



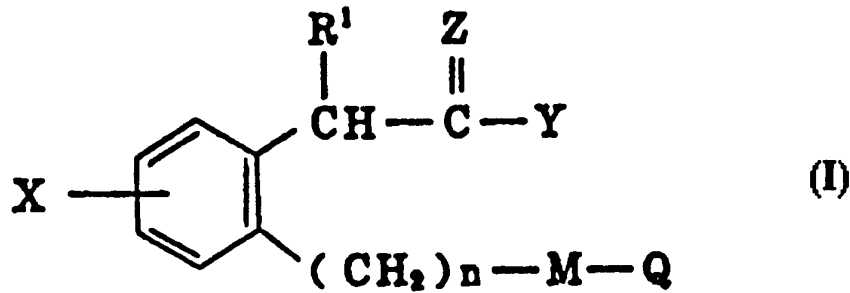
<p>(51) 国際特許分類6 C07C 57/30, 57/58, 59/48, 59/52, 59/64, 69/612, 69/73, 205/53, 229/34, 233/11, 235/32, 317/44, 323/56, 327/04, 327/22, 327/36, 327/40, C07D 211/14, 213/64, 215/14, 231/14, 239/26, 239/34, 239/38, 239/88, 239/93, 239/94, 265/30, 277/68, 295/125, 307/83, 311/76, 313/08, A01N 37/00, 43/00</p>	<p>A1</p>	<p>(11) 国際公開番号 WO95/27693</p> <p>(43) 国際公開日 1995年10月19日 (19.10.95)</p>											
<p>(21) 国際出願番号 PCT/JP95/00663 (22) 国際出願日 1995年4月6日 (06.04.95)</p> <p>(30) 優先権データ</p> <table border="0"> <tr> <td>特願平6/68432</td> <td>1994年4月6日 (06.04.94)</td> <td>JP</td> </tr> <tr> <td>特願平6/155791</td> <td>1994年7月7日 (07.07.94)</td> <td>JP</td> </tr> <tr> <td>特願平6/271198</td> <td>1994年11月4日 (04.11.94)</td> <td>JP</td> </tr> <tr> <td>特願平7/11790</td> <td>1995年1月27日 (27.01.95)</td> <td>JP</td> </tr> </table> <p>(71) 出願人 (米国を除くすべての指定国について) 塩野義製薬株式会社(SHIONOGI & CO., LTD.)(JP/JP) 〒541 大阪府大阪市中央区道修町3丁目1番8号 Osaka, (JP)</p> <p>(72) 発明者: および (75) 発明者/出願人 (米国についてのみ) 大塚俊一(OHTSUKA, Toshikazu)(JP/JP) 〒520-34 滋賀県甲賀郡甲賀町大字大原中833番地181 Shiga, (JP) 村司孝己(MURASHI, Takami)(JP/JP) 〒520-32 滋賀県甲賀郡甲西町大字三雲1496番地102 Shiga, (JP) 鈴木慎司(SUZUKI, Shinji)(JP/JP) 〒520-34 滋賀県甲賀郡甲賀町大字油日2496 Shiga, (JP)</p>	特願平6/68432	1994年4月6日 (06.04.94)	JP	特願平6/155791	1994年7月7日 (07.07.94)	JP	特願平6/271198	1994年11月4日 (04.11.94)	JP	特願平7/11790	1995年1月27日 (27.01.95)	JP	<p>益子道生(MASUKO, Michio)(JP/JP) 〒528 滋賀県甲賀郡水口町水口614-18 Shiga, (JP) 竹中秀行(TAKENAKA, Hideyuki)(JP/JP) 〒518-04 三重県名張市すずらん台東3-137 Mie, (JP)</p> <p>(74) 代理人 弁理士 青山 稔, 外(AOYAMA, Tamotsu et al.) 〒540 大阪府大阪市中央区城見1丁目3番7号 IMPビル 青山特許事務所 Osaka, (JP)</p> <p>(81) 指定国 AM, AU, BB, BG, BR, BY, CA, CN, CZ, EE, FI, GE, HU, IS, JP, KG, KR, KZ, LK, LR, LT, LV, MD, MG, MN, MX, NO, NZ, PL, RO, RU, SG, SI, SK, TJ, TT, UA, US, UZ, VN, 欧州特許(AT, BE, CH, DE, DK, ES, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI特許(BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, ML, MR, NE, SN, TD, TG), ARIPO特許(KE, MW, SD, SZ, UG).</p> <p>添付公開書類 国際調査報告書</p>
特願平6/68432	1994年4月6日 (06.04.94)	JP											
特願平6/155791	1994年7月7日 (07.07.94)	JP											
特願平6/271198	1994年11月4日 (04.11.94)	JP											
特願平7/11790	1995年1月27日 (27.01.95)	JP											

(54) Title: α-SUBSTITUTED PHENYLACETIC ACID DERIVATIVE, PROCESS FOR PRODUCING THE SAME, AND AGRICULTURAL BACTERICIDE CONTAINING THE SAME

(54) 発明の名称 α-置換フェニル酢酸誘導体、その製造法ならびにそれを含有する農業用殺菌剤

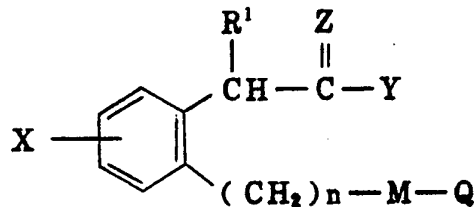
(57) Abstract

An α-substituted phenylacetic acid derivative useful as an agricultural bactericide, represented by general formula (I), or a salt thereof, a process for producing the same, an intermediate for the production thereof, and an agricultural bactericide containing the same as the active ingredient, wherein R¹ represents halogen, alkyl, OH, alkylthio, alkylsulfinyl, alkylsulfonyl, amino or nitro; Q represents aryl, heterocycle, mono- or disubstituted methyleneamino, (substituted amino-)methyl, alkyl, alkenyl, alkynyl, substituted carbonyl or substituted sulfonyl; X represents hydrogen, halogen, alkyl or OH; Y represents OH, alkylthio or amino; Z represents oxygen or sulfur; M represents oxygen, S(O)_i (i being 0, 1 or 2), NR² (R² being hydrogen, alkyl or acyl) or a single bond; and n represents 0, 1 or 2.



(57) 要約

農業用殺菌剤として有用な下記式 (I) で表される α -置換フェニル酢酸誘導体、その製造法、その製造用中間体、およびそれを有効成分として含有する農業用殺菌剤。



(I)

〔式中、 R^1 はハロゲン、アルキル、OH、アルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、アミノまたはニトロ；Q はアリール、ヘテロ環、モノまたはジ置換メチレンアミノ、(置換イミノ)メチル、アルキル、アルケニル、アルキニル、置換カルボニルまたは置換スルホニル；X は水素、ハロゲン、アルキルまたはOH；Y はOH、アルキルチオまたはアミノ(ただし、 R^1 がOHの場合、Y はアルコキシではない)；Z は酸素または硫黄；M は酸素、 $\text{S}(\text{O})_i$ (i は0、1または2)、 NR^2 (R^2 は水素、アルキルまたはアシル)または単結合；およびn は0、1または2を示す〕で表される化合物またはその塩。

情報としての用途のみ

PCTに基づいて公開される国際出願をパンフレット第一頁にPCT加盟国を同定するために使用されるコード

AM	アルメニア	EE	エストニア	LK	スリランカ	RU	ロシア連邦
AT	オーストリア	ES	スペイン	LR	リベリア	SD	スーダン
AU	オーストラリア	FI	フィンランド	LT	リトアニア	SE	スウェーデン
BB	バルバドス	FR	フランス	LU	ルクセンブルグ	SG	シンガポール
BE	ベルギー	GA	ガボン	LV	ラトヴィア	SI	スロヴェニア
BF	ブルキナ・ファソ	GB	イギリス	MC	モナコ	SK	スロバキア共和国
BG	ブルガリア	GE	グルジア	MD	モルドバ	SN	セネガル
BJ	ベナン	GN	ギニア	MG	マダガスカル	SZ	スワジランド
BR	ブラジル	GR	ギリシャ	ML	マリ	TD	チュニジア
BY	ベラルーシ	HU	ハンガリー	MN	モンゴル	TG	トゴ
CA	カナダ	IE	アイルランド	MR	モーリタニア	TJ	タジキスタン
CF	中央アフリカ共和国	IS	アイスランド	MW	モザンビーク	TM	トルクメニスタン
CG	コンゴ	IT	イタリア	MX	メキシコ	TT	トリニダード・トバゴ
CH	スイス	JP	日本	NE	ニジェール	UA	ウクライナ
CI	コート・ジボアール	KE	ケニア	NL	オランダ	UG	ウガンダ
CM	カメルーン	KG	キルギスタン	NO	ノルウェー	US	米国
CN	中国	KP	朝鮮民主主義人民共和国	NZ	ニュージーランド	UZ	ウズベキスタン共和国
CZ	チェコ共和国	KR	大韓民国	PL	ポーランド	VN	ベトナム
DE	ドイツ	KZ	カザフスタン	PT	ポルトガル		
DK	デンマーク	LI	リヒテンシュタイン	RO	ルーマニア		

明 細 書

α -置換フェニル酢酸誘導体、その製造法ならびにそれを含有する農業用殺菌剤

技術分野

本発明は、新規 α -置換フェニル酢酸誘導体、その製造法ならびにそれを有効成分として含有する農業用殺菌剤に関する。

背景技術

ある種の α -置換フェニル酢酸エステル誘導体は、既に、特開昭60-54949号およびDE 2742065に記載されているが、これらはいずれも該フェニル基の3位に置換基を有するものであり、2位に置換基を有する化合物は開示されていない。また特開平3-17052号および特開平3-157350号も α -置換フェニル酢酸エステル誘導体を開示するが、これは2-ヒドロキシ-2-フェニル酢酸またはその酢酸エステルを開示し、それらがいずれも中間体または殺虫剤として開示されているにすぎず、殺菌活性を有することは何ら開示されていない。

また、特開平4-288045号、特開平4-261147号、WO93/15046、EP-A-498396、特開平3-169842号、EP-A-532022、特開平7-17930号およびEP-A-619301にもこれら類縁化合物が開示されている。

本発明は、優れた殺菌活性を有する新規化合物、その製造法、およびそれを有効成分として含有する農業用殺菌剤を提供することを目的とする。

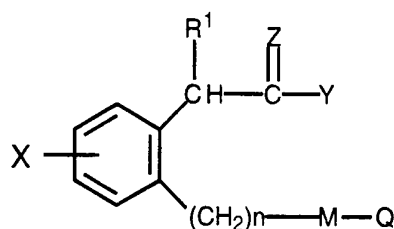
発明の開示

かかる事情に鑑み、本発明者らは、優れた殺菌活性を有する化合物を得

るために鋭意研究を重ねた結果、フェニル基が2位で置換された新規 α -置換フェニル酢酸誘導体が、強力な殺菌活性を有することを見出し、本発明を完成した。

すなわち、本発明は、

1. 一般式 (I) :



(I)

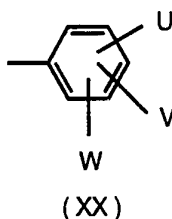
[式中、R¹はハロゲン原子、置換されていてもよいアルキル基、置換されていてもよい水酸基、アルキルチオ基、アルキルスルフィニル基、アルキルスルホニル基、置換されていてもよいアミノ基またはニトロ基；Qは置換されていてもよいアリール基、置換されていてもよいヘテロ環基、モノ置換またはジ置換メチレンアミノ基、置換されていてもよい(置換イミノ)メチル基、置換されていてもよいアルキル基、置換されていてもよいアルケニル基、置換されていてもよいアルキニル基、置換カルボニル基または置換スルホニル基；Xは水素原子、ハロゲン原子、置換されていてもよいアルキル基または置換されていてもよい水酸基；Yは置換されていてもよい水酸基、アルキルチオ基または置換されていてもよいアミノ基(ただし、R¹が水酸基の場合、Yはアルコキシ基ではない)；Zは酸素原子または硫黄原子；Mは酸素原子、S(O)_i(iは0、1または2)、NR²(R²は水素原子、アルキル基またはアシル基)または単結合；およびnは0、1または2を示す]で表される化合物またはその塩、

2. R^1 がハロゲン原子、アルキル基、ハロアルキル基、アルコキシアルキル基、水酸基、アルコキシ基、アルケニルオキシ基、アルキニルオキシ基、ハロアルコキシ基、ハロアルケニルオキシ基、ハロアルキニルオキシ基、アルコシアルコキシ基、アルキルカルボニルオキシ基、(アルキルチオ)カルボニルオキシ基、アルキルスルホニルオキシ基、アリールスルホニルオキシ基、モノあるいはジアルキル置換カルバモイルオキシ基、アリーロキシ基、アルキルチオ基、アルキルスルフィニル基、アルキルスルホニル基、アルキル基で置換されていてもよいアミノ基、ニトロ基またはテトラヒドロピラニルオキシ基である上記1記載の化合物またはその塩、

3. R^1 がアルコキシ基である上記1記載の化合物またはその塩、

4. R^1 がメトキシ基である上記1記載の化合物またはその塩、

5. Qが一般式 (XX) :



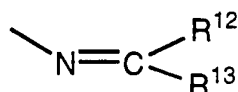
[式中、U、VおよびWは同一または異なって、水素原子、ハロゲン原子、置換されていてもよいアルキル基、置換されていてもよい水酸基、アルキルチオ基、または置換されていてもよいアミノ基を示す]で表される基である上記1記載の化合物またはその塩、

6. U、VおよびWが同一または異なって、水素原子、塩素原子、メチル基、トリフルオロメチル基またはメトキシ基である上記5記載の化合物またはその塩、

7. Qがそれぞれ置換されていてもよいピリジル基、ピリミジニル基、キノリル基、キナゾリニル基、ベンゾチアゾリル基またはピラゾリル基である上記1記載の化合物またはその塩、

8. Qが置換されていてもよいピリジル基である上記1記載の化合物またはその塩、

9. Qが式 (a) :



(a)

[式中、 R^{12} および R^{13} は同一または異なって水素原子、置換されていてもよいアルキル基、アシル基、アルキルチオ基、アルキルスルフィニル基、アルキルスルホニル基、置換されていてもよいアミノ基、シクロアルキル基、置換されていてもよいアリール基または置換されていてもよいヘテロ環基を示すか、あるいは R^{12} と R^{13} が結合してヘテロ原子が含まれていてもよい単環または多環を形成していることを示す。]で表される基である上記1記載の化合物またはその塩、

10. R^{12} および R^{13} が同一または異なって水素原子、アルキル基、ハロアルキル基、アルコキシアルキル基、アルキルカルボニル基、置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいナフチル基または置換されていてもよいヘテロ環基であるか、あるいは R^{12} と R^{13} が結合して、他の環と縮合していてもよいシクロペンタン環またはシクロヘキサン環を形成している上記9記載の化合物またはその塩、

11. R^{12} がアルキル基である上記9記載の化合物またはその塩、

12. R^{12} がメチル基またはエチル基である上記9記載の化合物またはその塩、

13. R^{13} が、ハロゲン原子、置換されていてもよいアルキル基、置換されていてもよい水酸基、アルキルチオ基、置換されていてもよいアミノ基、ニトロ基、フェニル基およびシアノ基からなる群から選択される1～3個の置換基を有していてもよいフェニル基である上記9記載の化合物またはその塩、

14. R^{13} が、塩素原子、メチル基、トリフルオロメチル基およびメトキシ基からなる群から選択される1～3個の置換基を有していてもよいフェニル基である上記9記載の化合物またはその塩、

15. R^{13} が、それぞれ置換されていてもよいピリジル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基、ピリミジニル基、フリル基、チエニル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、キノリル基、キナゾリニル基、ピラジニル基、モルホリノ基またはピペラジニル基である上記9記載の化合物またはその塩、

16. Xが水素原子である上記1記載の化合物またはその塩、

17. Yがアルコキシ基である上記1記載の化合物またはその塩、

18. Yがメトキシ基である上記1記載の化合物またはその塩、

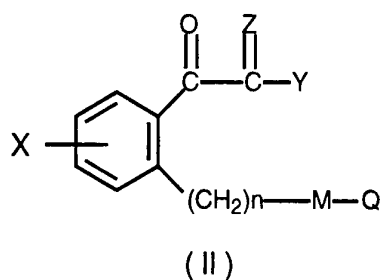
19. Yがモノアルキルアミノ基である上記1記載の化合物またはその塩、

20. Yがモノメチルアミノ基である上記1記載の化合物またはその塩、

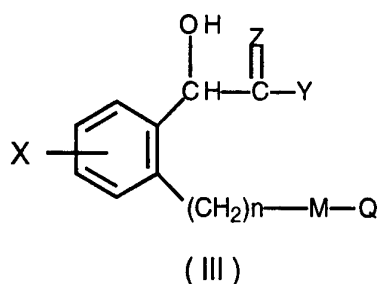
21. Zが酸素原子である上記1記載の化合物またはその塩、

22. Mが酸素原子、硫黄原子または置換されていてもよいアミノ基である上記1記載の化合物またはその塩、

23. nが0である上記1記載の化合物またはその塩、
 24. nが1である上記1記載の化合物またはその塩、
 25. 請求項1記載の化合物を有効成分として含有することを特徴とする農業用殺菌剤、
 26. 一般式 (I I) :

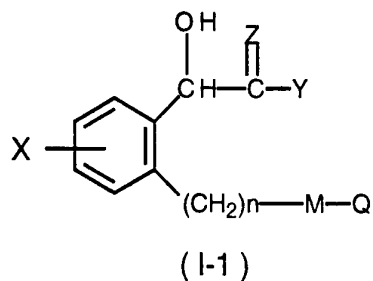


[式中、各記号は上記1と同意義]で表される化合物を還元することを特徴とする一般式 (I I I) :



[式中、各記号は上記1と同意義]で表される化合物の製造法、

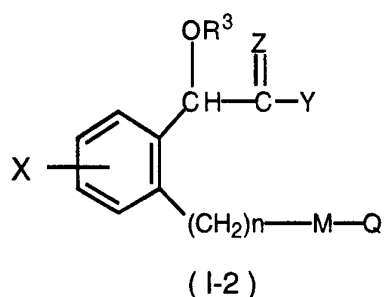
27. 一般式 (I-1) :



[式中、各記号は上記1と同意義]で表される化合物を、一般式 (X X I I) :

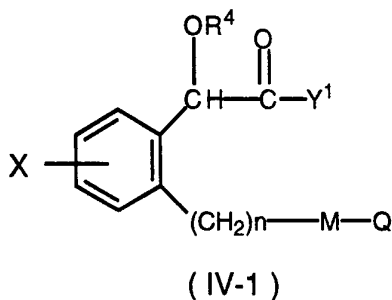


[式中、 R^3 はアルキル基、アルケニル基、アルキニル基、ハロアルキル基、アルコキシアルキル基、アルキルカルボニル基、(アルキルチオ)カルボニル基、アルキルスルホニル基、アリールスルホニル基、またはモノあるいはジアルキル置換カルバモイル基；およびLは脱離基を示す]で表される化合物と反応させることを特徴とする一般式 (I-2) :

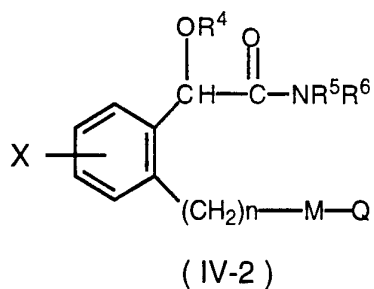


[式中、各記号は上記と同意義]で表される化合物の製造法、

28. 一般式 (IV-1) :

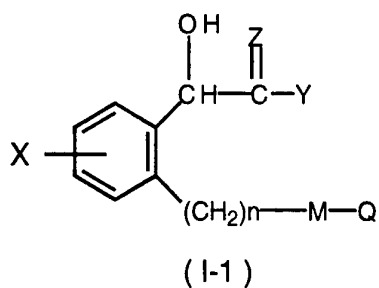


[式中、 R^4 はアルキル基、アルケニル基、アルキニル基、ハロアルキル基またはアルコキシアルキル基；および Y^1 はアルコキシ基またはアルキルチオ基を示す]で表される化合物をアミン類と反応させることを特徴とする一般式 (IV-2) :

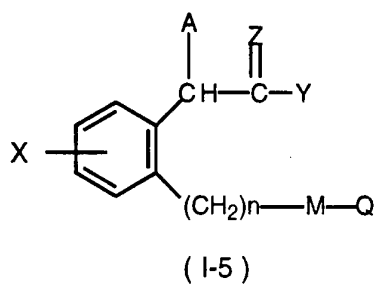


[式中、 R^5 は水素原子またはアルキル基、 R^6 は水素原子、アルキル基またはヒドロキシルアルキル基を示し、他の記号は上記と同意義]で表される化合物の製造法、

29. 一般式 (I - 1) :

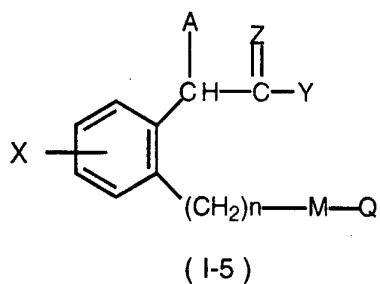


[式中、各記号は上記1と同意義]で表される化合物をハロゲン化することを特徴とする一般式 (I - 5) :

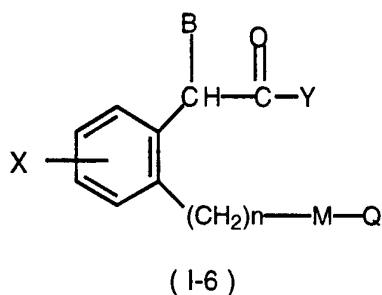


[式中、Aはハロゲン原子を示し、他の記号は上記1と同意義]で表される化合物の製造法、

30. 一般式 (I - 5) :

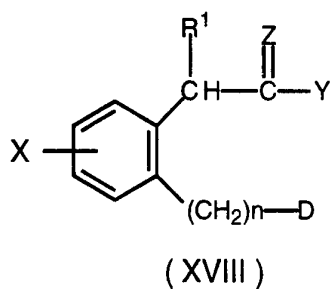


[式中、Aはハロゲン原子を示し、他の記号は上記1と同意義]で表される化合物を求核剤と反応させることを特徴とする一般式 (I - 6) :



[式中、Bはアルコキシ基、アルケニルオキシ基、アルキニルオキシ基、ハロアルコキシ基、アルコキシアルコキシ基、アルキルチオ基、アルキル基で置換されていてもよいアミノ基またはニトロ基を示し、他の記号は上記1と同意義]で表される化合物の製造法、

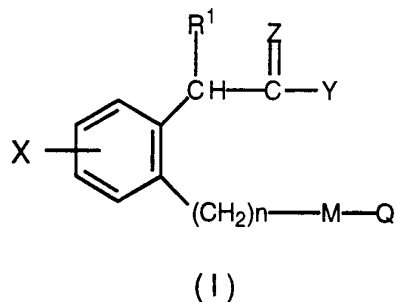
31. 一般式 (XVIIII) :



[式中、Dはハロゲン原子を示し、他の記号は上記1と同意義]で表される化合物を一般式 (XIX) :

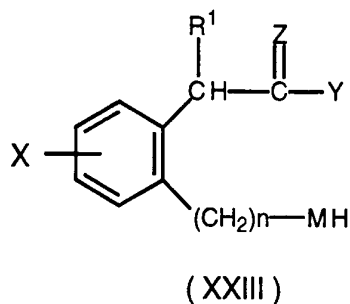


[式中、各記号は上記 1 と同意義]で表される化合物と反応させることを特徴とする一般式 (I) :



[式中、各記号は上記 1 と同意義]で表される化合物の製造法、

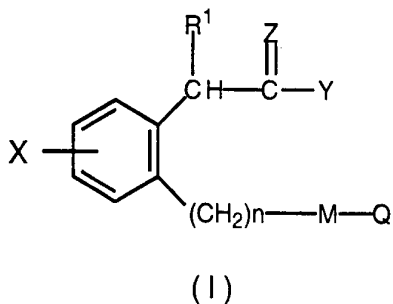
32. 一般式 (XXIII) :



[式中、各記号は上記 1 と同意義]で表される化合物を一般式 (XXIV) :

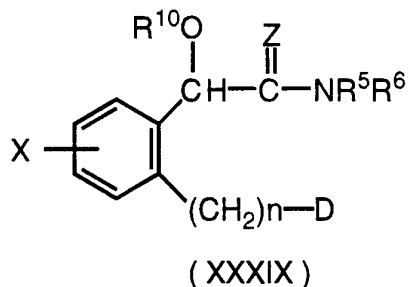


[式中、Lは脱離基を示し、Qは上記 1 と同意義]で表される化合物と反応させることを特徴とする一般式 (I) :



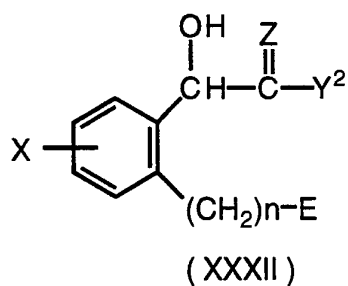
[式中、各記号は上記1と同意義]で表される化合物の製造法、

33. 一般式 (XXXIX) :



[式中、R⁵は水素原子またはアルキル基、R⁶は水素原子、アルキル基またはヒドロキシルアルキル基、R¹⁰は置換されていてもよいアルキル基、置換されていてもよいアルケニル基または置換されていてもよいアルキニル基、Dはハロゲン原子を示し、他の記号は上記1と同意義]で表される化合物またはその塩、

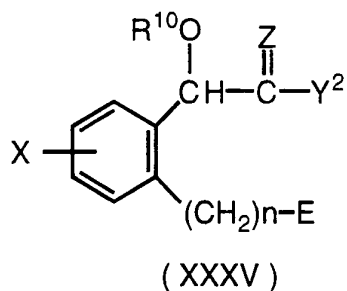
34. 一般式 (XXXII) :



[式中、Y²はアルコキシ基、Eは保護されている水酸基を示し、他の記号は上記1と同意義]で表される化合物またはその塩、

35. Eがテトラヒドロピラニルオキシ基または1-エトキシエトキシ基である上記34記載の化合物またはその塩、

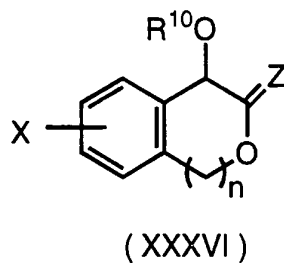
36. 一般式 (XXXV) :



[式中、 R^{10} は置換されていてもよいアルキル基、置換されていてもよいアルケニル基または置換されていてもよいアルキニル基、 Y^2 はアルコキシ基、Eは保護されている水酸基を示し、他の記号は上記1と同意義]で表される化合物またはその塩、

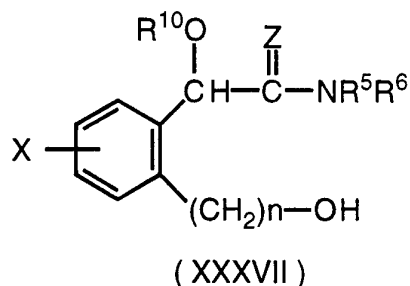
37. Eがテトラヒドロピラニルオキシ基または1-エトキシエトキシ基である上記36記載の化合物またはその塩、

38. 一般式 (XXXVI) :



[式中、 R^{10} は置換されていてもよいアルキル基、置換されていてもよいアルケニル基または置換されていてもよいアルキニル基を示し、他の記号は上記1と同意義]で表される化合物またはその塩、

39. 一般式 (XXXVII) :



[式中、 R^5 は水素原子またはアルキル基、 R^6 は水素原子、アルキル基またはヒドロキシルアルキル基、 R^{10} は置換されていてもよいアルキル基、置換されていてもよいアルケニル基または置換されていてもよいアルキニル基を示し、他の記号は上記1と同意義]で表される化合物またはその塩、および

40. Zが酸素原子である上記33～39のいずれか1項に記載の化合物またはその塩に関する。

R^1 で示されるハロゲン原子としては、フッ素、塩素、臭素あるいはヨウ素が挙げられる。

R^1 で示される置換されていてもよいアルキル基としては、例えば炭素数1～8、好ましくは炭素数1～4のアルキル基が挙げられる。具体的には、例えばメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、t-ブチル、ペンチル、ヘキシルなどが挙げられる。このうちメチルおよびエチルが特に好ましい。置換アルキル基としては、例えば、置換基としてハロゲン原子(例、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、好ましくはフッ素)を有するハロアルキル基(例、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロメチル、2-ブロモエチル、2,3-ジクロロプロピルなど)；置換基として炭素数1～8、好ましくは炭素数1～4のアルコキシ基(例、

メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシなど) を有するアルコキシアルキル基 (例、メトキシメチル、エトキシメチル、メトキシエチルなど) などが挙げられる。このうち、ハロアルキル基としてはトリフルオロメチルが、アルコキシアルキル基としてはメトキシメチルが好ましい。

R^1 で示される置換されていてもよい水酸基としては、例えば水酸基、置換されていてもよいアルコキシ基、置換されていてもよいアルケニルオキシ基、置換されていてもよいアルキニルオキシ基、アルキルカルボニルオキシ基、(アルキルチオ)カルボニルオキシ基、アルキルスルホニルオキシ基、アリールスルホニルオキシ基、モノあるいはジアルキル置換カルバモイルオキシ基、アリーロキシ基、テトラヒドロピラニルオキシ基などが挙げられる。

該置換されていてもよいアルコキシ基としては、例えば炭素数1~8、好ましくは炭素数1~4のアルコキシ基、具体的には、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、ブトキシ、イソブトキシ、*t*-ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシルオキシなど；置換基としてハロゲン原子(例、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、好ましくはフッ素)を有するハロアルコキシ基、具体的には、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、クロロメトキシなど；置換基として炭素数1~8、好ましくは炭素数1~4のアルコキシ基(例、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシなど)を有するアルコキシアルコキシ基、具体的には、メトキシメトキシ、2-メトキシエトキシ、エトキシメトキシなどが挙げられる。このうち、アルコキシ基としてはメトキシ、エトキシおよびブトキシ、特にメトキシ好ましく、ハロアルコキシ基としてはジフルオロメトキシが好ましく、アルコキシアルコキシ基としてはメトキシメトキシが好ましい。

該置換されていてもよいアルケニルオキシ基としては、例えば炭素数2

～8、好ましくは炭素数2～4のアルケニルオキシ基、具体的には、ビニルオキシ、アリルオキシ、プロペニルオキシ、イソプロペニルオキシ、ブテニルオキシ、イソブテニルオキシ、ペンテニルオキシ、ヘキセニルオキシ、ヘキサジエニルオキシなど；置換基としてハロゲン原子（例、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素）を有するハロアルケニルオキシ基、具体的には、3,3-ジクロロ-2-プロペニルオキシ、4,4,4-トリフルオロメチル-2-ブテニルオキシなどが挙げられる。このうち、アリルオキシが好ましい。

該置換されていてもよいアルキニルオキシ基としては、例えば炭素数2～8、好ましくは炭素数2～4のアルキニルオキシ基、具体的には、エチニルオキシ、プロパルギルオキシ、ブチニルオキシなど；置換基としてハロゲン原子（例、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素）を有するハロアルキニルオキシ基、具体的には、3-クロロ-2-プロピニルオキシ、4,4,4-トリフルオロメチル-2-ブチニルオキシなどが挙げられる。このうち、プロパルギルオキシが好ましい。

該アルキルカルボニルオキシ基としては、炭素数1～8、好ましくは炭素数1～4のアルキル基を含有するアルキルカルボニルオキシ基、具体的には、アセトキシ、プロピオニルオキシ、ブチリルオキシなどが挙げられる。このうち、アセトキシが好ましい。

該（アルキルチオ）カルボニルオキシ基としては、炭素数1～8、好ましくは炭素数1～4のアルキル基を含有する（アルキルチオ）カルボニルオキシ基、具体的には、（メチルチオ）カルボニルオキシ、（エチルチオ）カルボニルオキシ、（プロピルチオ）カルボニルオキシなどが挙げられる。このうち（メチルチオ）カルボニルオキシが好ましい。

該アルキルスルホニルオキシ基としては、炭素数1～8、好ましくは炭

素数1～4のアルキル基を含有するアルキルスルホニルオキシ基、具体的には、メタンスルホニルオキシ、エタンスルホニルオキシ、プロパンスルホニルオキシなどが挙げられる。このうち、メタンスルホニルオキシが好ましい。

該アリールスルホニルオキシ基としては、炭素数6～12、好ましくは炭素数6～8のアリール基を含有するアリールスルホニルオキシ基、具体的には、ベンゼンスルホニルオキシ、p-トルエンスルホニルオキシなどが挙げられる。このうち、p-トルエンスルホニルオキシが好ましい。

該モノあるいはジアルキル置換カルバモイルオキシ基としては、例えば炭素数1～8、好ましくは炭素数1～4のアルキル基を含有するモノあるいはジアルキル置換カルバモイルオキシ基、具体的には、N-モノメチルカルバモイルオキシ、N,N-ジメチルカルバモイルオキシ、N-モノエチルカルバモイルオキシなどが挙げられる。このうち、N,N-ジメチルカルバモイルオキシが好ましい。

該アリールオキシ基としては、例えば炭素数6～12、好ましくは炭素数6～8のアリールオキシ基、具体的には、フェノキシ、2-メチルフェノキシ、2,5-ジメチルフェノキシなどが挙げられる。

該テトラヒドロピラニルオキシ基としては、例えば2-テトラヒドロピラニルオキシなどが挙げられる。

R¹で示されるアルキルチオ基としては、例えば炭素数1～8、好ましくは炭素数1～4のアルキルチオ基、具体的には、メチルチオ、エチルチオ、プロピルチオ、ブチルチオが挙げられる。このうち、メチルチオが好ましい。

R¹で示されるアルキルスルフィニル基としては、例えば炭素数1～8、好ましくは炭素数1～4のアルキルスルフィニル基、具体的には、メチル

スルフィニル、エチルスルフィニル、プロピルスルフィニルなどが挙げられる。このうち、メチルスルフィニルが好ましい。

R^1 で示されるアルキルスルホニル基としては、例えば炭素数1～8、好ましくは炭素数1～4のアルキルスルホニル基、具体的には、メチルスルホニル、エチルスルホニル、プロピルスルホニルなどが挙げられる。このうち、メチルスルホニルが好ましい。

R^1 で示される置換されていてもよいアミノ基としては、例えばアミノ基、炭素数1～8、好ましくは炭素数1～4のアルキル基でモノまたはジ置換されているアミノ基（例、モノメチルアミノ、ジメチルアミノ、モノエチルアミノなど）、ホルミル基でモノ置換されているアミノ基、炭素数2～8、好ましくは炭素数2～4のアルキルカルボニル基でモノ置換されているアミノ基（例、メチルカルボニルアミノなど）などが挙げられる。このうち、炭素数1～4のアルキル基で置換されたものが好ましく、モノメチルアミノが特に好ましい。

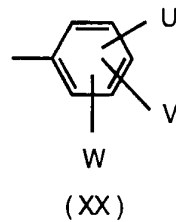
R^1 は、好ましくは、ハロゲン原子、アルキル基、ハロアルキル基、アルコキシアリル基、水酸基、アルコキシ基、アルケニルオキシ基、アルキニルオキシ基、ハロアルコキシ基、ハロアルケニルオキシ基、ハロアルキニルオキシ基、アルコキシアルコキシ基、アルキルカルボニルオキシ基、（アルキルチオ）カルボニルオキシ基、アルキルスルホニルオキシ基、アリールスルホニルオキシ基、モノあるいはジアルキル置換カルバモイルオキシ基、アリールオキシ基、アルキルチオ基、アルキルスルフィニル基、アルキルスルホニル基、アルキル基で置換されていてもよいアミノ基、ニトロ基またはテトラヒドロピラニルオキシ基である。さらに好ましくは、アルコキシ基または水酸基である。このうちメトキシ基が特に好ましい。

Qで示される置換されていてもよいアリール基としては、炭素数6～14のアリール基、例えばフェニル基、ナフチル基などが挙げられる。これらアリール基が置換されている場合の置換基としては、低級(C₁₋₈、好ましくはC₁₋₆、さらに好ましくはC₁₋₄；以下の置換基においても同意義を示す)アルキル基(例、メチル、エチル、プロピル、ブチルなど)、低級アルケニル基(例、ビニル、アリル、クロチルなど)、低級アルキニル基(例、エチニル、プロパルギル、ブチニルなど)、シクロアルキル基(例、シクロプロピル、シクロペンチル、シクロヘキシルなど)、低級アルコキシ低級アルキル基(例、メトキシメチル、エトキシメチル、2-メトキシエチルなど)、シクロアルケニル基(例、シクロペンテニル、シクロヘキセニルなど)、低級アルカノイル基(例、アセチル、プロピオニル、イソブチリルなど)、低級アルキルシリル基(例、トリメチルシリル、トリエチルシリル、トリプロピルシリル、トリブチルシリルなど)、ハロ(低級)アルキル基(例、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロメチル、2-ブロモエチル、2,3-ジクロロプロピルなど)、ジ(低級)アルキルアミノ基(例、ジメチルアミノ、ジエチルアミノなど)、フェニル基、フェニル(低級)アルキル基(例、ベンジル、フェネチルなど)、フェニル(低級)アルケニル基(例、スチリル、シンナミルなど)、フリル(低級)アルキル基(例、3-フリルメチル、2-フリルエチルなど)、フリル(低級)アルケニル基(例、3-フリルビニル、2-フリルアリルなど)、ハロゲン原子(例、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素)、ニトロ、シアノ、低級アルキルチオ基(例、メチルチオ、エチルチオ、プロピルチオなど)、低級アルコキシカルボニル基(例、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、プロポキシカルボニルなど)、ホルミル基、アミノ基、モノ(低級)アルキルアミノ基(例、メチルアミノ、エチルアミノなど)、-OR[式中、Rは、

水素原子、低級アルキル基（例、メチル、エチル、プロピル、ブチルなど）、低級アルケニル基（例、ビニル、アリル、クロチルなど）、低級アルキニル基（例、エチニル、2-プロピニル、3-ブチニルなど）、ハロ(低級)アルキル基（例、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロメチル、2-ブロモエチル、2,3-ジクロロプロピルなど）、低級アルカノイル基（例、アセチル、プロピオニル、ブチリルなど）、フェニル、低級アルコキシフェニル基（例、3-メトキシフェニル、4-エトキシフェニルなど）、ニトロフェニル基（例、3-ニトロフェニル、4-ニトロフェニルなど）、フェニル(低級)アルキル基（例、ベンジル、フェネチル、フェニルプロピルなど）、シアノフェニル(低級)アルキル基（例、3-シアノフェニルメチル、4-シアノフェニルエチルなど）、ベンゾイル、テトラヒドロピラニル、ピリジル、トリフルオロメチルピリジル、ピリミジニル、ベンゾチアゾリル、キノリル、ベンゾイル(低級)アルキル基（例、ベンゾイルメチル、ベンゾイルエチルなど）、ベンゼンスルホニル、または低級アルキルベンゼンスルホニル基（例、トルエンスルホニルなど）、 $-CH_2-G-R'$ [式中、Gは、 $-O-$ 、 $-S-$ 、または $-NR''-$ （ここで R'' は水素原子または低級アルキル基）であり、 R' は、フェニル、ハロフェニル（例、2-クロロフェニル、4-フルオロフェニルなど）、低級アルコキシフェニル基（例、2-メトキシフェニル、4-エトキシフェニルなど）、ピリジル、またはピリミジニルである]などが挙げられる。

これら置換基は、該環の置換可能ないずれの位置にあってもよい。該置換基は1～5個、好ましくは1～4個、さらに好ましくは1～3個であり、これらは同一であっても異なってもよい。

Qで示される置換されていてもよいアリアル基は、好ましくは、一般式 (XX) :



[式中、U、VおよびWは同一または異なって、水素原子、ハロゲン原子、置換されていてもよいアルキル基、置換されていてもよい水酸基、アルキルチオ基、または置換されていてもよいアミノ基を示す]で表される。

U、VおよびWで示されるハロゲン原子としては、例えばフッ素、塩素、臭素、ヨウ素、好ましくは塩素が挙げられる。

U、VおよびWで示される置換されていてもよいアルキル基としては、例えば上記R¹で示される置換されていてもよいアルキル基として例示した基が挙げられる。このうち、アルキル基、ハロアルキル、アルコキシアルキル基が好ましく、メチルまたはエチル、トリフルオロメチルがさらに好ましく、特にメチルが好ましい。

U、VおよびWで示される置換されていてもよい水酸基としては、例えば上記R¹で示される置換されていてもよい水酸基として例示した基が挙げられる。このうち、アルコキシ基、アルケニルオキシ基、アルキニルオキシ基、ハロアルコキシ基またはフェノキシ基が好ましく、アルコキシ基がさらに好ましく、メトキシ基が特に好ましい。

U、VおよびWで示されるアルキルチオ基および置換されていてもよいアミノ基としては、例えば上記R¹で示されるアルキルチオ基および置換されていてもよいアミノ基として例示した基がそれぞれ挙げられる。このうち、メチルチオおよびジメチルアミノがそれぞれ好ましい。

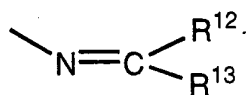
Qで示される置換されていてもよいヘテロ環基としては、例えば、窒素、

酸素および硫黄から選ばれる1～4個のヘテロ原子を環構成原子として含有する5～7員ヘテロ環基が挙げられる。これらのヘテロ環基は、さらに別のヘテロ環またはベンゼン環と縮合環を形成していてもよい。具体的には、それぞれ置換されていてもよいピリジル基（例、ピリジン-2-イル、ピリジン-3-イルなど）、ピリミジニル基（例、ピリミジン-4-イル、ピリミジン-2-イル）、キノリル基（例、キノリン-4-イル、）、キナゾリニル基（例、キナゾリン-4-イル、）、ベンゾチアゾリル基（例、ベンゾチアゾール-2-イル、）、ピラゾリル基（例、ピラゾール-5-イル、）などが挙げられる。このうち、置換されていてもよいピリジル基が好ましい。

これらヘテロ環基が置換されている場合、その置換基としては、上記Qで示されるアリアル基の置換基として例示した基が挙げられる。このうち、ハロゲン原子、ハロ（低級）アルキル基、アルコキシ基、アルコキシカルボニル基またはホルミル基が好ましく、塩素原子またはトリフルオロメチル基がさらに好ましい。これら置換基は、該環の置換可能ないずれの位置にあってもよい。該置換基は1～5個、好ましくは1～4個、さらに好ましくは1～3個であり、これらは同一であっても異なってもよい。

Qで示されるモノ置換またはジ置換メチレンアミノ基は、例えば式

(a) :



(a)

[式中、R¹²およびR¹³は同一または異なって水素原子、置換されていてもよいアルキル基、アシル基、アルキルチオ基、アルキルスルフィニル基、

アルキルスルホニル基、置換されていてもよいアミノ基、シクロアルキル基、置換されていてもよいアリール基または置換されていてもよいヘテロ環基を示すか、あるいは R^{12} と R^{13} が結合してヘテロ原子が含まれていてもよい単環または多環を形成していることを示す（ただし、 R^{12} および R^{13} が同時に水素原子である場合を除く）]で表される。

式(a)中、 R^{12} または R^{13} で示される置換されていてもよいアルキル基としては、例えば上記 R^1 で示されるアルキル基または置換アルキル基と同様の基が挙げられる。このうち、メチルおよびエチルが好ましい。

R^{12} または R^{13} で示されるアシル基としては、例えばアルキルカルボニル基、アリールカルボニル基などが挙げられる。該アルキルカルボニル基としては、例えば C_{1-6} アルキル-カルボニル基、好ましくは C_{1-4} アルキル-カルボニル基、具体的には、例えばアセチル、トリフルオロアセチル、プロピオニル、ブチリルなどが挙げられる。該アリールカルボニル基としては、例えば C_{6-14} アリール-カルボニル基、具体的には、例えばベンゾイル、ナフトイルなどが挙げられる。

R^{12} または R^{13} で示されるアルキルチオ基、アルキルスルフィニル基、アルキルスルホニル基、置換されていてもよいアミノ基としては、それぞれ R^1 で示されるアルキルチオ基、アルキルスルフィニル基、アルキルスルホニル基、置換されていてもよいアミノ基と同様の基が挙げられる。

R^{12} または R^{13} で示されるシクロアルキル基としては、炭素数3~7、好ましくは炭素数5~6のシクロアルキル基、具体的には、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチルな

どが挙げられる。

R^{12} または R^{13} で示される置換されていてもよいアリール基としては、例えば C_{6-14} アリール基、具体的には、例えばフェニル、ナフチル（例、1-ナフチルなど）、フルオレニルなどが挙げられる。このうち、フェニルが好ましい。該アリール基は、これら環基の可能ないずれの位置で置換されていてもよく、置換基の数は1～3個である。置換基の具体例としては、ハロゲン原子、置換されていてもよいアルキル基、置換されていてもよい水酸基、アルキルチオ基、置換されていてもよいアミノ基、ニトロ基、フェニル基、シアノ基などが挙げられる。

R^{12} または R^{13} で示される置換されていてもよいアリール基の置換基としてのハロゲン原子としては、例えば、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素が挙げられる。

R^{12} または R^{13} で示される置換されていてもよいアリール基の置換基としての置換されていてもよいアルキル基としては、例えば、上記 R^1 で示される置換されていてもよいアルキル基と同様の基が挙げられる。このうち、アルキル基またはハロアルキル基が好ましく、特にメチルまたはトリフルオロメチルが好ましい。

R^{12} または R^{13} で示される置換されていてもよいアリール基の置換基としての置換されていてもよい水酸基としては、例えば、水酸基、アルコキシ基、アルケニルオキシ基、アルキニルオキシ基、ハロアルコキシ基、アリールオキシ基などが挙げられる。該アルコキシ基としては、例えば炭素数1～8、好ましくは炭素数1～4のアルコキシ基、具体的には、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシなどが挙げられる。このうちメトキ

シが好ましい。該アルケニルオキシ基としては、例えば炭素数2～8、好ましくは炭素数2～4のアルケニルオキシ基、具体的には、ビニルオキシ、アリルオキシ、クロチルオキシなどが挙げられる。このうち、アリルオキシが好ましい。該アルキニルオキシ基としては、例えば炭素数2～8、好ましくは炭素数2～4のアルキニルオキシ基、具体的には、エチニルオキシ、プロパルギルオキシ、ブチニルオキシなどが挙げられる。このうち、プロパルギルオキシが好ましい。該ハロアルコキシ基としては、上記アルコキシ基が少なくとも1個のハロゲン原子（例、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素）で置換されたもの、具体的には、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、クロロメトキシなどが挙げられる。このうち、ジフルオロメトキシが好ましい。該アリールオキシ基としては、例えば炭素数6～12、好ましくは炭素数6～8のアリールオキシ基、具体的には、フェノキシ、ナフトキシなどが挙げられる。

R^{12} または R^{13} で示される置換されていてもよいアリール基の置換基としてのアルキルチオ基としては、例えば、炭素数1～8、好ましくは炭素数1～4、さらに好ましくは炭素数1～2のアルキルチオ基が挙げられる。具体的には、例えば、メチルチオ、エチルチオ、プロピルチオ、ブチルチオなどが挙げられる。このうち、メチルチオが好ましい。

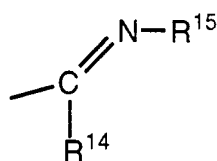
R^{12} または R^{13} で示される置換されていてもよいアリール基の置換基としての置換されていてもよいアミノ基としては、例えば、アミノ基、炭素数1～8、好ましくは炭素数1～4のアルキル基でモノまたはジ置換されているアミノ基（例、モノメチルアミノ、ジメチルアミノ、モノエチルアミノなど）などが挙げられる。

