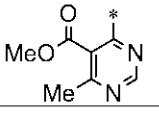
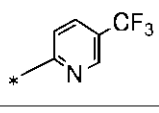
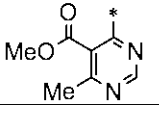
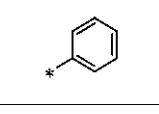
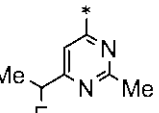
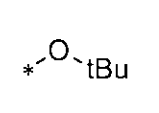
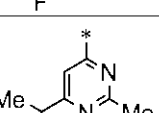
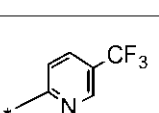
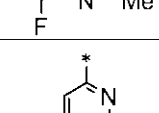
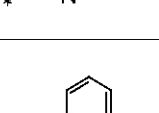
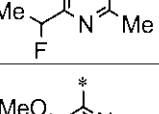
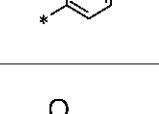
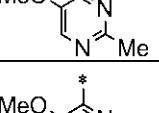
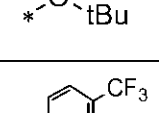
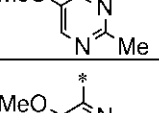
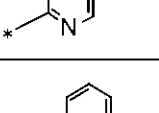
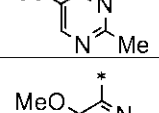
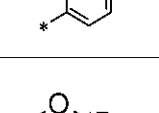
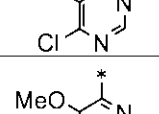
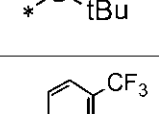
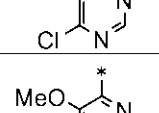
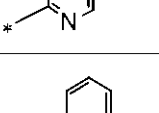
第1表つづき

No.	A	R ¹	Za	R ²	(R ³) _n	Zb	R ⁴	物性
1-118		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-CH ₂ -		
1-119		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-CH ₂ -		
1-120		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-CH ₂ -		10
1-121		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-CH ₂ -		
1-122		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-CH ₂ -		
1-123		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-CF ₂ -		20
1-124		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-CF ₂ -		
1-125		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-CH ₂ -		
1-126		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-CH ₂ -		
1-127		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-CH ₂ -		30
1-128		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-		
1-129		H	-CH ₂ -	H		—		
1-130		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-		40
1-131		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-		

【 0 1 3 9 】

【表 10】

第1表つづき

No.	A	R ¹	Za	R ²	(R ³) _n	Zb	R ⁴	物性
1-132		H	-CH ₂ -	H		—		
1-133		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-CH ₂ -		
1-134		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-		88.2°C
1-135		H	-CH ₂ -	H		—		
1-136		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-CH ₂ -		
1-137		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-		122.0°C
1-138		H	-CH ₂ -	H		—		
1-139		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-CH ₂ -		Oil
1-140		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-		115.6°C
1-141		H	-CH ₂ -	H		—		
1-142		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-CH ₂ -		131.5°C

10

20

30

【0140】

【表 1 1】

第1表つづき

No.	A	R ¹	Za	R ²	(R ³) _n	Zb	R ⁴	物性
1-143		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-	*-O-tBu	112.7°C
1-144		H	-CH ₂ -	H		—		Oil
1-145		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-CH ₂ -		Oil
1-146		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-CH ₂ -		Oil
1-147		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-	*-O-tBu	Oil
1-148		H	-CH ₂ -	H		—		135.2°C
1-149		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-CH ₂ -		114.6°C
1-150		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-CH ₂ -		Oil
1-151		H	—	H		—		149.7°C
1-152		H	-(CH ₂) ₂ -	H		-(C=O)-	*-O-tBu	Oil
1-153		H	—	H		-(C=O)-	*-O-tBu	Oil
1-154		H	-CH ₂ -	H	3-F	-(C=O)-	*-O-tBu	Oil
1-155		H	-CH ₂ -	H	3-F	—		Oil

10

20

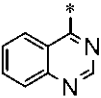
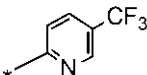
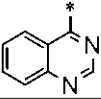
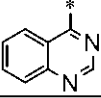
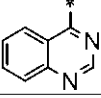
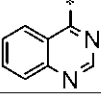
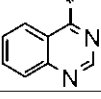
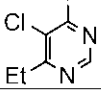
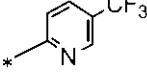
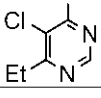
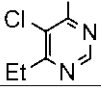
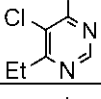
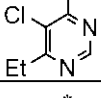
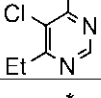
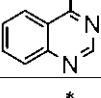
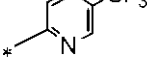
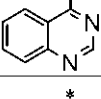
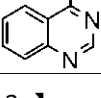
30

