



(21) 申請案號：107146386

(22) 申請日：中華民國 107 (2018) 年 12 月 21 日

(51) Int. Cl. : *A01N43/32 (2006.01)* *A01N43/08 (2006.01)*
 A01N43/10 (2006.01) *A01N43/28 (2006.01)*
 A01N43/40 (2006.01) *A01N43/56 (2006.01)*
 A01N43/60 (2006.01) *A01N43/80 (2006.01)*
 A01N47/40 (2006.01) *C07D213/81 (2006.01)*
 C07D213/60 (2006.01) *C07D231/14 (2006.01)*
 C07D239/28 (2006.01) *C07D263/34 (2006.01)*
 C07D307/68 (2006.01) *C07D327/06 (2006.01)*
 C07D333/38 (2006.01) *C07D401/12 (2006.01)*
 C07D405/12 (2006.01) *C07D409/12 (2006.01)*
 C07D413/12 (2006.01) *A01G7/06 (2006.01)*
 A01G13/00 (2006.01) *A01P3/00 (2006.01)*

(30) 優先權：2017/12/21 日本 2017-244785

(71) 申請人：日商石原產業股份有限公司 (日本) ISHIHARA SANGYO KAISHA, LTD. (JP)
日本

(72) 發明人：中村裕治 NAKAMURA, YUJI (JP)；伏木田地 FUSHIKIDA, KUNI (JP)；大北達哉 OKITA, TATSUYA (JP)；伊藤智也 ITO, TOMOYA (JP)；岩本拓也 IWAMOTO, TAKUYA (JP)；田中薰 TANAKA, KAORU (JP)；西村光子 NISHIMURA, MITSUKO (JP)

(74) 代理人：林志剛

申請實體審查：無 申請專利範圍項數：11 項 圖式數：0 共 156 頁

(54) 名稱

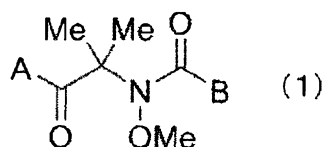
N-甲氧基醯胺化合物或其鹽及含有該等之農園藝用殺菌劑

(57) 摘要

本發明為提供一種對於範圍廣泛之植物病原菌，發揮高度防除效果之農園藝用殺菌劑。

式(1)：

[化 1]

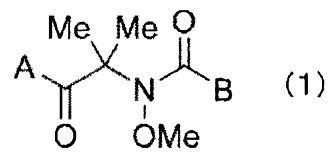


(式中，各記號係如說明書所記載)表示之化合物或其鹽。

特徵化學式：

式(1)

[化1]



【發明說明書】

【中文發明名稱】

N－甲氧基醯胺化合物或其鹽及含有該等之農園藝用殺菌劑

【技術領域】

【0001】本發明係關於N-甲氧基醯胺化合物或其鹽及含有該等之農園藝用殺菌劑。

【先前技術】

【0002】具有一定之苯甲醯甲基醯胺構造的化合物，已知對各式各樣之有害生物的防除有用。例如，分別於專利文獻1及2中，記載具有作為殺蟲劑、殺蟎劑或殺線蟲劑有用之苯甲醯甲基醯胺構造的化合物，專利文獻3及4中記載具有作為農園藝用殺菌劑有用之苯甲醯甲基醯胺構造的化合物。然而，此等文獻中，後述式(1)之化合物，亦即具有醯胺之氮原子以甲氧基修飾之N-甲氧基醯胺構造的化合物，並未伴隨具體例而記載。

【0003】又，專利文獻5中雖記載具有N-甲氧基醯胺構造之農園藝用殺菌劑，但不具有後述式(1)之「-C(O)-C(Me)₂-」構造。進而，專利文獻6中雖揭示具有醯胺之氮原子以甲基修飾之N-甲基醯胺構造的化合物，但具有後述式(1)之「-C(O)-C(Me)₂-N(OMe)-C(O)-」構造之化合物，並未伴隨具體例而記載。

[先前技術文獻]

[專利文獻]

【0004】

[專利文獻1] 國際公開公報 WO01/60783

[專利文獻2] 國際公開公報 WO03/27059

[專利文獻3] 國際公開公報 WO2006/016708

[專利文獻4] 國際公開公報 WO2007/069777

[專利文獻5] 國際公開公報 WO2010/063700

[專利文獻6] 國際公開公報 WO2011/151369

【發明內容】

[發明欲解決之課題]

【0005】 自以往，為了防除植物病害所提供之多數農園藝用殺菌劑，各自在其光譜或植物病原菌防除效果具有特徵。然而，有對於特定之植物病害，效果不夠充分，或是與預防效果相比較，治療效果稍微劣化，或耐雨性劣化之殘效性比較上較短，藉由施用場面，對於植物病原菌，僅顯示實用上不夠充分之防除效果的情況。據此，正尋求不因施用場面，且對於範圍廣泛之植物病原菌，發揮高度防除效果之農園藝用殺菌劑的創製。

[用以解決課題之手段]

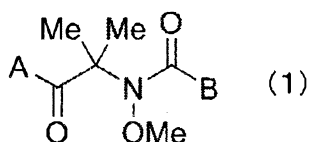
【0006】 本發明者們為了解決前述之問題點而研究的

結果，發現後述式(1)表示之化合物或其鹽對於各種植物病害，表現優異之防除效果的卓見，而完成本發明。

【0007】亦即，本發明係關於式(1)表示之化合物或其鹽(以下，亦稱為本發明化合物)，將本發明化合物作為有效成分含有之農園藝用殺菌劑及將本發明化合物施用在植物或土壤之防除植物病害之方法。

【0008】

[化1]



【0009】[式中，A為被 R^A 取代之苯基或被取代之吡啶基，

B為被 R^B 取代之雜環基，

R^A 可相同或相異為鹵素原子、可被 G^1 取代之烷基、烯基、可被 G^2 取代之炔基、環狀基、硝基、氰基或 $-L^A-Y^A$ ，或可鍵結2個 R^A ，形成可被 Z^1 取代之環，

R^B 可相同或相異為鹵素原子、烷基、烯基、鹵烷基、烷氧基烷基、環烷基或氰基，

L^A 為O、S、 $C(=O)$ 、 $C(=O)O$ 、 $C(=O)N(R^1)$ 、 $OC(=O)$ 、 $N(R^1)$ 、 $N(R^1)C(=O)$ 、 $N(R^1)C(=O)O$ 、 $C(=NR^2)$ 、SO、 SO_2 或 $SO_2N(R^1)$ ，

Y^A 為氫原子、可被 Z^2 取代之烷基、烯基或可被 Z^3 取代之環狀基，

R^1 為氫原子或烷基，

R^2 為氫原子、烷基或烷氧基，
 G^1 為鹵素原子或烷氧基，
 G^2 為環烷基或鹵素原子，
 Z^1 為鹵素原子、烷基、烷氧基或環烷基，
 Z^2 為鹵素原子、氰基、環烷基或烷氧基，
 Z^3 為鹵素原子或鹵烷基]。

[發明效果]

【0010】 本發明化合物與類似之以往化合物比較，由於可發揮優異之植物病害的防除效果及滲透傳遞性，故作為農園藝用殺菌劑有用。

【實施方式】

【0011】 在本說明書，在A之苯基或吡啶基的取代基即 R^A 之數可為1個，亦可為2個以上(例如2個、3個、4個等)。為2個以上時， R^A 可分別相同亦可相異。

又，在B之雜環基的取代基即 R^B 之數可為1個，亦可為2個以上(例如2個、3個、4個等)。為2個以上時， R^B 可分別相同亦可相異。

【0012】 在本說明書，作為鹵素原子或作為取代基之鹵素原子，可列舉氟、氯、溴或碘之各原子。作為取代基之鹵素原子之數可為1或2以上，為2個以上時，各鹵素原子可分別相同亦可相異。

又，鹵素原子之取代位置可為任一位置。

【0013】在本說明書，作為烷基或烷基部分，例如可列舉如甲基、乙基、丙基、異丙基、n-丁基、異丁基、s-丁基、t-丁基、n-戊基、新戊基、己基、庚基、辛基、壬基、癸基、十一烷基、十二烷基之直鏈或分枝鏈狀的C₁-C₁₂之基。

【0014】在本說明書，作為烯基或烯基部分，例如可列舉如乙烯基、1-丙烯基、2-丙烯基、異丙烯基、2-甲基-1-丙烯基、1-甲基-1-丙烯基、2-甲基-2-丙烯基、1-甲基-2-丙烯基、1-丁烯基、2-丁烯基、3-丁烯基、1-戊烯基、2-戊烯基、2-甲基-2-丁烯基、3-甲基-2-丁烯基、1-己烯基、2,3-二甲基-2-丁烯基之直鏈或分枝鏈狀的C₂-C₆之基。

【0015】在本說明書，作為炔基或炔基部分，例如可列舉如乙炔基、1-丙炔基、2-丙炔基、1-丁炔基、2-丁炔基、3-丁炔基、1-甲基-2-丙炔基、2-甲基-3-丁炔基、1-己炔基、2-己炔基、3-己炔基、4-己炔基、5-己炔基、3,3-二甲基-1-丁炔基之直鏈或分枝鏈狀的C₂-C₆之基。

【0016】在本說明書，作為環烷基或環烷基部分，例如可列舉如環丙基、環丁基、環戊基、環己基、環庚基、金剛烷基、雙環[1,1,1]戊基之C₃-C₁₀之基。

【0017】在本說明書，作為環狀基，係意指飽和或不飽和之碳環基或雜環基。所謂碳環基，係作為環原子僅包含碳原子之環狀基，可列舉如環烷基(例如環丙基、環丁基、環戊基、環己基、環庚基、金剛烷基、雙環[1,1,1]戊

基等)及芳基(例如苯基、萘基、茛基、二氫茛基等)之 C_3 - C_{10} 之基。作為雜環基，可列舉含有1~4個選自由O、S及N所成之群組中之至少1種的原子之3~6員之單環式的雜環基(例如如環氧乙烷基、噻喃基(thiiranyl)、氮坦基(azetidiny)之3員雜環基；如氧坦基(oxetanyl)、硫坦基(thietanyl)、氮坦基之4員雜環基；呋喃基、四氫呋喃基、噻吩基、吡咯基、唑啉基、咯啞基、二氧戊環基、噁唑基、異噁唑基、噻唑基、異噻唑基、咪唑基、咪唑啉基、咪唑啞基、吡唑基、吡唑啉基、吡唑啞基、三唑基、噁二唑基、噻二唑基、四唑基等之5員雜環基；吡喃基、吡啞基、哌啞基、二噁烷基、噁嗪基、嗎啉基、噻嗪基、噻嗪基、嘧啞基、吡嗪基、哌嗪基、三嗪基、噻喃基、二氫噻喃基、氧硫雜環己烯基(oxathiinyl)等之6員雜環基)，以及含有1~4個選自由O、S及N所成之群組中之至少1種的原子之縮合雜環基(例如苯并呋喃基、異苯并呋喃基、二氫苯并呋喃基、二氫異苯并呋喃基、苯并噻吩基、異苯并噻吩基、二氫苯并噻吩基、二氫異苯并噻吩基、四氫苯并噻吩基、吲哚基、異吲哚基、苯并噁唑基、苯并噻唑基、吲唑基、苯并咪唑基、苯并二氧環戊基(benzodioxolanyl)、苯并二噁烷基、苯并哌喃基、苯并二氫哌喃基、異苯并二氫哌喃基、色酮基(chromonyl)、色滿酮基(chromanonyl)、喹啉基、異喹啉基、噌啉基、酞嗪基、喹啞啉基、喹啞啉基、吲嗪基(indoliziny)l)、喹嗪基、咪唑并吡啞基、萘啞基、蝶啞基、二氫苯并惡嗪基、二氫苯并噁唑酮基、二氫

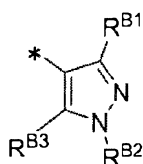
苯并噁嗪酮基 (benzoxazinonyl)、苯并硫氧雜環己基 (Benzothioxanyl)等)。

【0018】作為式(1)中之B表示之雜環基，可使用與作為前述環狀基例示之雜環基相同者。較佳為含有1~4個選自由O、S及N所成之群組中之至少1種的原子之5~6員之雜環基，更具體而言，可列舉以下。

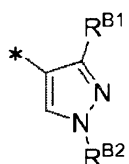
選自由式(B-1)~式(B-18)：

【0019】

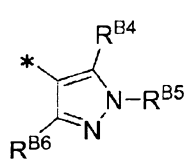
[化2]



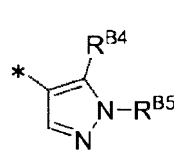
(B-1)



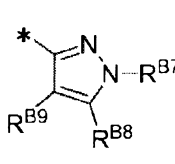
(B-2)



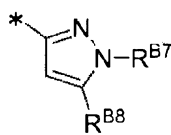
(B-3)



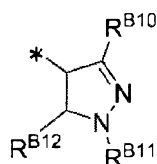
(B-4)



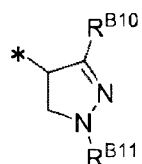
(B-5)



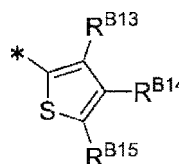
(B-6)



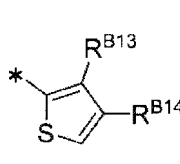
(B-7)



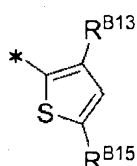
(B-8)



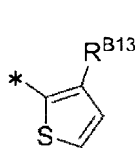
(B-9)



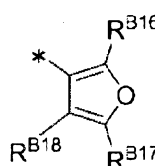
(B-10)



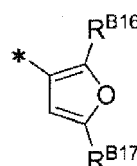
(B-11)



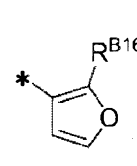
(B-12)



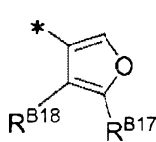
(B-13)



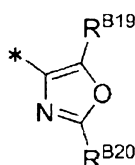
(B-14)



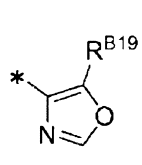
(B-15)



(B-16)



(B-17)



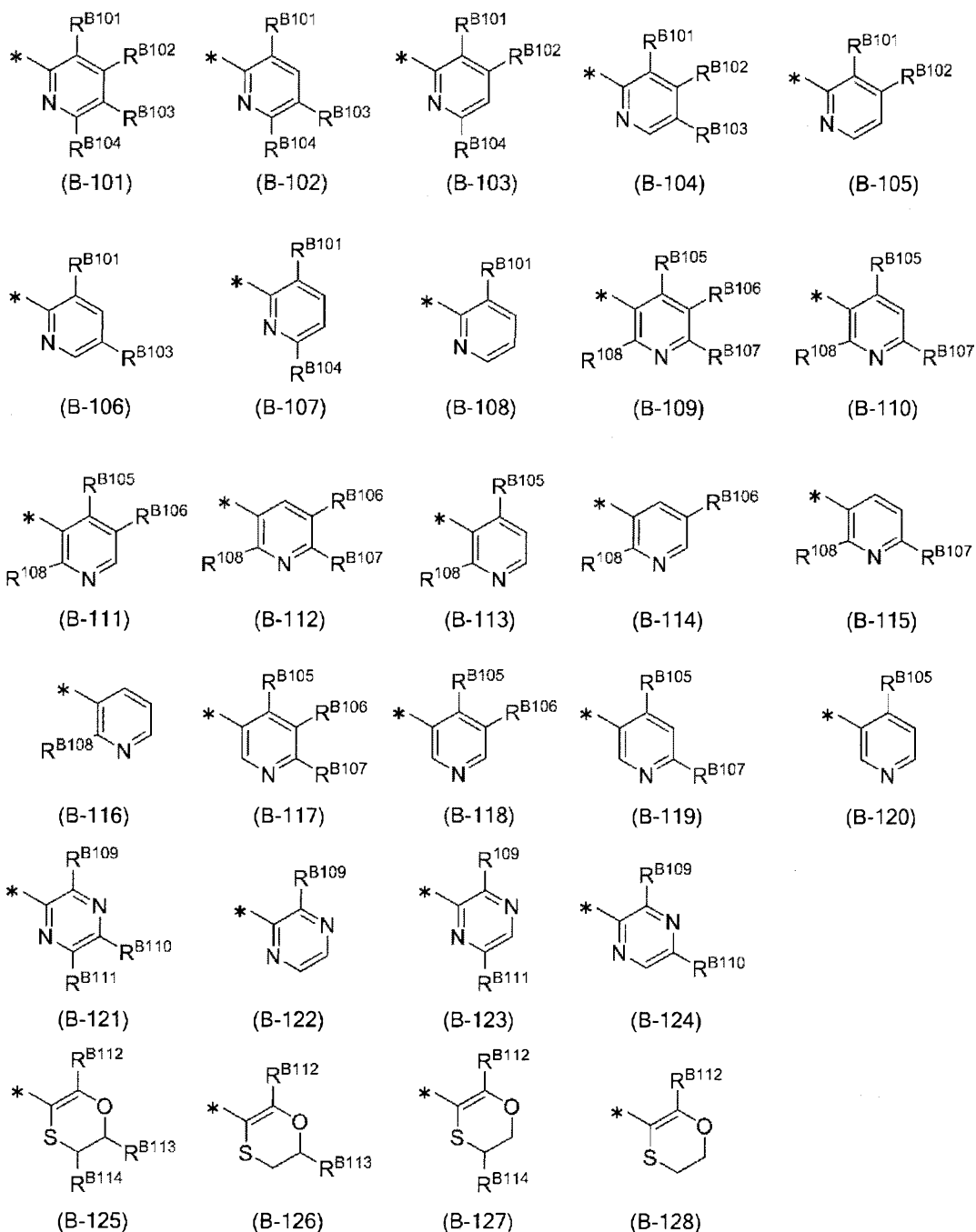
(B-18)

【0020】[式中， $R^{B1} \sim R^{B20}$ 可相同或相異為鹵素原子、烷基、烯基、鹵烷基、烷氧基烷基、環烷基或氰基，*表示鍵結位置]表示之5員雜環基及

式(B-101)~式(B-128)：

【0021】

[化3]



[式中， $R^{B101} \sim R^{B114}$ 可相同或相異為鹵素原子、烷基、烯基、鹵烷基、烷氧基烷基、環烷基或氰基，*表示鍵結位置]表示之6員雜環基所成之群組中之雜環基。

【0022】作為B表示之雜環基，有於與「*」鍵結之原子相鄰的原子上具有取代基較佳的情況。

【0023】在式(1)，作為在鍵結2個R^A形成環的態樣之A，可列舉可被Z¹取代之苯并二氧環戊基、苯并二噁烷基、苯并噻唑基、二氫苯并氧硫雜環己烯基(benzoxathiinyl)等。於此，與同一碳原子鍵結之2個Z¹可鍵結形成螺環，作為形成螺環時之A的例，可列舉螺環[苯并[d][1,3]二氧雜環戊烯(Dioxol)-2,1'-環戊烷]-5-基、螺環[苯并[d][1,3]二氧雜環戊烯(Dioxol)-2,1'-環丁烷]-5-基等。

【0024】作為式(1)之化合物之鹽，若為農業上所容許者，雖都包含，但例如可列舉如鈉鹽、鉀鹽之鹼金屬鹽；如鎂鹽、鈣鹽之鹼土類金屬鹽；如鹽酸鹽、過氯酸鹽、硫酸鹽、硝酸鹽之無機酸鹽；如乙酸鹽、甲烷磺酸鹽之有機酸鹽等。

【0025】本發明化合物中，雖存在各種同分異構物、例如光學同分異構物、幾何同分異構物等，但本發明中包含各同分異構物及同分異構物混合物雙方。尚，本發明化合物中，在該技術領域之技術常識的範圍內，亦包含前述者以外之各種同分異構物。

【0026】又，雖有因同分異構物的種類，導致成為與記載之構造式不同之化學構造的情況，但若為本發明領域具有通常知識者，由於該等為同分異構物的關係有充分認識，故非常清楚為本發明的範圍內。

【0027】本發明化合物雖可依以下所示知反應A~I及

通常之鹽的製造方法製造，但得到本發明化合物之方法，並不限定於此等之方法。例如，本發明化合物亦可藉由於在A之苯基或吡啶基上之取代基及/或在B之雜環基上之取代基，在本領域，適用周知之各種取代基變換反應(例如水解、氧化、還原、酯化、醯胺化、烷基化等)來製造。又，在本發明化合物之製造，在本領域，如有必要可適用通常所使用之保護及脫保護反應。

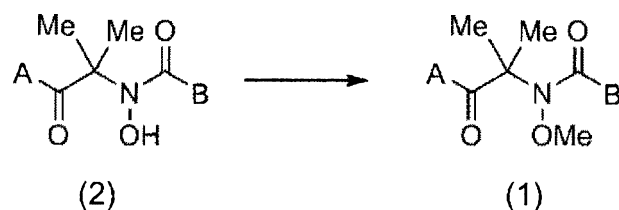
【0028】

反應A

反應A係藉由甲基化式(2)之化合物，得到式(1)之化合物之方法。

【0029】

[化4]



【0030】 式中之記號係如前述。

【0031】 反應A可依一般的甲基化的反應條件進行，通常可於甲基化劑、鹼及溶媒的存在下進行。

【0032】 作為甲基化劑，例如可列舉碘化甲烷、溴化甲烷、硫酸二甲酯、三甲基矽烷基重氮甲烷等。甲基化劑相對於式(2)之化合物1當量(當量為莫耳當量，以下相同)，可使用1~20當量，期望為1~10當量。

作為鹼，例如可從如鈉、鉀之鹼金屬；如甲醇鈉、乙

醇鈉、第3級丁醇鉀之鹼金屬醇鹽；如碳酸鈉、碳酸鉀之碳酸鹽；如碳酸氫鈉、碳酸氫鉀之碳酸氫鹽；如氫氧化鈉、氫氧化鉀之金屬氫氧化物；如氫化鈉、氫化鉀之金屬氫化物；如單甲基胺、二甲基胺、三乙基胺、二異丙基乙基胺之胺類；如吡啶、4-二甲基胺基吡啶之吡啶類；如甲基鋰、*n*-丁基鋰、鋰二異丙基醯胺、六甲基二矽氮烷鋰之有機鋰化合物等適當選擇1種或2種以上。鹼相對於式(2)之化合物1當量，可使用1~3當量，期望為1~2當量。

溶媒若為對反應為惰性的溶媒則任何溶媒皆可，例如可從如苯、甲苯、二甲苯、氯苯之芳香族烴類；如四氯化碳、氯化甲烷、氯仿、二氯甲烷、二氯乙烷、三氯乙烷、己烷、環己烷之脂肪族烴類；如二噁烷、四氫呋喃、二乙基醚、二甲氧基乙烷之醚類；如乙酸甲酯、乙酸乙酯之酯類；如甲醇、乙醇、丙醇、*tert*-丁醇之醇類；如二甲基亞砷、環丁砷、二甲基乙醯胺、*N,N*-二甲基甲醯胺、*N*-甲基吡咯烷酮、吡啶、乙腈、丙腈之極性非質子性溶媒；如丙酮、甲基乙基酮之酮類；水等中適當選擇1種或2種以上。

【0033】反應溫度通常為-78~100℃，期望為0~80℃，反應時間通常為0.1~48小時左右，期望為0.1~24小時左右。

【0034】反應A所使用之式(2)之化合物可依後述之反應1-1製造。

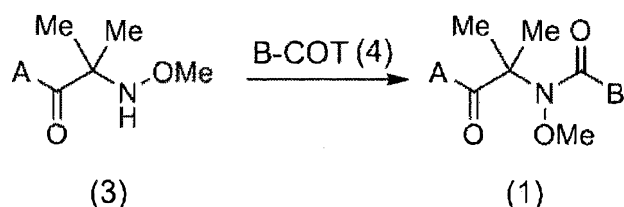
【0035】

反應B

反應B係將式(3)之化合物與式(4)之化合物進行反應，得到式(1)之化合物之方法。

【0036】

[化5]



【0037】式中，T為羥基、烷氧基、芳氧基或鹵素，其他記號係如前述。

【0038】反應B通常可於鹼及溶媒的存在下進行。式(4)之化合物相對於式(3)之化合物1當量，可使用1~3當量，期望為1~2當量。

【0039】鹼例如可從如鈉、鉀之鹼金屬；如甲醇鈉、乙醇鈉、第3級丁醇鉀之鹼金屬醇鹽；如碳酸鈉、碳酸鉀之碳酸鹽；如碳酸氫鈉、碳酸氫鉀之碳酸氫鹽；如氫氧化鈉、氫氧化鉀之金屬氫氧化物；如氫化鈉、氫化鉀之金屬氫化物；如單甲基胺、二甲基胺、三乙基胺、二異丙基乙基胺之胺類；如吡啶、4-二甲基胺基吡啶之吡啶類；如甲基鋰、n-丁基鋰、鋰二異丙基醯胺之有機鋰化合物等中適當選擇1種或2種以上。鹼相對於式(3)之化合物1當量，可使用1~3當量，期望為1~2當量。

溶媒若為對反應為惰性的溶媒則任何溶媒皆可，例如可從如苯、甲苯、二甲苯、氯苯之芳香族烴類；如四氯化碳、氯化甲烷、氯仿、二氯甲烷、二氯乙烷、三氯乙烷、

己烷、環己烷之脂肪族烴類；如二噁烷、四氫呋喃、二乙基醚、二甲氧基乙烷之醚類；如乙酸甲酯、乙酸乙酯之酯類；如二甲基亞砷、環丁砷、二甲基乙醯胺、N,N-二甲基甲醯胺、N-甲基吡咯烷酮、吡啶、乙腈、丙腈之極性非質子性溶媒；如丙酮、甲基乙基酮之酮類等中適當選擇1種或2種以上。

【0040】 反應B如有必要可於脫水縮合劑的存在下進行。作為脫水縮合劑，可列舉N,N'-二環己基碳二亞胺、氯磺醯基異氰酸酯、N,N'-羰基二咪唑、三氟乙酸酐等。脫水縮合劑相對於式(3)之化合物1當量，可使用1~5當量，期望為1~2當量。

【0041】 反應溫度通常為0~100℃，期望為0~50℃，反應時間通常為0.5~48小時左右，期望為1~24小時左右。

【0042】 反應B所使用之式(3)之化合物可依後述之反應1-2或反應1-3製造。式(4)之化合物可依以下之反應2-1或公知之方法製造，或可使用市售品。

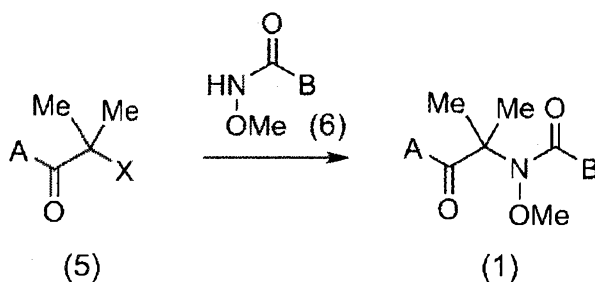
【0043】

反應C

反應C係將式(5)之化合物與式(6)之化合物進行反應，得到式(1)之化合物之方法。

【0044】

[化6]



【0045】式中，X為氯原子、溴原子或碘原子，其他記號係如前述。

【0046】反應C通常可於鹼及溶媒的存在下進行。式(6)之化合物相對於式(5)之化合物1當量，可使用1~3當量，期望為1~2當量。

【0047】作為鹼，例如可從如鈉、鉀之鹼金屬；如甲醇鈉、乙醇鈉、第3級丁醇鉀之鹼金屬醇鹽；如碳酸鈉、碳酸鉀之碳酸鹽；如碳酸氫鈉、碳酸氫鉀之碳酸氫鹽；如氫氧化鈉、氫氧化鉀之金屬氫氧化物；如氫化鈉、氫化鉀之金屬氫化物；如單甲基胺、二甲基胺、三乙基胺、二異丙基乙基胺之胺類等中適當選擇1種或2種以上。鹼相對於式(5)之化合物，可使用1~3當量，期望為1~2當量。

溶媒若為對反應為惰性的溶媒則任何溶媒皆可，例如可從如苯、甲苯、二甲苯、氯苯之芳香族烴類；如四氯化碳、氯化甲烷、氯仿、二氯甲烷、二氯乙烷、三氯乙烷、己烷、環己烷之脂肪族烴類；如二噁烷、四氫呋喃、二乙基醚、二甲氧基乙烷之醚類；如乙酸甲酯、乙酸乙酯之酯類；如甲醇、乙醇、丙醇、tert-丁醇之醇類；如二甲基亞砜、環丁砜、二甲基乙醯胺、N,N-二甲基甲醯胺、N-甲基

吡咯烷酮、吡啶、乙腈、丙腈之極性非質子性溶媒；如丙酮、甲基乙基酮之酮類；水等中適當選擇1種或2種以上。

【0048】反應溫度通常為0~100℃，期望為20~80℃，反應時間通常為0.1~48小時左右，期望為1~24小時左右。

【0049】反應C所使用之式(5)之化合物可依後述之反應1-9製造。式(6)之化合物可依公知之方法製造，或可使用市售品。

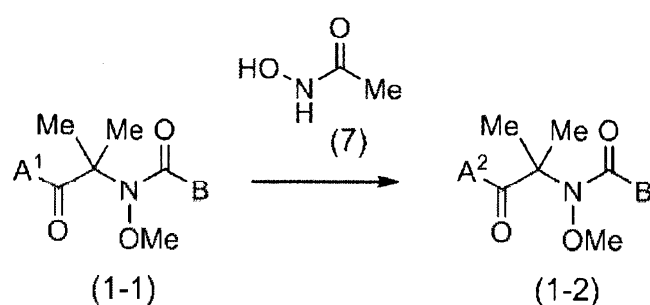
【0050】

反應D

反應D係使用式(7)之化合物，從A¹之R^A為氟之式(1-1)之化合物，變換成A²之R^A為羥基之式(1-2)之化合物之方法。

【0051】

[化7]



【0052】式中，A¹為被氟取代之苯基或被氟取代之吡啶基，A²為被羥基取代之苯基或被羥基取代之吡啶基，其他記號係如前述。

【0053】反應D通常可於鹼及溶媒的存在下進行。式(7)之化合物相對於式(1-1)之化合物1當量，可使用1~10

當量，期望為1~5當量。

【0054】鹼例如可從如鈉、鉀之鹼金屬；如甲醇鈉、乙醇鈉、第3級丁醇鉀之鹼金屬醇鹽；如碳酸鈉、碳酸鉀之碳酸鹽；如碳酸氫鈉、碳酸氫鉀之碳酸氫鹽；如氫氧化鈉、氫氧化鉀之金屬氫氧化物；如氫化鈉、氫化鉀之金屬氫化物；如單甲基胺、二甲基胺、三乙基胺、二異丙基乙基胺之胺類；如吡啶、4-二甲基胺基吡啶之吡啶類；如甲基鋰、n-丁基鋰、鋰二異丙基醯胺之有機鋰化合物等中適當選擇1種或2種以上。鹼相對於式(1-1)之化合物，可使用1~10當量，期望為1~5當量。

溶媒若為對反應為惰性的溶媒則任何溶媒皆可，例如可從如苯、甲苯、二甲苯、氯苯之芳香族烴類；如四氯化碳、氯化甲烷、氯仿、二氯甲烷、二氯乙烷、三氯乙烷、己烷、環己烷之脂肪族烴類；如二噁烷、四氫呋喃、二乙基醚、二甲氧基乙烷之醚類；如乙酸甲酯、乙酸乙酯之酯類；如二甲基亞砷、環丁砷、二甲基乙醯胺、N,N-二甲基甲醯胺、N-甲基吡咯烷酮、吡啶、乙腈、丙腈之極性非質子性溶媒；如丙酮、甲基乙基酮之酮類等中適當選擇1種或2種以上。

【0055】反應溫度通常為0~150℃，期望為50~100℃，反應時間通常為1~24小時左右，期望為1~12小時左右。

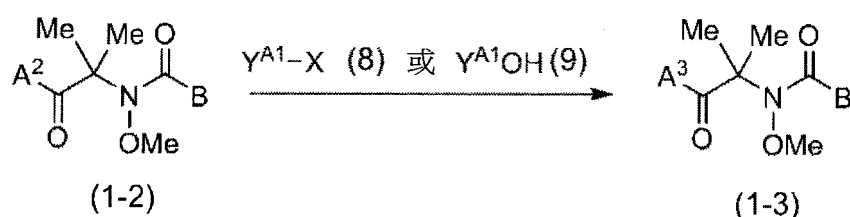
【0056】

反應E

反應E係使用式(8)之化合物或式(9)之化合物，將A²之R^A為羥基之式(1-2)之化合物變換成A³之R^A為-O-Y^{A1}之式(1-3)之化合物之方法。

【0057】

[化8]



【0058】式中，A³為被-O-Y^{A1}取代之苯基或吡啶基，Y^{A1}為可被Z²取代之烷基、烯基或可被Z³取代之環狀基，其他記號係如前述。

【0059】反應E通常可於式(8)之化合物、鹼及溶媒的存在下進行。或依一般的光延反應(Mitsunobu reaction)，可於式(9)之化合物、三苯基磷、偶氮二羧酸二酯及溶媒的存在下進行。式(8)之化合物或式(9)之化合物相對於式(1-2)之化合物1當量，可使用1~3當量，期望為1~2當量。三苯基磷相對於式(1-2)之化合物1當量，可使用1~3當量，期望為1~1.5當量。偶氮二羧酸二酯相對於式(1-2)之化合物1當量，可使用1~3當量，期望為1~1.5當量。

【0060】鹼例如可從如甲醇鈉、乙醇鈉、第3級丁醇鉀之鹼金屬醇鹽；如碳酸鈉、碳酸鉀之碳酸鹽；如碳酸氫鈉、碳酸氫鉀之碳酸氫鹽；如氫氧化鈉、氫氧化鉀之金屬氫氧化物；如氫化鈉、氫化鉀之金屬氫化物；如單甲基胺、二甲基胺、三乙基胺、二異丙基乙基胺之胺類；如吡

啖、4-二甲基胺基吡啖之吡啖類等中適當選擇1種或2種以上。鹼相對於式(1-2)之化合物，可使用1~2當量，期望為1~1.5當量。

溶媒若為對反應為惰性的溶媒則任何溶媒皆可，例如可從如苯、甲苯、二甲苯、氯苯之芳香族烴類；如四氯化碳、氯化甲烷、氯仿、二氯甲烷、二氯乙烷、三氯乙烷、己烷、環己烷之脂肪族烴類；如二噁烷、四氫呋喃、二乙基醚、二甲氧基乙烷之醚類；如乙酸甲酯、乙酸乙酯之酯類；如二甲基亞砷、環丁砷、二甲基乙醯胺、N,N-二甲基甲醯胺、N-甲基吡咯烷酮、吡啖之極性非質子性溶媒；如乙腈、丙腈、丙烯腈之腈類；如丙酮、甲基乙基酮之酮類；水等中適當選擇1種或2種以上。

作為偶氮二羧酸二酯，例如可使用偶氮二羧酸二乙酯等。

【0061】 反應溫度通常為 $-30\sim 100^{\circ}\text{C}$ ，期望為 $0\sim 50^{\circ}\text{C}$ ，反應時間通常為0.1~24小時左右，期望為0.1~12小時左右。

【0062】 反應E所使用之式(8)及式(9)之化合物可依公知之方法製造，或可使用市售品。

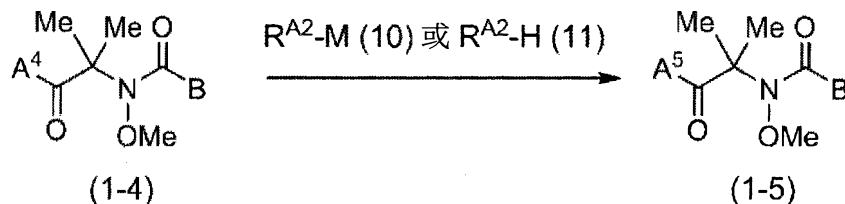
【0063】

反應F

反應F係使用式(10)之化合物或式(11)之化合物，將 A^4 之 R^A 為X之式(1-4)之化合物變換成 A^5 之 R^A 為特定之 R^{A2} 之式(1-5)之化合物之方法。

【 0064 】

[化9]



【 0065 】 式中， A^4 為被X取代之苯基或被X取代之吡啶基，式中， A^5 為被 $\text{R}^{\text{A}2}$ 取代之苯基或被 $\text{R}^{\text{A}2}$ 取代之吡啶基， $\text{R}^{\text{A}2}$ 為烷基、鹵烷基、烯基、炔基、環狀基、氰基或 $-\text{L}^{\text{A}1}-\text{Y}^{\text{A}}$ ， $\text{L}^{\text{A}1}$ 為O、S、 $\text{C}(=\text{O})$ 、 $\text{C}(=\text{O})\text{O}$ 、 $\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{R}^1)$ 、 $\text{N}(\text{R}^1)$ 、 $\text{N}(\text{R}^1)\text{C}(=\text{O})\text{O}$ 、SO、 SO_2 或 $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^1)$ ，M為如鎂、鋅之金屬原子或其鹽，或硼酸或其酯之殘基，其他記號係如前述。

【 0066 】 反應F通常可藉由將式(1-4)之化合物，於過渡金屬觸媒、溶媒及惰性氣體的存在下，如有必要添加鹼，與式(10)之化合物或式(11)之化合物進行反應來進行。

【 0067 】 作為式(10)之化合物或式(11)之化合物，若能進行反應則並未特別限定，可依公知之方法調製，或可使用市售品。式(10)之化合物或式(11)之化合物相對於式(1-4)之化合物，可使用1~10當量，期望為1~5當量。

【 0068 】 作為過渡金屬觸媒，可列舉包含鈮、銅、銻、鈦、鎳、鈷、鋁等之過渡金屬的觸媒。作為過渡金屬觸媒，可使用有機鹵素化物之交叉偶合反應所使用之公知之各種構造者，於本反應包含鈮之過渡金屬觸媒特別有

用。作為包含鈮之過渡金屬觸媒，例如可列舉鈮-碳、氯化鈮、乙酸鈮、二氯雙(乙腈)鈮、雙(二苯亞基(Dibenzylidene)丙酮)鈮、二氯雙(三苯基膦)鈮、肆(三苯基膦)鈮、二氯雙(1,4-雙(二苯基膦基)丁烷)鈮等。又，如有必要可將第3級膦或第3級亞磷酸酯作為配位子使用。作為第3級膦或第3級亞磷酸酯，可列舉三苯基膦、苯基二甲基膦、三-o-甲苯基膦、三-p-甲苯基膦、1,2-雙(二苯基膦基)乙烷、1,3-雙(二苯基膦基)丙烷、1,4-雙(二苯基膦基)丁烷、1,1'-雙(二苯基膦基)二茂鐵、三苯基亞磷酸酯等。過渡金屬觸媒相對於式(1-4)之化合物1當量，可使用0.001~0.5當量，期望為0.05~0.2當量。又，配位子相對於過渡金屬觸媒1當量，通常可使用1~50當量，期望為1~10當量。惟，因反應條件亦可使用此範圍外的量。

【0069】 作為鹼，例如可列舉如碳酸鈉、碳酸鉀、碳酸銻之鹼金屬碳酸鹽；如甲醇鈉、乙醇鈉、第3級丁醇鉀之鹼金屬醇鹽；如碳酸氫鈉之鹼金屬的碳酸氫鹽；如碳酸鈣之鹼土類金屬的碳酸鹽；如氫氧化鈉、氫氧化鉀之金屬氫氧化物；如氫化鈉、氫化鉀之金屬氫化物；如三乙基胺、二異丙基乙基胺、吡啶、4-(N,N-二甲基胺基)吡啶、咪唑之有機胺類等。鹼相對於式(1-4)之化合物，可使用1~20當量，期望為1~10當量。