R^{12} または R^{13} で示される置換されていてもよいヘテロ環基としては、

例えば、環内に1～4個、好ましくは1～2個のヘテロ原子（例、酸素、窒素、硫黄など）を含有するヘテロ環基が挙げられる。これらヘテロ環基は、該環の可能ないずれの位置に結合手を有していてもよい。該ヘテロ環基の具体例としては、例えば、ピリジル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基、ピリミジニル基、フリル基、チエニル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、キノリル基、キナゾリニル基、ピラジニル基、モルホリノ基、ピペラジニル基などが挙げられる。このうち、フリル基（例、2-フリルなど）、チエニル基（例、2-チエニルなど）、ピリジル基（2-ピリジルなど）、ピラジニル基（例、2-ピラジニルなど）、ピリミジニル基（例、2-ピリミジニルなど）、モルホリノ基が好ましい。該ヘテロ環基は置換されていてもよく、置換基としては、 R^{12} または R^{13} で示される置換されていてもよいアリール基の置換基と同様の基が挙げられる。

R^{12} と R^{13} が結合して形成されるヘテロ原子が含まれていてもよい単環または多環は、 R^{12} および R^{13} とこれらが結合する炭素原子と共に形成される、ヘテロ原子（例、酸素、窒素、硫黄など）を含有していてもよい4～8員環であり、該環は他の環と縮合環を形成していてもよい。該環の具体例としては、シクロペンタン、シクロヘキサン、インダン、1,2,3,4-テトラヒドロナフタレン、5,6,7,8-テトラヒドロキノリン、4,5,6,7-テトラヒドロベンゾ[b]フランなどが挙げられる。これらの環は、その可能ないずれの位置に2価の結合手を有していてもよい。

Qで示される置換されていてもよい（置換イミノ）メチル基は、例えば式（b）：



(b)

[式中、 R^{14} および R^{15} はそれぞれ上記 R^{12} および R^{13} と同意義]で表される。

Qで示される置換されていてもよいアルキル基のアルキル基としては、上記 R^1 で示されるアルキル基が挙げられる。Qで示される置換されていてもよいアルケニル基のアルケニル基としては、例えば、炭素数2～8、好ましくは炭素数3～6のアルケニル基、具体的には、アリル、プロペニル、イソプロペニル、ブテニル、イソブテニル、ペンテニル、ヘキセニル、ヘキサジエニルなどが挙げられる。Qで示される置換されていてもよいアルキニル基のアルキニル基としては、例えば、炭素数2～6、好ましくは炭素数2～4のアルキニル基、具体的には、プロパルギル、エチニル、ブチニルなどが挙げられる。これらアルキル基、アルケニル基、アルキニル基が置換されている場合の置換基としては、例えば、それぞれ上記 R^1 として例示したハロゲン原子、アルコキシ基、アルキルチオ基、アルキルスルフィニル基、アルキルスルホニル基、置換されたアミノ基、それぞれ上記Qとして例示した置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいナフチル基、置換されていてもよいヘテロ環基などが挙げられる。

Qで示される置換カルボニル基としては、例えば、(置換されていてもよいアルキル)カルボニル基、(置換されていてもよいフェニル)カルボニル基、(置換されていてもよいナフチル)カルボニル基、(置換されていてもよいヘテロ環基)カルボニル基などが挙げられる。

Qで示される置換スルホニル基としては、例えば、（置換されていてもよいアルキル）スルホニル基、（置換されていてもよいフェニル）スルホニル基、（置換されていてもよいナフチル）スルホニル基、（置換されていてもよいヘテロ環基）スルホニル基などが挙げられる。

これら置換カルボニル基または置換スルホニル基中の置換されていてもよいアルキル基としては上記R¹で例示した基が、置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいナフチル基、置換されていてもよいヘテロ環基としては各々上記Qとして例示した基が挙げられる。

Qは、好ましくは、一般式(X X)で表される基、それぞれ置換されていてもよいピリジル基、ピリミジニル基、キノリル基、キナゾリニル基、ベンゾチアゾリル基またはピラゾリル基、または式(a)で表される基である。

Xは水素原子、ハロゲン原子、置換されていてもよいアルキル基または置換されていてもよい水酸基を示すが、これは、上記一般式(I)中のフェニレン基が非置換の場合（すなわちXが水素原子の場合）のほか、フェニレン基がハロゲン原子、置換されていてもよいアルキル基および置換されていてもよい水酸基から選ばれる1～3個の置換基で可能ないずれかの位置で置換されている場合を包含する意である。該置換基が2個または3個の場合、これらは同一または異なってもよい。

Xで示されるハロゲン原子、置換されていてもよいアルキル基および置換されていてもよい水酸基としては、それぞれ、上記R¹で示されるこれらの基として例示した基が挙げられる。

Xは、好ましくは水素原子である。

Yで示される置換されていてもよい水酸基およびアルキルチオ基として

は、それぞれ、上記 R^1 で示されるこれらの基として例示した基が挙げられる。このうち、メトキシ基が好ましい。

Yで示される置換されていてもよいアミノ基は、例えば一般式 (XXI) :



[式中、 R^5 は水素原子またはアルキル基； R^6 は水素原子、アルキル基またはヒドロキシルアルキル基を示す]で表される。 R^5 または R^6 で示されるアルキル基および R^6 で示されるヒドロキシルアルキル基のアルキル基としては、上記 R^1 で示されるアルキル基として例示した基が挙げられる。好ましくは、 R^5 および R^6 が同一または異なって、水素原子またはアルキル基（好ましくはメチル基）である。このうち、Yがモノアルキルアミノ基、特にモノメチルアミノ基である場合が好ましい。

Yは、好ましくはアルコキシ基または上記一般式 (XXI) で表される基である。さらに好ましくは、メトキシ基またはモノアルキルアミノ基（好ましくはモノメチルアミノ基）である。

Zは、好ましくは酸素原子である。

R^2 で示されるアルキル基としては、例えば、上記 R^1 で示されるアルキル基として例示した基が挙げられる。このうち、メチルが好ましい。

R^2 で示されるアシル基としては、ホルミル；炭素数1～8、好ましくは炭素数1～4のアルキル基を含有するアルキルカルボニル基（例、アセチル、プロピオニル、ブチリルなど）；ベンゾイルなどが挙げられる。このうち、アセチルが好ましい。

Mは、好ましくは酸素原子、硫黄原子または NR^2 、さらに好ましくは

酸素原子である。

nは、好ましくは0または1である。

一般式 (I) で表される本発明化合物は2位に不斉炭素原子を有するが、それぞれの光学異性体の他、それらの混合物も本発明に包含される。

一般式 (I) で表される化合物は、好ましくは、

Xが水素原子、R¹が水酸基、Zが酸素原子、Yがアルキル基で置換されていてもよいアミノ基、Mが酸素原子、Qが置換されていてもよいフェニル基、およびnが0または1である化合物；

Xが水素原子、R¹がアルコキシ基、Zが酸素原子、Yがアルコキシ基または置換されていてもよいアミノ基、Mが酸素原子、Qが置換されていてもよいフェニル基、およびnが0または1である化合物；

Xが水素原子、R¹が水酸基、Zが酸素原子、Yがアルキル基で置換されていてもよいアミノ基、Mが酸素原子、Qが置換されていてもよいヘテロ環基、およびnが0または1である化合物；

Xが水素原子、R¹がアルコキシ基、Zが酸素原子、Yがアルコキシ基または置換されていてもよいアミノ基、Mが酸素原子、Qが置換されていてもよいヘテロ環基、およびnが0または1である化合物；

Xが水素原子、R¹がアルコキシ基、Zが酸素原子、Yがアルキル基で置換されていてもよいアミノ基、Mが酸素原子、Qが式 (a) で表される基、R¹²がアルキル基、R¹³が置換されていてもよいフェニル基または置換されていてもよいモルホリノ基、およびnが1である化合物；または

Xが水素原子、R¹がアルコキシ基、Zが酸素原子、Yがアルキル基で置換されていてもよいアミノ基、Mがアシルアミノ基、Qが式 (a) で表

される基、 R^{12} がアルキル基、 R^{13} が置換されていてもよいフェニル基または置換されていてもよいモルホリノ基、および n が1である化合物である。

一般式 (I) で表される化合物のより好ましい具体例を以下に挙げる。

Xが水素原子、 R^1 が水酸基、Zが酸素原子、Yがモノメチルアミノ基、Mが酸素原子、Qがフェニル基、および n が0である化合物 (化合物番号 1) ;

Xが水素原子、 R^1 が水酸基、Zが酸素原子、Yがアミノ基、Mが酸素原子、Qがフェニル基、および n が0である化合物 (化合物番号 2) ;

Xが水素原子、 R^1 が水酸基、Zが酸素原子、Yがモノメチルアミノ基、Mが酸素原子、Qが3,4-ジメチルフェニル基、および n が0である化合物 (化合物番号 15) ;

Xが水素原子、 R^1 が水酸基、Zが酸素原子、Yがモノメチルアミノ基、Mが酸素原子、Qが3,5-ジメチルフェニル基、および n が0である化合物 (化合物番号 16) ;

Xが水素原子、 R^1 が水酸基、Zが酸素原子、Yがモノメチルアミノ基、Mが酸素原子、Qが2-メチルフェニル基、および n が1である化合物 (化合物番号 64) ;

Xが水素原子、 R^1 が水酸基、Zが酸素原子、Yがモノメチルアミノ基、Mが酸素原子、Qが2,5-ジメチルフェニル基、および n が1である化合物 (化合物番号 75) ;

Xが水素原子、 R^1 が水酸基、Zが酸素原子、Yがモノメチルアミノ基、

Mが酸素原子、Qが4-クロロ-2-メチルフェニル基、およびnが1である化合物（化合物番号113）；

Xが水素原子、R¹がメトキシ基、Zが酸素原子、Yがメトキシ基、Mが酸素原子、Qが2,5-ジメチルフェニル基、およびnが1である化合物（化合物番号139）；

Xが水素原子、R¹がメトキシ基、Zが酸素原子、Yがモノメチルアミノ基、Mが酸素原子、Qが2,5-ジメチルフェニル基、およびnが1である化合物（化合物番号140）；

Xが水素原子、R¹がメトキシ基、Zが酸素原子、Yがモノメチルアミノ基、Mが酸素原子、Qが4-クロロ-2-メチルフェニル基、およびnが1である化合物（化合物番号186）；

Xが水素原子、R¹がメトキシ基、Zが酸素原子、Yがモノメチルアミノ基、Mが酸素原子、Qが2-メチルフェニル基、およびnが1である化合物（化合物番号197）；

Xが水素原子、R¹がメトキシ基、Zが酸素原子、Yがモノメチルアミノ基、Mが酸素原子、Qが3-クロロ-5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル基、およびnが1である化合物（化合物番号427）；

Xが水素原子、R¹がメトキシ基、Zが酸素原子、Yがモノメチルアミノ基、Mが酸素原子、Qが3,5-ジクロロピリジン-2-イル基、およびnが1である化合物（化合物番号433）；

Xが水素原子、R¹がメトキシ基、Zが酸素原子、Yがモノメチルアミノ基、Mが酸素原子、Qが3-トリフルオロメチル-5-クロロピリジン-2-イル基、およびnが1である化合物（化合物番号448）；

Xが水素原子、R¹がメトキシ基、Zが酸素原子、Yがモノメチルアミノ基、Mが酸素原子、Qが3-クロロピリジン-2-イル基、およびnが1である化合物（化合物番号466）；

Xが水素原子、R¹がメチル基、Zが酸素原子、Yがモノメチルアミノ基、Mが酸素原子、Qが α -メチル-4-クロロベンジリデンアミノ基、およびnが1である化合物（化合物番号474）；

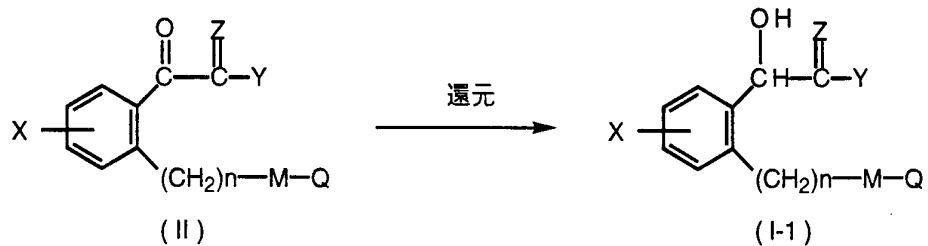
Xが水素原子、R¹がメチル基、Zが酸素原子、Yがモノメチルアミノ基、Mが酸素原子、Qが α -メチル-4-メトキシベンジリデンアミノ基、およびnが1である化合物（化合物番号492）；

Xが水素原子、R¹がメチル基、Zが酸素原子、Yがモノメチルアミノ基、Mが酸素原子、Qが4, α -ジメチルベンジリデンアミノ基、およびnが1である化合物（化合物番号498）；または

Xが水素原子、R¹がメチル基、Zが酸素原子、Yがモノメチルアミノ基、Mが酸素原子、Qが α -メチル-4-トリフルオロメチルベンジリデンアミノ基、およびnが1である化合物（化合物番号526）。

つぎに、一般式（I）に包含される本発明化合物の好ましい製造法を例示する。

A法



[式中、各記号は上記と同意義]

本発明化合物 (I-1) は、化合物 (II) を還元することにより製造することができる。

還元剤としては、ケトンの還元を用いる通常の還元剤、例えば金属水素化物、金属水素錯化合物などを用いることができる。具体的には、三配位ボラン (例、ボランなど)、四配位ボラート (例、水素化ホウ素ナトリウム、水素化ホウ素リチウムなど)、三配位アルミニウム (例、水素化ジイソブチルアルミニウムなど)、四配位アルミナート錯体 (例、水素化リチウムアルミニウムなど) などが挙げられる。還元剤の使用量は、化合物 (II) に対して 0.25 ~ 3 当量、好ましくは 1.0 ~ 1.2 当量使用する。

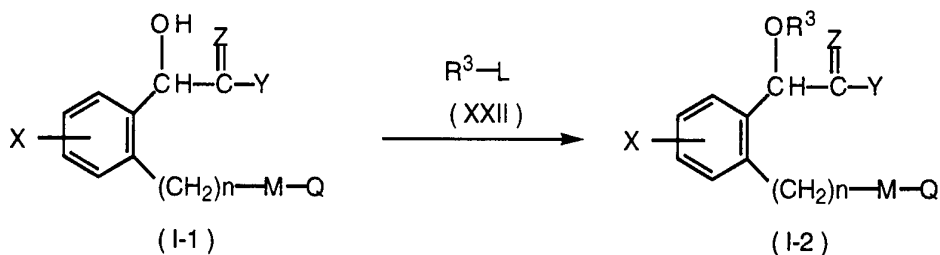
反応溶媒は、メタノール、エタノールなどのアルコール類；ジエチルエーテル、テトラヒドロフランなどのエーテル類；水などが挙げられ、これらを単独でまたはこれらを混合して使用することができる。

反応温度は、-20℃から溶媒還流温度までの適当な温度、好ましくは 0 ~ 50℃、反応時間は、0.5 時間 ~ 24 時間、好ましくは 0.5 ~ 2 時間である。

得られた本発明化合物 (I-1) は、公知の手段 (例、クロマトグラフィー、再結晶など) により分離精製することができる。

本反応で原料として用いる化合物 (II) は、例えば特開平 3-246268 号、特開平 5-97768 号または特開平 5-331124 号に記載の方法により、例えば、対応するハロゲン化フェニルをブチルリチウムまたはマグネシウムと反応させ、ついでシュウ酸ジアルキルと反応させることにより製造することができる。あるいは、下記 Q 法により製造することもできる。

B 法



[式中、 R^3 はアルキル基、アルケニル基、アルキニル基、ハロアルキル基、ハロアルケニル基、ハロアルキニル基、アルコシアルキル基、アルキルカルボニル基、(アルキルチオ)カルボニル基、アルキルスルホニル基、アリールスルホニル基またはモノあるいはジアルキル置換カルバモイル基、 L は脱離基あるいは $\text{R}^3\text{---L}$ でジヒドロピランを示し、他の記号は上記と同意義]

R^3 で示される各基としては、例えば、上記 R^1 で示される置換されている水酸基の置換基に相当する基が挙げられる。 L で示される脱離基としては、例えば、ハロゲン原子(例、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素)、アルキルスルホニルオキシ(例、メタンスルホニルオキシなど)などが挙げられる。

本発明化合物(I-2)は、本発明化合物(I-1)を化合物(XXI)と反応させてアルキル化、アルケニル化、アルキニル化、カルボニル化、スルホニル化、カルバモイル化またはテトラヒドロピラニル化することにより製造することができる。

アルキル化、アルケニル化およびアルキニル化は、例えば、塩基存在下、化合物(XXI)としてそれぞれ、ハロゲン化アルキル、ハロゲン化アルケニルおよびハロゲン化アルキニルを用いて行うことができる。ハロゲン化アルキルとしては、例えば、塩化メチル、臭化メチル、ヨウ化メチル、塩化エチル、臭化エチル、ヨウ化エチル、1-ヨードプロパン、2-ヨ-

ドプロパン、1-ヨードブタン、クロロトリフルオロメタン、1,2-ジブロモエタン、クロロメチルエーテルなどが挙げられる。ハロゲン化アルケニルとしては、例えば、アリルブロミドなどが挙げられる。ハロゲン化アルキニルとしては、例えばプロパルギルブロミドなどが挙げられる。これらを化合物(I-1)に対して1~5当量、好ましくは1~2当量用いる。

塩基としては、例えば、有機塩基(例、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウムt-ブトキシドなど)、無機塩基(例、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム、水素化カリウムなど)などが挙げられ、それらを化合物(I-1)に対して1~5当量、好ましくは1~2当量用いる。

反応溶媒としては、ジエチルエーテル、テトラヒドロフランなどのエーテル類；N、N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、トルエンなどを使用することができる。

反応温度は、-20℃から溶媒還流温度までの適当な温度、好ましくは0~50℃、反応時間は、0.5時間~48時間、好ましくは0.5~10時間である。

カルボニル化は、例えば、塩基存在下、化合物(XXII)として酸ハロゲン化物(例、アセチルクロリド、アセチルブロミド、プロピオニルクロリド、チオアセチルクロリドなど)あるいは酸無水物(例、無水酢酸、無水プロピオン酸など)を用いて行うことができる。これら酸ハロゲン化物あるいは酸無水物は化合物(I-1)に対して1~5当量、好ましくは1~2当量用いる。

塩基としては、例えば、有機塩基(例、トリエチルアミン、N、N-ジメチルアニリン、ピリジンなど)あるいは無機塩基(炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、水素化ナトリウムなど)が挙げられ、それらを化合物(I-

1) に対して1～5当量、好ましくは1～2当量用いる。

反応溶媒は、例えば、塩化メチレン、クロロホルムなどのハロゲン化炭化水素類；ジエチルエーテル、テトラヒドロフランなどのエーテル類；N、N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、トルエンなどを使用することができる。

反応温度は、-20℃から溶媒還流温度までの適当な温度、好ましくは0～50℃、反応時間は0.5時間～24時間、好ましくは0.5～5時間である。

スルホニル化は、例えば、塩基存在下、化合物(X X I I)としてアルキルスルホニルハライド(例、メタンスルホニルクロリド、エタンスルホニルクロリドなどのアルキルスルホニルクロリドなど)あるいはアリールスルホニルハライド(例、ベンゼンスルホニルクロリド、p-トルエンスルホニルクロリドなどのアリールスルホニルクロリドなど)を用いて行うことができる。これらアルキルスルホニルハライドあるいはアリールスルホニルハライドは、化合物(I-1)に対して1～5当量、好ましくは1～2当量用いる。

塩基としては、例えば、有機塩基(例、トリエチルアミン、N、N-ジメチルアニリン、ピリジンなど)あるいは無機塩基(例、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、水素化ナトリウムなど)が挙げられ、それらを化合物(I-1)に対して1～5当量、好ましくは1～2当量用いる。

反応溶媒としては、例えば、塩化メチレン、クロロホルムなどのハロゲン化炭化水素類；ジエチルエーテル、テトラヒドロフランなどのエーテル類；N,N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、トルエンなどを使用することができる。

反応温度は、-20℃から溶媒還流温度までの適当な温度、好ましくは

0～50℃、反応時間は、0.5時間～24時間、好ましくは0.5～5時間である。

カルバモイル化は、例えば、塩基存在下、化合物（XXII）としてN-アルキル化されていてもよいカルバモイルハライド（例、モノエチルカルバモイルクロリド、ジメチルカルバモイルクロリドなど）を用いて行うことができる。該カルバモイルハライドは化合物（I-1）に対して1～5当量、好ましくは1～2当量用いる。

塩基としては、例えば、有機塩基（例、トリエチルアミン、N、N-ジメチルアニリン、ピリジンなど）あるいは無機塩基（例、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、水素化ナトリウムなど）が挙げられ、それらを化合物（I-1）に対して1～5当量、好ましくは1～2当量用いる。

反応溶媒は、例えば、塩化メチレン、クロロホルムなどのハロゲン化炭化水素類；ジエチルエーテル、テトラヒドロフランなどのエーテル類；N、N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、トルエンなどを使用することができる。

反応温度は、-20℃から溶媒還流温度までの適当な温度、好ましくは20～70℃、反応時間は、0.5時間～48時間、好ましくは0.5～12時間である。

テトラヒドロピラニル化は、テトラヒドロピラニル基による通常の水酸基保護法を用いて行うことができる。例えば、下記Y法の反応と同様にして行うことができる。

得られた本発明化合物（I-2）は、公知の手段（例、クロマトグラフィー、再結晶など）により分離精製することができる。

C法



[式中、各記号は上記と同意義]

本発明化合物 (I-4) は、本発明化合物 (I-3) にイオウ化剤を反応させることにより製造することができる。

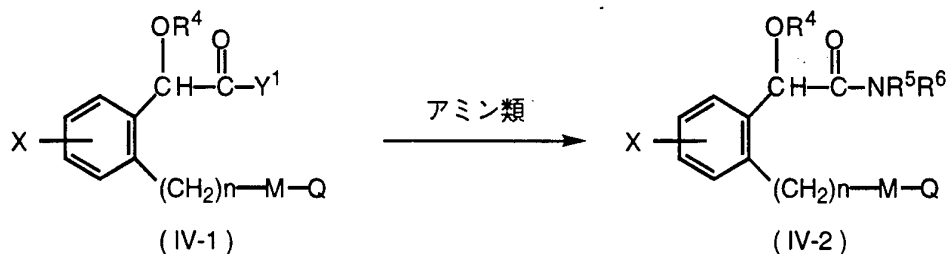
イオウ化剤としては、例えば、五硫化リンあるいはローソン試薬が挙げられ、それらを化合物 (I-3) に対して 1~5 当量、好ましくは 1~2 当量用いる。

反応溶媒としては、例えば、トルエン、キシレンなどの芳香族炭化水素類；あるいはピリジンが挙げられそれらを単独または混合して使用することができる。

反応温度は室温~溶媒還流温度までの適当な温度、好ましくは 80℃~150℃、反応時間は、0.5 時間~48 時間、好ましくは 0.5~12 時間である。

得られた本発明化合物 (I-4) は、公知の手段 (例、クロマトグラフィー、再結晶など) により分離精製することができる。

D法



[式中、R⁴はアルキル基、アルケニル基、アルキニル基、ハロアルキル基、

ハロアルケニル基、ハロアルキニル基またはアルコキシアルキル基、 R^5 は水素原子またはアルキル基、 R^6 は水素原子、アルキル基またはヒドロキシアルキル基、 Y^1 はアルコキシ基またはアルキルチオ基を示し、他の記号は上記と同意義]

R^4 で示される各基としては、例えば、上記 R^1 で示される置換されている水酸基の置換基に相当する基が挙げられる。 Y^1 で示されるアルコキシ基およびアルキルチオ基としては、例えば、それぞれ上記 R^1 として例示したアルコキシ基およびアルキルチオ基が挙げられる。

本発明化合物 (IV-2) は、本発明化合物 (IV-1) にアミン類を反応させることにより製造することができる。

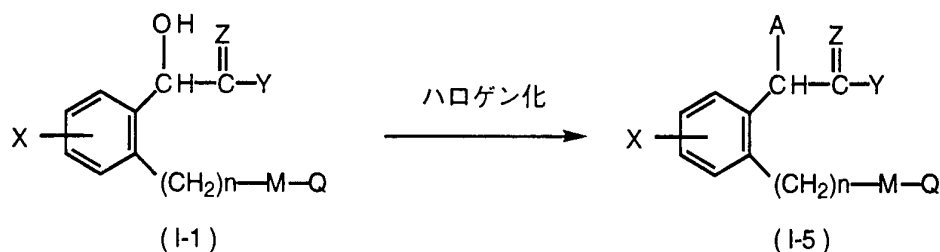
アミン類としては式 (V) : R^5R^6NH (式中、 R^5 および R^6 は上記と同意義) で表される化合物、具体的には、液体アンモニア；メチルアミン、エチルアミンなどの一級アミン；ジメチルアミン、ジエチルアミンなどの二級アミンが挙げられ、その使用量は化合物 (IV-1) に対して1~5当量、好ましくは1~2当量である。

反応溶媒としては、例えば、メタノール、エタノールなどのアルコール類；トルエン、キシレンなどの芳香族炭化水素類；塩化メチレン、クロロホルムなどのハロゲン化炭化水素類；エーテル、テトラヒドロフランなどのエーテル類；あるいは水が挙げられそれらを単独または混合して使用することができる。

反応温度は $0^{\circ}C$ ~溶媒還流温度までの適当な温度、好ましくは $20^{\circ}C$ ~ $80^{\circ}C$ 、反応時間は、0.5時間~48時間、好ましくは0.5~12時間である。

得られた本発明化合物（I V-2）は、公知の手段（例、クロマトグラフィ、再結晶など）により分離精製することができる。

E法



[式中、Aはハロゲン原子を示し、他の記号は上記と同意義]

Aで示されるハロゲン原子としては、例えば、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素が挙げられる。

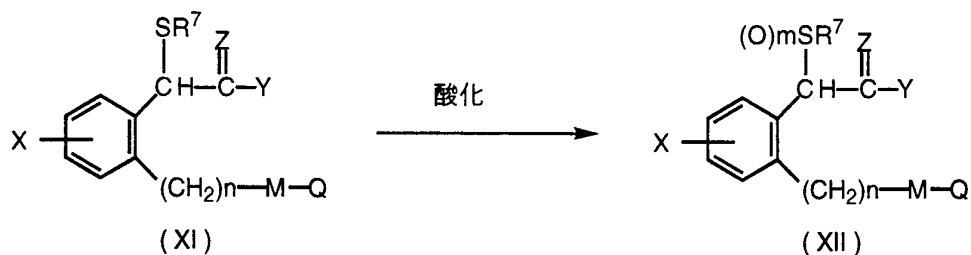
本発明化合物（I-5）は、本発明化合物（I-1）をハロゲン化することにより製造することができる。該ハロゲン化に用いるハロゲン化剤としては、例えば、塩化チオニル、オキシ塩化リン、五塩化リン、四塩化炭素-トリフェニルホスフィンなどの塩素化剤；臭化チオニル、三臭化リン、四臭化炭素-トリフェニルホスフィンなどの臭素化剤が挙げられ、それらを一般式（I-1）に対して1～5当量、好ましくは1～2当量用いる。

反応溶媒としては、例えば、トルエン、キシレンなどの芳香族炭化水素類；塩化メチレン、クロロホルムなどのハロゲン化炭化水素類；エーテル、テトラヒドロフランなどのエーテル類を使用することができる。

反応温度は0℃～溶媒還流温度までの適当な温度、好ましくは20℃～80℃、反応時間は、0.5時間～48時間、好ましくは0.5～12時間である。

得られた本発明化合物（I-5）は、公知の手段（例、クロマトグラフィ、再結晶など）により分離精製することができる。

F法



[式中、 R^7 はアルキル基、 m は1または2を示し、他の記号は上記と同意義]

R^7 で示されるアルキル基としては、例えば、上記 R^1 で示されるアルキル基として例示した基が挙げられる。

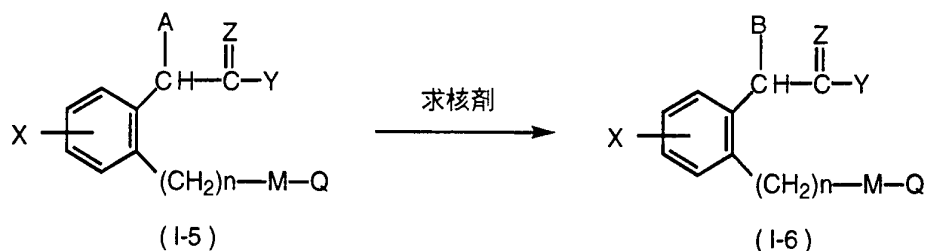
本発明化合物(XII)は、本発明化合物(XI)を酸化することにより製造することができる。該酸化反応に用いる酸化剤としては、例えば、過酸化水素、過酢酸、過安息香酸、 m -クロロ過安息香酸などの過酸類、メタ過ヨウ素酸ナトリウム、ヒドロペルオキシドなどが挙げられ、それらを化合物(XI)に対して1~10当量、好ましくは1~3当量用いる。

反応溶媒としては、例えば、トルエン、キシレンなどの芳香族炭化水素類；塩化メチレン、クロロホルムなどのハロゲン化炭化水素類；エーテル、テトラヒドロフランなどのエーテル類；メタノール、エタノールなどのアルコール類；あるいは水が挙げられそれらを単独または混合して使用することができる。

反応温度は -20°C ~溶媒還流温度までの適当な温度、好ましくは 0°C ~ 50°C 、反応時間は、0.5時間~48時間、好ましくは0.5~12時間である。

得られた本発明化合物(XII)は、公知の手段(例、クロマトグラフィー、再結晶など)により分離精製することができる。

G法



[式中、Aはハロゲン原子、Bは置換されている水酸基、アルキルチオ基、アルキル基で置換されていてもよいアミノ基またはニトロ基を示し、他の記号は上記と同意義]

Bで示される各基としては、例えば上記R¹で示されるこれらの基として例示したものが挙げられる。

本発明化合物(I-6)は、本発明化合物(I-5)に求核剤を反応させてA基を置換することにより製造することができる。

例えば、置換されている水酸基に置換する場合は、求核剤として、例えばアルコールの金属塩(例、ナトリウムメトキシド、ナトリウム2-プロペノキシド、カリウム2-プロピノキシド、カリウム2,2,2-トリフルオロエトキシド、ナトリウムメトキシメトキシドなど)を直接用いるか、あるいは反応液中でアルコール類と金属水素化物(例、水素化ナトリウム、水素化カリウムなど)によりアルコールの金属塩を生成して用いる。どちらの場合もアルコールの金属塩として一般式(I-5)に対して1~5当量、好ましくは1~2当量用いる。

反応溶媒としては、例えば、トルエン、キシレンなどの芳香族炭化水素類；塩化メチレン、クロロホルムなどのハロゲン化炭化水素類；エーテル、テトラヒドロフランなどのエーテル類；N,N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシドを使用することができる。

反応温度は0℃~溶媒還流温度までの適当な温度、好ましくは20℃~

80℃、反応時間は、0.5時間～48時間、好ましくは0.5～12時間である。

アルキルチオ基に置換する場合は、例えば、アルキルメルカプタンの金属塩（例、ナトリウムチオメトキシド、ナトリウムチオエトキシドなど）を直接用いるか、あるいは反応液中でアルキルメルカプタンと金属水素化物（例、水素化ナトリウム、水素化カリウムなど）または水酸化物（例、水酸化ナトリウム、水酸化カリウムなど）によりアルキルメルカプタンの金属塩を生成して用いる。いずれの場合もアルキルメルカプタンの金属塩として化合物（I-5）に対して1～5当量、好ましくは1～2当量用いる。

反応溶媒としては、例えば、トルエン、キシレンなどの芳香族炭化水素類；エーテル、テトラヒドロフランなどのエーテル類；アセトニトリル、N,N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシドまたは水などを単独であるいは混合して使用することができる。

反応温度は0℃から溶媒還流温度までの適当な温度、好ましくは20℃～80℃、反応時間は0.5時間～48時間、好ましくは0.5～12時間である。

アルキル基で置換されていてもよいアミノ基に置換する場合は、例えばアミン類（例、液体アンモニア、アンモニア水、モノメチルアミン、ジメチルアミンなど）を化合物（I-5）に対して1～5当量、好ましくは1～2当量用いる。

反応溶媒としては、例えば、トルエン、キシレンなどの芳香族炭化水素類；エーテル、テトラヒドロフランなどのエーテル類；メタノール、エタノールなどのアルコール類；N,N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシドまたは水などを単独であるいは混合して使用することができる。

反応温度は -20°C から溶媒還流温度までの適当な温度、好ましくは 0°C ～ 80°C 、反応時間は0.5時間～48時間、好ましくは0.5～12時間である。

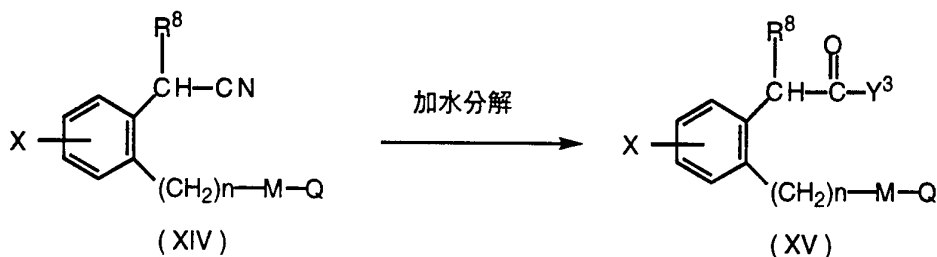
ニトロ基に置換する場合は、亜硝酸塩（例、亜硝酸ナトリウム、亜硝酸カリウムなど）を化合物（I-5）に対して1～5当量、好ましくは1～2当量、さらにプロログルシノールを化合物（I-5）に対して1～5当量、好ましくは1～2当量用いる。

反応溶媒としては、例えば、トルエン、キシレンなどの芳香族炭化水素類；エーテル、テトラヒドロフランなどのエーテル類；メタノール、エタノールなどのアルコール類；N,N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシドなどを使用することができる。

反応温度は 0°C から溶媒還流温度までの適当な温度、好ましくは 20°C ～ 80°C 、反応時間は0.5時間～48時間、好ましくは0.5～12時間である。

得られた本発明化合物（I-6）は、公知の手段（例、クロマトグラフィー、再結晶など）により分離精製することができる。

H法



[式中、 R^8 はアルキル基、ハロアルキル基またはアルコキシアリル基、

Y^3 は水酸基またはアミノ基を示し、他の記号は上記と同意義]

R⁸で示される各基としては、例えば上記R¹で示されるこれらの基として例示したものが挙げられる。

本発明化合物(XV)は、化合物(XIV)を酸または塩基を用いて加水分解することにより製造することができる。

酸としては、例えば、鉱酸(例、塩酸、臭化水素酸、硫酸、硝酸、リン酸など)あるいは有機酸(例、ギ酸、酢酸など)が挙げられ、それらを単独あるいは混合して使用することができる。塩基としては、例えば、有機塩基(例、ナトリウムエトキシドなど)あるいは無機塩基(例、水酸化ナトリウム、水酸化カリウムなど)が挙げられる。これら酸または塩基は、化合物(XIV)に対して1~10当量、好ましくは1~3当量用いる。

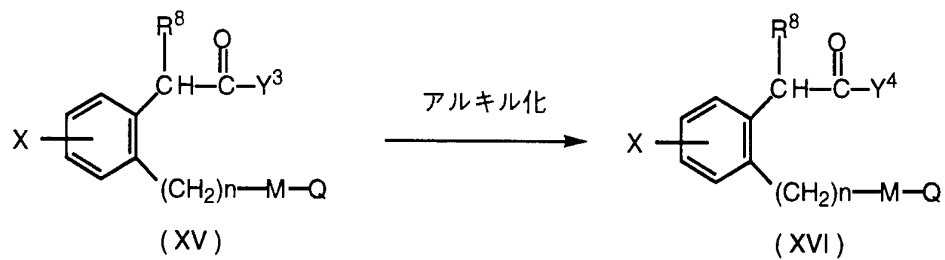
反応溶媒としては、例えば、トルエン、キシレンなどの芳香族炭化水素類；エーテル、テトラヒドロフランなどのエーテル類；メタノール、エタノールなどのアルコール類；N、N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、水などが挙げられ、それらを単独あるいは混合して使用することができる。

反応温度は-80℃~溶媒還流温度までの適当な温度、好ましくは0℃~80℃、反応時間は、0.5時間~48時間、好ましくは0.5~6時間である。

得られた本発明化合物(XV)は、公知の手段(例、クロマトグラフィ、再結晶など)により分離精製することができる。

本反応で原料として用いる化合物(XIV)は、例えば下記R法により製造することができる。

I法



[式中、 Y^4 はアルコキシ基、モノまたはジアルキル基で置換されたアミノ基を示し、他の記号は上記と同意義]

Y^4 で示される各基としては、例えば、上記 R^1 で示されるこれらの基として例示したものが挙げられる。

本発明化合物(XVI)は、本発明化合物(XV)をアルキル化することにより製造することができる。アルキル化は、塩基存在下、ハロゲン化アルキル類を用いて行うことができる。ハロゲン化アルキル類としては、塩化メチル、臭化メチル、ヨウ化メチル、塩化エチル、臭化エチル、ヨウ化エチル、1-ヨードプロパン、2-ヨードプロパン、1-ヨードブタンなどが挙げられ、それらを化合物(XV)に対して1~5当量、好ましくは1~2当量用いる。

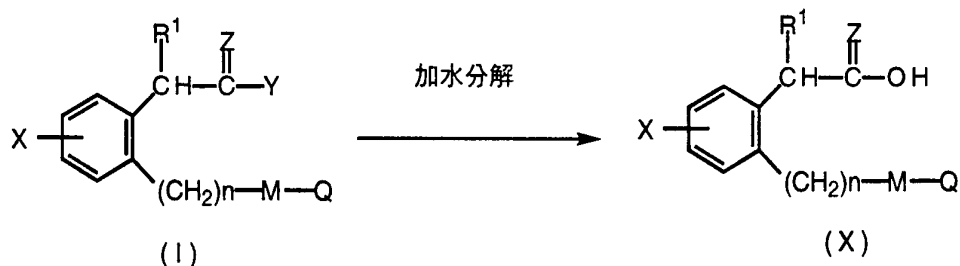
塩基としては、例えば、有機塩基(例、ブチルリチウム、ナトリウムエトキシドなど)あるいは無機塩基(例、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、ナトリウムアミド、水素化ナトリウムなど)が挙げられ、それらを化合物(XV)に対して1~5当量、好ましくは1~2当量用いる。

反応溶媒としては、例えば、トルエン、キシレンなどの芳香族炭化水素類；塩化メチレン、クロロホルムなどのハロゲン化炭化水素類；エーテル、テトラヒドロフランなどのエーテル類；メタノール、エタノールなどのアルコール類；N、N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシドなどを使用することができる。

反応温度は -80°C ～溶媒還流温度までの適当な温度、好ましくは 0°C ～ 80°C 、反応時間は、0.5時間～48時間、好ましくは0.5～6時間である。

得られた本発明化合物(XVI)は、公知の手段(例、クロマトグラフィー、再結晶など)により分離精製することができる。

Ⅰ法



[式中、各記号は上記と同意義]

本発明化合物(X)は、適当な溶媒中、本発明化合物(I)を加水分解することにより製造することができる。

加水分解は、化合物(I)を塩基で処理することにより行うことができる。塩基としては、例えば有機塩基(例、ナトリウムエトキシドなどの金属アルコキシド類)あるいは無機塩基(例、水酸化ナトリウム、水酸化カリウムなどの水酸化金属塩など)が挙げられ、それらを化合物(I)に対して1～10当量、好ましくは1～3当量用いる。

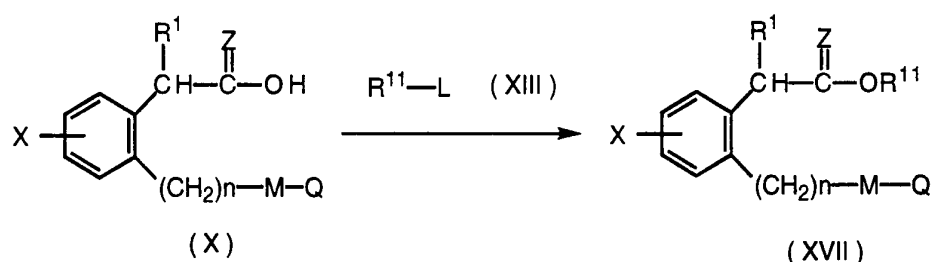
反応溶媒としては、トルエン、キシレンなどの芳香族炭化水素類；エーテル、テトラヒドロフランなどのエーテル類；メタノール、エタノールなどのアルコール類；N、N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、水などが挙げられ、それらを単独あるいは混合して使用することができる。

反応温度は -80°C ～溶媒還流温度までの適当な温度、好ましくは 0°C

～80℃、反応時間は、0.5時間～48時間、好ましくは0.5～6時間である。

得られた本発明化合物(X)は、公知の手段(例、クロマトグラフィー、再結晶など)により分離精製することができる。

K法



[式中、R¹¹はアルキル基、アルケニル基またはアルキニル基を示し、他の記号は上記と同意義]

本発明化合物(XVII)は、本発明化合物(X)に化合物(XIII)を反応させることにより製造することができる。

本反応は、例えば、塩基存在下、化合物(XIII)としてハロゲン化アルキル、ハロゲン化アルケニルおよびハロゲン化アルキニルを用いて行うことができる。ハロゲン化アルキルとしては、例えば、塩化メチル、臭化メチル、ヨウ化メチル、塩化エチル、臭化エチル、ヨウ化エチル、1-ヨードプロパン、2-ヨードプロパン、1-ヨードブタン、クロロトリフルオロメタン、1,2-ジブロモエタン、クロロメチルエーテルなどが挙げられる。ハロゲン化アルケニルとしては、例えば、アリルブロミドなどが挙げられる。ハロゲン化アルキニルとしては、例えばプロパルギルブロミドなどが挙げられる。これらを化合物(X)に対して1～5当量、好ましくは1～2当量用いる。

塩基としては、例えば、有機塩基(例、ナトリウムメトキシド、ナトリ

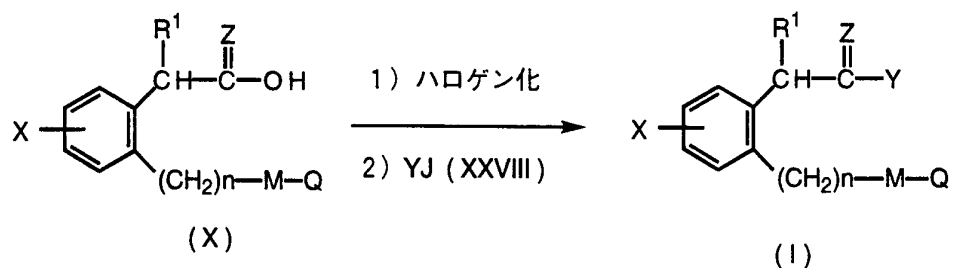
ウムエトキシド、カリウム *t*-ブトキシドなど)、無機塩基 (例、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム、水素化カリウムなど) などが挙げられ、それらを化合物 (X) に対して 1~5 当量、好ましくは 1~2 当量用いる。

反応溶媒としては、ジエチルエーテル、テトラヒドロフランなどのエーテル類; N、N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、トルエンなどを使用することができる。

反応温度は、-20℃から溶媒還流温度までの適当な温度、好ましくは 0~50℃、反応時間は、0.5 時間~48 時間、好ましくは 0.5~10 時間である。

得られた本発明化合物 (XVI I) は、公知の手段 (例、クロマトグラフィ、再結晶など) により分離精製することができる。

L 法



[式中、J は水素原子または金属塩を示し、他の記号は上記と同意義]

本発明化合物 (I) は、まず本発明化合物 (X) をハロゲン化し、ついで化合物 (XXVII I) と反応させることにより製造することができる。

J で示される金属塩としては、アルカリ金属塩 (ナトリウム塩、カリウム塩など)、アルカリ土類金属塩 (マグネシウム塩、カルシウム塩など) などが挙げられる

ハロゲン化は、例えばハロゲン化スルホニルを触媒量の塩基、例えば N、

N-ジメチルホルムアミドの存在下、一般式 (X) に対して 1 ~ 5 当量、好ましくは 1 ~ 2 当量用いて行う。

ハロゲン化スルホニルとしては、例えば塩化スルホニルあるいは臭化スルホニルを用いる。

反応溶媒は、例えば、塩化メチレン、1、2-ジクロロエタンなどのハロゲン化炭化水素類；ジエチルエーテルなどのエーテル類；トルエンなどの芳香族炭化水素類などを使用することができる。

反応温度は、室温から溶媒還流温度までの適当な温度、反応時間は、0.5 ~ 24 時間、好ましくは 1 ~ 5 時間である。

得られた酸ハロゲン化物は、精製せず次の反応に使用することができる。

該酸ハロゲン化物は、例えば、塩基存在下にアルコール類、メルカプタン類またはアミン類、あるいはそれらの金属塩 Y J (X X V I I I) と反応させて一般式 (I) に変換することができる。

塩基としては、例えば、有機塩基 (例、トリエチルアミン、N、N-ジメチルアニリン、ピリジンなど) あるいは無機塩基 (例、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、水素化ナトリウムなど) が挙げられ、それらを酸ハロゲン化物に対して 1 ~ 5 当量、好ましくは 1 ~ 2 当量用いる。

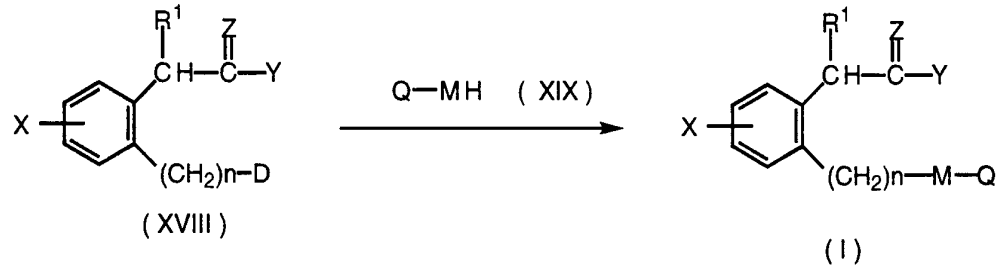
反応溶媒としては、例えば、塩化メチレン、1、2-ジクロロエタンなどのハロゲン化炭化水素類；ジエチルエーテルなどのエーテル類；トルエンなどの芳香族炭化水素類、ジメチルスルホキシド、N、N-ジメチルホルムアミドなどを使用することができる。

反応温度は、0℃から溶媒還流温度までの適当な温度、好ましくは 0℃から室温、反応時間は、0.5 ~ 24 時間、好ましくは 0.5 ~ 2 時間である。

得られた本発明化合物 (I) は、公知の手段 (例、クロマトグラフィー、

再結晶など)により分離精製することができる。

M法



[式中、Dはハロゲン原子を示し、他の記号は上記と同意義]

本発明化合物 (I) は、適当な溶媒中、化合物 (XVIII) に化合物 (XIX) を反応させることにより製造することができる。

上記式中、Dで示されるハロゲン原子としては、例えばフッ素、塩素、臭素、ヨウ素が挙げられる。

化合物 (XIX) は化合物 (XVIII) に対して1~3当量、好ましくは1~1.5当量使用する。

本反応は好ましくは塩基存在下で行う。塩基としては、例えば有機塩基 (例、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウムt-ブトキシドなどのアルコキシド；ピリジン、トリエチルアミンなどのアミン類など)、無機塩基 (例、水酸化ナトリウム、水酸化カリウムなどの水酸化金属塩；炭酸ナトリウム、炭酸カリウムなどの炭酸金属塩；水素化ナトリウム、水素化カリウムなどの水素化物など) などが挙げられ、それらを化合物 (XVIII) に対して1~5当量、好ましくは1~2当量用いる。

