

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 特許公報(B2)

(11) 特許番号

特許第5391257号
(P5391257)

(45) 発行日 平成26年1月15日(2014.1.15)

(24) 登録日 平成25年10月18日(2013.10.18)

(51) Int. Cl. F I
CO7D 333/38 (2006.01) CO7D 333/38 CSP
AO1N 43/08 (2006.01) AO1N 43/08 F
AO1P 3/00 (2006.01) AO1P 3/00

請求項の数 1 (全 79 頁)

(21) 出願番号	特願2011-255697 (P2011-255697)	(73) 特許権者	000000354
(22) 出願日	平成23年11月24日(2011.11.24)		石原産業株式会社
(62) 分割の表示	特願2005-231840 (P2005-231840) の分割		大阪府大阪市西区江戸堀一丁目3番15号
原出願日	平成17年8月10日(2005.8.10)	(72) 発明者	中村 裕治
(65) 公開番号	特開2012-102101 (P2012-102101A)		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
(43) 公開日	平成24年5月31日(2012.5.31)	(72) 発明者	三谷 滋
審査請求日	平成23年11月24日(2011.11.24)		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
(31) 優先権主張番号	特願2004-235634 (P2004-235634)	(72) 発明者	米田 哲夫
(32) 優先日	平成16年8月12日(2004.8.12)		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
(33) 優先権主張国	日本国(JP)	審査官	今井 周一郎
(31) 優先権主張番号	特願2005-178614 (P2005-178614)		
(32) 優先日	平成17年6月17日(2005.6.17)		
(33) 優先権主張国	日本国(JP)		

最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 酸アミド誘導体

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項1】

N-[4'-(2-プロピルオキシ)-1,1,2'-トリメチル]フェナシル]-3-メチル-2-チオフェンカルボキサミド又はその塩。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、酸アミド誘導体に関する。

【背景技術】

【0002】

WO2001/60783及びWO2003/27059には、一定の化学構造を有する酸アミド誘導体が有害生物防除剤の有効成分として有用であることが記載されている。しかしながら、そこには後記式(1)の化合物が殺菌作用を有することについては記載されていない。一方、本出願人の特願2003-420864には、酸アミド誘導体を有効成分として含有する殺菌性組成物が記載されているが、このものの有効成分化合物は後記式(1)の化合物とは異なる。

【先行技術文献】

【特許文献】

【0003】

【特許文献1】 国際公開公報 WO 01/60783

【特許文献2】国際公開公報 WO 03/27059

【特許文献3】日本特許出願 特願2003-420864

【発明の概要】

【発明が解決しようとする課題】

【0004】

従来から提供されている多くの殺菌性組成物は、予防効果と治療効果のいずれか一方が不十分であったり、残効性が不十分であったり、或は、施用場面によっては植物病害に対する防除効果が不十分であったりするなど、実用上いくつかの問題点を抱えている。従って、このような問題点を克服した殺菌性組成物が希求されている。

【課題を解決するための手段】

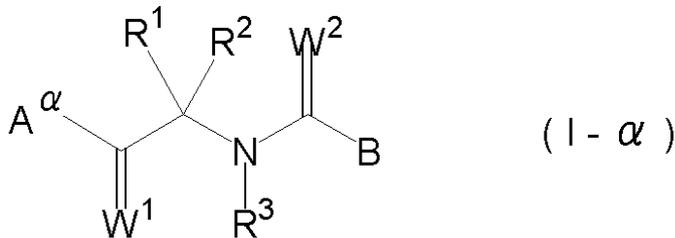
【0005】

本発明者らは、前述の問題点を解決すべく研究した結果、後記式(1)の酸アミド誘導体を含む殺菌性組成物が、種々の有害菌類、例えば卵菌類、子囊菌類、担子菌類、不完全菌類に起因する各種病害に対して優れた予防効果及び治療効果を発揮し、同時に、実用上満足できる残効性を有することを見出し、本発明を完成した。

すなわち本発明は、従来、具体的に知られていなかった式(1-α)：

【0006】

【化1】



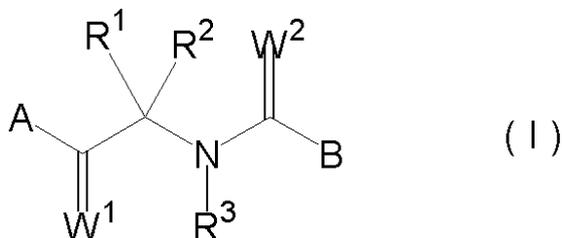
【0007】

[A は X で置換されてもよいフェニルであり； B は Y で置換されたチエニルであり； X はフ素原子、塩素原子、沃素原子、アルキル又はアルコキシであり； Y はハロゲン、アルキル又はアルコキシであり； R¹及びR²は各々アルキルであり； R³は水素原子であり； W¹及びW²は共に酸素原子である] で表される酸アミド誘導体又はその塩に関する。

さらに、本発明は、式(1)：

【0008】

【化2】



【0009】

[式中、A は X で置換されてもよいフェニル、X で置換されてもよいベンジル、X で置換されてもよいナフチル、X で置換されてもよい複素環、X で置換されてもよい縮合複素環、インダニル(インダニルは、ハロゲン、アルキル又はアルコキシで置換されてもよい)又はテトラヒドロナフチル(テトラヒドロナフチルは、ハロゲン、アルキル又はアルコキシで置換されてもよい)であり； B は Y で置換されてもよい複素環(但し、ピリジルは除く)、Y で置換されてもよい縮合複素環又は Y で置換されてもよいナフチルであり； X はハロゲン、E¹で置換されてもよいアルキル、E¹で置換されてもよいアルケニル、E¹で置換されてもよいアルキニル、ヒドロキシ、シアノオキシ、E¹で置換されてもよいアルコキシ、E¹で置換されてもよいアルケニルオキシ、E¹で置換されてもよいアルキニルオ

10

20

30

40

50

キシ、メルカプト、シアノチオ、 E^1 で置換されてもよいアルキルチオ、 E^1 で置換されてもよいアルケニルチオ、 E^1 で置換されてもよいアルキニルチオ、 E^2 で置換されてもよいアルキルスルフィニル、 E^2 で置換されてもよいアルキルスルホニル、 J で置換されてもよいシクロアルキル、 J で置換されてもよいシクロアルキルオキシ、 J で置換されてもよいシクロアルキルチオ、シアノ、ニトロ、ホルミル、 Y で置換されてもよいフェニル、 Y で置換されてもよいフェノキシ、 Y で置換されてもよいフェニルチオ、 Y で置換されてもよいフェニルアルキル、 Y で置換されてもよいフェニルアルケニル、 Y で置換されてもよいフェニルアルキニル、 Y で置換されてもよいフェニルアルキルオキシ、 Y で置換されてもよいフェニルアルケニルオキシ、 Y で置換されてもよいフェニルアルキニルオキシ、 Y で置換されてもよいフェニルアルキルチオ、 Y で置換されてもよいフェニルアルケニルチオ、 Y で置換されてもよいフェニルアルキニルチオ、 Y で置換されてもよいフェニルアミノ、 $-OR^4$ 、 $-SR^5$ 、 $-NR^6R^7$ 、 $-CO_2R^8$ 、 $-C(=O)NR^8R^9$ 、 $-SO_2NR^8R^9$ 、 $-CH=NR^{10}$ 又は複素環（複素環は、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ又はアルキルカルボニルで置換されてもよい）であり； Y はハロゲン、 E^1 で置換されてもよいアルキル、 E^1 で置換されてもよいアルケニル、 E^1 で置換されてもよいアルキニル、ヒドロキシ、シアノオキシ、 E^1 で置換されてもよいアルコキシ、 E^1 で置換されてもよいアルケニルオキシ、 E^1 で置換されてもよいアルキニルオキシ、メルカプト、シアノチオ、 E^1 で置換されてもよいアルキルチオ、 E^1 で置換されてもよいアルケニルチオ、 E^1 で置換されてもよいアルキニルチオ、 E^2 で置換されてもよいアルキルスルフィニル、 E^2 で置換されてもよいアルキルスルホニル、 J で置換されてもよいシクロアルキル、 J で置換されてもよいシクロアルキルオキシ、 J で置換されてもよいシクロアルキルチオ、シアノ、ニトロ、ホルミル、 $-OR^4$ 、 $-SR^5$ 、 $-NR^6R^7$ 、 $-CO_2R^8$ 、 $-C(=O)NR^8R^9$ 、 $-SO_2NR^8R^9$ 、 $-CH=NR^{10}$ 又は複素環（複素環は、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ又はアルキルカルボニルで置換されてもよい）であり； R^1 及び R^2 は各々独立に水素原子、アルキル、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、ハロアルコキシアルキル、シアノアルキル、アルコキシカルボニルアルキル、アルケニル、ハロアルケニル、アルコキシアルケニル、アルキニル、ハロアルキニル、アルコキシアルキニル、シクロアルキル、ハロシクロアルキル、（アルキル）シクロアルキル、（ハロアルキル）シクロアルキル、シアノ又は $-CO_2R^8$ であり、また R^1 と R^2 は一緒になって3～6員飽和炭素環を形成してもよく； R^3 は水素原子、 E^1 で置換されてもよいアルキル、 E^1 で置換されてもよいアルケニル、 E^1 で置換されてもよいアルキニル、ヒドロキシ、シアノオキシ、 E^1 で置換されてもよいアルコキシ、 J で置換されてもよいシクロアルキル、 J で置換されてもよいシクロアルキルオキシ、 J で置換されてもよいシクロアルキルチオ、シアノ、ホルミル、 $-C(=W^3)R^{11}$ 、 $-C(=W^3)OR^{12}$ 、 $-C(=W^3)SR^{12}$ 、 $-C(=W^3)NR^{12}R^{13}$ 、 $-S(O)mR^{12}$ 又は $-S(O)nNR^{12}R^{13}$ であり； R^4 は $-C(=W^3)R^{12}$ 、 $-C(=W^3)OR^{12}$ 、 $-C(=W^3)SR^{12}$ 、 $-C(=W^3)NR^{12}R^{13}$ 、 $-S(O)mR^{12}$ 、 $-S(O)nNR^{12}R^{13}$ 又は複素環（複素環は、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ又はアルキルカルボニルで置換されてもよい）であり； R^5 は $-C(=W^3)R^{12}$ 、 $-C(=W^3)OR^{12}$ 、 $-C(=W^3)SR^{12}$ 、 $-C(=W^3)NR^{12}R^{13}$ 又は複素環（複素環は、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ又はアルキルカルボニルで置換されてもよい）であり； R^6 は水素原子、アルキル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、ハロアルコキシアルキル、シアノアルキル、（シクロアルキル）アルキル、シクロアルキル、シアノ、 $-C(=W^3)R^{12}$ 、 $-C(=W^3)OR^{12}$ 、 $-C(=W^3)SR^{12}$ 、 $-C(=W^3)NR^{12}R^{13}$ 、 $-S(O)mR^{12}$ 、 $-S(O)nNR^{12}R^{13}$ 又は複素環（複素環は、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ又はアルキルカルボニルで置換されてもよい）であり； R^7 は水素原子、アルキル、ハロアルキル、アルコキシアルキル又はハロアルコキシアルキルであり； R^8 及び R^9 は各々独立に水素原子、アルキル、ハロアルキル、アルコキシアルキル又はハロアルコキシアルキルであり、隣接する R^8 と R^9 は一緒になって環を形成してもよく； R^{10} はアルキル（アルキルは、ハロゲン、アルコキシ又はハロアルコキシで置換されてもよい）、アルコキシ（ア

10

20

30

40

50

ルコキシは、ハロゲン、アルコキシ又はハロアルコキシで置換されてもよい)、アルケニルオキシ(アルケニルオキシは、ハロゲン、アルコキシ又はハロアルコキシで置換されてもよい)、アルキニルオキシ(アルキニルオキシは、ハロゲン、アルコキシ又はハロアルコキシで置換されてもよい)又はアルコキシカルボニル(アルコキシカルボニルは、ハロゲン、アルコキシ又はハロアルコキシで置換されてもよい)であり; R^{11} は水素原子、 E^3 で置換されてもよいアルキル、フェニル(フェニルは、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ又はアルキルカルボニルで置換されてもよい)又は複素環(複素環は、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ又はアルキルカルボニルで置換されてもよい)であり; R^{12} 及び R^{13} は各々独立に E^3 で置換されてもよいアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、 J で置換されてもよいシクロアルキル又はフェニル(フェニルは、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ又はアルキルカルボニルで置換されてもよい)であり、隣接する R^{12} と R^{13} は一緒になって環を形成してもよく; W^1 、 W^2 及び W^3 は各々独立に酸素原子又は硫黄原子であり; m 及び n は各々独立に0~2の整数であり; E^1 はハロゲン、ヒドロキシ、アルコキシ、ハロアルコキシ、メルカプト、アルキルチオ、ハロアルキルチオ、アルキルスルホニル、シクロアルキル、アミノ、モノアルキルアミノ、ジアルキルアミノ、シアノ、ニトロ、ヒドロキシカルボニル、アルコキシカルボニル、アルキルカルボニルオキシ、トリアルキルシリル又は複素環(複素環は、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ又はアルキルカルボニルで置換されてもよい)であり; E^2 はハロゲン、ヒドロキシ、アルコキシ、ハロアルコキシ、シクロアルキル、アミノ、モノアルキルアミノ、ジアルキルアミノ、シアノ、ニトロ、ヒドロキシカルボニル、アルコキシカルボニル、トリアルキルシリル又は複素環(複素環は、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ又はアルキルカルボニルで置換されてもよい)であり; E^3 はハロゲン、アルコキシ、アルキルチオ、アミノ、モノアルキルアミノ、ジアルキルアミノ、シクロアルキル、シアノ、アルコキシカルボニル、ハロアルコキシ、ハロアルキルチオ又はフェニル(フェニルは、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ又はアルキルカルボニルで置換されてもよい)であり; J はハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ又はハロアルコキシである]で表される酸アミド誘導体又はその塩を有効成分として含有する殺菌性組成物に関する。また、本発明は、前記誘導体又はその塩の有効量を施用して種々の有害菌類或は種々の有害菌類に起因する各種病害を防除する方法、前記誘導体又はその塩の有効量を施用して作物を保護する或は作物の収穫量を向上させる方法に関する。

【0010】

前記式(1)中、Aに含まれる置換基としてのX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。Aに含まれるインダニル又はテトラヒドロナフチルの置換基であるハロゲン、アルキル又はアルコキシの置換数は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。B又はXに含まれる置換基としてのY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。X、Y、 R^3 、 R^{11} 、 R^{12} 又は R^{13} に含まれる置換基としての E^1 、 E^2 又は E^3 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。X、Y、 R^3 、 R^{12} 又は R^{13} に含まれる置換基としてのJ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。X、Y、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 、 E^1 、 E^2 又は E^3 に含まれるフェニル又は複素環の置換基であるハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ又はアルキルカルボニルの置換数は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。 R^{10} に含まれるアルキル、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ又はアルコキシカルボニルの置換基であるハロゲン、アルコキシ又はハロアルコキシの置換数は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。

10

20

30

40

50

【0011】

A、B、X、Y、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^{11} 、 E^1 又は E^2 中の複素環としてはO、S及びNからなる群より選ばれた少なくとも1種の原子を1～4含有する3、5若しくは6員複素環が望ましく、例えばオキシラニルのような3員複素環；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員複素環；ピラニル、ピリジル、ピペリジニル、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員複素環が挙げられる。

10

【0012】

A又はB中の縮合複素環としてはO、S及びNからなる群より選ばれた少なくとも1種の原子を1～4含有する8～10員縮合複素環、例えばベンゾフラニル、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などが挙げられる。

20

【0013】

A、X、Y、 R^1 ～ R^3 、 R^6 ～ R^{13} 、 E^1 ～ E^3 又はJ中のアルキル又はアルキル部分は、直鎖状又は分枝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、tert-ブチル、ペンチル、ヘキシル、ヘプチルのような C_{1-7} のものなどが挙げられる。

【0014】

X、Y、 R^1 ～ R^3 、 R^6 、 R^{12} 、 R^{13} 又は E^1 ～ E^3 中のシクロアルキル又はシクロアルキル部分としては、炭素数3～6のもの、例えばシクロプロピル、シクロペンチル、シクロヘキシルなどが挙げられる。また、 R^1 と R^2 が一緒になって形成する3～6員飽和炭素環の具体例としては、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシルが挙げられる。

30

【0015】

X、Y、 R^1 ～ R^3 又は R^{10} 中のアルケニル又はアルケニル部分としては、炭素数2～7の直鎖又は分枝状のもの、例えばビニル、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、1-ヘプテニルなどが挙げられる。また、X、Y、 R^1 ～ R^3 又は R^{10} 中のアルキニル又はアルキニル部分としては、炭素数2～7の直鎖又は分枝状のもの、例えばエチニル、2-ブチニル、2-ペンチニル、3-ヘキシニル、4-ジメチル-2-ペンチニルなどが挙げられる。

40

【0016】

A、X、Y、 R^1 ～ R^{13} 、 E^1 ～ E^3 又はJ中のハロゲン又は置換基としてのハロゲンとしては、弗素、塩素、臭素又は沃素の各原子が挙げられる。置換基としてのハロゲンの数は1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。

前記式(1-)中の置換基A又はXの定義は、各々前記式(1)中の置換基A又はXの定義に準ずる。

【0017】

前記式(1)又は(1-)の酸アミド誘導体の塩としては、農業上許容されるものであればあらゆるものが含まれるが、例えばナトリウム塩、カリウム塩のようなアルカリ金属

50

塩；マグネシウム塩、カルシウム塩のようなアルカリ土類金属塩；塩酸塩、過塩素酸塩、硫酸塩、硝酸塩のような無機酸塩；酢酸塩、メタンスルホン酸塩のような有機酸塩などが挙げられる。

【0018】

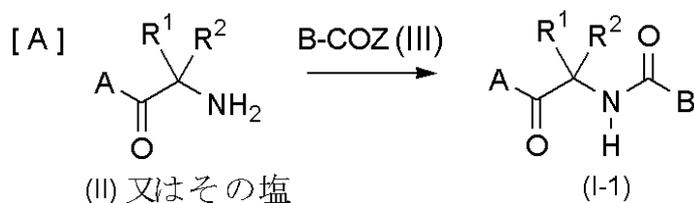
前記式(1)又は(1-)の酸アミド誘導体には、各種異性体、例えば光学異性体、幾何異性体などが存在するが、本発明には各異性体及び異性体混合物の双方が含まれる。尚、本発明には、当該技術分野における技術常識の範囲内において、前記したもの以外の各種異性体も含まれる。また、異性体の種類によっては、前記式(1)又は(1-)とは異なる化学構造となる場合があるが、当業者であればそれらが異性体の関係にあることが十分認識できる為、本発明の範囲内であることは明らかである。

10

前記式(1)又は(1-)の酸アミド誘導体又はその塩は、以下の反応〔A〕～〔K〕、〔U〕～〔W〕並びに、通常の塩の製造方法に従って製造することができる。

【0019】

【化3】



20

【0020】

反応〔A〕中、A、B、R¹及びR²は前述の通りであり、Zはヒドロキシ、アルコキシ又はハロゲンであり、ハロゲンとしては弗素、塩素、臭素又は沃素の各原子が挙げられる。

反応〔A〕は、通常、塩基及び溶媒の存在下で行うことができる。

塩基は、例えばナトリウム、カリウムのようなアルカリ金属；ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウム第3級ブトキシドのようなアルカリ金属アルコキシド；炭酸ナトリウム、炭酸カリウムのような炭酸塩；重炭酸ナトリウム、重炭酸カリウムのような重炭酸塩；水酸化ナトリウム、水酸化カリウムのような金属水酸化物；水素化ナトリウム、水素化カリウムのような金属水素化物；モノメチルアミン、ジメチルアミン、トリエチルアミンのようなアミン類；ピリジン、4-ジメチルアミノピリジンのようなピリジン類；メチルリチウム、n-ブチルリチウム、リチウムジイソプロピルアミドのような有機リチウム化合物などから1種又は2種以上を適宜選択できる。塩基は、式(II)の化合物に対し1～3倍モル、望ましくは1～2倍モル使用できる。

30

【0021】

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

40

【0022】

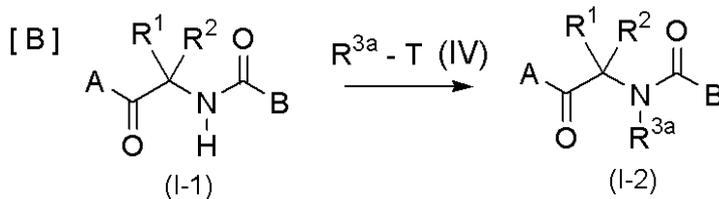
反応〔A〕は、必要に応じて脱水縮合剤の存在下で行うことができる。該脱水縮合剤としてはN,N'-ジシクロヘキシルカルボジイミド、クロロスルホニルイソシアネート、N,N'-カルボニルジイミダゾール、トリフルオロ酢酸無水物などが挙げられる。

反応〔A〕は、通常0～100℃、望ましくは0～50℃で行うことができ、その反応時間は、通常0.5～48時間程度、望ましくは1～24時間程度とすることができる。

50

【0023】

【化4】



【0024】

反応〔B〕中、A、B、R¹及びR²は前述の通りであり、R^{3a}はE¹で置換されてもよいアルキル、E¹で置換されてもよいアルケニル、E¹で置換されてもよいアルキニル、ヒドロキシ、シアノオキシ、E¹で置換されてもよいアルコキシ、Jで置換されてもよいシクロアルキル、Jで置換されてもよいシクロアルキルオキシ、Jで置換されてもよいシクロアルキルチオ、シアノ、ホルミル、-C(=W³)R¹¹、-C(=W³)OR¹²、-C(=W³)SR¹²、-C(=W³)NR¹²R¹³、-S(O)_mR¹²又は-S(O)_nNR¹²R¹³(E¹、J、R¹¹、R¹²、R¹³、W³、m及びnは前述の通り)であり、Tはハロゲンであり、ハロゲンとしては弗素、塩素、臭素又は沃素の各原子が挙げられる。

10

【0025】

反応〔B〕は、通常塩基及び溶媒の存在下で行うことができる。

塩基は、例えばナトリウム、カリウムのようなアルカリ金属；ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウム第3級ブトキシドのようなアルカリ金属アルコキシド；炭酸ナトリウム、炭酸カリウムのような炭酸塩；重炭酸ナトリウム、重炭酸カリウムのような重炭酸塩；水酸化ナトリウム、水酸化カリウムのような金属水酸化物；水素化ナトリウム、水素化カリウムのような金属水素化物；モノメチルアミン、ジメチルアミン、トリエチルアミンのようなアミン類；ピリジン、4-ジメチルアミノピリジンのようなピリジン類などから1種又は2種以上を適宜選択できる。塩基は、式(I-1)の化合物に対して1~3倍モル、望ましくは1~1.5倍モル使用できる。

20

【0026】

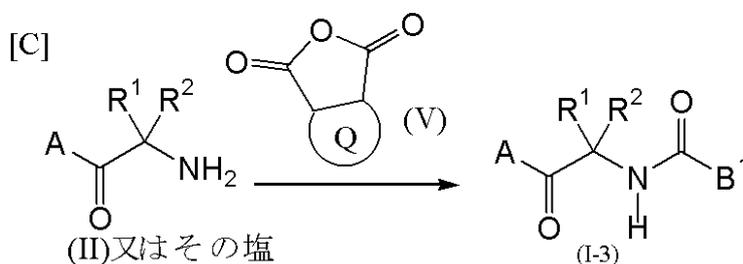
溶媒は、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、例えばベンゼン、トルエン、キシレン、クロロベンゼンのような芳香族炭化水素類；四塩化炭素、塩化メチル、クロロホルム、ジクロロメタン、ジクロロエタン、トリクロロエタン、ヘキサン、シクロヘキサンのような脂肪族炭化水素類；ジオキサン、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、ジメトキシエタンのようなエーテル類；酢酸メチル、酢酸エチルのようなエステル類；ジメチルスルホキシド、スルホラン、ジメチルアセトアミド、ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン、ピリジンのような極性非プロトン性溶媒；アセトニトリル、プロピオニトリル、アクリロニトリルのようなニトリ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

30

反応〔B〕は、通常0~100℃、望ましくは0~50℃で行なうことができ、その反応時間は、通常1~300時間程度、望ましくは1~150時間程度とすることができる。

【0027】

【化5】



【0028】

反応〔C〕中、A、R¹及びR²は前述の通りであり、B¹は-CO₂Hで置換された複素

50

環又は $-CO_2H$ で置換された縮合複素環であり、式(V)はQ(フェニル、複素環又は縮合複素環)のジカルボン酸無水物である。

反応〔C〕は、通常溶媒の存在下で行うことができる。該溶媒は、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、例えばベンゼン、トルエン、キシレン、クロロベンゼンのような芳香族炭化水素類；四塩化炭素、塩化メチル、クロロホルム、ジクロロメタン、ジクロロエタン、トリクロロエタン、ヘキサン、シクロヘキサンのような脂肪族炭化水素類；ジオキサン、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、ジメトキシエタンのようなエーテル類；酢酸メチル、酢酸エチルのようなエステル類；ジメチルスルホキシド、スルホラン、ジメチルアセトアミド、ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン、ピリジンのような極性非プロトン性溶媒；アセトニトリル、プロピオニトリル、アクリロニトリルのようなニトリル類；アセトン、メチルエチルケトンのようなケトン類；メタノール、エタノール、プロパノール、tert-ブタノールのようなアルコール類などから1種又は2種以上を適宜選択できる。

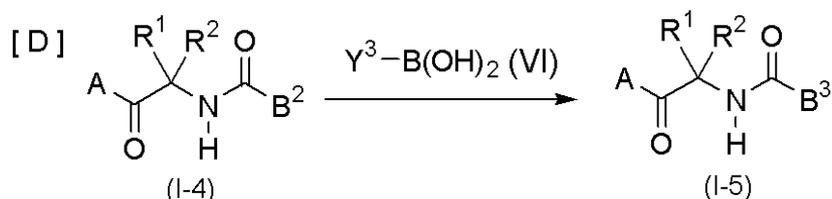
【0029】

反応〔C〕は、必要に応じて塩基の存在下で行うことができる。該塩基としては、例えばナトリウム、カリウムのようなアルカリ金属；ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウム第3級ブトキシドのようなアルカリ金属アルコキシド；炭酸ナトリウム、炭酸カリウムのような炭酸塩；重炭酸ナトリウム、重炭酸カリウムのような重炭酸塩；水酸化ナトリウム、水酸化カリウムのような金属水酸化物；水素化ナトリウム、水素化カリウムのような金属水素化物；モノメチルアミン、ジメチルアミン、トリエチルアミンのようなアミン類；ピリジン、4-ジメチルアミノピリジンのようなピリジン類などから1種又は2種以上を適宜選択できる。塩基は、式(II)の化合物に対して1~3倍モル、望ましくは1~1.5倍モル使用できる。

反応〔C〕の反応は、通常0~150、望ましくは0~80で行なうことができ、その反応時間は、通常0.5~96時間程度、望ましくは1~48時間程度とすることができる。

【0030】

【化6】



【0031】

反応〔D〕中、A、 R^1 及び R^2 は前述の通りであり、 B^2 は Y^2 で置換された複素環又は Y^2 で置換された縮合複素環であり、 B^3 は Y^3 で置換された複素環又は Y^3 で置換された縮合複素環であり、 Y^2 は塩素、臭素又は沃素の各原子であり、 Y^3 は複素環(複素環は、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ又はハロアルコキシで置換されてもよい)である。

反応〔D〕は、通常触媒、塩基、溶媒及び不活性ガスの存在下で行うことができる。

触媒は、例えばテトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(0)、ビス(ジベンジリデンアセトン)パラジウム(0)、トリス(ジベンジリデンアセトン)ジパラジウム(0)のようなパラジウム錯体などから1種又は2種以上を適宜選択できる。

塩基は、例えば炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸カルシウムのような炭酸塩；重炭酸ナトリウム、重炭酸カリウムのような重炭酸塩；水酸化ナトリウム、水酸化カリウムのような金属水酸化物などから1種又は2種以上を適宜選択できる。塩基は、式(I-4)の化合物に対して1~20倍モル、望ましくは1~10倍モル使用できる。

【0032】

溶媒は、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、例えばベンゼン、トルエン、キシレン、クロロベンゼンのような芳香族炭化水素類；四塩化炭素、塩化メチル、ク

10

20

30

40

50

ロロホルム、ジクロロメタン、ジクロロエタン、トリクロロエタン、ヘキサン、シクロヘキサンのような脂肪族炭化水素類；ジオキサン、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、ジメトキシエタンのようなエーテル類；酢酸メチル、酢酸エチルのようなエステル類；ジメチルスルホキシド、スルホラン、ジメチルアセトアミド、ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン、ピリジンのような極性非プロトン性溶媒；アセトニトリル、プロピオニトリル、アクリロニトリルのようなニトリル類；アセトン、メチルエチルケトンのようなケトン類；メタノール、エタノール、プロパノール、tert-ブタノールのようなアルコール類；水などから1種又は2種以上を適宜選択できる。

【0033】

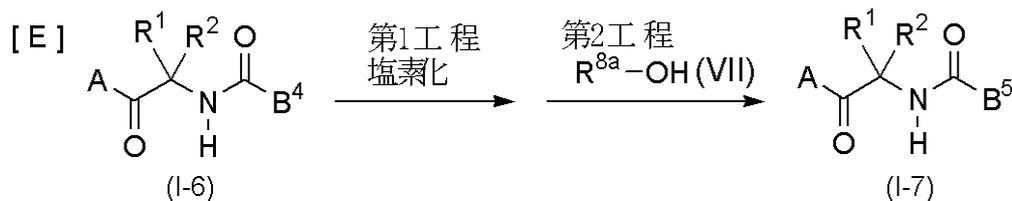
不活性ガスは、例えば窒素ガス、アルゴンガスなどを使用できる。

10

反応〔D〕の反応は、通常0~150、望ましくは15~100で行なうことができ、その反応時間は、通常0.5~96時間程度、望ましくは1~48時間程度とすることができる。