【0070】 溶媒若為對反應為惰性的溶媒則任何溶媒皆可，例如可從如苯、甲苯、二甲苯、氯苯之芳香族烴類；如四氯化碳、氯化甲烷、氯仿、二氯甲烷、二氯乙烷、三

氯乙烷、己烷、環己烷之脂肪族烴類；如二噁烷、四氫呋喃、二乙基醚、二甲氧基乙烷之醚類；如乙酸甲酯、乙酸乙酯之酯類；如二甲基亞砷、環丁砷、二甲基乙醯胺、N,N-二甲基甲醯胺、N-甲基吡咯烷酮、吡啶之極性非質子性溶媒；如乙腈、丙腈、丙烯腈之腈類；如丙酮、甲基乙基酮之酮類；如甲醇、乙醇、丙醇、tert-丁醇之醇類；水等中適當選擇1種或2種以上。

【0071】惰性氣體例如可使用氮氣體、氬氣體等。

【0072】反應溫度通常為 $-100\sim 200^{\circ}\text{C}$ ，期望為 $-78\sim 100^{\circ}\text{C}$ ，反應時間通常為 $0.5\sim 96$ 小時左右，期望為 $1\sim 48$ 小時左右。

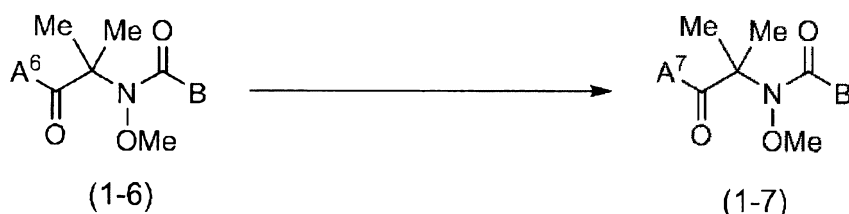
【0073】

反應 G

反應 G 係藉由 A^6 之 R^A 為胺基之式 (1-6) 之化合物與 (鹵) 烷基化劑或醯化劑的反應，或還原的烷基化反應，變換成 A^7 之 R^A 為 $-L^{A2}-Y^{A1}$ 之式 (1-7) 之化合物之方法。

【0074】

[化10]



【0075】式中， A^6 為被胺基取代之苯基或被胺基取代之吡啶基， A^7 為被 $-L^{A2}-Y^{A1}$ 取代之苯基或被 $-L^{A2}-Y^{A1}$ 取代之吡啶基， L^{A2} 為 $N(R^1)$ 、 $N(R^1)C(=O)$ 或 $N(R^1)C(=O)O$ ，其

他記號係如前述。

【0076】反應G當中，(鹵)烷基化劑或醃化劑的反應通常可於鹼及溶媒的存在下進行。(鹵)烷基化劑或醃化劑相對於式(1-6)之化合物1當量，可使用1~3當量，期望為1~2當量。

【0077】鹼及溶媒可使用前述反應E所列舉者。

作為(鹵)烷基化劑，例如可列舉如碘化甲烷、溴化甲烷之鹵素化烷基；硫酸二甲酯等之硫酸二烷酯；三甲基矽烷基重氮甲烷；氯二氟甲烷、氯二氟乙酸鈉等。

作為醃化劑，可列舉醃基氯等之酸氯化物；乙酸酐等之酸酐等。

【0078】反應溫度通常為-30~100℃，期望為0~50℃，反應時間通常為0.1~24小時左右，期望為0.1~12小時左右。

【0079】在反應G之還原的烷基化反應，依一般的還原的烷基化反應，可於醛、還原劑、酸及溶媒的存在下進行。醛相對於式(1-6)之化合物1當量，可使用1~10當量，期望為1~5當量。

作為在還原的烷基化之醛，例如可使用甲醛、乙醛等。

作為還原劑，例如可從氰基氫化硼鈉、氫化三乙醃氧基硼鈉等中適當選擇1種或2種以上。還原劑相對於式(1-6)之化合物1當量，可使用1~5當量，期望為1~2當量。

作為酸，例如可使用乙酸等。酸相對於式(1-6)之化合

物 1 當量，可使用 1~30 當量，期望為 1~10 當量。

作為溶媒，溶媒若為對反應為惰性的溶媒則任何溶媒皆可，例如可從如乙腈、丙腈之腈類；如二噁烷、四氫呋喃、二乙基醚、二甲氧基乙烷之醚類；如甲醇、乙醇、丙醇、*tert*-丁醇之醇類；水等中適當選擇 1 種或 2 種以上。

反應溫度通常為 0~80℃，期望為 0~50℃，反應時間通常為 0.1~48 小時左右，期望為 0.5~24 小時左右。

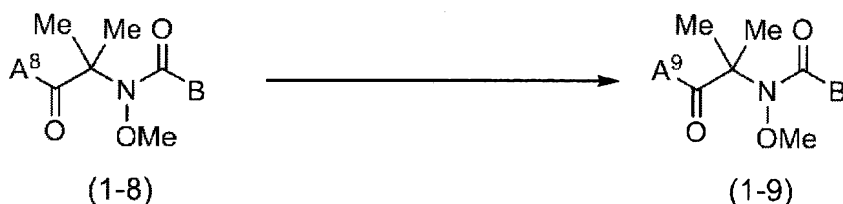
【0080】

反應 H

反應 H 係將式 (1-8) 之化合物變換成式 (1-9) 之化合物之方法。

【0081】

[化11]



【0082】式中，A⁸為被與相鄰之碳原子鍵結的 2 個羥基取代之苯基，A⁹為可被 Z¹取代之苯并二氧環戊基，其他記號係如前述。

【0083】反應 H 通常可於酮、醛或原酸酯、與酸或脫水劑及溶媒的存在下進行。酮、醛或原酸酯相對於式 (1-8) 之化合物 1 當量，可使用 1~50 當量，期望為 1~5 當量。

或反應 H 可於 1,1-二溴乙烷或二溴二氟甲烷、與鹼及溶媒的存在下進行。1,1-二溴乙烷及二溴二氟甲烷相對於

式(1-8)之化合物1當量，可使用1~10當量，期望為1~2當量。

【0084】作為酮、醛或原酸酯，雖可因應所期望之Z¹適當選擇，但例如可列舉如丙酮、甲基乙基酮之酮；如乙醛、異丁基醛之醛；如原甲酸乙酯、原乙酸乙酯之原酸酯。

作為酸，例如可列舉鹽酸、硫酸、對甲苯磺酸等。作為脫水劑，例如可列舉五氧化二磷等。作為鹼，例如可列舉如氫氧化鈉、氫氧化鉀之金屬氫氧化物；如碳酸鈉、碳酸鉀、碳酸銻之碳酸鹽等。酸相對於式(1-8)之化合物1當量，可使用0.01~5當量，期望為0.05~1當量。脫水劑或鹼相對於式(1-8)之化合物1當量，可使用1~10當量，期望為1~2當量。

溶媒若為對反應為惰性的溶媒則任何溶媒皆可，例如可從如苯、甲苯、二甲苯、氯苯之芳香族烴類；如四氯化碳、氯化甲烷、氯仿、二氯甲烷、二氯乙烷、三氯乙烷、己烷、環己烷之脂肪族烴類；如甲醇、乙醇、丙醇、tert-丁醇之醇類；如乙腈、丙腈、丙烯腈之腈類；如二甲基亞砜、環丁砜、二甲基乙醯胺、N,N-二甲基甲醯胺、N-甲基吡咯烷酮之極性非質子性溶媒等中適當選擇1種或2種以上。

【0085】反應溫度通常為0~150℃，期望為20~100℃，反應時間通常為0.1~48小時左右，期望為1~24小時左右。

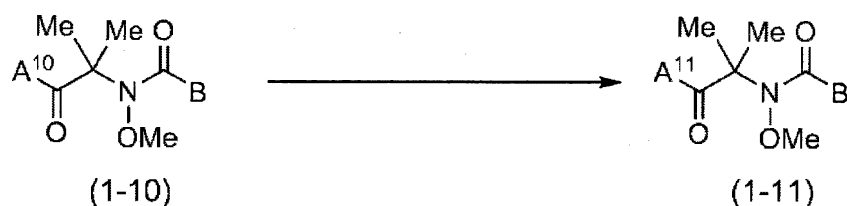
【 0086】

反應 I

反應 I 係將式 (1-10) 之化合物變換成式 (1-11) 之化合物之方法。

【 0087】

[化12]



【 0088】 式中， A^{10} 為被烯基或炔基取代之苯基或被烯基或炔基取代之吡啶基， A^{11} 為被烷基取代之苯基或被烷基取代之吡啶基，其他記號係如前述。

【 0089】 反應 I 可依一般的接觸還原，氫環境下，藉由將鉑、氧化鉑、鉑黑、雷尼鎳、鈀、鈀碳、銻、銻-氧化鋁等作為觸媒使用來進行。

【 0090】 反應 I 通常可於溶媒的存在下進行。溶媒若為對反應為惰性的溶媒則任何溶媒皆可，例如可從如苯、甲苯、二甲苯之芳香族烴類；如己烷、環己烷之脂肪族烴類；如二噁烷、四氫呋喃、二乙基醚、二甲氧基乙烷之醚類；如乙酸甲酯、乙酸乙酯之酯類；如二甲基亞砷、環丁砷、二甲基乙醯胺、N,N-二甲基甲醯胺、N-甲基吡咯烷酮、吡啶、乙腈、丙腈之極性非質子性溶媒；如丙酮、甲基乙基酮之酮類；如甲醇、乙醇、丙醇、tert-丁醇之醇類；水等中適當選擇 1 種或 2 種以上。

【0091】反應溫度通常為0~150℃，期望為0~80℃，反應時間通常為0.5~96小時左右，期望為0.5~48小時左右。

【0092】雖將反應A~I所使用之化合物的製造方法記載於以下，但並非被限定於此等之方法者，此等之化合物可依公知之方法製造，或可使用市售品。

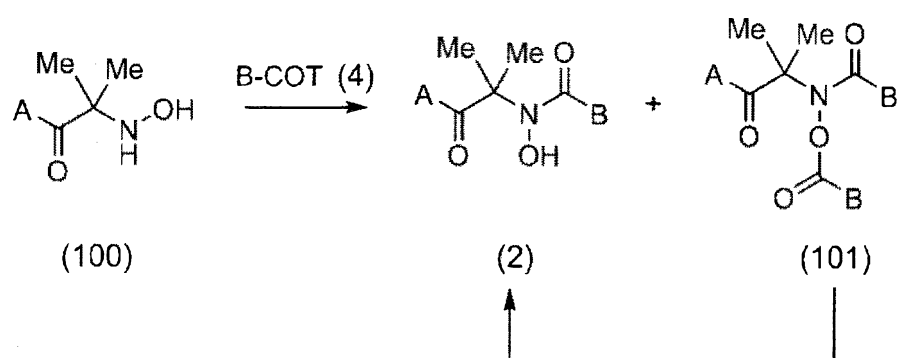
【0093】

反應 1-1

反應 1-1係將式(100)之化合物與式(4)之化合物進行反應，得到式(2)之化合物之方法。進而，藉由水解與式(2)之化合物一同得到之式(101)之化合物，可得到式(2)之化合物。

【0094】

[化13]



【0095】式中之記號係如前述。

【0096】在反應 1-1，式(100)之化合物與式(4)之化合物的反應通常可於鹼及溶媒的存在下進行，或如有必要可於脫水縮合劑的存在下進行。

作為鹼、溶媒及脫水縮合劑，可使用於前述反應 B 所

列舉者。式(4)之化合物相對於式(100)之化合物1當量，可使用1~3當量，期望為1~2當量。鹼相對於式(100)之化合物1當量，可使用1~3當量，期望為1~2當量。

【0097】反應溫度通常為0~100℃，期望為0~50℃，反應時間通常為0.5~48小時左右，期望為1~24小時左右。

【0098】在反應1-1，可藉由水解與式(2)之化合物一同得到之式(101)之化合物，對式(2)之化合物導入。

水解可依一般的水解的反應條件進行，通常可於酸或鹼及溶媒的存在下進行。

【0099】作為酸，例如可列舉鹽酸、硫酸等。作為鹼，例如可列舉如氫氧化鈉、氫氧化鉀之金屬氫氧化物等。酸或鹼相對於式(100)之化合物1當量，可使用1~10當量，期望為1~5當量。

溶媒若為對反應為惰性的溶媒則任何溶媒皆可，例如可從如甲醇、乙醇、丙醇、*tert*-丁醇之醇類；如乙腈、丙腈、丙烯腈之腈類；如丙酮、甲基乙基酮之酮類；水等中適當選擇1種或2種以上。

【0100】水解之反應溫度通常為0~100℃，期望為20~80℃，反應時間通常為0.1~12小時左右，期望為0.1~1小時左右。

【0101】反應1-1所使用之式(100)之化合物可依以下之反應1-4或反應1-5製造。式(4)之化合物可依以下之反應2-1或公知之方法製造，或可使用市售品。

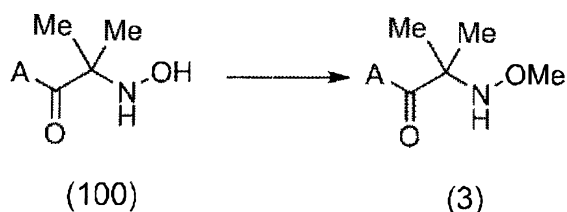
【 0102】

反應 1-2

反應 1-2 係藉由甲基化式 (100) 之化合物，得到式 (3) 之化合物之方法。

【 0103】

[化14]



【 0104】 式中之記號係如前述。

【 0105】 反應 1-2 可依前述反應 A 進行。

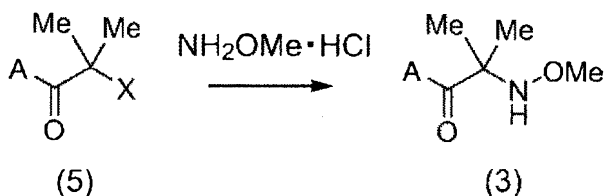
【 0106】

反應 1-3

反應 1-3 係將式 (5) 之化合物與 O-甲基羥基胺鹽酸鹽進行反應，得到式 (3) 之化合物之方法。

【 0107】

[化15]



【 0108】 式中之記號係如前述。

【 0109】 反應 1-3 可依照反應 C 進行。O-甲基羥基胺鹽酸鹽相對於式 (5) 之化合物 1 當量，可使用 1~3 當量，期望為 1~2 當量。

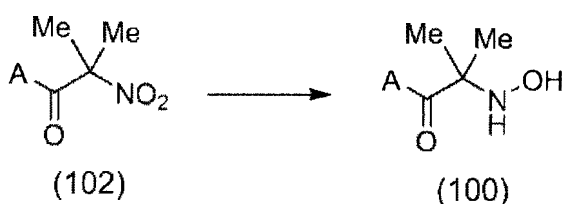
【0110】

反應 1-4

反應 1-4 係還原式 (102) 之化合物，得到式 (100) 之化合物之方法。

【0111】

[化16]



【0112】式中之記號係如前述。

【0113】作為還原反應，例如可於氫環境下藉由將氧化鉑、雷尼鎳、鈀-碳、銻等作為觸媒之接觸還原；於由如鐵、鋅之金屬、與如鹽酸、乙酸、氯化銨之酸所構成之反應系的還原來進行。

【0114】反應 1-4 通常可於溶媒的存在下進行。溶媒若為對反應為惰性的溶媒則任何溶媒皆可，例如可從如苯、甲苯、二甲苯之芳香族烴類；如己烷、環己烷之脂肪族烴類；如二噁烷、四氫呋喃、二乙基醚、二甲氧基乙烷之醚類；如乙酸甲酯、乙酸乙酯之酯類；如二甲基亞砷、環丁砷、二甲基乙醯胺、N,N-二甲基甲醯胺、N-甲基吡咯烷酮、吡啶、乙腈、丙腈之極性非質子性溶媒；如丙酮、甲基乙基酮之酮類；如甲醇、乙醇、丙醇、tert-丁醇之醇類；水等中適當選擇 1 種或 2 種以上。

【0115】反應溫度通常為 0 ~ 150 °C，期望為 0 ~ 80

℃，反應時間通常為0.5～96小時左右，期望為0.5～48小時左右。

【0116】前述反應1-4所使用之式(102)之化合物可依以下之反應1-6或反應1-8製造。

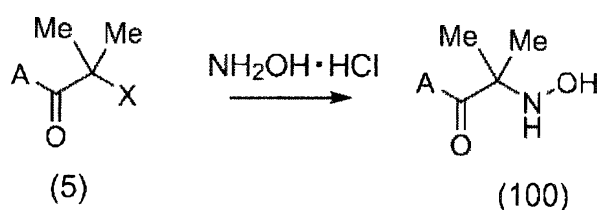
【0117】

反應1-5

反應1-5係將式(5)之化合物與羥基胺鹽酸鹽進行反應，得到式(100)之化合物之方法。

【0118】

[化17]



【0119】式中之記號係如前述。

【0120】反應1-5可依照反應C進行。羥基胺鹽酸鹽相對於式(5)之化合物1當量，可使用1～3當量，期望為1～2當量。

【0121】反應溫度通常為0～100℃，期望為20～80℃，反應時間通常為0.1～48小時左右，期望為1～24小時左右。

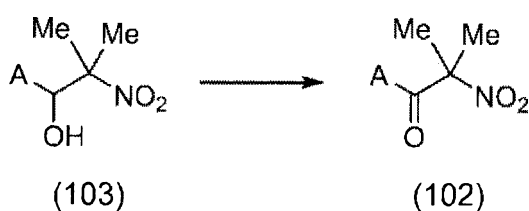
【0122】

反應1-6

反應1-6係氧化式(103)之化合物，得到式(102)之化合物之方法。

【 0123 】

[化18]



【 0124 】 式中之記號係如前述。

【 0125 】 作為氧化反應，例如可列舉於由鉻酸與硫酸、吡啶、吡啶鎘鹽所構成之反應系的氧化；於由二甲基亞砷與草醯氯所構成之反應系的氧化；於由過鈎酸四丙基銨與如N-甲基嗎啉-N-氧化物之共氧化劑所構成之反應系的氧化；藉由戴斯-馬丁氧化劑(Dess-Martin Periodinane)之氧化；藉由二氧化錳之氧化等。

【 0126 】 反應1-6通常可於溶媒的存在下進行。溶媒若為對反應為惰性的溶媒則任何溶媒皆可，例如可從如苯、甲苯、二甲苯之芳香族烴類；如四氯化碳、氯仿、二氯甲烷、二氯乙烷、三氯乙烷、己烷、環己烷之脂肪族烴類；如二噁烷、四氫呋喃、二乙基醚、二甲氧基乙烷之醚類；如乙酸甲酯、乙酸乙酯之酯類；如二甲基亞砷、環丁砷、二甲基乙醯胺、N,N-二甲基甲醯胺、N-甲基吡咯烷酮、吡啶、乙腈、丙腈之極性非質子性溶媒；如丙酮、甲基乙基酮之酮類；如甲醇、乙醇、丙醇、tert-丁醇之醇類；水等中適當選擇1種或2種以上。

【 0127 】 反應溫度通常為-78~150℃，期望為-50~80℃，反應時間通常為0.5~96小時左右，期望為0.5~48

小時左右。

【0128】反應1-6所使用之式(103)之化合物可依以下之反應1-7製造。

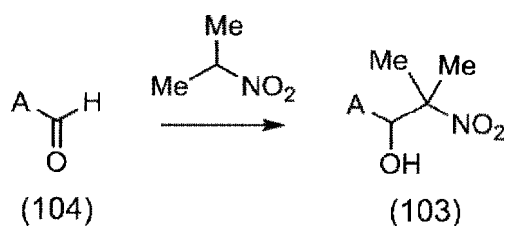
【0129】

反應1-7

反應1-7係將式(104)之化合物與2-硝基丙烷進行反應，得到式(103)之化合物之方法。

【0130】

[化19]



【0131】式中之記號係如前述。

【0132】反應1-7可依一般的硝基醇醛反應進行，通常可於鹼的存在下，如有必要可於溶媒的存在下進行。2-硝基丙烷相對於式(104)之化合物1當量，可使用1~30當量，期望為1~10當量。

【0133】作為鹼，例如可從如鈉、鉀之鹼金屬；如甲醇鈉、乙醇鈉、第3級丁醇鉀之鹼金屬醇鹽；如碳酸鈉、碳酸鉀之碳酸鹽；如碳酸氫鈉、碳酸氫鉀之碳酸氫鹽；如氫氧化鈉、氫氧化鉀之金屬氫氧化物；如氫化鈉、氫化鉀之金屬氫化物；如單甲基胺、二甲基胺、三乙基胺、二異丙基乙基胺之胺類；如1,8-二氮雜雙環[5.4.0]十一-7-烯之

脘類；如四甲基脘、1,5,7-三氮雜雙環[4.4.0]癸-5-烯之脘類等中適當選擇1種或2種以上。鹼相對於式(104)之化合物，可使用0.1~2當量，期望為0.1~1當量。

溶媒若為對反應為惰性的溶媒則任何溶媒皆可，例如可從如甲醇、乙醇、丙醇、tert-丁醇之醇類；如乙腈、丙腈、丙烯腈之腈類；如丙酮、甲基乙基酮之酮類；如四氯化碳、氯仿、二氯甲烷、二氯乙烷、三氯乙烷、己烷、環己烷之脂肪族烴類；如二噁烷、四氫呋喃、二乙基醚、二甲氧基乙烷之醚類；如二甲基亞砷、環丁砷、二甲基乙醯胺、N,N-二甲基甲醯胺、N-甲基吡咯烷酮、吡啶之極性非質子性溶媒；水等中適當選擇1種或2種以上。

【0134】反應溫度通常為0~100℃，期望為20~50℃，反應時間通常為0.1~168小時左右，期望為1~24小時左右。

【0135】反應1-7所使用之式(104)之化合物可依公知之方法製造，或可使用市售品。

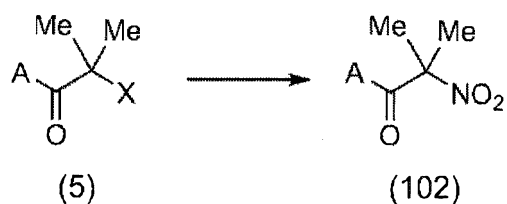
【0136】

反應1-8

反應1-8係硝基化式(5)之化合物，得到式(102)之化合物之方法。

【0137】

[化20]



【0138】式中之記號係如前述。

【0139】反應1-8通常可於硝基化劑及溶媒的存在下進行。

【0140】作為硝基化劑，例如可從亞硝酸鈉、亞硝酸鉀等中適當選擇1種或2種以上。硝基化劑相對於式(5)之化合物1當量，可使用1~2當量，期望為1~1.5當量。

溶媒若為對反應為惰性的溶媒則任何溶媒皆可，例如可從如苯、甲苯、二甲苯、氯苯之芳香族烴類；如四氯化碳、氯仿、二氯甲烷、二氯乙烷、三氯乙烷、己烷、環己烷之脂肪族烴類；如二噁烷、四氫呋喃、二乙基醚、二甲氧基乙烷之醚類；如乙酸甲酯、乙酸乙酯之酯類；如二甲基亞砜、環丁砜、二甲基乙醯胺、N,N-二甲基甲醯胺、N-甲基吡咯烷酮、吡啶、乙腈、丙腈之極性非質子性溶媒；如丙酮、甲基乙基酮之酮類；如甲醇、乙醇、丙醇、tert-丁醇之醇類；水等中適當選擇1種或2種以上。

【0141】反應溫度通常為0~150℃，期望為20~50℃，反應時間通常為0.1~96小時左右，期望為0.5~24小時左右。

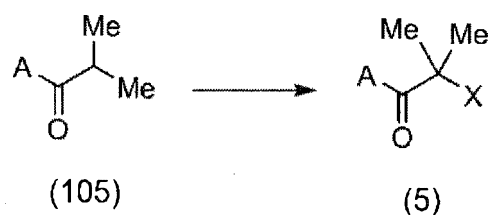
【0142】

反應1-9

反應 1-9 係鹵素化式 (105) 之化合物，得到式 (5) 之化合物之方法。

【0143】

[化21]



【0144】式中之記號係如前述。

【0145】反應 1-9 可於鹵素化劑 (例如氯化劑、溴化劑或碘化劑) 及溶媒的存在下，如有必要可於鹼的存在下進行。鹵素化劑相對於式 (105) 之化合物 1 當量，可使用 1~2 當量，期望為 1~1.5 當量。

【0146】作為氯化劑，例如可從氯、N-氯琥珀醯亞胺等中適當選擇 1 種或 2 種以上，作為溴化劑，例如可從溴、N-溴琥珀醯亞胺、三甲基苯基三溴化銨等中適當選擇 1 種或 2 種以上，作為碘化劑，例如可從碘、N-碘琥珀醯亞胺等中適當選擇 1 種或 2 種以上。

溶媒若為對反應為惰性的溶媒則任何溶媒皆可，例如可從如四氯化碳、氯化甲烷、氯仿、二氯甲烷、二氯乙烷、三氯乙烷、己烷、環己烷之脂肪族烴類；如二噁烷、四氫呋喃、二乙基醚、二甲氧基乙烷之醚類；如乙酸甲酯、乙酸乙酯之酯類；如二甲基亞砷、環丁砷、二甲基乙醯胺、N,N-二甲基甲醯胺、N-甲基吡咯烷酮、吡啶之極性

非質子性溶媒；如乙酸、丙酸之有機酸；水等中適當選擇1種或2種以上。

作為鹼，例如可列舉鋰二異丙基醯胺等。鹼相對於式(105)之化合物，可使用1~2當量，期望為1~1.2當量。

於鹼的存在下進行時，通常溶媒可從如四氫呋喃、二乙基醚之醚類中適當選擇1種或2種以上。

反應1-9如有必要可將如乙酸、丙酸之有機酸或如氯化鋁之路易斯酸作為觸媒使用。又，可藉由過剩使用作為觸媒之有機酸，兼作溶媒。

【0147】 反應溫度通常為 $-100\sim 150^{\circ}\text{C}$ ，期望為 $-78\sim 110^{\circ}\text{C}$ ，反應時間通常為0.1~48小時左右，期望為0.5~24小時左右。於鹼的存在下進行時，反應溫度通常為 $-100\sim 0^{\circ}\text{C}$ ，期望為 $-78\sim -20^{\circ}\text{C}$ ，反應時間通常為0.1~12小時左右，期望為0.5~6小時左右，又，於酸的存在下進行時，反應溫度通常為 $0\sim 150^{\circ}\text{C}$ ，期望為 $20\sim 110^{\circ}\text{C}$ ，反應時間通常為0.1~48小時左右，期望為1~24小時左右。

【0148】 反應1-9所使用之式(105)之化合物可依以下之反應1-10~反應1-19製造。

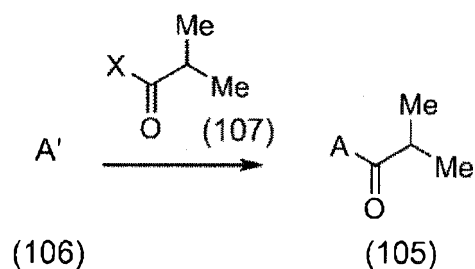
【0149】

反應1-10

反應1-10係藉由式(106)之化合物及式(107)之化合物的佛瑞德-克來福特反應，得到式(105)之化合物之方法。

【0150】

[化22]



【0151】式中，A'係相當於A之環，其他記號係如前述。

【0152】反應1-10可依一般的佛瑞德-克來福特反應進行，通常可於酸及溶媒的存在下進行。式(107)之化合物相對於式(106)之化合物1當量，可使用1~3當量，期望為1~2當量。

作為酸，例如可從如鹽酸、硫酸之無機酸；如對甲苯磺酸、三氟甲烷磺酸之有機酸；如氯化鋁、氯化鐵、氯化鋅、乙醚合三氟化硼之路易斯酸等中適當選擇1種或2種以上。酸相對於式(106)之化合物1當量，可使用0.1~3當量，期望為1~2當量。

溶媒若為對反應為惰性的溶媒則任何溶媒皆可，例如可從如乙腈、丙腈、丙烯腈之腈類；如四氯化碳、氯仿、二氯甲烷、二氯乙烷、三氯乙烷、己烷、環己烷之脂肪族烴類；如二噁烷、四氫呋喃、二乙基醚、二甲氧基乙烷之醚類；如二甲基亞砷、環丁砷、二甲基乙醯胺、N,N-二甲基甲醯胺、N-甲基吡咯烷酮、吡啶之極性非質子性溶媒等中適當選擇1種或2種以上。

【0153】反應溫度通常為0~100℃，期望為0~80

°C，反應時間通常為0.1~48小時左右，期望為1~24小時左右。

【0154】反應1-10所使用之式(106)及式(107)之化合物可依公知之方法製造，或可使用市售品。

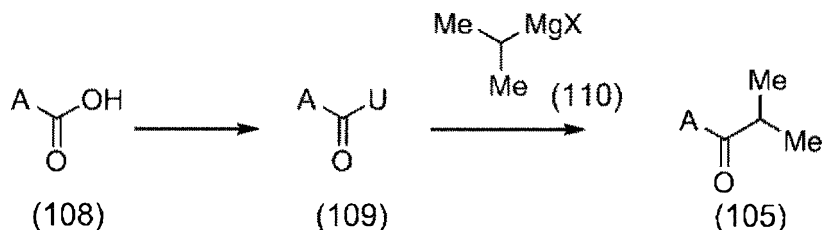
【0155】

反應1-11

反應1-11係包含氯化或醯胺化式(108)之化合物，得到式(109)之化合物之第1步驟，及將式(109)之化合物與式(110)之化合物進行反應，得到式(105)之化合物之第2步驟的方法。

【0156】

[化23]



【0157】式中，U為氯原子、二烷基胺基(例如二甲基胺基、二乙基胺基)或N-甲氧基-N-甲基胺基，其他記號係如前述。

【0158】

第1步驟

第1步驟為氯化時，可於氯化劑及溶媒的存在下進行，為醯胺化時，可於二烷基胺(例如二甲基胺)或N-甲氧基-N-甲基胺、脫水縮合劑、鹼及溶媒的存在下進行。

【0159】作為氯化劑，例如可從亞硫醯氯、草醯氯、五氯化磷等中適當選擇1種或2種以上。氯化劑相對於式(108)之化合物1當量，可使用1~3當量，期望為1~2當量。

作為脫水縮合劑、鹼及溶媒，可使用於前述反應B所列舉者。脫水縮合劑相對於式(108)之化合物1當量，可使用1~3當量，期望為1~2當量。鹼相對於式(108)之化合物，可使用1~10當量，期望為1~5當量。

【0160】反應溫度通常為0~100℃，期望為0~80℃，反應時間通常為0.1~48小時左右，期望為1~24小時左右。

【0161】

第2步驟

第2步驟通常可於溶媒的存在下，如有必要可於惰性氣體的存在下進行。式(110)之化合物相對於式(108)或式(109)之化合物，可使用1~3當量，期望為1~1.5當量。

【0162】溶媒若為對反應為惰性的溶媒則任何溶媒皆可，例如可從如二噁烷、四氫呋喃、二乙基醚之醚類等中適當選擇1種或2種以上。惰性氣體，例如可從氮氣體、氬氣體等中適當選擇。

【0163】反應溫度通常為-20~100℃，期望為0~50℃，反應時間通常為1~48小時左右，期望為1~20小時左右。

【0164】反應1-11所使用之式(108)及式(110)之化合

物可依公知之方法製造，或可使用市售品。

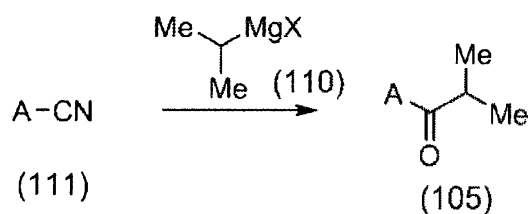
【0165】

反應 1-12

反應 1-12 係將式 (111) 之化合物與式 (110) 之化合物進行反應，得到式 (105) 之化合物之方法。

【0166】

[化24]



【0167】 式中之記號係如前述。

【0168】 反應 1-12 通常可於溶媒的存在下，如有必要可於觸媒及惰性氣體的存在下進行。式 (110) 之化合物相對於式 (111) 之化合物 1 當量，可使用 1~3 當量，期望為 1~1.5 當量。觸媒相對於式 (111) 之化合物 1 當量，可使用 0.001~1 當量，期望為 0.01~0.5 當量。

【0169】 作為觸媒，例如可列舉碘化銅(I)等。

溶媒及惰性氣體可使用於前述反應 1-11 之第 2 步驟所列舉者。

【0170】 反應溫度通常為 -20~100℃，期望為 0~50℃，反應時間通常為 1~48 小時左右，期望為 1~20 小時左右。

【0171】 反應 1-12 所使用之式 (111) 之化合物可依公知之方法製造，或可使用市售品。

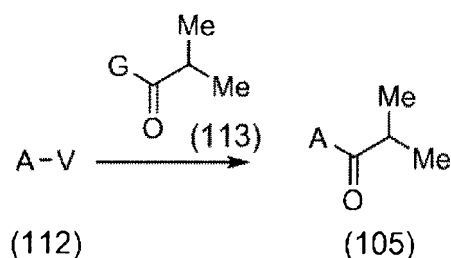
【 0172】

反應 1-13

反應 1-13 係將式 (112) 之化合物與式 (113) 之化合物進行反應，得到式 (105) 之化合物之方法。

【 0173】

[化25]



【 0174】 式中，V 為溴原子或碘原子，G 為脫離基(例如如氯原子、溴原子之鹵素；如甲氧基、環氧基之烷氧基；如二甲基胺基、二乙基胺基之二烷基胺基；可被 N-甲氧基-N-甲基胺基或烷基取代之氮丙啶基等)，其他記號係如前述。

【 0175】 反應 1-13 通常可於有機金屬試藥及溶媒的存在下，或可於金屬鎂、活性化劑及溶媒的存在下，如有必要可於惰性氣體的存在下進行。式 (113) 之化合物相對於式 (112) 之化合物 1 當量，可使用 1~3 當量，期望為 1~1.5 當量。

有機金屬試藥可從如甲基鋰、n-丁基鋰之有機鋰化合物；如異丙基氯化鎂之格氏化合物等中適當選擇 1 種或 2 種以上。有機金屬試藥相對於式 (112) 之化合物 1 當量，可使用 1~2 當量，期望為 1~1.5 當量。

金屬鎂相對於式(112)之化合物1當量，可使用1~3當量，期望為1~1.5當量。作為活性化劑，可列舉碘、1,2-二溴乙烷等。活性化劑相對於式(112)之化合物1當量，可使用0.01~1當量，期望為0.05~0.5當量。

溶媒若為對反應為惰性的溶媒則任何溶媒皆可，例如可從如己烷、環己烷之脂肪族烴類；如二噁烷、四氫呋喃、二乙基醚之醚類等中適當選擇1種或2種以上。

惰性氣體例如可從氮氣體、氬氣體等中適當選擇。

【0176】反應溫度通常為-100~100℃，期望為-78~80℃，反應時間通常為1~48小時左右，期望為1~20小時左右。

【0177】反應1-13所使用之式(112)及式(113)之化合物可依公知之方法製造，或可使用市售品。

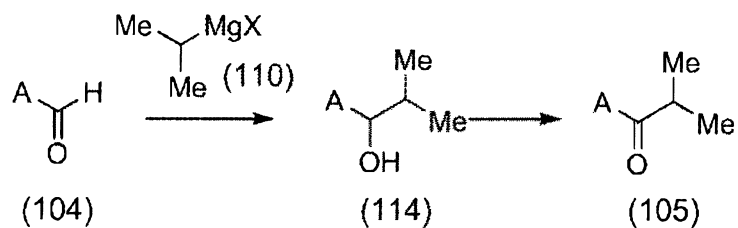
【0178】

反應1-14

反應1-14係包含使式(104)之化合物及式(110)之化合物進行反應，得到式(114)之化合物之第1步驟，以及氧化式(114)之化合物，得到式(105)之化合物之第2步驟的方法。

【0179】

[化26]



【0180】式中之記號係如前述。

【0181】

第1步驟

第1步驟可依前述反應1-11之第2步驟進行。

【0182】

第2步驟

第2步驟可依前述反應1-6進行。

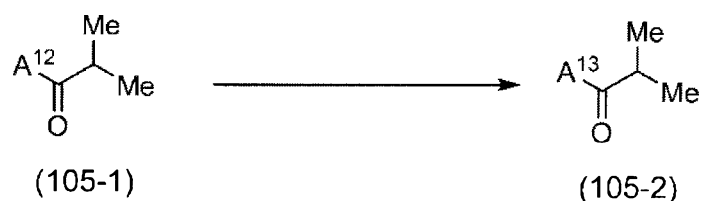
【0183】

反應1-15

反應1-15係藉由 A^{12} 之 R^A 為 $-L^{A3}-Y^{A2}$ 之式(105-1)之化合物與(鹵)烷基化劑、醯化劑或烷氧基羰基化劑的反應、光延反應或還原的烷基化，變換成 A^{13} 之 R^A 為 $-L^{A4}-Y^{A2}$ 之式(105-2)之化合物的方法。

【0184】

[化27]

【0185】式中， A^{12} 為被 $-L^{A3}-Y^{A2}$ 取代之苯基或被

$-L^{A^3}-Y^{A^2}$ 取代之吡啶基， L^{A^3} 為O、S或 $N(R^1)$ ， A^{13} 為被
 $-L^{A^4}-Y^{A^2}$ 取代之苯基或被 $-L^{A^4}-Y^{A^2}$ 取代之吡啶基， L^{A^4} 為
 O、 $OC(=O)$ 、S、 $N(R^1)$ 、 $N(R^1)C(=O)$ 或 $N(R^1)C(=O)O$ ，其
 他記號係如前述。

【0186】反應1-15可依反應G進行。

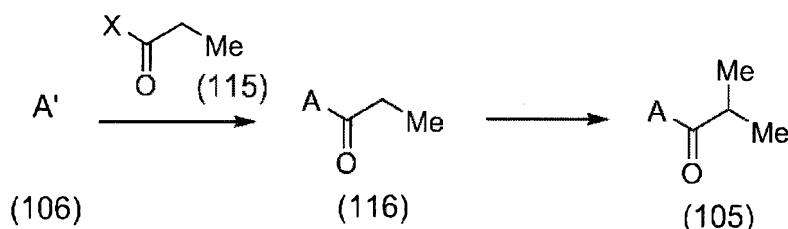
【0187】

反應1-16

反應1-16係包含藉由式(106)之化合物及式(115)之化
 合物的佛瑞德-克來福特反應，得到式(116)之化合物之第1
 步驟，及甲基化式(116)之化合物，得到式(105)之化合物
 之第2步驟的方法。

【0188】

[化28]



【0189】式中之記號係如前述。

【0190】第1步驟可依前述反應1-10進行。

【0191】第2步驟可依前述反應A進行。

【0192】

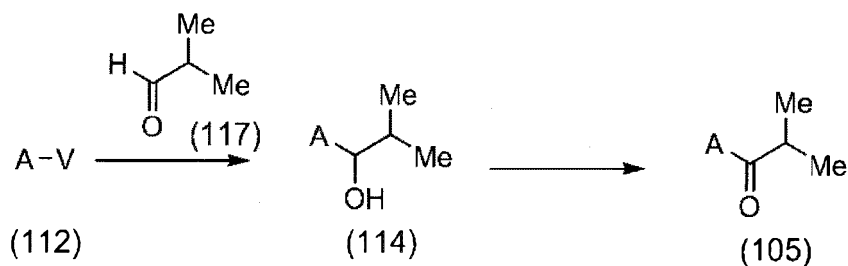
反應1-17

反應1-17係包含將式(112)之化合物與(117)之化合物
 進行反應，得到式(114)之化合物之第1步驟，及氧化式

(114)之化合物，得到式(105)之化合物之第2步驟的方法。

【0193】

[化29]