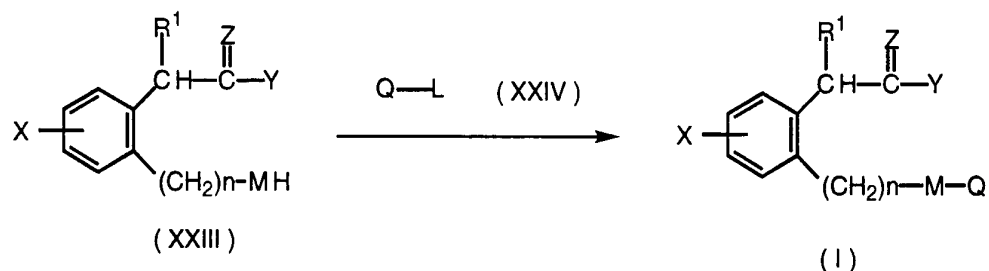
反応溶媒としては、例えばジエチルエーテル、テトラヒドロフランなどのエーテル類；N、N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、トルエンなどを使用することができる。

反応温度は、-20℃から溶媒還流温度までの適当な温度、好ましくは

0～50℃、反応時間は、0.5時間～72時間、好ましくは0.5～10時間である。

得られた本発明化合物（I）は、公知の手段（例、クロマトグラフィー、再結晶など）により分離精製することができる。

N法



[式中、Lは脱離基を示し、他の記号は上記と同意義]

本発明化合物（I）は、化合物（XXIII）に化合物（XXIV）を反応させることにより製造することができる。

化合物（XXIV）としては、上記Qで示される基がその可能ないずれかの位置でLにより置換されているものが挙げられる。化合物（XXIV）の好ましい具体例としては、ハロゲン化アルキル（例、塩化メチル、臭化メチル、ヨウ化メチル、塩化エチル、臭化エチル、ヨウ化エチル、1-ヨードプロパン、2-ヨードプロパン、1-ヨードブタン、クロロトリフルオロメタン、1,2-ジブロモエタン、クロロメチルエーテルなど）；ハロゲン化アルケニル（例、アリルブロミドなど）；ハロゲン化アルキニル（例、プロパルギルブロミドなど）；酸ハロゲン化物（例、アセチルクロリド、アセチルブロミド、プロピオニルクロリド、チオアセチルクロリドなど）；酸無水物（例、無水酢酸、無水プロピオン酸など）；アルキルスルホニルハライド（例、メタンスルホニルクロリド、エタンスルホニルクロリドなどのアルキルスルホニルクロリドなど）；アリールスルホニルハライド（例、

ベンゼンスルホニルクロリド、p-トルエンスルホニルクロリドなどのアリールスルホニルクロリドなど) ; N-アルキル化されていてもよいカルバモイルハライド (例、モノエチルカルバモイルクロリド、ジメチルカルバモイルクロリドなど) ; ピリジン類 (例、2,3-ジクロロピリジン、2,5-ジクロロピリジン、2-クロロ-3-トリフルオロメチルピリジン、2-クロロ-5-トリフルオロメチルピリジン、2-クロロ-3-メチルピリジン、2,3,5-トリクロロピリジン、2,3-ジクロロ-5-トリフルオロメチルピリジン、2,5-ジクロロ-3-トリフルオロメチルピリジンなど) ; ピリミジン類 (例、4,6-ジクロロピリミジン、2-クロロ-4,6-ジメチルピリミジン、4-クロロ-5-エトキシカルボニル-6-エチルピリミジンなど) ; ピラゾール類 (例、5-クロロ-4-ホルミル-1-メチルピラゾール、5-クロロ-4-メトキシカルボニル-1,3-ジメチルピラゾールなど) ; キノリン類 (例、4-クロロキノリンなど) ; ベンゾチアゾール類 (例、2-クロロベンゾチアゾールなど) ; キナゾリン類 (例、4-クロロキナゾリンなど) ; ベンゼン類 (例、1-ヨード-4-ニトロベンゼン、1-ブロモ-4-トリフルオロメチルベンゼンなど) などが挙げられる。

例えばQが置換されていてもよいアリール基の場合、本反応は塩基存在下、化合物 (XXIV) を化合物 (XXIII) に対して1~5当量、好ましくは1~2当量用いて行う。塩基としては、例えば有機塩基 (例、トリエチルアミン、N,N-ジメチルアニリン、ピリジンなど) あるいは無機塩基 (例、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、水素化ナトリウムなど) などが挙げられ、それらを化合物 (XXIII) に対して1~5当量、好ましくは1~2当量用いる。反応溶媒としては、例えばテトラヒドロフランなどのエーテル類 ; トルエンなどの芳香族炭化水素類 ; ジメチルスルホキシ

ド；N,N-ジメチルホルムアミドなどを用いることができる。反応温度は、室温～200℃、好ましくは100～150℃、反応時間は、1～48時間、好ましくは2～24時間である。

例えばQが置換されていてもよいヘテロ環基の場合、本反応は塩基存在下、化合物（XXIV）を化合物（XXIII）に対して1～5当量、好ましくは1～2当量用いて行う。塩基としては、例えば有機塩基（例、トリエチルアミン、N,N-ジメチルアニリン、ピリジンなど）あるいは無機塩基（例、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、水素化ナトリウムなど）などが挙げられ、それらを化合物（XXIII）に対して1～5当量、好ましくは1～2当量用いる。反応溶媒としては、例えばテトラヒドロフランなどのエーテル類；トルエンなどの芳香族炭化水素類；ジメチルスルホキシド；N,N-ジメチルホルムアミドなどを用いることができる。反応温度は、0～150℃、好ましくは室温～80℃、反応時間は、0.5～48時間、好ましくは2～12時間である。

例えばQがそれぞれ置換されていてもよいアルキル基、アルケニル基またはアルキニル基の場合、本反応は塩基存在下、化合物（XXIV）を化合物（XXIII）に対して1～5当量、好ましくは1～2当量用いて行う。塩基としては、例えば、有機塩基（例、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウムt-ブトキシドなど）、無機塩基（例、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム、水素化カリウムなど）などが挙げられ、それらを化合物（I-1）に対して1～5当量、好ましくは1～2当量用いる。反応溶媒としては、ジエチルエーテル、テトラヒドロフランなどのエーテル類；N,N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、トルエンなどを使用することができる。反応温度は、-20℃から溶媒還流温度までの適当な温度、好ましくは0～50℃、反

応時間は、0.5 時間～48 時間、好ましくは0.5～10 時間である。

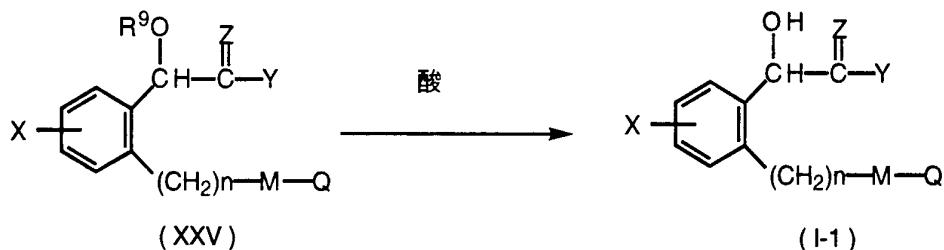
例えばQが置換カルボニル基の場合、本反応は塩基存在下、化合物(X X I V)を化合物(X X I I I)に対して1～5 当量、好ましくは1～2 当量用いて行う。塩基としては、例えば、有機塩基(例、トリエチルアミン、N、N-ジメチルアニリン、ピリジンなど)あるいは無機塩基(炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、水素化ナトリウムなど)が挙げられ、それらを化合物(X X I I I)に対して1～5 当量、好ましくは1～2 当量用いる。反応溶媒は、例えば、塩化メチレン、クロロホルムなどのハロゲン化炭化水素類；ジエチルエーテル、テトラヒドロフランなどのエーテル類；N、N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、トルエンなどを使用することができる。反応温度は、-20℃から溶媒還流温度までの適当な温度、好ましくは0～70℃、さらに好ましくは20～50℃、反応時間は0.5 時間～48 時間、好ましくは0.5～12 時間、さらに好ましくは0.5～5 時間である。

例えばQが置換スルホニル基の場合、本反応は塩基存在下、化合物(X X I V)を化合物(X X I I I)に対して1～5 当量、好ましくは1～2 当量用いて行う。塩基としては、例えば、有機塩基(例、トリエチルアミン、N、N-ジメチルアニリン、ピリジンなど)あるいは無機塩基(例、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、水素化ナトリウムなど)が挙げられ、それらを化合物(X X I I I)に対して1～5 当量、好ましくは1～2 当量用いる。反応溶媒としては、例えば、塩化メチレン、クロロホルムなどのハロゲン化炭化水素類；ジエチルエーテル、テトラヒドロフランなどのエーテル類；N,N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、トルエンなどを使用することができる。反応温度は、-20℃から溶媒還流温度までの適当な温度、好ましくは0～50℃、反応時間は、0.5 時間～

24時間、好ましくは0.5～5時間である。

得られた本発明化合物(I)は、公知の手段(例、クロマトグラフィー、再結晶など)により分離精製することができる。

〇法



[式中、R⁹はテトラヒドロピラニル基を示す]

本発明化合物(I-1)は本発明化合物(XXV)を酸で処理することにより製造することができる。

R⁹で示されるテトラヒドロピラニル基としては、例えば2-テトラヒドロピラニルなどが挙げられる。

本発明化合物(I-1)は、適当な溶媒中、化合物(XXV)を酸で処理することにより製造することができる。

本反応で用いる酸としては、例えば塩酸、臭化水素酸、硝酸および硫酸などの鉱酸；パラトルエンスルホン酸などのスルホン酸類；パラトルエンスルホン酸ピリジニウムなどの酸塩基対などが挙げられる。それらを化合物(XXV)に対して0.01～0.5当量、好ましくは0.05～0.2当量用いる。

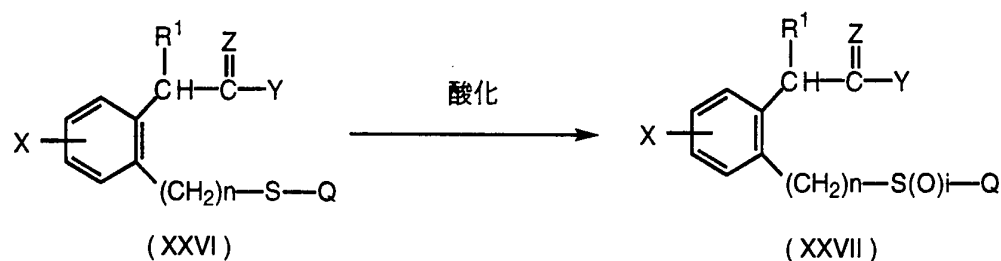
反応溶媒としては、例えばメタノール、エタノールなどのアルコール類；トルエン、キシレンなどの芳香族炭化水素類；塩化メチレン、クロロホルムなどのハロゲン化炭化水素類；エーテル、テトラヒドロフランなどのエーテル類；あるいは水が挙げられそれらを単独または混合して使用するこ

とができる。

反応温度は0℃～溶媒還流温度までの適当な温度、好ましくは20℃～80℃、反応時間は、0.5時間～48時間、好ましくは0.5～12時間である。

得られた本発明化合物(I-1)は、公知の手段(例、クロマトグラフィー、再結晶など)により分離精製することができる。

P法



[式中、各記号は上記と同意義]

本発明化合物(XXVII)は、本発明化合物(XXVI)を酸化することにより製造することができる。該酸化反応に用いる酸化剤としては、例えば、過酸化水素、過酢酸、過安息香酸、m-クロロ過安息香酸などの過酸類、メタ過ヨウ素酸ナトリウム、ヒドロペルオキシドなどが挙げられ、それらを化合物(XXVI)に対して1～10当量、好ましくは1～3当量用いる。

反応溶媒としては、例えば、トルエン、キシレンなどの芳香族炭化水素類；塩化メチレン、クロロホルムなどのハロゲン化炭化水素類；エーテル、テトラヒドロフランなどのエーテル類；メタノール、エタノールなどのアルコール類；あるいは水が挙げられそれらを単独または混合して使用することができる。

反応温度は-20℃～溶媒還流温度までの適当な温度、好ましくは0℃

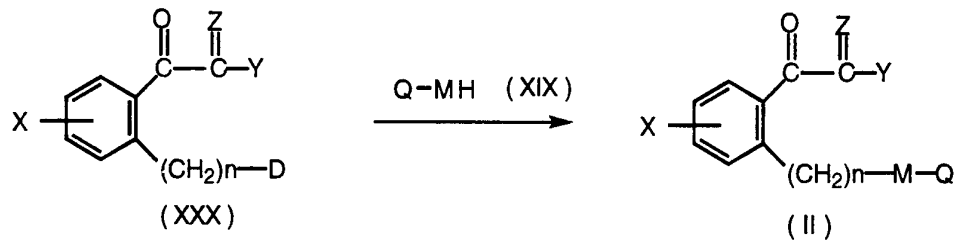
～50℃、反応時間は、0.5時間～48時間、好ましくは0.5～12時間である。

得られた本発明化合物 (XXVII) は、公知の手段 (例、クロマトグラフィー、再結晶など) により分離精製することができる。

以下、上記本発明化合物の製造法で原料として用いることができる化合物の製造法を説明する。

A法の反応の原料として用いることができる化合物 (II) は、好ましくは以下のQ法により製造することができる。

Q法



[式中、各記号は上記と同意義]

すなわち、化合物 (II) は、適当な溶媒中、塩基存在下、化合物 (XXX) に化合物 (XIX) を反応させることにより製造することができる。

化合物 (XIX) は化合物 (XXX) に対して1～3当量、好ましくは1～1.5当量使用する。

塩基としては、例えば有機塩基 (例、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウムt-ブトキシドなどのアルコキシド；ピリジン、トリエチルアミンなどのアミン類など)、無機塩基 (例、水酸化ナトリウム、水酸化カリウムなどの水酸化金属塩；炭酸ナトリウム、炭酸カリウムなどの炭酸金属塩；水素化ナトリウム、水素化カリウムなどの水素化物など) などが挙げられ、それらを化合物 (XXX) に対して1～5当量、好ましくは1～2当量用いる。

反応溶媒としては、例えばジエチルエーテル、テトラヒドロフランなどのエーテル類；N、N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、トルエンなどを使用することができる。

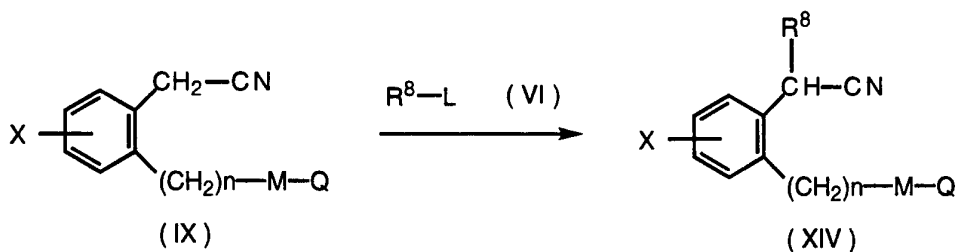
反応温度は、 -20°C から溶媒還流温度までの適当な温度、好ましくは $0\sim 50^{\circ}\text{C}$ 、反応時間は、0.5時間～48時間、好ましくは0.5～10時間である。

得られた化合物 (I I) は、反応液のままか粗製物として、あるいは公知の手段 (例、クロマトグラフィー、再結晶など) により分離精製後、次工程で使用することができる。

本反応の原料として用いる化合物 (X X X) は、例えば特開平2-3651あるいは特開平2-164866に従い、対応するアルキルフェニル体をハロゲン化することにより得ることができる。

H法の反応の原料として用いることができる化合物 (X I V) は、好ましくは以下のR法により製造することができる。

R法



[式中、 R^8 はアルキル基、ハロアルキル基またはアルコキシアリル基を示し、他の記号は上記と同意義]

化合物 (X I V) は、化合物 (I X) に化合物 (V I) を反応させることにより得られる。

R^8 で示される各基としては、上記 R^1 として例示したものが挙げられる。

化合物 (VI) の具体例としては、塩化メチル、臭化メチル、ヨウ化メチル、塩化エチル、臭化エチル、ヨウ化エチル、1-ヨウドプロパン、2-ヨウドプロパン、1-ヨウドブタン、クロロトリフルオロメタン、1、2-ジブロモエタン、クロロメチルエーテルなどが挙げられ、その使用量は化合物 (IX) に対して1~5当量、好ましくは1~2当量である。

本反応は、通常、塩基存在下で行う。塩基としては、例えば、有機塩基(例、ブチルリチウム、ナトリウムエトキシドなど)あるいは無機塩基(例、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、ナトリウムアミド、水素化ナトリウムなど)が挙げられ、それらを該ベンジルシアニドに対して1~5当量、好ましくは1~2当量用いる。

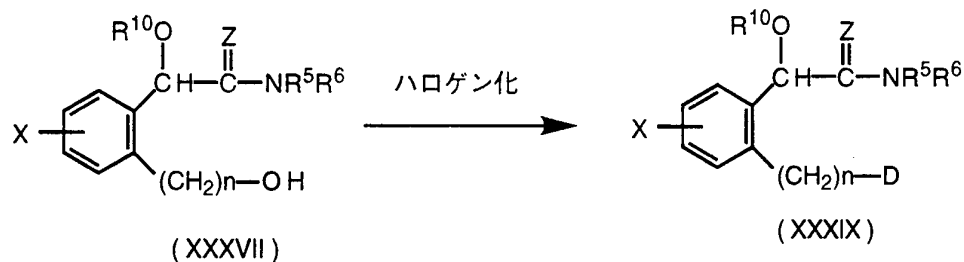
反応溶媒としては、例えば、トルエン、キシレンなどの芳香族炭化水素類；塩化メチレン、クロロホルムなどのハロゲン化炭化水素類；エーテル、テトラヒドロフランなどのエーテル類；メタノール、エタノールなどのアルコール類；N、N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシドなどを使用することができる。

反応温度は-80℃~溶媒還流温度までの適当な温度、好ましくは0℃~80℃、反応時間は、0.5時間~48時間、好ましくは0.5~6時間である。

得られた化合物 (XIV) は、公知の手段(例、クロマトグラフィー、再結晶など)により分離精製することができる。

また、M法の反応の原料として用いることができる化合物(XVII I)に包含される化合物(XXXIX)は、好ましくは以下のS法により製造することができる。

S法



[式中、 R^5 は水素原子またはアルキル基、 R^6 は水素原子、アルキル基またはヒドロキシルアルキル基、 R^{10} は置換されていてもよいアルキル基、置換されていてもよいアルケニル基または置換されていてもよいアルキニル基を示し、他の記号は上記と同意義]

すなわち、化合物 (XXXIX) は、適当な溶媒中、化合物 (XXXVII) をハロゲン化することにより製造することができる。

R^{10} で示される各々置換されていてもよいアルキル基、アルケニル基およびアルキニル基としては、上記 R^1 で示される置換されていてもよい水酸基の置換基として例示したアルキル基、アルケニル基およびアルキニル基が挙げられる。

本反応に用いるハロゲン化剤としては、例えば塩化チオニル、オキシ塩化リン、五塩化リン、四塩化炭素ートリフェニルホスフィンなどの塩素化剤；臭化チオニル、三臭化リン、四臭化炭素ートリフェニルホスフィンなどの臭素化剤が挙げられ、それらを化合物 (XXXVII) に対して1～5当量、好ましくは1～2当量用いる。

反応溶媒としては、例えばトルエン、キシレンなどの芳香族炭化水素類；塩化メチレン、クロロホルムなどのハロゲン化炭化水素類；エーテル、テトラヒドロフランなどのエーテル類を使用することができる。

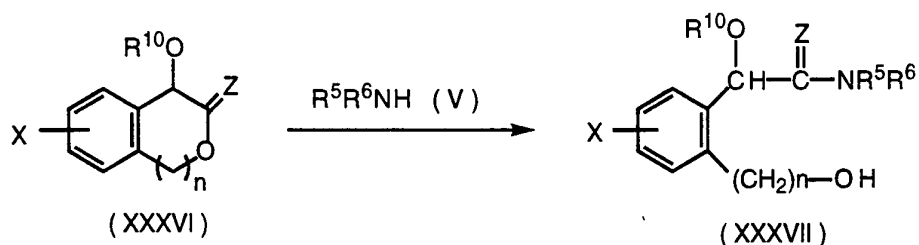
反応温度は 0°C ～溶媒還流温度までの適当な温度、好ましくは 20°C ～

80℃、反応時間は、0.5時間～48時間、好ましくは0.5～12時間である。

得られた化合物 (XXXIX) は、反応液のままか粗製物として、あるいは公知の手段 (例、クロマトグラフィー、再結晶など) により分離精製後、次工程で使用することができる。

本反応の原料として使用することができる化合物 (XXXVII) は、好ましくは以下のT法により製造することができる。

T法



[式中、各記号は上記と同意義]

すなわち、化合物 (XXXVII) は、適当な溶媒中、化合物 (XXXVI) に化合物 (V) を反応させることにより製造することができる。

化合物 (V) の好ましい具体例としては、液体アンモニア；メチルアミン、エチルアミンなどの一級アミン；ジメチルアミン、ジエチルアミンなどの二級アミンが挙げられ、それらを化合物 (XXXVI) に対して1～5当量、好ましくは1～2当量用いる。

反応溶媒としては、メタノール、エタノールなどのアルコール類；トルエン、キシレンなどの芳香族炭化水素類；塩化メチレン、クロロホルムなどのハロゲン化炭化水素類；エーテル、テトラヒドロフランなどのエーテル類；あるいは水が挙げられそれらを単独または混合して使用することができる。

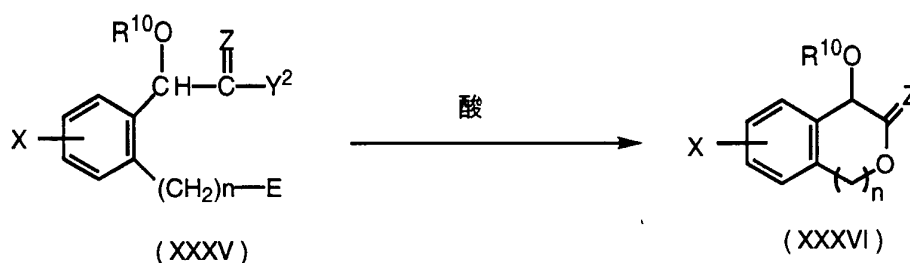
反応温度は0℃～溶媒還流温度までの適当な温度、好ましくは20℃～

80℃、反応時間は、0.5時間～48時間、好ましくは0.5～12時間である。

得られた化合物 (XXXVII) は、反応液のままか粗製物として、あるいは公知の手段 (例、クロマトグラフィー、再結晶など) により分離精製後、次工程で使用することができる。

本反応の原料として使用することができる化合物 (XXXVI) は、好ましくは以下のU法により製造することができる。

U法



[式中、 Y^2 はアルコキシ基、Eは保護されている水酸基を示し、他の記号は上記と同意義]

すなわち、化合物 (XXXVI) は、適当な溶媒中、化合物 (XXXV) を酸で処理することにより製造することができる。

上記式中、 Y^2 で示されるアルコキシ基としては、上記Yで示されるアルコキシ基と同様の基が挙げられる。

Eで示される保護されている水酸基の保護基としては、例えばティー・ダブリュー・グリーン (T.W. Green)、*「プロテクティブ・グループス・イン・オーガニック・シンセシス (Protective Groups in Organic Synthesis)」*、p.1～113、ジョン・ワイリー・アンド・サンズ (John Wiley & Sons) (1981)；シー・ビー・リーズ (C.B. Reese) *「プロテクティブ・グループス・イン・オーガニック・ケミストリー (Protective Groups in Organic*

Chemistry)、ジェイ・エフ・マックオミー (J.F. McOmie) 編、p. 95 ~ 143、プレナム・プレス (Plenum Press) (1973) などに記載のエーテル型保護基、アセタール型保護基などの通常の水酸基の保護基が挙げられる。

エーテル型保護基としては、例えば、アルキル基 (例、 C_{1-6} アルキル基、好ましくは C_{1-4} アルキル基、例えばメチル、エチル、プロピル、*t*-ブチルなど)、アルケニル基 (例、 C_{2-6} アルケニル基、好ましくは C_{2-4} アルケニル基、例えばアリルなど)、アラルキル基 (例、置換または非置換 C_{6-10} アリール- C_{1-4} アルキル基、例えばベンジル、*p*-メトキシベンジル、トリフェニルメチルなど)、トリアルキルシリル基 (例、トリ C_{1-6} アルキルシリル、例えばトリスプロピルシリル、*t*-ブチルジメチルシリルなど)、アルキルジアリールシリル基 (例、 C_{1-6} アルキルジ C_{6-10} アリールシリル、例えば*t*-ブチルジフェニルシリルなど)、トリアラルキルシリル基 (例、トリベンジルシリルなど) などが挙げられる。

アセタール型保護基としては、例えば、アルコキシアルキル基 (例、 C_{1-4} アルコキシ- C_{1-4} アルキル、例えばメトキシメチル、1-エトキシエチル、1-メチル-1-メトキシエチルなど)、アルコキシアルコキシアルキル基 (例、 C_{1-4} アルコキシ- C_{1-4} アルコキシ- C_{1-4} アルキル、例えばメトキシエトキシメチルなど)、アルキルチオアルキル基 (例、 C_{1-4} アルキルチオ- C_{1-4} アルキル、例えばメチルチオメチルなど)、テトラヒドロピラニル基 (例、テトラヒドロピラン-2-イル、4-メトキシテトラヒドロピラン-4-イルなど)、テトラヒドロチオピラニル基 (例、テトラヒドロチオピラン-2-イルなど)、テトラヒドロフラニル基 (例、

テトラヒドロフラン-2-イルなど)、テトラヒドロチオフラニル基(例、テトラヒドロチオフラン-2-イルなど)、アラルキルオキシアルキル基(例、ベンジルオキシメチルなど)などが挙げられる。

このうち、酸処理により脱保護できる保護基が好ましい。中でもテトラヒドロピラニル基(すなわちEがテトラヒドロピラニルオキシ基の場合)、1-エトキシエチル基(すなわちEが1-エトキシエトキシ基の場合)が好ましく、特にテトラヒドロピラン-2-イル(すなわちEが2-テトラヒドロピラニルオキシの場合)が好ましい。

本反応で用いる酸としては、例えば塩酸、臭化水素酸、硝酸および硫酸などの鉱酸；パラトルエンスルホン酸などのスルホン酸類；パラトルエンスルホン酸ピリジニウムなどの酸塩基対などが挙げられる。それらを化合物(XXXV)に対して0.01~0.5当量、好ましくは0.05~0.2当量用いる。

反応溶媒としては、例えばメタノール、エタノールなどのアルコール類；トルエン、キシレンなどの芳香族炭化水素類；塩化メチレン、クロロホルムなどのハロゲン化炭化水素類；エーテル、テトラヒドロフランなどのエーテル類；あるいは水が挙げられそれらを単独または混合して使用することができる。

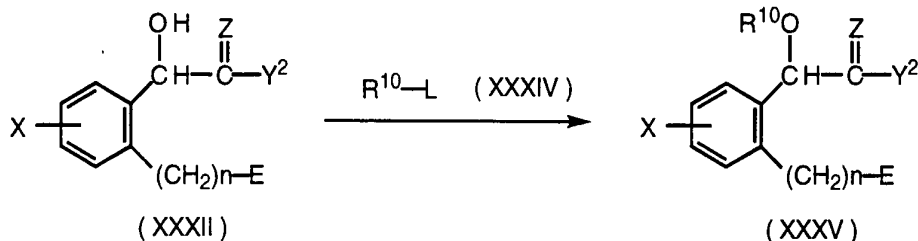
反応温度は0℃~溶媒還流温度までの適当な温度、好ましくは20℃~80℃、反応時間は、0.5時間~48時間、好ましくは0.5~12時間である。

得られた化合物(XXXVI)は、反応液のままか粗製物として、あるいは公知の手段(例、クロマトグラフィー、再結晶など)により分離精製後、次工程で使用することができる。

本反応の原料として使用することができる化合物(XXXV)は、好ま

しくは以下のV法により製造することができる。

V法



[式中、Lは脱離基を示し、他の記号は上記と同意義]

すなわち、化合物 (XXXV) は、適当な溶媒中、塩基存在下、化合物 (XXXII) に化合物 (XXXIV) を反応させることにより製造することができる。

上記式中、Lで示される脱離基としては、例えばハロゲン原子 (例、塩素、臭素、ヨウ素など)、アルキルスルホニルオキシ基 (例、メタンスルホニルオキシなど)、アリールスルホニルオキシ基など (例、パラートルエンルスルホニルオキシなど) などが挙げられる。

本反応で用いる化合物 (XXXIV) の好ましい具体例としては、ハロゲン化アルキル (例、塩化メチル、臭化メチル、ヨウ化メチル、塩化エチル、臭化エチル、ヨウ化エチル、1-ヨードプロパン、2-ヨードプロパン、1-ヨードブタン、クロロトリフルオロメタン、1,2-ジブロモエタン、クロロメチルエーテルなど)、ハロゲン化アルケニル (例、アシルブロミドなど)、ハロゲン化アルキニル (例、プロパルギルブロミドなど) などが挙げられ、これらを化合物 (XXXII) に対して1~5当量、好ましくは1~2当量用いる。

塩基としては、例えば有機塩基 (例、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウムt-ブトキシドなどのアルコキシド類)、無機塩基 (例、水酸化ナトリウム、水酸化カリウムなどの水酸化金属塩；水素化

ナトリウム、水素化カリウムなどの水素化物など)などが挙げられ、それらを化合物 (XXXI) に対して1~5当量、好ましくは1~2当量用いる。

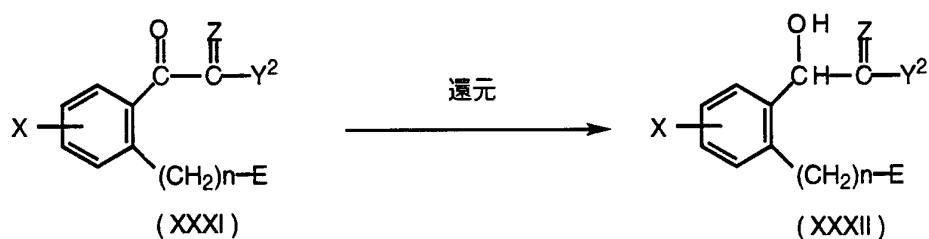
反応溶媒は、ジエチルエーテル、テトラヒドロフランなどのエーテル類; N、N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、トルエンなどを使用することができる。

反応温度は、-20℃から溶媒還流温度までの適当な温度、好ましくは0~50℃、反応時間は、0.5時間~48時間、好ましくは0.5~10時間である。

得られた化合物 (XXXV) は、反応液のままか粗製物として、あるいは公知の手段 (例、クロマトグラフィー、再結晶など) により分離精製後、次工程で使用することができる。

本反応の原料として使用することができる化合物 (XXXI) は、好ましくは以下のW法により製造することができる。

W法



[式中、各記号は上記と同意義]

すなわち、化合物 (XXXI) は、適当な溶媒中、化合物 (XXXI) を還元することにより製造することができる。

還元剤としては、ケトンの還元に用いる通常還元剤、例えば金属水素化物、金属水素錯化合物などを用いることができる。具体的には、三配位ボラン (例、ボランなど)、四配位ボラート (例、水素化ホウ素ナトリウ

ム、水素化ホウ素リチウムなど)、三配位アルミニウム(例、水素化ジイソブチルアルミニウムなど)、四配位アルミナート錯体(例、水素化リチウムアルミニウムなど)などが挙げられる。還元剤の使用量は、化合物(XXXI)に対して0.25~3当量、好ましくは1.0~1.2当量使用する。

反応溶媒としては、例えばメタノール、エタノールなどのアルコール類;ジエチルエーテル、テトラヒドロフランなどのエーテル類;水などが挙げられ、これらを単独でまたはこれらを混合して使用することができる。

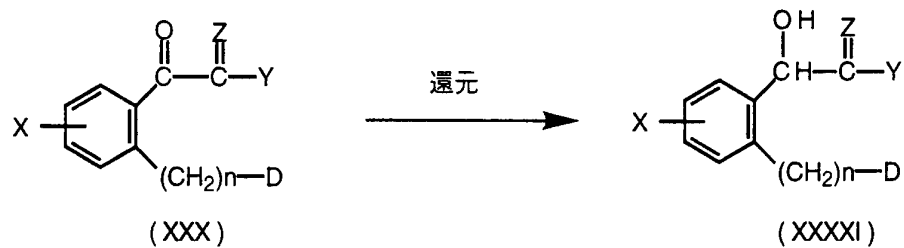
反応温度は、-20℃から溶媒還流温度までの適当な温度、好ましくは0~50℃、反応時間は、0.5時間~24時間、好ましくは0.5~2時間である。

得られた化合物(XXXXI)は、反応液のままか粗製物として、あるいは公知の手段(例、クロマトグラフィー、再結晶など)により分離精製後、次工程で使用することができる。

本反応の原料として用いる化合物(XXXI)は、例えばジャーナル・オブ・オーガニック・ケミストリー、USSR、5巻、1530ページ(1969年)に従い、2-(置換メチル)-1-プロモベンゼン類のグリニヤール化合物にシュウ酸ジアルキル類を反応させることにより得ることができる。

また、M法の原料として用いることができる化合物(XVII)に包含される化合物(XXXXI)は、以下のX法により製造することができる。

X法



[式中、各記号は上記と同意義]

すなわち、化合物 (XXXXI) は、適当な溶媒中、一般式 (XXX) で表される化合物を還元することにより製造することができる。

還元剤としては、ケトンの還元に用いる通常の還元剤、例えば金属水素化物、金属水素錯化合物などを用いることができる。具体的には、例えば三配位ボラン (例、ボランなど)、四配位ボラート (例、水素化ホウ素ナトリウム、水素化ホウ素リチウムなど)、三配位アルミニウム (例、水素化ジイソブチルアルミニウムなど)、四配位アルミナート錯体 (例、水素化リチウムアルミニウムなど) などが挙げられる。還元剤の使用量は、化合物 (XXX) に対して 0.25 ~ 3 当量、好ましくは 1.0 ~ 1.2 当量使用する。

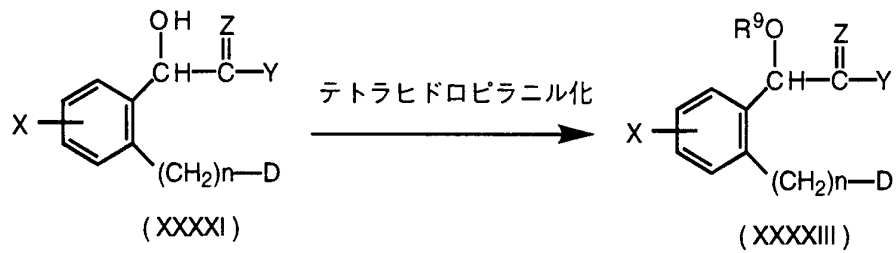
反応溶媒としては、例えばメタノール、エタノールなどのアルコール類；ジエチルエーテル、テトラヒドロフランなどのエーテル類；水などが挙げられ、これらを単独でまたはこれらを混合して使用することができる。

反応温度は、 -20°C から溶媒還流温度までの適当な温度、好ましくは $0 \sim 50^{\circ}\text{C}$ 、反応時間は、0.5 時間 ~ 24 時間、好ましくは 0.5 ~ 2 時間である。

得られた化合物 (XXXXI) は、反応液のままか粗製物として、あるいは公知の手段 (例、クロマトグラフィー、再結晶など) により分離精製後、次工程で使用することができる。

また、M法の原料として用いることができる化合物 (X V I I I) に包含される化合物 (X X X X I I I) は、好ましくは以下のY法により製造することができる。

Y法



[式中、R⁹はテトラヒドロピラニル基を示し、他の記号は上記と同意義]

すなわち、化合物 (X X X X I I I) は、化合物 (X X X X I) をテトラヒドロピラニル化することにより製造することができる。

R⁹で示されるテトラヒドロピラニル基としては、例えば2-テトラヒドロピラニルなどが挙げられる。

該テトラヒドロピラニル化は、テトラヒドロピラニル基による通常の水酸基保護法を用いて行うことができる。例えば、適当な溶媒中、酸存在下、化合物 (X X X X I) にジヒドロピランを反応させることにより行うことができる。

酸としては、例えばパラートルエンスルホン酸、塩酸、オキシ塩化リンなどや、パラートルエンスルホン酸ピリジニウムなどの酸塩基対が挙げられる。それらを化合物 (X X X X I) に対して0.01~0.5当量、好ましくは0.05~0.2当量用いる。

反応溶媒としては、例えばトルエン、キシレンなどの芳香族炭化水素類；塩化メチレン、クロロホルムなどのハロゲン化炭化水素類；あるいはエーテル、テトラヒドロフランなどのエーテル類などが挙げられそれらを単独

または混合して使用することができる。

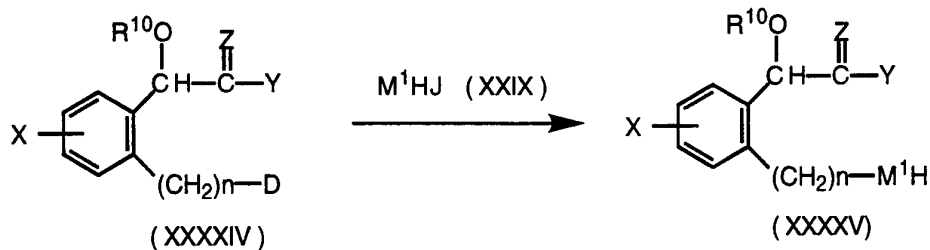
反応温度は0℃～溶媒還流温度までの適当な温度、好ましくは20℃～80℃、反応時間は、0.5時間～48時間、好ましくは0.5～12時間である。

得られた化合物 (XXXXIII) は、反応液のままか粗製物として、あるいは公知の手段 (例、クロマトグラフィー、再結晶など) により分離精製後、次工程で使用することができる。

本反応の原料として用いることができる化合物 (XXXXI) は、好ましくは上記X法により製造することができる。

また、N法の原料として用いることができる化合物 (XXIII) に含まれる化合物 (XXXXV) は、以下のZ法により製造することができる。

Z法



[式中、R¹⁰は置換されていてもよいアルキル基、置換されていてもよいアルケニル基または置換されていてもよいアルキニル基、Dはハロゲン原子、M¹は硫黄原子またはNR² (R²は水素原子、アルキル基またはアシル基)を示し、他の記号は上記と同意義]

すなわち、化合物 (XXXXV) は化合物 (XXXXIV) を化合物 (XXIX) と反応させることにより製造することができる。

化合物 (XXIX) はその金属塩であってもよい。金属塩としては、

アルカリ金属塩（ナトリウム塩、カリウム塩など）、アルカリ土類金属塩（マグネシウム塩、カルシウム塩など）などが挙げられる。

化合物（X X I X）としてメルカプタン類、例えば硫化水素の金属塩（例、水硫化ナトリウム、水硫化カリウム）を使用する場合、その使用量は化合物（X X X X I V）に対して1～5当量、好ましくは1～2当量である。反応溶媒としては、例えば、メタノール、エタノールなどのアルコール類；塩化メチレン、1、2-ジクロロエタンなどのハロゲン化炭化水素類；ジエチルエーテルなどのエーテル類；トルエンなどの芳香族炭化水素類、ジメチルスルホキシド、N、N-ジメチルホルムアミドなどを使用することができる。反応温度は、0℃から溶媒還流温度までの適当な温度、好ましくは室温から溶媒還流温度、反応時間は、0.5～24時間、好ましくは1～5時間である。

化合物（X X I X）としてアミン類、例えばアミン、アミンの金属塩（例、ナトリウムアミドなどを使用する場合、その使用量は化合物（X X X X I V）に対して1～5当量、好ましくは1～2当量である。反応溶媒としては、例えば、メタノール、エタノールなどのアルコール類；塩化メチレン、1、2-ジクロロエタンなどのハロゲン化炭化水素類；ジエチルエーテルなどのエーテル類；トルエンなどの芳香族炭化水素類、ジメチルスルホキシド、N、N-ジメチルホルムアミドなどを使用することができる。反応温度は、0℃から溶媒還流温度までの適当な温度、好ましくは0℃から室温、反応時間は、0.5～24時間、好ましくは1～5時間である。

得られた化合物（X X X X V）は、反応液のままか粗製物として、あるいは公知の手段（例、クロマトグラフィー、再結晶など）により分離精製後、次工程で使用することができる。

本発明の一般式（I）で表される化合物は、栽培植物またはその種、例

えば稲、コムギ、オオムギ、ライムギ、トウモロコシ、キビ、アワ、ソバ、大豆、小豆、落花生等あるいは果樹、例えば、かんきつ類、ブドウ、リンゴ、ナシ、桃、もしくは野菜、例えばキュウリ、ナス、トマト、カボチャ、またはインゲンを冒す病原菌(真菌)および土壤に由来する病原菌に対して有効である。本発明化合物は特に、イネいもち病菌(*P yricularia oryzae*)、イネ紋枯病菌(*R hizoctonia solani*)、ムギうどんこ病菌(*E rysiphe graminis*)、キュウリうどんこ病菌(*S phaerotheca fuliginea*)、タバコうどんこ病菌(*E rysiphe cichoracearum*)、バレイショ疫病菌(*P hylophthora infestans*)、キュウリべと病菌(*P seudoperonospora cubensis*)、ダイズべと病菌(*P eronospora manshurica*)、ブドウべと病菌(*P lasaopara viticola*)、あるいは野菜類、ブドウ等の灰色かび病菌(*B otrytis cinerea*)、キュウリ苗立枯病菌(*P ythium aphanidermatum*)、そば、大豆、なたね等の菌核病菌(*S clerotinia sclerotiorum*)、大豆、小豆、ばれいしょ、落下生等の白絹病菌(*C orticium rolfisii*)、ムギ眼紋病(*P seudocercospora herpotrichoides*)、エンバク冠さび病菌 (*P uccinia coronata*) 等に対して強力な抗菌活性を示す。それ故、本発明の一般式 (I) で表される化合物は農業用殺菌剤として有用である。

本発明の一般式 (I) で表される化合物の適用は植物に有効物質を、噴霧、散布、塗布等して処理するか、または植物の種子、または植物の周囲の土壤、あるいは種子を播種する土壤、水田、水耕栽培の水を有効物質で処理することにより行うことができる。適用は植物が病原菌に感染する前または感染後に行うことができる。

本化合物は通常の製剤の形態、例えば、液剤、水和剤、乳化剤、懸濁剤、液状濃縮剤、錠剤、顆粒剤、エアロゾル、粉末剤、ペースト剤、燻煙剤などのような農業用殺菌剤に適する薬剤として使用することができる。

このような形態は、少なくとも1種の本発明の化合物と適当な固体また

は液体の担体類、および所望により、有効物質の分散性や、他の性質の改善のために適当な補助剤(例えば、界面活性剤、展着剤、分散剤、安定剤)とともに混合する通常の方法によって得ることができる。

固体の担体、または希釈剤の例としては、植物性物質(例えば、穀物粉、タバコ茎粉、大豆粉、クルミ殻粉、野菜粉、カンナ屑、ぬか、樹皮粉、繊維素粉、野菜抽出残渣)、繊維状物質(例えば、紙、ダンボール紙、ぼろ布)、人工の可塑性粉末、粘土(例えば、カオリン、ベントナイト、白土)、タルクおよび無機物質(葉ろう石、絹雲母、軽石、硫黄粉、活性炭)、化学肥料(例えば、硫酸、りん酸アンモニウム、硝酸アンモニウム、尿素、塩化アンモニウム)などがある。

液体担体および希釈剤としては、水、アルコール類(例えば、メタノール、エタノール)、ケトン類(例えば、アセトン、メチルエチルケトン)、エーテル類(例えば、ジエチルエーテル、ジオキサン、セロソルブ、テトラヒドロフラン)、芳香族炭化水素(例えばベンゼン、トルエン、キシレン、メチルナフタレン)、脂肪族炭化水素(例えば、ガソリン、ケロシン、灯油)、エステル類、ニトリル類、酸アミド(例えば、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド)、ハロゲン化炭化水素(例えば、ジクロロエタン、四塩化炭素)などがある。

界面活性剤の例としては、アルキル硫酸エステル、スルホン酸アルキル、スルホン酸アルキルアリール、ポリエチレングリコールエーテル、多価アルコールエステル類などがある。展着剤または分散剤の例には、カゼイン、ゼラチン、デンプン粉、カルボキシメチルセルロース、アラビアゴム、アルギン酸、リグニン、ベントナイト、糖蜜、ポリビニルアルコール、パイン油および寒天などが挙げられる。安定剤としては、PAP(イソプロピルリン酸塩混合物)、リン酸トリクレジル(TCP)、トルー油、エポキシ油、

界面活性剤類、脂肪酸類およびそのエステル類が挙げられる。

上記の成分に加えて、本発明の製剤は他の殺菌剤、殺虫剤、除草剤、または肥料と混合して使用することができる。

一般に、上記製剤は、少なくとも1種の本発明の一般式(I)で表される化合物を、1~95重量%、好ましくは、2.0~80重量%含む。これらの製剤は単独で、または希釈して使用することができ、本発明の該化合物、約1.0g~5kg/ヘクタール、好ましくは、約2g~100g/ヘクタールを、通常は、約1~50,000ppm、好ましくは、約100~5,000ppmの濃度で使用する。

実施例

以下に、実施例および試験例を示して本発明をさらに詳しく説明するが、本発明はこれらに限定されるものではない。NMRデータ中のスピン結合定数(J)はヘルツ(Hz)で示す。

実施例1

2-ヒドロキシ-2-(2-フェノキシフェニル)アセトアミド(化合物番号2)の合成

2-オキソ-2-(2-フェノキシフェニル)アセトアミド4.82g(20.0mmol)をエタノール50mlに溶解し、氷冷下に水素化ホウ素ナトリウム0.76g(20.0mmol)をゆっくり加えた。30分間攪拌後、1N-塩酸で中和し、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を留去し、得られた油状物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン-酢酸エチルで溶出)で精製し、目的の2-ヒドロキシ-2-(2-フェノキシフェニル)アセトアミド4.3g(89%)を結晶として得た。n-ヘキサン-塩化メチレン混合溶媒で再結晶を行い、無色結晶を得た。

融点：121～122℃

NMR(δ ppm TMS/ CDCl_3): 4.11(1H,brs), 5.46(1H,s), 5.57(1H,brs),
6.58(1H,brs), 6.88(1H,dd,J=7.9,1.2), 7.03(2H,dd,J=7.9,1.2), 7.13-7.20(2H,m),
7.23-7.27(1H,m), 7.29-7.40(2H,m), 7.58(1H,dd,J=7.9,1.2).

実施例 2

2-[2-(2,5-ジメチルフェノキシメチル)フェニル]-2-ヒドロキシー-N-メチルアセトアミド(化合物番号75)の合成

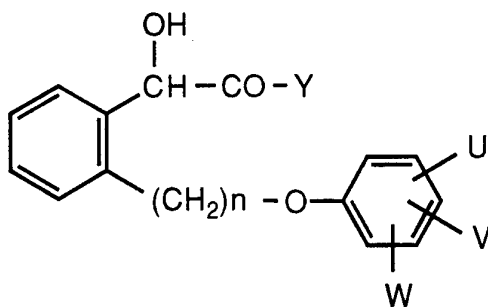
2-[2-(2,5-ジメチルフェノキシメチル)フェニル]-N-メチル-2-オキソアセトアミド0.93g(3.1mmol)をメタノール10mlに溶解し、氷冷下に水素化ホウ素ナトリウム0.06g(1.6mmol)をゆっくり加えた。30分間攪拌後、1N-塩酸で中和し、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を留去し、得られた油状物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン-酢酸エチルで溶出)で精製し、目的の2-[2-(2,5-ジメチルフェノキシメチル)フェニル]-2-ヒドロキシー-N-メチルアセトアミド0.85g(91%)を白色結晶として得た。

融点：86～87℃

NMR(δ ppm TMS/ CDCl_3): 2.16(3H,s), 2.35(3H,s), 2.78(3H,d,J = 4.9),
4.35(1H,d,J=3.7), 4.94(1H,d,J=11.0), 5.34(1H,d,J=11.0), 5.35(1H,d,J=3.7),
6.49(1H,brs), 6.78(1H,d,J=7.3), 6.87(1H,s), 7.06(1H,d,J=7.3), 7.32-
7.48(4H,m).

