

(12) 特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局

(43) 国際公開日
2014 年 5 月 15 日(15.05.2014)



(10) 国際公開番号
WO 2014/073622 A1

(51) 国際特許分類:

A01N 43/12 (2006.01) A01N 43/54 (2006.01)
A01C 1/00 (2006.01) A01N 43/56 (2006.01)
A01G 7/06 (2006.01) A01N 43/80 (2006.01)
A01N 25/00 (2006.01) A01N 47/02 (2006.01)
A01N 43/36 (2006.01) A01N 47/04 (2006.01)
A01N 43/40 (2006.01) A01P 21/00 (2006.01)

(21) 国際出願番号: PCT/JP2013/080167

(22) 国際出願日: 2013 年 10 月 31 日(31.10.2013)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:
特願 2012-247318 2012 年 11 月 9 日(09.11.2012) JP

(71) 出願人: 住友化学株式会社(SUMITOMO CHEMICAL COMPANY, LIMITED) [JP/JP]; 〒1048260 東京都中央区新川二丁目 2 7 番 1 号 Tokyo (JP).

(72) 発明者: 椋本 藤夫(MUKUMOTO, Fujio); 〒6658555 兵庫県宝塚市高司四丁目 2 番 1 号住友化学株式会社内 Hyogo (JP). 玉置 裕章(TAMAKI, Hiroaki); 〒6658555 兵庫県宝塚市高司四丁目 2 番 1 号住友化学株式会社内 Hyogo (JP). 日下 慎太郎(KUSAKA, Shintaro); 〒6658555 兵庫県宝塚市高

司四丁目 2 番 1 号住友化学株式会社内 Hyogo (JP). 岩越 光彦(IWAKOSHI, Mitsuhiko); 〒6658555 兵庫県宝塚市高司四丁目 2 番 1 号住友化学株式会社内 Hyogo (JP).

(74) 代理人: 中山 亨, 外(NAKAYAMA, Tohru et al.); 〒5418550 大阪府大阪市中央区北浜四丁目 5 番 3 3 号住友化学知的財産センター株式会社内 Osaka (JP).

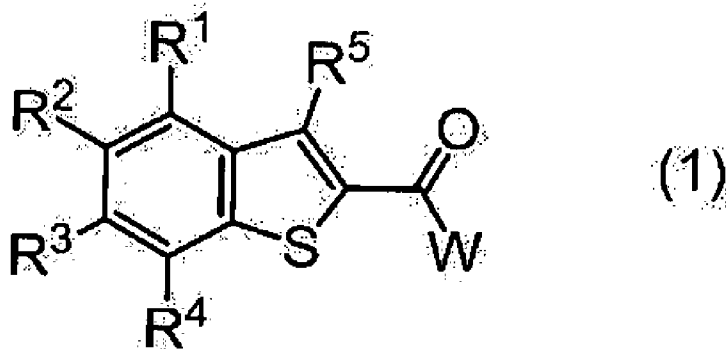
(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BN, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IR, IS, JP, KE, KG, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PA, PE, PG, PH, PL, PT, QA, RO, RS, RU, RW, SA, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.

(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT,

[続葉有]

(54) Title: METHOD FOR PROMOTING PLANT GROWTH

(54) 発明の名称: 植物の生長を促進する方法



(57) Abstract: This method for promoting plant growth treats plans with the compound indicated in formula (1). However, methods for promoting plant growth and that treat plants with compounds corresponding to each of (1) to (8) below are excluded. (1) methyl 4-(trifluoromethyl)benzo[b]thiophene-2-carboxylate. (2) methyl 5-(trifluoromethyl)benzo[b]thiophene-2-carboxylate. (3) methyl 6-(trifluoromethyl)benzo[b]thiophene-2-carboxylate. (4) methyl 7-(trifluoromethyl)benzo[b]thiophene-2-carboxylate. (5) ethyl 4-(trifluoromethyl)benzo[b]thiophene-2-carboxylate. (6) ethyl 5-(trifluoromethyl)benzo[b]thiophene-2-carboxylate. (7) ethyl 6-(trifluoromethyl)benzo[b]thiophene-2-carboxylate. (8) ethyl 7-(trifluoromethyl)benzo[b]thiophene-2-carboxylate.

(57) 要約: 下記式 (1) で示される化合物を、植物に処理する植物の生長促進方法。但し、以下の (1) から (8) のいずれかに該当する化合物を、植物に処理する植物の生長促進方法は除く。(1) 4-(トリフルオロメチル)ベンゾ[b]チオフェン-2-カルボン酸メチル (2) 5-(トリフルオロメチル)ベンゾ[b]チオフェン-2-カルボン酸メチル (3) 6-(トリフルオロメチル)ベンゾ[b]チオフェン-2-カルボン酸メチル (4) 7-(トリフルオロメチル)ベンゾ[b]チオフェン-2-カルボン酸メチル (5) 4-(トリフルオロメチル)ベンゾ[b]チオフェン-2-カルボン酸エチル (6) 5-(トリフルオロメチル)ベンゾ[b]チオフェン-2-カルボン酸エチル (7) 6-(トリフルオロメチル)ベンゾ[b]チオフェン-2-カルボン酸エチル (8) 7-(トリフルオロメチル)ベンゾ[b]チオフェン-2-カルボン酸エチル

WO 2014/073622 A1

WO 2014/073622 A1



NL, NO, PL, PT, RO, RS, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI 添付公開書類:

(BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, KM, ML, — 国際調査報告 (条約第 21 条(3))
MR, NE, SN, TD, TG).

明 細 書

発明の名称

植物の生長を促進する方法

5 技術分野

[0001]

本発明は、植物の生長を促進する方法に関する。

背景技術

10 [0002]

いくつかの化学物質には、植物に施用することによって植物の生長を促進する効果を示すものが知られている。例えば、アミノレブリン酸はその施用により植物に対して生長促進効果を示す。

[先行技術文献]

15 [非特許文献]

[0003]

[非特許文献1]「Biosynthesis, biotechnological production and applications of 5-aminolevulinic acid」 K. Sasaki et al., (2002) Applied Microbial Biotechnology 58: pp. 23-29

20

発明の概要

[0004]

本発明は、植物の生長を促進する優れた方法等を提供することを課題とする。

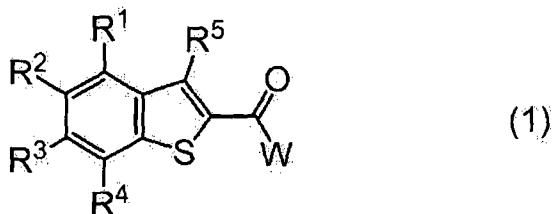
25 [0005]

本発明者は、鋭意検討した結果、特定の化合物を植物に施用することによってその植物の生長が促進されることを見出し、本発明に到達した。

[0006]

即ち、本発明は次の通りである。

30 [1] 下記式(1)



[式中、

Wは、 $-OR^6$ 、 $-ON=CR^7R^8$ 、 $-SR^9$ または $-NR^7R^{10}$ を表し、

35 R^1 は、水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC2-C6アルケニル基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC2-C6アルキニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよい6員芳香族複素環基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよい5員芳香族複素環基、カルボキシ基、1個以上のハロゲン原子を有していても

40

よいC 2－C 6アルキルカルボニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいベンゾイル基、C 2－C 6アルコキシカルボニル基、アミノカルボニル基、 $-NR^{1\ 1}R^{1\ 2}$ 、 $-S(O)_2NR^7R^{1\ 1}$ 、 $-OR^{1\ 1}$ 、 $-S(O)_mR^{1\ 1}$ または $-SF_5$ を表し、

- 5 R² は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 2－C 6アルケニル基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 2－C 6アルキニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよい6員芳香族複素環基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよい5員芳香族複素環基、カルボキシ基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 2－C 6アルキルカルボニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいベンゾイル基、C 2－C 6アルコキシカルボニル基、アミノカルボニル基、 $-NR^{1\ 2}R^{1\ 3}$ 、 $-S(O)_2NR^7R^{1\ 1}$ 、 $-OR^{1\ 3}$ 、 $-S(O)_mR^{1\ 3}$ または $-SF_5$ を表し、

15 R³ およびR⁴ は同一または相異なり、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 2－C 6アルケニル基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 2－C 6アルキニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよい6員芳香族複素環基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよい5員芳香族複素環基、カルボキシ基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 2－C 6アルキルカルボニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいベンゾイル基、C 2－C 6アルコキシカルボニル基、アミノカルボニル基、 $-NR^{1\ 1}R^{1\ 2}$ 、 $-S(O)_2NR^7R^{1\ 1}$ 、 $-OR^{1\ 1}$ 、 $-S(O)_mR^{1\ 1}$ または $-SF_5$ を表し、

20 R⁵ は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、カルボキシ基、C 2－C 6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1\ 1}R^{1\ 2}$ 、 $-S(O)_2NR^7R^{1\ 1}$ 、 $-OR^{1\ 4}$ 、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよい6員芳香族複素環基または群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよい5員芳香族複素環基を表し、

35 R⁶ は、群Zより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 3－C 6アルケニル基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 3－C 6アルキニル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 4－C 7シクロアルキルアルキル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 3－C 6シクロアルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、またはベンゼン環部分が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 7－C 9フェニルアルキル基を表し、

40 R⁷ およびR⁸ は同一または相異なり、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基または水素原子を表し、

45 R⁹ は、水素原子、群Zより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－

C 6 アルキル基、群 X より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよい C 3 - C 6 アルケニル基、群 X より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよい C 3 - C 6 アルキニル基、群 Y より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよいフェニル基、またはベンゼン環部分が群 Y より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよい C 7 - C 9 フェニルアルキル基を表し、

R^{1 0} は、水素原子、シアノ基、群 Z より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよい C 1 - C 6 アルキル基、群 Y より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよいフェニル基、ベンゼン環部分が群 Y より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよいベンジル基、-OR⁷ または -NR⁷R⁸ を表し、

R^{1 1} は、群 X より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよい C 1 - C 6 アルキル基、群 X より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよい C 3 - C 6 アルケニル基、群 X より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよい C 3 - C 6 アルキニル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 4 - C 7 シクロアルキルアルキル基、ベンゼン環部分が群 Y より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよい C 7 - C 9 フェニルアルキル基、6 員芳香族複素環部分が群 Y より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよい 6 員芳香族複素環 C 1 - C 3 アルキル基、群 Y より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよいフェニル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 3 - C 6 シクロアルキル基または水素原子を表し（ただし、-S(O)_mR^{1 1}における m が 1 または 2 である場合は、

R^{1 1} は水素原子を表さない。）

R^{1 2} は、水素原子、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 4 アルキル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 4 アルキルスルホニル基、群 Y より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよいフェニルスルホニル基、ベンゼン環部分が群 Y より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよい C 7 - C 9 フェニルアルキルスルホニル基、C 2 - C 6 アルコキシカルボニル基、-C(O)R^{1 5} または -C(O)NR⁷R⁸ を表し、

R^{1 3} は群 X より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよい C 1 - C 6 アルキル基、群 X より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよい C 3 - C 6 アルケニル基、群 X より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよい C 3 - C 6 アルキニル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 4 - C 7 シクロアルキルアルキル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 3 - C 6 シクロアルキル基、ベンゼン環部分が群 Y より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよい C 7 - C 9 フェニルアルキル基または水素原子を表し（ただし、-S(O)_mR^{1 3}における m が 1 または 2 である場合は、R^{1 3} は水素原子ではない。

）

R^{1 4} は、群 X より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよい C 1 - C 6 アルキル基、群 X より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよい C 3 - C 6 アルケニル基、群 X より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよい C 3 - C 6 アルキニル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 4 - C 7 シクロアルキルアルキル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 3 - C 6 シクロアルキル基、ベンゼン環部分が群 Y より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよい C 7 - C 9 フェニルアルキル基、群 Y より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよいフェニル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 2 - C 6 アルキルカルボニル基、群 Y より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよい

ベンゾイル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 6 アルキルスルホニル基、群 Y より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよいフェニル

スルホニル基または水素原子を表し、

R^{1-5} は、水素原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよい5員芳香族複素環基、または群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよい6員芳香族複素環基を表し、

mは0、1または2を表す。

群Xはハロゲン原子、シアノ基および1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルコキシ基からなる群を表し、

群Yはハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基および1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルコキシ基からなる群を表し、

群Zはハロゲン原子、ヒドロキシ基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルコキシ基およびC2-C6アルコキシカルボニル基からなる群を表す。]で示される化合物（以下、本発明化合物と記す。）を、植物に処理する植物の生長促進方法。

但し、以下の(1)から(8)のいずれかに該当する化合物を、植物に処理する植物の生長促進方法は除く。

(1) 4-(トリフルオロメチル)ベンゾ[b]チオフェン-2-カルボン酸メチル

(2) 5-(トリフルオロメチル)ベンゾ[b]チオフェン-2-カルボン酸メチル

(3) 6-(トリフルオロメチル)ベンゾ[b]チオフェン-2-カルボン酸メチル

(4) 7-(トリフルオロメチル)ベンゾ[b]チオフェン-2-カルボン酸メチル

(5) 4-(トリフルオロメチル)ベンゾ[b]チオフェン-2-カルボン酸エチル

(6) 5-(トリフルオロメチル)ベンゾ[b]チオフェン-2-カルボン酸エチル

(7) 6-(トリフルオロメチル)ベンゾ[b]チオフェン-2-カルボン酸エチル

(8) 7-(トリフルオロメチル)ベンゾ[b]チオフェン-2-カルボン酸エチル

[2] 式(1)で示される化合物が、

R^1 が、水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC2-C6アルケニル基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC2-C6アルキニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよい5員芳香族複素環基、カルボキシ基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルキルカルボニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいベンゾイル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、アミノカルボニル基、 $-NR^{1-1}R^{1-2}$ 、 $-S(O)_2NR^{1-1}R^{1-1}$ 、 $-OR^{1-1}$ 、 $-S(O)_mR^{1-1}$ または $-SF_5$ であり、

R^4 が、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、群Xより選ばれる1

個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 2－C 6アルケニル基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 2－C 6アルキニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよい5員芳香族複素環基、カルボキシ基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 2－C 6アルキルカルボニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいベンゾイル基、C 2－C 6アルコキシカルボニル基、アミノカルボニル基、 $-NR^{1,1}R^{1,2}$ 、 $-S(O)_2NR^{7,1}R^{1,1}$ 、 $-OR^{1,1}$ 、 $-S(O)_mR^{1,1}$ または $-SF_5$ である[1]に記載の方法。

[3] 式(1)で示される化合物が、

R^1 が、水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 4アルキル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 2－C 4アルケニル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 2－C 4アルキニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいピリジル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいピリミジニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいチエニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいピロリル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 2－C 5アルキルカルボニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいベンゾイル基、C 2－C 4アルコキシカルボニル基、アミノカルボニル基、 $-NR^{1,1}R^{1,2}$ 、 $-OR^{1,1}$ 、 $-S(O)_mR^{1,1}$ または $-SF_5$ であり、

R^2 が、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 4アルキル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 2－C 4アルケニル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 2－C 4アルキニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいピリジル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいピリミジニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいチエニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいピロリル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 2－C 5アルキルカルボニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいベンゾイル基、C 2－C 4アルコキシカルボニル基、アミノカルボニル基、 $-NR^{1,2}R^{1,3}$ 、 $-OR^{1,3}$ 、 $-S(O)_mR^{1,3}$ または $-SF_5$ であり、

R^3 および R^4 が同一または相異なり、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 4アルキル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 2－C 4アルケニル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 2－C 4アルキニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいピリジル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいピリミジニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいチエニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいピロリル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 2－C 5アルキルカルボニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいベンゾイル基、C 2－C 4アルコキシカルボニル基、アミノカルボニル基、 $-NR^{1,1}R^{1,2}$ 、 $-OR^{1,1}$ 、 $-S(O)_mR^{1,1}$ または $-SF_5$ であり、

R⁵ が、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基、C2-C5アルキルカルボニル基、-NR^{1 1} R^{1 2}、-S(O)₂ NR⁷ R^{1 1}、-OR^{1 4} または群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基であり、

5 R⁶ が、群Zより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC3-C6アルケニル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC3-C6アルキニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基またはベンゼン環部分が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC7-C9フェニルアルキル基であり、

10 R⁷ およびR⁸ が同一または相異なり、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基または水素原子であり、

R⁹ が、水素原子、群Zより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC3-C6アルケニル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC3-C6アルキニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、またはベンゼン環部分が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC7-C9フェニルアルキル基であり、

20 R^{1 0} が、水素原子、シアノ基、群Zより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、-OR⁷ または-NR⁷ R⁸ であり、

R^{1 1} が、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキル基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC3-C4アルキニル基、ベンゼン環部分が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC7-C9フェニルアルキル基、ピリジン環部分が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいピリジルC1-C3アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基または水素原子であり（ただし、-S(O)_m R^{1 1} におけるmが1または2である場合は、R^{1 1} は水素原子ではない。
30 ）。）、

R^{1 2} が、水素原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキルスルホニル基、ベンゼン環部分が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニルスルホニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいベンジルスルホニル基、-C(O) R^{1 5} または-C(O) NR⁷ R⁸ であり、

R^{1 3} が、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキル基または水素原子であり（ただし、-S(O)_m R^{1 3} におけるmが1または2である場合は、R^{1 3} は水素原子ではない。）、

40 R^{1 4} が、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C4アルキル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC3-C6アルケニル基、ベンゼン環部分が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいベンジル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C5アルキルカルボニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいベンゾイル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニルスルホニル基または水素原子であ
45

り、

R¹⁻⁵ が、水素原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいチエニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいピラゾリル基または群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいイソキサゾリル基である[1]に記載の方法。

[4] 植物が、非生物学的ストレスに暴露された又は暴露されるであろう植物である[1]から[3]のいずれかに記載の方法。

[5] 植物への処理が、散布処理、土壌処理、種子処理又は水耕処理である[1]から[4]のいずれかに記載の方法。

[6] 植物への処理が、種子処理である[1]から[4]のいずれかに記載の方法。

[7] 植物がイネ、トウモロコシ、又はコムギである[1]から[6]のいずれかに記載の方法。

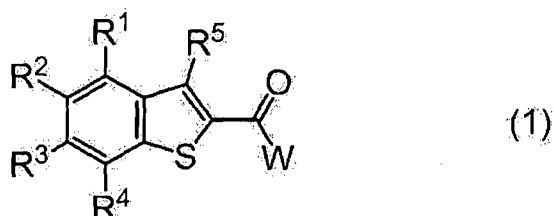
[8] 植物が遺伝子組換え植物である[1]から[7]、[15]、[16]のいずれかに記載の方法。

[9] 非生物学的ストレスが高温ストレスである[4]から[8]、[15]、[16]のいずれかに記載の方法。

[10] 非生物学的ストレスが低温ストレスである[4]から[8]、[15]、[16]のいずれかに記載の方法。

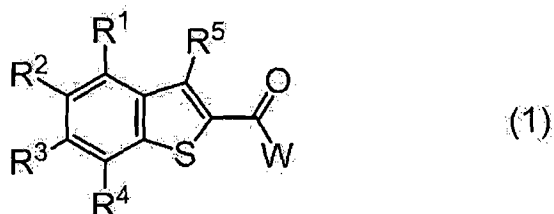
[11] 非生物学的ストレスが乾燥ストレスである[4]から[8]、[15]、[16]のいずれかに記載の方法。

[12] 植物の生長を促進するための、前記式(1)



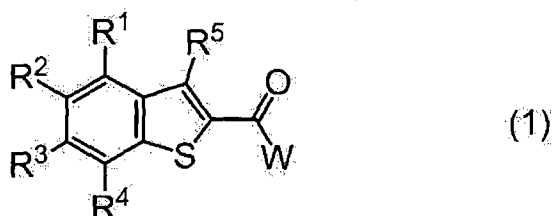
で示される化合物の使用。

[13] 前記式(1)



で示される化合物を有効量含む[1]から[3]のいずれかの化合物が処理される植物種子。

[14] 前記式(1)



で示される化合物及び不活性成分を含有する植物生長促進組成物。

[0007]

[15] 植物がダイズである[1]から[6]のいずれかーに記載の方法。

[16] 植物がワタである[1]から[6]のいずれかーに記載の方法。

5 発明を実施するための形態

[0008]

本発明において、植物の生長を促進する（以下、「生長促進」と記すことがある。）とは、苗立ち率向上、健全葉数増加、草丈増、植物体重量増加、葉面積増加、種子又は果実の数又は重量の増加、着花数又は着果数の増加、根部生長の増加をいう。

[0009]

生長促進は、以下にあげるパラメーターを用いて定量化が可能である。

(1) 苗立ち率

植物の種子を、例えば土壌中、ろ紙上、寒天培地上、砂上などに播種し、一定期間栽培する。その後、生き残った幼植物の割合を調査する。

(2) 健全葉数又は健全葉率

各植物について健全な葉の枚数を数え、総健全葉数を調査する。あるいは植物の全ての葉数に対する健全葉数の割合を調査する。

(3) 草丈

各植物について地上部分の茎の根元から先端の枝葉までの長さを測定する。

(4) 植物体重量

各植物の地上部を切り取り、重量を測定して、植物新鮮重量を求める、あるいは切り取ったサンプルを乾燥させた後に重量を測定して、植物乾燥重量を求める。

(5) 葉面積

植物をデジタルカメラで撮影し、写真の緑色の部分の面積を画像解析ソフト例えばWin ROOF（三谷商事社製）で定量することにより、あるいは目視による評価によって、植物の葉面積を求める。

(6) 葉色

植物の葉をサンプリングし、葉緑素計（例えばSPAD-502、コニカミノルタ製）を用いて葉緑素量を測定することにより、葉色を求める。また、植物をデジタルカメラで撮影し、写真の緑色の部分の面積を画像解析ソフト例えばWin ROOF（三谷商事社製）で色抽出を行い定量することにより、植物の葉の緑色部分の面積を求める。

(7) 種子あるいは果実の数又は重量

植物を種子あるいは果実が結実あるいは登熟するまで栽培した後、植物当りの果実数を計測あるいは植物当りの総果実重量を測定する。また、種子が登熟するまで栽培した後、例えば穂数、登熟歩合、千粒重などの収量構成要素を調査する。

(8) 着花率、着果率、結実率、又は種子充填率

植物を着果するまで栽培した後、着花数と着果数を数え着果率％（着果数/着花数×100）を求める。種子登熟後に結実数と種子充填数を数え結実率（結実数/着花数×100）、種子充填率％（種子充填数/結実数×100）を求める。

(9) 根部生長

植物を土壌あるいは水耕にて栽培し、その根部の長さを計測する、あるいは根部を切り取りその新鮮重量等を測定する。

[0010]

本発明方法において本発明化合物を植物に処理する場合、当該植物の全体であって一部

(茎葉、芽、花、果実、穂、種子、球根、塊茎、根等)であって良く、又当該植物の種々の生育ステージ(播種時前、播種時、播種後出芽前後などの発芽期、育苗時、苗移植時、挿し木又は挿し苗時、定植後の生育時などの栄養生長期、開花前、開花中、開花後、出穂直前又は出穂期などの生殖生長期、収穫予定前、成熟予定前、果実の着色開始期などの収穫期)であって良い。ここで球根とは、鱗茎、球茎、根茎、塊根、および担根体を意味する。また、苗としては、実生、挿し木等を含むものとする。

[0011]

本明細書の記載において用いられる置換基について、例を挙げて以下に説明する。

[0012]

本発明化合物における「ハロゲン原子」としては、フッ素原子、塩素原子、臭素原子およびヨウ素原子等が挙げられる。

[0013]

本発明化合物における「C1-C6アルキル基」としては、例えばメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、sec-ブチル基、tert-ブチル基、ペンチル基、2,2-ジメチルプロピル基、3-メチルブチル基、2,3-ジメチルブチル基、3,3-ジメチルブチル基およびヘキシル基等が挙げられる。

[0014]

本発明化合物における「群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基」としては、例えばメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、sec-ブチル基、tert-ブチル基、ペンチル基、2,2-ジメチルプロピル基、3-メチルブチル基、2,3-ジメチルブチル基、3,3-ジメチルブチル基、ヘキシル基、トリクロロメチル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、2,2,2-トリフルオロエチル基、ペンタフルオロエチル基、ヘプタフルオロプロピル基、ヘプタフルオロイソプロピル基、シアノメチル基、2-シアノエチル基、メトキシメチル基、2-メトキシエチル基、エトキシメチル基、2-エトキシエチル基、トリフルオロメトキシメチル基および2,2,2-トリフルオロエトキシメチル基等が挙げられる。

[0015]

本発明化合物における「群Zより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基」としては、例えばメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、sec-ブチル基、tert-ブチル基、ペンチル基、2,2-ジメチルプロピル基、3-メチルブチル基、2,3-ジメチルブチル基、3,3-ジメチルブチル基、ヘキシル基、トリクロロメチル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、2,2,2-トリフルオロエチル基、ペンタフルオロエチル基、ヘプタフルオロプロピル基、ヘプタフルオロイソプロピル基、2-ヒドロキシエチル基、メトキシメチル基、2-メトキシエチル基、エトキシメチル基、2-エトキシエチル基、トリフルオロメトキシメチル基、2,2,2-トリフルオロエトキシメチル基およびメトキシカルボニルメチル基等が挙げられる。

[0016]

本発明化合物における「1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基」としては、例えばメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、sec-ブチル基、tert-ブチル基、ペンチル基、2, 2-ジメチルプロピル基、3-メチルブチル基、2, 3-ジメチルブチル基、3, 3-ジメチルブチル基、ヘキシル基、クロロメチル基、トリクロロメチル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、2, 2, 2-トリフルオロエチル基、ペンタフルオロエチル基、ヘプタフルオロプロピル基およびヘプタフルオロイソプロピル基等が挙げられる。

[0017]

本発明化合物における「C1-C4アルキル基」としては、例えばメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、sec-ブチル基およびtert-ブチル基が挙げられる。

[0018]

本発明化合物における「群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C4アルキル基」としては、例えばメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、sec-ブチル基、tert-ブチル基、クロロメチル基、トリクロロメチル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、2, 2, 2-トリフルオロエチル基、ペンタフルオロエチル基、ヘプタフルオロプロピル基、ヘプタフルオロイソプロピル基、シアノメチル基、2-シアノエチル基、メトキシメチル基、2-メトキシエチル基、エトキシメチル基、2-エトキシエチル基、トリフルオロメトキシメチル基および2, 2, 2-トリフルオロエトキシメチル基等が挙げられる。

[0019]

本発明化合物における「1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基」としては、例えばメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、sec-ブチル基、tert-ブチル基、トリクロロメチル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、2, 2, 2-トリフルオロエチル基、ペンタフルオロエチル基、ヘプタフルオロプロピル基およびヘプタフルオロイソプロピル基等が挙げられる。

[0020]

本発明化合物における「C1-C3アルキル基」としては、例えばメチル基、エチル基、プロピル基およびイソプロピル基が挙げられる。

[0021]

本発明化合物における「1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキル基」としては、例えばメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、2, 2, 2-トリフルオロエチル基、ペンタフルオロエチル基、ヘプタフルオロプロピル基およびヘプタフルオロイソプロピル基等が挙げられる。

[0022]

本発明化合物における「C4-C7シクロアルキルアルキル基」としては、例えばシクロプロピルメチル基、1-シクロプロピルエチル基、2-シクロプロピルエチル基、シクロブチルメチル基、1-シクロブチルエチル基、シクロペンチルメチル基およびシクロヘキシルメチル基等が挙げられる。

[0023]

本発明化合物における「1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC4-C

7 シクロアルキルアルキル基」としては、例えばシクロプロピルメチル基、1
ーシクロプロピルエチル基、2ーシクロプロピルエチル基、シクロブチルメチ
ル基、1ーシクロブチルエチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシル
メチル基、2, 2ージフルオロシクロプロピルメチル基、1ー(2, 2ージク
5 ロロシクロプロピル)エチル基、2, 2ージブromoシクロブチルメチル基およ
び2ークロロシクロペンチルメチル基等が挙げられる。

[0024]

本発明化合物における「C3ーC6シクロアルキル基」としては、例えばシク
ロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、およびシクロヘキシル基
10 等が挙げられる。

[0025]

本発明化合物における「1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC3ーC
6シクロアルキル基」としては、例えばシクロプロピル基、シクロブチル基、
シクロペンチル基、シクロヘキシル基、2, 2ージフルオロシクロプロピル基
15 、2, 2ージクロロシクロプロピル基、2ークロロシクロペンチル基および4ー
ヨードシクロヘキシル基等が挙げられる。

[0026]

本発明化合物における「C2ーC6アルケニル基」としては、例えばビニル基
、1ープロペニル基、アリル基、イソプロペニル基、2ーメチルー1ープロペ
20 ニル基、1ーブテニル基、2ーブテニル基、3ーブテニル基、1ーペンテニル
基および1ーヘキセニル基等が挙げられる。

[0027]

本発明化合物における「群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC
2ーC6アルケニル基」としては、例えばビニル基、1ープロペニル基、アリ
25 ル基、イソプロペニル基、2ーメチルー1ープロペニル基、1ーブテニル基、
2ーブテニル基、3ーブテニル基、1ーペンテニル基、1ーヘキセニル基、2
、2ージフルオロエテニル基、2, 2ージクロロエテニル基、2ーシアノー1
ーエテニル基、2ーメトキシー1ーエテニル基、2ーエトキシー1ーエテニル
基、3, 3ージフルオロー2ープロペニル基、3, 3ージクロロー2ープロペ
30 ニル基、4ーメトキシー2ーメチルー2ーブテニル基および3ーシアノー2ー
ブテニル基等が挙げられる。

[0028]

本発明化合物における「C3ーC6アルケニル基」としては、例えばアリル基
、1ーメチルー2ープロペニル基、2ーメチルー2ープロペニル基、2ーブテ
35 ニル基、3ーブテニル基、2ーペンテニル基、4ーペンテニル基、2ーヘキセ
ニル基および5ーヘキセニル基等が挙げられる。

[0029]

本発明化合物における「群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC
3ーC6アルケニル基」としては、例えばアリル基、1ーメチルー2ープロペ
40 ニル基、2ーメチルー2ープロペニル基、2ーブテニル基、3ーブテニル基、
2ーペンテニル基、4ーペンテニル基、2ーヘキセニル基、5ーヘキセニル基
、3, 3ージフルオロー2ープロペニル基、3, 3ージクロロー2ープロペニ
ル基、4ーメトキシー2ーメチルー2ーブテニル基および3ーシアノー2ーブ
テニル基等が挙げられる。

[0030]

本発明化合物における「1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC3ーC

6アルケニル基」としては、例えば2-プロペニル基、1-メチル-2-プロ
ペニル基、2-メチル-2-プロペニル基、2-ブテニル基、3-ブテニル基
、2-ペンテニル基、4-ペンテニル基、2-ヘキセニル基、5-ヘキセニル
基、3, 3-ジフルオロ-2-プロペニル基および3, 3-ジクロロ-2-プロ
5 ペニル基等が挙げられる。

[0031]

本発明化合物における「C2-C4アルケニル基」としては、例えばビニル基
、1-プロペニル基、アリル基、イソプロペニル基、2-メチル-1-プロペ
10 ニル基、1-ブテニル基、2-ブテニル基および3-ブテニル基等が挙げられ
る。

[0032]

本発明化合物における「1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C
4アルケニル基」としては、例えばビニル基、1-プロペニル基、アリル基、
イソプロペニル基、2-メチル-1-プロペニル基、1-ブテニル基、2-ブ
15 テニル基、3-ブテニル基、2, 2-ジフルオロエテニル基、2, 2-ジクロ
ロエテニル基、3, 3-ジフルオロ-2-プロペニル基および3, 3-ジクロ
ロ-2-プロペニル基等が挙げられる。

[0033]

本発明化合物における「C2-C6アルキニル基」としては、例えばエチニル
20 基、1-プロピニル基、プロパルギル基、1-ブチニル基、2-ブチニル基、
3-ブチニル基、3, 3-ジメチル-1-ブチニル基、1-ペンチニル基、2-
ペンチニル基および1-ヘキシニル基等が挙げられる。

[0034]

本発明化合物における「群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC
25 2-C6アルキニル基」としては、例えばエチニル基、プロパルギル基、1-
プロピニル基、1-ブチニル基、2-ブチニル基、3-ブチニル基、3, 3-
ジメチル-1-ブチニル基、1-ペンチニル基、1-ヘキシニル基、4-クロ
ロ-2-ブチニル基、4-シアノ-2-ブチニル基、5-シアノ-2-ペンチ
ニル基、4-メトキシ-2-ブチニル基および4-(2-クロロエトキシ)-
30 2-ブチニル基等が挙げられる。

[0035]

本発明化合物における「C3-C6アルキニル基」としては、例えばプロパル
ギル基、2-ブチニル基、3-ブチニル基、2-ペンチニル基、4-ペンチ
ニル基、2-ヘキシニル基および5-ヘキシニル基等が挙げられる。

[0036]

本発明化合物における「群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC
3-C6アルキニル基」としては、例えばプロパルギル基、2-ブチニル基、
3-ブチニル基、2-ペンチニル基、2-ヘキシニル基、4-クロロ-2-ブ
チニル基、4-シアノ-2-ブチニル基、5-シアノ-2-ペンチニル基、4-
40 -メトキシ-2-ブチニル基および4-(2-クロロエトキシ)-2-ブチ
ニル基等が挙げられる。

[0037]

本発明化合物における「1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC3-C
6アルキニル基」としては、例えばプロパルギル基、2-ブチニル基、3-ブ
45 チニル基、3, 3-ジメチル-1-ブチニル基、2-ペンチニル基、4-ペン
チニル基、2-ヘキシニル基、5-ヘキシニル基および4-クロロ-2-ブチ

ニル基等が挙げられる。

[0038]

本発明化合物における「C₂-C₄アルキニル基」としては、例えばエチニル基、プロパルギル基、1-プロピニル基、1-ブチニル基、2-ブチニル基および3-ブチニル基等が挙げられる。

[0039]

本発明化合物における「1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC₂-C₄アルキニル基」としては、例えばエチニル基、プロパルギル基、1-プロピニル基、1-ブチニル基、2-ブチニル基、3-ブチニル基および4-クロロ-2-ブチニル基等が挙げられる。

[0040]

本発明化合物における「C₃-C₄アルキニル基」としては、例えばプロパルギル基、2-ブチニル基および3-ブチニル基等が挙げられる。

[0041]

本発明化合物における「群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC₃-C₄アルキニル基」としては、例えばプロパルギル基、2-ブチニル基、3-ブチニル基、4-クロロ-2-ブチニル基および4-メトキシ-2-ブチニル基等が挙げられる。

[0042]

本発明化合物における「群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基」としては、例えばフェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、2-ブロモフェニル基、3-ブロモフェニル基、4-ブロモフェニル基、2-ヨードフェニル基、3-ヨードフェニル基、4-ヨードフェニル基、2-シアノフェニル基、3-シアノフェニル基、4-シアノフェニル基、2-ニトロフェニル基、3-ニトロフェニル基、4-ニトロフェニル基、2-メチルフェニル基、3-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-イソプロピルフェニル基、3-イソプロピルフェニル基、4-イソプロピルフェニル基、2-ブチルフェニル基、3-ブチルフェニル基、4-ブチルフェニル基、2-イソブチルフェニル基、3-イソブチルフェニル基、4-イソブチルフェニル基、3-tert-ブチルフェニル基、4-tert-ブチルフェニル基、2-ジフルオロメチルフェニル基、3-ジフルオロメチルフェニル基、4-ジフルオロメチルフェニル基、2-トリフルオロメチルフェニル基、3-トリフルオロメチルフェニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基、2-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)フェニル基、3-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)フェニル基、4-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)フェニル基、2-ペンタフルオロエチルフェニル基、3-ペンタフルオロエチルフェニル基、4-ペンタフルオロエチルフェニル基、2-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、3-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、4-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、2-ヘプタフルオロイソプロピルフェニル基、3-ヘプタフルオロイソプロピルフェニル基、4-ヘプタフルオロイソプロピルフェニル基、2-メトキシフェニル基、3-メトキシフェニル基、4-メトキシフェニル基、2-tert-ブトキシフェニル基、3-tert-ブトキシフェニル基、4-tert-ブトキシフェニル基、2-ペンチロキシフェニル基、3-ペンチロキシフェニル基、4-ペンチロキシフェニル基、2-(2, 2-ジメチルプロポキシ)フェニル基、3-(2, 2-ジメチル

プロポキシ) フェニル基、4-(2, 2-ジメチルプロポキシ) フェニル基、2-(3-メチルブトキシ) フェニル基、3-(3-メチルブトキシ) フェニル基、4-(3-メチルブトキシ) フェニル基、2-ジフルオロメトキシフェニル基、3-ジフルオロメトキシフェニル基、4-ジフルオロメトキシフェニル基、2-トリフルオロメトキシフェニル基、3-トリフルオロメトキシフェニル基、4-トリフルオロメトキシフェニル基、4-(2, 2, 2-トリフルオロエトキシ) フェニル基、2, 4-ジメトキシフェニル基および3-クロロ-4-メチルフェニル基等が挙げられる。

[0043]

- 10 本発明化合物における「C7-C9フェニルアルキル基」としては、例えばベンジル基、1-フェニルエチル基、2-フェニルエチル基、1-フェニルプロピル基、2-フェニルプロピル基、3-フェニルプロピル基および1-メチル-1-フェニルエチル基等が挙げられる。

[0044]

- 15 本発明化合物における「ベンゼン環部分が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC7-C9フェニルアルキル基」としては、例えばベンジル基、2-フルオロベンジル基、3-クロロベンジル基、3-メトキシベンジル基、4-クロロベンジル基、4-メチルベンジル基、4-トリフルオロメチル基、1-(3-クロロフェニル)エチル基、2-(4-ブロモフェニル)エチル基、1-(2-シアノフェニル)プロピル基、2-(3-ニトロフェニル)プロピル基、3-(3-メトキシフェニル)プロピル基および1-メチル-1-(4-トリフルオロメトキシフェニル)エチル基等が挙げられる。
- 20

[0045]

- 25 本発明化合物における「ベンゼン環部分が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいベンジル基」としては、例えば2-フルオロベンジル基、3-クロロベンジル基、4-ブロモベンジル基、2-シアノベンジル基、3-ニトロベンジル基、3-メトキシベンジル基、4-トリフルオロメトキシベンジル基、4-クロロベンジル基、4-メチルベンジル基および4-トリフルオロメチルベンジル基等が挙げられる。

[0046]

- 30 本発明化合物における「6員芳香族複素環基」としては、例えば2-ピリジル基、3-ピリジル基、4-ピリジル基、3-ピリダジニル基、4-ピリダジニル基、2-ピリミジニル基、4-ピリミジニル基、5-ピリミジニル基、2-ピラジニル基、4-(1, 2, 3-トリアジニル)基、5-(1, 2, 3-トリアジニル)基、3-(1, 2, 4-トリアジニル)基、5-(1, 2, 4-トリアジニル)基、6-(1, 2, 4-トリアジニル)基および2-(1, 3, 5-トリアジニル)基等が挙げられる。
- 35

[0047]

- 40 本発明化合物における「群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよい6員芳香族複素環基」としては、例えば2-ピリジル基、3-フルオロ-2-ピリジル基、4-フルオロ-2-ピリジル基、5-フルオロ-2-ピリジル基、6-フルオロ-2-ピリジル基、3-クロロ-2-ピリジル基、4-クロロ-2-ピリジル基、5-クロロ-2-ピリジル基、6-クロロ-2-ピリジル基、3-ブロモ-2-ピリジル基、4-ブロモ-2-ピリジル基、5-ブロモ-2-ピリジル基、6-ブロモ-2-ピリジル基、3-ヨード-2-ピリジル基、4-ヨード-2-ピリジル基、5-ヨード-2-ピリジル基、6-ヨード-
- 45

2-ピリジル基、3-シアノ-2-ピリジル基、4-シアノ-2-ピリジル基、5-シアノ-2-ピリジル基、6-シアノ-2-ピリジル基、3-ニトロ-2-ピリジル基、4-ニトロ-2-ピリジル基、5-ニトロ-2-ピリジル基、6-ニトロ-2-ピリジル基、3-メチル-2-ピリジル基、4-メチル-2-ピリジル基、5-メチル-2-ピリジル基、6-メチル-2-ピリジル基、3-エチル-2-ピリジル基、4-エチル-2-ピリジル基、5-エチル-2-ピリジル基、6-エチル-2-ピリジル基、3-プロピル-2-ピリジル基、4-プロピル-2-ピリジル基、5-プロピル-2-ピリジル基、6-プロピル-2-ピリジル基、3-イソプロピル-2-ピリジル基、4-イソプロピル-2-ピリジル基、5-イソプロピル-2-ピリジル基、6-イソプロピル-2-ピリジル基、3-ブチル-2-ピリジル基、4-ブチル-2-ピリジル基、5-ブチル-2-ピリジル基、6-ブチル-2-ピリジル基、3-イソブチル-2-ピリジル基、4-イソブチル-2-ピリジル基、5-イソブチル-2-ピリジル基、6-イソブチル-2-ピリジル基、3-sec-ブチル-2-ピリジル基、4-sec-ブチル-2-ピリジル基、5-sec-ブチル-2-ピリジル基、6-sec-ブチル-2-ピリジル基、3-tert-ブチル-2-ピリジル基、4-tert-ブチル-2-ピリジル基、5-tert-ブチル-2-ピリジル基、6-tert-ブチル-2-ピリジル基、3-ジフルオロメチル-2-ピリジル基、4-ジフルオロメチル-2-ピリジル基、5-ジフルオロメチル-2-ピリジル基、6-ジフルオロメチル-2-ピリジル基、3-トリフルオロメチル-2-ピリジル基、4-トリフルオロメチル-2-ピリジル基、5-トリフルオロメチル-2-ピリジル基、6-トリフルオロメチル-2-ピリジル基、3-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)-2-ピリジル基、4-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)-2-ピリジル基、5-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)-2-ピリジル基、6-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)-2-ピリジル基、3-ペンタフルオロエチル-2-ピリジル基、4-ペンタフルオロエチル-2-ピリジル基、5-ペンタフルオロエチル-2-ピリジル基、6-ペンタフルオロエチル-2-ピリジル基、3-ヘプタフルオロプロピル-2-ピリジル基、4-ヘプタフルオロプロピル-2-ピリジル基、5-ヘプタフルオロプロピル-2-ピリジル基、6-ヘプタフルオロプロピル-2-ピリジル基、3-ヘプタフルオロイソプロピル-2-ピリジル基、4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-ピリジル基、5-ヘプタフルオロイソプロピル-2-ピリジル基、6-ヘプタフルオロイソプロピル-2-ピリジル基、3-ピリジル基、2-メチル-3-ピリジル基、4-メチル-3-ピリジル基、5-メチル-3-ピリジル基、6-メチル-3-ピリジル基、2-エチル-3-ピリジル基、4-エチル-3-ピリジル基、5-エチル-3-ピリジル基、6-エチル-3-ピリジル基、2-プロピル-3-ピリジル基、4-プロピル-3-ピリジル基、5-プロピル-3-ピリジル基、6-プロピル-3-ピリジル基、2-イソプロピル-3-ピリジル基、4-イソプロピル-3-ピリジル基、5-イソプロピル-3-ピリジル基、6-イソプロピル-3-ピリジル基、2-ブチル-3-ピリジル基、4-ブチル-3-ピリジル基、5-ブチル-3-ピリジル基、6-ブチル-3-ピリジル基、2-イソブチル-3-ピリジル基、4-イソブチル-3-ピリジル基、5-イソブチル-3-ピリジル基、6-イソブチル-3-ピリジル基、2-sec-ブチル-3-ピリジル基、4-sec-ブチル-3-ピリジル基、5-sec-ブチル-3-ピリジル基、6-sec-ブチル-3-ピリジル基、2-tert

ーブチル-3-ピリジル基、4-tert-ブチル-3-ピリジル基、5-tert-
 ーブチル-3-ピリジル基、6-tert-ブチル-3-ピリジル基、
 2-ジフルオロメチル-3-ピリジル基、4-ジフルオロメチル-3-ピリジ
 ル基、5-ジフルオロメチル-3-ピリジル基、6-ジフルオロメチル-3-
 5 ピリジル基、2-トリフルオロメチル-3-ピリジル基、4-トリフルオロメ
 チル-3-ピリジル基、5-トリフルオロメチル-3-ピリジル基、6-トリ
 フルオロメチル-3-ピリジル基、2-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)
 -3-ピリジル基、4-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)-3-ピリジル
 10 基、5-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)-3-ピリジル基、6-(2,
 2, 2-トリフルオロエチル)-3-ピリジル基、2-ペンタフルオロエチル
 -3-ピリジル基、4-ペンタフルオロエチル-3-ピリジル基、5-ペンタ
 フルオロエチル-3-ピリジル基、6-ペンタフルオロエチル-3-ピリジ
 ル基、2-ヘプタフルオロプロピル-3-ピリジル基、4-ヘプタフルオロプロ
 15 ピル-3-ピリジル基、5-ヘプタフルオロプロピル-3-ピリジル基、6-
 ヘプタフルオロプロピル-3-ピリジル基、2-ヘプタフルオロイソプロピル
 -3-ピリジル基、4-ヘプタフルオロイソプロピル-3-ピリジル基、5-
 ヘプタフルオロイソプロピル-3-ピリジル基、6-ヘプタフルオロイソプロ
 ピル-3-ピリジル基、4-ピリジル基、2-メチル-4-ピリジル基、3-
 メチル-4-ピリジル基、2-エチル-4-ピリジル基、3-エチル-4-ピ
 20 リジル基、2-プロピル-4-ピリジル基、3-プロピル-4-ピリジル基、
 2-イソプロピル-4-ピリジル基、3-イソプロピル-4-ピリジル基、2-
 ブチル-4-ピリジル基、3-ブチル-4-ピリジル基、2-イソブチル-
 4-ピリジル基、3-イソブチル-4-ピリジル基、2-sec-ブチル-4-
 -ピリジル基、3-sec-ブチル-4-ピリジル基、2-tert-ブチル-4-
 25 -ピリジル基、3-tert-ブチル-4-ピリジル基、2-ジフルオロ
 メチル-4-ピリジル基、3-ジフルオロメチル-4-ピリジル基、2-トリ
 フルオロメチル-4-ピリジル基、3-トリフルオロメチル-4-ピリジル基
 、2-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)-4-ピリジル基、3-(2, 2,
 2-トリフルオロエチル)-4-ピリジル基、2-ペンタフルオロエチル-
 30 4-ピリジル基、3-ペンタフルオロエチル-4-ピリジル基、2-ヘプタフ
 ルオロプロピル-4-ピリジル基、3-ヘプタフルオロプロピル-4-ピリジ
 ル基、2-ヘプタフルオロイソプロピル-4-ピリジル基、3-ヘプタフルオ
 ロイソプロピル-4-ピリジル基、3-ピリダジニル基、4-メチル-3-ピ
 リダジニル基、5-メチル-3-ピリダジニル基、6-メチル-3-ピリダジ
 35 ニル基、4-エチル-3-ピリダジニル基、5-エチル-3-ピリダジニル基
 、6-エチル-3-ピリダジニル基、4-プロピル-3-ピリダジニル基、5-
 プロピル-3-ピリダジニル基、6-プロピル-3-ピリダジニル基、4-
 イソプロピル-3-ピリダジニル基、5-イソプロピル-3-ピリダジニル基
 、6-イソプロピル-3-ピリダジニル基、4-ブチル-3-ピリダジニル基
 40 、5-ブチル-3-ピリダジニル基、6-ブチル-3-ピリダジニル基、4-
 イソブチル-3-ピリダジニル基、5-イソブチル-3-ピリダジニル基、6-
 イソブチル-3-ピリダジニル基、4-sec-ブチル-3-ピリダジニル
 基、5-sec-ブチル-3-ピリダジニル基、6-sec-ブチル-3-ピ
 リダジニル基、4-tert-ブチル-3-ピリダジニル基、5-tert-
 45 ブチル-3-ピリダジニル基、6-tert-ブチル-3-ピリダジニル基、
 4-ジフルオロメチル-3-ピリダジニル基、5-ジフルオロメチル-3-ピ

リダジニル基、6-ジフルオロメチル-3-ピリダジニル基、4-トリフルオ
 ロメチル-3-ピリダジニル基、5-トリフルオロメチル-3-ピリダジニル
 基、6-トリフルオロメチル-3-ピリダジニル基、4-(2, 2, 2-トリ
 フルオロエチル)-3-ピリダジニル基、5-(2, 2, 2-トリフルオロエ
 5 チル)-3-ピリダジニル基、6-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)-3
 -ピリダジニル基、4-ペンタフルオロエチル-3-ピリダジニル基、5-ペ
 ンタフルオロエチル-3-ピリダジニル基、6-ペンタフルオロエチル-3-
 ピリダジニル基、4-ヘプタフルオロプロピル-3-ピリダジニル基、5-ヘ
 プタフルオロプロピル-3-ピリダジニル基、6-ヘプタフルオロプロピル-
 10 3-ピリダジニル基、4-ヘプタフルオロイソプロピル-3-ピリダジニル基
 、5-ヘプタフルオロイソプロピル-3-ピリダジニル基、6-ヘプタフルオ
 ロイソプロピル-3-ピリダジニル基、6-クロロ-3-ピリダジニル基、6
 -メトキシ-3-ピリダジニル基、6-シアノ-3-ピリダジニル基、4-ピ
 リダジニル基、3-メチル-4-ピリダジニル基、5-メチル-4-ピリダジ
 15 ニル基、6-メチル-4-ピリダジニル基、3-エチル-4-ピリダジニル基
 、5-エチル-4-ピリダジニル基、6-エチル-4-ピリダジニル基、3-
 プロピル-4-ピリダジニル基、5-プロピル-4-ピリダジニル基、6-ブ
 ロピル-4-ピリダジニル基、3-イソプロピル-4-ピリダジニル基、5-
 イソプロピル-4-ピリダジニル基、6-イソプロピル-4-ピリダジニル基
 20 、3-ブチル-4-ピリダジニル基、5-ブチル-4-ピリダジニル基、6-
 ブチル-4-ピリダジニル基、3-イソブチル-4-ピリダジニル基、5-イ
 ソブチル-4-ピリダジニル基、6-イソブチル-4-ピリダジニル基、3-
 sec-ブチル-4-ピリダジニル基、5-sec-ブチル-4-ピリダジニ
 ル基、6-sec-ブチル-4-ピリダジニル基、3-tert-ブチル-4
 25 -ピリダジニル基、5-tert-ブチル-4-ピリダジニル基、6-tert
 -ブチル-4-ピリダジニル基、3-ジフルオロメチル-4-ピリダジニル
 基、5-ジフルオロメチル-4-ピリダジニル基、6-ジフルオロメチル-4
 -ピリダジニル基、3-トリフルオロメチル-4-ピリダジニル基、5-トリ
 フルオロメチル-4-ピリダジニル基、6-トリフルオロメチル-4-ピリダ
 30 ジニル基、3-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)-4-ピリダジニル基、
 5-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)-4-ピリダジニル基、6-(2,
 2, 2-トリフルオロエチル)-4-ピリダジニル基、3-ペンタフルオロエ
 チル-4-ピリダジニル基、5-ペンタフルオロエチル-4-ピリダジニル基
 、6-ペンタフルオロエチル-4-ピリダジニル基、3-ヘプタフルオロプロ
 35 ピル-4-ピリダジニル基、5-ヘプタフルオロプロピル-4-ピリダジニル
 基、6-ヘプタフルオロプロピル-4-ピリダジニル基、3-ヘプタフルオロ
 イソプロピル-4-ピリダジニル基、5-ヘプタフルオロイソプロピル-4-
 ピリダジニル基、6-ヘプタフルオロイソプロピル-4-ピリダジニル基、2
 -ピリミジニル基、4-メチル-2-ピリミジニル基、5-メチル-2-ピリ
 40 ミジニル基、4-エチル-2-ピリミジニル基、5-エチル-2-ピリミジニ
 ル基、4-プロピル-2-ピリミジニル基、5-プロピル-2-ピリミジニル
 基、4-イソプロピル-2-ピリミジニル基、5-イソプロピル-2-ピリミ
 ジニル基、4-ブチル-2-ピリミジニル基、5-ブチル-2-ピリミジニル
 基、4-イソブチル-2-ピリミジニル基、5-イソブチル-2-ピリミジニ
 45 ル基、4-sec-ブチル-2-ピリミジニル基、5-sec-ブチル-2-
 ピリミジニル基、4-tert-ブチル-2-ピリミジニル基、5-tert

ーブチルー2ーピリミジ
 ニル基、4ージフルオロメチルー2ーピリミジニル基、5ージフルオロメチル
 ー2ーピリミジニル基、4ートリフルオロメチルー2ーピリミジニル基、5ー
 トリフルオロメチルー2ーピリミジニル基、4ー(2, 2, 2ートリフルオロ
 5 エチル)ー2ーピリミジニル基、5ー(2, 2, 2ートリフルオロエチル)ー
 2ーピリミジニル基、4ーペンタフルオロエチルー2ーピリミジニル基、5ー
 ペンタフルオロエチルー2ーピリミジニル基、4ーヘプタフルオロプロピル
 ー2ーピリミジニル基、5ーヘプタフルオロプロピルー2ーピリミジニル基、4
 ーヘプタフルオロイソプロピルー2ーピリミジニル基、5ーヘプタフルオロイ
 10 ソプロピルー2ーピリミジニル基、4ークロロー2ーピリミジニル基、5ーク
 ロロー2ーピリミジニル基、4ーシアノー2ーピリミジニル基、5ーシアノー
 2ーピリミジニル基、5ーニトロー2ーピリミジニル基、4ーピリミジニル基
 、2ーメチルー4ーピリミジニル基、5ーメチルー4ーピリミジニル基、6ー
 メチルー4ーピリミジニル基、2ーエチルー4ーピリミジニル基、5ーエチル
 15 ー4ーピリミジニル基、6ーエチルー4ーピリミジニル基、2ープロピルー4
 ーピリミジニル基、5ープロピルー4ーピリミジニル基、6ープロピルー4
 ーピリミジニル基、2ーイソプロピルー4ーピリミジニル基、5ーイソプロピル
 ー4ーピリミジニル基、6ーイソプロピルー4ーピリミジニル基、2ーブチル
 ー4ーピリミジニル基、5ーブチルー4ーピリミジニル基、6ーブチルー4
 20 ーピリミジニル基、2ーイソブチルー4ーピリミジニル基、5ーイソブチルー4
 ーピリミジニル基、6ーイソブチルー4ーピリミジニル基、2ーsecーブチ
 ルー4ーピリミジニル基、5ーsecーブチルー4ーピリミジニル基、6ーs
 ecーブチルー4ーピリミジニル基、2ーtertーブチルー4ーピリミジニ
 ル基、5ーtertーブチルー4ーピリミジニル基、6ーtertーブチルー
 25 4ーピリミジニル基、2ージフルオロメチルー4ーピリミジニル基、5ージフ
 ルオロメチルー4ーピリミジニル基、6ージフルオロメチルー4ーピリミジニ
 ル基、2ートリフルオロメチルー4ーピリミジニル基、5ートリフルオロメチ
 ルー4ーピリミジニル基、6ートリフルオロメチルー4ーピリミジニル基、2
 ー(2, 2, 2ートリフルオロエチル)ー4ーピリミジニル基、5ー(2, 2
 30 , 2ートリフルオロエチル)ー4ーピリミジニル基、6ー(2, 2, 2ートリ
 フルオロエチル)ー4ーピリミジニル基、2ーペンタフルオロエチルー4ーピ
 リミジニル基、5ーペンタフルオロエチルー4ーピリミジニル基、6ーペンタ
 フルオロエチルー4ーピリミジニル基、2ーヘプタフルオロプロピルー4ーピ
 リミジニル基、5ーヘプタフルオロプロピルー4ーピリミジニル基、6ーヘプ
 35 タフルオロプロピルー4ーピリミジニル基、2ーヘプタフルオロイソプロピル
 ー4ーピリミジニル基、5ーヘプタフルオロイソプロピルー4ーピリミジニル
 基、6ーヘプタフルオロイソプロピルー4ーピリミジニル基、2ークロロー4
 ーピリミジニル基、2ーシアノー4ーピリミジニル基、5ークロロー4ーピリ
 ミジニル基、5ーシアノー4ーピリミジニル基、5ーニトロー4ーピリミジニ
 40 ル基、5ーピリミジニル基、2ーメチルー5ーピリミジニル基、4ーメチル
 ー5ーピリミジニル基、2ーエチルー5ーピリミジニル基、4ーエチルー5ーピ
 リミジニル基、2ープロピルー5ーピリミジニル基、4ープロピルー5ーピリ
 ミジニル基、2ーイソプロピルー5ーピリミジニル基、4ーイソプロピルー5
 ーピリミジニル基、2ーブチルー5ーピリミジニル基、4ーブチルー5ーピリ
 45 ミジニル基、2ーイソブチルー5ーピリミジニル基、4ーイソブチルー5ーピ
 リミジニル基、2ーsecーブチルー5ーピリミジニル基、4ーsecーブチ

ルー5-ピリミジニル基、2-tert-ブチルー5-ピリミジニル基、4-
 tert-ブチルー5-ピリミジニル基、2-ジフルオロメチルー5-ピリミ
 ジニル基、4-ジフルオロメチルー5-ピリミジニル基、2-トリフルオロメ
 チルー5-ピリミジニル基、4-トリフルオロメチルー5-ピリミジニル基、
 5 2-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)-5-ピリミジニル基、4-(2,
 2, 2-トリフルオロエチル)-5-ピリミジニル基、2-ペンタフルオロエ
 チルー5-ピリミジニル基、4-ペンタフルオロエチルー5-ピリミジニル基
 、2-ヘプタフルオロプロピルー5-ピリミジニル基、4-ヘプタフルオロプロ
 ピルー5-ピリミジニル基、2-ヘプタフルオロイソプロピルー5-ピリミ
 10 ジニル基、4-ヘプタフルオロイソプロピルー5-ピリミジニル基、2-ピラ
 ジニル基、3-メチルー2-ピラジニル基、5-メチルー2-ピラジニル基、
 6-メチルー2-ピラジニル基、3-エチルー2-ピラジニル基、5-エチルー
 2-ピラジニル基、6-エチルー2-ピラジニル基、3-プロピルー2-ピ
 ラジニル基、5-プロピルー2-ピラジニル基、6-プロピルー2-ピラジニ
 15 ル基、3-イソプロピルー2-ピラジニル基、5-イソプロピルー2-ピラジ
 ニル基、6-イソプロピルー2-ピラジニル基、3-ブチルー2-ピラジニル
 基、5-ブチルー2-ピラジニル基、6-ブチルー2-ピラジニル基、3-イ
 ソブチルー2-ピラジニル基、5-イソブチルー2-ピラジニル基、6-イソ
 ブチルー2-ピラジニル基、3-sec-ブチルー2-ピラジニル基、5-s
 20 ec-ブチルー2-ピラジニル基、6-sec-ブチルー2-ピラジニル基、
 3-tert-ブチルー2-ピラジニル基、5-tert-ブチルー2-ピラ
 ジニル基、6-tert-ブチルー2-ピラジニル基、3-ジフルオロメチルー
 2-ピラジニル基、5-ジフルオロメチルー2-ピラジニル基、6-ジフル
 オロメチルー2-ピラジニル基、3-トリフルオロメチルー2-ピラジニル基
 25 、5-トリフルオロメチルー2-ピラジニル基、6-トリフルオロメチルー2
 -ピラジニル基、3-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)-2-ピラジニル
 基、5-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)-2-ピラジニル基、6-(2,
 2, 2-トリフルオロエチル)-2-ピラジニル基、3-ペンタフルオロエ
 チルー2-ピラジニル基、5-ペンタフルオロエチルー2-ピラジニル基、6
 30 -ペンタフルオロエチルー2-ピラジニル基、3-ヘプタフルオロプロピルー
 2-ピラジニル基、5-ヘプタフルオロプロピルー2-ピラジニル基、6-ヘ
 プタフルオロプロピルー2-ピラジニル基、3-ヘプタフルオロイソプロピ
 ルー2-ピラジニル基、5-ヘプタフルオロイソプロピルー2-ピラジニル基、
 6-ヘプタフルオロイソプロピルー2-ピラジニル基、3-クロロ-2-ピラ
 35 ジニル基、3-シアノ-2-ピラジニル基、3-ニトロ-2-ピラジニル基、
 5-クロロ-2-ピラジニル基、5-シアノ-2-ピラジニル基、5-ニトロ
 -2-ピラジニル基、6-クロロ-2-ピラジニル基、4-(1, 2, 3-トリ
 アジニル)基、5-メチルー4-(1, 2, 3-トリアジニル)基、6-メ
 チルー4-(1, 2, 3-トリアジニル)基、5-エチルー4-(1, 2, 3
 40 -トリアジニル)基、6-エチルー4-(1, 2, 3-トリアジニル)基、5
 -プロピルー4-(1, 2, 3-トリアジニル)基、6-プロピルー4-(1
 , 2, 3-トリアジニル)基、5-イソプロピルー4-(1, 2, 3-トリア
 ジニル)基、6-イソプロピルー4-(1, 2, 3-トリアジニル)基、5-
 ブチルー4-(1, 2, 3-トリアジニル)基、6-ブチルー4-(1, 2,
 45 3-トリアジニル)基、5-イソブチルー4-(1, 2, 3-トリアジニル)
 基、6-イソブチルー4-(1, 2, 3-トリアジニル)基、5-sec-ブ

チル-4-(1, 2, 3-トリアジニル)基、6-sec-ブチル-4-(1, 2, 3-トリアジニル)基、5-tert-ブチル-4-(1, 2, 3-トリアジニル)基、6-tert-ブチル-4-(1, 2, 3-トリアジニル)基、5-ジフルオロメチル-4-(1, 2, 3-トリアジニル)基、6-ジフルオロメチル-4-(1, 2, 3-トリアジニル)基、5-トリフルオロメチル-4-(1, 2, 3-トリアジニル)基、6-トリフルオロメチル-4-(1, 2, 3-トリアジニル)基、5-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)-4-(1, 2, 3-トリアジニル)基、6-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)-4-(1, 2, 3-トリアジニル)基、5-ペンタフルオロエチル-4-(1, 2, 3-トリアジニル)基、6-ペンタフルオロエチル-4-(1, 2, 3-トリアジニル)基、5-ヘプタフルオロプロピル-4-(1, 2, 3-トリアジニル)基、6-ヘプタフルオロプロピル-4-(1, 2, 3-トリアジニル)基、5-ヘプタフルオロイソプロピル-4-(1, 2, 3-トリアジニル)基、6-ヘプタフルオロイソプロピル-4-(1, 2, 3-トリアジニル)基、5-(1, 2, 3-トリアジニル)基、4-メチル-5-(1, 2, 3-トリアジニル)基、4-エチル-5-(1, 2, 3-トリアジニル)基、4-プロピル-5-(1, 2, 3-トリアジニル)基、4-イソプロピル-5-(1, 2, 3-トリアジニル)基、4-ブチル-5-(1, 2, 3-トリアジニル)基、4-イソブチル-5-(1, 2, 3-トリアジニル)基、4-sec-ブチル-5-(1, 2, 3-トリアジニル)基、4-tert-ブチル-5-(1, 2, 3-トリアジニル)基、4-ジフルオロメチル-5-(1, 2, 3-トリアジニル)基、4-トリフルオロメチル-5-(1, 2, 3-トリアジニル)基、4-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)-5-(1, 2, 3-トリアジニル)基、4-ペンタフルオロエチル-5-(1, 2, 3-トリアジニル)基、4-ヘプタフルオロプロピル-5-(1, 2, 3-トリアジニル)基、4-ヘプタフルオロイソプロピル-5-(1, 2, 3-トリアジニル)基、3-(1, 2, 4-トリアジニル)基、5-メチル-3-(1, 2, 4-トリアジニル)基、6-メチル-3-(1, 2, 4-トリアジニル)基、5-エチル-3-(1, 2, 4-トリアジニル)基、6-エチル-3-(1, 2, 4-トリアジニル)基、5-プロピル-3-(1, 2, 4-トリアジニル)基、6-プロピル-3-(1, 2, 4-トリアジニル)基、5-イソプロピル-3-(1, 2, 4-トリアジニル)基、6-イソプロピル-3-(1, 2, 4-トリアジニル)基、5-ブチル-3-(1, 2, 4-トリアジニル)基、6-ブチル-3-(1, 2, 4-トリアジニル)基、5-イソブチル-3-(1, 2, 4-トリアジニル)基、6-イソブチル-3-(1, 2, 4-トリアジニル)基、5-sec-ブチル-3-(1, 2, 4-トリアジニル)基、6-sec-ブチル-3-(1, 2, 4-トリアジニル)基、5-tert-ブチル-3-(1, 2, 4-トリアジニル)基、6-tert-ブチル-3-(1, 2, 4-トリアジニル)基、5-ジフルオロメチル-3-(1, 2, 4-トリアジニル)基、6-ジフルオロメチル-3-(1, 2, 4-トリアジニル)基、5-トリフルオロメチル-3-(1, 2, 4-トリアジニル)基、6-トリフルオロメチル-3-(1, 2, 4-トリアジニル)基、5-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)-3-(1, 2, 4-トリアジニル)基、6-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)-3-(1, 2, 4-トリアジニル)基、5-ペンタフルオロエチル-3-(1, 2, 4-トリアジニル)基、6-ペンタフルオロエチル-3-(1, 2, 4-トリアジニル)基、5-ヘプタフルオ

ロブロピル-3-(1, 2, 4-トリアジニル)基、6-ヘプタフルオロブ
 ロピル-3-(1, 2, 4-トリアジニル)基、5-ヘプタフルオロイソブ
 ロピル-3-(1, 2, 4-トリアジニル)基、6-ヘプタフルオロイソブ
 ロピル-3-(1, 2, 4-トリアジニル)基、5-(1, 2, 4-トリアジニル)
 5 基、3-メチル-5-(1, 2, 4-トリアジニル)基、6-メチル-5-(
 1, 2, 4-トリアジニル)基、3-エチル-5-(1, 2, 4-トリアジニ
 ル)基、6-エチル-5-(1, 2, 4-トリアジニル)基、3-プロピル-
 5-(1, 2, 4-トリアジニル)基、6-プロピル-5-(1, 2, 4-ト
 リアジニル)基、3-イソプロピル-5-(1, 2, 4-トリアジニル)基、
 10 6-イソプロピル-5-
 (1, 2, 4-トリアジニル)基、3-ブチル-5-(1, 2, 4-トリアジ
 ニル)基、6-ブチル-5-(1, 2, 4-トリアジニル)基、3-イソブチ
 ル-5-(1, 2, 4-トリアジニル)基、6-イソブチル-5-(1, 2,
 4-トリアジニル)基、3-sec-ブチル-5-(1, 2, 4-トリアジニ
 15 ル)基、6-sec-ブチル-5-(1, 2, 4-トリアジニル)基、3-tert-
 ブチル-5-(1, 2, 4-トリアジニル)基、6-tert-ブチ
 ル-5-(1, 2, 4-トリアジニル)基、3-ジフルオロメチル-5-(1
 , 2, 4-トリアジニル)基、6-ジフルオロメチル-5-(1, 2, 4-ト
 リアジニル)基、3-トリフルオロメチル-5-(1, 2, 4-トリアジニ
 20)基、6-トリフルオロメチル-5-(1, 2, 4-トリアジニル)基、3-
 (2, 2, 2-トリフルオロエチル)-5-(1, 2, 4-トリアジニル)基
 、6-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)-5-(1, 2, 4-トリアジニ
 ル)基、3-ペンタフルオロエチル-5-(1, 2, 4-トリアジニル)基、
 6-ペンタフルオロエチル-5-(1, 2, 4-トリアジニル)基、3-ヘ
 25 タフルオロブロピル-5-(1, 2, 4-トリアジニル)基、6-ヘプタフル
 オロブロピル-5-(1, 2, 4-トリアジニル)基、3-ヘプタフルオロイ
 ソブロピル-5-(1, 2, 4-トリアジニル)基、6-ヘプタフルオロイソ
 ブロピル-5-(1, 2, 4-トリアジニル)基、6-(1, 2, 4-トリア
 ジニル)基、3-メチル-6-(1, 2, 4-トリアジニル)基、5-メチル
 30 -6-(1, 2, 4-トリアジニル)基、3-エチル-6-(1, 2, 4-トリ
 アジニル)基、5-エチル-6-(1, 2, 4-トリアジニル)基、3-ブ
 ロピル-6-(1, 2, 4-トリアジニル)基、5-プロピル-6-(1, 2
 , 4-トリアジニル)基、3-イソプロピル-6-(1, 2, 4-トリアジニ
 ル)基、5-イソプロピル-6-(1, 2, 4-トリアジニル)基、3-ブチ
 35 ル-6-(1, 2, 4-トリアジニル)基、5-ブチル-6-(1, 2, 4-ト
 リアジニル)基、3-イソブチル-6-(1, 2, 4-トリアジニル)基、
 5-イソブチル-6-(1, 2, 4-トリアジニル)基、3-sec-ブチル
 -6-(1, 2, 4-トリアジニル)基、5-sec-ブチル-6-(1, 2
 , 4-トリアジニル)基、3-tert-ブチル-6-(1, 2, 4-トリア
 40 ジニル)基、5-tert-ブチル-6-(1, 2, 4-トリアジニル)基、
 3-ジフルオロメチル-6-(1, 2, 4-トリアジニル)基、5-ジフルオ
 ロメチル-6-(1, 2, 4-トリアジニル)基、3-トリフルオロメチル-
 6-(1, 2, 4-トリアジニル)基、5-トリフルオロメチル-6-(1,
 2, 4-トリアジニル)基、3-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)-6-
 45 (1, 2, 4-トリアジニル)基、5-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)
 -6-(1, 2, 4-トリアジニル)基、3-ペンタフルオロエチル-6-(

1, 2, 4-トリアジニル) 基、5-ペンタフルオロエチル-6-(1, 2, 4-トリアジニル) 基、3-ヘプタフルオロプロピル-6-(1, 2, 4-トリアジニル) 基、5-ヘプタフルオロプロピル-6-(1, 2, 4-トリアジニル) 基、3-ヘプタフルオロイソプロピル-6-(1, 2, 4-トリアジニル) 基、5-ヘプタフルオロイソプロピル-6-(1, 2, 4-トリアジニル) 基、2-(1, 3, 5-トリアジニル) 基、4-クロロ-2-(1, 3, 5-トリアジニル) 基、4, 6-ジクロロ-2-(1, 3, 5-トリアジニル) 基、4-メチル-2-(1, 3, 5-トリアジニル) 基、4-エチル-2-(1, 3, 5-トリアジニル) 基、4-プロピル-2-(1, 3, 5-トリアジニル) 基、4-ブチル-2-(1, 3, 5-トリアジニル) 基、4-イソブチル-2-(1, 3, 5-トリアジニル) 基、4-sec-ブチル-2-(1, 3, 5-トリアジニル) 基、4-tert-ブチル-2-(1, 3, 5-トリアジニル) 基、4-ジフルオロメチル-2-(1, 3, 5-トリアジニル) 基、4-トリフルオロメチル-2-(1, 3, 5-トリアジニル) 基、4-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)-2-(1, 3, 5-トリアジニル) 基、4-ペンタフルオロエチル-2-(1, 3, 5-トリアジニル) 基、4-ヘプタフルオロプロピル-2-(1, 3, 5-トリアジニル) 基および4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-(1, 3, 5-トリアジニル) 基等が挙げられる。

[0048]

本発明化合物における「6員芳香族複素環C1-C3アルキル基」としては、例えば2-ピリジルメチル基、2-(2-ピリジル)エチル基、1-(2-ピリジル)プロピル基、3-ピリジルメチル基、4-ピリジルメチル基、3-ピリダジニルメチル基、2-ピリミジニルメチル基、2-ピラジニルメチル基および1-[4-(1, 2, 3-トリアジニル)]エチル基等が挙げられる。

[0049]

本発明化合物における「6員芳香族複素環部分が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよい6員芳香族複素環C1-C3アルキル基」としては、例えば2-ピリジルメチル基、3-フルオロ-2-ピリジルメチル基、5-クロロ-2-ピリジルメチル基、5-トリフルオロメチル-2-ピリジルメチル基、2-(4-クロロ-2-ピリジル)エチル基、1-(5-ブロモ-2-ピリジル)プロピル基、6-ブロモ-2-ピリジルメチル基、3-ヨード-2-ピリジルメチル基、4-シアノ-2-ピリジルメチル基、5-ニトロ-2-ピリジルメチル基、6-メチル-2-ピリジルメチル基、3-ジフルオロメチル-2-ピリジルメチル基、4-トリフルオロメチル-2-ピリジルメチル基、3-ピリジルメチル基、6-クロロ-3-ピリジルメチル基、4-ピリジルメチル基、2-クロロ-4-ピリジルメチル基、4-メチル-3-ピリダジニルメチル基、6-ジフルオロメチル-3-ピリダジニルメチル基、4-トリフルオロメチル-3-ピリダジニルメチル基、4-メチル-2-ピリミジニルメチル基、5-ジフルオロメチル-2-ピリミジニルメチル基、5-トリフルオロメチル-2-ピリミジニルメチル基、5-イソプロピル-2-ピラジニルメチル基、5-ジフルオロメチル-2-ピラジニルメチル基、6-トリフルオロメチル-2-ピラジニルメチル基、3-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)-2-ピラジニルメチル基および1-[5-tert-ブチル-4-(1, 2, 3-トリアジニル)]エチル基等が挙げられる。

[0050]

本発明化合物における「群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいピリジル基」としては、例えば2-ピリジル基、3-フルオロ-2-ピリジル基、4-フルオロ-2-ピリジル基、5-フルオロ-2-ピリジル基、6-フルオロ-2-ピリジル基、3-クロロ-2-ピリジル基、4-クロロ-2-ピリジル基、5-クロロ-2-ピリジル基、6-クロロ-2-ピリジル基、3-ブロモ-2-ピリジル基、4-ブロモ-2-ピリジル基、5-ブロモ-2-ピリジル基、6-ブロモ-2-ピリジル基、3-ヨード-2-ピリジル基、4-ヨード-2-ピリジル基、5-ヨード-2-ピリジル基、6-ヨード-2-ピリジル基、3-シアノ-2-ピリジル基、4-シアノ-2-ピリジル基、5-シアノ-2-ピリジル基、6-シアノ-2-ピリジル基、3-ニトロ-2-ピリジル基、4-ニトロ-2-ピリジル基、5-ニトロ-2-ピリジル基、6-ニトロ-2-ピリジル基、3-メチル-2-ピリジル基、4-メチル-2-ピリジル基、5-メチル-2-ピリジル基、6-メチル-2-ピリジル基、3-エチル-2-ピリジル基、4-エチル-2-ピリジル基、5-エチル-2-ピリジル基、6-エチル-2-ピリジル基、3-プロピル-2-ピリジル基、4-プロピル-2-ピリジル基、5-プロピル-2-ピリジル基、6-プロピル-2-ピリジル基、3-イソプロピル-2-ピリジル基、4-イソプロピル-2-ピリジル基、5-イソプロピル-2-ピリジル基、6-イソプロピル-2-ピリジル基、3-ブチル-2-ピリジル基、4-ブチル-2-ピリジル基、5-ブチル-2-ピリジル基、6-ブチル-2-ピリジル基、3-イソブチル-2-ピリジル基、4-イソブチル-2-ピリジル基、5-イソブチル-2-ピリジル基、6-イソブチル-2-ピリジル基、3-sec-ブチル-2-ピリジル基、4-sec-ブチル-2-ピリジル基、5-sec-ブチル-2-ピリジル基、6-sec-ブチル-2-ピリジル基、3-tert-ブチル-2-ピリジル基、4-tert-ブチル-2-ピリジル基、5-tert-ブチル-2-ピリジル基、6-tert-ブチル-2-ピリジル基、3-ジフルオロメチル-2-ピリジル基、4-ジフルオロメチル-2-ピリジル基、5-ジフルオロメチル-2-ピリジル基、6-ジフルオロメチル-2-ピリジル基、3-トリフルオロメチル-2-ピリジル基、4-トリフルオロメチル-2-ピリジル基、5-トリフルオロメチル-2-ピリジル基、6-トリフルオロメチル-2-ピリジル基、3-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)-2-ピリジル基、4-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)-2-ピリジル基、5-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)-2-ピリジル基、6-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)-2-ピリジル基、3-ペンタフルオロエチル-2-ピリジル基、4-ペンタフルオロエチル-2-ピリジル基、5-ペンタフルオロエチル-2-ピリジル基、6-ペンタフルオロエチル-2-ピリジル基、3-ヘプタフルオロプロピル-2-ピリジル基、4-ヘプタフルオロプロピル-2-ピリジル基、5-ヘプタフルオロプロピル-2-ピリジル基、6-ヘプタフルオロプロピル-2-ピリジル基、3-ヘプタフルオロイソプロピル-2-ピリジル基、4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-ピリジル基、5-ヘプタフルオロイソプロピル-2-ピリジル基、6-ヘプタフルオロイソプロピル-2-ピリジル基、3-ピリジル基、2-メチル-3-ピリジル基、4-メチル-3-ピリジル基、5-メチル-3-ピリジル基、6-メチル-3-ピリジル基、2-エチル-3-ピリジル基、4-エチル-3-ピリジル基、5-エチル-3-ピリジル基、6-エチル-3-ピリジル基、2-プロピル-3-ピリジル基、4-プロピル-3-ピリジル基、5-プロピル-3-ピリジル基、6-プロピル-3-ピリジル基、