【0194】

第1步驟

第1步驟可依前述反應1-13進行。

【0195】

第2步驟

第2步驟可依前述反應1-6進行。

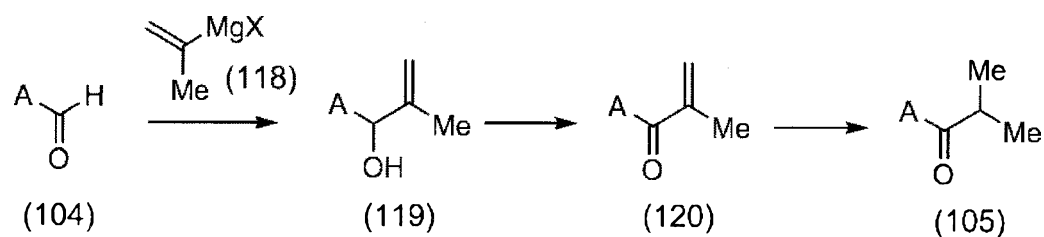
【0196】

反應1-18

反應1-18係包含使式(104)之化合物及式(118)之化合物進行反應，得到式(119)之化合物之第1步驟，氧化式(119)之化合物，得到式(120)之化合物之第2步驟的方法，以及還原式(120)之化合物，得到式(105)之化合物之第3步驟的方法。

【0197】

[化30]



【0198】式中之記號係如前述。

【0199】

第1步驟

第1步驟可依前述反應1-11之第2步驟進行。

【0200】

第2步驟

第2步驟可依前述反應1-6進行。

【0201】

第3步驟

第3步驟可依前述反應I進行。

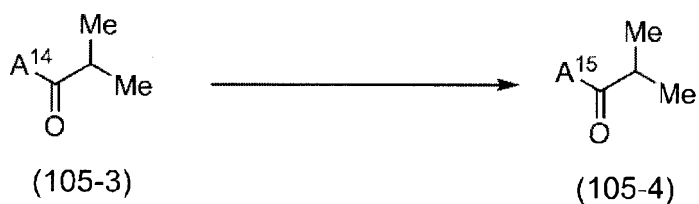
【0202】

反應1-19

反應1-19係將A¹⁴之R^A為羥基之式(105-3)之化合物，變換成A¹⁵之R^A為巰基或胺基之式(105-4)之化合物的方法。

【0203】

[化31]



【0204】式中， A^{14} 為被羥基取代之苯基或被羥基取代之吡啶基， A^{15} 為被巰基或胺基取代之苯基或被巰基或胺基取代之吡啶基，其他記號係如前述。

【0205】反應1-19可依一般的Froberg·Schönberg反應進行。通常可於鹼及溶媒的存在下，將式(105-3)之化合物與二甲基硫代胺甲醯氯進行反應，接著經由重排反應、水解，得到式(105-4)之化合物。二甲基硫代胺甲醯氯相對於式(105-3)之化合物1當量，可使用1~5當量，期望為1~2當量。

或反應1-19可依一般的Smiles重排反應進行。通常可於鹼及溶媒的存在下，將式(105-3)之化合物與2-溴異丁基醯胺進行反應，接著經由重排反應、水解，得到式(105-4)之化合物。2-溴異丁基醯胺相對於式(105-3)之化合物1當量，可使用1~10當量，期望為1~3當量。

重排反應可於溶媒的存在下進行，水解可依前述反應1-1進行。

【0206】在反應1-19，作為鹼，可使用於前述反應1-7所列舉者。鹼相對於式(105-3)之化合物1當量，可使用1~5當量，期望為1~3當量。

溶媒若為對反應為惰性的溶媒則任何溶媒皆可，例如可從如乙腈、丙腈、丙烯腈之腈類；如四氯化碳、氯仿、二氯甲烷、二氯乙烷、三氯乙烷、己烷、環己烷之脂肪族烴類；如二噁烷、四氫呋喃、二乙基醚、二甲氧基乙烷之醚類；如二甲基亞砷、環丁砷、二甲基乙醯胺、N,N-二甲

基甲醯胺、N-甲基吡咯烷酮、吡啶之極性非質子性溶媒；
N,N-二甲基苯胺等中適當選擇1種或2種以上。

【0207】反應溫度通常為0~200℃，期望為20~150℃，反應時間通常為1~48小時左右，期望為1~20小時左右。

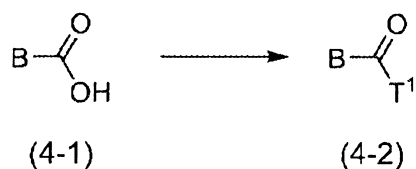
【0208】

反應2-1

反應2-1係藉由式(4)之化合物當中，溴化或氯化T為羥基之式(4-1)之化合物，得到T為溴原子或氯原子之式(4-2)之化合物的方法。

【0209】

[化32]



【0210】式中，T¹為溴原子或氯原子，其他記號係如前述。

【0211】反應2-1通常可將式(4-1)之化合物於溶媒的存在下，藉由與溴化劑或氯化劑進行反應來進行。

【0212】作為溶媒，若能進行反應則並未特別限定，例如可從如苯、甲苯、二甲苯、氯苯之芳香族烴類；如己烷、庚烷、石油醚、石油醚、環己烷之脂肪族烴類；如氯仿、二氯甲烷、四氯化碳、1,2-二氯乙烷之鹵素化烴類；二乙基醚、四氫呋喃、二噁烷等之醚類及此等之混合溶媒

等中適當選擇1種或2種以上。

作為溴化劑，若能進行反應則並未特別限定，可列舉磷醯溴等。作為氯化劑，若能進行反應則並未特別限定，可列舉草醯氯、亞硫醯氯、磷醯氯等。溴化劑或氯化劑相對於式(4-1)之化合物1當量，可以1~10當量，期望為1~3當量的比例使用。

【0213】反應2-1亦可添加N,N-二甲基甲醯胺進行。N,N-二甲基甲醯胺相對於式(4-1)之化合物1當量，可以0.01~3當量，期望為0.05~0.3當量的比例使用。

【0214】反應溫度通常為0~200℃，期望為0~100℃，反應時間通常為0.1~12小時左右。

【0215】式(4-1)之化合物可依公知之方法或藉由後述之方法製造，或可使用市售品。作為公知之方法，例如雖可列舉國際公開公報WO1993/11117號、美國專利第5,093,347號等，但並非被限定於此等，若為本發明領域具有通常知識者，可將各式各樣之文獻所記載的一般的合成方法或適當組合該等，適用在本發明。

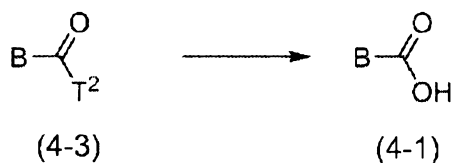
【0216】

反應2-2

反應2-2係將 T^2 為烷氧基或芳氧基之式(4-3)之化合物與酸或鹼進行反應，得到式(4-1)之化合物之方法。

【0217】

[化33]



【0218】式中， T^2 為烷氧基或芳氧基，其他記號係如前述。

【0219】反應2-2通常可藉由將式(4-3)之化合物於溶媒的存在下，與酸或鹼進行反應來進行。

【0220】作為酸，若能進行反應則並未特別限定，例如可使用鹽酸、硫酸、三氟乙酸、p-甲苯磺酸等。作為鹼，若能進行反應則並未特別限定，例如可列舉如碳酸鈉、碳酸鉀、碳酸銻之鹼金屬碳酸鹽；如碳酸氫鈉之鹼金屬的碳酸氫鹽；如碳酸鈣之鹼土類金屬的碳酸鹽；如氫氧化鈉、氫氧化鉀之金屬氫氧化物等。酸或鹼相對於式(4-3)之化合物1當量，可以0.1~20當量，期望為0.1~10當量的比例使用。

作為溶媒，若能進行反應則並未特別限定，例如可從苯、甲苯等之芳香族烴類；如己烷、庚烷之脂肪族烴類；二乙基醚、四氫呋喃、二噁烷等之醚類；甲醇、乙醇等之醇類；氯仿、二氯乙烷、四氯化碳等之鹵素化烴類；水及此等之混合溶媒等中適當選擇1種或2種以上。

【0221】反應溫度通常為0~200℃，期望為0~100℃，反應時間通常為1~48小時左右。

【0222】式(4-3)之化合物可依公知之方法或藉由後述

之方法製造，或可使用市售品。作為公知之方法，例如雖可列舉國際公開公報 WO2001/23358 號、Journal of the American Chemical Society、128 卷、5310～5311 頁(2006 年)、美國專利第 5,093,347 號、美國專利第 5,223,526 號等，但並非被限定於此等，若為本發明領域具有通常知識者，亦可將各式各樣之文獻所記載的一般的合成方法或適當組合該等，適用在本發明。

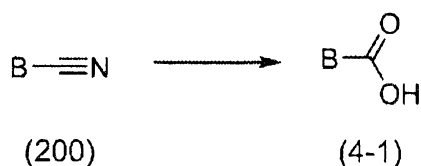
【0223】

反應 2-3

反應 2-3 係將式 (200) 之化合物與酸或鹼進行反應，得到式 (4-1) 之化合物之方法。

【0224】

[化34]



【0225】 式中之記號係如前述。

【0226】 反應 2-3 通常可藉由將式 (200) 之化合物於溶媒的存在下，與酸或鹼進行反應來進行。

【0227】 作為酸、鹼及溶媒，可使用於前述反應 2-2 所列舉者。酸或鹼相對於式 (200) 之化合物 1 當量，可以 1～20 當量，期望為 1～10 當量的比例使用。

【0228】 反應溫度通常為 0～200℃，期望為 0～100℃，反應時間通常為 1～48 小時左右。

【0229】式(200)之化合物可依公知之方法製造，或可使用市售品。

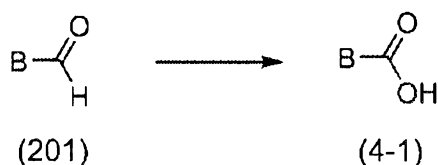
【0230】

反應 2-4

反應 2-4 係藉由氧化式(201)之化合物，得到式(4-1)之化合物之方法。

【0231】

[化35]



【0232】式中之記號係如前述。

【0233】反應 2-4 通常可藉由將式(201)之化合物於溶媒的存在下，與氧化劑進行反應來進行。

【0234】作為氧化劑，若能進行反應則並未特別限定，例如可列舉亞氯酸鈉、氧化鉻、二鉻酸吡啶鎊、過錳酸鉀等。氧化劑相對於式(201)之化合物 1 當量，可以 0.01 ~ 20 當量，期望為 0.1 ~ 10 當量的比例使用。

作為溶媒，若能進行反應則並未特別限定，例如可從如苯、甲苯、二甲苯、氯苯之芳香族烴類；如己烷、庚烷、石油醚、石油醚、環己烷之脂肪族烴類；如氯仿、二氯甲烷、四氯化碳、1,2-二氯乙烷之鹵素化烴類；如乙醇、甲醇、丁醇之醇類；水及此等之混合溶媒等中適當選擇 1 種或 2 種以上。

【0235】作為反應溫度，通常為 $-100\sim 100^{\circ}\text{C}$ ，期望為 $-80\sim 50^{\circ}\text{C}$ ，反應時間通常為 $1\sim 48$ 小時左右。

【0236】式(201)之化合物可依公知之方法製造，或可使用市售品。

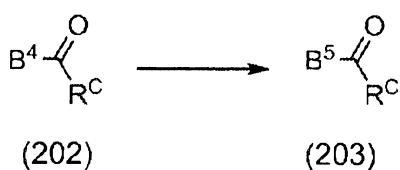
【0237】

反應2-5

反應2-5係將式(202)之化合物變換成式(203)之化合物之方法。

【0238】

[化36]



【0239】式中， B^4 為被 X 取代之雜環基， B^5 為被 Q^1 取代之雜環基， Q^1 為烷基、鹵烷基、氰基或環烷基， R^{C} 為氫原子、烷氧基或芳基烷氧基，其他記號係如前述。

【0240】反應2-5可依反應F進行。

【0241】式(202)之化合物可依公知之方法製造，或可使用市售品。

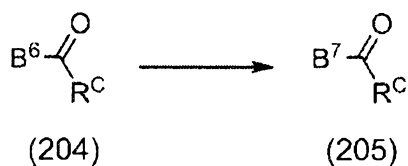
【0242】

反應2-6

反應2-6係將式(204)之化合物變換成式(205)之化合物之方法。

【0243】

[化37]



【0244】式中， B^6 為被 Q^2 取代之雜環基， B^7 為被單氟烷基或烷氧基烷基取代之雜環基， Q^2 為被 Q^3 取代之烷基， Q^3 為羥基、氯原子、溴原子、碘原子、硝基、烷基磺酸酯或氟磺酸酯，其他記號係如前述。

【0245】反應2-6通常可於鹼及溶媒的存在下，藉由與烷基化劑及氟化劑進行反應來進行。

【0246】作為烷基化劑，若能進行反應則並未特別限定，例如可列舉如碘化甲烷、溴化甲烷之鹵素化烷基、硫酸二甲酯等之硫酸二烷基酯、三甲基矽烷基重氮甲烷等。

作為氟化劑，若能進行反應則並未特別限定，可列舉如氟化銫之氟化物鹽；如氟化四-n-丁基銨等之四級銨鹽；如CRYSTAL FLUOR之脫氧的氟化劑等。

作為鹼，例如可從如甲醇鈉、乙醇鈉、第3級丁醇鉀之鹼金屬醇鹽；如碳酸鈉、碳酸鉀之碳酸鹽；如碳酸氫鈉、碳酸氫鉀之碳酸氫鹽；如氫氧化鈉、氫氧化鉀之金屬氫氧化物；如氫化鈉、氫化鉀之金屬氫化物；如單甲基胺、二甲基胺、三乙基胺、二異丙基乙基胺之胺類；如吡啶、4-二甲基胺基吡啶之吡啶類；如甲基鋰、n-丁基鋰、鋰二異丙基醯胺之有機鋰化合物等中適當選擇1種或2種以上。烷基化劑、氟化劑或鹼相對於式(204)之化合物1當

量，可以1~20當量，期望為1~10當量的比例使用。

溶媒若為對反應為惰性的溶媒則任何溶媒皆可，例如可從如苯、甲苯、二甲苯、氯苯之芳香族烴類；如四氯化碳、氯化甲烷、氯仿、二氯甲烷、二氯乙烷、三氯乙烷、己烷、環己烷之脂肪族烴類；如二噁烷、四氫呋喃、二乙基醚、二甲氧基乙烷之醚類；如甲醇、乙醇、丙醇、tert-丁醇之醇類；如二甲基亞砷、環丁砷、二甲基乙醯胺、N,N-二甲基甲醯胺、N-甲基吡咯烷酮、吡啶、乙腈、丙腈之極性非質子性溶媒；水及此等之混合溶媒等中適當選擇1種或2種以上。

【0247】反應溫度通常為0~100℃，期望為0~80℃，反應時間通常為0.1~48小時左右，期望為0.1~24小時左右。

【0248】式(204)之化合物可依公知之方法製造，或可使用市售品。

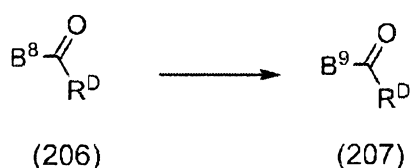
【0249】

反應2-7

反應2-7係得到具有氟原子之式(207)之化合物的方法。

【0250】

[化38]



【0251】式中， B^8 為可被 Q^5 取代之雜環基， B^9 為被氟取代之雜環基， Q^5 為脫離基(例如氯、溴、碘、硝基、烷基磺酸酯或氟磺酸酯等)、胺基或羥基， R^D 為氫、烷氧基、芳氧基、芳基烷氧基、羥基或鹵素。

【0252】在反應2-7， Q^5 為脫離基時，通常於溶媒的存在下，可藉由將式(206)之化合物與氟化劑進行反應，得到式(207)之化合物。

作為氟化劑，若能進行反應則並未特別限定，可列舉如氟化銫之氟化物鹽；如氟化四甲基銨、氟化四-n-丁基銨等之四級銨鹽等。氟化劑相對於式(206)之化合物1當量，可以1~20當量，期望為1~10當量的比例使用。

溶媒若為對反應為惰性的溶媒則任何溶媒皆可，例如可從如苯、甲苯、二甲苯、氯苯之芳香族烴類；如四氯化碳、氯化甲烷、氯仿、二氯甲烷、二氯乙烷、三氯乙烷、己烷、環己烷之脂肪族烴類；如二噁烷、四氫呋喃、二乙基醚、二甲氧基乙烷之醚類；如二甲基亞砷、環丁砷、二甲基乙醯胺、N,N-二甲基甲醯胺、N-甲基吡咯烷酮、吡啶、乙腈、丙腈之極性非質子性溶媒及此等之混合溶媒等中適當選擇1種或2種以上。

反應溫度通常為0~200℃，期望為20~150℃，反應時間通常為0.1~48小時左右，期望為0.1~24小時左右。

【0253】在反應2-7， Q^5 為胺基時，可藉由Balz-Seaman反應，得到式(207)之化合物。此情況下，通常於溶媒的存在下，將式(206)之化合物與亞硝酸鈉及四氟硼

酸進行反應。亞硝酸鈉及四氟硼酸相對於式(206)之化合物1當量，可以1~20當量，期望為1~10當量的比例使用。

溶媒若為對反應為惰性的溶媒則任何溶媒皆可，例如可從如苯、甲苯、二甲苯、氯苯之芳香族烴類；如四氯化碳、氯化甲烷、氯仿、二氯甲烷、二氯乙烷、三氯乙烷、己烷、環己烷之脂肪族烴類；如二噁烷、四氫呋喃、二乙基醚、二甲氧基乙烷之醚類；如二甲基亞砷、環丁砷、二甲基乙醯胺、N,N-二甲基甲醯胺、N-甲基吡咯烷酮、吡啶、乙腈、丙腈之極性非質子性溶媒及此等之混合溶媒等中適當選擇1種或2種以上。

反應溫度通常為0~200℃，期望為20~150℃，反應時間通常為0.1~48小時左右，期望為0.1~24小時左右。

【0254】在反應2-7， Q^5 為羥基時，於式(206)之化合物，通常於溶媒的存在下，如有必要於氟化物鹽的存在下，可藉由使脫氧的氟化劑進行反應，得到式(207)之化合物。

脫氧的氟化劑若能進行反應則並未特別限定，可列舉PhenoFluor等。脫氧的氟化劑相對於式(206)之化合物1當量，可以1~20當量，期望為1~10當量的比例使用。

氟化物鹽可列舉氟化鉀、氟化銻等。氟化物鹽相對於式(206)之化合物1當量，可以1~10當量，期望為1~5當量的比例使用。

溶媒若為對反應為惰性的溶媒則任何溶媒皆可，例如

可從如苯、甲苯、二甲苯、氯苯之芳香族烴類；如四氯化碳、氯化甲烷、氯仿、二氯甲烷、二氯乙烷、三氯乙烷、己烷、環己烷之脂肪族烴類；如二噁烷、四氫呋喃、二乙基醚、二甲氧基乙烷之醚類；如二甲基亞砷、環丁砷、二甲基乙醯胺、N,N-二甲基甲醯胺、N-甲基吡咯烷酮、吡啶、乙腈、丙腈之極性非質子性溶媒及此等之混合溶媒等中適當選擇1種或2種以上。

反應溫度通常為0~200℃，期望為20~150℃，反應時間通常為0.1~48小時左右，期望為0.1~24小時左右。

【0255】在反應2-7，B⁸為未被Q⁵取代之雜環基時，通常於溶媒的存在下，如有必要於鹼的存在下，可藉由使親電子的氟化劑進行反應，得到式(207)之化合物。

親電子的氟化劑若能進行反應則並未特別限定，可列舉氟試劑(Selectfluor)、N-氟苯磺醯亞胺等。親電子的氟化劑相對於式(206)之化合物1當量，可以1~20當量，期望為1~10當量的比例使用。

溶媒若為對反應為惰性的溶媒則任何溶媒皆可，例如可從如苯、甲苯、二甲苯、氯苯之芳香族烴類；如四氯化碳、氯化甲烷、氯仿、二氯甲烷、二氯乙烷、三氯乙烷、己烷、環己烷之脂肪族烴類；如二噁烷、四氫呋喃、二乙基醚、二甲氧基乙烷之醚類；如二甲基亞砷、環丁砷、二甲基乙醯胺、N,N-二甲基甲醯胺、N-甲基吡咯烷酮、吡啶、乙腈、丙腈之極性非質子性溶媒及此等之混合溶媒等中適當選擇1種或2種以上。

鹼可從如鋰二異丙基醯胺、六甲基二矽基胺鋰之鋰醯胺化合物等中適當選擇1種或2種以上。鹼相對於式(206)之化合物1當量，可以1~5當量，期望為1~2當量的比例使用。

反應溫度通常為 $-100\sim 200^{\circ}\text{C}$ ，期望為 $-78\sim 150^{\circ}\text{C}$ ，反應時間通常為0.1~48小時左右，期望為0.1~24小時左右。

【0256】式(206)之化合物可依公知之方法製造，或可使用市售品。又，式(206)之化合物亦可依照例如Journal of the American Chemical Society、139卷、1452~1455頁(2017年)、Journal of Organic Chemistry、80卷、12137~12145頁(2015年)、Organic Process Research & Development、18卷、1041~1044頁(2014年)等所記載之方法，或依該等之方法製造。

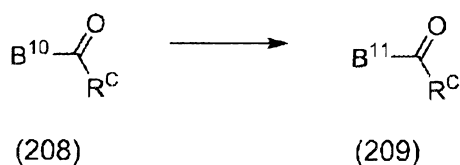
【0257】

反應2-8

反應2-8係(鹵)烷基化或環烷基化式(208)之化合物，變換成式(209)之化合物之方法。

【0258】

[化39]



【0259】式中， B^{10} 為可被 R^{B} 取代之具有NH之雜環

基， B^{11} 為可被 R^B 取代，且具有被(鹵)烷基或環烷基取代之N的雜環基，其他記號係如前述。

【0260】反應2-8通常於鹼及溶媒的存在下，可藉由於式(208)之化合物使(鹵)烷基化劑或環烷基化劑進行反應來進行。又，本反應亦可藉由將式(208)之化合物於過渡金屬試藥及溶媒存在下，如有必要添加鹼，與有機金屬試藥進行反應來進行。

【0261】作為(鹵)烷基化劑，若能進行反應則並未特別限定，例如可列舉如碘化甲烷、溴化甲烷之鹵素化烷基、硫酸二甲酯等之硫酸二烷基酯、三甲基矽烷基重氮甲烷；氯二氟甲烷、氯二氟乙酸鈉等。作為環烷基化劑，若能進行反應則並未特別限定，例如可列舉碘化環丙基等。

作為鹼，例如可從如甲醇鈉、乙醇鈉、第3級丁醇鉀之鹼金屬醇鹽；如碳酸鈉、碳酸鉀之碳酸鹽；如碳酸氫鈉、碳酸氫鉀之碳酸氫鹽；如氫氧化鈉、氫氧化鉀之金屬氫氧化物；如氫化鈉、氫化鉀之金屬氫化物；如單甲基胺、二甲基胺、三乙基胺、二異丙基乙基胺之胺類；如吡啶、4-二甲基胺基吡啶之吡啶類；如甲基鋰、n-丁基鋰、鋰二異丙基醯胺之有機鋰化合物等中適當選擇1種或2種以上。(鹵)烷基化劑、環烷基化劑或鹼相對於式(208)之化合物1當量，可以1~20當量，期望為1~10當量的比例使用。

作為有機金屬試藥，若能進行反應則並未特別限定，例如可列舉有機硼化合物等。有機金屬試藥可依公知之方

法調製，或可使用市售品。有機金屬試藥相對於式(208)之化合物1當量，可使用1~10當量，期望為1~5當量。

作為過渡金屬試藥，可使用交叉偶合反應所使用之公知之各種構造者，本反應中包含銅之過渡金屬試藥特別有用。例如可列舉乙酸銅(II)等。又，如有必要可將二胺作為配位子使用。作為二胺，可列舉N,N,N',N'-四甲基乙二胺、2,2'-聯吡啶基等。過渡金屬試藥相對於式(208)之化合物1當量，可使用0.1~5當量，期望為0.5~1.5當量。又，配位子相對於過渡金屬觸媒1當量，通常可使用1~10當量，期望為1~5當量。惟，因反應條件亦可使用此範圍外的量。

溶媒若為對反應為惰性的溶媒則任何溶媒皆可，例如可從如苯、甲苯、二甲苯、氯苯之芳香族烴類；如四氯化碳、氯化甲烷、氯仿、二氯甲烷、二氯乙烷、三氯乙烷、己烷、環己烷之脂肪族烴類；如二噁烷、四氫呋喃、二乙基醚、二甲氧基乙烷之醚類；如甲醇、乙醇、丙醇、tert-丁醇之醇類；如二甲基亞砷、環丁砷、二甲基乙醯胺、N,N-二甲基甲醯胺、N-甲基吡咯烷酮、吡啶、乙腈、丙腈之極性非質子性溶媒；水及此等之混合溶媒等中適當選擇1種或2種以上。

【0262】反應溫度通常為0~100℃，期望為0~80℃，反應時間通常為0.1~48小時左右，期望為0.1~24小時左右。

【0263】式(208)之化合物可依公知之方法製造，或

可使用市售品。

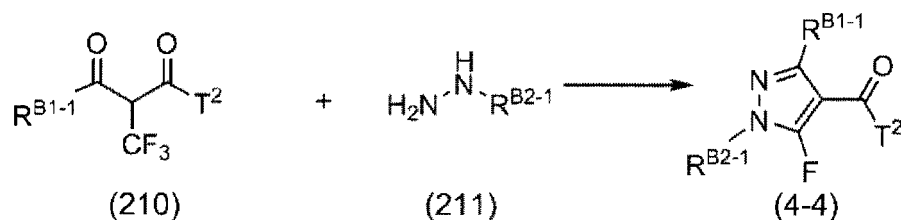
【0264】

反應 2-9

反應 2-9 係使式 (210) 之化合物及式 (211) 之化合物進行反應，得到式 (4-4) 之化合物之方法。

【0265】

[化40]



【0266】 式中， $\text{R}^{\text{B}1-1}$ 為烷基或鹵烷基， $\text{R}^{\text{B}2-1}$ 為烷基或環烷基，其他記號係如前述。

【0267】 反應 2-9 通常於溶媒的存在下，可藉由將式 (210) 之化合物及式 (211) 之化合物，如有必要於鹼的存在下，進行反應來進行。式 (211) 之化合物相對於式 (210) 之化合物 1 當量，可以 1~10 當量，期望為 1~2 當量的比例使用。

【0268】 作為溶媒，若能進行反應則並未特別限定，例如可從如苯、甲苯、二甲苯、氯苯之芳香族烴類；如己烷、庚烷、石油醚、石油醚、環己烷之脂肪族烴類；如氯仿、二氯甲烷、四氯化碳、1,2-二氯乙烷之鹵素化烴類；如二乙基醚、二異丙基醚、二丁基醚、四氫呋喃、二噁烷、乙二醇二甲基醚之醚類；如乙腈、丙腈、丙烯腈之腈類；如乙醇、甲醇、丁醇之醇類；如吡啶之有機胺類；水

及此等之混合溶媒等中適當選擇1種或2種以上。

【0269】作為鹼，若能進行反應則並未特別限定，例如可列舉如碳酸鈉、碳酸鉀、碳酸銻之鹼金屬碳酸鹽；如甲醇鈉、乙醇鈉、第3級丁醇鉀之鹼金屬醇鹽；如碳酸氫鈉之鹼金屬的碳酸氫鹽；如碳酸鈣之鹼土類金屬的碳酸鹽；如氫氧化鈉、氫氧化鉀之金屬氫氧化物；如氫化鈉、氫化鉀之金屬氫化物；如三乙基胺、二異丙基乙基胺、吡啶、4-(N,N-二甲基胺基)吡啶之有機胺類等。鹼相對於式(210)之化合物1當量，可以0.001~10當量，期望為0.005~5當量的比例使用。

【0270】反應溫度通常為-30~200℃，期望為0~80℃，反應時間通常為1~48小時左右。

【0271】式(210)之化合物及式(211)之化合物可依公知之方法或藉由後述之方法製造，或可使用市售品。

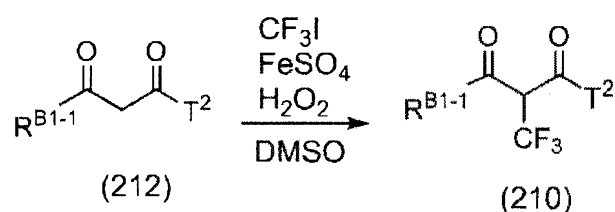
【0272】

反應2-10

反應2-10係將式(212)之化合物與三氟碘甲烷及過氧化氫進行反應，得到式(210)之化合物之方法。

【0273】

[化41]



【0274】式中之記號係如前述。

反應 2-10 例如可依照 Tetrahedron、68 卷、2636~2649 頁(2012 年)等所記載之方法，或依照該等之方法，製造式 (210) 之化合物。式 (212) 之化合物可依公知之方法製造，或可使用市售品。

【0275】本發明化合物作為以低藥量可防除有害菌類之農園藝用殺菌劑的有效成分有用。作為農園藝用殺菌劑使用時，本發明化合物，例如可防除屬於卵菌類 (Oomycetes)、子囊菌類 (Ascomycetes)、担子菌類 (Basidiomycetes)、不完全菌類 (Deuteromycetes) 等之有害菌類，其中，對屬於子囊菌類 (Ascomycetes)、不完全菌類 (Deuteromycetes) 等之有害菌類的防除特別有效。

【0276】作為前述有害菌類更具體之例，例如可列舉如以下者等。

作為卵菌類，可列舉如馬鈴薯或番茄疫病菌 (*Phytophthora infestans*)、番茄灰色疫病菌 (*Phytophthora capsici*) 之疫病菌 (*Phytophthora*) 屬；如黃瓜霜霉病 (*Pseudoperonospora cubensis*) 之露菌病菌 (*Pseudoperonospora*) 屬；如葡萄霜霉病 (*Plasmopara viticola*) 之單軸黴菌 (*Plasmopara*) 屬；如稻苗立枯病菌 (*Pythium graminicola*)、小麥褐色雪腐病菌 (*Pythium iwayamai*) 之腐霉菌 (*Pythium*) 屬等。

【0277】作為子囊菌類，可列舉如小麥白粉病菌 (*Erysiphe graminis*) 之白粉菌 (*Erysiphe*) 屬；如黃瓜白粉病菌 (*Sphaerotheca fuliginea*)、草莓白粉病菌 (*Sphaerotheca*

humuli)之草單囊殼(*Sphaerotheca*)屬；如葡萄白粉病菌(*Uncinula necator*)之鈎絲殼(*Uncinula*)屬；如蘋果白粉病菌(*Podosphaera leucotricha*)之絲單囊殼(*Podosphaera*)屬；如豌豆褐紋病菌(*Mycosphaerella pinodes*)、蘋果黑點病菌(*Mycosphaerella pomi*)、香蕉香蕉葉斑病菌(*Mycosphaerella musicola*)、柿子圓星落葉病菌(*Mycosphaerella nawae*)、草莓蛇紋石病菌(*Mycosphaerella fragariae*)之球腔菌(*Mycosphaerella*)屬；如蘋果黑星病菌(*Venturia inaequalis*)、梨黑星病菌(*Venturia nashicola*)之黑星菌(*Venturia*)屬；如大麥網斑病菌(*Pyrenophora teres*)、大麥斑葉病菌(*Pyrenophora graminea*)之核腔菌(*Pyrenophora*)屬；如綠豆菌核病菌、黃瓜菌核病菌、甘藍菌核病菌、白菜菌核病菌、胡椒菌核病菌、青椒菌核病菌或洋蔥菌核病菌之各種菌核病菌(*Sclerotinia sclerotiorum*)、如小麥雪腐大粒菌核病菌(*Sclerotinia borealis*)、番茄小粒菌核病菌(*Sclerotinia minor*)、苜蓿菌核病菌(*Sclerotinia trifoliorum*)之核盤菌(*Sclerotinia*)屬；如花生小菌核病菌(*Botryolinia arachidis*)之孢盤菌(*Botryolinia*)屬；如稻芝麻斑病菌(*Cochliobolus miyabeanus*)之旋孢腔菌(*Cochliobolus*)屬；如黃瓜藤枯病菌(*Didymella bryoniae*)之亞隔孢殼(*Didymella*)屬；如稻馬鹿苗病菌(*Gibberella fujikuroi*)之赤黴菌(*Gibberella*)屬；如葡萄黑痘病菌(*Elsinoe ampelina*)、柑橘瘡痂病菌(*Elsinoe fawcettii*)之痂囊腔菌(*Elsinoe*)屬；如柑橘黑點病菌(*Diaporthe citri*)、葡

萄科膨病菌(*Diaporthe* sp.)之間座殼菌(*Diaporthe*)屬；如蘋果念珠菌病菌(*Monilinia mali*)、桃灰色病菌(*Monilinia fructicola*)之鏈核盤菌(*Monilinia*)屬；如葡萄晚腐病菌(*Glomerella cingulata*)之炭疽刺盤孢菌(*Glomerella*)屬等。

【0278】作為担子菌類，可列舉如稻紋枯病菌(*Rhizoctonia solani*)之絲核菌(*Rhizoctonia*)屬；如小麥裸黑穗病菌(*Ustilago nuda*)之黑粉菌(*Ustilago*)屬；如燕麥冠銹病菌(*Puccinia coronata*)、小麥葉銹病菌(*Puccinia recondita*)、小麥黃銹病菌(*Puccinia striiformis*)之柄銹菌(*Puccinia*)屬；如大豆銹病菌(*Phakopsora pachyrhizi*)之層銹菌(*Phakopsora*)屬；如小麥或大麥雪腐小粒菌核病菌(*Typhula incarnata*, *Typhula ishikariensis*)之雪腐菌核菌(*Typhula*)屬等。

【0279】作為不完全菌類，可列舉如小麥穎枯病菌(*Septoria nodorum*)、小麥葉枯病菌(*Septoria tritici*)之殼針孢菌(*Septoria*)屬；如葡萄灰黴病菌、柑橘灰黴病菌、黃瓜灰黴病菌、番茄灰黴病菌、草莓灰黴病菌、茄子灰黴病菌、綠豆灰黴病菌、紅豆灰黴病菌、豌豆灰黴病菌、花生灰黴病菌、胡椒灰黴病菌、青椒灰黴病菌、萵苣灰黴病菌、洋蔥灰黴病菌、星辰花灰黴病菌、康乃馨灰黴病菌、玫瑰灰黴病菌、三色堇灰黴病菌或向日葵灰黴病菌之各種灰黴病菌(*Botrytis cinerea*)、如洋蔥灰腐病菌(*Botrytis allii*)、引起因洋蔥之葡萄孢屬菌導致之葉枯病的病原菌(*Botrytis squamosa*, *Botrytis byssoidea*, *Botrytis tulipae*)之

葡萄孢菌 (*Botrytis*) 屬；如小麥赤黴病菌 (*Fusarium graminearum*)、黃瓜鶴見病菌 (*Fusarium oxysporum*) 之鐮孢菌 (*Fusarium*) 屬、如稻瘟病菌 (*Pyricularia oryzae*) 之梨孢 (*Pyricularia*) 屬；如甜菜褐斑病菌 (*Cercospora beticola*)、柿子角斑病菌 (*Cercospora kaki*) 之尾孢菌 (*Cercospora*) 屬；如黃瓜炭疽病菌 (*Colletotrichum orbiculare*) 之炭疽刺盤孢菌 (*Colletotrichum*) 屬；如蘋果斑點落葉病菌 (*Alternaria alternata* apple pathotype)、梨黑斑病菌 (*Alternaria alternata* Japanese pear pathotype)、馬鈴薯早疫或番茄輪紋病菌 (*Alternaria solani*)、甘藍或白菜黑斑病菌 (*Alternaria brassicae*)、甘藍黑煙病菌 (*Alternaria brassicola*)、洋蔥或蔥黑斑病菌 (*Alternaria porri*) 之鏈隔孢菌 (*Alternaria*) 屬；如甘藍根朽病菌 (*Phoma lingam*) 之莖點霉 (*Phoma*) 屬；如小麥眼紋病菌 (*Pseudocercospora herpotrichoides*) 之假小尾孢黴 (*Pseudocercospora*) 屬；如葡萄褐斑病菌 (*Pseudocercospora vitis*) 之假尾孢菌 (*Pseudocercospora*) 屬；如大麥雲形病菌 (*Rhynchosporium secalis*) 之雲紋菌 (*Rhynchosporium*) 屬；如桃黑星病菌 (*Cladosporium carpophilum*) 之枝孢菌 (*Cladosporium*) 屬；如桃擬莖點黴腐敗病菌 (*Phomopsis* sp.) 之擬莖點黴 (*Phomopsis*) 屬；如柿子炭疽病菌 (*Gloeosporium kaki*) 之盤長孢黴 (*Gloeosporium*) 屬；如番茄葉黴病菌 (*Fulvia fulva*) 之葉黴病菌 (*Fulvia*) 屬；如黃瓜褐斑病菌 (*Corynespora cassicola*) 之棒狀桿孢菌 (*Corynespora*) 屬等。

【0280】本發明化合物由於可防除前述之各種有害菌類，故可預防性或治療性防除各種病害。尤其是本發明化合物對於農園藝領域成為問題的各種病害，例如對梨孢菌導致之稻瘟病、鐮孢菌導致之馬鹿苗病、旋孢腔菌導致之芝麻斑病、絲核菌導致之紋枯病等之稻之病害；白粉菌導致之白粉病、鐮孢菌導致之赤黴病或冠腐病、柄銹菌導致之銹病、腐霉菌導致之褐色雪腐病、黑粉菌導致之裸黑穗病、假小尾孢黴菌導致之眼紋病、殼針孢菌導致之葉枯病或穎枯病等之麥類之病害；鐮孢菌導致之赤黴病、暗球腔菌導致之斑點病、柄銹菌導致之銹病、*Setosphaeria*菌導致之煤紋病、旋孢腔菌導致之芝麻斑病、腐霉菌導致之根腐病、黑粉菌導致之黑穗病等之玉米之病害；黑粉菌導致之黑穗病、殼多孢菌導致之葉燒病、柄銹菌導致之銹病、赤黴菌導致之梢頭腐敗病、*Caldariomyces*菌導致之煙塵病、假尾孢菌導致之葉枯病等之甘蔗之病害等之稻科作物之病害；卵黴菌導致之白粉病、層銹菌導致之銹病、墓萄露菌病菌導致之霜霉病、疫病菌導致之疫病、炭疽刺盤孢菌導致之炭疽病、核盤菌導致之菌核病、葡萄孢菌導致之灰黴病、鐮孢菌導致之根腐病或立枯病等之豆科作物之病害；鐮孢菌導致之枯萎病、墓萄露菌病菌導致之霜霉病、鏈隔孢菌導致之黑斑病、莖點霉菌導致之根朽病等之十字花科作物之病害；盤梗黴菌導致之霜霉病、疫病菌導致之疫病、葡萄孢菌導致之灰黴病、核盤菌導致之菌核病、銹孢銹菌導致之銹病等之菊科作物之病害；鏈隔孢菌導致之