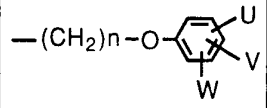


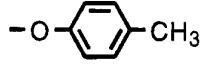
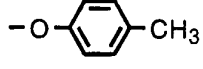
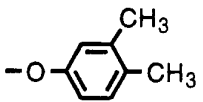
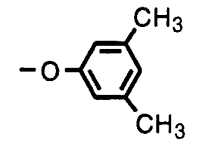
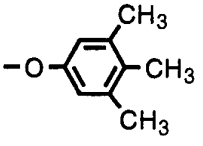
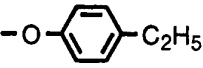
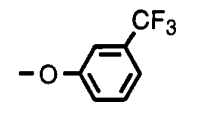
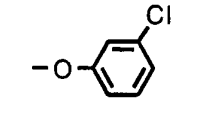
実施例 3

実施例1または2と同様にして、一般式(I-7)で表される本発明化合物を合成した。得られた化合物およびその代表的化合物の物性データを以下に示す。



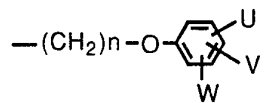
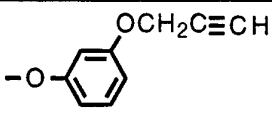
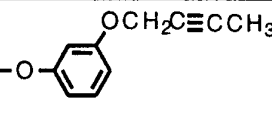
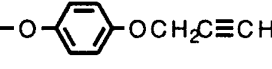
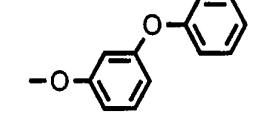
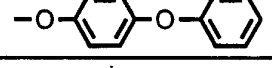
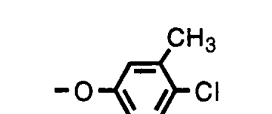
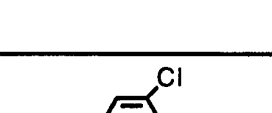
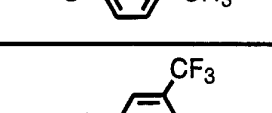
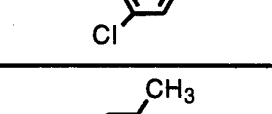
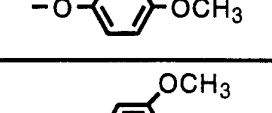
(1-7)

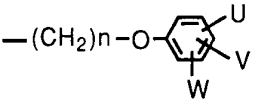
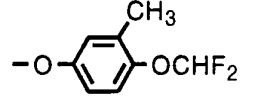
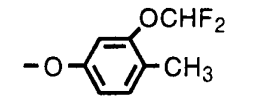
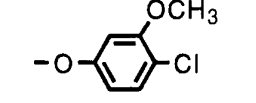
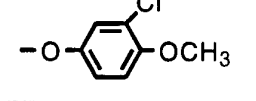
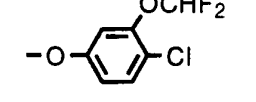
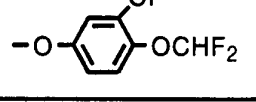
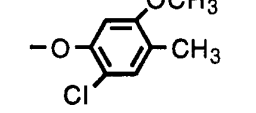
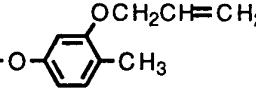
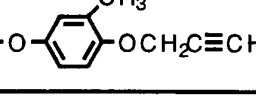
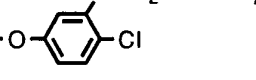
化合物 番号		Y	性状	融点または ¹ H-NMR(CDCl ₃) δ ppm
1		NHCH ₃	結晶	99.0~99.5 °C
2		NH ₂	結晶	121~122 °C
3		N(CH ₃) ₂	結晶	127~128 °C
4		NHCH ₂ OH	結晶	94.5~95.5 °C
5		NHCH ₃		
6		NH ₂		
7		NHCH ₃	油状物	2.34(3H, s), 2.81(3H, d, J=4.9), 4.20(1H, br), 5.40(1H, s), 6.4(1H, brs), 6.80-6.88(3H, m), 6.96(1H, d, J=7.3), 7.13-7.28(3H, m), 7.55(1H, dd, J=7.3, 1.8).
8		NHCH ₂ OH		
9		N(CH ₃) ₂		
10		NH ₂		

化合物 番号		Y	性状	融点または ¹ H-NMR(CDCl ₃) δ ppm
1 1		NHCH ₃	結晶	7 9 ~ 8 2 °C
1 2		NHCH ₂ OH		
1 3		N(CH ₃) ₂		
1 4		NHC ₂ H ₅		
1 5		NHCH ₃	油状物	2.25(6H,s),2.84(3H,d,J=4.9),5.43(1H,s),6.58(1H,brs),6.74(1H,dd,J=7.3,1.2),6.81(1H,s),6.83(1H,d,J=7.3),7.11(1H,d,J=7.3),7.13(1H,dt,J=1.2,7.3),7.22(1H,dt,J=1.8,7.3),7.54(1H,dd,J=7.3,1.8).
1 6		NHCH ₃	結晶	1 1 9 ~ 1 2 0 °C
1 7		NHCH ₃		
1 8		NHCH ₃		
1 9		NHCH ₃		
2 0		NHCH ₃		

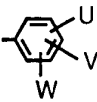
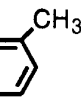

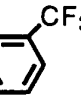
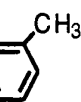
化合物 番号		Y	性状	融点または ¹ H-NMR(CDCl ₃) δ ppm
2 1		NHCH ₃		
2 2		NH ₂		
2 3		NHCH ₃	油状物	2.83(3H, d, J=4.9), 4.20 (1H, brs), 5.36(1H, s), 6.41(1H, brs), 6.84(1H, d, J=6.7), 6.93-6.98(2H, m), 7.16-7.33(4H, m), 7.53(1H, dd, J=7.3, 1.8).
2 4		NHCH ₂ OH		
2 5		N(CH ₃) ₂		
2 6		NHC ₂ H ₅		
2 7		NHCH ₃		
2 8		NHCH ₃		
2 9		NHCH ₃		
3 0		NHCH ₃		

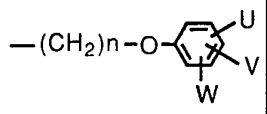
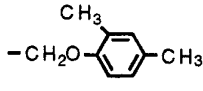
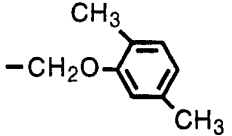
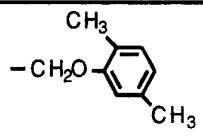
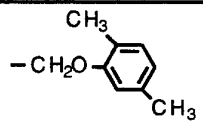
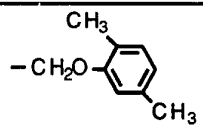
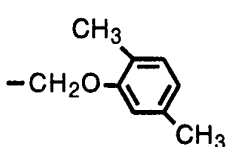
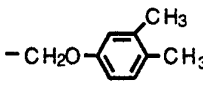
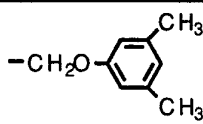
化合物 番号		Y	性状	融点または ¹ H-NMR(CDCl ₃) δ ppm
3 1		NHCH ₃		
3 2		NHCH ₃		
3 3		NHCH ₃		
3 4		NHCH ₃		
3 5		NHCH ₃		
3 6		NHCH ₃		
3 7		NHCH ₃		
3 8		NHCH ₃		
3 9		NHCH ₃		
4 0		NHCH ₃		

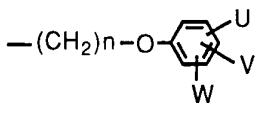
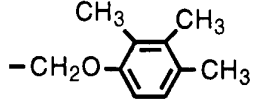
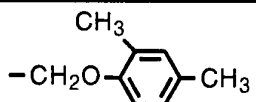
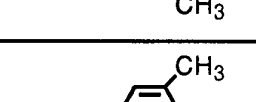
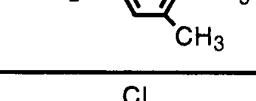
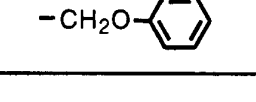
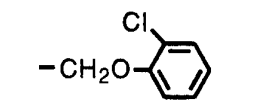
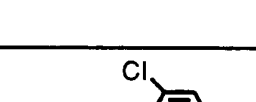
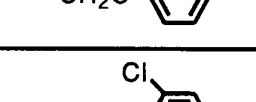
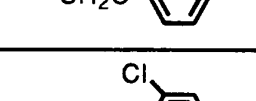
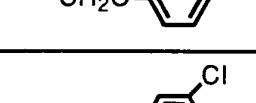
化合物 番号		Y	性状	融点または ¹ H-NMR(CDCl ₃) δ ppm
4 1		NHCH ₃		
4 2		NHCH ₃		
4 3		NHCH ₃		
4 4		NHCH ₃		
4 5		NHCH ₃		
4 6		NHCH ₃	油状物	2.34(3H, s), 2.83(3H, d, J = 4.9), 4.20(1H, brs), 5.36(1H, s), 6.41(1H, brs), 6.76-6.90(3H, m), 7.17-7.31(3H, m), 7.56(1H, dd, J=7.3, 1.8).
4 7		NHCH ₃		
4 8		NHCH ₃		
4 9		NHCH ₃		
5 0		NHCH ₃		

化合物 番号	$-(CH_2)_n-O-$ 	Y	性状	融点または $^1H-NMR(CDCl_3)$ δ ppm
5 1		NHCH ₃		
5 2		NHCH ₃		
5 3		NHCH ₃		
5 4		NHCH ₃		
5 5		NHCH ₃		
5 6		NHCH ₃		
5 7		NHCH ₃		
5 8		NHCH ₃		
5 9		NHCH ₃		
6 0		NHCH ₃		

化合物 番号		Y	性状	融点または ¹ H-NMR(CDCl ₃) δ ppm
6 1		NHCH ₃		
6 2		NH ₂		
6 3		NHCH ₃	油状物	2.81(3H, d, J=4.9), 5.02(1H, d, J=11.0), 5.26(1H, s), 5.30 (1H, d, J=11.0), 6.73(1H, brs), 6.97(2H, d, J=7.9), 7.05 (1H, t, J=7.3), 7.31-7.50 (6H, m)
6 4		NHCH ₃	結晶	104.6~105.7 °C
6 5		NH ₂		
6 6		NHCH ₂ OH		
6 7		N(CH ₃) ₂		
6 8		NHC ₂ H ₅		

化合物 番号	$-(\text{CH}_2)_n-\text{O}-$ 	Y	性状	融点または $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta \text{ ppm}$
69	$-\text{CH}_2\text{O}-$ 	NHCH_3	油状物	2.36(3H, s), 2.75(3H, d, J=4.8), 4.55(1H, brs), 4.97(1H, d, J=11.0), 5.20(1H, s), 5.21(1H, d, J=11.0), 6.73-6.84(4H, m), 7.19(1H, t, J=7.6), 7.28-7.44(4H, m)
70	$-\text{CH}_2\text{O}-$ 	NHCH_3	油状物	2.30(3H, s), 2.77(3H, d, J=4.8), 4.55(1H, m), 4.97(1H, d, J=11.0), 5.23(1H, s), 5.24(1H, d, J=11.0), 6.83(1H, brs), 6.85(2H, d, J=8.8), 7.13(2H, d, J=8.8), 7.29-7.48(4H, m)
71	$-\text{CH}_2\text{O}-$ 	NHCH_3	油状物	2.76(3H, d, J=4.8), 4.60(1H, brs), 5.11(1H, d, J=11.0), 5.12(1H, s), 5.16(1H, d, J=11.0), 6.61(1H, brs), 7.09-7.18(2H, m), 7.27-7.44(6H, m)
72	$-\text{CH}_2\text{O}-$ 	NHCH_3		

化合物 番号		Y	性状	融点または ¹ H-NMR(CDCl ₃) δ ppm
7 3		NHCH ₃		
7 4		NH ₂	油状物	2.12(3H,s),2.33(3H,s),4.40(1H, d, J=4.3), 4.93(1H, d, J=11.0), 5.27(1H, d, J=11.0), 5.34(1H, d, J=4.3), 6.06(1H, brs), 6.63(1H, brs), 6.75(1H, d, J=7.3), 6.83(1H, s), 7.03(1H, d, J=7.9), 7.29-7.47(4H, m).
7 5		NHCH ₃	結晶	86~87 °C
7 6		NHCH ₂ OH		
7 7		N(CH ₃) ₂	結晶	144~145 °C
7 8		NHC ₂ H ₅	油状物	0.99(3H, d, J=7.3), 2.17(3H, s), 2.32(3H, s), 3.13-3.27(2H, m), 4.45(1H, d, J=4.3), 4.96(1H, d, J=11.6), 5.24(1H, d, J=11.6), 5.28(1H, d, J=4.3), 6.62(1H, brs).
7 9		NHCH ₃		
8 0		NHCH ₃		

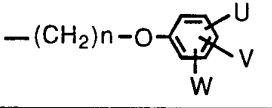
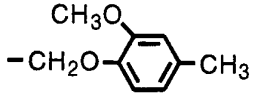
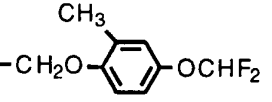
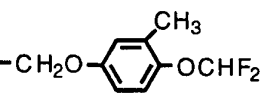
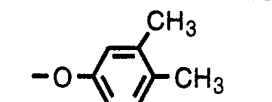
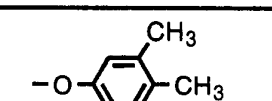
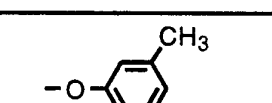
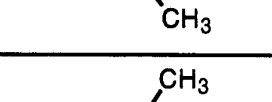
化合物 番号		Y	性状	融点または ¹ H-NMR(CDCl ₃) δ ppm
8 1		NHCH ₃		
8 2		NHCH ₃		
8 3		NHCH ₃		
8 4		NH ₂		
8 5		NHCH ₃	油状物	2.80(3H, d, J=4.9), 4.99(1H, d, J=10.4), 5.28(1H, s), 5.42(1H, d, J=10.4), 6.62(1H, brs), 7.00(1H, t, J=7.3), 7.16(1H, d, J=7.9), 7.28-7.50(6H, m)
8 6		NHCH ₂ OH		
8 7		N(CH ₃) ₂		
8 8		NHC ₂ H ₅		
8 9		NHCH ₃		
9 0		NH ₂		

化合物 番号		Y	性状	融点または ¹ H-NMR(CDCl ₃) δ ppm
9 1		NHCH ₃	結晶	6 8 ~ 7 0 °C
9 2		NHCH ₂ OH		
9 3		N(CH ₃) ₂		
9 4		NHC ₂ H ₅		
9 5		NHCH ₃		
9 6		NHCH ₃		
9 7		NHCH ₃		
9 8		NHCH ₃		
9 9		NHCH ₃	油状物	2.80(3H, d, J=4.9), 5.00(1H, d, J=11.0), 5.26(1H, s), 5.38(1H, d, J=11.0), 6.50(1H, brs), 7.07(1H, d, J=8.5), 7.25- 7.29(1H, m), 7.31-7.50 (5H, m)
1 0 0		NHCH ₃		

化合物 番号		Y	性状	融点または ¹ H-NMR(CDCl ₃) δ ppm
101		NHCH ₃		
102		NHCH ₃		
103		NHCH ₃		
104		NHCH ₃	油状物	2.76(3H, d, J=4.8), 3.76(3H, s), 4.50(1H, brs), 4.95(1H, d, J=11.0), 5.19(1H, d, J=11.0) 5.24(1H, s), 6.83-6.88(5H, m), 7.30-7.43(4H, m)
105		NHCH ₃		
106		NHCH ₃		
107		NHCH ₃		
108		NHCH ₃		
109		NHCH ₃		
110		NHCH ₃		

化合物 番号		Y	性状	融点または ¹ H-NMR(CDCl ₃) δ ppm
111		NHCH ₃		
112		NH ₂	結晶	151~152℃
113		NHCH ₃	結晶	142~143℃
114		NHCH ₂ OH		
115		N(CH ₃) ₂	結晶	125~127℃
116		NHC ₂ H ₅	油状物	0.99-1.17(合わせて3H), 2.19(3H, s), 3.15-3.31(合 わせて2H), 4.48(1H, br), 5.02(1H, d, J = 11.8), 5.18 (1H, d, J=11.6), 5.21(1H, s), 6.61(1H, brs), 6.83(1H, d, J = 8.5), 7.08(1H, d, J = 8.5), 7.12(1H, s), 7.31- 7.43(4H, m).
117		NHCH ₃		
118		NHCH ₃		
119		NHCH ₃		

化合物 番号		Y	性状	融点または ¹ H-NMR(CDCl ₃) δ ppm
1 2 0		NHCH ₃		
1 2 1		NHCH ₃		
1 2 2		NHCH ₃		
1 2 3		NHCH ₃		
1 2 4		NHCH ₃		
1 2 5		NHCH ₃		
1 2 6		NHCH ₃		
1 2 7		NHCH ₃		
1 2 8		NHCH ₃		
1 2 9		NHCH ₃		
1 3 0		NHCH ₃		

化合物 番号		Y	性状	融点または ¹ H-NMR(CDCl ₃) δ ppm
131		NHCH ₃		
132		NHCH ₃		
133		NHCH ₃		
134		NH ₂		
135		NHCH ₂ OH		
136		NH ₂		
137		NHCH ₂ OH		

実施例 4

2-[2-(2,5-ジメチルフェノキシメチル)フェニル]-2-メトキシ酢酸メチル(化合物番号139)の合成

2-[2-(2,5-ジメチルフェノキシメチル)フェニル]-2-ヒドロキシ酢酸メチル(0.72g, 2.4 mmol)、ヨウ化メチル(0.68g, 4.8 mmol)のN、N-ジメチルホルムアミド(6 ml)溶液を0℃で攪拌下、その中に60%油状水素化ナトリウム(0.13g, 3.3 mmol)を加えた。30分後、氷、水の順に加え酢酸エチルで抽出し、水、飽和食塩水の順に洗い、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を留去後、残渣をシリカゲルカラムクロマト

グラフィー（*n*-ヘキサン/酢酸エチル=9/1）で精製し、目的物の2-[2-(2,5-ジメチルフェノキシメチル)フェニル]-2-ヒドロキシ酢酸メチル(0.69g, 92%)を油状物として得た。

NMR (δ ppm, TMS/ CDCl_3): 2.21(3H,s), 2.33(3H,s), 3.40(3H,s), 3.70(3H,s), 5.10(1H,d,J=12.2), 5.14(1H,s), 5.28(1H,d,J=12.2), 6.71(1H,d,J=7.3), 6.76(1H,s), 7.04(1H,d,J=7.3), 7.33-7.40(2H,m), 7.50-7.56(2H,m).

実施例 5

2-[2-(2,5-ジメチルフェノキシメチル)フェニル]-2-メトキシ-N-メチル酢酸アミド（化合物番号140）の合成

2-[2-(2,5-ジメチルフェノキシメチル)フェニル]-2-メトキシ酢酸メチル(0.44g, 1.40 mmol)のメタノール(5 ml)溶液を室温下で攪拌し、その中に40%メチルアミンメタノール溶液(0.33g, 4.2 mmol)を加えた。22時間後、減圧濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（*n*-ヘキサン/酢酸エチル=2/1）で精製し、目的物の2-[2-(2,5-ジメチルフェノキシメチル)フェニル]-2-メトキシ-N-メチル酢酸アミド(0.36g, 82%)を白色結晶として得た。

融点：86-88℃

NMR (δ ppm, TMS/ CDCl_3): 2.19(3H,s), 2.32(3H,s), 2.83(3H,d,J=4.9), 3.36(3H,s), 5.04(1H,s), 5.07(1H,d,J=11.6), 5.47(1H,d,J=11.6), 6.70(1H,d,J=7.3), 6.79(1H,brs), 6.79(1H,s), 7.03(1H,d,J=7.9), 7.33-7.43(3H,m), 7.49-7.54(1H,m).

実施例 6

2-[2-(2,5-ジメチルフェノキシメチル)フェニル]-2-メトキシ-N-メチル酢酸チオアミド（化合物番号170）の合成

2-[2-(2,5-ジメチルフェノキシメチル)フェニル]-2-メトキシ

シー-N-メチル酢酸アミド(0.12g, 0.38 mmol)、ローソン試薬(0.14g, 0.35 mmol)のトルエン(5 ml)溶液を80℃で2時間加熱攪拌した。室温に冷却後、反応溶液をそのままシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン/酢酸エチル=4/1)で精製し、目的の2-[2-(2,5-ジメチルフェノキシメチル)フェニル]-2-メトキシ-N-メチル酢酸チオアミド(0.13g, 100%)を油状物として得た。

NMR (δ ppm, TMS/ CDCl_3): 2.20(3H,s), 2.32(3H,s), 3.23(3H,d,J=4.8), 3.35(3H,s), 5.12(1H,d,J=11.6), 5.40(1H,s), 5.58(1H,d,J=11.6), 6.70(1H,d,J=7.3), 6.81(1H,s), 7.03(1H,d,J=7.3), 7.28-7.38(3H,m), 7.48-7.52(1H, m), 8.78(1H,brs).

実施例 7

2-アセトキシ-2-[2-(2,5-ジメチルフェノキシメチル)フェニル]-2-N-メチル酢酸アミド(化合物番号144)の合成

2-[2-(2,5-ジメチルフェノキシメチル)フェニル]-2-ヒドロキシ-N-メチル酢酸アミド(0.57g, 1.9 mmol)、無水酢酸(0.43g, 4.2 mmol)のピリジン(3 ml)溶液を室温下8時間攪拌した。減圧留去後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン/酢酸エチル=1/1)で精製し、目的の2-アセトキシ-2-[2-(2,5-ジメチルフェノキシメチル)フェニル]-N-メチル酢酸アミド(0.53g, 82%)を白色結晶として得た。

融点: 114-115℃

NMR (δ ppm, TMS/ CDCl_3): 2.18(3H,s), 2.19(3H,s), 2.34(3H,s), 2.76(3H,d,J=4.9), 5.02(1H,d,J=11.6), 5.45(1H,d,J=11.6), 6.19(1H,brs), 6.35(1H,s), 6.75(1H,d,J=7.3), 6.85(1H,s), 7.05(1H,d,J=7.3), 7.36-7.58(4H,m).

実施例 8

2-クロロ-2-[2-(2,5-ジメチルフェノキシメチル)フェニル]酢酸メチル(化合物番号149)の合成

2-[2-(2,5-ジメチルフェノキシメチル)フェニル]-2-ヒドロキシ酢酸メチル(0.50g, 1.6 mmol)の1,2-ジクロロエタン(20 ml)溶液を室温下で攪拌し、その中に塩化チオニル(0.61g, 5.1 mmol)を加え、一終夜加熱還流した。減圧留去後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン/酢酸エチル=97/3)で精製し、目的物の2-クロロ-2-[2-(2,5-ジメチルフェノキシメチル)フェニル]酢酸メチル(0.35g, 66%)を油状物として得た。

NMR (δ ppm, TMS/ CDCl_3): 2.20(3H,s), 2.35(3H,s), 3.76(3H,s), 5.14(2H,s), 5.84(1H,s), 6.73(1H,d,J=7.3), 6.77(1H,s), 7.05(1H,d,J=7.3), 7.38-7.48(3H,m), 7.66(1H,d,J=7.3).

実施例 9

2-[2-(2,5-ジメチルフェノキシメチル)フェニル]-2-ニトロ酢酸メチル(化合物番号439)の合成

2-クロロ-2-[2-(2,5-ジメチルフェノキシメチル)フェニル]酢酸メチル(0.35g, 1.1 mmol)、亜硝酸ナトリウム(0.13g, 1.9 mmol)、プロロゲルシノール(0.145g, 1.1 mmol)のN,N-ジメチルホルムアミド(10 ml)溶液を室温下6時間攪拌した。水を加え、エーテルで抽出し、水、飽和食塩水の順に洗い、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を留去後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン/塩化メチレン=1/1)で精製し、目的物の2-[2-(2,5-ジメチルフェノキシメチル)フェニル]-2-ニトロ酢酸メチル(0.08g, 22%)を油状物として得た。

NMR (δ ppm, TMS/ CDCl_3): 2.09(3H,s), 2.34(3H,s), 3.85(3H,s),

5.05(1H,d,J=11.0), 5.10(1H,d,J=11.0), 6.68(1H,s), 6.74(1H,d,J=7.3),
6.75(1H,s), 7.03(1H,d,J=7.3), 7.48-7.53(2H,m), 7.61-7.66(1H,m).

実施例 10

2-[2-(2,5-ジメチルフェノキシメチル)フェニル]-2-メチル
チオ酢酸メチル (化合物番号 162) の合成

2-クロロ-2-[2-(2,5-ジメチルフェノキシメチル)フェニル]
酢酸メチル(0.21g, 0.66 mmol)、ナトリウムチオメトキシド(0.06g,
0.86 mmol)のN,N-ジメチルホルムアミド(3 ml)溶液を室温下24時間
攪拌した。水を加え、エーテルで抽出し、水、飽和食塩水の順に洗い、無
水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を留去後、残渣をシリカゲルカラムク
ロマトグラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル=9/1) で精製し、目的
物の2-[2-(2,5-ジメチルフェノキシメチル)フェニル]-2-チオ
メチル酢酸メチル(0.13g, 60%)を油状物として得た。

NMR (δ ppm, TMS/ CDCl_3): 2.10(3H,s), 2.20(3H,s), 2.34(3H,s), 3.71(3H,s),
4.95(1H,s), 5.13(2H,s), 6.72(1H,d,J=7.3), 6.77(1H,s), 7.04(1H,d,J=7.3), 7.30-
7.40(2H,m), 7.46(1H,dd,J=7.3,1.8), 7.68(1H,dd,J=7.3,1.8).

実施例 11

2-[2-(2,5-ジメチルフェノキシメチル)フェニル]-2-メチル
スルフィニル酢酸メチル (化合物番号 358) および 2-[2-(2,5-ジ
メチルフェノキシメチル)フェニル]-2-メチルスルホニル酢酸メチル(化
合物番号 359) の合成

2-[2-(2,5-ジメチルフェノキシメチル)フェニル]-2-メチル
チオ酢酸メチル(0.13g, 0.39 mmol)の塩化メチレン(5 ml)溶液を0℃で
攪拌し、その中に80%メタ-クロロ過安息香酸(0.12g, 0.56 mmol)を
加えた。0℃で2時間攪拌後、反応液をチオ硫酸ナトリウム水溶液、1N

一水酸化ナトリウム水溶液で洗い無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を留去後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（*n*-ヘキサン/酢酸エチル=3/1つづいて1/1）で精製し、目的物の2-[2-(2,5-ジメチルフェノキシメチル)フェニル]-2-メチルスルホニル酢酸メチル(0.08g, 56%)を結晶として、2-[2-(2,5-ジメチルフェノキシメチル)フェニル]-2-メチルスルフィニル酢酸メチル(0.03g, 22%)を油状物として得た。

化合物番号359；融点122-124℃

NMR (δ ppm, TMS/ CDCl_3): 2.17(3H,s), 2.34(3H,s), 3.03(3H,s), 3.81(3H,s), 5.02(1H,d,J=11.6), 5.39(1H,d,J=11.6), 5.67(1H,s), 6.72(1H,d,J=7.3), 6.79(1H,s), 7.03(1H,d,J=7.3), 7.40-7.55(3H,m), 7.81-7.85(1H,m).

化合物番号358；NMR (δ ppm, TMS/ CDCl_3): 2.17(3H,s), 2.34と2.36(合わせて3H), 2.44と2.63(合わせて3H), 3.78と3.81(合わせて3H), 4.98-5.22(合わせて3H), 6.71-7.81(合わせて7H).

実施例12

2-[2-(2,5-ジメチルフェノキシメチル)フェニル]ブチロニトリルの合成

2-[2-(2,5-ジメチルフェノキシメチル)フェニル]アセトニトリル(2.00g, 8.0 mmol)のN,N-ジメチルホルムアミド(20 ml)溶液を0℃で攪拌し、その中に60%油状水素化ナトリウム(0.38g, 9.5 mmol)を加え、つづいてヨウ化エチル(1.37g, 8.8 mmol)を5分間で滴下した。1時間後、水を加え酢酸エチルで抽出し、水つづいて飽和食塩水の順に洗い、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を留去後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（*n*-ヘキサン/酢酸エチル=19/1）で精製し、目的物の2-[2-(2,5-ジメチルフェノキシメチル)フェニル]ブチロ

ニトリル(1.91g, 86%)を油状物として得た。

NMR (δ ppm, TMS/ CDCl_3): 1.10(3H,t,J=7.3), 1.97(2H,5重線,J=7.3),
2.16(3H,s), 2.34(3H,s), 4.05(1H,t,J=7.3), 4.96(1H,d,J=11.0),
5.05(1H,d,J=11.0), 6.73(1H,d,J=7.3), 6.76(1H,s), 7.04(1H,d,J=7.3), 7.31-
7.44(3H,m), 7.55(1H,d,J=7.9).

実施例 13

2-[2-(2,5-ジメチルフェノキシメチル)フェニル]ブチルアミド
(化合物番号159)の合成

2-[2-(2,5-ジメチルフェノキシメチル)フェニル]ブチロニトリル(1.00g, 3.6 mmol)、96%水酸化ナトリウム(0.44g, 10.6 mmol)のメタノール(10 ml)溶液を44時間加熱還流した。溶媒を留去後、水を加え、酢酸エチルで抽出し、飽和食塩水で洗い無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を留去後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン/酢酸エチル=3/1)で精製し、目的物の2-[2-(2,5-ジメチルフェノキシメチル)フェニル]ブチルアミド(0.28g, 26%)を白色結晶として得た。

融点: 100-101°C

NMR (δ ppm, TMS/ CDCl_3): 0.89(3H,t,J=7.3), 1.78-1.89(1H,m), 2.15(3H,s),
2.15-2.28(1H,m), 2.36(3H,s), 3.73(1H,t,J=7.3), 4.84(1H,d,J=11.0),
5.20(1H,brs), 5.26(1H,d,J=11.0), 5.86(1H,brs), 6.77(1H,d,J=7.3),
7.30(1H,d,J=7.3), 7.38-7.43(2H,m), 7.49(1H,d,J=7.3).

実施例 14

2-[2-(2,5-ジメチルフェノキシメチル)フェニル]-N-メチル
ブチルアミド(化合物番号146)およびN,N-ジメチル-2-[2-(2,
5-ジメチルフェノキシメチル)フェニル]ブチルアミド(化合物番号16

3) の合成

2-[2-(2,5-ジメチルフェノキシメチル)フェニル]ブチルアミド(0.19g, 0.6 mmol)をN,N-ジメチルホルムアミド(5 ml)に溶かし、0℃で攪拌した。その中に、60%油状水素化ナトリウム(0.05g, 1.3 mmol)を加えた。5分後ヨウ化メチル(0.18g, 1.3 mmol)を加え、その後室温下で2時間攪拌した。0℃で氷、水の順に加え、酢酸エチルで抽出した。抽出液を水、飽和食塩水の順に洗い無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を留去後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン/酢酸エチル=4/1つづいて3/1)で精製し、目的物のN,N-ジメチル-2-[2-(2,5-ジメチルフェノキシメチル)フェニル]ブチルアミド(0.06g, 29%)と2-[2-(2,5-ジメチルフェノキシメチル)フェニル]-N-メチルブチルアミド(0.11g, 55%)をそれぞれ白色結晶として得た。

化合物番号163；融点：62-62.5℃

NMR (δ ppm, TMS/ CDCl_3): 0.94(3H,t,J=7.3), 1.62-1.77(1H,m), 2.09-2.26(1H,m), 2.14(3H,s), 2.36(3H,s), 2.85(3H,s), 2.95(3H,s), 3.93(1H,dd,J=9.1,4.9), 4.96(1H,d,J=11.0), 5.15(1H,d,J=11.0), 6.73(1H,d,J=7.3), 6.80(1H,s), 7.05(1H,d,J=7.9), 7.23-7.46(4H,m).

化合物番号146；融点：108-110℃

NMR (δ ppm, TMS/ CDCl_3): 0.86(3H,t,J=7.3), 1.77-1.88(1H,m), 2.16(3H,s), 2.16-2.29(1H,m), 2.35(3H,s), 2.67(3H,d,J=4.9), 3.63(1H,t,J=7.3), 4.84(1H,d,J=11.0), 5.24(1H,d,J=11.0), 5.80(1H,brs), 6.76(1H,d,J=7.3), 6.84(1H,s), 7.06(1H,d,J=7.3), 7.27(1H,t,J=7.3), 7.38(2H,t,J=7.3), 7.49(1H,d,J=7.3).

実施例15

2-[2-(2,5-ジメチルフェノキシメチル)フェニル]酪酸メチル(化合物番号145)の合成

2-[2-(2,5-ジメチルフェノキシメチル)フェニル]ブチロニトリル(0.67g, 2.4 mmol)、96%水酸化ナトリウム(0.73g, 17.5 mmol)のエタノール(8 ml)溶液を43時間加熱還流した。溶媒を留去後、水を加え、1N-塩酸でpH 3にして酢酸エチルで抽出した。抽出液を無水硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去した。粗生物をN,N-ジメチルホルムアミド(5 ml)に溶かし、室温下で攪拌した。その中に、ヨウ化メチル(0.50 g, 3.5 mmol)、炭酸カリウム(0.50 g, 3.6 mmol)の順に加えた。1時間後水を加え、酢酸エチルで抽出した。抽出液を水、飽和食塩水の順に洗い無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を留去後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン/酢酸エチル=9/1)で精製し、目的物の2-[2-(2,5-ジメチルフェノキシメチル)フェニル]酪酸メチル(0.62g, 83%)を白色結晶として得た。

融点: 62-65°C

NMR (δ ppm, TMS/ CDCl_3): 0.91(3H,t,J=7.3), 1.78-1.89(1H,m), 2.07-2.21(1H,m), 2.18(3H,s), 2.34(3H,s), 3.64(3H,s), 3.84(1H,t,J=7.3), 5.02(1H,d,J=11.0), 5.19(1H,d,J=11.0), 6.71(1H,d,J=7.3), 6.78(1H,s), 7.04(1H,d,J=7.3), 7.27-7.44(2H,m), 7.44-7.47(2H,m).

実施例16

α -メトキシ-N-メチル-(2,3,5-トリメチルフェノキシメチル)フェニルアセトアミド(化合物番号465)の合成

2-クロロメチル- α -メトキシ-N-メチルフェニルアセトアミド(0.25g, 1.1 mmol)と2,3,5-トリメチルフェノール(0.18g, 1.3 mmol)のN,N-ジメチルホルムアミド(3 ml)溶液を0°Cで攪拌し、その中

に60%の油状水素化ナトリウム(0.08g, 2.0mmol)を加えた。0℃で70分、つづいて室温下で1時間攪拌後、氷、水の順に加えた。酢酸エチルで抽出し、飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン/酢酸エチル=7/3)で精製し、目的物の α -メトキシ-N-メチル-(2,3,5-トリメチルフェノキシメチル)フェニルアセトアミド(0.17g, 50%)を油状物として得た。

NMR (δ ppm, TMS/ CDCl_3): 2.11(3H,s), 2.23(3H,s), 2.29(3H,s), 2.81(3H,d,J=4.9), 3.35(3H,s), 5.03(1H,s), 5.03(1H,d,J=11.6), 5.44(1H,d,J=11.6), 6.64(1H,s), 6.68(1H,s), 6.80(1H,brs), 7.32-7.43(3H,m), 7.50-7.53(1H,m).

実施例17

(3-クロロ-5-トリフルオロメチル-2-ピリジルオキシメチル)- α -メトキシ-N-メチル-フェニルアセトアミド(化合物番号427)の合成

2-ヒドロキシメチル- α -メトキシ-N-メチルフェニルアセトアミド(1.00g, 4.8mmol)のN,N-ジメチルホルムアミド(5ml)溶液を0℃で攪拌し、その中に60%の油状水素化ナトリウム(0.19g, 4.8mmol)を加えた。0℃で30分間攪拌後、2,3-ジクロロ-5-トリフルオロメチルピリジン(1.24g, 5.7mmol)を加え、0℃で2時間攪拌後、氷、水の順に加えた。エーテルで抽出し、飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン/酢酸エチル=1/1)で精製し、目的物の(3-クロロ-5-トリフルオロメチル-2-ピリジルオキシメチル)- α -メトキシ-N-メチル-フェニルアセトアミド(1.40g, 75%)を油状物として得た。

融点：133～135℃

NMR (δ ppm, TMS/ CDCl_3): 2.83(3H,d,J=4.9), 3.38(3H,s), 5.19(1H,s),
5.60(1H,d,J=12.2), 5.92(1H,d,J=12.2), 6.80(1H,brs), 7.28-7.40(3H,m), 7.55-
7.538(1H,m), 7.84(1H,s), 8.32(1H,s).

実施例 18

以上の実施例 4～17と同様にして、一般式 (I) で表される種々の化合物を合成した。得られた化合物およびその代表的物性データを以下に示す。表中、U、VおよびWはQで示される一般式 (XX) で表される基における置換基を意味する。また、表中には実施例 4～17で得られた化合物およびその物性データも併記する。

化合物 番号	X	R ¹	Z	Y	M	n	U	V	W
139	H	OCH ₃	O	OCH ₃	O	1	2-CH ₃	5-CH ₃	H
140	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	2-CH ₃	5-CH ₃	H
141	H	OCH ₂ OCH ₃	O	OCH ₃	O	1	2-CH ₃	5-CH ₃	H
142	H	OCH ₂ OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	2-CH ₃	5-CH ₃	H
143	H	OCOCH ₃	O	OCH ₃	O	1	2-CH ₃	5-CH ₃	H
144	H	OCOCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	2-CH ₃	5-CH ₃	H
145	H	C ₂ H ₅	O	OCH ₃	O	1	2-CH ₃	5-CH ₃	H
146	H	C ₂ H ₅	O	NHCH ₃	O	1	2-CH ₃	5-CH ₃	H
147	H	NH ₂	O	OCH ₃	O	1	2-CH ₃	5-CH ₃	H
148	H	NH ₂	O	NHCH ₃	O	1	2-CH ₃	5-CH ₃	H
149	H	Cl	O	OCH ₃	O	1	2-CH ₃	5-CH ₃	H
150	H	Cl	O	NHCH ₃	O	1	2-CH ₃	5-CH ₃	H
151	H	OC ₂ H ₅	O	OCH ₃	O	1	2-CH ₃	5-CH ₃	H
152	H	OC ₄ H ₉	O	OCH ₃	O	1	2-CH ₃	5-CH ₃	H
153	H	OCH ₂ CH=CH ₂	O	OCH ₃	O	1	2-CH ₃	5-CH ₃	H
154	H	CF ₃	O	OCH ₃	O	1	2-CH ₃	5-CH ₃	H
155	H	OC ₂ H ₅	O	NHCH ₃	O	1	2-CH ₃	5-CH ₃	H
156	H	OC ₄ H ₉	O	NHCH ₃	O	1	2-CH ₃	5-CH ₃	H

化合物 番号	X	R ¹	Z	Y	M	n	U	V	W
159	H	C ₂ H ₅	O	NH ₂	O	1	2-CH ₃	5-CH ₃	H
160	H	SCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	2-CH ₃	5-CH ₃	H
161	H	OCH ₃	O	NH ₂	O	1	2-CH ₃	5-CH ₃	H
162	H	SCH ₃	O	OCH ₃	O	1	2-CH ₃	5-CH ₃	H
163	H	C ₂ H ₅	O	N(CH ₃) ₂	O	1	2-CH ₃	5-CH ₃	H
165	H	OCH ₃	O	N(CH ₃) ₂	O	1	2-CH ₃	5-CH ₃	H
166	H	OC ₂ H ₅		N(CH ₃) ₂	O	1	2-CH ₃	5-CH ₃	H
167	H	C ₂ H ₅	O	OH	O	1	2-CH ₃	5-CH ₃	H
169	H	OCH ₃	S	OCH ₃	O	1	2-CH ₃	5-CH ₃	H
170	H	OCH ₃	S	NHCH ₃	O	1	2-CH ₃	5-CH ₃	H
171	H	OCOCH ₃	O	NHCH ₃	O	0	H	H	H
173	H	OCOCH ₃	O	NHCH ₃	O	0	2-CH ₃	H	H
174	H	OCH ₃	O	OCH ₃	O	1	4-Cl	H	H
175	H	C ₂ H ₅	O	OH	O	0	4-OCH ₃	H	H
176	H	OCH ₃	O	SCH ₃	O	1	2-CH ₃	5-CH ₃	H
177	H	C ₂ H ₅	O	NH ₂	O	0	4-OCH ₃	H	H

化合物 番号	X	R ¹	Z	Y	M	n	U	V	W
178	H	OCOCH ₃	O	NHCH ₃	O	0	3-CH ₃	4-CH ₃	H
179	H	OCH ₃	O	N(CH ₃) ₂	O	1	2-CH ₃	H	H
180	H	C ₂ H ₅	O	OCH ₃	O	0	4-OCH ₃	H	H
181	H	OCOCH ₃	O	OCH ₃	O	0	H	H	H
182	H	OCH ₃	O	OCH ₃	O	0	H	H	H
183	H	OC ₂ H ₅	O	OCH ₃	O	0	H	H	H
184	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	0	H	H	H
185	H	OCH ₃	O	OC ₂ H ₅	O	1	2-CH ₃	4-Cl	H
186	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	2-CH ₃	4-Cl	H
188	H	OC ₂ H ₅	O	NHCH ₃	O	0	H	H	H
189	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	4-Cl	H	H
193	H	OCH ₃	O	OCH ₃	O	1	2-Cl	H	H
194	H	OCH ₃	O	OCH ₃	O	1	2-CH ₃	H	H
195	H	OCH ₃	O	OCH ₃	O	1	H	H	H
196	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	2-Cl	H	H
197	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	2-CH ₃	H	H

化合物 番号	X	R ¹	Z	Y	M	n	U	V	W
198	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	H	H	H
205	H	OCH ₃	O	OCH ₃	O	1	3-Cl	5-Cl	H
206	H	OCH ₃	O	OCH ₃	O	1	2-Cl	4-Cl	H
207	H	OCH ₃	O	OCH ₃	O	1	3-CF ₃	H	H
208	H	OCH ₃	O	OCH ₃	O	1	4-OCH ₃	H	H
209	H	OCH ₃	O	OCH ₃	O	1	4-CH ₃	H	H
210	H	OCH ₃	O	OCH ₃	O	1	3-CH ₃	H	H
211	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	4-CH ₃	H	H
212	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	3-CH ₃	H	H
213	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	3-Cl	5-Cl	H
214	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	3-CF ₃	H	H
215	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	4-OCH ₃	H	H
216	H	OCH ₃	O	OCH ₃	O	1	2-CH ₃	3-CH ₃	H
217	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	2-CH ₃	3-CH ₃	H

化合物 番号	X	R ¹	Z	Y	M	n	U	V	W
2 1 8	H	OCH ₃	O	OCH ₃	O	1	2-CH ₃	4-CH ₃	H
2 1 9	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	2-CH ₃	4-CH ₃	H
2 2 0	H	OCH ₃	O	OCH ₃	O	1	3-CH ₃	4-CH ₃	H
2 2 1	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	3-CH ₃	4-CH ₃	H
2 2 2	H	OCH ₃	O	OCH ₃	O	1	3-CH ₃	5-CH ₃	H
2 2 3	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	3-CH ₃	5-CH ₃	H
2 2 4	H	OCH ₃	O	OCH ₃	O	1	2-CH ₃	3-CH ₃	4-CH ₃
2 2 5	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	2-CH ₃	3-CH ₃	4-CH ₃
2 2 6	H	OCH ₃	O	OCH ₃	O	1	2-CH ₃	4-CH ₃	5-CH ₃
2 2 7	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	2-CH ₃	4-CH ₃	5-CH ₃
2 2 8	H	OCH ₃	O	OCH ₃	O	1	3-CH ₃	4-CH ₃	5-CH ₃
2 2 9	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	3-CH ₃	4-CH ₃	5-CH ₃
2 3 0	H	OCH ₃	O	OCH ₃	O	1	3-Cl	H	H
2 3 1	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	3-Cl	H	H
2 3 2	H	OCH ₃	O	OCH ₃	O	1	2-Br	H	H
2 3 3	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	2-Br	H	H
2 3 4	H	OCH ₃	O	OCH ₃	O	1	4-Br	H	H
2 3 5	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	4-Br	H	H
2 3 6	H	OCH ₃	O	OCH ₃	O	1	4-F	H	H
2 3 7	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	4-F	H	H

化合物 番号	X	R ¹	Z	Y	M	n	U	V	W
2 3 8	H	OCH ₃	O	OCH ₃	O	1	4-I	H	H
2 3 9	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	4-I	H	H
2 4 0	H	OCH ₃	O	OCH ₃	O	1	3-Cl	4-Cl	H
2 4 1	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	3-Cl	4-Cl	H
2 4 2	H	OCH ₃	O	OCH ₃	O	1	2-Cl	5-Cl	H
2 4 3	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	2-Cl	5-Cl	H
2 4 4	H	OCH ₃	O	OCH ₃	O	1	2-OCH ₃	H	H
2 4 5	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	2-OCH ₃	H	H
2 4 6	H	OCH ₃	O	OCH ₃	O	1	3-OCH ₃	H	H
2 4 7	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	3-OCH ₃	H	H
2 4 8	H	OCH ₃	O	OCH ₃	O	1	3-OC ₂ H ₅	H	H
2 4 9	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	3-OC ₂ H ₅	H	H
2 5 0	H	OCH ₃	O	OCH ₃	O	1	3-OCH ₂ CH=CH ₂	H	H
2 5 1	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	3-OCH ₂ CH=CH ₂	H	H
2 5 2	H	OCH ₃	O	OCH ₃	O	1	4-OCH ₂ C≡CH	H	H
2 5 3	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	4-OCH ₂ C≡CH	H	H
2 5 4	H	OCH ₃	O	OCH ₃	O	1	2-OCHF ₂	H	H
2 5 5	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	2-OCHF ₂	H	H
2 5 6	H	OCH ₃	O	OCH ₃	O	1	4-OCHF ₂	H	H
2 5 7	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	4-OCHF ₂	H	H

化合物 番号	X	R ¹	Z	Y	M	n	U	V	W
258	H	OCH ₃	O	OCH ₃	O	1	3-OPh	H	H
259	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	3-OPh	H	H
260	H	OCH ₃	O	OCH ₃	O	1	3-OCH ₃	4-OCH ₃	H
261	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	3-OCH ₃	4-OCH ₃	H
262	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	2-Cl	4-Cl	H
263	H	OCH ₃	O	OCH ₃	O	1	2-CH ₃	4-Cl	H
264	H	OCH ₃	O	OCH ₃	O	1	2-CH ₃	4-Br	H
265	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	2-CH ₃	4-Br	H
266	H	OCH ₃	O	OCH ₃	O	1	2-Cl	4-CH ₃	H
267	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	2-Cl	4-CH ₃	H
268	H	OCH ₃	O	OCH ₃	O	1	3-CH ₃	4-Cl	H
269	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	3-CH ₃	4-Cl	H
270	H	OCH ₃	O	OCH ₃	O	1	2-CH ₃	3-CH ₃	4-Cl
271	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	2-CH ₃	3-CH ₃	4-Cl
272	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	3-Cl	4-CH ₃	5-Cl
273	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	2-Cl	5-CF ₃	H
274	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	2-Cl	4-OCH ₃	H
275	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	2-Br	4-OCH ₃	H
276	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	3-Cl	4-OCH ₃	H
277	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	3-OCH ₃	4-Cl	H