ルー 3-ピリジル基、2-イソプロピル-3-ピリジル基、4-イソプロピル-
 3-ピリジル基、5-イソプロピル-3-ピリジル基、6-イソプロピル-
 3-ピリジル基、2-ブチル-3-ピリジル基、4-ブチル-3-ピリジル基、
 5-ブチル-3-ピリジル基、6-ブチル-3-ピリジル基、2-イソブチル-
 3-ピリジル基、4-イソブチル-3-ピリジル基、5-イソブチル-3-
 5 ピリジル基、6-イソブチル-3-ピリジル基、2-sec-ブチル-3-
 ピリジル基、4-sec-ブチル-3-ピリジル基、5-sec-ブチル-3-
 ピリジル基、6-sec-ブチル-3-ピリジル基、2-tert-ブチル-
 3-ピリジル基、4-tert-ブチル-3-ピリジル基、5-tert-
 10 ブチル-3-ピリジル基、6-tert-ブチル-3-ピリジル基、2-ジフル
 ルオロメチル-3-ピリジル基、4-ジフルオロメチル-3-ピリジル基、5-
 ジフルオロメチル-3-ピリジル基、6-ジフルオロメチル-3-ピリジル
 基、2-トリフルオロメチル-3-ピリジル基、4-トリフルオロメチル-3-
 15 ピリジル基、5-トリフルオロメチル-3-ピリジル基、6-トリフルオロ
 メチル-3-ピリジル基、2-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)-3-ピ
 リジル基、4-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)-3-ピリジル基、5-
 (2, 2, 2-トリフルオロエチル)-3-ピリジル基、6-(2, 2, 2-
 20 トリフルオロエチル)-3-ピリジル基、2-ペンタフルオロエチル-3-ピ
 リジル基、4-ペンタフルオロエチル-3-ピリジル基、5-ペンタフルオロ
 エチル-3-ピリジル基、6-ペンタフルオロエチル-3-ピリジル基、2-
 ヘプタフルオロプロピル-3-ピリジル基、4-ヘプタフルオロプロピル-3-
 25 ピリジル基、5-ヘプタフルオロプロピル-3-ピリジル基、6-ヘプタフ
 ルオロプロピル-3-ピリジル基、2-ヘプタフルオロイソプロピル-3-ピ
 リジル基、4-ヘプタフルオロイソプロピル-3-ピリジル基、5-ヘプタフ
 ルオロイソプロピル-3-ピリジル基、6-ヘプタフルオロイソプロピル-3-
 30 ピリジル基、4-ピリジル基、2-メチル-4-ピリジル基、3-メチル-
 4-ピリジル基、2-エチル-4-ピリジル基、3-エチル-4-ピリジル基
 、2-プロピル-4-ピリジル基、3-プロピル-4-ピリジル基、2-イソ
 プロピル-4-ピリジル基、3-イソプロピル-4-ピリジル基、2-ブチル
 35 -4-ピリジル基、3-ブチル-4-ピリジル基、2-イソブチル-4-ピリ
 ジル基、3-イソブチル-4-ピリジル基、2-sec-ブチル-4-ピリジ
 ル基、3-sec-ブチル-4-ピリジル基、2-tert-ブチル-4-ピリ
 ジル基、3-tert-ブチル-4-ピリジル基、2-ジフルオロメチル-
 4-ピリジル基、3-ジフルオロメチル-4-ピリジル基、2-トリフルオロ
 40 メチル-4-ピリジル基、3-トリフルオロメチル-4-ピリジル基、2-(
 2, 2, 2-トリフルオロエチル)-4-ピリジル基、3-(2, 2, 2-トリ
 フルオロエチル)-4-ピリジル基、2-ペンタフルオロエチル-4-ピリ
 ジル基、3-ペンタフルオロエチル-4-ピリジル基、2-ヘプタフルオロ
 プロピル-4-ピリジル基、3-ヘプタフルオロプロピル-4-ピリジル基、2-
 45 ヘプタフルオロイソプロピル-4-ピリジル基および3-ヘプタフルオロイ
 ソプロピル-4-ピリジル基等が挙げられる。

[0051]

本発明化合物における「ピリジルC1-C3アルキル基」としては、例えば2-
 45 ピリジルメチル基、3-ピリジルメチル基、4-ピリジルメチル基、2-(
 2-ピリジル)エチル基および1-(2-ピリジル)プロピル基等が挙げられ
 る。

[0052]

本発明化合物における「ピリジン環部分が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいピリジルC1-C3アルキル基」としては、例えば2-ピリジルメチル基、3-ピリジルメチル基、4-ピリジルメチル基、(3-フルオロ-2-ピリジル)メチル基、(5-クロロ-2-ピリジル)メチル基、2-(4-クロロ-2-ピリジル)エチル基、1-(5-ブロモ-2-ピリジル)プロピル基、(6-ブロモ-2-ピリジル)メチル基、(3-ヨード-2-ピリジル)メチル基、(4-シアノ-2-ピリジル)メチル基、(5-ニトロ-2-ピリジル)メチル基、(6-メチル-2-ピリジル)メチル基、(3-ジフルオロメチル-2-ピリジル)メチル基および(4-トリフルオロメチル-2-ピリジル)メチル基、(5-トリフルオロメチル-2-ピリジル)メチル基、(6-クロロ-3-ピリジル)メチル基および(2-クロロ-4-ピリジル)メチル基等が挙げられる。

[0053]

本発明化合物における「群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいピリミジニル基」としては、例えば2-ピリミジニル基、4-メチル-2-ピリミジニル基、5-メチル-2-ピリミジニル基、4-エチル-2-ピリミジニル基、5-エチル-2-ピリミジニル基、4-プロピル-2-ピリミジニル基、5-プロピル-2-ピリミジニル基、4-イソプロピル-2-ピリミジニル基、5-イソプロピル-2-ピリミジニル基、4-ブチル-2-ピリミジニル基、5-ブチル-2-ピリミジニル基、4-イソブチル-2-ピリミジニル基、5-イソブチル-2-ピリミジニル基、4-sec-ブチル-2-ピリミジニル基、5-sec-ブチル-2-ピリミジニル基、4-tert-ブチル-2-ピリミジニル基、5-tert-ブチル-2-ピリミジニル基、4-ジフルオロメチル-2-ピリミジニル基、5-ジフルオロメチル-2-ピリミジニル基、4-トリフルオロメチル-2-ピリミジニル基、5-トリフルオロメチル-2-ピリミジニル基、4-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)-2-ピリミジニル基、5-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)-2-ピリミジニル基、4-ペンタフルオロエチル-2-ピリミジニル基、5-ペンタフルオロエチル-2-ピリミジニル基、4-ヘプタフルオロプロピル-2-ピリミジニル基、5-ヘプタフルオロプロピル-2-ピリミジニル基、4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-ピリミジニル基、5-ヘプタフルオロイソプロピル-2-ピリミジニル基、4-ピリミジニル基、2-メチル-4-ピリミジニル基、5-メチル-4-ピリミジニル基、6-メチル-4-ピリミジニル基、2-エチル-4-ピリミジニル基、5-エチル-4-ピリミジニル基、6-エチル-4-ピリミジニル基、2-プロピル-4-ピリミジニル基、5-プロピル-4-ピリミジニル基、6-プロピル-4-ピリミジニル基、2-イソプロピル-4-ピリミジニル基、5-イソプロピル-4-ピリミジニル基、6-イソプロピル-4-ピリミジニル基、2-ブチル-4-ピリミジニル基、5-ブチル-4-ピリミジニル基、6-ブチル-4-ピリミジニル基、2-イソブチル-4-ピリミジニル基、5-イソブチル-4-ピリミジニル基、6-イソブチル-4-ピリミジニル基、2-sec-ブチル-4-ピリミジニル基、5-sec-ブチル-4-ピリミジニル基、6-sec-ブチル-4-ピリミジニル基、2-tert-ブチル-4-ピリミジニル基、5-tert-ブチル-4-ピリミジニル基、6-tert-ブチル-4-ピリミジニル基、2-ジフルオロメチル-4-ピリミジニル基、5-ジフルオロメチル-4-ピリミジニル基、6

ジフルオロメチル-4-ピリミジニル基、2-トリフルオロメチル-4-ピリミジニル基、5-トリフルオロメチル-4-ピリミジニル基、6-トリフルオロメチル-4-ピリミジニル基、2-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)-4-ピリミジニル基、5-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)-4-ピリミジニル基、6-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)-4-ピリミジニル基、2-ペンタフルオロエチル-4-ピリミジニル基、5-ペンタフルオロエチル-4-ピリミジニル基、6-ペンタフルオロエチル-4-ピリミジニル基、2-ヘプタフルオロプロピル-4-ピリミジニル基、5-ヘプタフルオロプロピル-4-ピリミジニル基、6-ヘプタフルオロプロピル-4-ピリミジニル基、2-ヘプタフルオロイソプロピル-4-ピリミジニル基、5-ヘプタフルオロイソプロピル-4-ピリミジニル基、6-ヘプタフルオロイソプロピル-4-ピリミジニル基、5-ピリミジニル基、2-メチル-5-ピリミジニル基、4-メチル-5-ピリミジニル基、2-エチル-5-ピリミジニル基、4-エチル-5-ピリミジニル基、2-プロピル-5-ピリミジニル基、4-プロピル-5-ピリミジニル基、2-イソプロピル-5-ピリミジニル基、4-イソプロピル-5-ピリミジニル基、2-ブチル-5-ピリミジニル基、4-ブチル-5-ピリミジニル基、2-イソブチル-5-ピリミジニル基、4-イソブチル-5-ピリミジニル基、2-sec-ブチル-5-ピリミジニル基、4-sec-ブチル-5-ピリミジニル基、2-tert-ブチル-5-ピリミジニル基、4-tert-ブチル-5-ピリミジニル基、2-ジフルオロメチル-5-ピリミジニル基、4-ジフルオロメチル-5-ピリミジニル基、2-トリフルオロメチル-5-ピリミジニル基、4-トリフルオロメチル-5-ピリミジニル基、2-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)-5-ピリミジニル基、4-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)-5-ピリミジニル基、2-ペンタフルオロエチル-5-ピリミジニル基、4-ペンタフルオロエチル-5-ピリミジニル基、2-ヘプタフルオロプロピル-5-ピリミジニル基、4-ヘプタフルオロプロピル-5-ピリミジニル基、2-ヘプタフルオロイソプロピル-5-ピリミジニル基および4-ヘプタフルオロイソプロピル-5-ピリミジニル基等が挙げられる。

[0054]

本発明化合物における「5員芳香族複素環基」としては、例えば1-ピラゾリル基、3-ピラゾリル基、4-ピラゾリル基、5-ピラゾリル基、1-イミダゾリル基、2-イミダゾリル基、1-ピロリル基、2-ピロリル基、3-ピロリル基、1-(1, 2, 4-トリアゾリル)基、1-(1, 2, 3, 4-テトラゾリル)基、1-(1, 2, 3, 5-テトラゾリル)基、2-フリル基、3-フリル基、2-チエニル基、3-チエニル基、3-イソキサゾリル基、4-イソキサゾリル基および5-イソキサゾリル基、等が挙げられる。

[0055]

本発明化合物における「群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよい5員芳香族複素環基」としては、例えば1-ピラゾリル基、3-クロロ-1-ピラゾリル基、3-ブロモ-1-ピラゾリル基、3-ニトロ-1-ピラゾリル基、3-メチル-1-ピラゾリル基、3-トリフルオロメチル-1-ピラゾリル基、4-メチル-1-ピラゾリル基、4-クロロ-1-ピラゾリル基、4-ブロモ-1-ピラゾリル基、4-シアノ-1-ピラゾリル基、1-メチル-3-ピラゾリル基、1-ジフルオロメチル-3-ピラゾリル基、1, 5-ジメチル-3-ピラゾリル基および1, 4-ジメチル-5-ピラゾリル基、3, 5-ジ

メチルー1-ピラゾリル基、1-イミダゾリル基、4-トリフルオロメチルー
 1-イミダゾリル基、1-ピロリル基、2-フルオロ-1-ピロリル基、3-
 シアノー1-ピロリル基、2-メチルー1-ピロリル基、3-トリフルオロメ
 チルー1-ピロリル基、3-ニトロ-1-ピロリル基、2-ピロリル基、3-
 5 フルオロ-2-ピロリル基、4-フルオロ-2-ピロリル基、5-フルオロ-
 2-ピロリル基、3-クロロ-2-ピロリル基、4-クロロ-2-ピロリル基
 、5-クロロ-2-ピロリル基、3-ブromo-2-ピロリル基、4-ブromo-
 2-ピロリル基、5-ブromo-2-ピロリル基、3-ヨード-2-ピロリル基
 、4-ヨード-2-ピロリル基、5-ヨード-2-ピロリル基、3-シアノー
 10 2-ピロリル基、4-シアノー2-ピロリル基、5-シアノー2-ピロリル基
 、3-ニトロ-2-ピロリル基、4-ニトロ-2-ピロリル基、5-ニトロ-
 2-ピロリル基、3-メチルー2-ピロリル基、4-メチルー2-ピロリル基
 、5-メチルー2-ピロリル基、3-エチルー2-ピロリル基、4-エチルー
 2-ピロリル基、5-エチルー2-ピロリル基、3-プロピル-2-ピロリル
 15 基、4-プロピル-2-ピロリル基、5-プロピル-2-ピロリル基、3-イ
 ソプロピル-2-ピロリル基、4-イソプロピル-2-ピロリル基、5-イソ
 プロピル-2-ピロリル基、3-tert-ブチル-2-ピロリル基、4-tert-
 20 基、5-tert-ブチル-2-ピロリル基、3-ジフルオロメチルー2-ピロリル
 基、4-ジフルオロメチルー2-ピロリル基、5-ジフルオロメチルー2-ピロリル
 基、3-トリフルオロメチルー2-ピロリル基、4-トリフルオロメチルー2-
 25 基、5-トリフルオロメチルー2-ピロリル基、2-フルオロ-3-ピロリル基、
 4-フルオロ-3-ピロリル基、5-フルオロ-3-ピロリル基、2-クロロ-
 3-ピロリル基、4-クロロ-3-ピロリル基、5-クロロ-3-ピロリル
 基、2-ブromo-3-ピロリル基、4-ブromo-3-ピロリル基、5-ブromo-
 3-ピロリル基、2-ヨード-3-ピロリル基、4-ヨード-3-ピロリル
 基、5-ヨード-3-ピロリル基、2-シアノー3-ピロリル基、4-シアノー
 3-ピロリル基、5-シアノー3-ピロリル基、2-ニトロ-3-ピロリル
 30 基、4-ニトロ-3-ピロリル基、5-ニトロ-3-ピロリル基、2-メチルー
 3-ピロリル基、4-メチルー3-ピロリル基、5-メチルー3-ピロリル
 基、2-エチルー3-ピロリル基、4-エチルー3-ピロリル基、5-エチルー
 3-ピロリル基、2-プロピル-3-ピロリル基、4-プロピル-3-ピロリル
 基、5-プロピル-3-ピロリル基、2-イソプロピル-3-ピロリル基
 、4-イソプロピル-3-ピロリル基、5-イソプロピル-3-ピロリル基、
 35 2-tert-ブチル-3-ピロリル基、4-tert-ブチル-3-ピロリル
 基、5-tert-ブチル-3-ピロリル基、2-ジフルオロメチルー3-
 ピロリル基、4-ジフルオロメチルー3-ピロリル基、5-ジフルオロメチルー
 3-ピロリル基、2-トリフルオロメチルー3-ピロリル基、4-トリフル
 オロメチルー3-ピロリル基、5-トリフルオロメチルー3-ピロリル基、1-
 40 (1, 2, 4-トリアゾリル)基、3-クロロ-1-(1, 2, 4-トリア
 ズリル)基、1-(1, 2, 3, 4-テトラゾリル)基、1-(1, 2, 3,
 5-テトラゾリル)基、2-フリル基、3-クロロ-2-フリル基、5-ブromo-
 2-フリル基、3-ヨード-2-フリル基、4-シアノー2-フリル基、
 5-ニトロ-2-フリル基、3-メチルー2-フリル基、4-tert-ブチ
 45 ル-2-フリル基、5-メチルー2-フリル基、5-トリフルオロメチルー2-
 フリル基、3-フリル基、2-フルオロ-3-フリル基、4-クロロ-3-

フリル基、2-ブロモ-3-フリル基、5-ブロモ-3-フリル基、2-ヨード-3-フリル基、4-シアノ-3-フリル基、4-ニトロ-3-フリル基、
 2-メチル-3-フリル基、2-tert-ブチル-3-フリル基、4-ジフル
 5 フルオロメチル-3-フリル基、5-ジフルオロメチル-3-フリル基、2-トリフルオロメチル-3-フリル基、4-トリフルオロメチル-3-フリル基、
 5-トリフルオロメチル-3-フリル基、2-チエニル基、3-フルオロ-2-チエニル基、4-フルオロ-2-チエニル基、5-フルオロ-2-チエニル
 10 基、3-クロロ-2-チエニル基、4-クロロ-2-チエニル基、5-クロロ-2-チエニル基、3-ブロモ-2-チエニル基、4-ブロモ-2-チエニル
 基、5-ブロモ-2-チエニル基、3-ヨード-2-チエニル基、4-ヨード-2-チエニル基、5-ヨード-2-チエニル基、3-シアノ-2-チエニル
 15 基、4-シアノ-2-チエニル基、5-シアノ-2-チエニル基、3-ニトロ-2-チエニル基、4-ニトロ-2-チエニル基、5-ニトロ-2-チエニル
 基、3-メチル-2-チエニル基、4-メチル-2-チエニル基、5-メチル-2-チエニル基、3-エチル-2-チエニル基、4-エチル-2-チエニル
 20 基、5-エチル-2-チエニル基、3-プロピル-2-チエニル基、4-プロピル-2-チエニル基、5-プロピル-2-チエニル基、3-イソプロピル-2-チエニル
 基、4-イソプロピル-2-チエニル基、5-イソプロピル-2-チエニル基、3-tert-ブチル-2-チエニル基、4-tert-ブチ
 25 ル-2-チエニル基、5-tert-ブチル-2-チエニル基、3-ジフルオロメチル-2-チエニル基、4-ジフルオロメチル-2-チエニル基、5-ジ
 フルオロメチル-2-チエニル基、3-トリフルオロメチル-2-チエニル基、4-トリフルオロメチル-2-チエニル基、5-トリフルオロメチル-2-チエニル
 30 基、3-チエニル基、2-フルオロ-3-チエニル基、4-フルオロ-3-チエニル基、5-フルオロ-3-チエニル基、2-クロロ-3-チエニル
 基、4-クロロ-3-チエニル基、5-クロロ-3-チエニル基、2-ブロモ-3-チエニル基、4-ブロモ-3-チエニル基、5-ブロモ-3-チエニ
 35 ル基、2-ヨード-3-チエニル基、4-ヨード-3-チエニル基、5-ヨード-3-チエニル基、2-シアノ-3-チエニル基、4-シアノ-3-チエニ
 ル基、5-シアノ-3-チエニル基、2-ニトロ-3-チエニル基、4-ニトロ-3-チエニル基、5-ニトロ-3-チエニル基、2-メチル-3-チエニ
 40 ル基、4-メチル-3-チエニル基、5-メチル-3-チエニル基、2-エチル-3-チエニル基、4-エチル-3-チエニル基、5-エチル-3-チエニ
 ル基、2-プロピル-3-チエニル基、4-プロピル-3-チエニル基、5-プロピル-3-チエニル基、2-イソプロピル-3-チエニル基、4-イソプロ
 45 ピル-3-チエニル基、5-イソプロピル-3-チエニル基、2-tert-ブチル-3-チエニル基、4-tert-ブチル-3-チエニル基、5-tert-
 基、2-tert-ブチル-3-チエニル基、2-ジフルオロメチル-3-チエニル基、4-ジフルオロメチル-3-チエニル基、5-ジフルオロメチル-3-チエニ
 50 ル基、2-トリフルオロメチル-3-チエニル基、4-トリフルオロメチル-3-チエニル基、5-トリフルオロメチル-3-チエニル基、2, 5-ジクロ
 ロ-3-チエニル基、3-イソオキサゾリル基、4-クロロ-3-イソキサゾ
 55 リル基、5-クロロ-3-イソキサゾリル基、3-ブロモ-4-イソキサゾリル基、5-ブロモ-4-イソキサゾリル基、3-ニトロ-5-イソキサゾリル
 基、4-ニトロ-5-イソキサゾリル基、4-メチル-3-イソキサゾリル基、5-メチル-3-イソキサゾリル基、3-トリフルオロメチル-4-イソキ

サゾリル基、5-トリフルオロメチル-4-イソキサゾリル基、3-メチル-5-イソキサゾリル基および4-メチル-5-イソキサゾリル基等が挙げられる。

[0056]

- 5 本発明化合物における「群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいチエニル基」としては、例えば2-チエニル基、3-フルオロ-2-チエニル基、4-フルオロ-2-チエニル基、5-フルオロ-2-チエニル基、3-クロロ-2-チエニル基、4-クロロ-2-チエニル基、5-クロロ-2-チエニル基、3-ブromo-2-チエニル基、4-ブromo-2-チエニル基、5-ブromo-2-チエニル基、3-ヨード-2-チエニル基、4-ヨード-2-チエニル基、5-ヨード-2-チエニル基、3-シアノ-2-チエニル基、4-シアノ-2-チエニル基、5-シアノ-2-チエニル基、3-ニトロ-2-チエニル基、4-ニトロ-2-チエニル基、5-ニトロ-2-チエニル基、3-メチル-2-チエニル基、4-メチル-2-チエニル基、5-メチル-2-チエニル基、3-エチル-2-チエニル基、4-エチル-2-チエニル基、5-エチル-2-チエニル基、3-プロピル-2-チエニル基、4-プロピル-2-チエニル基、5-プロピル-2-チエニル基、3-イソプロピル-2-チエニル基、4-イソプロピル-2-チエニル基、5-イソプロピル-2-チエニル基、3-tert-ブチル-2-チエニル基、4-tert-ブチル-2-チエニル基、5-tert-ブチル-2-チエニル基、3-ジフルオロメチル-2-チエニル基、4-ジフルオロメチル-2-チエニル基、5-ジフルオロメチル-2-チエニル基、3-トリフルオロメチル-2-チエニル基、4-トリフルオロメチル-2-チエニル基、5-トリフルオロメチル-2-チエニル基、3-チエニル基、2-フルオロ-3-チエニル基、4-フルオロ-3-チエニル基、5-フルオロ-3-チエニル基、2-クロロ-3-チエニル基、4-クロロ-3-チエニル基、5-クロロ-3-チエニル基、2-ブromo-3-チエニル基、4-ブromo-3-チエニル基、5-ブromo-3-チエニル基、2-ヨード-3-チエニル基、4-ヨード-3-チエニル基、5-ヨード-3-チエニル基、2-シアノ-3-チエニル基、4-シアノ-3-チエニル基、5-シアノ-3-チエニル基、2-ニトロ-3-チエニル基、4-ニトロ-3-チエニル基、5-ニトロ-3-チエニル基、2-メチル-3-チエニル基、4-メチル-3-チエニル基、5-メチル-3-チエニル基、2-エチル-3-チエニル基、4-エチル-3-チエニル基、5-エチル-3-チエニル基、2-プロピル-3-チエニル基、4-プロピル-3-チエニル基、5-プロピル-3-チエニル基、2-イソプロピル-3-チエニル基、4-イソプロピル-3-チエニル基、5-イソプロピル-3-チエニル基、2-tert-ブチル-3-チエニル基、4-tert-ブチル-3-チエニル基、5-tert-ブチル-3-チエニル基、2-ジフルオロメチル-3-チエニル基、4-ジフルオロメチル-3-チエニル基、5-ジフルオロメチル-3-チエニル基、2-トリフルオロメチル-3-チエニル基、4-トリフルオロメチル-3-チエニル基、5-トリフルオロメチル-3-チエニル基および2, 5-ジクロロ-3-チエニル基等が挙げられる。

[0057]

- 45 本発明化合物における「群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいピロリル基」としては、例えば1-ピロリル基、2-フルオロ-1-ピロリル基、3-シ

アノー１－ピロリル基、２－メチル－１－ピロリル基、３－トリフルオロメチル－１－ピロリル基、３－ニトロ－１－ピロリル基、２－ピロリル基、３－フルオロ－２－ピロリル基、４－フルオロ－２－ピロリル基、５－フルオロ－２－ピロリル基、３－クロロ－２－ピロリル基、４－クロロ－２－ピロリル基、
 5 ５－クロロ－２－ピロリル基、３－ブromo－２－ピロリル基、４－ブromo－２－ピロリル基、５－ブromo－２－ピロリル基、３－ヨード－２－ピロリル基、４－ヨード－２－ピロリル基、５－ヨード－２－ピロリル基、３－シアノ－２－ピロリル基、４－シアノ－２－ピロリル基、５－シアノ－２－ピロリル基、
 10 ３－ニトロ－２－ピロリル基、４－ニトロ－２－ピロリル基、５－ニトロ－２－ピロリル基、３－メチル－２－ピロリル基、４－メチル－２－ピロリル基、５－メチル－２－ピロリル基、３－エチル－２－ピロリル基、４－エチル－２－ピロリル基、５－エチル－２－ピロリル基、
 15 ３－プロピル－２－ピロリル基、４－プロピル－２－ピロリル基、５－プロピル－２－ピロリル基、３－イソプロピル－２－ピロリル基、４－イソプロピル－２－ピロリル基、５－イソプロピル－２－ピロリル基、
 20 ３－tert-ブチル－２－ピロリル基、４－tert-ブチル－２－ピロリル基、５－tert-ブチル－２－ピロリル基、３－ジフルオロメチル－２－ピロリル基、４－ジフルオロメチル－２－ピロリル基、
 25 ５－ジフルオロメチル－２－ピロリル基、３－トリフルオロメチル－２－ピロリル基、４－トリフルオロメチル－２－ピロリル基、５－トリフルオロメチル－２－ピロリル基、
 30 ３－ピロリル基、２－フルオロ－３－ピロリル基、４－フルオロ－３－ピロリル基、５－フルオロ－３－ピロリル基、２－クロロ－３－ピロリル基、
 35 ４－クロロ－３－ピロリル基、５－クロロ－３－ピロリル基、２－ブromo－３－ピロリル基、４－ブromo－３－ピロリル基、５－ブromo－３－ピロリル基、
 2－ヨード－３－ピロリル基、４－ヨード－３－ピロリル基、５－ヨード－３－ピロリル基、２－シアノ－３－ピロリル基、４－シアノ－３－ピロリル基、
 5－シアノ－３－ピロリル基、２－ニトロ－３－ピロリル基、４－ニトロ－３－ピロリル基、５－ニトロ－３－ピロリル基、
 2－メチル－３－ピロリル基、４－メチル－３－ピロリル基、５－メチル－３－ピロリル基、
 2－エチル－３－ピロリル基、４－エチル－３－ピロリル基、５－エチル－
 3 ３－ピロリル基、２－プロピル－３－ピロリル基、４－プロピル－３－ピロリル基、
 5 ５－プロピル－３－ピロリル基、２－イソプロピル－３－ピロリル基、
 4 ４－イソプロピル－３－ピロリル基、５－イソプロピル－３－ピロリル基、
 2 ２－tert-ブチル－３－ピロリル基、４－tert-ブチル－３－ピロリル基、
 5 ５－tert-ブチル－３－ピロリル基、２－ジフルオロメチル－３－ピロリル基、
 4 ４－ジフルオロメチル－３－ピロリル基、５－ジフルオロメチル－
 3 ３－ピロリル基、２－トリフルオロメチル－３－ピロリル基、
 4 ４－トリフルオロメチル－３－ピロリル基および
 5 ５－トリフルオロメチル－３－ピロリル基等
 が挙げられる。

[0058]

本発明化合物における「群Yより選ばれる１個以上の基を有していてもよいピラゾリル基」としては、例えば１－ピラゾリル基、３－クロロ－１－ピラゾリル基、
 3 ３－ブromo－１－ピラゾリル基、３－ニトロ－１－ピラゾリル基、３－メチル－１－ピラゾリル基、
 4 ４－メチル－１－ピラゾリル基、４－クロロ－１－ピラゾリル基、４－ブromo－
 1 １－ピラゾリル基、４－シアノ－１－ピラゾリル基、
 45 1 １－メチル－３－ピラゾリル基、
 1 １－ジフルオロメチル－３－ピラゾリル基、
 1, 5 5－ジメチル－３－

ピラゾリル基、1, 4-ジメチル-5-ピラゾリル基および3, 5-ジメチル-1-ピラゾリル基等が挙げられる。

[0059]

本発明化合物における「群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいイソキサゾリル基」としては、例えば3-イソオキサゾリル基、4-クロロ-3-イソキサゾリル基、5-クロロ-3-イソキサゾリル基、3-ブロモ-4-イソキサゾリル基、5-ブロモ-4-イソキサゾリル基、3-ニトロ-5-イソキサゾリル基、4-ニトロ-5-イソキサゾリル基、4-メチル-3-イソキサゾリル基、5-メチル-3-イソキサゾリル基、3-トリフルオロメチル-4-イソキサゾリル基、5-トリフルオロメチル-4-イソキサゾリル基、3-メチル-5-イソキサゾリル基および4-メチル-5-イソキサゾリル基等が挙げられる。

[0060]

本発明化合物における「C2-C6アルキルカルボニル基」としては、例えばアセチル基、エチルカルボニル基、プロピルカルボニル基、イソプロピルカルボニル基、ブチルカルボニル基、イソブチルカルボニル基、sec-ブチルカルボニル基、tert-ブチルカルボニル基、ペンチルカルボニル基、2, 2-ジメチルプロピルカルボニル基、3-メチルブチルカルボニル基およびペンチルカルボニル等々が挙げられる。

[0061]

本発明化合物における「1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルキルカルボニル基」としては、例えばアセチル基、エチルカルボニル基、プロピルカルボニル基、イソプロピルカルボニル基、ブチルカルボニル基、イソブチルカルボニル基、sec-ブチルカルボニル基、tert-ブチルカルボニル基、ペンチルカルボニル基、2, 2-ジメチルプロピルカルボニル基、3-メチルブチルカルボニル基、トリクロロアセチル基、ジフルオロアセチル基、トリフルオロアセチル基、(2, 2, 2-トリフルオロエチル)カルボニル基、ペンタフルオロエチルカルボニル基、ヘプタフルオロプロピルカルボニル基およびヘプタフルオロイソプロピルカルボニル基等々が挙げられる。

[0062]

本発明化合物における「C2-C5アルキルカルボニル基」としては、例えばアセチル基、エチルカルボニル基、プロピルカルボニル基、イソプロピルカルボニル基、ブチルカルボニル基、イソブチルカルボニル基、sec-ブチルカルボニル基およびtert-ブチルカルボニル基等々が挙げられる。

[0063]

本発明化合物における「1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C5アルキルカルボニル基」としては、例えばアセチル基、エチルカルボニル基、プロピルカルボニル基、イソプロピルカルボニル基、ブチルカルボニル基、イソブチルカルボニル基、sec-ブチルカルボニル基、tert-ブチルカルボニル基、トリクロロアセチル基、ジフルオロアセチル基、トリフルオロアセチル基、(2, 2, 2-トリフルオロエチル)カルボニル基、ペンタフルオロエチルカルボニル基、ヘプタフルオロプロピルカルボニル基およびヘプタフルオロイソプロピルカルボニル基等々が挙げられる。

[0064]

本発明化合物における「群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいベンゾイル基」としては、例えばベンゾイル基、2-フルオロベンゾイル基、3

ーフルオロベンゾイル基、4-フルオロベンゾイル基、2-クロロベンゾイル
 基、3-クロロベンゾイル基、4-クロロベンゾイル基、2-ブロモベンゾイ
 ル基、3-ブロモベンゾイル基、4-ブロモベンゾイル基、2-ヨードベンゾ
 イル基、3-ヨードベンゾイル基、4-ヨードベンゾイル基、2-シアノベン
 5 ゾイル基、3-シアノベンゾイル基、4-シアノベンゾイル基、2-ニトロベン
 ゾイル基、3-ニトロベンゾイル基、4-ニトロベンゾイル基、2-メチル
 ベンゾイル基、3-メチルベンゾイル基、4-メチルベンゾイル基、2-エチ
 ルベンゾイル基、3-エチルベンゾイル基、4-エチルベンゾイル基、2-プロ
 10 ピルベンゾイル基、3-プロピルベンゾイル基、4-プロピルベンゾイル基
 、2-イソプロピルベンゾイル基、3-イソプロピルベンゾイル基、4-イソ
 プロピルベンゾイル基、2-ブチルベンゾイル基、3-ブチルベンゾイル基、
 4-ブチルベンゾイル基、2-イソブチルベンゾイル基、3-イソブチルベン
 ゾイル基、4-イソブチルベンゾイル基、2-sec-ブチルベンゾイル基、
 3-sec-ブチルベンゾイル基、4-sec-ブチルベンゾイル基、2-tert-
 15 tert-ブチルベンゾイル基、3-tert-ブチルベンゾイル基、4-tert-
 tert-ブチルベンゾイル基、2-ペンチルベンゾイル基、3-ペンチルベンゾ
 イル基、4-ペンチルベンゾイル基、2-(2, 2-ジメチルプロピル)ベン
 ゾイル基、3-(2, 2-ジメチルプロピル)ベンゾイル基、4-(2, 2-ジ
 20 ジメチルプロピル)ベンゾイル基、2-(3-メチルブチル)ベンゾイル基、
 3-(3-メチルブチル)ベンゾイル基、4-(3-メチルブチル)ベンゾイ
 ル基、2-(2, 3-ジメチルブチル)ベンゾイル基、3-(2, 3-ジメチ
 ルブチル)ベンゾイル基、4-(2, 3-ジメチルブチル)ベンゾイル基、2-
 25 (3, 3-ジメチルブチル)ベンゾイル基、3-(3, 3-ジメチルブチル)
)ベンゾイル基、4-(3, 3-ジメチルブチル)ベンゾイル基、2-ヘキシ
 ルベンゾイル基、3-ヘキシルベンゾイル基、4-ヘキシルベンゾイル基、2-
 ートリクロロメチルベンゾイル基、3-ートリクロロメチルベンゾイル基、4-
 ートリクロロメチルベンゾイル基、2-ジフルオロメチルベンゾイル基、3-ジ
 フルオロメチルベンゾイル基、4-ジフルオロメチルベンゾイル基、2-トリ
 30 フルオロメチルベンゾイル基、3-トリフルオロメチルベンゾイル基、4-トリ
 フルオロメチルベンゾイル基、2-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)ベン
 ゾイル基、3-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)ベンゾイル基、4-(
 2, 2, 2-トリフルオロエチル)ベンゾイル基、2-ペンタフルオロエチル
 ベンゾイル基、3-ペンタフルオロエチルベンゾイル基、4-ペンタフルオロ
 35 エチルベンゾイル基、2-ヘプタフルオロプロピルベンゾイル基、3-ヘプタ
 フルオロプロピルベンゾイル基、4-ヘプタフルオロプロピルベンゾイル基、
 2-ヘプタフルオロイソプロピルベンゾイル基、3-ヘプタフルオロイソプロ
 ピルベンゾイル基、4-ヘプタフルオロイソプロピルベンゾイル基、2-メト
 キシベンゾイル基、3-メトキシベンゾイル基、4-メトキシベンゾイル基、
 2-エトキシベンゾイル基、3-エトキシベンゾイル基、4-エトキシベン
 40 ゾイル基、2-プロポキシベンゾイル基、3-プロポキシベンゾイル基、4-プロ
 ポキシベンゾイル基、2-イソプロポキシベンゾイル基、3-イソプロポキ
 シベンゾイル基、4-イソプロポキシベンゾイル基、2-ブトキシベンゾイ
 ル基、3-ブトキシベンゾイル基、4-ブトキシベンゾイル基、2-イソブトキ
 シベンゾイル基、3-イソブトキシベンゾイル基、4-イソブトキシベン
 45 ゾイル基、2-sec-ブトキシベンゾイル基、3-sec-ブトキシベンゾイ
 ル基、4-sec-ブトキシベンゾイル基、2-tert-ブトキシベンゾイ

基、3-tert-ブトキシベンゾイル基、4-tert-ブトキシベンゾイル基、2-ペンチロキシベンゾイル基、3-ペンチロキシベンゾイル基、4-ペンチロキシベンゾイル基、2-(2,2-ジメチルプロポキシ)ベンゾイル基、3-(2,2-ジメチルプロポキシ)ベンゾイル基、4-(2,2-ジメチルプロポキシ)ベンゾイル基、2-ペンタフルオロエトキシベンゾイル基、3-ペンタフルオロエトキシベンゾイル基、4-ペンタフルオロエトキシベンゾイル基、2-ヘプタフルオロプロポキシベンゾイル基、3-ヘプタフルオロプロポキシベンゾイル基、4-ヘプタフルオロプロポキシベンゾイル基、2-ヘプタフルオロイソプロポキシベンゾイル基、3-ヘプタフルオロイソプロポキシベンゾイル基、4-ヘプタフルオロイソプロポキシベンゾイル基、2-トリフルオロメトキシベンゾイル基、3-トリフルオロメトキシベンゾイル基および4-トリフルオロメトキシベンゾイル基等が挙げられる。

[0065]

本発明化合物における「C2-C6アルコキシカルボニル基」としては、例えばメトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、プロポキシカルボニル基、イソプロポキシカルボニル基、ブトキシカルボニル基、イソブトキシカルボニル基、sec-ブトキシカルボニル基、tert-ブトキシカルボニル基、ペンチロキシカルボニル基、2,2-ジメチルプロポキシカルボニル基および3-メチルブトキシカルボニル基等が挙げられる。

[0066]

本発明化合物における「C2-C5アルコキシカルボニル基」としては、例えばメトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、プロポキシカルボニル基、イソプロポキシカルボニル基、ブトキシカルボニル基、イソブトキシカルボニル基、sec-ブトキシカルボニル基およびtert-ブトキシカルボニル基が挙げられる。

[0067]

本発明化合物における「C2-C4アルコキシカルボニル基」としては、例えばメトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、プロポキシカルボニル基およびイソプロポキシカルボニル基が挙げられる。

[0068]

本発明化合物における「C1-C4アルキルスルホニル基」としては、例えばメチルスルホニル基、エチルスルホニル基、プロピルスルホニル基、イソプロピルスルホニル基、ブチルスルホニル基、イソブチルスルホニル基、sec-ブチルスルホニル基およびtert-ブチルスルホニル基が挙げられる。

[0069]

本発明化合物における「1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキルスルホニル基」としては、例えばメチルスルホニル基、エチルスルホニル基、プロピルスルホニル基、イソプロピルスルホニル基、ブチルスルホニル基、イソブチルスルホニル基、sec-ブチルスルホニル基、tert-ブチルスルホニル基、トリクロロメチルスルホニル基、ジフルオロメチルスルホニル基、トリフルオロメチルスルホニル基および2,2,2-トリフルオロエチルスルホニル基等が挙げられる。

[0070]

本発明化合物における「C1-C6アルキルスルホニル基」としては、例えばメチルスルホニル基、エチルスルホニル基、プロピルスルホニル基、イソプロピルスルホニル基、ブチルスルホニル基、イソブチルスルホニル基、sec-

ブチルスルホニル基、tert-ブチルスルホニル基、ペンチルスルホニル基、2, 2-ジメチルプロピルスルホニル基、3-メチルブチルスルホニル基、2, 3-ジメチルブチルスルホニル基、3, 3-ジメチルブチルスルホニル基およびヘキシルスルホニル基等が挙げられる。

5 [0071]

本発明化合物における「1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキルスルホニル基」としては、例えばメチルスルホニル基、エチルスルホニル基、プロピルスルホニル基、イソプロピルスルホニル基、ブチルスルホニル基、イソブチルスルホニル基、sec-ブチルスルホニル基、tert-ブチルスルホニル基、ペンチルスルホニル基、2, 2-ジメチルプロピルスルホニル基、3-メチルブチルスルホニル基、2, 3-ジメチルブチルスルホニル基、3, 3-ジメチルブチルスルホニル基、ヘキシルスルホニル基、トリクロロメチルスルホニル基、ジフルオロメチルスルホニル基、トリフルオロメチルスルホニル基、2, 2, 2-トリフルオロエチルスルホニル基、ペンタフルオロエチルスルホニル基、ヘプタフルオロプロピルスルホニル基およびヘプタフルオロイソプロピルスルホニル基等が挙げられる。

[0072]

本発明化合物における「群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニルスルホニル基」としては、例えば2-フルオロフェニルスルホニル基、3-クロロフェニルスルホニル基、4-クロロフェニルスルホニル基、2-ヨードフェニルスルホニル基、3-シアノフェニルスルホニル基、4-ニトロフェニルスルホニル基、2-メチルフェニルスルホニル基、4-メチルフェニルスルホニル基、4-tert-ブチルフェニルスルホニル基、4-ジフルオロメチルフェニルスルホニル基、2-トリフルオロメチルフェニルスルホニル基、2-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)フェニルスルホニル基、4-ペンタフルオロエチルフェニルスルホニル基、4-ヘプタフルオロイソプロピルフェニルスルホニル基、2-メトキシフェニルスルホニル基、3-ジフルオロメトキシフェニルスルホニル基、4-ジフルオロメトキシフェニルスルホニル基、2-トリフルオロメトキシフェニルスルホニル基および4-(2, 2, 2-トリフルオロエトキシ)フェニルスルホニル基等が挙げられる。

[0073]

本発明化合物における「C7-C9フェニルアルキルスルホニル基」としては、例えばベンジルスルホニル基、1-フェニルエチルスルホニル基、2-フェニルエチルスルホニル基、1-フェニルプロピルスルホニル基、2-フェニルプロピルスルホニル基、3-フェニルプロピルスルホニル基および1-メチル-1-フェニルエチルスルホニル基等が挙げられる。

[0074]

本発明化合物における「ベンゼン環部分が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC7-C9フェニルアルキルスルホニル基」としては、例えばベンジルスルホニル基、2-フルオロベンジルスルホニル基、3-クロロベンジルスルホニル基、4-ブロモベンジルスルホニル基、2-シアノベンジルスルホニル基、3-ニトロベンジルスルホニル基、3-メトキシベンジルスルホニル基、4-トリフルオロメトキシベンジルスルホニル基、1-(3-クロロフェニル)エチルスルホニル基、2-(4-ブロモフェニル)エチルスルホニル基、1-(2-シアノフェニル)プロピルスルホニル基、2-(3-ニトロフェニル)プロピルスルホニル基、3-(3-メトキシフェニル)プロピルス

ルホニル基および1-メチル-1-(4-トリフルオロメトキシフェニル)エチルスルホニル基等が挙げられる。

[0075]

本発明化合物における「ベンゼン環部分が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいベンジルスルホニル基」としては、例えばベンジルスルホニル基、2-フルオロベンジルスルホニル基、3-クロロベンジルスルホニル基、4-ブロモベンジルスルホニル基、2-シアノベンジルスルホニル基、3-ニトロベンジルスルホニル基、3-メトキシベンジルスルホニル基および4-トリフルオロメトキシベンジルスルホニル基等が挙げられる。

[0076]

本発明化合物における「C1-C6アルコキシ基」としては、例えばメトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、イソプロポキシ基、ブトキシ基、イソブトキシ基、sec-ブトキシ基、tert-ブトキシ基、ペンチロキシ基、2,2-ジメチルプロポキシ基、3-メチルブトキシ基、2,3-ジメチルブトキシ基、3,3-ジメチルブトキシ基およびヘキシロキシ基等が挙げられる。

[0077]

本発明化合物における「1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルコキシ基」としては、例えばメトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、イソプロポキシ基、ブトキシ基、イソブトキシ基、sec-ブトキシ基、tert-ブトキシ基、ペンチロキシ基、2,2-ジメチルプロポキシ基、3-メチルブトキシ基、2,3-ジメチルブトキシ基、3,3-ジメチルブトキシ基、ヘキシロキシ基、トリクロロメトキシ基、ジフルオロメトキシ基、トリフルオロメトキシ基、2,2,2-トリフルオロエトキシ基、ペンタフルオロエトキシ基、ヘプタフルオロプロポキシ基およびヘプタフルオロイソプロポキシ基等が挙げられる。

[0078]

本発明化合物としては、例えば以下の化合物が挙げられる。

式(1)において、R¹が水素原子である化合物；

式(1)において、R¹がハロゲン原子である化合物；

式(1)において、R¹がニトロ基である化合物；

式(1)において、R¹がC1-C6アルキル基である化合物；

式(1)において、R¹が群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基である化合物；

式(1)において、R¹がC2-C6アルケニル基である化合物；

式(1)において、R¹が群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC2-C6アルケニル基である化合物；

式(1)において、R¹がC2-C6アルキニル基である化合物；

式(1)において、R¹が群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC2-C6アルキニル基である化合物；

[0079]

式(1)において、R¹がフェニル基である化合物；

式(1)において、R¹が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

式(1)において、R¹が6員芳香族複素環基である化合物；

式(1)において、R¹が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよい6員芳香族複素環基である化合物；

- 式(1)において、 R^1 が5員芳香族複素環基である化合物；
 式(1)において、 R^1 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよい5員芳香族複素環基である化合物；
 式(1)において、 R^1 がカルボキシ基である化合物；
 5 式(1)において、 R^1 がC2-C6アルキルカルボニル基である化合物；
 式(1)において、 R^1 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルキルカルボニル基である化合物；
 式(1)において、 R^1 がベンゾイル基である化合物；
 式(1)において、 R^1 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよい
 10 ベンゾイル基である化合物；
 式(1)において、 R^1 がC2-C6アルコキシカルボニル基である化合物；
 式(1)において、 R^1 がアミノカルボニル基である化合物；

[0080]

- 式(1)において、 R^1 が $-NR^{11}R^{12}$ である化合物；
 15 式(1)において、 R^1 が $-S(O)_2NR^7R^{11}$ である化合物；
 式(1)において、 R^1 が $-OR^{11}$ である化合物；
 式(1)において、 R^1 が $-S(O)_mR^{11}$ である化合物；
 式(1)において、 R^1 が $-SF_5$ である化合物；

[0081]

- 20 式(1)において、 R^1 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基である化合物；
 式(1)において、 R^1 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C4アルケニル基である化合物；
 式(1)において、 R^1 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C4アルキニル基である化合物；
 25 式(1)において、 R^1 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいピリジル基である化合物；
 式(1)において、 R^1 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいピリミジニル基である化合物；
 30 式(1)において、 R^1 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいチエニル基である化合物；
 式(1)において、 R^1 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいピロリル基である化合物；
 式(1)において、 R^1 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C5アルキルカルボニル基である化合物；
 35

[0082]

- 式(1)において、 R^2 が水素原子である化合物；
 式(1)において、 R^2 がハロゲン原子である化合物；
 式(1)において、 R^2 がシアノ基である化合物；
 40 式(1)において、 R^2 がニトロ基である化合物；
 式(1)において、 R^2 がC1-C6アルキル基である化合物；
 式(1)において、 R^2 が群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基である化合物；
 式(1)において、 R^2 がC2-C6アルケニル基である化合物；
 45 式(1)において、 R^2 が群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC2-C6アルケニル基である化合物；

式(1)において、 R^2 がC2-C6アルキニル基である化合物；
 式(1)において、 R^2 が群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC2-C6アルキニル基である化合物；

[0083]

- 5 式(1)において、 R^2 がフェニル基である化合物；
 式(1)において、 R^2 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；
 式(1)において、 R^2 が6員芳香族複素環基である化合物；
 式(1)において、 R^2 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよい6員芳香族複素環基である化合物；
 10 式(1)において、 R^2 が5員芳香族複素環基である化合物；
 式(1)において、 R^2 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよい5員芳香族複素環基である化合物；

[0084]

- 15 式(1)において、 R^2 がカルボキシ基である化合物；
 式(1)において、 R^2 がC2-C6アルキルカルボニル基である化合物；
 式(1)において、 R^2 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルキルカルボニル基である化合物；
 式(1)において、 R^2 がベンゾイル基である化合物；
 20 式(1)において、 R^2 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいベンゾイル基である化合物；
 式(1)において、 R^2 がC2-C6アルコキシカルボニル基である化合物；
 式(1)において、 R^2 がアミノカルボニル基である化合物；

[0085]

- 25 式(1)において、 R^2 が $-NR^{12}R^{13}$ である化合物；
 式(1)において、 R^2 が $-S(O)_2NR^7R^{11}$ である化合物；
 式(1)において、 R^2 が $-OR^{13}$ である化合物；
 式(1)において、 R^2 が $-S(O)_mR^{13}$ である化合物；
 式(1)において、 R^2 が $-SF_5$ である化合物；

30 [0086]

- 式(1)において、 R^2 がC1-C4アルキル基である化合物；
 式(1)において、 R^2 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基である化合物；
 式(1)において、 R^2 がC2-C4アルケニル基である化合物；
 35 式(1)において、 R^2 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C4アルケニル基である化合物；
 式(1)において、 R^2 がC2-C4アルキニル基である化合物；
 式(1)において、 R^2 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C4アルキニル基である化合物；

40 [0087]

- 式(1)において、 R^2 がピリジル基である化合物；
 式(1)において、 R^2 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいピリジル基である化合物；
 式(1)において、 R^2 がピリミジニル基である化合物；
 45 式(1)において、 R^2 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいピリミジニル基である化合物；

式(1)において、 R^2 がチエニル基である化合物；

式(1)において、 R^2 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいチエニル基である化合物；

式(1)において、 R^2 がピロリル基である化合物；

- 5 式(1)において、 R^2 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいピロリル基である化合物；

[0088]

式(1)において、 R^2 がC2-C5アルキルカルボニル基である化合物；

- 10 式(1)において、 R^2 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C5アルキルカルボニル基である化合物；

式(1)において、 R^2 がC2-C4アルコキシカルボニル基である化合物；

[0089]

式(1)において、 R^3 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^3 がハロゲン原子である化合物；

- 15 式(1)において、 R^3 がシアノ基である化合物；

式(1)において、 R^3 がニトロ基である化合物；

式(1)において、 R^3 がC1-C6アルキル基である化合物；

式(1)において、 R^3 が群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基である化合物；

- 20 式(1)において、 R^3 がC2-C6アルケニル基である化合物；

式(1)において、 R^3 が群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC2-C6アルケニル基である化合物；

式(1)において、 R^3 がC2-C6アルキニル基である化合物；

- 25 式(1)において、 R^3 が群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC2-C6アルキニル基である化合物；

[0090]

式(1)において、 R^3 がフェニル基である化合物；

式(1)において、 R^3 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

- 30 式(1)において、 R^3 が6員芳香族複素環基である化合物；

式(1)において、 R^3 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよい6員芳香族複素環基である化合物；

式(1)において、 R^3 が5員芳香族複素環基である化合物；

- 35 式(1)において、 R^3 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよい5員芳香族複素環基である化合物；

式(1)において、 R^3 がカルボキシ基である化合物；

式(1)において、 R^3 がC2-C6アルキルカルボニル基である化合物；

式(1)において、 R^3 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルキルカルボニル基である化合物；

- 40 式(1)において、 R^3 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいベンゾイル基である化合物；

式(1)において、 R^3 がC2-C6アルコキシカルボニル基である化合物；

式(1)において、 R^3 がアミノカルボニル基である化合物；

[0091]

- 45 式(1)において、 R^3 が $-NR^{11}R^{12}$ である化合物；

式(1)において、 R^3 が $-S(O)_2NR^7R^{11}$ である化合物；

式(1)において、 R^3 が $-OR^{1,1}$ である化合物；
式(1)において、 R^3 が $-S(O)_m R^{1,1}$ である化合物；
式(1)において、 R^3 が $-SF_5$ である化合物；

[0092]

- 5 式(1)において、 R^3 が C1-C4アルキル基である化合物；
式(1)において、 R^3 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基である化合物；
式(1)において、 R^3 が C2-C4アルケニル基である化合物；
式(1)において、 R^3 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C4アルケニル基である化合物；
10 式(1)において、 R^3 が C2-C4アルキニル基である化合物；
式(1)において、 R^3 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C4アルキニル基である化合物；
式(1)において、 R^3 がピリジル基である化合物；
15 式(1)において、 R^3 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいピリジル基である化合物；
式(1)において、 R^3 がピリミジニル基である化合物；
式(1)において、 R^3 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいピリミジニル基である化合物；

20 [0093]

- 式(1)において、 R^3 がチエニル基である化合物；
式(1)において、 R^3 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいチエニル基である化合物；
式(1)において、 R^3 がピロリル基である化合物；
25 式(1)において、 R^3 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいピロリル基である化合物；
式(1)において、 R^3 がピラゾリル基である化合物；
式(1)において、 R^3 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいピラゾリル基である化合物；
30 式(1)において、 R^3 が C2-C5アルキルカルボニル基である化合物；
式(1)において、 R^3 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C5アルキルカルボニル基である化合物；
式(1)において、 R^3 が C2-C4アルコキシカルボニル基である化合物；

[0094]

- 35 式(1)において、 R^4 が水素原子である化合物；
式(1)において、 R^4 がハロゲン原子である化合物；
式(1)において、 R^4 がシアノ基である化合物；
式(1)において、 R^4 がニトロ基である化合物；
式(1)において、 R^4 が C1-C6アルキル基である化合物；
40 式(1)において、 R^4 が群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基である化合物；
式(1)において、 R^4 が C2-C6アルケニル基である化合物；
式(1)において、 R^4 が群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC2-C6アルケニル基である化合物；
45 式(1)において、 R^4 が C2-C6アルキニル基である化合物；
式(1)において、 R^4 が群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよい

C 2 - C 6 アルキニル基である化合物；

[0095]

式(1)において、 R^4 がフェニル基である化合物；

式(1)において、 R^4 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

式(1)において、 R^4 が6員芳香族複素環基である化合物；

式(1)において、 R^4 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよい6員芳香族複素環基である化合物；

式(1)において、 R^4 が5員芳香族複素環基である化合物；

式(1)において、 R^4 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよい5員芳香族複素環基である化合物；

[0096]

式(1)において、 R^4 がカルボキシ基である化合物；

式(1)において、 R^4 がC 2 - C 6 アルキルカルボニル基である化合物；

式(1)において、 R^4 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 2 - C 6 アルキルカルボニル基である化合物；

式(1)において、 R^4 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいベンゾイル基である化合物；

式(1)において、 R^4 がC 2 - C 6 アルコシカルボニル基である化合物；

式(1)において、 R^4 がアミノカルボニル基である化合物；

式(1)において、 R^4 が $-NR^{1,1}R^{1,2}$ である化合物；

式(1)において、 R^4 が $-S(O)_2NR^7R^{1,1}$ である化合物；

式(1)において、 R^4 が $-OR^{1,1}$ である化合物；

式(1)において、 R^4 が $-S(O)_mR^{1,1}$ である化合物；

式(1)において、 R^4 が $-SF_5$ である化合物；

[0097]

式(1)において、 R^4 がC 1 - C 4 アルキル基である化合物；

式(1)において、 R^4 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1 - C 4 アルキル基である化合物；

式(1)において、 R^4 がC 2 - C 4 アルケニル基である化合物；

式(1)において、 R^4 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 2 - C 4 アルケニル基である化合物；

式(1)において、 R^4 がC 2 - C 4 アルキニル基である化合物；

式(1)において、 R^4 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 2 - C 4 アルキニル基である化合物；

式(1)において、 R^4 がピリジル基である化合物；

式(1)において、 R^4 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいピリジル基である化合物；

式(1)において、 R^4 がピリミジニル基である化合物；

式(1)において、 R^4 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいピリミジニル基である化合物；

[0098]

式(1)において、 R^4 がチエニル基である化合物；

式(1)において、 R^4 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいチエニル基である化合物；

式(1)において、 R^4 がピロリル基である化合物；

式(1)において、 R^4 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいピロリル基である化合物；

式(1)において、 R^4 がC2-C5アルキルカルボニル基である化合物；

式(1)において、 R^4 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C5アルキルカルボニル基である化合物；

式(1)において、 R^4 がC2-C4アルコキシカルボニル基である化合物；
[0099]

式(1)において、 R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^5 がハロゲン原子である化合物；

式(1)において、 R^5 がシアノ基である化合物；

式(1)において、 R^5 がニトロ基である化合物；

式(1)において、 R^5 がC1-C6アルキル基である化合物；

式(1)において、 R^5 が群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基である化合物；

[0100]

式(1)において、 R^5 がカルボキシ基である化合物；

式(1)において、 R^5 がC2-C6アルコキシカルボニル基である化合物；

式(1)において、 R^5 が $-NR^{11}R^{12}$ である化合物；

式(1)において、 R^5 が $-S(O)_2NR^7R^{11}$ である化合物；

式(1)において、 R^5 が $-OR^{14}$ である化合物；

式(1)において、 R^5 がフェニル基である化合物；

式(1)において、 R^5 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

式(1)において、 R^5 が6員芳香族複素環基である化合物；

式(1)において、 R^5 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよい6員芳香族複素環基である化合物；

式(1)において、 R^5 が5員芳香族複素環基である化合物；

式(1)において、 R^5 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよい5員芳香族複素環基である化合物；

[0101]

式(1)において、 R^5 がC1-C4アルキル基である化合物；

式(1)において、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基である化合物；

式(1)において、 R^5 がC2-C5アルコキシカルボニル基である化合物；

[0102]

式(1)において、 R^5 がピロリル基である化合物；

式(1)において、 R^5 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいピロリル基である化合物；

[0103]

式(1)において、 R^1 がハロゲン原子であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^1 がハロゲン原子であり、 R^5 がハロゲン原子である化合物；

式(1)において、 R^1 がハロゲン原子であり、 R^5 が群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基である化合物；

式(1)において、 R^1 がハロゲン原子であり、 R^5 がカルボキシ基である化

合物；

式(1)において、 R^1 がハロゲン原子であり、 R^5 がC2-C6アルコキシカルボニル基である化合物；

5 式(1)において、 R^1 がハロゲン原子であり、 R^5 が $-NR^{1,1}R^{1,2}$ である化合物；式(1)において、 R^1 がハロゲン原子であり、 R^5 が $-OR^{1,4}$ である化合物；

式(1)において、 R^1 がハロゲン原子であり、 R^5 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

10 式(1)において、 R^1 がハロゲン原子であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基である化合物；

[0104]

式(1)において、 R^1 が群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

15 式(1)において、 R^1 が群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基であり、 R^5 がハロゲン原子である化合物；

式(1)において、 R^1 が群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基であり、 R^5 が群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基である化合物；

20 式(1)において、 R^1 が群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基であり、 R^5 がカルボキシ基である化合物；

式(1)において、 R^1 が群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基であり、 R^5 がC2-C6アルコキシカルボニル基である化合物；

25 式(1)において、 R^1 が群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基であり、 R^5 が $-NR^{1,1}R^{1,2}$ である化合物；

式(1)において、 R^1 が群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基であり、 R^5 が $-OR^{1,4}$ である化合物；

30 式(1)において、 R^1 が群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基であり、 R^5 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

式(1)において、 R^1 が群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基である化合物；

[0105]

35 式(1)において、 R^1 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^1 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基であり、 R^5 がハロゲン原子である化合物；

40 式(1)において、 R^1 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基であり、 R^5 が群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基である化合物；

式(1)において、 R^1 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基であり、 R^5 がカルボキシ基である化合物；

45 式(1)において、 R^1 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基であり、 R^5 がC2-C6アルコキシカルボニル基である化合物；

式(1)において、 R^1 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよい

フェニル基であり、 R^5 が $-NR^{1,1}R^{1,2}$ である化合物；

式（１）において、 R^1 が群 Y より選ばれる １ 個以上の基を有していてもよいフェニル基であり、 R^5 が $-OR^{1,4}$ である化合物；

式（１）において、 R^1 が群 Y より選ばれる １ 個以上の基を有していてもよいフェニル基であり、 R^5 が群 Y より選ばれる １ 個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

式（１）において、 R^1 が群 Y より選ばれる １ 個以上の基を有していてもよいフェニル基であり、 R^5 が １ 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C １－C ４アルキル基である化合物；

10 [0106]

式（１）において、 R^1 が群 Y より選ばれる １ 個以上の基を有していてもよい ６ 員芳香族複素環基であり、 R^5 がハロゲン原子である化合物；

式（１）において、 R^1 が群 Y より選ばれる １ 個以上の基を有していてもよい ６ 員芳香族複素環基であり、 R^5 が群 X より選ばれる １ 個以上の基を有していてもよい C １－C ６アルキル基である化合物；

15 式（１）において、 R^1 が群 Y より選ばれる １ 個以上の基を有していてもよい ６ 員芳香族複素環基であり、 R^5 がカルボキシ基である化合物；

式（１）において、 R^1 が群 Y より選ばれる １ 個以上の基を有していてもよい ６ 員芳香族複素環基であり、 R^5 が C ２－C ６アルコキシカルボニル基である化合物；

20 式（１）において、 R^1 が群 Y より選ばれる １ 個以上の基を有していてもよい ６ 員芳香族複素環基であり、 R^5 が $-NR^{1,1}R^{1,2}$ である化合物；

式（１）において、 R^1 が群 Y より選ばれる １ 個以上の基を有していてもよい ６ 員芳香族複素環基であり、 R^5 が $-OR^{1,4}$ である化合物；

25 式（１）において、 R^1 が群 Y より選ばれる １ 個以上の基を有していてもよい ６ 員芳香族複素環基であり、 R^5 が群 Y より選ばれる １ 個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

式（１）において、 R^1 が群 Y より選ばれる １ 個以上の基を有していてもよい ６ 員芳香族複素環基であり、 R^5 が １ 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C １－C ４アルキル基である化合物；

30 [0107]

式（１）において、 R^1 が群 Y より選ばれる １ 個以上の基を有していてもよい ５ 員芳香族複素環基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式（１）において、 R^1 が群 Y より選ばれる １ 個以上の基を有していてもよいチエニル基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

35 式（１）において、 R^1 が群 Y より選ばれる １ 個以上の基を有していてもよい ５ 員芳香族複素環基であり、 R^5 がハロゲン原子である化合物；

式（１）において、 R^1 が群 Y より選ばれる １ 個以上の基を有していてもよい ５ 員芳香族複素環基であり、 R^5 が群 X より選ばれる １ 個以上の基を有していてもよい C １－C ６アルキル基である化合物；

式（１）において、 R^1 が群 Y より選ばれる １ 個以上の基を有していてもよい ５ 員芳香族複素環基であり、 R^5 がカルボキシ基である化合物；

式（１）において、 R^1 が群 Y より選ばれる １ 個以上の基を有していてもよい ５ 員芳香族複素環基であり、 R^5 が C ２－C ６アルコキシカルボニル基である化合物；

45 式（１）において、 R^1 が群 Y より選ばれる １ 個以上の基を有していてもよい

5員芳香族複素環基であり、 R^5 が $-NR^{1,1}R^{1,2}$ である化合物；

式（1）において、 R^1 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよい

5員芳香族複素環基であり、 R^5 が $-OR^{1,4}$ である化合物；

式（1）において、 R^1 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよい

5員芳香族複素環基であり、 R^5 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

式（1）において、 R^1 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよい

5員芳香族複素環基であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基である化合物；

10 [0108]

式（1）において、 R^1 がカルボキシ基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式（1）において、 R^1 がカルボキシ基であり、 R^5 がハロゲン原子である化合物；

15 式（1）において、 R^1 がカルボキシ基であり、 R^5 が群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基である化合物；

式（1）において、 R^1 がカルボキシ基であり、 R^5 がカルボキシ基である化合物；

20 式（1）において、 R^1 がカルボキシ基であり、 R^5 がC2-C6アルコキシカルボニル基である化合物；

式（1）において、 R^1 がカルボキシ基であり、 R^5 が $-NR^{1,1}R^{1,2}$ である化合物；式（1）において、 R^1 がカルボキシ基であり、 R^5 が $-OR^{1,4}$ である化合物；

25 式（1）において、 R^1 がカルボキシ基であり、 R^5 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

式（1）において、 R^1 がカルボキシ基であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基である化合物；

[0109]

30 式（1）において、 R^1 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルキルカルボニル基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式（1）において、 R^1 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルキルカルボニル基であり、 R^5 がハロゲン原子である化合物；

35 式（1）において、 R^1 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルキルカルボニル基であり、 R^5 が群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基である化合物；

式（1）において、 R^1 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルキルカルボニル基であり、 R^5 がカルボキシ基である化合物；

40 式（1）において、 R^1 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルキルカルボニル基であり、 R^5 がC2-C6アルコキシカルボニル基である化合物；

式（1）において、 R^1 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルキルカルボニル基であり、 R^5 が $-NR^{1,1}R^{1,2}$ である化合物；

式（1）において、 R^1 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルキルカルボニル基であり、 R^5 が $-OR^{1,4}$ である化合物；

45 式（1）において、 R^1 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルキルカルボニル基であり、 R^5 が群Yより選ばれる1個以上の基を有

していてもよいフェニル基である化合物；

式(1)において、 R^1 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルキルカルボニル基であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基である化合物；

5 [0110]

式(1)において、 R^1 がC2-C6アルコキシカルボニル基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^1 がC2-C5アルコキシカルボニル基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

10 式(1)において、 R^1 がC2-C6アルコキシカルボニル基であり、 R^5 がハロゲン原子である化合物；

式(1)において、 R^1 がC2-C6アルコキシカルボニル基であり、 R^5 が群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基である化合物；

15 式(1)において、 R^1 がC2-C6アルコキシカルボニル基であり、 R^5 がカルボキシ基である化合物；

式(1)において、 R^1 がC2-C6アルコキシカルボニル基であり、 R^5 がC2-C6アルコキシカルボニル基である化合物；

20 式(1)において、 R^1 がC2-C6アルコキシカルボニル基であり、 R^5 が $-NR^{11}R^{12}$ である化合物；

式(1)において、 R^1 がC2-C6アルコキシカルボニル基であり、 R^5 が $-OR^{14}$ である化合物；

式(1)において、 R^1 がC2-C6アルコキシカルボニル基であり、 R^5 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

25 式(1)において、 R^1 がC2-C6アルコキシカルボニル基であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基である化合物；

[0111]

30 式(1)において、 R^1 がアミノカルボニル基であり、 R^5 がハロゲン原子である化合物；

式(1)において、 R^1 がアミノカルボニル基であり、 R^5 が群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基である化合物；

式(1)において、 R^1 がアミノカルボニル基であり、 R^5 がカルボキシ基である化合物；

35 式(1)において、 R^1 がアミノカルボニル基であり、 R^5 がC2-C6アルコキシカルボニル基である化合物；

式(1)において、 R^1 がアミノカルボニル基であり、 R^5 が $-NR^{11}R^{12}$ である化合物；

40 式(1)において、 R^1 がアミノカルボニル基であり、 R^5 が $-OR^{14}$ である化合物；式(1)において、 R^1 がアミノカルボニル基であり、 R^5 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

式(1)において、 R^1 がアミノカルボニル基であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基である化合物；

45 式(1)において、 R^1 が $-NR^{11}R^{12}$ であり、 R^5 が水素原子である化合物；

[0112]

式(1)において、 R^1 が $-OR^{11}$ であり、 R^5 が水素原子である化合物；
 式(1)において、 R^1 が $-OR^{11}$ であり、 R^5 がハロゲン原子である化合物；

式(1)において、 R^1 が $-OR^{11}$ であり、 R^5 が群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基である化合物；

式(1)において、 R^1 が $-OR^{11}$ であり、 R^5 がカルボキシ基である化合物；

式(1)において、 R^1 が $-OR^{11}$ であり、 R^5 がC2-C6アルコキシカルボニル基である化合物；

式(1)において、 R^1 が $-OR^{11}$ であり、 R^5 が $-NR^{11}R^{12}$ である化合物；

式(1)において、 R^1 が $-OR^{11}$ であり、 R^5 が $-OR^{14}$ である化合物；

式(1)において、 R^1 が $-OR^{11}$ であり、 R^5 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

式(1)において、 R^1 が $-OR^{11}$ であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基である化合物；

[0113]

式(1)において、 R^1 が $-S(O)_mR^{11}$ であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^1 が $-S(O)_mR^{11}$ であり、 R^5 がハロゲン原子である化合物；

式(1)において、 R^1 が $-S(O)_mR^{11}$ であり、 R^5 が群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基である化合物；

式(1)において、 R^1 が $-S(O)_mR^{11}$ であり、 R^5 がカルボキシ基である化合物；

式(1)において、 R^1 が $-S(O)_mR^{11}$ であり、 R^5 がC2-C6アルコキシカルボニル基である化合物；

式(1)において、 R^1 が $-S(O)_mR^{11}$ であり、 R^5 が $-NR^{11}R^{12}$ である化合物；

式(1)において、 R^1 が $-S(O)_mR^{11}$ であり、 R^5 が $-OR^{14}$ である化合物；式(1)において、 R^1 が $-S(O)_mR^{11}$ であり、 R^5 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

式(1)において、 R^1 が $-S(O)_mR^{11}$ であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基である化合物；

[0114]

式(1)において、 R^1 が $-SF_5$ であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^1 が $-SF_5$ であり、 R^5 がハロゲン原子である化合物；

式(1)において、 R^1 が $-SF_5$ であり、 R^5 が群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基である化合物；

式(1)において、 R^1 が $-SF_5$ であり、 R^5 がカルボキシ基である化合物；

式(1)において、 R^1 が $-SF_5$ であり、 R^5 がC2-C6アルコキシカルボニル基である化合物；

式(1)において、 R^1 が $-SF_5$ であり、 R^5 が $-NR^{11}R^{12}$ である化合物；

合物；

式(1)において、 R^1 が $-SF_5$ であり、 R^5 が $-OR^{1'4}$ である化合物；
式(1)において、 R^1 が $-SF_5$ であり、 R^5 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

- 5 式(1)において、 R^1 が $-SF_5$ であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基である化合物；

[0115]

式(1)において、 R^1 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

- 10 式(1)において、 R^1 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基であり、 R^5 がハロゲン原子である化合物；

式(1)において、 R^1 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基であり、 R^5 が群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基である化合物；

- 15 式(1)において、 R^1 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基であり、 R^5 がカルボキシ基である化合物；

式(1)において、 R^1 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基であり、 R^5 がC2-C6アルコキシカルボニル基である化合物；

- 20 式(1)において、 R^1 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基であり、 R^5 が $-NR^{1'1}R^{1'2}$ である化合物；

式(1)において、 R^1 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基であり、 R^5 が $-OR^{1'4}$ である化合物；

- 25 式(1)において、 R^1 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基であり、 R^5 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

式(1)において、 R^1 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基である化合物；

- 30 [0116]

式(1)において、 R^1 が水素原子であり、 R^5 がハロゲン原子である化合物；

式(1)において、 R^1 が水素原子であり、 R^5 が群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基である化合物；

- 35 式(1)において、 R^1 が水素原子であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基である化合物；

式(1)において、 R^1 が水素原子であり、 R^5 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

- 40 式(1)において、 R^1 が水素原子であり、 R^5 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよい5員芳香族複素環基である化合物；

式(1)において、 R^1 が水素原子であり、 R^5 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいピロリル基である化合物；

式(1)において、 R^1 が水素原子であり、 R^5 が $-NR^{1'1}R^{1'2}$ である化合物；

- 45 式(1)において、 R^1 が水素原子であり、 R^5 が $-OR^{1'4}$ である化合物；
式(1)において、 R^1 が水素原子であり、 R^5 がC2-C6アルコキシカル

ボニル基である化合物；

式（１）において、 R^1 が水素原子であり、 R^5 が $C2-C5$ アルコキシカルボニル基である化合物；

[0117]

5 式（１）において、 R^2 がハロゲン原子であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式（１）において、 R^2 がハロゲン原子であり、 R^5 がハロゲン原子である化合物；

10 式（１）において、 R^2 がハロゲン原子であり、 R^5 が群 X より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよい $C1-C6$ アルキル基である化合物；

式（１）において、 R^2 がハロゲン原子であり、 R^5 がカルボキシ基である化合物；

式（１）において、 R^2 がハロゲン原子であり、 R^5 が $C2-C6$ アルコキシカルボニル基である化合物；

15 式（１）において、 R^2 がハロゲン原子であり、 R^5 が $-NR^{1,1}R^{1,2}$ である化合物；式（１）において、 R^2 がハロゲン原子であり、 R^5 が $-OR^{1,4}$ である化合物；

式（１）において、 R^2 がハロゲン原子であり、 R^5 が群 Y より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

20 式（１）において、 R^2 がハロゲン原子であり、 R^5 が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい $C1-C4$ アルキル基である化合物；

[0118]

式（１）において、 R^2 が群 X より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよい $C1-C6$ アルキル基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

25 式（１）において、 R^2 が群 X より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよい $C1-C6$ アルキル基であり、 R^5 がハロゲン原子である化合物；

式（１）において、 R^2 が群 X より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよい $C1-C6$ アルキル基であり、 R^5 が群 X より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよい $C1-C6$ アルキル基である化合物；

30 式（１）において、 R^2 が群 X より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよい $C1-C6$ アルキル基であり、 R^5 がカルボキシ基である化合物；

式（１）において、 R^2 が群 X より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよい $C1-C6$ アルキル基であり、 R^5 が $C2-C6$ アルコキシカルボニル基である化合物；

35 式（１）において、 R^2 が群 X より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよい $C1-C6$ アルキル基であり、 R^5 が $-NR^{1,1}R^{1,2}$ である化合物；

式（１）において、 R^2 が群 X より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよい $C1-C6$ アルキル基であり、 R^5 が $-OR^{1,4}$ である化合物；

40 式（１）において、 R^2 が群 X より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよい $C1-C6$ アルキル基であり、 R^5 が群 Y より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

式（１）において、 R^2 が群 X より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよい $C1-C6$ アルキル基であり、 R^5 が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい $C1-C4$ アルキル基である化合物；

45 [0119]

式（１）において、 R^2 が群 Y より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよい

フェニル基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式（１）において、 R^2 が群 Y より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよいフェニル基であり、 R^5 がハロゲン原子である化合物；

式（１）において、 R^2 が群 Y より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよい
5 フェニル基であり、 R^5 が群 X より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよい
C 1－C 6 アルキル基である化合物；

式（１）において、 R^2 が群 Y より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよいフェニル基であり、 R^5 がカルボキシ基である化合物；

式（１）において、 R^2 が群 Y より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよい
10 フェニル基であり、 R^5 が C 2－C 6 アルコキシカルボニル基である化合物；

式（１）において、 R^2 が群 Y より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよいフェニル基であり、 R^5 が $-NR^{1.1}R^{1.2}$ である化合物；