【0034】

【化7】



20

【0035】

反応〔E〕中、A、 R^1 及び R^2 は前述の通りであり、 B^4 は $-CO_2H$ で置換された複素環又は $-CO_2H$ で置換された縮合複素環であり、 B^5 は $-CO_2R^{8a}$ で置換された複素環又は $-CO_2R^{8a}$ で置換された縮合複素環基であり、 R^{8a} はアルキル、ハロアルキル、アルコキシアルキル又はハロアルコキシアルキルである。

反応〔E〕中の第1工程は、塩素化剤の存在下で行うことができる。該塩素化剤としては、例えば塩化チオニル、塩化オキサリル、五塩化リンなどから1種又は2種以上を適宜選択できる。

反応〔E〕中の第1工程は、必要に応じて溶媒の存在下で行うことができる。該溶媒は、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、例えばベンゼン、トルエン、キシレン、クロロベンゼンのような芳香族炭化水素類；四塩化炭素、塩化メチル、クロロホルム、ジクロロメタン、ジクロロエタン、トリクロロエタン、ヘキサン、シクロヘキサンのような脂肪族炭化水素類；ジオキサン、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、ジメトキシエタンのようなエーテル類；酢酸メチル、酢酸エチルのようなエステル類；などから1種又は2種以上を適宜選択できる。

30

【0036】

反応〔E〕中の第1工程の反応は、通常0~200、望ましくは15~150で行なうことができ、その反応時間は、通常0.1~72時間程度、望ましくは0.5~3時間程度とすることができる。

反応〔E〕中の第2工程は、必要に応じて塩基の存在下で行うことができる。該塩基は、例えばナトリウム、カリウムのようなアルカリ金属；ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウム第3級ブトキシドのようなアルカリ金属アルコキシド；炭酸ナトリウム、炭酸カリウムのような炭酸塩；重炭酸ナトリウム、重炭酸カリウムのような重炭酸塩；水酸化ナトリウム、水酸化カリウムのような金属水酸化物；水素化ナトリウム、水素化カリウムのような金属水素化物；モノメチルアミン、ジメチルアミン、トリエチルアミンのようなアミン類；ピリジン、4-ジメチルアミノピリジンのようなピリジン類などから1種又は2種以上を適宜選択できる。塩基は、式(I-6)の化合物に対して1~5倍モル、望ましくは1~2倍モル使用できる。

40

【0037】

反応〔E〕中の第2工程は、必要に応じて溶媒の存在下で行うことができる。該溶媒は

50

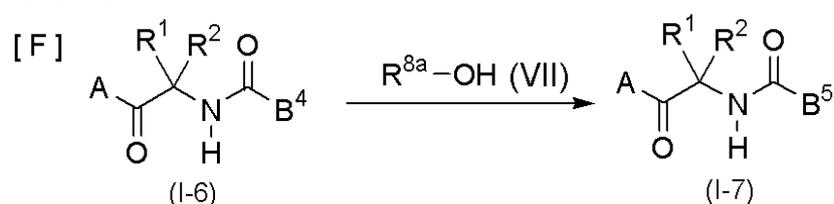
、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、例えばベンゼン、トルエン、キシレン、クロロベンゼンのような芳香族炭化水素類；四塩化炭素、塩化メチル、クロロホルム、ジクロロメタン、ジクロロエタン、トリクロロエタン、ヘキサン、シクロヘキサンのような脂肪族炭化水素類；ジオキサン、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、ジメトキシエタンのようなエーテル類；酢酸メチル、酢酸エチルのようなエステル類；ジメチルスルホキシド、スルホラン、ジメチルアセトアミド、ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン、ピリジンのような極性非プロトン性溶媒；アセトニトリル、プロピオニトリル、アクリロニトリルのようなニトリル類；アセトン、メチルエチルケトンのようなケトン類などから1種又は2種以上を適宜選択できる。尚、この反応においては、式(VII)の化合物を過剰に用いることにより溶媒を兼ねることができる。

10

反応〔E〕中の第2工程の反応は、通常0~100、望ましくは0~50で行なうことができ、その反応時間は、通常0.1~48時間程度、望ましくは0.5~6時間程度とすることができる。

【0038】

【化8】



20

【0039】

反応〔F〕中、A、B⁴、B⁵、R¹、R²及びR^{8a}は前述の通りであり、反応〔F〕は、通常触媒又は脱水縮合剤の存在下で行うことができる。

触媒は、例えば塩酸、硫酸のような鉱酸；パラトルエンスルホン酸のような有機酸；三フッ化ホウ素エーテラートのようなルイス酸などから1種又は2種以上を適宜選択できる。

脱水縮合剤は、N,N'-ジシクロヘキシルカルボジイミド、クロロスルホニルイソシアネート、N,N'-カルボニルジイミダゾール、トリフルオロ酢酸無水物などから1種又は2種以上を適宜選択できる。

30

【0040】

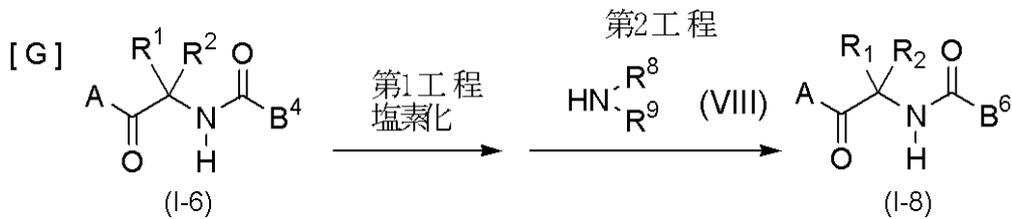
反応〔F〕は、必要に応じて溶媒の存在下で行うことができる。該溶媒は、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、例えばベンゼン、トルエン、キシレン、クロロベンゼンのような芳香族炭化水素類；四塩化炭素、塩化メチル、クロロホルム、ジクロロメタン、ジクロロエタン、トリクロロエタン、ヘキサン、シクロヘキサンのような脂肪族炭化水素類；ジオキサン、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、ジメトキシエタンのようなエーテル類；酢酸メチル、酢酸エチルのようなエステル類；ジメチルスルホキシド、スルホラン、ジメチルアセトアミド、ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン、ピリジンのような極性非プロトン性溶媒；アセトニトリル、プロピオニトリル、アクリロニトリルのようなニトリル類；アセトン、メチルエチルケトンのようなケトン類；メタノール、エタノール、プロパノール、tert-ブタノールのようなアルコール類などから1種又は2種以上を適宜選択できる。尚、この反応においては、式(VII)の化合物を過剰に用いることにより溶媒を兼ねることができる。

40

反応〔F〕の反応、通常0~200、望ましくは0~100で行なうことができ、その反応時間は、通常0.1~96時間程度、望ましくは0.5~24時間程度とすることができる。

【0041】

【化9】



【0042】

反応〔G〕中、A、B⁴、R¹、R²、R⁸及びR⁹は前述の通りであり、B⁶は-CO-NR⁸R⁹で置換された複素環又は-CO-NR⁸R⁹で置換された縮合複素環基（R⁸及びR⁹は前述の通り）である。

10

反応〔G〕中の第1工程は、前記反応〔E〕の第1工程に準じて行うことができる。

反応〔G〕中の第2工程は、必要に応じて塩基の存在下で行うことができる。該塩基は、例えばナトリウム、カリウムのようなアルカリ金属；ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウム第3級ブトキシドのようなアルカリ金属アルコキシド；炭酸ナトリウム、炭酸カリウムのような炭酸塩；重炭酸ナトリウム、重炭酸カリウムのような重炭酸塩；水酸化ナトリウム、水酸化カリウムのような金属水酸化物；水素化ナトリウム、水素化カリウムのような金属水素化物；モノメチルアミン、ジメチルアミン、トリエチルアミンのようなアミン類；ピリジン、4-ジメチルアミノピリジンのようなピリジン類などから1種又は2種以上を適宜選択できる。塩基は、式（I-6）の化合物に対して1~10倍モル、望ましくは1~2倍モル使用できる。

20

【0043】

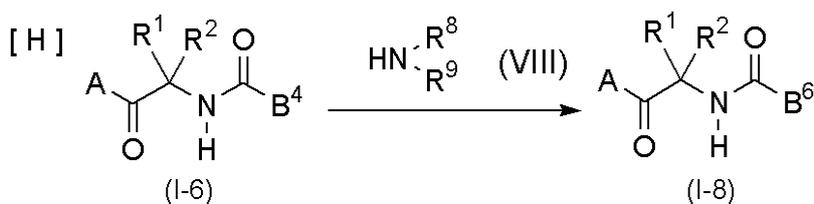
反応〔G〕中の第2工程は、必要に応じて溶媒の存在下で行うことができる。該溶媒は、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、例えばベンゼン、トルエン、キシレン、クロロベンゼンのような芳香族炭化水素類；四塩化炭素、塩化メチル、クロロホルム、ジクロロメタン、ジクロロエタン、トリクロロエタン、ヘキサン、シクロヘキサンのような脂肪族炭化水素類；ジオキサン、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、ジメトキシエタンのようなエーテル類；酢酸メチル、酢酸エチルのようなエステル類；ジメチルスルホキシド、スルホラン、ジメチルアセトアミド、ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン、ピリジンのような極性非プロトン性溶媒；アセトニトリル、プロピオニトリル、アクリロニトリルのようなニトリル類；アセトン、メチルエチルケトンのようなケトン類；水などから1種又は2種以上を適宜選択できる。

30

反応〔G〕中の第2工程の反応は、通常0~100℃、望ましくは0~50℃で行なうことができ、その反応時間は、通常0.1~48時間程度、望ましくは0.5~6時間程度である。

【0044】

【化10】



40

【0045】

反応〔H〕中、A、B⁴、B⁶、R¹、R²、R⁸及びR⁹は前述の通りである。

反応〔H〕は、通常脱水縮合剤及び溶媒の存在下で行うことができる。

脱水縮合剤は、N,N'-ジシクロヘキシルカルボジイミド、クロロスルホニルイソシアネート、N,N'-カルボニルジイミダゾール、トリフルオロ酢酸無水物などから1種又は2種以上を適宜選択できる。

溶媒は、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、例えばベンゼン、トルエン、キシレン、クロロベンゼンのような芳香族炭化水素類；四塩化炭素、塩化メチル、ク

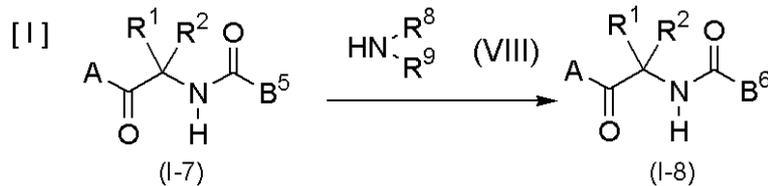
50

ロロホルム、ジクロロメタン、ジクロロエタン、トリクロロエタン、ヘキサン、シクロヘキサンのような脂肪族炭化水素類；ジオキサン、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、ジメトキシエタンのようなエーテル類；酢酸メチル、酢酸エチルのようなエステル類；ジメチルスルホキシド、スルホラン、ジメチルアセトアミド、ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン、ピリジンのような極性非プロトン性溶媒；アセトニトリル、プロピオニトリル、アクリロニトリルのようなニトリル類；アセトン、メチルエチルケトンのようなケトン類などから1種又は2種以上を適宜選択できる。

反応〔H〕の反応は、通常0~200、望ましくは0~100で行なうことができ、その反応時間は、通常0.1~96時間程度、望ましくは0.5~24時間程度とすることができる。

【0046】

【化11】



【0047】

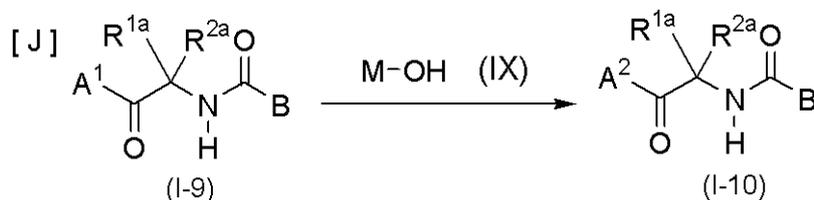
反応〔I〕中、A、B⁵、B⁶、R¹、R²、R⁸及びR⁹は前述の通りである。

反応〔I〕は、通常溶媒の存在下で行うことができる。該溶媒は、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、例えばベンゼン、トルエン、キシレン、クロロベンゼンのような芳香族炭化水素類；四塩化炭素、塩化メチル、クロロホルム、ジクロロメタン、ジクロロエタン、トリクロロエタン、ヘキサン、シクロヘキサンのような脂肪族炭化水素類；ジオキサン、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、ジメトキシエタンのようなエーテル類；酢酸メチル、酢酸エチルのようなエステル類；ジメチルスルホキシド、スルホラン、ジメチルアセトアミド、ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン、ピリジンのような極性非プロトン性溶媒；アセトニトリル、プロピオニトリル、アクリロニトリルのようなニトリル類；アセトン、メチルエチルケトンのようなケトン類；メタノール、エタノール、プロパノール、tert-ブタノールのようなアルコール類；水などから1種又は2種以上を適宜選択する。尚、この反応においては、式(VIII)の化合物を過剰に用いることにより溶媒を兼ねることができる。

反応〔I〕の反応は、通常0~150、望ましくは0~80で行なうことができ、その反応時間は、通常0.1~48時間程度、望ましくは0.5~24時間程度とすることができる。

【0048】

【化12】



【0049】

反応〔J〕中、Bは前述の通りであり、A¹は-O R⁴で置換されたフェニル、-O R⁴で置換されたベンジル、-O R⁴で置換されたナフチル、-O R⁴で置換された複素環又は-O R⁴で置換された縮合複素環（R⁴は前述の通り）であり、A²は-O Hで置換されたフェニル、-O Hで置換されたベンジル、-O Hで置換されたナフチル、-O Hで置換された複素環又は-O Hで置換された縮合複素環であり、R^{1a}及びR^{2a}は各々アルキル、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、ハロアルコキシアルキル、シアノアルキル、アルコキシカルボニルアルキル、アルケニル、ハロアルケニル、アルコキシアルケニル、アルキニル、ハロアルキニル、アルコキシアルキニル、シクロアルキル、ハロシクロアルキル、(アルキル)シクロアルキル、(ハロアルキル)シクロアルキル又はシアノであり

10

20

30

40

50

、また R^{1a} と R^{2a} は一緒になって 3 ~ 6 員飽和炭素環を形成してもよく、M はナトリウム又はカリウムである。

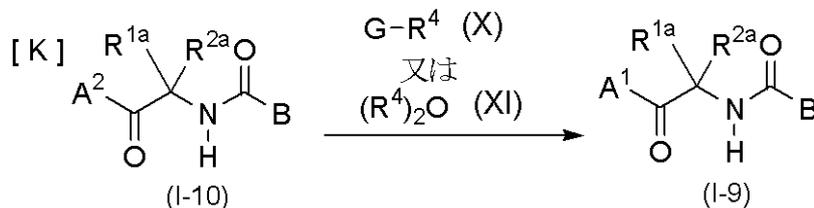
【0050】

反応〔J〕は、通常溶媒の存在下で行うことができる。該溶媒は、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、例えばベンゼン、トルエン、キシレン、クロロベンゼンのような芳香族炭化水素類；四塩化炭素、塩化メチル、クロロホルム、ジクロロメタン、ジクロロエタン、トリクロロエタン、ヘキサン、シクロヘキサンのような脂肪族炭化水素類；ジオキサン、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、ジメトキシエタンのようなエーテル類；ジメチルスルホキシド、スルホラン、ジメチルアセトアミド、ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン、ピリジンのような極性非プロトン性溶媒；アセトニトリル、プロピオニトリル、アクリロニトリルのようなニトリル類；アセトン、メチルエチルケトンのようなケトン類；メタノール、エタノール、プロパノール、tert-ブタノールのようなアルコール類；水などから 1 種又は 2 種以上を適宜選択できる。

反応〔J〕の反応は、通常 0 ~ 100 °C、望ましくは 20 ~ 80 °C で行なうことができ、その反応時間は、通常 0.1 ~ 24 時間程度、望ましくは 0.1 ~ 12 時間程度とすることができる。

【0051】

【化13】



【0052】

反応〔K〕中、 A^1 、 A^2 、 B 、 R^{1a} 、 R^{2a} 及び R^4 は前述の通りであり、 G は塩素、臭素又は沃素の各原子である。

反応〔K〕は、通常塩基及び溶媒の存在下で行うことができる。

塩基は、例えばナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウム第 3 級ブトキシドのようなアルカリ金属アルコキシド；炭酸ナトリウム、炭酸カリウムのような炭酸塩；重炭酸ナトリウム、重炭酸カリウムのような重炭酸塩；水酸化ナトリウム、水酸化カリウムのような金属水酸化物；水素化ナトリウム、水素化カリウムのような金属水素化物；モノメチルアミン、ジメチルアミン、トリエチルアミンのようなアミン類；ピリジン、4-ジメチルアミノピリジンのようなピリジン類などから 1 種又は 2 種以上を適宜選択することができる。塩基は、式 (I-10) の化合物に対して 1 ~ 2 倍モル、望ましくは 1 ~ 1.5 倍モル使用することができる。

【0053】

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

反応〔K〕の反応は、通常 -20 ~ 100 °C、望ましくは 0 ~ 50 °C で行なうことができ、その反応時間は、通常 0.1 ~ 24 時間程度、望ましくは 0.1 ~ 12 時間程度である。

前記反応〔A〕又は〔C〕で使用される式 (II) の化合物は、以下の反応〔L〕~〔N〕に従って製造することができる。

【0054】

10

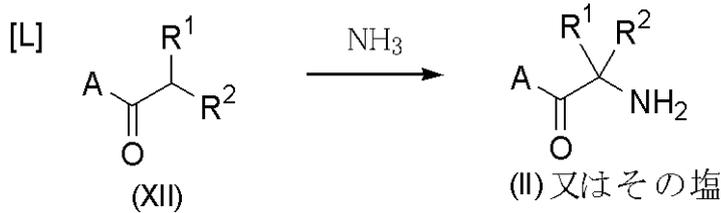
20

30

40

50

【化14】



【0055】

反応〔L〕中、A、R¹及びR²は前述の通りである。反応〔L〕においては、反応の後処理或は通常塩形成反応に準じて化合物(II)の塩を製造できる。

反応〔L〕は、通常酸化剤及び水の存在下で行うことができる。

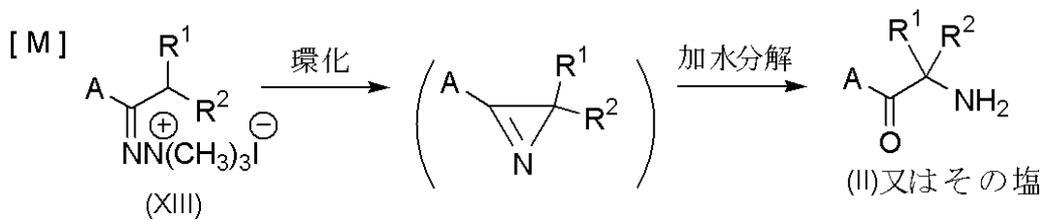
酸化剤としては、例えばフェリシアン化カリウムなどが挙げられる。酸化剤は、式(XI)の化合物に対して1~10倍モル、望ましくは1~5倍モル使用できる。

反応〔L〕は、必要に応じて溶媒の存在下で行うことができる。該溶媒としては、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、例えばジオキサン、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、ジメトキシエタンのようなエーテル類；酢酸メチル、酢酸エチルのようなエステル類；ジメチルスルホキシド、スルホラン、ジメチルアセトアミド、ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン、ピリジン、アセトニトリル、プロピオニトリルのような極性非プロトン性溶媒；アセトン、メチルエチルケトンのようなケトン類などから1種又は2種以上を適宜選択できる。また、反応〔L〕で用いる水は、過剰に用いることにより、溶媒を兼ねることができる。

反応〔L〕は、通常20~150℃、望ましくは50~100℃で行うことができ、その反応時間は、通常0.5~30時間程度、望ましくは1~20時間程度とすることができる。

【0056】

【化15】



【0057】

反応〔M〕中、A、R¹及びR²は前述の通りである。反応〔M〕においては、反応の後処理或は通常塩形成反応に準じて化合物(II)の塩を製造できる。

反応〔M〕の環化反応は、通常塩基及び溶媒の存在下で行うことができる。

塩基は、例えばナトリウム、カリウムのようなアルカリ金属；ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウム第3級ブトキシドのようなアルカリ金属アルコキシド；水素化ナトリウム、水素化カリウムのような金属水素化物などから1種又は2種以上を適宜選択する。塩基は、式(XIII)の化合物に対して1~3倍モル、望ましくは1~1.5倍モル使用できる。

【0058】

溶媒は、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、例えばベンゼン、トルエン、キシレン、クロロベンゼンのような芳香族炭化水素類；ジオキサン、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、ジメトキシエタンのようなエーテル類；メタノール、エタノール、プロパノール、tert-ブタノールのようなアルコール類；アセトニトリル、プロピオニトリル、アクリロニトリルのようなニトリル類などから1種又は2種以上を適宜選択できる。

反応〔M〕の環化反応の反応は、通常0~150℃、望ましくは30~100℃で行うことができ、その反応時間は、通常0.5~24時間程度、望ましくは1~12時間程度とすることができる。

10

20

30

40

50

【0059】

反応〔M〕の加水分解反応は、一般的な加水分解反応に準じて行うことができ、通常酸又は塩基及び溶媒の存在下で行うことができる。

酸としては、例えば塩化水素、硫酸などが挙げられる。塩基としては例えば水酸化ナトリウム、水酸化カリウムのような金属水酸化物などが挙げられる。

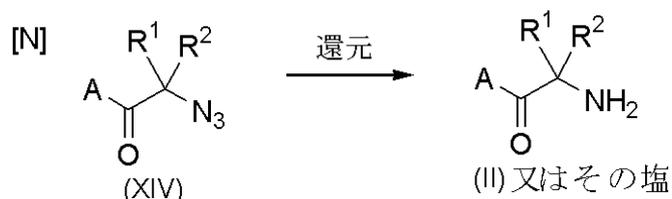
溶媒は、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、例えばメタノール、エタノール、プロパノール、tert-ブタノールのようなアルコール類；アセトニトリル、プロピオニトリル、アクリロニトリルのようなニトリル類；アセトン、メチルエチルケトンのようなケトン類；水などから1種又は2種以上を適宜選択できる。

反応〔M〕の加水分解反応の反応は、通常0~100、望ましくは20~80で行なうことができ、反応時間は、通常0.1~12時間程度、望ましくは0.1~1時間程度とすることができる。

10

【0060】

【化16】



20

【0061】

反応〔N〕中、A、R¹及びR²は前述の通りである。反応〔N〕においては、反応の後処理或は通常の塩形成反応に準じて化合物(II)の塩を製造できる。

反応〔N〕の還元反応としては、例えば接触還元、金属水素化物（水素化ホウ素ナトリウム、水素化アルミニウムリチウムなど）による還元；トリフェニルホスフィン、ジメチルスルフィド又はジフェニルスルフィドによる還元；鉄、銅のような金属と、ギ酸、酢酸のようなカルボン酸から構成される反応系での還元などが挙げられる。接触還元は、通常、水素雰囲気下で、白金、酸化白金、白金黒、ラネーニッケル、パラジウム、パラジウム炭素、ロジウム、ロジウム-アルミナなどを触媒として使用することにより行うことができる。

30

【0062】

反応〔N〕は、通常、溶媒の存在下で行うことができる。該溶媒は、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、例えばベンゼン、トルエン、キシレンのような芳香族炭化水素類；ヘキサン、シクロヘキサンのような脂肪族炭化水素類；ジオキサソラン、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、ジメトキシエタンのようなエーテル類；酢酸メチル、酢酸エチルのようなエステル類；ジメチルスルホキシド、スルホラン、ジメチルアセトアミド、ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン、ピリジン、アセトニトリル、プロピオニトリルのような極性非プロトン性溶媒；アセトン、メチルエチルケトンのようなケトン類；メタノール、エタノール、プロパノール、tert-ブタノールのようなアルコール類；水などから1種又は2種以上を適宜選択できる。

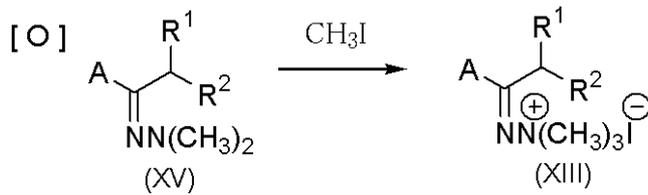
40

反応〔N〕は、通常0~150、望ましくは0~80で行うことができ、その反応時間は、通常0.5~96時間程度、望ましくは0.5~48時間程度とすることができる。

前記反応〔M〕で使用される式(XIII)の化合物は、以下の反応〔O〕に従って製造できる。

【0063】

【化17】



【0064】

反応〔O〕中、A、R¹及びR²は前述の通りである。

反応〔O〕は、必要に応じて溶媒の存在下で行うことができる。該溶媒としては、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、例えばベンゼン、トルエン、キシレン、クロロベンゼンのような芳香族炭化水素類；四塩化炭素、クロロホルム、ジクロロメタン、ジクロロエタン、トリクロロエタン、ヘキサン、シクロヘキサンのような脂肪族炭化水素類；ジオキサン、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、ジメトキシエタンのようなエーテル類；酢酸メチル、酢酸エチルのようなエステル類；メタノール、エタノール、プロパノール、tert-ブタノールのようなアルコール類；アセトニトリル、プロピオニトリルのような極性非プロトン性溶媒；アセトン、メチルエチルケトンのようなケトン類などから1種又は2種以上を適宜選択できる。

【0065】

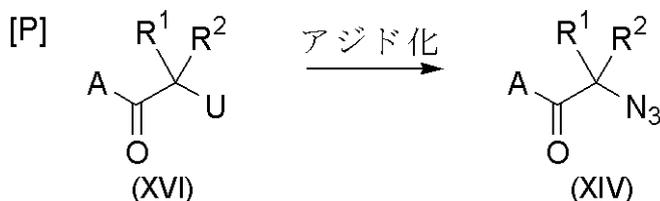
反応〔O〕のヨウ化メチルは、式(VII)の化合物に対し1~10倍モル、望ましくは1~3倍モル使用できる。また、ヨウ化メチルは過剰に用いることにより、溶媒を兼ねることができる。

反応〔O〕は、通常0~100℃、望ましくは10~50℃で行うことができ、その反応時間は、通常0.5~48時間程度、望ましくは1~24時間程度とすることができる。

前記反応〔N〕で使用される式(XIV)の化合物は、以下の反応〔P〕に従って製造できる。

【0066】

【化18】



【0067】

反応〔P〕中、A、R¹及びR²は前述の通りであり、Uは塩素又は臭素の各原子である。

反応〔P〕は、アジド化剤の存在下で行うことができる。該アジド化剤としては、例えばアジ化ナトリウム、アジ化カリウム、トリメチルシリルアジドなどから1種又は2種以上を適宜選択できる。

【0068】

反応〔P〕は、通常、溶媒の存在下で行うことができる。該溶媒は、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、例えばベンゼン、トルエン、キシレン、クロロベンゼンのような芳香族炭化水素類；四塩化炭素、クロロホルム、ジクロロメタン、ジクロロエタン、トリクロロエタン、ヘキサン、シクロヘキサンのような脂肪族炭化水素類；ジオキサン、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、ジメトキシエタンのようなエーテル類；酢酸メチル、酢酸エチルのようなエステル類；ジメチルスルホキシド、スルホラン、ジメチルアセトアミド、ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン、ピリジン、アセトニトリル、プロピオニトリルのような極性非プロトン性溶媒；アセトン、メチルエチルケトンのようなケトン類；メタノール、エタノール、プロパノール、tert-ブタノールのよう

10

20

30

40

50

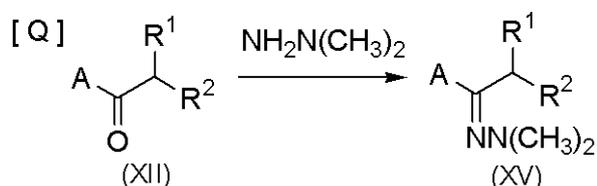
なアルコール類；水などから1種又は2種以上を適宜選択できる。

反応〔P〕は、通常0~150、望ましくは20~90で行うことができ、その反応時間は、通常0.1~96時間程度、望ましくは0.5~12時間程度とすることができる。

前記反応〔O〕で使用される式(XV)の化合物は、以下の反応〔Q〕に従って製造できる。

【0069】

【化19】



10

【0070】

反応〔Q〕中、A、R¹及びR²は前述の通りである。

反応〔Q〕は一般的なヒドラゾン合成反応に準じて行うことができ、必要に応じて脱水剤及び/又は触媒の存在下で行うことができる。

脱水剤としては、例えばモレキュラーシーブなどが挙げられる。脱水剤は、式(XII)の化合物の重量に対して通常は1~30倍、望ましくは5~10倍使用できる。

触媒としては、例えば四塩化チタンなどが挙げられる。

反応〔Q〕のジメチルヒドラジンは、式(XII)の化合物に対して通常は1~30倍モル、望ましくは5~10倍モル使用できる。

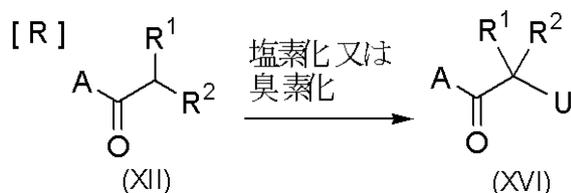
20

反応〔Q〕の反応は、通常20~150、望ましくは50~120で行なうことができ、その反応時間は、通常5~200時間程度、望ましくは24~120時間程度とすることができる。

前記反応〔P〕で使用される式(XVI)の化合物は、以下の反応〔R〕に従って製造できる。

【0071】

【化20】



30

【0072】

反応〔R〕中、A、R¹、R²及びUは前述の通りである。

反応〔R〕は、塩素化剤又は臭素化剤の存在下で行うことができる。該塩素化剤としては、例えば塩素、N-クロロコハク酸イミドなどから1種又は2種以上を適宜選択し、臭素化剤としては、例えば臭素、N-プロモコハク酸イミド、フェニルトリメチルアンモニウムトリプロミドなどから1種又は2種以上を適宜選択できる。