40

【 0 1 4 1 】

【表 1 2】

第1表つづき

No.	A	R ¹	Za	R ²	(R ³) _n	Zb	R ⁴	物性
1-156		H	-CH(CH ₃)-	H		—		
1-157		H	-CH(CH ₃)-	H		-(C=O)-	*-O-tBu	159.2°C
1-158		H	-CH(CH ₃)-	H		-(C=O)-CH ₂ -		
1-159		H	-CH(CH ₃)-	H		-(C=O)-CH ₂ -		
1-160		H	-CH(CH ₃)-	H		-(C=O)-CH ₂ -		
1-161		H	-CH(CH ₃)-	H		-(C=O)-CH ₂ -		
1-162		H	-CH(CH ₃)-	H		—		
1-163		H	-CH(CH ₃)-	H		-(C=O)-	*-O-tBu	119.5°C
1-164		H	-CH(CH ₃)-	H		-(C=O)-CH ₂ -		
1-165		H	-CH(CH ₃)-	H		-(C=O)-CH ₂ -		
1-166		H	-CH(CH ₃)-	H		-(C=O)-CH ₂ -		
1-167		H	-CH(CH ₃)-	H		-(C=O)-CH ₂ -		
1-168		H	-CH(CH ₂ CH ₃)-	H		—		
1-169		H	-CH(CH ₂ CH ₃)-	H		-(C=O)-	*-O-tBu	149.3°C
1-170		H	-CH(CH ₂ CH ₃)-	H		-(C=O)-CH ₂ -		

10

20

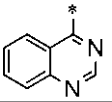
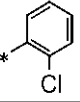
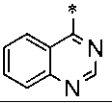
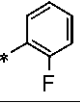
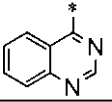
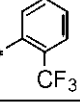
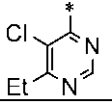
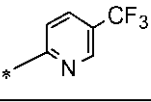
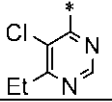
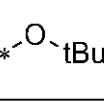
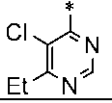
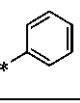
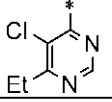
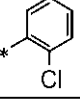
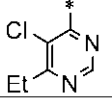
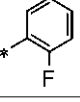
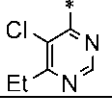
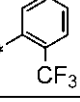
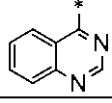
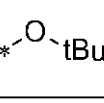
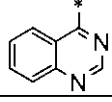
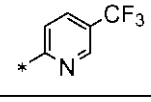
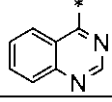
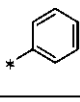
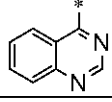
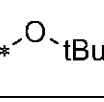
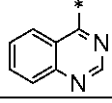
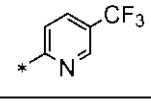
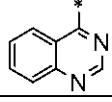
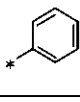
30

40

【 0 1 4 2 】

【表 1 3】

第1表つづき

No.	A	R ¹	Za	R ²	(R ³) _n	Zb	R ⁴	物性
1-171		H	-CH(CH ₂ CH ₃)-	H		-(C=O)-CH ₂ -		
1-172		H	-CH(CH ₂ CH ₃)-	H		-(C=O)-CH ₂ -		
1-173		H	-CH(CH ₂ CH ₃)-	H		-(C=O)-CH ₂ -		
1-174		H	-CH(CH ₂ CH ₃)-	H		—		
1-175		H	-CH(CH ₂ CH ₃)-	H		-(C=O)-		106.5°C
1-176		H	-CH(CH ₂ CH ₃)-	H		-(C=O)-CH ₂ -		
1-177		H	-CH(CH ₂ CH ₃)-	H		-(C=O)-CH ₂ -		
1-178		H	-CH(CH ₂ CH ₃)-	H		-(C=O)-CH ₂ -		
1-179		H	-CH(CH ₂ CH ₃)-	H		-(C=O)-CH ₂ -		
1-180		H	—	Me		-(C=O)-		
1-181		H	—	Me		—		
1-182		H	—	Me		-(C=O)-CH ₂ -		
1-183		H	—	Et		-(C=O)-		
1-184		H	—	Et		—		
1-185		H	—	Et		-(C=O)-CH ₂ -		

10

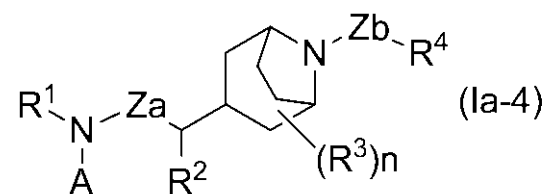
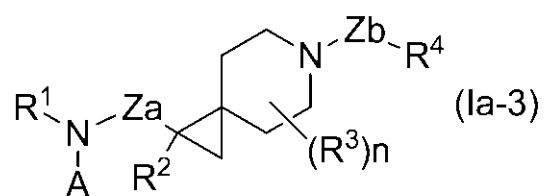
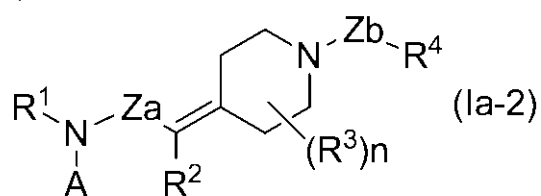
20