化合物 番号	X	R ¹	Z	Y	M	n	U	V	W
278	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	3-Cl	4-OCH ₃	5-Cl
279	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	2-Cl	4-OCHF ₂	H
280	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	3-Cl	4-OCHF ₂	H
281	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	2-CH ₃	4-OCH ₃	H
282	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	2-OCH ₃	4-CH ₃	H
283	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	2-CH ₃	4-OCHF ₂	H
285	H	OCH ₃	O	OCH ₃	O	0	4-Cl	H	H
286	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	0	4-Cl	H	H
288	H	OCH ₃	O	OCH ₃	O	0	4-CH ₃	H	H
289	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	0	4-CH ₃	H	H
291	H	OCH ₃	O	OCH ₃	O	0	3-CH ₃	4-CH ₃	H
292	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	0	3-CH ₃	4-CH ₃	H
293	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	0	2-CH ₃	H	H
294	H	OCH ₃	O	OCH ₃	O	0	3-CH ₃	H	H
295	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	0	3-CH ₃	H	H
296	H	OCH ₃	O	OCH ₃	O	0	3-CH ₃	5-CH ₃	H
297	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	0	3-CH ₃	5-CH ₃	H

化合物 番号	X	R ¹	Z	Y	M	n	U	V	W
298	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	0	3-CH ₃	4-CH ₃	5-CH ₃
299	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	0	4-C ₂ H ₅	H	H
300	H	OCH ₃	O	OCH ₃	O	0	3-CF ₃	H	H
301	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	0	3-CF ₃	H	H
302	H	OCH ₃	O	OCH ₃	O	0	3-Cl	H	H
303	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	0	3-Cl	H	H
304	H	OCH ₃	O	OCH ₃	O	0	3-Br	H	H
305	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	0	3-Br	H	H
306	H	OCH ₃	O	OCH ₃	O	0	4-Br	H	H
307	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	0	4-Br	H	H
308	H	OCH ₃	O	OCH ₃	O	0	4-F	H	H
309	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	0	4-F	H	H
310	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	0	4-I	H	H
311	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	0	3-Cl	4-Cl	H
312	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	0	2-Cl	H	H
313	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	0	3-OCH ₃	H	H
314	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	0	3-OC ₃ H ₇	H	H
315	H	OCH ₃	O	OCH ₃	O	0	4-OCH ₃	H	H
316	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	0	4-OCH ₃	H	H
317	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	0	4-OC ₂ H ₅	H	H

化合物 番号	X	R ¹	Z	Y	M	n	U	V	W
3 1 8	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	0	3-OCH ₃	4-OCH ₃	H
3 1 9	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	0	3-OCHF ₂	H	H
3 2 0	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	0	4-OCHF ₂	H	H
3 2 1	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	0	3-OCH ₂ CH=CH ₂	H	H
3 2 2	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	0	4-OCH ₂ CH=CH ₂	H	H
3 2 3	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	0	3-OCH ₂ C≡CH	H	H
3 2 4	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	0	3-OCH ₂ C≡CCH ₃	H	H
3 2 5	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	0	4-OCH ₂ C≡CH	H	H
3 2 6	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	0	3-OPh	H	H
3 2 7	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	0	4-OPh	H	H
3 2 8	H	OCH ₃	O	OCH ₃	O	0	3-CH ₃	4-Cl	H
3 2 9	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	0	3-CH ₃	4-Cl	H
3 3 0	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	0	3-Cl	4-CH ₃	H
3 3 1	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	0	2-Cl	5-CF ₃	H
3 3 2	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	0	3-CH ₃	4-OCH ₃	H
3 3 3	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	0	3-OCH ₃	4-CH ₃	H
3 3 4	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	0	3-CH ₃	4-OCHF ₂	H
3 3 5	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	0	3-OCHF ₂	4-CH ₃	H
3 3 6	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	0	3-OCH ₃	4-Cl	H
3 3 7	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	0	3-Cl	4-OCH ₃	H

化合物 番号	X	R ¹	Z	Y	M	n	U	V	W
3 3 8	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	0	3-OCHF ₂	4-Cl	H
3 3 9	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	0	3-Cl	4-OCHF ₂	H
3 4 0	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	0	2-Cl	4-CH ₃	5-OCH ₃
3 4 1	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	0	3-CH ₂ CH =CH ₂	4-CH ₃	H
3 4 2	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	0	3-CH ₃	4-OCH ₂ C ≡CH	H
3 4 3	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	0	3-CH ₂ CH =CH ₂	4-Cl	H
3 4 4	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	0	3-Cl	4-OCH ₂ C ≡CH	H
3 4 5	4-Cl	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	2-CH ₃	5-CH ₃	H
3 4 6	5-Cl	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	2-CH ₃	5-CH ₃	H
3 4 7	4- CH ₃	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	2-CH ₃	5-CH ₃	H
3 4 8	5- CH ₃	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	2-CH ₃	5-CH ₃	H
3 4 9	4- OCH ₃	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	2-CH ₃	5-CH ₃	H
3 5 0	5- OCH ₃	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	2-CH ₃	5-CH ₃	H
3 5 1	H	OCH ₂ C ≡CH	O	NHCH ₃	O	1	2-CH ₃	5-CH ₃	H
3 5 2	H	OCHF ₂	O	NHCH ₃	O	1	2-CH ₃	5-CH ₃	H
3 5 3	H	OCOSCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	2-CH ₃	5-CH ₃	H
3 5 4	H	OSO ₂ CH ₃	O	NHCH ₃	O	1	2-CH ₃	5-CH ₃	H
3 5 5	H	OSO ₂ Ph- 4-CH ₃	O	NHCH ₃	O	1	2-CH ₃	5-CH ₃	H
3 5 6	H	OCONHCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	2-CH ₃	5-CH ₃	H
3 5 7	H	OCON(CH ₃) ₂	O	NHCH ₃	O	1	2-CH ₃	5-CH ₃	H

化合物 番号	X	R ¹	Z	Y	M	n	U	V	W
358	H	SOCH ₃	O	OCH ₃	O	1	2-CH ₃	5-CH ₃	H
359	H	SO ₂ CH ₃	O	OCH ₃	O	1	2-CH ₃	5-CH ₃	H
360	H	SOCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	2-CH ₃	5-CH ₃	H
361	H	SO ₂ CH ₃	O	NHCH ₃	O	1	2-CH ₃	5-CH ₃	H
362	H	NHCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	2-CH ₃	5-CH ₃	H
363	H	N(CH ₃) ₂	O	NHCH ₃	O	1	2-CH ₃	5-CH ₃	H
364	H	NO ₂	O	NHCH ₃	O	1	2-CH ₃	5-CH ₃	H
365	H	NO ₂	O	NHCH ₃	O	0	H	H	H
366	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	S	1	2-CH ₃	5-CH ₃	H
367	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	NH	1	2-CH ₃	5-CH ₃	H
368	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	NCH ₃	1	2-CH ₃	5-CH ₃	H
369	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	NCHO	1	2-CH ₃	5-CH ₃	H
370	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	NCOCH ₃	1	2-CH ₃	5-CH ₃	H
371	H	OCH ₃	S	NHCH ₃	O	1	2-CH ₃	H	H
372	H	OCH ₃	S	NHCH ₃	O	1	2-CH ₃	4-Cl	H
373	H	SCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	2-CH ₃	H	H
374	H	SCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	2-CH ₃	4-Cl	H
375	H	OC ₂ H ₅	O	NHCH ₃	O	1	2-CH ₃	H	H
376	H	OC ₂ H ₅	O	NHCH ₃	O	1	2-CH ₃	4-Cl	H
377	H	SCH ₃	O	NHCH ₃	O	0	H	H	H

化合物 番号	X	R ¹	Z	Y	M	n	U	V	W
379	H	SCH ₃	O	NHCH ₃	O	0	4-CH ₃	H	H
380	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	4-SCH ₃	H	H
381	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	S	1	2-CH ₃	H	H
382	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	S	1	2-CH ₃	4-Cl	H
383	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	4-SCH ₃	H	H
384	H	CH ₃	O	NHCH ₃	O	1	2-CH ₃	5-CH ₃	H
385	H	OCOC ₂ H ₅	O	NHCH ₃	O	1	2-CH ₃	5-CH ₃	H
386	H	OCH ₃	O	NHC ₂ H ₅	O	1	2-CH ₃	5-CH ₃	H
387	H	OCH ₃	O	NH ₂	O	1	2-CH ₃	H	H
388	H	OCH ₃	O	NH ₂	O	1	2-CH ₃	4-Cl	H

化合物 番号	X	R ¹	Z	Y	M	n	Q
389	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	0	6-Cl-ピリミジン-4-イル
390	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	0	4,6-(CH ₃) ₂ -ピリミジン-2-イル
391	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	0	3,5-Cl ₂ -ピリジン-2-イル
392	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	0	5-Cl-ピリジン-2-イル
393	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	0	5-CF ₃ -ピリジン-2-イル
394	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	0	5-CF ₃ -6-Cl-ピリジン-2-イル
395	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	0	キノリン-4-イル
396	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	0	キナゾリン-4-イル
397	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	0	ベンゾチアゾール-2-イル
398	H	OCH ₃	O	OCH ₃	O	1	ベンゾチアゾール-2-イル
399	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	ベンゾチアゾール-2-イル
400	H	OCH ₃	O	OCH ₃	O	1	キノリン-4-イル
401	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	キノリン-4-イル
402	H	OCH ₃	O	OCH ₃	O	1	キナゾリン-4-イル
403	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	キナゾリン-4-イル
404	H	OCH ₃	O	OCH ₃	O	1	1,3-(CH ₃) ₂ -4-CO ₂ CH ₃ - ピラゾール-5-イル
405	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	1,3-(CH ₃) ₂ -4-CO ₂ CH ₃ - ピラゾール-5-イル
406	H	OCH ₃	O	OCH ₃	O	1	1-CH ₃ -4-CHO-ピラゾール- 5-イル
407	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	1-CH ₃ -4-CHO-ピラゾール- 5-イル
408	H	OCH ₃	O	OCH ₃	O	1	5-CO ₂ C ₂ H ₅ -6-C ₂ H ₅ - ピリミジン-4-イル

化合物 番号	X	R ¹	Z	Y	M	n	Q
409	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	5-CO ₂ C ₂ H ₅ -6-C ₂ H ₅ - ピリミジン-4-イル
410	H	OCH ₃	O	OCH ₃	O	1	4,6-(CH ₃) ₂ -ピリミジン-2-イル
411	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	4,6-(CH ₃) ₂ -ピリミジン-2-イル
412	H	OCH ₃	O	OCH ₃	O	1	6-Cl-ピリミジン-4-イル
413	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	6-Cl-ピリミジン-4-イル
414	H	OCH ₃	O	OCH ₃	O	1	5-Cl-6-CH ₃ -ピリミジン-4-イル
415	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	5-Cl-6-CH ₃ -ピリミジン-4-イル
416	H	OCH ₃	O	OCH ₃	O	1	5-CF ₃ -6-Cl-ピリミジン-2-イル
417	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	5-CF ₃ -6-Cl-ピリミジン-2-イル
418	H	OH	O	NHCH ₃	O	1	3-CF ₃ -6-Cl-ピリミジン-2-イル
419	H	OCH ₃	O	OCH ₃	O	1	3-CF ₃ -6-Cl-ピリミジン-2-イル
420	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	3-CF ₃ -6-Cl-ピリミジン-2-イル
421	H	OH	O	NHCH ₃	O	1	3-CF ₃ -ピリミジン-2-イル
422	H	OCH ₃	O	OCH ₃	O	1	3-CF ₃ -ピリミジン-2-イル
423	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	3-CF ₃ -ピリミジン-2-イル
425	H	OH	O	NHCH ₃	O	1	3-Cl-5-CF ₃ -ピリミジン-2-イル
426	H	OCH ₃	O	OCH ₃	O	1	3-Cl-5-CF ₃ -ピリミジン-2-イル
427	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	3-Cl-5-CF ₃ -ピリミジン-2-イル
428	H	OH	O	NHCH ₃	O	1	5-CF ₃ -ピリミジン-2-イル

化合物 番号	X	R ¹	Z	Y	M	n	Q
4 2 9	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	5-CF ₃ -ピリジン-2-イル
4 3 0	H	OCH ₃	O	OCH ₃	O	1	5-CF ₃ -ピリジン-2-イル
4 3 1	H	OH	O	NHCH ₃	O	1	3,5-Cl ₂ -ピリジン-2-イル
4 3 2	H	OCH ₃	O	OCH ₃	O	1	3,5-Cl ₂ -ピリジン-2-イル
4 3 3	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	3,5-Cl ₂ -ピリジン-2-イル
4 3 4	H	OH	O	NHCH ₃	O	1	2-Cl-ピリジン-3-イル
4 3 6	H	OCH ₃	O	OCH ₃	O	1	2-Cl-ピリジン-3-イル
4 3 7	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	2-Cl-ピリジン-3-イル

化合物 番号	X	R ¹	Z	Y	M	n	U	V	W
4 3 8	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	4-CH ₂ OCH ₃	H	H
4 3 9	H	NO ₂	O	OCH ₃	O	1	2-CH ₃	5-CH ₃	H

化合物 番号	X	R ¹	Z	Y	M	n	Q
4 4 1	H	OH	O	NHCH ₃	O	1	5-CF ₃ -6-Cl-ピリジン-2-イル
4 4 3	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	5-Cl-ピリジン-2-イル
4 4 6	H	OH	O	NHCH ₃	O	1	3-CF ₃ -5-Cl-ピリジン-2-イル
4 4 7	H	OCH ₃	O	OCH ₃	O	1	3-CF ₃ -5-Cl-ピリジン-2-イル
4 4 8	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	3-CF ₃ -5-Cl-ピリジン-2-イル
4 5 1	H	OH	O	NHCH ₃	O	1	6-CF ₃ -ピリジン-2-イル

化合物 番号	X	R ¹	Z	Y	M	n	Q
4 5 2	H	OCH ₃	O	OCH ₃	O	1	6-CF ₃ -ピリジン-2-イル
4 5 3	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	6-CF ₃ -ピリジン-2-イル
4 5 4	H	OCH ₃	O	OCH ₃	O	1	5-Cl-ピリジン-2-イル
4 5 5	H	OH	O	NHCH ₃	O	1	5-Cl-ピリジン-2-イル
4 5 7	H	OH	O	NHCH ₃	O	1	5-CF ₃ -3,6-Cl ₂ -ピリジン-2-イル
4 5 8	H	OCH ₃	O	OCH ₃	O	1	5-CF ₃ -3,6-Cl ₂ -ピリジン-2-イル
4 5 9	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	5-CF ₃ -3,6-Cl ₂ -ピリジン-2-イル

化合物 番号	X	R ¹	Z	Y	M	n	U	V	W
4 6 0	H	OCH ₃	S	NH ₂	O	1	2-CH ₃	5-CH ₃	H
4 6 1	H	OC ₄ H ₉	S	NHCH ₃	O	1	2-CH ₃	5-CH ₃	H
4 6 2	H	NH ₂ ·HCl	O	NHCH ₃	O	1	2-CH ₃	5-CH ₃	H
4 6 3	H	NH ₂ ·HCl	O	OCH ₃	O	1	2-CH ₃	5-CH ₃	H
4 6 5	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	2-CH ₃	3-CH ₃	5-CH ₃

化合物 番号	X	R ¹	Z	Y	M	n	Q
4 6 6	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	3-Cl-ピリジン-2-イル
4 6 7	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	O	1	3-CH ₃ -ピリジン-2-イル
4 6 8	H	OCH ₃	O	NHCH ₃	S	1	3,5-Cl ₂ -ピリジン-2-イル

化合物 番号	X	R ¹	Z	Y	M	n	U	V	W
4 6 9	H	OCH ₃	O	N(CH ₃)C ₂ H ₅	O	1	2-CH ₃	4-Cl	H
4 7 0	H	OCH ₃	O	OH	O	1	2-CH ₃	5-CH ₃	H
4 7 1	H	OCH ₃	S	N(CH ₃) ₂	O	1	2-CH ₃	H	H
4 7 2	H	OCH ₃	O	NCH ₃	O	1	2-Cl	5-CH ₃	H
4 7 3	H	OCH ₃	O	NCH ₃	O	1	2-CH ₃	6-CH ₃	H

化合物 番号	融点または ¹ H-NMR(CDCl ₃) δ ppm
139	2.21(3H, s), 2.33(3H, s), 3.40(3H, s), 3.70(3H, s), 5.10(1H, d, J=12.2), 5.14(1H, s), 5.28(1H, d, J=12.2), 6.71(1H, d, J=7.3), 6.76(1H, s), 7.04(1H, d, J=7.3), 7.33-7.40(2H, m), 7.50-7.56(2H, m)
140	86 - 88 °C
141	2.23(3H, s), 2.32(3H, s), 3.36(3H, s), 3.71(3H, s), 4.67(1H, d, J=6.7), 4.75(1H, d, J=6.7), 5.17(1H, d, J=12.2), 5.23(1H, d, J=12.2), 5.49(1H, s), 6.71(1H, d, J=7.9), 6.75(1H, s), 7.04(1H, d, J=7.3), 7.34-7.40(2H, m), 7.53-7.57(2H, m)
142	81 - 82 °C
143	77 - 80 °C
144	114 - 115 °C
145	62 - 65 °C
146	108 - 110 °C
149	2.20(3H, s), 2.35(3H, s), 3.76(3H, s), 5.14(2H, s), 5.84(1H, s), 6.73(1H, d, J=7.3), 6.77(1H, s), 7.05(1H, d, J=7.3), 7.38-7.48(3H, m), 7.66(1H, d, J=7.3)
150	111 ~ 113 °C
151	1.26(3H, t, J=7.3), 2.21(3H, s), 2.32(3H, s), 3.42-3.67(2H, m), 3.70(3H, s), 5.12(1H, d, J=12.2), 5.23(1H, s), 5.28(1H, d, J=12.2), 6.70(1H, d, J=7.3), 6.75(1H, s), 7.04(1H, d, J=7.3), 7.32-7.38(2H, m), 7.49-7.58(2H, m)

化合物 番号	融点または ¹ H-NMR(CDCl ₃) δ ppm
1 5 2	0.89(3H, t, J=7.3), 1.32-1.45(2H, m), 1.57-1.68(2H, m), 2.22(3H, s), 2.33(3H, s), 3.39-3.47(1H, m), 3.52-3.60(1H, m), 3.70(3H, s), 5.12(1H, d, J=12.2), 5.20(1H, s), 5.27(1H, d, J=12.2), 6.71(1H, d, J=7.9), 6.75(1H, s), 7.04(1H, d, J=7.3), 7.34-7.39(2H, m), 7.52-7.55(2H, m)
1 5 5	9 8 - 1 0 0 °C
1 5 6	5 8 - 6 0 °C
1 5 9	1 0 0 - 1 0 1 °C
1 6 1	2.19(3H, s), 2.32(3H, s), 3.36(3H,s), 5.02(1H, s), 5.07(1H, d, J=11.6), 5.40(1H, d, J=11.6), 5.88(1H, brs), 6.70(1H, d, J=7.3), 6.71(1H, brs), 6.78(1H, s), 7.03(1H, d, J=7.3), 7.32-7.40(2H, m), 7.42-7.48(1H, m), 7.50-7.53(1H, m)
1 6 2	2.10(3H, s), 2.20(3H, s), 2.34(3H, s), 3.71(3H, s), 4.95(1H, s), 5.13(2H, s), 6.72(1H, d, J=7.3), 6.77(1H, s), 7.04(1H, d, J=7.3), 7.30-7.40(2H, m), 7.46(1H, dd, J=7.3, 1.8), 7.68(1H, dd, J=7.3, 1.8)
1 6 3	6 2 - 6 2 . 5 °C
1 6 5	2.17(3H, s), 2.33(3H, s), 2.87(3H, s), 3.00(3H, s), 3.44(3H, s), 5.02(1H, d, J=11.6), 5.26(1H, d, J=11.6), 5.32(1H,s), 6.71(1H, d, J=7.3), 6.79(1H, s), 7.03(1H, d, J=7.3), 7.30-7.40(3H, m), 7.50-7.54(1H, m)
1 6 6	8 0 - 8 1 °C

化合物 番号	融点または ¹ H-NMR(CDCl ₃) δ ppm
170	2.20(3H, s), 2.32(3H, s), 3.23(3H, d, J=4.8), 3.35(3H, s), 5.12(1H, d, J=11.6), 5.40(1H, s), 5.58(1H, d, J=11.6), 6.70(1H, d, J=7.3), 6.81(1H, s), 7.03(1H, d, J=7.3), 7.28-7.38(3H, m), 7.48-7.52(1H, m), 8.78(1H, brs)
171	2.10(3H, s), 2.78(3H, d, J=4.8), 6.18(1H, brs), 6.34(1H, s), 6.87(1H, dd, J=8.2, 1.0), 6.97-7.00(2H, m), 7.11-7.16(2H, m), 7.26-7.36(3H, m), 7.58(1H, dd, J=7.8, 1.7)
173	2.15(3H, s), 2.25(3H, s), 2.74(3H, d, J=4.9), 5.10(1H, d, J=11.9), 5.44(1H, d, J=11.9), 6.29(1H, brs), 6.36(1H, s), 6.91(1H, t, J=7.3), 6.98(1H, d, J=7.3), 7.14-7.19(2H, m), 7.34-7.40(2H, m), 7.46-7.56(2H, m)
174	3.39(3H, s), 3.70(3H, s), 5.05(1H, s), 5.09(1H, d, J=12.0), 5.25(1H, d, J=12.0), 6.86-6.92(2H, m), 7.22-7.26(2H, m), 7.35-7.38(2H, m), 7.45-7.49(2H, m)
175	1.11(3H, t, J=7.3), 1.99(2H, 5重線, J=7.3), 3.81(3H, s), 4.24(1H, t, J=7.3), 6.74(1H, dd, J=7.9, 1.2), 6.87-6.97(4H, m), 7.11(1H, ddd, J=7.9, 7.6, 1.2), 7.21(1H, ddd, J=7.9, 7.6, 1.8), 7.49(1H, dd, J=7.6, 1.8)
176	2.20(3H, s), 2.23(3H, s), 2.32(3H, s), 3.46(3H, s), 5.05(1H, d, J=12.2), 5.15(1H, s), 5.34(1H, d, J=12.2), 6.70(1H, d, J=7.3), 6.76(1H, s), 7.03(1H, d, J=7.3), 7.32-7.40(2H, m), 7.47-7.57(2H, m)
177	65 - 67 °C
178	2.12(3H, s), 2.23(6H, s), 2.78(3H, d, J=4.9), 6.26(1H, brs), 6.36(1H, s), 6.72(1H, dd, J=7.9, 1.8), 6.80(1H, s), 6.82(1H, d, J=7.9), 7.09(2H, t, J=7.3), 7.25(1H, dt, J=1.8, 7.9), 7.56(1H, dd, J=7.3, 1.8)
179	98 - 99.5 °C
180	0.91(3H, t, J=7.3), 1.65-1.92(1H, m), 2.04-2.17(1H, m), 3.61(3H, s), 3.78(3H, s), 3.98(1H, t, J=7.3), 6.78(1H, dd, J=7.9, 1.8), 6.82-6.93(4H, m), 7.05(1H, t, J=7.3), 7.15(1H, dt, J=7.9, 1.8), 7.35(1H, dd, J=7.3, 1.8)
181	39 - 41 °C

化合物 番号	融点または ¹ H-NMR(CDCl ₃) δ ppm
1 8 2	3.41(3H, s), 3.66(3H, s), 5.24(1H, s), 6.90(1H, d, J=7.9), 6.99(2H, d, J=7.3), 7.10(1 H, t, J=7.3), 7.25-7.36(3H, m), 7.52(1H, dd, J=7.9, 1.8)
1 8 3	1.21(3H, t, J=7.3), 3.44-3.65(2H, m), 3.64(3H, s), 5.35(1H, s), 6.88(1H, t, J=7.9), 6.98(2H, d, J=7.9), 7.08(1H, t, J=7.3), 7.14(1H, t, J=7.3), 7.23-7.34(3H, m), 7.55(1H dd, J=7.9, 1.8)
1 8 4	2.82(3H, d, J=4.9), 3.35(3H, s), 5.03(1H, s), 6.82(1H, brs), 6.88(1H, d, J=7.9), 7.04(2H, d, J=7.9), 7.12(2H, t, J=7.9), 7.23-7.42(4H, m)
1 8 5	1.20(3H, d, J=7.3), 2.24(3H, s), 3.40(3H, s), 4.08-4.27(2H, m), 5.06(1H, s), 5.14(1H, d, J=12.2), 5.29(1H, d, J=12.2), 6.83(1H, d, J=7.9), 7.08-7.13(2H, m), 7.33-7.39(2H, m), 7.47-7.55(2H, m)
1 8 6	1 1 1 - 1 1 3 °C
1 8 8	1.16(3H, t, J=7.3), 2.82(3H, d, J=4.9), 3.50(2H, q, J=7.3), 5.15(1H, s), 6.86(1H, d, J=7.9), 6.90(1H, brs), 7.03(2H, d, J=7.9), 7.09(2H, t, J=7.9), 7.20-7.37(4H, m)
1 8 9	8 7 - 8 8 °C
1 9 3	3.42(3H, s), 3.70(3H, s), 5.15(1H, s), 5.20(1H, d, J=12.0), 5.39(1H, d, J=12.0), 6.93(1H, dt, J=1.8, 8.0), 7.03(1H, d, J=8.0), 7.21(1H, dt, J=1.8, 8.0), 7.36-7.40(3H, m), 7.51-7.59(2H, m)
1 9 4	2.26(3H, s), 3.40(3H, s), 3.70(3H, s), 5.13(1H, s), 5.13(1H, d, J=12.0), 5.30(1H, d, J=12.0), 6.89-6.94(2H, m), 7.10-7.20(2H, m), 7.35-7.40(2H, m), 7.50-7.52(2H, m)
1 9 5	3.40(3H, s), 3.70(3H, s), 5.11(1H, s), 5.11(1H, d, J=12.0), 5.30(1H, d, J=12.0), 6.90-7.00(3H, m), 7.25-7.38(4H, m), 7.47-7.51(2H, m)
1 9 6	8 6 - 8 7 °C
1 9 7	9 1 - 9 2 °C
1 9 8	2.81(3H, s), 3.35(3H, s), 5.00(1H, s), 5.08(1H, d, J=12.0), 5.48(1H, d, J=12.0), 6.80(1H, brs), 6.93-6.97(3H, m), 7.25-7.49(6H, m)
2 0 5	6 9 - 7 2 °C

化合物 番号	融点または ¹ H-NMR(CDCl ₃) δ ppm
206	3.41(3H, s), 3.72(3H, s), 5.10(1H, s), 5.18(1H, d, J=12.0), 5.34(1H, d, J=12.0), 6.92(1H, d, J=8.6), 6.17(1H, dd, J=9.0, 2.4), 7.36-7.40(2H, m), 7.50-7.56(2H, m)
207	3.41(3H, s), 3.71(3H, s), 5.06(1H, s), 5.16(1H, d, J=12.0), 5.34(1H, d, J=12.0), 7.17(1H, m), 7.22-7.30(2H, m), 7.38-7.42(3H, m), 7.47-7.52(2H, m)
208	3.39(3H, s), 3.70(3H, s), 3.77(3H, s), 5.04(1H, d, J=12.0), 5.11(1H, s), 5.24(1H, d, J=12.0), 6.80-6.88(2H, m), 6.90-6.95(2H, m), 7.30-7.40(2H, m), 7.45-7.55(2H, m)
209	2.29(3H, s), 3.39(3H, s), 3.70(3H, s), 5.07(1H, d, J=12.0), 5.11(1H, s), 5.27(1H, d, J=12.0), 6.89(2H, d, J=18.6), 7.09(1H, t, J=8.6), 7.30-7.40(2H, m), 7.45-7.51(2H, m)
210	2.34(3H, s), 3.40(3H, s), 3.70(3H, s), 5.08(1H, d, J=12.0), 5.11(1H, s), 5.28(1H, d, J=12.0), 6.89(2H, d, J=8.6), 6.91(1H, s), 7.18(1H, t, J=8.0), 7.32-7.40(2H, m), 7.45-7.55(2H, m)
211	98 - 100 °C
212	2.33(3H, s), 2.82(3H, d, J=4.8), 3.35(3H, s), 5.00(1H, s), 5.04(1H, d, J=12.0), 5.48(1H, d, J=12.0), 6.75-6.81(3H, m), 7.17(1H, t, J=7.3), 7.30-7.46(4H, m)
213	2.82(3H, d, J=4.8), 3.36(3H, s), 4.94(1H, s), 5.05(1H, d, J=12.0), 5.47(1H, d, J=12.0), 6.80(1H, brs), 6.89(2H, d, J=1.2), 6.96(1H, t, J=1.2), 7.33-7.47(4H, m)
214	2.82(3H, d, J=4.8), 3.36(3H, s), 4.98(1H, s), 5.13(1H, d, J=12.0), 5.53(1H, d, J=12.0), 6.81(1H, brs), 7.15-7.26(3H, m), 7.33- 7.50(5H, m)
215	2.81(3H, d, J=4.8), 3.35(3H, s), 3.76(3H, s), 5.01(1H, s), 5.03(1H, d, J=12.0), 5.42 (1H, d, J=12.0), 6.81(1H, brs), 6.81-6.84(2H, m), 6.86-6.89(2H, m), 7.30-7.48(4H, m)
216	2.18(3H, s), 2.28(3H, s), 3.40(3H, s), 3.70(3H, s), 5.11(1H, d, J= 12.2), 5.13(1H, s), 5.28(1H, d, J=12.2), 6.81(2H, d, J=7.8), 7.08(1H, t, J=7.8), 7.35-7.38(2H, m), 7.51-7.54(2H, m)
217	2.16(3H, s), 2.27(3H, s), 2.82(3H, d, J=4.9), 3.35(3H, s), 5.02(1H, s), 5.04(1H, d, J=11.6), 5.44(1H, d, J=11.6), 6.80(1H, d, J=7.9), 6.82(1H, brs), 6.84(1H, d, J=7.9), 7.05(1H, t, J=7.9), 7.30- 7.40(3H, m), 7.49-7.52(1H, m)
218	2.23(3H, s), 2.27(3H, s), 3.39(3H, s), 3.70(3H, s), 5.10(1H, d, J=12.2), 5.11(1H, s), 5.27(1H, d, J=12.2), 6.81(1H, d, J=7.8), 6.95(1H, d, J=7.8), 6.98(1H, s), 7.34-7.38(2H, m), 7.50-7.54(2H, m)
219	104 - 106 °C

化合物 番号	融点または ¹ H-NMR(CDCl ₃) δ ppm
2 2 1	2.17(3H, s), 2.19(3H, s), 2.81(3H, d, J=4.9), 3.35(3H, s), 5.00(1H s), 5.02(1H, d, J=12.2), 5.42(1H, d, J=12.2), 6.75(1H, dd, J=7.9, 2.4), 6.80(1H, d, J=2.4), 6.83(1H, brs), 7.02(1H, d, J=7.9) 7.30-7.50(4H, m)
2 2 3	2.29(6H, s), 2.82(3H, d, J=4.9), 3.36(3H, s), 5.00(1H, s), 5.02(1H, d, J=11.0), 5.44(1H, d, J=11.0), 6.63(3H, s), 6.82(1H, brs), 7.29-7.48(4H, m)
2 3 1	2.82(3H, d, J=4.9), 3.35(3H, s), 4.97(1H, s), 5.04(1H, d, J=12.0), 5.47(1H, d, J=12.0), 6.84(1H, brs), 6.85(1H, dd, J=7.4, 1.8), 6.95(1H, dd, J=7.4, 1.8), 6.99(1H, t, J=1.8), 7.20(1H, t, J=7.4), 7.33-7.45(4H, m)
2 3 3	8 7 - 8 8 °C
2 4 5	2.81(3H, d, J=4.9), 3.37(3H, s), 3.85(3H, s), 5.06(1H, s), 5.20(1H, d, J=12.2), 5.37(1H, d, J=12.2), 6.85(1H, brs), 6.96-7.03(4H, m), 7.30-7.35(2H, m), 7.44-7.49(2H, m)
2 6 2	1 2 1 - 1 2 3 °C
2 6 3	2.23(3H, s), 3.40(3H, s), 3.70(3H, s), 5.08(1H, s), 5.12(1H, d, J=12.2), 5.27(1H, d, J=12.2), 6.83(1H, d, J=7.9), 7.10(1H, dd, J=7.3, 2.4), 7.33-7.39(2H, m), 7.42-7.55(2H, m)
2 6 7	9 7 - 9 9 °C
2 8 2	2.30(3H, s), 2.80(3H, d, J=4.9), 3.36(3H, s), 3.83(3H, s), 5.06(1H, s), 5.17(1H, d, J=12.2), 5.32(1H, d, J=12.2), 6.73-6.80(2H, m), 6.87(1H, brs), 6.89(1H, d, J=7.9), 7.30-7.35(2H, m), 7.42-7.48(2H, m)
2 8 5	3.40(3H, s), 3.64(3H, s), 5.18(1H, s), 6.87-6.93(3H, m), 7.11(1H, d, J=7.3), 7.26-7.33(3H, m), 7.51(1H, dd, J=7.3, 1.8)
2 8 6	2.81(3H, d, J=4.9), 3.33(3H, s), 4.99(1H, s), 6.85(1H, brs), 6.86(1H, d, J=8.6), 6.94-6.98(2H, m), 7.14(1H, t, J=7.3), 7.26-7.36(4H, m)
2 8 8	2.33(3H, s), 3.41(3H, s), 3.68(3H, s), 5.26(1H, s), 6.83-6.91(3H, m), 7.11-7.15(3H, m), 7.23-7.28(1H, m), 7.48(1H, dd, J=8.0, 1.8)
2 8 9	2.32(3H, s), 2.82(3H, d, J=4.9), 3.35(3H, s), 5.04(1H, s), 6.82(1H, brs), 6.84(1H, d, J=8.6), 6.91-6.94(2H, m), 7.08-7.15(3H, m), 7.20-7.26(1H, m), 7.34(1H, dd, J=7.3, 1.8)
2 9 1	2.23(6H, s), 3.4(3H, s), 3.68(3H, s), 5.26(1H, s), 6.71-6.74(1H, m), 6.80-6.86(2H, m), 7.05-7.13(2H, m), 7.22-7.28(1H, m), 7.48(1H, dd, J=7.3, 1.8)

化合物 番号	融点または ¹ H-NMR(CDCl ₃) δ ppm
2 9 2	2.22(6H, s), 2.83(3H, d, J=4.9), 3.36(3H, s), 5.04(1H, s), 6.73-6.86(4H, m), 7.05-7.10 (2H, m), 7.20-7.25 (1H, m), 7.34 (1H, dd, J=7.3, 1.8)
2 9 3	3.40(3H, s), 3.71(3H, s), 5.19(1H, s), 5.49(1H, d, J=12.2), 5.67 (1H, d, J=12.2), 6.85(1H, d, J=8.6), 7.35-7.39(2H, m), 7.49-7.53 (2H, m), 7.79(1H, dd, J=7.3, 1.8), 8.46(1H, s)
2 9 4	2.32(3H, s), 3.40(3H, s), 3.67(3H, s), 5.23(1H, s), 6.76-6.90(4H, m), 7.11-7.30(2H, m), 7.49(1H, dd, J=7.3, 1.8)
2 9 5	2.32(3H, s), 2.82(3H, d, J=4.9), 3.35(3H, s), 5.03(1H, s), 6.80-6.91(5H, m), 7.10-7.28(3H, m), 7.34(1H, dd, J=7.3, 1.8)
2 9 6	2.27(6H, s), 3.40(3H, s), 3.67(3H, s), 5.23(1H, s), 6.61(2H, s), 6.74(1H, s), 6.88(1H, d, J=8.6), 7.13(1H, t, J=8.0), 7.24-7.28(1H, m), 7.49(1H, dd, J=7.3, 1.8)
2 9 7	2.27(6H, s), 2.83(3H, d, J=4.9), 3.35(3H, s), 5.02(1H, s), 6.65(2H, s), 6.73(1H, s), 6.75(1H, brs), 6.86(1H, d, J=8.0), 7.06-7.09(1H, m), 7.21-7.28(1H, m), 7.34(1H, dd, J=7.3, 1.8)
3 2 8	2.28(3H, s), 3.40(3H, s), 3.67(3H, s), 5.18(1H, s), 6.73-6.77(1H, m), 6.86-6.89(2H, m), 7.19(1H, d, J=7.3), 7.25-7.30(2H, m), 7.51(1H, dd, J=7.3, 1.8)
3 2 9	2.33(3H, s), 2.82(3H, d, J=4.9), 3.34(3H, s), 4.99(1H, s), 6.77-6.93(4H, m), 7.12(1H, t, J=7.3), 7.24-7.36(3H, m)
3 5 8	2.17(3H, s), 2.34-2.36(合わせて 3H), 2.44-2.63(合わせて 3H), 3.78 -3.81(合わせて 3H), 4.98-5.22(合わせて 3H), 6.71-7.81(合わせて 7H)
3 5 9	1 2 2 - 1 2 4 °C
3 6 2	2.16(3H, s), 2.35(3H, s), 2.39(3H, s), 2.82(3H, d, J=4.9), 4.36(1H, s), 5.13(1H, d, J=11.0), 5.25(1H, d, J=11.0), 6.73(1H, d, J=7.3), 6.84(1H, s), 7.04(1H, d, J=7.3), 7.07(1H, brs), 7.29-7.49(4H, m)
3 6 6	2.26(3H, s), 2.28(3H, s), 2.79(3H, d, J=4.9), 3.36(3H, s), 4.06(1H, d, J=12.2), 4.69(1H, d, J=12.2), 5.18(1H, s), 6.84(1H, brs), 6.91(1H, d, J=7.3), 7.04(1H, d, J=7.3), 7.14(1H, s), 7.18-7.28(3H, m), 7.36 (1H, d, J=7.3)
3 7 2	1.56(3H, s), 2.22(3H, s), 3.23(3H, d, J=4.9), 3.35(3H, s), 5.15(1H, d, J=12.2), 5.36(1H, s), 5.58(1H, d, J=12.2), 6.88(1H, d, J=7.9), 7.11(1H, d, J=7.9), 7.13(1H, s), 7.29-7.37(3H, m), 7.45-7.48(1H, m), 8.75(1H, brs)
4 1 3	2.83(3H, d, J=4.9), 3.36(3H, s), 5.09(1H, s), 5.50(1H, d, J=13.0), 5.86(1H, d, J=13.0), 6.80(1H, s), 6.85(1H, brs), 7.32-7.38 (3H, m), 7.45-7.49(1H, m), 8.57(1H, s)

化合物 番号	融点または ¹ H-NMR(CDCl ₃) δ ppm
4 1 7	1 1 5 - 1 1 7 °C
4 2 0	1 3 1 - 1 3 3 °C
4 2 1	2.84(3H, d, J=4.9), 4.99(1H, brs), 5.39(1H, s), 5.57(1H, d, J=12.2), 5.67(1H, d, J=12.2), 6.50(1H, brs), 7.00(1H, dd, J=6.7, 6.1), 7.31-7.37(3H, m), 7.49-7.51(1H, m), 7.90(1H, dd, J=6.1, 1.8), 8.27(1H, dd, J=6.7, 1.8)
4 2 2	6 3 - 6 4 °C
4 2 3	1 0 5 - 1 0 7 °C
4 2 7	1 3 3 - 1 3 5 °C
4 2 9	7 9 - 8 1 °C
4 3 0	3.40(3H, s), 3.71(3H, s), 5.19(1H, s), 5.49(1H, d, J=12.2), 5.67(1H, d, J=12.2), 6.85(1H, d, J=8.6), 7.35-7.39(2H, m), 7.46-7.52(2H, m), 7.80(1H, dd, J=8.6, 1.8), 8.46(1H, s)
4 3 2	3.42(3H, s), 3.70(3H, s), 5.25(1H, s), 5.49(1H, d, J=12.2), 5.66(1H, d, J=12.2), 7.34-7.38(2H, m), 7.52-7.56(2H, m), 7.65(1H, d, J=2.4), 8.01(1H, d, J=2.4)
4 3 3	1 1 4 - 1 1 5 °C
4 3 4	5 8 - 6 0 °C
4 3 6	1 0 2 - 1 0 4 °C
4 3 7	2.82(3H, d, J=5.5), 3.39(3H, s), 5.03(1H, s), 5.22(1H, d, J=12.0), 5.64(1H, d, J=12.0), 6.82(1H, brs), 7.19(1H, dd, J=8.0, 4.8), 7.33-7.49(5H, m), 8.01(1H, dd, J=4.8, 1.8)
4 3 9	2.09(3H, s), 2.34(3H, s), 3.85(3H, s), 5.05(1H, d, J=11.0), 5.10(1H, d, J=11.0), 6.68(1H, s), 6.74(1H, d, J=7.3), 6.75(1H, s), 7.03(1H, d, J=7.3), 7.48-7.53(2H, m), 7.61-7.66(1H, m)
4 4 3	8 9 - 9 0 °C
4 4 8	8 0 - 8 2 °C
4 5 3	8 3 - 8 5 °C
4 5 4	3.39(3H, s), 3.70(3H, s), 5.19(1H, s), 5.38(1H, d, J=12.2), 5.58(1H, d, J=12.2), 6.73(1H, d, J=9.1), 7.30-7.37(2H, m), 7.47-7.55(3H, m), 8.11(1H, d, J=2.4)

化合物 番号	融点または ¹ H-NMR(CDCl ₃) δ ppm
4 5 9	1 0 3 - 1 0 5 °C
4 6 1	0.87(3H, t, J=7.3), 1.26-1.40(2H, m), 1.51-1.62(2H, m), 2.20(3H, s), 2.31(3H, s), 3.22(3H, d, J=4.9), 3.44(2H, t, J=7.3), 5.14(1H, d, J=11.6), 5.46(1H, s), 5.59(1H, d, J=11.6), 6.69(1H, d, J=7.3), 6.80(1H, s), 7.02(1H, d, J=7.3), 7.31-7.34(3H, m), 7.47-7.51(1H, m), 8.82(1H, brs).
4 6 2	2 0 5 - 2 1 0 °C
4 6 3	1 0 5 - 1 1 0 °C
4 6 5	2.11(3H, s), 2.23(3H, s), 2.29(3H, s), 2.81(3H, d, J=4.9), 3.35(3H, s), 5.03(1H, s), 5.03(1H, d, J= 11.6), 5.44(1H, d, J=11.6), 6.64(1H, s), 6.68(1H, s), 7.32-7.43(3H, m), 7.50-7.53(1H, m)
4 6 6	8 1 - 8 2 °C
4 6 7	9 1 - 9 2 °C
4 6 8	2.83(1H, d, J=4.9), 3.38(3H, s), 4.47(1H, d, J=12.2), 4.88(1H, d, J= 12.2), 5.14(1H, s), 6.82(1H, brs), 7.20-7.30(2H, m), 7.32-7.38(1H, m), 7.42-7.49(1H, m), 7.56(1H, d, J=1.8), 8.35(1H, d, J=1.8)
4 6 9	0.91 と 1.13(合わせて 3H, それぞれ s), 2.21(3H, s), 2.85 と 2.95(合わせて 3H, それぞれ s), 3.26 と 3.48(合わせて 2H, それぞれ m), 3.43(3H, s), 5.05(1H, d, J=12.2), 5.22(1H, s), 5.25(1H, d, J=12.2), 6.86(1H, d, J=9.1), 7.12(1H, d, J=7.3), 7.13(1H, s), 7.33-7.41(3H, m), 7.49-7.55(1H, m)
4 7 0	2.18(3H, s), 2.32(3H, s), 3.41(3H, s), 5.05(1H, d, J=11.6), 5.17(1H, s), 5.31(1H, d, J=11.6), 6.71(1H, d, J=7.3), 6.76(1H, s), 7.02(1H, d, J=7.9), 7.35-7.41(2H, m), 7.48-7.54(2H, m)
4 7 1	2.27(3H, s), 3.22(3H, s), 3.49(3H, s), 3.54(3H, s), 5.09(1H, d, J= 12.2), 5.26(1H, d, J=12.2), 5.72(1H, s), 6.86-6.94(2H, m), 7.15-7.20 (2H, m), 7.25-7.39(3H, m), 7.56(1H, d, J=7.3)
4 7 2	1 1 0 - 1 1 2 °C
4 7 3	2.28(6H, s), 2.80(3H, d, J=4.9), 3.33(3H, s), 4.87(1H, d, J=12.2), 5.06(1H, s), 5.27(1H, d, J=12.2), 6.77(1H, brs), 6.98(1H, dd, J=8.5, 6.1), 7.02(2H, d, J=7.3), 7.30-7.43(3H, m), 7.60-7.63(1H, m)

実施例 19

(E) - 2 - ベンジリデンアミノオキシメチル - α - メトキシ - N - メチルフェニルアセトアミド (化合物番号 480) の合成

2 - ヒドロキシメチル - α - メトキシ - N - メチルフェニルアセトアミド (0.42g, 2.0mmol) のテトラヒドロフラン (4ml) 溶液を 0℃ で攪拌し、その中に塩化チオニル (0.17ml, 2.4mmol)、N, N - ジメチルホルムアミド 1 滴を加えた。室温下で 2 時間攪拌後、水を加えエーテルで抽出した。飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を留去し、粗生成物 0.38g を油状物として得た。その粗生成物の N, N - ジメチルホルムアミド (6ml) 溶液に、ベンズアルデヒドオキシム (0.37g, 3.1mmol)、炭酸カリウム (0.55g, 4.0mmol) を加え、室温下で 3 日間攪拌した。水を加え、エーテルで抽出し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n - ヘキサン / 酢酸エチル = 13 / 7) で精製し、目的物の (E) - 2 - ベンジリデンアミノオキシメチル - α - メトキシ - N - メチルフェニルアセトアミド (0.32g, 51%) を白色結晶として得た。

融点： 75.0 - 75.5℃

NMR (δ ppm, TMS/ CDCl_3) : 2.84(3H,d,J=4.9), 3.34(3H,s), 5.13(1H,s), 5.23(1H,d,J=12.2), 5.65(1H,d,J=12.2), 6.80(1H,brs), 7.27-7.40(6H,m), 7.41-7.48(1H,m), 7.53-7.58(2H,m), 8.10(1H,s).

実施例 20

(E) - 2 - ベンジリデンアミノオキシメチル - α - ヒドロキシフェニル酢酸メチル (化合物番号 483) の合成

2 - (2 - ブロモメチル) フェニル - 2 - オキソ酢酸メチル (0.51g, 2.0mmol) のメタノール (10ml) 溶液に水素化ホウ素ナトリウム (0.04g,

1.0mmol)を加えた。8分後、酢酸を加え過剰の試薬を潰し、水を加えて酢酸エチルで抽出した。無水硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去後し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（*n*-ヘキサン/酢酸エチル=4/1）で精製し、目的物の2-ブロモメチル- α -ヒドロキシフェニル酢酸メチル(0.41g, 80%)を油状物として得た。

つづいて、2-ブロモメチル- α -ヒドロキシフェニル酢酸メチル(0.40g, 1.5mmol)のアセトン(6ml)溶液にベンズアルデヒドオキシム(0.28g, 2.3mmol)、炭酸カリウム(0.43g, 3.1mmol)を加え、室温下で18時間攪拌した。水を加え、エーテルで抽出し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（*n*-ヘキサン/酢酸エチル=3/1）で精製し、目的物の(E)-2-ベンジリデンアミノオキシメチル- α -ヒドロキシフェニル酢酸メチル(0.08g, 17%)を油状物として得た。

NMR (δ ppm, TMS/ CDCl_3) : 3.74(1H,d,J=5.5), 3.75(3H,s),
5.31(1H,d,J=12.2), 5.42(1H,d,J=12.2), 5.59(1H,d,J=5.5), 7.34-7.39(6H,m),
7.41-7.50(1H,m), 7.52-7.66(2H,m), 8.11(1H,s).