【0073】

反応〔R〕は、通常、溶媒の存在下で行うことができる。該溶媒は、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、例えば四塩化炭素、塩化メチル、クロロホルム、ジクロロメタン、ジクロロエタン、トリクロロエタン、ヘキサン、シクロヘキサンのような脂肪族炭化水素類；ジオキサン、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、ジメトキシエタンのようなエーテル類；酢酸メチル、酢酸エチルのようなエステル類；ジメチルスルホキシド、スルホラン、ジメチルアセトアミド、ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン、ピリジンのような極性非プロトン性溶媒；酢酸、プロピオン酸のような有機酸；水などから1種又は2種以上を適宜選択できる。

40

【0074】

反応〔R〕は、必要に応じ塩基の存在下で行うことができる。該塩基としては、例えば

50

リチウムジイソプロピルアミドなどが挙げられる。塩基は、式 (XII) の化合物に対し1~2倍モル、望ましくは1~1.2倍モル使用できる。

塩基の存在下で行う場合、通常溶媒はテトラヒドロフラン、ジエチルエーテルのようなエーテル類から1種又は2種以上を適宜選択できる。

反応〔R〕は、必要に応じ酢酸、プロピオン酸のような有機酸或は塩化アルミニウムのようなルイス酸を触媒として使用することができる。また、溶媒としての有機酸を過剰に用いることにより触媒を兼ねることができる。

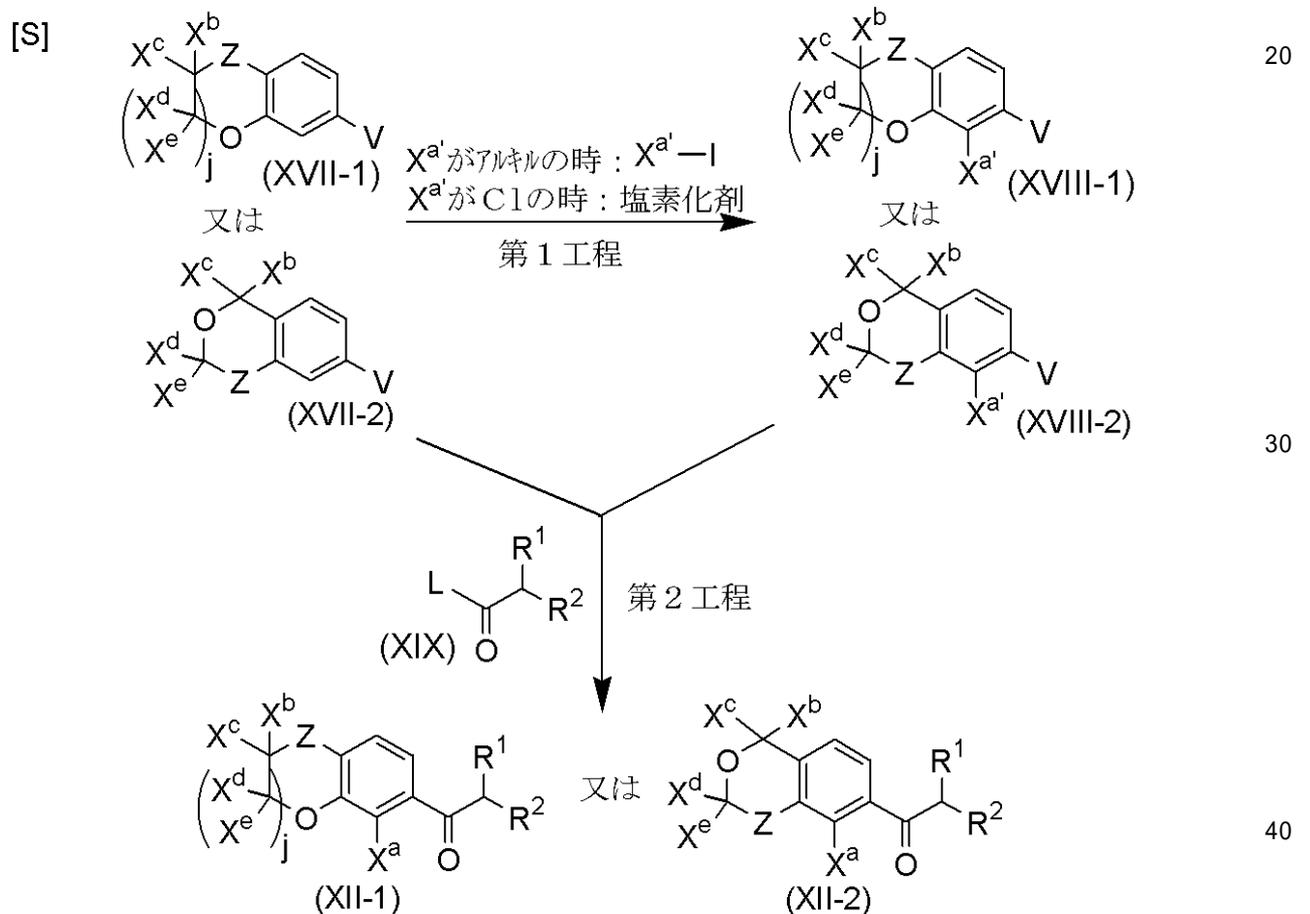
【0075】

反応〔R〕は、通常-100~150、望ましくは-78~110で行うことができ、その反応時間は、通常0.1~48時間程度、望ましくは0.5~24時間程度とすることができるが、塩基の存在下で行う場合、通常-100~0、望ましくは-78~-20で行うことができ、その反応時間は、通常0.1~12時間程度、望ましくは0.5~6時間程度とすることができるが、また、酸の存在下で行う場合、通常0~150、望ましくは20~110で行うことができ、その反応時間は、通常0.1~48時間程度、望ましくは1~24時間程度とすることができる。

前記反応〔Q〕で使用される式 (XII) の化合物は公知化合物であるか、或は以下の反応〔S〕~〔T〕又はこれらに準じた方法に従って製造することができる。

【0076】

【化21】



【0077】

反応〔S〕中、 R^1 及び R^2 は前述の通りであり、 Z は酸素原子、硫黄原子又は又は $-\text{C}(\text{G}^1)\text{G}^2-$ であり、 X^a は水素原子、塩素原子又はアルキルであり、 $X^{a'}$ は塩素原子又はアルキルであり、 X^b 、 X^c 、 X^d 、 X^e 、 G^1 及び G^2 は各々独立に水素原子、弗素原子又は塩素原子であり、 V は臭素原子又は沃素原子であり、 j は0又は1であり、 L は脱離基、より具体的には塩素原子、臭素原子のようなハロゲン；メトキシ、エトキシのようなアルコキシ；ジメチルアミノ、ジエチルアミノのようなジアルキルアミノ； N -メトキシ- N -メチルアミノ又はアルキルで置換されていてもよいアジリジニルなどである。

反応〔S〕の第1工程は、通常、塩基及び溶媒の存在下で行うことができる。

塩基は、リチウムジイソプロピルアミドのような有機リチウム化合物などから適宜選択できる。塩基は、式(XVII-1)又は(XVII-2)の化合物に対し1~2倍モル、望ましくは1~1.5倍モル使用できる。

【0078】

溶媒は、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、例えばジオキサン、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテルのようなエーテル類などから1種又は2種以上を適宜選択できる。

反応〔S〕の第1工程で用いる塩素化剤としては、例えばN-クロロコハク酸イミドなどが挙げられる。

反応〔S〕の第1工程で用いる式： $X^{a'}$ -Iは、式(XVII-1)又は(XVII-2)の化合物に対し1~10倍モル、望ましくは1~5倍モル使用できる。また、反応〔S〕の第1工程で用いる塩素化剤は、式(XVII-1)又は(XVII-2)の化合物に対し1~5倍モル、望ましくは1~3倍モル使用できる。

反応〔S〕の第1工程は、必要に応じ不活性ガスの存在下で行うことができる。該不活性ガスは、例えば窒素ガス、アルゴンガスなどから適宜選択できる。

反応〔S〕の第1工程は、通常-100~50、望ましくは-70~25で行うことができ、その反応時間は、通常1~48時間程度、望ましくは1~20時間程度とすることができる。

【0079】

反応〔S〕の第2工程は、通常、塩基及び溶媒の存在下で行うことができる。

塩基は、メチルリチウム、n-ブチルリチウムのような有機リチウム化合物；イソプロピルマグネシウムクロリドのようなグリニャール化合物などから1種又は2種以上を適宜選択できる。塩基は、式(XVII-1)、(XVII-2)、(XVIII-1)又は(XVIII-2)の化合物に対し1~2倍モル、望ましくは1~1.5倍モル使用できる。

溶媒は、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、例えばジオキサン、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテルのようなエーテル類などから1種又は2種以上を適宜選択できる。

反応〔S〕の第2工程で用いる式(XIX)の化合物は、式(XVII-1)、(XVII-2)、(XVIII-1)又は(XVIII-2)の化合物に対し1~3倍モル、望ましくは1~1.5倍モル使用できる。

反応〔S〕の第2工程は、必要に応じ不活性ガスの存在下で行うことができる。該不活性ガスは、例えば窒素ガス、アルゴンガスなどから適宜選択できる。

反応〔S〕の第2工程は、通常-100~50、望ましくは-70~25で行うことができ、その反応時間は、通常1~48時間程度、望ましくは1~20時間程度とすることができる。

【0080】

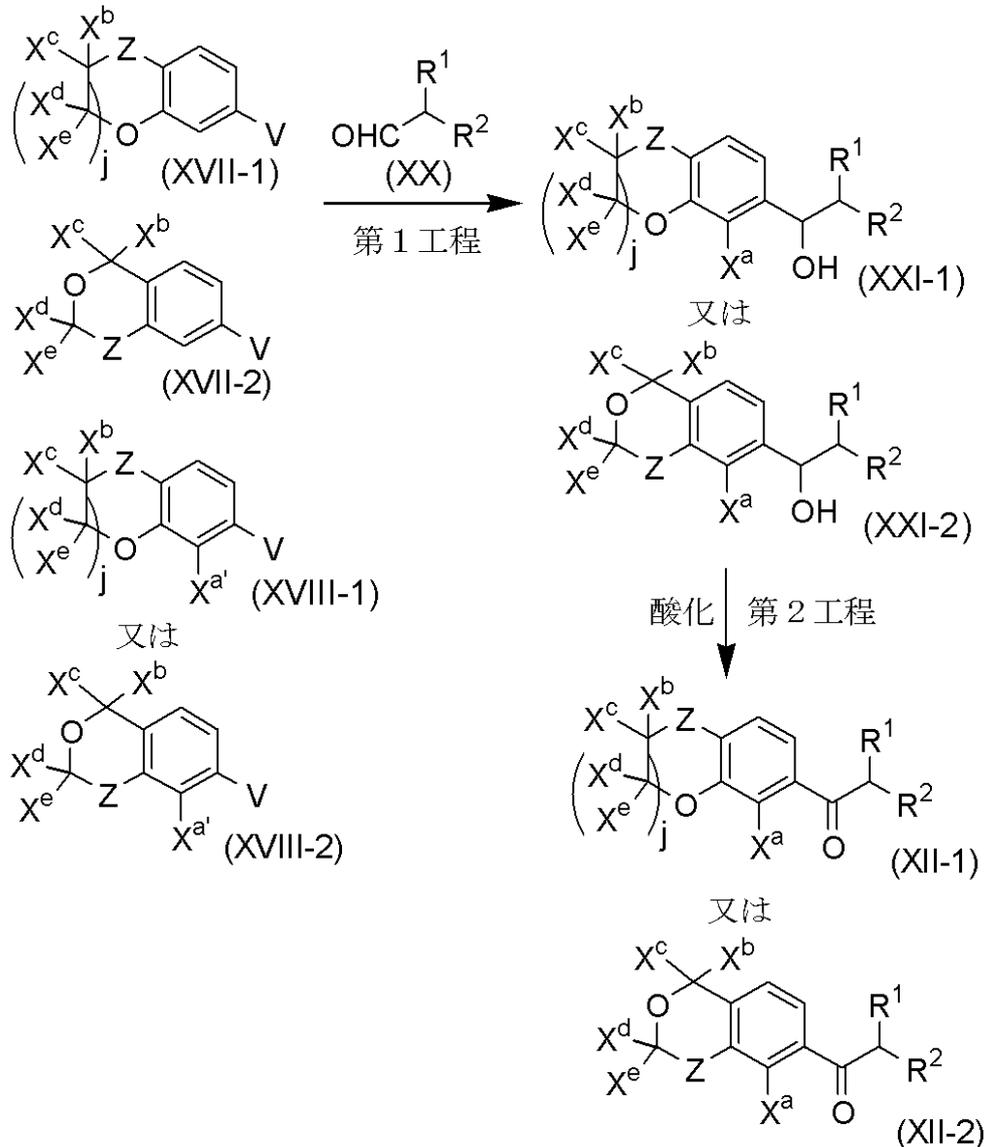
10

20

30

【化22】

[T]



10

20

30

【0081】

反応 [T] 中、 R^1 、 R^2 、 Z 、 X^a 、 $X^{a'}$ 、 X^b 、 X^c 、 X^d 、 X^e 、 V 及び j は前述の通りである。

反応 [T] の第1工程は、通常、塩基及び溶媒の存在下で行うことができる。

塩基は、メチルリチウム、 n -ブチルリチウムのような有機リチウム化合物；イソプロピルマグネシウムクロリドのようなグリニャール化合物などから1種又は2種以上を適宜選択できる。塩基は、式 (XVII-1)、(XVII-2)、(XVIII-1) 又は (XVIII-2) の化合物に対し1~2倍モル、望ましくは1~1.5倍モル使用できる。

溶媒は、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、例えばジオキサン、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテルのようなエーテル類などから1種又は2種以上を適宜選択できる。

40

反応 [T] の第1工程で用いる式 (XX) は、式 (XVII-1)、(XVII-2)、(XVIII-1) 又は (XVIII-2) の化合物に対し1~3倍モル、望ましくは1~1.5倍モル使用できる。

【0082】

反応 [T] の第1工程は、必要に応じ不活性ガスの存在下で行うことができる。該不活性ガスは、例えば窒素ガス、アルゴンガスなどから適宜選択できる。

反応 [T] の第1工程は、通常 -100~50、望ましくは -70~25 で行うことができ、その反応時間は、通常1~48時間程度、望ましくは1~20時間程度とすることができる。

50

反応〔T〕の第2工程は、通常、酸化剤及び溶媒の存在下で行うことができる。

酸化剤は、クロロクロム酸ピリジニウム、二酸化マンガンなどから1種又は2種以上を適宜選択できる。酸化剤は、式(XXI-1)又は(XXI-2)の化合物に対し1~10倍モル、望ましくは1~3倍モル使用できる。

溶媒は、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、例えばベンゼン、トルエン、キシレン、クロロベンゼンのような芳香族炭化水素類；四塩化炭素、クロロホルム、ジクロロメタン、ジクロロエタン、トリクロロエタン、ヘキサン、シクロヘキサンのような脂肪族炭化水素類などから1種又は2種以上を適宜選択できる。

反応〔T〕の第2工程は、通常0~150℃、望ましくは20~100℃で行うことができ、その反応時間は、通常0.5~24時間程度、望ましくは1~12時間程度とすることができる。

【0083】

【化23】



【0084】

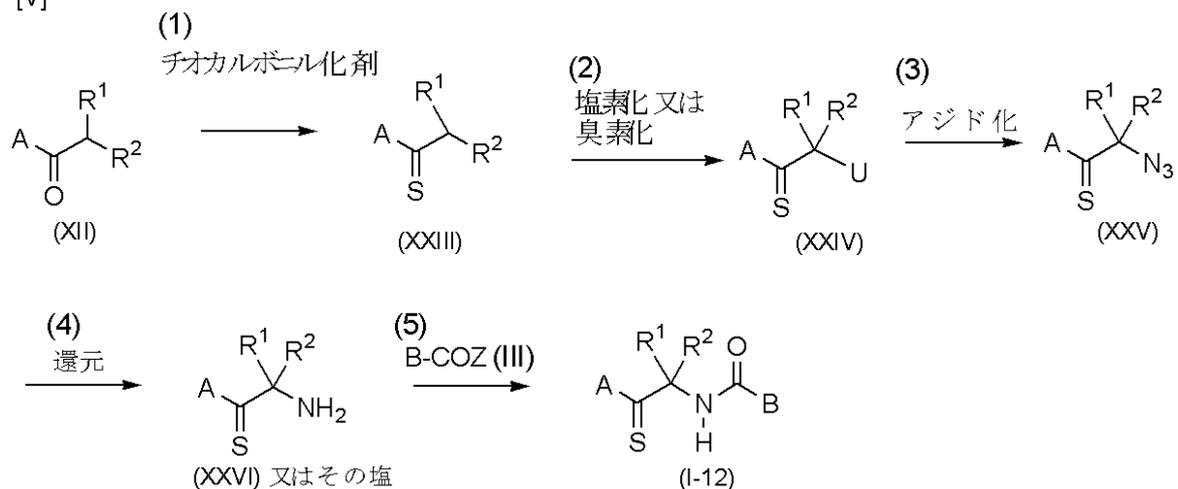
反応〔U〕中、A、B、R¹、R²及びZは前述の通りである。

反応〔U〕は、前記反応〔A〕に準じて行うことができる。

【0085】

【化24】

[V]



【0086】

反応〔V〕中、A、B、R¹、R²、U及びZは前述の通りである。また、チオカルボニル化剤としては、ローソン試薬、五硫化ニリンなどが挙げられる。反応〔V〕は、上記フロー中の(1)~(5)のように5段階の反応から成り、各々の反応の反応条件については、以下に説明する。

(1)の反応は、通常、溶媒の存在下で行うことができる。該溶媒は、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、例えばベンゼン、トルエン、キシレンのような芳香族炭化水素類；ペンタン、ヘキサン、ヘプタン、石油エーテル、リグロイン、石油ベンジンのような脂肪族炭化水素類；ジエチルエーテル、ジプロピルエーテル、ジブチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類；二硫化炭素などから1種又は2種以上を適宜選択できる。

【0087】

10

20

30

40

50

(1)の反応は、通常 - 20 ~ 150 、望ましくは0 ~ 110 で行うことができ、その反応時間は、通常0.1 ~ 48時間とすることができる。

(1)の反応において、チオカルボニル化剤は、式(XII)の化合物に対し0.4 ~ 2倍モル使用できる。

(2)の反応は、前記反応〔R〕に準じて行うことができる。

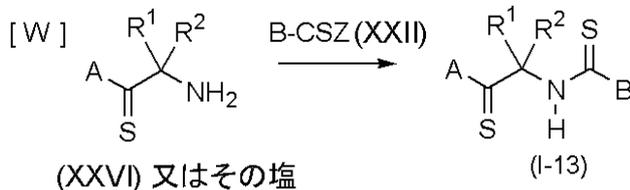
(3)の反応は、前記反応〔P〕に準じて行うことができる。

(4)の反応は、前記反応〔N〕に準じて行うことができる。

(5)の反応は、前記反応〔A〕に準じて行うことができる。

【0088】

【化25】



10

【0089】

反応〔W〕中、A、B、R¹、R²及びZは前述の通りである。

反応〔W〕は、前記反応〔A〕に準じて行うことができる。

尚、式(1)の酸アミド誘導体又はその塩は、必要に応じWO2001/60783或はWO2003/27059に開示された方法を参考にして製造することもできる。

20

【発明の効果】

【0090】

式(1)の酸アミド誘導体又はその塩を有効成分として含有する殺菌性組成物(以下本発明組成物と略す)は、低薬量で有害菌類を防除することができ、例えば農園芸用の殺菌性組成物として有用である。

【発明を実施するための最良の形態】

【0091】

本発明組成物の望ましい態様について以下に記述する。

本発明組成物は、低薬量で有害菌類を防除できる殺菌性組成物として有用であり、特に、農園芸用の殺菌性組成物として有用である。農園芸用の殺菌性組成物として用いた場合、本発明組成物は、例えば卵菌類(Oomycetes)、子囊菌類(Ascomycetes)、担子菌類(Basidiomycetes)、不完全菌類(Deuteromycetes)などに属する有害菌類を防除でき、なかでも子囊菌類(Ascomycetes)、不完全菌類(Deuteromycetes)などに属する有害菌類の防除に特に有効である。

30

【0092】

前記有害菌類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。

卵菌類として、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*)のようなピシューム(*Pythium*)属などが挙げられる。

40

【0093】

子囊菌類として、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*)、バナナブラックシ

50

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、キュウリ菌核病菌、キャベツ菌核病菌、ハクサイ菌核病菌、トウガラシ菌核病菌、ピーマン菌核病菌又はタマネギ菌核病菌のような各種菌核病菌 (*Sclerotinia sclerotiorum*)、コムギ雪腐大粒菌核病菌 (*Sclerotinia borealis*)、トマト小粒菌核病菌 (*Sclerotinia minor*)、アルファルファ菌核病菌 (*Sclerotinia trifoliorum*) のようなスクレロティニア (*Sclerotinia*) 属；ラッカセイ小菌核病菌 (*Botrylinia arachidis*) のようなボトリオリニア (*Botrylinia*) 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；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。

10

【0094】

20

担子菌類として、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；エンバク冠さび病菌 (*Puccinia coronata*)、コムギ赤さび病菌 (*Puccinia recondita*)、コムギ黄さび病菌 (*Puccinia striiformis*) のようなブクシニア (*Puccinia*) 属；コムギ又はオオムギ雪腐小粒菌核病菌 (*Typhula incarnata*, *Typhula ishikariensis*) のようなティフラ (*Typhula*) 属などが挙げられる。

【0095】

不完全菌類として、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、カンキツ灰色かび病菌、キュウリ灰色かび病菌、トマト灰色かび病菌、イチゴ灰色かび病菌、ナス灰色かび病菌、インゲン灰色かび病菌、アズキ灰色かび病菌、エンドウ灰色かび病菌、ラッカセイ灰色かび病菌、トウガラシ灰色かび病菌、ピーマン灰色かび病菌、レタス灰色かび病菌、タマネギ灰色かび病菌、スターチス灰色かび病菌、カーネーション灰色かび病菌、バラ灰色かび病菌、パンジー灰色かび病菌又はヒマワリ灰色かび病菌のような各種灰色かび病菌 (*Botrytis cinerea*)、タマネギ灰色腐敗病菌 (*Botrytis allii*)、タマネギのボトリチス属菌による葉枯れ症を引き起こす病原菌 (*Botrytis squamosa*, *Botrytis byssoidea*, *Botrytis tulipae*) のようなボトリチス (*Botrytis*) 属；イネいもち病菌 (*Pyricularia oryzae*) のようなピリキュリア (*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*)、キャベツ又はハクサイ黒斑病菌 (*Alternaria brassicae*)、キャベツ黒すす病菌 (*Alternaria brassicola*)、タマネギ又はネギ黒斑病菌 (*Alternaria porri*) のようなアルタナリア (*Alternaria*) 属；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レラ (*Pseudocercospora*) 属；オオムギ雲形病菌 (*Rhynchosporium secalis*) のようなリンコスפורリウム (*Rhynchosporium*) 属；モモ黒星病菌 (*Cladosporium carpophilum*) のようなクラドスפורリウム (*Cladosporium*) 属；モモホモブシス腐敗病菌 (*Phomopsis* sp.) のような

30

40

50

ホモプシス (*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。

【 0 0 9 6 】

本発明組成物は、前述した各種有害菌類を防除できることから、各種病害を予防的又は治療的に防除することができる。特に本発明組成物は、農園芸分野で問題となる各種病害、例えばイネのいもち病、ごま葉枯病、紋枯病又は苗立枯病 ; ムギ類のうどんこ病、赤かび病、赤さび病、黄さび病、網斑病、斑葉病、雪腐病、裸黒穂病、眼紋病、雲形病、葉枯病又はふ枯病 ; カンキツの黒点病又はそうか病 ; リンゴのモニリア病、うどんこ病、黒点病、斑点落葉病又は黒星病 ; ナシの黒星病又は黒斑病 ; モモの灰星病、黒星病又はフォモプシス腐敗病 ; ブドウの黒とう病、晩腐病、褐斑病、枝膨病、うどんこ病又はべと病 ; カキの炭そ病、円星落葉病又は角斑病 ; ウリ類の炭そ病、うどんこ病、つる枯病、褐斑病又はべと病 ; トマトの輪紋病、灰色疫病、葉かび病又は疫病 ; パナナのブラックシガトカ病 ; テンサイの褐斑病 ; エンドウの褐紋病 ; アブラナ科野菜の黒斑病 ; ジャガイモの疫病又は夏疫病 ; イチゴのうどんこ病又は蛇の目病 ; 豆類、野菜類、果樹類、花卉類など種々の作物の灰色かび病又は菌核病 ; 等の各種病害の防除に有効であり、中でも、キュウリ、インゲン、アズキ、ダイズ、エンドウ、ラッカセイ、トマト、イチゴ、ナス、トウガラシ、ピーマン、レタス、タマネギ、ブドウ、カンキツ、スターチス、カーネーション、バラ、パンジー、ヒマワリなどの灰色かび病又は菌核病の防除に特に有効である。

【 0 0 9 7 】

また本発明組成物は、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等の植物病原菌によって引き起こされる土壤病害の予防的又は治療的防除にも有効である。

また、本発明組成物はベンズイミダゾール、ストロビルリン、ジカルボキシイミド、フェニルアמיד、エルゴステロール生合成阻害剤などの薬剤に対する各種抵抗性有害菌類の防除にも有効である。

更に本発明組成物は、優れた浸透移行性を有していることから、本発明組成物を含有する有害生物防除剤を土壤に施用することによって土壤中の有害菌類の防除と同時に、茎葉部の有害菌類をも防除することができる。

【 0 0 9 8 】

本発明組成物は、通常、式(1)の酸アミド誘導体又はその塩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、カオリナイト及びセリサイトの混合物、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、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、アルキルアリアル硫酸塩、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、アルキルアリアルスルホン酸塩、アリアルスルホン酸塩、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、アルキルアリアルリン酸塩、スチリルアリアルリン酸塩、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アルエーテル硫酸塩、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アルリン酸エステ

ル塩、ナフタレンスルホン酸ホルマリン縮合物の塩のような陰イオン系の界面活性剤や展着剤；ソルビタン脂肪酸エステル、グリセリン脂肪酸エステル、脂肪酸ポリグリセライド、脂肪酸アルコールポリグリコールエーテル、アセチレングリコール、アセチレンアルコール、オキシアルキレンブロックポリマー、ポリオキシエチレンアルキルエーテル、ポリオキシエチレンアルキルアリアルエーテル、ポリオキシエチレンスチリルアリアルエーテル、ポリオキシエチレングリコールアルキルエーテル、ポリエチレングリコール、ポリオキシエチレン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレングリセリン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレン硬化ヒマシ油、ポリオキシプロピレン脂肪酸エステルのような非イオン系の界面活性剤や展着剤；オリブ油、カポック油、ひまし油、シュロ油、椿油、ヤシ油、ごま油、トウモロコシ油、米ぬか油、落花生油、綿実油、大豆油、菜種油、亜麻仁油、きり油、液状パラフィンなどの植物油や鉱物油などが挙げられる。これら補助剤の各成分は、本発明の目的から逸脱しないかぎり、1種又は2種以上を適宜選択して使用することができる。また、前記した補助剤以外にも当該分野で知られたものの中から適宜選んで使用することもでき、例えば、増量剤、増粘剤、沈降防止剤、凍結防止剤、分散安定剤、薬害軽減剤、防黴剤など通常使用される各種補助剤も使用することができる。式(1)の酸アミド誘導体又はその塩と各種補助剤との配合割合は0.001：99.999～95：5、望ましくは0.005：99.995～90：10である。これら製剤の実際の使用に際しては、そのまま使用するか、または水等の希釈剤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。

10

20

【0099】

本発明組成物の施用は、気象条件、製剤形態、対象作物、施用時期、施用場所、有害菌類の種類や発生状況、病害の種類や発生状況などの相違により一概に規定できないが、一般に、茎葉処理の場合0.1～10,000ppm、望ましくは1～2,000ppmの有効成分濃度で施用ことができ、その施用適量は1ヘクタールあたり式(1)の酸アミド誘導体又はその塩が、0.1～50,000g、望ましくは1～30,000g程度とすることができる。土壌処理の場合には、一般に1ヘクタールあたり式(1)の酸アミド誘導体又はその塩を10～100,000g、望ましくは、200～20,000g施用することができる。

【0100】

本発明組成物の種々の製剤、又はその希釈物の施用は、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、水面施用等）、土壌施用（混入、灌注等）、表面施用（塗布、粉衣、被覆等）等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）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100%含有することが可能である。

30

【0101】

本発明組成物は、他の農薬、肥料、薬害軽減剤などと混用或は併用することができ、この場合に一層優れた効果、作用性を示すことがある。他の農薬としては、除草剤、殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺土壌害虫剤、殺菌剤、抗ウイルス剤、誘引剤、抗生物質、植物ホルモン、植物成長調整剤などが挙げられる。特に、式(1)の酸アミド誘導体又はその塩と、他の殺菌性有効成分化合物の1種又は2種以上とを混用或は併用した混合殺菌性組成物は、適用範囲、薬剤処理の時期、防除活性等を好ましい方向へ改良することができる。尚、式(1)の酸アミド誘導体又はその塩と他の殺菌剤の有効成分化合物は、各々別々に製剤したものを散布時に混合して使用しても、両者を一緒に製剤して使用してもよい。本発明には、このような混合殺菌性組成物も含まれる。

40

【0102】

式(1)の酸アミド誘導体又はその塩と他の殺菌性有効成分化合物との混合比は、気象条件、製剤形態、対象作物、施用時期、施用場所、有害菌類の種類や発生状況、病害の種類や発生状況などの相違により一概に規定できないが、一般に1：300～300：1、望ましくは1：100～100：1とすることができる。また、施用適量は1ヘクタール当りの総有効成分化合物量として0.1～70,000g、望ましくは1～30,000gとすることができる。本発明には、