式（１）において、 R^2 が群 Y より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよいフェニル基であり、 R^5 が $-OR^{1.4}$ である化合物；

式（１）において、 R^2 が群 Y より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよい
15 フェニル基であり、 R^5 が群 Y より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよい
フェニル基である化合物；

式（１）において、 R^2 が群 Y より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよいフェニル基であり、 R^5 が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－

20 C 4 アルキル基である化合物；

[0 1 2 0]

式（１）において、 R^2 が群 Y より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよい 6 員芳香族複素環基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式（１）において、 R^2 が群 Y より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよい
25 6 員芳香族複素環基であり、 R^5 がハロゲン原子である化合物；

式（１）において、 R^2 が群 Y より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよい 6 員芳香族複素環基であり、 R^5 が群 X より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよい C 1－C 6 アルキル基である化合物；

式（１）において、 R^2 が群 Y より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよい
30 6 員芳香族複素環基であり、 R^5 がカルボキシ基である化合物；

式（１）において、 R^2 が群 Y より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよい 6 員芳香族複素環基であり、 R^5 が C 2－C 6 アルコキシカルボニル基である化合物；

式（１）において、 R^2 が群 Y より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよい
35 6 員芳香族複素環基であり、 R^5 が $-NR^{1.1}R^{1.2}$ である化合物；

式（１）において、 R^2 が群 Y より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよい 6 員芳香族複素環基であり、 R^5 が $-OR^{1.4}$ である化合物；

式（１）において、 R^2 が群 Y より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよい 6 員芳香族複素環基であり、 R^5 が群 Y より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

式（１）において、 R^2 が群 Y より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよい 6 員芳香族複素環基であり、 R^5 が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 4 アルキル基である化合物；

[0 1 2 1]

式（１）において、 R^2 が群 Y より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよい
45 5 員芳香族複素環基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^2 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよい5員芳香族複素環基であり、 R^5 がハロゲン原子である化合物；

式(1)において、 R^2 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよい5員芳香族複素環基であり、 R^5 が群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基である化合物；

式(1)において、 R^2 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよい5員芳香族複素環基であり、 R^5 がカルボキシ基である化合物；

式(1)において、 R^2 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよい5員芳香族複素環基であり、 R^5 がC2-C6アルコキシカルボニル基である化合物；

式(1)において、 R^2 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよい5員芳香族複素環基であり、 R^5 が $-NR^{1,1}R^{1,2}$ である化合物；

式(1)において、 R^2 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよい5員芳香族複素環基であり、 R^5 が $-OR^{1,4}$ である化合物；

式(1)において、 R^2 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよい5員芳香族複素環基であり、 R^5 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

式(1)において、 R^2 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよい5員芳香族複素環基であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基である化合物；

[0122]

式(1)において、 R^2 がカルボキシ基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^2 がカルボキシ基であり、 R^5 がハロゲン原子である化合物；

式(1)において、 R^2 がカルボキシ基であり、 R^5 が群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基である化合物；

式(1)において、 R^2 がカルボキシ基であり、 R^5 がカルボキシ基である化合物；

式(1)において、 R^2 がカルボキシ基であり、 R^5 がC2-C6アルコキシカルボニル基である化合物；

式(1)において、 R^2 がカルボキシ基であり、 R^5 が $-NR^{1,1}R^{1,2}$ である化合物；式(1)において、 R^2 がカルボキシ基であり、 R^5 が $-OR^{1,4}$ である化合物；

式(1)において、 R^2 がカルボキシ基であり、 R^5 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

式(1)において、 R^2 がカルボキシ基であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基である化合物；

[0123]

式(1)において、 R^2 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルキルカルボニル基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^2 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルキルカルボニル基であり、 R^5 がハロゲン原子である化合物；

式(1)において、 R^2 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルキルカルボニル基であり、 R^5 が群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基である化合物；

式(1)において、 R^2 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルキルカルボニル基であり、 R^5 がカルボキシ基である化合物；

式(1)において、 R^2 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルキルカルボニル基であり、 R^5 がC2-C6アルコキシカルボニル基である化合物；

式(1)において、 R^2 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルキルカルボニル基であり、 R^5 が $-NR^{1,1}R^{1,2}$ である化合物；

式(1)において、 R^2 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルキルカルボニル基であり、 R^5 が $-OR^{1,4}$ である化合物；

10 式(1)において、 R^2 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルキルカルボニル基であり、 R^5 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

式(1)において、 R^2 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルキルカルボニル基であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基である化合物；

[0124]

式(1)において、 R^2 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいベンゾイル基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^2 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいベンゾイル基であり、 R^5 がハロゲン原子である化合物；

式(1)において、 R^2 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいベンゾイル基であり、 R^5 が群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基である化合物；

式(1)において、 R^2 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいベンゾイル基であり、 R^5 がカルボキシ基である化合物；

式(1)において、 R^2 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいベンゾイル基であり、 R^5 がC2-C6アルコキシカルボニル基である化合物；

式(1)において、 R^2 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいベンゾイル基であり、 R^5 が $-NR^{1,1}R^{1,2}$ である化合物；

式(1)において、 R^2 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいベンゾイル基であり、 R^5 が $-OR^{1,4}$ である化合物；

式(1)において、 R^2 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいベンゾイル基であり、 R^5 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

式(1)において、 R^2 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいベンゾイル基であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基である化合物；

[0125]

40 式(1)において、 R^2 がC2-C6アルコキシカルボニル基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^2 がC2-C6アルコキシカルボニル基であり、 R^5 がハロゲン原子である化合物；

式(1)において、 R^2 がC2-C6アルコキシカルボニル基であり、 R^5 が群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基である化合物；

式(1)において、 R^2 がC2-C6アルコキシカルボニル基であり、 R^5 がカルボキシ基である化合物；

式(1)において、 R^2 がC2-C6アルコキシカルボニル基であり、 R^5 がC2-C6アルコキシカルボニル基である化合物；

5 式(1)において、 R^2 がC2-C6アルコキシカルボニル基であり、 R^5 が $-NR^{11}R^{12}$ である化合物；

式(1)において、 R^2 がC2-C6アルコキシカルボニル基であり、 R^5 が $-OR^{14}$ である化合物；

10 式(1)において、 R^2 がC2-C6アルコキシカルボニル基であり、 R^5 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

式(1)において、 R^2 がC2-C6アルコキシカルボニル基であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基である化合物；

[0126]

15 式(1)において、 R^2 がアミノカルボニル基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^2 がアミノカルボニル基であり、 R^5 がハロゲン原子である化合物；

20 式(1)において、 R^2 がアミノカルボニル基であり、 R^5 が群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基である化合物；

式(1)において、 R^2 がアミノカルボニル基であり、 R^5 がカルボキシ基である化合物；

式(1)において、 R^2 がアミノカルボニル基であり、 R^5 がC2-C6アルコキシカルボニル基である化合物；

25 式(1)において、 R^2 がアミノカルボニル基であり、 R^5 が $-NR^{11}R^{12}$ である化合物；

式(1)において、 R^2 がアミノカルボニル基であり、 R^5 が $-OR^{14}$ である化合物；式(1)において、 R^2 がアミノカルボニル基であり、 R^5 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

30 式(1)において、 R^2 がアミノカルボニル基であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基である化合物；

[0127]

式(1)において、 R^2 が $-NR^{12}R^{13}$ であり、 R^5 が水素原子である化合物；

35 式(1)において、 R^2 が $-NR^{12}R^{13}$ であり、 R^5 がハロゲン原子である化合物；式(1)において、 R^2 が $-NR^{12}R^{13}$ であり、 R^5 が群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基である化合物；

40 式(1)において、 R^2 が $-NR^{12}R^{13}$ であり、 R^5 がカルボキシ基である化合物；式(1)において、 R^2 が $-NR^{12}R^{13}$ であり、 R^5 がC2-C6アルコキシカルボニル基である化合物；

式(1)において、 R^2 が $-NR^{12}R^{13}$ であり、 R^5 が $-NR^{11}R^{12}$ である化合物；

45 式(1)において、 R^2 が $-NR^{12}R^{13}$ であり、 R^5 が $-OR^{14}$ である化合物；

式(1)において、 R^2 が $-NR^{12}R^{13}$ であり、 R^5 が群Yより選ばれる

1 個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；
式（1）において、 R^2 が $-NR^{1\ 2} R^{1\ 3}$ であり、 R^5 が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 4 アルキル基である化合物；

[0 1 2 8]

- 5 式（1）において、 R^2 が $-S(O)_2 NR^7 R^{1\ 1}$ であり、 R^5 が水素原子である化合物；
式（1）において、 R^2 が $-S(O)_2 NR^7 R^{1\ 1}$ であり、 R^5 がハロゲン原子である化合物；
式（1）において、 R^2 が $-S(O)_2 NR^7 R^{1\ 1}$ であり、 R^5 が群 X より
10 選ばれる 1 個以上の基を有していてもよい C 1 - C 6 アルキル基である化合物；
式（1）において、 R^2 が $-S(O)_2 NR^7 R^{1\ 1}$ であり、 R^5 がカルボキシ基である化合物；
式（1）において、 R^2 が $-S(O)_2 NR^7 R^{1\ 1}$ であり、 R^5 が C 2 - C
15 6 アルコキシカルボニル基である化合物；
式（1）において、 R^2 が $-S(O)_2 NR^7 R^{1\ 1}$ であり、 R^5 が $-NR^{1\ 1} R^{1\ 2}$ である化合物；
式（1）において、 R^2 が $-S(O)_2 NR^7 R^{1\ 1}$ であり、 R^5 が $-OR^{1\ 4}$ である化合物；
20 式（1）において、 R^2 が $-S(O)_2 NR^7 R^{1\ 1}$ であり、 R^5 が群 Y より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；
式（1）において、 R^2 が $-S(O)_2 NR^7 R^{1\ 1}$ であり、 R^5 が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 4 アルキル基である化合物；

[0 1 2 9]

- 25 式（1）において、 R^2 が $-OR^{1\ 3}$ であり、 R^5 が水素原子である化合物；
式（1）において、 R^2 が $-OR^{1\ 3}$ であり、 R^5 がハロゲン原子である化合物；
式（1）において、 R^2 が $-OR^{1\ 3}$ であり、 R^5 が群 X より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよい C 1 - C 6 アルキル基である化合物；
30 式（1）において、 R^2 が $-OR^{1\ 3}$ であり、 R^5 がカルボキシ基である化合物；
式（1）において、 R^2 が $-OR^{1\ 3}$ であり、 R^5 が C 2 - C 6 アルコキシカルボニル基である化合物；
式（1）において、 R^2 が $-OR^{1\ 3}$ であり、 R^5 が $-NR^{1\ 1} R^{1\ 2}$ である
35 化合物；
式（1）において、 R^2 が $-OR^{1\ 3}$ であり、 R^5 が $-OR^{1\ 4}$ である化合物；
式（1）において、 R^2 が $-OR^{1\ 3}$ であり、 R^5 が群 Y より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；
40 式（1）において、 R^2 が $-OR^{1\ 3}$ であり、 R^5 が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 4 アルキル基である化合物；

[0 1 3 0]

- 式（1）において、 R^2 が $-S(O)_m R^{1\ 3}$ であり、 R^5 が水素原子である化合物；
45 式（1）において、 R^2 が $-S(O)_m R^{1\ 3}$ であり、 R^5 がハロゲン原子である化合物；

式(1)において、 R^2 が $-S(O)_m R^{13}$ であり、 R^5 が群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基である化合物；

式(1)において、 R^2 が $-S(O)_m R^{13}$ であり、 R^5 がカルボキシ基である化合物；

5 式(1)において、 R^2 が $-S(O)_m R^{13}$ であり、 R^5 がC2-C6アルコキシカルボニル基である化合物；

式(1)において、 R^2 が $-S(O)_m R^{13}$ であり、 R^5 が $-NR^{11}R^{12}$ である化合物；

10 式(1)において、 R^2 が $-S(O)_m R^{13}$ であり、 R^5 が $-OR^{14}$ である化合物；式(1)において、 R^2 が $-S(O)_m R^{13}$ であり、 R^5 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

式(1)において、 R^2 が $-S(O)_m R^{13}$ であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基である化合物；

[0131]

15 式(1)において、 R^2 が $-SF_5$ であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^2 が $-SF_5$ であり、 R^5 がハロゲン原子である化合物；

式(1)において、 R^2 が $-SF_5$ であり、 R^5 が群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基である化合物；

20 式(1)において、 R^2 が $-SF_5$ であり、 R^5 がカルボキシ基である化合物；

式(1)において、 R^2 が $-SF_5$ であり、 R^5 がC2-C6アルコキシカルボニル基である化合物；

25 式(1)において、 R^2 が $-SF_5$ であり、 R^5 が $-NR^{11}R^{12}$ である化合物；

式(1)において、 R^2 が $-SF_5$ であり、 R^5 が $-OR^{14}$ である化合物；

式(1)において、 R^2 が $-SF_5$ であり、 R^5 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

30 式(1)において、 R^2 が $-SF_5$ であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基である化合物；

[0132]

式(1)において、 R^2 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

35 式(1)において、 R^2 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基であり、 R^5 がハロゲン原子である化合物；

式(1)において、 R^2 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基であり、 R^5 が群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基である化合物；

40 式(1)において、 R^2 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基であり、 R^5 がカルボキシ基である化合物；

式(1)において、 R^2 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基であり、 R^5 がC2-C6アルコキシカルボニル基である化合物；

45 式(1)において、 R^2 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基であり、 R^5 が $-NR^{11}R^{12}$ である化合物；

式(1)において、 R^2 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-

C 4アルキル基であり、 R^5 が $-OR^{1\ 4}$ である化合物；

式 (1) において、 R^2 が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 4アルキル基であり、 R^5 が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 4アルキル基である化合物；

- 5 式 (1) において、 R^2 が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 4アルキル基であり、 R^5 が群 Y より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

[0 1 3 3]

式 (1) において、 R^2 が水素原子であり、 R^5 が水素原子である化合物；

- 10 式 (1) において、 R^2 が群 Y より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよいピリジル基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式 (1) において、 R^2 が群 Y より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよいピリミジニル基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

- 15 式 (1) において、 R^2 が群 Y より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよいチエニル基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式 (1) において、 R^2 が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 2－C 5アルキルカルボニル基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式 (1) において、 R^2 が群 Y より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよいベンゾイル基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

- 20 [0 1 3 4]

式 (1) において、 R^2 が水素原子であり、 R^5 がハロゲン原子である化合物；

式 (1) において、 R^2 が水素原子であり、 R^5 が群 X より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよい C 1－C 6アルキル基である化合物；

- 25 式 (1) において、 R^2 が水素原子であり、 R^5 が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 4アルキル基である化合物；

式 (1) において、 R^2 が水素原子であり、 R^5 が群 Y より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

- 30 式 (1) において、 R^2 が水素原子であり、 R^5 が群 Y より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよい 5 員芳香族複素環基である化合物；

式 (1) において、 R^2 が水素原子であり、 R^5 が群 Y より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよいピロリル基である化合物；

式 (1) において、 R^2 が水素原子であり、 R^5 が $-NR^{1\ 1} R^{1\ 2}$ である化合物；

- 35 式 (1) において、 R^2 が水素原子であり、 R^5 が $-OR^{1\ 4}$ である化合物；

式 (1) において、 R^2 が水素原子であり、 R^5 が $-S(O)_2 NR^7 R^{1\ 1}$ である化合物；

[0 1 3 5]

式 (1) において、 R^2 がニトロ基であり、 R^5 が $-OR^{1\ 4}$ である化合物；

- 40 [0 1 3 6]

式 (1) において、 R^3 がハロゲン原子であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式 (1) において、 R^3 がハロゲン原子であり、 R^5 がハロゲン原子である化合物；

- 45 式 (1) において、 R^3 がハロゲン原子であり、 R^5 が群 X より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよい C 1－C 6アルキル基である化合物；

式(1)において、 R^3 がハロゲン原子であり、 R^5 がカルボキシ基である化合物；

式(1)において、 R^3 がハロゲン原子であり、 R^5 がC2-C6アルコキシカルボニル基である化合物；

- 5 式(1)において、 R^3 がハロゲン原子であり、 R^5 が $-NR^{11}R^{12}$ である化合物；式(1)において、 R^3 がハロゲン原子であり、 R^5 が $-OR^{14}$ である化合物；

式(1)において、 R^3 がハロゲン原子であり、 R^5 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

- 10 式(1)において、 R^3 がハロゲン原子であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基である化合物；

[0137]

式(1)において、 R^3 がカルボキシ基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

- 15 式(1)において、 R^3 がカルボキシ基であり、 R^5 がハロゲン原子である化合物；

式(1)において、 R^3 がカルボキシ基であり、 R^5 が群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基である化合物；

- 20 式(1)において、 R^3 がカルボキシ基であり、 R^5 がカルボキシ基である化合物；

式(1)において、 R^3 がカルボキシ基であり、 R^5 がC2-C6アルコキシカルボニル基である化合物；

- 25 式(1)において、 R^3 がカルボキシ基であり、 R^5 が $-NR^{11}R^{12}$ である化合物；式(1)において、 R^3 がカルボキシ基であり、 R^5 が $-OR^{14}$ である化合物；

式(1)において、 R^3 がカルボキシ基であり、 R^5 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

式(1)において、 R^3 がカルボキシ基であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基である化合物；

- 30 [0138]

式(1)において、 R^3 がC2-C6アルコキシカルボニル基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^3 がC2-C6アルコキシカルボニル基であり、 R^5 がハロゲン原子である化合物；

- 35 式(1)において、 R^3 がC2-C6アルコキシカルボニル基であり、 R^5 が群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基である化合物；

式(1)において、 R^3 がC2-C6アルコキシカルボニル基であり、 R^5 がカルボキシ基である化合物；

- 40 式(1)において、 R^3 がC2-C6アルコキシカルボニル基であり、 R^5 がC2-C6アルコキシカルボニル基である化合物；

式(1)において、 R^3 がC2-C6アルコキシカルボニル基であり、 R^5 が $-NR^{11}R^{12}$ である化合物；

- 45 式(1)において、 R^3 がC2-C6アルコキシカルボニル基であり、 R^5 が $-OR^{14}$ である化合物；

式(1)において、 R^3 がC2-C6アルコキシカルボニル基であり、 R^5 が

群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；
式(1)において、 R^3 がC2-C6アルコキシカルボニル基であり、 R^5 が
1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基である化合
物；

5 [0139]

式(1)において、 R^3 がアミノカルボニル基であり、 R^5 が水素原子である
化合物；

式(1)において、 R^3 がアミノカルボニル基であり、 R^5 がハロゲン原子で
ある化合物；

10 式(1)において、 R^3 がアミノカルボニル基であり、 R^5 が群Xより選ばれ
る1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基である化合物；

式(1)において、 R^3 がアミノカルボニル基であり、 R^5 がカルボキシ基で
ある化合物；

式(1)において、 R^3 がアミノカルボニル基であり、 R^5 がC2-C6アル
15 コキシカルボニル基である化合物；

式(1)において、 R^3 がアミノカルボニル基であり、 R^5 が $-NR^{11}R^{12}$
である化合物；

式(1)において、 R^3 がアミノカルボニル基であり、 R^5 が $-OR^{14}$ であ
る化合物；式(1)において、 R^3 がアミノカルボニル基であり、 R^5 が群Y

20 より選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

式(1)において、 R^3 がアミノカルボニル基であり、 R^5 が1個以上のハロ
ゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基である化合物；

[0140]

式(1)において、 R^3 が群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよい
25 C1-C6アルキル基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^3 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-
C4アルキル基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^3 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-
C4アルキル基であり、 R^5 がハロゲン原子である化合物；

30 式(1)において、 R^3 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-
C4アルキル基であり、 R^5 が群Xより選ばれる1個以上の基を有していても
よいC1-C6アルキル基である化合物；

式(1)において、 R^3 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-
C4アルキル基であり、 R^5 がカルボキシ基である化合物；

35 式(1)において、 R^3 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-
C4アルキル基であり、 R^5 がC2-C6アルコキシカルボニル基である化合
物；

式(1)において、 R^3 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-
C4アルキル基であり、 R^5 が $-NR^{11}R^{12}$ である化合物；

40 式(1)において、 R^3 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-
C4アルキル基であり、 R^5 が $-OR^{14}$ である化合物；

式(1)において、 R^3 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-
C4アルキル基であり、 R^5 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していても
よいフェニル基である化合物；

45 式(1)において、 R^3 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-
C4アルキル基であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC

1-C4アルキル基である化合物；

[0141]

式(1)において、 R^3 が水素原子であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^3 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-

5 C4アルケニル基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^3 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C4アルキニル基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^3 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

10 式(1)において、 R^3 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよい6員芳香族複素環基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^3 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいピリジル基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

15 式(1)において、 R^3 が $-NR^{11}R^{12}$ であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^3 が $-OR^{14}$ であり、 R^5 が水素原子である化合物；

[0142]

式(1)において、 R^3 が水素原子であり、 R^5 がハロゲン原子である化合物；

20 式(1)において、 R^3 が水素原子であり、 R^5 が群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基である化合物；

式(1)において、 R^3 が水素原子であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基である化合物；

25 式(1)において、 R^3 が水素原子であり、 R^5 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよい5員芳香族複素環基である化合物；

式(1)において、 R^3 が水素原子であり、 R^5 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいピロリル基である化合物；

式(1)において、 R^3 が水素原子であり、 R^5 が $-NR^{11}R^{12}$ である化合物；

30 式(1)において、 R^3 が水素原子であり、 R^5 が $-OR^{14}$ である化合物；

[0143]

式(1)において、 R^4 がハロゲン原子であり、 R^5 が水素原子である化合物；

35 式(1)において、 R^4 がハロゲン原子であり、 R^5 がハロゲン原子である化合物；

式(1)において、 R^4 がハロゲン原子であり、 R^5 が群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基である化合物；

式(1)において、 R^4 がハロゲン原子であり、 R^5 がカルボキシ基である化合物；

40 式(1)において、 R^4 がハロゲン原子であり、 R^5 がC2-C6アルコキシカルボニル基である化合物；

式(1)において、 R^4 がハロゲン原子であり、 R^5 が $-NR^{11}R^{12}$ である化合物；式(1)において、 R^4 がハロゲン原子であり、 R^5 が $-OR^{14}$ である化合物；

45 式(1)において、 R^4 がハロゲン原子であり、 R^5 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

式(1)において、 R^4 がハロゲン原子であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基である化合物；

[0144]

式(1)において、 R^4 がカルボキシ基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^4 がカルボキシ基であり、 R^5 がハロゲン原子である化合物；

式(1)において、 R^4 がカルボキシ基であり、 R^5 が群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基である化合物；

式(1)において、 R^4 がカルボキシ基であり、 R^5 がカルボキシ基である化合物；

式(1)において、 R^4 がカルボキシ基であり、 R^5 がC2-C6アルコキシカルボニル基である化合物；

式(1)において、 R^4 がカルボキシ基であり、 R^5 が $-NR^{11}R^{12}$ である化合物；式(1)において、 R^4 がカルボキシ基であり、 R^5 が $-OR^{14}$ である化合物；

式(1)において、 R^4 がカルボキシ基であり、 R^5 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

式(1)において、 R^4 がカルボキシ基であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基である化合物；

[0145]

式(1)において、 R^4 がC2-C6アルコキシカルボニル基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^4 がC2-C6アルコキシカルボニル基であり、 R^5 がハロゲン原子である化合物；

式(1)において、 R^4 がC2-C6アルコキシカルボニル基であり、 R^5 が群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基である化合物；

式(1)において、 R^4 がC2-C6アルコキシカルボニル基であり、 R^5 がカルボキシ基である化合物；

式(1)において、 R^4 がC2-C6アルコキシカルボニル基であり、 R^5 がC2-C6アルコキシカルボニル基である化合物；

式(1)において、 R^4 がC2-C6アルコキシカルボニル基であり、 R^5 が $-NR^{11}R^{12}$ である化合物；

式(1)において、 R^4 がC2-C6アルコキシカルボニル基であり、 R^5 が $-OR^{14}$ である化合物；

式(1)において、 R^4 がC2-C6アルコキシカルボニル基であり、 R^5 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

式(1)において、 R^4 がC2-C6アルコキシカルボニル基であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基である化合物；

[0146]

式(1)において、 R^4 がアミノカルボニル基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^4 がアミノカルボニル基であり、 R^5 がハロゲン原子である化合物；

式(1)において、 R^4 がアミノカルボニル基であり、 R^5 が群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基である化合物；

式(1)において、 R^4 がアミノカルボニル基であり、 R^5 がカルボキシ基である化合物；

- 5 式(1)において、 R^4 がアミノカルボニル基であり、 R^5 がC2-C6アルコキシカルボニル基である化合物；

式(1)において、 R^4 がアミノカルボニル基であり、 R^5 が $-NR^{11}R^{12}$ である化合物；

- 10 式(1)において、 R^4 がアミノカルボニル基であり、 R^5 が $-OR^{14}$ である化合物；式(1)において、 R^4 がアミノカルボニル基であり、 R^5 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

式(1)において、 R^4 がアミノカルボニル基であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基である化合物；

[0147]

- 15 式(1)において、 R^4 が群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^4 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

- 20 式(1)において、 R^4 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基であり、 R^5 がハロゲン原子である化合物；

式(1)において、 R^4 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基であり、 R^5 が群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基である化合物；

- 25 式(1)において、 R^4 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基であり、 R^5 がカルボキシ基である化合物；

式(1)において、 R^4 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基であり、 R^5 がC2-C6アルコキシカルボニル基である化合物；

- 30 式(1)において、 R^4 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基であり、 R^5 が $-NR^{11}R^{12}$ である化合物；

式(1)において、 R^4 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基であり、 R^5 が $-OR^{14}$ である化合物；

- 35 式(1)において、 R^4 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基であり、 R^5 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

式(1)において、 R^4 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基である化合物；

[0148]

- 40 式(1)において、 R^4 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^4 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基であり、 R^5 がハロゲン原子である化合物；

- 45 式(1)において、 R^4 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基であり、 R^5 が群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基である化合物；

式(1)において、 R^4 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基であり、 R^5 が $-NR^{11}R^{12}$ である化合物；

式(1)において、 R^4 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基であり、 R^5 が $-OR^{14}$ である化合物；

5 [0149]

式(1)において、 R^4 が水素原子であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^4 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^4 が $-OR^{11}$ であり、 R^5 が水素原子である化合物；

10 式(1)において、 R^4 が水素原子であり、 R^5 がハロゲン原子である化合物；

式(1)において、 R^4 が水素原子であり、 R^5 が群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基である化合物；

15 式(1)において、 R^4 が水素原子であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基である化合物；

式(1)において、 R^4 が水素原子であり、 R^5 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

式(1)において、 R^4 が水素原子であり、 R^5 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよい5員芳香族複素環基である化合物；

20 式(1)において、 R^4 が水素原子であり、 R^5 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいピロリル基である化合物；

式(1)において、 R^4 が水素原子であり、 R^5 がC2-C6アルコキシカルボニル基である化合物；

25 式(1)において、 R^4 が水素原子であり、 R^5 がC2-C4アルコキシカルボニル基である化合物；

式(1)において、 R^4 が水素原子であり、 R^5 が $-NR^{11}R^{12}$ である化合物；

式(1)において、 R^4 が水素原子であり、 R^5 が $-OR^{14}$ である化合物；

30 式(1)において、 R^4 が水素原子であり、 R^5 が $-S(O)_2NR^7R^{11}$ である化合物；

[0150]

式(1)において、 R^1 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 が水素原子である化合物；式(1)において、 R^1 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 がハロゲン原子である化合物；

35 式(1)において、 R^1 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 が群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基である化合物；

式(1)において、 R^1 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 がカルボキシ基である化合物；

40 式(1)において、 R^1 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 がC2-C6アルコキシカルボニル基である化合物；

式(1)において、 R^1 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 が $-NR^{11}R^{12}$ である化合物；

式(1)において、 R^1 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 が $-OR^{14}$ である化合物；

45 式(1)において、 R^1 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

式(1)において、 R^1 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基である化合物；

[0151]

式(1)において、 R^2 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 がハロゲン原子である化合物；

式(1)において、 R^2 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 が群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基である化合物；

式(1)において、 R^2 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 がカルボキシ基である化合物；

式(1)において、 R^2 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 がC2-C6アルコキシカルボニル基である化合物；

式(1)において、 R^2 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 が $-NR^{11}R^{12}$ である化合物；

式(1)において、 R^2 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 が $-OR^{14}$ である化合物；

式(1)において、 R^2 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

式(1)において、 R^2 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基である化合物；

[0152]

式(1)において、 R^3 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 が水素原子である化合物；式(1)において、 R^3 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 がハロゲン原子である化合物；

式(1)において、 R^3 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 が群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基である化合物；

式(1)において、 R^3 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 がカルボキシ基である化合物；

式(1)において、 R^3 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 がC2-C6アルコキシカルボニル基である化合物；

式(1)において、 R^3 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 が $-NR^{11}R^{12}$ である化合物；

式(1)において、 R^3 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 が $-OR^{14}$ である化合物；

式(1)において、 R^3 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

式(1)において、 R^3 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基である化合物；

[0153]

式(1)において、 R^4 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 が水素原子である化合物；式(1)において、 R^4 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 がハロゲン原子である化合物；

式(1)において、 R^4 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 が群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基である化合物；

式(1)において、 R^4 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 がカルボキシ基である化合物；

式(1)において、 R^4 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 がC2-C6ア

ルコキシカルボニル基である化合物；

式（１）において、 R^4 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 が $-NR^{11}R^{12}$ である化合物；

式（１）において、 R^4 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 が $-OR^{14}$ である化合物；

式（１）において、 R^4 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 が群 Y より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

式（１）において、 R^4 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 4 アルキル基である化合物；

[0154]

式（１）において、 R^1 がハロゲン原子であり、 R^5 がトリフルオロメチル基である

化合物；

式（１）において、 R^1 が群 X より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよい C 1 - C 6 アルキル基であり、 R^5 がトリフルオロメチル基である化合物；

式（１）において、 R^1 が群 Y より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよいフェニル基であり、 R^5 がトリフルオロメチル基である化合物；

式（１）において、 R^1 が群 Y より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよい 6 員芳香族複素環基であり、 R^5 がトリフルオロメチル基である化合物；

式（１）において、 R^1 が群 Y より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよい 5 員芳香族複素環基であり、 R^5 がトリフルオロメチル基である化合物；

式（１）において、 R^1 がカルボキシ基であり、 R^5 がトリフルオロメチル基である化合物；

式（１）において、 R^1 が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 2 - C 6 アルキルカルボニル基であり、 R^5 がトリフルオロメチル基である化合物；

式（１）において、 R^1 が C 2 - C 6 アルコキシカルボニル基であり、 R^5 がトリフルオロメチル基である化合物；

式（１）において、 R^1 がアミノカルボニル基であり、 R^5 がトリフルオロメチル基である化合物；

式（１）において、 R^1 が $-OR^{11}$ であり、 R^5 がトリフルオロメチル基である化合物；

式（１）において、 R^1 が $-S(O)_mR^{11}$ であり、 R^5 がトリフルオロメチル基である化合物；

式（１）において、 R^1 が $-SF_5$ であり、 R^5 がトリフルオロメチル基である化合物；式（１）において、 R^1 が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 4 アルキル基であり、 R^5 がトリフルオロメチル基である化合物；

[0155]

式（１）において、 R^2 がハロゲン原子であり、 R^5 がトリフルオロメチル基である化合物；

式（１）において、 R^2 が群 X より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよい C 1 - C 6 アルキル基であり、 R^5 がトリフルオロメチル基である化合物；

式（１）において、 R^2 が群 Y より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよいフェニル基であり、 R^5 がトリフルオロメチル基である化合物；

式（１）において、 R^2 が群 Y より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよい

6員芳香族複素環基であり、 R^5 がトリフルオロメチル基である化合物；
 式（1）において、 R^2 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよい
 5 5員芳香族複素環基であり、 R^5 がトリフルオロメチル基である化合物；
 式（1）において、 R^2 がカルボキシ基であり、 R^5 がトリフルオロメチル基
 である化合物；

[0156]

式（1）において、 R^2 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2－
 C6アルキルカルボニル基であり、 R^5 がトリフルオロメチル基である化合物
 ；

10 式（1）において、 R^2 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよい
 ベンゾイル基であり、 R^5 がトリフルオロメチル基である化合物；
 式（1）において、 R^2 がC2－C6アルコキシカルボニル基であり、 R^5 が
 トリフルオロメチル基である化合物；

[0157]

15 式（1）において、 R^2 がアミノカルボニル基であり、 R^5 がトリフルオロメ
 チル基である化合物；

式（1）において、 R^2 が $-NR^{1,2}R^{1,3}$ であり、 R^5 がトリフルオロメチ
 ル基である化合物；

20 式（1）において、 R^2 が $-S(O)_2NR^7R^{1,1}$ であり、 R^5 がトリフル
 オロメチル基である化合物；

式（1）において、 R^2 が $-OR^{1,3}$ であり、 R^5 がトリフルオロメチル基で
 ある化合物；

式（1）において、 R^2 が $-S(O)_mR^{1,3}$ であり、 R^5 がトリフルオロメ
 チル基である化合物；

25 式（1）において、 R^2 が $-SF_5$ であり、 R^5 がトリフルオロメチル基であ
 る化合物；式（1）において、 R^2 が1個以上のハロゲン原子を有していても
 よいC1－C4アルキル基であり、 R^5 がトリフルオロメチル基である化合物
 ；

[0158]

30 式（1）において、 R^3 がハロゲン原子であり、 R^5 がトリフルオロメチル基
 である化合物；

式（1）において、 R^3 がカルボキシ基であり、 R^5 がトリフルオロメチル基
 である化合物；

35 式（1）において、 R^3 がC2－C6アルコキシカルボニル基であり、 R^5 が
 トリフルオロメチル基である化合物；

式（1）において、 R^3 がアミノカルボニル基であり、 R^5 がトリフルオロメ
 チル基である化合物；

式（1）において、 R^3 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1－
 C4アルキル基であり、 R^5 がトリフルオロメチル基である化合物；

40 [0159]

式（1）において、 R^4 がハロゲン原子であり、 R^5 がトリフルオロメチル基
 である化合物；

式（1）において、 R^4 がカルボキシ基であり、 R^5 がトリフルオロメチル基
 である化合物；

45 式（1）において、 R^4 がC2－C6アルコキシカルボニル基であり、 R^5 が
 トリフルオロメチル基である化合物；

式(1)において、 R^4 がアミノカルボニル基であり、 R^5 がトリフルオロメチル基である化合物；

式(1)において、 R^4 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基であり、 R^5 がトリフルオロメチル基である化合物；

5 [0160]

式(1)において、 R^1 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^2 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^3 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^4 が水素原子である化合物；

10 式(1)において、 R^5 が水素原子である化合物；

[0161]

式(1)において、 R^1 がフッ素原子である化合物；

式(1)において、 R^2 がフッ素原子である化合物；

式(1)において、 R^3 がフッ素原子である化合物；

15 式(1)において、 R^4 がフッ素原子である化合物；

式(1)において、 R^5 がフッ素原子である化合物；

[0162]

式(1)において、 R^1 が塩素原子である化合物；

式(1)において、 R^2 が塩素原子である化合物；

20 式(1)において、 R^3 が塩素原子である化合物；

式(1)において、 R^4 が塩素原子である化合物；

式(1)において、 R^5 が塩素原子である化合物；

式(1)において、 R^1 が臭素原子である化合物；

式(1)において、 R^2 が臭素原子である化合物；

25 式(1)において、 R^3 が臭素原子である化合物；

式(1)において、 R^4 が臭素原子である化合物；

式(1)において、 R^5 が臭素原子である化合物；

[0163]

式(1)において、 R^1 がヨウ素原子である化合物；

30 式(1)において、 R^2 がヨウ素原子である化合物；

式(1)において、 R^3 がヨウ素原子である化合物；

式(1)において、 R^4 がヨウ素原子である化合物；

式(1)において、 R^5 がヨウ素原子である化合物；

[0164]

35 式(1)において、 R^1 がメチル基である化合物；

式(1)において、 R^2 がメチル基である化合物；

式(1)において、 R^3 がメチル基である化合物；

式(1)において、 R^4 がメチル基である化合物；

式(1)において、 R^5 がメチル基である化合物；

40 [0165]

式(1)において、 R^1 がエチル基である化合物；

式(1)において、 R^2 がエチル基である化合物；

式(1)において、 R^3 がエチル基である化合物；

式(1)において、 R^4 がエチル基である化合物；

45 式(1)において、 R^5 がエチル基である化合物；

式(1)において、 R^1 がイソプロピル基である化合物；

式(1)において、 R^2 がイソプロピル基である化合物；
式(1)において、 R^3 がイソプロピル基である化合物；
式(1)において、 R^4 がイソプロピル基である化合物；
式(1)において、 R^5 がイソプロピル基である化合物；

5 [0166]

式(1)において、 R^1 がtert-ブチル基である化合物；
式(1)において、 R^2 がtert-ブチル基である化合物；
式(1)において、 R^3 がtert-ブチル基である化合物；
式(1)において、 R^4 がtert-ブチル基である化合物；
10 式(1)において、 R^5 がtert-ブチル基である化合物；
式(1)において、 R^1 がジフルオロメチル基である化合物；
式(1)において、 R^2 がジフルオロメチル基である化合物；
式(1)において、 R^3 がジフルオロメチル基である化合物；
式(1)において、 R^4 がジフルオロメチル基である化合物；
15 式(1)において、 R^5 がジフルオロメチル基である化合物；
式(1)において、 R^1 がトリフルオロメチル基である化合物；
式(1)において、 R^2 がトリフルオロメチル基である化合物；
式(1)において、 R^3 がトリフルオロメチル基である化合物；
式(1)において、 R^4 がトリフルオロメチル基である化合物；
20 式(1)において、 R^5 がトリフルオロメチル基である化合物；

[0167]

式(1)において、 R^1 が2, 2, 2-トリフルオロエチル基である化合物；
式(1)において、 R^2 が2, 2, 2-トリフルオロエチル基である化合物；
式(1)において、 R^3 が2, 2, 2-トリフルオロエチル基である化合物；
25 式(1)において、 R^4 が2, 2, 2-トリフルオロエチル基である化合物；
式(1)において、 R^5 が2, 2, 2-トリフルオロエチル基である化合物；
式(1)において、 R^1 がペンタフルオロエチル基である化合物；
式(1)において、 R^2 がペンタフルオロエチル基である化合物；
式(1)において、 R^3 がペンタフルオロエチル基である化合物；
30 式(1)において、 R^4 がペンタフルオロエチル基である化合物；
式(1)において、 R^5 がペンタフルオロエチル基である化合物；

[0168]

式(1)において、 R^1 がヘプタフルオロプロピル基である化合物；
式(1)において、 R^2 がヘプタフルオロプロピル基である化合物；
35 式(1)において、 R^3 がヘプタフルオロプロピル基である化合物；
式(1)において、 R^4 がヘプタフルオロプロピル基である化合物；
式(1)において、 R^5 がヘプタフルオロプロピル基である化合物；
式(1)において、 R^1 がヘプタフルオロイソプロピル基である化合物；
式(1)において、 R^2 がヘプタフルオロイソプロピル基である化合物；
40 式(1)において、 R^3 がヘプタフルオロイソプロピル基である化合物；
式(1)において、 R^4 がヘプタフルオロイソプロピル基である化合物；
式(1)において、 R^5 がヘプタフルオロイソプロピル基である化合物；

[0169]

式(1)において、 R^1 がメトキシカルボニル基である化合物；
45 式(1)において、 R^2 がメトキシカルボニル基である化合物；
式(1)において、 R^3 がメトキシカルボニル基である化合物；

式(1)において、 R^4 がメトキシカルボニル基である化合物；
 式(1)において、 R^5 がメトキシカルボニル基である化合物；
 式(1)において、 R^1 がエトキシカルボニル基である化合物；
 式(1)において、 R^2 がエトキシカルボニル基である化合物；
 5 式(1)において、 R^3 がエトキシカルボニル基である化合物；
 式(1)において、 R^4 がエトキシカルボニル基である化合物；
 式(1)において、 R^5 がエトキシカルボニル基である化合物；

[0170]

式(1)において、 R^1 がジフルオロメトキシカルボニル基である化合物；
 10 式(1)において、 R^2 がジフルオロメトキシカルボニル基である化合物；
 式(1)において、 R^3 がジフルオロメトキシカルボニル基である化合物；
 式(1)において、 R^4 がジフルオロメトキシカルボニル基である化合物；
 式(1)において、 R^5 がジフルオロメトキシカルボニル基である化合物；

[0171]

15 式(1)において、 R^1 がトリフルオロメトキシカルボニル基である化合物；
 式(1)において、 R^2 がトリフルオロメトキシカルボニル基である化合物；
 式(1)において、 R^3 がトリフルオロメトキシカルボニル基である化合物；
 式(1)において、 R^4 がトリフルオロメトキシカルボニル基である化合物；
 式(1)において、 R^5 がトリフルオロメトキシカルボニル基である化合物；

20 [0172]

式(1)において、 R^1 が2, 2, 2-トリフルオロエトキシカルボニル基である化合物；

式(1)において、 R^2 が2, 2, 2-トリフルオロエトキシカルボニル基である化合物；

25 式(1)において、 R^3 が2, 2, 2-トリフルオロエトキシカルボニル基である化合物；

式(1)において、 R^4 が2, 2, 2-トリフルオロエトキシカルボニル基である化合物；

式(1)において、 R^5 が2, 2, 2-トリフルオロエトキシカルボニル基である化合物；

30 [0173]

式(1)において、 R^1 がヒドロキシ基である化合物；

式(1)において、 R^1 がメトキシ基である化合物；

式(1)において、 R^1 がアミノ基である化合物；

35 式(1)において、 R^1 がジメチルアミノ基である化合物；

式(1)において、 R^1 が2-チエニル基である化合物；

[0174]

式(1)において、 R^2 が2-クロロフェニル基である化合物；

式(1)において、 R^2 が3-クロロフェニル基である化合物；

40 式(1)において、 R^2 が4-クロロフェニル基である化合物；

式(1)において、 R^2 が4-トリフルオロメチルフェニル基である化合物；

式(1)において、 R^2 が2-ピリジル基である化合物；

式(1)において、 R^2 が3-ピリジル基である化合物；

式(1)において、 R^2 が4-ピリジル基である化合物；

45 式(1)において、 R^2 が2-ピリミジニル基である化合物；

式(1)において、 R^2 が2-チエニル基である化合物；

- 式(1)において、 R^2 がアセチル基である化合物；
 式(1)において、 R^2 がトリフルオロアセチル基である化合物；
 式(1)において、 R^2 がアミノ基である化合物；
 式(1)において、 R^2 がアセチルアミノ基である化合物；
 5 式(1)において、 R^2 がトリフルオロアセチルアミノ基である化合物；
 式(1)において、 R^2 がベンゾイルアミノ基である化合物；
 式(1)において、 R^2 が2-チエニルカルボニルアミノ基である化合物；
 式(1)において、 R^2 が3-(2-クロロフェニル)ウレイド基である化合物；
 10 式(1)において、 R^2 がメチルスルホニルアミノ基である化合物；
 式(1)において、 R^2 がトリフルオロメチルスルホニルアミノ基である化合物；
 式(1)において、 R^2 が4-メチルフェニルスルホニルアミノ基である化合物；
 15 式(1)において、 R^2 が4-クロロフェニルスルホニルアミノ基である化合物；
 式(1)において、 R^2 がベンジルスルホニルアミノ基である化合物；
 式(1)において、 R^2 がヒドロキシ基である化合物；
 式(1)において、 R^2 がメトキシ基である化合物；
 20 式(1)において、 R^2 がトリフルオロメトキシ基である化合物；
 式(1)において、 R^2 がメチルチオ基である化合物；
 式(1)において、 R^2 がトリフルオロメチルチオ基である化合物；
 式(1)において、 R^2 がトリフルオロメチルスルフィニル基である化合物；
 式(1)において、 R^2 がトリフルオロメチルスルホニル基である化合物；
 25 [0175]
 式(1)において、 R^3 がビニル基である化合物；
 式(1)において、 R^3 がエチニル基である化合物；
 式(1)において、 R^3 が4-トリフルオロメトキシフェニル基である化合物；
 30 式(1)において、 R^3 が6-トリフルオロメチルー3-ピリジル基である化合物；
 式(1)において、 R^3 が1-ジフルオロメチルー3-ピラゾリジル基である化合物；
 式(1)において、 R^3 がアミノ基である化合物；
 35 式(1)において、 R^3 がヒドロキシ基である化合物；
 式(1)において、 R^3 がメトキシ基である化合物；
 式(1)において、 R^3 がプロパルギルオキシ基である化合物；
 式(1)において、 R^3 が3-メトキシベンジロキシ基である化合物；
 式(1)において、 R^3 が4-トリフルオロメチルベンジロキシ基である化合物；
 40 物；
 [0176]
 式(1)において、 R^4 が3-メチルフェニル基である化合物；
 式(1)において、 R^4 が2-メトキシフェニル基である化合物；
 式(1)において、 R^4 がヒドロキシ基である化合物；
 45 式(1)において、 R^4 がメトキシ基である化合物；
 式(1)において、 R^4 が2-メチルフェノキシ基である化合物；

式(1)において、 R^4 が4-トリフルオロメチルフェノキシ基である化合物；
式(1)において、 R^4 が4-トリフルオロメトキシフェノキシ基である化合物；

5 [0177]

- 式(1)において、 R^5 が1-ピロリル基である化合物；
式(1)において、 R^5 がアミノ基である化合物；
式(1)において、 R^5 がメチルアミノ基である化合物；
式(1)において、 R^5 がジメチルアミノ基である化合物；
10 式(1)において、 R^5 がホルミルアミノ基である化合物；
式(1)において、 R^5 がアセチルアミノ基である化合物；
式(1)において、 R^5 がトリフルオロアセチルアミノ基である化合物；
式(1)において、 R^5 がベンゾイルアミノ基である化合物；
式(1)において、 R^5 が5-ブロモ-2-チエニルカルボニルアミノ基である化合物；
15 式(1)において、 R^5 が2, 5-ジクロロ-3-チエニルカルボニルアミノ基である化合物；
式(1)において、 R^5 が1-メチル-3-ピラゾリルカルボニルアミノ基である化合物；
式(1)において、 R^5 が1, 5-ジメチル-3-ピラゾリルカルボニルアミノ基である化合物；
20 式(1)において、 R^5 が1, 4-ジメチル-5-ピラゾリルカルボニルアミノ基である化合物；
式(1)において、 R^5 が3-メチル-5-イソキサゾリルカルボニルアミノ基である化合物；
25 式(1)において、 R^5 がヒドロキシ基である化合物；
式(1)において、 R^5 がメトキシ基である化合物；
式(1)において、 R^5 がエトキシ基である化合物；
式(1)において、 R^5 がイソプロポキシ基である化合物；
式(1)において、 R^5 がアリルオキシ基である化合物；
30 式(1)において、 R^5 がベンジロキシ基である化合物；
式(1)において、 R^5 がアセチルオキシ基である化合物；
式(1)において、 R^5 が2-クロロベンゾイルオキシ基である化合物；
式(1)において、 R^5 が4-メチルフェニルスルホニルオキシ基である化合物；
35 式(1)において、 R^5 がN-メチル-アミノスルホニル基である化合物；
式(1)において、 R^5 がN-(3-クロロベンジル)-アミノスルホニル基である化合物；
式(1)において、 R^5 がN-(4-メチルフェニル)-アミノスルホニル基である化合物；
40 式(1)において、 R^5 がN-(4-メチルフェニル)-アミノスルホニル基である化合物；
式(1)において、 R^5 がN-(2-ピリジルメチル)-アミノスルホニル基である化合物；

[0178]

- 45 式(1)において、 R^1 が水素原子であり、 R^5 が水素原子である化合物；
式(1)において、 R^1 がフッ素原子であり、 R^5 が水素原子である化合物；

- 式(1)において、 R^1 が塩素原子であり、 R^5 が水素原子である化合物；
 式(1)において、 R^1 が臭素原子であり、 R^5 が水素原子である化合物；
 式(1)において、 R^1 がヨウ素原子であり、 R^5 が水素原子である化合物；
 式(1)において、 R^1 がニトロ基であり、 R^5 が水素原子である化合物；
 5 式(1)において、 R^1 がアミノ基であり、 R^5 が水素原子である化合物；
 式(1)において、 R^1 がジメチルアミノ基であり、 R^5 が水素原子である化合物；
 式(1)において、 R^1 がメトキシ基であり、 R^5 が水素原子である化合物；
 式(1)において、 R^1 がメチル基であり、 R^5 が水素原子である化合物；
 10 式(1)において、 R^1 がジフルオロメチル基であり、 R^5 が水素原子である化合物；
 式(1)において、 R^1 がペンタフルオロエチル基であり、 R^5 が水素原子である化合物；
 式(1)において、 R^1 がメトキシカルボニル基であり、 R^5 が水素原子である化合物；式(1)において、 R^1 がフェニル基であり、 R^5 が水素原子である化合物；
 15 式(1)において、 R^1 が2-チエニル基であり、 R^5 が水素原子である化合物；
 [0179]
 20 式(1)において、 R^1 が水素原子であり、 R^5 が塩素原子である化合物；
 式(1)において、 R^1 が水素原子であり、 R^5 がニトロ基である化合物；
 式(1)において、 R^1 が水素原子であり、 R^5 がアミノ基である化合物；
 式(1)において、 R^1 が水素原子であり、 R^5 がホルミルアミノ基である化合物；
 25 式(1)において、 R^1 が水素原子であり、 R^5 がアセチルアミノ基である化合物；
 式(1)において、 R^1 が水素原子であり、 R^5 がトリフルオロアセチルアミノ基である化合物；
 式(1)において、 R^1 が水素原子であり、 R^5 がベンゾイルアミノ基である化合物；
 30 式(1)において、 R^1 が水素原子であり、 R^5 が5-ブロモ-2-チエニルカルボニルアミノ基である化合物；
 式(1)において、 R^1 が水素原子であり、 R^5 が2, 5-ジクロロ-3-チエニルカルボニルアミノ基である化合物；
 35 式(1)において、 R^1 が水素原子であり、 R^5 が1-メチル-3-ピラゾリルカルボニルアミノ基である化合物；
 式(1)において、 R^1 が水素原子であり、 R^5 が1, 5-ジメチル-3-ピラゾリルカルボニルアミノ基である化合物；
 式(1)において、 R^1 が水素原子であり、 R^5 が1, 4-ジメチル-5-ピラゾリルカルボニルアミノ基である化合物；
 40 式(1)において、 R^1 が水素原子であり、 R^5 が3-メチル-5-イソキサゾリルカルボニルアミノ基である化合物；
 式(1)において、 R^1 が水素原子であり、 R^5 がヒドロキシ基である化合物；
 45 式(1)において、 R^1 が水素原子であり、 R^5 がメトキシ基である化合物；
 式(1)において、 R^1 が水素原子であり、 R^5 がエトキシ基である化合物；

- 式(1)において、 R^1 が水素原子であり、 R^5 がイソプロポキシ基である化合物；
- 式(1)において、 R^1 が水素原子であり、 R^5 がアリルオキシ基である化合物；
- 5 式(1)において、 R^1 が水素原子であり、 R^5 がベンジロキシ基である化合物；
- 式(1)において、 R^1 が水素原子であり、 R^5 がアセチルオキシ基である化合物；
- 式(1)において、 R^1 が水素原子であり、 R^5 が2-クロロベンゾイルオキシ基である化合物；
- 10 式(1)において、 R^1 が水素原子であり、 R^5 が4-メチルフェニルスルホンオキシ基である化合物；
- 式(1)において、 R^1 が水素原子であり、 R^5 がN-メチルーアミノスルホン基である化合物；
- 15 式(1)において、 R^1 が水素原子であり、 R^5 がN-(3-クロロベンジル)-アミノスルホン基である化合物；
- 式(1)において、 R^1 が水素原子であり、 R^5 がN-(4-メチルフェニル)-アミノスルホン基である化合物；
- 式(1)において、 R^1 が水素原子であり、 R^5 がN-(4-メチルベンジル)-アミノスルホン基である化合物；
- 20 式(1)において、 R^1 が水素原子であり、 R^5 がN-(2-ピリジルメチル)-アミノスルホン基である化合物；
- 式(1)において、 R^1 が水素原子であり、 R^5 がアセチルオキシ基である化合物
- 25 式(1)において、 R^1 が水素原子であり、 R^5 がメチル基である化合物；
- 式(1)において、 R^1 が水素原子であり、 R^5 がトリフルオロメチル基である化合物；式(1)において、 R^1 が水素原子であり、 R^5 がヘプタフルオロプロピル基である化合物；
- 式(1)において、 R^1 が水素原子であり、 R^5 がメトキシカルボニル基である化合物；式(1)において、 R^1 が水素原子であり、 R^5 がフェニル基である化合物；
- 30 式(1)において、 R^1 が水素原子であり、 R^5 が1-ピロリル基である化合物；
- [0180]
- 35 式(1)において、 R^1 が塩素原子であり、 R^5 がアミノ基である化合物；
- [0181]
- 式(1)において、 R^2 が水素原子であり、 R^5 が水素原子である化合物；
- 式(1)において、 R^2 がシアノ基であり、 R^5 が水素原子である化合物；
- 式(1)において、 R^2 がニトロ基であり、 R^5 が水素原子である化合物；
- 40 式(1)において、 R^2 がフッ素原子であり、 R^5 が水素原子である化合物；
- 式(1)において、 R^2 が塩素原子であり、 R^5 が水素原子である化合物；
- 式(1)において、 R^2 が臭素原子であり、 R^5 が水素原子である化合物；
- 式(1)において、 R^2 がヨウ素原子であり、 R^5 が水素原子である化合物；
- 式(1)において、 R^2 がメチル基であり、 R^5 が水素原子である化合物；
- 45 式(1)において、 R^2 がジフルオロメチル基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^2 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 が水素原子である化合物；式(1)において、 R^2 がペンタフルオロエチル基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^2 がヘプタフルオロプロピル基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^2 がtert-ブチル基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^2 が2-クロロフェニル基であり、 R^5 が水素原子である化合物；式(1)において、 R^2 が3-クロロフェニル基であり、 R^5 が水素原子である化合物；式(1)において、 R^2 が4-クロロフェニル基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^2 が4-トリフルオロメチルフェニル基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^2 が2-ピリジル基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^2 が3-ピリジル基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^2 が4-ピリジル基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^2 が2-ピリミジニル基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^2 が2-チエニル基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^2 がアセチル基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^2 がトリフルオロアセチル基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^2 がベンゾイル基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^2 がメトキシカルボニル基であり、 R^5 が水素原子である化合物；式(1)において、 R^2 がアミノ基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^2 がアセチルアミノ基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^2 がクロロアセチルアミノ基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^2 がトリフルオロアセチルアミノ基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^2 がベンゾイルアミノ基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^2 が2-チエニルカルボニルアミノ基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^2 がメチルスルホニルアミノ基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^2 がトリフルオロメチルスルホニルアミノ基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^2 が4-クロロフェニルスルホニルアミノ基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^2 が4-メチルフェニルスルホニルアミノ基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^2 がベンジルスルホニルアミノ基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

5 式(1)において、 R^2 がヒドロキシ基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^2 がメトキシ基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^2 がトリフルオロメトキシ基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

10 式(1)において、 R^2 がメチルチオ基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^2 がトリフルオロメチルチオ基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

15 式(1)において、 R^2 がトリフルオロメチルスルフィニル基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^2 がトリフルオロメチルスルホニル基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

[0182]

式(1)において、 R^2 が水素原子であり、 R^5 が塩素原子である化合物；

20 式(1)において、 R^2 が水素原子であり、 R^5 がニトロ基である化合物；

式(1)において、 R^2 が水素原子であり、 R^5 がメチル基である化合物；

式(1)において、 R^2 が水素原子であり、 R^5 がトリフルオロメチル基である化合物；式(1)において、 R^2 が水素原子であり、 R^5 がメトキシカルボニル基である化合物；式(1)において、 R^2 が水素原子であり、 R^5 がフェニル基である化合物；

25 式(1)において、 R^2 が水素原子であり、 R^5 が1-ピロリル基である化合物；

式(1)において、 R^2 が水素原子であり、 R^5 がアミノ基である化合物；

30 式(1)において、 R^2 が水素原子であり、 R^5 がホルミルアミノ基である化合物；

式(1)において、 R^2 が水素原子であり、 R^5 がアセチルアミノ基である化合物；

式(1)において、 R^2 が水素原子であり、 R^5 がトリフルオロアセチルアミノ基である化合物；

35 式(1)において、 R^2 が水素原子であり、 R^5 がベンゾイルアミノ基である化合物；

式(1)において、 R^2 が水素原子であり、 R^5 が5-ブロモ-2-チエニルカルボニルアミノ基である化合物；

40 式(1)において、 R^2 が水素原子であり、 R^5 が2, 5-ジクロロ-3-チエニルカルボニルアミノ基である化合物；

式(1)において、 R^2 が水素原子であり、 R^5 が1-メチル-3-ピラゾリルカルボニルアミノ基である化合物；

式(1)において、 R^2 が水素原子であり、 R^5 が1, 5-ジメチル-3-ピラゾリルカルボニルアミノ基である化合物；

45 式(1)において、 R^2 が水素原子であり、 R^5 が1, 4-ジメチル-5-ピラゾリルカルボニルアミノ基である化合物；

式(1)において、 R^2 が水素原子であり、 R^5 が3-メチル-5-イソキサゾリルカルボニルアミノ基である化合物；

式(1)において、 R^2 が水素原子であり、 R^5 がN-メチル-アミノスルホニル基である化合物；

5 式(1)において、 R^2 が水素原子であり、 R^5 がN-(3-クロロベンジル)-アミノスルホニル基である化合物；

式(1)において、 R^2 が水素原子であり、 R^5 がN-(4-メチルフェニル)-アミノスルホニル基である化合物；

10 式(1)において、 R^2 が水素原子であり、 R^5 がN-(4-メチルベンジル)-アミノスルホニル基である化合物；

式(1)において、 R^2 が水素原子であり、 R^5 がN-(2-ピリジルメチル)-アミノスルホニル基である化合物；

式(1)において、 R^2 が水素原子であり、 R^5 がヒドロキシ基である化合物；

15 式(1)において、 R^2 が水素原子であり、 R^5 がメトキシ基である化合物；

式(1)において、 R^2 が水素原子であり、 R^5 がエトキシ基である化合物；

式(1)において、 R^2 が水素原子であり、 R^5 がイソプロポキシ基である化合物；

20 式(1)において、 R^2 が水素原子であり、 R^5 がベンジロキシ基である化合物；

式(1)において、 R^2 が水素原子であり、 R^5 がアセチルオキシ基である化合物；

式(1)において、 R^2 が水素原子であり、 R^5 が2-クロロベンゾイルオキシ基である化合物；

25 式(1)において、 R^2 が水素原子であり、 R^5 が4-メチルフェニルスルホニルオキシ基である化合物；

[0183]

30 式(1)において、 R^2 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 が塩素原子である化合物；式(1)において、 R^2 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 がメチル基である化合物；式(1)において、 R^2 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 がトリフルオロメチル基である化合物；

式(1)において、 R^2 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 がアミノ基である化合物；式(1)において、 R^2 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 がメチルアミノ基である化合物；

35 式(1)において、 R^2 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 がジメチルアミノ基である化合物；

式(1)において、 R^2 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 がホルミルアミノ基である化合物；

40 式(1)において、 R^2 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 がアセチルアミノ基である化合物；

式(1)において、 R^2 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 がトリフルオロアセチルアミノ基である化合物；

式(1)において、 R^2 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 がヒドロキシ基である化合物；

45 式(1)において、 R^2 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 がエトキシ基である化合物；

式(1)において、 R^2 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 がメトキシ基である化合物；

式(1)において、 R^2 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 がイソプロポキシ基である化合物；

5 式(1)において、 R^2 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 がアリルオキシ基である化合物；

式(1)において、 R^2 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 がベンジロキシ基である化合物；

10 式(1)において、 R^2 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 がアセチルオキシ基である化合物；

[0184]

式(1)において、 R^2 がニトロ基であり、 R^5 がヒドロキシ基である化合物；

15 式(1)において、 R^2 が3-(2-クロロフェニル)ウレイド基であり、 R^5 がメトキシ基である化合物；

[0185]

式(1)において、 R^3 がニトロ基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^3 がフッ素原子であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^3 が塩素原子であり、 R^5 が水素原子である化合物；

20 式(1)において、 R^3 が臭素原子であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^3 がメチル基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^3 がビニル基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^3 がエチニル基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

25 式(1)において、 R^3 がメトキシカルボニル基であり、 R^5 が水素原子である化合物；式(1)において、 R^3 がフェニル基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^3 が4-トリフルオロメトキシフェニル基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

30 式(1)において、 R^3 が6-トリフルオロメチルー3-ピリジル基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^3 がアミノ基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^3 がヒドロキシ基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^3 がメトキシ基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

35 式(1)において、 R^3 がプロパルギルオキシ基であり、 R^5 が水素原子である化合物；式(1)において、 R^3 が3-メトキシベンジロキシ基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^3 が4-トリフルオロメチルベンジロキシ基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

40 式(1)において、 R^3 が水素原子であり、 R^5 がアセチルオキシ基である化合物；

式(1)において、 R^3 が水素原子であり、 R^5 が2-クロロベンゾイルオキシ基である化合物；

45 式(1)において、 R^3 が水素原子であり、 R^5 が4-メチルフェニルスルホンオキシ基である化合物；

[0186]

- 式(1)において、 R^3 が水素原子であり、 R^5 がニトロ基である化合物；
式(1)において、 R^3 が水素原子であり、 R^5 が塩素原子である化合物；
式(1)において、 R^3 が水素原子であり、 R^5 がメチル基である化合物；
式(1)において、 R^3 が水素原子であり、 R^5 がトリフルオロメチル基である化合物；
5 式(1)において、 R^3 が水素原子であり、 R^5 がヘプタフルオロプロピル基である化合物；
式(1)において、 R^3 が水素原子であり、 R^5 がメトキシカルボニル基である化合物；
式(1)において、 R^3 が水素原子であり、 R^5 がフェニル基である化合物；
10 式(1)において、 R^3 が水素原子であり、 R^5 が1-ピロリル基である化合物；
式(1)において、 R^3 が水素原子であり、 R^5 がアミノ基である化合物；
式(1)において、 R^3 が水素原子であり、 R^5 がメチルアミノ基である化合物；
15 式(1)において、 R^3 が水素原子であり、 R^5 がジメチルアミノ基である化合物；
式(1)において、 R^3 が水素原子であり、 R^5 がホルミルアミノ基である化合物；
式(1)において、 R^3 が水素原子であり、 R^5 がアセチルアミノ基である化合物；
20 式(1)において、 R^3 が水素原子であり、 R^5 がトリフルオロアセチルアミノ基である化合物；
式(1)において、 R^3 が水素原子であり、 R^5 がベンゾイルアミノ基である化合物；
25 式(1)において、 R^3 が水素原子であり、 R^5 がヒドロキシ基である化合物；
式(1)において、 R^3 が水素原子であり、 R^5 がメトキシ基である化合物；
式(1)において、 R^3 が水素原子であり、 R^5 がエトキシ基である化合物；
式(1)において、 R^3 が水素原子であり、 R^5 がイソプロポキシ基である化合物；
30 式(1)において、 R^3 が水素原子であり、 R^5 がアリルオキシ基である化合物；
式(1)において、 R^3 が水素原子であり、 R^5 がベンジロキシ基である化合物；
35 式(1)において、 R^3 が水素原子であり、 R^5 が5-ブロモ-2-チエニルカルボニルアミノ基である化合物；
式(1)において、 R^3 が水素原子であり、 R^5 が2, 5-ジクロロ-3-チエニルカルボニルアミノ基である化合物；
式(1)において、 R^3 が水素原子であり、 R^5 が1-メチル-3-ピラゾリルカルボニルアミノ基である化合物；
40 式(1)において、 R^3 が水素原子であり、 R^5 が1, 5-ジメチル-3-ピラゾリルカルボニルアミノ基である化合物；
式(1)において、 R^3 が水素原子であり、 R^5 が1, 4-ジメチル-5-ピラゾリルカルボニルアミノ基である化合物；
45 式(1)において、 R^3 が水素原子であり、 R^5 が3-メチル-5-イソキサゾリルカルボニルアミノ基である化合物；

式(1)において、 R^3 が水素原子であり、 R^5 がN-メチルーアミノスルホニル基である化合物；

式(1)において、 R^3 が水素原子であり、 R^5 がN-(3-クロロベンジル)-アミノスルホニル基である化合物；

5 式(1)において、 R^3 が水素原子であり、 R^5 がN-(4-メチルフェニル)-アミノスルホニル基である化合物；

式(1)において、 R^3 が水素原子であり、 R^5 がN-(4-メチルベンジル)-アミノスルホニル基である化合物；

10 式(1)において、 R^3 が水素原子であり、 R^5 がN-(2-ピリジルメチル)-アミノスルホニル基である化合物；

[0187]

式(1)において、 R^3 が1-ジフルオロメチルー3-ピラゾリジル基であり、 R^5 が塩素原子である化合物；

15 式(1)において、 R^3 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 がアミノ基である化合物；

[0188]

式(1)において、 R^4 がフッ素原子であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^4 が塩素原子であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^4 が臭素原子であり、 R^5 が水素原子である化合物；

20 式(1)において、 R^4 がメチル基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^4 がフェニル基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^4 がヒドロキシ基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^4 がメトキシ基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

25 式(1)において、 R^4 が2-メチルフェノキシ基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^4 が4-トリフルオロメチルフェノキシ基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

[0189]

30 式(1)において、 R^4 が水素原子であり、 R^5 がニトロ基である化合物；

式(1)において、 R^4 が水素原子であり、 R^5 が塩素原子である化合物；

式(1)において、 R^4 が水素原子であり、 R^5 がメチル基である化合物；

35 式(1)において、 R^4 が水素原子であり、 R^5 がトリフルオロメチル基である化合物；式(1)において、 R^4 が水素原子であり、 R^5 がヘプタフルオロプロピル基である化合物；

式(1)において、 R^4 が水素原子であり、 R^5 がメトキシカルボニル基である化合物；式(1)において、 R^4 が水素原子であり、 R^5 がフェニル基である化合物；

40 式(1)において、 R^4 が水素原子であり、 R^5 が1-ピロリル基である化合物；

式(1)において、 R^4 が水素原子であり、 R^5 がアミノ基である化合物；

式(1)において、 R^4 が水素原子であり、 R^5 がメチルアミノ基である化合物；

45 式(1)において、 R^4 が水素原子であり、 R^5 がジメチルアミノ基である化合物；

式(1)において、 R^4 が水素原子であり、 R^5 がホルミルアミノ基である化

合物；

式(1)において、 R^4 が水素原子であり、 R^5 がアセチルアミノ基である化合物；

式(1)において、 R^4 が水素原子であり、 R^5 がトリフルオロアセチルアミノ基である化合物；

式(1)において、 R^4 が水素原子であり、 R^5 がベンゾイルアミノ基である化合物；

式(1)において、 R^4 が水素原子であり、 R^5 がヒドロキシ基である化合物；

式(1)において、 R^4 が水素原子であり、 R^5 がメトキシ基である化合物；

式(1)において、 R^4 が水素原子であり、 R^5 がエトキシ基である化合物；

式(1)において、 R^4 が水素原子であり、 R^5 がイソプロポキシ基である化合物；

式(1)において、 R^4 が水素原子であり、 R^5 がアリルオキシ基である化合物；

式(1)において、 R^4 が水素原子であり、 R^5 がベンジロキシ基である化合物；

式(1)において、 R^4 が4-トリフルオロメトキシフェノキシ基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^4 が水素原子であり、 R^5 がアセチルオキシ基である化合物；

式(1)において、 R^4 が水素原子であり、 R^5 が2-クロロベンゾイルオキシ基である化合物；

式(1)において、 R^4 が水素原子であり、 R^5 が4-メチルフェニルスルホニルオキシ基である化合物；

式(1)において、 R^4 が水素原子であり、 R^5 が5-ブロモ-2-チエニルカルボニルアミノ基である化合物；

式(1)において、 R^4 が水素原子であり、 R^5 が2, 5-ジクロロ-3-チエニルカルボニルアミノ基である化合物；

式(1)において、 R^4 が水素原子であり、 R^5 が1-メチル-3-ピラゾリルカルボニルアミノ基である化合物；

式(1)において、 R^4 が水素原子であり、 R^5 が1, 5-ジメチル-3-ピラゾリルカルボニルアミノ基である化合物；

式(1)において、 R^4 が水素原子であり、 R^5 が1, 4-ジメチル-5-ピラゾリルカルボニルアミノ基である化合物；

式(1)において、 R^4 が水素原子であり、 R^5 が3-メチル-5-イソキサゾリルカルボニルアミノ基である化合物；

式(1)において、 R^4 が水素原子であり、 R^5 がN-メチル-アミノスルホニル基である化合物；

式(1)において、 R^4 が水素原子であり、 R^5 がN-(3-クロロベンジル)-アミノスルホニル基である化合物；

式(1)において、 R^4 が水素原子であり、 R^5 がN-(4-メチルフェニル)-アミノスルホニル基である化合物；

式(1)において、 R^4 が水素原子であり、 R^5 がN-(4-メチルベンジル)-アミノスルホニル基である化合物；

式(1)において、 R^4 が水素原子であり、 R^5 がN-(2-ピリジルメチル

) -アミノスルホニル基である化合物；

[0190]

式(1)において、 R^3 および R^4 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^1 および R^4 が水素原子である化合物；

5 式(1)において、 R^2 および R^3 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^2 および R^4 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^1 および R^2 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^1 および R^3 が水素原子である化合物；

[0191]

10 式(1)において、 R^3 、 R^4 および R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^1 、 R^4 および R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^2 、 R^3 および R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^2 、 R^4 および R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^1 、 R^2 および R^5 が水素原子である化合物；

15 式(1)において、 R^1 、 R^3 および R^5 が水素原子である化合物；

[0192]

式(1)において、 R^2 、 R^3 および R^4 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^1 、 R^3 および R^4 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^1 、 R^2 および R^4 が水素原子である化合物；

20 式(1)において、 R^1 、 R^2 および R^3 が水素原子である化合物；

[0193]

式(1)において、 R^1 、 R^3 および R^4 が水素原子であり、 R^2 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基である化合物；

25 式(1)において、 R^2 、 R^3 および R^4 が水素原子であり、 R^1 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基である化合物；

式(1)において、 R^3 、 R^4 および R^5 が水素原子であり、 R^1 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基である化合物；

式(1)において、 R^3 、 R^4 および R^5 が水素原子であり、 R^2 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基である化合物；

30 [0194]

式(1)において、 R^2 、 R^3 および R^4 が水素原子であり、 R^1 がメチル基である化合物；

式(1)において、 R^2 、 R^3 および R^4 が水素原子であり、 R^1 がジフルオロメチル基である化合物；

35 式(1)において、 R^2 、 R^3 および R^4 が水素原子であり、 R^1 がトリフルオロメチル基である化合物；

式(1)において、 R^2 、 R^3 および R^4 が水素原子であり、 R^1 がペンタフルオロエチル基である化合物；

[0195]

40 式(1)において、 R^3 、 R^4 および R^5 が水素原子であり、 R^1 がメチル基である化合物；

式(1)において、 R^3 、 R^4 および R^5 が水素原子であり、 R^1 がジフルオロメチル基である化合物；

45 式(1)において、 R^3 、 R^4 および R^5 が水素原子であり、 R^1 がトリフルオロメチル基である化合物；

式(1)において、 R^3 、 R^4 および R^5 が水素原子であり、 R^1 がペンタフ

ルオロエチル基である化合物；

[0196]

式(1)において、 R^1 、 R^3 および R^4 が水素原子であり、 R^2 がメチル基である化合物；

- 5 式(1)において、 R^1 、 R^3 および R^4 が水素原子であり、 R^2 がジフルオロメチル基である化合物；

(1)において、 R^1 、 R^3 および R^4 が水素原子であり、 R^2 がトリフルオロメチル基である化合物；

- 10 式(1)において、 R^1 、 R^3 および R^4 が水素原子であり、 R^2 がペンタフルオロエチル基である化合物；

式(1)において、 R^1 、 R^3 および R^4 が水素原子であり、 R^2 がヘプタフルオロプロピル基である化合物；

式(1)において、 R^1 、 R^3 および R^4 が水素原子であり、 R^2 が *tert*-ブチル基である化合物；

- 15 [0197]

式(1)において、 R^3 、 R^4 および R^5 が水素原子であり、 R^2 がメチル基である化合物；

式(1)において、 R^3 、 R^4 および R^5 が水素原子であり、 R^2 がジフルオロメチル基である化合物；

- 20 (1)において、 R^3 、 R^4 および R^5 が水素原子であり、 R^2 がトリフルオロメチル基である化合物；

式(1)において、 R^3 、 R^4 および R^5 が水素原子であり、 R^2 がペンタフルオロエチル基である化合物；

- 25 式(1)において、 R^3 、 R^4 および R^5 が水素原子であり、 R^2 がヘプタフルオロプロピル基である化合物；

式(1)において、 R^3 、 R^4 および R^5 が水素原子であり、 R^2 が *tert*-ブチル基である化合物；

[0198]

- 30 式(1)において、 R^1 、 R^3 および R^4 が水素原子であり、 R^2 がトリフルオロメチル基である化合物；

式(1)において、 R^2 、 R^3 および R^4 が水素原子であり、 R^1 がトリフルオロメチル基である化合物；

式(1)において、 R^3 、 R^4 および R^5 が水素原子であり、 R^1 がトリフルオロメチル基である化合物；

- 35 式(1)において、 R^3 、 R^4 および R^5 が水素原子であり、 R^2 がトリフルオロメチル基である化合物；

式(1)において、 R^2 、 R^3 および R^4 が水素原子であり、 R^1 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

- 40 式(1)において、 R^1 、 R^3 および R^4 が水素原子であり、 R^2 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

式(1)において、 R^3 、 R^4 および R^5 が水素原子であり、 R^1 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

式(1)において、 R^3 、 R^4 および R^5 が水素原子であり、 R^2 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

- 45 [0199]

式(1)において、 R^2 、 R^3 および R^4 が水素原子であり、 R^1 がフェニル

基である化合物；

[0200]

式(1)において、 R^3 、 R^4 および R^5 が水素原子であり、 R^1 がフェニル基である化合物；

5 [0201]

式(1)において、 R^1 、 R^3 および R^4 が水素原子であり、 R^2 がフェニル基である化合物；

式(1)において、 R^1 、 R^3 および R^4 が水素原子であり、 R^2 が2-クロロフェニル基である化合物；

10 式(1)において、 R^1 、 R^3 および R^4 が水素原子であり、 R^2 が3-クロロフェニル基である化合物；

式(1)において、 R^1 、 R^3 および R^4 が水素原子であり、 R^2 が4-クロロフェニル基である化合物；

15 式(1)において、 R^1 、 R^3 および R^4 が水素原子であり、 R^2 が4-トリフルオロメチルフェニル基である化合物；

[0202]

式(1)において、 R^3 、 R^4 および R^5 が水素原子であり、 R^2 がフェニル基である化合物；

20 式(1)において、 R^3 、 R^4 および R^5 が水素原子であり、 R^2 が2-クロロフェニル基である化合物；

式(1)において、 R^3 、 R^4 および R^5 が水素原子であり、 R^2 が3-クロロフェニル基である化合物；

式(1)において、 R^3 、 R^4 および R^5 が水素原子であり、 R^2 が4-クロロフェニル基である化合物；

25 式(1)において、 R^3 、 R^4 および R^5 が水素原子であり、 R^2 が4-トリフルオロメチルフェニル基である化合物；

[0203]

式(1)において、 R^2 、 R^3 、 R^4 および R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^1 、 R^3 、 R^4 および R^5 が水素原子である化合物；

30 式(1)において、 R^1 、 R^2 、 R^4 および R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^1 、 R^2 、 R^3 および R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^1 、 R^2 、 R^3 および R^4 が水素原子である化合物；