輪紋病、葉黴病菌導致之葉黴病、疫病菌導致之疫病、葡萄孢菌導致之灰黴病、卵黴菌導致之白粉病、鐮孢菌導致之萎凋病、假尾孢菌導致之煤黴病等之番茄之病害；鏈隔孢菌導致之早疫病、疫病菌導致之疫病、核盤菌導致之菌核病、鐮孢菌導致之乾腐病等之馬鈴薯之病害等之茄科作物之病害；炭疽刺盤孢菌導致之炭疽病、草單囊殼菌導致之白粉病、亞隔孢殼(*Didymella*)菌導致之藤枯病、露菌病菌導致之霜霉病、疫病菌導致之疫病、棒狀桿孢菌導致之褐斑病、鐮孢菌導致之鶴見病等之葫蘆科作物之病害；墓葡萄露菌病菌導致之霜霉病、疫病菌導致之疫病、葡萄孢菌導致之灰黴病、核盤菌導致之菌核病、柄銹菌導致之銹病等之蔥科作物之病害；鏈隔孢菌導致之黑葉枯病或黑斑病、葡萄孢菌導致之灰黴病、核盤菌導致之菌核病、白粉菌導致之白粉病、尾孢菌導致之斑點病等之繖形科作物之病害；葡萄孢菌導致之葉枯病、疫病菌導致之疫病、擬莖點黴菌導致之莖枯病等之百合科作物之病害；墓葡萄露菌病菌導致之霜霉病、白粉菌導致之白粉病、絲核菌導致之立枯病等之蓼科作物之病害；鐮孢菌導致之鶴見病、長喙黴菌導致之黑斑病、鏈黴菌導致之立枯病等之旋花科作物之病害；墓葡萄露菌病菌導致之霜霉病、疫病菌導致之疫病、葡萄孢菌導致之灰黴病、核盤菌導致之菌核病、卵黴菌導致之白粉病、尾孢菌導致之褐斑病等之藜科作物之病害；痂囊腔菌導致之黑痘病、炭疽刺盤孢菌導致之晚腐病、白粉菌導致之白粉病、單軸黴菌導致之霜霉病、葡萄孢菌導

致之灰黴病、假尾孢菌導致之褐斑病、胴枯病菌導致之科膨病等之葡萄科作物之病害；草單囊殼菌導致之白粉病、葡萄孢菌導致之灰黴病、炭疽刺盤孢菌導致之炭疽病、鐮孢菌導致之乾腐病等之草莓之病害；鏈核盤菌導致之念珠菌病、絲單囊殼菌導致之白粉病、鏈隔孢菌導致之斑點落葉病、黑星菌導致之黑星病、炭疽刺盤孢菌導致之炭疽病、褐斑病菌導致之褐斑病、葡萄座腔菌導致之輪紋病、接瓶黴菌導致之煤點病、黏孢殼菌(Gloeodes)導致之煤斑病、球腔菌導致之黑點病等之蘋果之病害；黑星菌導致之黑星病、鏈隔孢菌導致之黑斑病、球針殼菌導致之白粉病、疫病菌導致之疫病、鐮孢菌導致之果實腐敗病等之梨類之病害；鏈核盤菌導致之灰色病、枝孢菌導致之黑星病、擬莖點黴菌導致之擬莖點黴腐敗病等之桃之病害等之薔薇科作物之病害；胴枯病菌導致之黑點病、痂囊腔菌導致之瘡痂病、鐮孢菌導致之鐮孢立枯病等之柑橘之病害等之芸香科作物之病害；盤長孢黴菌導致之炭疽病、尾孢菌導致之落葉病、球針殼菌導致之白粉病、接瓶黴菌導致之煤點病等之柿樹科作物之病害；炭疽刺盤孢菌導致之炭疽病、擬盤多毛孢菌導致之輪斑病、假單胞菌導致之赤燒病、山茶菌導致之餅病等之山茶花科作物之病害；等之植物病害的防除為有效。

又，對鐮孢菌導致之赤黴病或冠腐病、炭疽刺盤孢菌導致之炭疽病、腥黑粉菌導致之腥黑粉病、黑粉菌導致之裸黑穗病、頭芽胞菌導致之條斑病、殼針孢菌導致之穎枯

病等之麥類之病害；

雙孔孢菌導致之芝麻斑病、炭疽刺盤孢菌導致之炭疽病、鏟孢菌導致之苗立枯病等之玉米之病害；炭疽刺盤孢菌導致之赤腐病、長喙黴菌導致之黑腐病、指梗黴菌導致之霜霉病等之甘蔗之病害等之稻科作物之病害；尾孢菌導致之紫斑病、墓萄露菌病菌導致之霜霉病、鏟孢菌導致之立枯病、殼針孢菌導致之褐紋病、胴枯病菌導致之黑點病、炭疽刺盤孢菌導致之炭疽病、*Septogloeum*菌導致之昏睡病等之大豆之病害等之豆科作物之病害；鏈隔孢 蕈苔屬真菌導致之黑斑病、鏈隔孢鏈隔孢菌導致之黑煙病、墓萄露菌病菌導致之霜霉病、假單胞菌導致之黑斑細菌病、黃單胞菌導致之黑腐病、莖點霉菌導致之根朽病等之甘藍之病害；鏈隔孢菌導致之黑斑病、鏟孢菌導致之枯萎病、黃單胞菌導致之黑腐病等之蘿蔔之病害；鏈隔孢菌導致之黑斑病、黃單胞菌導致之黑腐病、輪黴菌導致之黃化病等之白菜之病害等之十字花科作物之病害；鏈隔孢菌導致之輪紋病、棒桿菌導致之潰瘍病、黃單胞菌導致之斑點細菌病等之番茄之病害；鏈隔孢菌導致之褐斑病、擬莖點黴菌導致之褐紋病等之茄子之病害；鏈黴菌導致之瘡痂病、長蠕孢黴菌導致之銀痂病、馬鈴薯粉痂菌(*Spongospora*)導致之粉狀瘡痂病等之馬鈴薯之病害等茄科作物之病害；鏈隔孢菌導致之黑斑病、假單胞菌導致之斑點細菌病、黃單胞菌導致之褐斑細菌病等之黃瓜之病害等之葫蘆科作物之病害；鏈隔孢菌導致之黑斑病、葡萄孢菌

導致之灰腐病或菌絲性腐敗病、鐮孢菌導致之乾腐病、墓
萄露菌病菌導致之霜霉病等之洋蔥之病害等之蔥科作物之
病害；鏈隔孢菌導致之黑葉枯病或黑斑病、黃單胞菌導致
之斑點細菌病；芹菜之殼針孢菌導致之葉枯病、核盤菌導
致之菌核病、假單胞菌導致之葉枯細菌病等之紅蘿蔔之病
害等之繖形科作物之病害；墓萄露菌病菌導致之霜霉病、
鐮孢菌導致之萎凋病、炭疽刺盤孢菌導致之炭疽病等之菠
菜之病害等之藜科作物之病害；等之種子傳染性病害亦有
效。

進而，對因鐮孢菌、腐霉菌、絲核菌、輪黴菌、根腫
菌、根串珠黴菌等之有害菌類所引起之土壤病害的防除亦
有效。

【0281】作為可從各種有害菌類藉由本發明來保護之
植物，若為農業上有用者，雖並未特別限制，但例如可列
舉稻科作物(稻、小麥、大麥、燕麥、黑麥、玉米、甘蔗
等)、豆科作物(大豆、菜豆、紅豆等)、十字花科作物(甘
藍、白菜、蘿蔔、蕪菁、青花菜、花椰菜、油菜花、油菜
等)、菊科作物(萵苣、牛蒡、春菊等)、茄科作物(馬鈴
薯、茄子、番茄、青椒、煙草等)、葫蘆科作物(黃瓜、南
瓜、甜瓜、西瓜等)、蔥科作物(蔥、韭菜、薤、大蒜等)、
繖形科作物(芹菜、紅蘿蔔、香菜等)、百合科作物(百合、
鬱金香、蘆筍等)、蓼科(蕎麥等)、旋花科(甘藷等)、藜科
作物(菠菜、甜菜等)、葡萄科作物(葡萄等)、薔薇科作物
(玫瑰、草莓、蘋果、梨、桃、枇杷、杏仁等)、芸香科作

物(蜜柑、檸檬、橙等)、柿樹科作物(柿子等)、山茶花科作物(茶等)、木犀科作物(橄欖、茉莉花等)、錦葵科作物(棉花、可可、秋葵等)、芭蕉科作物(香蕉等)、薑科作物(薑等)、茜草科作物(咖啡樹等)或鳳梨科作物(鳳梨、鳳梨(Ananas)等)。

【0282】又，本發明化合物相對於苯并咪唑、甲氧基丙烯酸酯(Strobilurin)、二甲醯亞胺、苯基醯胺、麥角固醇生合成阻害劑等之藥劑的各種抵抗性有害菌類的防除亦有效。

【0283】進而，本發明化合物由於具有優異之滲透傳遞性，故可藉由將含有本發明化合物之農園藝用殺菌劑施用在土壤，與土壤中之有害菌類的防除同時，亦防除莖葉部之有害菌類。

【0284】本發明化合物通常雖可混合本發明化合物與各種農業上之輔助劑，製劑成粉劑、粒劑、顆粒可濕性粉劑、可濕性粉劑、水性懸濁劑、油性懸濁劑、水溶劑、乳劑、液劑、糊劑、氣霧劑、微量散布劑等之各種形態使用，但只要能適合本發明的目的，可成為於通常之該領域使用之所有製劑形態。作為製劑所使用之輔助劑，可列舉矽藻土、熟石灰、碳酸鈣、滑石、白碳、高嶺土、膨潤土、高嶺石及絹雲母之混合物、黏土、碳酸鈉、碳酸氫鈉、芒硝、沸石、澱粉等之固型載體；水、甲苯、二甲苯、溶劑石腦油、二噁烷、丙酮、異佛爾酮、甲基異丁基酮、氯苯、環己烷、二甲基亞砷、N,N-二甲基甲醯胺、二

甲基乙醯胺、N-甲基-2-吡咯烷酮、醇等之溶劑；如脂肪酸鹽、苯甲酸鹽、烷基磺基琥珀酸鹽、二烷基磺基琥珀酸鹽、聚羧酸鹽、烷基硫酸酯鹽、烷基硫酸鹽、烷基芳基硫酸鹽、烷基二甘醇醚硫酸鹽、醇硫酸酯鹽、烷基磺酸鹽、烷基芳基磺酸鹽、芳基磺酸鹽、木質素磺酸鹽、烷基二苯基醚二磺酸鹽、聚苯乙烯磺酸鹽、烷基磷酸酯鹽、烷基芳基磷酸鹽、苯乙烯基芳基磷酸鹽、聚氧乙烯烷基醚硫酸酯鹽、聚氧乙烯烷基芳基醚硫酸鹽、聚氧乙烯烷基芳基醚硫酸酯鹽、聚氧乙烯烷基醚磷酸鹽、聚氧乙烯烷基芳基磷酸酯鹽、萘磺酸福爾馬林縮合物的鹽之陰離子系的界面活性劑或展著劑；如山梨糖醇脂肪酸酯、甘油脂肪酸酯、脂肪酸聚甘油酯、脂肪酸醇聚甘醇醚、乙炔二醇、乙炔醇、氧化烯嵌段聚合物、聚氧乙烯烷基醚、聚氧乙烯烷基芳基醚、聚氧乙烯苯乙烯基芳基醚、聚氧乙二醇烷基醚、聚乙二醇、聚氧乙烯脂肪酸酯、聚氧乙烯山梨糖醇脂肪酸酯、聚氧乙烯甘油脂肪酸酯、聚氧乙烯硬化蓖麻油、聚氧丙烯脂肪酸酯之非離子系的界面活性劑或展著劑；橄欖油、木棉油、蓖麻油、棕櫚油、山茶油、椰子油、芝麻油、玉米油、米糠油、花生油、棉籽油、大豆油、菜子油、亞麻子油、桐油、液狀石蠟等之植物油或礦物油等。此等輔助劑之各成分只要不偏離本發明的目的，可適當選擇1種或2種以上使用。又，除了前述之輔助劑以外，亦可從於該領域所知悉者當中適當選擇使用，例如亦可使用增量劑、增黏劑、防止沉澱劑、防凍劑、分散安定劑、防護劑、防黴劑

等通常所使用之各種輔助劑。本發明化合物與各種輔助劑的摻合比例為0.001:99.999～95:5，期望為0.005:99.995～90:10。於此等製劑實際之使用時，可直接使用，或以水等之稀釋劑稀釋成指定濃度，如有必要可添加各種展著劑(界面活性劑、植物油、礦物油等)使用。

【0285】本發明化合物之施用雖因氣象條件、製劑形態、對象作物、施用時期、施用場所、有害菌類的種類或發生狀況、病害的種類或發生狀況等之不同，無法一概規定，但一般而言，於莖葉處理的情況可以0.1～10,000 ppm，期望為1～2,000ppm的有效成分濃度施用，其施用適量每1公頃之本發明化合物可成為0.1～50,000g，期望為1～30,000g左右。土壤處理的情況，一般而言，可將每1公頃之本發明化合物施用10～100,000g，期望為200～20,000g。種子處理的情況，一般而言，可將種子每1kg之本發明化合物施用0.001～10g，期望為0.01～1g。

【0286】本發明化合物之各種製劑或其稀釋物的施用，通常為一般所進行之施用方法，亦即，可藉由散布(例如散布、噴霧、墨霧(Misting)、霧化(Atomizing)、散粒、水面施用等)、土壤施用(混入、灌注等)、表面施用(塗布、粉衣、被覆等)等進行。又，亦可藉由所謂超高濃度少量散布法(ultra low volume)施用。在此方法，可含有100%之活性成分。

【0287】本發明化合物可與其他農藥、肥料、防護劑等混用或併用，此情況下有時會顯示更為優異之效果、作

用性。作為其他農藥，可列舉除草劑、殺蟲劑、殺蟎劑、殺線蟲劑、殺土壤害蟲劑、殺菌劑、抗病毒劑、引誘劑、抗生物質、植物激素、植物成長調整劑等。尤其是混用或併用本發明化合物、與其他殺菌性有效成分化合物之1種或2種以上的混合殺菌性組成物，有將適用範圍、藥劑處理之時期、防除活性等往較佳之方向改良的情況。尚，本發明化合物與其他殺菌劑的有效成分化合物，即使每個分別製劑者於散布時混合進行使用，亦可將兩者一起製劑來使用。本發明中亦包含這般之混合殺菌性組成物。

【0288】本發明化合物與其他殺菌性有效成分化合物的混合比，雖因氣象條件、製劑形態、對象作物、施用時期、施用場所、有害菌類的種類或發生狀況、病害的種類或發生狀況等之不同無法一概規定，但一般而言可成為1:300~300:1，期望為1:100~100:1。又，作為施用適量每1公頃之總有效成分化合物量，可成為0.1~70,000g，期望為1~30,000g。本發明中，亦包含藉由這般之混合殺菌性組成物的施用之植物病害的防除方法。

【0289】通過本發明化合物的施用，亦可進一步合併其他農藥例如殺菌劑、殺蟲劑、殺蟎劑、殺線蟲劑、殺土壤害蟲劑、抗病毒劑、引誘劑、除草劑、植物生長調整劑等來處理。

【0290】作為上述其他農藥中之殺菌劑的有效成分化合物(一般名或日本植物防疫協會試驗代碼)，例如可從下述之化合物群組中適當選擇。即使是並未特別記載的情

況，於此等化合物存在如鹽、烷基酯、光學同分異構物之各種構造同分異構物等時，當然亦包含該等。

如嘧菌胺(mepanipyrim)、嘧黴胺(pyrimethanil)、嘧菌環胺(cyprodinil)之苯胺基嘧啶系化合物；

如滅脫定(ametoctradin)之三唑并嘧啶(Triazolopyrimidine)系化合物；

如氰啶胺(fluazinam)之吡啶胺系化合物；

如三泰芬(triadimefon)、比多農(bitertanol)、氟菌唑(triflumizole)、乙環唑(etaconazole)、丙環唑(propiconazole)、戊菌唑(penconazole)、氟矽唑(flusilazole)、邁克尼(myclobutanil)、環克唑(cyproconazole)、戊唑醇(tebuconazole)、己唑醇(hexaconazole)、順呋醚唑(furconazole-cis)、咪鮮安(prochloraz)、滅特唑(metconazole)、氟環唑(epoxiconazole)、氟醚唑(tetraconazole)、反丁烯二酸噁咪唑(oxpoconazole fumarate)、丙硫菌唑(prothioconazole)、三唑醇(triadimenol)、粉唑醇(flutriafol)、苯醚甲環唑(difenoconazole)、氟喹唑(fluquinconazole)、腈苯唑(fenbuconazole)、糠菌唑(bromuconazole)、烯唑醇(diniconazole)、三環唑(tricyclazole)、矽氟唑(simeconazole)、稻瘟酯(pefurazoate)、種菌唑(ipconazole)、醯胺唑(imibenconazole)、阿扎康唑(azaconazole)、環菌唑(triticonazole)、依滅列(imazalil)、ipfentrifluconazole、氯氟醚菌唑(mefentrifluconazole)之唑系化合物；

如灰蟻猛(quinomethionate)之喹啉系化合物；

如代森猛(maneb)、代森鋅(zineb)、代森錳鋅(mancozeb)、聚胺基甲酸酯(polycarbamate)、代森聯(metiram)、丙森鋅(propineb)、福美雙(thiram)之二硫代胺基甲酸酯系化合物；

如四氯苯酞(ftalide)、四氯異苯(chlorothalonil)、五氯硝基苯(quintozene)之有機氯系化合物；

如苯菌靈(benomyl)、甲基硫菌靈(thiophanate-methyl)、多菌靈(carbendazim)、噻菌靈(thiabendazole)、弗貝唑(fuberiazole)之咪唑系化合物；

如霜脞氰(cymoxanil)之氰基乙醯胺系化合物；

如甲霜靈(metalaxyl)、甲霜靈-M(metalaxyl-M；別名精甲霜靈(mefenoxam))、悉霜靈(oxadixyl)、甲呋醯胺(ofurace)、苯霜靈(benalaxyl)、精苯霜靈(benalaxyl-M、別名可瑞西(kiralaxyl、chiralaxyl))、呋霜靈(furalaxyl)、伐利芬(valifenalate)之醯基胺基酸系化合物；

如酯菌胺(cyprofuram)、萎銹靈(carboxin)、氧化萎銹靈(oxycarboxin)、噻呋醯胺(thifluzamide)、啞醯菌胺(boscalid)、環醯菌胺(fenhexamid)、異噻菌胺(isotianil)、噻醯菌胺(tiadinil)、吡瑞氟密得(Pyraziflumid)之苯胺系化合物；

如苯氟醯胺(dichlofluanid)之磺醯胺系化合物；

如氫氧化銅(cupric hydroxide)、有機銅(oxine copper)、無水硫酸銅、壬基酚磺酸銅、8-羥基喹啉銅、十二烷基

苯磺酸雙乙二胺銅絡鹽(II)(別名DBEDC)之銅系化合物；

如疫霜靈鋁(fosetyl-Al)、甲基立枯磷(tolclofos-methyl)、護粒松(edifenphos)、異稻瘟淨(iprobenfos)之有機磷系化合物；

如克菌丹(captan)、四氯丹(captafol)及滅菌丹(folpet)之鄰苯二甲醯亞胺系化合物；

如二甲菌核利(procymidone)、異菌脲(iprodione)、乙烯菌核利(vinclozolin)之二碳二亞胺系化合物；

如福多寧(flutolanil)、滅普寧(mepronil)、麥鏽靈(benodanil)之苯甲醯苯胺系化合物；

環丙醯菌胺(carpropamid)、雙氯氰菌胺(diclocymet)、矽噻菌胺(silthiopham)、氰菌胺(fenoxanil)之醯胺系化合物；

如苯并烯氟菌唑(benzovindiflupyr)、比沙吩(bixafen)、氟茛唑菌胺(fluidapyr)、氟唑菌醯胺(fluxapyroxad)、福拉比(furametpyr)、吡唑萘菌胺(isopyrazam)、戊苯吡菌胺(penflufen)、吡噻菌胺(penthiopyrad)、氟唑菌醯脛胺(pydiflumetofen)、環丙吡菌胺(sedaxane)、isoflucypram、inpyrfluxam、吡瑞普尼(pyrapropoyne)之吡唑羧醯胺系化合物；

如氟吡菌胺(fluopicolide)、氟吡菌醯胺(fluopyram)、座賽胺(zoxamide)、fluopimomide之苯并醯胺系化合物；

如甲呋醯胺(fenfuram)之糠苯胺(furanilide)系化合物；

如艾索非他滅(isofetamid)之噻吩醯胺系化合物；

如賽福寧(triforine)之哌嗪系化合物；

如比芬諾(pyrifenox)、啖菌唑(pyrisoxazole)、aminopyrifen之吡啶系化合物；

如氯苯嘧啶醇(fenarimol)、富米綜(ferimzone)、尼瑞莫(nuarimol)之嘧啶系化合物；

如苯銹啖(fenpropidin)之哌啶系化合物；

如丁基嗎啉(fenpropimorph)、十三嗎啉(tridemorph)之嗎啉系化合物；

如三苯基氫氧化錫(fentin hydroxide)、三苯基乙酸錫(fentin acetate)之有機錫系化合物；

如戊菌隆(pencycuron)之脲系化合物；

如烯醯嗎啉(dimethomorph)、氟嗎啉(flumorph)、丁吡嗎啉(pyrimorph)、丙森鋅(iprovalicarb)、苯噻菌胺(benthiavalicarb-isopropyl)、曼普胺(mandipropamid)之羧酸醯胺系化合物；

如乙黴威(diethofencarb)之苯基胺基甲酸酯(Carbamate)系化合物；

如咯菌腈(fludioxonil)、拌種咯(fenpiclonil)之氰基吡咯系化合物；

如嘧菌酯(azoxystrobin)、克收欣(kresoxim-methyl)、苯氧菌胺(metominostrobin)、三氟敏(trifloxystrobin)、啖氧菌酯(picoxystrobin)、肱醚菌胺(oryzastrobin)、嘧菌胺(dimoxystrobin)、百克敏(pyraclostrobin)、氟嘧菌酯(

fluoxastrobin)、烯肱菌酯(Enestroburin)、唑菌酯(Pyraoxystrobin)、唑胺菌酯(Pyrametostrobin)、丁香菌酯(coumoxystrobin)、亞托敏(enoxastrobin)、烯肱菌胺(fenaminstrobin)、氟菌蟎酯(flufenoxystrobin)、氯啞菌酯(triclopyricarb)、滿得賓(mandestrobin)之甲氧基丙烯酸酯(Strobilurin)系化合物；

如噁唑菌酮(famoxadone)、奧賽普林(oxathiapiprolin)之噁唑啞酮系化合物；

如噻唑菌胺(ethaboxam)之噻唑羧醯胺系化合物；

如咪唑菌酮(fenamidone)之咪唑啞酮系化合物；

如磺菌胺(flusulfamide)之苯磺醯胺系化合物；

如環氟菌胺(cyflufenamid)之肱醚系化合物；

如腓硫醯(dithianon)之蔥醯系化合物；

如美啞卡(meptyldinocap)之巴豆酸系化合物；

如井岡黴素(validamycin)、嘉賜黴素(kasugamycin)、鏈黴素(streptomycin)、保粒黴素(polyoxins)之抗生物質；

如雙胍辛胺(iminoctadine)、多果定(dodine)之胍系化合物；

如特布弗喹(tebufloquin)、快諾芬(quinoxyfen)、quinofumelin、ipflufenquin之喹啞系化合物；

如氟噻菌淨(flutianil)之四氫噻唑系化合物；

如鹽酸霜黴威(propamocarb hydrochloride)、吡本卡(pyribencarb)、托普洛卡(tolprocarb)胺基甲酸酯(Carbamate)系化合物；

如皮卡布西 (picarbutrazox)、metyltetraprole 之四唑系化合物；

如唑磺菌胺 (amisulbrom)、氰唑磺菌胺 (cyazofamid) 之磺醯胺系化合物；

如苯菌酮 (metrafenone)、哌瑞芬酮 (pyriofenone) 之烯丙基苯基酮系化合物；

如烯丙苯噻唑 (probenazole)、二氯苯泰 (dichlobentiazox) 之苯并噻唑系化合物；

如胺苯吡菌酮 (fenpyrazamine) 之苯基吡唑系化合物；

如亞賜圍 (isoprothiolane) 之二硫戊環系化合物；

如 fencicoxamid、florypicoxamid 之甲吡啶醯胺系化合物；

如硫 (Sulfur)、石灰硫劑之硫系化合物；

作為其他化合物，如咯嗪酮 (pyroquilon)、達菌清 (diclomezine)、氯化苦 (chloropicrin)、棉隆 (dazomet)、威百敏 (metam-sodium)、丙氧嗪啉 (proquinazid)、螺環菌胺 (spiroxamine)、大芬滅替松 (dipymetitrone) 等；

如 *Bacillus amyloliquefaciens* strain QST713、*Bacillus amyloliquefaciens* strain FZB24、*Bacillus amyloliquefaciens* strain MBI600、*Bacillus amyloliquefaciens* strain D747、*Pseudomonas fluorescens*、*Bacillus subtilis*、*Trichoderma atroviride* SKT-1 之微生物殺菌劑；及如茶樹油 (Tea tree oil) 之植物萃取物。

【0291】作為上述其他農藥中之殺蟲劑、殺蟎劑、殺

線蟲劑或殺土壤害蟲劑，亦即殺害蟲劑的有效成分化合物（一般名或日本植物防疫協會試驗代碼），例如可從下述之化合物群組中適當選擇。即使是並未特別記載的情況，於此等化合物存在如鹽、烷基酯、光學同分異構物之各種構造同分異構物等時，當然亦包含該等。

如佈飛松 (profenofos)、二氯松 (dichlorvos)、芬滅松 (fenamiphos)、撲滅松 (fenitrothion)、EPN((RS)-(O-ethyl O-4-nitrophenyl phenylphosphonothioate))、大利松 (diazinon)、陶斯松 (chlorpyrifos)、甲基毒死蜱 (chlorpyrifos-methyl)、歐殺松 (acephate)、普硫松 (prothiofos)、福賽絕 (fosthiazate)、硫線磷 (cadusafos)、二硫松 (disulfoton)、加福松 (isoxathion)、亞芬松 (isofenphos)、乙硫磷 (ethion)、益多松 (etrimfos)、拜裕松 (quinalphos)、二甲基乙烯磷 (dimethylvinphos)、大滅松 (dimethoate)、硫丙磷 (sulprofos)、二甲硫吸磷 (thiometon)、繁類松 (vamidothion)、白克松 (pyraclofos)、必芬松 (pyridaphenthion)、嘧啶磷甲酯 (pirimiphos-methyl)、丙蟲磷 (propaphos)、裕必松 (phosalone)、福木松 (formothion)、馬拉松 (malathion)、四氯乙烯磷 (tetrachlorvinphos)、克芬松 (chlorfenvinphos)、殺螟腈 (cyanophos)、三氯松 (trichlorfon)、滅大松 (methidathion)、賽達松 (phenthoate)、異亞砒磷 (oxydeprofos、別名 ESP)、谷速松 (azinphos-methyl)、芬殺松 (fenthion)、庚烯磷 (heptenophos)、氯化甲醇 (methoxychlor)、帕若提 (parathion)、磷蟲威 (

phosphocarb)、滅多松-S-甲酯(demeton-S-methyl)、亞速靈(monocrotophos)、達馬松(methamidophos)、依米塞松(imicyafos)、帕若提-甲酯(parathion-methyl)、托福松(terbufos)、福賜米松(phosphamidon)、益滅松(phosmet)、福瑞松(phorate)之有機磷酸酯系化合物；

如加保利(carbaryl)、安丹(propoxur)、得滅克(aldicarb)、加保扶(carbofuran)、硫敵克(thiodicarb)、納乃得(methomyl)、歐殺滅(oxamyl)、乙硫苯威(ethiofencarb)、比加普(pirimicarb)、丁基滅必蝨(fenobucarb)、丁基加保扶(carbosulfan)、免扶克(benfuracarb)、免敵克(bendiocarb)、呋線威(furathiocarb)、異丙威(isoprocarb)、治滅蝨(metolcarb)、滅爾蝨(xylylcarb)、XMC(3,5-xylyl methylcarbamate)、芬硫克(fenothiocarb)之胺基甲酸酯(Carbamate)系化合物；

如培丹(cartap)、硫賜安(thiocyclam)、硫賜安草酸鹽(thiocyclam oxalate)、硫賜安鹽酸鹽(thiocyclam hydrochloride)、免速達(bensultap)、殺蟲雙(thiosultap)、殺蟲單(monosultap；別名殺蟲雙單鈉(thiosultap-monosodium)、殺蟲雙(bisultap；別名殺蟲雙二鈉(thiosultap-disodium)、多噠烷(polythialan)之沙蠶毒素衍生物；

如大克蟎(dicofol)、四氯殺蟎砒(tetradifon)、安殺番(endosulfan)、得氯蟎(dienochlor)、特地靈(dieldrin)之有機氯系化合物；

如芬佈賜(fenbutatin oxide)、三環錫(cyhexatin)之有機金屬系化合物；

如芬化利(fenvalerate)、百滅靈(permethrin)、賽滅寧(cypermethrin)、 α -賽滅寧(alpha-cypermethrin)、 ζ -賽滅寧(zeta-cypermethrin)、 θ -賽滅寧(theta-cypermethrin)、 β -賽滅寧(beta-cypermethrin)、第滅靈(deltamethrin)、三氟氯氰菊酯(cyhalothrin)、 γ -三氟氯氰菊酯(gamma-cyhalothrin)、 λ -三氟氯氰菊酯(lambda-cyhalothrin)、七氟菊酯(tefluthrin)、 κ -汰福寧(kappa-tefluthrin)、依芬寧(ethofenprox)、三氟醚菊酯(flufenprox)、氟氯氰菊酯(cyfluthrin)、 β -氟氯氰菊酯(beta-cyfluthrin)、甲氰菊酯(fenpropathrin)、氟氰戊菊酯(flucythrinate)、氟氰胺菊酯(fluvalinate)、乙氰菊酯(cycloprothrin)、除蟲菊素(pyrethrins)、氰戊菊酯(esfenvalerate)、胺菊酯(tetramethrin)、苜呋菊酯(resmethrin)、普提芬布(protrifenbute)、畢芬寧(bifenthrin)、 κ -畢芬寧(kappa-bifenthrin)、氟丙菊酯(acrinathrin)、丙烯菊酯(allethrin)、氟胺氰戊菊酯(tau-fluvalinate)、四溴菊酯(tralomethrin)、丙氟菊酯(profluthrin)、甲氧苄氟甲酯(metofluthrin)、甲氧苄氟菊酯單體(epsilon-metofluthrin)、七福司靈(heptafluthrin)、酚丁滅寧(phenothrin)、氯苯菊酯(flumethrin)、沒氟菊酯(momfluorothrin)、甲氧苄氟菊酯單體(epsilon-momfluorothrin)、氟矽菊酯(silafluofen)、右旋反式氯丙炔菊酯(chloroprallethrin)之除蟲菊酯系化合物；

如二福隆 (diflubenzuron)、克福隆 (chlorfluazuron)、得福隆 (teflubenzuron)、氟芬隆 (flufenoxuron)、祿芬隆 (lufenuron)、諾伐隆 (novaluron)、三福隆 (triflumuron)、六福隆 (hexaflumuron)、雙三氟蟲脲 (bistrifluron)、諾唯福隆 (noviflumuron)、氟札隆 (fluazuron) 之苯甲醯基脲系化合物；

如美賜平 (methoprene)、百利普芬 (pyriproxyfen)、芬諾克 (fenoxycarb)、二苯丙醚 (diofenolan) 之幼年激素類化合物；

如嗒蟎酮 (pyridaben) 之嗒嗒酮系化合物；

如芬普蟎 (fenpyroximate)、芬普尼 (fipronil)、乙蟲腈 (ethiprole)、乙醯蟲腈 (acetoprole)、吡蟲腈 (pyrafluprole)、吡瑞蟲腈 (pyriprole)、塞比芬 (cyenopyrafen)、丁烯氟蟲腈 (flufiprole) 之吡啶系化合物；

如氟蟲雙醯胺 (pyflubumide)、吡蟎胺 (tebufenpyrad)、啞蟲醯胺 (tolfenpyrad) 之吡啶羧醯胺系化合物；

如氯蟲醯胺 (chlorantraniliprole)、氰蟲醯胺 (cyantraniliprole)、環溴蟲醯胺 (cyclaniliprole)、氟氰蟲醯胺 (tetraniliprole)、tyclopiazoflor 之吡啶基吡啶系化合物；

如益達胺 (imidacloprid)、烯啶蟲胺 (nitenpyram)、亞滅培 (acetamiprid)、噻蟲啉 (thiacloprid)、噻蟲嗒 (thiamethoxam)、可尼丁 (clothianidin)、尼啶替弗 (nidinotefuran)、達特南 (dinotefuran)、硝蟲噻嗒 (

nithiazine)之新菸鹼系化合物；

如得芬諾 (tebufenozide)、美芬諾 (methoxyfenozide)、可芬諾 (chromafenozide)、氯蟲醯肼 (halofenozide)之胍系化合物；

如三氟甲吡醚 (pyridaly1)、氟尼胺 (flonicamid)之吡啶系化合物；

如賜派芬 (spirodiclofen)、螺甲蟎酯 (spiromesifen)之特窗酸 (tetronic acid)系化合物；

如螺蟲乙酯 (spirotetramat)、spiropidion之吡咯酮酸 (tetramic acid)系化合物；

如啞蟎酯 (fluacrypyrim)、啞蟎胺 (pyriminostrobin)之甲氧基丙烯酸酯 (strobilurin)系化合物；

如氟芬林 (flufenerim)、啞蟎醚 (pyrimidifen)之吡啶胺系化合物；

如馬拉松 (malathion)之有機硫化合物；

如氟芬隆 (flufenoxuron)之脲系化合物；

如賽滅淨 (cyromazine)之三嗪系化合物；

如愛美松 (hydramethylnon)之腺系化合物；

如氟蟲胺 (flubendiamide)、溴氟苯胺 (broflanilide)、氯氟氰蟲醯胺 (cyhalodiamide)之二醯胺系化合物；

如殺蟎隆 (diafenthiuron)、滅蟲隆 (chloromethiuron)之硫脲系化合物；

如三亞蟎 (amitraz)、殺蟲脘 (chlordimeform)、伊托明 (chloromebuform)之甲脘系化合物；

如吡蚜酮(pymetrozine)、pyrifluquinazone之吡啶偶氮甲鹼(Azomethine)系化合物；

如afoxolaner、氟拉內(fluralaner)、氟米塔麥(fluxametamide)、寵愛食剋(sarolaner)之異噁唑啉系化合物；

又，作為其他化合物，如布酚淨(buprofezin)、噻蟎酮(hexythiazox)、啞蚜威(triazamate)、蟲蟎腈(chlorfenapyr)、茛蟲威(indoxacarb)、亞醜蟎(acequinocyl)、依殺蟎(etoxazole)、1,3-二氯丙烯(1,3-dichloropropene)、苯克提(benclotiaz)、聯苯肼(bifenazate)、毆蟎多(propargite)、克芬蟎(clofentezine)、氰氟蟲脞(metaflumizone)、丁氟蟎酯(cyflumetofen)、芬殺蟎(fenazaquin)、醯胺氟美(amidoflumet)、氟蟲胺(sulfluramid)、愛美松(hydramethylnon)、介乙醛(metaldehyde)、速殺氟(sulfoxaflor)、氟速芬(fluensulfone)、唯布汀(verbutin)、二克滅(dicloromezotiaz)、三氟苯嘧啶(triflumezopyrim)、fluhexafon、替奧沙芬(tioxazafen)、雙丙環蟲酯(afidopyropen)、氟米克(flometoquin)、氟哌二福隆(flupyradifurone)、氯氟氰蟲醯胺(fluzaindolizine)、acynonapyr、benzpyrimoxan、flupyrimin、oxazosulfyl之化合物等。

又，本發明化合物可與下述化合物組合施用。

如 *Bacillus thuringiensis aizawai*、*Bacillus thuringiensis kurstaki*、*Bacillus thuringiensis israelensis*、

Bacillus thuringiensis japonensis、*Bacillus thuringiensis tenebrionis*或*Bacillus thuringiensis*所生成之結晶蛋白毒素、昆蟲病原病毒劑、昆蟲病原絲狀菌劑、線蟲病原絲狀菌劑等之微生物農藥；

如阿巴汀(abamectin)、因滅汀(emamectin benzoate)、伊維菌素(ivermectin)、密滅汀(milbemectin)、倍脈心(milbemycin oxime)、列比美汀(lepimectin)、賜諾殺(spinosad)、司平托列(spinetoram)之抗生物質及半合成抗生物質；

如印棟素(azadirachtin)、毒魚藤素(rotenone)、瑞諾啉(ryanodine)之天然物；

如待乙妥(deet)之忌避劑；

如石蠟油、礦物油(mineral oil)之物理性防除劑。

【0292】本發明期望的態樣係如以下。惟，本發明並非被限定於此等者。

[1]一種式(1)表示之化合物或其鹽。

[2]如前述[1]所記載之化合物或其鹽，其中，**B**為選自由式(B-1)～式(B-18)及式(B-101)～式(B-128)表示之基所成之群組中之雜環基。

[3]如前述[1]所記載之化合物或其鹽，其中，**B**為選自由式(B-1)～式(B-4)表示之基所成之群組中之雜環基。

[4]如前述[1]所記載之化合物或其鹽，其中，**B**為式(B-1)或式(B-2)表示之基。

[5]如前述[4]所記載之化合物或其鹽，其中， R^{B1} 為鹵

素原子、烷基、烯基、鹵烷基、烷氧基烷基或氰基； R^{B2} 為烷基、鹵烷基或環烷基； R^{B3} 為鹵素原子。

[6]如前述[1]~[5]所記載之化合物或其鹽，其中，[式中，A為被 R^A 取代之苯基或被取代之吡啶基，

B為被 R^B 取代之雜環基，

R^A 可相同或相異為鹵素原子、烷基、鹵烷基、烯基、炔基、環狀基、硝基、氰基或 $-L^A-Y^A$ ，或可鍵結2個 R^A ，形成可被 Z^1 取代之環，

R^B 可相同或相異為鹵素原子、烷基、鹵烷基、烷氧基烷基、環烷基或氰基，

L^A 為O、S、 $C(=O)$ 、 $C(=O)O$ 、 $C(=O)N(R^1)$ 、 $OC(=O)$ 、 $N(R^1)$ 、 $N(R^1)C(=O)$ 、 $N(R^1)C(=O)O$ 、 $C(=NR^2)$ 、 SO 、 SO_2 或 $SO_2N(R^1)$ ，

Y^A 為氫原子、可被 Z^2 取代之烷基、烯基或可被 Z^3 取代之環狀基，

R^1 為氫原子或烷基，

R^2 為氫原子、烷基或烷氧基，

Z^1 為鹵素原子， Z^2 為鹵素原子、氰基、環烷基或烷氧基，

Z^3 為鹵素原子或鹵烷基。

[7]如前述[6]所記載之化合物或其鹽，其中， R^{B1} 為鹵素原子、烷基、鹵烷基、烷氧基烷基或氰基； R^{B2} 為烷基、鹵烷基或環烷基； R^{B3} 為鹵素原子。

[8]如前述[1]~[7]所記載之化合物或其鹽，其中，A

為被 R^A 取代之苯基。

[9]如前述 [1]~ [7]所記載之化合物或其鹽，其中，A 為被相同或相異之 2~ 3個 R^A 取代之苯基。

[10]如前述 [1]~ [7]所記載之化合物或其鹽，其中，A 為 2位及 4位之至少一者被 R^A 取代之苯基。

[11]如前述 [1]~ [7]所記載之化合物或其鹽，其中，A 為可被 Z^1 取代之苯并二氧環戊基。

[12]如前述 [1]~ [11]所記載之化合物或其鹽，其中， R^A 為鹵素原子、烷基、鹵烷基或 $-L^A-Y^A$ 。

【0293】 [13]一種農園藝用殺菌劑，其係將如前述 [1]~ [12]所記載之化合物或其鹽作為有效成分含有。

[14]一種防除植物病害之方法，其係將如前述 [1]~ [13]所記載之化合物或其鹽施用在植物或土壤。

[實施例]

【0294】 其次，雖記載本發明的實施例，但本發明並非被限定於此等者。

【0295】

合成例 1：N-(1-(3,4-二氯苯基)-2-甲基-1-氧代丙烷-2-基)-N-甲氧基-2,5-二甲基呋喃-3-羧醯胺(化合物 No.202)之合成
(1)1-(3,4-二氯苯基)-2-甲基-2-硝基丙烷-1-醇的合成

於 3,4-二氯苯并醛 (5g) 與 2-硝基丙烷 (10.26ml) 之混合物，加入 1,5,7-三氮雜雙環 [4.4.0] 癸-5-烯 (TBD、1.19g)，在室溫攪拌。24 小時後，將反應混合物投入水中，在乙酸

乙酯萃取。將有機層以水洗淨，再以無水硫酸鎂乾燥、過濾後，減壓下進行濃縮。將所得之殘渣以管柱層析(溶離液：乙酸乙酯/庚烷)純化，而得到固體之目的物(0.97g)。

$^1\text{H NMR}$ ($\text{CDCl}_3/500\text{MHz}$) : $\delta(\text{ppm})= 7.50$ (d, $J=2.0$ Hz, 1H), 7.45 (d, $J = 8.0$ Hz, 1H), 7.21 (dd, $J = 8.0, 2.0$ Hz, 1H), 5.28 (s, 1H), 2.73 (brs, 1H), 1.57 (s, 3H), 1.46 (s, 3H).