50

このような混合殺菌性組成物の施用による有害菌類の防除方法も含まれる。

【 0 1 0 3 】

上記他の農薬中の、殺菌性有効成分化合物（一般名；一部申請中を含む、又は日本植物防疫協会供試試験コード）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；

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）、ベンコナゾール（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（Epoxyconazole）、テトラコナゾール（Tetraconazole）、オキシポコナゾールフマル酸塩（Oxpoconazole fumarate）、シプロコナゾール（Sipconazole）、プロチオコナゾール（Prothioconazole）、トリアジメノール（Triadimenol）、フルトリアフオール（Flutriafol）、ジフェノコナゾール（Difenoconazole）、フルキンコナゾール（Fluquinconazole）、フェンブコナゾール（Fenbuconazole）、ブロムコナゾール（Bromuconazole）、ジニコナゾール（Diniconazole）、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
10
20
プロコナゾール（Ipconazole）、イミベンコナゾール（Imibenconazole）のようなアゾール系化合物；

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）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；

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）、シアゾファミド（Cyazofamid）のようなイミダゾール系化合物；
30

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）、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）、フララキシル（Furalaxyl）、シプロフラム（Cyprofuram）のようなフェニルアミド系化合物；

ジクロフルアニド（Dichlofluanid）のようなスルフェン酸系化合物；

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）、トルコホスメチル（Tolcofos Methyl）、S - ベンジル O , O - ジ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ヒドロゲンホスホネートのような有機リン系化合物；
40

キャプタン（Captan）、キャプタホル（Captafol）、フォルベット（Folpet）のようなN - ハロゲノチオアルキル系化合物；

プロシミドン（Procymidone）、イプロジオン（Iprodione）、ビクロゾリン（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）、ゾキサミド（Zoxamid）、チアジニル（Tiadinil）のようなベンズアニリド系化合物；

ボスカリド（Boscalid）のようなアニリド系化合物；

トリホリン（Triforine）のようなピペラジン系化合物；
50

ピリフェノックス (Pyrifenox) のようなピリジン系化合物 ;
 フェナリモル (Fenarimol)、フルトリアフォル (Flutriafol) のようなカルピノール系化合物 ;
 フェンプロピジン (Fenpropidine) 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) のようなモルフォリン系化合物 ;
 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 ; 10
 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)、メトミノフェン (Metominofen)、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)、フルアクリピリム (Fluacrypyrin) のようなストロビルリン系化合物 ; 20
 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 ;
 シルチオファム (Siltiopham) のようなシリルアミド系化合物 ;
 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) のようなアミノアシッドアミドカーバメート系化合物 ;
 フェナミドン (Fenamidone) のようなイミダゾリジン系化合物 ;
 フェンヘキサミド (Fenhexamid) のようなハイ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 ;
 フェノキサニル (Fenoxanil) のようなフェノキシアミド系化合物 ; 30
 ポリオキシシン (Polyoxins) のような抗生物質 ;
 イミノクタジン (Iminoctadine) のようなグアニジン系化合物 ;
 また、その他の化合物として、イソプロチオラン (Isoprothiolane)、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)、スピロキサミン (Spiroxamine) 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)、ニコピフェン (Nicobifen)、メトラフェノン (Metrafenone)、MTF-753 (ペンチオピラド、Pentiopyrad)、UBF-307、ジクロシメット (Diclocymet)、プロキンアジド (Proquinazid)、NC-224 (Amibromdole、Amisulbrom)、KIF-7767 (KUF-1204、Pyribencarb methyl、Mepyracarb)、Syngenta 446510 (Mandipropamid、Dipromandamid) などが挙げられる。 40

【 0 1 0 4 】

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の有効成分化合物 (一般名 ; 一部申請中を含む) としては、例えばプロフェノホス (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)、クロルピリホスメチル (Chlorpyrifos-methyl)、アセフェート (Acephate)、プロチオホス (Prothiofos)、ホスチアゼート (Fosthi azate)、ホスホカルブ (Phosphocarb)、カズサホス (Cadusafos)、ジスルホトン (Disulfoton)、クロルピリホス (Chlorpyrifos)、デメトン-S-メチル (Demeton-S-methyl)、ジメトエート (Dimethoate)、メタミドホス (Methamidophos) のような有機リン酸 50

エステル系化合物；

カルバリル (Carbaryl)、プロポキスル (Propoxur)、アルジカルブ (Aldicarb)、カルボフラン (Carbofuran)、チオジカルブ (Thiodicarb)、メソミル (Methomyl)、オキサミル (Oxamyl)、エチオフェンカルブ (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) 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) のようなネライストキシシン誘導体；

ジコホル (Dicofol)、テトラジホン (Tetradifon) のような有機塩素系化合物；

酸化フェンブタスズ (Fenbutatin Oxide) 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)、フェンプロパトリン (Fenpropathrin)、ピフェントリン (Bifenthrin) 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)、ルフェヌロン (Lufenuron)、ノバルロン (Novaluron) のようなベンゾイルウレア系化合物；

メトプレネ (Methoprene)、ピリプロキシフェン (Pyriproxyfen)、フェノキシカルブ (Fenoxycarb) 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)、エチプロール (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)、ジノテフラン (Dinotefuran) などのネオニコチノイド；

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) などのヒドラジン系化合物；

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、フロニカミド (Flonicamid)、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)、トリアザメイト (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)、フルフェンリム (Flufenerim)、ピリダリル (Pyridalyl)、スピロジクロフェン (Spirodiclofen)、ピフェナゼート (Bifenazate)、スピロメシフェン (Spiromesifen)、スピロテトラマト (spirotetramat)、プロパルギット (Propargite)、クロフェンテジン (Clofentezine)、フルアクリピリム (Flucrypyrim)、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) のような化合物；などが挙げられる。更に、B T 剤、昆虫病原ウイルス剤、昆虫病原糸状菌剤、線虫病原糸状菌剤などのような微生物農薬、アベルメクチン (Avermectin)、エマメクチンベンゾエート (Emamectin-Benzoate)、ミルベメクチン (Milbemectin)、スピノサッド (Spinosad)、イベルメクチン (Ivermectin)、レピメクチン (Lepimectin) のような抗生物質、アザディラクチン (Azadirachtin) のような天然物などが挙げられる。

【 0 1 0 5 】

10

20

30

40

50

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

(1) 前記式(1)で表される酸アミド誘導体又はその塩。

(2) 前記式(1)中、AがXで置換されてもよいフェニル、Xで置換されてもよいナフチル、Xで置換されてもよい複素環又はXで置換されてもよい縮合複素環であり；BがYで置換されてもよい複素環(但し、ピリジルは除く)、Yで置換されてもよい縮合複素環又はYで置換されてもよいナフチルであり；Xがハロゲン、アルキル(アルキルは、ハロゲン、ヒドロキシ、アルコキシ、ハロアルコキシ、アルキルチオ、アルキルスルホニル、シクロアルキル、アミノ、モノアルキルアミノ、ジアルキルアミノ、シアノ、アルコキシカルボニル又はアルキルカルボニルオキシで置換されてもよい)、アルケニル、ハロアルケニル、アルキニル(アルキニルは、ハロゲン、ヒドロキシ、アルコキシ、アミノ、ヒドロキシカルボニル、アルコキシカルボニル又はトリアルキルシリルで置換されてもよい)、ヒドロキシ、シアノオキシ、アルコキシ(アルコキシは、ハロゲン、アルコキシ、ハロアルコキシ、アルキルチオ、シクロアルキル、モノアルキルアミノ、ジアルキルアミノ、シアノ又は複素環で置換されてもよい)、アルケニルオキシ、ハロアルケニルオキシ、アルキニルオキシ、ハロアルキニルオキシ、アルキルチオ(アルキルチオは、ハロゲン、シクロアルキル又はシアノで置換されてもよい)、アルケニルチオ、ハロアルケニルチオ、アルキニルチオ、ハロアルキニルチオ、アルキルスルフィニル、ハロアルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、ハロアルキルスルホニル、ハロゲンで置換されてもよいシクロアルキル、ハロゲンで置換されてもよいシクロアルキルオキシ、ハロゲンで置換されてもよいシクロアルキルチオ、シアノ、ニトロ、ホルミル、フェニル(フェニルは、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル又はアルコキシで置換されてもよい)、アルキルで置換されてもよいフェノキシ、アルキルで置換されてもよいフェニルチオ、アルキルで置換されてもよいフェニルアルキル、アルキルで置換されてもよいフェニルアルケニル、アルキルで置換されてもよいフェニルアルキニル、アルキルで置換されてもよいフェニルアルケニルオキシ、アルキルで置換されてもよいフェニルアルキニルオキシ、アルキルで置換されてもよいフェニルアミノ、 $-OR^4$ 、 $-SR^5$ 、 $-NR^6R^7$ 、 $-CO_2R^8$ 、 $-C(=O)NR^8R^9$ 、 $-SO_2NR^8R^9$ 、 $-CH=NR^{10}$ 又は複素環(複素環は、ハロゲン、アルキル又はアルキルカルボニルで置換されてもよい)であり；Yがハロゲン、アルキル(アルキルは、ハロゲン、アルコキシ、ハロアルコキシ、アミノ、モノアルキルアミノ又はジアルキルアミノで置換されてもよい)、アルケニル、アルキニル、ヒドロキシ、アルコキシ、ハロアルコキシ、アルキルチオ、ハロアルキルチオ、アルキルスルフィニル、ハロアルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、ハロアルキルスルホニル、シクロアルキル、シアノ、ニトロ、ホルミル、 $-OR^4$ 、 $-NR^6R^7$ 、 $-CO_2R^8$ 、 $-C(=O)NR^8R^9$ 、 $-SO_2NR^8R^9$ 、 $-CH=NR^{10}$ であり； R^1 及び R^2 が各々独立に水素原子、アルキル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、アルケニル、アルキニル又はシクロアルキルであり、また R^1 と R^2 は一緒になって3~6員飽和炭素環を形成してもよく； R^3 が水素原子、アルキル(アルキルは、ハロゲン、アルコキシ、ハロアルコキシ、アルキルチオ、アミノ、モノアルキルアミノ、ジアルキルアミノ又はシアノで置換されてもよい)、アルケニル、アルキニル、ヒドロキシ、アルコキシ、ハロアルコキシ、シクロアルキル、シクロアルキルオキシ、シアノ、ホルミル、 $-C(=W^3)R^{11}$ 、 $-C(=W^3)OR^{12}$ 又は $-S(O)mR^{12}$ である酸アミド誘導体又はその塩。

【0106】

(3) AがXで置換されてもよいフェニル、Xで置換されてもよいナフチル、Xで置換されてもよい複素環又はXで置換されてもよい縮合複素環であり；BがYで置換されてもよい5員複素環、ピラジニル又はYで置換されてもよい縮合複素環であり；Xがハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、ジアルキルアミノアルキル、アルキニル、トリアルキルシリルアルキニル、ヒドロキシ、アルコキシ、ハロアルコキシ、アルコキシアルコキシ、シクロアルキル、ニトロ、フェニル、フェニルアルキニル、ハロアルキルで置換されてもよいピリジルオキシ、アルキルカルボニルオキシ、アルキルスルホニルオ

10

20

30

40

50

キシ又は複素環（複素環は、ハロゲン、アルキル又はアルキルカルボニルで置換されてもよい）であり；Yがハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、シクロアルキル又はホルミルであり；R¹及びR²が各々独立に水素原子又はアルキルであり；R³が水素原子、アルキル、アルキルカルボニル又はアルコキシカルボニルであり；W¹及びW²が各々独立に酸素原子又は硫黄原子である酸アミド誘導体又はその塩。

(4) W¹及びW²が共に酸素原子である前記(3)の酸アミド誘導体又はその塩。

(5) BがYで置換されてもよい縮合複素環である前記(3)の酸アミド誘導体又はその塩。

【0107】

(6) 縮合複素環がベンゾフラニル、ジヒドロベンゾフラニル、ベンゾジオキサニル又はキノリルである前記(5)の酸アミド誘導体又はその塩。

10

(7) BがYで置換されてもよい5員複素環であり；Xがハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルキニル、ヒドロキシ、アルコキシ、ハロアルコキシ、アルコキシアルコキシ、シクロアルキル、ニトロ、フェニルアルキル、ハロアルキルで置換されてもよいピリジルオキシ、アルキルカルボニルオキシ又は複素環（複素環は、ハロゲン、アルキル又はアルキルカルボニルで置換されてもよい）であり；Yがハロゲン、アルキル、ハロアルキル又はアルコキシであり；R³が水素原子、アルキルカルボニル又はアルコキシカルボニルであり；W¹及びW²が共に酸素原子である前記(3)の酸アミド誘導体又はその塩。

(8) BがYで置換されてもよいフリル、Yで置換されてもよいチエニル、Yで置換されてもよいピロリル、Yで置換されてもよいオキサゾリル、Yで置換されてもよいイソキサゾリル、Yで置換されてもよいチアゾリル、Yで置換されてもよいイソチアゾリル、Yで置換されてもよいピラゾリル又はYで置換されてもよいチアジアゾリルである前記(3)又は(7)の酸アミド誘導体又はその塩。

20

(9) BがYで置換されてもよいフリル、Yで置換されてもよいチエニル、Yで置換されてもよいピロリル、Yで置換されてもよいオキサゾリル、Yで置換されてもよいチアゾリル、Yで置換されてもよいイソチアゾリル、Yで置換されてもよいピラゾリル又はYで置換されてもよいチアジアゾリルである前記(8)の酸アミド誘導体又はその塩。

(10) BがYで置換されたフリルである前記(9)の酸アミド誘導体又はその塩。

(11) BがYで置換されたチエニルである前記(9)の酸アミド誘導体又はその塩。

(12) BがYで置換されたピラゾリルである前記(9)の酸アミド誘導体又はその塩。

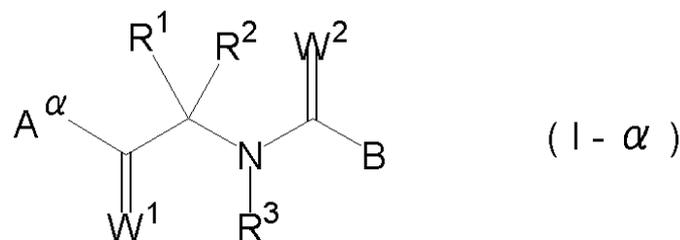
30

【0108】

(13) 前記式(1-):

【0109】

【化26】



40

【0110】

[AはXで置換されてもよいフェニル、Xで置換されたナフチル、Xで置換されたチエニル、Xで置換されてもよいベンゾジオキサニル又はXで置換されてもよいベンゾジオキサニルであり；BはYで置換されてもよい複素環（但し、ピリジルは除く）、Yで置換されてもよい縮合複素環又はYで置換されてもよいナフチルであり；Xは弗素原子、塩素原子、沃素原子、アルキル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、ジアルキルアミノアルキル、アルキニル、トリアルキルシリルアルキニル、ヒドロキシ、アルコキシ、ハロアルコキシ、アルコキシアルコキシ、シクロアルキル、ニトロ、フェニル、フェニルアルキニル、ハロアルキルで置換されてもよいピリジルオキシ、アルキルカルボニル

50

オキシ、アルキルスルホニルオキシ又は複素環（複素環は、ハロゲン、アルキル又はアルキルカルボニルで置換されてもよい）であり；Yはハロゲン、E¹で置換されてもよいアルキル、E¹で置換されてもよいアルケニル、E¹で置換されてもよいアルキニル、ヒドロキシ、シアノオキシ、E¹で置換されてもよいアルコキシ、E¹で置換されてもよいアルケニルオキシ、E¹で置換されてもよいアルキニルオキシ、メルカプト、シアノチオ、E¹で置換されてもよいアルキルチオ、E¹で置換されてもよいアルケニルチオ、E¹で置換されてもよいアルキニルチオ、E²で置換されてもよいアルキルスルフィニル、E²で置換されてもよいアルキルスルホニル、Jで置換されてもよいシクロアルキル、Jで置換されてもよいシクロアルキルオキシ、Jで置換されてもよいシクロアルキルチオ、シアノ、ニトロ、ホルミル、-OR⁴、-SR⁵、-NR⁶R⁷、-CO₂R⁸、-C(=O)NR⁸R⁹、-SO₂NR⁸R⁹、-CH=NR¹⁰又は複素環（複素環は、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ又はアルキルカルボニルで置換されてもよい）であり；R¹及びR²は各々独立に水素原子、アルキル、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、ハロアルコキシアルキル、シアノアルキル、アルコキシカルボニルアルキル、アルケニル、ハロアルケニル、アルコキシアルケニル、アルキニル、ハロアルキニル、アルコキシアルキニル、シクロアルキル、ハロシクロアルキル、(アルキル)シクロアルキル、(ハロアルキル)シクロアルキル、シアノ又は-CO₂R⁸であり、またR¹とR²は一緒になって3～6員飽和炭素環を形成してもよく；R³は水素原子、E¹で置換されてもよいアルキル、E¹で置換されてもよいアルケニル、E¹で置換されてもよいアルキニル、ヒドロキシ、シアノオキシ、E¹で置換されてもよいアルコキシ、Jで置換されてもよいシクロアルキル、Jで置換されてもよいシクロアルキルオキシ、Jで置換されてもよいシクロアルキルチオ、シアノ、ホルミル、-C(=W³)R¹¹、-C(=W³)OR¹²、-C(=W³)SR¹²、-C(=W³)NR¹²R¹³、-S(O)mR¹²又は-S(O)nNR¹²R¹³であり；R⁴は-C(=W³)R¹²、-C(=W³)OR¹²、-C(=W³)SR¹²、-C(=W³)NR¹²R¹³、-S(O)mR¹²、-S(O)nNR¹²R¹³又は複素環（複素環は、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ又はアルキルカルボニルで置換されてもよい）であり；R⁵は-C(=W³)R¹²、-C(=W³)OR¹²、-C(=W³)SR¹²、-C(=W³)NR¹²R¹³又は複素環（複素環は、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ又はアルキルカルボニルで置換されてもよい）であり；R⁶は水素原子、アルキル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、ハロアルコキシアルキル、シアノアルキル、(シクロアルキル)アルキル、シクロアルキル、シアノ、-C(=W³)R¹²、-C(=W³)OR¹²、-C(=W³)SR¹²、-C(=W³)NR¹²R¹³、-S(O)mR¹²、-S(O)nNR¹²R¹³又は複素環（複素環は、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ又はアルキルカルボニルで置換されてもよい）であり；R⁷は水素原子、アルキル、ハロアルキル、アルコキシアルキル又はハロアルコキシアルキルであり；R⁸及びR⁹は各々独立に水素原子、アルキル、ハロアルキル、アルコキシアルキル又はハロアルコキシアルキルであり、隣接するR⁸とR⁹は一緒になって環を形成してもよく；R¹⁰はアルキル（アルキルは、ハロゲン、アルコキシ又はハロアルコキシで置換されてもよい）、アルコキシ（アルコキシは、ハロゲン、アルコキシ又はハロアルコキシで置換されてもよい）、アルケニルオキシ（アルケニルオキシは、ハロゲン、アルコキシ又はハロアルコキシで置換されてもよい）、アルキニルオキシ（アルキニルオキシは、ハロゲン、アルコキシ又はハロアルコキシで置換されてもよい）又はアルコキシカルボニル（アルコキシカルボニルは、ハロゲン、アルコキシ又はハロアルコキシで置換されてもよい）であり；R¹¹は水素原子、E³で置換されてもよいアルキル、フェニル（フェニルは、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ又はアルキルカルボニルで置換されてもよい）又は複素環（複素環は、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ又はアルキルカルボニルで置換されてもよい）であり；R¹²及びR¹³は各々独立にE³で置換されてもよいアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、Jで置換されてもよいシクロアルキル又はフェニル（フェニルは、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ又はアルキルカルボニルで置換されてもよい）であり、隣接するR¹²とR¹³は一緒になって環を形成

10

20

30

40

50

してもよく； W^1 、 W^2 及び W^3 は各々独立に酸素原子又は硫黄原子であり； m 及び n は各々独立に0～2の整数であり； E^1 はハロゲン、ヒドロキシ、アルコキシ、ハロアルコキシ、メルカプト、アルキルチオ、ハロアルキルチオ、アルキルスルホニル、シクロアルキル、アミノ、モノアルキルアミノ、ジアルキルアミノ、シアノ、ニトロ、ヒドロキシカルボニル、アルコキシカルボニル、アルキルカルボニルオキシ、トリアルキルシリル又は複素環（複素環は、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ又はアルキルカルボニルで置換されてもよい）であり； E^2 はハロゲン、ヒドロキシ、アルコキシ、ハロアルコキシ、シクロアルキル、アミノ、モノアルキルアミノ、ジアルキルアミノ、シアノ、ニトロ、ヒドロキシカルボニル、アルコキシカルボニル、トリアルキルシリル又は複素環（複素環は、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ又はアルキルカルボニルで置換されてもよい）であり； E^3 はハロゲン、アルコキシ、アルキルチオ、アミノ、モノアルキルアミノ、ジアルキルアミノ、シクロアルキル、シアノ、アルコキシカルボニル、ハロアルコキシ、ハロアルキルチオ又はフェニル（フェニルは、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ又はアルキルカルボニルで置換されてもよい）であり； J はハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ又はハロアルコキシである J で表される酸アミド誘導体又はその塩。

(14) 前記式(I-)中、 B が Y で置換されてもよい5員複素環、ピラジニル又は Y で置換されてもよい縮合複素環であり； X が弗素原子、塩素原子、沃素原子、アルキル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、ジアルキルアミノアルキル、アルキニル、トリアルキルシリルアルキニル、ヒドロキシ、アルコキシ、ハロアルコキシ、アルコキシアルコキシ、シクロアルキル、ニトロ、フェニル、フェニルアルキニル、ハロアルキルで置換されてもよいピリジルオキシ、アルキルカルボニルオキシ、アルキルスルホニルオキシ又は複素環（複素環は、ハロゲン、アルキル又はアルキルカルボニルで置換されてもよい）であり； Y がハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、シクロアルキル又はホルミルであり； R^1 及び R^2 が各々独立に水素原子又はアルキルであり； R^3 が水素原子、アルキル、アルキルカルボニル又はアルコキシカルボニルであり； W^1 及び W^2 が各々独立に酸素原子又は硫黄原子である酸アミド誘導体又はその塩。

(15) W^1 及び W^2 が共に酸素原子である前記(14)の酸アミド誘導体又はその塩。

(16) B が Y で置換されてもよい縮合複素環である前記(14)の酸アミド誘導体又はその塩。

(17) 縮合複素環がベンゾフラニル、ジヒドロベンゾフラニル、ベンゾジオキサニル又はキノリルである前記(16)の酸アミド誘導体又はその塩。

【0111】

(18) B が Y で置換されてもよい5員複素環であり； X が弗素原子、塩素原子、沃素原子、アルキル、ハロアルキル、アルキニル、ヒドロキシ、アルコキシ、ハロアルコキシ、アルコキシアルコキシ、シクロアルキル、ニトロ、フェニルアルキニル、ハロアルキルで置換されてもよいピリジルオキシ、アルキルカルボニルオキシ又は複素環（複素環は、ハロゲン、アルキル又はアルキルカルボニルで置換されてもよい）であり； Y がハロゲン、アルキル、ハロアルキル又はアルコキシであり； R^3 が水素原子、アルキルカルボニル又はアルコキシカルボニルであり； W^1 及び W^2 が共に酸素原子である前記(14)の酸アミド誘導体又はその塩。

(19) B が Y で置換されてもよいフリル、 Y で置換されてもよいチエニル、 Y で置換されてもよいピロリル、 Y で置換されてもよいオキサゾリル、 Y で置換されてもよいイソキサゾリル、 Y で置換されてもよいチアゾリル、 Y で置換されてもよいイソチアゾリル、 Y で置換されてもよいイミダゾリル、 Y で置換されてもよいピラゾリル又は Y で置換されてもよいチアジアゾリルである前記(14)又は(18)の酸アミド誘導体又はその塩。

(20) B が Y で置換されてもよいフリル、 Y で置換されてもよいチエニル、 Y で置換されてもよいピロリル、 Y で置換されてもよいオキサゾリル、 Y で置換されてもよいイソキサゾリル、 Y で置換されてもよいチアゾリル、 Y で置換されてもよいイソチアゾリル、 Y で置換されてもよいピラゾリル又は Y で置換されてもよいチアジアゾリルである(19)

10

20

30

40

50

の酸アミド誘導体又はその塩。

(21) BがYで置換されたフリルである前記(20)の酸アミド誘導体又はその塩。

(22) BがYで置換されたチエニルである前記(20)の酸アミド誘導体又はその塩。

(23) BがYで置換されたピラゾリルである前記(20)の酸アミド誘導体又はその塩

。

【0112】

(24) AがXで置換されてもよいフェニル、Xで置換されてもよいナフチル、Xで置換されてもよいベンゾジオキサニル又はXで置換されてもよいベンゾジオキサニルであり；BがYで置換されてもよいフリル、Yで置換されてもよいチエニル又はYで置換されてもよいピラゾリルであり；Xがハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ又はハロアルコキシであり；Yはハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ又はハロアルコキシであり；R³が水素原子であり；W¹及びW²が共に酸素原子である前記(3)又は(14)の酸アミド誘導体又はその塩。

10

(25) BがYで置換されたフリル、Yで置換されたチエニル又はYで置換されたピラゾリルである前記(24)の酸アミド誘導体又はその塩。

(26) BがYで置換されたフリル、Yで置換されたチエニル又はYで置換されたピラゾリルであり、Yがハロゲン、アルキル又はハロアルキルである前記(24)の酸アミド誘導体又はその塩。

(27) AがXで置換されたフェニル又はXで置換されたベンゾジオキサニルであり、BがYで置換されたフリル、Yで置換されたチエニル又はYで置換されたピラゾリルである前記(24)の酸アミド誘導体又はその塩。

20

(28) AがXで置換されたフェニル又はXで置換されたベンゾジオキサニルであり、BがYで置換されたフリル、Yで置換されたチエニル又はYで置換されたピラゾリルであり、Xがハロゲン、アルキル又はアルコキシであり、Yがハロゲン、アルキル又はハロアルキルである前記(24)の酸アミド誘導体又はその塩。

(29) AがXで置換されたフェニル又はXで置換されたベンゾジオキサニルであり、BがYで置換されたフリル、Yで置換されたチエニル又はYで置換されたピラゾリルであり、R₁及びR₂が各々アルキルであり、Xがハロゲン、アルキル又はアルコキシであり、Yがハロゲン、アルキル又はハロアルキルである前記(24)の酸アミド誘導体又はその塩。

30

(30) BがYで置換されたフリルである前記(24)～(29)の酸アミド誘導体又はその塩。

(31) BがYで置換されたチエニルである前記(24)～(29)の酸アミド誘導体又はその塩。

(32) BがYで置換されたピラゾリルである前記(24)～(29)の酸アミド誘導体又はその塩。

【0113】

(33) 前記(1)～(32)の酸アミド誘導体又はその塩を有効成分として含有する殺菌性組成物。

(34) 前記(1)～(32)の酸アミド誘導体又はその塩と、他の殺菌性有効成分化合物とを有効成分として含有する混合殺菌性組成物。

40

(35) 他の殺菌性有効成分化合物が、アニリノピリミジン系化合物、ピリジナミン系化合物、アゾール系化合物、キノキサリン系化合物、ジチオカーバメート系化合物、有機塩素系化合物、イミダゾール系化合物、シアノアセトアミド系化合物、フェニルアミド系化合物、スルフェン酸系化合物、銅系化合物、イソキサゾール系化合物、有機リン系化合物、N-ハロゲノチオアルキル系化合物、ジカルボキシイミド系化合物、ベンズアニリド系化合物、アニリド系化合物、ピペラジン系化合物、ピリジン系化合物、カルピノール系化合物、ペペリジン系化合物、モルフォリン系化合物、有機スズ系化合物、尿素系化合物、シンナミック酸系化合物、フェニルカーバメート系化合物、シアノピロール系化合物、ストロビルリン系化合物、オキサゾリジノン系化合物、チアゾールカルボキサミド系化合物

50

、シリルアミド系化合物、アミノアシッドアミドカーバメート系化合物、イミダゾリジン系化合物、ハイドロキシアニリド系化合物、ベンゼンスルホンアミド系化合物、オキシムエーテル系化合物、フェノキシアミド系化合物、抗生物質、グアニジン系化合物、イソプロチオラン、ピロキロン、ジクロメジン、キノキシフェン、プロパモカルブ塩酸塩、スピロキサミン、クロルピクリン、ダゾメット、メタムナトリウム塩、ニコピフェン、メトラフェノン、MTF-753、UBF-307、ジクロシメット、プロキンアジド、NC-224、KIF-7767及びSyngenta 446510からなる群から選択される少なくとも1種であることを特徴とする前記(34)の混合殺菌性組成物。

(36)他の殺菌性有効成分化合物が、ピリジナミン系化合物、アゾール系化合物、ジチオカーバメート系化合物、有機塩素系化合物、イミダゾール系化合物、銅系化合物、ジカルボキシイミド系化合物、アニリド系化合物、ピペラジン系化合物、ピリジン系化合物、カルビノール系化合物、フェニルカーバメート系化合物、シアノピロール系化合物、ストロピルリン系化合物、ハイドロキシアニリド系化合物、MTF-753及びKIF-7767からなる群から選択される少なくとも1種であることを特徴とする前記(35)の混合殺菌性組成物。