30

40

【表 1 4】

第 2 表



10

No.	式	A	R ¹	Za	R ²	(R ³) _n	Zb	R ⁴	物性
2-1	Ia-2		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-	*-O-tBu	Oil
2-2	Ia-2		H	-CH ₂ -	H		—	*-O-tBu	198.5°C
2-3	Ia-3		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-	*-O-tBu	Oil
2-4	Ia-4		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-	*-O-tBu	131.0°C
2-5	Ia-4		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-	*-O-tBu	Oil
2-6	Ia-4		H	-CH ₂ -	H		—	*-O-tBu	Oil
2-7	Ia-4		H	-CH ₂ -	H		-(C=O)-	*-O-tBu	Oil
2-8	Ia-4		H	-CH ₂ -	H		—	*-O-tBu	Oil

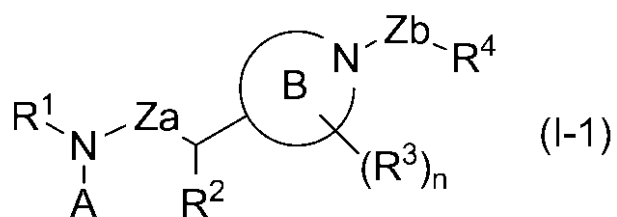
20

30

40

【 0 1 4 4 】

第 3 表



No.	A	R ¹	Za	R ²	B	(R ³) _n	Zb	R ⁴	物性
3-1		H	-CH ₂ -	H			-(C=O)-	*-O-tBu	Oil
3-2		H	-CH ₂ -	H			—		146.6°C
3-3		H	-CH ₂ -	H			-(C=O)-	*-O-tBu	Oil
3-4		H	-CH ₂ -	H			—		130.6°C
3-5		H	-CH ₂ -	H			-(C=O)-	*-O-tBu	Oil
3-6		H	-CH ₂ -	H			-(C=O)-	*-O-tBu	Oil
3-7		H	-CH ₂ -	H			—		Oil
3-8		H	-CH ₂ -	H			-(C=O)-	*-O-tBu	138.4°C
3-9		H	-CH ₂ -	H			—		126.6°C

本発明化合物のいくつかにつき、 ^1H -NMRのデータ〔 ^1H -核磁気共鳴分光法（Varian NMR-300MHz）にて測定； δ は化学シフト値（ppm）である〕を第4表に示す。