[0204]

35 式(1)において、 R^2 、 R^3 、 R^4 および R^5 が水素原子であり、 R^1 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

式(1)において、 R^1 、 R^3 、 R^4 および R^5 が水素原子であり、 R^2 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

式(1)において、 R^1 、 R^2 、 R^4 および R^5 が水素原子であり、 R^3 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

40 式(1)において、 R^1 、 R^2 、 R^3 および R^5 が水素原子であり、 R^4 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

式(1)において、 R^1 、 R^2 、 R^3 および R^4 が水素原子であり、 R^5 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

[0205]

45 式(1)において、 R^2 、 R^3 、 R^4 および R^5 が水素原子であり、 R^1 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基である化合物

式(1)において、 R^1 、 R^3 、 R^4 および R^5 が水素原子であり、 R^2 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基である化合物

5 式(1)において、 R^1 、 R^2 、 R^4 および R^5 が水素原子であり、 R^3 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基である化合物

式(1)において、 R^1 、 R^2 、 R^3 および R^5 が水素原子であり、 R^4 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基である化合物

10 式(1)において、 R^1 、 R^2 、 R^3 および R^4 が水素原子であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基である化合物

[0206]

15 式(1)において、Wが $-OR^6$ である化合物；

式(1)において、Wが $-OR^6$ 、 $-ON=CR^7R^8$ または $-SR^9$ である化合物；

式(1)において、Wが $-NR^7R^{10}$ である化合物；

式(1)において、Wが $-ON=CR^7R^8$ である化合物；

20 式(1)において、Wが $-SR^9$ である化合物；

[0207]

式(1)において、Wが $-OR^6$ または $-SR^9$ である化合物；

式(1)において、Wが $-OR^6$ または $-ON=CR^7R^8$ である化合物；

式(1)において、Wが $-OR^6$ または $-NR^7R^{10}$ である化合物；

25 式(1)において、Wが $-SR^9$ または $-NR^7R^{10}$ である化合物；

[0208]

式(1)において、

30 R^6 および R^9 が群Zより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC3-C6アルキニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC7-C9フェニルアルキル基または群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

式(1)において、

35 R^6 および R^9 が群Zより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基である化合物；

式(1)において、

R^6 および R^9 がC1-C6アルキル基である化合物；

[0209]

式(1)において、Wが $-OR^6$ または $-SR^9$ であり、

40 R^6 および R^9 が群Zより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC3-C6アルキニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC7-C9フェニルアルキル基または群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

45 式(1)において、Wが $-OR^6$ または $-SR^9$ であり、

R^6 および R^9 が群Zより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C

6 アルキル基である化合物；

式（１）において、Wが $-OR^6$ または $-SR^9$ であり、

R^6 および R^9 がC 1－C 6 アルキル基である化合物；

[0 2 1 0]

5 式（１）において、Wが $-OR^6$ であり、

R^6 が群Zより選ばれる１個以上の基を有していてもよいC 1－C 6 アルキル基、群Xより選ばれる１個以上の基を有していてもよいC 3－C 6 アルキニル基、群Yより選ばれる１個以上の基を有していてもよいC 7－C 9 フェニルアルキル基または群Yより選ばれる１個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

式（１）において、Wが $-OR^6$ であり、

R^6 が群Zより選ばれる１個以上の基を有していてもよいC 1－C 6 アルキル基である化合物；

式（１）において、Wが $-OR^6$ であり、

15 R^6 がC 1－C 6 アルキル基である化合物；

[0 2 1 1]

式（１）において、Wが $-SR^9$ であり、

R^9 が群Zより選ばれる１個以上の基を有していてもよいC 1－C 6 アルキル基または群Yより選ばれる１個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

式（１）において、Wが $-SR^9$ であり、

R^9 が群Zより選ばれる１個以上の基を有していてもよいC 1－C 6 アルキル基である化合物；

式（１）において、Wが $-SR^9$ であり、

25 R^9 がC 1－C 6 アルキル基である化合物；

[0 2 1 2]

式（１）において、Wが $-NR^7 R^{10}$ であり、 R^7 が水素原子である化合物；

式（１）において、Wが $-NR^7 R^{10}$ であり、 R^7 が水素原子であり、

30 R^{10} が、水素原子、シアノ基、群Zより選ばれる１個以上の基を有していてもよいC 1－C 6 アルキル基、群Yより選ばれる１個以上の基を有していてもよいフェニル基、ベンゼン環部分が群Yより選ばれる１個以上の基を有していてもよいベンジル基、 $-OH$ または $-NH_2$ である化合物；

式（１）において、Wが $-NR^7 R^{10}$ であり、 R^7 が水素原子であり、

35 R^{10} が、水素原子、シアノ基、群Zより選ばれる１個以上の基を有していてもよいC 1－C 6 アルキル基、群Yより選ばれる１個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OH$ または $-NH_2$ である化合物；

[0 2 1 3]

式（１）において、Wが $-NR^7 R^{10}$ であり、 R^7 が水素原子であり、

40 R^{10} が、水素原子、群Zより選ばれる１個以上の基を有していてもよいC 1－C 6 アルキル基または群Yより選ばれる１個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

式（１）において、Wが $-NR^7 R^{10}$ であり、 R^7 が水素原子であり、

R^{10} が、水素原子または群Zより選ばれる１個以上の基を有していてもよいC 1－C 6 アルキル基である化合物；

45 式（１）において、Wが $-NR^7 R^{10}$ であり、 R^7 が水素原子であり、

R^{10} が、水素原子または C1-C6 アルキル基である化合物；

[0214]

式(1)において、Wが $-NR^7R^{10}$ であり、

5 R^{10} が、水素原子、シアノ基、群Zより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OH$ または $-NH_2$ である化合物；

式(1)において、Wが $-NR^7R^{10}$ であり、

10 R^{10} が、水素原子、群Zより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基または群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

式(1)において、Wが $-NR^7R^{10}$ であり、

R^{10} が、水素原子または群Zより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基である化合物；

式(1)において、Wが $-NR^7R^{10}$ であり、

15 R^{10} が、水素原子またはC1-C6アルキル基である化合物；

[0215]

式(1)において、Wが $-NR^7R^{10}$ であり、

R^{10} が、シアノ基、 $-OH$ または $-NH_2$ である化合物；

式(1)において、Wが $-NR^7R^{10}$ であり、 R^7 が水素原子であり、

20 R^{10} が、シアノ基、 $-OH$ または $-NH_2$ である化合物；

[0216]

式(1)において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボ

25 ニル基、 $-NR^{11}R^{12}$ 、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_mR^{11}$ であり、

R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{12}R^{13}$ 、 $-OR^{13}$ または $-S(O)_mR^{13}$ であり、

30 R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{11}R^{12}$ 、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_mR^{11}$ であり、

R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{11}R^{12}$ 、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_mR^{11}$ であり、

35 R^5 が、ハロゲン原子、ニトロ基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{11}R^{12}$ 、 $-S(O)_2NR^7R^{11}$ 、 $-OR^{14}$ 、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基または群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよい5員芳香族複素環基である化合物；

[0217]

45 式(1)において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{11}$ または $-S(O)$

$m R^{11}$ であり、

R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{13}$ または $-S(O)_m R^{13}$ であり、

5 R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_m R^{11}$ であり、

10 R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_m R^{11}$ であり、

R^5 が、ハロゲン原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基、 $-NR^{11} R^{12}$ 、 $-OR^{14}$ または群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

[0218]

15 式(1)において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_m R^{11}$ であり、

20 R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{13}$ または $-S(O)_m R^{13}$ であり、

R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_m R^{11}$ であり、

25 R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_m R^{11}$ であり、

30 R^5 が、ハロゲン原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基、 $-OR^{14}$ または群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基であり、

R^{11} が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキル基であり、

R^{13} が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキル基であり、

35 R^{14} が群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C4アルキル基または水素原子である化合物；

[0219]

式(1)において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボ

40 ニル基、 $-NR^{11} R^{12}$ 、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_m R^{11}$ であり、 R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{12}$

45 R^{13} 、 $-OR^{13}$ または $-S(O)_m R^{13}$ であり、

R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を

有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C 2－C 6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1\ 1}R^{1\ 2}$ 、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_mR^{1\ 1}$ であり、
 R⁴が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を
 5 有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C 2－C 6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1\ 1}R^{1\ 2}$ 、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_mR^{1\ 1}$ であり、
 R⁵が、ハロゲン原子、ニトロ基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 4アルキル基、C 2－C 6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1\ 1}R^{1\ 2}$ 、 $-S(O)_2NR^7R^{1\ 1}$ 、 $-OR^{1\ 4}$ 、群Yより選ばれる1個以上の
 10 基を有していてもよいフェニル基または群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよい5員芳香族複素環基であり、
 Wが $-OR^6$ または $-SR^9$ である化合物；

[0 2 2 0]

15 式(1)において、R¹が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C 2－C 6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1\ 1}R^{1\ 2}$ 、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_mR^{1\ 1}$ であり、
 R²が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を
 20 有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C 2－C 6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1\ 2}R^{1\ 3}$ 、 $-OR^{1\ 3}$ または $-S(O)_mR^{1\ 3}$ であり、
 R³が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C 2－C 6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1\ 1}R^{1\ 2}$ 、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_mR^{1\ 1}$ であり、
 25 R⁴が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C 2－C 6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1\ 1}R^{1\ 2}$ 、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_mR^{1\ 1}$ であり、
 R⁵が、ハロゲン原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 4アルキル基、C 2－C 6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1\ 1}R^{1\ 2}$ 、 $-OR^{1\ 4}$ または群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基
 30 であり、
 Wが $-OR^6$ または $-SR^9$ であり、
 R⁶およびR⁹が群Zより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基または群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

[0 2 2 1]

40 式(1)において、R¹が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C 2－C 6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1\ 1}R^{1\ 2}$ 、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_mR^{1\ 1}$ であり、
 R²が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を
 45 有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C 2－C 6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1\ 2}$

$R^{1\ 3}$ 、 $-OR^{1\ 3}$ または $-S(O)_m R^{1\ 3}$ であり、
 R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1\ 1}$

5 $R^{1\ 2}$ 、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、
 R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1\ 1}$
 $R^{1\ 2}$ 、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、

10 R^5 が、ハロゲン原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1\ 1} R^{1\ 2}$ 、 $-OR^{1\ 4}$ または群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基であり、

Wが $-OR^6$ または $-SR^9$ であり、

15 R^6 および R^9 が群Zより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基である化合物；

[0222]

式(1)において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1\ 1} R^{1\ 2}$ 、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、

R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1\ 2}$

25 $R^{1\ 3}$ 、 $-OR^{1\ 3}$ または $-S(O)_m R^{1\ 3}$ であり、
 R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1\ 1}$
 $R^{1\ 2}$ 、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、

30 R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1\ 1}$
 $R^{1\ 2}$ 、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、

R^5 が、ハロゲン原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1\ 1} R^{1\ 2}$ 、 $-OR^{1\ 4}$ または群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基であり、

Wが $-OR^6$ または $-SR^9$ であり、

R^6 および R^9 がC1-C6アルキル基である化合物；

40 [0223]

式(1)において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1\ 1} R^{1\ 2}$ 、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、

45 R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有

していてもよいフェニル基、C 2－C 6 アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1\ 2}$
 $R^{1\ 3}$ 、 $-OR^{1\ 3}$ または $-S(O)_m R^{1\ 3}$ であり、

R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群 X より選ばれる 1 個以上の基を
 有していてもよい C 1－C 6 アルキル基、群 Y より選ばれる 1 個以上の基を有

5 していてもよいフェニル基、C 2－C 6 アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1\ 1}$
 $R^{1\ 2}$ 、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、

R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群 X より選ばれる 1 個以上の基を
 有していてもよい C 1－C 6 アルキル基、群 Y より選ばれる 1 個以上の基を有

10 していてもよいフェニル基、C 2－C 6 アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1\ 1}$
 $R^{1\ 2}$ 、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、

R^5 が、ハロゲン原子、ニトロ基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよ
 い C 1－C 4 アルキル基、C 2－C 6 アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1\ 1} R^{1\ 2}$ 、 $-S(O)_2 NR^7 R^{1\ 1}$ 、 $-OR^{1\ 4}$ 、群 Y より選ばれる 1 個以上の

基を有していてもよいフェニル基または群 Y より選ばれる 1 個以上の基を有し

15 ていてもよい 5 員芳香族複素環基であり、

W が $-OR^6$ であり、

R^6 が群 Z より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよい C 1－C 6 アルキル
 基である化合物；

[0 2 2 4]

20 式 (1) において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群 X より選ば
 れる 1 個以上の基を有していてもよい C 1－C 6 アルキル基、群 Y より選ばれ

る 1 個以上の基を有していてもよいフェニル基、C 2－C 6 アルコキシカルボ
 ニル基、 $-NR^{1\ 1} R^{1\ 2}$ 、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、

25 R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群 X より選ばれる 1 個以上の基を
 有していてもよい C 1－C 6 アルキル基、群 Y より選ばれる 1 個以上の基を有

していてもよいフェニル基、C 2－C 6 アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1\ 2}$
 $R^{1\ 3}$ 、 $-OR^{1\ 3}$ または $-S(O)_m R^{1\ 3}$ であり、

R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群 X より選ばれる 1 個以上の基を
 有していてもよい C 1－C 6 アルキル基、群 Y より選ばれる 1 個以上の基を有

30 していてもよいフェニル基、C 2－C 6 アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1\ 1}$
 $R^{1\ 2}$ 、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、

R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群 X より選ばれる 1 個以上の基を
 有していてもよい C 1－C 6 アルキル基、群 Y より選ばれる 1 個以上の基を有

35 していてもよいフェニル基、C 2－C 6 アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1\ 1}$
 $R^{1\ 2}$ 、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、

R^5 が、ハロゲン原子、ニトロ基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよ
 い C 1－C 4 アルキル基、C 2－C 6 アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1\ 1} R^{1\ 2}$ 、 $-S(O)_2 NR^7 R^{1\ 1}$ 、 $-OR^{1\ 4}$ 、群 Y より選ばれる 1 個以上の

基を有していてもよいフェニル基または群 Y より選ばれる 1 個以上の基を有し

40 ていてもよい 5 員芳香族複素環基であり、

W が $-OR^6$ であり、

R^6 が C 1－C 6 アルキル基である化合物；

[0 2 2 5]

式 (1) において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群 X より選ば
 45 れる 1 個以上の基を有していてもよい C 1－C 6 アルキル基、群 Y より選ばれ

る 1 個以上の基を有していてもよいフェニル基、C 2－C 6 アルコキシカルボ

ニル基、 $-NR^{11}R^{12}$ 、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_mR^{11}$ であり、
 R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を
 有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有
 していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{12}$
 5 R^{13} 、 $-OR^{13}$ または $-S(O)_mR^{13}$ であり、

R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を
 有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有
 していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{11}$
 R^{12} 、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_mR^{11}$ であり、

10 R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を
 有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有
 していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{11}$
 R^{12} 、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_mR^{11}$ であり、

R^5 が、ハロゲン原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C
 15 4アルキル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{11}R^{12}$ 、 $-O$
 R^{14} または群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基で
 あり、

Wが $-NR^7R^{10}$ である化合物；

[0226]

20 式(1)において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ば
 れる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ば
 れる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボ
 ニル基、 $-NR^{11}R^{12}$ 、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_mR^{11}$ であり、

R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を
 有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有
 していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{12}$
 25 R^{13} 、 $-OR^{13}$ または $-S(O)_mR^{13}$ であり、

R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を
 有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有
 していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{11}$
 30 R^{12} 、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_mR^{11}$ であり、

R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を
 有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有
 していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{11}$
 35 R^{12} 、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_mR^{11}$ であり、

R^5 が、ハロゲン原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C
 4アルキル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{11}R^{12}$ 、 $-O$
 R^{14} または群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基で
 あり、

40 Wが $-NR^7R^{10}$ であり、 R^7 が水素原子である化合物；

[0227]

式(1)において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ば
 れる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ば
 れる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボ
 45 ニル基、 $-NR^{11}R^{12}$ 、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_mR^{11}$ であり、

R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を

有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C 2－C 6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1\ 2}$
 $R^{1\ 3}$ 、 $-OR^{1\ 3}$ または $-S(O)_m R^{1\ 3}$ であり、

R³が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を
 5 有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C 2－C 6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1\ 1}$
 $R^{1\ 2}$ 、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、

R⁴が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を
 10 有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C 2－C 6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1\ 1}$
 $R^{1\ 2}$ 、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、

R⁵が、ハロゲン原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 4アルキル基、C 2－C 6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1\ 1} R^{1\ 2}$ 、 $-OR^{1\ 4}$ または群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基で
 15 あり、

Wが $-NR^7 R^{1\ 0}$ であり、

R⁷が水素原子であり、

R^{1 0}が、水素原子、群Zより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基または群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；
 20 [0 2 2 8]

式(1)において、R¹が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C 2－C 6アルコキシカルボ
 25 ニル基、 $-NR^{1\ 1} R^{1\ 2}$ 、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、

R²が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C 2－C 6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1\ 2}$
 $R^{1\ 3}$ 、 $-OR^{1\ 3}$ または $-S(O)_m R^{1\ 3}$ であり、

R³が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C 2－C 6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1\ 1}$
 $R^{1\ 2}$ 、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、

R⁴が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C 2－C 6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1\ 1}$
 $R^{1\ 2}$ 、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、

R⁵が、ハロゲン原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 4アルキル基、C 2－C 6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1\ 1} R^{1\ 2}$ 、 $-OR^{1\ 4}$ または群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基で
 40 あり、

Wが $-NR^7 R^{1\ 0}$ であり、

R⁷が水素原子であり、

R^{1 0}が、水素原子またはC 1－C 6アルキル基である化合物；

45 [0 2 2 9]

式(1)において、R¹が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ば

れる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_m R^{1,1}$ であり、

5 R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1,3}$ または $-S(O)_m R^{1,3}$ であり、

R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_m R^{1,1}$ であり、

10 R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_m R^{1,1}$ であり、

R^5 が、ハロゲン原子、ニトロ基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基、 $-NR^{1,1} R^{1,2}$ 、 $-S(O)_2 NR^7 R^{1,1}$ 、 $-OR^{1,4}$ 、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基または群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよい5員芳香族複素環基であり、

Wが $-OR^6$ であり、

R^6 がC1-C6アルキル基である化合物；

20 [0230]

式(1)において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_m R^{1,1}$ であり、

25 R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1,3}$ または $-S(O)_m R^{1,3}$ であり、

R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_m R^{1,1}$ であり、

30 R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_m R^{1,1}$ であり、

R^5 が、ハロゲン原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基、 $-NR^{1,1} R^{1,2}$ 、 $-OR^{1,4}$ または群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基であり、

Wが $-NR^7 R^{1,0}$ であり、

R^7 が水素原子であり、

$R^{1,0}$ が、水素原子またはC1-C6アルキル基である化合物；

40 [0231]

式(1)において、 R^1 がハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよい5員芳香族複素環基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1,1} R^{1,2}$ 、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_m R^{1,1}$ であり、

45 R^2 、 R^3 および R^4 が水素原子である化合物；

[0232]

式(1)において、 R^1 、 R^3 および R^4 が水素原子であり、
 R^2 がハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよい6員芳香族複素環基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよい5員芳香族複素環基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルキルカルボニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいベンゾイル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、アミノカルボニル基、 $-NR^{12}R^{13}$ 、 $-OR^{13}$ 、 $-S(O)_mR^{13}$ または $-SF_5$ である化合物；

[0233]

式(1)において、 R^1 、 R^2 および R^4 が水素原子であり、
 R^3 がハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC2-C6アルケニル基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC2-C6アルキニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよい6員芳香族複素環基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{11}R^{12}$ 、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_mR^{11}$ である化合物；

[0234]

式(1)において、 R^1 、 R^2 および R^3 が水素原子であり、
 R^4 がハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{11}R^{12}$ 、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_mR^{11}$ である化合物；

[0235]

式(1)において、 R^1 がハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよい5員芳香族複素環基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{11}R^{12}$ 、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_mR^{11}$ であり、
 R^2 、 R^3 、 R^4 および R^5 が水素原子である化合物；

[0236]

式(1)において、 R^1 、 R^3 、 R^4 および R^5 が水素原子であり、
 R^2 がハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよい6員芳香族複素環基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよい5員芳香族複素環基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルキルカルボニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいベンゾイル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、アミノカルボニル基、 $-NR^{12}R^{13}$ 、 $-OR^{13}$ 、 $-S(O)_mR^{13}$ または $-SF_5$ である化合物；

[0237]

式(1)において、 R^1 、 R^2 、 R^4 および R^5 が水素原子であり、
 R^3 がハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していても

よいC 2－C 6アルケニル基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 2－C 6アルキニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよい6員芳香族複素環基、C 2－C 6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1,1}R^{1,2}$ 、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_mR^{1,1}$ である化合物；

[0238]

式(1)において、 R^1 、 R^2 、 R^3 および R^5 が水素原子であり、 R^4 がハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C 2－C 6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1,1}R^{1,2}$ 、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_mR^{1,1}$ である化合物；

[0239]

式(1)において、 R^1 、 R^2 、 R^3 および R^4 が水素原子であり、 R^5 が、ハロゲン原子、ニトロ基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 4アルキル基、C 2－C 6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1,1}R^{1,2}$ 、 $-OR^{1,4}$ 、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基または群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよい5員芳香族複素環基である化合物；

[0240]

式(1)において、 R^1 、 R^2 、 R^3 および R^4 が水素原子であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 4アルキル基、 $-NR^{1,1}R^{1,2}$ または $-OR^{1,4}$ である化合物；

[0241]

式(1)において、 R^1 、 R^2 、 R^3 および R^4 が水素原子であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 4アルキル基または $-OR^{1,4}$ であり、 $R^{1,4}$ が群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 4アルキル基、ベンゼン環部分が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 7－C 9フェニルアルキル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 2－C 6アルキルカルボニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいベンゾイル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニルスルホニル基または水素原子である化合物；

[0242]

式(1)において、 R^1 、 R^2 、 R^3 および R^4 が水素原子であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 4アルキル基または $-OR^{1,4}$ であり、 $R^{1,4}$ が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 4アルキル基または水素原子である化合物；

[0243]

式(1)において、 R^1 、 R^2 、 R^3 および R^4 が水素原子であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 4アルキル基である化合物；

[0244]

式(1)において、 R^1 、 R^2 、 R^3 および R^4 が水素原子であり、 R^5 が $-OR^{1,4}$ であり、 $R^{1,4}$ が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 4アルキル基ま

たは水素原子である化合物；

[0245]

- 式(1)において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1,1}R^{1,2}$ 、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_mR^{1,1}$ であり、 R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1,2}R^{1,3}$ 、 $-OR^{1,3}$ または $-S(O)_mR^{1,3}$ であり、 R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1,1}R^{1,2}$ 、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_mR^{1,1}$ であり、 R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1,1}R^{1,2}$ 、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_mR^{1,1}$ であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基である化合物；

[0246]

- 式(1)において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1,1}R^{1,2}$ 、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_mR^{1,1}$ であり、 R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1,2}R^{1,3}$ 、 $-OR^{1,3}$ または $-S(O)_mR^{1,3}$ であり、 R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1,1}R^{1,2}$ 、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_mR^{1,1}$ であり、 R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1,1}R^{1,2}$ 、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_mR^{1,1}$ であり、 R^5 が $-OR^{1,4}$ であり、 $R^{1,4}$ が群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C4アルキル基または水素原子である化合物；

[0247]

- 式(1)において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1,1}R^{1,2}$ 、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_mR^{1,1}$ であり、 R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を

有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C 2－C 6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1\ 2}$ $R^{1\ 3}$ 、 $-OR^{1\ 3}$ または $-S(O)_m R^{1\ 3}$ であり、

5 R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C 2－C 6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1\ 1}$ $R^{1\ 2}$ 、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、

10 R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C 2－C 6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1\ 1}$ $R^{1\ 2}$ 、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、

R^5 が水素原子である化合物；

[0 2 4 8]

15 式(1)において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、

20 R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1\ 3}$ または $-S(O)_m R^{1\ 3}$ であり、

R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、

25 R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、

R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 4アルキル基である化合物；

[0 2 4 9]

30 式(1)において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、

35 R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1\ 3}$ または $-S(O)_m R^{1\ 3}$ であり、

R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、

40 R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、

R^5 が水素原子である化合物；

[0 2 5 0]

45 式(1)において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれ

る1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_m R^{11}$ であり、

R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有

5 していてもよいフェニル基、 $-OR^{13}$ または $-S(O)_m R^{13}$ であり、

R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有

していてもよいフェニル基、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_m R^{11}$ であり、

10 R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有

していてもよいフェニル基、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_m R^{11}$ であり、

R^5 が $-OR^{14}$ であり、

R^{14} が群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C4アルキル基または水素原子である化合物；

15 [0251]

式(1)において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_m R^{11}$ であり、

20 R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{13}$ または $-S(O)_m R^{13}$ であり、

R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有

25 していてもよいフェニル基、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_m R^{11}$ であり、

R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有

していてもよいフェニル基、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_m R^{11}$ であり、

30 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基であり、

R^{11} が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキル基であり、

R^{13} が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキル基である化合物；

35 [0252]

式(1)において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_m R^{11}$ であり、

40 R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{13}$ または $-S(O)_m R^{13}$ であり、

R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有

45 していてもよいフェニル基、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_m R^{11}$ であり、

R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を

有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、 R^5 が水素原子であり、

$R^{1\ 1}$ が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 3アルキル基であり、

$R^{1\ 3}$ が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 3アルキル基である化合物；

[0 2 5 3]

式(1)において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C 2－C 6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1\ 1} R^{1\ 2}$ 、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、

R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C 2－C 6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1\ 2}$

$R^{1\ 3}$ 、 $-OR^{1\ 3}$ または $-S(O)_m R^{1\ 3}$ であり、

R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C 2－C 6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1\ 1}$

$R^{1\ 2}$ 、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、

R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C 2－C 6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1\ 1}$ $R^{1\ 2}$ 、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、

R^5 がトリフルオロメチル基である化合物；

[0 2 5 4]

式(1)において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C 2－C 6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1\ 1} R^{1\ 2}$ 、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、

R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C 2－C 6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1\ 2}$ $R^{1\ 3}$ 、 $-OR^{1\ 3}$ または $-S(O)_m R^{1\ 3}$ であり、

R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C 2－C 6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1\ 1}$ $R^{1\ 2}$ 、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、

R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C 2－C 6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1\ 1}$ $R^{1\ 2}$ 、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、

R^5 がトリフルオロメチル基であり、

Wが $-OR^6$ であり、

R^6 が群Zより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基である化合物；

[0255]

式(1)において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{11}R^{12}$ 、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_mR^{11}$ であり、 R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{12}R^{13}$ 、 $-OR^{13}$ または $-S(O)_mR^{13}$ であり、 R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{11}R^{12}$ 、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_mR^{11}$ であり、 R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{11}R^{12}$ 、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_mR^{11}$ であり、 R^5 がトリフルオロメチル基であり、Wが $-NR^7R^{10}$ である化合物；

[0256]

式(1)において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{11}R^{12}$ 、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_mR^{11}$ であり、 R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{12}R^{13}$ 、 $-OR^{13}$ または $-S(O)_mR^{13}$ であり、 R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{11}R^{12}$ 、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_mR^{11}$ であり、 R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{11}R^{12}$ 、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_mR^{11}$ であり、 R^5 がトリフルオロメチル基であり、Wが $-NR^7R^{10}$ であり、

R^7 が水素原子であり、

R^{10} が、水素原子、群Zより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基または群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

[0257]

式(1)において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボ

ニル基、 $-NR^{11}R^{12}$ 、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_mR^{11}$ であり、
 R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{12}$
 5 R^{13} 、 $-OR^{13}$ または $-S(O)_mR^{13}$ であり、
 R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{11}$
 R^{12} 、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_mR^{11}$ であり、
 10 R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{11}$
 R^{12} 、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_mR^{11}$ であり、
 R^5 がトリフルオロメチル基であり、
 15 Wが $-SR^9$ であり、
 R^9 が群Zより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基である化合物；

[0258]

式(1)において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_mR^{11}$ であり、

R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{13}$ または $-S(O)_mR^{13}$ であり、

R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_mR^{11}$ であり、

R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_mR^{11}$ であり、

R^5 がトリフルオロメチル基である化合物；

[0259]

式(1)において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_mR^{11}$ であり、

R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{13}$ または $-S(O)_mR^{13}$ であり、

R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_mR^{11}$ であり、

R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_mR^{11}$ であり、

R^5 がトリフルオロメチル基であり、

$R^{1\ 1}$ が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキル基であり、

5 $R^{1\ 3}$ が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキル基である化合物；

[0260]

式(1)において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、メチル基、トリフルオロメチル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、

10 R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、メチル基、トリフルオロメチル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1\ 3}$ または $-S(O)_m R^{1\ 3}$ であり、

15 R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、メチル基、トリフルオロメチル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、

R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、メチル基、トリフルオロメチル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、

R^5 がトリフルオロメチル基であり、

20 $R^{1\ 1}$ がメチル基またはトリフルオロメチル基であり、

$R^{1\ 3}$ がメチル基またはトリフルオロメチル基である化合物；

[0261]

式(1)において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、メチル基、トリフルオロメチル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、

25 R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、メチル基、トリフルオロメチル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1\ 3}$ または $-S(O)_m R^{1\ 3}$ であり、

30 R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、メチル基、トリフルオロメチル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、

R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、メチル基、トリフルオロメチル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、

35 R^5 が水素原子基であり、

$R^{1\ 1}$ がメチル基またはトリフルオロメチル基であり、

$R^{1\ 3}$ がメチル基またはトリフルオロメチル基である化合物；

[0262]

式(1)において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、メチル基、トリフルオロメチル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、

40 R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、メチル基、トリフルオロメチル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1\ 3}$ または $-S(O)_m R^{1\ 3}$ であり、

45 R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、メチル基、トリフルオロメチル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1\ 1}$

または $-S(O)_m R^{11}$ であり、
 R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、メチル基、トリフルオロメチル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{11}$
 または $-S(O)_m R^{11}$ であり、

- 5 R^5 がトリフルオロメチル基であり、
 R^{11} がメチル基であり、
 R^{13} がメチル基である化合物；

[0263]

- 10 式(1)において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、メチル基、トリフルオロメチル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_m R^{11}$ であり、
 R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、メチル基、トリフルオロメチル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{13}$
 または $-S(O)_m R^{13}$ であり、
 15 R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、メチル基、トリフルオロメチル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{11}$
 または $-S(O)_m R^{11}$ であり、
 R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、メチル基、トリフルオロメチル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{11}$
 20 または $-S(O)_m R^{11}$ であり、
 R^5 が水素原子基であり、
 R^{11} がメチル基であり、
 R^{13} がメチル基である化合物；

[0264]

- 25 式(1)において、 R^1 がハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{11}R^{12}$ 、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_m R^{11}$ であり、
 R^2 、 R^3 および R^4 が水素原子であり、
 30 R^5 がハロゲン原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{11}R^{12}$ 、 $-OR^{11}$ または群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

[0265]

- 35 式(1)において、 R^1 、 R^3 および R^4 が水素原子であり、
 R^2 がハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{12}R^{13}$ 、 $-OR^{13}$ または $-S(O)_m R^{13}$ であり、
 40 R^5 がハロゲン原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{11}R^{12}$ 、 $-OR^{14}$ または群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

[0266]

- 45 式(1)において、 R^1 、 R^2 および R^4 が水素原子であり、
 R^3 がハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していて

もよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C 2－C 6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1\ 1}R^{1\ 2}$ 、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_mR^{1\ 1}$ であり、

- 5 R^5 がハロゲン原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 4アルキル基、C 2－C 6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1\ 1}R^{1\ 2}$ 、 $-OR^{1\ 4}$ または群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

[0 2 6 7]

式(1)において、 R^1 、 R^2 および R^3 が水素原子であり、

- 10 R^4 がハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C 2－C 6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1\ 1}R^{1\ 2}$ 、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_mR^{1\ 1}$ であり、

- 15 R^5 がハロゲン原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 4アルキル基、C 2－C 6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1\ 1}R^{1\ 2}$ 、 $-OR^{1\ 4}$ または群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

[0 2 6 8]

式(1)において、 R^1 がハロゲン原子、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_mR^{1\ 1}$ であり、 R^2 、 R^3 、 R^4 および R^5 が水素原子である化合物；

[0 2 6 9]

式(1)において、 R^1 、 R^3 、 R^4 および R^5 が水素原子であり、 R^2 がハロゲン原子、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1\ 3}$ または $-S(O)_mR^{1\ 3}$ である化合物；

[0 2 7 0]

式(1)において、 R^1 、 R^2 、 R^4 および R^5 が水素原子であり、

- 30 R^3 がハロゲン原子、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_mR^{1\ 1}$ である化合物；

[0 2 7 1]

式(1)において、 R^1 、 R^2 、 R^3 および R^5 が水素原子であり、

- 35 R^4 がハロゲン原子、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_mR^{1\ 1}$ である化合物；

[0 2 7 2]

式(1)において、 R^1 がハロゲン原子、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_mR^{1\ 1}$ であり、

R^2 、 R^3 および R^4 が水素原子であり、

R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 4アルキル基、 $-NR^{1\ 1}R^{1\ 2}$ または $-OR^{1\ 4}$ である化合物；

- 45 [0 2 7 3]

式(1)において、 R^1 、 R^3 および R^4 が水素原子であり、

R^2 がハロゲン原子、群 X より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよい C 1 - C 6 アルキル基、群 Y より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1\ 3}$ または $-S(O)_m R^{1\ 3}$ であり、

R^5 が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 4 アルキル基、
5 $NR^{1\ 1} R^{1\ 2}$ または $-OR^{1\ 4}$ である化合物；

[0274]

式 (1) において、 R^1 、 R^2 および R^4 が水素原子であり、

R^3 がハロゲン原子、群 X より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよい C 1 - C 6 アルキル基、群 Y より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、
10

R^5 が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 4 アルキル基、
 $NR^{1\ 1} R^{1\ 2}$ または $-OR^{1\ 4}$ である化合物；

[0275]

式 (1) において、 R^1 、 R^2 および R^3 が水素原子であり、

R^4 がハロゲン原子、群 X より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよい C 1 - C 6 アルキル基、群 Y より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、
15

R^5 が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 4 アルキル基、
 $NR^{1\ 1} R^{1\ 2}$ または $-OR^{1\ 4}$ である化合物；

20 [0276]

式 (1) において、 R^1 がハロゲン原子であり、 R^2 、 R^3 、 R^4 および R^5 が水素原子である化合物；

[0277]

式 (1) において、 R^1 、 R^3 、 R^4 および R^5 が水素原子であり、 R^2 がハロゲン原子である化合物；
25

[0278]

式 (1) において、 R^1 、 R^2 、 R^4 および R^5 が水素原子であり、 R^3 がハロゲン原子である化合物；

[0279]

式 (1) において、 R^1 、 R^2 、 R^3 および R^5 が水素原子であり、 R^4 がハロゲン原子である化合物；
30

[0280]

式 (1) において、 R^1 が群 X より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよい C 1 - C 6 アルキル基、であり、 R^2 、 R^3 、 R^4 および R^5 が水素原子である化合物；
35

[0281]

式 (1) において、 R^1 、 R^3 、 R^4 および R^5 が水素原子であり、

R^2 が群 X より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよい C 1 - C 6 アルキル基である化合物；

40 [0282]

式 (1) において、 R^1 、 R^2 、 R^4 および R^5 が水素原子であり、

R^3 が群 X より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよい C 1 - C 6 アルキル基である化合物；

[0283]

45 式 (1) において、 R^1 、 R^2 、 R^3 および R^5 が水素原子であり、

R^4 が群 X より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよい C 1 - C 6 アルキル

基である化合物；

[0284]

式(1)において、 R^1 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基であり、 R^2 、 R^3 、 R^4 および R^5 が水素原子である化合物；

[0285]

式(1)において、 R^1 、 R^3 、 R^4 および R^5 が水素原子であり、 R^2 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基である化合物；

[0286]

式(1)において、 R^1 、 R^2 、 R^4 および R^5 が水素原子であり、 R^3 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基である化合物；

[0287]

式(1)において、 R^1 、 R^2 、 R^3 および R^5 が水素原子であり、 R^4 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基である化合物；

[0288]

式(1)において、 R^1 がトリフルオロメチル基であり、 R^2 、 R^3 、 R^4 および R^5 が水素原子である化合物；

[0289]

式(1)において、 R^1 がトリフルオロメチル基であり、 R^2 、 R^3 、 R^4 および R^5 が水素原子であり、 W が $-OR^6$ であり、

R^6 が群Zより選ばれる1個以上の基を有しているC1-C6アルキル基である化合物；

[0290]

式(1)において、 R^1 がトリフルオロメチル基であり、 R^2 、 R^3 、 R^4 および R^5 が水素原子であり、

W が $-OR^6$ であり、

R^6 がC3-C6アルキル基である化合物；

[0291]

式(1)において、 R^1 がトリフルオロメチル基であり、 R^2 、 R^3 、 R^4 および R^5 が水素原子であり、

W が $-ON=CR^7R^8$ 、 $-SR^9$ または $-NR^7R^{10}$ である化合物；

[0292]

式(1)において、 R^1 がトリフルオロメチル基であり、 R^2 、 R^3 、 R^4 および R^5 が水素原子であり、

W が $-ON=CR^7R^8$ である化合物；

[0293]

式(1)において、 R^1 がトリフルオロメチル基であり、 R^2 、 R^3 、 R^4 および R^5 が水素原子であり、

W が $-SR^9$ である化合物；

[0294]

式(1)において、 R^1 がトリフルオロメチル基であり、 R^2 、 R^3 、 R^4 および R^5 が水素原子であり、

Wが $-SR^9$ であり、

R^9 が群Zより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基である化合物；

[0295]

- 5 式(1)において、 R^1 がトリフルオロメチル基であり、 R^2 、 R^3 、 R^4 および R^5 が水素原子であり、

Wが $-NR^7R^{10}$ である化合物；

[0296]

- 10 式(1)において、 R^1 がトリフルオロメチル基であり、 R^2 、 R^3 、 R^4 および R^5 が水素原子であり、

Wが $-NR^7R^{10}$ であり、 R^7 が水素原子であり、 R^{10} が、水素原子、群Zより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基または群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

[0297]

- 15 式(1)において、 R^1 、 R^3 、 R^4 および R^5 が水素原子であり、 R^2 がトリフルオロメチル基である化合物；

[0298]

- 20 式(1)において、 R^1 、 R^3 、 R^4 および R^5 が水素原子であり、 R^2 がトリフルオロメチル基であり、Wが $-OR^6$ であり、 R^6 が群Zより選ばれる1個以上の基を有しているC1-C6アルキル基である化合物；

[0299]

式(1)において、 R^1 、 R^3 、 R^4 および R^5 が水素原子であり、 R^2 がトリフルオロメチル基であり、Wが $-OR^6$ であり、 R^6 がC3-C6アルキル基である化合物；

- 25 [0300]

式(1)において、 R^1 、 R^3 、 R^4 および R^5 が水素原子であり、 R^2 がトリフルオロメチル基であり、Wが $-ON=CR^7R^8$ 、 $-SR^9$ または $-NR^7R^{10}$ である化合物；

[0301]

- 30 式(1)において、 R^1 、 R^3 、 R^4 および R^5 が水素原子であり、 R^2 がトリフルオロメチル基であり、Wが $-ON=CR^7R^8$ である化合物；

[0302]

式(1)において、 R^1 、 R^3 、 R^4 および R^5 が水素原子であり、 R^2 がトリフルオロメチル基であり、Wが $-SR^9$ である化合物；

- 35 [0303]

式(1)において、 R^1 、 R^3 、 R^4 および R^5 が水素原子であり、 R^2 がトリフルオロメチル基であり、Wが $-SR^9$ であり、 R^9 が群Zより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基である化合物；

[0304]

- 40 式(1)において、 R^1 、 R^3 、 R^4 および R^5 が水素原子であり、 R^2 がトリフルオロメチル基であり、Wが $-NR^7R^{10}$ である化合物；

[0305]

- 45 式(1)において、 R^1 、 R^3 、 R^4 および R^5 が水素原子であり、 R^2 がトリフルオロメチル基であり、Wが $-NR^7R^{10}$ であり、 R^7 が水素原子であり、 R^{10} が、水素原子、群Zより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基または群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよい

いフェニル基である化合物；

[0306]

式(1)において、 R^1 、 R^2 、 R^4 および R^5 が水素原子であり、 R^3 がトリフルオロメチル基である化合物；

5 [0307]

式(1)において、 R^1 、 R^2 、 R^4 および R^5 が水素原子であり、 R^3 がトリフルオロメチル基であり、
Wが $-OR^6$ であり、 R^6 が群Zより選ばれる1個以上の基を有しているC1-C6アルキル基である化合物；

10 [0308]

式(1)において、 R^1 、 R^2 、 R^4 および R^5 が水素原子であり、 R^3 がトリフルオロメチル基であり、
Wが $-OR^6$ であり、 R^6 がC3-C6アルキル基である化合物；

[0309]

15 式(1)において、 R^1 、 R^2 、 R^4 および R^5 が水素原子であり、 R^3 がトリフルオロメチル基であり、
Wが $-ON=CR^7R^8$ 、 $-SR^9$ または $-NR^7R^{10}$ である化合物；

[0310]

20 式(1)において、 R^1 、 R^2 、 R^4 および R^5 が水素原子であり、 R^3 がトリフルオロメチル基であり、
Wが $-ON=CR^7R^8$ である化合物；

[0311]

25 式(1)において、 R^1 、 R^2 、 R^4 および R^5 が水素原子であり、 R^3 がトリフルオロメチル基であり、
Wが $-SR^9$ である化合物；

[0312]

30 式(1)において、 R^1 、 R^2 、 R^4 および R^5 が水素原子であり、 R^3 がトリフルオロメチル基であり、
Wが $-SR^9$ であり、 R^9 が群Zより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基である化合物；

[0313]

式(1)において、 R^1 、 R^2 、 R^4 および R^5 が水素原子であり、 R^3 がトリフルオロメチル基であり、Wが $-NR^7R^{10}$ である化合物；

[0314]

35 式(1)において、 R^1 、 R^2 、 R^4 および R^5 が水素原子であり、 R^3 がトリフルオロメチル基であり、Wが $-NR^7R^{10}$ であり、 R^7 が水素原子であり、 R^{10} が、水素原子、群Zより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基または群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

40 [0315]

式(1)において、 R^1 、 R^2 、 R^3 および R^5 が水素原子であり、 R^4 がトリフルオロメチル基である化合物；

[0316]

45 式(1)において、 R^1 、 R^2 、 R^3 および R^5 が水素原子であり、 R^4 がトリフルオロメチル基であり、
Wが $-OR^6$ であり、 R^6 が群Zより選ばれる1個以上の基を有しているC1

—C 6 アルキル基である化合物；

[0317]

式(1)において、 R^1 、 R^2 、 R^3 および R^5 が水素原子であり、 R^4 がトリフルオロメチル基であり、

- 5 Wが—OR⁶であり、 R^6 がC 3—C 6 アルキル基である化合物；

[0318]

式(1)において、 R^1 、 R^2 、 R^3 および R^5 が水素原子であり、 R^4 がトリフルオロメチル基であり、

Wが—ON=CR⁷R⁸、—SR⁹ または—NR⁷R¹⁰である化合物；

- 10 [0319]

式(1)において、 R^1 、 R^2 、 R^3 および R^5 が水素原子であり、 R^4 がトリフルオロメチル基であり、

Wが—ON=CR⁷R⁸である化合物；

[0320]

- 15 式(1)において、 R^1 、 R^2 、 R^3 および R^5 が水素原子であり、 R^4 がトリフルオロメチル基であり、

Wが—SR⁹である化合物；

[0321]

式(1)において、 R^1 、 R^2 、 R^3 および R^5 が水素原子であり、 R^4 がトリフルオロメチル基であり、

- 20 Wが—SR⁹であり、 R^9 が群Zより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1—C 6 アルキル基である化合物；

[0322]

式(1)において、 R^1 、 R^2 、 R^3 および R^5 が水素原子であり、 R^4 がトリフルオロメチル基であり、

- 25 Wが—NR⁷R¹⁰である化合物；

[0323]

式(1)において、 R^1 、 R^2 、 R^3 および R^5 が水素原子であり、 R^4 がトリフルオロメチル基であり、

- 30 Wが—NR⁷R¹⁰であり、 R^7 が水素原子であり、 R^{10} が、水素原子、群Zより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1—C 6 アルキル基または群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

[0324]

式(1)において、 R^1 、 R^2 、 R^3 および R^4 が水素原子であり、 R^5 がトリフルオロメチル基である化合物；

- 35 [0325]

式(1)において、 R^1 、 R^2 、 R^3 および R^4 が水素原子であり、 R^5 がトリフルオロメチル基であり、

- 40 Wが—OR⁶であり、 R^6 が群Zより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1—C 6 アルキル基である化合物；

[0326]

式(1)において、 R^1 、 R^2 、 R^3 および R^4 が水素原子であり、 R^5 がトリフルオロメチル基であり、

Wが—ON=CR⁷R⁸である化合物；

- 45 [0327]

式(1)において、 R^1 、 R^2 、 R^3 および R^4 が水素原子であり、 R^5 がト

リフルオロメチル基であり、
Wが $-SR^9$ である化合物；

[0328]

- 5 式(1)において、 R^1 、 R^2 、 R^3 および R^4 が水素原子であり、 R^5 がトリフルオロメチル基であり、
Wが $-SR^9$ であり、 R^9 が群Zより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基である化合物；

[0329]

- 10 式(1)において、 R^1 、 R^2 、 R^3 および R^4 が水素原子であり、 R^5 がトリフルオロメチル基であり、
Wが $-NR^7R^{10}$ である化合物；

[0330]

- 15 式(1)において、 R^1 、 R^2 、 R^3 および R^4 が水素原子であり、 R^5 がトリフルオロメチル基であり、
Wが $-NR^7R^{10}$ であり、 R^7 が水素原子であり、 R^{10} が、水素原子、群Zより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基または群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

[0331]

- 20 式(1)において、 R^1 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基であり、
 R^2 、 R^3 、 R^4 および R^5 が水素原子である化合物；

[0332]

式(1)において、 R^1 、 R^3 、 R^4 および R^5 が水素原子であり、 R^2 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

- 25 [0333]

式(1)において、 R^1 、 R^2 、 R^4 および R^5 が水素原子であり、 R^3 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

[0334]

- 30 式(1)において、 R^1 、 R^2 、 R^3 および R^5 が水素原子であり、 R^4 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

[0335]

式(1)において、 R^1 が $-OR^{11}$ であり、 R^2 、 R^3 、 R^4 および R^5 が水素原子である化合物；

[0336]

- 35 式(1)において、 R^1 、 R^3 、 R^4 および R^5 が水素原子であり、 R^2 が $-OR^{13}$ である化合物；

[0337]

式(1)において、 R^1 、 R^2 、 R^4 および R^5 が水素原子であり、 R^3 が $-OR^{11}$ である化合物；

- 40 [0338]

式(1)において、 R^1 、 R^2 、 R^3 および R^5 が水素原子であり、 R^4 が $-OR^{11}$ である化合物；

[0339]

- 45 式(1)において、 R^1 が $-S(O)_mR^{11}$ であり、 R^2 、 R^3 、 R^4 および R^5 が水素原子である化合物；

[0340]

式 (1) において、 R^1 、 R^3 、 R^4 および R^5 が水素原子であり、 R^2 が $-S(O)_m R^{1\ 3}$ である化合物；

[0341]

5 式 (1) において、 R^1 、 R^2 、 R^4 および R^5 が水素原子であり、 R^3 が $-S(O)_m R^{1\ 1}$ である化合物；

[0342]

式 (1) において、 R^1 、 R^2 、 R^3 および R^5 が水素原子であり、 R^4 が $-S(O)_m R^{1\ 1}$ である化合物；

[0343]

10 式 (1) において、 R^1 が $-OR^{1\ 1}$ であり、 R^2 、 R^3 、 R^4 および R^5 が水素原子であり、 $R^{1\ 1}$ が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C1-C3 アルキル基である化合物；

[0344]

15 式 (1) において、 R^1 、 R^3 、 R^4 および R^5 が水素原子であり、 R^2 が $-OR^{1\ 3}$ であり、 $R^{1\ 3}$ が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C1-C3 アルキル基である化合物；

[0345]

20 式 (1) において、 R^1 、 R^2 、 R^4 および R^5 が水素原子であり、 R^3 が $-OR^{1\ 1}$ であり、 $R^{1\ 1}$ が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C1-C3 アルキル基である化合物；

[0346]

式 (1) において、 R^1 、 R^2 、 R^3 および R^5 が水素原子であり、 R^4 が $-OR^{1\ 1}$ であり、 $R^{1\ 1}$ が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C1-C3 アルキル基である化合物；

25 [0347]

式 (1) において、 R^1 が $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、 R^2 、 R^3 、 R^4 および R^5 が水素原子であり、 $R^{1\ 1}$ が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C1-C3 アルキル基である化合物；

[0348]

30 式 (1) において、 R^1 、 R^3 、 R^4 および R^5 が水素原子であり、 R^2 が $-S(O)_m R^{1\ 3}$ であり、 $R^{1\ 3}$ が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C1-C3 アルキル基である化合物；

[0349]

35 式 (1) において、 R^1 、 R^2 、 R^4 および R^5 が水素原子であり、 R^3 が $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、 $R^{1\ 1}$ が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C1-C3 アルキル基である化合物；

[0350]

40 式 (1) において、 R^1 、 R^2 、 R^3 および R^5 が水素原子であり、 R^4 が $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、 $R^{1\ 1}$ が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C1-C3 アルキル基である化合物；

[0351]

式 (1) において、 R^1 がハロゲン原子であり、 R^2 、 R^3 および R^4 が水素原子であり、 R^5 が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C1-C4 アルキル基、 $-NR^{1\ 1} R^{1\ 2}$ または $-OR^{1\ 4}$ である化合物；

45 [0352]

式 (1) において、 R^1 、 R^3 および R^4 が水素原子であり、 R^2 がハロゲン

原子であり、 R^5 が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい $C1-C4$ アルキル基、 $-NR^{11}R^{12}$ または $-OR^{14}$ である化合物；

[0353]

式 (1) において、 R^1 、 R^2 および R^4 が水素原子であり、 R^3 がハロゲン原子であり、

R^5 が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい $C1-C4$ アルキル基、 $-NR^{11}R^{12}$ または $-OR^{14}$ である化合物；

[0354]

式 (1) において、 R^1 、 R^2 および R^3 が水素原子であり、 R^4 がハロゲン原子であり、 R^5 が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい $C1-C4$ アルキル基、 $-NR^{11}R^{12}$ または $-OR^{14}$ である化合物；

[0355]

式 (1) において、 R^1 が群 X より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよい $C1-C6$ アルキル基であり、 R^2 、 R^3 および R^4 が水素原子であり、 R^5 が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい $C1-C4$ アルキル基、 $-NR^{11}R^{12}$ または $-OR^{14}$ である化合物；

[0356]

式 (1) において、 R^1 、 R^3 および R^4 が水素原子であり、 R^2 が群 X より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよい $C1-C6$ アルキル基であり、 R^5 が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい $C1-C4$ アルキル基、 $-NR^{11}R^{12}$ または $-OR^{14}$ である化合物；

[0357]

式 (1) において、 R^1 、 R^2 および R^4 が水素原子であり、 R^3 が群 X より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよい $C1-C6$ アルキル基であり、 R^5 が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい $C1-C4$ アルキル基、 $-NR^{11}R^{12}$ または $-OR^{14}$ である化合物；

[0358]

式 (1) において、 R^1 、 R^2 および R^3 が水素原子であり、 R^4 が群 X より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよい $C1-C6$ アルキル基であり、 R^5 が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい $C1-C4$ アルキル基、 $-NR^{11}R^{12}$ または $-OR^{14}$ である化合物；

[0359]

式 (1) において、 R^1 が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい $C1-C4$ アルキル基であり、 R^2 、 R^3 および R^4 が水素原子であり、 R^5 が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい $C1-C4$ アルキル基、 $-NR^{11}R^{12}$ または $-OR^{14}$ である化合物；

[0360]

式 (1) において、 R^1 、 R^3 および R^4 が水素原子であり、 R^2 が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい $C1-C4$ アルキル基であり、 R^5 が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい $C1-C4$ アルキル基、 $-NR^{11}R^{12}$ または $-OR^{14}$ である化合物；

[0361]

式 (1) において、 R^1 、 R^2 および R^4 が水素原子であり、 R^3 が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい $C1-C4$ アルキル基であり、 R^5 が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい $C1-C4$ アルキル基、 $-NR^{11}R^{12}$ または $-OR^{14}$ である化合物；

[0362]

式(1)において、 R^1 、 R^2 および R^3 が水素原子であり、 R^4 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基、 $-NR^{11}R^{12}$ または $-OR^{14}$ である化合物；

[0363]

式(1)において、 R^1 がトリフルオロメチル基であり、 R^2 、 R^3 および R^4 が水素原子であり、 R^5 がハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基、C2-C5アルコキシカルボニル基、 $-NR^{11}R^{12}$ 、 $-S(O)_2NR^7R^{11}$ 、 $-OR^{14}$ または群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

[0364]

式(1)において、 R^1 、 R^3 および R^4 が水素原子であり、 R^2 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 がハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基、C2-C5アルコキシカルボニル基、 $-NR^{11}R^{12}$ 、 $-S(O)_2NR^7R^{11}$ 、 $-OR^{14}$ または群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

[0365]

式(1)において、 R^1 、 R^2 および R^4 が水素原子であり、 R^3 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 がハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基、C2-C5アルコキシカルボニル基、 $-NR^{11}R^{12}$ 、 $-S(O)_2NR^7R^{11}$ 、 $-OR^{14}$ または群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

[0366]

式(1)において、 R^1 、 R^2 および R^3 が水素原子であり、 R^4 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 がハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基、C2-C5アルコキシカルボニル基、 $-NR^{11}R^{12}$ 、 $-S(O)_2NR^7R^{11}$ 、 $-OR^{14}$ または群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

[0367]

式(1)において、 R^1 がトリフルオロメチル基であり、 R^2 、 R^3 および R^4 が水素原子であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基、 $-NR^{11}R^{12}$ または $-OR^{14}$ である化合物；

[0368]

式(1)において、 R^1 、 R^3 および R^4 が水素原子であり、 R^2 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基、 $-NR^{11}R^{12}$ または $-OR^{14}$ である化合物；

[0369]

式(1)において、 R^1 、 R^2 および R^4 が水素原子であり、 R^3 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基、 $-NR^{11}R^{12}$ または $-OR^{14}$ である化合物；

[0370]

式(1)において、 R^1 、 R^2 および R^3 が水素原子であり、 R^4 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基、 $-NR^{1,1}R^{1,2}$ または $-OR^{1,4}$ である化合物；

[0371]

- 5 式(1)において、 R^1 がトリフルオロメチル基であり、 R^2 、 R^3 および R^4 が水素原子であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基または $-OR^{1,4}$ であり、 $R^{1,4}$ が群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C4アルキル基または水素原子である化合物；

10 [0372]

式(1)において、 R^1 、 R^3 および R^4 が水素原子であり、 R^2 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基または $-OR^{1,4}$ であり、 $R^{1,4}$ が群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C4アルキル基または水素原子である化合物；

15 [0373]

式(1)において、 R^1 、 R^2 および R^4 が水素原子であり、 R^3 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基または $-OR^{1,4}$ であり、 $R^{1,4}$ が群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C4アルキル基または水素原子である化合物；

20 [0374]

式(1)において、 R^1 、 R^2 および R^3 が水素原子であり、 R^4 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基または $-OR^{1,4}$ であり、 $R^{1,4}$ が群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C4アルキル基または水素原子である化合物；

25 [0375]

式(1)において、 R^1 がトリフルオロメチル基であり、 R^2 、 R^3 および R^4 が水素原子であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基または $-OR^{1,4}$ であり、 $R^{1,4}$ が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基または水素原子である化合物；

[0376]

- 35 式(1)において、 R^1 、 R^3 および R^4 が水素原子であり、 R^2 がトリフルオロメチル基であり、
 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基または $-OR^{1,4}$ であり、
 $R^{1,4}$ が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基または水素原子である化合物；

40 [0377]

式(1)において、 R^1 、 R^2 および R^4 が水素原子であり、 R^3 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基または $-OR^{1,4}$ であり、 $R^{1,4}$ が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基または水素原子である化合物；

45 [0378]

式(1)において、 R^1 、 R^2 および R^3 が水素原子であり、 R^4 がトリフル

オロメチル基であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基または $-OR^{1\ 4}$ であり、 $R^{1\ 4}$ が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基または水素原子である化合物；

[0379]

- 5 式(1)において、 R^1 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基であり、 R^2 、 R^3 および R^4 が水素原子であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基、 $-NR^{1\ 1} R^{1\ 2}$ または $-OR^{1\ 4}$ である化合物；

[0380]

- 10 式(1)において、 R^1 、 R^3 および R^4 が水素原子であり、 R^2 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基、 $-NR^{1\ 1} R^{1\ 2}$ または $-OR^{1\ 4}$ である化合物；

[0381]

- 15 式(1)において、 R^1 、 R^2 および R^4 が水素原子であり、 R^3 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基、 $-NR^{1\ 1} R^{1\ 2}$ または $-OR^{1\ 4}$ である化合物；

[0382]

- 20 式(1)において、 R^1 、 R^2 および R^3 が水素原子であり、 R^4 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基、 $-NR^{1\ 1} R^{1\ 2}$ または $-OR^{1\ 4}$ である化合物；

[0383]

- 25 式(1)において、 R^1 が $-OR^{1\ 1}$ であり、 R^2 、 R^3 および R^4 が水素原子であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基、 $-NR^{1\ 1} R^{1\ 2}$ または $-OR^{1\ 4}$ であり、 $R^{1\ 1}$ が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキル基である化合物；

- 30 [0384]

式(1)において、 R^1 、 R^3 および R^4 が水素原子であり、 R^2 が $-OR^{1\ 3}$ であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基、 $-NR^{1\ 1} R^{1\ 2}$ または $-OR^{1\ 4}$ であり、 $R^{1\ 3}$ が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキル基である化合物；

- 35 [0385]

式(1)において、 R^1 、 R^2 および R^4 が水素原子であり、 R^3 が $-OR^{1\ 1}$ であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基、 $-NR^{1\ 1} R^{1\ 2}$ または $-OR^{1\ 4}$ であり、

- 40 $R^{1\ 1}$ が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキル基である化合物；

[0386]

- 45 式(1)において、 R^1 、 R^2 および R^3 が水素原子であり、 R^4 が $-OR^{1\ 1}$ であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基、 $-NR^{1\ 1} R^{1\ 2}$ または $-OR^{1\ 4}$ であり、 $R^{1\ 1}$ が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキル基で

ある化合物；

[0387]

- 式(1)において、 R^1 が $-S(O)_m R^{1'1}$ であり、 R^2 、 R^3 および R^4 が水素原子であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基、 $-NR^{1'1} R^{1'2}$ または $-OR^{1'4}$ であり、 $R^{1'1}$ が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキル基である化合物；

[0388]

- 式(1)において、 R^1 、 R^3 および R^4 が水素原子であり、 R^2 が $-S(O)_m R^{1'3}$ であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基、 $-NR^{1'1} R^{1'2}$ または $-OR^{1'4}$ であり、 $R^{1'3}$ が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキル基である化合物；

[0389]

- 式(1)において、 R^1 、 R^2 および R^4 が水素原子であり、 R^3 が $-S(O)_m R^{1'1}$ であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基、 $-NR^{1'1} R^{1'2}$ または $-OR^{1'4}$ であり、 $R^{1'1}$ が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキル基である化合物；

[0390]

- 式(1)において、 R^1 、 R^2 および R^3 が水素原子であり、 R^4 が $-S(O)_m R^{1'1}$ であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基、 $-NR^{1'1} R^{1'2}$ または $-OR^{1'4}$ であり、 $R^{1'1}$ が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキル基である化合物；

[0391]

- 式(1)において、 R^1 がハロゲン原子であり、 R^2 、 R^3 および R^4 が水素原子であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基または $-OR^{1'4}$ であり、 $R^{1'4}$ が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基または水素原子である化合物；

[0392]

- 式(1)において、 R^1 、 R^3 および R^4 が水素原子であり、 R^2 がハロゲン原子であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基または $-OR^{1'4}$ であり、 $R^{1'4}$ が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基または水素原子である化合物；

[0393]

- 式(1)において、 R^1 、 R^2 および R^4 が水素原子であり、 R^3 がハロゲン原子であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基または $-OR^{1'4}$ であり、 $R^{1'4}$ が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基または水素原子である化合物；

[0394]

- 式(1)において、 R^1 、 R^2 および R^3 が水素原子であり、 R^4 がハロゲン原子であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基または $-OR^{1'4}$ であり、 $R^{1'4}$ が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基または水素原子である化合物；

[0395]

- 式(1)において、 R^1 が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基であり、 R^2 、 R^3 および R^4 が水素原子であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基または $-OR^{1'4}$ であり、 $R^{1'4}$ が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキ

ル基または水素原子である化合物；

[0396]

式(1)において、 R^1 、 R^3 および R^4 が水素原子であり、 R^2 が群Yより
5 選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基であり、 R^5 が1個以上の
ハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基または $-OR^{1,4}$ であり、 $R^{1,4}$ が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル
基または水素原子である化合物；

[0397]

式(1)において、 R^1 、 R^2 および R^4 が水素原子であり、 R^3 が群Yより
10 選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基であり、 R^5 が1個以上の
ハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基または $-OR^{1,4}$ であり、 $R^{1,4}$ が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル
基または水素原子である化合物；

[0398]

式(1)において、 R^1 、 R^2 および R^3 が水素原子であり、 R^4 が群Yより
15 選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基であり、 R^5 が1個以上の
ハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基または $-OR^{1,4}$ であり、 $R^{1,4}$ が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル
基または水素原子である化合物；

[0399]

式(1)において、 R^1 が $-OR^{1,1}$ であり、 R^2 、 R^3 および R^4 が水素原
子であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アル
20 キル基または $-OR^{1,4}$ であり、 $R^{1,1}$ が1個以上のハロゲン原子を有してい
てもよいC1-C3アルキル基であり、 $R^{1,4}$ が1個以上のハロゲン原子を有
25 していてもよいC1-C4アルキル基または水素原子である化合物；

[0400]

式(1)において、 R^1 、 R^3 および R^4 が水素原子であり、 R^2 が $-OR^{1,3}$
30 であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アル
キル基または $-OR^{1,4}$ であり、 $R^{1,3}$ が1個以上のハロゲン原子を有してい
てもよいC1-C3アルキル基であり、 $R^{1,4}$ が1個以上のハロゲン原子を有
していてもよいC1-C4アルキル基または水素原子である化合物；

[0401]

式(1)において、 R^1 、 R^2 および R^4 が水素原子であり、 R^3 が $-OR^{1,1}$
35 であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アル
キル基または $-OR^{1,4}$ であり、 $R^{1,1}$ が1個以上のハロゲン原子を有してい
てもよいC1-C3アルキル基であり、 $R^{1,4}$ が1個以上のハロゲン原子を有
していてもよいC1-C4アルキル基または水素原子である化合物；

[0402]

式(1)において、 R^1 、 R^2 および R^3 が水素原子であり、 R^4 が $-OR^{1,1}$
40 であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アル
キル基または $-OR^{1,4}$ であり、 $R^{1,1}$ が1個以上のハロゲン原子を有してい
てもよいC1-C3アルキル基であり、 $R^{1,4}$ が1個以上のハロゲン原子を有
していてもよいC1-C4アルキル基または水素原子である化合物；

[0403]

式(1)において、 R^1 が $-S(O)_m R^{1,1}$ であり、 R^2 、 R^3 および R^4
45 が水素原子であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-

C 4 アルキル基または $-OR^{1\ 4}$ であり、 $R^{1\ 1}$ が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 3 アルキル基であり、 $R^{1\ 4}$ が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 4 アルキル基または水素原子である化合物；

[0404]

- 5 式 (1) において、 R^1 、 R^3 および R^4 が水素原子であり、 R^2 が $-S(O)_m R^{1\ 3}$ であり、 R^5 が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 4 アルキル基または $-OR^{1\ 4}$ であり、 $R^{1\ 3}$ が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 3 アルキル基であり、 $R^{1\ 4}$ が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 4 アルキル基または水素原子である化合物；

10 [0405]

式 (1) において、 R^1 、 R^2 および R^4 が水素原子であり、 R^3 が $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、 R^5 が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 4 アルキル基または $-OR^{1\ 4}$ であり、 $R^{1\ 1}$ が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 3 アルキル基であり、 $R^{1\ 4}$ が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 4 アルキル基または水素原子である化合物；

15 [0406]

式 (1) において、 R^1 、 R^2 および R^3 が水素原子であり、 R^4 が $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、 R^5 が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 4 アルキル基または $-OR^{1\ 4}$ であり、 $R^{1\ 1}$ が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 3 アルキル基であり、 $R^{1\ 4}$ が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 4 アルキル基または水素原子である化合物；

20 [0407]

式 (1) において、 R^1 がトリフルオロメチル基であり、 R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群 X より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよい C 1 - C 6 アルキル基、群 Y より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよいフェニル基、C 2 - C 6 アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1\ 2} R^{1\ 3}$ 、 $-OR^{1\ 3}$ または $-S(O)_m R^{1\ 3}$ であり、 R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群 X より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよい C 1 - C 6 アルキル基、群 Y より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよいフェニル基、C 2 - C 6 アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1\ 1} R^{1\ 2}$ 、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、 R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群 X より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよい C 1 - C 6 アルキル基、群 Y より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよいフェニル基、C 2 - C 6 アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1\ 1} R^{1\ 2}$ 、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、 R^5 が水素原子、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 4 アルキル基または $-OR^{1\ 4}$ である化合物；

30 [0408]

式 (1) において、 R^1 がトリフルオロメチル基であり、 R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群 X より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよい C 1 - C 6 アルキル基、群 Y より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよいフェニル基、C 2 - C 6 アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1\ 2} R^{1\ 3}$ 、 $-OR^{1\ 3}$ または $-S(O)_m R^{1\ 3}$ であり、 R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群 X より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよい C 1 - C 6 アルキル基、群 Y より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよいフェニル基、C 2 - C 6 アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1\ 1} R^{1\ 2}$ 、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、 R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群 X より選ばれる 1

45

個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C 2－C 6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1\ 1}R^{1\ 2}$ 、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_mR^{1\ 1}$ であり、 R^5 が水素原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 4アルキル基または $-OR^{1\ 4}$ であり、Wが $-OR^6$ であり、 R^6 が群Zより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基である化合物；

[0409]

式(1)において、 R^1 がトリフルオロメチル基であり、 R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C 2－C 6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1\ 2}R^{1\ 3}$ 、 $-OR^{1\ 3}$ または $-S(O)_mR^{1\ 3}$ であり、 R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C 2－C 6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1\ 1}R^{1\ 2}$ 、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_mR^{1\ 1}$ であり、 R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C 2－C 6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1\ 1}R^{1\ 2}$ 、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_mR^{1\ 1}$ であり、 R^5 が水素原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 4アルキル基または $-OR^{1\ 4}$ であり、Wが $-NR^7R^{1\ 0}$ である化合物；

[0410]

式(1)において、 R^1 がトリフルオロメチル基であり、 R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C 2－C 6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1\ 2}R^{1\ 3}$ 、 $-OR^{1\ 3}$ または $-S(O)_mR^{1\ 3}$ であり、 R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C 2－C 6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1\ 1}R^{1\ 2}$ 、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_mR^{1\ 1}$ であり、 R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C 2－C 6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1\ 1}R^{1\ 2}$ 、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_mR^{1\ 1}$ であり、 R^5 が水素原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 4アルキル基または $-OR^{1\ 4}$ であり、Wが $-NR^7R^{1\ 0}$ であり、 R^7 が水素原子であり、 $R^{1\ 0}$ が、水素原子、群Zより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基または群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

[0411]

式(1)において、 R^1 がトリフルオロメチル基であり、 R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C 2－C 6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1\ 2}R^{1\ 3}$ 、 $-OR^{1\ 3}$ または $-S(O)_mR^{1\ 3}$ であり、 R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、

群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1,1}R^{1,2}$ 、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_mR^{1,1}$ であり、 R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1,1}R^{1,2}$ 、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_mR^{1,1}$ であり、 R^5 が水素原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基または $-OR^{1,4}$ であり、Wが $-SR^9$ であり、 R^9 が群Zより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基である化合物；

10 [0412]

式(1)において、 R^1 がトリフルオロメチル基であり、 R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1,3}$ または $-S(O)_mR^{1,3}$ であり、 R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_mR^{1,1}$ であり、 R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_mR^{1,1}$ であり、 R^5 が水素原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基または $-OR^{1,4}$ である化合物；

[0413]

式(1)において、 R^1 がトリフルオロメチル基であり、 R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1,3}$ または $-S(O)_mR^{1,3}$ であり、 R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_mR^{1,1}$ であり、 R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_mR^{1,1}$ であり、 R^5 が水素原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基または $-OR^{1,4}$ であり、 $R^{1,1}$ が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキル基であり、 $R^{1,3}$ が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキル基であり、 $R^{1,4}$ が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基または水素原子である化合物；

[0414]

40 式(1)において、 R^1 がトリフルオロメチル基であり、 R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、メチル基、トリフルオロメチル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1,3}$ または $-S(O)_mR^{1,3}$ であり、 R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_mR^{1,1}$ であり、 R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1

個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、 R^5 が水素原子、メチル基、トリフルオロメチル基または $-OR^{1\ 4}$ であり、 $R^{1\ 1}$ がメチル基またはトリフルオロメチル基であり、 $R^{1\ 3}$ がメチル基またはトリフルオロメチル基であり、 $R^{1\ 4}$ が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 4アルキル基または水素原子である化合物；

[0 4 1 5]

式(1)において、 R^1 がトリフルオロメチル基であり、 R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、メチル基、トリフルオロメチル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1\ 3}$ または $-S(O)_m R^{1\ 3}$ であり、 R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、 R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、 R^5 が水素原子、メチル基、トリフルオロメチル基または $-OR^{1\ 4}$ であり、 $R^{1\ 1}$ がメチル基であり、 $R^{1\ 3}$ がメチル基であり、 $R^{1\ 4}$ が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 4アルキル基または水素原子である化合物；

[0 4 1 6]

式(1)において、 R^1 がトリフルオロメチル基であり、 R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C 2－C 6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1\ 2} R^{1\ 3}$ 、 $-OR^{1\ 3}$ または $-S(O)_m R^{1\ 3}$ であり、 R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C 2－C 6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1\ 1} R^{1\ 2}$ 、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、 R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C 2－C 6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1\ 1} R^{1\ 2}$ 、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、 R^5 が水素原子である化合物；

[0 4 1 7]

式(1)において、 R^1 がトリフルオロメチル基であり、 R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1\ 3}$ または $-S(O)_m R^{1\ 3}$ であり、 R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、 R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、 R^5 が水素原子ある化合物；

[0418]

式(1)において、 R^1 がトリフルオロメチル基であり、 R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1\ 3}$ または $-S(O)_m R^{1\ 3}$ であり、 R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、 R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、 R^5 が水素原子であり、 $R^{1\ 1}$ が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキル基であり、 $R^{1\ 3}$ が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキル基である化合物；

[0419]

式(1)において、 R^1 がトリフルオロメチル基であり、 R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、メチル基、トリフルオロメチル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1\ 3}$ または $-S(O)_m R^{1\ 3}$ であり、 R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、 R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、 R^5 が水素原子であり、 $R^{1\ 1}$ がメチル基またはトリフルオロメチル基であり、 $R^{1\ 3}$ がメチル基またはトリフルオロメチル基である化合物；

[0420]

式(1)において、 R^1 がトリフルオロメチル基であり、 R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、メチル基、トリフルオロメチル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1\ 3}$ または $-S(O)_m R^{1\ 3}$ であり、 R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、 R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、 R^5 が水素原子であり、 $R^{1\ 1}$ がメチル基であり、 $R^{1\ 3}$ がメチル基である化合物；

[0421]

式(1)において、 R^1 がトリフルオロメチル基であり、 R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1\ 2} R^{1\ 3}$ 、 $-OR^{1\ 3}$ または $-S(O)_m R^{1\ 3}$ であり、 R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6ア

ルコキシカルボニル基、 $-NR^{1,1}R^{1,2}$ 、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_mR^{1,1}$ であり、 R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1,1}R^{1,2}$ 、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_mR^{1,1}$ であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基または $-OR^{1,4}$ である化合物；

[0422]

式(1)において、 R^1 がトリフルオロメチル基であり、 R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1,3}$ または $-S(O)_mR^{1,3}$ であり、 R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_mR^{1,1}$ であり、 R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_mR^{1,1}$ であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基または $-OR^{1,4}$ である化合物；

[0423]

式(1)において、 R^1 がトリフルオロメチル基であり、 R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1,3}$ または $-S(O)_mR^{1,3}$ であり、 R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_mR^{1,1}$ であり、 R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_mR^{1,1}$ であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基または $-OR^{1,4}$ である化合物； $R^{1,1}$ が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキル基であり、 $R^{1,3}$ が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキル基であり、 $R^{1,4}$ が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基または水素原子である化合物；

[0424]

式(1)において、 R^1 がトリフルオロメチル基であり、 R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、メチル基、トリフルオロメチル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1,3}$ または $-S(O)_mR^{1,3}$ であり、 R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_mR^{1,1}$ であり、 R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_mR^{1,1}$

¹ であり、 R^5 がメチル基、トリフルオロメチル基または $-OR^{14}$ であり、 R^{11} がメチル基またはトリフルオロメチル基であり、 R^{13} がメチル基またはトリフルオロメチル基であり、 R^{14} が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基または水素原子である化合物；

5 [0425]

式(1)において、 R^1 がトリフルオロメチル基であり、 R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、メチル基、トリフルオロメチル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{13}$ または $-S(O)_m R^{13}$ であり、 R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1
10 1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_m R^{11}$ であり、 R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_m R^{11}$
15 ¹ であり、 R^5 がメチル基、トリフルオロメチル基または $-OR^{14}$ であり、 R^{11} がメチル基であり、 R^{13} がメチル基であり、 R^{14} が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基または水素原子である化合物；

[0426]

20 式(1)において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボ
25 ニル基、 $-NR^{11} R^{12}$ 、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_m R^{11}$ であり、 R^2 がトリフルオロメチル基であり、 R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アル
30 コキシカルボニル基、 $-NR^{11} R^{12}$ 、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_m R^{11}$ であり、 R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボ
35 ニル基、 $-NR^{11} R^{12}$ 、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_m R^{11}$ であり、 R^5 が水素原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基または $-OR^{14}$ である化合物；

[0427]

35 式(1)において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボ
40 ニル基、 $-NR^{11} R^{12}$ 、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_m R^{11}$ であり、 R^2 がトリフルオロメチル基であり、 R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アル
45 コキシカルボニル基、 $-NR^{11} R^{12}$ 、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_m R^{11}$ であり、 R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボ
50 ニル基、 $-NR^{11} R^{12}$ 、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_m R^{11}$ であり、 R^5 が水

素原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基または $-OR^{1,4}$ であり、Wが $-OR^6$ であり、 R^6 が群Zより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基である化合物；

[0428]

- 5 式(1)において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1,1}R^{1,2}$ 、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_mR^{1,1}$ であり、 R^2 がトリフルオロメチル基であり、 R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1,1}R^{1,2}$ 、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_mR^{1,1}$ であり、 R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1,1}R^{1,2}$ 、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_mR^{1,1}$ であり、 R^5 が水素原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基または $-OR^{1,4}$ であり、Wが $-NR^7R^{1,0}$ である化合物；