【0296】

(2)1-(3,4-二氯苯基)-2-甲基-2-硝基丙烷-1-酮的合成

於1-(3,4-二氯苯基)-2-甲基-2-硝基丙烷-1-醇(0.97g)之二氯甲烷(20mL)溶液，加入戴斯-馬丁氧化劑(DMP、1.64g)，在室溫攪拌一晚。將反應混合物投入水中，以碳酸氫鈉水溶液中和，濾出不溶物。將濾液在乙酸乙酯萃取，將有機層以水洗淨。以無水硫酸鎂乾燥、過濾後，減壓下進行濃縮。將所得之殘渣以管柱層析(溶離液：乙酸乙酯/庚烷)純化，而得到油狀之目的物(0.78g)。

$^1\text{H NMR}$ ($\text{CDCl}_3/500\text{MHz}$) : $\delta(\text{ppm})=7.90$ (d, $J= 1.5\text{Hz}$, 1H)、7.53-7.49 (m, 2H)、1.92 (s, 6H).

【0297】

(3)1-(3,4-二氯苯基)-2-(羥基胺基)-2-甲基丙烷-1-酮的合成

於1-(3,4-二氯苯基)-2-甲基-2-硝基丙烷-1-酮(0.76g)與氯化銨(1.55g)之四氫呋喃(10mL)、水(5mL)、乙醇(5mL)之混合溶液，冰水下劃分鋅(0.95g)加入並攪拌。15分鐘後，將反應混合物使用矽鈣石過濾，將所得之濾液投入水中，在乙酸乙酯萃取。將有機層以水洗淨，再以無水硫酸鎂乾

燥、過濾後，減壓下進行濃縮。將所得之殘渣以管柱層析(庚烷：乙酸乙酯)純化，而得到固體之目的物(0.48g)。

【0298】

(4)N-(1-(3,4-二氯苯基)-2-甲基-1-氧代丙烷-2-基)-N-羥基-2,5-二甲基咪喃-3-羧醯胺的合成

於1-(3,4-二氯苯基)-2-(羥基胺基)-2-甲基丙烷-1-酮(0.3g)與三乙基胺(TEA、0.37g)之四氫咪喃溶液(10ml)，加入2,5-二甲基咪喃-3-碳醯氯(0.4g)，以室溫攪拌一晚。將反應混合物投入水中，在乙酸乙酯萃取。

將有機層以水洗淨，再以無水硫酸鎂乾燥、過濾後，減壓下進行濃縮。將所得之殘渣以管柱層析(庚烷：乙酸乙酯)純化，而得到糖果狀之N-(1-(3,4-二氯苯基)-2-甲基丙烷-1-氧代丙烷-2-基)-N-((2,5-二甲基咪喃-3-羧基)氧基)-2,5-二甲基咪喃-3-羧醯胺(0.53g)。將此溶解於乙醇(10ml)、四氫咪喃(5ml)及水(5ml)之混合溶媒，加入氫氧化鈉(0.22g)，在室溫攪拌。1小時後，將反應混合物投入水中，在乙酸乙酯萃取。將有機層以水洗淨，再以無水硫酸鎂乾燥、過濾後，減壓下進行濃縮，而得到糖果狀之目的物(0.38g)。

$^1\text{H NMR}$ ($\text{CDCl}_3/500\text{MHz}$): $\delta(\text{ppm}) = 8.15$ (d, $J=1.5\text{Hz}$, 1H), 7.88 (dd, $J=8.5, 2.5\text{Hz}$, 1H), 7.41 (d, $J=8.5\text{Hz}$, 1H), 6.21 (s, 1H), 2.24 (s, 3H), 2.20 (s, 3H), 1.60 (s, 6H).

【0299】

(5)N-(1-(3,4-二氯苯基)-2-甲基-1-氧代丙烷-2-基)-N-甲氧

基-2,5-二甲基咪喃-3-羧醯胺(化合物No.202)之合成

於 N-(1-(3,4-二氯苯基)-2-甲基-1-氧代丙烷-2-基)-N-羥基-2,5-二甲基咪喃-3-羧醯胺(0.218g)之 N,N-二甲基甲醯胺溶液(7ml)，冰冷下加入氫化鈉(0.03g、60%)並攪拌。15分鐘後，以同溫加入碘化甲烷(0.21g)並攪拌。1小時後，將反應混合物投入水中，加入鹽酸而成為酸性。將混合物在乙酸乙酯萃取。將有機層以水洗淨，再以無水硫酸鎂乾燥、過濾後，減壓下進行濃縮。將所得之殘渣以管柱層析(庚烷：乙酸乙酯)純化，而得到固體之目的物(0.21g)。

$^1\text{H NMR}$ ($\text{CDCl}_3/500\text{MHz}$) : $\delta(\text{ppm}) = 8.16$ (d, $J=2.5\text{Hz}$, 1H), 7.88 (dd, $J=8.5, 2.5\text{ Hz}$, 1H), 7.42 (d, $J=8.5\text{ Hz}$, 1H), 6.28 (s, 1H), 3.85 (s, 3H), 2.31 (s, 3H), 2.24 (s, 3H), 1.68 (brs, 6H).

【0300】

合成例2：3-(二氟甲基)-N-(1-(4-異丙氧基-2-甲基苯基)-2-甲基-1-氧代丙烷-2-基)-N-甲氧基-1-甲基-1H-吡唑-4-羧醯胺(化合物No.8)之合成

【0301】

(1)2-溴-1-(4-異丙氧基-2-甲基苯基)-2-甲基丙烷-1-酮的合成

於根據日本特開2016-108332號合成之1-(4-異丙氧基-2-甲基苯基)-2-甲基丙烷-1-酮(14.41g)之四氫咪喃(100mL)溶液，加入三甲基苯基三溴化銨(28.87g)，以室溫攪拌5小時。反應結束後，過濾反應混合物，將所得之濾液減壓下

進行濃縮。將所得之殘渣以管柱層析(溶離液：乙酸乙酯/庚烷)純化，而得到目的物(20.4g)。

【0302】

(2)1-(4-異丙氧基-2-甲基苯基)-2-甲基-2-硝基丙烷-1-酮的合成

於2-溴-1-(4-異丙氧基-2-甲基苯基)-2-甲基丙烷-1-酮(20.4g)之二甲基亞砷(100mL)溶液，加入亞硝酸鈉(7.6g)，在室溫攪拌4小時使其反應。加入二甲基亞砷(40mL)在40℃攪拌2小時使其反應。反應結束後，冷卻至室溫加入水，以乙酸乙酯萃取。將合併之有機層以飽和食鹽水洗淨，再以硫酸鈉乾燥，減壓下進行濃縮。將所得之殘渣以管柱層析(庚烷：乙酸乙酯)純化，而得到目的物(19.5g)。

$^1\text{H NMR}$ ($\text{CDCl}_3/300\text{MHz}$): $\delta(\text{ppm})=7.31(\text{d}, J=8.7 \text{ Hz}, 1\text{H}), 6.76(\text{d}, J=2.4 \text{ Hz}, 1\text{H}), 6.64(\text{dd}, J=9.0, 2.7 \text{ Hz}, 1\text{H}), 4.63-4.55(\text{m}, 1\text{H}), 2.45(\text{s}, 3\text{H}), 1.92(\text{s}, 6\text{H}), 1.34(\text{d}, J=6.0 \text{ Hz}, 6\text{H})$.

【0303】

(3)2-(羥基胺基)-1-(4-異丙氧基-2-甲基苯基)-2-甲基丙烷-1-酮的合成

以與合成例1(3)同樣的方法，從1-(4-異丙氧基-2-甲基苯基)-2-甲基-2-硝基丙烷-1-酮(1.0g)得到目的物(0.5g)。

$^1\text{H NMR}$ ($\text{CDCl}_3/300\text{MHz}$): $\delta(\text{ppm})=7.35(\text{d}, J=8.4 \text{ Hz}, 1\text{H}), 6.73(\text{d}, J=2.4 \text{ Hz}, 1\text{H}), 6.67(\text{dd}, J=8.7, 2.7 \text{ Hz}, 1\text{H}), 4.60-4.52(\text{m}, 1\text{H}), 2.38(\text{s}, 3\text{H}), 1.36(\text{s}, 6\text{H}), 1.32(\text{d}, J=6.0$

Hz, 6H).

【0304】

(4)3-(二氟甲基)-N-羥基-N-(1-(4-異丙氧基-2-甲基苯基)-2-甲基-1-氧代丙烷-2-基)-1-甲基-1H-吡啶-4-羧醯胺的合成

於根據美國專利第5093347號合成之3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡啶-4-羧酸(7.5g)之甲苯(10mL)溶液，加入草醯氯(12.12g)及N,N-二甲基甲醯胺(0.01g)，在80℃攪拌1小時。將反應混合溶液於減壓下進行濃縮，而得到3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡啶-4-羧醯氯。使所得之羧醯氯溶解在四氫呋喃(1mL)，調製四氫呋喃溶液。而且，於2-(羥基胺基)-1-(4-異丙氧基-2-甲基苯基)-2-甲基丙烷-1-酮(4.8g)之四氫呋喃(9mL)溶液加入三乙基胺(5.8g)，加入經調製之羧醯氯的四氫呋喃溶液。在室溫攪拌4小時。反應結束後，加入飽和碳酸氫鈉水溶液，以乙酸乙酯萃取。以飽和食鹽水洗淨後，將有機層以硫酸鈉乾燥，減壓下進行濃縮。使所得之殘渣溶解於乙醇(50mL)，於其反應溶液加入2M氫氧化鈉水溶液(50mL)，在室溫攪拌15小時30分鐘。反應結束後，加入水以乙酸乙酯萃取。以飽和食鹽水洗淨後，將有機層以硫酸鈉乾燥，減壓下進行濃縮。得到將所得之殘渣以管柱層析(庚烷：乙酸乙酯)純化之混合物。再度使混合物溶解於乙醇(50mL)，於其乙醇溶液加入2M鈉水溶液(50mL)，在室溫攪拌18小時。反應結束後，加入水以乙酸乙酯萃取。以飽和食鹽水洗淨後，將有機層以硫酸鈉乾燥，減壓下進行濃縮，而得到目的物(5.0g)。

^1H NMR ($\text{CDCl}_3/300\text{MHz}$) : $\delta(\text{ppm})= 7.82(\text{s}, 1\text{H}), 7.68(\text{d}, J=8.7 \text{ Hz}, 1\text{H}), 7.05(\text{t}, J=54.5 \text{ Hz}, 1\text{H}), 6.73(\text{d}, J=2.4 \text{ Hz}, 1\text{H}), 6.62(\text{dd}, J=8.7, 2.7 \text{ Hz}, 1\text{H})$ 、 $4.60\text{-}4.53(\text{m}, 1\text{H})$ 、 $3.82(\text{s}, 3\text{H}), 2.38(\text{s}, 3\text{H}), 1.65(\text{brs}, 6\text{H}), 1.32(\text{d}, J=6.0 \text{ Hz}, 6\text{H})$

【0305】

(5)3-(二氟甲基)-N-(1-(4-異丙氧基-2-甲基苯基)-2-甲基-1-氧代丙烷-2-基)-N-甲氧基-1-甲基-1H-吡啶-4-羧醯胺(化合物 No.8)之合成

於3-(二氟甲基)-N-羥基-N-(1-(4-異丙氧基-2-甲基苯基)-2-甲基-1-氧代丙烷-2-基)-1-甲基-1H-吡啶-4-羧醯胺(0.45g)之N,N-二甲基甲醯胺(15mL)溶液，加入氫化鈉(0.07g、60%)，在冰水浴冷卻並加入碘化甲烷(0.19g)。在冰水浴直接冷卻1小時並攪拌使其反應後，使溫度上昇至室溫，攪拌1小時使其反應。反應結束後，加入水以乙酸乙酯萃取。將合併之有機層以飽和食鹽水洗淨，以硫酸鈉乾燥，減壓下進行濃縮。將所得之殘渣以管柱層析(庚烷：乙酸乙酯)純化，而得到目的物(0.33g)。

^1H NMR ($\text{CDCl}_3/300\text{MHz}$) : $\delta(\text{ppm})= 7.78 (\text{s}, 1\text{H}), 8.00 (\text{d}, J=8.4 \text{ Hz}, 1\text{H}), 7.05 (\text{t}, J=54.3 \text{ Hz}, 1\text{H}), 6.71 (\text{d}, J=2.4 \text{ Hz}, 1\text{H}), 6.57 (\text{dd}, J=8.4, 2.4 \text{ Hz}, 1\text{H}), 4.59\text{-}4.51 (\text{m}, 1\text{H}), 3.94 (\text{s}, 3\text{H}), 3.80 (\text{s}, 3\text{H}), 2.41 (\text{s}, 3\text{H}), 1.74 (\text{brm}, 6\text{H}), 1.30 (\text{d}, J=6.0 \text{ Hz}, 6\text{H})$

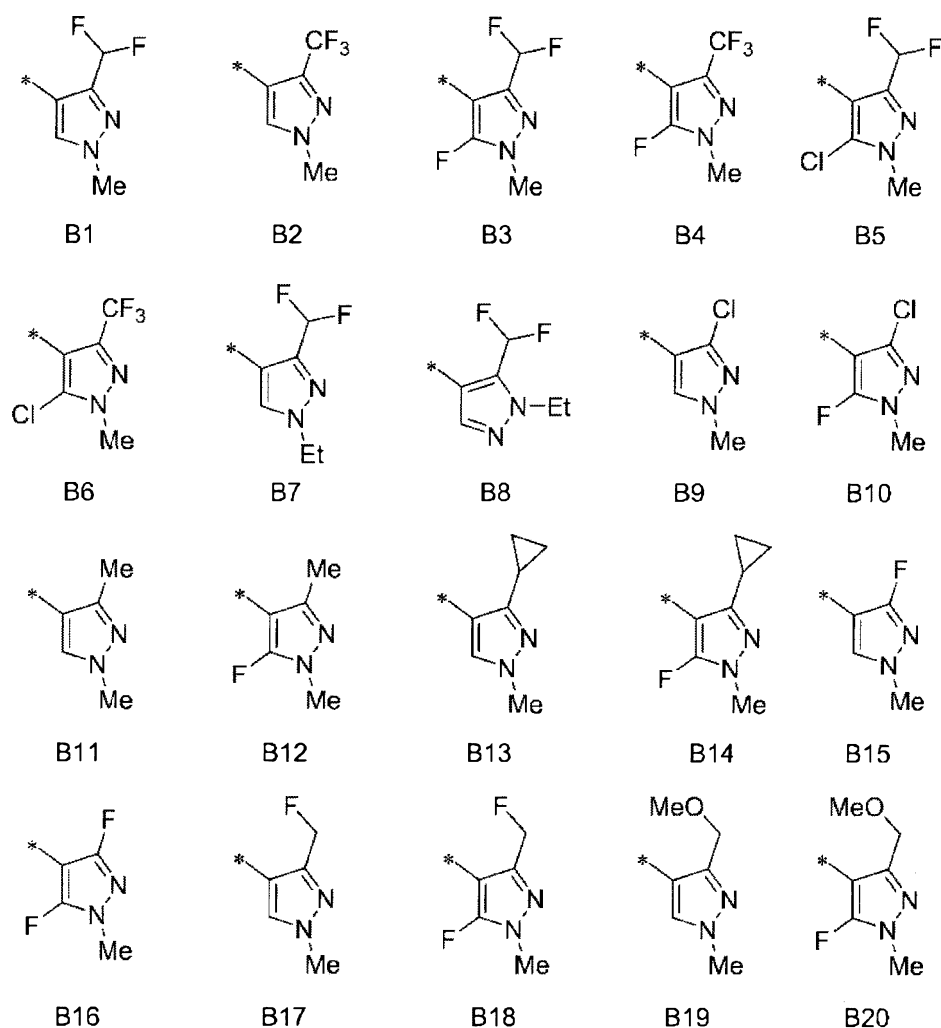
【0306】 其次，將本發明化合物之代表例具體列舉於

第1表。此等化合物可在前述製造方法及前述合成例以及本技術領域，根據公知之方法合成。

表中，No.表示化合物No.。第1表之物性欄所記載之數值為熔點(°C)，記載為NMR之化合物於第2表表示¹H-NMR光譜數據。於第1表中之B欄使用之簡稱分別表示以下之取代基。又，Me表示甲基，Et表示乙基。

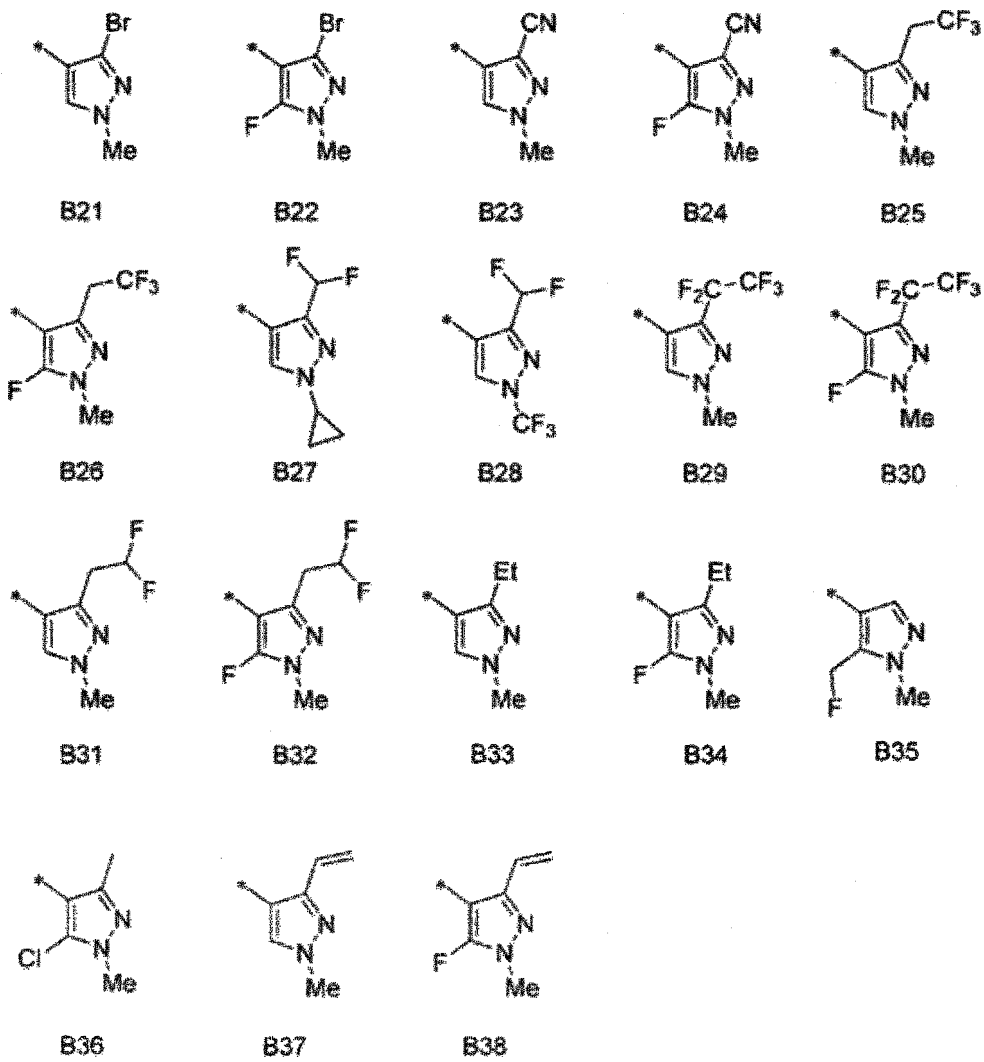
【0307】

[化42]



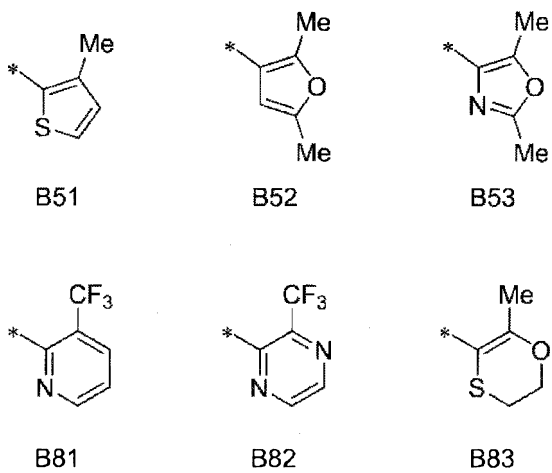
【0308】

[化43]



【 0309 】

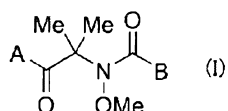
[化44]



【 0310 】

[表 1]

第1表



No.	A	B	物性
1	4-(環己氧基)-2-甲基苯基	B81	NMR
2	3,4-二氯苯基	B51	123.9°C
3	3,4-二氟苯基	B1	149-151°C
4	3,4-二氟苯基	B2	146-148°C
5	3,4-二氟苯基	B4	97-101°C
6	4-(環己氧基)-2-甲基苯基	B1	NMR
7	4-異丙氧基-2-甲基苯基	B51	114.6°C
8	4-異丙氧基-2-甲基苯基	B1	NMR
9	4-異丙氧基-2-甲基苯基	B82	NMR
10	4-(環己氧基)-3-氟苯基	B1	NMR
11	4-氟苯基	B1	NMR
12	3-氟-4-羥基苯基	B1	NMR
13	3,4-二氯苯基	B1	159-160°C
14	4-異丙氧基-2-甲基苯基	B81	NMR
15	4-異丙氧基-2-甲基苯基	B2	NMR
16	4-異丙氧基苯基	B1	NMR
17	4-(環戊氧基)-3-氟苯基	B1	NMR
18	3-氟-4-異丙氧基苯基	B1	NMR
19	4-(環戊氧基)-2-甲基苯基	B1	NMR
20	4-(環丁氧基)-2-甲基苯基	B1	NMR
21	4-((3-氯-5-(三氟甲基)吡啶-2-基)氧基)苯基	B1	NMR
22	4-(環戊氧基)苯基	B1	NMR
23	3,4-二氯苯基	B82	164.0°C
24	3,4-二氯苯基	B2	146.1°C
25	4-(2,2-二氟乙氧基)苯基	B1	NMR
26	4-(2-氯-4-(三氟甲基)苯氧基)苯基	B1	NMR
27	4-丙氧基苯基	B1	NMR
28	4-((3-氯吡啶-2-基)氧基)苯基	B1	NMR
29	4-乙氧基-3-氟苯基	B1	NMR
30	3-氟-4-丙氧基苯基	B1	NMR

【0311】

[表 2]

第1表(接著)

No.	A	B	物性
31	4-甲氧基-2-甲基苯基	B1	NMR
32	2-甲基-4-(1-甲基丙-1-氧基)苯基	B1	NMR
33	4-異丁氧基-2-甲基苯基	B1	NMR
34	4-乙氧基-2-甲基苯基	B1	NMR
35	4-丁氧基-2-甲基苯基	B1	NMR
36	3-氯-4-氟苯基	B1	145-147°C
37	3-氯-4-氟苯基	B2	132-134°C
38	3-氯-4-氟苯基	B4	127-129°C
39	4-(環丁氧基)苯基	B1	NMR
40	4-氟苯基	B2	NMR
41	4-羥基苯基	B2	212-214°C
42	4-(環戊氧基)-2-甲基苯基	B2	NMR
43	2-甲基-4-丙氧基苯基	B2	104.3°C
44	2-甲基-4-(1-甲基丙-1-氧基)苯基	B2	NMR
45	4-異丁氧基-2-甲基苯基	B2	NMR
46	4-(乙硫基)苯基	B1	
47	4-(乙基亞磺醯基)苯基	B1	
48	4-(乙基磺醯基)苯基	B1	
49	4-硝基苯基	B1	
50	4-(乙基胺基)苯基	B1	
51	4-(乙基甲基胺基)苯基	B1	
52	4-((3-氯-5-(三氟甲基)吡啶-2-基)氧基)-2-甲基苯基	B2	99.3°C
53	4-(2-氯-4-(三氟甲基)苯氧基)-2-甲基苯基	B2	116.0°C
54	4-(2,2-二氟乙氧基)-2-甲基苯基	B2	120.0°C
55	4-甲氧基-2-甲基苯基	B2	92.7°C
56	4-乙氧基-2-甲基苯基	B2	96.8°C
57	4-丁氧基-2-甲基苯基	B2	113.8°C
58	4-乙硫基-2-甲基苯基	B1	
59	4-乙基亞磺醯基-2-甲基苯基	B1	
60	4-乙基磺醯基-2-甲基苯基	B1	

【 0312 】

[表 3]

第1表(接著)

No.	A	B	物性
61	2-甲基-4-硝基苯基	B1	
62	4-(乙基胺基)-2-甲基苯基	B1	
63	4-(乙基甲基胺基)-2-甲基苯基	B1	
64	4-((3-氯-5-(三氟甲基)吡啶-2-基)氧基)-2-甲基苯基	B81	NMR
65	3-氯-4-乙氧基苯基	B1	NMR
66	3-溴-4-氟苯基	B1	
67	3-溴-4-氟苯基	B2	
68	3-溴-4-氟苯基	B4	
69	3,5-二溴-4-乙氧基苯基	B1	NMR
70	4-((3,5-二氯吡啶-2-基)氧基)苯基	B1	NMR
71	4-((5-溴-3-氯吡啶-2-基)氧基)苯基	B1	NMR
72	4-乙氧基-3-甲基苯基	B1	NMR
73	3-氯-4-異丙氧基苯基	B1	NMR
74	4-乙氧基苯基	B1	NMR
75	4-(環己氧基)苯基	B2	NMR
76	4-異丙氧基苯基	B2	136-138°C
77	4-((3-氯-5-(三氟甲基)吡啶-2-基)氧基)-2-甲基苯基	B1	103.5°C
78	4-((3-氯-5-(三氟甲基)苯氧基)-2-甲基苯基	B1	128.3°C
79	2-甲基-4-丙氧基苯基	B1	NMR
80	4-(2,2-二氟乙氧基)-2-甲基苯基	B1	NMR
81	4-((6-氯苯并[d]噁唑-2-基)氧基)苯基	B1	NMR
82	4-((6-氯喹啉-2-基)氧基)苯基	B1	NMR
83	4-(環戊氧基)苯基	B2	NMR
84	4-(1-甲基-丙-1-氧基)苯基	B2	114-116°C
85	4-(2,2-二氟乙氧基)苯基	B2	118-120°C
86	4-丁氧基苯基	B2	128-129°C
87	4-((3-氯-5-(三氟甲基)吡啶-2-基)氧基)苯基	B2	63-66°C
88	4-(2-甲基烯丙基)氧基苯基	B1	NMR
89	4-溴-3-氯苯基	B1	NMR
90	4-氟-2-甲基苯基	B1	

【 0313 】

[表 4]

第1表(接著)

No.	A	B	物性
91	4-氟-2-甲基苯基	B2	
92	4-氟-2-甲基苯基	B4	
93	4-丙氧基苯基	B2	108-110°C
94	4-乙氧基苯基	B2	150-152°C
95	4-甲氧基苯基	B2	148-150°C
96	3-溴-4-氯苯基	B1	162.4°C
97	3-氯-4-甲基苯基	B1	161.6°C
98	4-氯-3-甲基苯基	B1	NMR
99	5-氯吡啶-2-基	B1	
100	5-氯吡啶-2-基	B2	
101	5-氯吡啶-2-基	B4	
102	4,5-二氯吡啶-2-基	B1	
103	4,5-二氯吡啶-2-基	B2	
104	4,5-二氯吡啶-2-基	B4	
105	2-氟-4-異丙氧基苯基	B1	102.1°C
106	4-氯-2-甲基苯基	B1	161.3°C
107	4-氯-2-甲基苯基	B2	150.9°C
108	4-(4-氯苯氧基)苯基	B1	164-165°C
109	4-異丙氧基苯基	B81	139.0°C
110	4-異丙氧基-2-甲基苯基	B3	NMR
111	4-氯苯基	B2	120-122°C
112	4-氯苯基	B1	114-116°C
113	4-溴-2-甲基苯基	B2	142-144°C
114	4-溴-2-甲基苯基	B1	151-153°C
115	4-異戊基氧基-2-甲基苯基	B1	92.9°C
116	4-(3-甲基丁-2-烯-1-基)氧基-2-甲基苯基	B1	79.2°C
117	2,3-二氫-1H-茚-5-基	B1	123.1°C
118	3,4-二氯苯基	B81	134.6°C
119	4-異丁氧基苯基	B2	NMR
120	4-(2-氯-4-(三氟甲基)苯氧基)苯基	B2	135-137°C

【 0314 】

[表 5]

第1表(接著)

No.	A	B	物性
121	4-異丙氧基-2-甲基苯基	B6	168.8°C
122	4-(三氟甲基)苯基	B1	124-125°C
123	4-(三氟甲基)苯基	B2	114-116°C
124	4-(4-氯苯氧基)苯基	B2	140-141°C
125	4-(4-氯苯氧基)苯基	B81	156-157°C
126	4-(丁-3-烯-2-基)氧基-2-甲基苯基	B1	NMR
127	4-(氰基甲基)氧基-2-甲基苯基	B1	NMR
128	2-甲基-4-(1-甲基氰基甲基)氧基苯基	B1	NMR
129	2-氯-4-異丙氧基苯基	B1	146.6°C
130	3,4-二氯苯基	B3	123.5°C
131	4-(環己基甲氧基)苯基	B2	128-130°C
132	4-(環丙基甲氧基)苯基	B2	NMR
133	4-異丙氧基苯基	B3	NMR
134	3,4-二氯苯基	B4	122.4°C
135	4-氯-3-乙基苯基	B1	
136	4-氯-3-乙基苯基	B2	
137	4-氯-3-乙基苯基	B4	
138	4-異丙氧基-2-甲基苯基	B5	NMR
139	4-異丙氧基苯基	B5	NMR
140	4-異丙氧基-2-甲基苯基	B4	NMR
141	2-氟-4-異丙氧基苯基	B3	NMR
142	2-氟-4-異丙氧基苯基	B2	127.1°C
143	4-溴-3-氟苯基	B1	140-142°C
144	4-溴-3-氟苯基	B2	123-126°C
145	4-溴-3-氟苯基	B4	123-128°C
146	4-異丙氧基-2-甲氧基苯基	B1	NMR
147	4-異丙氧基苯基	B4	NMR
148	4-異丙氧基-2-甲基苯基	B7	NMR
149	4-異丙氧基-2-(三氟甲氧基)苯基	B1	122-124°C
150	4-異丙氧基-2-(三氟甲氧基)苯基	B2	102-103°C

【 0315 】

[表 6]

第1表(接著)

No.	A	B	物性
151	4-異丙氧基-2-(三氟甲基)苯基	B1	145-147°C
152	4-異丙氧基-2-(三氟甲基)苯基	B2	106-110°C
153	4-異丙氧基-2-(三氟甲基)苯基	B3	NMR
154	4-異丙氧基-2-(三氟甲基)苯基	B4	NMR
155	3,4-二溴苯基	B1	157-160°C
156	3,4-二溴苯基	B2	
157	3,4-二溴苯基	B4	120-122°C
158	4-(三氟甲氧基)苯基	B1	110.9°C
159	4-(三氟甲氧基)苯基	B3	NMR
160	4-(三氟甲氧基)苯基	B2	97.5°C
161	4-(三氟甲氧基)苯基	B4	NMR
162	4-氟-3-(三氟甲基)苯基	B1	
163	4-氟-3-(三氟甲基)苯基	B2	
164	4-氟-3-(三氟甲基)苯基	B4	
165	4-溴-3-(三氟甲基)苯基	B1	
166	4-溴-3-(三氟甲基)苯基	B2	
167	4-溴-3-(三氟甲基)苯基	B4	
168	4-溴苯基	B1	
169	4-溴苯基	B2	
170	4-溴苯基	B4	
171	4-甲基苯基	B1	141-145°C
172	4-甲基苯基	B2	
173	4-甲基苯基	B4	
174	4-氰基苯基	B1	
175	4-硝基苯基	B1	
176	4-(丙-1-炔-1-基)-苯基	B1	
177	4-(3,3-二甲基丁-1-炔-1基)苯基	B1	
178	4-乙烯基苯基	B1	
179	4-環丙基苯基	B1	
180	4-(苯基)苯基	B1	

【 0316】

[表 7]

第1表(接著)

No.	A	B	物性
181	2,4-二氯苯基	B1	178-180°C
182	2,4-二氯苯基	B3	69-72°C
183	2,4-二氯苯基	B2	153-155°C
184	2,4-二氯苯基	B4	NMR
185	2,4-二氯苯基	B81	NMR
186	2,4-二氟苯基	B1	
187	2,4-二氟苯基	B2	
188	2,4-二氟苯基	B4	
189	4-氯-2-甲基胺基苯基	B1	
190	4-氯-2-二甲基胺基苯基	B1	
191	4-(三氟甲氧基)苯基	B81	NMR
192	2,3-二氯苯基	B1	146-148°C
193	2,3-二氯苯基	B3	NMR
194	2,3-二氯苯基	B2	122-124°C
195	2,3-二氯苯基	B4	NMR
196	4-異丙氧基-2-甲基苯基	B8	NMR
197	4-氯-2-(三氟甲基)苯基	B1	117.0°C
198	4-氯-2-(三氟甲基)苯基	B3	119.3°C
199	4-氯-2-(三氟甲基)苯基	B2	129.4°C
200	4-氯-2-氟苯基	B1	121.6°C
201	2,4,6-三氯苯基	B1	NMR
202	3,4-二氯苯基	B52	114.1°C
203	3-氯苯基	B1	178-180°C
204	3-氯苯基	B2	157-159°C
205	3-氯苯基	B3	NMR
206	3-氯苯基	B4	NMR
207	4-氯-2-氟苯基	B3	105.4°C
208	4-氯-2-氟苯基	B2	116.6°C
209	4-氯-2-氟苯基	B4	113.5°C
210	4-碘-2-甲基苯基	B1	

【 0317 】

[表 8]

第1表(接著)

No.	A	B	物性
211	4-碘-2-甲基苯基	B2	
212	4-碘-2-甲基苯基	B4	
213	3,4-二氯苯基	B83	97.8°C
214	2,5-二甲基苯基	B1	134-135°C
215	2,5-二甲基苯基	B2	121-123°C
216	2,5-二甲基苯基	B3	84-86°C
217	2,5-二甲基苯基	B4	101-103°C
218	2,5-二氯苯基	B1	NMR
219	2,5-二氯苯基	B2	120-121°C
220	2,5-二氯苯基	B4	110-112°C
221	5-異丙氧基-2-甲基苯基	B1	NMR
222	5-異丙氧基-2-甲基苯基	B2	NMR
223	5-異丙氧基-2-甲基苯基	B4	NMR
224	4-氯-2-甲氧基苯基	B1	142.5°C
225	4-氯-2-甲基苯基	B51	125.9°C
226	4-氯-2-甲基苯基	B52	83.7°C
227	3-氯-2-甲基苯基	B1	158-160°C
228	3-氯-2-甲基苯基	B2	142-143°C
229	3-氯-2-甲基苯基	B4	129-131°C
230	3,5-二氯苯基	B1	164-166°C
231	3,5-二氯苯基	B4	133-135°C
232	3,5-二氯苯基	B2	175-177°C
233	4-氯-2-甲基苯基	B3	NMR
234	3,4-二氯苯基	B9	173.6°C
235	3,4-二氯苯基	B10	129-131°C
236	4-氯-2-甲基苯基	B83	NMR
237	4-氯-2-甲基苯基	B9	148.2°C
238	4-氯-2-甲基苯基	B10	NMR
239	4-異丙氧基-2-甲基苯基	B17	NMR
240	4-異丙氧基-2-甲基苯基	B18	

【 0318 】

[表 9]

第1表(接著)

No.	A	B	物性
241	4-異丙氧基-2-甲基苯基	B19	
242	4-氯-2-甲基苯基	B20	
243	4-氯-2-甲基苯基	B23	155-158°C
244	4-氯-2-甲基苯基	B24	
245	4-氯-2-甲基苯基	B25	
246	4-氯-2-甲基苯基	B26	
247	4-氯-2-甲基苯基	B81	152.6°C
248	4-氯-2-甲基苯基	B11	133.0°C
249	4-氯-2-甲基苯基	B12	NMR
250	4-異丙氧基-2-甲基苯基	B11	NMR
251	4-異丙氧基-2-甲基苯基	B12	
252	3,4-二氯苯基	B11	NMR
253	4-氯-2-甲基苯基	B13	137-139°C
254	4-氯-2-甲基苯基	B14	
255	3,4-二氯苯基	B13	158-160°C
256	3,4-二氯苯基	B14	
257	3,4-二氯苯基	B12	NMR
258	4-氯-2-甲基苯基	B4	NMR
259	4-異丙氧基-2-甲基苯基	B13	NMR
260	4-異丙氧基-2-甲基苯基	B14	
261	4-異丙氧基-2-甲基苯基	B9	130.6°C
262	4-氯-2-甲基苯基	B15	
263	4-氯-2-甲基苯基	B16	
264	3,4-二氯苯基	B15	
265	3,4-二氯苯基	B16	
266	4,5-二氯-2-甲基苯基	B1	NMR
267	4,5-二氯-2-甲基苯基	B2	NMR
268	4,5-二氯-2-甲基苯基	B4	NMR
269	4-氯-3-(三氟甲基)苯基	B1	131-133°C
270	4-氯-3-(三氟甲基)苯基	B4	129-132°C

【 0319 】

[表 10]

第1表(接著)