【 0 1 4 6 】

【表 1 6】

No.	溶媒	δ 値
1-3	DMSO-d6	8.45 (1H, s)、8.30 (3H, m)、7.78 (2H, m)、7.53 (1H, t)、7.06 (1H, s)、6.82 (1H, s)、4.41 (2H, d)、3.68 (2H, m)、2.89 (2H, t)、1.85 (5H, m)、1.25 (3H, m)
1-12	CDCl ₃	8.63 (1H, s)、7.86 (5H, m)、7.46 (1H, t)、6.83 (2H, d)、6.19 (1H, brs)、3.89 (4H, m)、2.81 (2H, t)、2.38 (1H, br)、1.86 (10H, m)、1.37 (3H, m)
1-16	DMSO-d6	8.99 (1H, s)、8.43 (1H, s)、8.35 (1H, dd)、8.25 (2H, m)、7.76 (3H, m)、7.51 (1H, t)、4.50 (1H, d)、3.60 (3H, m)、3.04 (2H, t)、2.84 (2H, t)、1.97 (1H, m)、1.70 (4H, m)、1.26 (3H, m)
1-28	CD ₃ OD	8.41 (1H, s)、8.09 (1H, d)、7.77 (2H, m)、7.51 (1H, m)、7.49 (5H, m)、4.56 (1H, m)、3.96 (1H, m)、3.66 (2H, s)、3.62 (2H, m)、2.91 (1H, t)、2.54 (1H, t)、1.60 (5H, m)、1.11 (2H, m)
1-31	CD ₃ OD	8.42 (1H, s)、8.09 (1H, dd)、7.74 (2H, m)、7.53 (5H, m)、4.54 (1H, d)、4.03 (1H, m)、3.87 (2H, d)、3.66 (2H, m)、3.07 (1H, dt)、2.66 (1H, dt)、1.74 (5H, m)、1.09 (2H, m)
1-32	CD ₃ OD	8.42 (1H, s)、8.09 (1H, d)、7.74 (2H, m)、7.52 (1H, t)、7.18 (2H, m)、6.91 (2H, m)、4.53 (1H, m)、3.97 (1H, m)、3.75 (2H, s)、3.64 (2H, m)、3.02 (1H, t)、2.65 (1H, t)、1.73 (5H, m)、1.07 (2H, m)
1-33	CD ₃ OD	8.41 (1H, s)、8.06 (1H, dd)、7.70 (2H, m)、7.47 (1H, m)、7.19 (1H, m)、6.80 (3H, m)、4.52 (1H, m)、3.94 (1H, m)、3.71 (2H, s)、3.60 (2H, m)、3.96 (1H, dt)、3.58 (1H, dt)、1.72 (5H, m)、0.98 (2H, m)
1-34	CD ₃ OD	8.41 (1H, s)、8.08 (1H, d)、7.69 (2H, m)、7.51 (1H, m)、7.16 (2H, d)、6.87 (2H, d)、4.52 (1H, d)、3.98 (1H, d)、3.76 (3H, s)、3.64 (4H, m)、3.00 (1H, t)、2.62 (1H, t)、1.73 (5H, m)、0.98 (2H, m)
1-35	CD ₃ OD	8.42 (1H, s)、8.08 (1H, d)、7.73 (2H, m)、7.50 (1H, t)、7.36 (1H, d)、7.22 (3H, m)、4.53 (1H, d)、3.95 (3H, m)、3.60 (2H, t)、3.05 (1H, t)、3.63 (1H, t)、1.82 (2H, d)、1.62 (3H, m)、1.21 (2H, m)
1-38	CD ₃ OD	8.41 (1H, s)、8.06 (1H, dd)、7.70 (2H, m)、7.47 (1H, m)、7.20 (4H, m)、4.50 (1H, m)、3.93 (1H, m)、3.73 (2H, s)、3.61 (2H, m)、2.99 (1H, dt)、2.60 (1H, dt)、1.69 (5H, m)、1.02 (2H, m)
1-39	CD ₃ OD	8.33 (1H, s)、8.00 (1H, dd)、7.65 (2H, m)、7.42 (1H, m)、7.18 (2H, m)、7.02 (2H, m)、4.43 (1H, d)、3.91 (1H, d)、3.68 (2H, d)、3.58 (2H, m)、3.00 (1H, dt)、2.57 (1H, dt)、1.75 (2H, m)、1.58 (3H, m)、1.02 (2H, m)
1-43	CD ₃ OD	8.43 (1H, s)、8.06 (2H, m)、7.71 (2H, m)、7.59 (1H, m)、7.47 (2H, m)、7.37 (1H, m)、4.43 (1H, d)、4.06 (3H, m)、3.66 (2H, t)、3.14 (1H, dt)、2.64 (1H, dt)、1.78 (5H, m)、1.26 (2H, m)
1-47	CD ₃ OD	8.40 (1H, s)、8.07 (1H, dd)、7.77 (1H, m)、7.68 (1H, m)、7.52 (6H, m)、4.55 (1H, d)、3.86 (1H, d)、3.62 (2H, t)、2.92 (1H, t)、2.78 (1H, t)、1.90 (1H, d)、1.61 (4H, m)、1.21 (1H, m)、0.83 (1H, m)