【0114】

(37)他の殺菌性有効成分化合物が、フルアジナム、トリアジメホン、ピテルタノール、トリフルミゾール、エタコナゾール、プロピコナゾール、ペンコナゾール、フルシラゾール、マイクロブタニル、シブコナゾール、テブコナゾール、ヘキサコナゾール、ファーコナゾールシス、プロクロラズ、メトコナゾール、エポキシコナゾール、テトラコナゾール、オキスポコナゾールフマル酸塩、シブコナゾール、プロチオコナゾール、トリアジメノール、フルトリアフオール、ジフェノコナゾール、フルキンコナゾール、フェンコナゾール、プロムコナゾール、ジニコナゾール、トリシクラゾール、プロベナゾール、シメコナゾール、ペフラゾエート、イブコナゾール、イミベンコナゾール、マンネブ、ジネブ、マンゼブ、ポリカーバメート、メチラム、プロピネブ、フサライド、クロロタロニル、キントゼン、ベノミル、チオファネートメチル、カーベンダジム、シアゾファミド、水酸化第二銅、有機銅、プロシミドン、イブロジオン、ピンクロゾリン、ボスカリド、ジエトフェンカルブ、フルジオキサニル、フェンピクロニル、アゾキシストロピン、クレソキシムメチル、メトミノフェン、トリフロキシストロピン、ピコキシストロピン、オリザストロピン、ジモキシストロピン、ピラクロストロピン、フルオキサストロピン、フルアクリピリム、フェンヘキサミド、ポリオキシシン、イミノクタジン、MTF-753及びKIF-7767からなる群から選択される少なくとも1種であることを特徴とする前記(36)の混合殺菌性組成物。

(38)前記(1)～(32)の酸アミド誘導体又はその塩の有効量を施用して、有害菌類を防除する方法。

(39)前記(1)～(32)の酸アミド誘導体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。

(40)前記(1)～(32)の酸アミド誘導体又はその塩の有効量を施用して、作物を保護する方法。

(41)前記(1)～(32)の酸アミド誘導体又はその塩の有効量を施用して、作物の収穫量を向上させる方法。

【実施例】

【0115】

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(1)又は(1-)の酸アミド誘導体又はその塩の合成例を記載する。

合成例1

N-[(3', 4'-ジクロロ-1, 1-ジメチル)フェナシル] - 2 - メチル - 3 - フランカルボキサミド(後記化合物No.1-57)の合成

(1)亜鉛3.12gに、3,4-ジクロロベンゾイルクロライド10.0g、2-プロモイソ酪酸エチル9.31g及び無水エーテル90mlの混合物を、窒素雰囲気下で滴下した後、還流下で15時間反応

10

20

30

40

50

させた。反応混合物をセライト濾過し、濾液を20%硫酸、次いで水で洗浄した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した後減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（展開溶媒：酢酸エチル/n-ヘキサン=1/19）で精製して、油状の2-(3',4'-ジクロロベンゾイル)イソ酪酸エチル8.7gを得た。このもののNMRスペクトルデータは以下の通りである。

¹H-NMR ppm (Solvent : CDCl₃ / 400MHz)

1.11(t, 3H), 1.52(s, 6H), 4.14(q, 2H), 7.48(d, 1H), 7.63(dd, 1H), 7.96(d, 1H)

【0116】

(2) 2-(3',4'-ジクロロベンゾイル)イソ酪酸エチル8.7g、硫酸14.2ml、水14.2ml及び酢酸40mlの混合物を、還流下で15時間反応させた。反応混合物を氷水中に投入し、酢酸エチルで抽出した後水洗した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した後減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（展開溶媒：酢酸エチル/n-ヘキサン=1/19）で精製して、油状の3,4-ジクロロイソブチロフェノン6.47gを得た。このもののNMRスペクトルデータは以下の通りである。

¹H-NMR ppm (Solvent : CDCl₃ / 400MHz)

1.21(d, 6H), 3.46(m, 1H), 7.55(d, 1H), 7.79(dd, 1H), 8.02(d, 1H)

【0117】

(3) 3,4-ジクロロイソブチロフェノン6.47g及びテトラヒドロフラン100mlの混合物に、フェニルトリメチルアンモニウムトリプロミド9.32gを加え、室温で4時間反応させた。反応混合物を濾過し、濾液を減圧濃縮して、油状の-ブromo-3,4-ジクロロイソブチロフェノン6.39gを得た。このもののNMRスペクトルデータは以下の通りである。

¹H-NMR ppm (Solvent : CDCl₃ / 300MHz)

2.01(s, 6H), 7.50(d, 1H), 8.0(dd, 1H), 8.20(d, 1H)

【0118】

(4) -ブromo-3,4-ジクロロイソブチロフェノン6.39g及びジメチルスルホキシド60mlの混合物に、アジ化ナトリウム2.8gを加え、50℃で1時間反応させた。反応混合物を水中に投入し、酢酸エチルで抽出した後水洗した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した後減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（展開溶媒：酢酸エチル/n-ヘキサン=1/9）で精製して、油状の-アジド-3,4-ジクロロイソブチロフェノン6.34gを得た。このもののNMRスペクトルデータは以下の通りである。

¹H-NMR ppm (Solvent : CDCl₃ / 300MHz)

1.60(s, 6H), 7.53(d, 1H), 7.97(dd, 1H), 8.20(d, 1H)

【0119】

(5) -アジド-3,4-ジクロロイソブチロフェノン6.34g、テトラヒドロフラン90ml及び水3.2mlの混合物に、トリフェニルホスフィン7.74gを加え、室温で23時間反応させた。反応混合物を減圧濃縮し、残渣に水、次いで塩酸を加え弱酸性とした後エーテルで洗浄した。水層を水酸化ナトリウム水溶液で中和し、エーテルで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧濃縮した。残渣に酢酸エチルを加え、氷冷下で塩化水素ガスを導入し、生じた固体を濾取し乾燥して、-アミノ-3,4-ジクロロイソブチロフェノン塩酸塩5.92gを得た。

【0120】

(6) -アミノ-3,4-ジクロロイソブチロフェノン塩酸塩0.3g及びテトラヒドロフラン10mlの混合物に、トリエチルアミン0.31gを加え、室温で5時間攪拌し、その混合物を減圧濃縮した。得られた残渣、2-メチル-3-フランカルボン酸0.195g及びジクロロメタン20mlの混合物に、氷冷下でN,N'-ジシクロヘキシルカルボジイミド0.29g及びジクロロメタン10mlの混合物を滴下した後、室温で15時間反応させた。反応混合物を濾過し、濾液をジクロロメタンで希釈して、炭酸カリウム水溶液、次いで水で洗浄した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥した後減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（展開溶媒：酢酸エチル/n-ヘキサン=1/9）で精製して、融点175~178℃の目的物0.08gを得た。このもののNMRスペクトルデータは以下の通りである。

10

20

30

40

50

¹H-NMR ppm (Solvent : CDCl₃ / 400MHz)

1.71(s,6H), 2.43(s,3H), 6.28(s,1H), 6.44(d,1H), 7.26(d,1H), 7.44(d,1H), 7.84(dd,1H), 8.11(d,1H)

【 0 1 2 1 】

合成例 2

N - [(3' - ジフルオロメトキシ - 1 , 1 - ジメチル) フェナシル] - 5 - クロロ - 1 , 3 - ジメチル - 4 - ピラゾールカルボキサミド (後記化合物No.1-72) の合成

(1)3-ジフルオロメトキシベンゾニトリル4.09g及び無水エーテル20mlの混合物に、マグネシウム0.75g、2-プロモプロパン4.46g及び無水エーテル24mlを用いて調製したグリニヤール試薬を滴下した。滴下終了後、室温で27時間反応させた。反応混合物を氷水中に投入し、6N硫酸を加え弱酸性とした後0.5時間攪拌した。その混合物をエーテルで抽出し、水洗した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した後減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (展開溶媒 : 酢酸エチル/n-ヘキサン = 1/19) で精製して、3-ジフルオロメトキシイソブチロフェノン2.04gを得た。このもののNMRスペクトルデータは以下の通りである。

¹H-NMR ppm (Solvent : CDCl₃ / 300MHz)

1.23(d,6H), 3.52(m,1H), 6.56(t,1H), 7.32(dd,1H), 7.48(t,1H), 7.70(s,1H), 7.80(d,1H)

【 0 1 2 2 】

(2)3-ジフルオロメトキシイソブチロフェノン2.04g及びテトラヒドロフラン30mlの混合物に、フェニルトリメチルアンモニウムトリプロミド3.58gを加え、室温で2時間反応させた。反応混合物を濾過し、濾液を減圧濃縮して、油状の -プロモ-3-ジフルオロメトキシイソブチロフェノン2.79gを得た。

【 0 1 2 3 】

(3) -プロモ-3-ジフルオロメトキシイソブチロフェノン2.79g及びジメチルスルホキシド35mlの混合物に、アジ化ナトリウム1.24gを加え、50 で1時間反応させた。反応混合物を水中に投入し、酢酸エチルで抽出した後水洗した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した後減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (展開溶媒 : 酢酸エチル/n-ヘキサン = 1/9) で精製して、油状の -アジド-3-ジフルオロメトキシイソブチロフェノン2.21gを得た。このもののNMRスペクトルデータは以下の通りである。

¹H-NMR ppm (Solvent : CDCl₃ / 300MHz)

1.61(s,6H), 6.56(t,1H), 7.34(dd,1H), 7.48(t,1H), 7.86(s,1H), 7.98(d,1H)

【 0 1 2 4 】

(4) -アジド-3-ジフルオロメトキシイソブチロフェノン2.18g、メタノール35ml及び5%パラジウム炭素0.109gの混合物を、水素雰囲気下、室温で1.5時間反応させた。反応混合物をセライト濾過し、濾液を減圧濃縮した。残渣に酢酸エチルを加え、氷冷下で塩化水素ガスを導入した後減圧濃縮し、 -アミノ-3-ジフルオロメトキシイソブチロフェノン塩酸塩1.76gを得た。

【 0 1 2 5 】

(5) -アミノ-3-ジフルオロメトキシイソブチロフェノン塩酸塩0.3g及びテトラヒドロフラン10mlの混合物に、トリエチルアミン0.33gを加え、そこへ5-クロロ-1,3-ジメチル-4-ピラゾールカルボニルクロライド0.25g及びテトラヒドロフラン5mlの混合物を氷冷下で滴下した。滴下終了後、室温で3時間反応させた。反応混合物を酢酸エチルで抽出し、水洗した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した後減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (展開溶媒 : 酢酸エチル/n-ヘキサン = 1/4) で精製して、融点138~139 の目的物0.23gを得た。このもののNMRスペクトルデータは以下の通りである。

¹H-NMR ppm (Solvent : CDCl₃ / 400MHz)

1.75(s,6H), 2.28(s,3H), 3.80(s,3H), 6.50(t,1H), 6.80(s,1H), 7.23(dd,1H), 7.38(t,1H), 7.84(s,1H), 7.86(d,1H)

【 0 1 2 6 】

合成例 3

N - [2 - (2 ' - ナフチルカルボニル) - 2 - プロピル] - 5 - クロロ - 1 , 3 - ジメチル - 4 - ピラゾールカルボキサミド (化合物No.2-1) の合成

(1) 2-ナフトニトリル3.0g及び無水エーテル20mlの混合物に、マグネシウム0.61g、2-プロモプロパン3.6g及び無水エーテル18mlを用いて調製したグリニヤール試薬を滴下した。滴下終了後、還流下で12時間反応させた。反応混合物を氷水中に投入し、6N硫酸を加え弱酸性とした後0.5時間攪拌した。その混合物を酢酸エチルで抽出し、水洗した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した後減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィ（展開溶媒：酢酸エチル/n-ヘキサン = 1/50）で精製して、2-ナフチル イソプロピルケトン1.14gを得た。このもののNMRスペクトルデータは以下の通りである。

¹H-NMR ppm (Solvent : CDCl₃ / 400MHz)

1.27(d, 6H), 3.73(m, 1H), 7.53 ~ 7.65(m, 2H), 7.86 ~ 7.92(m, 2H), 7.97(d, 1H), 8.03(dd, 1H), 8.48(d, 1H)

【 0 1 2 7 】

(2) 2-ナフチル イソプロピルケトン1.14g及びテトラヒドロフラン25mlの混合物に、フェニルトリメチルアンモニウムトリプロミド2.16gを加え、室温で3時間反応させた。反応混合物を濾過し、濾液を減圧濃縮して、油状の -プロモイソプロピル 2-ナフチルケトン1.59gを得た。

【 0 1 2 8 】

(3) -プロモイソプロピル 2-ナフチルケトン1.59g及びジメチルスルホキシド40mlの混合物に、アジ化ナトリウム0.75gを加え、50 で1.5時間反応させた。反応混合物を水中に投入し、酢酸エチルで抽出した後水洗した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した後減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィ（展開溶媒：酢酸エチル/n-ヘキサン = 1/9）で精製して、油状の -アジドイソプロピル 2-ナフチルケトン1.19gを得た。

このもののNMRスペクトルデータは以下の通りである。

¹H-NMR ppm (Solvent : CDCl₃ / 400MHz)

1.68(s, 1H), 7.54 ~ 7.66(m, 2H), 7.86 ~ 7.90(m, 2H), 7.98(d, 1H), 8.10(dd, 1H), 8.74(d, 1H)

【 0 1 2 9 】

(4) -アジドイソプロピル 2-ナフチルケトン0.3g、メタノール10ml及び5%パラジウム炭素15mgの混合物を、水素雰囲気下、室温で1時間反応させた。反応混合物をセライト濾過し、濾液を減圧濃縮して、油状の -アミノイソプロピル 2-ナフチルケトン0.26gを得た。

【 0 1 3 0 】

(5) -アミノイソプロピル 2-ナフチルケトン0.26g及びテトラヒドロフラン10mlの混合物に、トリエチルアミン0.19gを加え、そこへ5-クロロ-1,3-ジメチル-4-ピラゾールカルボニルクロライド0.24g及びテトラヒドロフラン5mlの混合物を氷冷下で滴下した。滴下終了後、室温で15時間反応させた。反応混合物を酢酸エチルで抽出し、水洗した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した後減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィ（展開溶媒：酢酸エチル/n-ヘキサン = 2/3）で精製して、融点145 ~ 147 の目的物0.15gを得た。このもののNMRスペクトルデータは以下の通りである。

¹H-NMR ppm (Solvent : CDCl₃ / 300MHz)

1.87(s, 6H), 2.28(s, 3H), 3.79(s, 3H), 7.05(s, 1H), 7.48 ~ 7.58(m, 2H), 7.80 ~ 7.90(m, 3H), 8.05(dd, 1H), 8.56(d, 1H)

【 0 1 3 1 】

合成例 4

N - [2 - [(2 ' , 2 ' , 3 ' , 3 ' - テトラフルオロ - 1 ' , 4 ' - ベンゾジオキサン - 6 ' - イル) カルボニル] イソプロピル] - 3 - メチル - 2 - チオフェンカルボキサミド (後記化合物No.4-10) の合成

(1) 6 - プロモ - 2 , 2 , 3 , 3 - テトラフルオロ - 1 , 4 - ベンゾジオキサン3.0g及

10

20

30

40

50

びジエチルエーテル38mlの混合物に、窒素雰囲気下、-50℃にてn-ブチルリチウム(1.57 M n-ヘキサン溶液)7.3mlを滴下した後、同温度で30分間攪拌した。そこへ、-70℃以下でイソブチルアルデヒド0.83gを滴下した後、室温まで昇温し、15時間反応させた。反応混合物を水中に投入し、塩酸にて弱酸性として、ジエチルエーテルで抽出した。有機層を水洗し、硫酸マグネシウムで乾燥した後減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒:酢酸エチル/n-ヘキサン=1/9)で精製して、油状の1-(2', 2', 3', 3'-テトラフルオロ-1', 4'-ベンゾジオキサン-6'-イル)-2-メチルプロパノール1.8gを得た。このもののNMRスペクトルデータは以下の通りである。

¹H-NMR ppm (Solvent: CDCl₃ / 400MHz)

0.83(d, 3H), 0.96(d, 3H), 1.92(m, 1H), 4.40(d, 1H), 6.90(d, 1H), 7.10(s, 2H), 7.14(s, 1H)

【0132】

(2)クロロクロム酸ピリジニウム2.08g、酢酸ナトリウム1.05g及びジクロロメタン20mlの混合物に、1-(2', 2', 3', 3'-テトラフルオロ-1', 4'-ベンゾジオキサン-6'-イル)-2-メチルプロパノール1.8g及びジクロロメタン7mlの混合物を加え、室温で2時間反応させた。反応混合物をセライト濾過し、濾液を減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒:酢酸エチル/n-ヘキサン=1/19)で精製して、油状の2,2,3,3-テトラフルオロ-1,4-ベンゾジオキサン-6-イル イソプロピル ケトン1.40gを得た。このもののNMRスペクトルデータは以下の通りである。

¹H-NMR ppm (Solvent: CDCl₃ / 400MHz)

1.23(d, 6H), 3.48(m, 1H), 7.24(d, 1H), 7.78(d, 1H), 7.81(dd, 1H)

【0133】

(3)2, 2, 3, 3-テトラフルオロ-1, 4-ベンゾジオキサン-6-イル イソプロピル ケトン1.40g及びテトラヒドロフラン19.7mlの混合物に、フェニルトリメチルアンモニウムトリプロミド1.89gを加え、室温で2時間反応させた。反応混合物を濾過し、濾液を減圧濃縮して、油状の-プロモイソプロピル 2, 2, 3, 3-テトラフルオロ-1, 4-ベンゾジオキサン-6-イル ケトン1.78gを得た。

【0134】

(4)-プロモイソプロピル 2, 2, 3, 3-テトラフルオロ-1, 4-ベンゾジオキサン-6-イル ケトン1.78g及びジメチルスルホキシド10mlの混合物に、アジ化ナトリウム0.65gを加え、50℃で2時間反応させた。反応混合物を水中に投入し、ジエチルエーテルで抽出した後水洗した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した後減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒:酢酸エチル/n-ヘキサン=1/19)で精製して、油状の-アジドイソプロピル 2, 2, 3, 3-テトラフルオロ-1, 4-ベンゾジオキサン-6-イル ケトン1.5gを得た。このもののNMRスペクトルデータは以下の通りである。

¹H-NMR ppm (Solvent: CDCl₃ / 400MHz)

1.61(s, 6H), 7.23(d, 1H), 8.01~8.03(m, 2H)

【0135】

(5)-アジドイソプロピル 2, 2, 3, 3-テトラフルオロ-1, 4-ベンゾジオキサン-6-イル ケトン0.25g、メタノール15ml及び5%パラジウム炭素13mgの混合物を、窒素雰囲気下、室温で1時間反応させた。反応混合物をセライト濾過し、濾液を減圧濃縮して、油状の-アミノイソプロピル 2, 2, 3, 3-テトラフルオロ-1, 4-ベンゾジオキサン-6-イル ケトン0.23gを得た。

【0136】

(6)-アミノイソプロピル 2, 2, 3, 3-テトラフルオロ-1, 4-ベンゾジオキサン-6-イル ケトン0.23g及びテトラヒドロフラン10mlの混合物に、トリエチルアミン0.16gを加え、そこへ3-メチル-2-チオフェンカルボニルクロライド0.13g及びテトラヒドロフラン5mlの混合物を、氷冷下で滴下した後、室温で3時間反応させた。反応混合物を酢酸エチルで抽出し、水洗した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した後減圧濃縮した

10

20

30

40

50

。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（展開溶媒：酢酸エチル/n-ヘキサン=1/4）で精製して、融点120~122 の目的物0.23gを得た。このもののNMRスペクトルデータは以下の通りである。

¹H-NMR ppm (Solvent : CDCl₃ / 300MHz)

1.76(s, 6H), 2.39(s, 3H), 6.54(s, 1H), 6.84(d, 1H), 7.24(d, 1H), 7.42(d, 1H), 7.84(s, 1H), 7.96(s, 1H)

【 0 1 3 7 】

合成例 5

N - [(3 ' , 4 ' - ジクロロ - 1 , 1 - ジメチル) フェナシル] - 3 - メチル - 2 - チオフェンカルボキサミド (後記化合物No.1-20) の合成

前記合成例 1 (1) ~ (5) の方法に準じて得た - アミノ - 3 , 4 - ジクロロイソブチロフェノン塩酸塩268mgと、テトラヒドロフラン5mlとの混合物に、トリエチルアミン303mgを加え、そこへ3 - メチル - 2 - チオフェンカルボニルクロライド265mg及びテトラヒドロフラン2.5mlの混合物を氷冷下で滴下した。滴下終了後、室温で3時間反応させた。反応混合物を酢酸エチルで抽出し、水洗した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した後減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（展開溶媒：酢酸エチル/n-ヘキサン=1/3）で精製して、融点141 の目的物180mgを得た。このもののNMRスペクトルデータは以下の通りである。

¹H-NMR ppm (Solvent : CDCl₃ / 400MHz)

1.72(s, 6H), 2.37(s, 3H), 6.53(s, 1H), 6.85(d, 1H), 7.25(d, 1H), 7.43(d, 1H), 7.86(dd, 1H), 8.13(s, 1H)

【 0 1 3 8 】

合成例 6

N - [(4 ' - メトキシ - 2 ' - メチル - 1 , 1 - ジメチル) フェナシル] - 3 - メチル - 2 - チオフェンカルボキサミド (後記化合物No.1-160) の合成

(1) 塩化アルミニウム7.15g及び二硫化炭素20mlの混合物にイソブチリルクロリド5.7g及び二硫化炭素5mlの混合物を、10 以下で滴下し0.5時間反応させた。次いでm-クレゾール5.0g及び二硫化炭素5mlの混合物を5 以下で滴下した後室温で4時間反応させた。反応混合物を氷水及び塩酸の混合物中に投入し、塩化メチレンで抽出した後水洗した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥した後減圧濃縮した。残渣にテトラヒドロフラン60ml、水30ml及び水酸化ナトリウム3.7gを加え室温で1.5時間反応させた。反応混合物を減圧濃縮した後氷水中に投入し希硫酸で弱酸性とし、酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した後減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（展開溶媒：酢酸エチル/n-ヘキサン=1/9）で精製して、固体の4-ヒドロキシ-2-メチルイソブチロフェノン2.45gを得た。このもののNMRスペクトルデータは以下の通りである。

¹H-NMR ppm (Solvent : CDCl₃ / 400MHz)

1.15(d, 6H), 2.43(s, 3H), 3.40(m, 1H), 6.70(m, 2H), 7.57(d, 1H)

【 0 1 3 9 】

(2) 4-ヒドロキシ-2-メチルイソブチロフェノン0.8g、炭酸カリウム0.68g及びジメチルホルムアミド15mlの混合物に硫酸ジメチル0.62g及びジメチルホルムアミド3mlの混合物を加え室温で3時間反応させた。反応混合物を水中投入し酢酸エチルで抽出し水洗した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した後減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（展開溶媒：酢酸エチル/n-ヘキサン=1/9）で精製して、油状の4-メトキシ-2-メチルイソブチロフェノン0.59gを得た。このもののNMRスペクトルデータは以下の通りである。

¹H-NMR ppm (Solvent : CDCl₃ / 400MHz)

1.13(d, 6H), 2.46(s, 1H), 3.38(m, 1H), 6.72(m, 2H), 7.59(d, 1H)

【 0 1 4 0 】

(3) 4-メトキシ-2-メチルイソブチロフェノン0.59g及びテトラヒドロフラン15mlの混合物に、フェニルトリメチルアンモニウムトリプロミド1.16gを加え、室温で2.5時間反応さ

10

20

30

40

50

せた。反応混合物にエーテルを加え不溶物を濾別し、濾液を減圧濃縮して、油状の -プロモ-4-メトキシ-2-メチルイソブチロフェノン0.7gを得た。

【 0 1 4 1 】

(4) -プロモ-4-メトキシ-2-メチルイソブチロフェノン0.7g及びジメチルスルホキシド8mlの混合物に、アジ化ナトリウム0.4gを加え、50 で1.5時間反応させた。反応混合物を水中に投入し、酢酸エチルで抽出した後水洗した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した後減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（展開溶媒：酢酸エチル/n-ヘキサン = 1/9）で精製して、油状の -アジド-4-メトキシ-2-メチルイソブチロフェノン0.67gを得た。このもののNMRスペクトルデータは以下の通りである。

¹H-NMR ppm (Solvent : CDCl₃ / 300MHz)

1.54(s, 6H), 2.33(s, 1H), 3.81(s, 3H), 6.72(dd, 1H), 6.75(d, 1H), 7.61(d, 1H)

10

【 0 1 4 2 】

(5) -アジド-4-メトキシ-2-メチルイソブチロフェノン0.25g、メタノール10ml及び5%パラジウム炭素13mgの混合物を、水素雰囲気下、室温で3時間反応させた。反応混合物をセライト濾過し、濾液を減圧濃縮して、油状の -アミノ-4-メトキシ-2-メチルイソブチロフェノン0.23gを得た。

【 0 1 4 3 】

(6) -アミノ-4-メトキシ-2-メチルイソブチロフェノン0.22g及びテトラヒドロフラン12mlの混合物に、トリエチルアミン0.13gを加え、そこへ3-メチル-2-チオフェンカルボニルクロライド0.17g及びテトラヒドロフラン3mlの混合物を氷冷下で滴下した。滴下終了後、室温で2時間反応させた。反応混合物を酢酸エチルで抽出し、水洗した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した後減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（展開溶媒：酢酸エチル/n-ヘキサン = 1/3）で精製して、融点99 ~ 101 の目的物0.35gを得た。このもののNMRスペクトルデータは以下の通りである。

20

¹H-NMR ppm (Solvent : CDCl₃ / 300MHz)

1.77(s, 6H), 2.38(s, 3H), 2.45(s, 3H), 6.81(dd, 1H), 6.71(s, 1H), 6.85(m, 2H), 7.26(d, 1H), 7.49(d, 1H)

【 0 1 4 4 】

合成例 7

N - [(3 ' , 4 ' - ジメトキシ - 1 , 1 - ジメチル) フェナシル] - 3 - メチル - 2 - チオフェンカルボキサミド (後記化合物No.1-535) の合成

30

(1) 3,4-ジメトキシベンズアルデヒド5.0g及びエーテル50mlの混合物に2-プロモプロパン5.6g、マグネシウム0.94g及びエーテル30mlより調製したイソプロピルマグネシウムプロミドエーテル溶液を滴下し、還流下に15時間反応させた。反応混合物を氷水中に投入し、希硫酸を加え攪拌した後塩化メチレンで抽出し、水洗した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥した後減圧濃縮して、油状の 1 - (3 ' , 4 ' - ジメトキシフェニル) - 2 - メチルプロパノール6.3gを得た。

【 0 1 4 5 】

(2) クロロクロム酸ピリジニウム6.5g、酢酸ナトリウム4.9g及びジクロロメタン100mlの混合物に、 1 - (3 ' , 4 ' - ジメトキシフェニル) - 2 - メチルプロパノール6.28g及びジクロロメタン 30mlの混合物を加え、室温で15時間反応させた。反応混合物をセライト濾過し、濾液を減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（展開溶媒：酢酸エチル/n-ヘキサン = 3/7）で精製して、油状の3,4-ジメトキシイソブチロフェノン3.9gを得た。このもののNMRスペクトルデータは以下の通りである。

40

¹H-NMR ppm (Solvent : CDCl₃ / 400MHz)

1.70(d, 6H), 3.50(m, 1H), 3.89(s, 3H), 3.90(s, 3H), 6.85(d, 1H), 7.50(d, 1H), 7.56(dd, 1H)

【 0 1 4 6 】

(3) 3,4-ジメトキシイソブチロフェノン1.0g及びテトラヒドロフラン20mlの混合物に、フェニルトリメチルアンモニウムトリプロミド1.81gを加え、室温で2時間反応させた。反応混合物にエーテルを加え不溶物を濾別し、濾液を減圧濃縮して、油状の -プロモ-3,4-

50

ジメトキシイソブチロフェノンを得た。

【 0 1 4 7 】

(4) -ブromo-3,4-ジメトキシイソブチロフェノン及びジメチルスルホキシド20mlの混合物に、アジ化ナトリウム0.62gを加え、50 で1.5時間反応させた。反応混合物を水中に投入し、酢酸エチルで抽出した後水洗した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した後減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（展開溶媒：酢酸エチル/n-ヘキサン=1/4）で精製して、油状の -アジド-3,4-ジメトキシイソブチロフェノン1.1gを得た。このもののNMRスペクトルデータは以下の通りである。

¹H-NMR ppm (Solvent : CDCl₃ / 400MHz)

1.56(s, 6H), 3.91(s, 3H), 3.93(s, 3H), 6.86(d, 1H), 7.62(d, 1H), 7.94(dd, 1H)

10

【 0 1 4 8 】

(5) -アジド-3,4-ジメトキシイソブチロフェノン0.25g、メタノール15ml及び5%パラジウム炭素13mgの混合物を、水素雰囲気下、室温で3時間反応させた。反応混合物をセライト濾過し、濾液を減圧濃縮して、油状の -アミノ-3,4-ジメトキシイソブチロフェノン0.2gを得た。

【 0 1 4 9 】

(6) -アミノ-3,4-ジメトキシイソブチロフェノン0.2g及び1,2-ジクロロエタン12mlの混合物に、トリエチルアミン0.11gを加え、そこへ3-メチル-2-チオフェンカルボニルクロライド0.14g及び1,2-ジクロロエタン2mlの混合物を氷冷下で滴下した。滴下終了後、室温で1.5時間反応させた。反応混合物を塩化メチレンで抽出し、水洗した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥した後減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（展開溶媒：酢酸エチル/n-ヘキサン=3/2）で精製して、融点138~140 の目的物0.1gを得た。このもののNMRスペクトルデータは以下の通りである。

20

¹H-NMR ppm (Solvent : CDCl₃ / 300MHz)

1.82(s, 6H), 2.44(s, 3H), 3.89(s, 6H), 6.80(d, 1H), 6.85(d, 1H), 6.88(s, 1H), 7.23(d, 1H), 7.63(d, 1H), 7.75(dd, 1H)

【 0 1 5 0 】

次に、式(1)又は(1-)の酸アミド誘導体又はその塩の代表例を第1表~第9表に具体的に挙げる。これら化合物は前記合成例或は前記した種々の製造方法に基づいて合成することができる。

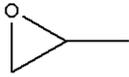
30

表中、No.は化合物No.を示し、Meはメチル、Etはエチル、Pr(i)はイソプロピル、Pr(n)はノルマルプロピル、Bu(t)はターシャリーブチル、Bu(n)はノルマルブチル、Bu(sec)はセカンダリーブチル、COはカルボニル、CO₂はカルボキシルを、Phはフェニルを各々示す。また、表中、Ph(4-Cl)とあるのは、4位に塩素原子が置換したフェニルを示し、Ph(3,4-Cl₂)とあるのは、3位と4位に各々塩素原子が置換したフェニルを示し、他の同様の記載もこれらに準じる。また、表中で用いた略号D 1~D 7及びB 1~B 117は、各々以下の置換基を示す。