No.	A	B	物性
271	4-氯-3-(三氟甲基)苯基	B2	134-136°C
272	3,4-二氯苯基	B21	159.7°C
273	3,4-二氯苯基	B22	
274	4-氯-2-甲基苯基	B21	165.0°C
275	4-氯-2-甲基苯基	B22	
276	4-異丙氧基-2-甲基苯基	B21	121.9°C
277	4-異丙氧基-2-甲基苯基	B22	
278	2,2-二氟-苯并[d][1,3]二氧五環-5-基	B1	124-125°C
279	2,2-二氟-苯并[d][1,3]二氧五環-5-基	B2	85-87°C
280	2,2-二氟-苯并[d][1,3]二氧五環-5-基	B4	81-83°C
281	2,2-二氟-4-甲基-苯并[d][1,3]二氧五環-5-基	B1	133-134°C
282	2,2-二氟-4-甲基-苯并[d][1,3]二氧五環-5-基	B2	146-147°C
283	2,2-二氟-4-甲基-苯并[d][1,3]二氧五環-5-基	B4	125-127°C
284	3,4-二氯苯基	B53	112.5°C
285	3,4-二氯-2-甲基苯基	B1	NMR
286	3,4-二氯-2-甲基苯基	B2	136-137°C
287	3,4-二氯-2-甲基苯基	B4	113-115°C
288	4-氯苯基	B21	152.7°C
289	4-氯苯基	B3	NMR
290	4-氯-3-氟苯基	B1	135-138°C
291	4-氯-3-氟苯基	B2	124-126°C
292	4-氯-3-氟苯基	B4	113-117°C
293	3-氯-吡啶-2-基	B1	
294	3-氯-吡啶-2-基	B2	
295	3-氯-吡啶-2-基	B4	
296	3,4-二氯苯基	B17	150-152°C
297	3,4-二氯苯基	B18	
298	3,4-二氯苯基	B19	128-131°C
299	3,4-二氯苯基	B20	
300	3-氟-4-(三氟甲基)苯基	B1	

【 0320 】

[表 11]

第1表(接著)

No.	A	B	物性
301	3-氟-4-(三氟甲基)苯基	B2	
302	3-氟-4-(三氟甲基)苯基	B4	
303	3-氯-4-(三氟甲基)苯基	B1	
304	3-氯-4-(三氟甲基)苯基	B2	
305	3-氯-4-(三氟甲基)苯基	B4	
306	4-氯-2-甲基苯基	B29	
307	4-氯-2-甲基苯基	B30	
308	3,4-二氯苯基	B23	
309	3,4-二氯苯基	B24	
310	3,4-二氯苯基	B25	NMR
311	3,4-二氯苯基	B26	
312	3,4-二氯苯基	B27	115-117°C
313	3,4-二氯苯基	B28	NMR
314	3,4-二氯苯基	B29	122-125°C
315	3,4-二氯苯基	B30	
316	3-溴-4-(三氟甲基)苯基	B1	
317	3-溴-4-(三氟甲基)苯基	B2	
318	3-溴-4-(三氟甲基)苯基	B4	
319	4-異丙氧基-2-甲基苯基	B31	
320	4-異丙氧基-2-甲基苯基	B32	
321	4-異丙氧基-2-甲基苯基	B29	
322	4-異丙氧基-2-甲基苯基	B30	
323	6-氯吡啶-3-基	B1	
324	6-氯吡啶-3-基	B2	
325	6-氯吡啶-3-基	B4	
326	4-甲醯基苯基	B1	
327	4-丙醯基苯基	B1	
328	4-(甲氧基羰基)苯基	B1	
329	2-甲基-4-((甲基亞胺基)甲基)苯基	B1	
330	4-((甲氧基亞胺基)甲基)苯基	B1	

【 0321 】

[表 12]

第1表(接著)

No.	A	B	物性
331	4-(1-(甲基亞胺基)丙基)苯基	B1	
332	2-氯吡啶-4-基	B1	
333	2-氯吡啶-4-基	B2	
334	2-氯吡啶-4-基	B4	
335	5,6-二氯吡啶-2-基	B1	
336	5,6-二氯吡啶-2-基	B2	
337	5,6-二氯吡啶-2-基	B4	
338	2-氟苯基	B1	132-134°C
339	2-氟苯基	B2	93-95°C
340	2-氟苯基	B4	
341	2-氯苯基	B1	164-166°C
342	2-氯苯基	B2	142-143°C
343	2-氯苯基	B4	NMR
344	2-甲基苯基	B1	143-145°C
345	2-甲基苯基	B2	
346	2-甲基苯基	B4	
347	4-氯-2-甲基苯基	B17	139-141°C
348	4-氯-2-甲基苯基	B18	
349	4-氯-2-甲基苯基	B19	
350	4-異丙氧基-2-甲基苯基	B20	
351	4-異丙氧基-2-甲基苯基	B23	
352	4-異丙氧基-2-甲基苯基	B24	
353	2-溴苯基	B1	157-160°C
354	2-溴苯基	B2	
355	2-溴苯基	B4	
356	2-溴-4-氯苯基	B1	175-177°C
357	2-溴-4-氯苯基	B2	
358	2-溴-4-氯苯基	B4	
359	5-異丙氧基吡啶-2-基	B1	
360	5-異丙氧基吡啶-2-基	B2	

【 0322 】

[表 13]

第1表(接著)

No.	A	B	物性
361	5-異丙氧基吡啶-2-基	B4	
362	5-溴吡啶-2-基	B1	
363	5-溴吡啶-2-基	B2	
364	5-溴吡啶-2-基	B4	
365	4-氯-2-乙基苯基	B1	NMR
366	4-乙醯氧基苯基	B1	
367	4-(甲氧基甲氧基)苯基	B1	
368	2-甲基-4-(丙-1-炔-1-基)-苯基	B1	
369	4-(3,3-二甲基丁-1-炔-1基)-2-甲基苯基	B1	
370	2-甲基-4-乙烯基苯基	B1	
371	4-環丙基-2-甲基苯基	B1	
372	2-甲基-4-苯基苯基	B1	
373	4-甲醯基-2-甲基苯基	B1	
374	2-甲基-4-丙醯基苯基	B1	
375	4-(甲氧基羰基)-2-甲基苯基	B1	
376	2-甲基-4-((甲基亞胺基)甲基)苯基	B1	
377	4-((甲氧基亞胺基)甲基)-2-甲基苯基	B1	
378	2-甲基-4-(1-(甲基亞胺基)丙基)苯基	B1	
379	4-異丙氧基-2-甲基苯基	B10	NMR
380	4-異丙氧基-2-甲基苯基	B15	
381	4-異丙氧基-2-甲基苯基	B16	
382	2,2-二氟-5-甲基-苯并[d][1,3]二氧五環-6-基	B1	
383	2,2-二氟-5-甲基-苯并[d][1,3]二氧五環-6-基	B2	
384	2,2-二氟-5-甲基-苯并[d][1,3]二氧五環-6-基	B4	
385	4-溴-2-氟苯基	B1	
386	4-溴-2-氟苯基	B2	
387	4-溴-2-氟苯基	B4	
388	4-異丙氧基-2-甲基苯基	B25	
389	4-異丙氧基-2-甲基苯基	B26	
390	4-異丙氧基-2-甲基苯基	B27	

【 0323 】

[表 14]

第1表(接著)

No.	A	B	物性
391	4-異丙氧基-2-甲基苯基	B28	
392	3,4-二氯苯基	B31	NMR
393	3,4-二氯苯基	B32	
394	3,4-二氯苯基	B33	115-117°C
395	3,4-二氯苯基	B34	
396	3,4-二氯苯基	B35	
397	4-氯-2-甲基苯基	B27	
398	4-氯-2-甲基苯基	B28	
399	4-氯-2-甲基苯基	B31	
400	4-氯-2-甲基苯基	B32	
401	2-甲基-4-(三氟甲基)苯基	B1	
402	2-甲基-4-(三氟甲基)苯基	B2	
403	2-甲基-4-(三氟甲基)苯基	B4	
404	4-異丙氧基-2-甲基苯基	B33	NMR
405	4-異丙氧基-2-甲基苯基	B34	
406	4-異丙氧基-2-甲基苯基	B35	
407	2-甲基-4-(三氟甲氧基)苯基	B1	NMR
408	2-甲基-4-(三氟甲氧基)苯基	B2	
409	2-甲基-4-(三氟甲氧基)苯基	B4	
410	4-氯-2-甲基苯基	B33	81-85°C
411	4-氯-2-甲基苯基	B34	
412	4-氯-2-甲基苯基	B35	131.6°C
413	5-(三氟甲基)吡啶-2-基	B1	
414	5-(三氟甲基)吡啶-2-基	B2	
415	5-(三氟甲基)吡啶-2-基	B4	
416	5-甲氧基吡啶-2-基	B1	
417	5-甲氧基吡啶-2-基	B2	
418	5-甲氧基吡啶-2-基	B4	
419	5-乙氧基吡啶-2-基	B1	
420	5-乙氧基吡啶-2-基	B2	

【 0324 】

[表 15]

第1表(接著)

No.	A	B	物性
421	5-乙氧基吡啶-2-基	B4	
422	5-甲基吡啶-2-基	B1	
423	5-甲基吡啶-2-基	B2	
424	5-甲基吡啶-2-基	B4	
425	5-異丙基吡啶-2-基	B1	
426	5-異丙基吡啶-2-基	B2	
427	5-異丙基吡啶-2-基	B4	
428	5-乙基吡啶-2-基	B1	
429	5-乙基吡啶-2-基	B2	
430	5-乙基吡啶-2-基	B4	
431	5-環丙基吡啶-2-基	B1	
432	5-環丙基吡啶-2-基	B2	
433	5-環丙基吡啶-2-基	B4	
434	4-溴-2-甲基苯基	B3	NMR
435	4-溴-2-甲基苯基	B4	
436	2-乙基-4-異丙氧基苯基	B1	NMR
437	2-乙基-4-異丙氧基苯基	B2	
438	2-乙基-4-異丙氧基苯基	B4	
439	4-異丙氧基-2-異丙基苯基	B1	
440	4-異丙氧基-2-異丙基苯基	B2	
441	4-異丙氧基-2-異丙基苯基	B4	
442	4-氯-2-異丙基苯基	B1	
443	4-氯-2-異丙基苯基	B2	
444	4-氯-2-異丙基苯基	B4	
445	5-氯-3-甲基吡啶-2-基	B1	
446	5-氯-3-甲基吡啶-2-基	B2	
447	5-氯-3-甲基吡啶-2-基	B4	
448	5-異丙氧基-3-甲基吡啶-2-基	B1	
449	5-異丙氧基-3-甲基吡啶-2-基	B2	
450	5-異丙氧基-3-甲基吡啶-2-基	B4	
451	3,5-二氯吡啶-2-基	B1	
452	3,5-二氯吡啶-2-基	B2	
453	3,5-二氯吡啶-2-基	B4	
454	3-氯-5-(三氟甲基)吡啶-2-基	B1	
455	3-氯-5-(三氟甲基)吡啶-2-基	B2	
456	3-氯-5-(三氟甲基)吡啶-2-基	B4	

【 0325 】

[表 16]

第1表(接著)

No.	A	B	物性
457	4-甲氧基-2-甲基苯基	B81	106-109°C
458	4-溴-2-甲基苯基	B81	146-147°C
459	4-甲氧基-2-甲基苯基	B3	NMR
460	2,4-二甲基苯基	B1	109-111°C
461	2,2-二氟-4-甲基-苯并[d][1,3]二氧五環-5-基	B3	157-158°C
462	2,2-二氟-苯并[d][1,3]二氧五環-5-基	B3	111-112°C
463	2,2-二氟-苯并[d][1,3]二氧五環-4-基	B1	134-135°C
464	2,2-二氟-7-甲基-苯并[d][1,3]二氧五環-4-基	B1	175-177°C
465	4,5-二氯-2-甲基苯基	B12	95.2°C
466	4-異丁基-2-甲基苯基	B1	NMR
467	4-氰基-2-甲基苯基	B1	150-151°C
468	苯并[d][1,3]二氧五環-5-基	B1	180-182°C
469	苯并[d][1,3]二氧五環-5-基	B2	157-159°C
470	2,2-二甲基苯并[d][1,3]二氧五環-5-基	B1	144-146°C
471	4-(二氟甲氧基)-2-甲基苯基	B1	NMR
472	3,4-二氯-2-甲基苯基	B3	93-95°C
473	5-氯-2-甲基苯基	B1	100-102°C
474	2-溴-4-異丙氧基苯基	B1	158.9°C
475	4-乙基-2-甲基苯基	B1	92-93°C
476	2-甲基-4-丙基苯基	B1	NMR
477	4-(二氟甲氧基)-2-甲基苯基	B3	NMR
478	4-(二氟甲氧基)-2-甲基苯基	B21	91-93°C
479	2,2,4-三甲基苯并[d][1,3]二氧五環-5-基	B1	111-113°C
480	2,2,6-三甲基苯并[d][1,3]二氧五環-5-基	B1	156-159°C
481	2-甲基苯并[d][1,3]二氧五環-5-基	B1	
482	2,4-二甲基苯并[d][1,3]二氧五環-5-基	B1	
483	2-乙基-4-甲基苯基	B1	NMR
484	4-(環丙基乙炔基)-2-甲基苯基	B1	NMR
485	4-異丙基-2-甲基苯基	B3	NMR
486	4-乙基-2-甲基苯基	B3	NMR
487	2,4-二甲基苯基	B3	110-114°C
488	螺環[苯并[d][1,3]二氧五環-2,1'-環戊烷]-5-基	B1	
489	4-甲基螺環[苯并[d][1,3]二氧五環-2,1'-環戊烷]-5-基	B1	
490	2-甲基-2-丙基苯并[d][1,3]二氧五環-5-基	B1	

【 0326 】

[表 17]

第1表(接著)

No.	A	B	物性
491	2,4-二甲基苯基	B2	88-90°C
492	2,4-二甲基-2-丙基苯并[d][1,3]二氧五環-5-基	B1	
493	2,2-二乙基苯并[d][1,3]二氧五環-5-基	B1	
494	2,2-二乙基-4-甲基苯并[d][1,3]二氧五環-5-基	B1	
495	2,4-二甲基苯基	B51	128-130°C
496	3,5-二氯-4-甲基苯基	B1	173-176°C
497	2,4,5-三甲基苯基	B1	148.9°C
498	5-氟-2,4-二甲基苯基	B1	NMR
499	5-溴-4-氯-2-甲基苯基	B1	149.9°C
500	4-氯-2,5-二甲基苯基	B1	129.0°C
501	4-溴-5-氯-2-甲基苯基	B1	NMR
502	5-氯-2,4-二甲基苯基	B1	126.5°C
503	2,4-二甲基苯基	B4	123-125°C
504	2-溴-4-甲基苯基	B1	138-140°C
505	2-丁基-4-甲基苯基	B1	NMR
506	4-甲基-2-戊基苯基	B1	NMR
507	2-異戊基-4-甲基苯基	B1	
508	(E)-4-甲基-2-(丙-1-烯-1-基)苯基	B1	
509	4-甲基-2-異丙烯基苯基	B1	
510	4-甲基-2-(2-甲基丙-1-烯-1-基)苯基	B1	
511	4-甲基-2-丙基苯基	B1	NMR
512	2-異丙基-4-甲基苯基	B1	
513	2-異丁基-4-甲基苯基	B1	93-95°C
514	2-甲氧基苯并[d][1,3]二氧五環-5-基	B1	
515	2-甲氧基-4-甲基苯并[d][1,3]二氧五環-5-基	B1	
516	2-乙基-2-甲基苯并[d][1,3]二氧五環-5-基	B1	
517	2-乙基-2,4-二甲基苯并[d][1,3]二氧五環-5-基	B1	
518	2-異丙基苯并[d][1,3]二氧五環-5-基	B1	
519	2-異丙基-4-甲基苯并[d][1,3]二氧五環-5-基	B1	
520	2,4-二甲基苯基	B6	80-84°C
521	2,4-二甲基苯基	B9	120-122°C
522	2,4-二甲基苯基	B21	118-119°C
523	2,4-二甲基苯基	B36	NMR
524	2,4-二甲基苯基	B81	103-105°C
525	2,4-二甲基苯基	B83	NMR

【 0327 】

[表 18]

第1表(接著)

No.	A	B	物性
526	4-(甲氧基乙基)苯基	B1	
527	4-(甲氧基乙基)-2-甲基苯基	B1	
528	4-(乙氧基乙基)苯基	B1	
529	4-(乙氧基乙基)-2-甲基苯基	B1	
530	5-氯-4-甲氧基-2-甲基苯基	B1	125.5°C
531	5-氯-4-羥基-2-甲基苯基	B1	217.7°C
532	5-氯-4-異丙氧基-2-甲基苯基	B1	NMR
533	5-氯-2-甲基-4-(1-甲基丙-1-氧基)-苯基	B1	NMR
534	2-甲基-4-(2,2,2-三氟乙基)苯基	B1	
535	5-氯-4-乙氧基-2-甲基苯基	B1	
536	5-氯-2-甲基-4-丙氧基苯基	B1	
537	2-環丙基-2-甲基苯并[d][1,3]二氧五環-5-基	B1	
538	2-環丙基-2,4-二甲基苯并[d][1,3]二氧五環-5-基	B1	
539	螺環[苯并[d][1,3]二氧五環-2,1'-環丁烷]-5-基	B1	
540	4-甲基螺環[苯并[d][1,3]二氧五環-2,1'-環丁烷]-5-基	B1	
541	5-氟-4-甲氧基-2-甲基苯基	B1	NMR
542	5-氟-4-異丙氧基-2-甲基苯基	B1	NMR
543	4-乙氧基-5-氟-2-甲基苯基	B1	NMR
544	5-氟-2-甲基-4-丙氧基苯基	B1	NMR
545	5-氟-2-甲基-4-(1-甲基丙-1-氧基)苯基	B1	106.7°C
546	5-氟-4-羥基-2-甲基苯基	B1	229.4°C
547	4-丁氧基-5-氯-2-甲基苯基	B1	
548	5-氯-2-甲基-4-(戊基氧基)苯基	B1	
549	5-氯-4-異丁氧基-2-甲基苯基	B1	
550	5-氯-2-甲基-4-(新戊基氧基)苯基	B1	

【 0328 】

[表 19]

第1表(接著)

No.	A	B	物性
551	4-(tert-丁氧基)-5-氯-2-甲基苯基	B1	
552	5-氯-4-(異戊基氧基)-2-甲基苯基	B1	
553	5-氯-4-(3,3-二甲基丁氧基)-2-甲基苯基	B1	
554	5-氯-2-甲基-4-((4-甲基戊烷-2-基)氧基)苯基	B1	
555	5-氯-2-甲基-4-(2,2,2-三氟乙氧基)苯基	B1	
556	2-異丁基-2-甲基苯并[d][1,3]二氧五環-5-基	B1	
557	2-異丁基-2,4-二甲基苯并[d][1,3]二氧五環-5-基	B1	NMR
558	2,2-二丙基苯并[d][1,3]二氧五環-5-基	B1	
559	4-甲基-2,2-二丙基苯并[d][1,3]二氧五環-5-基	B1	
560	2-甲基-2-戊基苯并[d][1,3]二氧五環-5-基	B1	
561	2,4-二甲基-2-戊基苯并[d][1,3]二氧五環-5-基	B1	
562	5-氯-4-(2,2-二氟乙氧基)-2-甲基苯基	B1	
563	5-氯-4-(環戊氧基)-2-甲基苯基	B1	
564	4-(烯丙基氧基)-5-氯-2-甲基苯基	B1	
565	4-(丁-3-烯-2-基氧基)-5-氯-2-甲基苯基	B1	
566	5-氯-2-甲基-4-((3-甲基丁-2-烯-1-基)氧基)苯基	B1	
567	5-氯-4-(甲氧基甲氧基)-2-甲基苯基	B1	
568	4-乙醯氧基-5-氯-2-甲基苯基	B1	
569	5-氯-4-(異丁醯基氧基)-2-甲基苯基	B1	
570	5-氯-2-甲基-4-(三甲基乙醯基氧基)苯基	B1	
571	2-乙氧基-4-甲基苯并[d][1,3]二氧五環-5-基	B1	
572	2-乙氧基苯并[d][1,3]二氧五環-5-基	B1	
573	2-異丙氧基苯并[d][1,3]二氧五環-5-基	B1	
574	2-異丙氧基-4-甲基苯并[d][1,3]二氧五環-5-基	B1	
575	2-丙氧基苯并[d][1,3]二氧五環-5-基	B1	
576	4-甲基-2-丙氧基苯并[d][1,3]二氧五環-5-基	B1	
577	4-丁氧基-5-氟-2-甲基苯基	B1	98.2°C
578	5-氟-2-甲基-4-(戊基氧基)苯基	B1	
579	5-氟-4-異丁氧基-2-甲基苯基	B1	NMR
580	5-氟-2-甲基-4-(新戊基氧基)苯基	B1	

【 0329 】

[表 20]

第1表(接著)

No.	A	B	物性
581	4-(tert-丁氧基)-5-氟-2-甲基苯基	B1	
582	5-氟-4-(異戊基氧基)-2-甲基苯基	B1	NMR
583	4-(3,3-二甲基丁氧基)-5-氟-2-甲基苯基	B1	NMR
584	5-氟-2-甲基-4-((4-甲基戊烷-2-基)氧基)苯基	B1	
585	5-氟-2-甲基-4-(2,2,2-三氟乙氧基)苯基	B1	NMR
586	4-(2,2-二氟乙氧基)-5-氟-2-甲基苯基	B1	NMR
587	4-(環戊氧基)-5-氟-2-甲基苯基	B1	NMR
588	4-(烯丙基氧基)-5-氟-2-甲基苯基	B1	NMR
589	4-(丁-3-烯-2-基氧基)-5-氟-2-甲基苯基	B1	NMR
590	5-氟-2-甲基-4-((3-甲基丁-2-烯-1-基)氧基)苯基	B1	
591	5-氟-4-(甲氧基甲氧基)-2-甲基苯基	B1	NMR
592	4-乙醯氧基-5-氟-2-甲基苯基	B1	NMR
593	5-氟-4-(異丁醯基氧基)-2-甲基苯基	B1	NMR
594	5-氟-2-甲基-4-(三甲基乙醯基氧基)苯基	B1	
595	2-丁基-2-甲基苯并[d][1,3]二氧五環-5-基	B1	
596	2-丁基-2,4-二甲基苯并[d][1,3]二氧五環-5-基	B1	
597	2-甲氧基-2-甲基苯并[d][1,3]二氧五環-5-基	B1	
598	2-甲氧基-2,4-二甲基苯并[d][1,3]二氧五環-5-基	B1	
599	2-乙氧基-2-甲基苯并[d][1,3]二氧五環-5-基	B1	
600	2-乙氧基-2,4-二甲基苯并[d][1,3]二氧五環-5-基	B1	
601	2-甲基-4-((三氟甲基)乙炔基)苯基	B1	
602	4-氯-2-甲基苯基	B37	NMR
603	4-異丙氧基-2-甲基苯基	B37	
604	3,4-二氯苯基	B37	
605	4-羥基-2-甲基苯基	B1	
606	3-氯-4-乙基苯基	B1	
607	2-異丙烯基-4-異丙氧基苯基	B1	
608	4-異丙氧基-2-丙基苯基	B1	
609	3-氯-4-異丙烯基苯基	B1	
610	3-氯-4-異丙基苯基	B1	

【 0330 】

[表 21]

第1表(接著)

No.	A	B	物性
611	4-丁基-3-氯苯基	B1	
612	3,4-二羥基-2-甲基苯基	B1	
613	3,4-二丁氧基-2-甲基苯基	B1	
614	3-氟-4-甲基苯基	B1	
615	4-乙基-3-氟苯基	B1	
616	3-氟-4-丙基苯基	B1	
617	3-氟苯基	B1	
618	3-氟-4-異丁基苯基	B1	
619	3-氟-4-異丙烯基苯基	B1	
620	3-氟-4-異丙基苯基	B1	
621	4-氯-2-乙烯基苯基	B1	
622	2-甲基-4-(2-甲基丙-1-烯-1-基)苯基	B1	
623	4-異丙烯基-2-甲基苯基	B1	
624	4-異丙基-2-甲基苯基	B1	
625	4-氯-2-氰基苯基	B1	
626	4-(溴甲基)苯基	B1	
627	4-羧基-2-甲基苯基	B1	
628	4-胺甲醯基-2-甲基苯基	B1	
629	4-甲氧基羰基-2-甲基苯基	B1	
630	2-甲基-4-(甲基胺甲醯基)苯基	B1	
631	4-(二甲基胺甲醯基)-2-甲基苯基	B1	
632	2-乙烯基苯基	B1	
633	2-乙基苯基	B1	
634	2-(環丙基乙炔基)苯基	B1	
635	4-氯-2-異丙烯基苯基	B1	
636	4-氯-2-環丙基苯基	B1	
637	4-氯-2-(環丙基乙炔基)苯基	B1	
638	(E)-4-氯-2-(丙-1-烯-1-基)苯基	B1	
639	4-氯-2-(2-甲基丙-1-烯-1-基)苯基	B1	
640	(E)-2-甲基-4-(丙-1-烯-1-基)苯基	B1	
641	(E)-4-(丁-2-烯-2-基)-2-甲基苯基	B1	
642	2-甲基-4-(3-甲基丁-2-烯-2-基)苯基	B1	
643	2-甲基-4-(噻吩-3-基)苯基	B1	
644	4-氯-2-丙基苯基	B1	
645	2,4-二丙基苯基	B1	

【 0331 】

[表 22]

第1表(接著)

No.	A	B	物性
646	4-氯-2-異丁基苯基	B1	
647	2-異丁基苯基	B1	
648	2-甲基-4-丙基苯基	B1	
649	2-甲基-4-(1-甲基丙基)苯基	B1	
650	2-甲基-4-(3-甲基丁烷-2-基)苯基	B1	
651	4-氯-2-(噁吩-3-基)苯基	B1	
652	(E)-2-(丁-2-烯-2-基)-4-氯苯基	B1	
653	4-氯-2-(3-甲基丁-2-烯-2-基)苯基	B1	
654	2-(1-甲基丙基)苯基	B1	
655	2-甲基-2-(1-甲基丙基)苯并[d][1,3]二氧五環-5-基	B1	
656	2,4-二甲基-2-(1-甲基丙基)-苯并[d][1,3]二氧五環-5-基	B1	
657	2-異戊基-2-甲基苯并[d][1,3]二氧五環-5-基	B1	
658	2-異戊基-2,4-二甲基苯并[d][1,3]二氧五環-5-基	B1	
659	2-乙基-4-甲基苯并[d][1,3]二氧五環-5-基	B1	
660	2-乙基苯并[d][1,3]二氧五環-5-基	B1	
661	4-氯-2-(苯基)苯基	B1	
662	2-異丙烯基苯基	B1	
663	(E)-2-(丙-1-烯-1-基)苯基	B1	
664	2-異丙基苯基	B1	
665	2-丙基苯基	B1	
666	2-(2-甲基丙-1-烯-1-基)苯基	B1	
667	4-氯-2-甲基-5-乙烯基苯基	B1	
668	4-氯-5-異丙烯基-2-甲基苯基	B1	
669	4-氯-5-乙基-2-甲基苯基	B1	
670	4-氯-5-異丙基-2-甲基苯基	B1	
671	4-氯-2-甲基-5-丙基苯基	B1	
672	(E)-4-氯-2-甲基-5-(丙-1-烯-1-基)苯基	B1	
673	2-(3-甲基丁-2-烯-2-基)苯基	B1	
674	2-丁基-4-氯苯基	B1	
675	4-氯-2-異戊基苯基	B1	

【 0332 】

[表 23]

第1表(接著)

No.	A	B	物性
676	4-氯-2-戊基苯基	B1	
677	4-丁基-2-甲基苯基	B1	
678	2-甲基-4-戊基苯基	B1	
679	4-異戊基-2-甲基苯基	B1	
680	4-(異丙硫基)-2-甲基苯基	B1	
681	4-(tert-丁氧基羰基-N-甲基胺基)-2-甲基苯基	B1	
682	4-氯-5-環丙基-2-甲基苯基	B1	
683	4-氯-5-異丁基-2-甲基苯基	B1	
684	4-氯-5-異丁烯基-2-甲基苯基	B1	
685	5-氯-2-甲基-4-乙烯基苯基	B1	
686	5-氯-4-異丙烯基-2-甲基苯基	B1	
687	5-氯-4-乙基-2-甲基苯基	B1	
688	5-氯-4-異丙基-2-甲基苯基	B1	
689	2-(tert-丁氧基羰基-N-甲基胺基)-4-氯苯基	B1	
690	2-胺基-4-氯苯基	B1	
691	(E)-5-氯-2-甲基-4-(丙-1-烯-1-基)苯基	B1	
692	5-氯-2-甲基-4-丙基苯基	B1	
693	4-氯-2-羥基苯基	B1	
694	4-氯-2-(甲基胺基)苯基	B1	
695	2-乙醯胺基-4-氯苯基	B1	
696	2-乙醯氧基-4-氯苯基	B1	
697	3,4-二乙氧基-2-甲基苯基	B1	
698	(E)-4-氟-2-(丙-1-烯-1-基)苯基	B1	
699	4-氟-2-丙基苯基	B1	
700	2-丁基-4-氟苯基	B1	
701	4-氟-2-戊基苯基	B1	
702	2-溴-4-氟苯基	B1	
703	(E)-2-氟-4-(丙-1-烯-1-基)苯基	B1	
704	4-丁基-2-氟苯基	B1	
705	4-環丙基-2-氟苯基	B1	

【 0333 】

[表 24]

第1表(接著)

No.	A	B	物性
706	2-氟-4-甲基苯基	B1	
707	2-氟-4-乙炔基苯基	B1	
708	4-乙基-2-氟苯基	B1	
709	2-氟-4-丙基苯基	B1	
710	4-甲基-2-乙炔基苯基	B1	
711	2-溴-5-氟苯基	B1	
712	2-溴-3-氟苯基	B1	
713	2-溴-6-氟苯基	B1	
714	2-丙基苯并[d][1,3]二氧五環-5-基	B1	
715	4-甲基-2-丙基苯并[d][1,3]二氧五環-5-基	B1	
716	2-丁基-4-甲基苯并[d][1,3]二氧五環-5-基	B1	
717	2-丁基苯并[d][1,3]二氧五環-5-基	B1	
718	2-異丁基苯并[d][1,3]二氧五環-5-基	B1	
719	2-甲基-4-(甲基胺基)苯基	B1	
720	2-(3-甲基丁烷-2-基)苯基	B1	
721	4-(二甲基胺基)-2-甲基苯基	B1	
722	2-丁基-5-氟苯基	B1	
723	(E)-3-氟-2-(丙-1-烯-1-基)苯基	B1	
724	3-氟-2-丙基苯基	B1	
725	2-溴吡啶-3-基	B1	
726	2-丁基-6-氟苯基	B1	
727	(E)-2-(丙-1-烯-1-基)吡啶-3-基	B1	
728	2-丙基吡啶-3-基	B1	
729	2-(二甲基胺基)吡啶-3-基	B1	
730	4-氯-2-(甲氧基甲氧基)苯基	B1	
731	4-氯-2-丙氧基苯基	B1	
732	4-氯-2-(乙基羰基氧基)苯基	B1	
733	4-氯-2-(異丁醯基氧基)苯基	B1	
734	6-甲基吡啶-3-基	B1	
735	(E)-6-(丙-1-烯-1-基)吡啶-3-基	B1	
736	6-丙基吡啶-3-基	B1	
737	6-溴吡啶-3-基	B1	
738	2-甲基-4-(甲硫基)苯基	B1	
739	4-(異丙基亞磺醯基)-2-甲基苯基	B1	
740	4-(異丙基磺醯基)-2-甲基苯基	B1	

【 0334 】

[表 25]

第1表(接著)

No.	A	B	物性
741	2-甲基-4-(甲基亞磺醯基)苯基	B1	
742	2-甲基-4-(甲基磺醯基)苯基	B1	
743	(E)-2-(丁-1-烯-1-基)-4-氟苯基	B1	
744	(E)-4-氟-2-(戊-1-烯-1-基)苯基	B1	
745	4-氟-2-(2-甲基丙-1-烯-1-基)苯基	B1	
746	4-氟-2-異丁基苯基	B1	
747	5-氟-2-(丙-1-烯-1-基)苯基	B1	
748	5-氟-2-丙基苯基	B1	
749	2-丁基-3-氟苯基	B1	
750	4-乙基苯基	B1	
751	2-異丁基-4-甲基苯并[d][1,3]二氧五環-5-基	B1	
752	2-異丙基-2-甲基苯并[d][1,3]二氧五環-5-基	B1	
753	2-異丙基-2,4-二甲基苯并[d][1,3]二氧五環-5-基	B1	
754	2-乙基-2-丙基苯并[d][1,3]二氧五環-5-基	B1	
755	2-乙基-4-甲基-2-丙基苯并[d][1,3]二氧五環-5-基	B1	
756	(E)-4-(丙-1-烯-1-基)苯基	B1	
757	4-丙基苯基	B1	
758	4-戊基苯基	B1	
759	4-丁基苯基	B1	
760	4-(乙氧基甲基)-2-甲基苯基	B1	
761	2-(乙氧基甲基)-4-甲基苯基	B1	
762	2-戊基吡啶-3-基	B1	
763	2-丙氧基吡啶-3-基	B1	
764	2-丁氧基吡啶-3-基	B1	
765	4-(甲氧基乙氧基)吡啶-3-基	B1	
766	4-(乙氧基乙氧基)吡啶-3-基	B1	
767	6-乙烯基吡啶-3-基	B1	
768	6-異丙烯基吡啶-3-基	B1	
769	6-(2-甲基丙-1-烯-1-基)吡啶-3-基	B1	
770	6-丁基吡啶-3-基	B1	
771	6-環丙基吡啶-3-基	B1	
772	6-(環丙基乙炔基)吡啶-3-基	B1	
773	6-異戊基吡啶-3-基	B1	
774	6-乙基吡啶-3-基	B1	
775	6-異丙基吡啶-3-基	B1	

【 0335 】

[表 26]

第1表(接著)

No.	A	B	物性
776	6-異丁基吡啶-3-基	B1	
777	3-氟-2,4-二甲基苯基	B1	
778	2-羥基-4-甲基苯基	B1	
779	2-(乙醯氧基)-4-甲基苯基	B1	
780	2-(乙基羰基氧基)-4-甲基苯基	B1	
781	2-丁基苯基	B1	
782	4-甲基-2-(丙基羰基氧基)苯基	B1	
783	2-(甲氧基甲氧基)-4-甲基苯基	B1	
784	4-甲基-2-丙氧基苯基	B1	
785	2-(2-甲氧基乙氧基)-4-甲基苯基	B1	
786	2-丁氧基-4-甲基苯基	B1	
787	4-氯-2-(甲氧基羰基)苯基	B1	
788	2-羧基-4-氯苯基	B1	
789	4-氯-2-(甲基胺基羰基)苯基	B1	
790	4-乙基-2,2-二甲基苯并[d][1,3]二氧五環-5-基	B1	
791	4-乙基-2,2-二氟-苯并[d][1,3]二氧五環-5-基	B1	
792	2,2,4-三乙基苯并[d][1,3]二氧五環-5-基	B1	
793	2-環丙基-4-乙基-2-甲基苯并[d][1,3]二氧五環-5-基	B1	
794	5-氟吡啶-2-基	B1	
795	4-氯-2-(甲氧基甲氧基)苯基	B1	
796	2-(丁基胺基)-4-氯苯基	B1	
797	4-氯-2-((3,3-二甲基丁基)胺基)苯基	B1	
798	4-氯-2-(3,3-二甲基丁烷醯胺基)苯基	B1	
799	4-氯-2-(甲氧基羰基胺基)苯基	B1	
800	4-氯-2-(乙氧基羰基胺基)苯基	B1	
801	4-乙基螺環[苯并[d][1,3]二氧五環-2,1'-環丁烷]-5-基	B1	
802	4-乙基-2-異丁基-2-甲基苯并[d][1,3]二氧五環-5-基	B1	
803	4-乙基-2,2-二丙基苯并[d][1,3]二氧五環-5-基	B1	
804	2-(烯丙基氧基羰基胺基)-4-氯苯基	B1	
805	4-氯-2-(丙氧基羰基胺基)苯基	B1	

【 0336】

[表 27]

第1表(接著)

No.	A	B	物性
806	4-氯-2-(異丙烯基氧基羰基胺基)苯基	B1	
807	4-氯-2-(異丙氧基羰基胺基)苯基	B1	
808	4-氯-2-(新戊基氧基羰基胺基)苯基	B1	
809	4-氯-2-((甲基)(三甲基乙醯基氧基)胺基)苯基	B1	
810	2-環丙基-4-氟-2-甲基苯并[d][1,3]二氧五環-5-基	B1	
811	4-氟螺環[苯并[d][1,3]二氧五環-2,1'-環丁烷]-5-基	B1	
812	4-氟-2-異丁基-2-甲基苯并[d][1,3]二氧五環-5-基	B1	
813	4-氯-2-(丙基羰基氧基)苯基	B1	
814	4-氯-2-(環丙基羰基氧基)苯基	B1	
815	4-氯-2-(環己基羰基氧基)苯基	B1	
816	4-溴-5-氟-2-甲基苯基	B1	
817	5-氟-2-甲基-4-乙烯基苯基	B1	
818	(E)-5-氟-2-甲基-4-(丙-1-烯-1-基)苯基	B1	
819	5-氟-2-甲基-4-丙基苯基	B1	
820	5-氟-2-甲基-4-異丙烯基苯基	B1	
821	5-氟-4-異丙基-2-甲基苯基	B1	
822	5-溴-2,4-二甲基苯基	B1	
823	2,4-二甲基-5-乙烯基-苯基	B1	
824	5-甲氧基-2,4-二甲基苯基	B1	
825	5-乙基-2,4-二甲基苯基	B1	
826	5-(二氟甲基)-2,4-二甲基苯基	B1	
827	2,4-二甲基-5-(三氟甲基)苯基	B1	
828	4-氯-5-甲氧基-2-甲基苯基	B1	
829	2-(1-甲基丙基)-4-氯苯基	B1	
830	2-溴-4-氯-3-甲基苯基	B1	
831	4-氯-2,3-二甲基苯基	B1	
832	4-氯-2-乙基-3-甲基苯基	B1	
833	2,3,4-三甲基苯基	B1	
834	3-甲基吡啶-4-基	B1	
835	3-乙基吡啶-4-基	B1	

【 0337 】

[表 28]

第1表(接著)

No.	A	B	物性
836	3,5-二氯-4-乙基苯基	B1	160-162°C
837	3,4,5-三甲基苯基	B1	
838	6-氯-2-甲基吡啶-3-基	B1	
839	4-氟-2,2-二甲基苯并[d][1,3]二氧五環-5-基	B1	
840	2,2,4-三氟-苯并[d][1,3]二氧五環-5-基	B1	
841	2,2-二乙基-4-氟苯并[d][1,3]二氧五環-5-基	B1	
842	4-氯-2-甲基苯基	B38	
843	4-異丙氧基-2-甲基苯基	B38	
844	3,4-二氯苯基	B38	
845	4-氟-2,2-二丙基苯并[d][1,3]二氧五環-5-基	B1	
846	4-氟-2-甲基-2-(1-甲基丙基)苯并[d][1,3]二氧五環-5-基	B1	
847	2-乙基-4-甲基-2-(2-甲基丁基)苯并[d][1,3]二氧五環-5-基	B1	
848	2-乙氧基-2-乙基-4-甲基苯并[d][1,3]二氧五環-5-基	B1	
849	6-氯-4-甲基吡啶-3-基	B1	
850	3-氯-2,4-二甲基苯基	B1	

【 0338 】

[表29]

第2表

No.	¹ H-NMR (300MHz 或 500MHz/溶媒) δ 值
1	(500 MHz, acetone-d ₆) 8.83(d, J=4.5 Hz,1H), 8.24(dd, J=8.0, 1.5 Hz, 1H), 8.00(d, J=8.5 Hz, 1H), 7.71(ddd, J=8.5, 5.0, 1.0 Hz, 1H), 6.81-6.77(m, 2H), 4.46-4.41(m, 1H), 3.71(s, 3H), 2.39(s, 3H), 2.04-1.97(m, 2H), 1.78-1.74(m, 2H), 1.67(brm, 6H), 1.58-1.27(m, 6H)
6	(500 MHz, acetone-d ₆) 8.19 (s, 1H), 7.75 (d, J=8.5 Hz, 1H), 7.01 (t, J=54.3 Hz, 1H), 6.75 (d, J=3.0 Hz, 1H), 6.64 (dd, J= 8.5, 3.0 Hz, 1H), 4.36-4.31 (m, 1H), 3.93 (s, 3H), 3.89 (s, 3H), 2.36 (s, 3H), 1.94-1.88 (m, 2H), 1.80-1.60 (m, 8H), 1.58-1.51 (m, 1H), 1.46-1.25 (m, 5H).
8	(300 MHz, CDCl ₃) 7.78 (s, 1H), 8.00 (d, J=8.4 Hz, 1H), 7.05 (t, J=54.3 Hz, 1H), 6.71 (d, J=2.4 Hz, 1H), 6.57 (dd, J=8.4, 2.4 Hz, 1H), 4.59-4.51 (m, 1H), 3.94 (s, 3H), 3.80 (s, 3H), 2.41 (s, 3H), 1.74 (brm, 6H), 1.30 (d, J=6.0 Hz, 6H)
9	(500 MHz, CDCl ₃) 8.741 (d, J=19.0 Hz, 1H), 8.736 (d, J=19.0 Hz, 1H), 7.81 (d, J= 8.5 Hz, 1H), 6.74 (d, J= 3.0 Hz, 1H), 6.69 (dd, J= 8.5, 3.0 Hz, 1H), 4.62-4.57 (m, 1H), 3.66 (s, 3H), 2.43 (s, 3H), 1.75 (brs, 6H), 1.34 (s, 3H), 1.33 (s, 3H).
10	(500 MHz, acetone-d ₆) 8.35 (s, 1H), 7.87-7.84 (m, 1H), 7.75 (m, 1H), 7.14-6.88 (m, 2H), 4.47-4.42 (m, 1H), 4.04 (s, 3H), 3.97 (s, 3H), 1.97-1.92 (m, 2H), 1.78-1.47 (m, 11H) 1.43-1.25 (m, 3H).
11	(500 MHz, acetone-d ₆) 8.34 (s, 1H), 8.12-8.08 (m, 2H), 7.15-7.10 (m, 2H), 6.96 (t, J=54.3 Hz, 1H), 4.03 (s, 3H), 3.96 (s, 3H), 1.80-1.55 (brm, 6H).
12	(500 MHz, acetone-d ₆) 9.33 (brs, OH), 8.35 (s, 1H), 7.80-7.78 (m, 1H), 7.76-7.73 (m, 1H), 7.00 (t, J=54.5 Hz, 1H), 6.97-6.93 (m, 1H), 4.03 (s, 3H), 3.97 (s, 3H), 1.80-1.55 (brm, 6H).
14	(300 MHz, CDCl ₃) 8.77-8.74 (m, 1H), 8.00-7.97 (m, 1H), 7.88 (d, J=8.4 Hz, 1H), 7.47-7.43 (m, 1H), 6.75-6.69 (m, 2H), 4.64-4.56 (m, 1H), 3.67 (s, 3H), 2.45 (s, 3H), 1.73 (brm, 6H), 1.34 (d, J=6.0Hz, 6H).
15	(300 MHz, CDCl ₃) 7.68 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.58 (s, 1H), 6.72 (d, J=2.4 Hz, 1H), 6.61 (dd, J=8.7, 2.4 Hz, 1H), 4.53-4.61 (m, 1H), 3.92 (s, 3H), 3.66 (s, 3H), 2.41 (s, 3H), 1.74 (brm, 6H), 1.32 (d, J=6.3 Hz, 6H).