[0429]

- 20 式(1)において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1,1}R^{1,2}$ 、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_mR^{1,1}$ であり、 R^2 がトリフルオロメチル基であり、 R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1,1}R^{1,2}$ 、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_mR^{1,1}$ であり、 R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1,1}R^{1,2}$ 、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_mR^{1,1}$ であり、 R^5 が水素原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基または $-OR^{1,4}$ であり、Wが $-NR^7R^{1,0}$ であり、 R^7 が水素原子であり、 $R^{1,0}$ が、水素原子、群Zより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基または群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

[0430]

- 40 式(1)において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1,1}R^{1,2}$ 、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_mR^{1,1}$ であり、 R^2 がトリフルオロメチル基であり、 R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1,1}R^{1,2}$ 、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_mR^{1,1}$ であり、 R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1

個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C 2－C 6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1,1}R^{1,2}$ 、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_mR^{1,1}$ であり、 R^5 が水素原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 4アルキル基または $-OR^{1,4}$ であり、Wが $-SR^9$ であり、 R^9 が群Zより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基である化合物；

[0431]

式(1)において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_mR^{1,1}$ であり、 R^2 がトリフルオロメチル基であり、 R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_mR^{1,1}$ であり、 R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_mR^{1,1}$ であり、 R^5 が水素原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 4アルキル基または $-OR^{1,4}$ である化合物；

[0432]

式(1)において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_mR^{1,1}$ であり、 R^2 がトリフルオロメチル基であり、 R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_mR^{1,1}$ であり、 R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_mR^{1,1}$ であり、 R^5 が水素原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 4アルキル基または $-OR^{1,4}$ であり、 $R^{1,1}$ が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 3アルキル基であり、 $R^{1,4}$ が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 4アルキル基または水素原子である化合物；

[0433]

式(1)において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、メチル基、トリフルオロメチル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_mR^{1,1}$ であり、 R^2 がトリフルオロメチル基であり、 R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、メチル基、トリフルオロメチル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_mR^{1,1}$ であり、 R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、メチル基、トリフルオロメチル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_mR^{1,1}$ であり、 R^5 が水素原子、メチル基、トリフルオロメチル基または $-OR^{1,4}$ であり、 $R^{1,1}$ がメチル基またはトリフルオロメチル基であり、 $R^{1,4}$ が1個以上のハ

ロゲン原子を有していてもよいC 1－C 4アルキル基または水素原子である化合物；

[0 4 3 4]

式(1)において、R¹が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、メチル基、トリフルオロメチル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_m R^{1,1}$ であり、R²がトリフルオロメチル基であり、R³が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、メチル基、トリフルオロメチル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_m R^{1,1}$ であり、R⁴が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、メチル基、トリフルオロメチル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_m R^{1,1}$ であり、R⁵が水素原子、メチル基、トリフルオロメチル基または $-OR^{1,4}$ であり、

R^{1,1}がメチル基であり、R^{1,4}が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 4アルキル基または水素原子である化合物；

[0 4 3 5]

式(1)において、R¹が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C 2－C 6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1,1}R^{1,2}$ 、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_m R^{1,1}$ であり、R²がトリフルオロメチル基であり、R³が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C 2－C 6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1,1}R^{1,2}$ 、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_m R^{1,1}$ であり、R⁴が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C 2－C 6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1,1}R^{1,2}$ 、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_m R^{1,1}$ であり、R⁵が水素原子である化合物；

[0 4 3 6]

式(1)において、R¹が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_m R^{1,1}$ であり、R²がトリフルオロメチル基であり、R³が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_m R^{1,1}$ であり、R⁴が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_m R^{1,1}$ であり、R⁵が水素原子ある化合物；

[0 4 3 7]

式(1)において、R¹が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_m R^{1,1}$ であり、R²がトリフルオロメチル基であり、R³が水素原子、ハロ

ゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_m R^{1,1}$ であり、 R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_m R^{1,1}$ であり、 R^5 が水素原子であり、 $R^{1,1}$ が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキル基である化合物；

[0438]

式(1)において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、メチル基、トリフルオロメチル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_m R^{1,1}$ であり、 R^2 がトリフルオロメチル基であり、 R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、メチル基、トリフルオロメチル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_m R^{1,1}$ であり、 R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、メチル基、トリフルオロメチル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_m R^{1,1}$ であり、 R^5 が水素原子であり、 $R^{1,1}$ がメチル基またはトリフルオロメチル基である化合物；

[0439]

式(1)において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、メチル基、トリフルオロメチル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_m R^{1,1}$ であり、 R^2 がトリフルオロメチル基であり、 R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、メチル基、トリフルオロメチル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_m R^{1,1}$ であり、 R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、メチル基、トリフルオロメチル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_m R^{1,1}$ であり、 R^5 が水素原子であり、 $R^{1,1}$ がメチル基である化合物；

[0440]

式(1)において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1,1} R^{1,2}$ 、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_m R^{1,1}$ であり、 R^2 がトリフルオロメチル基であり、 R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1,1} R^{1,2}$ 、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_m R^{1,1}$ であり、 R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1,1} R^{1,2}$ 、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_m R^{1,1}$ であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基または $-OR^{1,4}$ である化合物；

[0441]

式(1)において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ば

れる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_m R^{1,1}$ であり、 R^2 がトリフルオロメチル基であり、 R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_m R^{1,1}$ であり、 R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_m R^{1,1}$ であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基または $-OR^{1,4}$ である化合物；

[0442]

式(1)において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_m R^{1,1}$ であり、 R^2 がトリフルオロメチル基であり、 R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_m R^{1,1}$ であり、 R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_m R^{1,1}$ であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基または $-OR^{1,4}$ であり、 $R^{1,1}$ が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキル基であり、 $R^{1,4}$ が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基または水素原子である化合物；

[0443]

式(1)において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、メチル基、トリフルオロメチル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_m R^{1,1}$ であり、 R^2 がトリフルオロメチル基であり、 R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、メチル基、トリフルオロメチル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_m R^{1,1}$ であり、 R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、メチル基、トリフルオロメチル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_m R^{1,1}$ であり、 R^5 がメチル基、トリフルオロメチル基または $-OR^{1,4}$ であり、 $R^{1,1}$ がメチル基またはトリフルオロメチル基であり、 $R^{1,4}$ が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基または水素原子である化合物；

[0444]

式(1)において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、メチル基、トリフルオロメチル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_m R^{1,1}$ であり、 R^2 がトリフルオロメチル基であり、 R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、メチル基、トリフルオロメチル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_m R^{1,1}$ であり、 R^4 が水素原子、ハロゲン

原子、ニトロ基、メチル基、トリフルオロメチル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_m R^{11}$ であり、 R^5 がメチル基、トリフルオロメチル基または $-OR^{14}$ であり、 R^{11} がメチル基であり、 R^{14} が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基または水素原子である化合物；

[0445]

式(1)において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{11} R^{12}$ 、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_m R^{11}$ であり、 R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{12} R^{13}$ 、 $-OR^{13}$ または $-S(O)_m R^{13}$ であり、 R^3 がトリフルオロメチル基であり、 R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{11} R^{12}$ 、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_m R^{11}$ であり、 R^5 が水素原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基または $-OR^{14}$ である化合物；

[0446]

式(1)において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{11} R^{12}$ 、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_m R^{11}$ であり、 R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{12} R^{13}$ 、 $-OR^{13}$ または $-S(O)_m R^{13}$ であり、 R^3 がトリフルオロメチル基であり、 R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{11} R^{12}$ 、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_m R^{11}$ であり、 R^5 が水素原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基または $-OR^{14}$ であり、Wが $-OR^6$ であり、 R^6 が群Zより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基である化合物；

[0447]

式(1)において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{11} R^{12}$ 、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_m R^{11}$ であり、 R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{12} R^{13}$ 、 $-OR^{13}$ または $-S(O)_m R^{13}$ であり、 R^3 がトリフルオロメチル基であり、 R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1

個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C 2－C 6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{11}R^{12}$ 、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_mR^{11}$ であり、 R^5 が水素原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 4アルキル基または $-OR^{14}$ であり、Wが $-NR^7R^{10}$ である化合物；

[0448]

式(1)において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C 2－C 6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{11}R^{12}$ 、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_mR^{11}$ であり、 R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C 2－C 6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{12}R^{13}$ 、 $-OR^{13}$ または $-S(O)_mR^{13}$ であり、 R^3 がトリフルオロメチル基であり、 R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C 2－C 6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{11}R^{12}$ 、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_mR^{11}$ であり、 R^5 が水素原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 4アルキル基または $-OR^{14}$ であり、Wが $-NR^7R^{10}$ であり、 R^7 が水素原子であり、 R^{10} が、水素原子、群Zより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基または群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

[0449]

式(1)において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C 2－C 6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{11}R^{12}$ 、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_mR^{11}$ であり、 R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C 2－C 6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{12}R^{13}$ 、 $-OR^{13}$ または $-S(O)_mR^{13}$ であり、 R^3 がトリフルオロメチル基であり、 R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C 2－C 6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{11}R^{12}$ 、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_mR^{11}$ であり、 R^5 が水素原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 4アルキル基または $-OR^{14}$ であり、Wが $-SR^9$ であり、 R^9 が群Zより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基である化合物；

[0450]

式(1)において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_mR^{11}$ であり、 R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{13}$ または $-S(O)_m$

$R^{1\ 3}$ であり、 R^3 がトリフルオロメチル基であり、 R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、 R^5 が水素原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基または $-OR^{1\ 4}$ である化合物；

[0451]

式(1)において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、 R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1\ 3}$ または $-S(O)_m R^{1\ 3}$ であり、 R^3 がトリフルオロメチル基であり、 R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、 R^5 が水素原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基または $-OR^{1\ 4}$ であり、 R^6 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキル基であり、 R^9 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキル基であり、 $R^{1\ 4}$ が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基または水素原子である化合物；

[0452]

式(1)において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、メチル基、トリフルオロメチル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、 R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、メチル基、トリフルオロメチル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1\ 3}$ または $-S(O)_m R^{1\ 3}$ であり、

R^3 がトリフルオロメチル基であり、 R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、メチル基、トリフルオロメチル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、 R^5 が水素原子、メチル基、トリフルオロメチル基または $-OR^{1\ 4}$ であり、 $R^{1\ 1}$ がメチル基またはトリフルオロメチル基であり、 $R^{1\ 3}$ がメチル基またはトリフルオロメチル基であり、 $R^{1\ 4}$ が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基または水素原子である化合物；

[0453]

式(1)において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、メチル基、トリフルオロメチル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、 R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、メチル基、トリフルオロメチル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1\ 3}$ または $-S(O)_m R^{1\ 3}$ であり、

R^3 がトリフルオロメチル基であり、 R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、メチル基、トリフルオロメチル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、 R^5

が水素原子、メチル基、トリフルオロメチル基または $-OR^{14}$ であり、 R^{11} がメチル基であり、 R^{13} がメチル基であり、 R^{14} が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基または水素原子である化合物；
[0454]

- 5 式(1)において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{11}R^{12}$ 、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_mR^{11}$ であり、 R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{12}R^{13}$ 、 $-OR^{13}$ または $-S(O)_mR^{13}$ であり、 R^3 がトリフルオロメチル基であり、 R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{11}R^{12}$ 、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_mR^{11}$ であり、 R^5 が水素原子である化合物；
[0455]

- 20 式(1)において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_mR^{11}$ であり、 R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{13}$ または $-S(O)_mR^{13}$ であり、 R^3 がトリフルオロメチル基であり、 R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_mR^{11}$ であり、 R^5 が水素原子である化合物；
[0456]

- 30 式(1)において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_mR^{11}$ であり、 R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{13}$ または $-S(O)_mR^{13}$ であり、 R^3 がトリフルオロメチル基であり、 R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_mR^{11}$ であり、 R^5 が水素原子であり、 R^{11} が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキル基であり、 R^{13} が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキル基である化合物；
[0457]

- 45 式(1)において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、メチル基、トリフルオロメチル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェ

ニル基、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_m R^{11}$ であり、 R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、メチル基、トリフルオロメチル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{13}$ または $-S(O)_m R^{13}$ であり、 R^3 がトリフルオロメチル基であり、 R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、メチル基、トリフルオロメチル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_m R^{11}$ であり、 R^5 が水素原子であり、 R^{11} がメチル基またはトリフルオロメチル基であり、 R^{13} がメチル基またはトリフルオロメチル基である化合物；

[0458]

式(1)において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、メチル基、トリフルオロメチル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_m R^{11}$ であり、 R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、メチル基、トリフルオロメチル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{13}$ または $-S(O)_m R^{13}$ であり、

R^3 がトリフルオロメチル基であり、 R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、メチル基、トリフルオロメチル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_m R^{11}$ であり、 R^5 が水素原子であり、 R^{11} がメチル基であり、 R^{13} がメチル基である化合物；

[0459]

式(1)において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{11} R^{12}$ 、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_m R^{11}$ であり、 R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{12} R^{13}$ 、 $-OR^{13}$ または $-S(O)_m R^{13}$ であり、 R^3 がトリフルオロメチル基であり、 R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{11} R^{12}$ 、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_m R^{11}$ であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基または $-OR^{14}$ である化合物；

[0460]

式(1)において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_m R^{11}$ であり、 R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{13}$ または $-S(O)_m R^{13}$ であり、 R^3 がトリフルオロメチル基であり、 R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_m R^{11}$ であり、 R^5 が1個以上のハロゲン

原子を有していてもよいC 1－C 4アルキル基または $-OR^{1\ 4}$ である化合物；

[0 4 6 1]

式(1)において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、 R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1\ 3}$ または $-S(O)_m R^{1\ 3}$ であり、 R^3 がトリフルオロメチル基であり、 R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 4アルキル基または $-OR^{1\ 4}$ であり、 $R^{1\ 1}$ が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 3アルキル基であり、 $R^{1\ 3}$ が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 3アルキル基であり、 $R^{1\ 4}$ が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 4アルキル基または水素原子である化合物；

[0 4 6 2]

式(1)において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、メチル基、トリフルオロメチル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、 R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、メチル基、トリフルオロメチル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1\ 3}$ または $-S(O)_m R^{1\ 3}$ であり、 R^3 がトリフルオロメチル基であり、 R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、メチル基、トリフルオロメチル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、 R^5 がメチル基、トリフルオロメチル基または $-OR^{1\ 4}$ であり、 $R^{1\ 1}$ がメチル基またはトリフルオロメチル基であり、 $R^{1\ 3}$ がメチル基またはトリフルオロメチル基であり、 $R^{1\ 4}$ が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 4アルキル基または水素原子である化合物；

[0 4 6 3]

式(1)において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、メチル基、トリフルオロメチル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、 R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、メチル基、トリフルオロメチル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1\ 3}$ または $-S(O)_m R^{1\ 3}$ であり、 R^3 がトリフルオロメチル基であり、 R^4 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、メチル基、トリフルオロメチル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、 R^5 がメチル基、トリフルオロメチル基または $-OR^{1\ 4}$ であり、 $R^{1\ 1}$ がメチル基であり、 $R^{1\ 3}$ がメチル基であり、 $R^{1\ 4}$ が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 4アルキル基または水素原子である化合物；

[0464]

式(1)において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボ
 5 ニル基、 $-NR^{1,1}R^{1,2}$ 、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_mR^{1,1}$ であり、 R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1,2}R^{1,3}$ 、 $-OR^{1,3}$ または $-S(O)_mR^{1,3}$ であり、 R^3 が水素原子、ハロゲ
 10 ン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1,1}R^{1,2}$ 、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_mR^{1,1}$ であり、 R^4 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 が水素原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基または $-OR^{1,4}$ である化合物；

[0465]

式(1)において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボ
 20 ニル基、 $-NR^{1,1}R^{1,2}$ 、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_mR^{1,1}$ であり、 R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1,2}R^{1,3}$ 、 $-OR^{1,3}$ または $-S(O)_mR^{1,3}$ であり、 R^3 が水素原子、ハロゲ
 25 ン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1,1}R^{1,2}$ 、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_mR^{1,1}$ であり、 R^4 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 が水素原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基または $-OR^{1,4}$ であり、Wが $-OR^6$ であり、 R^6 が群Zより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基である化合物；

[0466]

式(1)において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボ
 35 ニル基、 $-NR^{1,1}R^{1,2}$ 、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_mR^{1,1}$ であり、 R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1,2}R^{1,3}$ 、 $-OR^{1,3}$ または $-S(O)_mR^{1,3}$ であり、 R^3 が水素原子、ハロゲ
 40 ン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1,1}R^{1,2}$ 、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_mR^{1,1}$ であり、 R^4 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 が水素原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基または $-OR^{1,4}$ であり、Wが $-NR^7R^{1,0}$ である化合物；

[0467]

式(1)において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボ
 5 ニル基、 $-NR^{1.1}R^{1.2}$ 、 $-OR^{1.1}$ または $-S(O)_mR^{1.1}$ であり、 R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボ
 10 ニル基、 $-NR^{1.1}R^{1.2}$ 、 $-OR^{1.1}$ または $-S(O)_mR^{1.1}$ であり、 R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボ
 15 ニル基、 $-NR^{1.1}R^{1.2}$ 、 $-OR^{1.1}$ または $-S(O)_mR^{1.1}$ であり、 R^4 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 が水素原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基または $-OR^{1.4}$ であり、 R^7 が水素原子であり、 $R^{1.0}$ が、水素原子、群Zより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基または群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基である化合物；

[0468]

式(1)において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボ
 20 ニル基、 $-NR^{1.1}R^{1.2}$ 、 $-OR^{1.1}$ または $-S(O)_mR^{1.1}$ であり、 R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボ
 25 ニル基、 $-NR^{1.2}R^{1.3}$ 、 $-OR^{1.3}$ または $-S(O)_mR^{1.3}$ であり、 R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボ
 30 ニル基、 $-NR^{1.1}R^{1.2}$ 、 $-OR^{1.1}$ または $-S(O)_mR^{1.1}$ であり、 R^4 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 が水素原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基または $-OR^{1.4}$ であり、Wが $-SR^9$ であり、 R^9 が群Zより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基である化合物；

[0469]

式(1)において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1.1}$ または $-S(O)_mR^{1.1}$ であり、 R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1.3}$ または $-S(O)_mR^{1.3}$ であり、 R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1.1}$ または $-S(O)_mR^{1.1}$ であり、 R^4 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 が水素原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基または $-OR^{1.4}$ である化合物；

[0470]

式(1)において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_m R^{1,1}$ であり、 R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1,3}$ または $-S(O)_m R^{1,3}$ であり、 R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_m R^{1,1}$ であり、 R^4 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 が水素原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基または $-OR^{1,4}$ であり、 $R^{1,1}$ が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキル基であり、 $R^{1,3}$ が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキル基であり、 $R^{1,4}$ が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基または水素原子である化合物；

[0471]

式(1)において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、メチル基、トリフルオロメチル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_m R^{1,1}$ であり、 R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、メチル基、トリフルオロメチル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1,3}$ または $-S(O)_m R^{1,3}$ であり、 R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、メチル基、トリフルオロメチル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_m R^{1,1}$ であり、 R^4 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 が水素原子、メチル基、トリフルオロメチル基または $-OR^{1,4}$ であり、 $R^{1,1}$ がメチル基またはトリフルオロメチル基であり、 $R^{1,3}$ がメチル基またはトリフルオロメチル基であり、 $R^{1,4}$ が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基または水素原子である化合物；

[0472]

式(1)において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、メチル基、トリフルオロメチル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_m R^{1,1}$ であり、 R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、メチル基、トリフルオロメチル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1,3}$ または $-S(O)_m R^{1,3}$ であり、 R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、メチル基、トリフルオロメチル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1,1}$ または $-S(O)_m R^{1,1}$ であり、 R^4 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 が水素原子、メチル基、トリフルオロメチル基または $-OR^{1,4}$ であり、 $R^{1,1}$ がメチル基であり、 $R^{1,3}$ がメチル基であり、 $R^{1,4}$ が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基または水素原子である化合物；

[0473]

式(1)において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボ

ニル基、 $-NR^{11}R^{12}$ 、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_mR^{11}$ であり、 R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{12}R^{13}$ 、 $-OR^{13}$ または $-S(O)_mR^{13}$ であり、 R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{11}R^{12}$ 、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_mR^{11}$ であり、 R^4 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

[0474]

式(1)において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_mR^{11}$ であり、 R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{13}$ または $-S(O)_mR^{13}$ であり、 R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_mR^{11}$ であり、 R^4 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 が水素原子である化合物；

[0475]

式(1)において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_mR^{11}$ であり、 R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{13}$ または $-S(O)_mR^{13}$ であり、 R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_mR^{11}$ であり、 R^4 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 が水素原子であり、 R^{11} が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキル基であり、 R^{13} が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキル基である化合物；

[0476]

式(1)において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、メチル基、トリフルオロメチル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_mR^{11}$ であり、 R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、メチル基、トリフルオロメチル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{13}$ または $-S(O)_mR^{13}$ であり、 R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、メチル基、トリフルオロメチル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{11}$ または $-S(O)_mR^{11}$ であり、 R^4 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 が水素原子であり、 R^{11} がメチル基またはトリフルオロメチル

基であり、 $R^{1\ 3}$ がメチル基またはトリフルオロメチル基である化合物；

[0477]

式(1)において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、メチル基、トリフルオロメチル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、 R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、メチル基、トリフルオロメチル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1\ 3}$ または $-S(O)_m R^{1\ 3}$ であり、 R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、メチル基、トリフルオロメチル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、 R^4 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 が水素原子であり、 $R^{1\ 1}$ がメチル基であり、 $R^{1\ 3}$ がメチル基である化合物；

[0478]

式(1)において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1\ 1} R^{1\ 2}$ 、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、 R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1\ 2} R^{1\ 3}$ 、 $-OR^{1\ 3}$ または $-S(O)_m R^{1\ 3}$ であり、 R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{1\ 1} R^{1\ 2}$ 、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、 R^4 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基または $-OR^{1\ 4}$ である化合物；

[0479]

式(1)において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、 R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1\ 3}$ または $-S(O)_m R^{1\ 3}$ であり、 R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、 R^4 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基または $-OR^{1\ 4}$ である化合物；

[0480]

式(1)において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、 R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる

1 個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1\ 3}$ または $-S(O)_m R^{1\ 3}$ であり、 R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる 1 個以上の基を有していてもよい C 1 - C 6 アルキル基、群Yより選ばれる 1 個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、 R^4 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 4 アルキル基または $-OR^{1\ 4}$ であり、 $R^{1\ 1}$ が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 3 アルキル基であり、 $R^{1\ 3}$ が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 3 アルキル基であり、 $R^{1\ 4}$ が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 4 アルキル基または水素原子である化合物；

[0 4 8 1]

式 (1) において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、メチル基、トリフルオロメチル基、群Yより選ばれる 1 個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、 R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、メチル基、トリフルオロメチル基、群Yより選ばれる 1 個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1\ 3}$ または $-S(O)_m R^{1\ 3}$ であり、 R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、メチル基、トリフルオロメチル基、群Yより選ばれる 1 個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、 R^4 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 がメチル基、トリフルオロメチル基または $-OR^{1\ 4}$ であり、 $R^{1\ 1}$ がメチル基またはトリフルオロメチル基であり、 $R^{1\ 3}$ がメチル基またはトリフルオロメチル基であり、 $R^{1\ 4}$ が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 4 アルキル基または水素原子である化合物；

[0 4 8 2]

式 (1) において、 R^1 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、メチル基、トリフルオロメチル基、群Yより選ばれる 1 個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、 R^2 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、メチル基、トリフルオロメチル基、群Yより選ばれる 1 個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1\ 3}$ または $-S(O)_m R^{1\ 3}$ であり、 R^3 が水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、メチル基、トリフルオロメチル基、群Yより選ばれる 1 個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^{1\ 1}$ または $-S(O)_m R^{1\ 1}$ であり、 R^4 がトリフルオロメチル基であり、 R^5 がメチル基、トリフルオロメチル基または $-OR^{1\ 4}$ であり、 $R^{1\ 1}$ がメチル基であり、 $R^{1\ 3}$ がメチル基であり、 $R^{1\ 4}$ が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 4 アルキル基または水素原子である化合物。

[0 4 8 3]

本発明方法において本発明化合物を使用する場合、本発明化合物のみで使用してもよいが、後述するとおり種々の不活性成分（固体担体、液体担体、界面活性剤、その他の製剤用補助剤等）を用いて製剤化された植物生長促進組成物として使用することができる。

[0 4 8 4]

製剤化の際に用いられる固体担体としては、例えばカオリンクレー、アッタパルジャイトクレー、ベントナイト、モンモリロナイト、酸性白土、パイロフィライト、タルク、珪藻土、方解石等の鉱物、トウモロコシ穂軸粉、クルミ殻粉等の天然有機物、尿素等の合成有機物、炭酸カルシウム、硫酸アンモニウム

等の塩類、合成含水酸化珪素等の合成無機物等からなる微粉末又は粒状物等が挙げられ、液体担体としては、例えばキシレン、アルキルベンゼン、メチルナフタレン等の芳香族炭化水素類、2-プロパノール、エチレングリコール、プロピレングリコール、エチレングリコールモノエチルエーテル等のアルコール類、アセトン、シクロヘキサノン、イソホロン等のケトン類、ダイズ油、綿実油等の植物油、石油系脂肪族炭化水素類、エステル類、ジメチルスルホキシド、アセトニトリル、及び水が挙げられる。

[0485]

界面活性剤としては、例えばアルキル硫酸エステル塩、アルキルアリールスルホン酸塩、ジアルキルスルホコハク酸塩、ポリオキシエチレンアルキルアリエーテルリン酸エステル塩、リグニンスルホン酸塩、ナフタレンスルホネートホルムアルデヒド重縮合物等の陰イオン界面活性剤、ポリオキシエチレンアルキルアリエーテル、ポリオキシエチレンアルキルポリオキシプロピレンブロックコポリマー、ソルビタン脂肪酸エステル等の非イオン界面活性剤、及びアルキルトリメチルアンモニウム塩等の陽イオン界面活性剤が挙げられる。

[0486]

その他の製剤用補助剤としては、例えばポリビニルアルコール、ポリビニルピロリドン等の水溶性高分子、アラビアガム、アルギン酸及びその塩、CMC（カルボキシメチルセルロース）、ザンサンガム等の多糖類、アルミニウムマグネシウムシリケート、アルミナゾル等の無機物、防腐剤、着色剤、及びPAP（酸性リン酸イソプロピル）、BHT等の安定化剤が挙げられる。

[0487]

本発明方法において、本発明化合物を植物に処理する場合、本発明化合物の有効量を植物又はその栽培地に処理することにより行われる。植物又は植物の栽培地に処理する場合は、本発明化合物は1回もしくは複数回処理する。

[0488]

本発明方法における施用方法としては、具体的には、例えば、茎葉散布等の植物の茎葉、花器又は穂への処理、植物を植えつける前又は植えつけた後の土壌（栽培地）への処理、種子消毒や種子浸漬、種子コート等の種子への処理、苗への処理、種芋等の球根への処理等が挙げられる。

[0489]

本発明方法における植物の茎葉、花器又は穂への処理としては、具体的には、例えば、茎葉散布、樹幹散布等の植物の表面に施用する処理方法が挙げられる。また、開花前、開花中、開花後を含む開花時期における花器あるいは植物全体に散布処理する方法が挙げられる。また、穀物等においては出穂時期の穂あるいは植物全体に散布する方法が挙げられる。

[0490]

本発明方法における土壌処理方法としては、例えば、土壌への散布、土壌混和、土壌への薬液灌注（薬液灌水、土壌注入、薬液ドリップ）が挙げられ、処理する場所としては例えば、植穴、作条、植穴付近、作条付近、栽培地の全面、植物地際部、株間、樹幹下、主幹畦、培土、育苗箱、育苗トレイ、苗床等が挙げられ、処理時期としては播種前、播種時、播種直後、育苗期、定植前、定植時、及び定植後の生育期等が挙げられる。また、上記土壌処理において、複数の本発明化合物を植物に同時に処理してもよく、本発明化合物を含有するペースト肥料等の固形肥料を土壌へ施用してもよい。また、本発明化合物を灌水

液に混合してもよく、例えば、灌水設備（灌水チューブ、灌水パイプ、スプリンクラー等）への注入、

条間湛水液への混入、水耕液へ混入等が挙げられる。また、あらかじめ灌水液と本発明化合物を混合し、例えば、上記灌水方法やそれ以外の散水、湛水等の

5 しかるべき灌水方法を用いて処理することができる。

[0491]

本発明において、本発明化合物で処理されてなる植物種子は、植物種子の内部又は表面、或いは、植物種子の周囲に形成された被覆部に、本発明化合物の有効量を保持している。本発明方法における種子への処理としては、対象とする植物の種子、球根等に本発明化合物を処理する方法であって、具体的には、

10 例えば、本発明化合物の懸濁液を霧状にして種子表面もしくは球根表面に吹きつける吹きつけ処理、本発明化合物の水和剤、乳剤、又はフロアブル剤等に少量の水を加えるか、又はそのまま種子もしくは球根に塗付する塗沫処理、本発明化合物の溶液に一定時間種子を浸漬する浸漬処理、フィルムコート処理、

15 ペレットコート処理が挙げられる。なお、本発明において、本発明化合物で処理されてなる植物種子とは、土壌あるいは栽培する培地に播種する前の状態の植物の種子を意味する。

[0492]

本発明方法における苗への処理としては、例えば、本発明化合物を水で適当な有効成分濃度に希釈調製した希釈液を苗全体に散布する散布処理、その希釈液に苗を浸漬する浸漬処理、粉剤に調製した本発明化合物を苗全体に付着させる塗布処理、育苗中の培土に有効量の本発明化合物を処理する育苗箱処理が挙げられる。また、苗を植えつける前又は植えつけた後の土壌への処理としては、

20 例えば、本発明化合物を水で適当な有効成分濃度に希釈調製した希釈液を、苗を植えつけた後に苗及び周辺土壌に散布する方法、粒剤又は粒剤等の固形剤に調製した本発明化合物を、苗を植えつけた後周辺土壌に散布する方法が挙げられる。

[0493]

また、本発明化合物を水耕栽培における水耕液に混合して用いてもよく、また組織培養における培地成分の1つとして用いてもよい。本発明方法における水耕処理方法としては、水

耕栽培に使用する場合に、通常用いられる園試等の水耕栽培用の水耕培地に培地中濃度として0.001ppm～1,000ppmの範囲で溶解又は懸濁して用いることができる。また組織培養や細胞培養時に使用する場合は、通常用いられるムラシゲ・スークグ培地等の植物組織培養用培地やホグランド水耕培養液等の水耕培地に、培地中濃度として0.001ppm～1,000ppmの範囲で溶解又は懸濁して用いることができる。この場合、定法に従い、炭素源としての糖類、各種植物ホルモン等を適宜加えることができる

[0494]

本発明化合物を、植物又は植物の生育場所に処理する場合、その処理量は、処理する植物の種類、製剤形態、処理時期、気象条件等によって変化させ得るが、10,000m²あた

り有効成分量として、通常0.1～10,000グラム、好ましくは1～1,000グラムの範囲である。土壌に全面混和する場合は、その処理量は、10,000m²あたり有効成分量として、通常0.1～10,000グラム、好ましくは1～1,000グラムである。

[0495]

乳剤、水和剤、フロアブル剤、マイクロカプセル剤等は、通常水で希釈して散布することにより処理する。この場合、有効成分の濃度は、通常0.1～10,000ppm、好ましくは1～1000ppmの範囲である。粉剤、粒剤等は通常希釈することなくそのまま処理する。

[0496]

種子への処理においては、種子100キログラムに対する本発明化合物の重量としては、通常0.01～1,000グラム、好ましくは0.1～100グラムの範囲である。

[0497]

本発明方法が適用可能な植物としては、下記の植物が挙げられる。

[0498]

農作物：トウモロコシ、イネ、コムギ、オオムギ、ライムギ、エンバク、ソルガム、ワタ、ダイズ、ラッカセイ、ソバ、テンサイ、セイヨウアブラナ、ヒマワリ、サトウキビ、タバコ、ホップ等。

[0499]

野菜：ナス科野菜（ナス、トマト、ジャガイモ、トウガラシ、ピーマン等）、ウリ科野菜（キュウリ、カボチャ、ズッキーニ、スイカ、メロン、マクワリ等）、アブラナ科野菜（ダイコン、カブ、セイヨウワサビ、コールラビ、ハクサイ、キャベツ、アブラナ、カラシナ、ブロッコリー、カリフラワー等）、キク科野菜（ゴボウ、シュンギク、アーティチョーク、レタス等）、ユリ科野菜（ネギ、タマネギ、ニンニク、アスパラガス等）、セリ科野菜（ニンジン、パセリ、セロリ、アメリカボウフウ等）、アカザ科野菜（ホウレンソウ、フダンソウ等）、シソ科野菜（シソ、ミント、バジル等）、マメ科作物（エンドウ、インゲンマメ、アズキ、ソラマメ、ヒヨコマメ等）、イチゴ、サツマイモ、ヤマノイモ、サトイモ、コンニャク、ショウガ、オクラ等。

[0500]

果樹：仁果類（リンゴ、ナシ、セイヨウナシ、カリン、マルメロ等）、核果類（モモ、スモモ、ネクタリン、ウメ、オウトウ、アンズ、プルーン等）、カンキツ類（ウンシュウミカン、オレンジ、レモン、ライム、グレープフルーツ等）、堅果類（クリ、クルミ、ハシバミ、アーモンド、ピスタチオ、カシューナッツ、マカダミアナッツ等）、液果類（ブルーベリー、クランベリー、ブラックベリー、ラズベリー等）、ブドウ、カキ、オリーブ、ビワ、バナナ、コーヒ、ナツメヤシ、ココヤシ、アブラヤシ等。

[0501]

果樹以外の樹木：チャ、クワ、花木類（サツキ、ツバキ、アジサイ、サザンカ、シキミ、サクラ、ユリノキ、サルスベリ、キンモクセイ等）、街路樹（トネリコ、カバノキ、ハナミズキ、ユーカリ、イチョウ、ライラック、カエデ、カシ、ポプラ、ハナズオウ、フウ、プラタナス、ケヤキ、クロベ、モミノキ、ツガ、ネズ、マツ、トウヒ、イチイ、ニレ、トチノキ等）、サンゴジュ、イヌマキ、スギ、ヒノキ、クロトン、マサキ、カナメモチ、等。

[0502]

芝生：シバ類（ノシバ、コウライシバ等）、バミューダグラス類（ギョウギシバ等）、ベントグラス類（コヌカグサ、ハイコヌカグサ、イトコヌカグサ等）、ブルーグラス類（ナガハグサ、オオスズメノカタビラ等）、フェスク類（

オニウシノケグサ、イトウシノケグサ、ハイウシノケグサ等)、ライグラス類(ネズミムギ、ホソムギ等)、カモガヤ、オオアワガエリ等。

その他: 花卉類(バラ、カーネーション、キク、トルコギキョウ、カスミソウ、ガーベラ、マリーゴールド、サルビア、ペチュニア、バーベナ、チューリップ、アスター、リンドウ、ユリ、パンジー、シクラメン、ラン、スズラン、ラベンダー、ストック、ハボタン、プリムラ、ポインセチア、グラジオラス、カトレア、デージー、シンビジウム、ペゴニア等)、バイオ燃料植物(ヤトロファ、ベニバナ、アマナズナ類、スイッチグラス、ミスカンサス、クサヨシ、ダンチク、ケナフ、キャッサバ、ヤナギ等)、観葉植物等。

[0503]

本発明に適用可能な植物として、好ましくは、チャ、リンゴ、ナシ、ブドウ、オウトウ、モモ、ネクタリン、カキ、ウメ、スモモ、ダイズ、レタス、キャベツ、トマト、ナス、キュウリ、スイカ、メロン、インゲンマメ、エンドウ、アズキ、シバ、セイヨウアブラナ、イチゴ、アーモンド、トウモロコシ、ソルガム、ソラマメ、ハクサイ、ジャガイモ、ラッカセイ、イネ、コムギ、サトイモ、コンニャク、ヤマノイモ、ダイコン、カブ、パセリ、マクワウリ、オクラ、ショウガ、レモン、オレンジ、グレープフルーツ、ライム、ブルーベリー、クリ、ホップ、バジルが挙げられ、より好ましくはイネ科植物又はナス科植物、更に好ましくはイネ科植物、また更に好ましくはイネ、コムギ、トウモロコシなどが挙げられる。

[0504]

上記植物は、植物に除草剤耐性を付与する遺伝子や害虫に対する選択的毒素を産生する遺伝子、植物に病害抵抗性を付与する遺伝子、非生物学的ストレスを緩和する遺伝子などが遺伝子組換え法あるいは交配育種によって導入された植物であってもよく、これらを複数組み合わせたスタック品種であってもよい。

[0505]

本発明化合物を、殺虫剤、殺菌剤、及び特定の除草剤に対するセーフナー等と同時に種子に処理してもよく、またそれらと同時に植物に施用してもよい。

[0506]

本発明方法は、本発明化合物の処理される植物が、非生物学的ストレスに暴露された又は暴露されるであろう植物であっても良い。当該非生物学的ストレスは、下記式で表される「ストレスの強さ」の値として、105~200、好ましくは110~180、より

好ましくは120~160であればよい。

[0507]

式(I): 「ストレスの強さ」=100×「非生物学的ストレス条件に暴露されていない植物におけるいずれか一つの植物表現型」/「非生物学的ストレス条件に暴露された植物における当該いずれか一つの植物表現型」

[0508]

ここで、「非生物学的ストレス」とは、高温ストレス又は低温ストレスである温度ストレス、乾燥ストレス又は過湿ストレスである水分ストレス、塩ストレス等の非生物学的ストレス条件に暴露された場合に植物細胞の生理機能の低下を来し、植物の生理状態が悪化して生育が阻害されるようなストレスをいう。

高温ストレスとは、植物の生育適温又は発芽適温よりも高い温度に暴露された場合に受けるストレスをいい、具体的には、植物が栽培されている環境におけ

る平均栽培温度が25℃以上、より厳しくは30℃以上、更に厳しくは35℃以上である条件を挙げることができる。低温ストレスとは、植物の生育適温又は発芽適温よりも低い温度に暴露された場合に受けるストレスをいい、具体的には、植物が栽培されている環境における平均栽培温度が15℃以下、より厳しくは10℃以下、更により厳しくは5℃以下である条件を挙げることができる。また、乾燥ストレスとは、植物は降雨量や灌水量の減少により土壌中の水分含量が減少し、吸水が阻害され植物の生育が阻害されるような水分環境に暴露された場合に受けるストレスをいい、具体的には、土壌の種類により値は異なることがあるが、植物が栽培されている土壌含水率が15重量%以下、より厳しくは10重量%以下、更に厳しくは、7.5重量%以下が水分ストレスのある条件、又は、植物が栽培されている土壌のpF値が、2.3以上、厳しくは2.7以上、更に厳しくは3.0以上の条件を挙げることができる。過湿ストレスとは土壌中の水分含量が過剰になり植物の生育が阻害されるような水分環境に暴露された場合に受けるストレスをいい、具体的には、土壌の種類により値は異なることがあるが、植物が栽培されている土壌含水率が30重量%以上、厳しくは40重量%以上、更に厳しくは50重量%以上の、又は、植物が栽培されている土壌のpF値が1.7以下、厳しくは1.0以下、更に厳しくは0.3以下である。なお、土壌のpF値は、「土壌・植物栄養・環境事典」（大洋社、1994年、松坂ら）の61～62頁の「pF値測定法」に記述されている原理に従い、測定することができる。また、塩ストレスとは、植物が栽培されている土壌あるいは水耕液中の塩類の蓄積により浸透圧が上昇し植物の吸水が阻害される結果、生育が阻害されるような環境に暴露された場合に受けるストレスをいい、具体的には、土壌あるいは水耕液中の塩による浸透圧ポテンシャルが0.2MPa（NaCl濃度では2,400ppm）以上、厳しくは0.25MPa以上、さらに厳しくは0.30MPa以上である条件である。土壌における浸透圧は、土壌を水で希釈して上澄み液の塩濃度を分析することによって、以下のラウールの式に基づいて求めることができる。

ラウールの式 $\pi \text{ (atm)} = c R T$

$R = 0.082 \text{ (L} \cdot \text{atm} / \text{mol} \cdot \text{K)}$

$T = \text{絶対温度 (K)}$

$c = \text{イオンモル濃度 (mol / L)}$

$1 \text{ atm} = 0.1 \text{ MPa}$

[0509]

次に本発明化合物の製造法について説明する。

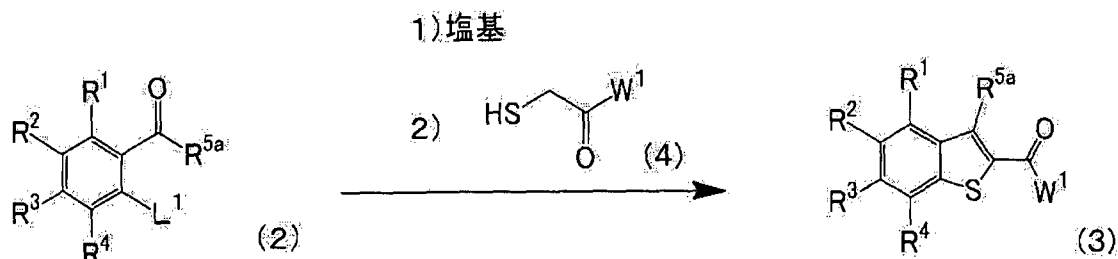
[0510]

本発明化合物は、例えば、以下の（製造法1）～（製造法18）にしたがって製造することができる。

[0511]

（製造法1）

式（3）で示される化合物は、例えば、以下のスキームにしたがって製造することができる。



[式中、 W^1 はヒドロキシ基、 $-OR^6$ または $-NR^7R^{10}$ を表し、
 L^1 は、ハロゲン原子またはニトロ基を表し、
 R^{5a} は、水素原子、群 X より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよい C1
 5 $-C6$ アルキル基または群 Y より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよいフェニル基を表し、
 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^6 、 R^7 および R^{10} は前記と同じ意味を表す。
]

本反応は通常溶媒中で行なう。使用できる溶媒としては、例えば、ベンゼン
 10、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類；ジエチルエーテル、ジイソプロ
 ピルエーテル、1, 4-ジオキサン、テトラヒドロフラン、1, 2-ジメトキ
 シエタン等のエーテル類；ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロ
 エタン等のハロゲン化炭化水素類；N, N-ジメチルホルムアミド、N, N-
 15 ジメチルアセトアミド等のアミド類；スルホラン等のスルホン類及びこれらの
 混合物が挙げられる。

本反応には、式 (4) で示される化合物が、式 (2) で示される化合物 1 モル
 に対して、通常 1 モル以上、好ましくは 1 ~ 1.2 モル用いられる。

本反応は、塩基としては、例えば、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の無機
 20 塩基、ナトリウムメトキシド等の金属アルコキシド、水素化ナトリウム等のア
 ルカリ金属水素化物、トリエチルアミン、トリブチルアミン、N, N-ジイソ
 プロピルエチルアミン等の有機塩基等が挙げられる。

本反応には、塩基の使用量は、式 (2) で示される化合物 1 モルに対して、通
 常 1 ~ 5 モル、好ましくは 1 ~ 1.2 モル用いられる。

本反応の反応温度は通常 0 ~ 200 °C、好ましくは 30 ~ 100 °C である。

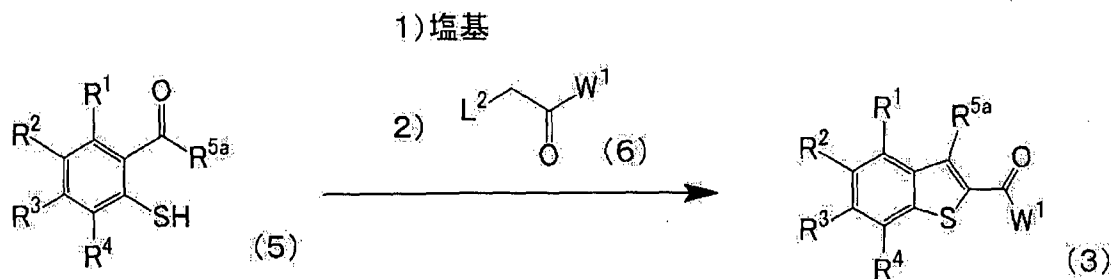
25 本反応の反応時間は通常 30 分 ~ 30 時間である。

本反応の終了は、反応混合物の一部をサンプリングして、薄層クロマトグラ
 フィー、高速液体クロマトグラフィー等の分析手段により確認することができ
 る。本反応の終了後、例えば反応混合物に水を加えた後、有機溶媒にて抽出し
 30、得られた有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、式 (3)
) で示される化合物を単離することができる。単離された式 (3) で示される
 化合物は、クロマトグラフィーおよび再結晶等により精製することもできる。

[0512]

(製造法 2)

式 (3) で示される化合物は、例えば、以下のスキームにしたがって製造する
 35 ことができる。



〔式中、 L^2 は、ハロゲン原子を表し、
 W^1 、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 および R^{5a} は前記と同じ意味を表す。〕

本反応は通常溶媒中で行なう。使用できる溶媒としては、例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、1, 4-ジオキサン、テトラヒドロフラン、1, 2-ジメトキシエタン等のエーテル類；ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類；N, N-ジメチルホルムアミド、N, N-ジメチルアセトアミド等のアミド類；スルホラン等のスルホン類及びこれらの混合物が挙げられる。

本反応には、式 (6) で示される化合物が、式 (5) で示される化合物 1 モルに対して、通常 1 モル以上、好ましくは 1 ~ 2 モル用いられる。

本反応は通常、塩基の存在下で行われる。本反応に用いられる塩基としては、例えば、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の無機塩基、ナトリウムメトキシド等の金属アルコキシド、水素化ナトリウム等のアルカリ金属水素化物、トリエチルアミン、トリブチルアミン、N, N-ジイソプロピルエチルアミン等の有機塩基等が挙げられる。本反応には、塩基が、式 (5) で示される化合物 1 モルに対して、通常 1 モル以上、好ましくは 1 ~ 2 モル用いられる。

本反応の反応温度は通常 0 ~ 200 °C、好ましくは 30 ~ 100 °C である。

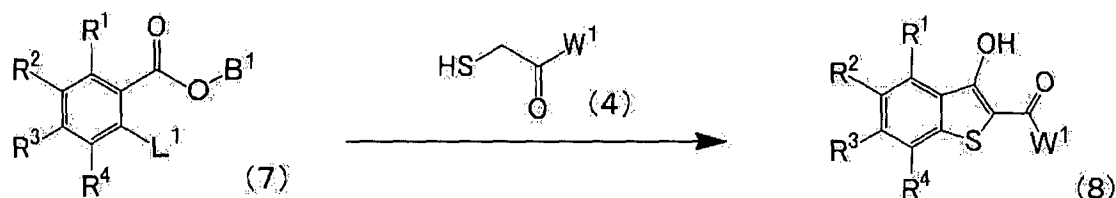
本反応の反応時間は通常 30 分 ~ 30 時間である。

本反応の終了は、反応混合物の一部をサンプリングして、薄層クロマトグラフィー、高速液体クロマトグラフィー等の分析手段により確認することができる。本反応の終了後、例えば反応混合物に水を加えた後、有機溶媒にて抽出し、得られた有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、式 (3) で示される化合物を単離することができる。単離された式 (3) で示される化合物は、クロマトグラフィーおよび再結晶等により精製することもできる。

〔0513〕

(製造法 3)

式 (8) で示される化合物は、例えば、以下のスキームにしたがって製造することができる。



〔式中、 B^1 は、C1-C6アルキル基を表し、
 L^1 、 W^1 、 R^1 、 R^2 、 R^3 および R^4 は前記と同じ意味を表す。〕

本反応は通常溶媒中で行なう。使用できる溶媒としては、例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、1, 4-ジオキサン、テトラヒドロフラン、1, 2-ジメトキシ

シエタン等のエーテル類；ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類；N, N-ジメチルホルムアミド、N, N-ジメチルアセトアミド等のアミド類；スルホラン等のスルホン類及びこれらの混合物が挙げられる。

- 5 本反応には、式（４）で示される化合物が、式（７）で示される化合物１モルに対して、通常１モル以上、好ましくは１～１．２モル用いられる。

本反応は通常、塩基の存在下で行われる。本反応に用いられる塩基としては、例えば、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の無機塩基、ナトリウムメトキシド等の金属アルコキシド、水素化ナトリウム等のアルカリ金属水素化物、トリ
10 エチルアミン、トリブチルアミン、N, N-ジイソプロピルエチルアミン等の有機塩基等が挙げられる。本反応には、塩基が、式（７）で示される化合物１モルに対して、通常１～５モル、好ましくは１～１．２モル用いられる。

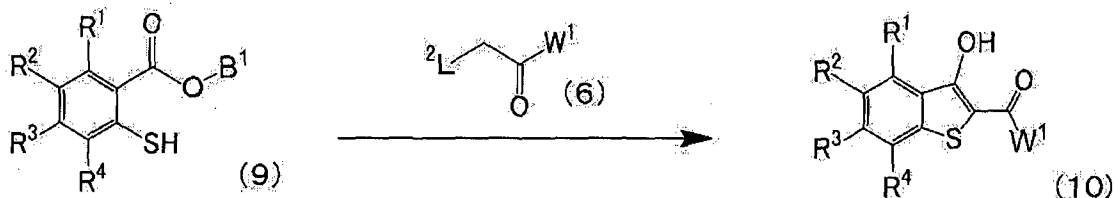
本反応の反応温度は通常０～２００℃、好ましくは３０～１００℃である。本反応の反応時間は通常３０分～３０時間である。

- 15 本反応の終了は、反応混合物の一部をサンプリングして、薄層クロマトグラフィー、高速液体クロマトグラフィー等の分析手段により確認することができる。本反応の終了後、例えば反応混合物に酸を加えた後、析出した固体をろ取し、水およびヘキサンにて洗浄後、乾燥する等の後処理操作を行うことにより、式（８）で示される化合物を単離することができる。単離された式（８）で
20 示される化合物は、クロマトグラフィーおよび再結晶等により精製することもできる。

[0514]

（製造法４）

式（１０）で示される化合物は、例えば、以下のスキームにしたがって製造
25 することができる。



〔式中、 B^1 、 L^2 、 W^1 、 R^1 、 R^2 、 R^3 および R^4 は前記と同じ意味を表す。〕

- 30 本反応は通常溶媒中に行なう。使用できる溶媒としては、例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、1, 4-ジオキサン、テトラヒドロフラン、1, 2-ジメトキシエタン等のエーテル類；ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類；N, N-ジメチルホルムアミド、N, N-ジメチルアセトアミド等のアミド類；スルホラン等のスルホン類及びこれらの
35 混合物が挙げられる。

本反応には、式（６）で示される化合物が、式（９）で示される化合物１モルに対して、通常１モル以上、好ましくは１～２モル用いられる。

- 40 本反応は通常、塩基の存在下で行われる。本反応に用いられる塩基としては、例えば、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の無機塩基、ナトリウムメトキシド等の金属アルコキシド、水素化ナトリウム等のアルカリ金属水素化物、トリエチルアミン、トリブチルアミン、N, N-ジイソプロピルエチルアミン等の有機塩基等が挙げられる。本反応には、塩基が、式（９）で示される化合物１

モルに対して、通常1～10モル、好ましくは1～2モル用いられる。

本反応の反応温度は通常0～200℃、好ましくは30～100℃である。

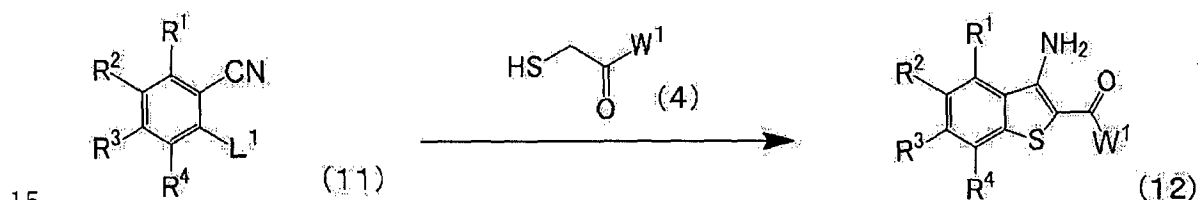
本反応の反応時間は通常30分～30時間である。

5 本反応の終了は、反応混合物の一部をサンプリングして、薄層クロマトグラフィー、高速液体クロマトグラフィー等の分析手段により確認することができる。本反応の終了後、例えば反応混合物に酸を加えた後、析出した固体をろ取し、水およびヘキサンにて洗浄後、乾燥する等の後処理操作を行うことにより、式(10)で示される化合物を単離することができる。単離された式(10)

10 ともできる。
[0515]

(製造法5)

式(12)で示される化合物は、例えば、以下のスキームにしたがって製造することができる。



[式中、 L^1 、 W^1 、 R^1 、 R^2 、 R^3 および R^4 は前記と同じ意味を表す。]

本反応は通常溶媒中で行なう。使用できる溶媒としては、例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、1,4-ジオキサン、テトラヒドロフラン、1,2-ジメトキシエタン等のエーテル類；ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類；N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド等のアミド類；スルホラン等のスルホン類及びこれらの混合物が挙げられる。

25 本反応には、式(4)で示される化合物が、式(11)で示される化合物1モルに対して、通常1モル以上、好ましくは1～1.2モル用いられる。

本反応は通常、塩基の存在下で行われる。本反応に用いられる塩基としては、例えば、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の無機塩基、ナトリウムメトキシド等の金属アルコキシド、水素化ナトリウム等のアルカリ金属水素化物、トリエチルアミン、トリブチルアミン、N,N-ジイソプロピルエチルアミン等の有機塩基等が挙げられる。本反応には、塩基が、式(11)で示される化合物1モルに対して、通常1～10モル、好ましくは1～1.2モル用いられる。

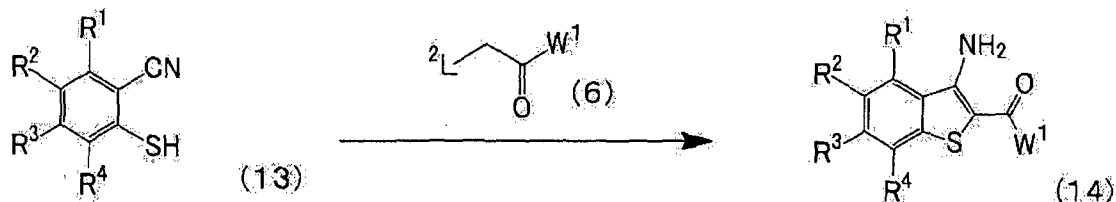
本反応の反応温度は通常0～200℃、好ましくは30～100℃である。本反応の反応時間は通常30分～30時間である。

35 本反応の終了は、反応混合物の一部をサンプリングして、薄層クロマトグラフィー、高速液体クロマトグラフィー等の分析手段により確認することができる。本反応の終了後、例えば反応混合物に水を加えた後、有機溶媒にて抽出し、得られた有機層を乾燥、濃縮後、クロマトグラフィーおよび再結晶等を行うことにより、式(12)で示される化合物を単離することができる。

40 [0516]
(製造法6)

式(14)で示される化合物は、例えば、以下のスキームにしたがって製造す

ることができる。



〔式中、 L^2 、 W^1 、 R^1 、 R^2 、 R^3 および R^4 は前記と同じ意味を表す。〕

- 5 本反応は通常溶媒中で行なう。使用できる溶媒としては、例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、1, 4-ジオキサン、テトラヒドロフラン、1, 2-ジメトキシエタン等のエーテル類；ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類；N, N-ジメチルホルムアミド、N, N-ジメチルアセトアミド等のアミド類；スルホラン等のスルホン類及びこれらの混合物が挙げられる。

本反応には、式（6）で示される化合物が、式（13）で示される化合物1モルに対して、通常1モル以上、好ましくは1～2モル用いられる。

- 15 本反応は通常、塩基の存在下で行われる。本反応に用いられる塩基としては、例えば、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の無機塩基、ナトリウムメトキシド等の金属アルコキシド、水素化ナトリウム等のアルカリ金属水素化物、トリエチルアミン、トリブチルアミン、N, N-ジイソプロピルエチルアミン等の有機塩基等が挙げられる。本反応には、塩基の使用量は、式（13）で示される化合物1モルに対して、通常1～5モル、好ましくは1～2モル用いられる。

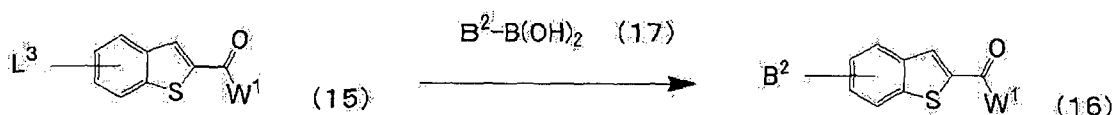
- 20 本反応の反応温度は通常0～200℃、好ましくは30～100℃である。本反応の反応時間は通常30分～30時間である。

- 25 本反応の終了は、反応混合物の一部をサンプリングして、薄層クロマトグラフィー、高速液体クロマトグラフィー等の分析手段により確認することができる。本反応の終了後、例えば反応混合物に水を加えた後、有機溶媒にて抽出し、得られた有機層を乾燥、濃縮後、クロマトグラフィーおよび再結晶等を行うことにより、式（14）で示される化合物を単離することができる。

〔0517〕

（製造法7）

- 30 式（16）で示される化合物は、例えば、以下のスキームにしたがって製造することができる。



〔式中、 L^3 は、3位、4位、5位、6位または7位に置換した脱離基（例えば、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子等のハロゲン原子等）を表し、 B^2 は、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC2-C6アルケニル基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC2-C6アルキニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよい6員芳香族複素環基または群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよい5員芳香族複素環基を表し、 W^1 は前記と同じ意味を表す。〕

本反応において、式(17)で示される化合物は、式(15)で示される化合物1モルに対して、通常1モル以上、好ましくは1～3モル用いられる。

本反応は、溶媒中で行われる。本反応に用いられる溶媒としては、例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類；メタノール、エタノール、プロパノール等のアルコール類；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、1,4-ジオキサン、テトラヒドロフラン、1,2-ジメトキシエタン等のエーテル類；アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類；アセトニトリル等のニトリル類；N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド等のアミド類；ジメチルスルホキシド等のスルホキシド類；スルホラン等のスルホン類；水及びこれらの混合物が挙げられる。

また、本反応は、塩基の存在下で行われる。本反応に用いられる塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリプロピルアミン、ピリジン、ジメチルアニリン、ジメチルアミノピリジン、1,8-ジアザビスクロ[5.4.0]-7-ウンデセン等の有機塩基；水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸カルシウム、炭酸セシウム、リン酸カリウム等の無機塩基等が挙げられる。本反応には、塩基が、式(15)で示される化合物1モルに対して、通常0.5～1.0モル当量、好ましくは1～5モル当量用いられる。

本反応は、通常、テトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(0)、ジクロロビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(II)、ジクロロビス(トリシクロヘキシルホスフィン)パラジウム(II)、[1,1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセン]パラジウム(II)ジクロリドジクロロメタン付加物等の触媒の存在下で行われる。本触媒は、式(15)で示される化合物1モルに対して、通常0.001～0.5モル、好ましくは0.01～0.2モル用いられる。

本反応には、さらに必要に応じて塩化リチウム等が式(15)で示される化合物1モルに対して、1モル～20モル、好ましくは2モル～10モル用いられる。

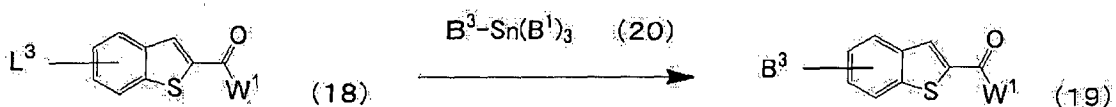
本反応の反応温度は、通常20～180℃、好ましくは60～150℃である。本反応の反応時間は通常30分～100時間である。本反応の進行は、反応混合物の一部を薄層クロマトグラフィー、高速液体クロマトグラフィー等で分析することにより確認できる。

本反応の終了後は、例えば反応混合物と水とを混合し、有機溶媒で抽出し、得られた有機層を乾燥、濃縮する等の操作を行うことにより、式(16)で示される化合物を単離することができる。単離された式(16)で示される化合物は、クロマトグラフィーおよび再結晶等により精製することもできる。

[0518]

(製造法8)

式(19)で示される化合物は、例えば、以下のスキームにしたがって製造することができる。



〔式中、 B^3 は、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC2-C6アルケニル基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC2-C6アルキニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル

基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよい6員芳香族複素環基または群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよい5員芳香族複素環基を表し、

B^1 、 L^3 および W^1 は前記と同じ意味を表す。]

- 5 本反応には、式(20)で示される化合物が、式(18)で示される化合物1モルに対して、通常1モル以上、好ましくは1~3モル用いられる。

本反応は、溶媒中で行われる。本反応に用いられる溶媒としては、例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、1,4-ジオキサン、テトラヒドロフラン、1,2-ジメトキシエタン等のエーテル類；N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド等のアミド類；ジメチルスルホキシド等のスルホキシド類及びこれらの混合物が挙げられる。

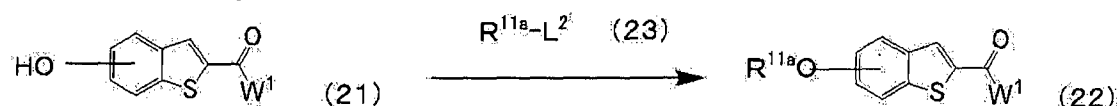
- 10 本反応は、通常、テトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(0)、ジクロロビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(II)等の触媒の存在下で行われる。本触媒は、式(18)で示される化合物1モルに対して、通常0.001~0.5モル、好ましくは0.01~0.2モル用いられる。

- 15 本反応の反応温度は、通常-80~180℃、好ましくは-30~150℃である。本反応の反応時間は通常30分~100時間である。本反応の進行は、反応混合物の一部を薄層クロマトグラフィー、高速液体クロマトグラフィー等
20 等で分析することにより確認できる。本反応の終了後は、例えば反応混合物と水とを混合し、有機溶媒で抽出し、得られた有機層を乾燥、濃縮する等の操作を行うことにより、式(19)で示される化合物を単離することができる。単離された式(19)で示される化合物は、クロマトグラフィーおよび再結晶等により精製することもできる。

- 25 [0519]

(製造法9)

式(22)で示される化合物は、例えば、以下のスキームにしたがって製造することができる。



- 30 [式中、HOは、3位、4位、5位、6位または7位に置換したヒドロキシ基を表し、

- 35 R^{11a} は群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC3-C6アルケニル基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC3-C6アルキニル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC4-C7シクロアルキルアルキル基、ベンゼン環部分が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC7-C9フェニルアルキル基、6員芳香族複素環部分が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよい6員芳香族複素環C1-C3アルキル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC3-C6シクロアルキル基を表し、

- 40 W^1 、 L^2 は前記と同じ意味を表す。]

本反応は溶媒中で行われる。本反応に使用される溶媒としては、例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、1,4-ジオキサン、テトラヒドロフラン、1,2-ジメ

トキシエタン等のエーテル類；ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類；アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類；アセトニトリル等のニトリル類；酢酸エチル等のエステル類；N, N-ジメチルホルムアミド、N, N-ジメチルアセトアミド等のアミド類；ジメチルスルホキシド等のスルホキシド類；スルホラン等のスルホン類及びこれらの混合物が挙げられる。

本反応には、式(23)で示される化合物が、式(21)で示される化合物1モルに対して、通常1モル以上、好ましくは1~3モル用いられる。

本反応は通常、塩基の存在下で行われる。本反応に用いられる塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリプロピルアミン、ピリジン、ジメチルアミノピリジン、1, 8-ジアザビシクロ[5. 4. 0]-7-ウンデセン等の有機塩基；水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸カルシウム等の無機塩基、水素化ナトリウム等の金属水素化物、ナトリウムメチラート、ナトリウムエチラート、t-ブトキシカリウム等の金属アルコキシド等が挙げられる。本反応には、塩基が、式(21)で示される化合物1モルに対して、通常0. 5~10モル当量、好ましくは1~5モル当量用いられる。

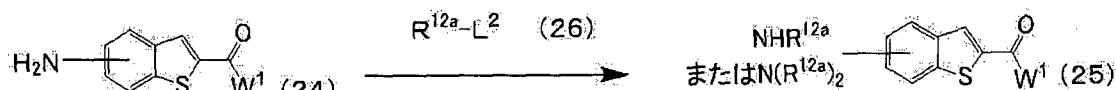
本反応の反応温度は通常、-30~180℃、好ましくは0~100℃である。本反応の反応時間は通常、10分間~30時間である。

本反応の進行は、反応混合物の一部を薄層クロマトグラフィー、高速液体クロマトグラフィー等で分析すること確認できる。本反応の終了後は、例えば反応混合物と水とを混合し、有機溶媒にて抽出し、得られた有機層を乾燥、濃縮する等の操作を行うことにより、式(22)で示される化合物を単離することができる。単離された式(22)で示される化合物は、クロマトグラフィーおよび再結晶等により精製することもできる。

[0520]

(製造法10)

式(25)で示される化合物は、例えば、以下のスキームにしたがって製造することができる。



〔式中、H₂Nは、3位、4位、5位、6位または7位に置換したアミノ基を表し、

R^{12a}は、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキルスルホニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニルスルホニル基、ベンゼン環部分が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC7-C9フェニルアルキルスルホニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、-C(O)R¹⁵または-C(O)NR⁷R⁸を表し、W¹、L²、R⁷、R⁸およびR¹⁵は前記と同じ意味を表す。〕

本反応は溶媒中で行うことができる。使用できる溶媒としては、例えば、ベンゼン、トルエン等の芳香族炭化水素類；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、1, 4-ジオキサン、テトラヒドロフラン、1, 2-ジメトキシエタン等のエーテル類；ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類；N, N-ジメチルホルムアミド、N, N-ジメチルアセトアミド等のアミド類；ジメチルスルホキシド等のスルホキシド類；ス

ルホラン等のスルホン類及びこれらの混合物が挙げられる。

本反応に用いられる式(26)で示される化合物の使用量は、式(24)で示される化合物に対して、通常1モル当量以上、好ましくは1～3モル当量である。

- 5 本反応は通常、塩基の存在下に行う。本反応において用いられる塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリプロピルアミン、ピリジン、ジメチルアミノピリジン、ジイソプロピルエチルアミン、1, 8-ジアザビシクロ[5.4.0]-7-ウンデセン等の有機塩基；水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸カルシウム、水素化ナトリウム等の無機塩基等が挙げられる。本反応には、塩基が、式(24)で示される化合物1モルに対して、通常0.5～10モル、好ましくは1～5モル用いられる。

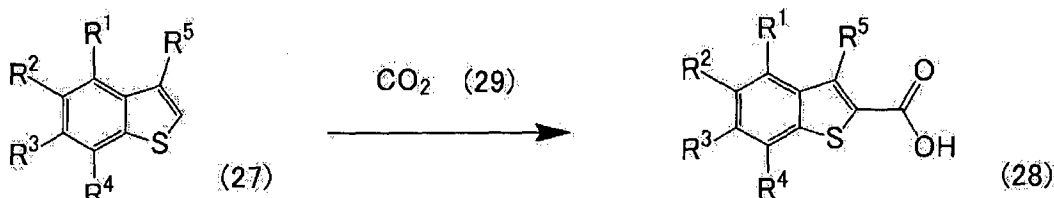
本反応の反応温度は通常、-30～180℃、好ましくは-10～50℃である。本反応の反応時間は通常、10分～30時間である。

- 15 本反応の終了は、反応混合物の一部をサンプリングして、薄層クロマトグラフィー、高速液体クロマトグラフィー等の分析手段により確認することができる。本反応の終了後、例えば反応混合物と水とを混合し、有機溶媒にて抽出し、得られた有機層を乾燥、濃縮する等の操作を行うことにより、式(25)で示される化合物を単離することができる。単離された式(25)で示される化合物は、クロマトグラフィーおよび再結晶等により精製することもできる。

[0521]

(製造法11)

式(28)で示される化合物は、例えば、以下のスキームにしたがって製造することができる。



- 25 [式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 および R^5 は前記と同じ意味を表す。]

本反応は通常溶媒中で行なう。使用できる溶媒としては、例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、1, 4-ジオキサン、テトラヒドロフラン、1, 2-ジメトキシエタン等のエーテル類及びこれらの混合物が挙げられる。

- 30 また、本反応は、塩基の存在下で行われる。本反応に用いられる塩基としては、例えば、*n*-ブチルリチウム、リチウムジイソプロピルアミド等が挙げられる。本反応には、塩基が、式(27)で示される化合物1モルに対して、通常1～2モル、好ましくは1～1.1モル用いられる。

- 35 本反応には、式(29)で示される化合物が、式(27)で示される化合物1モルに対して、通常10モル以上、好ましくは10～1000モル用いられる。

本反応の反応温度は通常-100～0℃である。本反応の反応時間は通常5分～5時間である。

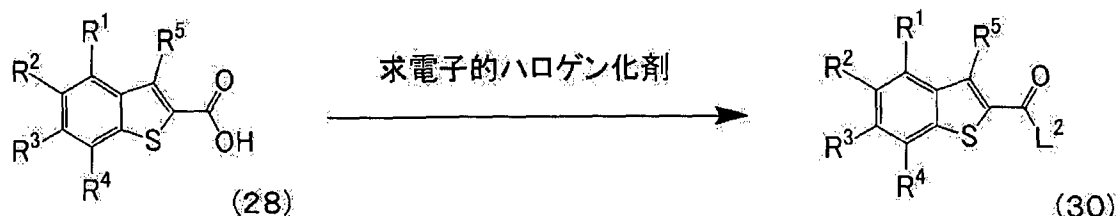
- 40 本反応の終了は、反応混合物の一部をサンプリングして、薄層クロマトグラフィー、高速液体クロマトグラフィー等の分析手段により確認することができる。本反応の終了後、例えば反応混合物に水を加え、有機溶媒で洗浄後、水層

に濃塩酸を加え、有機溶媒で抽出し、得られた有機層を乾燥、濃縮する等の操作を行うことにより、式(28)で示される化合物を単離することができる。

[0522]

(製造法12)

- 5 式(30)で示される化合物は、例えば、以下のスキームにしたがって製造することができる。



[式中、 L^2 、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 および R^5 は前記と同じ意味を表す。

]

- 10 本反応は通常溶媒中で行われる。本反応に用いられる溶媒としては、例えば、ベンゼン、トルエン等の芳香族炭化水素類；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、1,4-ジオキサン、テトラヒドロフラン、1,2-ジメトキシエタン等のエーテル類；ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類；ジメチルスルホキシド等のスルホキシド類；スルホラン等のスルホン類及びこれらの混合物が挙げられる。

15 本反応に用いられる求電子的ハロゲン化剤としては、例えば、塩化チオニルや塩化オキサリル、塩化ホスホリル、塩化スルフリル、三塩化リン、五塩化リン、三臭化リン、ホスゲン等が挙げられる。

- 20 本反応には、求電子的ハロゲン化剤が、式(28)で示される化合物1モルに対して、通常1~100モル、好ましくは2~20モル用いられる。

本反応には、さらに必要に応じてN,N-ジメチルホルムアミド等が、式(28)で示される化合物1モルに対して、0.001モル~1000モル、好ましくは0.01モル~50モル 本反応の反応温度は、通常室温から使用する溶媒の沸点の範囲であり、好ましくは60℃~溶媒の沸点である。本反応は封

- 25 管又は耐圧密閉容器中で行うこともできる。

本反応の反応時間は、通常5分~数日程度である。

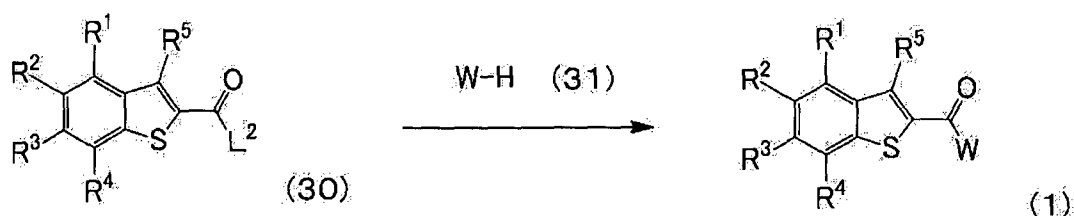
本反応の進行は、反応混合物の一部を薄層クロマトグラフィー、高速液体クロマトグラフィー等で分析することにより確認できる。本反応の終了後は、例えば反応混合物を濃縮する等の操作を行うことにより、式(30)で示される

- 30 化合物を単離することができる。

[0523]

(製造法13)

式(1)で示される化合物は、例えば、以下のスキームにしたがって製造することができる。



- 35 [式中、 W 、 L^2 、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 および R^5 は前記と同じ意味を表す。]

本反応は通常溶媒中で行なう。使用できる溶媒としては、例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、1, 4-ジオキサン、テトラヒドロフラン、1, 2-ジメトキシエタン等のエーテル類；ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類；N, N-ジメチルホルムアミド、N, N-ジメチルアセトアミド等のアミド類；スルホラン等のスルホン類；アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン等のケトン類及びこれらの混合物が挙げられる。

本反応には、式(31)で示される化合物が、式(30)で示される化合物1モルに対して、通常1モル以上、好ましくは1~50モル用いられる。

また、本反応は、塩基の存在下で行われる。本反応に用いられる塩基としては、例えば、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の金属炭酸塩、ナトリウムメトキシド等の金属アルコキシド、水素化ナトリウム等のアルカリ金属水素化物、トリエチルアミン、トリブチルアミン、N, N-ジイソプロピルエチルアミン等の有機塩基等が挙げられる。

本反応には、塩基が、式(30)で示される化合物1モルに対して、通常1~50モル、好ましくは1~5モル用いられる。

本反応の反応温度は通常0~200℃、好ましくは30~100℃である。

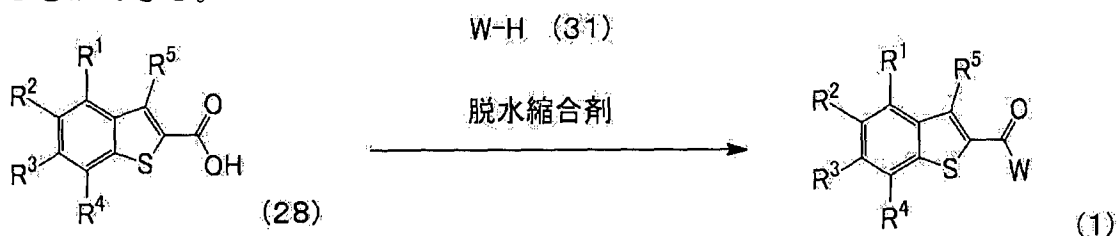
本反応の反応時間は通常30分~30時間である。

本反応の終了は、反応混合物の一部をサンプリングして、薄層クロマトグラフィー、高速液体クロマトグラフィー等の分析手段により確認することができる。本反応の終了後、例えば反応混合物に水を加えた後、有機溶媒にて抽出し、得られた有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、式(1)で示される化合物を単離することができる。単離された式(1)で示される化合物は、クロマトグラフィーおよび再結晶等により精製することもできる。

[0524]

(製造法14)

式(1)で示される化合物は、例えば、以下のスキームにしたがって製造することができる。



[式中、W、R¹、R²、R³、R⁴ および R⁵ は前記と同じ意味を表す。]

本反応は通常溶媒中で行なう。使用できる溶媒としては、例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、1, 4-ジオキサン、テトラヒドロフラン、1, 2-ジメトキシエタン等のエーテル類；ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類；N, N-ジメチルホルムアミド、N, N-ジメチルアセトアミド等のアミド類；スルホラン等のスルホン類、酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類及びこれらの混合物が挙げられる。

本反応には、式(31)で示される化合物が、式(28)で示される1モルに対して、通常1モル以上、好ましくは1~10モル用いられる。

本反応に用いられる脱水縮合剤としては、N, N-ジシクロヘキシルカルボ

ジイミド、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩等のカルボジイミド系、ベンゾトリアゾール-1-イルオキシートリス(ジメチルアミノ)ホスホニウム塩等のホスホニウム塩系等が挙げられる。