実施例 21

(E)-2-(2-ベンジリデンアミノオキシメチル)フェニル-2-オキソ酢酸メチルの合成

2-(2-ブロモメチル)フェニル-2-オキソ酢酸メチル(3.00g, 11.7mmol)のアセトン(10ml)溶液にベンズアルデヒドオキシム(2.13g, 17.6mmol)、炭酸カリウム(2.90g, 21.0mmol)を加え室温下で7時間攪拌した。水を加え、エーテルで抽出し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を留去後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（*n*-ヘキサン/酢酸エチル=17/3）で精製し、目的の(E)-2-(ベンジリデンアミ

ノオキシメチル) - 2-オキシフェニル酢酸メチル(2.39g, 69%)を得た。

NMR (δ ppm, TMS/ CDCl_3) : 3.89(3H,s), 5.32(1H,d,J=12.2),

5.40(1H,d,J=12.2), 7.32-7.59(8H,m), 7.70(1H,d,J=6.7), 8.16(1H,s).

実施例 2 2

(E) - α -ヒドロキシ-2-(α -メチル-4-クロロベンジリデンアミノオキシメチル)フェニル酢酸メチル(化合物番号479)の合成
2-ブロモメチル- α -ヒドロキシフェニル酢酸メチル(30.53g, 0.118mol)と3,4-ジヒドロ-2H-ピラン(17.84g, 0.212mol)の塩化メチレン(230ml)溶液を0℃で攪拌し、その中にパラートルエンスルホン酸ピリジニウム(2.96g, 0.012mol)を加え、室温下で2時間攪拌した。水を加え、塩化メチレンで抽出した。無水硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒を留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン/酢酸エチル=17/3)で精製し、目的の2-ブロモメチル- α -(テトラヒドロピラン-2-イル)フェニル酢酸メチル(33.58g, 83.0%)を油状物として得た。

つづいて、2-ブロモメチル- α -(テトラヒドロピラン-2-イル)フェニル酢酸メチル(4.00g, 11.7mmol)と4-クロロアセトフェノンオキシム(2.97g, 17.5mmol)のN,N-ジメチルホルムアミド(30ml)溶液を0℃で攪拌し、その中に60%油状水素化ナトリウム(0.70g, 17.5mmol)を加えた。2時間後水を加え、1N-塩酸でpH7とした後、エーテルで抽出した。無水硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒を留去し、粗生成物(6.28g)を得た。

その粗生成物をメタノール(35ml)に溶解し、パラートルエンスルホン酸ピリジニウム(0.29g, 1.2mmol)を加えた。30分間加熱還流後、反応液を減圧留去し、水を加えエーテルで抽出した。無水硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒を留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン/酢酸エチル=3/1)で精製し、目的の(E)- α -ヒドロキシ-

2 - (α -メチル-4-クロロベンジリデンアミノオキシ) フェニル酢酸メチル(2.75g, 68%)を油状物として得た。

NMR (δ ppm, TMS/ CDCl_3) : 2.23(3H,s), 3.75(3H,s), 3.77(1H,d,J=5.5), 5.34(1H,d,J=12.2), 5.42(1H,d,J=12.2), 7.29-7.38(5H,m), 7.43-7.48(1H,m), 7.56(2H,d,J=8.6).

実施例 2 3

(E) - α -メトキシ-2 - (α -メチル-4-クロロベンジリデンアミノオキシ) フェニル酢酸メチル (化合物番号 4 7 7) の合成

(E) - α -ヒドロキシ-2 - (α -メチル-4-クロロベンジリデンアミノオキシ) フェニル酢酸メチル(1.59g, 4.6mmol)、ヨウ化メチル(1.95g, 13.7mmol)のN,N-ジメチルホルムアミド(15ml)溶液を0℃で攪拌下、60%油状水素化ナトリウム(0.20g, 5.0mmol)を加えた。45分後、水を加え、1N-塩酸でpH1にした後エーテルで抽出した。飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を留去後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/塩化メチレン=9/1) で精製し、目的物の(E) - α -メトキシ-2 - (α -メチル-4-クロロベンジリデンアミノオキシ) フェニル酢酸メチル (1.19g, 72%)を油状物として得た。

NMR (δ ppm, TMS/ CDCl_3) : 2.23(3H,s), 3.39(3H,s), 3.71(3H,s), 5.24(1H,s), 5.27(1H,d,J=12.2), 5.51(1H,d,J=12.2), 7.30-7.54(6H,m), 7.58(2H,d,J=8.5).

実施例 2 4

(E) - α -メトキシ-N-メチル-2 - (α -メチル-4-クロロベンジリデンアミノオキシ) フェニル酢酸アミド (化合物番号 4 7 4) の合成

(E) - α -メトキシ-2 - (α -メチル-4-クロロベンジリデンア

ミノオキシ) フェニル酢酸メチル(0.48g, 1.3mmol)と40%モノメチルアミン-メタノール溶液(10ml)溶液を封管中80℃で15時間攪拌した。室温に冷却後、溶媒を減圧濃縮し、水を加え、1N-塩酸でpH1にした後塩化メチレンで抽出した。無水硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン/酢酸エチル=3/2)で精製し、目的物の(E)- α -メトキシ-N-メチル-2-(α -メチル-4-クロロベンジリデンアミノオキシ)フェニル酢酸アミド(0.41g, 86%)を油状物として得た。

NMR (δ ppm, TMS/CDCl₃) : 2.22(3H,s), 2.83(3H,d,J=4.9), 3.32(3H,s), 5.13(1H,s), 5.26(1H,d,J=12.2), 5.66(1H,d,J=12.2), 6.77(1H,brs), 7.29-7.47(6H,m), 7.57(2H,d,J=8.5).

実施例 25

(E)- α -メトキシ-N-メチル-2-(α -メチル-4-クロロベンジリデンアミノオキシ)フェニル酢酸チオアミド(化合物番号603)の合成

(E)- α -メトキシ-N-メチル-2-(α -メチル-4-クロロベンジリデンアミノオキシ)フェニル酢酸アミド(73mg, 0.2mmol)のトルエン(3ml)溶液に、ローソン試薬(40mg, 0.1mmol)を加え、80℃で1.5時間加熱攪拌した。室温に冷却後、水を加え、エーテルで抽出し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を留去後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン/酢酸エチル=4/1)で精製し、目的物の(E)- α -メトキシ-N-メチル-2-(α -メチル-4-クロロベンジリデンアミノオキシ)フェニル酢酸チオアミド(50mg, 66%)を油状物として得た。

NMR (δ ppm, TMS/CDCl₃) : 2.23(3H,s), 3.25(3H,d,J=4.9), 3.33(3H,s), 5.29(1H,d,J=12.2), 5.51(1H,s), 5.80(1H,d,J=12.2), 7.25-7.36(5H,m), 7.42-

7.47(1H,m), 7.58(2H,d,J=9.2), 8.77(1H,s).

実施例 26

α -ヒドロキシ-2-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシメチル)
フェニル酢酸エチルの合成

2-オキソ-2-[2-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシメチル)
フェニル]酢酸エチル(22.60g, 77.3mmol)のメタノール(20ml)溶液を0℃で攪
拌し、その中に水素化ホウ素ナトリウム(1.46g, 38.6mmol)を加えた。10
分後、水(100ml)を加え酢酸エチルで抽出し、無水硫酸マグネシウムで乾燥
後、溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘ
キサン/酢酸エチル=4/1) で精製し、目的物の α -ヒドロキシ-2-
(テトラヒドロピラン-2-イルオキシメチル) フェニル酢酸エチル
(20.47g, 90.0%)を油状物として得た。

NMR (δ ppm, TMS/ CDCl_3) : 1.19-1.22(3H,m), 1.50-1.73(6H,m), 3.52-
3.57(1H,m), 3.80と3.87(合わせて1H,それぞれd,J=5.5), 3.81-3.88(1H,m),
4.09-4.30(2H,m), 4.65と4.69(合わせて1H,それぞれd, J=12.2), 4.69(1H,m),
4.89と4.92(合わせて1H,それぞれd,J=12.2), 5.48(1H,m), 7.30-7.41(4H,m).

実施例 27

α -メトキシ-2-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシメチル) フ
ェニル酢酸エチルの合成

α -ヒドロキシ-2-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシメチル)
フェニル酢酸エチル(14.00g, 47.6mmol)のN,N-ジメチルホルムアミド
(40ml)溶液にヨウ化メチル(20.25g, 143mmol)を加え0℃で攪拌した。その
中に60%油状水素化ナトリウム(1.90g, 47.5mmol)を加えた。30分後、
水(100ml)を加えエーテルで抽出し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒
を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/

酢酸エチル=4/1)で精製し、目的物の α -メトキシ-2-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシメチル)フェニル酢酸エチル(14.00g, 95.5%)を油状物として得た。

NMR (δ ppm, TMS/ CDCl_3): 1.20(3H,t,J=6.8), 1.50-1.90(6H,m), 3.38と3.39(合わせて3H,それぞれs), 3.50-3.60(1H,m), 3.89-3.95(1H,m), 4.10-4.30(2H,m), 4.56と5.01(合わせて1H,それぞれd,J=12.2), 4.62(1H,m), 4.74と4.84(合わせて1H,それぞれd,J=12.2), 5.17と5.23(合わせて1H,それぞれs), 7.30-7.51(4H,m).

実施例 28

4-メトキシ-3-イソクロマノンの合成

α -メトキシ-2-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシメチル)フェニル酢酸エチル(14.00g, 45.4mmol)のメタノール(50ml)溶液に、パラートルエンスルホン酸ピリジニウム(0.30g)を加え1時間加熱還流した。室温に冷却後、水50mlを加え塩化メチレンで抽出した。無水硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒を留去し、残渣を再結晶(n-ヘキサン/酢酸エチル=1/1)で精製し、目的の4-メトキシ-3-イソクロマノン(6.00g, 74.2%)を白色結晶として得た。

融点: 82-86°C

NMR (δ ppm, TMS/ CDCl_3): 3.73(3H,s), 4.75(1H,s), 5.28(1H,d,J=14.0), 5.38(1H,d,J=14.0), 7.24-7.27(1H,m), 7.37(2H,m), 7.56(1H,d,J=7.3).

実施例 29

2-ヒドロキシメチル- α -メトキシ-N-メチルフェニル酢酸アミドの合成

4-メトキシ-3-イソクロマノン(7.50g, 42.1mmol)のメタノール(40ml)溶液に40%メチルアミン-メタノール溶液(9.80g, 126mmol)を加えた。室温下で1時間攪拌後、溶媒を留去して目的の2-ヒドロキシメチル- α -

メトキシ-N-メチルフェニル酢酸アミド(8.50g, 96.5%)を白色結晶として得た。

融点：80-82℃

NMR (δ ppm, TMS/ CDCl_3) : 2.86(3H,s), 3.35(3H,s), 4.47(1H,d,J=11.6), 4.88(1H,d,J=11.6), 5.08(1H,s), 6.98(1H,brs), 7.32-7.41(4H,m).

実施例 30

(E)- α -メトキシ-2-(α -メチル-4-クロロベンジリデンアミノオキシメチル)フェニル酢酸(化合物番号637)の合成

(E)- α -メトキシ-2-(α -メチル-4-クロロベンジリデンアミノオキシメチル)フェニル酢酸エチル(0.70g, 1.9mmol)のメタノール(10ml)溶液に1N-水酸化ナトリウム溶液(10ml)を加え、室温下2時間攪拌した。1N-塩酸でpH4として、塩化メチレンで抽出した。無水硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒を留去し、目的物の(E)- α -メトキシ-2-(α -メチル-4-クロロベンジリデンアミノオキシメチル)フェニル酢酸(0.50g, 77%)を油状物として得た。

NMR (δ ppm, TMS/ CDCl_3) : 2.20(3H,s), 3.39(3H,s), 5.25(1H,s), 5.25(1H,d,J=12.2), 5.52(1H,d,J=12.2), 7.30-7.57(8H,m).

実施例 31

以上の実施例19~30と同様にして、一般式(I)で表される種々の化合物を合成した。得られた化合物およびその代表的化合物の物性データを以下に示す。これら表には実施例19~30で得られた化合物およびその物性データも併記する。

また、表中、化合物番号474~935はMがO、Qが式(a)で表される基である化合物、化合物番号936~980はMが NR^2 、Qが式(a)で表される基である化合物、化合物番号981~1010はQが式(b)

で表される基である化合物である。

化合物 番号	X	R ¹	Y	Z	n	R ¹²	R ¹³
474	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	4-Cl-フェニル
475	H	OH	NHCH ₃	O	1	CH ₃	4-Cl-フェニル
476	H	OCH ₃	NH ₂	O	1	CH ₃	4-Cl-フェニル
477	H	OCH ₃	OCH ₃	O	1	CH ₃	4-Cl-フェニル
478	H	OH	NH ₂	O	1	CH ₃	4-Cl-フェニル
479	H	OH	OCH ₃	O	1	CH ₃	4-Cl-フェニル
480	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	H	フェニル
481	H	OH	NHCH ₃	O	1	H	フェニル
482	H	OCH ₃	OCH ₃	O	1	H	フェニル
483	H	OH	OCH ₃	O	1	H	フェニル
484	H	OCH ₃	NH ₂	O	1	H	フェニル
485	H	OH	NH ₂	O	1	H	フェニル
486	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	フェニル
487	H	OCH ₃	NH ₂	O	1	CH ₃	フェニル
488	H	OCH ₃	OCH ₃	O	1	CH ₃	フェニル

化合物 番号	X	R ¹	Y	Z	n	R ¹²	R ¹³
489	H	OH	NHCH ₃	O	1	CH ₃	フェニル
490	H	OH	NH ₂	O	1	CH ₃	フェニル
491	H	OH	OCH ₃	O	1	CH ₃	フェニル
492	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	4-OCH ₃ -フェニル
493	H	OCH ₃	NH ₂	O	1	CH ₃	4-OCH ₃ -フェニル
494	H	OCH ₃	OCH ₃	O	1	CH ₃	4-OCH ₃ -フェニル
495	H	OH	NHCH ₃	O	1	CH ₃	4-OCH ₃ -フェニル
496	H	OH	NH ₂	O	1	CH ₃	4-OCH ₃ -フェニル
497	H	OH	OCH ₃	O	1	CH ₃	4-OCH ₃ -フェニル
498	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	4-CH ₃ -フェニル
499	H	OCH ₃	NH ₂	O	1	CH ₃	4-CH ₃ -フェニル
500	H	OCH ₃	OCH ₃	O	1	CH ₃	4-CH ₃ -フェニル
501	H	OH	NHCH ₃	O	1	CH ₃	4-CH ₃ -フェニル
502	H	OH	NH ₂	O	1	CH ₃	4-CH ₃ -フェニル
503	H	OH	OCH ₃	O	1	CH ₃	4-CH ₃ -フェニル
504	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	2,4-Cl ₂ -フェニル
505	H	OCH ₃	NH ₂	O	1	CH ₃	2,4-Cl ₂ -フェニル
506	H	OCH ₃	OCH ₃	O	1	CH ₃	2,4-Cl ₂ -フェニル
507	H	OH	NHCH ₃	O	1	CH ₃	2,4-Cl ₂ -フェニル
508	H	OH	NH ₂	O	1	CH ₃	2,4-Cl ₂ -フェニル
509	H	OH	OCH ₃	O	1	CH ₃	2,4-Cl ₂ -フェニル

化合物 番号	X	R ¹	Y	Z	n	R ¹²	R ¹³
510	H	OH	NHCH ₃	O	1	CH ₃	2-Cl-フェニル
511	H	OH	NH ₂	O	1	CH ₃	2-Cl-フェニル
512	H	OH	OCH ₃	O	1	CH ₃	2-Cl-フェニル
513	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	2-Cl-フェニル
514	H	OCH ₃	NH ₂	O	1	CH ₃	2-Cl-フェニル
515	H	OCH ₃	OCH ₃	O	1	CH ₃	2-Cl-フェニル
516	H	OH	NHCH ₃	O	1	CH ₃	3-Cl-フェニル
517	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	3-Cl-フェニル
518	H	OCH ₃	OCH ₃	O	1	CH ₃	3-Cl-フェニル
519	H	OH	NHCH ₃	O	1	CH ₃	2-CF ₃ -フェニル
520	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	2-CF ₃ -フェニル
521	H	OCH ₃	OCH ₃	O	1	CH ₃	2-CF ₃ -フェニル
522	H	OH	NHCH ₃	O	1	CH ₃	3-CF ₃ -フェニル
523	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	3-CF ₃ -フェニル
524	H	OCH ₃	OCH ₃	O	1	CH ₃	3-CF ₃ -フェニル
525	H	OH	NHCH ₃	O	1	CH ₃	4-CF ₃ -フェニル
526	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	4-CF ₃ -フェニル
527	H	OCH ₃	OCH ₃	O	1	CH ₃	4-CF ₃ -フェニル
528	H	OH	NHCH ₃	O	1	CH ₃	4-NO ₂ -フェニル
529	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	4-NO ₂ -フェニル
530	H	OCH ₃	OCH ₃	O	1	CH ₃	4-NO ₂ -フェニル





化合物 番号	X	R ¹	Y	Z	n	R ¹²	R ¹³
5 3 1	H	OH	NHCH ₃	O	1	CH ₃	2-CH ₃ -フェニル
5 3 2	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	2-CH ₃ -フェニル
5 3 3	H	OCH ₃	OCH ₃	O	1	CH ₃	2-CH ₃ -フェニル
5 3 4	H	OH	NHCH ₃	O	1	CH ₃	3-CH ₃ -フェニル
5 3 5	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	3-CH ₃ -フェニル
5 3 6	H	OCH ₃	OCH ₃	O	1	CH ₃	3-CH ₃ -フェニル
5 3 7	H	OH	NHCH ₃	O	1	CH ₃	4-CN-フェニル
5 3 8	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	4-CN-フェニル
5 3 9	H	OCH ₃	OCH ₃	O	1	CH ₃	4-CN-フェニル
5 4 0	H	OH	NHCH ₃	O	1	C ₂ H ₅	4-Cl-フェニル
5 4 1	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	C ₂ H ₅	4-Cl-フェニル
5 4 2	H	OCH ₃	OCH ₃	O	1	C ₂ H ₅	4-Cl-フェニル
5 4 3	H	OH	NHCH ₃	O	1	C ₂ H ₅	4-OCH ₃ -フェニル
5 4 4	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	C ₂ H ₅	4-OCH ₃ -フェニル
5 4 5	H	OCH ₃	OCH ₃	O	1	C ₂ H ₅	4-OCH ₃ -フェニル
5 4 6	H	OH	NHCH ₃	O	1	CH ₃	CH ₃
5 4 7	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	CH ₃
5 4 8	H	OCH ₃	OCH ₃	O	1	CH ₃	CH ₃
5 4 9	H	OH	NHCH ₃	O	1	CH ₃ , C ₄ H ₉	EZ 混合物
5 5 0	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃ , C ₄ H ₉	EZ 混合物
5 5 1	H	OCH ₃	OCH ₃	O	1	CH ₃ , C ₄ H ₉	EZ 混合物

化合物 番号	X	R ¹	Y	Z	n	R ¹²	R ¹³
5 5 2	H	OH	NHCH ₃	O	1	CH ₃	2-OCH ₃ -フェニル
5 5 3	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	2-OCH ₃ -フェニル
5 5 4	H	OCH ₃	OCH ₃	O	1	CH ₃	2-OCH ₃ -フェニル
5 5 5	H	OH	NHCH ₃	O	1	CH ₃	3-OCH ₃ -フェニル
5 5 6	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	3-OCH ₃ -フェニル
5 5 7	H	OCH ₃	OCH ₃	O	1	CH ₃	3-OCH ₃ -フェニル
5 5 8	H	OH	NHCH ₃	O	1	CH ₃	3,4-(CH ₃) ₂ -フェニル
5 5 9	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	3,4-(CH ₃) ₂ -フェニル
5 6 0	H	OCH ₃	OCH ₃	O	1	CH ₃	3,4-(CH ₃) ₂ -フェニル
5 6 1	H	OH	NHCH ₃	O	1	CH ₃	3,4-Cl ₂ -フェニル
5 6 2	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	3,4-Cl ₂ -フェニル
5 6 3	H	OCH ₃	OCH ₃	O	1	CH ₃	3,4-Cl ₂ -フェニル
5 6 4	H	OH	NHCH ₃	O	1	CH ₃	3-CH ₃ -4-OCH ₃ -フェニル
5 6 5	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	3-CH ₃ -4-OCH ₃ -フェニル
5 6 6	H	OCH ₃	OCH ₃	O	1	CH ₃	3-CH ₃ -4-OCH ₃ -フェニル
5 6 7	H	OH	NHCH ₃	O	1	CH ₃	3-Cl-4-CH ₃ -フェニル
5 6 8	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	3-Cl-4-CH ₃ -フェニル
5 6 9	H	OCH ₃	OCH ₃	O	1	CH ₃	3-Cl-4-CH ₃ -フェニル
5 7 0	H	OH	NHCH ₃	O	1	CH ₃	COCH ₃
5 7 1	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	COCH ₃
5 7 2	H	OCH ₃	OCH ₃	O	1	CH ₃	COCH ₃

化合物 番号	X	R ¹	Y	Z	n	R ¹²	R ¹³
573	H	OH	NHCH ₃	O	1	CH ₃	CO-フェニル
574	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	CO-フェニル
575	H	OCH ₃	OCH ₃	O	1	CH ₃	CO-フェニル
576	H	OH	NHCH ₃	O	1	CH ₃	4-ビフェニリル
577	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	4-ビフェニリル
578	H	OCH ₃	OCH ₃	O	1	CH ₃	4-ビフェニリル
579	H	OH	NHCH ₃	O	1	CH ₃	1-ナフチル
580	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	1-ナフチル
581	H	OCH ₃	OCH ₃	O	1	CH ₃	1-ナフチル
582	H	OH	NHCH ₃	O	1	CH ₃	2-フリル
583	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	2-フリル
584	H	OCH ₃	OCH ₃	O	1	CH ₃	2-フリル
585	H	OH	NHCH ₃	O	1	CH ₃	2-チエニル
586	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	2-チエニル
587	H	OCH ₃	OCH ₃	O	1	CH ₃	2-チエニル
588	H	OH	NHCH ₃	O	1	CH ₃	2-ピリジル
589	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	2-ピリジル
590	H	OCH ₃	OCH ₃	O	1	CH ₃	2-ピリジル
591	H	OH	NHCH ₃	O	1	CH ₃	2-ピラジニル
592	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	2-ピラジニル
593	H	OCH ₃	OCH ₃	O	1	CH ₃	2-ピラジニル

化合物 番号	X	R ¹	Y	Z	n	R ¹²	R ¹³
594	H	OH	NHCH ₃	O	1	CH ₃	2-ピリミジニル
595	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	2-ピリミジニル
596	H	OCH ₃	OCH ₃	O	1	CH ₃	2-ピリミジニル
597	H	OH	NHCH ₃	O	1	CH ₃	5-CF ₃ -ピリジン-2-イル
598	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	5-CF ₃ -ピリジン-2-イル
599	H	OCH ₃	OCH ₃	O	1	CH ₃	5-CF ₃ -ピリジン-2-イル
600	H	OH	NHCH ₃	O	1	CH ₃	4-OC ₂ H ₅ -ピリミジン- 2-イル
601	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	4-OC ₂ H ₅ -ピリミジン- 2-イル
602	H	OCH ₃	OCH ₃	O	1	CH ₃	4-OC ₂ H ₅ -ピリミジン- 2-イル
603	H	OCH ₃	NHCH ₃	S	1	CH ₃	4-Cl-フェニル
604	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CF ₃	4-Cl-フェニル
605	H	OCHF ₂	NHCH ₃	O	1	CF ₃	4-Cl-フェニル
606	H	OCH ₃	NHCH ₃	S	1	CH ₃	4-OCH ₃ -フェニル
607	H	OCH ₃	SCH ₃	O	1	CH ₃	4-OCH ₃ -フェニル
608	H	OCH ₃	SCH ₃	O	1	CH ₃	4-Cl-フェニル
609	H	OCH ₃	NHCH ₃	S	1	CH ₃	4-CH ₃ -フェニル
610	H	OCH ₃	NHCH ₃	S	1	CH ₃	4-CF ₃ -フェニル
611	H	OCH ₃	SCH ₃	O	1	CH ₃	4-CH ₃ -フェニル
612	H	OH	NHCH ₃	O	1	CH ₂ OCH ₃	4-Cl-フェニル
613	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₂ OCH ₃	4-Cl-フェニル
614	H	OCH ₃	OCH ₃	O	1	CH ₂ OCH ₃	4-Cl-フェニル

化合物 番号	X	R ¹	Y	Z	n	R ¹²	R ¹³
615	H	OH	NHCH ₃	O	1	C ₂ H ₅	4-CH ₃ -フェニル
616	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	C ₂ H ₅	4-CH ₃ -フェニル
617	H	OCH ₃	OCH ₃	O	1	C ₂ H ₅	4-CH ₃ -フェニル
618	H	OH	NHCH ₃	O	1	C ₄ H ₉	4-CH ₃ -フェニル
619	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	C ₄ H ₉	4-CH ₃ -フェニル
620	H	OCH ₃	OCH ₃	O	1	C ₄ H ₉	4-CH ₃ -フェニル
621	H	OH	NHCH ₃	O	1	C ₄ H ₉	4-Cl-フェニル
622	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	C ₄ H ₉	4-Cl-フェニル
623	H	OCH ₃	OCH ₃	O	1	C ₄ H ₉	4-Cl-フェニル
624	H	OH	NHCH ₃	O	1	C ₄ H ₉	4-OCH ₃ -フェニル
625	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	C ₄ H ₉	4-OCH ₃ -フェニル
626	H	OCH ₃	OCH ₃	O	1	C ₄ H ₉	4-OCH ₃ -フェニル

化合物 番号	X	R ¹	Y	Z	n	$\begin{matrix} R^{12} \\ =C \\ R^{13} \end{matrix}$
627	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	
628	H	OCH ₃	OCH ₃	O	1	
629	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	
630	H	OCH ₃	OCH ₃	O	1	

化合物 番号	X	R ¹	Y	Z	n	R ¹²	R ¹³
6 3 1	H	OCH ₃	OC ₂ H ₅	O	1	CH ₃	4-Cl-フェニル
6 3 2	H	OCH ₃	NHC ₂ H ₅	O	1	CH ₃	4-Cl-フェニル
6 3 3	H	OC ₂ H ₅	OCH ₃	O	1	CH ₃	4-Cl-フェニル
6 3 4	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	O	1	CH ₃	4-Cl-フェニル
6 3 5	H	OC ₄ H ₉	NHCH ₃	O	1	CH ₃	4-Cl-フェニル
6 3 6	H	OC ₄ H ₉	OCH ₃	O	1	CH ₃	4-Cl-フェニル
6 3 7	H	OCH ₃	OH	O	1	CH ₃	4-Cl-フェニル
6 3 8	H	OCH ₃	N(CH ₃) ₂	O	1	CH ₃	4-Cl-フェニル
6 3 9	H	OCOCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	4-Cl-フェニル
6 4 0	H	OTHP	NHCH ₃	O	1	CH ₃	4-Cl-フェニル
6 4 1	H	OTHP	OCH ₃	O	1	CH ₃	4-Cl-フェニル
6 4 2	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	C ₂ H ₅	3-Cl-フェニル
6 4 3	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	C ₂ H ₅	2-Cl-フェニル
6 4 4	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	C ₂ H ₅	2-CH ₃ -フェニル
6 4 5	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	C ₂ H ₅	3-CH ₃ -フェニル
6 4 6	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	C ₂ H ₅	2-OCH ₃ -フェニル
6 4 7	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	C ₂ H ₅	3-OCH ₃ -フェニル
6 4 8	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	2	CH ₃	4-Cl-フェニル
6 4 9	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	2	CH ₃	4-CH ₃ -フェニル
6 5 0	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	2	CH ₃	4-OCH ₃ -フェニル
6 5 1	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	2	CH ₃	4-CF ₃ -フェニル

化合物 番号	X	R ¹	Y	Z	n	R ¹²	R ¹³
6 5 2	5-Cl	OH	NHCH ₃	O	1	CH ₃	4-Cl-フェニル
6 5 3	5-CH ₃	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	4-Cl-フェニル
6 5 4	5-OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	O	1	CH ₃	4-Cl-フェニル
6 5 5	5-Cl	OH	NHCH ₃	O	1	CH ₃	4-OCH ₃ -フェニル
6 5 6	5-CH ₃	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	4-OCH ₃ -フェニル
6 5 7	5-OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	O	1	CH ₃	4-OCH ₃ -フェニル
6 5 8	5-Cl	OH	NHCH ₃	O	1	CH ₃	2-ピリジル
6 5 9	5-CH ₃	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	2-ピリジル
6 6 0	5-OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	O	1	CH ₃	2-ピリジル
6 6 1	5-Cl	OH	NHCH ₃	O	1	CH ₃	2-ピラジニル
6 6 2	5-CH ₃	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	2-ピラジニル
6 6 3	5-OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	O	1	CH ₃	2-ピラジニル
6 6 4	5-Cl	OH	NHCH ₃	O	1	CH ₃	4-CH ₃ -フェニル
6 6 5	5-CH ₃	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	4-CH ₃ -フェニル
6 6 6	5-OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	O	1	CH ₃	4-CH ₃ -フェニル
6 6 7	5-Cl	OH	NHCH ₃	O	1	CH ₃	CH ₃
6 6 8	5-CH ₃	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	CH ₃
6 6 9	5-OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	O	1	CH ₃	CH ₃
6 7 0	H	OH	NHCH ₃	O	1	CH ₃ , C ₂ H ₅	EZ 混合物
6 7 1	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃ , C ₂ H ₅	EZ 混合物
6 7 2	H	OCH ₃	OCH ₃	O	1	CH ₃ , C ₂ H ₅	EZ 混合物

化合物 番号	X	R ¹	Y	Z	n	R ¹²	R ¹³
673	H	OCH ₃	OCH ₃	O	1	CH ₃	2-Cl-4-OCH ₃ -フェニル
674	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	2-Cl-4-OCH ₃ -フェニル
675	H	OCH ₃	OCH ₃	O	1	CH ₃	2-Cl-4-CH ₃ -フェニル
676	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	2-Cl-4-CH ₃ -フェニル
677	H	OCH ₃	OCH ₃	O	1	CH ₃	3-Cl-4-OCH ₃ -フェニル
678	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	3-Cl-4-OCH ₃ -フェニル
679	H	OCH ₃	OCH ₃	O	1	CH ₃	3-CH ₃ -4-Cl-フェニル
680	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	3-CH ₃ -4-Cl-フェニル
681	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	4-CH ₂ OCH ₃ -フェニル
682	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	4-OCHF ₂ -フェニル
683	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	2,4-(OCH ₃) ₂ -フェニル
684	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	3,4-(OCH ₃) ₂ -フェニル
685	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	2,5-(OCH ₃) ₂ -フェニル
686	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	2,4-(CH ₃) ₂ -フェニル
687	H	OCH ₃	OCH ₃	O	1	CH ₃	2,4-(CH ₃) ₂ -フェニル
688	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	4-フェノキシフェニル
689	H	OCH ₃	OCH ₃	O	1	CH ₃	2-F-4-OCH ₃ -フェニル
690	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	2-F-4-OCH ₃ -フェニル
691	H	OCH ₃	OCH ₃	O	1	CH ₃	3-F-4-OCH ₃ -フェニル
692	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	3-F-4-OCH ₃ -フェニル

化合物 番号	X	R ¹	Y	Z	n	R ¹²	R ¹³
693	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	H	4-OCH ₃ -フェニル
694	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	H	4-CH ₃ -フェニル
695	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	H	4-CF ₃ -フェニル
696	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	2-Br-フェニル
697	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	3-Br-フェニル
698	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	4-Br-フェニル
699	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	2-F-フェニル
700	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	3-F-フェニル
701	H	OCH ₃	OCH ₃	O	1	CH ₃	4-F-フェニル
702	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	4-OC ₂ H ₅ -フェニル
703	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	4-OC ₃ H ₇ -フェニル
704	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	4-OC ₄ H ₉ -フェニル
705	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	4-OCH ₂ CH=CH ₂ -フェニル
706	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	4-OCH ₂ C≡CH-フェニル
707	H	OCH ₃	OCH ₃	O	1	CH ₃	4-C ₂ H ₅ -フェニル
708	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	4-C ₃ H ₇ -フェニル
709	H	OCH ₃	OCH ₃	O	1	CH ₃	4-C ₄ H ₉ -フェニル
710	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	4-C(CH ₃) ₃ -フェニル
711	H	OCH ₃	OCH ₃	O	1	CH ₃	2,3,5-(CH ₃) ₃ -フェニル
712	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	3,4,5-(CH ₃) ₃ -フェニル

化合物 番号	X	R ¹	Y	Z	n	R ¹²	R ¹³
713	H	OCH ₃	NHC ₂ H ₅	O	1	CH ₃	4-F-フェニル
714	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	O	1	CH ₃	4-F-フェニル
715	H	OCH ₃	NHC ₂ H ₅	O	1	CH ₃	4-Br-フェニル
716	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	O	1	CH ₃	4-Br-フェニル
717	H	OCH ₃	NHC ₂ H ₅	O	1	CH ₃	4-CH ₃ -フェニル
718	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	O	1	CH ₃	4-CH ₃ -フェニル
719	H	OCH ₃	NHC ₂ H ₅	O	1	C ₂ H ₅	4-CH ₃ -フェニル
720	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	O	1	C ₂ H ₅	4-CH ₃ -フェニル
721	H	OCH ₃	NHC ₂ H ₅	O	1	CH ₃	4-OCH ₃ -フェニル
722	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	O	1	CH ₃	4-OCH ₃ -フェニル
723	H	OCH ₃	NHC ₂ H ₅	O	1	C ₂ H ₅	4-OCH ₃ -フェニル
724	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	O	1	C ₂ H ₅	4-OCH ₃ -フェニル
725	H	OCH ₃	NHC ₂ H ₅	O	1	CH ₃	4-CF ₃ -フェニル
726	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	O	1	CH ₃	4-CF ₃ -フェニル
727	H	OCH ₃	NHC ₂ H ₅	O	1	C ₂ H ₅	4-CF ₃ -フェニル
728	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	O	1	C ₂ H ₅	4-CF ₃ -フェニル
729	H	OCH ₃	NHC ₂ H ₅	O	1	CH ₃	4-OC ₂ H ₅ -フェニル
730	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	O	1	CH ₃	4-OC ₂ H ₅ -フェニル
731	H	OCH ₃	NHC ₂ H ₅	O	1	C ₂ H ₅	4-OC ₂ H ₅ -フェニル
732	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	O	1	C ₂ H ₅	4-OC ₂ H ₅ -フェニル

化合物 番号	X	R ¹	Y	Z	n	R ¹²	R ¹³
733	H	OCH ₃	OCH ₃	O	1	C ₃ H ₇	4-Cl-フェニル
734	H	OCH ₃	OCH ₃	O	1	2-チエニル	CH ₃
735	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	2-チエニル	CH ₃
736	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	C ₃ H ₇	4-Cl-フェニル
737	H	OCH ₃	OCH ₃	O	1	CH ₂ OCH ₃	フェニル
738	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₂ OCH ₃	フェニル
739	H	OCH ₃	NHC ₂ H ₅	O	1	C ₂ H ₅	4-Cl-フェニル
740	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	O	1	CH ₃	2,4-(CH ₃) ₂ -フェニル
741	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	O	1	CH ₃	3,4-(CH ₃) ₂ -フェニル
742	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	O	1	CH ₃	2-CH ₃ -4-OCH ₃ -フェ ニル
743	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	O	1	CH ₃	2-OCH ₃ -4-CH ₃ -フェ ニル
744	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	O	1	CH ₃	2-Cl-4-OCH ₃ -フェ ニル
745	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	C ₂ H ₅	2,4-(CH ₃) ₂ -フェニル
746	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	C ₂ H ₅	3,4-(CH ₃) ₂ -フェニル
747	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	C ₂ H ₅	2-CH ₃ -4-OCH ₃ -フェ ニル
748	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	C ₂ H ₅	2-OCH ₃ -4-CH ₃ -フェ ニル
749	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	C ₃ H ₇	2,4-(CH ₃) ₂ -フェニル
750	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	C ₃ H ₇	3,4-(CH ₃) ₂ -フェニル
751	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	C ₃ H ₇	2-CH ₃ -4-OCH ₃ -フェ ニル
752	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	C ₃ H ₇	2-OCH ₃ -4-CH ₃ -フェ ニル

化合物 番号	X	R ¹	Y	Z	n	R ¹²	R ¹³
753	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	O	1	CH ₃	4-CH ₃ -フェニル
754	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	O	1	CH ₃	4-OCH ₃ -フェニル
755	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	O	1	CH ₃	4-CF ₃ -フェニル
756	H	OC ₃ H ₇	NHCH ₃	O	1	CH ₃	4-Cl-フェニル
757	H	OC ₃ H ₇	NHCH ₃	O	1	CH ₃	4-CH ₃ -フェニル
758	H	OC ₃ H ₇	NHCH ₃	O	1	CH ₃	4-OCH ₃ -フェニル
759	H	OC ₃ H ₇	NHCH ₃	O	1	CH ₃	4-CF ₃ -フェニル
760	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	C ₂ H ₅	4-CF ₃ -フェニル
761	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	C ₃ H ₇	4-Cl-フェニル
762	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	C ₃ H ₇	4-CH ₃ -フェニル
763	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	C ₃ H ₇	4-OCH ₃ -フェニル
764	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	C ₃ H ₇	4-CF ₃ -フェニル
765	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	S	1	CH ₃	4-Cl-フェニル
766	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	S	1	CH ₃	4-CH ₃ -フェニル
767	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	S	1	CH ₃	4-OCH ₃ -フェニル
768	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	S	1	CH ₃	4-CF ₃ -フェニル
769	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	S	1	C ₂ H ₅	4-Cl-フェニル
770	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	S	1	C ₂ H ₅	4-CH ₃ -フェニル
771	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	S	1	C ₂ H ₅	4-OCH ₃ -フェニル
772	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	S	1	C ₂ H ₅	4-CF ₃ -フェニル

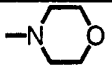
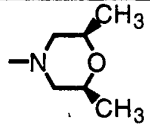
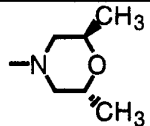
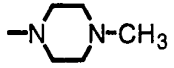
化合物 番号	X	R ¹	Y	Z	n	R ¹²	R ¹³
773	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	2,5-(CH ₃) ₂ -フェニル
774	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	O	1	CH ₃	2,5-(CH ₃) ₂ -フェニル
775	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	C ₂ H ₅	2,5-(CH ₃) ₂ -フェニル
776	H	OCH ₃	NHCH ₃	S	1	CH ₃	2,5-(CH ₃) ₂ -フェニル
777	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	3,5-(CH ₃) ₂ -フェニル
778	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	O	1	CH ₃	3,5-(CH ₃) ₂ -フェニル
779	H	OCH ₃	NHCH ₃	S	1	CH ₃	3,5-(CH ₃) ₂ -フェニル
780	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	C ₂ H ₅	3,5-(CH ₃) ₂ -フェニル
781	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	3-CH ₃ -4-OCH ₃ -フェニル
782	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	O	1	CH ₃	3-CH ₃ -4-OCH ₃ -フェニル
783	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	C ₂ H ₅	3-CH ₃ -4-OCH ₃ -フェニル
784	H	OCH ₃	NHCH ₃	S	1	CH ₃	3-CH ₃ -4-OCH ₃ -フェニル
785	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	2-ナフチル
786	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	C ₂ H ₅	2-ナフチル
787	H	OCH ₃	NHCH ₃	S	1	CH ₃	2-ナフチル
788	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	O	1	CH ₃	2-ナフチル
789	H	OCH ₃	SCH ₃	O	1	C ₂ H ₅	4-Cl-フェニル
790	H	OCH ₃	SCH ₃	O	1	C ₂ H ₅	4-CH ₃ -フェニル
791	H	OCH ₃	SCH ₃	O	1	C ₂ H ₅	4-OCH ₃ -フェニル
792	H	OCH ₃	SCH ₃	O	1	C ₂ H ₅	4-CF ₃ -フェニル

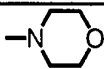
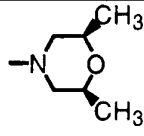
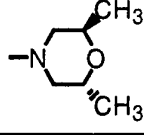
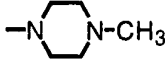
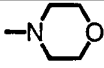
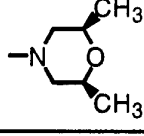
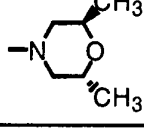
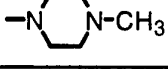
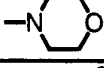
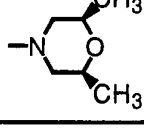
化合物 番号	X	R ¹	Y	Z	n	R ¹²	R ¹³
793	H	Cl	NHCH ₃	O	1	CH ₃	4-Cl-フェニル
794	H	SCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	4-Cl-フェニル
795	H	SCH ₃	NHCH ₃	O	1	C ₂ H ₅	4-Cl-フェニル
796	H	NHCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	4-Cl-フェニル
797	H	SCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	4-CF ₃ -フェニル
798	H	NHCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	4-CF ₃ -フェニル
799	H	SCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	3-CF ₃ -フェニル
800	H	NHCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	3-CF ₃ -フェニル
801	H	SCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	4-CH ₃ -フェニル
802	H	NHCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	4-CH ₃ -フェニル
803	H	SCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	4-OCH ₃ -フェニル
804	H	NHCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	4-OCH ₃ -フェニル
805	H	SCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	4-OCHF ₂ -フェニル
806	H	NHCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	4-OCHF ₂ -フェニル
807	H	Cl	NHCH ₃	O	1	CH ₃	4-NO ₂ -フェニル
808	H	SCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	4-NO ₂ -フェニル
809	H	SCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	3,4-(CH ₃) ₂ -フェニル
810	H	NHCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	3,4-(CH ₃) ₂ -フェニル
811	H	SCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	3,4-Cl ₂ -フェニル
812	H	NHCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	3,4-Cl ₂ -フェニル

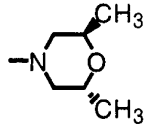
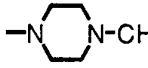
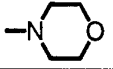
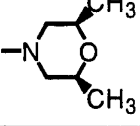
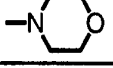
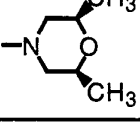
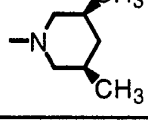
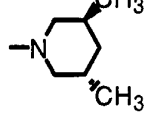
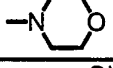
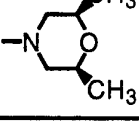
化合物 番号	X	R ¹	Y	Z	n	R ¹²	R ¹³
813	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	SCH ₃	4-Cl-フェニル
814	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	O	1	SCH ₃	4-Cl-フェニル
815	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	SC ₂ H ₅	4-Cl-フェニル
816	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	SC ₄ H ₉	4-Cl-フェニル
817	H	OCH ₃	OCH ₃	O	1	SCH ₃	4-Cl-フェニル
818	H	OCH ₃	NHCH ₃	S	1	SCH ₃	4-Cl-フェニル
819	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	SCH ₃	4-CH ₃ -フェニル
820	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	O	1	SCH ₃	4-CH ₃ -フェニル
821	H	OCH ₃	OCH ₃	O	1	SCH ₃	4-CH ₃ -フェニル
822	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	SC ₂ H ₅	4-CH ₃ -フェニル
823	H	OCH ₃	NHCH ₃	S	1	SCH ₃	4-CH ₃ -フェニル
824	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	SCH ₃	4-CF ₃ -フェニル
825	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	O	1	SCH ₃	4-CF ₃ -フェニル
826	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	SC ₂ H ₅	4-CF ₃ -フェニル
827	H	OCH ₃	NHCH ₃	S	1	SCH ₃	4-CF ₃ -フェニル
828	H	OCH ₃	OCH ₃	O	1	SCH ₃	4-CF ₃ -フェニル
829	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	SCH ₃	3-CF ₃ -フェニル
830	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	O	1	SCH ₃	3-CF ₃ -フェニル
831	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	SC ₂ H ₅	3-CF ₃ -フェニル
832	H	OCH ₃	NHCH ₃	S	1	SCH ₃	3-CF ₃ -フェニル

化合物 番号	X	R ¹	Y	Z	n	R ¹²	R ¹³
833	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	SOCH ₃	4-Cl-フェニル
834	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	SO ₂ CH ₃	4-Cl-フェニル
835	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	SOC ₂ H ₅	4-Cl-フェニル
836	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	SO ₂ C ₂ H ₅	4-Cl-フェニル
837	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	SCH ₃	4-OCH ₃ -フェニル
838	H	OCH ₃	NHCH ₃	S	1	SCH ₃	4-OCH ₃ -フェニル
839	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	SC ₂ H ₅	4-OCH ₃ -フェニル
840	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	O	1	SCH ₃	4-OCH ₃ -フェニル
841	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	SCH ₃	4-OCHF ₂ -フェニル
842	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	SC ₂ H ₅	4-OCHF ₂ -フェニル
843	H	OCH ₃	NHCH ₃	S	1	SCH ₃	4-OCHF ₂ -フェニル
844	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	O	1	SCH ₃	4-OCHF ₂ -フェニル
845	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	SCH ₃	3-Cl-フェニル
846	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	SC ₂ H ₅	3-Cl-フェニル
847	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	SCH ₃	2-Cl-フェニル
848	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	SC ₂ H ₅	2-Cl-フェニル
849	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	SCH ₃	4-C ₂ H ₅ -フェニル
850	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	O	1	SCH ₃	4-C ₂ H ₅ -フェニル
851	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	SC ₂ H ₅	4-OC ₂ H ₅ -フェニル
852	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	SCH ₃	4-OC ₂ H ₅ -フェニル

化合物 番号	X	R ¹	Y	Z	n	R ¹²	R ¹³
853	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	SCH ₃	3,4-(CH ₃) ₂ -フェニル
854	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	SC ₂ H ₅	3,4-(CH ₃) ₂ -フェニル
855	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	SCH ₃	3-Cl-4-OCH ₃ -フェニル
856	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	SC ₂ H ₅	3-Cl-4-OCH ₃ -フェニル
857	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	SCH ₃	3,4-Cl ₂ -フェニル
858	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	SC ₂ H ₅	3,4-Cl ₂ -フェニル
859	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	SC ₂ H ₅	4-NO ₂ -フェニル
860	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	SCH ₃	4-NO ₂ -フェニル
861	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	SCH ₃	4-フェノキシフェニル
862	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	SC ₂ H ₅	4-フェノキシフェニル
863	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	SCH ₃	2-フリル
864	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	SCH ₃	2-チエニル
865	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	SCH ₃	2-ピリジル
866	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	SCH ₃	3-ピリジル
867	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	SCH ₃	4-ピリジル
868	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	SCH ₃	2-ピリダジニル
869	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	SCH ₃	2-ピリミジニル
870	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	SCH ₃	5-ピリミジニル
871	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	SCH ₃	1-ナフチル
872	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	SCH ₃	2-ナフチル