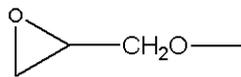
【 0 1 5 1 】

【化 2 7】

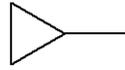
D1:



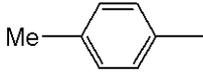
D2:



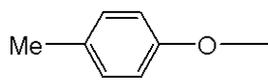
D3:



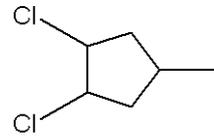
D4:



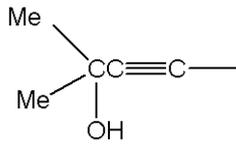
D5:



D6:

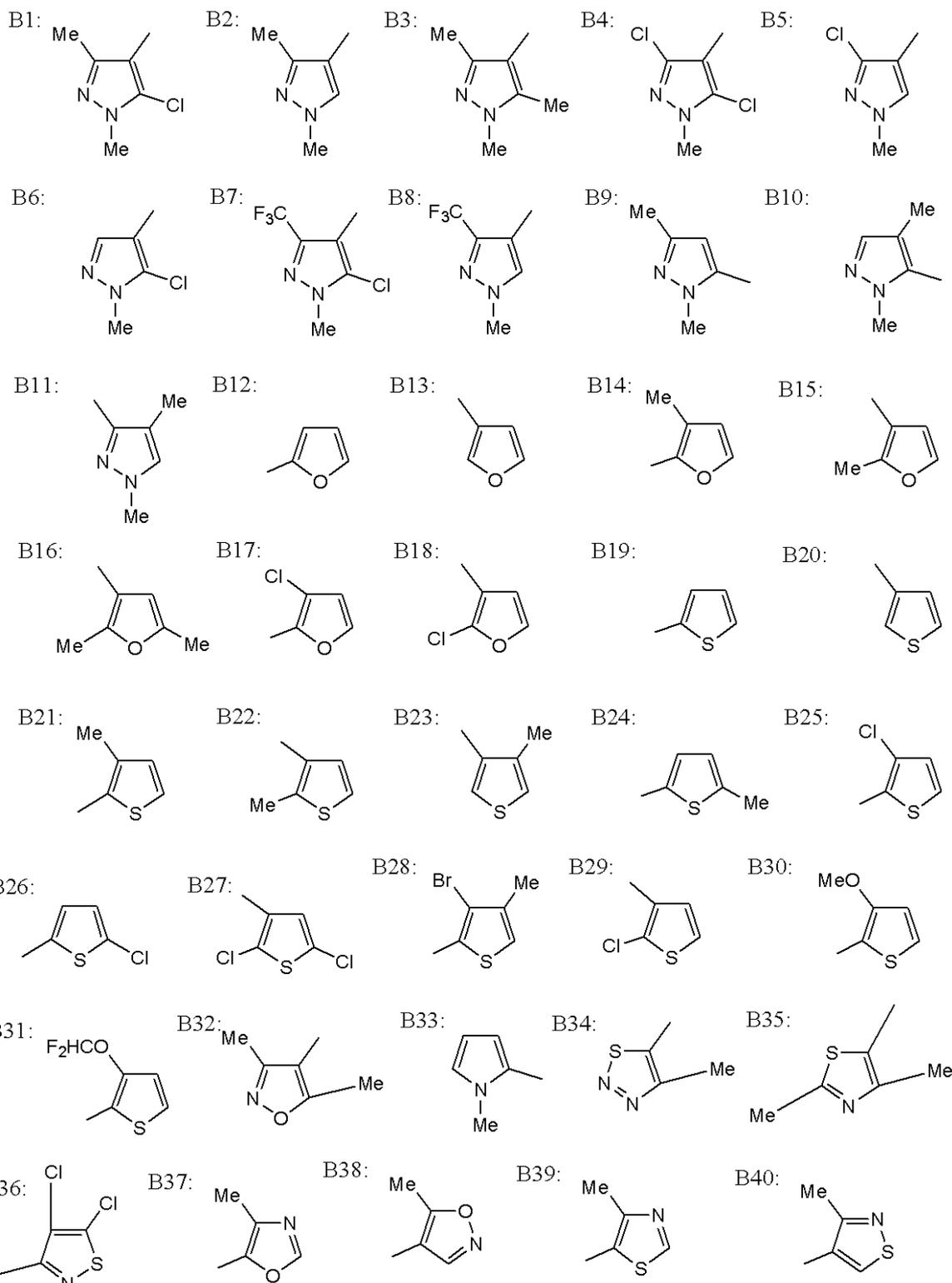


D7:



【 0 1 5 2 】

【化 2 8】



10

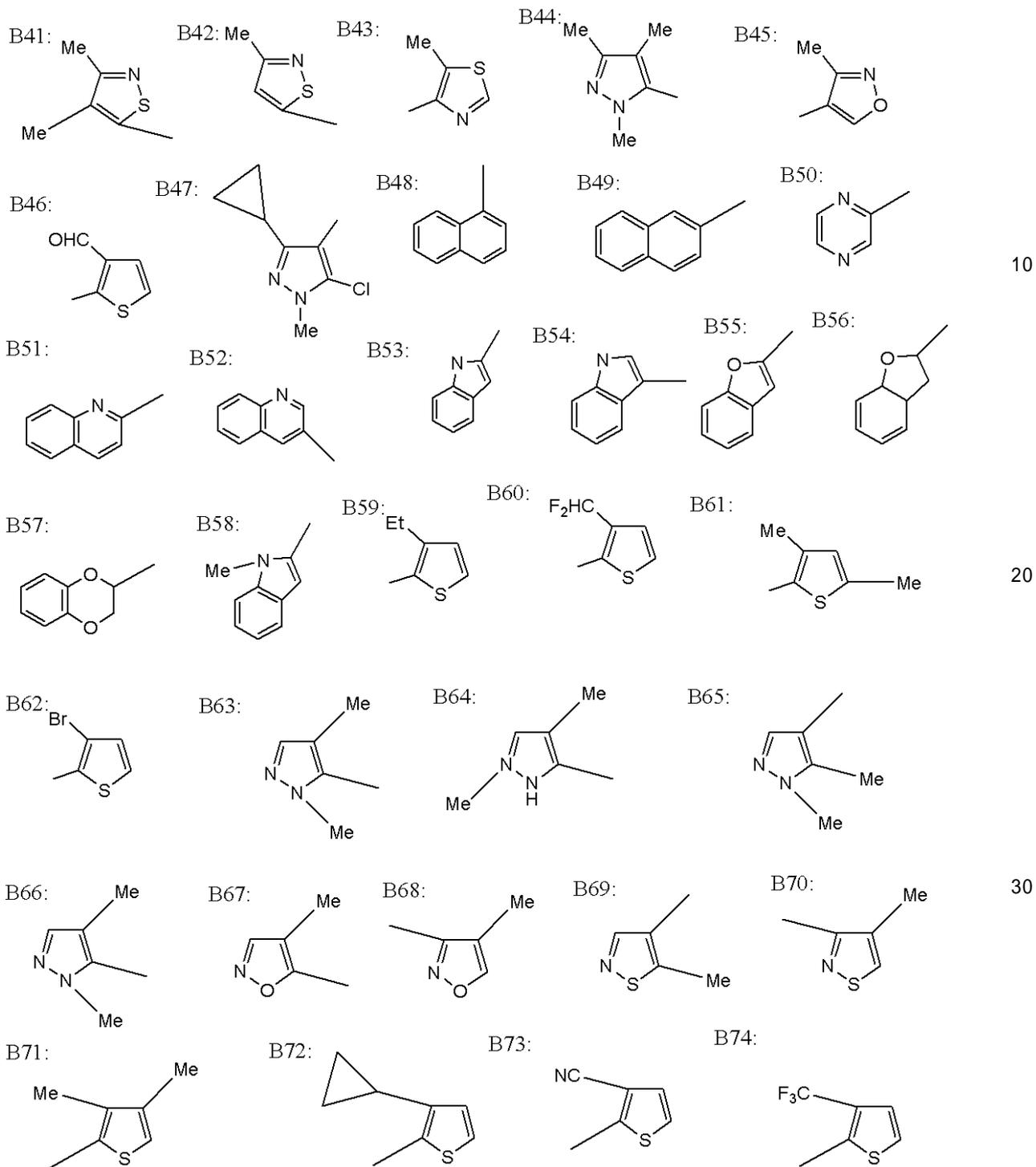
20

30

40

【 0 1 5 3】

【化 2 9】



【 0 1 5 4】

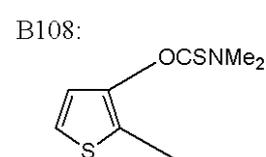
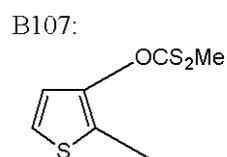
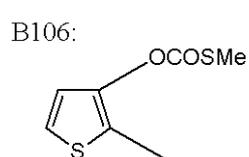
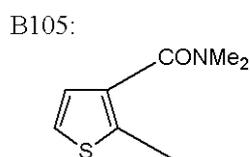
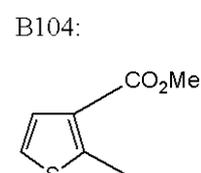
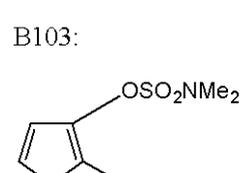
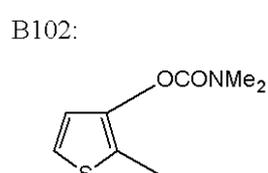
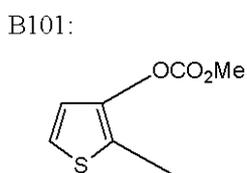
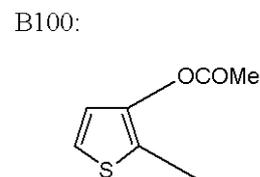
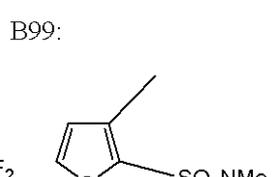
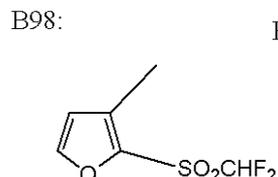
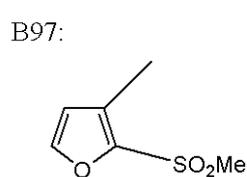
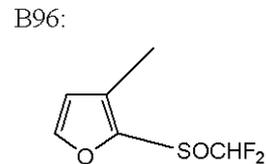
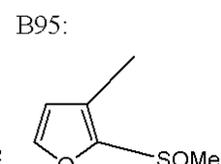
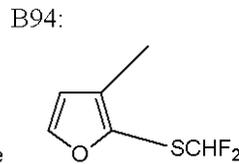
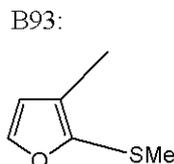
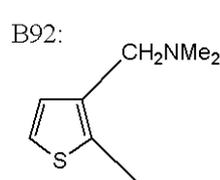
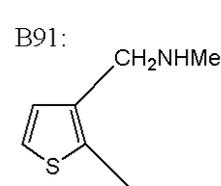
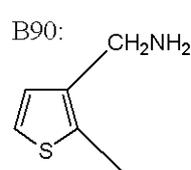
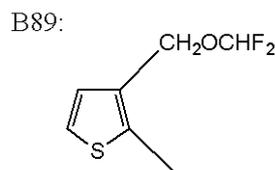
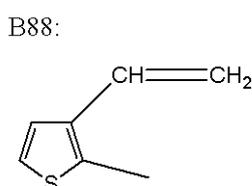
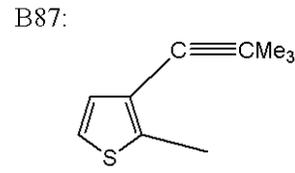
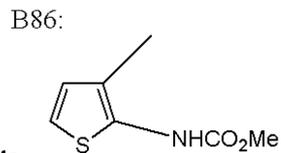
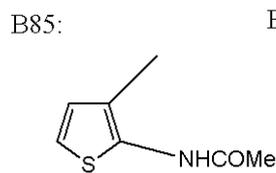
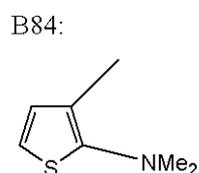
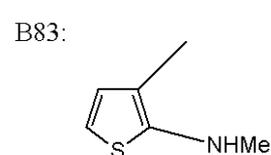
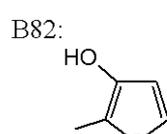
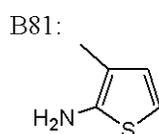
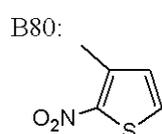
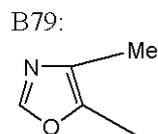
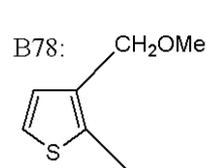
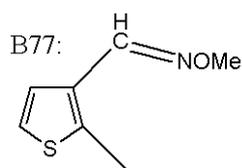
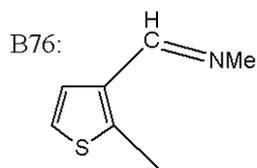
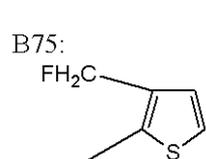
10

20

30

40

【化 3 0】



【 0 1 5 5】

10

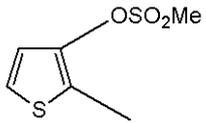
20

30

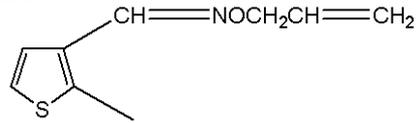
40

【化 3 1】

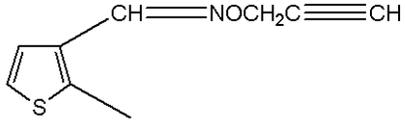
B109:



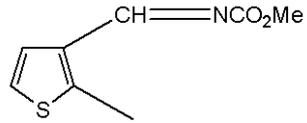
B110:



B111:

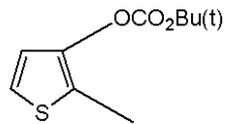


B112:

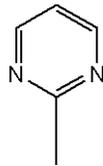


10

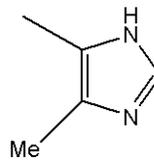
B113:



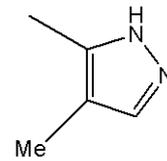
B114:



B115:

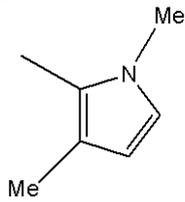


B116:



20

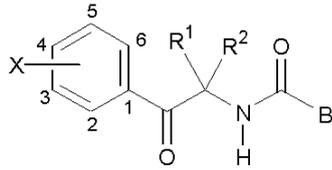
B117:



【 0 1 5 6 】

30

【表1】



第1表

No.	R ¹	R ²	X	B	物性(融点℃)
1-1	Me	Me	2-Me-4-F	B1	132~134
1-2	Me	Me	2-Me-4-F	B5	
1-3	Me	Me	2-Me-4-F	B8	
1-4	Me	Me	2-Me-4-Cl	B1	141~143
1-5	Me	Me	2-Me-4-Cl	B5	
1-6	Me	Me	2-Me-4-Cl	B21	96~100
1-7	Me	Me	2-Me-4-Br	B16	138~140
1-8	Me	Me	2-Me-4-Br	B8	
1-9	Me	Me	2-Me-4-Br	B21	108~110
1-10	Me	Me	4-Cl	B1	186~188
1-11	Me	Me	4-Cl	B16	184~186
1-12	Me	Me	H	B7	168~170
1-13	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B1	188~189
1-14	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B16	170~173
1-15	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B7	182~183
1-16	Me	Me	3-Cl	B1	112~113
1-17	Me	Me	3-Cl	B16	150~151
1-18	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B2	200~201
1-19	Me	Me	4-Br	B21	174
1-20	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B21	141
1-21	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B25	アモルファス
1-22	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B14	137
1-23	No.1-22のナトリウム塩				
1-24	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B24	固体
1-25	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B26	229
1-26	Me	Me	3-Br	B25	149
1-27	Me	Me	3-Br	B21	119
1-28	Me	Me	3-Me	B21	油状
1-29	Me	Me	3-CF ₃	B21	アモルファス
1-30	Me	Me	3-OMe	B21	128

10

20

30

40

【0157】

【表 2】
第 1 表つづき

No.	R ¹	R ²	X	B	物性(融点°C)
1-31	Me	Me	3-OCHF ₂	B21	110
1-32	Me	Me	4-Cl	B21	175
1-33	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B9	126~130
1-34	Me	Me	H	B1	103~105
1-35	Me	Me	4-Br	B19	235~240
1-36	Me	Me	4-Br	B16	183~185
1-37	Me	Me	4-Br	B20	245~247
1-38	Me	Me	3-Cl	B2	141~142
1-39	Me	Me	4-Cl	B2	140~141
1-40	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B12	225~227
1-41	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B5	171~172
1-42	Me	Me	3-F-4-F	B1	134~136
1-43	Me	Me	3-F-4-F	B16	150~152
1-44	Me	Me	2-Cl	B1	144~145
1-45	Me	Me	2-Cl	B16	130~132
1-46	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B6	固体
1-47	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B4	150~152
1-48	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B27	140~141
1-49	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B3	141~146
1-50	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B10	
1-51	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B11	
1-52	Me	Me	4-Br	B1	183~185
1-53	Me	Me	3-Cl-5-Cl	B16	168~170
1-54	Me	Me	3-Cl-5-Cl	B1	152~153
1-55	Me	Me	3-Br	B16	143~145
1-56	Me	Me	3-Br	B1	151~152
1-57	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B15	175~178
1-58	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B17	
1-59	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B18	
1-60	Me	Me	2-Cl-4-Cl	B16	165~167
1-61	Me	Me	2-Cl-4-Cl	B1	170~171

10

20

30

【 0 1 5 8 】

【表 3】
第1表つづき

No.	R ¹	R ²	X	B	物性(融点℃)
1-62	Me	Me	3-Me	B16	133~135
1-63	Me	Me	3-Me	B1	145~146
1-64	Me	Me	3-CF ₃	B16	125~127
1-65	Me	Me	3-CF ₃	B1	120~121
1-66	Me	Me	3-Cl	B21	128~130
1-67	Me	Me	3-Cl	B25	161~162
1-68	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B29	
1-69	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B30	93~96
1-70	Me	Et	3-Cl-4-Cl	B21	
1-71	Me	Me	3-OCHF ₂	B16	121~123
1-72	Me	Me	3-OCHF ₂	B1	138~139
1-73	Me	Me	3-OMe	B16	116~118
1-74	Me	Me	3-OMe	B1	118~120
1-75	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B22	155~158
1-76	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B31	油状
1-77	Me	Me	3-Me-4-Me	B21	101~102
1-78	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B23	220~222
1-79	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B28	109~110
1-80	Me	Me	3-Cl-4-F	B21	124~126
1-81	Me	Me	3-Cl-4-F	B16	
1-82	Me	Me	3-Cl-4-F	B1	
1-83		-(CH ₂) ₅ -	4-Br	B7	
1-84		-(CH ₂) ₅ -	4-Br	B11	
1-85	Me	Me	3,4-(OCHF ₂) ₂	B1	
1-86	Me	Me	3,4-(OCHF ₂) ₂	B21	147~150
1-87	Me	Me	4-OCF ₃	B1	
1-88	Me	Me	3-OCF ₃	B21	
1-89	Me	Me	4-CF ₃	B1	
1-90	Me	Me	4-CF ₃	B21	113~115
1-91	Me	Me	4-CF ₃	B15	
1-92	Me	Me	4-CF ₃	B11	
1-93	Me	Me	3-Me-4-Me	B16	133~135
1-94	Me	Me	4-NO ₂	B16	179~180
1-95	Me	Me	4-NO ₂	B1	168~170

10

20

30

40

【 0 1 5 9 】

【表4】
第1表つづき

No.	R ¹	R ²	X	B	物性(融点°C)
1-96	Me	Me	4-NO ₂	B21	135~137
1-97	Me	Me	3-Me-4-Me	B1	130~132
1-98	Me	Me	2-Me-4-OCHF ₂	B21	112~114
1-99	Me	Me	3-Cl-5-Cl	B21	137~140
1-100	Me	Me	3-Cl-4-Br	B21	120~121
1-101	Me	Me	3-Me-4-Cl	B21	108~112
1-102	Me	Me	3-Br-4-Cl	B21	117~120
1-103	Me	Me	3-Cl-4-Me	B21	115~118
1-104	Me	Me	2-Me-4-F	B21	107~109
1-105	Me	Me	4-Me	B21	152~154
1-106	Me	Me	4-OCF ₃	B21	116~120
1-107	Me	Me	3-Br-4-OCF ₃	B21	107~111
1-108	Me	Me	3-CF ₃ -4-Cl	B21	133~135
1-109	Me	Me	3-Cl-4-Br	B1	105~109
1-110	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B19	192~195
1-111	Me	Me	4-OCH ₂ CF ₃	B21	134~138
1-112	Me	Me	4-OCHF ₂	B21	118~120
1-113	Me	Me	3-OMe-4-Cl	B21	154~159
1-114	Me	Me	3-Me-4-OCF ₃	B21	116~118
1-115	Me	Me	3-Cl-4-Me-5-Me	B21	107~114
1-116	Me	Me	2-Cl-3-Cl-4-Cl	B1	133~137
1-117	Me	Me	2-Me-3-Cl-4-Cl	B1	94~98
1-118	Me	Me	2-Cl-3-Cl-4-Cl	B21	112~115
1-119	Me	Me	2-Me-3-Cl-4-Cl	B21	90~95
1-120	Me	Me	2-Me-3-Me-4-Cl	B21	油状
1-121	Me	Me	2-Cl-3-Me-4-Me	B21	油状
1-122	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B8	200~202
1-123	Me	H	4-Cl	B16	油状
1-124	Me	Me	4-Br	B39	126~129
1-125	Me	Me	4-Bu(t)	B21	130~134
1-126	Me	Me	4-Bu(t)	B1	161~165
1-127	Me	Me	3-Me-4-Cl	B21	108~112
1-128	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B37	157~159
1-129	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B43	120~125
1-130	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B44	165~170

10

20

30

40

【 0 1 6 0 】

【表5】
第1表つづき

No.	R ¹	R ²	X	B	物性(融点°C)
1-131	Me	Me	4-(2-チエニル)	B21	119.2
1-132	Me	Me	4-(5-Me-2-チエニル)	B21	176.8
1-133	Me	Me	4-(2-フリル)	B21	>300
1-134	Me	Me	4-(3-チエニル)	B21	>300
1-135	Me	Me	4-(5-Cl-2-チエニル)	B21	153.5
1-136	Me	Me	4-(2-Me-3-チエニル)	B21	アメ状
1-137	Me	Me	4-(5-COMe-2-チエニル)	B21	199.2
1-138	Me	Me	3-(2-チエニル)	B21	134.2
1-139	Me	Me	3-(3-チエニル)	B21	>300
1-140	Me	Me	3-(5-COMe-2-チエニル)	B21	油状
1-141	Me	Me	3-(5-Cl-2-チエニル)	B21	141.7
1-142	Me	Me	3-(5-Me-2-チエニル)	B21	137.8
1-143	Me	Me	3-(4-Me-3-チエニル)	B21	アモルファス
1-144	Me	Me	3-(2-フリル)	B21	固体
1-145	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B32	135~137
1-146	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B33	164
1-147	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B34	153~154
1-148	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B35	固体
1-149	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B36	固体
1-150	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B39	142~145
1-151	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B40	145~146
1-152	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B79	140~142
1-153	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B38	165~166
1-154	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B41	136~140
1-155	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B42	175~178
1-156	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B45	175~177
1-157	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B46	油状
1-158	Me	Me	4-(5-CF ₃ -ヒ°リジ°ン-2-イルオキシ)	B1	127~128
1-159	Me	Me	4-(5-CF ₃ -ヒ°リジ°ン-2-イルオキシ)	B21	138~140
1-160	Me	Me	2-Me-4-OMe	B21	99~101
1-161	Me	Me	2-Me-4-OEt	B21	85~88
1-162	Me	Me	2-Me-4-CF ₃	B21	110~113
1-163	Me	Me	2-Me-4-Me	B21	102~105
1-164	Me	Me	2-Me	B21	79~82
1-165	Me	Me	2-Me-3-Cl	B21	109~111

10

20

30

40

【 0 1 6 1 】

【表 6】
第 1 表つづき

No.	R ¹	R ²	X	B	物性(融点°C)
1-166	Me	Me	2-Br-4-CF ₃	B21	90~92
1-167	Me	Me	3-Br-4-Br	B21	127~130
1-168	Me	Me	3-Me-4-OCHF ₂	B21	100~106
1-169	Me	Me	4-[D 3]	B21	107~109
1-170	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B59	139~145
1-171	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B60	139~141
1-172	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B61	140~142
1-173	H	H	4-Cl	B21	119~121
1-174	Me	Me	2-Me-4-OPr	B21	97~100
1-175	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B62	89~92
1-176	Me	Me	3-Me-4-OMe	B21	123~125
1-177	Me	Me	3-Cl-4-OMe	B21	161~164
1-178	Me	Me	2-Me-3-Me-4-OMe	B21	88~90
1-179	Me	Me	2-Me-3-Me-4-OCHF ₂	B21	油状
1-180	Me	Me	4-OMe	B21	139~141
1-181	Me	Me	2-Me-4-OCOPr(i)	B21	アモルファス
1-182	Me	Me	2-Me-4-OH	B21	204~208
1-183	Me	Me	2-Me-4-OSO ₂ Me	B21	81~84
1-184	Me	Me	2-OMe	B21	油状
1-185	Me	Me	2-Me-3-OMe	B21	128~129
1-186	Me	Me	2-Me-4-OBu(n)	B21	69~71
1-187	Me	Me	2-Me-4-OCH ₂ CF ₃	B21	油状
1-188	Me	Me	2-Me-4-OCH ₂ CH ₂ OMe	B21	73~75
1-189	Me	H	4-Cl	B21	油状
1-190	Me	Me	2-Me-4-OPr(i)	B21	96~98
1-191	Me	Me	4-Br	B48	
1-192	Me	Me	4-Br	B49	
1-193	Me	Me	4-Br	B50	122~125
1-194	Me	Me	4-Br	B51	
1-195	Me	Me	4-Br	B52	192~195
1-196	Me	Me	4-Br	B53	
1-197	Me	Me	4-Br	B54	
1-198	Me	Me	4-Br	B13	
1-199	Me	Me	4-Br	B12	
1-200	Me	Me	4-Br	B63	132~134

10

20

30

40

【 0 1 6 2 】

【表 7】
第 1 表つづき

No.	R ¹	R ²	X	B	物性(融点℃)
1-201	Me	Me	4-Br	B55	164~166
1-202	Me	Me	4-Br	B56	145~147
1-203	Me	Me	4-Br	B57	45~47
1-204	Me	Me	4-Br	B57	50~58
1-205	Me	Me	3-F-4-Cl	B21	119~122
1-206	Me	Me	2-Me-4-Et	B21	77~81
1-207	Et	H	4-Cl	B21	114~117
1-208	Me	Me	2-Cl-4-Cl	B21	103~104
1-209	Me	Me	3-OCHF ₂ -4-Cl	B21	106~110
1-210	Me	Me	3-Cl-4-OCHF ₂	B21	137~139
1-211	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B63	
1-212	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B64	
1-213	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B65	
1-214	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B66	
1-215	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B67	
1-216	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B68	
1-217	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B69	
1-218	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B70	
1-219	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B71	122~124
1-220	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B72	
1-221	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B73	
1-222	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B74	
1-223	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B75	
1-224	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B76	
1-225	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B77	
1-226	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B78	
1-227	Me	Me	2-Me-4-O-[D 3]	B21	
1-228	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ NMe ₂	B21	
1-229	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ OMe	B21	
1-230	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ SMe	B21	
1-231	Me	Me	2-Me-5-OMe	B21	油状
1-232	Me	Me	2-Me-5-Cl	B21	
1-233	Me	Me	2-Me-6-OMe	B21	
1-234	Me	Me	2-Me-6-Me	B21	
1-235	Me	Me	2-Me-4-OMe-6-Me	B21	

10

20

30

40

【 0 1 6 3 】

【表 8】
第1表つづき

No.	R ¹	R ²	X	B	物性(融点°C)
1-236	Me	Me	2-Me-4-Br	B21	
1-237	Me	Me	2-Me-4-OCF ₂ CHF ₂	B21	
1-238	Me	Me	2-Me-4-OCH ₂ CF ₂ CF ₃	B21	
1-239	Me	Me	2-Me-4-OCF ₂ CHF ₂ CF ₃	B21	
1-240	Me	Me	2-Et-4-OMe	B21	
1-241	Me	Me	2-CF ₃ -4-OMe	B21	
1-242	Me	Me	2-CF ₃ -4-Cl	B21	
1-243	Me	Me	3-Me-4-Br	B21	
1-244	Me	Me	3-Br-4-Me	B21	118~120
1-245	Me	Me	2-Me-4-OCH ₂ CN	B21	
1-246	Me	Me	2-Me-4-NHCH ₂ CN	B21	
1-247	Me	Me	2-Me-4-SCH ₂ CN	B21	
1-248	Me	Me	2-Me-4-OCH ₂ -[D 3]	B21	
1-249	Me	Me	2-Me-4-NHCH ₂ -[D 3]	B21	
1-250	Me	Me	2-Me-4-SCH ₂ -[D 3]	B21	
1-251	Me	Me	2-Me-4-SMe	B21	
1-252	Me	Me	2-Me-4-SOMe	B21	
1-253	Me	Me	2-Me-4-SO ₂ Me	B21	
1-254	Me	Me	2-Me-4-CHO	B21	
1-255	Me	Me	2-Me-4-OCF ₃	B21	
1-256	Me	Me	2-Me-4-CHF ₂	B21	
1-257	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ -[D 3]	B21	
1-258	Me	Me	2-Me-4-[D 3]	B21	
1-259	Me	Me	2-OCHF ₂ -4-Cl	B21	
1-260	Me	Me	2-F-4-Cl	B21	
1-261	Me	Me	2-OMe-4-Cl	B21	
1-262	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ OCOMe	B21	
1-263	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ OH	B21	
1-264	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ Br	B21	
1-265	Me	Me	2-Me-4-I	B21	
1-266	Me	Me	2-Me-3-OEt	B21	
1-267	Me	Me	2-Me-4-シクロペンチルオキシ	B21	
1-268	Me	Me	2-Me-4-Ph	B21	97~102
1-269	Me	Me	2-Me-4-OPh	B21	
1-270	Me	Me	2-Me-4-OCOMe	B21	油状