本反応には、脱水縮合剤が、式(28)で示される化合物1モルに対して、通常1~50モル、好ましくは1~10モル用いられる。

本反応には、さらに必要に応じて4, 4-ジメチルアミノピリジン等が、式(28)で示される化合物1モルに対して、0.001モル~10モル、好ましくは0.01モル~0.5モル用いられる。

本反応は、さらに必要に応じて塩基の存在下で行われる。本反応に用いられる塩基としては、例えば、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の金属炭酸塩、ナトリウムメトキシド等の金属アルコキシド、水素化ナトリウム等のアルカリ金属水素化物、トリエチルアミン、トリブチルアミン、N, N-ジイソプロピルエチルアミン等の有機塩基等が、式(28)で示される化合物1モルに対して、通常1~50モル、好ましくは1~10モル用いられる。

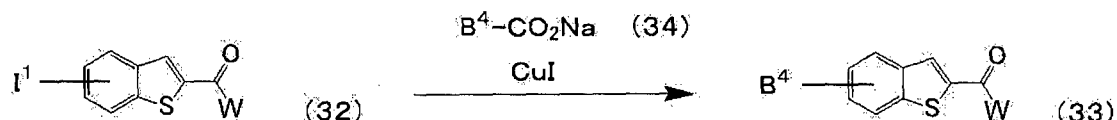
本反応の反応温度は通常0~200℃、好ましくは30~100℃である。本反応の反応時間は通常30分~30時間である。

本反応の終了は、反応混合物の一部をサンプリングして、薄層クロマトグラフィー、高速液体クロマトグラフィー等の分析手段により確認することができる。本反応の終了後、例えば反応混合物に水を加えた後、有機溶媒にて抽出し、得られた有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、式(1)で示される化合物を単離することができる。単離された式(1)で示される化合物は、クロマトグラフィーおよび再結晶等により精製することもできる。

[0525]

(製造法15)

式(33)で示される化合物は、例えば、以下のスキームにしたがって製造することができる。



[式中、I¹は、3位、4位、5位、6位または7位に置換したヨウ素原子を表し、

B⁴は、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基を表し、

Wは前記と同じ意味を表す。]

本反応には、式(34)で示される化合物が、式(32)で示される化合物1モルに対して、通常2モル以上、好ましくは2~20モル用いられる。

本反応は、溶媒中で行われる。本反応に用いられる溶媒としては、例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類；N, N-ジメチルホルムアミド、N, N-ジメチルアセトアミド、N-メチル-2-ピロリドン等のアミド類；ジメチルスルホキシド等のスルホキシド類、及びこれらの混合物が挙げられる。

本反応は、通常、ヨウ化銅(I)等の触媒の存在下で行われる。本反応には、本触媒が、式(32)で示される化合物1モルに対して、通常1モル以上、好ましくは1~10モル用いられる。

本反応の反応温度は、通常0~300℃、好ましくは120~250℃である。本反応の反応時間は通常30分~100時間である。本反応の進行は、反

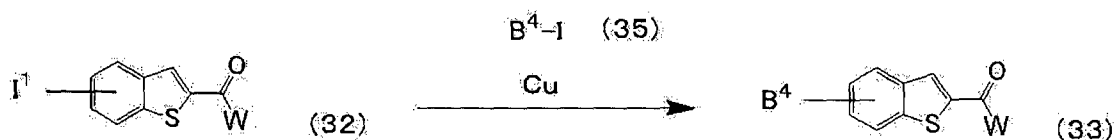
応混合物の一部を薄層クロマトグラフィー、高速液体クロマトグラフィー等で分析することにより確認できる。

本反応の終了後は、シリカゲルクロマトグラフィー等の操作を行うことにより、式(33)で示される化合物を単離することができる。

5 [0526]

(製造法16)

式(33)で示される化合物は、例えば、以下のスキームにしたがって製造することができる。



10 [式中、 I^1 、 B^4 、 W^2 は前記と同じ意味を表す。]

本反応には、式(35)で示される化合物が、式(32)で示される化合物1モルに対して、通常1モル以上、好ましくは1~20モル用いられる。

本反応は、溶媒中で行われる。本反応に用いられる溶媒としては、例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類；N，N-ジメチルホルムアミド、N，N-ジメチルアセトアミド、N-メチル-2-ピロリドン等のアミド類；ジメチルスルホキシド等のスルホキシド類及びこれらの混合物が挙げられる。

20 本反応は、通常、銅(0)等の触媒の存在下で行われる。本反応には、本触媒が、式(32)で示される化合物1モルに対して、通常1モル以上、好ましくは1~20モル用いられる。

本反応の反応温度は、通常0~300℃、好ましくは120~250℃である。本反応の反応時間は通常30分~100時間である。本反応の進行は、反応混合物の一部を薄層クロマトグラフィー、高速液体クロマトグラフィー等で分析することにより確認できる。

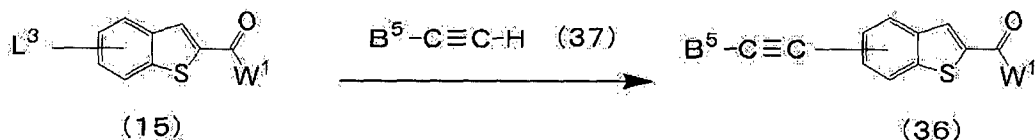
25 本反応の終了後は、シリカゲルクロマトグラフィー等の操作を行うことにより、式(33)で示される化合物を単離することができる。

[0527]

(製造法17)

式(36)で示される化合物は、例えば、パラジウム化合物、塩基および銅塩の存在下で、(15)と(37)を反応させることで製造することができる。

30



[式中、 B^5 は、水素原子、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C4アルキル基、トリメチルシリル基であり、 W^1 、 L^3 は前記と同じ意味を表す。]

35 本反応には、式(37)で示される化合物が、式(15)で示される化合物1モルに対して、通常1モル以上、好ましくは1~10モル用いられる。

本反応は、通常、塩基を溶媒として用いられるが、補助溶媒を用いてもよい。

40 本反応に用いられる塩基としては、例えば、トリエチルアミン、ジエチルアミン、ジイソプロピルアミン、トリプロピルアミン、ピリジン、ジメチルアニリン、ジメチルアミノピリジン、1，8-ジアザビシクロ[5.4.0]-7

ーウンデセン等の有機塩基等が挙げられる。本反応には、塩基が、式(15)で示される化合物1モルに対して、通常1～1000モル、好ましくは1～1000モル用いられる。

本反応に用いられる補助溶媒としては、例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、1,4-ジオキサン、テトラヒドロフラン、1,2-ジメトキシエタン等のエーテル類；アセトニトリル等のニトリル類；N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド等のアミド類；ジメチルスルホキシド等のスルホキシド類；スルホラン等のスルホン類及びこれらの混合物が挙げられる。

本反応に用いられるパラジウム化合物としては、例えば、テトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(0)、ジクロロビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(II)、ジクロロビス(トリシクロヘキシルホスフィン)パラジウム(II)、[1,1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセン]パラジウム(II)ジクロリドジクロロメタン付加物等が挙げられる。本反応には、本パラジウム化合物が、式(15)で示される化合物1モルに対して、通常0.001モル以上、好ましくは0.001～0.5モル用いられる。本反応に用いられる銅塩としては、例えば、ヨウ化銅(I)、臭化銅(I)等が挙げられる。本反応には、本銅塩が、式(15)で示される化合物1モルに対して、通常0.001モル以上、好ましくは0.001～0.5モル用いられる。

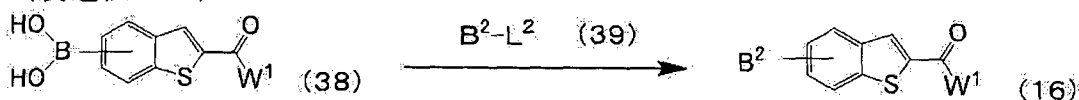
本反応の反応温度は、通常0～180℃、好ましくは10～100℃である。本反応の反応時間は通常30分～100時間である。本反応の進行は、反応混合物の一部を薄層クロマトグラフィー、高速液体クロマトグラフィー等で分析することにより確認できる。本反応の終了後は、例えば反応混合物と水とを混合し、有機溶媒で抽出し、得られた有機層を乾燥、濃縮する等の操作を行うことにより、式(36)で示される化合物を単離することができる。単離された式(36)で示される化合物は、クロマトグラフィーおよび再結晶等により精製することもできる。

なお、式(37)においてB⁵がトリメチルシリル基である化合物を、パラジウム化合物、塩基および銅塩の存在下に、化合物(15)と反応させ、更に、この反応により得られた化合物に対し、「GREENE'S PROTECTIVE GROUPS IN ORGANIC SYNTHESIS Fourth Edition, Wiley Interscience, 2007年」に記載の方法に準じて脱シリル化反応を行うことにより、式(36)におけるB⁵が水素原子である化合物を得ることができる。

[0528]

式(16)で示される化合物は、例えば、以下のスキームにしたがって製造することができる。

(製造法18)



〔式中、-B(OH)₂は、3位、4位、5位、6位または7位に置換した-B(OH)₂を表し、B²、L²、W¹は前記と同じ意味を表す。〕

本反応には、式(39)で示される化合物が、式(38)で示される化合物1モルに対して、通常1モル以上、好ましくは1～3モル用いられる。

本反応は、溶媒中で行われる。本反応に用いられる溶媒としては、例えば、

ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類；メタノール、エタノール、プロパノール等のアルコール類；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、1, 4-ジオキサン、テトラヒドロフラン、1, 2-ジメトキシエタン等のエーテル類；アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン等のケトン類；アセトニトリル等のニトリル類；N, N-ジメチルホルムアミド、N, N-ジメチルアセトアミド等のアミド類；ジメチルスルホキシド等のスルホキシド類；スルホラン等のスルホン類；水及びこれらの混合物が挙げられる。

また、本反応は、塩基の存在下で行われる。本反応に用いられる塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリプロピルアミン、ピリジン、ジメチルアニリン、ジメチルアミノピリジン、1, 8-ジアザビシクロ[5. 4. 0]-7-ウンデセン等の有機塩基；水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸カルシウム、炭酸セシウム、リン酸カリウム等の無機塩基等が挙げられる。本反応には塩基が、式(38)で示される化合物1モルに対して、通常0. 5~10モル、好ましくは1~5モル用いられる。

本反応は、通常、テトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(0)、ジクロロビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(II)、ジクロロビス(トリシクロヘキシルホスフィン)パラジウム(II)、[1, 1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセン]パラジウム(II)ジクロリドジクロロメタン付加物等の触媒の存在下で行われる。本反応には、本触媒が、式(38)で示される化合物1モルに対して、通常0. 001~0. 5モル、好ましくは0. 01~0. 2モル用いられる。

本反応には、さらに必要に応じて塩化リチウム等が式(38)で示される化合物1モルに対して、1モル~20モル、好ましくは2モル~10モル用いられる。

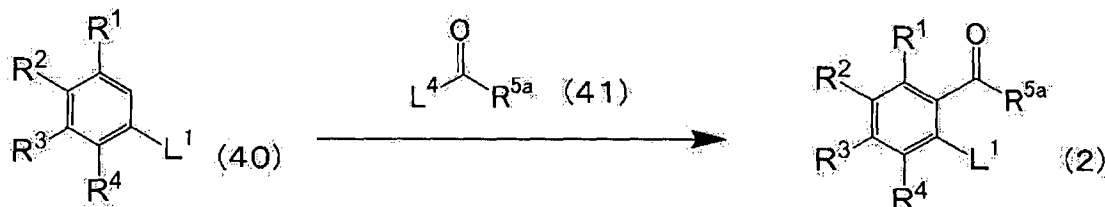
本反応の反応温度は、通常20~180℃、好ましくは60~150℃である。本反応の反応時間は通常30分~100時間である。本反応の進行は、反応混合物の一部を薄層クロマトグラフィー、高速液体クロマトグラフィー等で分析することにより確認できる。

本反応の終了後は、例えば反応混合物と水とを混合し、有機溶媒で抽出し、得られた有機層を乾燥、濃縮する等の操作を行うことにより、式(16)で示される化合物を単離することができる。単離された式(16)で示される化合物は、クロマトグラフィーおよび再結晶等により精製することもできる。

[0529]

参考製造法1

式(2)で示される化合物は、例えば、以下のスキームにしたがって製造することができる。



〔式中、 L^4 は、脱離基（例えば、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子等のハロゲン原子、メトキシ基、エトキシ基等のC1-C6アルコキシ基等、N-メトキシ-N-メチルアミノ基等）、 L^1 、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 および R^{5a}

は前記と同じ意味を表す。]

本反応は通常溶媒中で行なう。使用できる溶媒としては、例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、1, 4-ジオキサン、テトラヒドロフラン、1, 2-ジメトキシエタン等のエーテル類及びこれらの混合物が挙げられる。

本反応は塩基の存在下で行われる。本反応に用いられる塩基としては、例えば、*n*-ブチルリチウム、リチウムジイソプロピルアミド等が挙げられる。本反応には、塩基が、一般式(40)で示される化合物1モルに対して、通常1～2モル、好ましくは1～1.1モル用いられる。

本反応には、式(41)で示される化合物が、式(40)で示される化合物1モルに対して、通常1モル以上、好ましくは1～10モル用いられる。

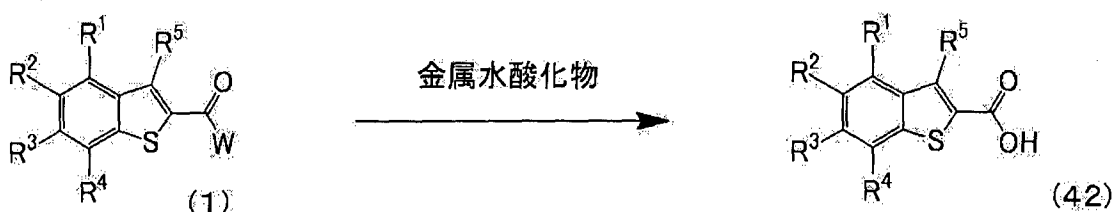
本反応の反応温度は通常-100～-30℃である。本反応の反応時間は通常5分～5時間である。

本反応の終了は、反応混合物の一部をサンプリングして、薄層クロマトグラフィー、高速液体クロマトグラフィー等の分析手段により確認することができる。本反応の終了後、例えば反応混合物に水を加えた後、有機溶媒にて抽出し、得られた有機層を乾燥、濃縮後、クロマトグラフィーおよび蒸留等を行うことにより、式(2)で示される化合物を単離することができる。

[0530]

参考製造法2

式(42)で示される化合物は、例えば式(1)で示される化合物に金属水酸化物を反応させることによって、製造することができる。



[式中、W、R¹、R²、R³、R⁴ および R⁵ は前記と同じ意味を表す。]

本反応は通常溶媒中で行われる。本反応に用いられる溶媒としては、例えば、水；テトラヒドロフラン、1, 4-ジオキサン等のエーテル類；メタノール、エタノール等のアルコール類及びこれらの混合物が挙げられる。

本反応に用いられる金属水酸化物としては、例えば、水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等のアルカリ金属の水酸化物が挙げられる。本反応には金属水酸化物が、式(1)で示される化合物1モルに対して、通常2～20モル、好ましくは2～4モル用いられる。

本反応の反応温度は、通常室温から溶媒の沸点の範囲であり、好ましくは溶媒の沸点である。本反応は封管又は耐圧密閉容器中で行うこともできる。本反応の反応時間は、通常5分～36時間程度である。

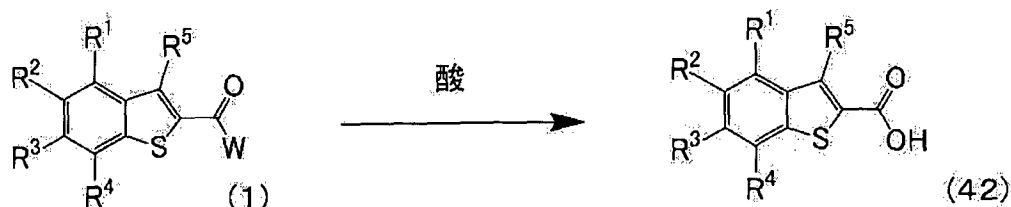
本反応の進行は、反応混合物の一部を薄層クロマトグラフィー、高速液体クロマトグラフィー等で分析することにより確認できる。本反応の終了後は、例えば反応混合物に塩酸を加えてから、有機溶媒で抽出し、得られた有機層を乾燥、濃縮する等の操作を行うことにより、式(42)で示される化合物を単離することができる。

[0531]

参考製造法3

式(42)で示される化合物は、例えば、以下のスキームにしたがって製造す

ることができる。



〔式中、W、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 および R^5 は前記と同じ意味を表す。〕

本反応は通常溶媒中で行われる。本反応に用いられる溶媒としては、例えば、水；酢酸、プロピオン酸等の有機カルボン酸類及びこれらの混合物が挙げられる。

本反応に用いられる酸としては、例えば、塩酸、臭化水素酸、トリフルオロメタンスルホン酸等が挙げられる。

本反応には酸が、式(1)で示される化合物1モルに対して、通常1～100モル、好ましくは2～20モル用いられる。

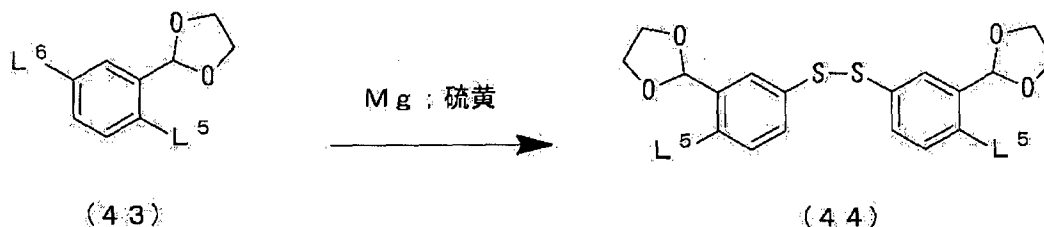
本反応の反応温度は、通常室温から使用する溶媒の沸点の範囲であり、好ましくは80℃～溶媒の沸点である。本反応は封管又は耐圧密閉容器中で行うこともできる。本反応の反応時間は、通常5分～数日程度である。

本反応の進行は、反応混合物の一部を薄層クロマトグラフィー、高速液体クロマトグラフィー等で分析することにより確認できる。本反応の終了後は、例えば反応混合物に水を加えてから、有機溶媒で抽出し、得られた有機層を乾燥、濃縮する等の操作を行うことにより、式(42)で示される化合物を単離することができる。

[0532]

参考製造法4

式(44)で示される化合物は、例えば、以下のスキームにしたがって製造することができる。



〔式中、 L^5 は、フッ素原子、塩素原子、ニトロ基等の脱離基を表し、 L^6 は、臭素原子またはヨウ素原子を表す。〕

本反応は通常溶媒中で行う。使用できる溶媒としては、例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、1,4-ジオキサン、テトラヒドロフラン、1,2-ジメトキシエタン等のエーテル類及びこれらの混合物が挙げられる。

本反応には、マグネシウムが、式(43)で示される化合物1モルに対して、通常1モル以上、好ましくは1～2モル当量用いられる。

本反応には、用いられる硫黄が、式(43)で示される化合物1モルに対して、通常0.125モル以上、好ましくは0.125～10モル用いられる。

本反応の反応温度は通常-100～100℃である。本反応の反応時間は通常5分～30時間である。

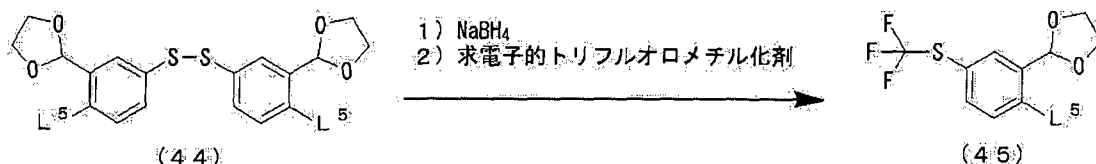
本反応の終了は、反応混合物の一部をサンプリングして、薄層クロマトグラフィー、高速液体クロマトグラフィー等の分析手段により確認することができる。

る。本反応の終了後、シリカゲルクロマトグラフィー等の精製を行うことにより、式(44)で示される化合物を単離することができる。

[0533]

参考製造法5

- 5 式(45)で示される化合物は、例えば、以下のスキームにしたがって製造することができる。



[式中、 L^5 は前記と同じ意味を表す。]

- 10 本反応は通常溶媒中で行う。使用できる溶媒としては、例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、1,4-ジオキサン、テトラヒドロフラン、1,2-ジメトキシエタン等のエーテル類；メタノール、エタノール、プロパノール等のアルコール類；ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン

- 15 本反応には、水素化ホウ素ナトリウムが、式(44)で示される化合物1モルに対して、通常1モル以上、好ましくは1~20モル用いられる。

本反応に用いられる求電子的トリフルオロメチル化剤としては、例えば、1-トリフルオロメチル-3,3-ジメチル-1,2-ベンゾヨードキソール等が挙げられる。本反応には求電子的トリフルオロメチル化剤が、式(44)で

- 20 示される化合物1モルに対して、通常1モル以上、好ましくは1~5モル用いられる。

本反応の反応温度は通常-100~150℃である。本反応の反応時間は通常5分~30時間である。

- 25 本反応の終了は、反応混合物の一部をサンプリングして、薄層クロマトグラフィー、高速液体クロマトグラフィー等の分析手段により確認することができる。本反応の終了後、シリカゲルカラムクロマトグラフィー等の精製を行うことにより、式(45)で示される化合物を単離することができる。

なお、式(45)に対して、「GREENE'S PROTECTIVE GROUPS IN ORGANIC SYNTHESIS Fourth Edition、Wiley Interscience、2007年」に記載の方法に準じて脱アセタール化反応を行うことにより、対応するアルデヒドを得ることができる。

[0534]

参考製造法6

- 35 式(46)で示される化合物は、例えば、以下のスキームにしたがって製造することができる。



[式中、 m^a は1または2を表し、 L^5 は前記と同じ意味を表す。]

本反応は、溶媒中で行われる。本反応に用いられる溶媒としては、例えば、

メタノール、エタノール、プロパノール等のアルコール類；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、1, 4-ジオキサン、テトラヒドロフラン、1, 2-ジメトキシエタン等のエーテル類；アセトニトリル等のニトリル類；ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類；酢酸等の有機酸；水及びこれらの混合物が挙げられる。

本反応に用いられる酸化剤としては、例えば、m-クロロ過安息香酸、過酸化水素水、等が挙げられる。本反応には酸化剤が、式(45)で示される化合物1モルに対して、通常1モル以上、好ましくは1~10モル用いられる。

本反応の反応温度は通常-100~150℃である。本反応の反応時間は通常5分~30時間である。

本反応の終了は、反応混合物の一部をサンプリングして、薄層クロマトグラフィー、高速液体クロマトグラフィー等の分析手段により確認することができる。本反応の終了後、シリカゲルカラムクロマトグラフィー等の精製を行うことにより、式(46)で示される化合物を単離することができる。

なお、式(46)に対して、「GREENE'S PROTECTIVE GROUPS IN ORGANIC SYNTHESIS Fourth Edition、Wiley Interscience、2007年」に記載の方法に準じて脱アセタール化反応を行うことにより、対応するアルデヒドを得ることができる。

[実施例]

[0535]

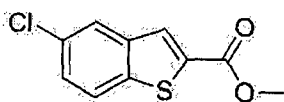
以下、本発明を製造例、製剤例及び試験例にてさらに詳しく説明するが、本発明は以下の例のみに限定されるものではない。なお、以下の例において、部は特にことわりの無い限り重量部を示す。

[0536]

製造例1

5-クロロ-2-フルオロベンズアルデヒド1.10g、チオグリコール酸メチル803mg、炭酸カリウム956mgおよびN,N-ジメチルホルムアミド15mlの混合物を60℃で2時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却した。反応混合物に水を加え、tert-ブチルメチルエーテルで3回抽出した。合わせた有機層を水、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮し、5-クロロベンゾ[b]チオフェン-2-カルボン酸メチル(以下、本発明化合物7と記す。)1.42gを得た。

本発明化合物7



¹H-NMR (CDCl₃) δ: 7.99 (s, 1H), 7.86 (d, 1H, J = 2.2 Hz), 7.79 (d, 1H, J = 8.7 Hz), 7.42 (dd, 1H, J = 8.7, 2.2 Hz), 3.95 (s, 3H).

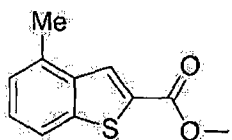
[0537]

製造例2

4-ブロモベンゾ[b]チオフェン-2-カルボン酸メチル500mg、メチルボロン酸161mg、リン酸カリウム1.17g、[1,1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセン]パラジウム(II)ジクロリドジクロロメタン付加物151mg、1,4-ジオキサン6mlおよび水0.1mlの混合物を、窒素雰囲気下、100℃で3時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却した後、減圧下濃縮した。残渣にクロロホルムおよび水を加え、不溶物をろ

別した。ろ液をクロロホルムで抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、4-メチルベンゾ[b]チオフェン-2-カルボン酸メチル（以下、本発明化合物22と記す。）340mgを得た。

5 本発明化合物22

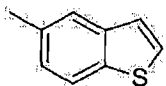


$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.17-8.16 (m, 1H), 7.71-7.69 (m, 1H), 7.37-7.35 (m, 1H), 7.20-7.18 (m, 1H), 3.95 (s, 3H), 2.64 (s, 3H).

10 [0538]

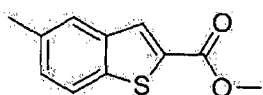
製造例3

工程1: 4-メチルベンゼンチオール4.00g、60%水素化ナトリウム1.4gおよびテトラヒドロフラン35mlの混合物に、ブromoアセトアルデヒドジエチルアセタール5.2gおよびテトラヒドロフラン10ml混合物を加えた。反応混合物を室温で15時間攪拌した。反応混合物に飽和塩化アンモニウム水溶液10mlを加え、tert-ブチルメチルエーテルで3回抽出した。合わせた有機層を水、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。175℃で45分間攪拌した五酸化ニリン5gおよびリン酸10gの混合物に、残渣を加え5分間攪拌した。氷水に反応混合物を加え、tert-ブチルメチルエーテルで3回抽出した。合わせた有機層を水、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、5-メチルベンゾ[b]チオフェン2.77gを得た。



25 工程2

5-メチルベンゾ[b]チオフェン2.77gおよびジエチルエーテル40mlの混合物を0℃で攪拌し、n-ブチルリチウム(2.6Mヘキサン溶液)18mlを加えた。この反応混合物を2時間攪拌した後、ドライアイス1gを加えた。反応混合物を室温にした後、水を加え、tert-ブチルメチルエーテルで3回洗浄した。水層に濃塩酸を加えた後、tert-ブチルメチルエーテルで3回抽出した。合わせた有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣およびメタノール20mlの混合物に、氷冷下で塩化オキサリル800mgを加えた。この混合物を80℃で2時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却した後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、5-メチルベンゾ[b]チオフェン-2-カルボン酸メチル（以下、本発明化合物23と記す。）387mgを得た。



本発明化合物23

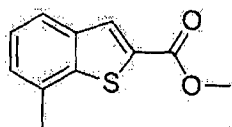
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.99(s, 1H), 7.75(d, 1H, J=8.6Hz), 7.67(s, 1H), 7.29(d, 1H, J=8.6Hz), 3.94(s, 3H), 2.48(s, 3H).

[0539]

製造例 4

- 7-ブロモベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル 600 mg、メチル
 5 ボロン酸 199 mg、リン酸カリウム 1.41 g、[1, 1'-ビス (ジフェニルホスフィノ) フェロセン] パラジウム (II) ジクロリドジクロロメタン
 付加物 181 mg、1, 4-ジオキサン 7 ml および水 0.12 ml の混
 合物を、窒素雰囲気下、100 °C で 2.5 時間攪拌した。反応混合物を室温
 まで冷却した後、減圧下濃縮した。残渣にクロロホルムおよび水を加え、不溶
 10 物をろ別した。ろ液をクロロホルムで抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄し、
 硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロ
 マトグラフィーに付し、7-メチルベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン
 酸メチル (以下、本発明化合物 25 と記す。) 402 mg を得た。

本発明化合物 25

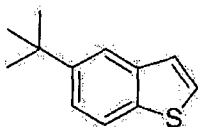


- 15 ¹H-NMR (CDCl₃) δ: 8.09 (s, 1H), 7.74-7.72 (m, 1H), 7.35-7.33 (m, 1H), 7.2
 7-7.25 (m, 1H), 3.95 (s, 3H), 2.57 (s, 3H).

[0540]

製造例 5

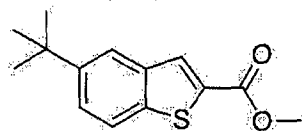
- 4-tert-ブチルベンゼンチオール 8.00 g、水素化ナトリウム 2.1
 20 0 g およびテトラヒドロフラン 70 ml の混合物に、ブromoアセトアルデヒド
 ジエチルアセタール 7.80 g およびテトラヒドロフラン 20 ml 混合物を加
 えた。反応混合物を室温で 15 時間攪拌した。反応混合物に飽和塩化アンモニ
 ウム水溶液 20 ml を加え、tert-ブチルメチルエーテルで 3 回抽出した
 。合わせた有機層を水、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後
 25 、減圧下濃縮した。175 °C で 45 分間攪拌した五酸化二リン 10 g およびリン
 酸 20 g の混合物に、残渣を加え 5 分間攪拌した。氷水に反応混合物を加え
 、tert-ブチルメチルエーテルで 3 回抽出した。合わせた有機層を水、飽
 和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣を
 30 シリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、5-tert-ブチルベンゾ [b]
] チオフェン 6.7 g を得た。



- 5-tert-ブチルベンゾ [b] チオフェン 3.00 g およびジエチルエー
 テル 40 ml の混合物を 0 °C で攪拌し、n-ブチルリチウム (2.6 M ヘキサ
 35 ン溶液) 15 ml を加えた。反応混合物を 2 時間攪拌した後、ドライアイス 1
 g を加えた。反応混合物を室温にした後、水を加え、tert-ブチルメチル
 エーテルで 3 回洗浄した。水層に濃塩酸を加えた後、tert-ブチルメチル
 エーテルで 3 回抽出した。合わせた有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネ
 シウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣およびメタノール 30 ml の混合
 40 物に、氷冷下で塩化オキサリル 402 mg を加えた。この混合物を 80 °C で 2
 時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却した後、減圧下濃縮した。残渣をシ
 リカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、5-tert-ブチルベンゾ [b]

】チオフェン-2-カルボン酸メチル（以下、本発明化合物27と記す。）416mgを得た。

本発明化合物27



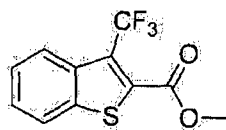
- 5 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.04 (s, 1H), 7.85-7.84 (m, 1H), 7.80-7.78 (m, 1H), 7.56-7.54 (m, 1H), 3.94 (s, 3H), 1.39 (s, 9H).

[0541]

製造例6

- 2-フルオロフェニル（トリフルオロメチル）ケトン1.00g、チオグリコール酸メチル633mg、トリエチルアミン737mgおよびアセトニトリル15mlの混合物を90℃で18時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却後、減圧下濃縮した。反応混合物に水を加え、tert-ブチルメチルエーテルで3回抽出した。合わせた有機層を水、1M塩酸、1M水酸化ナトリウム水溶液、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。
- 15 残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、3-トリフルオロメチルベンゾ[b]チオフェン-2-カルボン酸メチル（以下、本発明化合物28と記す。）415mgを得た。

本発明化合物28



- 20 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.15-8.14 (m, 1H), 7.90-7.87 (m, 1H), 7.53-7.51 (m, 2H), 3.99 (s, 3H).

[0542]

製造例7

- 4-ヨードベンゾ[b]チオフェン-2-カルボン酸メチル325mg、ペンタフルオロプロピオン酸ナトリウム1.90g、ヨウ化銅(I)486mg、N-メチル-2-ピロリドン5mlおよびキシレン5mlの混合物を、窒素雰囲気下160℃で5時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却した後、クロロホルムおよび水を加えて、不溶物をろ別した。ろ液から、クロロホルムで抽出した後、合わせた有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、4-ペンタフルオロエチルベンゾ[b]チオフェン-2-カルボン酸メチル（以下、本発明化合物29と記す。）80mgを得た。

本発明化合物29



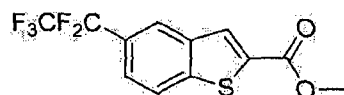
- 35 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.26 (s, 1H), 8.09-8.07 (m, 1H), 7.70-7.68 (m, 1H), 7.58-7.56 (m, 1H), 3.98 (s, 3H).

[0543]

製造例8

5-ヨードベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル 1.00 g、ペンタフルオロプロピオン酸ナトリウム 2.92 g、ヨウ化銅 (I) 1.50 g、N-メチル-2-ピロリドン 15 ml および N, N-ジメチルホルムアミド 15 ml の混合物を、窒素雰囲気下 160 °C で 5 時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却した後、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液および飽和アンモニア水溶液を加え、tert-ブチルメチルエーテルで 3 回抽出した。合わせた有機層を水、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、5-ペンタフルオロエチルベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル (以下、本発明化合物 30 と記す。) 556 mg を得た。

本発明化合物 30



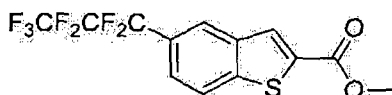
¹H-NMR (CDCl₃) δ: 8.15-8.12 (m, 2H), 8.00 (d, 1H, J = 8.8 Hz), 7.64 (d, 1H, J = 8.8 Hz), 3.99 (s, 3H).

[0544]

製造例 9

5-ヨードベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル 1000 mg、1-ヨードヘプタフルオロプロパン 2.79 g、銅 (0) 600 mg および N, N-ジメチルホルムアミド 20 ml の混合物を、窒素雰囲気下 150 °C で 8 時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却した後、tert-ブチルメチルエーテルおよび飽和アンモニア水溶液を加えた後、セライトを用いたろ過をした。ろ液を水、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、5-ヘプタフルオロプロピルベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル (以下、本発明化合物 31 と記す。) 351 mg を得た。

本発明化合物 31



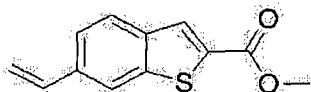
¹H-NMR (CDCl₃) δ: 8.14 (s, 1H), 8.12 (s, 1H), 8.00 (d, 1H, J = 8.5 Hz), 7.63 (d, 1H, J = 8.5 Hz), 3.97 (s, 3H).

[0545]

製造例 10

6-ブロモベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル 500 mg、トリブチルビニルスズ 877 mg、テトラキス (トリフェニルホスフィン) パラジウム (0) 213 mg およびトルエン 4 ml の混合物を、窒素雰囲気下、110 °C で 5 時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却した後、飽和塩化アンモニウム水溶液と酢酸エチルを加え、不溶物をろ別した。ろ液を酢酸エチルで抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、6-ビニルベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル (以下、本発明化合物 32 と記す。) 229 mg を得た。

本発明化合物 32

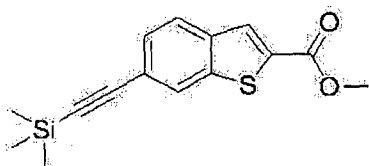


$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.03 (s, 1H), 7.84–7.81 (m, 2H), 7.52–7.50 (m, 1H), 6.82 (dd, 1H, $J = 17.6, 11.0$ Hz), 5.87 (d, 1H, $J = 17.6$ Hz), 5.36 (d, 1H, $J = 11.0$ Hz), 3.95 (s, 3H).

5 [0546]

製造例 11

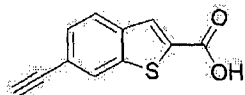
6-ブロモベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル 900 mg、ジイソプロピルアミン 2.28 ml、ジクロロビス (トリフェニルホスフィン) パラジウム (II) 116 mg、ヨウ化銅 (I) 32 mg、トリメチルシリルアセチレン 0.92 ml および トルエン 15 ml の混合物を、窒素雰囲気下、室温で 20 時間攪拌した。反応混合物を減圧下濃縮し、残渣にヘキサンを加え、不溶物をろ別した。ろ液を減圧下濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、6-(トリメチルシリルエチニル) ベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル 590 mg を得た。



15

工程 2

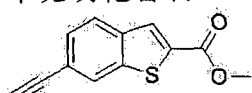
6-(トリメチルシリルエチニル) ベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル 590 mg、水酸化リチウム-水和物 215 mg、水 4 ml および メタノール 12 ml の混合物を 80 °C で 1 時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却後、水および濃塩酸を加え、析出した固体をろ過により集め、減圧下で乾燥し、6-エチニルベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸 402 mg を得た。



工程 3

25 6-エチニルベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸 217 mg および メタノール 10 ml の混合物に、0 °C でトリメチルシリルジエチルアミン (2 M ジエチルエーテル溶液) 4.3 ml を滴下した。反応混合物を 0 °C で 15 時間攪拌した後、室温下で 30 分間攪拌した。混合物を減圧下濃縮し、残渣にメタノールを加え、不溶物をろ取得し、6-エチニルベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル (以下、本発明化合物 33 と記す。) 182 mg を得た。

本発明化合物 33



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.04 (s, 1H), 8.01 (s, 1H), 7.83–7.81 (m, 1H), 7.51–7.48 (m, 1H), 3.95 (s, 3H), 3.19 (s, 1H).

35 [0547]

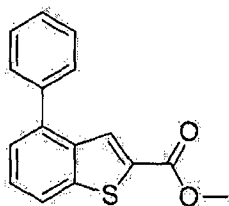
製造例 12

4-ブロモベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル 750 mg、フェ

ニルボロン酸 438 mg、塩化リチウム 610 mg、炭酸ナトリウム 528 mg、テトラキス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（0）160 mg、1,4-ジオキサン 30 ml および水 15 ml の混合物を、窒素雰囲気下、100℃で4時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却した後、減圧下濃縮した。

- 5 残渣にクロロホルムおよび水を加え、不溶物をろ別した。水層をクロロホルムで2回抽出し、合わせた有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、4-フェニルベンゾ[b]チオフェン-2-カルボン酸メチル（以下、本発明化合物34と記す。）477 mgを得た。

10 本発明化合物34



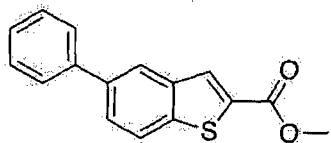
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.17-8.16 (m, 1H), 7.87-7.85 (m, 1H), 7.57-7.48 (m, 5H), 7.47-7.42 (m, 1H), 7.41-7.39 (m, 1H), 3.93 (s, 3H).

[0548]

15 製造例13

5-ブロモベンゾ[b]チオフェン-2-カルボン酸メチル 500 mg、フェニルボロン酸 292 mg、塩化リチウム 406 mg、炭酸ナトリウム 351 mg、テトラキス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（0）106 mg、1,4-ジオキサン 20 ml および水 10 ml の混合物を100℃で3時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却し、減圧下濃縮した。残渣に水を加え、クロロホルムで3回抽出した。合わせた有機層を水、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、5-フェニルベンゾ[b]チオフェン-2-カルボン酸メチル（以下、本発明化合物35と記す。）295 mgを得た。

25 本発明化合物35



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.11 (s, 1H), 8.07 (s, 1H), 7.93 (d, 1H, $J = 8.5$ Hz), 7.71 (d, 1H, $J = 8.5$ Hz), 7.66-7.64 (m, 2H), 7.49-7.47 (m, 2H), 7.40-7.38 (m, 1H), 3.97 (s, 3H).

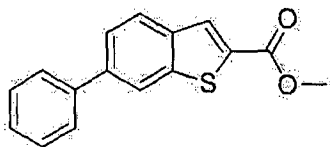
[0549]

30 製造例14

6-ブロモベンゾ[b]チオフェン-2-カルボン酸メチル 750 mg、フェニルボロン酸 438 mg、塩化リチウム 610 mg、炭酸ナトリウム 528 mg、テトラキス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（0）160 mg、1,4-ジオキサン 30 ml および水 15 ml の混合物を、窒素雰囲気下、100℃で4時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却した後、減圧下濃縮した。残渣にクロロホルムおよび水を加え、不溶物をろ別した。水層をクロロホルムで2回抽出し、合わせた有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾

燥した後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、6-フェニルベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル（以下、本発明化合物 36 と記す。） 475 mg を得た。

本発明化合物 36



5

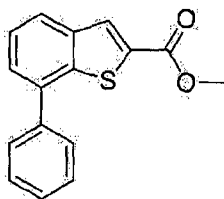
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.08 (s, 1H), 8.07-8.06 (m, 1H), 7.95-7.93 (m, 1H), 7.67-7.65 (m, 3H), 7.49-7.47 (m, 2H), 7.40-7.38 (m, 1H), 3.96 (s, 3H).

[0550]

製造例 15

- 10 7-ブロモベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル 750 mg、フェニルボロン酸 438 mg、塩化リチウム 610 mg、炭酸ナトリウム 528 mg、テトラキス（トリフェニルホスフィン）パラジウム (0) 160 mg、1,4-ジオキサン 30 ml および水 15 ml の混合物を、窒素雰囲気下、100℃で4時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却した後、減圧下濃縮した。
- 15 残渣にクロロホルムおよび水を加え、不溶物をろ別した。水層をクロロホルムで2回抽出し、合わせた有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、7-フェニルベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル（以下、本発明化合物 37 と記す。） 118 mg を得た。

20 本発明化合物 37

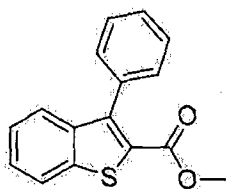


$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.14 (s, 1H), 7.88-7.86 (m, 1H), 7.72-7.71 (m, 2H), 7.54-7.41 (m, 5H), 3.94 (s, 3H).

[0551]

25 製造例 16

- 3-クロロベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル 274 mg、フェニルボロン酸 221 mg、リン酸カリウム 541 mg、トリフェニルホスフィン 31.7 mg、ビストリフェニルホスフィンニッケル (II) ジクロライド およびトルエン 7 ml の混合物を、窒素雰囲気下 120℃で6時間攪拌した。
- 30 反応混合物を室温まで冷却後、水を加え、酢酸エチルで抽出した。合わせた有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、3-フェニルベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル（以下、本発明化合物 38 と記す。） 260 mg を得た。
- 35 本発明化合物 38



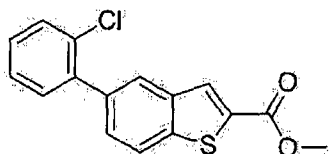
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.90–7.88 (m, 1H), 7.56–7.35 (m, 8H), 3.78 (s, 3H).

[0552]

製造例 17

- 5 5-ブロモベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル 1.00 g、2-クロロフェニルボロン酸 750 mg、塩化リチウム 813 mg、炭酸ナトリウム 704 mg、テトラキス (トリフェニルホスフィン) パラジウム (0) 213 mg、1, 4-ジオキサン 40 ml および水 20 ml の混合物を、窒素雰囲気下、100℃で4時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却した後、減圧下濃縮した。残渣にクロロホルムおよび水を加え、不溶物をろ別した。水層をクロロホルムで2回抽出し、合わせた有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、5-(2-クロロフェニル) ベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル (以下、本発明化合物 39 と記す。) 871 mg を得た。

15 本発明化合物 39



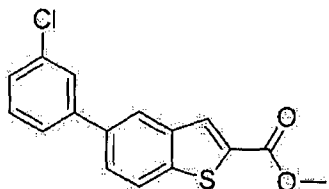
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.10 (s, 1H), 7.94–7.91 (m, 2H), 7.57–7.55 (m, 1H), 7.52–7.50 (m, 1H), 7.41–7.38 (m, 1H), 7.37–7.30 (m, 2H), 3.96 (s, 3H).

[0553]

20 製造例 18

- 5-ブロモベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル 1.00 g、3-クロロフェニルボロン酸 750 mg、塩化リチウム 813 mg、炭酸ナトリウム 704 mg、テトラキス (トリフェニルホスフィン) パラジウム (0) 213 mg、1, 4-ジオキサン 40 ml および水 20 ml の混合物を、窒素雰囲気下、100℃で4時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却した後、減圧下濃縮した。残渣にクロロホルムおよび水を加え、不溶物をろ別した。水層をクロロホルムで2回抽出し、合わせた有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、5-(3-クロロフェニル) ベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル (以下、本発明化合物 40 と記す。) 870 mg を得た。

30 本発明化合物 40



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.11 (s, 1H), 8.04 (d, 1H, $J = 1.9$ Hz), 7.94 (d, 1H, $J = 8.5$ Hz), 7.67 (dd, 1H, $J = 8.5, 1.9$ Hz), 7.64–7.63 (m, 1H), 7.53–7.51 (m, 1H), 7.42–7.40 (m, 1H), 7.37–7.35 (m, 1H), 3.97 (s, 3H).

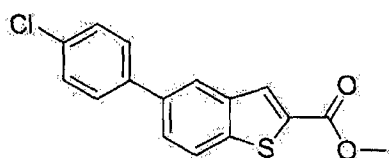
35

[0554]

製造例19

- 5-ブロモベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル 1.00 g、4-クロロフェニルボロン酸 750 mg、塩化リチウム 813 mg、炭酸ナトリウム 704 mg、テトラキス (トリフェニルホスフィン) パラジウム (0) 213 mg、1,4-ジオキサン 40 ml および水 20 ml の混合物を、窒素雰囲気下、100℃で4時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却した後、減圧下濃縮した。残渣にクロロホルムおよび水を加え、不溶物をろ別した。水層をクロロホルムで2回抽出し、合わせた有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、5-(4-クロロフェニル)ベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル (以下、本発明化合物41と記す。) 721 mgを得た。

本発明化合物41



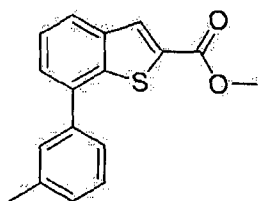
- ¹H-NMR (CDCl₃) δ: 8.11 (s, 1H), 8.03 (d, 1H, J = 1.8 Hz), 7.93 (d, 1H, J = 8.3 Hz), 7.66 (dd, 1H, J = 8.3, 1.8 Hz), 7.57 (d, 2H, J = 8.8 Hz), 7.44 (d, 2H, J = 8.8 Hz), 3.97 (s, 3H).

[0555]

製造例20

- 7-ブロモベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル 750 mg、3-メチルフェニルボロン酸 489 mg、塩化リチウム 610 mg、炭酸ナトリウム 528 mg、テトラキス (トリフェニルホスフィン) パラジウム (0) 160 mg、1,4-ジオキサン 30 ml および水 15 ml の混合物を 100℃で3時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却し、減圧下濃縮した。残渣にクロロホルムを加え、不溶物をろ別した。ろ液に水を加えた後、クロロホルムで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、7-(3-メチルフェニル)ベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル (以下、本発明化合物42と記す。) 385 mgを得た。

本発明化合物42



- ¹H-NMR (CDCl₃) δ: 8.13 (s, 1H), 7.86-7.84 (m, 1H), 7.52-7.46 (m, 4H), 7.41-7.39 (m, 1H), 7.26-7.23 (m, 1H), 3.94 (s, 3H), 2.45 (s, 3H).

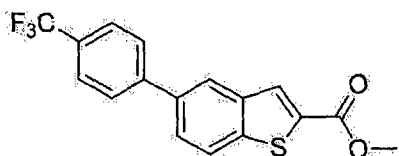
[0556]

製造例21

- 5-ブロモベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル 1.0 g、4-トリフルオロメチルフェニルボロン酸 911 mg、塩化リチウム 813 mg、炭酸ナトリウム 704 mg、テトラキス (トリフェニルホスフィン) パラジウム

(0) 213 mg、1, 4-ジオキサン 40 ml および水 20 ml の混合物を 100℃ で 2.5 時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却し、減圧下濃縮した。残渣にクロロホルムを加え、不溶物をろ別した。ろ液に水を加えた後、クロロホルムで抽出した。有機層を水、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣に *tert*-ブチルメチルエーテルを加え、不溶物をろ取し、減圧下乾燥し、5-(4-トリフルオロメチル)フェニルベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル (以下、本発明化合物 43 と記す。) 845 mg を得た。

本発明化合物 43



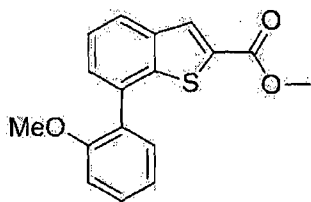
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.13 (s, 1H), 8.09-8.08 (m, 1H), 7.98-7.95 (m, 1H), 7.76-7.75 (m, 4H), 7.71-7.69 (m, 1H), 3.97 (s, 3H).

[0557]

製造例 22

7-ブロモベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル 750 mg、2-メトキシフェニルボロン酸 575 mg、塩化リチウム 610 mg、炭酸ナトリウム 528 mg、テトラキス (トリフェニルホスフィン) パラジウム (0) 160 mg、1, 4-ジオキサン 30 ml および水 15 ml の混合物を 100℃ で 3 時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却し、減圧下濃縮した。残渣にクロロホルムを加え、不溶物をろ別した。ろ液に水を加えた後、クロロホルムで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、7-(2-メトキシフェニル)ベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル (以下、本発明化合物 44 と記す。) 543 mg を得た。

本発明化合物 44



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.11 (s, 1H), 7.87-7.85 (m, 1H), 7.50-7.41 (m, 4H), 7.08-7.05 (m, 2H), 3.91 (s, 3H), 3.79 (s, 3H).

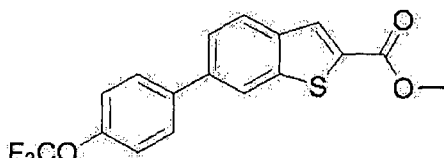
[0558]

製造例 23

6-ブロモベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル 500 mg、4-(トリフルオロメトキシ)フェニルボロン酸 494 mg、塩化リチウム 407 mg、炭酸ナトリウム 352 mg、テトラキス (トリフェニルホスフィン) パラジウム (0) 107 mg、1, 4-ジオキサン 20 ml および水 10 ml の混合物を 100℃ で 3.5 時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却し、減圧下濃縮した。残渣にクロロホルムを加え、不溶物をろ別した。ろ液に水を加えた後、クロロホルムで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー

に付し、6-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ベンゾ[b]チオフェン-2-カルボン酸メチル(以下、本発明化合物45と記す。)509mgを得た。

本発明化合物45



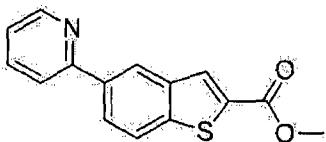
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.09 (s, 1H), 8.03 (s, 1H), 7.96-7.94 (m, 1H), 7.68-7.66 (m, 2H), 7.62-7.60 (m, 1H), 7.34-7.32 (m, 2H), 3.97 (s, 3H).

[0559]

製造例24

5-ブロモベンゾ[b]チオフェン-2-カルボン酸メチル500mg、2-(トリブチルスズ)ピリジン679mg、テトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(0)107mgおよびトルエン4mlの混合物を、窒素雰囲気下、120℃で4.5時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却し、酢酸エチルおよび水を加えた。水層を酢酸エチルで2回抽出し、合わせた有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、5-(2-ピリジル)ベンゾ[b]チオフェン-2-カルボン酸メチル(以下、本発明化合物46と記す。)368mgを得た。

本発明化合物46



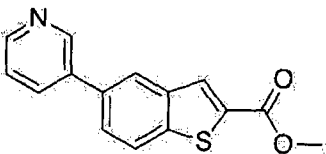
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.74-8.72 (m, 1H), 8.52-8.51 (m, 1H), 8.14-8.11 (m, 2H), 7.97-7.95 (m, 1H), 7.83-7.77 (m, 2H), 7.29-7.27 (m, 1H), 3.97 (s, 3H).

[0560]

製造例25

5-ブロモベンゾ[b]チオフェン-2-カルボン酸メチル1.00g、3-ピリジルボロン酸623mg、塩化リチウム813mg、炭酸ナトリウム704mg、テトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(0)213mg、1,4-ジオキサン40mlおよび水20mlの混合物を、窒素雰囲気下、100℃で4時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却した後、減圧下濃縮した。残渣にクロロホルムおよび水を加え、不溶物をろ別した。水層をクロロホルムで2回抽出し、合わせた有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、5-(3-ピリジル)ベンゾ[b]チオフェン-2-カルボン酸メチル(以下、本発明化合物47と記す。)754mgを得た。

本発明化合物47



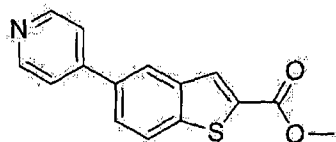
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.93–8.90 (m, 1H), 8.64–8.63 (m, 1H), 8.13 (s, 1H), 8.07 (s, 1H), 7.99–7.97 (m, 1H), 7.95–7.93 (m, 1H), 7.70–7.67 (m, 1H), 7.42–7.40 (m, 1H), 3.97 (s, 3H).

[0561]

5 製造例 26

5-ブロモベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル 1.00 g、4-ピリジルボロン酸 623 mg、塩化リチウム 813 mg、炭酸ナトリウム 704 mg、テトラキス (トリフェニルホスフィン) パラジウム (0) 213 mg、1,4-ジオキサン 40 ml および水 20 ml の混合物を、窒素雰囲気下、100 °C で 4 時間撹拌した。反応混合物を室温まで冷却した後、減圧下濃縮した。残渣にクロロホルムおよび水を加え、不溶物をろ別した。水層をクロロホルムで 2 回抽出し、合わせた有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、5-(4-ピリジル) ベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル (以下、本発明化合物 48 と記す。) 467 mg を得た。

本発明化合物 48

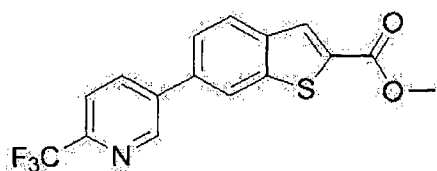


$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.70 (dd, 2H, $J = 4.5, 1.5$ Hz), 8.15–8.13 (m, 2H), 8.00–7.97 (m, 1H), 7.74–7.72 (m, 1H), 7.57 (dd, 2H, $J = 4.5, 1.5$ Hz), 3.98 (s, 3H).

[0562]

製造例 27

6-ブロモベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル 500 mg、2-トリフルオロメチルピリジン-5-ボロン酸 458 mg、塩化リチウム 407 mg、炭酸ナトリウム 352 mg、テトラキス (トリフェニルホスフィン) パラジウム (0) 107 mg、1,4-ジオキサン 20 ml および水 10 ml の混合物を 100 °C で 2 時間撹拌した。反応混合物を室温まで冷却し、減圧下濃縮した。残渣にクロロホルムを加え、不溶物をろ別した。ろ液に水を加えた後、クロロホルムで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、6-(6-トリフルオロメチル-3-ピリジル) ベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル (以下、本発明化合物 49 と記す。) 366 mg を得た。



35 本発明化合物 49

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.02 (s, 1H), 8.12–8.10 (m, 3H), 8.03–8.01 (m, 1H), 7.81–7.79 (m, 1H), 7.66–7.63 (m, 1H), 3.98 (s, 3H).

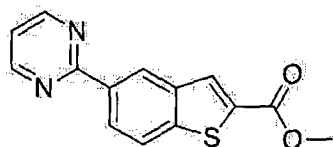
[0563]

製造例 28

2-メトキシカルボニルベンゾ [b] チオフェン-5-ボロン酸 1.00 g、
2-ブロモピリミジン 518 mg、塩化リチウム 718 mg、炭酸ナトリウム
622 mg、テトラキス (トリフェニルホスフィン) パラジウム (0) 188
mg、1, 4-ジオキサン 40 ml および水 20 ml の混合物を、窒素雰囲気
5 気下、100 °C で 3.5 時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却した後、
減圧下濃縮した。残渣にクロロホルムおよび水を加えた。

水層をクロロホルムで 2 回抽出し、合わせた有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸
マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣をクロロホルムおよび酢
酸エチルから再結晶し、5-(2-ピリミジニル) ベンゾ [b] チオフェン-
10 2-カルボン酸メチル (以下、本発明化合物 50 と記す。) 329 mg を得た。

本発明化合物 50



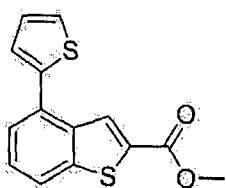
¹H-NMR (CDCl₃) δ: 8.99 (d, 1H, J = 1.8 Hz), 8.85 (d, 2H, J = 4.8 Hz), 8.5
15 7 (dd, 1H, J = 8.8, 1.8 Hz), 8.16 (s, 1H), 7.98 (d, 1H, J = 8.8 Hz), 7.23 (t,
1H, J = 4.8 Hz), 3.97 (s, 3H).

[0564]

製造例 29

4-ブロモベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル 353 mg、2-
20 チオフェンボロン酸 217 mg、塩化リチウム 287 mg、炭酸ナトリウム 2
48 mg、テトラキス (トリフェニルホスフィン) パラジウム (0) 75 m
g、1, 4-ジオキサン 10 ml および水 5 ml の混合物を、窒素雰囲気下、
100 °C で 3 時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却した後、減圧下濃縮し
た。残渣にクロロホルムおよび水を加え、不溶物をろ別した。水層をクロロホ
25 ルムで 2 回抽出し、合わせた有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウム
で乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー
に付し、4-(2-チエニル) ベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチ
ル (以下、本発明化合物 52 と記す。) 350 mg を得た。

本発明化合物 52



¹H-NMR (CDCl₃) δ: 8.42 (s, 1H), 7.84-7.82 (m, 1H), 7.51-7.48 (m, 2H), 7.4
30 4-7.42 (m, 1H), 7.36-7.35 (m, 1H), 7.20-7.18 (m, 1H), 3.95 (s, 3H).

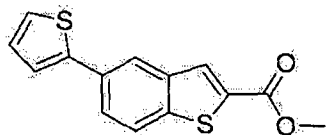
[0565]

製造例 30

5-ブロモベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル 1.00 g、チオ
35 フェン-2-ボロン酸 613 mg、塩化リチウム 813 mg、炭酸ナトリウム
704 mg、テトラキス (トリフェニルホスフィン) パラジウム (0) 213
mg、1, 4-ジオキサン 40 ml および水 20 ml の混合物を、窒素雰囲気
下、100 °C で 4 時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却した後、減圧下濃

縮した。残渣にクロロホルムおよび水を加え、不溶物をろ別した。水層をクロロホルムで2回抽出し、合わせた有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、5-(2-チエニル)ベンゾ[b]チオフェン-2-カルボン酸

メチル（以下、本発明化合物53と記す。）607mgを得た。



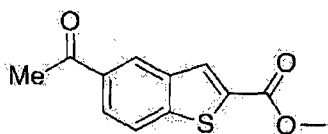
¹H-NMR (CDCl₃) δ: 8.09-8.08 (m, 1H), 8.07 (s, 1H), 7.87-7.85 (m, 1H), 7.74-7.71 (m, 1H), 7.38-7.37 (m, 1H), 7.32-7.31 (m, 1H), 7.12-7.11 (m, 1H), 3.96 (s, 3H).

[0566]

製造例31

2-フルオロ-5-アセチルベンズアルデヒド340mg、チオグリコール酸メチル283g、炭酸カリウム567mgおよびN,N-ジメチルホルムアミド10mlの混合物を80℃で2時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却した後、水を加え、析出した固体をろ取した。得られた個体を水で洗浄後、減圧下乾燥し、5-アセチルベンゾ[b]チオフェン-2-カルボン酸メチル（以下、本発明化合物54と記す。）277mgを得た。

本発明化合物54



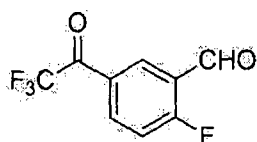
¹H-NMR (CDCl₃) δ: 8.48 (d, 1H, J = 1.8 Hz), 8.15 (s, 1H), 8.06 (dd, 1H, J = 8.6, 1.8 Hz), 7.94 (d, 1H, J = 8.6 Hz), 3.97 (s, 3H), 2.70 (s, 3H).

[0567]

製造例32

工程1

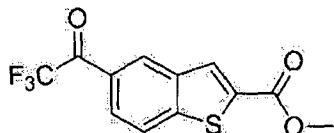
マグネシウム895mgおよびテトラヒドロフラン20mlの混合物に、50℃で2-(5-ブロモ-2-フルオロフェニル)-1,3-ジオキサラン7.0gおよびテトラヒドロフラン10mlの混合物を滴下し、30分間攪拌した。次に反応混合物に0℃でN-メトキシ-N-メチルトリフルオロアセトアミド3.82gを加えた後、室温下で1.5時間攪拌した。反応混合物に1M塩酸40mlを加え、還流下で3時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却後、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、2-フルオロ-5-トリフルオロアセチルベンズアルデヒド2.69gを得た。



工程 2

2-フルオロ-5-トリフルオロアセチルベンズアルデヒド 1.00 g、チオグリコール酸メチル 391 mg、炭酸カリウム 763 mg および N, N-ジメチルホルムアミド 10 ml の混合物を 80℃ で 1 時間攪拌した。反応混合物に水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を水および飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、5-トリフルオロアセチルベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル (以下、本発明化合物 55 と記す。) 462 mg を得た。

10 本発明化合物 55



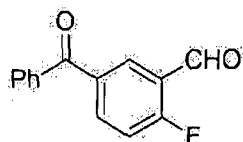
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.60 (s, 1H), 8.20-8.19 (m, 1H), 8.14-8.11 (m, 1H), 8.04-8.01 (m, 1H), 3.99 (s, 3H).

[0568]

15 製造例 33

工程 1

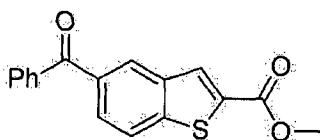
2-(5-ブロモ-2-フルオロフェニル)-1,3-ジオキサラン 2.00 g およびテトラヒドロフラン 10 ml の混合物に、-70℃ で、n-ブチルリチウム (1.6 M ヘキサン溶液) 5.1 ml を滴下し、30 分間攪拌した。反応混合物に、-70℃ で、ベンゾニトリル 919 mg およびテトラヒドロフラン 5 ml の混合物を滴下し、1 時間攪拌した。次に反応混合物を室温下で 1.5 時間攪拌後、1 M 塩酸 30 ml を加え、65℃ で 3 時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却した後、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、5-ベンゾイル-2-フルオロベンズアルデヒド 414 mg を得た。



工程 2

5-ベンゾイル-2-フルオロベンズアルデヒド 414 mg、チオグリコール酸メチル 250 mg、炭酸カリウム 501 mg および N, N-ジメチルホルムアミド 3 ml の混合物を 80℃ で 1 時間攪拌した。反応混合物に水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、5-ベンゾイルベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル (以下、本発明化合物 56 と記す。) 271 mg を得た。

本発明化合物 56



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.30 (s, 1H), 8.13 (s, 1H), 7.98–7.94 (m, 2H), 7.84–7.82 (m, 2H), 7.64–7.62 (m, 1H), 7.54–7.50 (m, 2H), 3.97 (s, 3H).

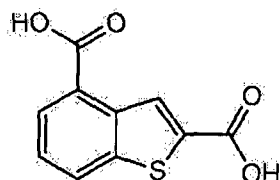
[0569]

5 製造例 34

工程 1

4-シアノベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル 250 mg、水酸化ナトリウム 608 mg、水 2 ml およびメタノール 3 ml の混合物を還流下で 14 時間攪拌した。

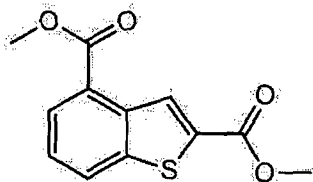
- 10 反応混合物を室温まで冷却後、水 5 ml および濃塩酸 2 ml を加え、析出した固体をろ過により集め、減圧下で乾燥し、ベンゾ [b] チオフェン-2, 4-ジカルボン酸 331 mg を得た。



15 工程 2

ベンゾ [b] チオフェン-2, 4-ジカルボン酸 200 mg、硫酸 100 mg およびメタノール 5 ml の混合物を還流下で 23 時間攪拌した。反応混合物に水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮しベンゾ [b] チオフェン-2, 4-ジカルボン酸-2, 4-ジメチル (以下、本発明化合物 57 と記す。) 220 mg を得た。

本発明化合物 57



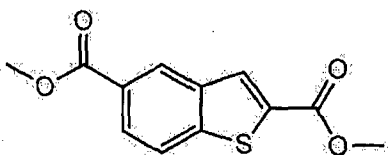
- 25 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.89 (s, 1H), 8.18–8.16 (m, 1H), 8.07–8.05 (m, 1H), 7.53–7.51 (m, 1H), 4.02 (s, 3H), 3.97 (s, 3H).

[0570]

製造例 35

- 3-ホルミル-4-ニトロ安息香酸メチル 1.00 g、チオグリコール酸メチル 609 mg、炭酸カリウム 761 mg および N, N-ジメチルホルムアミド 15 ml の混合物を 60°C で 3 時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却した。反応混合物に水を加え、酢酸エチルで 3 回抽出した。合わせた有機層を水、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、ベンゾ [b] チオフェン-2, 5-ジカルボン酸-2, 5-ジメチル (以下、本発明化合物 58 と記す。) 323 mg を得た。

本発明化合物 58



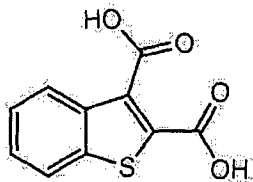
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.60-8.58 (m, 1H), 8.13-8.10 (m, 2H), 7.93-7.91 (m, 1H), 3.97 (s, 3H), 3.97 (s, 3H).

[0 5 7 1]

5 製造例 3 6

工程 1

2,3-ジヒドロ-1-ベンゾチオフェン-2,3-ジオン 1.87 g、炭酸ナトリウム 1.5 g および水 13.5 ml の混合物を室温で 1 時間攪拌した。クロロ酢酸 1.16 g、炭酸ナトリウム 0.6 g および水 5.4 ml からなる水溶液を、混合物に滴下し、80℃で 1 時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却した後、不溶物をろ別した。氷冷下でろ液に水酸化ナトリウム 15 g を加えた後、室温で 2 時間攪拌した。水溶液に氷冷下で濃塩酸を加えた後、析出した固体をろ過により集め、減圧下で乾燥し、ベンゾ[b]チオフェン-2,3-ジカルボン酸 440 mg を得た。

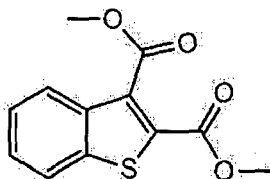


15

工程 2

ベンゾ[b]チオフェン-2,3-ジカルボン酸 280 mg、濃硫酸 200 mg およびメタノール 6 ml の混合物を 80℃で 4 時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却した後、減圧下濃縮した。残渣に酢酸エチルを加え、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液および飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、ベンゾ[b]チオフェン-2,3-ジカルボン酸-2,3-ジメチル（以下、本発明化合物 60 と記す。） 220 mg を得た。

25 本発明化合物 6 0



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.95-7.93 (m, 1H), 7.87-7.85 (m, 1H), 7.50-7.47 (m, 2H), 4.03 (s, 3H), 3.95 (s, 3H).

[0 5 7 2]

30 製造例 3 7

工程 1

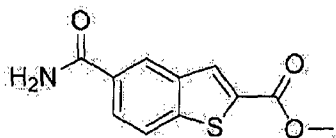
モレキュラーシーブス (4 Å) 2.00 g、塩化銅 (II) 二水和物 341 mg および水 200 ml を室温で 7 時間攪拌後、ろ取した。ろ取物を水 20 ml およびアセトン 20 ml で洗浄した後、150℃で 1 時間真空乾燥し、淡緑青色固形物 2.00 g を得た。

35

工程 2

工程 1 で得た淡緑青色固形物 500 mg、5-シアノベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル 1.00 g、アセトアルドキシム 2.8 ml およびメタノール 20 ml の混合物を、65℃で24時間攪拌した。反応混合物をろ過し、ろ液を減圧下濃縮した。残渣にアセトンを加え、不溶物をろ取し、減圧下乾燥し、5-アミノカルボニルベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル（以下、本発明化合物 61 と記す。）696 mg を得た。

本発明化合物 61



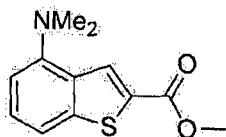
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.37-8.36 (m, 1H), 8.12 (s, 1H), 7.95-7.92 (m, 1H), 7.89-7.89 (m, 1H), 6.10 (br s, 1H), 5.64 (br s, 1H), 3.97 (s, 3H).

[0573]

製造例 38

4-アミノベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル 1.20 g、ヨウ化メチル 2.7 g、炭酸カリウム 1.76 g およびアセトニトリル 4 ml の混合物を、60℃で7時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却後、水 60 ml および酢酸エチル 60 ml を加え、不溶物をろ別し、ろ液から酢酸エチルで抽出した。合わせた有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮し、4-ジメチルアミノベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸（以下、本発明化合物 66 と記す。）255 mg を得た。

本発明化合物 66



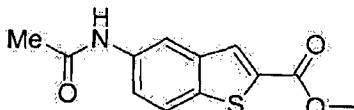
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.25 (s, 1H), 7.42-7.41 (m, 1H), 7.35-7.33 (m, 1H), 6.82-6.80 (m, 1H), 3.94 (s, 3H), 2.97 (s, 6H).

[0574]

製造例 39

5-アミノベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル 500 mg、無水酢酸 320 mg、ジイソプロピルエチルアミン 623 mg およびジクロロメタン 10 ml の混合物を室温で4時間攪拌した。反応混合物を、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液および飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、5-アセチルアミノベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル（以下、本発明化合物 67 と記す。）449 mg を得た。

本発明化合物 67



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.22-8.21 (m, 1H), 7.99 (s, 1H), 7.78-7.76 (m, 1H), 7.44-7.40 (m, 2H), 3.94 (s, 3H), 2.22 (s, 3H).

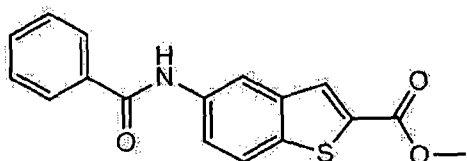
[0575]

製造例 4 0

5-アミノベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル 320 mg、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩 310 mg、安息香酸 294 mg、N,N-ジメチル-4-アミノピリジン 18.4 mg およびテトラヒドロフラン 20 ml の混合物を室温で 24 時間攪拌した。反応混合物を減圧下濃縮し、残渣に tert-ブチルメチルエーテルを加えた。有機層を 1 M 塩酸、1 M 水酸化ナトリウム水溶液および飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮し、5-ベンゾイルアミノベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル (以下、本発明化合物 68 と記す。

) 318 mg を得た。

本発明化合物 68



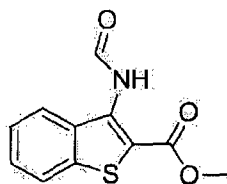
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.40 (br s, 1H), 8.05 (s, 1H), 7.91-7.90 (m, 3H), 7.86-7.84 (m, 1H), 7.58-7.53 (m, 4H), 3.96 (s, 3H).

[0576]

製造例 4 1

無水酢酸 5.60 g および蟻酸 3.11 g の混合物を 60 °C で 2 時間攪拌した。混合物を室温まで冷却後、テトラヒドロフラン 10 ml を加えた。この混合物に、3-アミノベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル 4.37 g およびテトラヒドロフラン 50 ml の混合物を氷冷下で滴下した。反応混合物を室温で 2 時間攪拌した。反応混合物を減圧濃縮し、残渣をテトラヒドロフランから再結晶し、3-ホルミルアミノベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル (以下、本発明化合物 69 と記す。) 4.06 g を得た。

本発明化合物 69



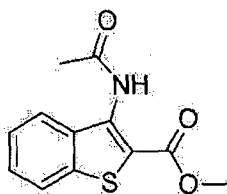
$^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$) δ : 10.45 (br s, 1H), 8.45-8.43 (m, 1H), 8.05-8.03 (m, 1H), 7.90 (br s, 1H), 7.60-7.58 (m, 1H), 7.51-7.49 (m, 1H), 3.84 (s, 3H).

[0577]

製造例 4 2

3-アミノベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル 100 mg およびテトラヒドロフラン 2 ml の混合物を氷冷下で攪拌後、60% 水素化ナトリウム 24 mg を加えた。氷冷下で反応混合物に塩化アセチル 45 mg を滴下後、室温で 46 時間攪拌した。混合物に水を加え、析出した固体をろ過により集め、ヘキサンで洗浄後、減圧下で乾燥し、3-アセチルアミノベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル (以下、本発明化合物 70 と記す。) 82 mg を得た。

本発明化合物 70



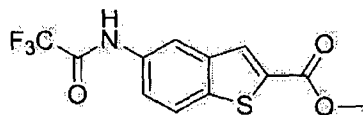
¹H-NMR (CDCl₃) δ: 9.47 (br s, 1H), 8.10–8.08 (m, 1H), 7.77–7.75 (m, 1H), 7.50–7.46 (m, 1H), 7.42–7.38 (m, 1H), 3.94 (s, 3H), 2.33 (s, 3H).

[0578]

5 製造例 43

5-アミノベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル 200 mg、無水トリフルオロ酢酸 456 mg、トリエチルアミン 205 mg およびテトラヒドロフラン 10 ml の混合物を室温で 24 時間攪拌した。反応混合物に *tert*-ブチルメチルエーテルを加え、水、1 M 塩酸、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液および飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、5-トリフルオロアセチルアミノベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル (以下、本発明化合物 71 と記す。) 260 mg を得た。

本発明化合物 71



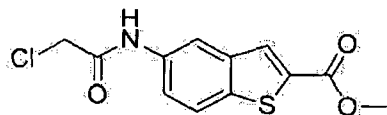
¹H-NMR (DMSO-D₆) δ: 11.48 (br s, 1H), 8.40 (d, 1H, J = 2.0 Hz), 8.27 (s, 1H), 8.11 (d, 1H, J = 8.8 Hz), 7.75 (dd, 1H, J = 8.8, 2.0 Hz), 3.92 (s, 3H).

[0579]

製造例 44

5-アミノベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル 150 mg、塩化クロロアセチル 170 mg、トリエチルアミン 304 mg およびテトラヒドロフラン 10 ml の混合物を室温で 24 時間攪拌した。反応混合物に *tert*-ブチルメチルエーテルを加え、水、1 M 塩酸、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液および飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、5-クロロアセチルアミノベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル (以下、本発明化合物 72 と記す。) 160 mg を得た。

本発明化合物 72



¹H-NMR (CDCl₃) δ: 8.36 (br s, 1H), 8.27 (s, 1H), 8.03 (s, 1H), 7.85–7.83 (m, 1H), 7.52–7.50 (m, 1H), 4.24 (s, 2H), 3.95 (s, 3H).