化合物 番号	X	R ¹	Y	Z	n	R ¹²	R ¹³
873	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1		CH ₃ , SCH ₃
874	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1		CH ₃ , SC ₂ H ₅
875	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1		CH ₃ , SC ₄ H ₉
876	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1		C ₂ H ₅ , SCH ₃
877	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1		C ₂ H ₅ , SC ₂ H ₅
878	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1		C ₂ H ₅ , SC ₄ H ₉
879	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1		C ₄ H ₉ , SCH ₃
880	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1		C ₄ H ₉ , SC ₂ H ₅
881	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1		C ₄ H ₉ , SC ₄ H ₉
882	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	
883	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	
884	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	
885	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	

化合物 番号	X	R ¹	Y	Z	n	R ¹²	R ¹³
886	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	C ₂ H ₅	
887	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	C ₂ H ₅	
888	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	C ₂ H ₅	
889	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	C ₂ H ₅	
890	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	C ₄ H ₉	
891	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	C ₄ H ₉	
892	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	C ₄ H ₉	
893	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	C ₄ H ₉	
894	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CF ₃	
895	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CF ₃	

化合物 番号	X	R ¹	Y	Z	n	R ¹²	R ¹³
896	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CF ₃	
897	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CF ₃	
898	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1		4-Cl-フェニル
899	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1		4-Cl-フェニル
900	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1		3-Cl-フェニル
901	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1		3-Cl-フェニル
902	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	
903	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	
904	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1		4-CH ₃ -フェニル
905	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1		4-CH ₃ -フェニル

化合物 番号	X	R ¹	Y	Z	n	R ¹²	R ¹³
906	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1		4-CF ₃ -フェニル
907	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1		4-CF ₃ -フェニル
908	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1		3-CF ₃ -フェニル
909	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1		3-CF ₃ -フェニル
910	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1		4-OCH ₃ -フェニル
911	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1		4-OCH ₃ -フェニル
912	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1		4-OCHF ₂ -フェニル
913	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1		4-OCHF ₂ -フェニル
914	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1		4-NO ₂ -フェニル
915	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1		4-NO ₂ -フェニル

化合物 番号	X	R ¹	Y	Z	n	R ¹²	R ¹³
916	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	NHCH ₃	4-Cl-フェニル
917	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	O	1	NHCH ₃	4-Cl-フェニル
918	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	NHC ₂ H ₅	4-Cl-フェニル
919	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	NHC ₄ H ₉	4-Cl-フェニル
920	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	NHCH ₃	4-CF ₃ -フェニル
921	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	NHC ₂ H ₅	4-CF ₃ -フェニル
922	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	NHCH ₃	3-CF ₃ -フェニル
923	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	NHC ₂ H ₅	3-CF ₃ -フェニル
924	H	OCH ₃	OCH ₃	O	1	NHCH ₃	4-CH ₃ -フェニル
925	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	NHC ₂ H ₅	4-CH ₃ -フェニル
926	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	NHCH ₃	4-OCH ₃ -フェニル
927	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	NHC ₂ H ₅	4-OCH ₃ -フェニル
928	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	NHCH ₃	4-OCHF ₂ -フェニル
929	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	NHC ₂ H ₅	4-OCHF ₂ -フェニル
930	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	NHCH ₃	4-NO ₂ -フェニル
931	H	OCH ₃	OCH ₃	O	1	NHC ₂ H ₅	4-NO ₂ -フェニル
932	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	NHCH ₃	3,4-(CH ₃) ₂ -フェニル
933	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	NHC ₂ H ₅	3,4-(CH ₃) ₂ -フェニル
934	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	NHCH ₃	3,4-Cl ₂ -フェニル
935	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	NHC ₂ H ₅	3,4-Cl ₂ -フェニル

化合物 番号	X	R ¹	Y	Z	n	R ²	R ¹²	R ¹³
936	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	COCH ₃	CH ₃	
937	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	COCH ₃	CH ₃	
938	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	COCH ₃	CH ₃	
939	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	COCH ₃	CH ₃	
940	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	CH ₃	4-Cl-フェニル
941	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	COCH ₃	CH ₃	4-Cl-フェニル
942	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	COC ₂ H ₅	CH ₃	4-Cl-フェニル
943	H	OCH ₃	NHCH ₃	S	1	COCH ₃	CH ₃	4-Cl-フェニル
944	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CO-フェニル	CH ₃	4-Cl-フェニル
945	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	O	1	COCH ₃	CH ₃	4-Cl-フェニル
946	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	COCH ₃	C ₂ H ₅	4-Cl-フェニル

化合物 番号	X	R ¹	Y	Z	n	R ²	R ¹²	R ¹³
947	H	OCH ₃	OCH ₃	O	1	COCH ₃	CH ₃	4-Cl-フェニル
948	H	OCH ₃	SCH ₃	O	1	COCH ₃	CH ₃	4-Cl-フェニル
949	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃ -フェニル
950	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	COCH ₃	CH ₃	4-CH ₃ -フェニル
951	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	COCH ₃	C ₂ H ₅	4-CH ₃ -フェニル
952	H	OCH ₃	OCH ₃	O	1	COCH ₃	CH ₃	4-CH ₃ -フェニル
953	H	OCH ₃	SCH ₃	O	1	COCH ₃	CH ₃	4-CH ₃ -フェニル
954	H	OCH ₃	NHCH ₃	S	1	COCH ₃	CH ₃	4-CH ₃ -フェニル
955	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	CH ₃	4-CF ₃ -フェニル
956	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	COCH ₃	CH ₃	4-CF ₃ -フェニル
957	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	COCH ₃	C ₂ H ₅	4-CF ₃ -フェニル
958	H	OCH ₃	OCH ₃	O	1	COCH ₃	CH ₃	4-CF ₃ -フェニル
959	H	OCH ₃	SCH ₃	O	1	COCH ₃	CH ₃	4-CF ₃ -フェニル
960	H	OCH ₃	NHCH ₃	S	1	COCH ₃	CH ₃	4-CF ₃ -フェニル
961	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	CH ₃	CH ₃	4-OCH ₃ -フェニル
962	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	COCH ₃	CH ₃	4-OCH ₃ -フェニル
963	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	COCH ₃	C ₂ H ₅	4-OCH ₃ -フェニル

化合物 番号	X	R ¹	Y	Z	n	R ²	R ¹²	R ¹³
964	H	OCH ₃	OCH ₃	O	1	COCH ₃	CH ₃	4-OCH ₃ -フェニル
965	H	OCH ₃	SCH ₃	O	1	COCH ₃	CH ₃	4-OCH ₃ -フェニル
966	H	OCH ₃	NHCH ₃	S	1	COCH ₃	CH ₃	4-OCH ₃ -フェニル
967	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	COCH ₃	CH ₃	3-CF ₃ -フェニル
968	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	COCH ₃	CH ₃	3,4-Cl ₂ -フェニル
969	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	COCH ₃	CH ₃	3,4-(CH ₃) ₂ -フェニル
970	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	COCH ₃	CH ₃	4-OCHF ₂ -フェニル
971	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	COCH ₃	CH ₃	4-フェノキシフェニル
972	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	COCH ₃	CH ₃	CH ₃
973	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	COCH ₃	CH ₃	C ₄ H ₉
974	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	COCH ₃	COCH ₃	4-Cl-フェニル
975	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	COCH ₃	CO-フェニル	4-Cl-フェニル
976	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	COCH ₃	SCH ₃	4-Cl-フェニル
977	H	OCH ₃	NHCH ₃	S	1	COCH ₃	SCH ₃	4-Cl-フェニル
978	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	COCH ₃	SCH ₃	4-CH ₃ -フェニル
979	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	COCH ₃	SCH ₃	4-CF ₃ -フェニル
980	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	COCH ₃	SCH ₃	4-OCH ₃ -フェニル

化合物 番号	X	R ¹	Y	Z	n	M	R ¹⁴	R ¹⁵
981	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	O	CH ₃	4-Cl-フェニル
982	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	O	シクロプロピル	4-Cl-フェニル
983	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	S	CH ₃	4-Cl-フェニル
984	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	S	シクロプロピル	4-Cl-フェニル
985	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	S	SCH ₃	4-Cl-フェニル
986	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	S	フェニル	4-Cl-フェニル
987	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	NH	シクロプロピル	4-Cl-フェニル
988	H	OCH ₃	OCH ₃	O	1	S	CH ₃	4-Cl-フェニル
989	H	OCH ₃	OCH ₃	O	1	S	シクロプロピル	4-Cl-フェニル
990	H	OCH ₃	OCH ₃	O	1	S	SCH ₃	4-Cl-フェニル
991	H	OCH ₃	SCH ₃	O	1	S	CH ₃	4-Cl-フェニル
992	H	OCH ₃	SCH ₃	O	1	S	シクロプロピル	4-Cl-フェニル
993	H	OCH ₃	SCH ₃	O	1	S	SCH ₃	4-Cl-フェニル
994	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	S	CH ₃	4-CH ₃ -フェニル
995	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	S	シクロプロピル	4-CH ₃ -フェニル

化合物 番号	X	R ¹	Y	Z	n	M	R ¹⁴	R ¹⁵
996	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	S	SCH ₃	4-CH ₃ -フェニル
997	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	S	CH ₃	4-CF ₃ -フェニル
998	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	S	シクロプロピル	4-CF ₃ -フェニル
999	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	S	SCH ₃	4-CF ₃ -フェニル
1000	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	S	CH ₃	4-OCH ₃ -フェニル
1001	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	S	シクロプロピル	4-OCH ₃ -フェニル
1002	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	S	SCH ₃	4-OCH ₃ -フェニル
1003	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	S	CH ₃	CH ₃
1004	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	S	シクロプロピル	CH ₃
1005	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	S	SCH ₃	CH ₃
1006	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	S	CH ₃	C ₄ H ₉
1007	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	S	シクロプロピル	C ₄ H ₉
1008	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	S	SCH ₃	C ₄ H ₉
1009	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	S	シクロプロピル	4-OC ₂ H ₅ -フェニル
1010	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	S	シクロプロピル	4-フェノキシフェニル

化合物 番号	X	R ¹	Y	Z	n	M	Q
1011	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	O	C ₄ H ₉
1012	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	O	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl
1013	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	O	CH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅
1014	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	O	CH ₂ CH ₂ SC ₂ H ₅
1015	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	O	CH ₂ CH ₂ NHC ₂ H ₅
1016	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	O	ベンジル
1017	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	O	2-CH ₃ -ベンジル
1018	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	O	3-CH ₃ -ベンジル
1019	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	O	4-CH ₃ -ベンジル
1020	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	O	フェネチル
1021	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	S	ベンジル
1022	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	NH	ベンジル
1023	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	O	3-ピリジルメチル
1024	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	O	CH ₂ CH=CH ₂
1025	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	O	CH ₂ CH=CCl ₂

化合物 番号	X	R ¹	Y	Z	n	M	Q
1026	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	O	CH ₂ CH=CH-フェニル
1027	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	O	CH ₂ C≡CH
1028	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	O	CH ₂ C≡C-CH ₃
1029	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	O	CH ₂ C≡C-フェニル
1030	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	O	ベンゾイル
1031	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	O	4-Cl-ベンゾイル
1032	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	O	4-CH ₃ -ベンゾイル
1033	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	O	4-CF ₃ -ベンゾイル
1034	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	O	4-OCH ₃ -ベンゾイル
1035	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	O	CO-ベンジル
1036	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	S	CO-ベンジル
1037	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	NH	CO-ベンジル
1038	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	O	4-トルエンスルホニル
1039	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	O	ベンジルスルホニル
1040	H	OCH ₃	NHCH ₃	O	1	NH	4-トルエンスルホニル

化合物 番号	物性
474	84 - 87 °C
475	105 - 106 °C
476	117 - 118 °C
477	2.23(3H, s), 3.39(3H, s), 3.71(3H, s), 5.24(1H, s), 5.27(1H, d, J=12.2), 5.51(1H, d, J=12.2), 7.30-7.54(6H, m), 7.58(2H, m)
478	120 - 122 °C
479	2.23(3H, s), 3.75(3H, s), 3.77(1H, d, J=5.5), 5.34(1H, d, J=12.2), 5.42(1H, d, J=12.2), 7.29-7.38 (5H, m), 7.43-7.48 (1H, m), 7.56 (2H, d, J=8.6)
480	2.84(3H, d, J=4.9), 3.34(3H, s), 5.13(1H, s), 5.23(1H, d, J=12.2), 5.65(1H, d, J=12.2), 6.80(1H, brs), 7.27-7.40(6H, m), 7.41-7.48(1H, m), 7.53-7.58(2H, m), 8.10(1H, s)
481	2.80(3H, d, J=4.9), 4.66(1H, brs), 5.25(1H, d, J=12.2), 5.41(1H, d, J=12.2), 5.42(1H, s), 6.60(1H, brs), 7.32-7.57(9H, m), 8.06(1H, s)
482	3.40(3H, s), 3.72(3H, s), 5.25(1H, s), 5.25(1H, d, J=12.2), 5.50(1H, d, J=12.2), 7.31-7.65(9H, m), 8.12(1H, s)
483	3.74(1H, d, J=5.5), 3.75(3H, s), 5.31(1H, d, J=12.2), 5.42(1H, d, J=12.2), 5.59(1H, d, J=5.5), 7.34-7.49(6H, m), 7.41-7.50(1H, m), 7.52-7.66(2H, m), 8.11(1H, s)
484	144 - 145 °C
486	123 - 125 °C
487	111.5 - 112.5 °C
488	2.26(3H, s), 3.39(3H, s), 3.71(3H, s), 5.27(1H, s), 5.28(1H, d, J=12.2), 5.52(1H, d, J=12.2), 7.32-7.40(5H, m), 7.43-7.56(2H, m), 7.61-7.69(2H, m)

化合物 番号	物性
4 8 9	2.24(3H, s), 2.65(3H, d, J=4.9), 4.83(1H, brs), 5.23(1H, d, J=12.2), 5.43(1H, d, J=12.2), 5.45(1H, s), 6.59(1H, brs), 7.31-7.40(6H, m), 7.44-7.48(1H, m), 7.52-7.58(2H, m)
4 9 0	9 3 - 9 4 °C
4 9 1	2.26(3H, s), 3.75(3H, S), 5.35(1H, d, J=12.2), 5.42(1H, d, J=12.2), 5.59(1H, s), 7.32-7.41(6H, m), 7.45-7.50(1H, m), 7.58-7.65(2H, m)
4 9 2	9 9 - 1 0 1.5 °C
4 9 3	1 4 1.5 - 1 4 2.5 °C
4 9 4	7 4 - 7 4.5 °C
4 9 5	2.21(3H, s), 2.68(3H, d, J=4.9), 3.82(3H, s), 4.95(1H, brs), 5.20(1H, d, J=12.2) 5.40(1H, d, J=12.2), 5.45(1H, s), 6.64(1H, brs), 6.89(2H, d, J=8.5), 7.31-7.48(4H, m), 7.50(2H, d, J=8.5)
4 9 6	2.20(3H, s), 3.82(3H, s), 5.21(1H, d, J=12.2), 5.39(1H, brs), 5.43 (1H, d, J=12.2), 5.48(1H, s), 6.79(1H, brs), 6.88(2H, d, J=8.5), 7.28- 7.46(4H, m), 7.49(2H, d, J=8.5)
4 9 7	7 2.5 - 7 3.5 °C
4 9 8	2.22(3H, s), 2.35(3H, s), 2.81(3H, d, J=5.5), 3.33(3H, s), 5.15(1H, s) 5.26(1H, d, J=12.2), 5.63(1H, d, J=12.2), 6.77(1H, brs), 7.15(2H, d, J=7.9), 7.28-7.48(4H, m), 7.52(2H, d, J=7.9)
4 9 9	1 2 2 - 1 2 3 °C
5 0 0	2.23(3H, s), 2.36(3H, s), 3.39(3H, s), 3.71(3H, s), 5.26(1H, d, J= 12.2), 5.27(1H, s), 5.38(1H, d, J=12.2), 7.16(2H, d, J=7.9), 7.32- 7.51(4H, m), 7.54(2H, d, J=7.9)
5 0 1	2.22(3H, s), 2.35(3H, s), 2.66(3H, d, J=4.9), 4.91(1H, brs), 5.21 (1H, d, J= 12.2), 5.41(1H, d, J=12.2), 5.45(1H, s), 6.62(1H, brs), 7.17 (2H, d, J=7.9), 7.31-7.47(6H, m)
5 0 2	1 0 5 - 1 0 6 °C

化合物 番号	物性
5 0 4	2.22(3H, s), 2.83(3H, d, J=4.9), 3.32(3H, s), 5.11(1H, s), 5.26(1H, d, J=12.2), 5.63(1H, d, J=12.2), 6.78(1H, brs), 7.23-7.46(7H, m)
5 0 5	1 1 8 - 1 2 0 . 5 °C
5 0 6	2.22(3H, s), 3.38(3H, s), 3.71(3H, s), 5.22(1H, s), 5.26(1H, d, J=12.2), 5.50(1H, d, J=12.2), 7.24-7.65(7H, m)
5 0 7	2.21(3H, s), 2.66(3H, d, J=4.9), 5.23 (1H, d, J=12.2), 5.39 (1H, d, J=12.2), 5.39(1H, s), 6.55(1H, brs), 7.15-7.47(7H, m)
5 1 0	2.23(3H, s), 2.56(3H, d, J=4.9), 4.72(1H, d, J=3.1), 5.22(1H, d, J=12.2), 5.41(1H, s), 5.42(1H, d, J=12.2), 6.58-6.68(1H, m), 7.19-7.49 (8H, m)
5 1 3	2.24(3H, s), 2.81(3H, d, J=4.9), 3.32(3H, s), 5.12(1H, s), 5.28(1H, d, J=12.2), 5.62(1H, d, J=12.2), 6.78(1H, brs), 7.21-7.48(8H, m)
5 1 5	2.25(3H, s), 3.39(3H, s), 3.71(3H, s), 5.24(1H, s), 5.27(1H, d, J=12.8), 5.51(1H, d, J=12.2), 7.22-7.65(8H, m)
5 1 6	2.22(3H, s), 2.72(3H, d, J=4.9), 4.62(1H, brs), 5.26(1H, d, J=12.2), 5.43(1H, s), 6.48(1H, brs), 7.27-7.65(8H, m)
5 1 7	8 7 - 8 8 °C
5 1 8	2.23(3H, s), 3.40(3H, s), 3.72(3H, s), 5.24(1H, s), 5.28(1H, d, J=12.2), 5.52(1H, d, J=12.2), 7.25-7.66(8H, m)
5 2 0	2.21(3H, s), 2.80(3H, d, J=4.9), 3.31(3H, s), 5.09(1H, s), 5.25(1H, d, J=12.2), 5.59(1H, d, J=12.2), 6.76(1H, brs), 7.29-7.57(7H, m), 7.67(1H, d, J=7.3)
5 2 3	2.27(3H, s), 2.83(3H, d, J=4.9), 3.33(3H, s), 5.13(1H, s), 5.29(1H, d, J=12.2), 5.70(1H, d, J=12.2), 6.78(1H, brs), 7.29-7.50(5H, m), 7.60(1H, d, J=7.9), 7.82(1H, d, J=7.9), 7.89(1H, s)

化合物 番号	物性
5 2 6	2.26(3H, s), 2.84(3H, d, J=4.9), 3.33(3H, s), 5.12(1H, s), 5.29(1H, d, J=12.2), 5.70(1H, d, J=12.2), 6.80(1H, brs), 7.29-7.48(4H, m), 7.60(2H, d, J=7.9), 7.75(2H, d, J=7.9)
5 2 7	2.27(3H, s), 3.40(3H, s), 3.72(3H, s), 5.24(1H, s), 5.30(1H, d, J=12.2), 5.54(1H, d, J=12.2), 7.32-7.57(4H, m), 7.61(2H, d, J=8.5), 7.76(2H, d, J=8.5)
5 2 9	2.28(3H, s), 2.84(3H, d, J=4.9), 3.33(3H, s), 5.11(1H, s), 5.32(1H, d, J=12.8), 5.74(1H, d, J=12.8), 6.84(1H, brs), 7.29-7.41(3H, m), 7.42-7.47(1H, m), 7.80(2H, d, J=8.6), 8.18(2H, d, J=8.6)
5 3 2	2.19(3H, s), 2.26(3H, s), 2.76(3H, d, J=4.9), 3.31(3H, s), 5.13(1H, s), 5.26(1H, d, J=12.2), 5.57(1H, d, J=12.2), 6.75(1H, brs), 7.10-7.28(4H, m), 7.29-7.38(3H, m), 7.42-7.47(1H, m)
5 3 5	2.23(3H, s), 2.36(3H, s), 2.82(3FH, d, J=4.9), 3.32(3H, s), 5.14(1H, s), 5.27(1H, d, J=12.2), 5.63(1H, d, J=12.2), 6.76(1H, brs), 7.10-7.45(8H, m)
5 4 1	1.10(3H, t, J=7.3), 2.74(2H, q, J=7.3), 2.83(3H, d, J=4.9), 3.32(3H, s), 5.12(1H, s), 5.25(1H, d, J=12.2), 5.65(1H, d, J=12.2), 6.78(1H, brs), 7.32(2H, d, J=8.5), 7.35-7.53(4H, m), 7.56(2H, d, J=8.5)
5 4 2	1.11(3H, t, J=7.9), 2.75(2H, q, J=7.9), 3.39(3H, s), 3.71(3H, s), 5.24(1H, s), 5.25(1H, d, J=12.2), 5.50(1H, d, J=12.2), 7.33(2H, d, J=8.5), 7.36-7.65(4H, m), 7.57(2H, d, J=8.5)
5 4 4	1.10(3H, t, J=7.6), 2.73(2H, q, J=7.6), 3.32(3H, s), 3.81(3H, s), 5.14(1H, s), 5.24(1H, d, J=12.2), 5.61(1H, d, J=12.2), 6.75(1H, brs), 6.84(2H, d, J=8.6), 7.30-7.40(3H, m), 7.45-7.50(1H, m), 7.56(2H, d, J=8.6)
5 4 7	1.86(6H, s), 2.82(3H, d, J=4.9), 3.33(3H, s), 5.09(1H, s), 5.11(1H, d, J=12.2), 5.43(1H, d, J=12.2), 6.72(1H, brs), 7.30-7.40(4H, m)
5 4 8	1.87(6H, s), 3.38(3H, s), 3.70(3H, s), 5.08(1H, d, J=12.2), 5.22(1H, s), 5.32(1H, d, J=12.2), 7.31-7.39(3H, m), 7.46-7.48(1H, m)
5 5 0	0.89(3H, t, J=7.3), 1.23-1.35(2H, m), 1.40-1.50(2H, m), 1.83(3H, s), 2.14 と 2.35 (合わせて 2H, それぞれ t, J=7.3), 2.83(3H, d, J=4.9), 3.33(3H, s), 5.08(1H, s), 5.09 と 5.11 (合わせて 1H, それぞれ d, J=12.2), 5.42 と 5.43 (合わせて 1H, それぞれ d, J=12.2), 6.80(1H, brs), 7.31-7.39(4H, m).

化合物 番号	物性
5 5 1	0.87-0.92(3H, m), 1.25-1.40(2H, m), 1.45-1.55(2H, m), 1.85 と 1.86 (合わせて 3H, それぞれ s), 2.16 と 2.35 (合わせて 2H, それぞれ t, J=7.3), 3.37(3H, s), 3.70(3H, s), 5.07 と 5.10 (合わせて 1H, それぞれ d, J=12.2), 5.21(1H, s), 5.33 と 5.34 (合わせて 1H, それぞれ d, J=12.2), 7.31-7.39(3H, m), 7.42-7.44(1H, m)
5 5 3	2.19(3H, s), 2.78(3H, d, J=4.9), 3.32(3H, s), 3.80(3H, s), 5.14(1H, s) 5.25(1H, d, J=12.2), 5.57(1H, d, J=12.2), 6.76(1H, brs), 6.87-6.95 (2H, m), 7.25-7.40(5H, m), 7.45-7.50(1H, m)
5 5 6	2.23(3H, s), 2.82(3H, d, J=4.9), 3.32(3H, s), 3.82(3H, s), 5.13(1H, s) 5.27(1H, d, J=12.2), 5.65(1H, d, J=12.2), 6.85(1H, brs), 6.90-6.92 (1H, m), 7.20-7.26(3H, m), 7.30-7.45(3H, m), 7.48-7.52(1H, m)
5 5 9	2.22(3H, s), 2.26(3H, s), 2.27(3H, s), 2.81(3H, d, J=4.9), 3.33(3H, s) 5.14(1H, s), 5.27(1H, d, J=12.2), 5.63(1H, d, J=12.2), 6.74-6.75(1H, m), 7.10(1H, d, J=7.9), 7.28-7.49(6H, m)
5 6 2	2.21(3H, s), 2.84(3H, d, J=4.9), 3.33(3H, s), 5.11(1H, s), 5.27(1H, d, J=12.2), 5.68(1H, d, J=12.2), 6.78-6.79(1H, m), 7.28-7.49(6H, m), 7.73(1H, brs)
5 7 1	1.93(3H, s), 2.35(3H, s), 2.85(3H, d, J=4.9), 3.32(3H, s), 5.50(1H, s), 5.30(1H, d, J=12.2), 5.79(1H, d, J=12.2), 6.82 (1H, brs), 7.29-7.43(4H, m)
5 7 2	1.94(3H, s), 2.36(3H, s), 3.39(3H, s), 3.72(3H, s), 5.15(1H, s), 5.34 (1H, d, J=12.2), 5.56(1H, d, J=12.2), 7.33-7.65(4H, m)
5 7 5	2.16(3H, s), 3.33(3H, s), 3.67(3H, s), 5.15(1H, s), 5.31(1H, d, J=12.2), 5.55(1H, d, J=12.2), 7.33-7.55(7H, m), 7.79-7.83(2H, m)
5 7 7	2.28(3H, s), 2.83(3H, d, J=4.9), 3.34(3H, s), 5.16(1H, s), 5.30(1H, d, J=12.2), 5.68(1H, d, J=12.2), 6.77(1H, brs), 7.31(7H, m), 7.57-7.62 (4H, m), 7.71(2H, d, J=8.5)
5 8 0	2.38(3H, s), 2.75(3H, d, J=4.9), 3.30(3H, s), 5.18(1H, s), 5.34(1H, d, J=12.2), 5.68(1H, d, J=12.2), 6.75(1H, brs), 7.33-7.55(8H, m), 7.81-7.93(3H, m)
5 8 1	2.38(3H, s), 3.39(3H, s), 3.69(3H, s), 5.31(1H, s), 5.32(1H, d, J=12.2), 5.56(1H, d, J=12.2), 7.36-7.60(8H, m), 7.83-7.95(3H, m)
5 8 3	2.17(3H, s), 2.83(3H, d, J=4.9), 3.34(3H, s), 5.10(1H, s), 5.29(1H, d, J=12.2), 5.62(1H, d, J=12.2), 6.43(1H, dd, J=3.7, 1.8), 6.62(1H, d, J=3.7), 6.79(1H, brs), 7.28-7.47(5H, m)

化合物 番号	物性
5 8 4	2.18(3H, s), 3.40(3H, s), 3.71(3H, s), 5.23(1H, s), 5.28(1H, d, J=12.2), 5.52(1H, d, J=12.2), 6.44(1H, dd, J=3.7, 1.8), 6.64(1H, d, J=3.7), 7.32-7.55(5H, m)
5 8 6	2.25(3H, s), 2.84(3H, d, J=4.9), 3.35(3H, s), 5.13(1H, s), 5.23(1H, d, J=12.2), 5.62(1H, d, J=12.2), 6.79(1H, brs), 6.99(1H, dd, J=4.9, 3.7), 6.98-7.47(6H, m)
5 8 7	2.26(3H, s), 3.40(3H, s), 3.71(3H, s), 5.24(1H, d, J=12.2), 5.25(1H, s), 5.47(1H, d, J=12.2), 7.00(1H, dd, J=5.5, 3.7), 7.21-7.53(6H, m)
5 8 9	2.35(3H, s), 2.84(3H, d, J=5.5), 3.33(3H, s), 5.14(1H, s), 5.30(1H, d, J=12.2), 5.73(1H, d, J=12.2), 6.80(1H, brs), 7.21-7.49(5H, m), 7.65(1H, dt, J=1.8, 7.9), 7.90(1H, d, J=7.9), 8.56-8.59(1H, m)
5 9 0	2.36(3H, s), 3.40(3H, s), 3.71(3H, s), 5.25(1H, s), 5.31(1H, d, J=12.2), 5.55(1H, d, J=12.2), 7.22-7.56(5H, m), 7.65(1H, dt, J=1.8, 7.9), 7.89(1H, d, J=7.9), 8.59(1H, dd, J=4.9, 1.8)
5 9 2	8 1 - 8 3 °C
5 9 3	2.33(3H, s), 3.41(3H, s), 3.73(3H, s), 5.24(1H, s), 5.35(1H, d, J=12.2), 5.58(1H, d, J=12.2), 7.32-7.56(4H, m), 8.49-8.53(2H, m), 9.15(1H, d, J=1.2)

化合物 番号	物性
603	2.23(3H, s), 3.25(3H, d, J=4.9), 3.33(3H, s), 5.29(1H, d, J=12.2), 5.51(1H, s), 5.80(1H, d, J=12.2), 7.25-7.36(5H, m), 7.42-7.47(1H, m), 7.58(2H, d, J=9.2), 8.77(1H, s)
606	105 - 107 °C
609	94.5 - 95.5 °C
610	2.27(3H, s), 3.26(3H, d, J=4.9), 3.33(3H, s), 5.32(1H, d, J=12.2), 5.51(1H, s), 5.84(1H, d, J=12.2), 7.27-7.48(4H, m), 7.60(2H, d, J= 7.9), 7.75(2H, d, J=7.9)
616	1.10(3H, t, J=7.6), 2.34(3H, s), 2.76(2H, q, J=7.6), 2.81(3H, d, J= 4.9), 3.32(3H, s), 5.14 (1H, s), 5.26(1H, d, J=12.2), 5.63(1H, d, J= 12.2), 6.76(1H, brs), 7.14(2H, d, J=7.8), 7.30-7.40(3H, m), 7.45- 7.50(1H, m), 7.51(2H, d, J=7.8)
627	1.55-1.68(6H, m), 2.19(2H, t, J=6.1), 2.44-2.49(2H, m), 2.83(3H, d, J=4.9), 3.33(3H, s), 5.09(1H, s), 5.10(1H, d, J=12.2), 5.42(1H, d, J=12.2), 6.75(1H, brs), 7.28-7.42(4H, m)
628	1.55-1.69(6H, m), 2.08(2H, t, d=6.1), 2.40-2.52(2H, m), 3.38(3H, s), 3.70(3H, s), 5.07(1H, d, J=12.2), 5.22(1H, s), 5.33(1H, d, J=12.2), 7.28-7.62(4H, m)
629	137.5 - 138.5 °C
630	2.88-2.93(2H, m), 3.01-3.05(2H, m), 3.41(3H, s), 3.72(3H, s), 5.26(1H, d, J=12.2), 5.30(1H, s), 5.49(1H, d, J=12.2), 7.24-7.37(5H, m), 7.45-7.54(2H, m), 7.69(2H, d, J=7.3)
631	1.20(3H, t, J=7.3), 2.23(3H, s), 3.39(3H, s), 4.14-4.22(2H, m), 5.22 (1H, s), 5.27(1H, d, J=12.2), 5.52(1H, d, J=12.2), 7.30-7.40(4H, m), 7.41-7.43(1H, m), 7.51-7.56(1H, m), 7.58(2H, d, J=8.6)
632	1.16(3H, t, J=7.3), 2.22(3H, s), 3.28-3.32(2H, m), 3.32(3H, s), 5.10 (1H, s), 5.25(1H, d, J=12.2), 5.66(1H, d, J=12.2), 6.72(1H, brs), 7.29-7.38(5H, m), 7.43-7.46(1H, m), 7.58(2H, d, J=8.6)

化合物 番号	物性
6 3 3	1.22-1.28(3H, m), 2.22(3H, s), 3.45-3.65(2H, m), 3.70(3H, s), 5.27 (1H, d, J=12.2), 5.32(1H, s), 5.50(1H, d, J=12.2), 7.29-7.38(4H, m), 7.41-7.43(1H, m), 7.53-7.55(1H, m), 7.57(2H, d, J=8.6)
6 3 4	1.23(3H, t, J=7.3), 2.21(3H, s), 2.83(3H, d, J=4.9), 3.45(2H, q, J= 7.3), 5.21(1H, s), 5.25(1H, d, J=12.2), 5.67(1H, d, J=12.2), 6.80(1H, brs), 7.29-7.32(4H, m), 7.37-7.42(2H, m), 7.57(2H, d, J=8.6)
6 3 5	0.87(3H, t, J=7.3), 1.29-1.35(2H, m), 1.53-1.58(2H, m), 2.21(3H, s), 2.83(3H, d, J=4.9), 3.40(2H, t, J=7.3), 5.19(1H, s), 5.25(1H, d, J= 12.2), 5.68(1H, d, J=12.2), 6.80(1H, brs), 7.29-7.43(6H, m), 7.57 (2H, d, J=8.6)
6 3 6	0.87(3H, t, J=7.3), 1.23-1.45(2H, m), 1.56-1.63(2H, m), 2.22(3H, s), 3.39-3.58(2H, m), 3.69(3H, s), 5.27(1H, d, J=12.2), 5.30(1H, s), 5.49(1H, d, J=12.2), 7.29-7.39(4H, m), 7.41-7.43(1H, m), 7.52-7.59 (3H, m)
6 3 7	1 0 2 - 1 0 3 °C
6 3 8	2.20(3H, s), 2.83(3H, s), 3.00(3H, s), 3.46(3H, s), 5.25(1H, d, J= 12.2), 5.38(1H, s), 5.45(1H, d, J=12.2), 7.30-7.35(5H, m), 7.44-7.47 (1H, m), 7.58(2H, d, J=8.6)
6 3 9	2.15(3H, s), 2.22(3H, s), 2.62(3H, d, J=4.9), 5.33(1H, d, J=12.2), 5.52(1H, d, J=12.2), 6.22(1H, brs), 6.47(1H, s), 7.31(2H, d, J=8.6), 7.34-7.39(2H, m), 7.42-7.53(2H, m), 7.56(2H, d, J=8.6)

化合物 番号	物性
6 7 1	1.06(3H, t, J=7.3), 1.84(3H, s), 2.16 と 2.35(合わせて2H, それぞれ q, J=7.3), 2.82(3H, d, J=4.9), 3.33(3H, s), 5.09 と 5.11(合わせて1H, それぞれ d, J=12.2), 5.11(1H, s), 5.40 と 5.42(合わせて1H, それぞれ d, J=12.2), 6.80(1H, brs), 7.30-7.39(4H, m)
6 7 2	1.04-1.10(3H, m), 1.84 と 1.85(合わせて3H, それぞれ s), 2.16 と 2.34(合わせて2H, それぞれ q, J=7.3), 3.38(3H, s), 3.70(3H, s), 5.07 と 5.12(合わせて1H, それぞれ d, J=12.2), 5.27(1H, s), 5.34 と 5.36(合わせて1H, それぞれ d, J=12.2), 7.30-7.38(3H, m), 7.42-7.45(1H, m)
6 7 8	2.20(3H, s), 2.83(3H, d, J=4.9), 3.33(3H, s), 3.91(3H, s), 5.13(1H, s), 5.25(1H, d, J=12.2), 5.65(1H, d, J=12.2), 6.77(1H, brs), 6.89(1H, d, J=8.5), 7.29-7.46(4H, m), 7.50(1H, dd, J=8.5, 2.4), 7.69(1H, d, J=2.4)
6 8 0	2.21(3H, s), 2.38(3H, s), 2.83(3H, d, J=4.9), 3.33(3H, s), 5.12(1H, s), 5.27(1H, d, J=12.2), 5.65(1H, d, J=12.2), 6.78(1H, brs), 7.29-7.51(7H, m)
6 8 2	2.23(3H, s), 2.81(3H, d, J=4.9), 3.32(3H, s), 5.12(1H, s), 5.27(1H, d, J=12.2), 5.66(1H, d, J=12.2), 6.51(1H, t, J=73.8), 6.81(1H, brs), 7.08(2H, d, J=8.6), 7.30-7.39(3H, m), 7.42-7.47(1H, m), 7.63(2H, d, J=8.6)
6 8 4	2.22(3H, s), 2.82(3H, d, J=4.9), 3.33(3H, s), 3.89(3H, s), 3.91(3H, s), 5.14(1H, s), 5.26(1H, d, J=12.2), 5.65(1H, d, J=12.2), 6.76-6.78(1H, m), 6.83(1H, d, J=8.5), 7.13(1H, dd, J=8.5, 2.4), 7.29(1H, d, J=2.4), 7.29-7.49(4H, m)
6 8 6	2.18(3H, s), 2.23(3H, s), 2.30(3H, s), 2.78(3H, d, J=4.9), 3.32(3H, s), 5.13(1H, s), 5.25(1H, d, J=12.2), 5.58(1H, d, J=12.2), 6.75(1H, brs), 6.97-7.47(7H, m)
6 8 8	2.22(3H, s), 2.78(3H, d, J=4.9), 3.31(3H, s), 5.14(1H, s), 5.27(1H, d, J=12.2), 5.66(1H, d, J=12.2), 6.80(1H, brs), 6.93-7.01(4H, m), 7.10(1H, t, J=7.3), 7.28-7.39(5H, m), 7.41-7.67(1H, m), 7.60(2H, d, J=9.2)
6 9 0	2.23(3H, d, J=3.1), 2.81(3H, d, J=4.9), 3.33(3H, s), 3.80(3H, s), 5.13(1H, s), 5.25(1H, d, J=12.2), 5.62(1H, d, J=12.2), 6.60(1H, dd, J=12.8, 2.4), 6.66(1H, dd, J=8.5, 2.4), 7.29-7.47(5H, m)
6 9 2	2.20(3H, s), 2.83(3H, d, J=4.9), 3.33(3H, s), 3.90(3H, s), 5.13(1H, s), 5.25(1H, d, J=12.2), 5.64(1H, d, J=12.2), 6.77-6.79(1H, m), 6.92(1H, t, J=8.5), 7.29-7.49(6H, m)
6 9 8	2.21(3H, s), 2.82(3H, d, J=4.9), 3.32(3H, s), 5.12(1H, s), 5.26(1H, d, J=12.2), 5.66(1H, d, J=12.2), 6.75(1H, brs), 7.28-7.40(3H, m), 7.42-7.55(5H, m)

化合物 番号	物性
7 0 1	2.22(3H, s), 2.82(3H, d, J=4.9), 3.32(3H, s), 5.13(1H, s), 5.25(1H, d, J=12.2), 5.65(1H, d, J=12.2), 6.73(1H, brs), 7.00-7.05(2H, m), 7.27-7.36(3H, m), 7.43-7.45(1H, m), 7.58-7.62(2H, m)
7 0 2	1.41(3H, t, J=7.3), 2.21(3H, s), 2.81(3H, d, J=4.9), 3.33(3H, s), 4.05(2H, q, J=7.3), 5.15(1H, s), 5.25(1H, d, J=12.2), 5.62(1H, d, J=12.2), 6.75(1H, brs), 6.86(2H, d, J=8.5), 7.30-7.48(4H, m), 7.56(2H, d, J=8.5)
7 0 4	0.97(3H, t, J=7.3), 1.49(2H, 6重線, J=7.3), 1.77(2H, 5重線, J=7.3), 2.21(3H, s), 2.81(3H, d, J=4.9), 3.33(3H, s), 3.97(2H, t, J=7.3), 5.15(1H, s), 5.25(1H, d, J=12.2), 5.62(1H, d, J=12.2), 6.75(1H, brs), 6.86(2H, d, J=8.5), 7.28-7.48(4H, m), 7.56(2H, d, J=8.5)
7 0 7	1.31(9H, s), 2.23(3H, s), 2.80(3H, d, J=4.9), 3.32(3H, s), 5.14(1H, s), 5.26(1H, d, J=12.2), 5.63(1H, d, J=12.2), 6.75(1H, brs), 7.30-7.38(5H, m), 7.42-7.47(1H, m), 7.56(2H, d, J=8.6)
7 1 0	1.22(3H, t, J=7.6), 2.22(3H, s), 2.65(2H, q, J=7.6), 2.81(3H, d, J=4.9), 3.32(3H, s), 5.14(1H, s), 5.26(1H, d, J=12.2), 5.63(1H, d, J=12.2), 6.75(1H, brs), 7.17(2H, d, J=8.6), 7.30-7.38(3H, m), 7.44-7.47(1H, m), 7.54(2H, d, J=8.6)
7 1 7	1.15(3H, t, J=7.3), 2.22(3H, s), 2.34(3H, s), 3.21-3.40(2H, m), 3.32(3H, s), 5.13(1H, s), 5.26(1H, d, J=12.2), 5.65(1H, d, J=12.2), 6.77(1H, brs), 7.14(2H, d, J=8.5), 7.28-7.39(3H, m), 7.44-7.48(1H, m), 7.52(2H, d, J=8.5)
7 1 8	1.19(3H, t, J=7.0), 2.21(3H, s), 2.34(3H, s), 2.82(3H, d, J=4.9), 3.47(2H, q, J=7.0), 5.23(1H, s), 5.26(1H, d, J=12.2), 5.67(1H, d, J=12.2), 6.85(1H, brs), 7.20-7.53(8H, m)

化合物 番号	物性
7 2 1	1.15(3H, t, J=7.3), 2.22(3H, s), 2.34(3H, s), 3.22-3.36(2H, m), 3.32(3H, s), 3.81(3H, s), 5.13(1H, s), 5.25(1H, d, J=12.2), 5.63(1H, d, J=12.2), 6.76(1H, brs), 6.86(2H, d, J=9.2), 7.29-7.38(3H, m), 7.43-7.48(1H, m), 7.58(2H, d, J=9.2)
7 2 2	1.18(3H, t, J=7.0), 2.20(3H, s), 2.82(3H, d, J=4.9), 3.48(2H, q, J=7.0), 3.81(3H, s), 5.23(1H, s), 5.25(1H, d, J=12.2), 5.64(1H, d, J=12.2), 6.80(1H, brs), 6.87(2H, d, J=8.3), 7.29-7.46(4H, m), 7.58(2H, d, J=8.3)
7 2 5	1.16(3H, t, J=7.3), 2.26(3H, s), 3.24-3.37(2H, m), 3.33(3H, s), 5.11(1H, s), 5.29(1H, d, J=12.2), 5.71(1H, d, J=12.2), 6.78(1H, brs), 7.29-7.40(3H, m), 7.44-7.47(1H, m), 7.59(2H, d, J=8.5), 7.75(2H, d, J=8.5)
7 2 6	8 8 ~ 9 0 °C
7 3 3	0.93(3H, t, J=7.3), 1.54(2H, 6重線, J=7.3), 2.72(2H, t, J=7.3), 3.39(3H, s), 3.71(3H, s), 5.24(1H, s), 5.25(1H, d, J=12.2), 5.49(1H, d, J=12.2), 7.29-7.53(4H, m), 7.32(2H, d, J=8.5), 7.56(2H, d, J=8.5)
7 3 4	2.34(3H, s), 3.34(3H, s), 3.67(3H, s), 5.29(1H, s), 5.30(1H, d, J=12.2), 5.58(1H, d, J=12.2), 7.70(1H, dd, J=5.5, 3.7), 7.32-7.56(6H, m)
7 3 5	2.32(3H, s), 2.79(3H, d, J=4.9), 3.29(3H, s), 5.18(1H, s), 5.31(1H, d, J=12.2), 5.72(1H, d, J=12.2), 6.74(1H, brs), 7.05-7.08(1H, m), 7.27-7.52(6H, m)
7 3 6	0.92(3H, t, J=7.3), 1.53(2H, 6重線, J=7.3), 2.71(2H, t, J=7.3), 2.83(3H, d, J=4.9), 3.32(3H, s), 5.12(1H, s), 5.25(1H, d, J=12.2), 5.65(1H, d, J=12.2), 6.75-6.78(1H, m), 7.28-7.53(4H, m), 7.31(2H, d, J=8.5), 7.55(2H, d, J=8.5)

化合物 番号	物性
7 3 7	3.29(3H, s), 3.39(3H, s), 3.71(3H, s), 4.62(2H, s), 5.22(1H, s), 5.28(1H, d, J=12.2), 5.53(1H, d, J=12.2), 7.30-7.36(5H, m), 7.39-7.44(1H, m), 7.45-7.50(1H, m), 7.62-7.67(2H, m)
7 3 8	2.81(3H, d, J=4.9), 3.29(3H, s), 3.32(3H, s), 4.62(2H, s), 5.11(1H, s), 5.27(1H, d, J=12.2), 5.57(1H, d, J=12.2), 6.78(1H, brs), 7.30-7.45 (6H, m), 7.56-7.59 (1H, m), 7.65-7.67(2H, m)
7 3 9	1.10(3H, t, J=7.3), 1.16(3H, t, J=7.3), 2.74(2H, q, J=7.3), 3.22-3.35(2H, m), 3.32(3H, s), 5.10(1H, s), 5.26(1H, d, J=12.2), 5.66(1H, d, J=12.2), 6.78(1H, brs), 7.27-7.39(3H, m), 7.31(2H, d, J=8.6), 7.42-7.47(1H, m), 7.56(2H, d, J=8.6)
7 4 0	1.11(3H, t, J=7.3), 2.76(2H, q, J=7.3), 2.82(3H, d, J=4.9), 3.32(3H, s), 5.12(1H, s), 5.25(1H, d, J=12.8), 5.65(1H, d, J=12.8), 6.51(1H, t, J=73.9), 6.77(1H, brs), 7.09(2H, d, J=8.6), 7.28-7.39(3H, m), 7.40-7.48(1H, m), 7.63(2H, d, J=8.6)
7 4 1	2.51-2.89(7H, m), 3.31 と 3.35(合わせて3H, それぞれ s), 3.50 と 3.79(合わせて2H, それぞれ s), 5.08-5.20(2H, m), 5.44-5.55(1H, m), 6.75(1H, brs), 7.09-7.20(4H, m), 7.25-7.45(4H, m)

化合物 番号	物性
7 5 6	0.89(3H, t, J=7.3), 1.56-1.63(2H, m), 2.21(3H, s), 2.84(3H, d, J=4.9), 3.36(2H, t, J=7.3), 5.20(1H, s), 5.25(1H, d, J=12.2), 5.69(1H, d, J=12.2), 6.85(1H, brs), 7.29-7.44(6H, m), 7.58(2H, dd, J=8.6, 1.8)
7 5 7	0.88(3H, t, J=7.3), 1.56-1.63(2H, m), 2.21(3H, s), 2.34(3H, s), 2.83(3H, d, J=4.9), 3.37(2H, t, J=7.3), 5.22(1H, s), 5.24(1H, d, J=12.2), 5.67(1H, d, J=12.2), 6.80(1H, brs), 7.14(2H, d, J=8.0), 7.29-7.43(4H, m), 7.52(2H, d, J=8.0)
7 5 8	0.88(3H, t, J=7.3), 1.56-1.64(2H, m), 2.21(3H, s), 2.83(3H, d, J=4.9), 3.37(2H, t, J=7.3), 3.81(3H, s), 5.22(1H, s), 5.24(1H, d, J=12.2), 5.67(1H, d, J=12.2), 6.80(1H, brs), 6.86(2H, d, J=8.3), 7.29-7.46(4H, m), 7.56(2H, d, J=8.3)
7 5 9	0.88(3H, t, J=7.3), 1.56-1.63(2H, m), 2.25(3H, s), 2.84(3H, d, J=4.9), 3.36(2H, t, J=7.3), 5.20(1H, s), 5.28(1H, d, J=12.2), 5.73(1H, d, J=12.2), 6.85(1H, brs), 7.29-7.46 (4 H, m), 7.59(2H, d, J=8.0), 7.73(2H, d, J=8.0)
7 7 3	2.18(3H, s), 2.21(3H, s), 2.30(3H, s), 2.78(3H, d, J=4.9), 3.32(3H, s), 5.13(1H, s), 5.26(1H, d, J=12.2), 5.58(1H, d, J=12.2), 6.76(1H, brs), 7.00-7.08(3H, m), 7.30-7.48(4H, m)
7 7 7	2.22(3H, s), 2.32(6H, s), 2.81(3H, d, J=4.9), 3.33(3H, s), 5.14(1H, s), 5.28(1H, d, J=12.2), 5.64(1H, d, J=12.2), 6.77(1H, brs), 6.99(1H, s), 7.24-7.48(6H, m)
7 8 1	2.21(3H, s), 2.22(3H, s), 2.81(3H, d, J=4.9), 3.33(3H, s), 3.83(3H, s), 5.14(1H, s), 5.26(1H, d, J=12.2), 5.62(1H, d, J=12.2), 6.75(1H, brs), 6.79(1H, d, J=8.5), 7.28-7.49(6H, m)