10

20

30

40

【表 17】

第4表つづき

No.	溶媒	δ 値
1-48	CD ₃ OD	8.41 (1H, s)、8.09 (1H, d)、7.74 (2H, m)、7.51 (1H, m)、7.36 (1H, m)、7.16 (1H, s)、7.00 (1H, d)、4.52 (1H, d)、4.00 (1H, d)、3.76 (2H, d)、3.65 (2H, t)、3.03 (1H, t)、2.63 (1H, t)、1.73 (5H, m)、1.03 (2H, m)
1-49	CD ₃ OD	8.42 (1H, s)、8.09 (1H, d)、7.74 (2H, m)、7.52 (1H, t)、7.26 (1H, dd)、6.94 (2H, m)、4.51 (1H, d)、3.98 (3H, m)、3.66 (2H, t)、3.08 (1H, t)、2.64 (1H, t)、1.82 (2H, t)、1.65 (3H, m)、1.07 (2H, m)
1-50	CD ₃ OD	8.43 (1H, s)、8.08 (1H, d)、7.72 (2H, m)、7.49 (1H, m)、6.37 (1H, s)、5.13 (2H, dd)、4.43 (1H, d)、3.93 (1H, d)、3.66 (2H, t)、3.12 (1H, t)、3.67 (1H, t)、2.25 (3H, s)、1.79 (5H, m)、1.21 (2H, m)
1-67	CD ₃ OD	8.39 (1H, d)、8.06 (1H, t)、7.66 (2H, d)、7.48 (1H, m)、7.25 (5H, m)、4.58 (1H, d)、3.95 (1H, d)、3.58 (2H, m)、2.95 (1H, t)、2.57 (1H, t)、1.48 (8H, m)、0.96 (1H, m)、0.54 (1H, m)
1-94	CD ₃ OD	8.42 (1H, s)、8.12 (1H, d)、7.78 (1H, t)、7.70 (1H, d)、7.52 (1H, t)、4.76 (2H, d)、3.71 (2H, t)、3.69 (2H, t)、2.96 (2H, t)、2.00 (2H, d)、1.85 (5H, m)、1.34 (5H, m)、0.96 (3H, t)
1-97	CDCl ₃	8.42 (1H, s)、8.37 (1H, s)、7.61 (1H, dd)、6.55 (1H, d)、5.35 (1H, br)、4.42 (2H, d)、3.09 (2H, q)、2.95 (4H, m)、1.88 (2H, d)、1.71 (3H, m)、1.34 (5H, m)
1-98	DMSO-d ₆	8.28 (1H, s)、7.29 (1H, t)、3.97 (2H, d)、3.65 (2H, s)、3.41 (2H, q)、2.69 (3H, m)、1.71 (2H, d)、1.48 (3H, s)、1.18 (4H, m)、1.13 (11H, m)
1-99	DMSO-d ₆	8.28 (1H, s)、7.30 (1H, t)、3.97 (4H, m)、3.41 (2H, q)、2.67 (4H, m)、1.69 (2H, d)、1.51 (5H, m)、1.34 (2H, m)、1.16 (3H, t)、1.08 (2H, m)、0.89 (3H, t)
1-100	DMSO-d ₆	8.28 (1H, s)、7.32 (1H, t)、4.35 (1H, d)、3.83 (1H, d)、3.42 (2H, m)、2.91 (1H, t)、2.69 (2H, q)、2.45 (2H, t)、2.25 (2H, t)、1.69 (2H, t)、1.48 (5H, m)、1.27 (2H, m)、1.18 (3H, t)、1.16 (4H, m)
1-101	DMSO-d ₆	8.28 (1H, s)、7.32 (1H, t)、4.42 (1H, d)、3.97 (1H, d)、3.44 (2H, m)、2.96 (1H, t)、2.43 (1H, t)、2.39 (2H, m)、1.73 (2H, m)、1.44 (3H, m)、1.13 (4H, m)、1.01 (12H, m)
1-102	CDCl ₃	8.39 (1H, s)、7.34 (5H, m)、5.29 (1H, br)、4.66 (1H, d)、3.88 (1H, d)、3.73 (2H, s)、3.54 (2H, q)、2.94 (1H, tt)、2.88 (2H, q)、2.61 (1H, tt)、1.79 (3H, m)、1.30 (5H, m)
1-103	CD ₃ OD	8.25 (1H, s)、7.97 (1H, s)、7.69 (1H, d)、7.56 (1H, t)、7.36 (2H, m)、4.51 (1H, d)、3.94 (2H, q)、3.57 (2H, t)、3.31 (2H, s)、3.10 (1H, tt)、2.77 (3H, m)、1.85 (2H, m)、1.59 (3H, m)、1.25 (4H, m)