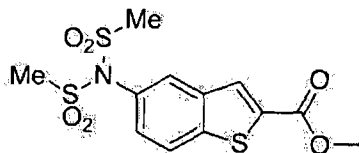
[0580]

製造例 45

工程 1

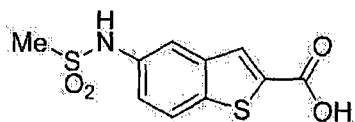
5-アミノベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル 500 mg、メタンスルホニルクロリド 552 mg、ジイソプロピルエチルアミン 623 mg およびジクロロメタン 10 ml の混合物を室温で 4 時間攪拌した。反応混合物を減圧下濃縮後、残渣に水を加え、析出した固体をろ取した。得られた固体を水

およびヘキサンで洗浄後、減圧下乾燥し、5-〔ビス(メチルスルホニル)アミノ〕ベンゾ〔b〕チオフェン-2-カルボン酸メチル 449 mg を得た。



工程 2

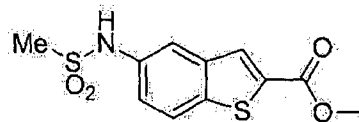
- 5 5-〔ビス(メチルスルホニル)アミノ〕ベンゾ〔b〕チオフェン-2-カルボン酸メチル 760 mg、水酸化リチウム水和物 228 mg、水 3 ml およびメタノール 6 ml の混合物を 80℃ で 2 時間攪拌した。反応混合物を減圧下濃縮し、残渣に水を加え、tert-ブチルメチルエーテルで洗浄した。水層に濃塩酸を加えた後、tert-ブチルメチルエーテルで抽出した。合わせた有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮し、5-メチルスルホニルアミノベンゾ〔b〕チオフェン-2-カルボン酸 568 mg を得た。



工程 3

- 15 5-(メチルスルホニル)アミノベンゾ〔b〕チオフェン-2-カルボン酸 406 mg、硫酸 200 mg およびメタノール 6 ml の混合物を 80℃ で 6 時間攪拌した。反応混合物に水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、5-メチルスルホニルアミノベンゾ〔b〕チオフェン-2-カルボン酸メチル (以下、本発明化合物 81 と記す。) 315 mg を得た。

本発明化合物 81



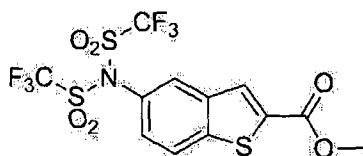
- 25 ¹H-NMR (CDCl₃) δ: 8.02 (s, 1H), 7.85 (d, 1H, J = 8.8 Hz), 7.79 (d, 1H, J = 2.3 Hz), 7.33 (dd, 1H, J = 8.8, 2.3 Hz), 6.70 (s, 1H), 3.96 (s, 3H), 3.04 (s, 3H).

[0581]

製造例 46

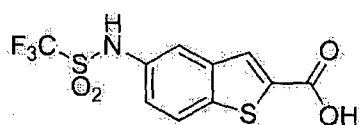
工程 1

- 30 5-アミノベンゾ〔b〕チオフェン-2-カルボン酸メチル 500 mg、トリフルオロメタンスルホン酸無水物 1.37 g、ジイソプロピルエチルアミン 623 mg およびジクロロメタン 10 ml の混合物を室温で 4 時間攪拌した。反応混合物に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、クロロホルムで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、5-〔ビス(トリフルオロメチルスルホニル)アミノ〕ベンゾ〔b〕チオフェン-2-カルボン酸メチル 500 mg を得た。



工程 2

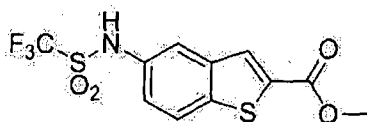
- 5-〔ビス(トリフルオロメチルスルホニル)アミノ〕ベンゾ〔b〕チオフェン-2-カルボン酸メチル 493 mg、水酸化リチウム-水和物 152 mg、
 5 水 3 ml およびメタノール 6 ml の混合物を 80℃ で 2 時間攪拌した。反応混合物を減圧下濃縮し、残渣に水を加え、tert-ブチルメチルエーテルで洗浄した。水層に濃塩酸を加えた後、tert-ブチルメチルエーテルで抽出した。合わせた有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮し、5-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)ベンゾ〔b〕チオフェン-2-カルボン酸 308 mg を得た。



工程 3

- 5-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)ベンゾ〔b〕チオフェン-2-カルボン酸 182 mg、硫酸 100 mg およびメタノール 6 ml の混合物を 80℃ で 6 時間攪拌した。反応混合物に水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、5-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)ベンゾ〔b〕チオフェン-2-カルボン酸メチル(以下、本発明化合物 83 と記す。) 169 mg を得た。

20 本発明化合物 83



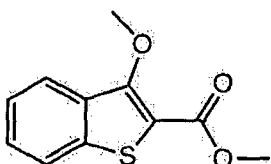
¹H-NMR (CDCl₃) δ: 8.04 (s, 1H), 7.88 (d, 1H, J = 8.7 Hz), 7.83 (d, 1H, J = 2.1 Hz), 7.38 (dd, 1H, J = 8.7, 2.1 Hz), 3.97 (s, 3H).

[0582]

25 製造例 47

- 3-ヒドロキシベンゾ〔b〕チオフェン-2-カルボン酸メチル 600 mg、ヨウ化メチル 819 mg、炭酸カリウム 797 mg および N, N-ジメチルホルムアミド 10 ml の混合物を 70℃ で 4 時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却後、tert-ブチルメチルエーテルを加え、水、1 M 水酸化ナトリウム水溶液および飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、3-メトキシベンゾ〔b〕チオフェン-2-カルボン酸メチル以下、本発明化合物 94 と記す。195 mg を得た。

本発明化合物 94



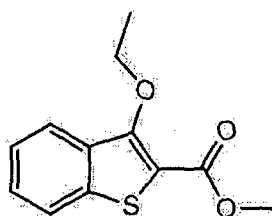
35

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.90–7.88 (m, 1H), 7.76–7.74 (m, 1H), 7.52–7.46 (m, 1H), 7.42–7.38 (m, 1H), 4.17 (s, 3H), 3.93 (s, 3H).

[0583]

製造例 48

- 5 3-ヒドロキシベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル 600 mg、ヨウ化エチル 800 mg、炭酸カリウム 797 mg および N, N-ジメチルホルムアミド 10 ml の混合物を室温で 12 時間攪拌した。反応混合物に *tert*-ブチルメチルエーテルを加え、水、1 M 水酸化ナトリウム水溶液および飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、3-エトキシベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル (以下、本発明化合物 95 と記す) 540 mg
- 10 を得た。

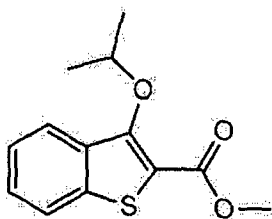


- 15 本発明化合物 95: $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.89–7.87 (m, 1H), 7.76–7.74 (m, 1H), 7.50–7.46 (m, 1H), 7.42–7.38 (m, 1H), 4.40 (q, 2H, $J = 7.0$ Hz), 3.92 (s, 3H), 1.48 (t, 3H, $J = 7.0$ Hz).

[0584]

製造例 49

- 20 3-ヒドロキシベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル 300 mg、ヨウ化イソプロピル 450 mg、炭酸カリウム 400 mg および N, N-ジメチルホルムアミド 10 ml の混合物を 70 °C で 12 時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却後、*tert*-ブチルメチルエーテルを加え、水、1 M 水酸化ナトリウム水溶液および飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、3-イソプロポキシベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル (以下、本発明化合物 96 と記す。) 321 mg を得た。
- 25



- 30 本発明化合物 96: $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.87 (d, 1H, $J = 8.0$ Hz), 7.74 (d, 1H, $J = 8.0$ Hz), 7.49–7.45 (m, 1H), 7.41–7.37 (m, 1H), 4.87–4.81 (m, 1H), 3.92 (s, 3H), 1.41–1.40 (m, 6H).

[0585]

製造例 50

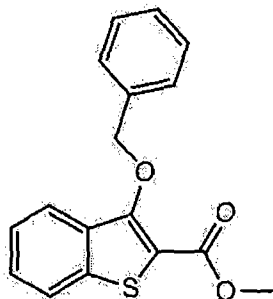
- 35 3-ヒドロキシベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル 600 mg、ベンジルブロミド 933 mg、炭酸カリウム 797 mg および N, N-ジメチルホルムアミド 10 ml の混合物を室温で 12 時間攪拌した。反応混合物に *t*

tert-ブチルメチルエーテルを加え、水、1 M水酸化ナトリウム水溶液および飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、3-ベンジロキシベンゾ [b]

チオフェン-2-カルボン酸メチル (以下、本発明化合物 97 と記す。)

560 mg を得た。

本発明化合物 97



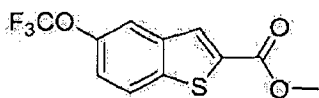
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.81-7.79 (m, 1H), 7.76-7.74 (m, 1H), 7.54-7.45 (m, 3H), 7.42-7.34 (m, 4H), 5.36 (s, 2H), 3.93 (s, 3H).

[0586]

製造例 51

2-フルオロ-5-トリフルオロメトキシベンズアルデヒド 3.00 g、チオグリコール酸メチル 1.33 g、炭酸カリウム 2.66 g および N,N-ジメチルホルムアミド 10 ml の混合物を 80 °C で 2 時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却した後、反応混合物に水を加え、酢酸エチルで 3 回抽出した。合わせた有機層を水、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮し、5-トリフルオロメトキシベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル (以下、本発明化合物 98 と記す。) 1.38 g を得た。

本発明化合物 98



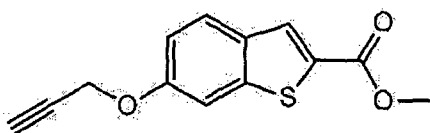
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.05 (s, 1H), 7.87 (d, 1H, $J = 8.8$ Hz), 7.73 (d, 1H, $J = 1.0$ Hz), 7.34 (dd, 1H, $J = 8.8, 1.0$ Hz), 3.96 (s, 3H).

[0587]

製造例 52

6-ヒドロキシベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル 300 mg、プロパルギルブロミド 206 mg、炭酸カリウム 260 mg およびアセトニトリル 5 ml の混合物を 60 °C で 4 時間攪拌した。反応混合物に酢酸エチルを加え、水および飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、6-プロパルギルオキシベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル (以下、本発明化合物 99 と記す。) 327 mg を得た。

本発明化合物 99



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.98 (s, 1H), 7.77 (d, 1H, $J = 8.8$ Hz), 7.40 (s, 1H), 7.

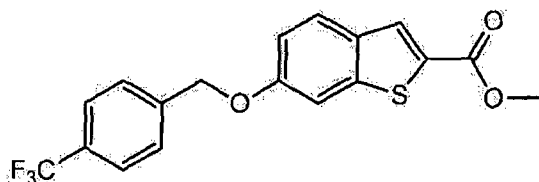
09 (d, 1H, J = 8.8 Hz), 4.78 (s, 2H), 3.93 (s, 3H), 2.57 (s, 1H).

[0588]

製造例 53

6-ヒドロキシベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル 300 mg、
4-トリフルオロメチルベンジルブロミド 414 mg、炭酸カリウム 260 mg
5 およびアセトニトリル 5 ml の混合物を 60℃ で 4 時間攪拌した。反応混合物にクロロホルムを加え、水および飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣を、ヘキサン 6 ml および酢酸エチル 18
10 ml の混合溶媒で洗浄後、減圧下で乾燥し、6-(4-トリフルオロメチルベンジルオキシ)ベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル (以下、本発明化合物 100 と記す。) 486 mg を得た。

本発明化合物 100



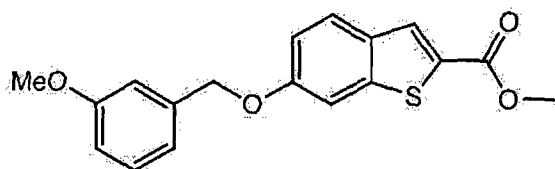
¹H-NMR (CDCl₃) δ: 7.98 (s, 1H), 7.79-7.76 (m, 1H), 7.67 (d, 2H, J = 8.1 Hz), 7.58 (d, 2H, J = 8.1 Hz), 7.35 (s, 1H), 7.12-7.10 (m, 1H), 5.21 (s, 2H),
15 3.93 (s, 3H).

[0589]

製造例 54

6-ヒドロキシベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル 300 mg、
3-メトキシベンジルブロミド 348 mg、炭酸カリウム 260 mg およびア
20 セトニトリル 5 ml の混合物を 60℃ で 4 時間攪拌した。反応混合物に酢酸エチルを加え、水および飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、6-(
25 3-メトキシベンジルオキシ)ベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル (以下、本発明化合物 101 と記す。) 442 mg を得た。

本発明化合物 101



¹H-NMR (CDCl₃) δ: 7.97 (s, 1H), 7.75 (d, 1H, J = 8.8 Hz), 7.35 (d, 1H, J = 2.3 Hz), 7.33-7.31 (m, 1H), 7.10 (dd, 1H, J = 8.8, 2.3 Hz), 7.04-7.01 (m,
30 2H), 6.90-6.87 (m, 1H), 5.12 (s, 2H), 3.92 (s, 3H), 3.83 (s, 3H).

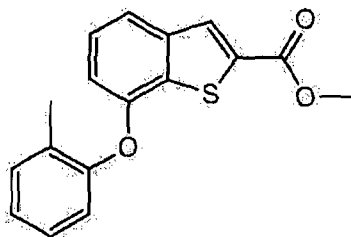
[0590]

製造例 55

7-ヒドロキシベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル 450 mg、
2-ヨードトルエン 565 mg、ヨウ化銅 (I) 41.1 mg、炭酸セシウム
35 1.41 g、N, N-ジメチルグリシン塩酸塩 90.4 mg および 1, 4-ジオキササン 5 ml の混合物を、還流下で 23 時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却後、水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を水、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラ

ムクロマトグラフィーに付し、7-(2-メチルフェノキシ)ベンゾ[b]チオフェン-2-カルボン酸メチル(以下、本発明化合物102と記す。)91 mgを得た。

本発明化合物102



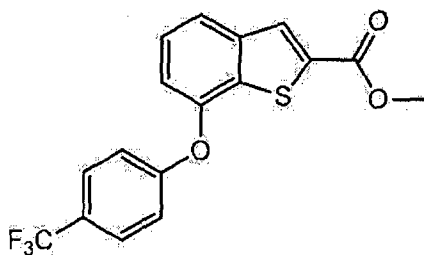
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.10 (s, 1H), 7.59-7.57 (m, 1H), 7.31-7.28 (m, 2H), 7.22-7.18 (m, 1H), 7.14-7.12 (m, 1H), 7.01-6.99 (m, 1H), 6.71-6.69 (m, 1H), 3.95 (s, 3H), 2.26 (s, 3H).

[0591]

10 製造例56

7-ヒドロキシベンゾ[b]チオフェン-2-カルボン酸メチル450 mg、4-ヨードベンゾトリフルオリド705 mg、ヨウ化銅(I)41.1 mg、炭酸セシウム1.41 g、N,N-ジメチルグリシン塩酸塩90.4 mgおよび1,4-ジオキサン5 mlの混合物を、還流下で23時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却後、水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を水、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、7-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)ベンゾ[b]チオフェン-2-カルボン酸メチル(以下、本発明化合物103と記す。)333 mgを得た。

20 本発明化合物103



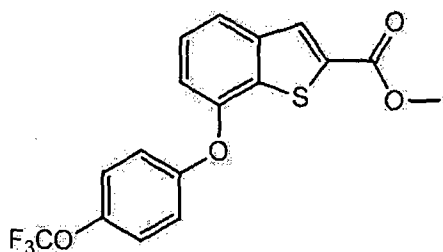
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.11 (s, 1H), 7.74-7.72 (m, 1H), 7.61 (d, 2H, $J = 8.6$ Hz), 7.42-7.40 (m, 1H), 7.12 (d, 2H, $J = 8.6$ Hz), 7.07-7.05 (m, 1H), 3.94 (s, 3H).

25 [0592]

製造例57

7-ヒドロキシベンゾ[b]チオフェン-2-カルボン酸メチル450 mg、1-ヨード-4-(トリフルオロメトキシ)ベンゼン746 mg、ヨウ化銅(I)41.1 mg、炭酸セシウム1.41 g、N,N-ジメチルグリシン塩酸塩90.4 mgおよび1,4-ジオキサン5 mlの混合物を、還流下で23時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却後、水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を水、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、7-[4-(トリフルオロメトキシ)フェノキシ]ベンゾ[b]チオフェン-2-カ

ルボン酸メチル（以下、本発明化合物 104 と記す。） 241 mg を得た。
本発明化合物 104



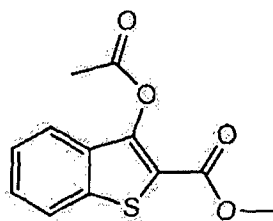
¹H-NMR (CDCl₃) δ: 8.10 (s, 1H), 7.68-7.66 (m, 1H), 7.38-7.36 (m, 1H), 7.22 (d, 2H, J = 9.1 Hz), 7.09 (d, 2H, J = 9.1 Hz), 6.97-6.95 (m, 1H), 3.94 (s, 3H).

[0593]

製造例 58

3-ヒドロキシベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル 300 mg、塩化アセチル 294 mg、トリエチルアミン 291 mg およびテトラヒドロフラン 10 ml の混合物を室温で 12 時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却後、減圧濃縮した。残渣に tert-ブチルメチルエーテルを加え、水、1 M 塩酸、1 M 水酸化ナトリウム水溶液および飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮し、3-アセチルオキシベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル（以下、本発明化合物 105 と記す。） 343 mg を得た。

本発明化合物 105



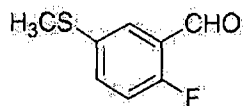
¹H-NMR (CDCl₃) δ: 7.82-7.80 (m, 1H), 7.73-7.71 (m, 1H), 7.53-7.49 (m, 1H), 7.45-7.41 (m, 1H), 3.91 (s, 3H), 2.48 (s, 3H).

[0594]

製造例 59

工程 1

2-(5-ブロモ-2-フルオロフェニル)-1,3-ジオキソラン 2.27 g およびテトラヒドロフラン 10 ml の混合物に、-70℃で、n-ブチルリチウム (1.6 M ヘキサン溶液) 6.0 ml を滴下し、30 分間攪拌した。反応混合物に、-70℃で、ジメチルジスルフィド 1.04 g およびテトラヒドロフラン 10 ml の混合物を滴下し、1 時間攪拌した。次に反応混合物を室温下で 1.5 時間攪拌後、1 M 塩酸 30 ml を加え、65℃で 3 時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却した後、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、2-フルオロ-5-メチルチオベンズアルデヒド 1.00 g を得た。



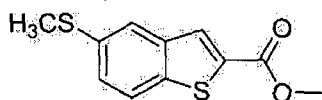
工程 2

2-フルオロ-5-メチルチオベンズアルデヒド 1.00 g、チオグリコール酸メチル 811 mg、炭酸カリウム 1.62 g および N, N-ジメチルホルムアミド 10 ml の混合物を 80 °C で 1 時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却した後、反応混合物に水を加え、酢酸エチルで 3 回抽出した。合わせた有機層を水、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、5-メチルチオベンゾ[

b] チオフェン-2-カルボン酸メチル (以下、本発明化合物 108 と記す。

) 385 mg を得た。

本発明化合物 108



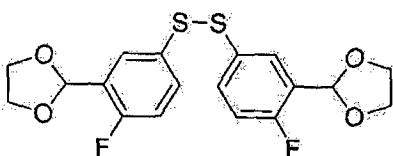
¹H-NMR (CDCl₃) δ: 7.98 (s, 1H), 7.76 (d, 1H, J = 8.6 Hz), 7.72 (d, 1H, J = 2.0 Hz), 7.39 (dd, 1H, J = 8.6, 2.0 Hz), 3.95 (s, 3H), 2.55 (s, 3H).

[0595]

製造例 60

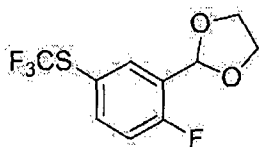
工程 1

マグネシウム 895 mg および テトラヒドロフラン 20 ml の混合物に、50 °C で 2-(5-ブロモ-2-フルオロフェニル)-1,3-ジオキソラン 7.0 g および テトラヒドロフラン 10 ml の混合物を滴下し、30 分間攪拌した。次に反応混合物に 0 °C で硫黄 1.36 g を加えた後、室温下で 1.5 時間攪拌した。反応混合物に飽和塩化アンモニウム水溶液 50 ml および酢酸エチル 50 ml を加え、不溶物をろ別した。ろ液より、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、[3-(1,3-ジオキソラン-2-イル)-4-フルオロフェニル]ジスルフィド 3.78 g を得た。



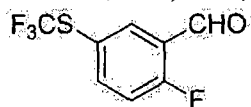
工程 2

[3-(1,3-ジオキソラン-2-イル)-4-フルオロフェニル]ジスルフィド 804 mg、水素化ホウ素ナトリウム 267 mg および テトラヒドロフラン 10 ml の混合物を、室温下で 10 時間攪拌した。反応混合物に飽和塩化アンモニウム水溶液 50 ml を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下濃縮した。得られた残渣およびジクロロメタン 10 ml の混合物に、-78 °C で 1-トリフルオロメチル-3,3-ジメチル-1,2-ベンゾヨードキソール 734 mg およびジクロロメタン 5 ml の混合物を加え、3 時間攪拌した。次に反応混合物を室温で 20 時間攪拌した後、シリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、3-(1,3-ジオキソラン-2-イル)-4-フルオロ-1-トリフルオロメチルチオベンゼン 785 mg を得た。



工程 3

- 3- (1, 3-ジオキソラン-2-イル) -4-フルオロ-1-トリフルオロ
 5 メチルチオベンゼン 785 mg および テトラヒドロフラン 10 ml の混合物に、
 1 M 塩酸 6 ml を加え、還流下で 10 時間攪拌した。反応混合物を室温まで
 冷却した後、水 40 ml を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水
 で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下濃縮し、残渣をシリカゲルカ
 ラムクロマトグラフィーに付し、2-フルオロ-5-トリフルオロメチルチオ
 ベンズアルデヒド 604 mg を得た。

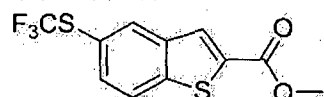


10

工程 4

- 2-フルオロ-5-(トリフルオロメチルチオ)ベンズアルデヒド 600 mg
 、チオグリコール酸メチル 369 mg、炭酸カリウム 556 mg および N, N-
 15 ジメチルホルムアミド 6 ml の混合物を 80 °C で 1 時間攪拌した。反応混
 合物を室温まで冷却した後、反応混合物に水を加え、酢酸エチルで 3 回抽出した。
 合わせた有機層を水、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した。
 減圧下濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、5-トリ
 フルオロメチルチオベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル (以下、
 本発明化合物 109 と記す。) 489 mg を得た。

- 20 本発明化合物 109



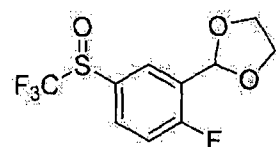
¹H-NMR (CDCl₃) δ: 8.20 (s, 1H), 8.08 (s, 1H), 7.92 (d, 1H, J = 8.6 Hz), 7.
 69 (d, 1H, J = 8.6 Hz), 3.97 (3H, s).

[0596]

- 25 製造例 61

工程 1

- 3- (1, 3-ジオキソラン-2-イル) -4-フルオロ-1- (トリフルオ
 ロメチルチオ) ベンゼン 609 mg および クロロホルム 10 ml の混合物に、
 0 °C で m-クロロ過安息香酸 588 mg (c a. 70 %) を加えた。反応混
 30 合物を室温に戻し、19 時間攪拌した。混合物に、飽和炭酸水素ナトリウム水溶
 液を加え、クロロホルムで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マ
 グネシウムで乾燥した。減圧下濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマト
 グラフィーに付し、3- (1, 3-ジオキソラン-2-イル) -4-フルオロ-1-
 トリフルオロメチルスルフィニルベンゼン 506 mg を得た。



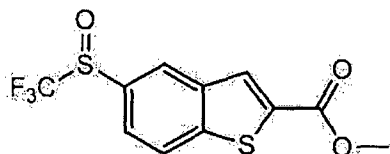
35

工程 2

3- (1, 3-ジオキソラン-2-イル) -4-フルオロ-1-トリフルオロ

メチルスルフィニルベンゼン 504 ml およびテトラヒドロフラン 5 ml の混合物に、1 M 塩酸 5 ml を加え、還流下で 15 時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却した後、水 20 ml を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下濃縮した。得られた残渣 432 mg、チオグリコール酸メチル 210 mg、炭酸カリウム 323 mg および N, N-ジメチルホルムアミド 5 ml の混合物を 80℃ で 2 時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却した後、反応混合物に水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を水、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、5-(トリフルオロメチルスルフィニル)ベンゾ[b]チオフェン-2-カルボン酸メチル (以下、本発明化合物 110 と記す。) 409 mg を得た。

本発明化合物 110



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.36 (s, 1H), 8.16 (d, 1H, $J = 0.8$ Hz), 8.10 (d, 1H, $J = 8.6$ Hz), 7.80 (dd, 1H, $J = 8.6, 0.8$ Hz), 3.99 (s, 3H).

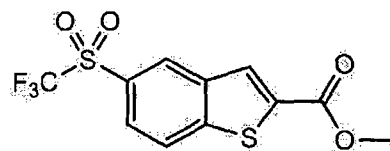
[0597]

製造例 62

3-(1,3-ジオキソラン-2-イル)-4-フルオロ-1-トリフルオロメチルチオベンゼン 450 mg およびクロロホルム 10 ml の混合物に、0℃ で m-クロロ過安息香酸 1.03 g (ca. 70%) を加えた。反応混合物を室温に戻し、28 時間攪拌した。

混合物に、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、クロロホルムで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した。得られた残渣およびテトラヒドロフラン 5 ml の混合物に、1 M 塩酸 5 ml を加え、還流下で 15 時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却した後、水 20 ml を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下濃縮した。得られた残渣 432 mg、チオグリコール酸メチル 196 mg、炭酸カリウム 302 mg および N, N-ジメチルホルムアミド 5 ml の混合物を 80℃ で 2 時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却した後、反応混合物に水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を水、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、5-(トリフルオロメチルスルホニル)ベンゾ[b]チオフェン-2-カルボン酸メチル (以下、本発明化合物 111 と記す。) 178 mg を得た。

本発明化合物 111



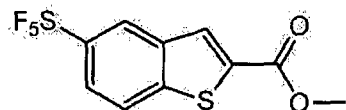
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.60 (s, 1H), 8.22-8.21 (m, 1H), 8.16-8.14 (m, 1H), 8.03-8.01 (m, 1H), 4.00 (s, 3H).

[0598]

製造例 63

2-フルオロ-5-ペンタフルオロスルフラニルベンズアルデヒド 1. 20 g、チオグリコール酸メチル 520 mg、炭酸カリウム 607 mg および N, N-ジメチルホルムアミド 15 ml の混合物を 60℃ で 2 時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却した。反応混合物に水を加え、tert-ブチルメチルエーテルで 3 回抽出した。合わせた有機層を水、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮し、5-ペンタフルオロスルフラニルベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル (以下、本発明化合物 117 と記す。) 1.40 g を得た。

本発明化合物 117



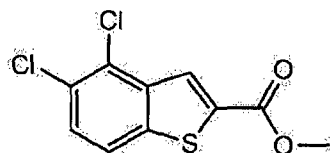
¹H-NMR (CDCl₃) δ: 8.29 (d, 1H, J = 2.2 Hz), 8.13 (s, 1H), 7.94 (d, 1H, J = 9.0 Hz), 7.83 (dd, 1H, J = 9.0, 2.2 Hz), 3.99 (s, 3H).

[0599]

製造例 64

2,3-ジクロロ-6-フルオロベンズアルデヒド 2. 0 g、チオグリコール酸メチル 1.16 g、炭酸カリウム 1.87 g および N, N-ジメチルホルムアミド 20 ml の混合物を室温で 12 時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却した。反応混合物に水を加え、tert-ブチルメチルエーテルで 3 回抽出した。合わせた有機層を水、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣をメタノールから再結晶し、4,5-ジクロロベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル (以下、本発明化合物 118 と記す。) 2.03 g を得た。

本発明化合物 118



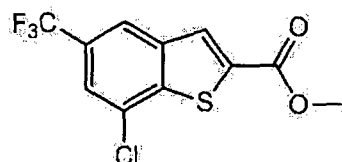
¹H-NMR (CDCl₃) δ: 8.18 (s, 1H), 7.68 (d, 1H, J = 8.7 Hz), 7.51 (d, 1H, J = 8.7 Hz), 3.98 (s, 3H).

[0600]

製造例 65

3-クロロ-5-トリフルオロメチル-2-フルオロベンズアルデヒド 2. 0 g、チオグリコール酸メチル 985 mg、炭酸カリウム 1.16 g および N, N-ジメチルホルムアミド 15 ml の混合物を 60℃ で 4 時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却した。反応混合物に水を加え、tert-ブチルメチルエーテルで 3 回抽出した。合わせた有機層を水、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣をメタノールから再結晶し、7-クロロ-5-トリフルオロメチルベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル (以下、本発明化合物 122 と記す。) 2.07 g を得た。

本発明化合物 122



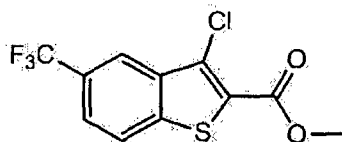
¹H-NMR (CDCl₃) δ: 8.15 (s, 1H), 8.07 (s, 1H), 7.68 (s, 1H), 4.00 (s, 3H).

[0601]

製造例 66

3-トリフルオロメチルけい皮酸 5.42 g、N,N-ジメチルホルムアミド 1.25 ml およびピリジン 0.5 ml の混合物を氷冷下で攪拌後、塩化チオニル 8.92 g を滴下した。混合物を 140℃ で 1 時間攪拌後、室温まで冷却した。混合物にメタノール 20 ml を加えた後、140℃ で 1 時間攪拌した。混合物を室温まで冷却後、水を加え、酢酸エチルで抽出した。合わせた有機層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液および飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、減圧下濃縮した。残渣にヘキサンで洗浄し、減圧下で乾燥し、3-クロロ-5-トリフルオロメチルベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル (以下、本発明化合物 123 と記す。) 234 mg を得た。

本発明化合物 123

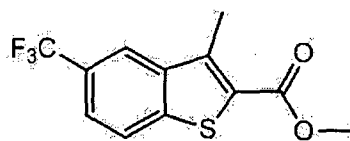


¹H-NMR (CDCl₃) δ: 8.26 (s, 1H), 7.96 (d, 1H, J = 8.6 Hz), 7.76 (d, 1H, J = 8.6 Hz), 4.00 (s, 3H).

[0602]

製造例 67

2-フルオロ-5-トリフルオロメチルアセトフェノン 1.00 g、炭酸カリウム 2.01 g、チオグリコール酸メチル 669 mg、N,N-ジメチルホルムアミド 5 ml の混合物を 80℃ で 7 時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却後、水を加え、酢酸エチルで抽出した。合わせた有機層を水および飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣にヘキサンを加え、析出した固体をろ過により集め、減圧下で乾燥し、5-トリフルオロメチル-3-メチルベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル (以下、本発明化合物 124 と記す。) 474 mg を得た。



30 本発明化合物 124 : ¹H-NMR (CDCl₃) δ: 8.10 (s, 1H), 7.94 (d, 1H, J = 8.6 Hz), 7.68 (d, 1H, J = 8.6 Hz), 3.95 (s, 3H), 2.82 (s, 3H).

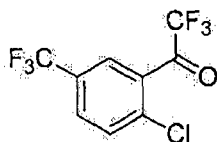
[0603]

製造例 68

工程 1

35 1-クロロ-2-ヨード-4-トリフルオロメチルベンゼン 3.00 g およびテトラヒドロフラン 15 ml の混合物に、-70℃ で、n-ブチリチウム (2.6 M ヘキサン溶液) 3.8 ml を滴下し、30 分間攪拌した。次に、N-メトキシ-N-メチルトリフルオロアセトアミド 1.69 g およびテトラヒドロフラン 5 ml の混合物を、-70℃ で滴下した。次に反応混合物を室温下で 1 時間攪拌した後、水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下濃縮し、

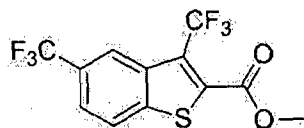
残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、2, 2, 2-トリフルオロ-1-[2-クロロ-5-トリフルオロメチルフェニル]エタノン1.66 gを得た。



5 工程 2

2, 2, 2-トリフルオロ-1-[2-クロロ-5-(トリフルオロメチル)フェニル]エタノン1.66 g、チオグリコール酸メチル422 mg、炭酸カリウム650 mgおよびN, N-ジメチルホルムアミド5 mlの混合物を80℃で2時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却した後、反応混合物に水を加え、酢酸エチルで3回抽出した。合わせた有機層を水、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、3, 5-ビス(トリフルオロメチル)ベンゾ[b]チオフェン-2-カルボン酸メチル(以下、本発明化合物125と記す。)685 mgを得た。

15 本発明化合物 1 2 5



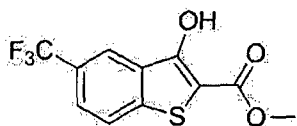
¹H-NMR (CDCl₃) δ: 8.41 (s, 1H), 8.01 (d, 1H, J = 8.6 Hz), 7.75 (d, 1H, J = 8.6 Hz), 4.01 (s, 3H).

[0604]

20 製造例 6 9

2-フルオロ-5-トリフルオロメチル安息香酸15.0 g、濃硫酸0.1 mlおよびメタノール50 mlの混合物を70℃で12時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却した後、減圧下濃縮した。残渣にtert-ブチルメチルエーテルを加え、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液および飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣にチオグリコール酸メチル7.24 g、炭酸カリウム8.6 gおよびN, N-ジメチルホルムアミド100 mlを加えた。この混合物を60℃で4時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却後、水を加え、tert-ブチルメチルエーテルで3回洗浄した。水層に濃塩酸を加えた後、tert-ブチルメチルエーテルで3回抽出した。合わせた有機層を水および飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣を酢酸エチルから再結晶し、3-ヒドロキシ-5-トリフルオロメチルベンゾ[b]チオフェン-2-カルボン酸メチル(以下、本発明化合物126と記す。)14.2 gを得た。

本発明化合物 1 2 6



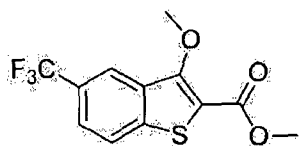
¹H-NMR (CDCl₃) δ: 10.10 (br s, 1H), 8.23 (s, 1H), 7.86 (d, 1H, J = 8.6 Hz), 7.71 (d, 1H, J = 8.6 Hz), 3.98 (s, 3H).

[0605]

製造例 7 0

3-ヒドロキシ-5-トリフルオロメチルベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル 1.20 g、ヨウ化メチル 1.2 g、炭酸カリウム 1.2 g および N, N-ジメチルホルムアミド 15 ml の混合物を室温で 12 時間攪拌した。
 5 反応混合物に tert-ブチルメチルエーテルを加え、水、1 M 水酸化ナトリウム水溶液および飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、粗精製物を得た。粗精製物をメタノールから再結晶し、3-メトキシ-5-トリフルオロメチルベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル (以下、本発明化合物 127 と記す。) 574 mg を得た。

本発明化合物 127



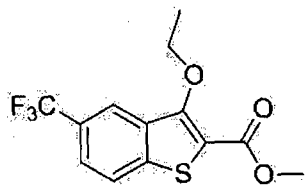
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.15 (s, 1H), 7.86 (d, 1H, $J = 8.5$ Hz), 7.69 (d, 1H, $J = 8.5$ Hz), 4.21 (s, 3H), 3.95 (s, 3H).

[0606]

製造例 7 1

3-ヒドロキシ-5-トリフルオロメチルベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル 800 mg、ヨウ化エチル 631 mg、炭酸カリウム 801 mg および N, N-ジメチルホルムアミド 20 ml の混合物を室温で 12 時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却後、tert-ブチルメチルエーテルを加え、1 M 水酸化ナトリウム水溶液、水、および飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮し、3-エトキシ-5-トリフルオロメチルベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル (以下、本発明化合物 128 と記す。) 480 mg を得た。

本発明化合物 128



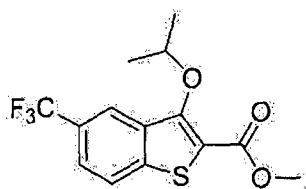
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.13 (s, 1H), 7.87-7.85 (m, 1H), 7.69-7.67 (m, 1H), 4.45 (q, 2H, $J = 7.0$ Hz), 3.93 (s, 3H), 1.50 (d, 3H, $J = 7.0$ Hz).

[0607]

製造例 7 2

3-ヒドロキシ-5-トリフルオロメチルベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル 812 mg、ヨウ化イソプロピル 985 mg、炭酸カリウム 802 mg および N, N-ジメチルホルムアミド 20 ml の混合物を室温で 12 時間攪拌した。反応混合物に tert-ブチルメチルエーテルを加え、水、1 M 水酸化ナトリウム水溶液および飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮し、3-イソプロポキシ-5-トリフルオロメチルベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル (以下、本発明化合物 129 と記す。) 766 mg を得た。

本発明化合物 1 2 9

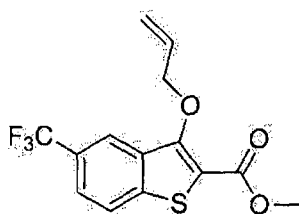


$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.12 (s, 1H), 7.87-7.84 (m, 1H), 7.69-7.66 (m, 1H), 4.92-4.88 (m, 1H), 3.94 (s, 3H), 1.42-1.40 (m, 6H).

[0608]

製造例 7 3

3-ヒドロキシ-5-トリフルオロメチルベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル 900 mg、臭化アリル 790 mg、炭酸カリウム 900 mg および N, N-ジメチルホルムアミド 10 ml の混合物を室温で 12 時間攪拌した。反応混合物に tert-ブチルメチルエーテルを加え、水および飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、粗精製物を得た。粗精製物をメタノールから再結晶し、3-アリルオキシ-5-トリフルオロメチルベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル (以下、本発明化合物 130 と記す。) 673 mg を得た。

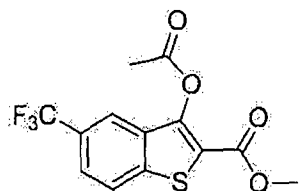


本発明化合物 130: $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.15-8.14 (m, 1H), 7.86 (d, 1H, $J = 8.5$ Hz), 7.69 (d, 1H, $J = 8.5$ Hz), 6.19-6.09 (m, 1H), 5.46-5.41 (m, 1H), 5.33-5.29 (m, 1H), 4.91-4.89 (m, 2H), 3.94 (s, 3H).

[0609]

製造例 7 4

3-ヒドロキシ-5-トリフルオロメチルベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル 500 mg、塩化アセチル 378 mg、トリエチルアミン 377 mg および テトラヒドロフラン 20 ml の混合物を室温で 12 時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却後、減圧濃縮した。残渣に tert-ブチルメチルエーテルを加え、水、1 M 塩酸、1 N 飽和炭酸水素ナトリウム水溶液および飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮し、3-アセチルオキシ-5-トリフルオロメチルベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル (以下、本発明化合物 131 と記す。) 550 mg を得た。



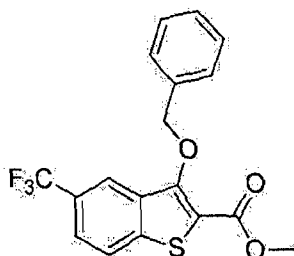
本発明化合物 131: $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.99 (s, 1H), 7.93 (d, 1H, $J = 8.5$ Hz), 7.72 (d, 1H, $J = 8.5$ Hz), 3.93 (s, 3H), 2.50 (s, 3H).

[0610]

製造例 75

3-ヒドロキシ-5-トリフルオロメチルベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル 1.51 g、ベンジルブロミド 1.86 g、炭酸カリウム 1.50 g および N, N-ジメチルホルムアミド 10 ml の混合物を室温で 12 時間攪拌した。反応混合物に tert-ブチルメチルエーテルを加え、水、1 M 水酸化ナトリウム水溶液および飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、3-ベンジロキシ-5-トリフルオロメチルベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル (以下、本発明化合物 132 と記す。) 1.18 g を得た。

本発明化合物 132



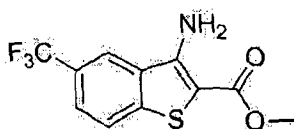
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.96 (s, 1H), 7.86-7.84 (m, 1H), 7.66-7.64 (m, 1H), 7.49-7.47 (m, 2H), 7.40-7.35 (m, 3H), 5.39 (s, 2H), 3.95 (s, 3H).

[0611]

製造例 76

2-クロロ-5-トリフルオロメチルベンゾニトリル 15.0 g、チオグリコール酸メチル 7.10 g、炭酸カリウム 9.70 g および N, N-ジメチルホルムアミド 100 ml を加えた。この混合物を 60 °C で 8 時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却後、水を加え、tert-ブチルメチルエーテルで 3 回抽出した。合わせた有機層を水および飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、3-アミノ-5-トリフルオロメチルベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル (以下、本発明化合物 133 と記す。) 9.57 g を得た。

本発明化合物 133



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.91 (s, 1H), 7.86-7.84 (m, 1H), 7.69-7.67 (m, 1H), 5.96 (br s, 2H), 3.91 (s, 3H).

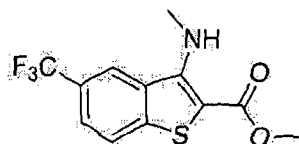
[0612]

製造例 77

3-アミノ-5-トリフルオロメチルベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル 1.50 g、ヨウ化メチル 6.00 g、炭酸カリウム 6.0 g および N, N-ジメチルホルムアミド 15 ml の混合物を 40 °C で 12 時間攪拌した。反応混合物に tert-ブチルメチルエーテルを加え、水および飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、3-(N-メチルアミノ)-5-トリフルオロメチルベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル (以下、本発明

化合物 134 と記す。) 250 mg を得た。

本発明化合物 134



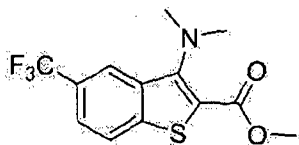
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.44 (s, 1H), 7.83-7.81 (m, 1H), 7.64-7.62 (m, 1H), 3.88 (s, 3H), 3.49 (d, 1H, $J = 5.6$ Hz), 3.46 (d, 3H, $J = 5.6$ Hz).

[0613]

製造例 78

3-アミノ-5-(トリフルオロメチル)ベンゾ[b]チオフェン-2-カルボン酸メチル 1.50 g、ヨウ化メチル 6.00 g、炭酸カリウム 6.0 g および N,N-ジメチルホルムアミド 15 ml の混合物を 40℃ で 12 時間攪拌した。反応混合物に tert-ブチルメチルエーテルを加え、水および飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、3-(N,N-ジメチルアミノ)-5-(トリフルオロメチル)ベンゾ[b]チオフェン-2-カルボン酸メチル (以下、本発明化合物 135 と記す。) 141 mg を得た。

本発明化合物 135



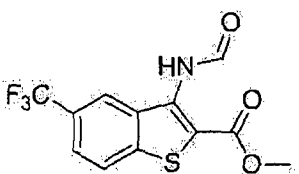
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.19 (s, 1H), 7.84-7.82 (m, 1H), 7.64-7.63 (m, 1H), 3.91 (s, 3H), 3.14 (s, 6H).

[0614]

製造例 79

無水酢酸 961 mg および蟻酸 533 mg の混合物を 60℃ で 2 時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却後、テトラヒドロフラン 10 ml を加えた。反応混合物に、3-アミノ-5-(トリフルオロメチル)ベンゾ[b]チオフェン-2-カルボン酸メチル 1.00 g およびテトラヒドロフラン 10 ml の混合物を氷冷下で滴下した。反応混合物を還流下で 6 時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却後、減圧濃縮した。残渣を酢酸エチルから再結晶し、3-ホルミルアミノ-5-(トリフルオロメチル)ベンゾ[b]チオフェン-2-カルボン酸メチル (以下、本発明化合物 136 と記す。) 940 mg を得た。

本発明化合物 136



$^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$) δ : 10.60 (br s, 1H), 8.45 (s, 1H), 8.32-8.30 (m, 2H), 7.90-7.88 (m, 1H), 3.87 (s, 3H).

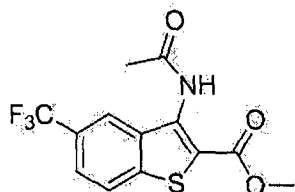
[0615]

製造例 80

3-アミノ-5-(トリフルオロメチル)ベンゾ[b]チオフェン-2-カル

ボン酸メチル 435 mg、塩化アセチル 371 mg、トリエチルアミン 460 mg およびテトラヒドロフラン 30 ml の混合物を還流下で 12 時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却後、減圧濃縮した。残渣に *tert*-ブチルメチルエーテルを加え、1 M 塩酸、1 N 飽和炭酸水素ナトリウム水溶液および飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、3-(アセチルアミノ)-5-(トリフルオロメチル)ベンゾ[b]チオフェン-2-カルボン酸メチル（以下、本発明化合物 137 と記す。）105 mg を得た。

本発明化合物 137



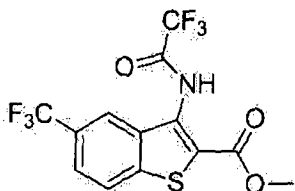
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.56 (br s, 1H), 8.44 (s, 1H), 7.87 (d, 1H, $J = 8.3$ Hz), 7.68 (d, 1H, $J = 8.3$ Hz), 3.97 (s, 3H), 2.36 (s, 3H).

[0616]

製造例 81

3-アミノ-5-(トリフルオロメチル)ベンゾ[b]チオフェン-2-カルボン酸メチル 500 mg、無水トリフルオロ酢酸 763 mg、炭酸カリウム 377 mg および N, N-ジメチルホルムアミド 20 ml の混合物を室温で 24 時間攪拌した。反応混合物に *tert*-ブチルメチルエーテルを加え、水、1 M 塩酸、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液および飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、3-(トリフルオロアセチルアミノ)-5-(トリフルオロメチル)ベンゾ[b]チオフェン-2-カルボン酸メチル（以下、本発明化合物 138 と記す。）201 mg を得た。

本発明化合物 138



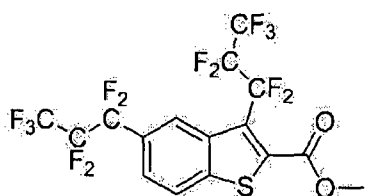
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 10.72 (br s, 1H), 8.50-8.48 (m, 1H), 7.95-7.93 (m, 1H), 7.76-7.74 (m, 1H), 4.02 (s, 3H).

[0617]

製造例 82

5-ヨードベンゾ[b]チオフェン-2-カルボン酸メチル 200 mg、1-ヨードヘプタフルオロプロパン 2.79 g、銅(0) 600 mg および N, N-ジメチルホルムアミド 20 ml の混合物を、窒素雰囲気下 150 °C で 8 時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却した後、*tert*-ブチルメチルエーテルおよび飽和アンモニア水溶液を加えた後、セライトを用いたろ過をした。ろ液を水、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、3,5-(ビスヘプタフルオロプロピル)ベンゾ[b]チオフェン-2-カルボン酸メチル（以下、本発明化合物 139 と記す。）140 mg を得た。

本発明化合物 1 3 9



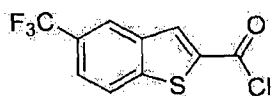
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.25 (s, 1H), 8.03 (d, 1H, $J = 8.5$ Hz), 7.71 (d, 1H, $J = 8.5$ Hz), 3.99 (s, 3H).

5 [0 6 1 8]

製造例 8 4

工程 1

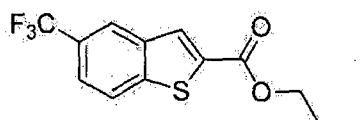
5-トリフルオロメチルベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸 3.00 g およびジクロロメタン 15 ml の混合物に、室温で塩化オキサリル 1.15 ml および N, N-ジメチルホルムアミド 47.2 μ l を加え、窒素雰囲気下で 2 時間攪拌した。反応混合物を減圧下濃縮し、5-トリフルオロメチルベンゾ [b] チオフェン-2-カルボニルクロリド 3.18 g を得た。



工程 2

15 5-トリフルオロメチルベンゾ [b] チオフェン-2-カルボニルクロリド 3.25 mg を、室温下で 1-プロパノール 2 ml に加え、1 時間攪拌した。混合物を減圧下濃縮し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、5-トリフルオロメチルベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸-1-プロピルエステル（以下、本発明化合物 1 4 4 と記す。）336 mg を得た。

20 本発明化合物 1 4 4



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.16 (s, 1H), 8.12 (s, 1H), 7.98 (d, 1H, $J = 8.3$ Hz), 7.67 (d, 1H, $J = 8.3$ Hz), 4.34-4.33 (m, 2H), 1.83-1.82 (m, 2H), 1.06-1.04 (m, 3H).

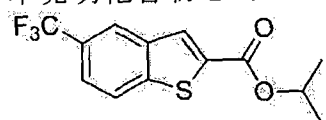
25 [0 6 1 9]

製造例 8 5

5-トリフルオロメチルベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸 400 mg および 2-プロパノール 20 ml の混合物に、氷冷下で塩化オキサリル 254 mg を加えた。この混合物を還流下で 24 時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却した後、減圧下濃縮した。

30 残渣にクロロホルムを加え、有機層を 1 M 水酸化ナトリウム水溶液および飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮し、5-トリフルオロメチルベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸-1-イソプロピルエステル（以下、本発明化合物 1 4 5 と記す。）217 mg を得た。

35 本発明化合物 1 4 5



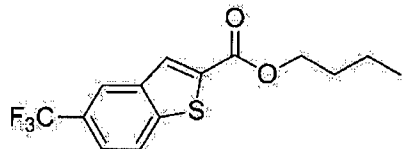
$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 8.14(s, 1H), 8.12(s, 1H), 7.98(d, 1H, $J=8.5\text{Hz}$), 7.67(d, 1H, $J=8.5\text{Hz}$), 5.28(m, 1H), 1.41(m, 6H).

[0620]

製造例 86

- 5 5-トリフルオロメチルベンゾ [b] チオフェン-2-カルボニルクロリド 325 mg を、室温下で 1-ブタノール 2 ml に加え、1.5 時間攪拌した。混合物を減圧下濃縮し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、5-トリフルオロメチルベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸-1-ブチルエステル (以下、本発明化合物 146 と記す。) 349 mg を得た。

10 本発明化合物 146



$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 8.16 (s, 1H), 8.11 (s, 1H), 7.97 (d, 1H, $J = 8.6 \text{ Hz}$), 7.66 (d, 1H, $J = 8.6 \text{ Hz}$), 4.39-4.37 (m, 2H), 1.79-1.75 (m, 2H), 1.52-1.48 (m, 2H), 1.01-0.99 (m, 3H).

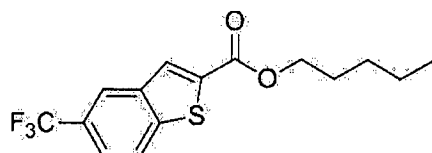
15

[0621]

製造例 87

- 5-トリフルオロメチルベンゾ [b] チオフェン-2-カルボニルクロリド 325 mg を、室温下で n-アミルアルコール 2 ml に加え、67 時間攪拌した。混合物を減圧下濃縮し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、5-トリフルオロメチルベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸-1-ペンチルエステル (以下、本発明化合物 147 と記す。) 380 mg を得た。

本発明化合物 147



25

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 8.16 (s, 1H), 8.11 (s, 1H), 7.98 (d, 1H, $J = 8.6 \text{ Hz}$), 7.67 (d, 1H, $J = 8.6 \text{ Hz}$), 4.37-4.36 (m, 2H), 1.81-1.77 (m, 2H), 1.45-1.41 (m, 4H), 0.96-0.93 (m, 3H).

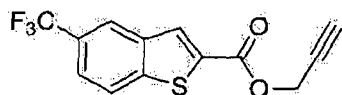
[0622]

30 製造例 88

- 5-トリフルオロメチルベンゾ [b] チオフェン-2-カルボニルクロリド 325 mg を、室温下でプロパルギルアルコール 2 ml に加え、67 時間攪拌した。混合物を減圧下濃縮し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、5-トリフルオロメチルベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸プロパルギルエステル (以下、本発明化合物 148 と記す。) 173 mg を得た。

35

本発明化合物 148



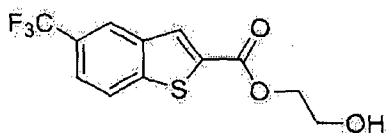
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.18-8.17 (m, 2H), 7.99 (d, 1H, $J = 8.6$ Hz), 7.69 (d, 1H, $J = 8.6$ Hz), 4.97 (d, 2H, $J = 2.5$ Hz), 2.57 (t, 1H, $J = 2.5$ Hz).

[0623]

5 製造例 89

エチレングリコール 0.5 ml、トリエチルアミン 369 μ l およびジクロロメタン 0.5 ml の混合物に、5-トリフルオロメチルベンゾ [b] チオフェン-2-カルボニルクロリド 325 mg およびジクロロメタン 0.5 ml の混合物を 0°C で滴下した。反応混合物を、室温下で 6.5 時間攪拌した。混合物に酢酸エチルを加え、不溶物をろ別した。ろ液を減圧下濃縮し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、5-トリフルオロメチルベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸 (2-ヒドロキシエチル) エステル (以下、本発明化合物 149 と記す。) 279 mg を得た。

本発明化合物 149



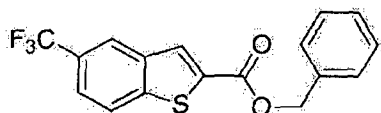
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.18-8.15 (m, 2H), 7.99 (d, 1H, $J = 8.6$ Hz), 7.69 (d, 1H, $J = 8.6$ Hz), 4.53-4.51 (m, 2H), 4.02-3.98 (m, 2H), 1.94-1.92 (m, 1H).

[0624]

製造例 90

2-トリフルオロ-5-(トリフルオロメチル)ベンズアルデヒド 5.02 g、メルカプト酢酸ベンジル 5.00 g、炭酸カリウム 4.69 g および N, N-ジメチルホルムアミド 20 ml の混合物を 60°C で 2 時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却した。反応混合物に水を加え、tert-ブチルメチルエーテルで 3 回抽出した。合わせた有機層を水、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、5-トリフルオロメチルベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸ベンジルエステル (以下、本発明化合物 150 と記す。) 6.54 g を得た。

本発明化合物 150



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.16-8.15 (m, 2H), 7.99-7.96 (m, 1H), 7.68-7.66 (m, 1H), 7.48-7.46 (m, 2H), 7.44-7.35 (m, 3H), 5.41 (s, 2H).

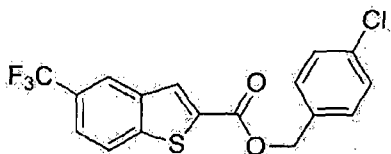
[0625]

製造例 91

5-トリフルオロメチルベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸 300 mg、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩 257 mg、N, N-ジメチル-4-アミノピリジン 14.9 mg、4-クロロベンジルアルコール 156 mg およびテトラヒドロフラン 20 ml の混合物を還流下で 12 時間攪拌した。反応混合物を減圧下濃縮し、残渣に酢酸エチルを

加えた。有機層を1 M塩酸および飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、5-トリフルオロメチルベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸 (4-クロロベンジル) エステル (以下、本発明化合物 1 5 1 と記す。) 2 9 1 m g

5 本発明化合物 1 5 1



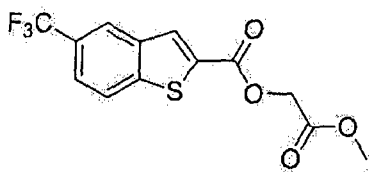
$^1\text{H-NMR}(\text{DMSO}-d_6)$ δ : 8.49(s, 1H), 8.41(s, 1H) 8.35(d, 1H, $J=8.5\text{Hz}$), 7.84(d, 1H, $J=8.5\text{Hz}$), 7.51(m, 4H), 5.41(s, 2H)

10 [0 6 2 6]

製造例 9 2

5-トリフルオロメチルベンゾ [b] チオフェン-2-カルボニルクロリド 3 2 5 m g、グリコール酸メチル 1 3 1 m g、トリエチルアミン 3 6 9 μ l およびテトラヒドロフラン 2 m l の混合物を、室温下で 6. 5 時間攪拌した。混合物を減圧下濃縮し、得られた残渣にヘキサンを加え、不溶物をろ取後、水およびヘキサンで洗浄した。ろ取物を減圧下乾燥し、5-トリフルオロメチルベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸 (メトキシカルボニル) メチルエステル (以下、本発明化合物 1 5 2 と記す。) 2 2 9 m g を得た。

本発明化合物 1 5 2



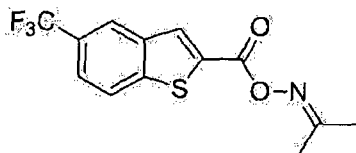
$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 8.22 (s, 1H), 8.18 (s, 1H), 8.00 (d, 1H, $J = 8.6 \text{ Hz}$), 7.69 (d, 1H, $J = 8.6 \text{ Hz}$), 4.90 (s, 2H), 3.82 (s, 3H).

[0 6 2 7]

製造例 9 3

25 アセトキシム 1 0 6 m g、トリエチルアミン 3 6 9 μ l およびジクロロメタン 2 m l の混合物に、5-トリフルオロメチルベンゾ [b] チオフェン-2-カルボニルクロリド 3 2 5 m g およびジクロロメタン 1. 5 m l の混合物を 0 $^{\circ}\text{C}$ で滴下した。反応混合物を室温下で 6. 5 時間攪拌した。混合物を減圧下濃縮し、得られた残渣に酢酸エチルを加え、不溶物をろ別した。ろ液を減圧下濃縮し、得られた残渣にヘキサンを加えて、不溶物をろ取した。ろ取物を水およびヘキサンで洗浄後、減圧下乾燥し、O-[(5-トリフルオロメチルベンゾ [b] チオフェン-2-イル) カルボニル] アセトキシム (以下、本発明化合物 1 5 3 と記す。) 3 2 5 m g を得た。

本発明化合物 1 5 3



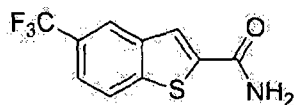
$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 8.22 (s, 1H), 8.18 (s, 1H), 7.99 (d, 1H, $J = 8.6 \text{ Hz}$), 7.

69 (d, 1H, J = 8.6 Hz), 2.17 (s, 3H), 2.15 (s, 3H).

[0628]

製造例 9 4

- 5 5-トリフルオロメチルベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸 500 mg
 およびテトラヒドロフラン 10 ml の混合物に、氷冷下で塩化オキサリル 51
 5 mg を加えた。この混合物を還流下で 3 時間攪拌した。混合物を室温まで冷
 却した後、減圧下濃縮した。残渣にテトラヒドロフラン 10 ml を加えた後、
 次に飽和アンモニア水 1 ml を加え、室温下で 1 時間攪拌した。反応混合物を
 10 減圧下濃縮し、残渣に水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を 1 M 水酸化
 ナトリウム水溶液および飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、
 減圧下濃縮し、5-トリフルオロメチルベンゾ [b] チオフェン-2-カル
 ボキサミド (以下、本発明化合物 154 と記す。) 235 mg を得た。



本発明化合物 154

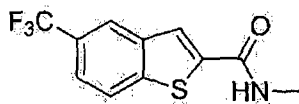
- 15 $^1\text{H-NMR}$ (DMSO- D_6) δ : 8.64-8.61 (m, 1H), 8.25-8.23 (m, 1H), 8.17-8.13 (m, 1H), 8.03-7.99 (m, 1H).

[0629]

製造例 9 5

- 20 5-トリフルオロメチルベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸 150 mg
 、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩 1
 17 mg、メチルアミン (2 M テトラヒドロフラン溶液) 2.8 ml、N,N-
 ジメチル-4-アミノピリジン 7.5 mg およびテトラヒドロフラン 10 ml
 の混合物を室温で 5 時間攪拌した。反応混合物を減圧下濃縮し、残渣にクロ
 ロホルムおよび水を加えた。有機層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、1 M 塩
 25 酸および飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮し
 た。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、N-メチル-5-トリ
 フルオロメチルベンゾ [b] チオフェン-2-カルボキサミド (以下、本発
 明化合物 155 と記す。) 100 mg を得た。

本発明化合物 155



- 30 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.10(s, 1H), 7.97(d, J=8.3 Hz, 1H), 7.80(s, 1H), 7.64(d, J
 =8.3 Hz, 1H), 3.06(m, 3H).

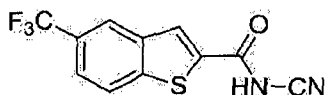
[0630]

製造例 9 6

- 35 シアナミド 61 mg、トリエチルアミン 369 μl およびジクロロメタン 1 ml
 の混合物に、5-トリフルオロメチルベンゾ [b] チオフェン-2-カルボ
 ニルクロリド 325 mg およびジクロロメタン 1 ml の混合物を 0°C で滴下し
 た。反応混合物を室温下で 6 時間攪拌した。混合物を減圧下濃縮し、得られた
 残渣に酢酸エチルを加え、不溶物をろ別した。ろ液を減圧下濃縮し、得られた
 40 残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、粗精製物を得た。得られ
 た粗精製物に酢酸エチルを加えて、飽和塩化アンモニウム水溶液および飽和食
 塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。得られた残
 渣をクロロホルムおよびヘキサンで洗浄後、減圧下乾燥し、N-シアノ-5-

トリフルオロメチルベンゾ [b] チオフェン-2-カルボキサミド (以下、本発明化合物 156 と記す。) 172 mg を得た。

本発明化合物 156

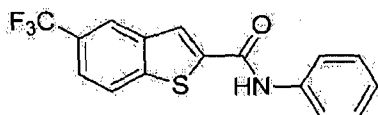


- 5 $^1\text{H-NMR}$ (Methanol- D_4) δ : 8.19 (s, 1H), 8.04 (d, 1H, $J = 8.6$ Hz), 7.99 (s, 1H), 7.62 (d, 1H, $J = 8.6$ Hz).

[0631]

製造例 97

- 5-トリフルオロメチルベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸 300 mg、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル) カルボジイミド塩酸塩 257 mg、N,N-ジメチル-4-アミノピリジン 14.9 mg、アニリン 170 mg およびテトラヒドロフラン 20 ml の混合物を室温で 18 時間攪拌した。反応混合物を減圧下濃縮し、残渣に酢酸エチルを加えた。有機層を 1 M 水酸化ナトリウム水溶液、1 M 塩酸および飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣を *tert*-ブチルメチルエーテルから再結晶をし、N-フェニル-5-トリフルオロメチルベンゾ [b] チオフェン-2-カルボキサミド (以下、本発明化合物 157 と記す。) 317 mg を得た。

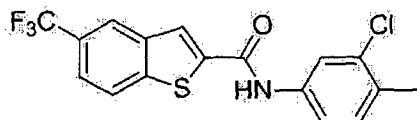


- 20 本発明化合物 157
 $^1\text{H-NMR}$ (DMSO- D_6) δ : 10.70 (br s, 1H), 8.48 (s, 1H), 8.46 (s, 1H), 8.33 (m, 1H), 7.79 (m, 2H), 7.77 (m, 1H), 7.40 (m, 2H), 7.15 (m, 1H).

[0632]

製造例 98

- 25 5-トリフルオロメチルベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸 300 mg、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル) カルボジイミド塩酸塩 257 mg、N,N-ジメチル-4-アミノピリジン 14.9 mg、4-アミノ-2-クロロトルエン 259 mg およびテトラヒドロフラン 20 ml の混合物を室温で 18 時間攪拌した。反応混合物を減圧下濃縮し、残渣に酢酸エチルを加えた。有機層を 1 M 水酸化ナトリウム水溶液、1 M 塩酸および飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣を *tert*-ブチルメチルエーテルから再結晶をし、N-(3-クロロ-4-メチルフェニル)-5-トリフルオロメチルベンゾ [b] チオフェン-2-カルボキサミド (以下、本発明化合物 158 と記す。) 270 mg を得た。



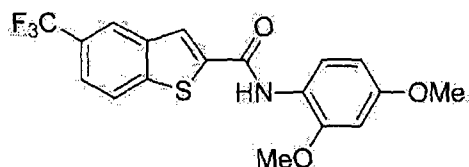
- 35 本発明化合物 158
 $^1\text{H-NMR}$ (DMSO- D_6) δ : 10.77 (br s, 1H), 8.47 (s, 1H), 8.46 (s, 1H), 8.34 (d, 1H, $J=8.5$ Hz), 7.93 (m, 1H), 7.80 (d, 1H, $J=8.5$ Hz), 7.61 (m, 1H), 7.36 (m, 1H), 2.32 (s, 3H)

- 40 [0633]

製造例 9

5-トリフルオロメチルベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸 300 mg、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル) カルボジイミド塩酸塩 257 mg、N,N-ジメチル-4-アミノピリジン 14.9 mg、2,4-ジメトキシアニリン 280 mg およびテトラヒドロフラン 20 ml の混合物を室温で 24 時間攪拌した。反応混合物を減圧下濃縮し、残渣に酢酸エチルを加えた。有機層を 1M 水酸化ナトリウム水溶液、1M 塩酸および飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、N-(2,4-ジメトキシフェニル)-5-トリフルオロメチルベンゾ [b] チオフェン-2-カルボキサミド (以下、本発明化合物 159 と記す。) 125 mg を得た。

本発明化合物 159



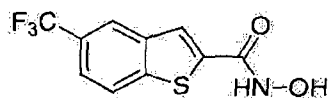
$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- D_6) δ : 9.92(br s, 1H), 8.42(m, 2H), 8.31(d, 1H, $J=8.7\text{Hz}$), 7.78(d, 1H, $J=8.7\text{Hz}$), 7.44(m, 1H), 6.68(s, 1H), 6.56(m, 1H), 3.82(s, 3H), 3.79(s, 3H).

[0634]

製造例 100

5-トリフルオロメチルベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル 1.00 g、塩酸ヒドロキシルアミン 803 mg、トリエチルアミン 276 mg およびメタノール 15 ml の混合物を還流下で 12 時間攪拌した。反応混合物を減圧下濃縮し、残渣に *tert*-ブチルメチルエーテルを加えた。有機層を 1M 塩酸および飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、N-ヒドロキシー-5-トリフルオロメチルベンゾ [b] チオフェン-2-カルボキサミド (以下、本発明化合物 160 と記す。) 217 mg を得た。

本発明化合物 160



$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- D_6) δ : 11.66 (br s, 1H), 9.37 (br s, 1H), 8.39 (s, 1H), 8.29 (d, 1H, $J = 8.5\text{ Hz}$), 8.06 (s, 1H), 7.75 (d, 1H, $J = 8.5\text{ Hz}$).

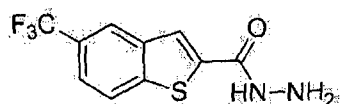
[0635]

製造例 101

5-トリフルオロメチルベンゾ [b] チオフェン-2-カルボン酸メチル 1.00 g、ヒドラジン-水和物 772 mg およびエタノール 15 ml の混合物を還流下で 12 時間攪拌した。反応混合物を減圧下濃縮した。残渣に *tert*-ブチルメチルエーテルを加えた。

有機層を 1M 塩酸および飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣を *tert*-ブチルメチルエーテルおよびエタノールから再結晶をし、N-アミノ-5-トリフルオロメチルベンゾ [b] チオフェン-2-カルボキサミド (以下、本発明化合物 161 と記す。) 595 mg を得た。

本発明化合物 1 6 1



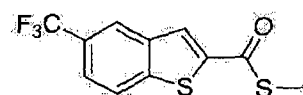
$^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$) δ : 10.21 (br s, 1H), 8.37 (s, 1H), 8.30–8.28 (m, 1H), 8.14 (s, 1H), 7.76–7.73 (m, 1H), 4.62 (br s, 2H).

5 [0 6 3 6]

製造例 1 0 2

メチルメルカプタンナトリウム 1 0 6 m g およびジクロロメタン 1 m l の混合物に、5-トリフルオロメチルベンゾ [b] チオフェン-2-カルボニルクロリド 3 2 5 m g およびジクロロメタン 2 m l の混合物を 0°C で滴下した。反応混合物を 0°C で 3. 5 時間攪拌した。混合物を減圧下濃縮し、得られた残渣に酢酸エチルを加え、不溶物をろ別した。ろ液を濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、5-トリフルオロメチルベンゾ [b] チオフェン-2-カルボチオ酸 S-メチルエステル (以下、本発明化合物 1 6 2 と記す。)

15 本発明化合物 1 6 2



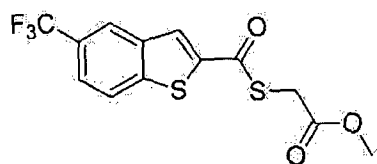
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.17 (s, 1H), 8.11 (s, 1H), 7.99 (d, 1H, $J = 8.6$ Hz), 7.68 (d, 1H, $J = 8.6$ Hz), 2.55 (s, 3H).

[0 6 3 7]

20 製造例 1 0 3

5-トリフルオロメチルベンゾ [b] チオフェン-2-カルボニルクロリド 3 2 5 m g、チオグリコール酸メチル 1 5 4 m g、トリエチルアミン 3 6 9 μ l およびテトラヒドロフラン 2 m l の混合物を、室温下で 4. 5 時間攪拌した。反応混合物をろ過し、ろ液を減圧濃縮した。得られた残渣をヘキサンで洗浄し、5-トリフルオロメチルベンゾ [b] チオフェン-2-カルボチオ酸 S-(メトキシカルボニルメチル) エステル (以下、本発明化合物 1 6 3 と記す。)

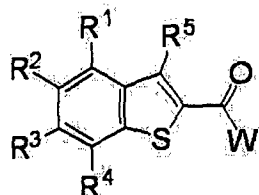
25



本発明化合物 1 6 3 : $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.19 (s, 1H), 8.16 (s, 1H), 8.00 (d, 1H, $J = 8.3$ Hz), 7.70 (d, 1H, $J = 8.3$ Hz), 3.95 (s, 2H), 3.80 (s, 3H).