化合物 番号	物性
7 8 5	2.35(3H, s), 2.80(3H, d, J=4.9), 3.33(3H, s), 5.17(1H, s), 5.33(1H, d, J=12.2), 5.73(1H, d, J=12.2), 6.79(1H, brs), 7.29-7.40(3H, m), 7.43-7.51(3H, m), 7.78-7.86(3H, m), 7.91(1H, dd, J=8.8, 1.8), 7.97(1H, s)
8 1 3	2.05(3H, s), 2.81(3H, d, J=4.9), 3.34(3H, s), 5.15(1H, s), 5.30(1H, d, J=12.2), 5.68(1H, s, J=12.2), 6.75(1H, brs), 7.30-7.47(8H, m)
8 1 9	2.02(3H, s), 2.37(3H, s), 2.78(3H, d, J=4.9), 3.35(3H, s), 5.16(1H, s), 5.30(1H, d, J=12.2), 5.63(1H, d, J=12.2), 6.73(1H, brs), 7.18-7.58(8H, m)
8 2 4	2.06(3H, s), 2.82(3H, d, J=4.9), 3.34(3H, s), 5.15(1H, s), 5.31(1H, d, J=12.2), 5.71(1H, d, J=12.2), 6.75(1H, brs), 7.29-7.47(4H, m), 7.54(2H, d, J=7.9), 7.67(2H, d, J=7.9)
8 3 7	2.05(3H, s), 2.78(3H, d, J=4.9), 3.35(3H, s), 3.82(3H, s), 5.16(1H, s), 5.30(1H, d, J=12.2), 5.63(1H, d, J=12.2), 6.73(1H, brs), 6.92(2H, d, J=8.6), 7.27-7.48(6H, m)
8 7 3	2.12(3H, s), 2.32(3H, s), 2.81(3H, d, J=4.9), 3.36(3H, s), 5.11(1H, s), 5.17(1H, d, J=12.2), 5.51(1H, d, J=12.2), 6.74(1H, brs), 7.26-7.42(4H, m)
8 7 9	0.91(3H, t, J=7.3), 1.33(2H, 6重線, J=7.3), 1.56(2H, 5重線, J=7.3), 2.31(3H, s), 2.40(2H, t, J=7.3), 2.81(3H, d, J=4.9), 3.36(3H, s), 5.10(1H, s), 5.18(1H, d, J=12.2), 5.50(1H, d, J=12.2), 6.73(1H, brs), 7.26-7.42(4H, m)
8 8 2	1 3 4 ~ 1 3 5 °C
8 8 3	1.18(6H, d, J=6.7), 1.95(3H, s), 2.27-2.36(2H, m), 2.83(3H, d, J=4.9), 3.34(3H, s), 3.45-3.49(2H, m), 3.59-3.67(2H, m), 5.00(1H, d, J=12.2), 5.09(1H, s), 5.30(1H, d, J=12.2), 6.75(1H, brs), 7.28-7.43(4H, m)

化合物 番号	物性
891	0.88(3H, t, J=7.3), 1.18(6H, d, J=6.7), 1.26-1.44(4H, m), 2.28-2.44(4H, m), 2.83(3H, d, J=4.9), 3.33(3H, s), 3.42-3.46(2H, m), 3.58-3.64(2H, m), 4.98(1H, d, J=12.2), 5.09(1H, s), 5.29(1H, d, J=12.2), 6.75(1H, brs), 7.27-7.43(4H, m)
898	2.76(3H, d, J=4.9), 2.99(4H, t, J=4.3), 3.04(3H, s), 3.68(4H, t, J=4.3), 4.90(1H, s), 4.97(1H, d, J=12.2), 5.33(1H, d, J=12.2), 6.61(1H, brs), 7.20-7.43(8H, m)
904	2.34(3H, s), 2.70(3H, d, J=4.9), 3.01(4H, t, J=4.9), 3.04(3H, s), 3.67(4H, t, J=4.9), 4.91(1H, s), 4.99(1H, d, J=12.2), 5.28(1H, d, J=12.2), 6.51(1H, brs), 7.15-7.36(8H, m)
905	1.12(6H, d, J=6.7), 2.29-2.39(2H, m), 2.35(3H, s), 2.69(3H, d, J=4.9), 3.04(3H, s), 3.22-3.30(2H, m), 3.59-3.70(2H, m), 4.90(1H, s), 4.98(1H, d, J=12.2), 5.26(1H, d, J=12.2), 6.50(1H, brs), 7.14-7.39(8H, m)
906	130 ~ 131 °C
907	1.13(6H, d, J=6.7), 2.32-2.42(2H, m), 2.77(3H, d, J=4.9), 2.98(3H, s), 3.15-3.23(2H, m), 3.59-3.71(2H, m), 4.86(1H, s), 4.96(1H, d, J=12.2), 5.34(1H, d, J=12.2), 6.64(1H, brs), 7.25-7.28(4H, m), 7.47(2H, d, J=7.9), 7.63(2H, d, J=7.9)
910	2.71(3H, d, J=4.9), 3.01(4H, t, J=4.9), 3.05(3H, s), 3.68(4H, t, J=4.9), 3.80(3H, s), 4.93(1H, s), 5.00(1H, d, J=12.2), 5.29(1H, d, J=12.2), 6.53(1H, brs), 6.87(2H, d, J=8.5), 7.23-7.39(6H, m)
911	1.12(3H, d, J=6.7), 1.13(3H, d, J=6.7), 2.28-2.38(2H, m), 2.70(3H, d, J=4.9), 3.06(3H, s), 3.22-3.27(2H, m), 3.56-3.70(2H, m), 3.81(3H, s), 4.92(1H, s), 5.00(1H, d, J=12.2), 5.28(1H, d, J=12.2), 6.52(1H, brs), 6.87(2H, d, J=9.2), 7.23-7.34(6H, m)
941	2.21(3H, s), 2.36(3H, s), 2.85(3H, d, J=4.9), 3.36(3H, s), 5.05(1H, s), 5.34(1H, d, J=12), 5.64(1H, d, J=12), 6.82(1H, brs), 7.33-7.40(5H, m), 7.48-7.50(1H, m), 7.81(2H, d, J=8.8)
982	0.72-0.74(2H, m), 1.00-1.05(2H, m), 1.61(1H, m), 2.82(3H, d, J=4.9), 3.54(3H, s), 4.26-4.31(1H, m), 4.55-4.60(1H, m), 5.07(1H, s), 6.85(1H, brs), 6.84-6.88(2H, m), 7.30-7.41(6H, m)

化合物 番号	物性
9 9 5	0.68-0.70(2H, m), 1.00-1.05(2H, m), 1.80-1.85(1H,m), 2.30(3H, s), 2.81(3H, d, J=4.9), 3.31(3H, s), 4.20(1H, d, J=13.0), 4.60(1H, d, J=13.0), 5.09(1H, s), 6.60(1H, brs), 6.75(2H, m), 7.00-7.20(2H, m), 7.30-7.55(4H, m)
1 0 1 7	2.33(3H, s), 2.68(3H, d, J=4.9), 3.30(3H, s), 4.59(2H, s), 4.67(1H, d, J=12.0), 4.91(1H, d, J=12.0), 5.01(1H, s), 6.70(1H, brs), 7.10-7.20(2H, m), 7.29-7.41(6H, m)
1 0 3 0	2.82(3H, d, J=4.9), 3.35(3H, s), 5.10(1H, s), 5.44(1H, d, J=12.8), 5.74(1H, d, J=12.8), 6.83(1H, brs), 7.30-7.58(7H, m), 8.07(2H, d, J=7.9)

なお、2-オキソ-2-[2-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシメチル)フェニル]酢酸誘導体は、以下の参考例1~3の方法で合成した。

参考例1

1-ブロモ-2-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシメチル)ベンゼンの合成

2-ブロモベンジルアルコール(25.00g, 0.134mol)の塩化メチレン(100ml)溶液にパラートルエンスルホン酸ピリジニウム(0.30g)を加え室温下で攪拌した。その中に3,4-ジヒドロ-2H-ピラン(16.86g, 0.200mol)を加えた。室温下で2時間攪拌後、飽和重炭酸ナトリウム水溶液(200ml)を加え、塩化メチレンで抽出した。無水硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒を留去し、目的物の1-ブロモ-2-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシメチル)ベンゼン(36.00g, 99.3%)を油状物として得た。

NMR (δ ppm, TMS/ CDCl_3): 1.45-1.80(6H,m), 3.45-3.55(1H,m), 3.80-3.90(1H,m), 4.52(1H,d,J=15.0), 4.80(1H,m), 4.90(1H,d,J=15.0), 7.16(1H,t,J=7.3), 7.31(1H,t,J=7.3), 7.51(1H,d,J=7.3), 7.54(1H,d,J=7.3).

参考例2

2-オキソ-2-[2-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシメチル)フェニル]酢酸エチルの合成

1-ブロモ-2-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシメチル)ベンゼン(27.11g, 0.100mol)のテトラヒドロフラン(50ml)溶液に、窒素ガス雰囲気下でマグネシウム(2.67g, 0.110mol)、ブロモエタン(0.20ml)を加え、室温下で1時間攪拌して、グリニャール試薬を調製した。そのグリニャール試薬を、-78℃で冷却したシュウ酸ジエチル(29.23g, 0.200mol)のテトラヒドロフラン(100ml)溶液に滴下した。-78℃で1時間攪拌後、水(150ml)を加え、エーテルで抽出した。無水硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒を留去し、残

渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（*n*-ヘキサン/酢酸エチル=4/1）で精製し、目的物の2-オキソ-2-[2-（テトラヒドロピラン-2-イルオキシメチル）フェニル]酢酸エチル(22.60g, 77.3%)を油状物として得た。

NMR (δ ppm, TMS/ CDCl_3) : 1.38(3H,t,J=7.0), 1.40-1.85(6H,m), 3.50-3.60(1H,m), 3.80-3.90(1H,m), 4.32-4.40(2H,m), 4.69(1H,m), 4.85(1H,d,J=14.6), 5.09(1H,d,J=14.6), 7.43(1H,t,J=7.3), 7.58-7.70(3H,m).

参考例 3

2-オキソ-N-メチル-2-[2-（テトラヒドロピラン-2-イルオキシメチル）フェニル]酢酸アミドの合成

2-オキソ-2-[2-（テトラヒドロピラン-2-イルオキシメチル）フェニル]酢酸エチル(2.00g, 6.8mmol)のメタノール(20ml)溶液に、40%モノメチルアミン-メタノール(2.65g, 34.1mmol)溶液を加え、室温下で2時間攪拌した。溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（*n*-ヘキサン/酢酸エチル=4/1）で精製し、目的物の2-オキソ-N-メチル-2-[2-（テトラヒドロピラン-2-イルオキシメチル）フェニル]酢酸アミド(1.30g, 69%)を油状物として得た。

NMR (δ ppm, TMS/ CDCl_3) : 1.56-1.80(6H,m), 2.96(3H,d,J=5.5), 3.40-3.50(1H,m), 3.75-3.85(1H,m), 4.60(1H,m), 4.75(1H,d,J=14.0), 4.97(1H,d,J=14.0), 7.05(1H,brs), 7.35-7.39(1H,m), 7.51(2H,m), 7.79(1H,d,J=7.9).

次に本発明の種々の化合物の茎葉散布による各種植物病害防除効果を以下のポット試験により説明する。

[試験方法]

試験はすべて予防効果試験、すなわち、被検液を検定植物に噴霧処理し、

24時間後に病原菌を接種する方法で行った。被検液は化合物を少量のN,N-ジメチルホルムアミドに溶解し、展着剤を含む蒸留水で500ppmとなるよう希釈した。防除率は以下の式により求めた。

$$\text{防除率 (\%)} = \{(\text{無処理区の発病程度} \cdot \text{病斑数等} - \text{処理区の発病程度} \cdot \text{病斑数等}) / \text{無処理区の発病程度} \cdot \text{病斑数等}\} \times 100$$

試験例1

イネいもち病防除効果試験

播種2週間後の稲（品種；愛知旭）苗を直径9cmのプラスチックカップに移植しさらに2週間育苗後、化合物溶液または懸濁液を茎葉部に噴霧処理した。病原菌の接種は、化合物溶液または懸濁液を噴霧処理した検定植物の茎葉部に、予めオートミール培地で培養したイネいもち病菌

(*Pyricularia oryzae*) の分生孢子懸濁液を噴霧することによって行った。

接種後は湿室（28℃、100% R.H.）に24時間保ち、さらに温室で5日間保った。接種6日後接種葉に現れた病斑数を調査し防除率を求めた。

本化合物はイネいもち病に対して高い防除率を示した。例えば化合物番号75、139、140、161、163、165、166、170、175、176、186、193、194、196、197、211、212、214、217、219、221、223、233、267、372、423、427、429、432、448、459、465、466、467、472、474、475、476、477、486、488、491、492、494、495、499、500、501、503、513、516、517、518、526、529、532、535、544、553、556、559、562、580、609、616、639、678、680、682、684、686、688、690、692、698、701、702、704、707、710、

717、718、721、722、725、726、733、736、
739、740、773、781、785、813、819、824、
837、883、および982は500 ppmで90%以上の防除率を示した。

試験例 2

キュウリうどんこ病防除効果試験

直径9 cmのプラスチックカップに播種し2～3週間育苗後のきゅうり
(品種；筑波白いぼ) 苗の第一本葉に化合物溶液または懸濁液を噴霧処理した。病原菌の接種は、化合物溶液または懸濁液を噴霧処理した検定植物に、きゅうり葉上で培養したキュウリうどんこ病菌(*Sphaerotheca fuliginea*)の分生孢子懸濁液を噴霧することにより行い、接種後は20℃の温室に保った。接種10日後接種葉に現れた標兆の占有面積程度を調査し防除率を求めた。

本化合物はキュウリうどんこ病に対して高い防除率を示した。例えば化合物番号64、75、78、113、139、140、141、142、
143、144、145、149、151、152、155、156、
161、165、170、173、174、176、179、180、
183、185、186、189、193、194、195、196、
197、198、205、206、207、208、209、210、
211、212、213、214、215、216、217、218、
219、221、223、231、233、262、263、267、
291、292、296、297、362、372、417、420、
423、427、429、432、433、436、437、443、
448、453、454、459、461、465、466、467、
468、469、472、474、475、476、477、482、

486、488、489、491、492、494、497、498、
500、501、503、504、506、513、515、516、
517、518、520、523、526、527、529、532、
535、541、542、544、553、556、559、577、
580、586、587、589、590、592、593、603、
606、609、616、627、639、678、680、682、
684、686、688、690、692、698、701、702、
704、707、710、717、718、721、722、725、
726、733、734、736、737、738、739、740、
756、759、773、777、781、785、813、819、
824、および883は、500 ppmで97%以上の防除率を示した。

試験例3

キュウリべと病防除効果試験

直径9 cmのプラスチックカップに播種し2～3週間育苗後のきゅうり
(品種；筑波白いぼ) 苗の第一本葉に化合物溶液または懸濁液を噴霧処理
した。病原菌の接種は、きゅうり葉上で培養したキュウリべと病菌
(*Pseudoperonospora cubensis*) の遊走子囊懸濁液を、化合物溶液または懸
濁液を噴霧処理したきゅうり葉の表面に滴下することにより行った。接種
後は20℃の湿室に10日間保った後接種部周辺に現れた病斑拡大程度を
調査し防除率を求めた。

本化合物はキュウリべと病に対して高い防除率を示した。例えば化合物
番号74、113、139、140、156、161、165、170、
176、186、189、193、194、196、197、206、
207、209、210、212、216、217、218、219、
221、223、231、233、263、267、291、362、

372、417、420、423、427、429、432、433、
443、448、453、459、465、466、467、468、
472、474、476、477、478、482、487、488、
489、491、492、494、495、496、497、498、
499、500、501、503、504、505、506、507、
508、509、512、513、515、516、517、518、
523、526、527、529、535、541、542、544、
553、556、559、562、576、580、581、583、
586、587、589、590、606、609、616、627、
639、678、680、682、684、686、688、690、
692、698、701、702、704、707、710、717、
718、721、722、725、726、733、734、735、
736、737、739、740、756、757、758、759、
773、777、781、785、813、819、824、837、
883、982、995、1016、1019、1030、1031、
1033、および1034は500 ppmで90%以上の防除率を示した。

試験例4

コムギうどんこ病防除効果試験

直径9 cmのプラスチックカップに播種し2～3週間育苗後の小麦（品種；農林61号）苗に化合物溶液または懸濁液を噴霧処理した。病原菌の接種は、小麦葉上で培養したコムギうどんこ病菌（*Erysiphe graminis* f. sp. *tritici*）の分生胞子を、化合物溶液または懸濁液を噴霧処理した検定植物上に払い落とすことにより行い、接種後は20℃の温室に保った。接種10日後接種葉に現れた標兆の占有面積程度を調査し防除率を求めた。

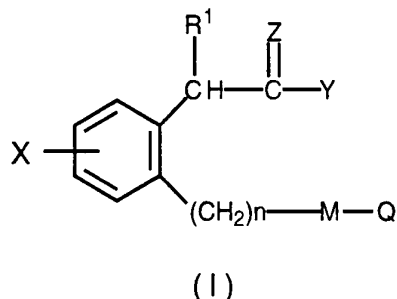
本化合物はコムギうどんこ病に対して高い防除率を示した。例えば化合

物番号 2、75、113、139、140、141、142、143、
144、145、151、152、161、170、174、175、
176、179、184、185、186、188、189、193、
194、195、196、197、198、206、212、216、
217、218、219、223、263、297、362、372、
417、420、423、427、429、432、433、443、
448、454、459、465、466、467、474、477、
488、492、498、500、517、518、526、527、
541、542、590、603、627、686、701、726、
739、および 883 は 500 ppm で 90% 以上の防除率を示した。

上記のとおり、本発明によれば、殺菌活性を有する新規 α -置換フェニル酢酸誘導体、その製造法、その製造用中間体およびそれを有効成分として含有する農業用殺菌剤が提供される。

請求の範囲

1. 一般式 (I) :



[式中、 R^1 はハロゲン原子、置換されていてもよいアルキル基、置換されていてもよい水酸基、アルキルチオ基、アルキルスルフィニル基、アルキルスルホニル基、置換されていてもよいアミノ基またはニトロ基； Q は置換されていてもよいアリール基、置換されていてもよいヘテロ環基、モノ置換またはジ置換メチレンアミノ基、置換されていてもよい(置換イミノ)メチル基、置換されていてもよいアルキル基、置換されていてもよいアルケニル基、置換されていてもよいアルキニル基、置換カルボニル基または置換スルホニル基； X は水素原子、ハロゲン原子、置換されていてもよいアルキル基または置換されていてもよい水酸基； Y は置換されていてもよい水酸基、アルキルチオ基または置換されていてもよいアミノ基(ただし、 R^1 が水酸基の場合、 Y はアルコキシ基ではない)； Z は酸素原子または硫黄原子； M は酸素原子、 $S(O)_i$ (i は0、1または2)、 NR^2 (R^2 は水素原子、アルキル基またはアシル基)または単結合；および n は0、1または2を示す]で表される化合物またはその塩。

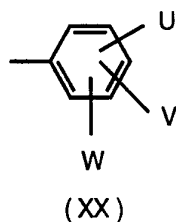
2. R^1 がハロゲン原子、アルキル基、ハロアルキル基、アルコキシアルキル基、水酸基、アルコキシ基、アルケニルオキシ基、アルキニルオキ

シ基、ハロアルコキシ基、ハロアルケニルオキシ基、ハロアルキニルオキシ基、アルコキシアルコキシ基、アルキルカルボニルオキシ基、(アルキルチオ)カルボニルオキシ基、アルキルスルホニルオキシ基、アリールスルホニルオキシ基、モノあるいはジアルキル置換カルバモイルオキシ基、アリールオキシ基、アルキルチオ基、アルキルスルフィニル基、アルキルスルホニル基、アルキル基で置換されていてもよいアミノ基、ニトロ基またはテトラヒドロピラニルオキシ基である請求項1記載の化合物またはその塩。

3. R^1 がアルコキシ基である請求項1記載の化合物またはその塩。

4. R^1 がメトキシ基である請求項1記載の化合物またはその塩。

5. Qが一般式 (XX) :



[式中、U、VおよびWは同一または異なって、水素原子、ハロゲン原子、置換されていてもよいアルキル基、置換されていてもよい水酸基、アルキルチオ基、または置換されていてもよいアミノ基を示す]で表される基である請求項1記載の化合物またはその塩。

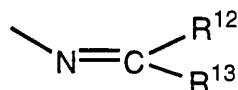
6. U、VおよびWが同一または異なって、水素原子、塩素原子、メチル基、トリフルオロメチル基またはメトキシ基である請求項5記載の化合物またはその塩。

7. Qがそれぞれ置換されていてもよいピリジル基、ピリミジニル基、キノリル基、キナゾリニル基、ベンゾチアゾリル基またはピラゾリル基で

ある請求項 1 記載の化合物またはその塩。

8. Q が置換されていてもよいピリジル基である請求項 1 記載の化合物またはその塩。

9. Q が式 (a) :



(a)

[式中、R¹²およびR¹³は同一または異なって水素原子、置換されていてもよいアルキル基、アシル基、アルキルチオ基、アルキルスルフィニル基、アルキルスルホニル基、置換されていてもよいアミノ基、シクロアルキル基、置換されていてもよいアリール基または置換されていてもよいヘテロ環基を示すか、あるいはR¹²とR¹³が結合してヘテロ原子が含まれていてもよい単環または多環を形成していることを示す。]で表される基である請求項 1 記載の化合物またはその塩。

10. R¹²およびR¹³が同一または異なって水素原子、アルキル基、ハロアルキル基、アルコキシアルキル基、アルキルカルボニル基、置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいナフチル基または置換されていてもよいヘテロ環基であるか、あるいはR¹²とR¹³が結合して、他の環と縮合していてもよいシクロペンタン環またはシクロヘキサン環を形成している請求項 9 記載の化合物またはその塩。

11. R¹²がアルキル基である請求項 9 記載の化合物またはその塩。

12. R¹²がメチル基またはエチル基である請求項 9 記載の化合物またはその塩。

13. R^{13} が、ハロゲン原子、置換されていてもよいアルキル基、置換されていてもよい水酸基、アルキルチオ基、置換されていてもよいアミノ基、ニトロ基、フェニル基およびシアノ基からなる群から選択される1～3個の置換基を有していてもよいフェニル基である請求項9記載の化合物またはその塩。

14. R^{13} が、塩素原子、メチル基、トリフルオロメチル基およびメトキシ基からなる群から選択される1～3個の置換基を有していてもよいフェニル基である請求項9記載の化合物またはその塩。

15. R^{13} が、それぞれ置換されていてもよいピリジル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基、ピリミジニル基、フリル基、チエニル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、キノリル基、キナゾリニル基、ピラジニル基、モルホリノ基またはピペラジニル基である請求項9記載の化合物またはその塩。

16. Xが水素原子である請求項1記載の化合物またはその塩。

17. Yがアルコキシ基である請求項1記載の化合物またはその塩。

18. Yがメトキシ基である請求項1記載の化合物またはその塩。

19. Yがモノアルキルアミノ基である請求項1記載の化合物またはその塩。

20. Yがモノメチルアミノ基である請求項1記載の化合物またはその塩。

21. Zが酸素原子である請求項1記載の化合物またはその塩。

22. Mが酸素原子、硫黄原子または NR^2 である請求項1記載の化合物またはその塩。

23. nが0である請求項1記載の化合物またはその塩。

24. n が1である請求項1記載の化合物またはその塩。

25. X が水素原子、 R^1 が水酸基、 Z が酸素原子、 Y がアルキル基で置換されていてもよいアミノ基、 M が酸素原子、 Q が置換されていてもよいフェニル基、および n が0または1である請求項1記載の化合物またはその塩。

26. X が水素原子、 R^1 がアルコキシ基、 Z が酸素原子、 Y がアルコキシ基または置換されていてもよいアミノ基、 M が酸素原子、 Q が置換されていてもよいフェニル基、および n が0または1である請求項1記載の化合物またはその塩。

27. X が水素原子、 R^1 が水酸基、 Z が酸素原子、 Y がアルキル基で置換されていてもよいアミノ基、 M が酸素原子、 Q が置換されていてもよいヘテロ環基、および n が0または1である請求項1記載の化合物またはその塩。

28. X が水素原子、 R^1 がアルコキシ基、 Z が酸素原子、 Y がアルコキシ基または置換されていてもよいアミノ基、 M が酸素原子、 Q が置換されていてもよいヘテロ環基、および n が0または1である請求項1記載の化合物またはその塩。

29. X が水素原子、 R^1 がアルコキシ基、 Z が酸素原子、 Y がアルキル基で置換されていてもよいアミノ基、 M が酸素原子、 R^{12} がアルキル基、 R^{13} が置換されていてもよいフェニル基または置換されていてもよいモルホリノ基、および n が1である請求項9記載の化合物またはその塩。

30. X が水素原子、 R^1 がアルコキシ基、 Z が酸素原子、 Y がアルキ

ル基で置換されていてもよいアミノ基、Mがアシルアミノ基、R¹²がアルキル基、R¹³が置換されていてもよいフェニル基または置換されていてもよいモルホリノ基、およびnが1である請求項9記載の化合物またはその塩。

31. 一般式(I)で表される化合物が、

Xが水素原子、R¹が水酸基、Zが酸素原子、Yがモノメチルアミノ基、Mが酸素原子、Qがフェニル基、およびnが0である化合物(化合物番号1)；

Xが水素原子、R¹が水酸基、Zが酸素原子、Yがアミノ基、Mが酸素原子、Qがフェニル基、およびnが0である化合物(化合物番号2)；

Xが水素原子、R¹が水酸基、Zが酸素原子、Yがモノメチルアミノ基、Mが酸素原子、Qが3,4-ジメチルフェニル基、およびnが0である化合物(化合物番号15)；

Xが水素原子、R¹が水酸基、Zが酸素原子、Yがモノメチルアミノ基、Mが酸素原子、Qが3,5-ジメチルフェニル基、およびnが0である化合物(化合物番号16)；

Xが水素原子、R¹が水酸基、Zが酸素原子、Yがモノメチルアミノ基、Mが酸素原子、Qが2-メチルフェニル基、およびnが1である化合物(化合物番号64)；

Xが水素原子、R¹が水酸基、Zが酸素原子、Yがモノメチルアミノ基、Mが酸素原子、Qが2,5-ジメチルフェニル基、およびnが1である化合物(化合物番号75)；

Xが水素原子、R¹が水酸基、Zが酸素原子、Yがモノメチルアミノ基、Mが酸素原子、Qが4-クロロ-2-メチルフェニル基、およびnが1である化合物（化合物番号113）；

Xが水素原子、R¹がメトキシ基、Zが酸素原子、Yがメトキシ基、Mが酸素原子、Qが2,5-ジメチルフェニル基、およびnが1である化合物（化合物番号139）；

Xが水素原子、R¹がメトキシ基、Zが酸素原子、Yがモノメチルアミノ基、Mが酸素原子、Qが2,5-ジメチルフェニル基、およびnが1である化合物（化合物番号140）；

Xが水素原子、R¹がメトキシ基、Zが酸素原子、Yがモノメチルアミノ基、Mが酸素原子、Qが4-クロロ-2-メチルフェニル基、およびnが1である化合物（化合物番号186）；

Xが水素原子、R¹がメトキシ基、Zが酸素原子、Yがモノメチルアミノ基、Mが酸素原子、Qが2-メチルフェニル基、およびnが1である化合物（化合物番号197）；

Xが水素原子、R¹がメトキシ基、Zが酸素原子、Yがモノメチルアミノ基、Mが酸素原子、Qが3-クロロ-5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル基、およびnが1である化合物（化合物番号427）；

Xが水素原子、R¹がメトキシ基、Zが酸素原子、Yがモノメチルアミノ基、Mが酸素原子、Qが3,5-ジクロロピリジン-2-イル基、およびnが1である化合物（化合物番号433）；

Xが水素原子、R¹がメトキシ基、Zが酸素原子、Yがモノメチルアミ

ノ基、Mが酸素原子、Qが3-トリフルオロメチル-5-クロロピリジン-2-イル基、およびnが1である化合物（化合物番号448）；

Xが水素原子、R¹がメトキシ基、Zが酸素原子、Yがモノメチルアミノ基、Mが酸素原子、Qが3-クロロピリジン-2-イル基、およびnが1である化合物（化合物番号466）；

Xが水素原子、R¹がメチル基、Zが酸素原子、Yがモノメチルアミノ基、Mが酸素原子、Qが α -メチル-4-クロロベンジリデンアミノ基、およびnが1である化合物（化合物番号474）；

Xが水素原子、R¹がメチル基、Zが酸素原子、Yがモノメチルアミノ基、Mが酸素原子、Qが α -メチル-4-メトキシベンジリデンアミノ基、およびnが1である化合物（化合物番号492）；

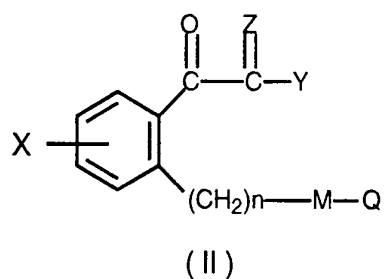
Xが水素原子、R¹がメチル基、Zが酸素原子、Yがモノメチルアミノ基、Mが酸素原子、Qが4, α -ジメチルベンジリデンアミノ基、およびnが1である化合物（化合物番号498）；または

Xが水素原子、R¹がメチル基、Zが酸素原子、Yがモノメチルアミノ基、Mが酸素原子、Qが α -メチル-4-トリフルオロメチルベンジリデンアミノ基、およびnが1である化合物（化合物番号526）

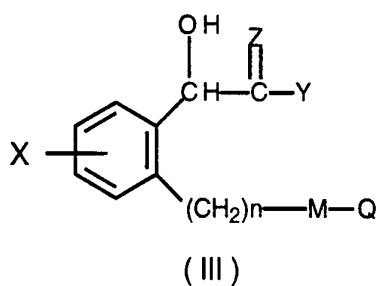
またはその塩である請求項1記載の化合物。

32. 請求項1記載の化合物を有効成分として含有することを特徴とする農業用殺菌剤。

33. 一般式（II）：

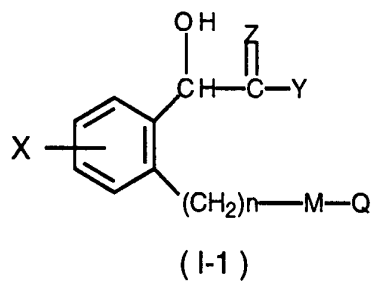


[式中、各記号は請求項1と同意義]で表される化合物を還元することを特徴とする一般式 (III) :



[式中、各記号は請求項1と同意義]で表される化合物の製造法。

34. 一般式 (I-1) :

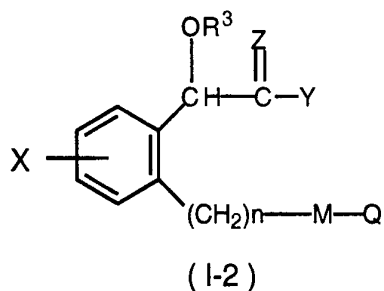


[式中、各記号は請求項1と同意義]で表される化合物を、一般式 (XXI I) :



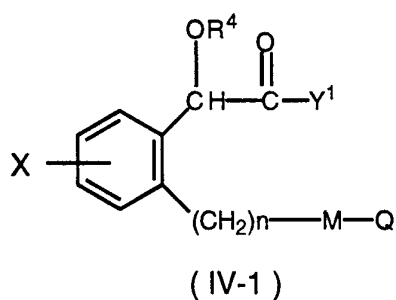
[式中、 R^3 はアルキル基、アルケニル基、アルキニル基、ハロアルキル基、アルコキシアルキル基、アルキルカルボニル基、(アルキルチオ)カルボ

ニル基、アルキルスルホニル基、アリアルスルホニル基、またはモノあるいはジアルキル置換カルバモイル基；およびLは脱離基を示す]で表される化合物と反応させることを特徴とする一般式（I-2）：

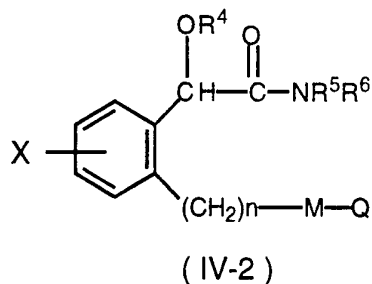


[式中、各記号は上記と同意義]で表される化合物の製造法。

35. 一般式（IV-1）：

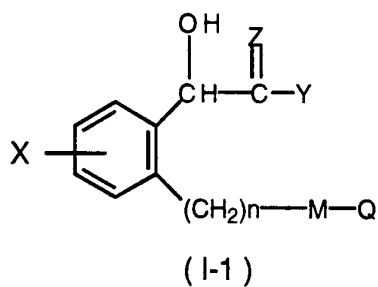


[式中、R⁴はアルキル基、アルケニル基、アルキニル基、ハロアルキル基またはアルコシアルキル基；およびY¹はアルコキシ基またはアルキルチオ基を示す]で表される化合物をアミン類と反応させることを特徴とする一般式（IV-2）：

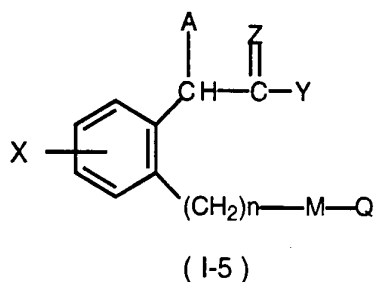


[式中、 R^5 は水素原子またはアルキル基、 R^6 は水素原子、アルキル基またはヒドロキシルアルキル基を示し、他の記号は上記と同意義]で表される化合物の製造法。

36. 一般式 (I-1) :

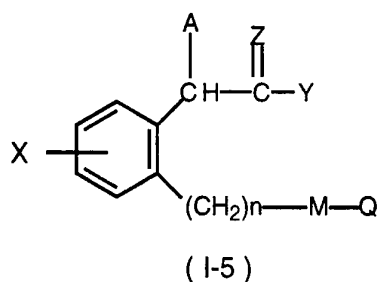


[式中、各記号は請求項1と同意義]で表される化合物をハロゲン化することを特徴とする一般式 (I-5) :

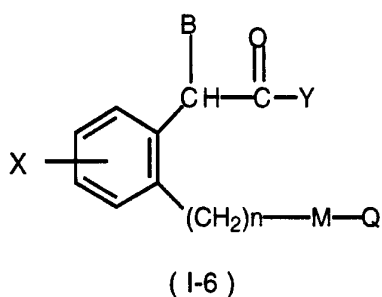


[式中、Aはハロゲン原子を示し、他の記号は請求項1と同意義]で表される化合物の製造法。

37. 一般式 (I-5) :

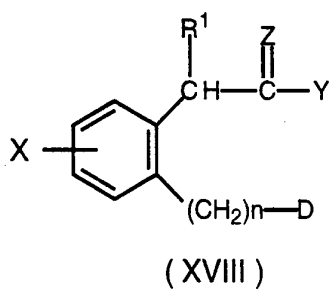


[式中、Aはハロゲン原子を示し、他の記号は請求項1と同意義]で表される化合物を求核剤と反応させることを特徴とする一般式 (I - 6) :



[式中、Bはアルコキシ基、アルケニルオキシ基、アルキニルオキシ基、ハロアルコキシ基、アルコキシアルコキシ基、アルキルチオ基、アルキル基で置換されていてもよいアミノ基またはニトロ基を示し、他の記号は請求項1と同意義]で表される化合物の製造法。

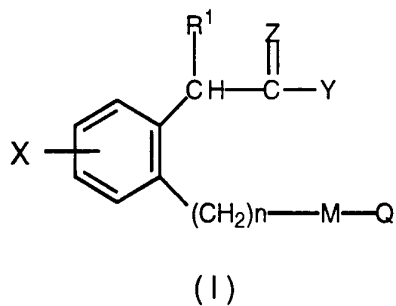
38. 一般式 (X V I I I) :



[式中、Dはハロゲン原子を示し、他の記号は請求項1と同意義]で表される化合物を一般式 (X I X) :

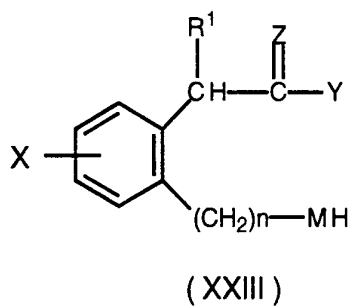


[式中、各記号は請求項 1 と同意義]で表される化合物と反応させることを特徴とする一般式 (I) :



[式中、各記号は請求項 1 と同意義]で表される化合物の製造法。

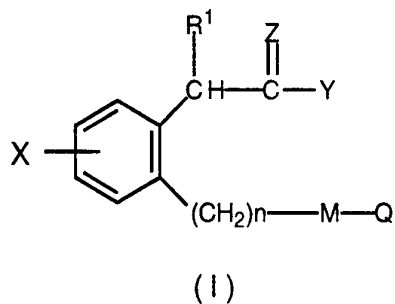
39. 一般式 (XXIII) :



[式中、各記号は請求項 1 と同意義]で表される化合物を一般式 (XXIV) :

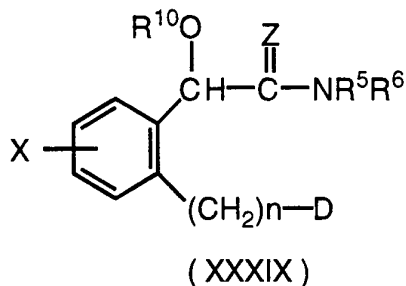


[式中、Lは脱離基を示し、Qは請求項 1 と同意義]で表される化合物と反応させることを特徴とする一般式 (I) :



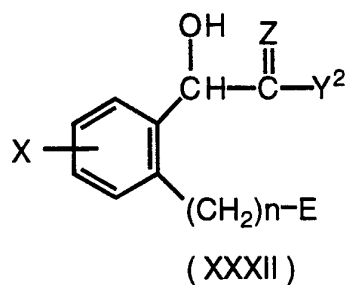
[式中、各記号は請求項 1 と同意義]で表される化合物の製造法。

40. 一般式 (XXXIX) :



[式中、 R^5 は水素原子またはアルキル基、 R^6 は水素原子、アルキル基またはヒドロキシルアルキル基、 R^{10} は置換されていてもよいアルキル基、置換されていてもよいアルケニル基または置換されていてもよいアルキニル基、Dはハロゲン原子を示し、他の記号は請求項 1 と同意義]で表される化合物またはその塩。

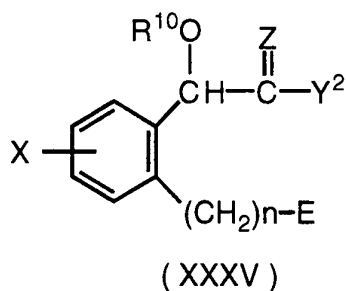
41. 一般式 (XXXII) :



[式中、 Y^2 はアルコキシ基、Eは保護されている水酸基を示し、他の記号は請求項 1 と同意義]で表される化合物またはその塩。

42. Eがテトラヒドロピラニルオキシ基または1-エトキシエトキシ基である請求項 41 記載の化合物またはその塩。

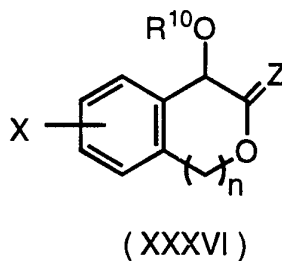
43. 一般式 (XXXV) :



[式中、 R^{10} は置換されていてもよいアルキル基、置換されていてもよいアルケニル基または置換されていてもよいアルキニル基、 Y^2 はアルコキシ基、Eは保護されている水酸基を示し、他の記号は請求項1と同意義]で表される化合物またはその塩。

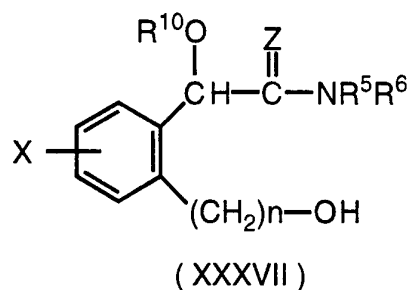
44. Eがテトラヒドロピラニルオキシ基または1-エトキシエトキシ基である請求項44記載の化合物またはその塩。

45. 一般式 (XXXVI) :



[式中、 R^{10} は置換されていてもよいアルキル基、置換されていてもよいアルケニル基または置換されていてもよいアルキニル基を示し、他の記号は請求項1と同意義]で表される化合物またはその塩。

46. 一般式 (XXXVII) :



[式中、 R^5 は水素原子またはアルキル基、 R^6 は水素原子、アルキル基またはヒドロキシルアルキル基、 R^{10} は置換されていてもよいアルキル基、置換されていてもよいアルケニル基または置換されていてもよいアルキニル基を示し、他の記号は請求項1と同意義]で表される化合物またはその塩。

47. Zが酸素原子である請求項40から請求項46のいずれか1項に記載の化合物またはその塩。

48. 植物病原菌に冒されたまたは冒され得る部分に請求項1記載の化合物またはその塩を有効成分として適用することを特徴とする植物病原菌の殺菌または予防方法。

49. 農業用殺菌剤の製造における請求項1記載の化合物またはその塩の使用。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP95/00663

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int. Cl⁶ C07C57/30, 57/58, 59/48, 59/52, 59/64, 69/612, 69/73,
205/53, 229/34, 233/11, 235/32, 317/44, 323/56, 327/04,

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int. Cl⁶ C07C57/00, 59/00, 69/00, 205/00, 229/00, 233/00,
235/00, 317/00, 323/00, 327/00, C07D211/00, 213/00,

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	JP, 63-139149, A (Tosoh Corp.), June 10, 1988 (10. 06. 88), Examples 24, 47 (Family: none)	1-3, 16, 17, 21, 23, 24, 32, 34, 37, 48, 49
Y		4-15, 18-20, 22, 25-32, 40-44, 46, 47
X	JP, 62-153283, A (Tosoh Corp.), July 8, 1987 (08. 07. 87), Examples 26, 44 (Family: none)	1, 2, 16, 21-23, 32, 48, 49
Y		3-15, 17-20, 24-32, 40-44, 46, 47

 Further documents are listed in the continuation of Box C. See patent family annex.

* Special categories of cited documents:

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier document but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

June 21, 1995 (21. 06. 95)

Date of mailing of the international search report

July 11, 1995 (11. 07. 95)

Name and mailing address of the ISA/

Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP95/00663

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	JP, 57-188579, A (Takeda Chemical Industries, Ltd.), November 19, 1982 (19. 11. 82), Raw Material compound of compound No. 1 & DK, 8202,150, A	1, 2, 17, 21-23, 33, 41, 47
X	JP, 1-157955, A (Fujisawa Pharmaceutical Co., Ltd.), June 21, 1989 (21. 06. 89), Example 9(9) (Family: none)	1-4, 16, 19, 21-23
X	JP, 5-504969, A (Merck & Co., Inc.), July 29, 1993 (29. 07. 93), Compounds 14, 15, 47, 48, 94 & WO, 91/11999, A & EP, 517,812, A1	1-3, 16-18, 21-23, 35, 37
X	JP, 42-10496, B1 (Aktiebolaget Hässle, Apotekare Paul Nordströme Fabriker), June 7, 1967 (07. 06. 67), Example & DE, 1,234,203, B & GB, 1,054,692, A & US, 3,422,140, A	1-4, 21-23, 43, 47
X	Journal of Pharmacy and Pharmacology, Vol. 25, No. 3, p. 208-212, 1973, Perrin, J. H. et al. "Circular dichroic investigation of the binding of fenopropfen, 2-(3-phenoxyphenyl) propionic acid, to human serum albumin", Table 1 2-(2-phenoxyphenyl) propionic acid	1, 2, 5, 6, 16, 21, 23
A	JP, 3-17052, A (BASF AG.), January 25, 1991 (25. 01. 91), Claim & EP, 400,417, A & US, 5,145,980, A	1 - 49
A	JP, 4-288045, A (BASF AG.), October 13, 1992 (13. 10. 92), Claim & EP, 477,631, A & US, 5,395,854, A	1 - 49

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP95/00663

Box III TEXT OF THE ABSTRACT (Continuation of Item 5 of the first sheet)

A(Continuation). CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

327/22, 327/36, 327/40, C07D211/14, 213/64, 215/14, 231/14,
239/26, 239/34, 239/38, 239/88, 239/93, 239/94, 265/30,
277/68, 295/125, 307/83, 311/76, 313/08, A01N37/00, 43/00

B(Continuation). FIELDS SEARCHED

215/00, 231/00, 239/00, 265/00, 277/00, 295/00, 307/00,
311/00, 313/00, A01N37/00, 43/00

A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))		
Int. Cl ⁶ C07C57/30, 57/58, 59/48, 59/52, 59/64, 69/612, 69/73, 205/53, 229/34,		
B. 調査を行った分野		
調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))		
Int. Cl ⁶ C07C57/00, 59/00, 69/00, 205/00, 229/00, 233/00, 235/00, 317/00,		
最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの		
国際調査で使用了電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)		
C. 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
X	JP, 63-139149, A (徳山曹達株式会社), 10. 6月. 1988 (10. 06. 88), 実施例 24, 47 (ファミリーなし)	1-3, 16, 17, 21, 23, 24, 32, 34, 37, 48, 49
Y		4-15, 18-20,
<input checked="" type="checkbox"/> C欄の続きにも文献が列挙されている。 <input type="checkbox"/> パテントファミリーに関する別紙を参照。		
* 引用文献のカテゴリー 「A」 特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの 「E」 先行文献ではあるが、国際出願日以後に公表されたもの 「L」 優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す) 「O」 口頭による開示、使用、展示等に言及する文献 「P」 国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願日の後に公表された文献		「T」 国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの 「X」 特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの 「Y」 特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの 「&」 同一パテントファミリー文献
国際調査を完了した日	国際調査報告の発送日	
21. 06. 95	11.07.95	
名称及びあて先 日本国特許庁 (ISA/JP) 郵便番号100 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号	特許庁審査官 (権限のある職員) 佐藤 修 印	4 H 9 3 5 6
	電話番号 03-3581-1101 内線	3444

C (続き). 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
A	JP, 3-17052, A (ビーエーエスエフ アクチエンゲゼル シャフト), 25. 1月. 1991 (25. 01. 91), 特許請求の範囲 & EP, 400,417, A & US, 5,145,980, A	1-49
A	JP, 4-288045, A (ビーエーエスエフ アクチエンゲゼ ルシャフト), 13. 10月. 1992 (13. 10. 92), 特許請求の範囲 & EP, 477,631, A & US, 5,395,854, A	1-49

A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl.⁰ 233/11, 235/32, 317/44, 323/56,
327/04, 327/22, 327/36, 327/40,
C07D211/14, 213/64, 215/14, 231/14,
239/26, 239/34, 239/38, 239/88,
239/93, 239/94, 265/30, 277/68,
295/125, 307/83, 311/76, 313/08,
A01N37/00, 43/00

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl.⁰ 323/00, 327/00, C07D211/00, 213/00,
215/00, 231/00, 239/00, 265/00,
277/00, 295/00, 307/00, 311/00,
313/00, A01N37/00, 43/00