10

20

30

40

【 0 1 4 8 】

【表 18】

第4表つづき

No.	溶媒	δ 値
1-104	CD ₃ OD	8.24 (1H, s)、7.28 (2H, m)、7.14 (2H, m)、4.48 (1H, d)、3.84 (1H, d)、3.75 (2H, q)、3.52 (2H, q)、3.07 (1H, tt)、2.68 (3H, m)、1.84 (2H, m)、1.58 (3H, m)、1.29 (5H, m)
1-139	CD ₃ OD	7.50 (1H, s)、7.31 (5H, m)、4.60 (1H, d)、4.10 (1H, d)、3.83 (3H, s)、3.76 (2H, s)、3.53 (2H, t)、3.06 (1H, t)、2.65 (2H, t)、2.34 (3H, s)、1.83 (2H, m)、1.55 (2H, m)、0.98 (2H, m)
1-144	CDCl ₃	8.53 (1H, s)、8.38 (1H, s)、7.61 (1H, dd)、6.65 (1H, dd)、6.00 (1H, m)、5.43 (1H, br)、4.38 (2H, d)、3.64 (2H, q)、2.94 (2H, t)、1.88 (2H, d)、1.66 (5H, m)、1.30 (3H, m)
1-145	CD ₃ OD	8.34 (1H, s)、7.36 (5H, m)、6.00 (1H, m)、4.53 (1H, d)、4.08 (1H, d)、4.56 (1H, m)、3.73 (2H, s)、3.53 (2H, m)、3.04 (1H, m)、2.66 (1H, m)、1.81 (5H, m)、1.08 (2H, m)
1-146	CD ₃ OD	8.36 (1H, s)、7.69 (1H, d)、7.66 (1H, t)、7.54 (2H, m)、6.00 (1H, m)、4.53 (1H, d)、4.12 (1H, q)、3.91 (3H, m)、3.57 (2H, t)、3.09 (1H, t)、3.04 (1H, m)、2.67 (1H, t)、1.85 (2H, d)、1.64 (6H, m)
1-147	CDCl ₃	8.64 (1H, s)、7.39 (1H, m)、7.07 (1H, m)、6.64 (1H, br)、4.15 (2H, m)、3.73 (2H, q)、2.80 (2H, t)、1.99 (4H, m)、1.59 (10H, m)、1.25 (3H, m)
1-150	CD ₃ OD	8.46 (1H, s)、7.69 (1H, d)、7.50 (4H, m)、7.23 (1H, m)、4.54 (1H, d)、3.97 (3H, m)、3.74 (2H, t)、3.11 (1H, m)、2.68 (1H, t)、1.88 (2H, d)、1.76 (3H, m)、1.18 (2H, m)
1-152	CDCl ₃	8.66 (1H, s)、7.85 (1H, d)、7.72 (2H, m)、7.55 (1H, t)、5.90 (1H, br)、4.15 (2H, m)、3.69 (2H, q)、2.63 (2H, t)、1.87 (4H, m)、1.39 (12H, m)、1.15 (2H, m)
1-153	CDCl ₃	8.66 (1H, s)、7.85 (1H, d)、7.76 (2H, m)、7.49 (1H, t)、6.11 (1H, br)、4.21 (2H, m)、3.59 (2H, br)、2.88 (2H, t)、1.96 (1H, m)、1.56 (2H, d)、1.32 (9H, s)、1.30 (2H, m)
1-154	CDCl ₃	8.65 (1H, s)、7.89 (1H, d)、7.77 (2H, m)、7.69 (1H, t)、5.72 (1H, br)、4.79 (1H, m)、4.15 (1H, m)、3.80 (2H, m)、2.89 (1H, m)、1.75 (6H, m)、1.62 (9H, s)、1.45 (2H, m)
1-155	CDCl ₃	8.67 (1H, s)、8.38 (1H, d)、7.84 (1H, dd)、7.77 (2H, m)、7.62 (1H, dd)、7.51 (1H, t)、6.70 (1H, d)、5.78 (1H, br)、4.89 (2H, m)、4.51 (1H, d)、3.80 (2H, m)、2.97 (2H, m)、1.89 (6H, m)

10

20

30

【 0 1 4 9 】

【表 19】

第4表つづき

No.	溶媒	δ 値
2-1	CDCl ₃	8.66 (1H, s)、7.86 (1H, d)、7.77 (2H, m)、7.49 (1H, t)、5.65 (1H, br)、5.51 (1H, t)、4.30 (2H, t)、3.47 (2H, t)、2.38 (2H, t)、2.24 (2H, t)、1.77 (2H, m)、1.49 (9H, s)
2-3	CDCl ₃	8.65 (1H, s)、7.83 (3H, m)、7.49 (1H, t)、5.99 (1H, br)、3.80 (2H, m)、3.45 (1H, t)、3.27 (2H, m)、2.34 (2H, m)、1.50 (11H, m)、1.20 (2H, m)、0.68 (1H, t)、0.38 (1H, t)
2-5	DMSO-d ₆	8.47 (1H, s)、7.89 (1H, br)、7.61 (1H, m)、7.26 (1H, m)、4.04 (2H, m)、3.55 (2H, d)、1.84 (3H, m)、1.64 (4H, m)、1.68 (15H, m)
2-6	DMSO-d ₆	8.36 (1H, m)、8.27 (1H, d)、7.70 (1H, t)、7.26 (1H, s)、6.79 (1H, m)、4.54 (2H, s)、3.26 (2H, m)、2.65 (2H, q)、2.09 (1H, m)、1.91 (6H, m)、1.31 (3H, m)、1.18 (4H, m)
2-7	CDCl ₃	8.65 (1H, s)、7.89 (1H, d)、7.75 (2H, m)、7.49 (1H, m)、5.80 (1H, br)、4.23 (2H, m)、3.68 (2H, m)、2.26 (1H, br)、2.03 (4H, m)、1.85 (4H, m)、1.40 (10H, m)、1.36 (1H, m)
2-8	CDCl ₃	8.66 (1H, s)、8.30 (1H, d)、7.85 (1H, d)、7.75 (2H, m)、7.66 (1H, m)、7.48 (1H, m)、6.62 (1H, t)、5.81 (1H, br)、4.56 (2H, s)、3.70 (2H, m)、2.37 (1H, m)、2.13 (4H, m)、1.81 (4H, m)、1.59 (2H, m)