10

20

30

40

【 0 1 6 4 】

【表 9】
第1表つづき

No.	R ¹	R ²	X	B	物性(融点°C)
1-271	Me	Me	2-Me-4-C≡CCMe ₃	B21	アモルファス
1-272	Me	Me	2-Me-4-OCH ₂ C≡CH	B21	
1-273	Me	Me	2-Me-4-OBu(sec)	B21	アメ状
1-274	Me	Me	2-Me-4-OCH([D 3])Me	B21	
1-275	Me	Me	2-Me-4-NH([D 3])Me	B21	
1-276	Me	Me	2-Me-4-C≡CPh	B21	アモルファス
1-277	Me	Me	2-Me-4-OCF ₂ CHFOCF ₃	B21	
1-278	Me	Me	2-Me-4-CN	B21	
1-279	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ C≡CCMe ₃	B21	
1-280	Me	Me	2-Me-4-C≡CMe	B21	
1-281	Me	Me	2-Me-4-C≡CH	B21	
1-282	Me	Me	2-Me-4-C≡CSiMe ₃	B21	アメ状
1-283	Me	Me	2-Me-4-[D 1]	B21	
1-284	Me	Me	2-Me-4-[D 2]	B21	
1-285	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ C≡CI	B21	
1-286	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ C≡CH	B21	
1-287	Me	Me	2-Me-4-CH=CF ₂	B21	
1-288	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ CH=CF ₂	B21	
1-289	Me	Me	2-Me-4-OCH ₂ CH=CCl ₂	B21	
1-290	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	B21	
1-291	Me	Me	2-Me-4-(CH ₂) ₅ CBrF ₂	B21	
1-292	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ C≡CI	B1	
1-293	Me	Et	3-Cl-4-Cl	B1	
1-294	Me	Et	3-Me-4-Cl	B1	
1-295	Me	Et	2-Me-4-OMe	B1	
1-296	Me	Et	2-Me-4-OEt	B1	
1-297	Me	Et	2-Me-4-OPr(i)	B1	
1-298	Me	Et	3-Cl-4-Br	B1	
1-299	Me	Et	3-Br-4-Cl	B1	
1-300	Me	Et	3-F-4-Cl	B1	
1-301	Me	Et	3-Me-4-Br	B1	
1-302	Et	Et	3-Cl-4-Cl	B1	
1-303	Et	Et	3-Me-4-Cl	B1	
1-304	Et	Et	2-Me-4-OEt	B1	
1-305	Et	Et	2-Me-4-OPr(i)	B1	

【 0 1 6 5 】

【表 10】
第1表つづき

No.	R ¹	R ²	X	B	物性(融点°C)
1-306	Me	Et	3-Cl-4-Cl	B16	
1-307	Me	Et	3-Me-4-Cl	B16	
1-308	Me	Et	2-Me-4-OMe	B16	
1-309	Me	Et	2-Me-4-OEt	B16	
1-310	Me	Et	2-Me-4-OPr(i)	B16	
1-311	Me	Et	3-Cl-4-Br	B16	
1-312	Me	Et	3-Br-4-Cl	B16	
1-313	Me	Et	3-F-4-Cl	B16	
1-314	Me	Et	3-Me-4-Br	B16	
1-315	Et	Et	3-Cl-4-Cl	B16	
1-316	Et	Et	3-Me-4-Cl	B16	
1-317	Et	Et	2-Me-4-OEt	B16	
1-318	Et	Et	2-Me-4-OPr(i)	B16	
1-319	Me	Et	3-Me-4-Cl	B21	
1-320	Me	Et	2-Me-4-OMe	B21	
1-321	Me	Et	2-Me-4-OEt	B21	
1-322	Me	Et	2-Me-4-OPr(i)	B21	
1-323	Me	Et	3-Cl-4-Br	B21	
1-324	Me	Et	3-Br-4-Cl	B21	
1-325	Me	Et	3-F-4-Cl	B21	
1-326	Me	Et	3-Me-4-Br	B21	
1-327	Et	Et	3-Cl-4-Cl	B21	
1-328	Et	Et	3-Me-4-Cl	B21	
1-329	Et	Et	2-Me-4-OEt	B21	
1-330	Et	Et	2-Me-4-OPr(i)	B21	
1-331	Me	Me	3-Me-4-Cl	B71	
1-332	Me	Me	2-Me-4-OMe	B71	
1-333	Me	Me	2-Me-4-OEt	B71	
1-334	Me	Me	2-Me-4-OPr(i)	B71	
1-335	Me	Me	3-Cl-4-Br	B71	
1-336	Me	Me	3-Br-4-Cl	B71	
1-337	Me	Me	3-F-4-Cl	B71	
1-338	Me	Me	3-Me-4-Br	B71	
1-339	Me	Me	2-Me-4-[D 4]	B21	
1-340	Me	Me	2-Me-4-[D 5]	B21	

10

20

30

40

【 0 1 6 6 】

【表 1 1】
第 1 表つづき

No.	R ¹	R ²	X	B	物性(融点℃)
1-341	Me	D3	3-Cl-4-Cl	B16	
1-342	Me	D3	3-Me-4-Cl	B16	
1-343	Me	D3	2-Me-4-OMe	B16	
1-344	Me	D3	2-Me-4-OEt	B16	
1-345	Me	D3	2-Me-4-OPr(i)	B16	
1-346	Me	D3	3-Cl-4-Br	B16	
1-347	Me	D3	3-Br-4-Cl	B16	
1-348	Me	D3	3-F-4-Cl	B16	
1-349	Me	D3	3-Me-4-Br	B16	
1-350	H	D3	3-Cl-4-Cl	B16	
1-351	H	D3	3-Me-4-Cl	B16	
1-352	H	D3	2-Me-4-OMe	B16	
1-353	H	D3	2-Me-4-OEt	B16	
1-354	H	D3	2-Me-4-OPr(i)	B16	
1-355	Me	D3	3-Cl-4-Cl	B21	
1-356	Me	D3	3-Me-4-Cl	B21	
1-357	Me	D3	2-Me-4-OMe	B21	
1-358	Me	D3	2-Me-4-OEt	B21	
1-359	Me	D3	2-Me-4-OPr(i)	B21	
1-360	Me	D3	3-Cl-4-Br	B21	
1-361	Me	D3	3-Br-4-Cl	B21	
1-362	Me	D3	3-F-4-Cl	B21	
1-363	Me	D3	3-Me-4-Br	B21	
1-364	H	D3	3-Cl-4-Cl	B21	
1-365	H	D3	3-Me-4-Cl	B21	
1-366	H	D3	2-Me-4-OMe	B21	
1-367	H	D3	2-Me-4-OEt	B21	
1-368	H	D3	2-Me-4-OPr(i)	B21	
1-369	Me	CH ₂ F	3-Cl-4-Cl	B21	
1-370	Me	CH ₂ F	3-Me-4-Cl	B21	
1-371	Me	CH ₂ Cl	2-Me-4-OMe	B21	
1-372	Me	CH ₂ F	2-Me-4-OEt	B21	
1-373	Me	CH ₂ F	2-Me-4-OPr(i)	B21	
1-374	CH ₂ F	CH ₂ F	2-Me-4-OEt	B21	
1-375	CH ₂ F	CH ₂ F	2-Me-4-OPr(i)	B21	

10

20

30

40

【 0 1 6 7 】

【表 1 2】

第1表つづき

No.	R ¹	R ²	X	B	物性(融点°C)
1-376	Me	Me	4-SMe	B16	
1-377	Me	Me	4-SOMe	B16	
1-378	Me	Me	4-SO ₂ Me	B16	
1-379	Me	Me	4-SO ₂ CF ₃	B16	
1-380	Me	Me	4-SO ₂ NMe ₂	B16	
1-381	Me	Me	4-CH ₂ CH=CH ₂	B16	
1-382	Me	Me	4-CH ₂ NHMe	B16	
1-383	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ NHMe	B21	
1-384	Me	Me	2-Me-4-OCH ₂ CN	B21	
1-385	Me	Me	2-Me-4-NHCH ₂ CN	B21	
1-386	Me	Me	2-Me-4-SCH ₂ CN	B21	
1-387	Me	Me	4-OCH ₂ CH=CH ₂	B16	
1-388	Me	Me	4-SCH ₂ CH=CH ₂	B16	
1-389	Me	Me	4-OCH ₂ C≡CH	B16	
1-390	Me	Me	4-SCH ₂ C≡CH	B16	
1-391	Me	Me	4-OCH ₂ C≡CI	B16	
1-392	Me	Me	4-SCH ₂ C≡CI	B16	
1-393	Me	Me	2-Me-4-OCF ₂ CHFOMe	B21	
1-394	Me	Me	4-S-CH ₂ CH=CF ₂	B16	
1-395	Me	Me	4-SOCHF ₂	B16	
1-396	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ OCHF ₂	B21	
1-397	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ NH ₂	B21	
1-398	Me	Me	2-Me-4-SCHF ₂	B21	
1-399	Me	Me	2-Me-4-SOCHF ₂	B21	
1-400	Me	Me	2-Me-4-SO ₂ CHF ₂	B21	
1-401	Me	Me	2-Me-4-OCH ₂ CH ₂ SMe	B21	
1-402	Me	Me	2-Me-4-OCH ₂ CH ₂ NHMe	B21	
1-403	Me	Me	2-Me-4-OCH ₂ CH ₂ NMe ₂	B21	
1-404	Me	Me	2-Me-4-NH-[D 3]	B21	
1-405	Me	Me	2-Me-4-S-[D 3]	B21	
1-406	Me	Me	2-Me-4-OCH ₂ CH ₂ OCHF ₂	B71	
1-407	Me	Me	4-CH=NOCH ₂ CH=CH ₂	B1	
1-408	Me	Me	4-CH=NOCH ₂ C≡CH	B1	
1-409	Me	Me	4-CH=NCO ₂ Me	B1	
1-410	Me	Me	2-Me-4-CH=NMe	B21	

10

20

30

40

【 0 1 6 8 】

【表 13】

第1表つづき

No.	R ¹	R ²	X	B	物性(融点°C)
1-411	Me	Me	2-Me-4-CH=N-OMe	B21	
1-412	Me	Me	4-[D 6]	B71	
1-413	Me	Me	2-Me-4-OCOCF ₃	B21	
1-414	Me	Me	2-Me-4-OCO ₂ Me	B16	
1-415	Me	Me	2-Me-4-OCONMe ₂	B16	
1-416	Me	Me	2-Me-4-OCOSPh	B16	
1-417	Me	Me	2-Me-4-OCSOMe	B14	
1-418	Me	Me	2-Me-4-OCS ₂ Me	B14	
1-419	Me	Me	2-Me-4-OCSNMe ₂	B14	
1-420	Me	Me	2-Me-4-OSCCl ₃	B14	
1-421	Me	Me	2-Me-4-OSO ₂ Me	B14	
1-422	Me	Me	2-Me-4-OSO ₂ CF ₃	B14	
1-423	Me	Me	2-Me-4-OSO ₂ Ph	B14	
1-424	Me	Me	2-Me-4-OSNMe ₂	B14	
1-425	Me	Me	2-Me-4-OSO ₂ NMe ₂	B14	
1-426	Me	Me	2-Me-4-NH ₂	B14	
1-427	Me	Me	2-Me-4-NH ₂ · HCl	B14	
1-428	Me	Me	2-Me-4-NHMe	B14	
1-429	Me	Me	2-Me-4-NMe ₂	B14	
1-430	Me	Me	2-Me-4-NHCOMe	B14	
1-431	Me	Me	2-Me-4-NHCOBu(t)	B14	
1-432	Me	Me	2-Me-4-NHCOCF ₃	B14	
1-433	Me	Me	2-Me-4-NHCO ₂ Me	B14	
1-434	Me	Me	2-Me-4-N(Me)CO ₂ Me	B14	
1-435	Me	Me	2-Me-4-NHCONMe ₂	B14	
1-436	Me	Me	2-Me-4-NHCOSMe	B14	
1-437	Me	Me	2-Me-4-NHCSOMe	B14	
1-438	Me	Me	2-Me-4-NHCS ₂ Me	B14	
1-439	Me	Me	2-Me-4-NHCSNMe ₂	B14	
1-440	Me	Me	2-Me-4-NHCS ₂ Ph	B14	
1-441	Me	Me	2-Me-4-NHSCCl ₃	B14	
1-442	Me	Me	2-Me-4-NHSOMe	B14	
1-443	Me	Me	2-Me-4-NHSO ₂ Me	B14	
1-444	Me	Me	2-Me-4-NHSO ₂ Ph	B14	
1-445	Me	Me	2-Me-4-NHCOPh	B14	

10

20

30

40

【 0 1 6 9 】

【表 1 4】
第 1 表つづき

No.	R ¹	R ²	X	B	物性(融点°C)
1-446	Me	Me	4-CO ₂ Me	B14	
1-447	Me	Me	4-CO ₂ Et	B14	
1-448	Me	Me	4-CO ₂ H	B14	
1-449	Me	Me	4-CONH ₂	B14	
1-450	Me	Me	4-CONMe ₂	B14	
1-451	Me	Me	4-CONHMe	B14	
1-452	Me	Me	2-Me-4-SCH ₂ CF ₃	B21	
1-453	Me	Me	2-Me-4-NHCH ₂ CF ₃	B21	
1-454	Me	Me	2-Me-4-SCHF ₂	B21	
1-455	Me	Me	2-Me-4-SO ₂ CH ₂ CF ₃	B21	
1-456	Me	Me	2-Me-4-OCN	B21	
1-457	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ CO ₂ Me	B21	
1-458	Me	Me	2-Me-4-OPh	B21	
1-459	Me	Me	2-Me-4-Ph	B21	
1-460	Me	Me	2-Me-4-C≡CCO ₂ Me	B21	
1-461	Me	Me	2-Me-4-C≡CCO ₂ H	B21	
1-462	Me	Me	2-Me-4-C≡CCH ₂ OH	B21	
1-463	Me	Me	2-Me-4-C≡CCH ₂ Br	B21	
1-464	Me	Me	2-Me-4-C≡CCH ₂ NH ₂ · HCl	B21	
1-465	Me	Me	2-Me-4-[D 7]	B21	
1-466	Me	Me	2-Me-4-C≡COEt	B21	
1-467	Me	Me	2-Me-4-C≡CCH ₂ OMe	B21	
1-468	Me	Me	2-Me-4-C≡C-[D 4]	B21	
1-469	Me	Me	2-Me-4-OCH ₂ -[D 4]	B21	
1-470	Me	Me	2-Me-4-[D 5]	B14	
1-471	Me	Me	2-Me-4-[D 4]	B14	
1-472	Me	Me	2-Me-4-CH=CH-[D 4]	B21	
1-473	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ -[D 4]	B21	
1-474	Me	Me	2-Me-4-OC≡C-[D 4]	B21	
1-475	Me	Me	2-Me-4-OCH=CH-[D 4]	B21	
1-476	Me	Me	4-Me	B62	
1-477	Me	Me	4-Me	B25	
1-478	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B80	
1-479	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B81	
1-480	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B82	

10

20

30

40

【 0 1 7 0 】

【表 15】
第1表つづき

No.	R ¹	R ²	X	B	物性(融点°C)
1-481	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B83	
1-482	Me	Me	3-Me-4-Cl	B84	
1-483	Me	Me	2-Me-4-OMe	B85	
1-484	Me	Me	2-Me-4-OEt	B86	
1-485	Me	Me	2-Me-4-OPr(i)	B87	
1-486	Me	Me	3-Cl-4-Br	B88	
1-487	Me	Me	3-Br-4-Cl	B89	
1-488	Me	Me	3-F-4-Cl	B90	
1-489	Me	Me	3-Me-4-Br	B91	
1-490	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B92	
1-491	Me	Me	3-Me-4-Cl	B93	
1-492	Me	Me	2-Me-4-OMe	B94	
1-493	Me	Me	2-Me-4-OEt	B95	
1-494	Me	Me	2-Me-4-OPr(i)	B96	
1-495	Me	Me	3-Cl-4-Br	B97	
1-496	Me	Me	3-Br-4-Cl	B98	
1-497	Me	Me	3-F-4-Cl	B99	
1-498	Me	Me	3-Me-4-Br	B100	
1-499	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B101	
1-500	Me	Me	3-Me-4-Cl	B102	
1-501	Me	Me	2-Me-4-OMe	B103	
1-502	Me	Me	2-Me-4-OEt	B104	
1-503	Me	Me	2-Me-4-OPr(i)	B105	
1-504	Me	Me	3-Cl-4-Br	B106	
1-505	Me	Me	3-Br-4-Cl	B107	
1-506	Me	Me	3-F-4-Cl	B108	
1-507	Me	Me	3-Me-4-Br	B109	
1-508	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B110	
1-509	Me	Me	3-Me-4-Cl	B111	
1-510	Me	Me	2-Me-4-OMe	B112	
1-511	Me	Me	2-Me-4-OEt	B113	
1-512	Me	Me	2-Me-4-OPr(i)	B114	
1-513	Me	Me	3-Cl-4-Br	B115	
1-514	Me	Me	3-Br-4-Cl	B116	
1-515	Me	Me	3-F-4-Cl	B117	
1-516	Me	Me	2-Br-5-OMe	B21	油状
1-517	Me	Me	2-Me-4-OCH(Me)OMe	B16	

10

20

30

40

【 0 1 7 1 】

【表 16】

第1表つづき

No.	R ¹	R ²	X	B	物性(融点℃)
1-518	Me	Me	4-CH ₂ Br	B25	アメ状
1-519	Me	Me	4-CH ₂ Br	B62	108~111
1-520	Me	Me	4-CH ₂ OMe	B25	97~102
1-521	Me	Me	4-CH ₂ NMe ₂	B25	アメ状
1-522	Me	Me	2-Me-4-OCH ₂ Ph	B14	
1-523	Me	CH ₂ Cl	3-F-4-Cl	B1	
1-524	Me	CH ₂ Cl	3-Me-4-Br	B14	
1-525	Me	CH ₂ Cl	3-Cl-4-Cl	B16	
1-526	Me	CH=CH ₂	3-Me-4-Cl	B21	
1-527	Me	CH=CH ₂	2-Me-4-OMe	B1	
1-528	Me	CH=CH ₂	2-Me-4-OEt	B14	
1-529	Me	C≡CH	2-Me-4-OPr(i)	B16	
1-530	Me	C≡CH	3-Cl-4-Br	B21	
1-531	Me	C≡CH	3-Br-4-Cl	B1	
1-532	Me	CH ₂ OMe	3-F-4-Cl	B14	
1-533	Me	CH ₂ OMe	3-Me-4-Br	B16	
1-534	Me	CH ₂ OMe	3-Cl-4-Cl	B21	
1-535	Me	Me	3-OMe-4-OMe	B21	138~140
1-536	Me	Me	2-Br	B21	アメ状
1-537	Me	Me	4-SPh	B1	
1-538	Me	Me	4-CH ₂ OMe	B62	74~76
1-539	Me	Me	4-CH ₂ NMe ₂	B62	アメ状
1-540	Me	Me	4-CH ₂ OMe	B21	117~119
1-541	Me	Me	4-CH ₂ SMe	B21	
1-542	Me	Me	4-CH ₂ NMe ₂	B21	
1-543	Me	Me	2-Me-4-Ph(4-Cl)	B21	
1-544	Me	Me	2-Me-4-Ph(4-OMe)	B21	
1-545	Me	Me	2-Me-4-CH=CHCMe ₃	B16	
1-546	Me	Me	2-Me-4-Ph(4-CF ₃)	B21	
1-547	Me	Me	2-Me-4-CH=CHPh	B14	
1-548	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ SO ₂ Me	B21	
1-549	Me	Me	4-Me	B25	96~98
1-550	Me	Me	4-Me	B62	98~102
1-551	Me	Me	4-SCO ₂ Me	B1	
1-552	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ CN	B16	
1-553	Me	Me	4-NHPh	B1	
1-554	Me	Me	2-Me-4-OBu(t)	B21	

10

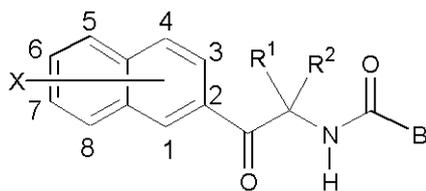
20

30

40

【 0 1 7 2 】

【表 17】



第2表

No.	R ¹	R ²	X	B	物性(融点°C)
2-1	Me	Me	H	B1	145~147
2-2	Me	Me	H	B16	159~161
2-3	Me	Me	H	B7	152~154
2-4	Me	Me	H	B2	固体
2-5	Me	Et	H	B1	
2-6	Me	Et	H	B16	
2-7	Me	Et	H	B21	
2-8	-(CH ₂) ₅ -		H	B16	
2-9	Me	Me	H	B12	225~226
2-10	Me	Me	H	B5	159~160
2-11	Me	Me	H	B8	196~198
2-12	Me	Me	H	B13	195~197
2-13	Me	Me	H	B15	158~160
2-14	Me	Me	H	B21	163~164
2-15	-(CH ₂) ₅ -		H	B21	
2-16	Me	Et	H	B1	
2-17	Me	Et	H	B5	
2-18	Me	Et	H	B8	
2-19	Me	Et	H	B11	
2-20	Me	Et	H	B14	
2-21	Me	Et	H	B15	
2-22	Me	Et	H	B16	
2-23	Me	Et	H	B21	
2-24	Me	Me	1-Me	B1	
2-25	Me	Me	3-Me	B5	
2-26	Me	Me	4-Me	B8	
2-27	Me	Me	5-Me	B14	
2-28	Me	Me	6-Me	B15	
2-29	Me	Me	7-Me	B16	
2-30	Me	Me	8-Me	B21	

【 0 1 7 3 】

10

20

30

40

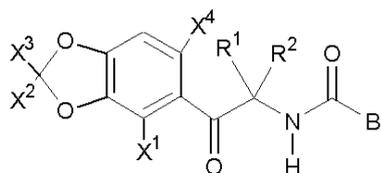
【表 1 8】

第2表つづき

No.	R ¹	R ²	X	B	物性(融点℃)
2-31	Me	Me	H	B48	
2-32	Me	Me	H	B49	
2-33	Me	Me	H	B19	
2-34	Me	Me	H	B20	
2-35	Me	Me	H	B50	
2-36	Me	Me	1-Me	B21	
2-37	Me	Me	1-Me	B16	

【 0 1 7 4 】

【表 19】



第3表

No.	R ¹	R ²	X ¹	X ²	X ³	X ⁴	B	物性(融点°C)
3-1	Me	Me	H	H	H	H	B1	127~128
3-2	Me	Me	H	H	H	H	B16	130~132
3-3	Me	Me	H	H	H	H	B21	155~158
3-4	Me	Me	H	F	F	H	B1	124~126
3-5	Me	Me	H	F	F	H	B16	
3-6	Me	Me	H	F	F	H	B21	116~118
3-7	Me	Me	Me	H	H	H	B1	
3-8	Me	Me	Me	H	H	H	B16	
3-9	Me	Me	Me	H	H	H	B21	98~102
3-10	Me	Me	Me	F	F	H	B1	99~107
3-11	Me	Me	Me	F	F	H	B16	
3-12	Me	Me	Me	F	F	H	B21	145~148
3-13	Me	Me	Cl	H	H	H	B1	
3-14	Me	Me	Cl	H	H	H	B16	
3-15	Me	Me	Cl	H	H	H	B21	
3-16	Me	Me	Cl	F	F	H	B1	
3-17	Me	Me	Cl	F	F	H	B16	
3-18	Me	Me	Cl	F	F	H	B21	
3-19	Me	Me	Me	F	F	H	B8	142~145
3-20	Me	Me	Me	F	F	H	B5	104~108
3-21	-(CH ₂) ₅ -		H	F	F	H	B21	
3-22	-(CH ₂) ₅ -		Me	F	F	H	B1	
3-23	Me	Me	H	F	F	H	B5	158~160
3-24	Me	Me	Me	F	F	H	B47	97~99
3-25	Me	Me	H	F	F	Me	B21	85~90
3-26	Me	Me	H	H	H	Me	B21	111~114
3-27	Me	Me	Me	Me	Me	H	B21	
3-28	Me	Me	Me	Me	H	H	B21	
3-29	Me	Me	Me	Et	H	H	B21	
3-30	Me	Me	Me	D3	H	H	B21	

10

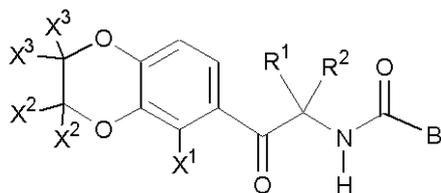
20

30

40

【 0 1 7 5 】

【表 20】



第4表

No.	R ¹	R ²	X ¹	X ²	X ³	B	物性(融点°C)
4-1	Me	Me	H	H	H	B1	
4-2	Me	Me	H	H	H	B5	
4-3	Me	Me	H	H	H	B8	
4-4	Me	Me	H	H	H	B16	
4-5	Me	Me	H	H	H	B21	
4-6	Me	Me	H	F	F	B1	
4-7	Me	Me	H	F	F	B5	
4-8	Me	Me	H	F	F	B8	
4-9	Me	Me	H	F	F	B11	
4-10	Me	Me	H	F	F	B21	120~122
4-11	Me	Me	Me	H	H	B1	
4-12	Me	Me	Me	H	H	B4	
4-13	Me	Me	Me	H	H	B8	
4-14	Me	Me	Me	H	H	B16	
4-15	Me	Me	Me	H	H	B21	
4-16	Me	Me	Me	F	F	B1	
4-17	Me	Me	Me	F	F	B15	
4-18	Me	Me	Me	F	F	B10	
4-19	Me	Me	Me	F	F	B21	74~78
4-20	Me	Me	Me	F	F	B25	
4-21	Me	Me	Me	H	Me	B21	
4-22	Me	Me	Me	H	Me	B16	
4-23	Me	Me	Me	H	Me	B14	
4-24	Me	Me	Me	Me	H	B1	
4-25	Me	Me	Me	Me	H	B5	
4-26	Me	Me	Me	Me	H	B8	
4-27	Me	Me	Me	H	Me	B1	
4-28	Me	Me	Me	H	Me	B5	
4-29	Me	Me	Me	H	Me	B8	
4-30	Me	Me	Me	H	Me	B71	

10

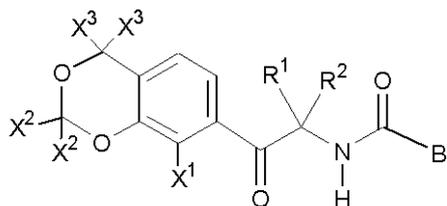
20

30

40

【 0 1 7 6 】

【表 2 1】



第5表

No.	R ¹	R ²	X ¹	X ²	X ³	B	物性(融点℃)
5-1	Me	Me	H	H	H	B1	
5-2	Me	Me	H	H	H	B5	
5-3	Me	Me	H	H	H	B7	
5-4	Me	Me	H	H	H	B14	
5-5	Me	Me	H	H	H	B15	
5-6	Me	Me	Me	H	H	B1	
5-7	Me	Me	Me	H	H	B5	
5-8	Me	Me	Me	H	H	B8	
5-9	Me	Me	Me	H	H	B11	
5-10	Me	Me	Me	H	H	B21	
5-11	Me	Me	H	F	F	B1	
5-12	Me	Me	H	F	F	B4	
5-13	Me	Me	H	F	F	B8	
5-14	Me	Me	H	F	F	B16	
5-15	Me	Me	H	F	F	B21	
5-16	Me	Me	Me	F	F	B1	
5-17	Me	Me	Me	F	F	B15	
5-18	Me	Me	Me	F	F	B10	
5-19	Me	Me	Me	F	F	B21	
5-20	Me	Me	Me	F	F	B25	
5-21	Me	Me	Me	H	Me	B21	
5-22	Me	Me	Me	H	Me	B16	
5-23	Me	Me	Me	H	Me	B14	
5-24	Me	Me	Me	F	H	B1	
5-25	Me	Me	Me	F	H	B5	
5-26	Me	Me	Me	F	H	B8	
5-27	Me	Me	Me	Me	H	B14	
5-28	Me	Me	Me	Me	H	B16	
5-29	Me	Me	Me	Me	H	B21	
5-30	Me	Me	Me	Me	Me	B21	