【 0339 】

[表30]

第2表(接著)

No.	¹ H-NMR (300MHz 或 500MHz/溶媒) δ 值
16	(500 MHz, acetone-d ₆) 8.34 (s, 1H), 8.01 (d, J= 9.0 Hz, 2H), 6.98 (t, J=54.5 Hz, 1H), 6.85 (d, J= 8.5 Hz, 2H), 4.69-4.62 (m, 1H), 4.01 (s, 3H), 3.96 (s, 3H), 1.67-1.60 (brm, 6H), 1.28 (s, 3H), 1.26 (s, 3H).
17	(500 MHz, acetone-d ₆) 8.35 (s, 1H), 7.88-7.85 (m, 1H), 7.73 (m, 1H), 7.10-6.88 (m, 2H), 4.94-4.90 (m, 1H), 4.04 (s, 3H), 3.97 (s, 3H), 1.99-1.90 (m, 2H), 1.82-1.55 (m, 12H).
18	(500 MHz, acetone-d ₆) 8.35(s, 1H), 7.86(ddd, J=8.5, 2.0, 1.0 Hz, 1H), 7.74(dd, J=13.0, 2.0Hz, 1H), 7.10(t, J=8.5Hz, 1H), 6.99(t, J=54.5Hz, 1H), 4.74-4.69(m, 1H), 4.04(s, 3H), 3.97(s, 3H), 1.69-1.66(m, 6H), 1.31(s, 3H), 1.30 (s, 3H)
19	(300 MHz, CDCl ₃) 7.77 (s, 1H), 7.65 (d, J=8.4 Hz, 1H), 7.04 (t, J=54.3 Hz, 1H), 6.69 (d, J=2.4 Hz, 1H), 6.55 (dd, J=8.7, 2.4 Hz, 1H), 4.76-4.71 (m, 1H), 3.94 (s, 3H), 3.79 (s, 3H), 2.40 (s, 3H), 1.93-1.58 (brm, 14H).
20	(300 MHz, CDCl ₃) 7.77 (s, 1H), 7.64 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.03 (t, J=54.3 Hz, 1H), 6.62 (d, J=2.4 Hz, 1H), 6.50 (dd, J=8.7, 2.4 Hz, 1H), 4.66-4.57 (m, 1H), 3.93 (s, 3H), 3.79 (s, 3H), 2.47-2.38 (brm, 5H), 2.18-2.05 (m, 2H), 1.89-1.62 (brm, 8H).
21	(500 MHz, acetone-d ₆) 8.38-8.34 (m, 3H), 8.17-8.14 (m, 2H), 7.28-7.24 (m, 2H), 7.00 (t, J=54.3 Hz, 1H), 4.04 (s, 3H), 3.96 (s, 3H), 1.85-1.55 (brm, 6H).
22	(500 MHz, acetone-d ₆) 8.34 (s, 1H), 8.02-7.99 (m, 2H), 6.98 (t, J=54.3 Hz, 1H), 6.86-6.83 (m, 2H), 4.86-4.82 (m, 1H), 4.01 (s, 3H), 3.96 (s, 3H), 1.96-1.90 (m, 2H), 1.78-1.55 (m, 12H).
25	(500 MHz, acetone-d ₆) 8.34 (s, 1H), 8.06-8.03 (m, 2H), 7.09-6.87 (m, 3H), 6.28 (tt, J=54.8, 4.0 Hz, 1H), 4.33 (dt, J=13.5, 4.0 Hz, 2H), 4.02 (s, 3H), 3.96 (s, 3H), 1.68 (brs, 6H).
26	(500 MHz, acetone-d ₆) 8.34 (s, 1H), 8.12-8.10 (m, 2H), 7.92 (m, 1H), 7.70 (dd, J=8.5, 1.5 Hz, 1H), 7.02 (d, J=8.5 Hz, 1H), 7.04-7.01 (m, 2H), 6.99 (t, J=54.5 Hz, 1H), 4.03 (s, 3H), 3.96 (s, 3H), 1.85-1.55 (brm, 6H).
27	(500 MHz, acetone-d ₆) 8.34 (s, 1H), 8.03-8.00 (m, 2H), 6.99 (t, J=54.5 Hz, 1H), 6.89-6.86 (m, 2H), 4.01 (s, 3H), 4.00-3.94 (m, 5H), 1.79-1.55 (m, 8H), 0.98 (t, J=7.5 Hz, 3H).

【 0340 】

[表31]

第2表(接著)

No.	¹ H-NMR (300MHz 或 500MHz/溶媒) δ 值
28	(500 MHz, acetone-d ₆) 8.35 (s, 1H), 8.14-8.11 (m, 2H), 8.05 (dd, J= 4.8, 1.5 Hz, 1H), 7.97 (dd, J= 8.0, 1.5 Hz, 1H), 7.19 (dd, J= 8.0, 4.8 Hz, 1H), 7.16(d, J=8.5 Hz, 2H), 7.00 (t, J=54.3 Hz, 1H), 4.03 (s, 3H), 3.96 (s, 3H), 1.70 (brs, 6H).
29	(500 MHz, acetone-d ₆) 8.34 (s, 1H), 7.87 (m, 1H), 7.74 (m, 1H), 7.10-6.88 (m, 2H), 4.15 (m, 2H), 4.04 (s, 3H), 3.97 (s, 3H), 1.80-1.50 (brm, 6H), 1.37 (t, 3 H, J=6.8 Hz).
30	(500 MHz, acetone-d ₆) 8.36 (s, 1H), 7.88-7.86 (m, 1H), 7.75 (m, 1H), 7.10-6.8 9 (m, 2H), 4.07-4.02 (m, 5H), 3.97 (s, 3H), 1.84-1.55 (m, 8H), 1.00 (t, J=7.5 Hz, 3H).
31	(300 MHz, CDCl ₃) 7.78 (s, 1H), 7.68 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.05 (t, J=54.3 Hz, 1 H), 6.72 (d, J=2.1 Hz, 1H), 6.60 (dd, J=8.7, 2.4 Hz, 1H), 3.94 (s, 3H), 3.80 (s , 3H), 3.78 (s, 3H), 2.42 (s, 3H), 1.74 (brm, 6H).
32	(300 MHz, CDCl ₃) 7.78 (s, 1H), 7.66 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.05 (t, J=54.3 Hz, 1 H), 6.70 (d, J=2.7 Hz, 1H), 6.57 (dd, J=8.4, 2.4 Hz, 1H), 4.33-4.27 (m, 1H), 3 .94 (s, 3H), 3.80 (s, 3H), 2.41 (s, 3H), 1.74-1.56 (brm, 8H), 1.30-1.25 (m, 3H) , 0.94 (t, J=7.5 Hz, 3H).
33	(300 MHz, CDCl ₃) 7.79 (s, 1H), 7.67 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.05 (t, J=54.3 Hz, 1 H), 6.72 (d, J=2.7 Hz, 1H), 6.59 (dd, J=8.7, 2.4 Hz, 1H), 3.95 (s, 3H), 3.80 (s , 3H), 3.70 (d, J=6.3 Hz, 2H), 2.42 (s, 3H), 2.10-2.01 (m, 1H), 1.74 (brm, 6H) , 1.00 (d, J=6.6 Hz, 6H).
34	(300 MHz, CDCl ₃) 7.78 (s, 1H), 7.67 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.05 (t, J=54.3 Hz, 1 H), 6.71 (d, J=2.7 Hz, 1H), 6.58 (dd, J=8.7, 2.7 Hz, 1H), 4.01 (q, J=7.0, 2H), 3.95 (s, 3H), 3.80 (s, 3H), 2.41 (s, 3H), 1.74 (brm, 6H) 1.39 (t, J=7.1 Hz, 3H)
35	(300 MHz, CDCl ₃) 7.78 (s, 1H), 7.67 (d, J=8.4 Hz, 1H), 7.05 (t, J=54.5 Hz, 1 H), 6.72 (d, J=2.4 Hz, 1H), 6.59 (dd, J=8.7, 2.7 Hz, 1H), 3.96-3.92 (m, 5H), 3 .80 (s, 3H), 2.42 (s, 3H), 1.79-1.69 (brm, 8H), 1.50-1.43 (m, 2H), 0.96 (t, J=7 .4 Hz, 3H).
39	(500 MHz, acetone-d ₆) 8.33 (s, 1H), 8.01-7.99 (m, 2H), 6.98 (t, J=54.5 Hz, 1H), 6.81-6.78 (m, 2H), 4.74-4.68 (m, 1H), 4.01 (s, 3H), 3.96 (s, 3H), 2.47-2.41 (m, 2H), 2.11-2.02 (m, 2H), 1.84-1.55 (m, 8H).

【 0341 】

[表32]

第2表(接著)

No.	¹ H-NMR (300MHz 或 500MHz/溶媒) δ 值
40	(500 MHz, CDCl ₃) 8.05 (dd, J=5.5, 9.0 Hz, 2H), 7.72 (s, 1H), 7.04 (t, J=8.5 Hz, 2H), 3.97 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 1.73 (s, 6H).
42	(300 MHz, CDCl ₃) 7.68 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.58 (s, 1H), 6.70 (d, J=2.4 Hz, 1H), 6.60 (dd, J=8.4, 2.4 Hz, 1H), 4.79-4.74 (m, 1H), 3.93 (s, 3H), 3.66 (s, 3H), 2.41 (s, 3H), 2.05-1.63 (brm, 14H).
44	(300 MHz, CDCl ₃) 7.68 (s, 1H), 7.57 (s, 1H), 6.72 (d, J=2.4 Hz, 1H), 6.62(dd, J=8.7, 2.7 Hz, 1H), 4.38-4.27 (m, 1H), 3.93 (s, 3H), 3.66 (s, 3H), 2.41 (s, 3H), 1.75-1.54 (brm, 8H), 1.30-1.24 (m, 3H), 0.96 (t, J=7.5 Hz, 3H).
45	(300 MHz, CDCl ₃) 7.68 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.59 (s, 1H), 6.73 (d, J=2.4 Hz, 1H), 6.63 (dd, J=8.4, 2.4 Hz, 1H), 3.93 (s, 3H), 3.71 (d, J=6.6 Hz, 2H), 3.66 (s, 3H), 2.41 (s, 3H), 2.11-2.02 (m, 1H), 1.74 (brm, 6H), 1.01 (d, J=6.9 Hz, 6H).
64	(500 MHz, acetone-d ₆) 8.86(d, J=5.5Hz, 1H), 8.41(dd, J=2.0, 1.0Hz, 1H), 8.35(d, J=2.0Hz, 1H), 8.26(d, J=8.0Hz, 1H), 8.11(d, J=8.5Hz, 1H), 7.73(dd, J=7.5, 4.5Hz, 1H), 7.18-7.14(m, 2H), 3.72(s, 3H), 2.44(s, 3H), 1.73(s, 6H).
65	(500 MHz, acetone-d ₆) 8.36 (s, 1H), 8.04 (d, J=2.5 Hz, 1H), 8.00 (dd, J=8.5, 2.5 Hz, 1H), 7.06 (d, J=8.5 Hz, 1H), 6.99 (t, J=54.3 Hz, 1H), 4.16 (q, J=7.0 Hz, 2H), 4.03 (s, 3H), 3.97 (s, 3H), 1.80-1.55 (brm, 6H), 1.39 (t, J=7.0 Hz, 3H).
69	(500 MHz, acetone-d ₆) 8.38 (s, 1H), 8.18 (s, 2H), 6.97 (t, J=54.5 Hz, 1H), 4.07 (q, J=7.0 Hz, 2H), 4.05 (s, 3H), 3.99 (s, 3H), 1.80-1.55 (brm, 6H), 1.41 (t, J=7.0 Hz, 3H).
70	(500 MHz, acetone-d ₆) 8.35 (s, 1H), 8.13 (m, 2H), 8.11 (d, J=2.5 Hz, 1H), 8.06 (d, J=2.5 Hz, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.00 (t, J=54.5 Hz, 1H), 4.04 (s, 3H), 3.96 (s, 3H), 1.90-1.50 (brm, 6H).
71	(500 MHz, acetone-d ₆) 8.35 (s, 1H), 8.21 (d, J=1.5 Hz, 1H), 8.14-8.11 (m, 3H), 7.20-7.18 (m, 2H), 6.99 (t, J=54.5 Hz, 1H), 4.03 (s, 3H), 3.96 (s, 3H), 1.70 (brs, 6H).
72	(500 MHz, acetone-d ₆) 8.35 (s, 1H), 7.91 (dd, J=8.5, 2.5 Hz, 1H), 7.85 (m, 1H), 6.99 (t, J=54.5 Hz, 1H), 6.83 (d, J=8.5 Hz, 1H), 4.06 (q, J=7.0 Hz, 2H), 4.01 (s, 3H), 3.96 (s, 3H), 2.14 (s, 3H), 1.80-1.50 (brm, 6H), 1.36 (t, J=7.0 Hz, 3H).

【 0342 】

[表33]

第2表(接著)

No.	¹ H-NMR (300MHz 或 500MHz/溶媒) δ 值
73	(500 MHz, acetone-d ₆) 8.34 (s, 1H), 8.03 (d, J=2.0 Hz, 1H), 7.98 (dd, J=8.5, 2.0 Hz, 1H), 7.08 (d, J=8.5 Hz, 1H), 6.97 (t, J=54.5 Hz, 1H), 4.72 (sep, J=6.0 Hz, 1H), 4.02 (s, 3H), 3.96 (s, 3H), 1.75-1.55 (brm, 6H), 1.31 (d, J=6.0 Hz, 6H).
74	(500 MHz, acetone-d ₆) 8.34 (s, 1H), 8.03-8.00 (m, 2H), 6.99 (t, J=54.5 Hz, 1H), 6.89-6.85 (m, 2H), 4.05 (q, J=7.0 Hz, 2H), 4.01 (s, 3H), 3.96 (s, 3H), 1.67 (brs, 6H), 1.34 (t, J=7.0 Hz, 3H).
75	(500 MHz, CDCl ₃) 8.01 (dd, J=7.0, 2.5 Hz, 2H), 7.70 (s, 1H), 6.84 (dd, J=7.0, 2.5 Hz, 2H), 4.34-4.27 (m, 1H), 3.95 (s, 3H), 3.76 (s, 3H), 1.99-1.97 (m, 2H), 1.80-1.78 (m, 2H), 1.73 (s, 6H), 1.60-1.20 (m, 6H).
79	(300 MHz, CDCl ₃) 7.79 (s, 1H), 7.67 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.05 (t, J=54.3 Hz, 1H), 6.72 (d, J=2.4 Hz, 1H), 6.59 (dd, J=8.7, 2.4 Hz, 1H), 3.95 (s, 3H), 3.90 (t, J=6.6, 2H), 3.80 (s, 3H), 2.41 (s, 3H), 1.81-1.74 (brm, 8H) 1.01 (t, J=7.3 Hz, 3H).
80	(300 MHz, CDCl ₃) 7.78 (d, J=1.2 Hz, 1H), 7.68 (d, J=8.4 Hz, 1H), 7.05 (t, J=54.5 Hz, 1H), 6.74 (d, J=2.7 Hz, 1H), 6.62 (dd, J=8.7, 2.7 Hz, 1H), 6.06 (tt, J=55.1, 4.1 Hz, 1H), 4.17 (dt, J=12.9, 4.2 Hz, 2H), 3.95 (s, 3H), 3.80 (s, 3H), 2.42 (s, 3H), 1.74 (brm, 6H).
81	(500 MHz, acetone-d ₆) 8.37 (s, 1H), 8.22-8.19 (m, 2H), 7.67 (d, J=2.5 Hz, 1H), 7.59-7.56 (m, 2H), 7.48 (d, J=8.5 Hz, 1H), 7.35 (d, J=8.5, 2.5 Hz, 1H), 7.00 (t, J=54.0 Hz, 1H), 4.06 (s, 3H), 3.96 (s, 3H), 1.85-1.55 (brm, 6H).
82	(500 MHz, acetone-d ₆) 8.79 (s, 1H), 8.36 (s, 1H), 8.19-8.16 (m, 2H), 8.07 (d, J=2.5 Hz, 1H), 7.74 (dd, J=9.0, 2.5 Hz, 1H), 7.67 (d, J=9.0 Hz, 1H), 7.39-7.36 (m, 2H), 7.02 (t, J=54.5 Hz, 1H), 4.05 (s, 3H), 3.96 (s, 3H), 1.85-1.55 (brm, 6H).
83	(500 MHz, CDCl ₃) 8.01 (d, J=9.5 Hz, 2H), 7.70 (s, 1H), 6.82 (d, J=9.0 Hz, 2H), 4.80-4.77 (m, 1H), 3.95 (s, 3H), 3.76 (s, 3H), 1.92-1.90 (m, 2H), 1.84-1.77 (m, 4H), 1.73 (s, 6H), 1.64-1.61 (m, 2H).

【 0343 】

[表34]

第2表(接著)

No.	¹ H-NMR (300MHz 或 500MHz/溶媒) δ 值
88	(500 MHz, acetone-d ₆) 8.34 (s, 1H), 8.04-8.00 (m, 2H), 6.98 (t, J=54.0 Hz, 1H), 6.92-6.89 (m, 2H), 5.05 (s, 1H), 4.94 (s, 1H), 4.50 (s, 2H), 4.01 (s, 3H), 3.96 (s, 3H), 1.78 (s, 3H), 1.75-1.55 (brn, 6H).
89	(300 MHz, CDCl ₃) 8.08 (d, J=2.1 Hz, 1H), 7.91 (s, 1H), 7.74 (dd, J=8.7, 2.1 Hz, 1H), 7.60 (d, J=8.4 Hz, 1H), 7.01 (t, J=54.3 Hz, 1H), 3.97 (s, 3H), 3.91 (s, 3H), 1.70 (brn, 6H).
98	(300 MHz, CDCl ₃) 7.88 (d, J=2.1 Hz, 1H), 7.86 (s, 1H), 7.74 (dd, J=8.4, 2.1 Hz, 1H), 7.28 (d, J=8.1 Hz, 1H), 7.02 (t, J=54.5 Hz, 1H), 3.97 (s, 3H), 3.90 (s, 3H), 2.36 (s, 3H), 1.71 (brn, 6H).
110	(500 MHz, CDCl ₃) 7.71 (d, J=8.5 Hz, 1H), 6.73 (t, J=54.5 Hz, 1H), 6.72 (d, J=2.5 Hz, 1H), 6.61 (dd, J=8.5, 2.5 Hz, 1H), 4.60-4.54 (m, 1H), 3.77 (s, 3H), 3.73 (s, 3H), 2.43 (s, 3H), 1.77 (s, 6H), 1.32 (d, J=6.0 Hz, 6H).
119	(500 MHz, CDCl ₃) 8.02 (d, J=9 Hz, 2H), 7.70 (s, 1H), 6.85 (d, J=9 Hz, 2H), 3.96 (s, 3H), 3.76 (s, 3H), 3.74 (d, J=6 Hz, 2H), 2.11-2.04 (m, 1H), 1.73 (s, 6H), 1.02 (d, J=7 Hz, 6H).
126	(300 MHz, CDCl ₃) 7.78 (s, 1H), 7.64 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.04 (t, J=54.3 Hz, 1H), 6.72 (d, J=2.4 Hz, 1H), 6.58 (dd, J=8.7, 2.4 Hz, 1H), 5.91-5.80 (m, 1H), 5.24-5.12 (m, 2H), 4.84-4.75 (m, 1H), 3.94 (s, 3H), 3.79 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 1.73 (brn, 6H), 1.40(d, J=6.3 Hz, 3H).
127	(300 MHz, CDCl ₃) 7.76 (s, 1H), 7.72 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.04 (t, J=54.3 Hz, 1H), 6.78 (d, J=2.7 Hz, 1H), 6.69 (dd, J=8.4, 2.4 Hz, 1H), 4.74 (s, 2H), 3.93 (s, 3H), 3.79 (s, 3H), 2.41 (s, 3H), 1.74 (brn, 6H).
128	(300 MHz, CDCl ₃) 7.75 (brn, 1H), 7.71 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.04 (t, J=54.3 Hz, 1H), 6.81 (d, J=1.8 Hz, 1H), 6.71 (dd, J=8.4, 2.4 Hz, 1H), 4.87 (q, J=6.7 Hz, 1H), 3.93 (s, 3H), 3.79 (s, 3H), 2.41 (s, 3H), 1.77 (d, J=6.6 Hz, 3H) 1.75 (brn, 6H).
132	(500 MHz, CDCl ₃) 8.02 (d, J=9.5 Hz, 2H), 7.70 (s, 1H), 6.85 (d, J=9.0 Hz, 2H), 3.95 (s, 3H), 3.83 (d, J=7.5 Hz, 2H), 3.76 (s, 3H), 1.74 (s, 6H), 0.88 (t, J=7 Hz, 1H), 0.67-0.63 (m, 2H), 0.37-0.34 (m, 2H).

【 0344 】

[表35]

第2表(接著)

No.	¹ H-NMR (300MHz 或 500MHz/溶媒) δ 值
133	(300 MHz, CDCl ₃) 8.02 (d, J=9.0 Hz, 2H), 6.83 (d, J=9.0 Hz, 2H), 6.74 (t, J=5.4 Hz, 1H), 4.66-4.56 (m, 1H), 3.82 (s, 3H), 3.79 (s, 3H), 1.77 (s, 6H), 1.34 (d, J=4.2 Hz, 6H).
138	(300 MHz, CDCl ₃) 7.74 (d, J=8.7 Hz, 1H), 6.73 (d, J=2.7 Hz, 1H), 6.64 (t, J=5.4 Hz, 1H), 6.66-6.60 (m, 1H), 4.62-4.54 (m, 1H), 3.86 (s, 3H), 3.64 (s, 3H), 2.43 (s, 3H), 1.75 (s, 6H), 1.33 (d, J=6.0 Hz, 6H).
139	(300 MHz, CDCl ₃) 8.07 (d, J=9.3 Hz, 2H), 6.84 (d, J=9.0 Hz, 2H), 6.68 (t, J=5.4 Hz, 1H), 4.65-4.57 (m, 1H), 3.87 (s, 3H), 3.73 (s, 3H), 1.74 (s, 6H), 1.35 (d, J=6.0 Hz, 6H).
140	(300 MHz, CDCl ₃) 7.72 (d, J=8.7 Hz, 1H), 6.72 (d, J=2.4 Hz, 1H), 6.62 (dd, J=8.7, 2.4 Hz, 1H), 4.63-4.54 (m, 1H), 3.79 (d, J=0.6 Hz, 3H), 3.68 (s, 3H), 2.43 (s, 3H), 1.76 (s, 6H), 1.33 (d, J=6.0 Hz, 6H).
141	(300 MHz, CDCl ₃) 7.68 (t, J=8.6 Hz, 1H), 6.73 (t, J=54.5 Hz, 1H), 6.70 (dd, J=9.0, 2.4 Hz, 1H), 6.52 (dd, J=13.5, 2.7 Hz, 1H), 4.58-4.50 (m, 1H), 3.78 (s, 3H), 3.70 (s, 3H), 1.70 (brm, 6H), 1.32 (d, J=6.0 Hz, 6H).
146	(300 MHz, CDCl ₃) 7.88 (brm, 1H), 7.52 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.20 (t, J=54.3 Hz, 1H), 6.48 (dd, J=8.7, 2.1 Hz, 1H), 6.40 (d, J=2.1 Hz, 1H), 4.61-4.53 (m, 1H), 3.98 (s, 3H), 3.80 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 1.58 (brm, 6H), 1.34 (d, J=6.3 Hz, 6H).
147	(300 MHz, CDCl ₃) 8.03 (d, J=9.0 Hz, 2H), 6.83 (d, J=9.0 Hz, 2H), 4.65-4.57 (m, 1H), 3.80 (d, J=0.9 Hz, 3H), 3.76 (s, 3H), 1.76 (s, 6H), 1.35 (d, J=6.0 Hz, 6H).
148	(300 MHz, CDCl ₃) 7.81 (s, 1H), 7.67 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.05 (t, J=54.6 Hz, 1H), 6.71 (d, J=2.4 Hz, 1H), 6.57 (dd, J=8.7, 2.4 Hz, 1H), 4.59-4.49 (m, 1H), 4.21 (q, J=7.2 Hz, 2H), 3.80 (s, 3H), 2.41 (s, 3H), 1.74 (s, 6H), 1.51 (t, J=7.2 Hz, 3H), 1.30 (d, J=6.0 Hz, 6H).
153	(300 MHz, CDCl ₃) 8.00 (d, J=8.9 Hz, 1H), 7.20 (d, J=2.5 Hz, 1H), 6.99 (dd, J=8.8, 2.5 Hz, 1H), 6.84 (t, J=54.5 Hz, 1H), 4.67-4.59 (m, 1H), 3.82 (s, 3H), 3.71 (s, 3H), 1.68 (s, 6H), 1.36 (d, J=6.0 Hz, 6H).

【 0345 】

[表36]

第2表(接著)

No.	¹ H-NMR (300MHz 或 500MHz/溶媒) δ 值
154	(300 MHz, CDCl ₃) 8.01(d, J=8.8 Hz, 1H), 7.21 (d, J=2.5 Hz, 1H), 7.00 (dd, J=8.8, 2.5 Hz, 1H), 4.67-4.59 (m, 1H), 3.84 (s, 3H), 3.66 (s, 3H), 1.67 (s, 6H), 1.36 (d, J =6.3 Hz, 6H).
159	(300 MHz, CDCl ₃) 8.09-8.06 (m, 2H), 7.22-7.19 (m, 2H), 6.70 (t, J=54.6 Hz, 1H), 3.82 (s, 3H), 3.79 (brm, 3H), 1.77 (brm, 6H).
161	(300 MHz, CDCl ₃) 8.10-8.05 (m, 2H), 7.25-7.20 (m, 2H), 3.81 (brm, 3H), 3.77 (s, 3H), 1.76 (brm, 6H).
184	(300 MHz, CDCl ₃) 7.79 (d, J=8.4 Hz, 1H), 7.44 (d, J=2.1 Hz, 1H), 7.28 (dd, J =8.4, 2.1 Hz, 1H), 3.85 (d, J=0.90 Hz, 3H), 3.62 (s, 3H), 1.65 (s, 6H).
185	(300 MHz, CDCl ₃) 8.84 (dd, J=4.8, 0.9 Hz, 1H), 8.05 (dd, J=8.1, 0.9 Hz, 1H), 7.91 (d, J=8.4 Hz, 1H), 7.53 (ddd, J=8.1, 4.8, 0.6 Hz, 1H), 7.45 (d, J=1.8 Hz, 1H), 7.33 (dd, J=8.4, 2.1 Hz, 1H), 3.59 (s, 3H), 1.68 (s, 6H).
191	(500 MHz, CDCl ₃) 8.77 (d, J= 4.5Hz, 1H), 8.25 (d, J=8.5 Hz, 2H), 8.00 (d, J= 8.0 Hz, 1H), 7.48 (dd, J = 8.0, 4.5 Hz, 1H), 7.27 (d, J= 9.0 Hz, 2H), 3.79 (s, 3H), 1.73 (brs, 6H)
193	(300 MHz, CDCl ₃) 7.77 (dd, J=7.8, 1.8 Hz, 1H), 7.51 (dd, J=7.8, 1.8 Hz, 1H), 7.25 (t, J=7.8 Hz, 1H), 6.86 (t, J=54.6 Hz, 1H), 3.83 (s, 3H), 3.67 (s, 3H), 1.67 (s, 6H).
195	(300 MHz, CDCl ₃) 7.78 (dd, J=7.8, 1.8 Hz, 1H), 7.51 (dd, J=7.8, 1.8 Hz, 1H), 7.25 (t, J=7.8 Hz, 1H), 3.85 (s, 3H), 3.62 (s, 3H), 1.67 (s, 6H).
196	(300 MHz, CDCl ₃) 7.85 (s, 1H), 7.71 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.21 (t, J=53.0 Hz, 1H), 6.71 (d, J=2.7 Hz, 1H), 6.58 (dd, J=8.7, 2.4 Hz, 1H), 4.59-4.49 (m, 1H), 4.33 (q, J=7.2 Hz, 2H), 3.82 (s, 3H), 2.42 (s, 3H), 1.75 (s, 6H), 1.46 (t, J=7.2 Hz, 3H), 1.30 (d, J=6.0 Hz, 6H).
201	(300 MHz, CDCl ₃) 7.75 (brm, 1H), 7.31 (s, 2H), 7.14 (t, J=54.3 Hz, 1H), 3.96 (s, 3H), 3.64 (s,3H), 1.92 (brm, 6H).
205	(300 MHz, CDCl ₃) 8.00 (t, J=2.0 Hz, 1H), 7.90 (dt, J=9.0, 1.4 Hz, 1H), 7.47-7.43 (m, 1H), 7.33 (t, J=8.0 Hz, 1H), 6.71 (t, J=54.6 Hz, 1H), 3.83 (s, 3H), 3.80 (t, J=0.9 Hz, 3H), 1.76 (s, 6H).

【 0346 】

[表37]

第2表(接著)

No.	¹ H-NMR (300MHz 或 500MHz/溶媒) δ 值
206	(300 MHz, CDCl ₃) 8.00 (t, J=1.8 Hz, 1H), 7.90 (dt, J=7.5, 1.4 Hz, 1H), 7.46 (ddd, J=8.0, 2.1, 1.1 Hz, 1H), 7.33 (t, J=7.8 Hz, 1H), 3.81 (d, J=0.9 Hz, 3H), 3.78 (s, 3H), 1.75 (s, 6H).
218	(300 MHz, CDCl ₃) 7.93 (s, 1H), 7.85 (d, J=2.3 Hz, 1H), 7.36-7.27 (m, 2H), 7.21(t, J=54.3 Hz, 1H), 4.00 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 1.70-1.57 (brm, 6H).
221	(300 MHz, CDCl ₃) 7.28 (s, 1H), 7.24(d, J= 2.6 Hz, 1H), 7.091 (t, J= 54.3 Hz, 1H), 7.087 (d, J= 8.4 Hz, 1H), 6.79 (dd, J=8.4, 2.6 Hz, 1H), 4.49-4.41(m, 1H), 3.95(s, 3H), 3.78(s, 3H), 2.30 (s, 3H), 1.72 (brs, 6H), 1.28 (d, J=6.0 Hz, 6H).
222	(300 MHz, CDCl ₃) 7.65 (s, 1H), 7.25 (s, 1H), 7.09 (d, J=8.5 Hz, 1H), 6.82 (dd, J= 8.4, 2.7 Hz, 1H), 4.53-4.45 (m, 1H), 3.94 (s, 3H), 3.65 (s, 3H), 2.30 (s, 3H), 1.73 (brs, 6H), 1.31(d, J=6.0 Hz, 6H).
223	(300 MHz, CDCl ₃) 7.25 (d, J=2.7 Hz, 1H), 7.11 (d, J=8.4 Hz, 1H), 6.83 (dd, J=8.4, 2.6Hz, 1H), 4.54-4.46(m, 1H), 3.80 (s, 3H), 3.67 (s, 3H), 2.31 (s, 3H), 1.73 (brs, 6H), 1.31 (d, J=6.3 Hz, 6H).
233	(500 MHz, CDCl ₃)7.63 (d, J=8.0 Hz, 1H), 7.20 (d, J=1.5 Hz, 1H), 7.11 (dd, J=8.0, 1.5 Hz, 1H), 6.72 (t, J= 54.5 Hz, 1H), 3.76 (s, 3H), 3.69 (s, 3H), 2.38 (s, 3H), 1.73 (brs, 6H).
236	(500 MHz, CDCl ₃) 7.65 (d, J=9.0 Hz, 1H), 7.21 (s, 1H), 7.11(d, J=8.0 Hz, 1H), 4.33-4.31 (m, 2H), 3.89 (s, 3H), 2.89-2.87 (m, 2H), 2.39 (s, 3H), 1.70 (d, J=2.0Hz, 3H), 1.65 (brs, 6H).
238	(300 MHz, CDCl ₃) 7.66 (d, J=8.4 Hz, 1H), 7.22 (d, J=2.1 Hz, 1H), 7.12 (dd, J=8.4, 2.1 Hz, 1H), 3.71 (s, 3H), 3.70 (d, J=1.2 Hz, 3H), 2.41 (s, 3H), 1.77 (s, 6H)
239	(300 MHz, CDCl ₃) 7.77 (d, J=0.9 Hz, 1H), 7.69 (d, J=8.7 Hz, 1H), 6.70 (d, J=2.4 Hz, 1H), 6.57 (dd, J=8.7, 2.4 Hz, 1H), 5.58-5.39 (brm, 2H), 4.59-4.51 (m, 1H), 3.91 (s, 3H), 3.80 (s, 3H), 2.42 (s, 3H), 1.73 (brs, 6H), 1.30 (d, J=6.0 Hz, 6H).
249	(300 MHz, CDCl ₃) 7.68 (d, J=8.4 Hz, 1H), 7.20(d, J=2.1 Hz, 1H), 7.10 (dd, J=8.4, 1.8 Hz, 1H), 3.69 (s, 3H), 3.64 (d, J=1.2 Hz, 3H), 2.41 (s, 3H), 2.14 (s, 3H), 1.73 (s, 6H).
250	(300 MHz, CDCl ₃) 7.72 (s, 1H), 7.71 (d, J=8.7 Hz, 1H), 6.69 (d, J=2.4 Hz, 1H), 6.56 (dd, J=8.7, 2.4 Hz, 1H), 4.60-4.48 (m, 1H), 3.81 (s, 3H), 3.76 (s, 3H), 2.42 (s, 3H), 2.30 (s, 3H), 1.70 (brm, 6H), 1.29 (d, J=6.3 Hz, 6H).
252	(300 MHz, CDCl ₃) 8.17 (d, J=2.1 Hz, 1H), 7.89 (dd, J=8.7, 2.1 Hz, 1H), 7.85 (s, 1H), 7.42 (d, J=8.7 Hz, 1H), 3.90 (s, 3H), 3.86 (s, 3H), 2.28 (s, 3H), 1.67 (brm, 6H).