10

20

【0150】

【表 20】

第4表つづき

No.	溶媒	δ 値
3-1	CDCl ₃	8.67 (1H, s)、7.86 (1H, d)、7.76 (2H, m)、7.50 (1H, t)、5.77 (1H, br)、3.75 (4H, m)、3.24 (1H, m)、2.97 (1H, m)、2.30 (1H, m)、2.07 (1H, m)、1.87 (2H, m)、1.57 (1H, m)、1.45 (9H, s)
3-3	CDCl ₃	8.55 (1H, s)、6.51 (1H, br)、3.67 (2H, q)、3.51 (2H, m)、3.21 (1H, m)、3.05 (2H, q)、2.85 (1H, m)、2.09 (2H, m)、2.02 (2H, m)、1.39 (13H, m)
3-5	CDCl ₃	8.66 (1H, s)、7.83 (3H, m)、7.49 (1H, t)、6.27 (1H, br)、3.90 (4H, m)、2.96 (2H, m)、1.87 (1H, m)、1.67 (6H, m)、1.46 (9H, s)
3-6	CDCl ₃	8.37 (1H, s)、5.53 (1H, br)、3.49 (6H, m)、2.80 (2H, m)、1.79 (2H, m)、1.38 (19H, m)
3-7	CDCl ₃	8.36 (1H, m)、8.30 (1H, d)、7.52 (1H, dd)、6.44 (1H, d)、5.65 (1H, br)、3.66 (2H, m)、3.49 (4H, m)、2.80 (2H, q)、1.96 (2H, m)、1.67 (6H, m)、1.42 (4H, m)

30

40

【0151】

以下に、本発明組成物の試験例を記載する。各試験において、防除指数は以下の基準に従った。

〔各種予防効果試験の防除指数〕〔発病程度：肉眼観察〕

- 5 : 病斑又は孢子形成が全く認められない。
- 4 : 病斑面積、病斑数又は孢子形成面積が、無処理区の10%未満。
- 3 : 病斑面積、病斑数又は孢子形成面積が、無処理区の40%未満。
- 2 : 病斑面積、病斑数又は孢子形成面積が、無処理区の70%未満。
- 1 : 病斑面積、病斑数又は孢子形成面積が、無処理区の70%以上。

【0152】

50

試験例 1 (コムギうどんこ病予防効果試験)

直径 6.0 cm のポリ鉢でコムギ (品種: 農林 61 号) を栽培し、1.5 から 2.5 葉期に達した時に各供試化合物を所定濃度に調整した混合薬液をスプレーガンにて、1 苗あたり 10 ml 散布した。薬液が乾燥した後、コムギうどんこ病菌 (*Erysiphe graminis*) の分生胞子を振り掛け接種し、20 の恒温室内に保った。接種 7 日もしくは 8 日後に病斑数を調査し、前記評価基準に従って防除指数を求めた。

前記化合物 No. 1-2、1-3、1-11、1-18、1-20、1-21、1-28、1-30、1-40、1-46、1-47、1-89、1-95、1-97、1-104、1-144、1-151、1-152、2-3、2-7、3-3、3-7 について試験したところ、400 ppm で防除指数 4 以上の効果を示した。

【0153】

10

試験例 2 (コムギふ枯病予防効果試験)

直径 6.0 cm のポリ鉢でコムギ (品種: 農林 61 号) を栽培し、1.5 から 2.5 葉期に達したときに、本発明化合物を所定濃度に調整した薬液をスプレーガンにて十分量散布した。薬液が乾燥した後 (処理当日) に、コムギふ枯病菌 (*Septoria nodorum*) の分生胞子懸濁液を噴霧接種し、約 1 日 20 の接種箱に保ち、その後 20 の恒温室内に保った。接種 10 日もしくは 11 日後に病斑数を調査し、前記評価基準に従って防除指数を求めた。

前記化合物 No. 1-1、1-151、2-8、3-7 について試験したところ、400 ppm で防除指数 4 以上の効果を示した。

【0154】

20

試験例 3 (コムギ赤さび病予防効果試験)

直径 6.0 cm のポリ鉢でコムギ (品種: 農林 61 号) を栽培し、1.5 から 2.5 葉期に達した時に各供試化合物を所定濃度に調整した混合薬液をスプレーガンにて、1 苗あたり 10 ml 散布した。薬液が乾燥した後、コムギ赤さび病菌 (*Puccinia recondita*) の分生胞子を振り掛け接種し、約 1 日 20 の接種箱に保ち、その後 20 の恒温室内に保った。接種 7 日もしくは 8 日後に病斑数を調査し、前記評価基準に従って防除指数を求めた。

前記化合物 No. 1-2、1-11、1-96、1-97、1-98、1-99、1-100、1-101、1-102、1-103、1-104、1-144、1-145、1-146、2-3、3-3、3-4、3-7 について試験したところ、400 ppm で防除指数 4 以上の効果を示した。

【0155】

30

試験例 4 (トマト疫病予防効果試験)

直径 7.5 cm のポリ鉢でトマト (品種: イエローペア) を栽培し、3 から 6 葉期に達したときに、本発明化合物を所定濃度に調整した薬液をスプレーガンにて十分量散布した。薬液が乾燥した後 (処理当日もしくは翌日) に、トマト疫病菌 (*Phytophthora infestans*) の遊走子囊懸濁液を噴霧接種し、20 の恒温室内に保った。接種 3 日もしくは 4 日後に病斑面積を調査し、前記評価基準に従って防除指数を求めた。