10

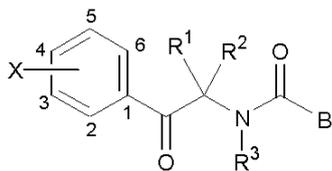
20

30

40

【 0 1 7 7 】

【表 2 2】

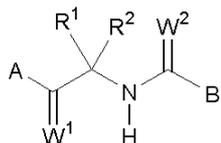


第 6 表

No.	R ¹	R ²	R ³	X	B	物性(融点°C)
6-1	Me	Me	CO ₂ Bu(t)	4-Br	B21	油状
6-2	Me	Me	COMe	4-Br	B21	油状
6-3	Me	Me	COMe	3-Cl-4-Cl	B21	油状
6-4	Me	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B1	147~150
6-5	Me	Me	CO ₂ Bu(t)	3-Cl-4-Cl	B21	66~68
6-6	Me	Me	SCCl ₃	3-Br-4-Cl	B1	
6-7	Me	Me	SPh	3-Cl-4-Br	B5	
6-8	Me	Me	SOPh	3-Me-4-Br	B8	
6-9	Me	Me	SO ₂ Ph	3-Me-4-Cl	B14	
6-10	Me	Me	SO ₂ Me	3-Cl-4-Cl	B16	
6-11	Me	Me	SO ₂ CF ₃	3-F-4-Cl	B21	
6-12	Me	Me	SO ₂ NMe ₂	2-Me-4-OMe	B71	
6-13	Me	Me	CH ₂ OMe	2-Me-4-OEt	B1	
6-14	Me	Me	CH ₂ SMe	2-Me-4-OPr(i)	B5	
6-15	Me	Me	CN	3-Br-4-Br	B8	
6-16	Me	Me	CHO	2-Me-4-Cl	B14	
6-17	Me	Me	CH ₂ CF ₃	2-Me-4-Br	B16	
6-18	Me	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Br-4-Cl	B21	
6-19	Me	Me	D 3	3-Cl-4-Br	B71	
6-20	Me	Me	OH	3-Me-4-Br	B1	
6-21	Me	Me	CO ₂ CH ₂ Ph	3-Me-4-Cl	B5	
6-22	Me	Me	CO ₂ CH ₂ OMe	3-Cl-4-Cl	B8	
6-23	Me	Me	COPh	3-Cl-4-Cl	B14	
6-24	Me	Me	COCF ₃	3-Cl-4-Cl	B16	
6-25	Me	Me	CH ₂ C≡CH	3-Cl-4-Cl	B21	
6-26	Me	Me	CH ₂ CH=CH ₂	3-F-4-Cl	B71	
6-27	Me	Me	CH ₂ CN	2-Me-4-OMe	B1	
6-28	Me	Me	シクロヘンチルオキシ	2-Me-4-OEt	B5	
6-29	Me	Me	CH ₂ CH ₂ OCHF ₂	2-Me-4-OPr(i)	B8	
6-30	Me	Me	CH ₂ CH ₂ NH ₂	3-Br-4-Br	B14	
6-31	Me	Me	CH ₂ CH ₂ NHMe	2-Me-4-Cl	B16	
6-32	Me	Me	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	2-Me-4-Br	B21	

【 0 1 7 8 】

【表 2 3】



第 7 表

No.	A	W ¹	R ¹	R ²	W ²	B	物性(融点℃)
7-1	2-チエニル	O	Me	Me	O	B1	101~105
7-2	2-チエニル	O	Me	Me	O	B21	118~121
7-3	3-チエニル	O	Me	Me	O	B1	121~125
7-4	5-Cl-3-チエニル	O	Me	Me	O	B21	138~142
7-5	2-Cl-5-Cl-3-チエニル	O	Me	Me	O	B21	119~121
7-6	5-Cl-2-チエニル	O	Me	Me	O	B21	127~132
7-7	5-Cl-2-チエニル	O	Me	Me	O	B1	115~120
7-8	4-Cl-2-チエニル	O	Me	Me	O	B21	119~121
7-9	4-Cl-2-チエニル	O	Me	Me	O	B1	油状
7-10	1-ナフチル	O	Me	Me	O	B48	
7-11	1-ナフチル	O	Me	Me	O	B49	
7-12	1-ナフチル	O	Me	Me	O	B19	
7-13	1-ナフチル	O	Me	Me	O	B20	
7-14	1-ナフチル	O	Me	Me	O	B50	
7-15	1-ナフチル	O	Me	Me	O	B12	
7-16	1-ナフチル	O	Me	Me	O	B13	
7-17	2-チエニル	O	Me	Me	O	B48	
7-18	2-チエニル	O	Me	Me	O	B49	
7-19	2-チエニル	O	Me	Me	O	B19	
7-20	2-チエニル	O	Me	Me	O	B20	
7-21	2-チエニル	O	Me	Me	O	B50	
7-22	2-チエニル	O	Me	Me	O	B12	
7-23	2-チエニル	O	Me	Me	O	B13	
7-24	3-チエニル	O	Me	Me	O	B48	
7-25	3-チエニル	O	Me	Me	O	B49	
7-26	3-チエニル	O	Me	Me	O	B19	
7-27	3-チエニル	O	Me	Me	O	B20	
7-28	3-チエニル	O	Me	Me	O	B50	
7-29	3-チエニル	O	Me	Me	O	B12	
7-30	3-チエニル	O	Me	Me	O	B13	

【 0 1 7 9 】

10

20

30

40

【表 2 4】

第7表 (つづき)

No.	A	W ¹	R ¹	R ²	W ²	B	物性(融点°C)
7-31	2-ヒ°リジ°ル	O	Me	Me	O	B48	
7-32	2-ヒ°リジ°ル	O	Me	Me	O	B49	
7-33	2-ヒ°リジ°ル	O	Me	Me	O	B19	
7-34	2-ヒ°リジ°ル	O	Me	Me	O	B20	
7-35	2-ヒ°リジ°ル	O	Me	Me	O	B50	
7-36	2-ヒ°リジ°ル	O	Me	Me	O	B12	
7-37	2-ヒ°リジ°ル	O	Me	Me	O	B13	
7-38	3-ヒ°リジ°ル	O	Me	Me	O	B48	
7-39	3-ヒ°リジ°ル	O	Me	Me	O	B49	
7-40	3-ヒ°リジ°ル	O	Me	Me	O	B19	
7-41	3-ヒ°リジ°ル	O	Me	Me	O	B20	
7-42	3-ヒ°リジ°ル	O	Me	Me	O	B50	
7-43	3-ヒ°リジ°ル	O	Me	Me	O	B12	
7-44	4-ヒ°リジ°ル	O	Me	Me	O	B13	
7-45	4-ヒ°リジ°ル	O	Me	Me	O	B48	
7-46	4-ヒ°リジ°ル	O	Me	Me	O	B49	
7-47	4-ヒ°リジ°ル	O	Me	Me	O	B19	
7-48	4-ヒ°リジ°ル	O	Me	Me	O	B20	
7-49	4-ヒ°リジ°ル	O	Me	Me	O	B50	
7-50	4-ヒ°リジ°ル	O	Me	Me	O	B12	
7-51	4-ヒ°リジ°ル	O	Me	Me	O	B13	
7-52	イント°-ル-3-イル	O	Me	Me	O	B48	
7-53	イント°-ル-3-イル	O	Me	Me	O	B49	
7-54	イント°-ル-3-イル	O	Me	Me	O	B19	
7-55	イント°-ル-3-イル	O	Me	Me	O	B20	
7-56	イント°-ル-3-イル	O	Me	Me	O	B50	
7-57	イント°-ル-3-イル	O	Me	Me	O	B12	
7-58	イント°-ル-3-イル	O	Me	Me	O	B13	
7-59	N-Me-イント°-ル-3-イル	O	Me	Me	O	B48	
7-60	N-Me-イント°-ル-3-イル	O	Me	Me	O	B49	

10

20

30

【 0 1 8 0 】

【表 25】

第7表 (つづき)

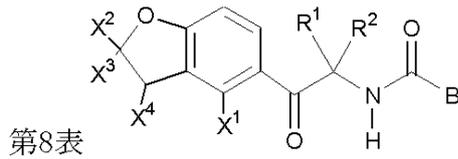
No.	A	W ¹	R ¹	R ²	W ²	B	物性(融点°C)
7-61	N-Me-イントール-3-イル	O	Me	Me	O	B19	
7-62	N-Me-イントール-3-イル	O	Me	Me	O	B20	
7-63	N-Me-イントール-3-イル	O	Me	Me	O	B50	
7-64	N-Me-イントール-3-イル	O	Me	Me	O	B12	
7-65	N-Me-イントール-3-イル	O	Me	Me	O	B13	
7-66	3-チエンル	O	Me	Me	O	B21	131~133
7-67	Ph(3,4-Cl ₂)	S	Me	Me	O	B21	
7-68	Ph(3,4-Cl ₂)	O	Me	Me	S	B21	
7-69	2-Cl-5-tertリジール	O	Me	Me	O	B21	
7-70	3-tertリジール	O	Me	Me	O	B21	
7-71	2-OMe-5-tertリジール	O	Me	Me	O	B21	
7-72	2-Cl-5-tertリジール	O	Me	Me	O	B16	
7-73	2-OMe-5-tertリジール	O	Me	Me	O	B16	
7-74	5-OMe-2-tertリジール	O	Me	Me	O	B21	
7-75	5-OMe-2-tertリジール	O	Me	Me	O	B16	
7-76	5-Cl-2-tertリジール	O	Me	Me	O	B21	
7-77	5-Cl-2-tertリジール	O	Me	Me	O	B16	

10

20

【 0 1 8 1 】

【表 2 6】



No.	R ¹	R ²	X ¹	X ²	X ³	X ⁴	B	物性(融点°C)
8-1	Me	Me	Me	F	F	H	B1	
8-2	Me	Me	Me	F	F	H	B5	
8-3	Me	Me	Me	F	F	H	B8	
8-4	Me	Me	Me	F	F	H	B14	
8-5	Me	Me	Me	F	F	H	B16	
8-6	Me	Me	Me	F	F	H	B21	
8-7	Me	Me	Me	F	F	H	B71	
8-8	Me	Me	Me	H	H	H	B1	
8-9	Me	Me	Me	H	H	H	B14	
8-10	Me	Me	Me	H	H	H	B16	
8-11	Me	Me	Me	Me	H	H	B1	
8-12	Me	Me	Me	Me	H	H	B5	
8-13	Me	Me	Me	Me	H	H	B8	
8-14	Me	Me	Me	Me	H	H	B14	
8-15	Me	Me	Me	Me	H	H	B16	
8-16	Me	Me	Me	Me	H	H	B21	
8-17	Me	Me	Me	Me	H	H	B71	
8-18	Me	Me	Me	Me	Me	H	B1	
8-19	Me	Me	Me	Me	Me	H	B5	
8-20	Me	Me	Me	Me	Me	H	B8	
8-21	Me	Me	Me	Me	Me	H	B14	
8-22	Me	Me	Me	Me	Me	H	B16	
8-23	Me	Me	Me	Me	Me	H	B21	
8-24	Me	Me	Me	Me	Me	H	B71	
8-25	Me	Me	H	F	F	H	B5	
8-26	Me	Me	H	F	F	H	B8	
8-27	Me	Me	Me	F	F	Me	B14	
8-28	Me	Me	Me	F	F	Me	B16	
8-29	Me	Me	Me	Me	H	Me	B21	
8-30	Me	Me	Me	Me	Me	Me	B71	

10

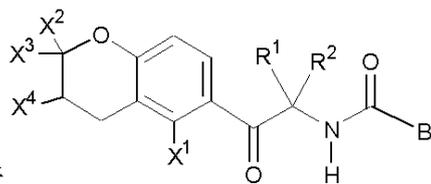
20

30

40

【 0 1 8 2 】

【表 27】



第9表

No.	R ¹	R ²	X ¹	X ²	X ³	X ⁴	B	物性(融点°C)
9-1	Me	Me	Me	F	F	H	B1	
9-2	Me	Me	Me	F	F	H	B5	
9-3	Me	Me	Me	F	F	H	B8	
9-4	Me	Me	Me	F	F	H	B14	
9-5	Me	Me	Me	F	F	H	B16	
9-6	Me	Me	Me	F	F	H	B21	
9-7	Me	Me	Me	F	F	H	B71	
9-8	Me	Me	Me	H	H	H	B1	
9-9	Me	Me	Me	H	H	H	B14	
9-10	Me	Me	Me	H	H	H	B16	
9-11	Me	Me	Me	Me	H	H	B1	
9-12	Me	Me	Me	Me	H	H	B5	
9-13	Me	Me	Me	Me	H	H	B8	
9-14	Me	Me	Me	Me	H	H	B14	
9-15	Me	Me	Me	Me	H	H	B16	
9-16	Me	Me	Me	Me	H	H	B21	
9-17	Me	Me	Me	Me	H	H	B71	
9-18	Me	Me	Me	Me	Me	H	B1	
9-19	Me	Me	Me	Me	Me	H	B5	
9-20	Me	Me	Me	Me	Me	H	B8	
9-21	Me	Me	Me	Me	Me	H	B14	
9-22	Me	Me	Me	Me	Me	H	B16	
9-23	Me	Me	Me	Me	Me	H	B21	
9-24	Me	Me	Me	Me	Me	H	B71	
9-25	Me	Me	H	F	F	H	B5	
9-26	Me	Me	H	F	F	H	B8	
9-27	Me	Me	Me	F	F	Me	B14	
9-28	Me	Me	Me	F	F	Me	B16	
9-29	Me	Me	Me	Me	H	Me	B21	
9-30	Me	Me	Me	Me	Me	Me	B71	

【 0 1 8 3 】

10

20

30

40

【表 28】

第 10 表

No.	¹ H-NMR δ ppm (Solvent : CDCl ₃ / 400MHz)	
1-21	1.73(s,6H),6.97(d,1H),7.42(m,2H),7.59(s,1H), 7.84(dd,1H),8.10(d,1H)	
1-24	1.56(s,6H),1.71(s,3H),6.44(s,1H),6.71(dd,1H),7.30(d,1H), 7.41(d,1H),7.82(dd,1H),8.08(d,1H)	
1-28	1.76(s,6H),2.34(s,3H),2.40(s,3H),6.83(m,2H),7.23(m,3H), 7.74(m,3H)	
1-29	1.74(s,6H),2.33(s,3H),6.51(s,1H),6.83(d,1H),7.22(d,1H), 7.50(t,1H),7.70(d,1H),8.18(d,1H),8.26(s,1H)	10
1-46	1.73(s,6H),3.88(s,3H),6.75(s,1H),7.45(d,1H),7.83(m,2H), 8.10(d,1H)	
1-76	1.71(s,6H),6.70(t,1H),6.90(d,1H),7.42(m,3H),7.81(dd,1H), 8.06(d,1H)	
1-120	1.72(s,6H),2.24(s,3H),2.35(s,3H),2.47(s,3H),6.80(s,1H), 6.86(d,1H),7.20(d,2H),7.25(d,1H)	
1-121	1.76(s,6H),2.34(s,3H),2.53(s,3H),6.88(d,1H),6.94(s,1H), 7.09(d,1H),7.24(d,1H),7.28(d,1H)	20
1-123	1.50(d,3H),2.26 (s,3H) ,2.56(s,3H),5.66(m,1H),6.70(bd,1H), 7.48(bd,1H),7.96(d,2H)	
1-136	1.81(s,6H),2.24(s,3H),2.39(s,3H),6.78(d,1H),6.83(d,1H), 7.20(d,1H),7.22(m,2H),7.40(d,2H),8.03(d,2H)	
1-140	1.73(s,6H),2.24(s,3H),2.47(s,3H),6.58(s,1H),6.75(d,1H), 7.15(d,1H),7.22(d,1H),7.33(d,1H),7.54(d,1H),7.63(dd,1H), 7.91(dd,1H),8.21(d,1H)	
1-143	1.76(s,3H),2.17(s,3H),2.36(s,3H),6.71(s,1H),6.83(d,1H), 7.00(d,1H),7.10(d,1H),7.20(d,1H),7.41(d,1H),7.47(d,1H), 7.93(dd,1H),7.96(d,1H)	30
1-144	1.77(s,6H),2.38(s,3H),6.45(d,1H),6.67(d,1H),6.83(d,1H), 7.22(d,1H),7.40(d,1H),7.47(d,1H),7.75(dd,1H),7.83(dd,1H), 8.26 (d, 1H)	
1-148	1.72 (s, 6H) , 2.53 (s, 3H) , 2.65 (s, 3H) , 6.38 (s, 1H) , 7.44 (d, 1H) , 7.89 (dd, 1H) , 8.05 (d, 1H)	
1-149	1.74 (s, 6H) , 7.45 (d, 1H) , 7.74 (s, 1H) , 7.82 (dd, 1H) , 8.07 (d, 1H)	
1-157	1.76(s,6H),7.38(d,1H),7.55(d,1H),7.59(d,1H),7.83(dd,1H), 8.09(d,1H),9.98(s,1H)	
1-179	1.72 (s, 6H) , 2.21 (s, 3H) , 2.22 (s, 3H) , 2.45 (s, 3H) , 6.50 (t, 1H) , 6.78(s,1H),6.85(d,1H),6.91(d,1H),7.25(m,2H)	40
1-181	1.32 (d, 6H) , 1.72 (s, 6H) , 2.36 (s, 3H) , 2.46 (s, 3H) , 2.80 (m, 1H) , 6.74 (s, 1H) , 6.84-6.92 (m, 2H) , 6.98 (s, 1H) , 7.25 (d, 1H) , 7.52 (d, 1H)	

【表 29】
第10表 (つづき)

No.	¹ H-NMR δ ppm (Solvent : CDCl ₃ / 400MHz)	
1-184	1.73(s, 6H), 2.46(s, 3H), 3.82(s, 3H), 6.84(d, 1H), 6.85-6.91(m, 3H), 7.00(t, 1H), 7.26(d, 1H), 7.27-7.39(m, 2H)	
1-187	1.75(s, 6H), 2.38(s, 3H), 2.43(s, 3H), 4.35(q, 2H), 6.69(s, 1H), 6.71(dd, 1H), 6.82(d, 1H), 6.86(d, 1H), 7.25(d, 1H), 7.52(d, 1H)	
1-189	1.52(d, 3H), 2.57(s, 3H), 5.67(m, 1H), 6.90(d, 1H), 7.0(bd, 1H), 7.31(d, 1H), 7.50(d, 2H), 7.97(d, 2H)	
1-231	1.77(s, 6H), 2.25(s, 3H), 2.48(s, 3H), 3.77(s, 3H), 6.85(dd, 1H), 6.87(d, 1H), 6.89(s, 1H), 6.97(d, 1H), 7.15(d, 1H), 7.26(d, 1H)	10
1-270	1.75(s, 6H), 2.29(s, 3H), 2.36(s, 3H), 2.44(s, 3H), 6.73(s, 1H), 6.86(d, 1H), 6.91(dd, 1H), 6.99(d, 1H), 7.25(d, 1H), 7.51(d, 1H)	
1-271	1.31(d, 9H), 1.73(s, 6H), 2.31(s, 3H), 2.44(s, 3H), 6.75(s, 1H), 6.85(d, 2H), 7.17(dd, 1H), 7.25(d, 1H), 7.28(bs, 1H), 7.39(d, 1H)	
1-273	0.96(t, 3H), 1.26-1.31(m, 3H), 1.61-1.75(m, 2H), 2.35(s, 3H), 2.44(s, 3H), 4.32(m, 1H), 6.64(dd, 1H), 6.75(d, 1H), 6.85(d, 1H), 6.88(s, 1H), 7.24(d, 1H), 7.47(d, 1H)	
1-276	1.75(s, 6H), 2.38(s, 3H), 2.43(s, 3H), 6.71(s, 1H), 6.85(d, 1H), 7.24(d, 1H), 7.32(dd, 1H), 7.34-7.36(m, 3H), 7.43(bs, 1H), 7.51-7.54(m, 2H)	20
1-282	0.24(s, 9H), 1.73(s, 6H), 2.33(s, 3H), 2.44(s, 3H), 6.68(s, 1H), 6.86(d, 1H), 7.24(dd, 1H), 7.25(d, 1H), 7.36(bs, 1H), 7.42(d, 1H)	
1-516	1.78(s, 6H), 2.53(s, 3H), 3.79(s, 3H), 6.76(s, 1H), 6.83(dd, 1H), 6.89(d, 1H), 7.14(d, 1H), 7.29(d, 1H), 7.47(d, 1H)	
1-518	1.78(s, 6H), 4.43(s, 2H), 6.96(d, 1H), 7.38(d, 2H), 7.41(d, 1H), 7.80(s, 1H), 7.96(d, 2H)	
1-521	1.74(s, 6H), 2.13(s, 6H), 3.34(s, 2H), 6.87(d, 1H), 7.25(d, 2H), 7.32(d, 1H), 7.86(s, 1H), 7.88(d, 2H)	30
1-536	1.73(s, 6H), 2.48(s, 3H), 6.75(s, 1H), 6.85(d, 1H), 7.22-7.26(m, 2H), 7.32(dt, 1H), 7.55-7.58(m, 2H)	
1-539	1.80(s, 6H), 2.30(s, 6H), 3.56(s, 2H), 7.01(d, 1H), 7.39(m, 3H), 7.93(s, 1H), 7.98(d, 2H)	
2-4	1.87(s, 6H), 2.45(s, 3H), 3.80(s, 3H), 7.54(m, 2H), 7.69(s, 1H), 7.90(m, 3H), 8.00(d, 1H), 8.50(s, 1H)	
6-1	0.75(s, 3H), 1.34(s, 9H), 1.59(s, 3H), 2.57(s, 3H), 6.93(d, 1H), 7.38(d, 1H), 7.39(d, 2H), 7.54(d, 2H)	
6-2	0.74(s, 3H), 1.62(s, 3H), 2.04(s, 3H), 2.56(s, 3H), 6.92(d, 1H), 7.35(d, 1H), 7.37(d, 2H), 7.53(d, 2H)	40
6-3	1.60(s, 6H), 2.04(s, 3H), 2.54(s, 3H), 6.91(d, 1H), 7.29(m, 1H), 7.36(m, 1H), 7.45(d, 1H), 7.54(s, 1H)	
7-9	1.60(s, 6H), 2.30(s, 3H), 3.76(s, 3H), 6.67(s, 1H), 6.91(d, 1H), 7.25(d, 1H)	

【 0 1 8 5 】

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。

〔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、病斑長、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、病斑長、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、病斑長、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、病斑長、病斑数又は孢子形成面積が、無処理区の70%以上。

【0186】

試験例1 (コムギうどんこ病予防効果試験)

直径7.5cmのポリ鉢でコムギ(品種:農林61号)を栽培し、1.5葉期に達した時に式(1)の酸アミド誘導体又はその塩を所定濃度に調整した薬液10mlをスプレーガンにて散布した。薬液が乾燥した後(処理当日)に、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6から7日後に孢子形成面積を調査し、前記評価基準に従って防除指数を求めた。前記化合物No.1-13、1-29、1-39、1-54、1-90、1-96、1-100、1-101、1-106、1-107、1-109、1-124、1-125、1-127、1-148、1-152、1-156、1-174、1-175、1-190、1-205、1-516、3-4、3-9、3-10、3-12、3-19、3-20、4-19、6-1又は7-2について試験したところ、全ての化合物が500ppmで防除指数4又は5の効果を示した。

10

【0187】

試験例2 (キュウリうどんこ病予防効果試験)

直径7.5cmのポリ鉢でキュウリ(品種:相模半白)を栽培し、1.5葉期に達した時に式(1)の酸アミド誘導体又はその塩を所定濃度に調整した薬液10mlをスプレーガンにて散布した。薬液が乾燥した後(処理当日もしくは翌日)に、うどんこ病菌(*Sphaerotheca fuliginea*)の分生胞子懸濁液を噴霧接種し、20の恒温室内に保った。接種6から7日後に孢子形成面積を調査し、前記評価基準に従って防除指数を求めた。前記化合物No.1-6、1-9、1-11、1-14、1-15、1-17~1-22、1-27~1-29、1-32、1-33、1-36、1-39、1-41~1-43、1-47、1-53~1-56、1-62~1-64、1-66、1-73、1-77、1-79、1-90、1-93、1-97~1-104、1-106~1-108、1-111、1-115、1-119、1-120、1-124、1-127、1-129、1-131、1-148、1-150、1-152、1-156、1-160、1-161、1-164、1-165、1-167、1-170、1-172、1-174、1-175、1-190、1-205、1-516、2-1、2-14、3-2、3-4、3-6、3-9、3-10、3-12、3-19、3-20、3-23、4-10又は6-1~6-3について試験したところ、全ての化合物が500ppmで防除指数4又は5の効果を示し、前記化合物No.1-34について試験したところ、200ppmで防除指数4の効果を示した。

20

【0188】

試験例3 (稲いもち病予防効果試験)

直径7.5cmのポリ鉢で稲(品種:日本晴)を栽培し、1.5葉期に達した時に式(1)の酸アミド誘導体又はその塩を所定濃度に調整した薬液10mlをスプレーガンにて散布した。薬液が乾燥した後(処理当日もしくは翌日)に、いもち病菌(*Pyricularia oryzae*)の分生胞子懸濁液を噴霧接種し、24時間20の接種箱に保ち、その後20の恒温室内に保った。接種5から7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.1-6、1-9、1-13、1-14、1-28、1-45、1-47、1-52、1-53、1-55、1-56、1-62、1-63、1-66、1-75、1-77、1-79、1-109、1-119、1-164、2-1、2-2、3-25又は4-19について試験したところ、全ての化合物が500ppmで防除指数4又は5の効果を示した。

30

【0189】

試験例4 (インゲン灰色かび病予防効果試験)

直径15cmのポリ鉢でインゲン(品種:大正金時)を栽培し、本葉が十分展開した時に式(1)の酸アミド誘導体又はその塩を所定濃度に調整した薬液10mlをスプレーガンにて散布した。薬液が乾燥した後(処理当日もしくは翌日)に、灰色かび病菌(*Botrytis cinerea*)胞子懸濁液(水で50%に希釈したジャガイモ・グルコース煎汁液)を接種し、20の恒温室内に保った。接種3日後に病斑長(mm)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.1-11、1-15、1-17、1-20、1-22、1-27、1-41、1-43、1-52、1-80、1-99、1-102、1-112~1-115、1-117、1-118、1-120、1-125、1-131、1-136、1-160、1-162、1-169、1-172、1-176、1-180、1-182、1-186~1-189、1-273、2-2、2-9、2-13、2-14又は7-6について試験したところ、全ての化合物が500ppmで防除指数4又は5の効果

40

50

を示した。

【 0 1 9 0 】

試験例 5 (インゲン菌核病予防効果試験)

直径 15 cm のポリ鉢でインゲン (品種: 大正金時) を栽培し、本葉が十分展開した時に式 (1) の酸アミド誘導体又はその塩を所定濃度に調整した薬液 10 ml をスプレーガンにて散布した。薬液が乾燥した後 (処理当日もしくは翌日) に、菌核病菌 (*Sclerotinia sclerotiorum*) の菌叢ディスクを接種し、20 の恒温室内に保った。接種 3 日後に病斑長 (mm) 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、1-4、1-7、1-10、1-16、1-18、1-19、1-21、1-26、1-30~1-33、1-36、1-38、1-42、1-44、1-46、1-57、1-60、1-64、1-69、1-71、1-73、1-75、1-80、1-86、1-93、1-96~1-98、1-103~1-105、1-108、1-111~1-114、1-117、1-118、1-123、1-126、1-128、1-129、1-133~1-136、1-141~1-144、1-146、1-149、1-150、1-159、1-161~1-163、1-165~1-171、1-176、1-180、1-181、1-186、1-188、1-208、1-209、1-271、1-273、1-276、1-535、2-1、2-3、2-4、2-10、2-11、2-13、3-2、3-3、3-6、3-23、3-26、4-10、6-2、6-3、7-2、7-4、7-6~7-8 又は 7-66 について試験したところ、全ての化合物が 500 ppm で防除指数 4 又は 5 の効果を示した。

10

【 0 1 9 1 】

試験例 6 (コムギふ枯病予防効果試験)

直径 7.5 cm のポリ鉢でコムギ (品種: 農林 61 号) を栽培し、1.5 葉期に達した時に式 (1) の酸アミド誘導体又はその塩を所定濃度に調整した薬液 10 ml をスプレーガンにて散布した。薬液が乾燥した後 (処理当日) に、ふ枯病菌 (*Septoria nodorum*) の分生孢子懸濁液を噴霧接種し、72 時間 20 の接種箱に保ち、その後 20 の恒温室内に保った。接種 5 から 10 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. 1-179 又は 1-189 について試験したところ、全ての化合物が 500 ppm で防除指数 4 又は 5 の効果を示した。

20

【 0 1 9 2 】

試験例 7 (稲紋枯病予防効果試験)

直径 7.5 cm のポリ鉢で稲 (品種: 日本晴) を栽培し、5 葉期に達した時に式 (1) の酸アミド誘導体又はその塩を所定濃度に調整した薬液 10 ml をスプレーガンにて散布した。薬液が乾燥した後 (処理当日もしくは翌日) に、あらかじめ培養した紋枯病菌 (*Rhizoctonia solani*) の菌叢ディスクを葉梢に挟み込み、紐で固定し 25 の接種箱に保った。接種 5 から 7 日後に病斑長を調査し、前記評価基準に従って防除指数を求めた。前記化合物 No. 1-130、1-137 又は 3-3 について試験したところ、全ての化合物が 500 ppm で防除指数 4 又は 5 の効果を示した。

30

【 0 1 9 3 】

次に本発明組成物の製剤例を記載するが、配合割合、剤型等は記載例のみに限定されるものではない。

製剤例 1

(1) 式 (1) の化合物	20 重量部	
(2) クレー	72 重量部	40
(3) リグニンスルホン酸ソーダ	8 重量部	

以上のものを均一に混合して水和剤とする。

製剤例 2

(1) 式 (1) の化合物	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。

製剤例 3

(1) 式 (1) の化合物	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	50

(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。

【0194】

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、式(1)の化合物とを4:1の重量割合で混合し、水和剤とする。

10

製剤例5

(1) 式(1)の化合物 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

(3) シリコーン 0.2 重量部

(4) 水 47.8 重量部

以上のものを均一に混合、粉碎した原液に更に

(5) ポリカルボン酸ナトリウム 5 重量部

(6) 無水硫酸ナトリウム 42.8 重量部

を加え均一に混合、造粒、乾燥して顆粒水和剤とする。

20

製剤例6

(1) 式(1)の化合物 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

(3) ポリオキシエチレンの燐酸エステル 0.1 重量部

(4) 粒状炭酸カルシウム 93.9 重量部

(1)~(3)を予め均一に混合し、適量のアセトンで希釈した後、(4)に吹付け、アセトンを除去して粒剤とする。

【0195】

製剤例7

(1) 式(1)の化合物 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 95.0 重量部

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

30

製剤例8

(1) 式(1)の化合物 20 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 72.7 重量部

以上のものを均一に混合、粉碎して水性懸濁剤とする。

40

フロントページの続き

(56)参考文献 特開2003-176258(JP,A)

(58)調査した分野(Int.Cl., DB名)

CAplus/REGISTRY(STN)