【 0347 】

[表38]

第2表(接著)

No.	¹ H-NMR (300MHz 或 500MHz/溶媒) δ 值
257	(300 MHz, CDCl ₃) 8.15 (d, J=2.1 Hz, 1H), 7.88 (dd, J=8.4, 2.1 Hz, 1H), 7.45 (d, J=8.4 Hz, 1H), 3.81 (s, 3H), 3.67 (d, J=2.1 Hz, 3H), 2.16 (s, 3H), 1.74 (br m, 6H).
258	(300 MHz, CDCl ₃) 7.65 (d, J=8.4 Hz, 1H), 7.23 (d, J=1.8 Hz, 1H), 7.13 (dd, J=8.4, 2.1 Hz, 1H), 3.80 (d, J=0.9 Hz, 3H), 3.66 (s, 3H), 2.40 (s, 3H), 1.74 (s, 6H)
259	(300 MHz, CDCl ₃) 7.76 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.67 (s, 1H), 6.70 (d, J=2.4 Hz, 1H), 6.58 (dd, J=8.7, 2.4 Hz, 1H), 4.60-4.52 (m, 1H), 3.78 (s, 3H), 3.76 (s, 3H), 2.44 (s, 3H), 2.40-2.31 (m, 1H), 1.71 (brs, 6H), 1.31 (d, J=6.3 Hz, 6H), 0.88-0.80 (m, 4H).
266	(300 MHz, CDCl ₃) 7.82 (s, 1H), 7.77 (s, 1H), 7.29 (s, 1H), 7.03 (t, J=54.3 Hz, 1H), 3.96 (s, 3H), 3.81 (s, 3H), 2.36 (s, 3H), 1.73 (brm, 6H).
267	(300 MHz, CDCl ₃) 7.78 (s, 1H), 7.68 (s, 1H), 7.30 (s, 1H), 3.95 (s, 3H), 3.69 (s, 3H), 2.36 (s, 3H), 1.72 (brm, 6H).
268	(300 MHz, CDCl ₃) 7.79 (s, 1H), 7.32 (d, J=0.6Hz, 1H), 3.80 (d, J=0.9Hz, 3H), 3.68 (s, 3H), 2.38 (s, 3H), 1.74 (brm, 6H).
285	(300 MHz, CDCl ₃) 7.84 (s, 1H), 7.54 (d, J=8.4 Hz, 1H), 7.28 (d, J= 8.4 Hz, 1H), 7.11 (t, J=54.3 Hz, 1H), 3.97 (s, 3H), 3.77 (s, 3H), 2.41 (s, 3H), 1.68 (br m, 6H)
289	(500 MHz, CDCl ₃) 7.95 (d, J=9.0Hz, 2H), 7.33 (d, J=8.5Hz, 2H), 6.70 (t, J=54.5Hz, 1H), 3.80 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 1.75 (brs, 6H).
310	(300 MHz, CDCl ₃) 8.14 (d, J=2.1Hz, 1H), 7.89-7.86 (m, 2H), 7.44(d, J=8.4Hz, 1H), 3.93 (s, 3H), 3.86 (s, 3H), 3.99-3.44 (brm, 2H), 1.70 (brs, 6H).
313	(300 MHz, CDCl ₃) 8.32(s, 1H), 8.09 (d, J=2.1Hz, 1H), 7.83 (dd, J=8.5, 2.1Hz, 1H), 7.47 (d, J=8.5Hz, 1H), 6.98(t, J=53.7Hz, 1H), 3.94 (s, 3H), 1.75 (brs, 6H)
343	(300 MHz, CDCl ₃) 7.84-7.81 (m, 1H), 7.43-7.40 (m, 1H), 7.36-7.28 (m, 2H), 3.85 (d, J=0.9 Hz, 3H), 3.61 (s, 3H), 1.67 (brs, 6H).
365	(300 MHz, CDCl ₃) 7.81 (s, 1H), 7.63 (d, J=8.4 Hz, 1H), 7.19-7.09 (m, 1H), 7.08 (t, J=54.3 Hz, 1H), 3.96 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 2.66 (q, J=7.5 Hz, 2H), 1.70 (brs, 6H), 1.26 (t, J=7.5 Hz, 3H).
379	(300 MHz, CDCl ₃) 7.73 (d, J=8.7 Hz, 1H), 6.71 (d, J=2.4 Hz, 1H), 6.61 (dd, J=8.7, 2.7 Hz, 1H), 4.61-4.53 (m, 1H), 3.73 (s, 3H), 3.68 (d, J=1.2 Hz, 3H), 2.44 (s, 3H), 1.79 (s, 6H), 1.32 (d, J=6.0 Hz, 6H)
392	(300 MHz, CDCl ₃) 8.14(d, J=2.1Hz, 1H), 7.89-7.85(m, 2H), 7.44(d, J=8.7Hz, 1H), 5.90(tt, J=57.0, 4.7Hz, 1H), 3.92(s, 3H), 3.91(s, 3H), 3.63-3.25(brm, 2H), 1.69(brs, 6H).

【 0348 】

[表39]

第2表(接著)

No.	¹ H-NMR (300MHz 或 500MHz/溶媒) δ 值
404	(300 MHz, CDCl ₃) 7.72 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.71 (s, 1H), 6.70 (d, J=2.4 Hz, 1H), 6.56 (dd, J=8.7, 2.7 Hz, 1H), 4.59-4.51 (m, 1H), 3.83 (s, 3H), 3.76 (s, 3H), 2.74 (q, J=7.5 Hz, 2H), 2.44 (s, 3H), 1.71 (brs, 6H), 1.30 (d, J=6.0 Hz, 6H), 1.07 (t, J=7.5 Hz, 3H).
407	(300 MHz, CDCl ₃) 7.77 (s, 1H), 7.72 (d, J=8.4 Hz, 1H), 7.07-6.95 (m, 2H), 7.05 (t, J=54.3 Hz, 1H), 3.95 (s, 3H), 3.79 (s, 3H), 2.42 (s, 3H), 1.73 (brs, 6H).
434	(500 MHz, CDCl ₃) 7.56 (d, 1H), 7.38 (s, 1H), 7.27(d,1H), 6.73(t,1H), 3.77(s,3H), 3.66(s,3H), 2.37(s,3H), 1.73(s,6H).
436	(300 MHz, CDCl ₃) 7.79 (s, 1H), 7.66 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.06 (t, J=54.3 Hz, 1H), 6.76 (d, J=2.7 Hz, 1H), 6.59 (dd, J=8.7, 2.7 Hz, 1H), 4.60-4.52 (m, 1H), 3.94 (s, 3H), 3.79 (s, 3H), 2.73-2.65 (brm, 2H), 1.73 (brm, 6H), 1.31 (d, J=6.0 Hz, 6H), 1.25 (t, J=7.5 Hz, 3H).
459	(500 MHz, CDCl ₃) 7.71(d,1H), 6.72(s,1H), 6.71(t,1H), 6.63(d,1H), 3.78(s,3H), 3.75(s,3H), 3.71(s,3H), 2.42(s,3H), 1.75(s,6H).
466	(300 MHz, CDCl ₃) 7.77 (s, 1H), 7.58 (d, J=7.8 Hz, 1H), 7.05 (t, J=54.3 Hz, 1H), 6.98 (s, 1H), 6.86 (d, J=8.1 Hz, 1H), 3.93 (s, 3H), 3.79 (s, 3H), 2.40-2.39 (m, 5H), 1.78-1.76 (m, 7H), 0.84 (s, 3H), 0.81 (s, 3H).
471	(500 MHz, CDCl ₃) 7.77(s,1H), 7.68(d,1H), 7.03(t,1H), 6.82(d,1H), 6.47(t,1H), 3.92(s,3H), 3.77(s,3H), 2.39(s,3H), 1.71(s,6H).
476	(300 MHz, CDCl ₃) 7.77 (s, 1H), 7.59 (d, J=8.1 Hz, 1H), 7.04 (t, J=54.3 Hz, 1H), 7.01 (s, 1H), 6.90 (d, J=6.9 Hz, 1H), 3.94 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 2.51 (t, J=7.5 Hz, 2H), 2.38 (s, 3H), 1.74 (brs, 6H), 1.62-1.54 (m, 2H), 0.87 (t, J=7.5 Hz, 3H).
477	(500 MHz, CDCl ₃) 7.71(d,1H), 6.94(s,1H), 6.86(d,1H), 6.70(t,1H), 6.50(t,1H), 3.75(s,3H), 3.70(s,3H), 2.41(s,3H), 1.74(s,6H).
483	(300 MHz, CDCl ₃) 7.82(s,1H), 7.57(d,1H), 7.07(t,1H), 6.91(d,1H), 3.94(s,3H), 3.77(s,3H), 2.65(q,2H), 2.31(s,3H), 1.71(s,6H), 1.25(t,3H).
484	(300 MHz, CDCl ₃) 7.77 (s, 1H), 7.57 (d, J=8.1 Hz, 1H), 7.20 (s, 1H), 7.10 (dd, J=8.1, 1.2 Hz, 1H), 7.06 (t, J=54.3 Hz, 1H), 3.95 (s, 3H), 3.77 (s, 3H), 2.35 (s, 3H), 1.71 (brs, 6H), 1.46-1.39 (m, 1H), 0.91-0.77 (m, 4H).
485	(500 MHz, CDCl ₃) 7.63(d,1H), 7.06(s,1H), 6.66(d,1H), 6.67(t,1H), 3.76(s,3H), 3.68(s,3H), 2.84(m,1H), 1.76(s,6H), 1.20(d,6H).
486	(500 MHz, CDCl ₃) 7.62(d,1H), 7.04(s,1H), 6.96(d,1H), 6.69(t,1H), 3.76(s,3H), 3.71(s,3H), 2.59(q,2H), 2.40(s,3H), 1.75(s,6H), 1.19(t,3H).

【 0349 】

[表40]

第2表(接著)

No.	¹ H-NMR (300MHz 或 500MHz/溶媒) δ 值
498	(500 MHz, acetone-d ₆) 8.22 (s, 1H), 7.41 (d, J=11.0 Hz, 1H), 7.08 (d, J=8.0 Hz, 1H), 7.03 (t, J=54.5 Hz, 1H), 3.94 (s, 3H), 3.88 (s, 3H), 2.28 (s, 3H), 2.16 (s, 3H), 1.66 (brs, 6H).
501	(300 MHz, CDCl ₃) 7.80 (s, 1H), 7.76 (s, 1H), 7.47 (d, J=0.6 Hz, 1H), 7.02 (t, J=54.3 Hz, 1H), 3.96 (s, 3H), 3.80 (s, 3H), 2.35 (s, 3H), 1.73 (brm, 6H).
505	(500 MHz, CDCl ₃) 7.81(s,1H),7.57(d,1H),7.07(t,1H),7.05(s,1H),6.90(d,1H),3.93(s,3H),3.76(s,3H),2.56(t,2H),2.29(s,3H),1.66-1.70(bs,8H),1.39(q,2H),0.92(t,3H).
506	(500 MHz, CDCl ₃) 7.81(s,1H),7.57(d,1H),7.07(t,1H),7.05(s,1H),6.90(d,1H),3.93(s,3H),3.76(s,3H),2.57(t,2H),2.28(s,3H),1.69(bs,8H),1.33-1.35(m,4H),0.89(t,3H).
511	(500 MHz, CDCl ₃) 7.81(s,1H),7.57(d,1H),7.07(t,1H),7.05(s,1H),6.90(d,1H),3.93(s,3H),3.76(s,3H),2.56(t,2H),2.28(s,3H),1.71(t,2H),1.67(s,6H),0.96(t,3H).
523	(500 MHz, CDCl ₃) 7.66(d,1H),7.03(s,1H),6.93(d,1H),3.74(s,3H),3.59(s,3H),2.40(s,3H),2.30(s,3H),2.11(s,3H),1.74(s,6H).
525	(500 MHz, CDCl ₃) 7.60(d,1H),7.02(s,1H),6.92(d,1H),4.31(t,2H),3.90(s,3H),2.87(t,2H),2.38(s,3H),2.28(s,3H),1.66(s,3H),1.65(s,6H).
532	(500 MHz, CDCl ₃) 7.79 (s, 1H), 7.74 (s, 1H), 7.00 (t, J=54.5 Hz, 1H), 6.71 (s, 1H), 4.58-4.52 (m,1H), 3.93 (s, 3H), 3.81 (s, 3H), 2.40 (s, 3H), 1.76 (brm, 6H) 1.32 (d, J=5.5 Hz, 6H).
533	(500 MHz, CDCl ₃) 7.79 (s, 1H), 7.74 (s, 1H), 7.00 (t, J=54.5 Hz, 1H), 6.69 (s, 1H), 4.36-4.30 (m,1H), 3.93 (s, 3H), 3.81 (s, 3H), 2.40 (s, 3H), 1.76-1.56 (brm, 8H) 1.28 (d, J=6.0 Hz, 3H), 0.94 (t, J=7.2 Hz, 3H).
541	(300 MHz, CDCl ₃) 7.79 (s, 1H), 7.50 (d, J=12.6 Hz, 1H), 7.03 (t, J=54.4 Hz, 1H), 6.75 (d, J=8.7 Hz, 1H), 3.94 (s, 3H), 3.86 (s, 3H), 3.82 (s, 3H), 2.41(s, 3H), 1.74(brm, 6H).
542	(300 MHz, CDCl ₃) 7.79 (s, 1H), 7.49 (d, J=12.6 Hz, 1H), 7.04 (t, J=54.3 Hz, 1H), 6.76 (d, J=8.4 Hz, 1H), 4.61-4.53 (m,1H), 3.95 (s, 3H), 3.82 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 1.74(brm, 6H), 1.33 (d, J=6.3 Hz, 6H).
543	(300 MHz, CDCl ₃) 7.79 (s, 1H), 7.50 (d, J=12.6 Hz, 1H), 7.04 (t, J=54.3 Hz, 1H), 6.75 (d, J=8.4 Hz, 1H), 4.09 (q, J=6.9Hz, 2H), 3.96 (s, 3H), 3.82 (s, 3H), 2.40 (s, 3H), 1.75(brs, 6H), 1.43 (t, J=6.9 Hz, 3H).

【 0350 】

[表41]

第2表(接著)

No.	¹ H-NMR (300MHz 或 500MHz/溶媒) δ 值
544	(300 MHz, CDCl ₃) 7.79 (s, 1H), 7.49 (d, J=12.9 Hz, 1H), 7.04 (t, J=54.4 Hz, 1H), 6.74 (d, J=8.4 Hz, 1H), 3.97 (t, J=6.4 Hz, 2H), 3.95 (s, 3H), 3.82 (s, 3H), 2.39(s, 3H), 1.88-1.74(brm, 8H), 1.02 (t, J=7.3 Hz, 3H).
557	(300 MHz, CDCl ₃) 7.78 (s, 1H), 7.23 (d, J=8.4 Hz, 1H), 7.04 (t, J=54.6 Hz, 1H), 6.43 (d, J=8.4 Hz, 1H), 3.95 (s, 3H), 3.81 (s, 3H), 2.25 (s, 3H), 1.90-1.79 (m, 3H), 1.75 (brs, 6H), 1.59 (s, 3H), 0.94 (d, J=6.3 Hz, 6H).
579	(300 MHz, CDCl ₃) 7.80 (s, 1H), 7.50 (d, J=12.6 Hz, 1H), 7.04 (t, J=54.3 Hz, 1H), 6.74 (d, J=8.4 Hz, 1H), 3.95 (s, 3H), 3.82 (s, 3H), 3.76 (d, J=6.9 Hz, 2H), 2.40 (s, 3H), 2.15-2.05 (m, 1H), 1.74 (brs, 6H), 1.02 (d, J=6.9Hz, 6H).
582	(300 MHz, CDCl ₃) 7.79 (s, 1H), 7.50 (d, J=12.6 Hz, 1H), 7.04 (t, J=54.3 Hz, 1H), 6.75 (d, J=8.7 Hz, 1H), 4.04 (t, J=6.6 Hz, 2H), 3.95 (s, 3H), 3.82 (s, 3H), 2.40 (s, 3H), 1.87-1.66 (m, 9H), 0.96 (d, J=6.6 Hz, 6H).
583	(300 MHz, CDCl ₃) 7.79 (s, 1H), 7.49 (d, J=12.6 Hz, 1H), 7.04 (t, J=54.4 Hz, 1H), 6.75 (d, J=8.4 Hz, 1H), 4.06 (t, J=7.2 Hz, 2H), 3.95 (s, 3H), 3.82 (s, 3H), 2.41 (s, 3H), 1.76-1.71(brm, 8H), 0.98 (s, 9H).
585	(300 MHz, CDCl ₃) 7.80 (s, 1H), 7.52 (d, J=12.3 Hz, 1H), 7.04 (t, J=54.3 Hz, 1H), 6.81 (d, J=8.1 Hz, 1H), 4.39 (q, J=7.8Hz, 2H), 3.96 (s, 3H), 3.82 (s, 3H), 2.38 (s, 3H), 1.73 (brs, 6H).
586	(300 MHz, CDCl ₃) 7.80 (s, 1H), 7.52 (d, J=12.3 Hz, 1H), 7.04 (t, J=54.3 Hz, 1H), 6.77 (d, J=8.4 Hz, 1H), 6.08(tt, J=54.9, 4.2 Hz, 1H), 4.22 (td, J=12.9, 4.2 Hz, 2H), 3.96 (s, 3H), 3.82 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 1.74 (brs, 6H).
587	(300 MHz, CDCl ₃) 7.79 (s, 1H), 7.49 (d, J=12.6 Hz, 1H), 7.04 (t, J=54.3 Hz, 1H), 6.74 (d, J=8.4 Hz, 1H), 4.81-4.77 (m, 1H), 3.95 (s, 3H), 3.82 (s, 3H), 2.40(s, 3H), 1.91-1.79 (m, 6H), 1.74 (brs, 6H), 1.66-1.59 (m, 2H).
588	(300 MHz, CDCl ₃) 7.79 (s, 1H), 7.51 (d, J=12.6 Hz, 1H), 7.04 (t, J=54.3 Hz, 1H), 6.76 (d, J=8.4 Hz, 1H), 6.02 (ddt, J=17.1, 10.5, 5.4 Hz, 1H), 5.40 (dq, J=17.1, 1.5 Hz, 1H), 5.30 (dq, J=10.5, 1.5 Hz, 1H), 4.58 (dt, J=5.4, 1.5 Hz, 2H), 3.95 (s, 3H), 3.82 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 1.75 (brs, 6H).
589	(300 MHz, CDCl ₃) 7.80 (s, 1H), 7.48 (d, J=12.6 Hz, 1H), 7.03 (t, J=54.3 Hz, 1H), 6.76 (d, J=8.4 Hz, 1H), 5.92-5.81 (m, 1H), 5.22 (d, J=17.4 Hz, 1H), 5.15 (dt, J=10.5, 1.0 Hz, 1H), 4.85-4.77 (m, 1H), 3.95 (s, 3H), 3.82 (s, 3H), 2.36 (s, 3H), 1.73(brm, 6H), 1.44 (d, J=6.3 Hz, 3H).

【 0351 】

[表42]

第2表(接著)

No.	¹ H-NMR (300MHz 或 500MHz/溶媒) δ 值
591	(300 MHz, CDCl ₃) 7.81 (s, 1H), 7.51 (d, J=12.3 Hz, 1H), 7.05 (t, J=54.3 Hz, 1H), 7.01 (d, J=8.4 Hz, 1H), 5.20 (s, 2H), 3.96 (s, 3H), 3.82 (s, 3H), 2.38 (s, 3H), 1.73(brs, 6H).
592	(300 MHz, CDCl ₃) 7.74 (s, 1H), 7.54 (d, J=11.1 Hz, 1H), 7.04 (t, J=54.3 Hz, 1H), 6.95 (d, J=7.5 Hz, 1H), 3.95 (s, 3H), 3.79 (s, 3H), 2.35 (s, 3H), 2.31 (s, 3H), 1.74(brs, 6H).
593	(300 MHz, CDCl ₃) 7.72 (s, 1H), 7.53 (d, J=11.1 Hz, 1H), 7.04 (t, J=54.4 Hz, 1H), 6.93 (d, J=7.5 Hz, 1H), 3.95 (s, 3H), 3.77 (s, 3H), 2.87-2.77(m, 1H), 2.34(s, 3H), 1.74(brm, 6H), 1.31 (d, J=7.2 Hz, 6H).
602	(300 MHz, CDCl ₃) 7.71-7.67 (m, 2H), 7.21 (d, J= 2.1 Hz, 1H), 7.09 (dd, J=8.4, 1.8 Hz, 1H), 6.95 (dd, J = 18.0, 11.1 Hz, 1H), 5.92 (dd, J= 18.0, 1.8 Hz, 1H), 5.26 (dd, J = 11.1, 1.8 Hz, 1H), 3.89 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 2.41 (s, 3H), 1.69 (brs, 6H).

【 0352】

試驗例1：對於小麥葉枯病之殺菌效果試驗

於包含以二甲基亞碲溶解之本發明化合物的 YBG(酵母萃取物、蛋白胨(Bacto Peptone)、甘油)介質，接種小麥葉枯病菌 (*Septoria tritici*)之孢子懸濁液，於室溫培養7天調查生育程度。

將化合物 No.2~11、13~22、24~40、42~45、52~57、65、69~89、93~97、105~108、110~117、119~124、126~134、138~155、157~161、171、181~184、192~195、197~209、213~218、224~235、237~239、243、248~250、252、253、257~259、261、266~272、274、276、278~292、296、312、338、339、341~344、347、353、356、379、392、394、404、407、410、434、436、459~479、483~487、491、496~506、511、513、520~522、524、530、532、533、541~545、557、577、

579、582、585～588、591、836以30ppm將小麥葉枯病菌的生育抑制70%以上。

【0353】

試驗例2：對於小麥赤黴病之殺菌效果試驗

於包含以二甲基亞砷溶解之本發明化合物的YBA(酵母萃取物、蛋白胨(Bacto Peptone)、乙酸鈉)介質，接種小麥赤黴病菌(*Fusarium graminearum*)之孢子懸濁液，以室溫培養3天調查生育程度。

將化合物No.3、5、6、8、10、11、13、15～18、20～22、24、26、27、29～32、35～40、42～45、55～57、65、69、70、72～74、76～79、81、82、86、88、89、93、96、97、105～108、110～117、122～124、126、129、130、133、134、140、143～145、153、155、157～160、171、181～183、192、194、197～209、213、216、225～231、233～239、243、248～250、252、253、257、258、261、266～269、271、272、274、276、278～292、296、344、347、356、379、392、394、404、407、410、412、434、436、459～467、470～473、475～479、483～487、491、495～506、511、513、521、522、525、530、532、533、541～545、557、577、579、582、585～588、591、836以30ppm將小麥赤黴病菌的生育抑制70%以上。

【0354】

試驗例3：對於小麥白粉病之效果試驗

以直徑6cm之乙烯盆栽培小麥，於到達1.5～2.0葉期

時，將本發明化合物調製成指定濃度之藥液 10mL 在噴槍散布。乾燥藥液後(處理當日)，灑上白粉病菌(*Erysiphe graminis*)之分生孢子進行接種，保持在 20°C 之恆溫室內。於接種 7 天後從孢子形成面積調查防除率。

將化合物 No.5、7、8、11、15、16、24、31、32、34、37~40、55、56、74、79、84、105~107、110~112、114、119、122、123、126、130、133、134、138~141、144、145、147、148、154、157~161、171、182、184、193、195~200、202、205~209、216、217、220、224~226、229、231、233、238、239、248~250、253、257~259、266~268、270、278~280、283、289~292、338、339、343、344、365、379、394、404、407、410、434、436、459~463、465、471、472、475~479、483~487、491、498、499、501~503 以 100ppm 將小麥白粉病的發病抑制 90% 以上。

【0355】

試驗例 4：對於綠豆灰黴病之效果試驗

以直徑 15cm 之聚鉢栽培綠豆，於本葉充分展開時，將本發明化合物調製成指定濃度之藥液 5mL 在噴槍散布。乾燥藥液後(處理當日或隔天)，接種含浸以 PS(馬鈴薯、蔗糖)介質調製之灰黴病菌(*Botrytis cinerea*)之分生孢子懸濁液的直徑 8mm 之紙盤，以多濕條件下保持在 20°C 之恆溫室內。從接種 3 日後之病斑長度調查防除率。

將化合物 No.6、8、15、17、19、20、31~35、42~

45、55～57、77、79、83、84、86、93、105、110、115、126、129、130、133、134、140～142、144、147、151、153、154、157、159、182、198、200、207、233、235、238、239、250、257、258、261、276、280、281、283、285、289、290、292、343、347、379、407、434、436、459、461、462、466、471、472、476、477、479、484～487、503、505、521、557以25ppm將綠豆灰黴病之發病抑制90%以上。

【0356】

試驗例5：對於綠豆菌核病之效果試驗

以直徑15cm之聚鉢栽培綠豆，於本葉充分展開時，將本發明化合物調製成指定濃度之藥液5mL在噴槍散布。乾燥藥液後(處理當日或隔天)，預先將以PSA(馬鈴薯、蔗糖、洋菜)介質培養之菌核病菌(*Sclerotinia sclerotiorum*)之菌叢盤(直徑4mm)之菌叢面從上進行接種，以多濕條件下保持在20℃之恆溫室內。從接種3日後之病斑長度調查防除率。

將化合物No.2、5～9、13～18、20、26、28、29、31～36、38、39、42～45、52～57、70、74～77、79、80、83、84、86～88、93、95～98、105～108、110～112、115～117、119、122、124、126～131、133、134、138～142、145、147、151～155、157～159、171、182、184、193、197、198、200、202、206、207、209、216～218、220、233、235、238、239、248、250、252、257～259、

261、269～272、274、276、278、280～283、285～287、289、290、292、296、338、339、343、347、365、379、394、404、407、410、434、436、459～463、465、471～475、477～479、484～487、498、503～506、511、513、530、533、557、602以25ppm將綠豆菌核病的發病抑制90%以上。

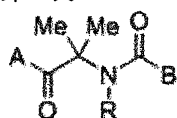
又，如第3表所示，本發明化合物之化合物No.75及No.112與醯胺之氮原子未被甲氧基修飾之化合物相比較，於25ppm顯示更為優異之效果。

效果之評估基準=A：防除率 95～100%、B：90～94%、C：50～89%、D：30～49%、E：0～29%

【0357】

[表43]

第3表



A	B	R	評估
4-(環己基)苯基	B2	OMe (No. 75)	A
		H	C
4-氯苯基	B1	OMe (No. 112)	B
		Me	E

【0358】

試驗例6：對於小麥葉枯病之效果試驗

於處理3日前，於噴霧接種葉枯病菌(*Septoria tritici*)之分生孢子懸濁液之小麥(以直徑6cm之乙烯盆栽培、1.5～2.0葉期)，將本發明化合物調製成指定濃度之藥液10mL

在噴槍散布，乾燥藥液後保持在15°C之恆溫室內。於接種24~28日後從病斑形成面積，調查顯示防除率90%以上之最低有效濃度，將與作為對於小麥葉枯病之殺菌劑使用之丙硫菌唑的最低有效濃度的濃度差以5階段評估。

評估基準之計算式= X/Y

X；本發明之化合物的最低有效濃度(ppm)、Y；丙硫菌唑之最低有效濃度(ppm)

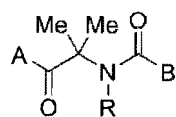
評估基準=A：1/128倍以下、B：較1/128更大且為1/32倍以下、C：較1/32更大且為1/8倍以下、D：較1/8更大且為1倍以下、E：較1倍更大

如第4表所示，本發明化合物之化合物No.8，與醯胺之氮原子為甲氧基以外之化合物相比較，顯示更為優異之效果。

【0359】

[表44]

第4表



A	B	R	評估
4-異丙氧基-2-甲基苯基	B1	OMe (No. 8)	A
		H	D
		Me	D
		Et	D
		異丙氧基	E
		COMe	E

【0360】其次，雖記載本發明組成物之製劑例，但摻合比例、劑型等並非僅被限定於記載例者。

製劑例 1

(1)式(1)之化合物	20重量份
(2)黏土	72重量份
(3)木質素磺酸蘇打	8重量份

將均一混合以上者作為可濕性粉劑。

製劑例 2

(1)式(1)之化合物	5重量份
(2)滑石	95重量份

將均一混合以上者作為粉劑。

製劑例 3

(1)式(1)之化合物	20重量份
(2)N,N'-二甲基乙醯胺	20重量份
(3)聚氧乙烯烷基苯基醚	10重量份
(4)二甲苯	50重量份

將均一混合以上者進行溶解作為乳劑。

【0361】

製劑例 4

(1)黏土	68重量份
(2)木質素磺酸蘇打	2重量份
(3)聚氧乙烯烷基芳基硫酸鹽	5重量份
(4)微粉二氧化矽	25重量份

將以上之各成分的混合物、與式(1)之化合物以4:1之重量比例混合，作為可濕性粉劑。

製劑例 5

(1)式(1)之化合物	50重量份
(2)經氧基化(Oxylated)之聚烷基苯基磷酸鹽-三乙醇胺	2重量份
(3)聚矽氧	0.2重量份
(4)水	47.8重量份

將均一混合以上者於經粉碎之原液進一步加入均一混合，

(5)聚羧酸鈉	5重量份
(6)無水硫酸鈉	42.8重量份

進行造粒、乾燥，作為顆粒可濕性粉劑。

製劑例 6

(1)式(1)之化合物	5重量份
(2)聚氧乙烯辛基苯基醚	1重量份
(3)聚氧乙烯之磷酸酯	0.1重量份
(4)粒狀碳酸鈣	93.9重量份

預先均一混合(1)~(3)，以適量之丙酮稀釋後，吹附在(4)，去除丙酮作為粒劑。

【0362】

製劑例 7

(1)式(1)之化合物	2.5重量份
(2)N-甲基-2-吡咯烷酮	2.5重量份
(3)大豆油	95.0重量份

將均一混合以上者溶解，作為微量散布劑(ultra low volume formulation)。

製劑例8

(1)式(1)之化合物	20重量份
(2)經氧基化之聚烷基酚磷酸鹽-三乙醇胺	2重量份
(3)聚矽氧	0.2重量份
(4)三仙膠	0.1重量份
(5)乙二醇	5重量份
(6)水	72.7重量份

將均一混合以上者進行粉碎，作為水性懸濁劑。

尚，將2017年12月21日所申請之日本特許出願2017-244785號之說明書、申請專利範圍及摘要之全內引用於此，作為本發明之說明書的揭示而取入者。



【發明摘要】

【中文發明名稱】

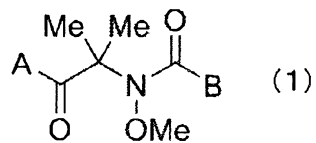
N-甲氧基醯胺化合物或其鹽及含有該等之農園藝用殺菌劑

【中文】

本發明為提供一種對於範圍廣泛之植物病原菌，發揮高度防除效果之農園藝用殺菌劑。

式(1)：

[化1]



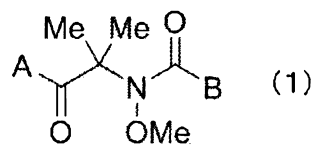
(式中，各記號係如說明書所記載)表示之化合物或其鹽。

【指定代表圖】無

【代表圖之符號簡單說明】無

【特徵化學式】式(1)

[化1]

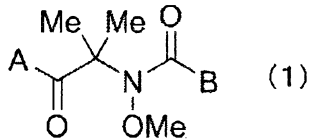


【發明申請專利範圍】

【第1項】

一種式(1)表示之化合物或其鹽，

[化1]



[式中，A為被 R^A 取代之苯基或被 R^A 取代之吡啶基，

B為被 R^B 取代之雜環基，

R^A 可相同或相異為鹵素原子、可被 G^1 取代之烷基、烯基、可被 G^2 取代之炔基、環狀基、硝基、氰基或 $-L^A-Y^A$ ，或可鍵結2個 R^A ，形成可被 Z^1 取代之環，

R^B 可相同或相異為鹵素原子、烷基、烯基、鹵烷基、烷氧基烷基、環烷基或氰基，

L^A 為O、S、 $C(=O)$ 、 $C(=O)O$ 、 $C(=O)N(R^1)$ 、 $OC(=O)$ 、 $N(R^1)$ 、 $N(R^1)C(=O)$ 、 $N(R^1)C(=O)O$ 、 $C(=NR^2)$ 、 SO 、 SO_2 或 $SO_2N(R^1)$ ， Y^A 為氫原子、可被 Z^2 取代之烷基、烯基或可被 Z^3 取代之環狀基，

R^1 為氫原子或烷基，

R^2 為氫原子、烷基或烷氧基，

G^1 為鹵素原子或烷氧基，

G^2 為環烷基或鹵素原子，

Z^1 為鹵素原子、烷基或烷氧基，

Z^2 為鹵素原子、氰基、環烷基或烷氧基，

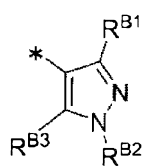
Z^3 為鹵素原子或鹵烷基]。

【第2項】

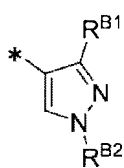
如請求項1之化合物或其鹽，其中，

B為選自由式(B-1)~式(B-18)表示之5員雜環基及式(B-101)~式(B-128)表示之6員雜環基所成之群組中之雜環基，

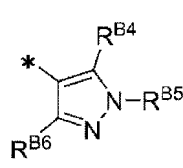
[化2]



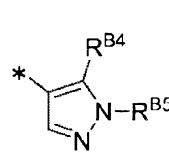
(B-1)



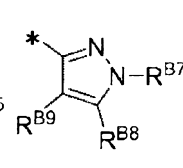
(B-2)



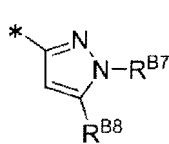
(B-3)



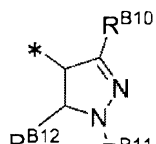
(B-4)



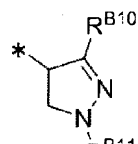
(B-5)



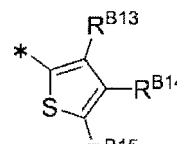
(B-6)



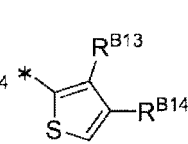
(B-7)



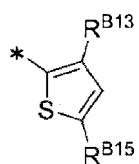
(B-8)



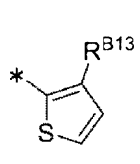
(B-9)



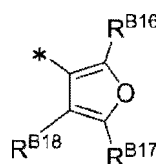
(B-10)



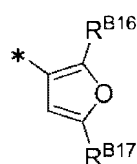
(B-11)



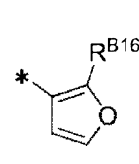
(B-12)



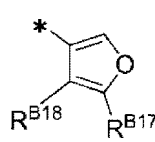
(B-13)



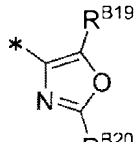
(B-14)



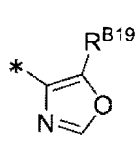
(B-15)



(B-16)



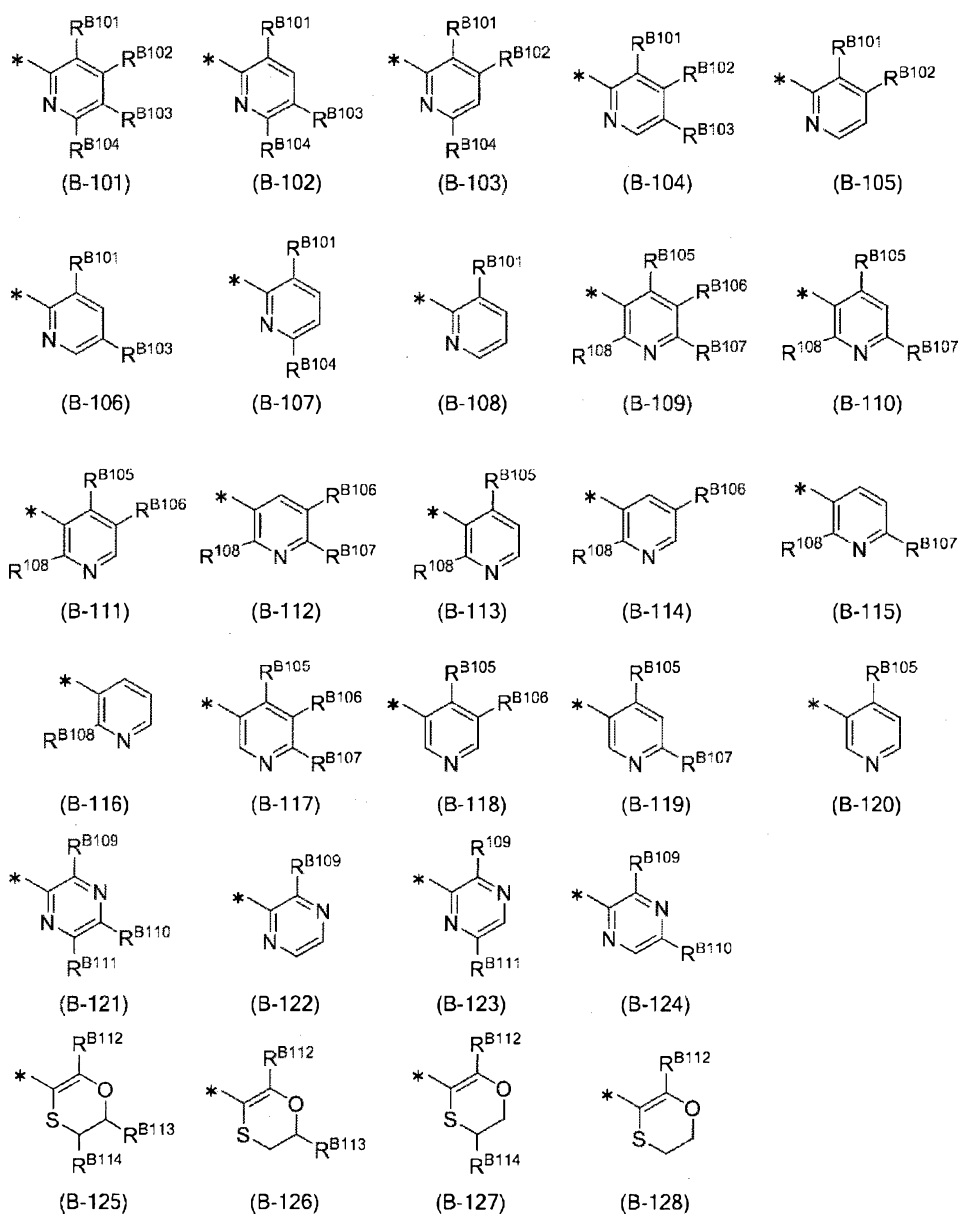
(B-17)



(B-18)

[式中， $R^{B1} \sim R^{B20}$ 可相同或相異為鹵素原子、烷基、烯基、鹵烷基、烷氧基烷基、環烷基或氰基，*表示鍵結位置]

[化3]

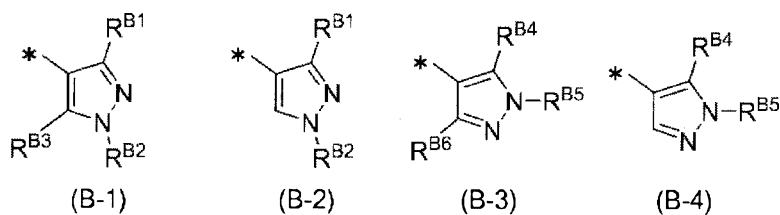


[式中， $R^{B101} \sim R^{B114}$ 可相同或相異為鹵素原子、烷基、烯基、鹵烷基、烷氧基烷基、環烷基或氰基，*表示鍵結位置]。

【第3項】

如請求項2之化合物或其鹽，其中，**B**為選自由下述之式(B-1)~式(B-4)表示之雜環基所成之群組中之雜環基，

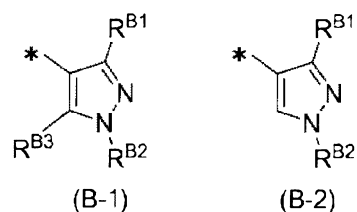
[化4]



【第4項】

如請求項2之化合物或其鹽，其中，B為下述之式(B-1)或式(B-2)表示之基，

[化5]



【第5項】

如請求項4之化合物或其鹽，其中， R^{B1} 為鹵素原子、烷基、烯基、鹵烷基、烷氧基烷基或氰基， R^{B2} 為烷基、鹵烷基或環烷基， R^{B3} 為鹵素原子。

【第6項】

如請求項1之化合物或其鹽，其中，A為被 R^A 取代之苯基。

【第7項】

如請求項1之化合物或其鹽，其中，A為2位及4位之至少一者被 R^A 取代之苯基。

【第8項】

如請求項1之化合物或其鹽，其中，A為可被 Z^1 取代之

苯并二氧環戊基(benzodioxolanyl)。

【第9項】

如請求項1之化合物或其鹽，其中， R^A 為鹵素原子、烷基、鹵烷基或 $-L^A-Y^A$ 。

【第10項】

一種農園藝用殺菌劑，其係將如請求項1之化合物或其鹽做為有效成分含有。

【第11項】

一種防除植物病害之方法，其係將如請求項1之化合物或其鹽施用在植物或土壤。