前記化合物 No. 1-1、1-2、1-3、1-4、1-5、1-6、1-9、1-10、1-11、1-12、1-13、1-17、1-18、1-19、1-20、1-21、1-22、1-23、1-24、1-28、1-29、1-30、1-31、1-32、1-33、1-34、1-35、1-36、1-37、1-38、1-39、1-40、1-41、1-42、1-43、1-44、1-45、1-47、1-48、1-49、1-50、1-65、1-66、1-67、1-91、1-93、1-94、1-95、1-96、1-97、1-98、1-99、1-100、1-101、1-102、1-103、1-104、1-143、1-144、1-145、1-146、1-147、1-149、1-150、1-151、1-152、1-154、1-155、1-157、1-163、2-1、2-2、2-3、2-4、2-5、2-6、2-7、2-8、3-1、3-2、3-3、3-4、3-5、3-8、3-9 について試験したところ、400 ppm もしくは 200 ppm で防除指数 4 以上の効果を示した。

【0156】

40

試験例 5 (キュウリべと病予防効果試験)

直径 7.5 cm のポリ鉢でキュウリ (品種: 相模半白) を栽培し、1.5 から 2.5 葉期に達したときに、本発明化合物を所定濃度に調整した薬液をスプレーガンにて十分量散布した。薬液が乾燥した後 (処理当日) に、キュウリべと病菌 (*Pseudoperonospora cubensis*) の遊走子囊懸濁液を噴霧接種し、約 1 日 20 の接種箱に保ち、20 の恒温室内に

50

保った。接種 7 日もしくは 8 日後に病斑面積を調査し、前記評価基準に従って防除指数を求めた。

前記化合物 No. 1-1、1-2、1-3、1-6、1-11、1-13、1-16、1-18、1-19、1-20、1-21、1-22、1-23、1-24、1-25、1-28、1-30、1-31、1-32、1-33、1-34、1-35、1-37、1-38、1-39、1-40、1-41、1-42、1-44、1-45、1-47、1-49、1-67、1-94、1-95、1-96、1-97、1-98、1-99、1-100、1-102、1-103、1-104、1-143、1-144、1-145、1-146、1-147、1-148、1-149、1-150、1-151、1-152、1-154、1-155、2-1、2-2、2-3、2-4、2-6、2-7、2-8、3-1、3-2、3-3、3-4、3-5、3-6、3-8、3-9 について試験したところ、400 ppm もしくは 200 ppm で防除指数 4 以上の効果を示した。

【0157】

10

試験例 6 (キュウリうどんこ病予防効果試験)

直径 7.5 cm のポリ鉢でキュウリ (品種: 相模半白) を栽培し、1.5 から 2.5 葉期に達したときに、本発明化合物を所定濃度に調整した薬液をスプレーガンにて十分量散布した。薬液が乾燥した後 (処理当日) に、キュウリうどんこ病菌 (*Sphaerotheca fuliginea*) の分生孢子濁液を噴霧接種し、20 の恒温室内に保った。接種 7 日後に病斑面積を調査し、前記評価基準に従って防除指数を求めた。

前記化合物 No. 1-1、1-2、1-3、1-9、1-11、1-18、1-30、1-37、1-97、1-100、1-102、1-103、1-104、1-144、1-146、1-151、1-155、2-6、3-1、3-3、3-4、3-7 について試験したところ、400 ppm で防除指数 4 以上の効果を示した。

【0158】

20

製剤例 1

(1) 本発明化合物	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。

【0159】

製剤例 2

(1) 本発明化合物	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。

30

【0160】

製剤例 3

(1) 本発明化合物	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。

【0161】

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アルエーテルサルフェート	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、本発明化合物とを 4 : 1 の重量割合で混合し、水和剤とする。

40

【0162】

製剤例 5

(1) 本発明化合物	50 重量部
(2) オキシレーテッドポリアルキルフェニルフォスフェートトリエタノールアミン	2 重量部

50

(3) シリコーン	0 . 2 重量部	
(4) 水	4 7 . 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	4 2 . 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。

【 0 1 6 3 】

製剤例 6

(1) 本発明化合物	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	10
(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	9 3 . 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。

【 0 1 6 4 】

製剤例 7

(1) 本発明化合物	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	9 5 . 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。 20

【 0 1 6 5 】

製剤例 8

(1) 本発明化合物	2 0 重量部	
(2) オキシレーテッドポリアルキルフェニルフォスフェートトリエタノールアミン	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	7 2 . 7 重量部	30

以上のものを均一に混合、粉碎して水性懸濁剤とする。

【産業上の利用可能性】

【 0 1 6 6 】

本発明化合物は、幅広い植物病原菌に対する高い防除効果を有し、且つ、高い安全性を併せ持つので、農園芸用殺菌剤として有用である。