30

[0 6 3 8]



(1)

本発明化合物の具体例としては、式 (1) 中の R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 および

R⁵ が表1～表7に示される基の組み合わせである化合物（本発明化合物1～163）が挙げられる。

下記の表において、Meはメチル基を表し、Etはエチル基を表し、nPrはプロピル基を表し、iPrはイソプロピル基を表し、nBuはブチル基を表し、5
、tBuはtert-ブチル基を表し、Phはフェニル基を表し、Bnはベンジル基を表す。

[0639]

[表1]

本発明 化合物	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	W	融点
1	H	H	H	H	H	MeO-	68.1 °C
2	F	H	H	H	H	MeO-	95.6 °C
3	H	F	H	H	H	MeO-	*
4	H	H	F	H	H	MeO-	91.5 °C
5	H	H	H	F	H	MeO-	84.0 °C
6	Cl	H	H	H	H	MeO-	89.4 °C
7	H	Cl	H	H	H	MeO-	-
8	H	H	Cl	H	H	MeO-	100.8 °C
9	H	H	H	Cl	H	MeO-	82.1 °C
10	H	H	H	H	Cl	MeO-	*
11	Br	H	H	H	H	MeO-	*
12	H	Br	H	H	H	MeO-	*
13	H	H	Br	H	H	MeO-	*
14	H	H	H	Br	H	MeO-	*
15	I	H	H	H	H	MeO-	*
16	H	I	H	H	H	MeO-	*
17	H	CN	H	H	H	MeO-	*
18	NO ₂	H	H	H	H	MeO-	*
19	H	NO ₂	H	H	H	MeO-	*
20	H	H	NO ₂	H	H	MeO-	*
21	H	H	H	H	NO ₂	MeO-	104.8 °C
22	Me	H	H	H	H	MeO-	-
23	H	Me	H	H	H	MeO-	-
24	H	H	Me	H	H	MeO-	*
25	H	H	H	Me	H	MeO-	-

[0640]

[表2]

本発明 化合物	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	W	融点
26	H	H	H	H	Me	MeO-	103.1 °C
27	H	t Bu	H	H	H	MeO-	-
28	H	H	H	H	CF ₃	MeO-	-
29	C ₂ F ₅	H	H	H	H	MeO-	-
30	H	C ₂ F ₅	H	H	H	MeO-	-
31	H	C ₃ F ₇	H	H	H	MeO-	-
32	H	H	H ₂ C=CH-	H	H	MeO-	-
33	H	H	HC≡C-	H	H	MeO-	-
34	Ph	H	H	H	H	MeO-	-
35	H	Ph	H	H	H	MeO-	-
36	H	H	Ph	H	H	MeO-	-
37	H	H	H	Ph	H	MeO-	-
38	H	H	H	H	Ph	MeO-	-
39	H	(2-C)Ph-	H	H	H	MeO-	-
40	H	(3-C)Ph-	H	H	H	MeO-	-
41	H	(4-C)Ph-	H	H	H	MeO-	-
42	H	H	H	(3-Me)Ph-	H	MeO-	-
43	H	(4-CF ₃)Ph-	H	H	H	MeO-	-
44	H	H	H	(2-MeO)Ph-	H	MeO-	-
45	H	H	(4-CF ₃ O)Ph-	H	H	MeO-	-
46	H	2-pyridyl-	H	H	H	MeO-	-
47	H	3-pyridyl-	H	H	H	MeO-	-
48	H	4-pyridyl-	H	H	H	MeO-	-
49	H	H	6-(trifluoro methyl)- 3-pyridyl-	H	H	MeO-	-
50	H	2-pyrimidinyl-	H	H	H	MeO-	-

[0641]

[表3]

本発明 化合物	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	W	融点
51	H	H	H	H	1-pyrrolyl-	MeO-	114.4 °C
52	2-thienyl-	H	H	H	H	MeO-	-
53	H	2-thienyl-	H	H	H	MeO-	-
54	H	MeC(O)-	H	H	H	MeO-	-
55	H	CF ₃ C(O)-	H	H	H	MeO-	-
56	H	PhC(O)-	H	H	H	MeO-	-
57	MeOC(O)-	H	H	H	H	MeO-	-
58	H	MeOC(O)-	H	H	H	MeO-	-
59	H	H	MeOC(O)-	H	H	MeO-	*
60	H	H	H	H	MeOC(O)-	MeO-	-
61	H	NH ₂ C(O)-	H	H	H	MeO-	-
62	NH ₂	H	H	H	H	MeO-	*
63	H	NH ₂	H	H	H	MeO-	*
64	H	H	NH ₂	H	H	MeO-	*
65	H	H	H	H	NH ₂	MeO-	*
66	Me ₂ N-	H	H	H	H	MeO-	-
67	H	MeC(O)NH-	H	H	H	MeO-	-
68	H	PhC(O)NH-	H	H	H	MeO-	-
69	H	H	H	H	HC(O)NH-	MeO-	-
70	H	H	H	H	MeC(O)NH-	MeO-	-
71	H	CF ₃ C(O)NH-	H	H	H	MeO-	-
72	H	ClCH ₂ C(O)NH ₂ -	H	H	H	MeO-	-
73	H	H	H	H	PhC(O)NH-	MeO-	146.1 °C
74	H	H	H	H	[(3-methyl-5-isoxazolyl)carbonyl]amino-	MeO-	208.0 °C(decomp.)
75	H	H	H	H	[(1-methyl-1H-pyrazol-3yl)carbonyl]amino-	MeO-	191.6 °C

[0642]

[表4]

本発明 化合物	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	W	融点
76	H	H	H	H	[(1,4-dimethyl-1H -pyrazol-5-yl) carbonyl]amino-	MeO-	201.9 °C(deco mp.)
77	H	H	H	H	[(1,5-dimethyl-1H -pyrazol-3-yl) carbonyl]amino-	MeO-	157.7 °C
78	H	(2-thienyl) C(O)NH-	H	H	H	MeO-	217.6 °C
79	H	H	H	H	[3-(2,5-dichloro- thienyl)]C(O)NH-	MeO-	169.9 °C
80	H	H	H	H	[2-(5-Bromo thienyl)]C(O)NH-	MeO-	136.3 °C
81	H	MeSO ₂ NH-	H	H	H	MeO-	-
82	H	BnSO ₂ NH-	H	H	H	MeO-	156.1 °C
83	H	CF ₃ SO ₂ NH-	H	H	H	MeO-	-
84	H	(4-Cl-Ph) SO ₂ NH-	H	H	H	MeO-	*
85	H	(4-Me-Ph) SO ₂ NH-	H	H	H	MeO-	*
86	H	OH	H	H	H	MeO-	*
87	H	H	OH	H	H	MeO-	*
88	H	H	H	OH	H	MeO-	*
89	H	H	H	H	OH	MeO-	*
90	MeO-	H	H	H	H	MeO-	*
91	H	MeO-	H	H	H	MeO-	*
92	H	H	MeO-	H	H	MeO-	*
93	H	H	H	MeO-	H	MeO-	*
94	H	H	H	H	MeO-	MeO-	-
95	H	H	H	H	EtO-	MeO-	-
96	H	H	H	H	iPrO-	MeO-	-
97	H	H	H	H	BnO-	MeO-	-
98	H	CF ₃ O-	H	H	H	MeO-	-
99	H	H	HC≡CCH ₂ O-	H	H	MeO-	-
100	H	H	(4-CF ₃ Bn)O-	H	H	MeO-	-

[0643]

[表5]

本発明 化合物	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	W	融点
101	H	H	(3-MeO-Bn)O-	H	H	MeO-	-
102	H	H	H	(2-Me)PhO-	H	MeO-	-
103	H	H	H	(4-CF ₃)PhO-	H	MeO-	-
104	H	H	H	(4-CF ₃ O)PhO-	H	MeO-	-
105	H	H	H	H	MeC(O)O-	MeO-	-
106	H	H	H	H	(2-ClPh) C(O)O-	MeO-	150.6 °C
107	H	H	H	H	(4-MePh) S(O) ₂ O-	MeO-	154.9 °C
108	H	MeS-	H	H	H	MeO-	-
109	H	CF ₃ S-	H	H	H	MeO-	-
110	H	CF ₃ S(O)-	H	H	H	MeO-	-
111	H	CF ₃ S(O) ₂ -	H	H	H	MeO-	-
112	H	H	H	H	MeNHS(O) ₂ -	MeO-	186.5 °C(dec omp.)
113	H	H	H	H	(4-MePh) CH ₂ NHS(O) ₂ -	MeO-	109.5 °C(dec omp.)
114	H	H	H	H	(3-ClPh) CH ₂ NHS(O) ₂ -	MeO-	*
115	H	H	H	H	[(2-pyridinyl methyl)amino] sulfonyl-	MeO-	146.2 °C(dec omp.)
116	H	H	H	H	(4-MePh) NHS(O) ₂ -	MeO-	161.2 °C(dec omp.)
117	H	SF ₅	H	H	H	MeO-	-
118	Cl	Cl	H	H	H	MeO-	-
119	Cl	H	H	H	NH ₂	MeO-	*
120	H	H	[{1-(difluoromethyl) -1H-pyrazol-3-yl-} carbonyl]amino-	H	Cl	MeO-	227.4 °C(dec omp.)
121	H	NO ₂	H	H	OH	MeO-	*
122	H	CF ₃	H	Cl	H	MeO-	-
123	H	CF ₃	H	H	Cl	MeO-	-

[0 6 4 4]

[表 6]

本発明 化合物	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	W	融点
124	H	CF ₃	H	H	Me	MeO-	-
125	H	CF ₃	H	H	CF ₃	MeO-	-
126	H	CF ₃	H	H	OH	MeO-	-
127	H	CF ₃	H	H	MeO-	MeO-	-
128	H	CF ₃	H	H	EtO-	MeO-	-
129	H	CF ₃	H	H	iPrO-	MeO-	-
130	H	CF ₃	H	H	H ₂ C=CHCH ₂ O-	MeO-	-
131	H	CF ₃	H	H	MeC(O)O-	MeO-	-
132	H	CF ₃	H	H	BnO-	MeO-	-
133	H	CF ₃	H	H	NH ₂	MeO-	-
134	H	CF ₃	H	H	MeNH-	MeO-	-
135	H	CF ₃	H	H	Me ₂ N-	MeO-	-
136	H	CF ₃	H	H	HC(O)NH-	MeO-	-
137	H	CF ₃	H	H	MeC(O)NH-	MeO-	-
138	H	CF ₃	H	H	CF ₃ CO(NH)-	MeO-	-
139	H	C ₂ F ₅	H	H	C ₂ F ₅	MeO-	-
140	H	H	CF ₃	H	NH ₂	MeO-	125.3 °C
141	H	(2-CF ₃) NHC(O)NH-	H	H	MeO-	MeO-	235.3 °C(d. ecomp.)
142	CF ₃	H	H	H	H	EtO-	50.8 °C
144	H	CF ₃	H	H	H	nPrO-	-
145	H	CF ₃	H	H	H	iPrO-	-
146	H	CF ₃	H	H	H	nBuO-	-
147	H	CF ₃	H	H	H	nC ₈ H ₁₇ O-	-
148	H	CF ₃	H	H	H	HC≡CCH ₂ O-	-
149	H	CF ₃	H	H	H	HOCH ₂ CH ₂ O-	-
150	H	CF ₃	H	H	H	BnO-	-

[0 6 4 5]

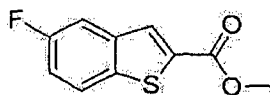
[表 7]

本発明 化合物	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	W
151	H	CF ₃	H	H	H	(4-ClBn)O-
152	H	CF ₃	H	H	H	MeOC(O)CH ₂ O-
153	H	CF ₃	H	H	H	Me ₂ C=NO-
154	H	CF ₃	H	H	H	NH ₂
155	H	CF ₃	H	H	H	MeNH-
156	H	CF ₃	H	H	H	(NC)NH-
157	H	CF ₃	H	H	H	PhNH-
158	H	CF ₃	H	H	H	(3-Cl-4-MePh) NH-
159	H	CF ₃	H	H	H	(2,4-diMeOPh) NH-
160	H	CF ₃	H	H	H	HONH-
161	H	CF ₃	H	H	H	NH ₂ NH-
162	H	CF ₃	H	H	H	MeS-
163	H	CF ₃	H	H	H	MeOC(O)CH ₂ S-

[0 6 4 6]

- 5 表 1 から表 7 の中で融点の欄に*を付した化合物について、それらの¹H-NMRデータを以下に示す。

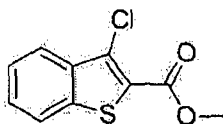
本発明化合物 3



- 10 ¹H-NMR (CDCl₃) δ : 8.01 (s, 1H), 7.81-7.79 (m, 1H), 7.54-7.52 (m, 1H), 7.24-7.22 (m, 1H), 3.95 (s, 3H).

[0 6 4 7]

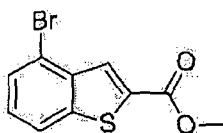
本発明化合物 10



- 15 ¹H-NMR (CDCl₃) δ : 8.00-7.97 (m, 1H), 7.84-7.82 (m, 1H), 7.56-7.48 (m, 2H), 3.97 (s, 3H).

[0 6 4 8]

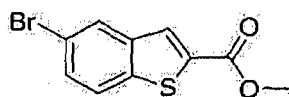
本発明化合物 11



- 20 ¹H-NMR (CDCl₃) δ : 8.19 (s, 1H), 7.80-7.78 (m, 1H), 7.59-7.57 (m, 1H), 7.31-7.29 (m, 1H), 3.97 (s, 3H).

[0 6 4 9]

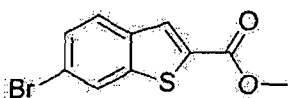
本発明化合物 1 2



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.03 (s, 1H), 7.98 (s, 1H), 7.73 (d, 1H, $J = 8.7$ Hz), 7.55 (d, 1H, $J = 8.7$ Hz), 3.96 (s, 3H).

5 [0 6 5 0]

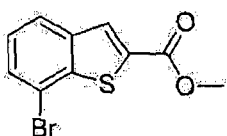
本発明化合物 1 3



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.02–8.01 (m, 2H), 7.74–7.72 (m, 1H), 7.52–7.50 (m, 1H), 3.95 (s, 3H).

10 [0 6 5 1]

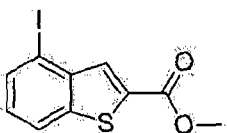
本発明化合物 1 4



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.15 (s, 1H), 7.85–7.83 (m, 1H), 7.62–7.60 (m, 1H), 7.31–7.29 (m, 1H), 3.96 (s, 3H).

15 [0 6 5 2]

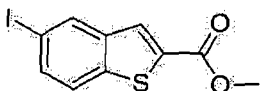
本発明化合物 1 5



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.12–8.11 (m, 1H), 7.83–7.81 (m, 2H), 7.16–7.14 (m, 1H), 3.96 (s, 3H).

20 [0 6 5 3]

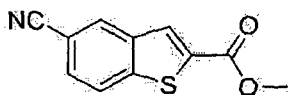
本発明化合物 1 6



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.23 (d, 1H, $J \approx 1.5$ Hz), 7.96 (s, 1H), 7.71 (dd, 1H, $J = 8.6, 1.5$ Hz), 7.61 (d, 1H, $J = 8.6$ Hz), 3.95 (s, 3H).

25 [0 6 5 4]

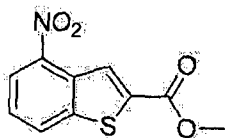
本発明化合物 1 7



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.22 (s, 1H), 8.10 (s, 1H), 7.98 (d, 1H, $J = 8.3$ Hz), 7.66 (d, 1H, $J = 8.3$ Hz), 3.98 (s, 3H).

30 [0 6 5 5]

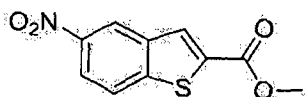
本発明化合物 1 8



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.88 (s, 1H), 8.39 (d, 1H, $J = 8.1$ Hz), 8.19 (d, 1H, $J = 8.1$ Hz), 7.61 (t, 1H, $J = 8.1$ Hz), 4.01 (s, 3H).

[0 6 5 6]

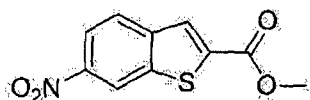
5 本発明化合物 1 9



$^1\text{H-NMR}$ (DMSO-D_6) δ : 9.01-9.00 (m, 1H), 8.46 (s, 1H), 8.37-8.32 (m, 2H), 3.93 (s, 3H).

[0 6 5 7]

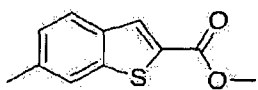
10 本発明化合物 2 0



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.82-8.80 (m, 1H), 8.28-8.25 (m, 1H), 8.14 (s, 1H), 8.02-7.99 (m, 1H), 3.99 (s, 3H).

[0 6 5 8]

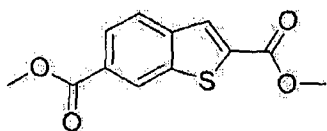
15 本発明化合物 2 4



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.01 (s, 1H), 7.76 (d, 1H, $J = 8.3$ Hz), 7.66 (s, 1H), 7.23 (d, 1H, $J = 8.3$ Hz), 3.94 (s, 3H), 2.49 (s, 3H).

[0 6 5 9]

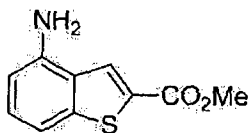
20 本発明化合物 5 9



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.60-8.58 (m, 1H), 8.10-8.08 (m, 1H), 8.07-8.05 (m, 1H), 7.93-7.91 (m, 1H), 3.98 (s, 3H), 3.97 (s, 3H).

[0 6 6 0]

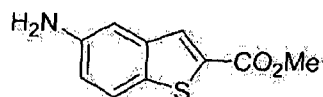
25 本発明化合物 6 2



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.05 (s, 1H), 7.26-7.25 (m, 2H), 6.63-6.62 (m, 1H), 4.17 (br s, 2H), 3.94 (s, 3H).

[0 6 6 1]

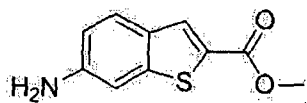
30 本発明化合物 6 3



$^1\text{H-NMR}$ (DMSO-D_6) δ : 7.92 (s, 1H), 7.65 (d, 1H, $J = 8.8$ Hz), 7.05 (d, 1H, $J = 2.2$ Hz), 6.89 (dd, 1H, $J = 8.8, 2.2$ Hz), 5.28 (br s, 2H), 3.85 (s, 3H).

[0 6 6 2]

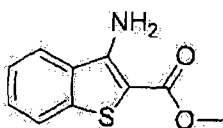
5 本発明化合物 6 4



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.91 (s, 1H), 7.63 (d, 1H, $J = 8.6$ Hz), 7.06 (d, 1H, $J = 2.3$ Hz), 6.77 (dd, 1H, $J = 8.6, 2.3$ Hz), 3.94 (br s, 2H), 3.90 (s, 3H).

[0 6 6 3]

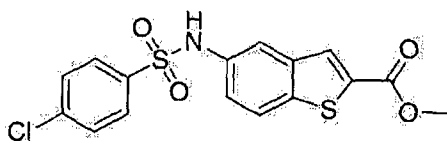
10 本発明化合物 6 5



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.74-7.72 (m, 1H), 7.65-7.63 (m, 1H), 7.49-7.46 (m, 1H), 7.38-7.36 (m, 1H), 5.91 (s, 2H), 3.89 (s, 3H).

[0 6 6 4]

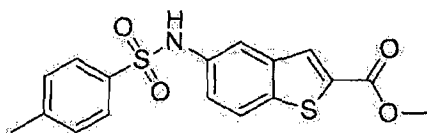
15 本発明化合物 8 4



$^1\text{H-NMR}$ (DMSO-D_6) δ : 10.54 (br s, 1H), 8.17 (s, 1H), 7.96-7.93 (m, 1H), 7.77-7.74 (m, 3H), 7.62-7.60 (m, 2H), 7.25-7.23 (m, 1H), 3.87 (s, 3H).

[0 6 6 5]

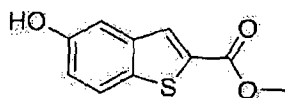
20 本発明化合物 8 5



$^1\text{H-NMR}$ (DMSO-D_6) δ : 10.40 (br s, 1H), 8.15 (s, 1H), 7.91 (d, 1H, $J = 8.8$ Hz), 7.74 (d, 1H, $J = 2.3$ Hz), 7.66 (d, 2H, $J = 8.3$ Hz), 7.32 (d, 2H, $J = 8.3$ Hz), 7.25 (dd, 1H, $J = 8.8, 2.3$ Hz), 3.87 (s, 3H), 2.30 (s, 3H).

[0 6 6 6]

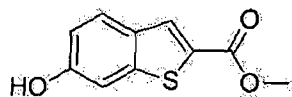
25 本発明化合物 8 6



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.94 (s, 1H), 7.71 (d, 1H, $J = 8.8$ Hz), 7.28 (d, 1H, $J = 2.5$ Hz), 7.05 (dd, 1H, $J = 8.8, 2.5$ Hz), 5.02 (br s, 1H), 3.94 (s, 3H).

[0 6 6 7]

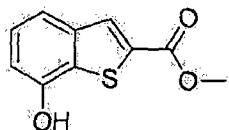
30 本発明化合物 8 7



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.97 (s, 1H), 7.75–7.73 (m, 1H), 7.28–7.27 (m, 1H), 6.97–6.95 (m, 1H), 5.33 (s, 1H), 3.93 (s, 3H).

[0668]

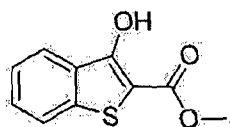
5 本発明化合物 88



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.06 (s, 1H), 7.50 (d, 1H, $J = 7.8$ Hz), 7.30 (t, 1H, $J = 7.8$ Hz), 6.85 (d, 1H, $J = 7.8$ Hz), 5.54 (s, 1H), 3.96 (s, 3H).

[0669]

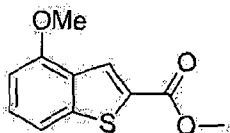
10 本発明化合物 89



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 10.13 (br s, 1H), 7.96–7.94 (m, 1H), 7.75–7.74 (m, 1H), 7.53–7.49 (m, 1H), 7.42–7.40 (m, 1H), 3.96 (s, 3H).

[0670]

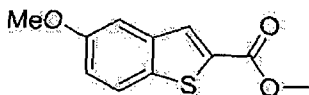
15 本発明化合物 90



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.24–8.23 (m, 1H), 7.41–7.38 (m, 2H), 6.76–6.74 (m, 1H), 3.96 (s, 3H), 3.93 (s, 3H).

[0671]

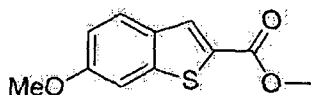
20 本発明化合物 91



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.99 (s, 1H), 7.73–7.71 (m, 1H), 7.29–7.28 (m, 1H), 7.13–7.11 (m, 1H), 3.94 (s, 3H), 3.88 (s, 3H).

[0672]

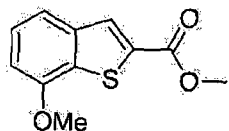
25 本発明化合物 92



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.97 (s, 1H), 7.74 (d, 1H, $J = 8.8$ Hz), 7.29 (d, 1H, $J = 2.3$ Hz), 7.02 (dd, 1H, $J = 8.8, 2.3$ Hz), 3.93 (s, 3H), 3.89 (s, 3H).

[0673]

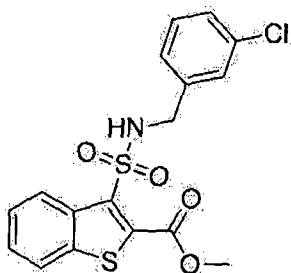
30 本発明化合物 93



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.05 (s, 1H), 7.48 (d, 1H, $J = 7.8$ Hz), 7.35 (t, 1H, $J = 7.8$ Hz), 6.86 (d, 1H, $J = 7.8$ Hz), 4.01 (s, 3H), 3.94 (s, 3H).

[0674]

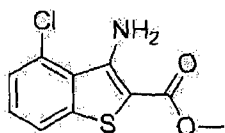
5 本発明化合物 114



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.77-8.76 (m, 1H), 7.84-7.82 (m, 1H), 7.55-7.53 (m, 2H), 7.06-6.94 (m, 4H), 4.27-4.24 (m, 2H), 3.98 (s, 3H).

[0675]

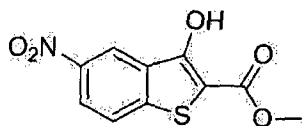
10 本発明化合物 119



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.61-7.59 (m, 1H), 7.32-7.28 (m, 2H), 6.84 (br s, 2H), 3.88 (s, 3H).

[0676]

15 本発明化合物 121



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 10.10 (s, 1H), 8.84 (s, 1H), 8.34 (d, 1H, $J = 8.8$ Hz), 7.87 (d, 1H, $J = 8.8$ Hz), 4.00 (s, 3H).

[0677]

20 製剤例 1

本発明化合物 1 ~ 163 のいずれかひとつの 10 部を、キシレン 35 部と N , N -ジメチルホル

ムアミド 35 部との混合物に溶解し、ポリオキシエチレンスチリルフェニルエーテル 14 部およびドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム 6 部を加え、良く

25 攪拌混合して各々の 10 % 乳剤を得る。

[0678]

製剤例 2

本発明化合物 1 ~ 163 のいずれかひとつの 20 部を、ラウリル硫酸ナトリウム 4 部、リグニンスルホン酸カルシウム 2 部、合成含水酸化珪素微粉末 20

30 部および珪藻土 54 部を混合した中に加え、良く攪拌混合して各々の 20 % 水和剤を得る。

[0679]

製剤例3

- 本発明化合物1～163のいずれかひとつの2部に、合成含水酸化珪素微粉末1部、リグニンスルホン酸カルシウム2部、ベントナイト30部およびカオリンクレー65部を加え充分攪拌混合する。ついでこれらの混合物に適量の水を加え、さらに攪拌し、造粒機で製粒し、通風乾燥して各々の2%粒剤を得る。

[0680]

製剤例4

- 本発明化合物1～163のいずれかひとつの1部を適量のアセトンに溶解し、これに合成含水酸化珪素微粉末5部、PAP0.3部およびフバサミクレー93.7部を加え、充分攪拌混合し、アセトンを蒸発除去して各々の1%粉剤を得る。

[0681]

15 製剤例5

- 本発明化合物1～163のいずれかひとつの10部；ポリオキシエチレンアルキルエーテルサルフェートアンモニウム塩17.5部を含むホワイトカーボン17.5部；および水55部を混合し、湿式粉砕法で微粉砕することにより、各々の10%フロアブル剤を得る。

20 [0682]

製剤例6

- 本発明化合物1～163のいずれかひとつの0.1部をキシレン5部およびトリクロロエタン5部に溶解し、これを脱臭灯油89.9部に混合して各々の0.1%油剤を得る。

[0683]

- 次に本発明組成物の植物種子への適用例を示す。

[0684]

適用例1

- 30 製剤例5にて作製したフロアブル製剤を、それぞれトウモロコシ乾燥種子100kgに対し、回転式種子処理機（シードドレッサー、Hans-Ulrich Hegel GmbH製）を用いて200ml塗沫処理することにより、各処理種子を得る。

[0685]

35 適用例2

- 製剤例5にて作製したフロアブル製剤を、それぞれコムギ乾燥種子10kgに対し、回転式種子処理機（シードドレッサー、Hans-Ulrich Hegel GmbH製）を用いて40ml塗沫処理することにより、各処理種子を得る。

40 [0686]

適用例3

- 45 製剤例5にて作製したフロアブル製剤を、それぞれイネ乾燥種子100kgに対し、回転式種子処理機（シードドレッサー、Hans-Ulrich Hegel GmbH製）を用いて200ml塗沫処理することにより、各処理種子を得る。

[0687]

試験例1 イネ水耕栽培による根部生長促進評価試験

(供試植物)

イネ (品種: 日本晴)

(栽培、化合物処理)

5 1/4倍濃度のホグランド水耕栽培液 (Hoagland and Arnon, California Agricultural Experiment Station 1950 Circular 347 pp.34) に、本発明化合物 3、9、11、14、15、20、22、23、26、27、29~31、34、35、37、38、40~4345、47、49、50、52、54~56、58、60、61、63~69、71、74、77、79、80、82、87、
10 88、95~97、100、102~104、106、108、109、114、120~124、126~129、131、133、136、139~142、144、145、147、148、150、153、157、159 および 162 のいずれかひとつを 100,000ppm の濃度で含む DMSO 溶液を 1/10,000 容添加し、本発明化合物 3、9、11、14、15、20、22、23、26、
15 27、29~31、34、35、37、38、40~4345、47、49、50、52、54~56、58、60、61、63~69、71、74、77、79、80、82、87、88、95~97、100、102~104、106、108、109、114、120~124、126~129、131、133、136、139~142、144、145、147、148、150、153、157、159 および 162 のいずれかひとつを 10ppm 含む水耕栽培液をそれぞれ調製した。無処理区としては、1/4倍濃度のホグランド水耕栽培液に DMSO を 1/10,000 容添加した水耕栽培液を使用した。

20 イネ種子を、1%次亜塩素酸ナトリウム水溶液に10分間浸漬し、次いで、70%エタノール溶液に浸漬して表面消毒し、その後、蒸留水で洗浄した。消毒後の種子を、前記の供試化合物を10ppm含む水耕栽培液に浸し、暗黒下、温度28℃で
25 3日間インキュベートし催芽処理を行った。

その後、供試化合物を10ppm含む水耕栽培液30mlを、側面をボール紙で覆って遮光したプラスチック製のチューブ (直径: 20mm×高さ: 113mm) に分注し、スチレンボードとビニール製メッシュを用いて作製したフロートを浮かべ
30 水耕栽培液水面にそのフロート上に、催芽処理後の当該イネ種子を置いて、チューブ上面の照度4,000ルクス、温度26℃、湿度50%、日長16時間で3日間栽培した。

(評価方法)

栽培後の当該イネ実生を、WinRHIZOシステム (REGENT INSTRUMENTS社製)
35)で種子根長を測定した。各試験区での、4個体又は5個体の種子根長の測定値の平均値を求めた結果、表8、9、10に示すように、本発明化合物 3、9、11、14、15、20、22、23、26、27、29~31、34、35、37、38、40~4345、47、49、50、52、54~56、58、60、61、63~69、71、74、77、79、80、82、87、88、95~97、100、102~104、106、108、109、114、
40 120~124、126~129、131、133、136、139~142、144、145、147、148、150、153、157、159 および 162 のいずれかひとつ処理した試験区は、無処理区と比較して、明らかに種子根が長かった。

[0688]

[表8]

試験化合物	種子根長相対値(%-無処理区)
本発明化合物3	>5
本発明化合物9	>5
本発明化合物11	>5
本発明化合物14	>5
本発明化合物15	>5
本発明化合物20	>5
本発明化合物22	>5
本発明化合物23	>5
本発明化合物26	>5
本発明化合物27	>5
本発明化合物29	>5
本発明化合物30	>5
本発明化合物31	>5
本発明化合物34	>5
本発明化合物35	>5
本発明化合物37	>5
本発明化合物38	>5
本発明化合物40	>5
本発明化合物41	>5
本発明化合物42	>5
本発明化合物43	>5
本発明化合物45	>5
本発明化合物47	>5
本発明化合物49	>5
本発明化合物50	>5
本発明化合物52	>5
本発明化合物54	>5
本発明化合物55	>5
本発明化合物56	>5
本発明化合物58	>5
本発明化合物60	>5
本発明化合物61	>5
本発明化合物63	>5
本発明化合物64	>5
本発明化合物65	>5

[0689]

[表9]

試験化合物	種子根長相対値(%-無処理区)
本発明化合物66	>5
本発明化合物67	>5
本発明化合物68	>5
本発明化合物69	>5
本発明化合物71	>5
本発明化合物74	>5
本発明化合物77	>5
本発明化合物79	>5
本発明化合物80	>5
本発明化合物82	>5
本発明化合物87	>5
本発明化合物88	>5
本発明化合物95	>5
本発明化合物96	>5
本発明化合物97	>5
本発明化合物100	>5
本発明化合物102	>5
本発明化合物103	>5
本発明化合物104	>5
本発明化合物106	>5
本発明化合物108	>5
本発明化合物109	>5

[0690]

[表10]

試験化合物	種子根長相対値(%-無処理区)
本発明化合物114	>5
本発明化合物120	>5
本発明化合物121	>5
本発明化合物122	>5
本発明化合物123	>5
本発明化合物124	>5
本発明化合物126	>5
本発明化合物127	>5
本発明化合物128	>5
本発明化合物129	>5
本発明化合物131	>5
本発明化合物133	>5
本発明化合物136	>5
本発明化合物139	>5
本発明化合物140	>5
本発明化合物141	>5
本発明化合物142	>5
本発明化合物144	>5
本発明化合物145	>5
本発明化合物147	>5
本発明化合物148	>5
本発明化合物150	>5
本発明化合物153	>5
本発明化合物157	>5
本発明化合物159	>5
本発明化合物162	>5

[0691]

5 試験例2 イネ水耕栽培による根部生長促進評価試験
(供試植物)

イネ (品種: 日本晴)

(栽培、化合物処理)

1/4倍濃度のホグランド水耕栽培液 (Hoagland and Arnon, California Agricultural Experiment Station 1950 Circular 347 pp.34) に、 本発明化合物1、4、5、7、8、10、13、16~18、24、25、28、32、33、36、44、46、48、53、75、76、78、90、91、94、98、99、101、105、111、112、130、132、134、135、138、146、151、152、154、155、160、161および163のいずれかひとつを10,000ppmの濃度で含むDMSO溶液を1/10,000容添加し、本発明化合物1、4、5、7、8、13、16~18、24、25、28、

32、33、36、44、46、48、53、75、76、78、90、91、94、98、99、101、105、111、112、130、132、134、135、138、146、151、152、154、155、160、161および163のいずれかひとつを1ppm含む水耕栽培液をそれぞれ調製した。無処理区としては、1/4倍濃度のホグランド水耕栽培液にDMSOを1/10,000容添加した水耕栽培液を使用した。

イネ種子を、1%次亜塩素酸ナトリウム水溶液に10分間浸漬し、次いで、70%エタノール溶液に浸漬して表面消毒し、その後、蒸留水で洗浄した。消毒後の種子を、前記の供試化合物を1ppm含む水耕栽培液に浸し、暗黒下、温度28℃で3日間インキュベートし催芽処理を行った。

その後、供試化合物を1ppm含む水耕栽培液30mlを、側面をボール紙で覆って遮光したプラスチック製のチューブ（直径：20mm×高さ：113mm）に分注し、スチレンボードとビニール製メッシュを用いて作製したフロートを浮かべ、水耕栽培液水面にそのフロート上に

、催芽処理後の当該イネ種子を置いて、チューブ上面の照度4,000ルクス、温度26℃、湿度50%、日長16時間で3日間栽培した。

（評価方法）

栽培後の当該イネ実生を、WinRHIZOシステム（REGENT INSTRUMENTS社製）で種子根長を測定した。各試験区での、4個体又は5個体の種子根長の測定値の平均値を求めた結果、表11、12に示すように、本発明化合物1、4、5、7、8、10、13、16～18、24、25、28、32、33、36、44、46、48、53、75、76、78、90、91、94、98、99、101、105、111、112、130、132、134、135、138、146、151、152、154、155、160、161および163のいずれかひとつ処理した試験区は、無処理区と比較して、明らかに種子根が長かった。

[0 6 9 2]

[表 1 1]

試験化合物	種子根長相対値(%-無処理区)
本発明化合物1	>5
本発明化合物4	>5
本発明化合物5	>5
本発明化合物7	>5
本発明化合物8	>5
本発明化合物10	>5
本発明化合物13	>5
本発明化合物16	>5
本発明化合物17	>5
本発明化合物18	>5
本発明化合物24	>5
本発明化合物25	>5
本発明化合物28	>5
本発明化合物32	>5
本発明化合物33	>5

[0693]

[表12]

試験化合物	種子根長相対値(%-無処理区)
本発明化合物36	>5
本発明化合物44	>5
本発明化合物46	>5
本発明化合物48	>5
本発明化合物53	>5
本発明化合物75	>5
本発明化合物76	>5
本発明化合物78	>5
本発明化合物90	>5
本発明化合物91	>5
本発明化合物94	>5
本発明化合物98	>5
本発明化合物99	>5
本発明化合物101	>5
本発明化合物105	>5
本発明化合物111	>5
本発明化合物112	>5
本発明化合物130	>5
本発明化合物132	>5
本発明化合物134	>5
本発明化合物135	>5
本発明化合物138	>5
本発明化合物143	>5
本発明化合物146	>5
本発明化合物151	>5
本発明化合物152	>5
本発明化合物154	>5
本発明化合物155	>5
本発明化合物160	>5
本発明化合物161	>5
本発明化合物163	>5

[0694]

- 5 試験例3 イネ水耕栽培による根部生長促進評価試験
(供試植物)

イネ(品種:日本晴)

(栽培、化合物処理)

- 10 1/4倍濃度のホグランド水耕栽培液(Hoagland and Arnon, California Agricultural Experiment Station 1950 Circular 347 pp.34)に、本発明化合物6、12、39、51、57、59、62、73、86、89、92、107、110

、113、125、137、149および156のいずれかひとつを1,000ppmの濃度で含むDMSO溶液を1/10,000容添加し、本発明化合物6、12、39、51、57、59、62、73、86、89、92、107、110、113、125、137、149および156のいずれかひとつを0.1ppm含む水耕栽培液をそれぞれ調製した。無処理区としては、1/4倍濃度のホグランド水耕栽培液にDMSOを1/10,000容添加した水耕栽培液を使用した。

イネ種子を、1%次亜塩素酸ナトリウム水溶液に10分間浸漬し、次いで、70%エタノール溶液に浸漬して表面消毒し、その後、蒸留水で洗浄した。消毒後の種子を、前記の供試化合物を0.1ppm含む水耕栽培液に浸し、暗黒下、温度28℃で3日間インキュベートし催芽処理を行った。

その後、供試化合物を0.1ppm含む水耕栽培液30mlを、側面をボール紙で覆って遮光したプラスチック製のチューブ（直径：20mm×高さ：113mm）に分注し、スチレンボードとビニール製メッシュを用いて作製したフロートを浮かべ、水耕栽培液水面にそのフロート上に、催芽処理後の当該イネ種子を置いて、チューブ上面の照度4,000ルクス、温度26℃、湿度50%、日長16時間で3日間栽培した。

（評価方法）

栽培後の当該イネ実生を、WinRHIZOシステム（REGENT INSTRUMENTS社製）で種子根長を測定した。各試験区での、4個体又は5個体の種子根長の測定値の平均値を求めた結果、表13に示すように、本発明化合物6、12、39、51、57、59、62、73、86、89、92、107、110、113、125、137、149および156のいずれかひとつ処理した試験区は、無処理区と比較して、明らかに種子根が長かった。

[0695]

[表13]

試験化合物	種子根長相対値(%-無処理区)
本発明化合物6	>5
本発明化合物12	>5
本発明化合物39	>5
本発明化合物51	>5
本発明化合物57	>5
本発明化合物59	>5
本発明化合物62	>5
本発明化合物73	>5
本発明化合物86	>5
本発明化合物89	>5
本発明化合物92	>5
本発明化合物107	>5
本発明化合物110	>5
本発明化合物113	>5
本発明化合物125	>5
本発明化合物137	>5
本発明化合物149	>5
本発明化合物156	>5

[0696]

- 5 試験例4 ベンサミアナタバコ水耕栽培による低温ストレス下での生長促進評価試験

(供試植物)

ベンサミアナタバコ (*Nicotiana benthamiana*)

(栽培、化合物処理)

- 10 本発明化合物3、4、10、12、14、22、26、28、31、39、40、42、45、54、57、58、60、65、66、68、69、71、73、76、82、89、90、97、98、101、102、104、106、108~111、116、118、123、133、139、141、142、150、155および161のいずれかひとつを濃度10,000ppmで含むDMSO溶液を調製し、1/2倍濃度のムラシゲ・スケーグ培地（水1L当たり、ムラシゲ・スケーグ培地用混合塩類（和光純薬社製）を2.3 g、ミオイノシトール（シグマアルドリッチ社製）を200 mg、ニコチン酸（和光純薬社製）を2 mg、ピリドキシン塩酸塩（和光純薬社製）を2 mg、チアミン塩酸塩（和光純薬社製）を20 mg、ショ糖（和光純薬社製）を20 g、MES（同仁化学研究所社製）を1 g含み、pH5.8に調整された培地）に、上記の本発明化合物のDMSO溶液を1/1,000容添加し、本発明化合物を濃度10ppmで含む当該培地を作製した。
- 15
- 20

ベンサミアナタバコの種子を5 μ Lの当該培地に播種し、22℃で一晩培養した。その後、本発明化合物を濃度10ppmで含む当該培地を45 μ L添加して照度4,00

0ルクス、温度22℃、日長16時間、で7日間栽培し、ベンサミアナタバコの実生を化合物で処理した。

なお、当該培地にかえて1/2倍濃度のムラシゲ・スクーグ培地にDMSOを1/1,000容添加した培地を使用して同様の処理を行った試験区を化合物無処理区とした。

(低温ストレス処理)

化合物処理したベンサミアナタバコの実生を、照度2,000ルクス、温度1.5±1.0℃、日長16時間、で7日間栽培して低温処理を行った。

(評価)

低温ストレス処理したベンサミアナタバコの実生を、照度4,000ルクス、温度22℃、日長16時間、で3日間栽培した後、スキャナライザーHTS (LemnaTec社)により緑色の葉面積を定量した。また、低温ストレス処理前の化合物無処理区の値も同様の方法で測定した。下記の計算式(1)に基づいて相対葉面積値を算出し、相対葉面積値が5以上のものを軽減効果ありとした。評価の結果、化合物無処理区の緑色葉面積に対して、本発明化合物3、4、10、12、14、22、26、28、31、39、40、42、45、54、57、58、60、65、66、68、69、71、73、76、82、89、90、97、98、101、102、104、106、108～111、116、118、123、133、139、141、142、150、155および161のいずれかひとつを10ppm処理した場合、相対葉面積値が5以上となり、本発明化合物の処理による生長促進効果が認められた。

計算式(1)：

相対葉面積＝

100*(本発明化合物処理区の緑色面積-本発明化合物無処理区の緑色面積)/(低温ストレス処理前の本発明化合物無処理区の緑色面積-本発明化合物無処理区の緑色面積)

[0697]

試験例5 ベンサミアナタバコ水耕栽培による低温ストレス下での生長促進評価試験

(供試植物)

ベンサミアナタバコ (Nicotiana benthamiana)

(栽培、化合物処理)

本発明化合物5、6、8、9、11、13、18、21、24、30、33～38、43、44、46、48、49、56、61、72、74、77、79、80、86、93、96、100、103、107、115、117、122、125、126、128、130、132、134～137、140、151および157～160のいずれかひとつを濃度1,000ppmで含むDMSO溶液を調製し、1/2倍濃度のムラシゲ・スクーグ培地(水1L当たり、ムラシゲ・スクーグ培地用混合塩類(和光純薬社製)を2.3g、ミオイノシトール(シグマアルドリッチ社製)を200mg、ニコチン酸(和光純薬社製)を2mg、ピリドキシン塩酸塩(和光純薬社製)を2mg、チアミン塩酸塩(和光純薬社製)を20mg、ショ糖(和光純薬社製)を20g、MES(同仁化学研究所社製)を1g含み、pH5.8に調整された培地)に、上記の本発明化合物のDMSO溶液を1/1,000容添加し、本発明化合物を濃度1ppmで含む当該培地を作製した。

ベンサミアナタバコの種子を5μLの当該培地に播種し、22℃で一晩培養した。その後、本発明化合物を濃度1ppmで含む当該培地を45μL添加して照度4,000

ルクス、温度22℃、日長16時間、で7日間栽培し、ベンサミアナタバコの実生を化合物で処理した。

なお、当該培地にかえて1/2倍濃度のムラシゲ・スクーグ培地にDMSOを1/1,000容添加した培地を使用して同様の処理を行った試験区を化合物無処理区とした。

(低温ストレス処理)

化合物処理したベンサミアナタバコの実生を、照度2,000ルクス、温度1.5±1.0℃、日長16時間、で7日間栽培して低温処理を行った。

(評価)

低温ストレス処理したベンサミアナタバコの実生を、照度4,000ルクス、温度22℃、日長16時間、で3日間栽培した後、スキナライザーHTS (LemnaTec社) により緑色の葉面積を定量した。また、低温ストレス処理前の化合物無処理区の値も同様の方法で測定した。下記の計算式(1)に基づいて相対葉面積値を算出し、相対葉面積値が5以上のものを軽減効果ありとした。評価の結果、化合物無処理区の緑色葉面積に対して、本発明化合物5、6、8、9、11、13、18、21、24、30、33~38、43、44、46、48、49、56、61、72、74、77、79、80、86、93、96、100、103、107、115、117、122、125、126、128、130、132、134~137、140、151および157~160のいずれかひとつを1 ppm処理した場合、相対葉面積値が5以上となり、本発明化合物の処理による生長促進効果が認められた。

計算式(1)：

相対葉面積＝

$$100 \times (\text{本発明化合物処理区の緑色面積} - \text{本発明化合物無処理区の緑色面積}) / (\text{低温ストレス処理前の本発明化合物無処理区の緑色面積} - \text{本発明化合物無処理区の緑色面積})$$

[0698]

試験例6 ベンサミアナタバコ水耕栽培による低温ストレス下での生長促進評価試験

(供試植物)

ベンサミアナタバコ (Nicotiana benthamiana)

(栽培、化合物処理)

本発明化合物1、2、7、16、17、25、29、41、47、50~52、55、59、64、75、78、85、87、88、95、99、112~114、127および154のいずれかひとつを濃度100ppmで含むDMSO溶液を調製し、1/2倍濃度のムラシゲ・スクーグ培地(水1 L当たり、ムラシゲ・スクーグ培地用混合塩類(和光純薬社製)を2.3 g、ミオイノシトール(シグマアルドリッチ社製)を200 mg、ニコチン酸(和光純薬社製)を2 mg、ピリドキシン塩酸塩(和光純薬社製)を2 mg、チアミン塩酸塩(和光純薬社製)を20 mg、ショ糖(和光純薬社製)を20 g、MES(同仁化学研究所社製)を1 g含み、pH5.8に調整された培地)に、上記の本発明化合物のDMSO溶液を1/1,000容添加し、本発明化合物を濃度0.1ppmで含む当該培地を作製した。

ベンサミアナタバコの種子を5 μLの当該培地に播種し、22℃で一晩培養した。その後、本発明化合物を濃度0.1ppmで含む当該培地を45 μL添加して照度4,000ルクス、温度22℃、日長16時間、で7日間栽培し、ベンサミアナタバコの実生を化合物で処理した。

なお、当該培地にかえて1/2倍濃度のムラシゲ・スカーグ培地にDMSOを1/1,000容添加した培地を使用して同様の処理を行った試験区を化合物無処理区とした。

(低温ストレス処理)

- 5 化合物処理したベンサミアナタバコの実生を、照度2,000ルクス、温度 $1.5 \pm 1.0^{\circ}\text{C}$ 、日長16時間、で7日間栽培して低温処理を行った。

(評価)

- 低温ストレス処理したベンサミアナタバコの実生を、照度4,000ルクス、温度 22°C 、日長16時間、で3日間栽培した後、スキャナライザーHTS (LemnaTec社) により緑色の葉面積を定量した。また、低温ストレス処理前の化合物無処理区の値も同様の方法で測定した。下記の計算式(1)に基づいて相対葉面積値を算出し、相対葉面積値が5以上のものを軽減効果ありとした。評価の結果、化合物無処理区の緑色葉面積に対して、本発明化合物1、2、7、16、17、25、29、41、47、50~52、55、59、64、75、78、85、87、88、95、99、112~114、127および154のいずれかひとつを0.1ppm処理した場合、相対葉面積値が5以上となり、本発明化合物の処理による生長促進効果が認められた。

計算式(1) :

相対葉面積 =

- 20 $100 \times (\text{本発明化合物処理区の緑色面積} - \text{本発明化合物無処理区の緑色面積}) / (\text{低温ストレス処理前の本発明化合物無処理区の緑色面積} - \text{本発明化合物無処理区の緑色面積})$
[0699]

試験例7 トウモロコシ種子処理による生長促進評価試験

- 25 (供試植物)

トウモロコシ (品種: パイオニア31P41 (パイオニア・ハイブレッド・ジャパン社製))

(種子処理)

- 10% (V/V) color coat red (Becker Underwood, Inc.)、10% (V/V) CF-Clear (Becker Underwood, Inc.)を含むブランクスラリー溶液を調製する。トウモロコシ種子100キログラム当り所定の化合物処理量となるように本発明化合物1~163のいずれかひとつをブランクスラリーに溶解し、スラリー溶液を調製する。50ml遠沈管(日本BD社製)に、種子14.4グラム当り0.35mlのスラリー溶液を入れ、スラリー溶液が乾くまで攪拌し、当該種子をコーティングする。また、ブランクスラリーを用いてコーティングした種子を無処理区用種子とする。

(栽培)

種子処理後の当該種子をポット (φ55 mm×高さ58mm) 中の培土 (愛菜) に1粒ずつ播種し、温度 27°C 、照度5,000ルクス、日長16時間で18日間栽培する。

(評価方法)

- 40 栽培後、生育した植物の各個体の地上部新鮮重量を秤量し、1個体あたりの平均重量を求める。

その結果、本発明化合物1~163のいずれかひとつを種子処理した区では、無処理区と比較して地上部新鮮重量が大きくなることが期待される。

[0700]

- 45 試験例8 トウモロコシ種子処理による低温ストレス下での生長促進評価試験 (供試植物)

トウモロコシ（品種：黒もち）

（種子処理）

10% (V/V) color coat red (Becker Underwood, Inc.)、10% (V/V) CF-Clear (Becker Underwood, Inc.)を含むブランクスラリー溶液を調製した。トウモロコシ
5 種子100kg当り0.5g、5g、あるいは50gの本発明化合物1、30のいずれかひとつをそれぞれブランクスラリーに溶解しスラリー溶液を調製した。50mL遠沈管（日本BD社製）に、トウモロコシ種子14.4g当り0.35mlのスラリー溶液を入れ、スラリー溶液が乾くまで攪拌し、当該種子をコーティングした。また、ブランクスラリーを用いてコーティングした種子を無処理区用種子とした。

10 （栽培）

種子処理後のトウモロコシ種子をポット（φ55 mm×高さ58mm）中の培土（愛菜）に1粒ずつ播種し、温度27℃、照度5,000ルクス、日長16時間の条件下で10日間栽培し、生育した実生を供試した。

（低温ストレス処理方法）

15 下記の温度条件に設定した人工気象室に、播種後10日目のポットを入れ、以下の条件で、4日間栽培した。

「条件；温度2.5±1℃、日長16時間、照度5,000ルクス」

（評価）

20 低温ストレス処理後に、温度27℃、照度5,000ルクス、日長16時間で、4日間栽培後、当該植物の各個体の地上部新鮮重量を秤量し、1個体あたりの平均重量を求めた。

その結果、本発明化合物1、30のいずれかひとつを種子処理した区では、トウモロコシ種子100kg当り0.5g、5g、あるいは50gのいずれの量で処理した処理区においても、無処理区と比べて地上部新鮮重量が5%以上大きかった。

25 [0701]

試験例9 イネ浸漬処理による低温ストレス下での生長促進評価試験

（供試植物）

イネ（品種：日本晴）

（栽培）

30 必要量のイネ種子を1,000ppm ベンレート水溶液に浸け、30℃で一晩暗黒下で培養し、ベンレート水溶液を蒸留水に置換して、30℃でさらに一晩暗黒下で培養し、催芽処理を行う。

406穴プラグトレーの穴にろ紙を載せ、催芽処理後のイネ種子をろ紙上に播種する。

35 これに1/2倍濃度の木村B水耕栽培液（Plant Science 119:39-47 (1996)参照）を加え、人工気象室内で以下の条件で5日間栽培する。

「条件；温度 昼28℃/夜23℃、湿度70%、照度8,500ルクス、日長12時間」

（化合物処理）

40 本発明化合物1～163のいずれかひとつの所定濃度のDMSO溶液を調製し、1/2倍濃度の木村B水耕栽培液にて希釈する。化合物を含む当該水耕栽培液を24穴プレートの各ウェルに2mlずつ分注し、生育したイネ実生を1ウェルに1個体ずつ移し、以下の条件下、照明培養棚で2日間栽培する。

「条件：温度25℃、照度5,000ルクス、日長12時間」

45 また、0.1%DMSOを含む水耕栽培液を用いて同様に栽培したイネ実生を無処理区とする。

（低温ストレス処理）

当該イネ実生を、24穴プレートごと保冷库内に移し、冷陰極管照明を用いて以下の条件で5日間栽培する。

「条件：温度4℃、照度3,500ルクス、日長12時間」

(評価)

- 5 低温ストレス処理後に、低温ストレス処理後のイネ実生を照明培養棚に移し、以下の条件で、さらに4日間栽培する。

「条件：温度25℃、照度5,000ルクス、日長12時間」

- 4日後、各処理区のイネ実生個体の地上部を写真撮影し、得られた画像データの緑色部分の面積を、画像解析ソフトWin ROOF（三谷商事社製）で定量して、植物の地上部の当該各個体の緑色面積を求める。処理区毎に、イネ実生1個体あたりの地上部の緑色面積の平均値を求めた結果、本発明化合物1～163のいずれかひとつを処理した区において、無処理区と比べて緑色面積が大きくなることが期待される。

[0702]

- 15 試験例10 イネ種子処理による低温ストレス下での生長促進評価試験

(供試植物)

イネ(品種：日本晴)

(種子処理)

- 20 5% (V/V) color coat red (Becker Underwood, Inc.)、5% (V/V) CF-Clear (Becker Underwood, Inc.)、1% Maxim XL (Syngenta社製)を含むブランクスラリー溶液を調製する。

- イネ種子100キログラム当たり所定の量となるように本発明化合物1～163のいずれかひとつをそれぞれブランクスラリー溶液に溶解しスラリー溶液とする。15ml遠沈管(AGCテクノグラス社製)に、イネ種子3グラム当たり0.1mlのスラリー溶液を入れ、スラリー溶液が乾くまで攪拌し、種子をコーティングする。また、ブランクスラリー溶液を用いてコーティングした種子を無処理区用種子とする。

(栽培方法)

- 30 406穴プラグトレイの底にろ紙を敷き、種子処理後のイネ種子を播種し、これに1/2倍濃度の木村B水耕栽培液(Plant Science 119:39-47 (1996))を加え、人工気象室内で、以下の条件下10日間栽培する。

「条件：温度 昼28℃/夜23℃、湿度70%、照度8,500ルクス、日長12時間」

(低温ストレス処理)

- 35 10日間栽培後の生じたイネ実生を、プラグトレイごと保冷库内に移し、以下の条件で、冷陰極管照明下、5日間栽培する。

「条件：温度4℃、照度3,500ルクス、日長12時間」

(評価)

- 40 低温ストレス処理後の同一処理区のイネ実生4個体を、ホグランド水耕栽培液(Hoagland and Arnon, California Agricultural Experiment Station 1950 Circular 347 pp.34) 60mlが入ったカップ(C-AP角カップ88、SHINGI社製)に移し、照明培養棚で以下の条件で12日間栽培する。

「条件：温度25℃、照度5,000ルクス、日長12時間」

12日後、各植物個体の地上部新鮮重量を秤量し、処理区ごとに、植物個体の地上部新鮮重量の平均値を求める。

- 45 その結果、本発明化合物1～163のいずれかひとつを処理した区において、無処理区と比較して地上部新鮮重量が大きくなることが期待される。

[0703]

試験例11 イネ浸漬処理による乾燥ストレス下での生長促進評価試験

(供試植物)

イネ (品種: 日本晴)

5 (栽培)

イネ種子を1,000ppmのベンレート水溶液に浸け、30℃暗黒下で一晩培養する。ベンレート水溶液を捨てて蒸留水に置換し、30℃暗黒下でさらに一晩培養する。406穴プラグトレーの穴にろ紙を載せ、催芽処理イネ種子をろ紙上に播種する。1/2倍濃度の木村B水耕栽培液 (Plant Science 119:39-47 (1996)参照)

10

に、所定の濃度の本発明化合物1~163のいずれかひとつを含むDMSO溶液を1/10,000容添加し、温度 昼28℃/夜23℃、湿度60%、照度8500ルクス、日長12時間の条件で、14日間栽培する。

(乾燥ストレス処理)

生育したイネ実生を5株ずつ空の35ml平底テストチューブ (アシスト/Sarstedt製) に入れ、ふたをせずに、温度 昼28℃/夜23℃、湿度: 60%、照度8,500ルクス、日長12時間で、2日間静置する。

15

(評価)

乾燥ストレス処理後の植物をホグランド水耕栽培液 (Hoagland and Arnon, California Agricultural Experiment Station 1950 Circular 347 pp.34参照) 100mlが入った遠沈管 (AGCテクノグラス) に入れ、温度 昼28℃/夜23℃、湿度60%、照度8,500ルクス、日長12時間で、14日間栽培する。

20

14日後、各試験区の供試植物の地上部新鮮重量を測定し、平均値を求める。その結果、本発明化合物1~163のいずれかひとつを処理したイネは、無処理区と比べて地上部新鮮重量が大きくなることが期待される。

25

[0704]

試験例12 コムギ灌注処理による高温ストレス下での生長促進評価試験

(供試植物)

コムギ (品種: アポジー)

(散布処理)

30

コムギ種子をプラスチックポット中の培土 (愛菜) に5粒ずつ播種し、温度 昼18℃/夜15℃、照度7,000ルクス、日長16時間の人工気象室にて10日間栽培する。ストレス試験前に1ポット当り3個体に間引きする。

所定量の本発明化合物1~163のいずれかひとつをDMSOに溶解して1000倍希釈する。

35

本発明化合物を所定の濃度で含有する水溶液15 mlを前記コムギ実生の生育したポットに土壤灌注処理する。また、本発明化合物を含まない0.1% DMSO溶液を処理し、無処理区とする。

(高温ストレス処理)

播種後13日目の当該供試植物を、人工気象室内で、温度 49℃、湿度 50%、照度 7,000ルクスの条件にて2.5時間、静置する。

40

(評価)

高温ストレス処理後に、人工気象室内で、温度 昼18℃/夜15℃、照度7,000ルクスで14日間栽培する。高温ストレス処理14日後の当該コムギをスキャナライザー3D-VIS (LemnaTec社製) で撮影し、葉の緑色部分の面積を計測する。その結果、本発明化合物1~163のいずれかひとつを処理したコムギは、本発明化合物を処理しなかったコムギ (無処理区) に比べて、葉の緑色の面

45

積が大きくなる効果が期待される。

[0705]

試験例 13 イネ種子処理による乾燥ストレス下での生長促進評価試験

(供試植物)

5 イネ (品種: 日本晴)

(種子処理)

5% (V/V) color coat red (Becker Underwood, Inc.), 5% (V/V) CF-Clear (Becker Underwood, Inc.), 1% Maxim XL (Syngenta社製)を含むブランクスラリー溶液を調製する。

10 イネ種子100キログラム当たり所定の量となるように本発明化合物 1 ~ 163 のいずれかひとつをそれぞれブランクスラリー溶液に溶解しスラリー溶液とする。50ml遠沈管(AGCテクノグラス社製)に、イネ種子10グラム当たり0.3mlのスラリー溶液を入れ、スラリー溶液が乾くまで攪拌し、種子をコーティングする。又、ブランクスラリー溶液を用いてコーティングした種子を無処理区用種子とする。

(栽培)

406穴プラグトレイの穴にろ紙を載せ、上記のように種子処理したイネ種子をろ紙上に播種して、1/2倍濃度の木村B水耕栽培液 (Plant Science 119:39-47 (1996)参照) を添加し、温度 昼28℃/夜23℃、湿度60%、照度8500ルクス、日長12時間の条件で、17日間栽培する。

(乾燥ストレス処理)

生育したイネ実生を5株ずつ空の35ml平底テストチューブ (アシスト/Sarstedt製) に入れ、ふたをせずに、温度 昼28℃/夜23℃、湿度: 60%、照度8,500ルクス、日長12時間で、2日間静置する。

25 (評価)

乾燥ストレス処理後の植物をホグランド水耕栽培液 (Hoagland and Arnon, California Agricultural Experiment Station 1950 Circular 347 pp.34参照) 100mlが入った遠沈管 (AGCテクノグラス) に入れ、温度 昼28℃/夜23℃、湿度60%、照度8,500ルクス、日長12時間で、14日間栽培する。

30 14日後、各試験区の供試植物5個体をまとめて地上部新鮮重量を測定し、各試験区の平均値を求める。その結果、本発明化合物 1 ~ 163 のいずれかひとつを処理した区において、無処理区と比べて地上部新鮮重量が大きくなる効果が期待される。

[0706]

35 試験例 14 低温ストレス下でのトウモロコシ土壌灌注処理による生育促進評価試験

トウモロコシ種子 (品種: パイオニア120 31P41) をプラスチックポット (直径55 mm×高さ58mm) 内の培土 (愛菜) に播種し、温度: 20-25℃、照度: 約5,000ルクス、日長16時間の条件下で、7日間栽培した。

40 各試験濃度の1,000倍濃度の化合物1, 3, 7, 10, 12, 13, 19, 26, 27, 30, 32, 38から43, 48, 49, 52, 55から58, 60, 62, 63, 65, 67, 69, 70, 73, 83, 85, 88, 93, 97, 100, 110, 111, 119, 125, 129から133, 135, 141, 145, 147, 152, 153, 156, 157, 159, 160および161のDMSO溶液を調製し、蒸留水にて希釈して試験液を調製した。得られた試験液20mlを株元に土壌灌注した後、温度: 27℃、湿度: 40-80%、照度: 約5,000ルクス、日長16時間の条件下で、2日間栽培した。これを本化合物処理区とした。化合物のDMSO溶液の代わり

に0.1%DMSO水溶液20mlを土壌灌注した区を無処理区とした。

土壌灌注した植物を、人工気象器内で、温度：2.5℃、湿度：40-80%、照度：約5,000ルクス、日長16時間の条件にて5日間栽培し低温ストレスに暴露した。当該低温ストレスに暴露した後、温度：27℃、湿度：40-80%、照度：約5,000ルクス、日長16時間の条件下で、4日間栽培した。

栽培後、各植物体の健全性を以下の評価指標に従って点数化した。

- 5 : 2/3以上が健全である葉が4枚以上
- 4 : 2/3以上が健全である葉が3枚
- 3 : 2/3以上が健全である葉が2枚
- 10 2 : 2/3以上が健全である葉が1枚
- 1 : 2/3以上が健全である葉が0枚
- 0 : 枯死

4植物体の健全性の点数の平均値を算出した。その結果、表14、15、16に示すように、化合物1, 3, 7, 10, 12, 13, 19, 26, 27, 30, 32, 38から43, 48, 49, 52, 55から58, 60, 62, 63, 65, 67, 69, 70, 73, 83, 85, 88, 93, 97, 100, 110, 111, 119, 125, 129から133, 135, 141, 145, 147, 152, 153, 156, 157, 159, 160および161で処理した処理区は無処理区よりも明らかに点数が大きかった。

[表 1 4]

試験化合物	試験濃度 (ppm)	点数の相対値 (%－無処理区)
試験化合物1	10	>5
試験化合物3	0.3	>5
試験化合物7	10	>5
試験化合物10	10	>5
試験化合物12	10	>5
試験化合物13	10	>5
試験化合物19	0.3	>5
試験化合物26	1	>5
試験化合物27	10	>5
試験化合物30	10	>5
試験化合物32	3	>5
試験化合物38	3	>5
試験化合物39	1	>5
試験化合物40	10	>5
試験化合物41	0.3	>5
試験化合物42	0.3	>5
試験化合物43	3	>5
試験化合物48	10	>5
試験化合物49	10	>5
試験化合物52	1	>5

[表 15]

試験化合物	試験濃度 (ppm)	点数の相対値 (%－無処理区)
試験化合物55	10	>5
試験化合物56	10	>5
試験化合物57	10	>5
試験化合物58	10	>5
試験化合物60	10	>5
試験化合物62	0.3	>5
試験化合物63	3	>5
試験化合物65	0.3	>5
試験化合物67	3	>5
試験化合物69	1	>5
試験化合物70	10	>5
試験化合物73	1	>5
試験化合物83	0.3	>5
試験化合物85	10	>5
試験化合物88	3	>5
試験化合物93	10	>5
試験化合物97	0.3	>5
試験化合物100	3	>5
試験化合物110	1	>5
試験化合物111	10	>5

[表 16]

試験化合物	試験濃度 (ppm)	点数の相対値 (%-無処理区)
試験化合物119	1	>5
試験化合物125	0.3	>5
試験化合物129	10	>5
試験化合物130	1	>5
試験化合物131	3	>5
試験化合物132	0.3	>5
試験化合物133	3	>5
試験化合物135	3	>5
試験化合物141	0.3	>5
試験化合物145	0.3	>5
試験化合物147	0.3	>5
試験化合物152	1	>5
試験化合物153	1	>5
試験化合物156	1	>5
試験化合物157	0.3	>5
試験化合物159	0.3	>5
試験化合物160	10	>5
試験化合物161	3	>5

産業上の利用可能性

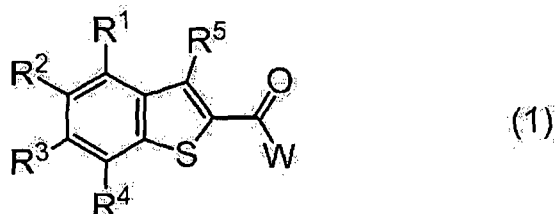
[0707]

- 5 本発明方法を用いることによって、効果的に植物の生長を促進することが可能となる。

請求の範囲

[請求項 1]

下記式 (1)



5 [式中、

Wは、 $-\text{OR}^6$ 、 $-\text{ON}=\text{CR}^7\text{R}^8$ 、 $-\text{SR}^9$ または $-\text{NR}^7\text{R}^{10}$ を表し

、
 R^1 は、水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Xより選ばれる1個以上の基を
 10 有していてもよいC2-C6アルケニル基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC2-C6アルキニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよい6員芳香族複素環基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよい5員芳香族複素環基、カルボキシ基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルキルカルボニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいベンゾイル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、アミノカルボニル基、 $-\text{NR}^{11}\text{R}^{12}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}^7\text{R}^{11}$ 、 $-\text{OR}^{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_m\text{R}^{11}$ または $-\text{SF}_5$ を表し、

R^2 は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、群Xより選ばれる1
 20 個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC2-C6アルケニル基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC2-C6アルキニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよい6員芳香族複素環基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよい5員芳香族複素環基、カルボキシ基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルキルカルボニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいベンゾイル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、アミノカルボニル基、 $-\text{NR}^{12}\text{R}^{13}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}^7\text{R}^{11}$ 、 $-\text{OR}^{13}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_m\text{R}^{13}$ または $-\text{SF}_5$ を表し、

R^3 および R^4 は同一または相異なり、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、
 30 ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC2-C6アルケニル基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC2-C6アルキニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよい6員芳香族複素環基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよい5員芳香族複素環基、カルボキシ基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルキルカルボニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいベンゾイル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、アミノカルボニル基、 $-\text{NR}^{11}\text{R}^{12}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}^7\text{R}^{11}$ 、 $-\text{OR}^{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_m\text{R}^{11}$ または $-\text{SF}_5$ を表し、

R^5 は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、カルボキシ基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-NR^{11}R^{12}$ 、 $-S(O)_2NR^7R^{11}$ 、 $-OR^{14}$ 、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよい6員芳香族複素環基または群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよい5員芳香族複素環基を表し、

R^6 は、群Zより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC3-C6アルケニル基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC3-C6アルキニル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC4-C7シクロアルキルアルキル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC3-C6シクロアルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、またはベンゼン環部分が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC7-C9フェニルアルキル基を表し、

R^7 および R^8 は同一または相異なり、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基または水素原子を表し、

R^9 は、水素原子、群Zより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC3-C6アルケニル基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC3-C6アルキニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、またはベンゼン環部分が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC7-C9フェニルアルキル基を表し、

R^{10} は、水素原子、シアノ基、群Zより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、ベンゼン環部分が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいベンジル基、 $-OR^7$ または $-NR^7R^8$ を表し、

R^{11} は、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC3-C6アルケニル基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC3-C6アルキニル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC4-C7シクロアルキルアルキル基、ベンゼン環部分が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC7-C9フェニルアルキル基、6員芳香族複素環部分が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよい6員芳香族複素環C1-C3アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC3-C6シクロアルキル基または水素原子を表し（ただし、 $-S(O)_mR^{11}$ におけるmが1または2である場合は、 R^{11} は水素原子を表さない。）

R^{12} は、水素原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキルスルホニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニルスルホニル基、ベンゼン環部分が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC7-C9フェニルアルキルスルホニル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、 $-C(O)R^{15}$ または $-C(O)NR^7R^8$ を表し、

R^{13} は、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アル

キル基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC3-C6アルケ
 ニル基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC3-C6アルキ
 ニル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC4-C7シクロアルキ
 ルアルキル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC3-C6シクロ
 5 アルキル基、ベンゼン環部分が群Yより選ばれる1個以上の基を有していても
 よいC7-C9フェニルアルキル基または水素原子を表し（ただし、-S(O)
 R^{1-3} におけるmが1または2である場合は、 R^{1-3} は水素原子を表さない。
 ））、

R^{1-4} は、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アル
 10 キル基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC3-C6アルケ
 ニル基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC3-C6アルキ
 ニル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC4-C7シクロアルキ
 ルアルキル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC3-C6シクロ
 アルキル基、ベンゼン環部分が群Yより選ばれる1個以上の基を有していても
 15 よいC7-C9フェニルアルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有して
 いてもよいフェニル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C
 6アルキルカルボニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよい
 ベンゾイル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキ
 ルスルホニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル
 20 スルホニル基または水素原子を表し、

R^{1-5} は、水素原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6
 アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、
 群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよい5員芳香族複素環基または
 群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよい6員芳香族複素環基を表し

25 、
 mは0、1または2を表す。

群Xはハロゲン原子、シアノ基および1個以上のハロゲン原子を有していても
 よいC1-C6アルコキシ基からなる群を表し、

群Yはハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、1個以上のハロゲン原子を有して
 30 いてもよいC1-C6アルキル基および1個以上のハロゲン原子を有していても
 よいC1-C6アルコキシ基からなる群を表し、

群Zはハロゲン原子、ヒドロキシ基、1個以上のハロゲン原子を有していても
 よいC1-C6アルコキシ基およびC2-C6アルコキシカルボニル基からなる
 群を表す。]で示される化合物を、植物に処理する植物の生長促進方法。

35 但し、以下の(1)から(8)のいずれかに該当する化合物を、植物に処理する
 植物の生長促進方法は除く。

(1) 4-(トリフルオロメチル)ベンゾ[b]チオフェン-2-カルボン酸メチ
 ル

(2) 5-(トリフルオロメチル)ベンゾ[b]チオフェン-2-カルボン酸メチ
 40 ル

(3) 6-(トリフルオロメチル)ベンゾ[b]チオフェン-2-カルボン酸メチ
 ル

(4) 7-(トリフルオロメチル)ベンゾ[b]チオフェン-2-カルボン酸メチ
 ル

45 (5) 4-(トリフルオロメチル)ベンゾ[b]チオフェン-2-カルボン酸エチ
 ル

(6) 5-(トリフルオロメチル)ベンゾ[b]チオフェン-2-カルボン酸エチル

(7) 6-(トリフルオロメチル)ベンゾ[b]チオフェン-2-カルボン酸エチル

5 (8) 7-(トリフルオロメチル)ベンゾ[b]チオフェン-2-カルボン酸エチル

[請求項2]

式(1)で示される化合物が、

10 R^1 が、水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC2-C6アルケニル基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC2-C6アルキニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよい5員芳香族複素環基、カルボキシ基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルキルカルボニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいベンゾイル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、アミノカルボニル基、 $-NR^{1.1}R^{1.2}$ 、 $-S(O)_2NR^7R^{1.1}$ 、 $-OR^{1.1}$ 、 $-S(O)_mR^{1.1}$ または $-SF_5$ であり、

15 R^4 が、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC2-C6アルケニル基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC2-C6アルキニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよい5員芳香族複素環基、カルボキシ基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルキルカルボニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいベンゾイル基、C2-C6アルコキシカルボニル基、アミノカルボニル基、 $-NR^{1.1}R^{1.2}$ 、 $-S(O)_2NR^7R^{1.1}$ 、 $-OR^{1.1}$ 、 $-S(O)_mR^{1.1}$ または $-SF_5$ である請求項1に記載の方法。

[請求項3]

30 式(1)で示される化合物が、

10 R^1 が、水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C4アルケニル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C4アルキニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいピリジル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいピリミジニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいチエニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいピロリル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C5アルキルカルボニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいベンゾイル基、C2-C4アルコキシカルボニル基、アミノカルボニル基、 $-NR^{1.1}R^{1.2}$ 、 $-OR^{1.1}$ 、 $-S(O)_mR^{1.1}$ または $-SF_5$ であり、

40 R^2 が、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C4アルケニル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C4アルキニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有して

- てもよいフェニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいピリジル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいピリミジニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいチエニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいピロリル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C5アルキルカルボニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいベンゾイル基、C2-C4アルコキシカルボニル基、アミノカルボニル基、 $-NR^{12}R^{13}$ 、 $-OR^{13}$ 、 $-S(O)_mR^{13}$ または $-SF_5$ であり、
- R³ およびR⁴ が同一または相異なり、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C4アルケニル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C4アルキニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいピリジル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいピリミジニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいチエニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいピロリル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C5アルキルカルボニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいベンゾイル基、C2-C4アルコキシカルボニル基、アミノカルボニル基、 $-NR^{11}R^{12}$ 、 $-OR^{11}$ 、 $-S(O)_mR^{11}$ または $-SF_5$ であり、
- R⁵ が、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基、C2-C5アルコキシカルボニル基、 $-NR^{11}R^{12}$ 、 $-S(O)_2NR^7R^{11}$ 、 $-OR^{14}$ または群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基であり、
- R⁶ が、群Zより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC3-C6アルケニル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC3-C6アルキニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基またはベンゼン環部分が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC7-C9フェニルアルキル基であり、
- R⁷ およびR⁸ が同一または相異なり、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基または水素原子であり、
- R⁹ が、水素原子、群Zより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC3-C6アルケニル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC3-C6アルキニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、またはベンゼン環部分が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC7-C9フェニルアルキル基であり、
- R¹⁰ が、水素原子、シアノ基、群Zより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC1-C6アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、 $-OR^7$ または $-NR^7R^8$ であり、
- R¹¹ が、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキル基、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC3-C4アルキニル基、ベンゼン環部分が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC7-C9フェニルアルキル基、ピリジン環部分が群Yより選ばれる1個以上の基を

有していてもよいピリジルC 1－C 3アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基または水素原子であり（ただし、 $-S(O)_m R^{1\ 1}$ におけるmが1または2である場合は、 $R^{1\ 1}$ は水素原子ではない。））、

5 $R^{1\ 2}$ が、水素原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 4アルキル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 4アルキルスルホニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニルスルホニル基、ベンゼン環部分が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいベンジルスルホニル基、 $-C(O)R^{1\ 5}$ または $-C(O)NR^7R^8$ であり、

10 $R^{1\ 3}$ が、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 3アルキル基または水素原子であり（ただし、 $-S(O)_m R^{1\ 3}$ におけるmが1または2である場合は、 $R^{1\ 3}$ は水素原子ではない。））、

15 $R^{1\ 4}$ が、群Xより選ばれる1個以上の基を有していてもよいC 1－C 4アルキル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 3－C 6アルケニル基、ベンゼン環部分が群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいベンジル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 2－C 5アルキルカルボニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいベンゾイル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニルスルホニル基または水素原子であり、

20 $R^{1\ 5}$ が、水素原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 4アルキル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいフェニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいチエニル基、群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいピラゾリル基または群Yより選ばれる1個以上の基を有していてもよいイソキサゾリル基である請求項1に記載の方法。

[請求項4]

30 植物が、非生物的ストレスに暴露された又は暴露されるであろう植物である請求項1から請求項3のいずれかーに記載の方法。

[請求項5]

植物への処理が、散布処理、土壌処理、種子処理又は水耕処理である請求項1から請求項4のいずれかーに記載の方法。

35 [請求項6]

植物への処理が、種子処理である請求項1から請求項4のいずれかーに記載の方法。

[請求項7]

40 植物がイネ、トウモロコシ、又はコムギである請求項1から請求項6のいずれかーに記載の方法。

[請求項8]

植物が遺伝子組換え植物である請求項1から請求項7、請求項15、請求項16のいずれかーに記載の方法。

[請求項9]

45 非生物的ストレスが高温ストレスである請求項4から請求項8、請求項15、請求項16のいずれかーに記載の方法。

[請求項 10]

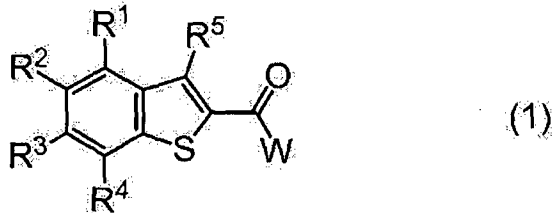
非生物的ストレスが低温ストレスである請求項 4 から請求項 8、請求項 15、請求項 16 のいずれかに記載の方法。

[請求項 11]

- 5 非生物的ストレスが乾燥ストレスである請求項 4 から請求項 8、請求項 15、請求項 16 のいずれかに記載の方法。

[請求項 12]

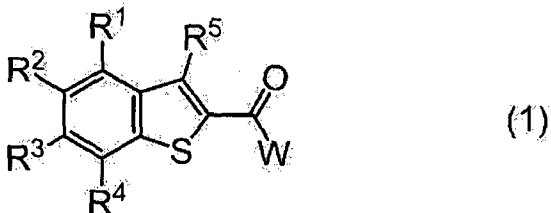
植物の生長を促進するための、前記式 (1)



- 10 で示される化合物の使用。

[請求項 13]

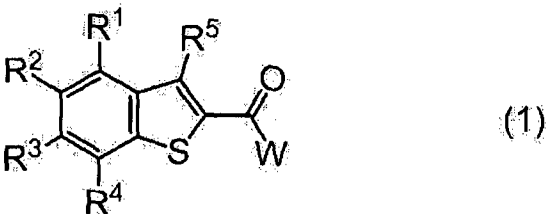
前記式 (1)



- 15 で示される化合物を有効量含む請求項 1 から請求項 3 のいずれかの化合物が処理されてなる植物種子。

[請求項 14]

前記式 (1)



で示される化合物及び不活性成分を含有する植物生長促進組成物。

- 20 [請求項 15]

植物がダイズである請求項 1 から請求項 6 のいずれかに記載の方法。

[請求項 16]

植物がワタである請求項 1 から請求項 6 のいずれかに記載の方法。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2013/080167

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

A01N43/12(2006.01)i, A01C1/00(2006.01)i, A01G7/06(2006.01)i,
 A01N25/00(2006.01)i, A01N43/36(2006.01)i, A01N43/40(2006.01)i,
 A01N43/54(2006.01)i, A01N43/56(2006.01)i, A01N43/80(2006.01)i,
 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)

A01N43/12, A01C1/00, A01G7/06, A01N25/00, A01N43/36, A01N43/40, A01N43/54,
 A01N43/56, A01N43/80, A01N47/02, A01N47/04, A01P21/00

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

Jitsuyo Shinan Koho 1922-1996 Jitsuyo Shinan Toroku Koho 1996-2014
 Kokai Jitsuyo Shinan Koho 1971-2014 Toroku Jitsuyo Shinan Koho 1994-2014

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

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	Tachibana, Shinya et al., Synthesis and physiological activity of thiophenes and furans with 3'- and 4'-methoxyacetophenone derivatives, Journal of Oleo Science, 2008, 57(2), 107-113	1-16
A	Kazuo KASEMURA et al., "Synthesis and Physiological Activities of Furans and Thiophenes with Methylacetophenone Residues", Journal of Antibacterial and Antifungal Agents, 2002, 30(12), 777 to 784	1-16
A	Hans Burström and Berit A. M. Hansen, Root Growth Effects of Indan, Indene, and Thionaphthene Derivatives, Physiologia Plantarum, 1956, 9(3), 502-514	1-16

☒ 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 application or patent 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
 28 January, 2014 (28.01.14)

Date of mailing of the international search report
 10 February, 2014 (10.02.14)

Name and mailing address of the ISA/
 Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2013/080167

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	Badger, G. M. et al., Thianaphthenecarboxylic acids, Journal of the Chemical Society, 1957, 2624-2630	1-16
A	WO 2007/009661 A2 (SYNGENTA PARTICIPATIONS AG), 25 January 2007 (25.01.2007), abstract; table 79 (Family: none)	1-16
A	US 2533086 A (Frederick Franklin Blicke), 05 December 1950 (05.12.1950), column 1, lines 1 to 29 (Family: none)	1-16
P,A	JP 2012-250978 A (Sumitomo Chemical Co., Ltd.), 20 December 2012 (20.12.2012), entire text & WO 2012/153860 A1	1-16
P,A	JP 2012-250979 A (Sumitomo Chemical Co., Ltd.), 20 December 2012 (20.12.2012), entire text & WO 2012/153861 A1	1-16

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2013/080167

Continuation of A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
(International Patent Classification (IPC))

A01N47/02(2006.01)i, A01N47/04(2006.01)i, A01P21/00(2006.01)i

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

A. 発明の属する分野の分類（国際特許分類（I P C））

Int.Cl. A01N43/12(2006.01)i, A01C1/00(2006.01)i, A01G7/06(2006.01)i, A01N25/00(2006.01)i,
A01N43/36(2006.01)i, A01N43/40(2006.01)i, A01N43/54(2006.01)i, A01N43/56(2006.01)i,
A01N43/80(2006.01)i, A01N47/02(2006.01)i, A01N47/04(2006.01)i, A01P21/00(2006.01)i

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（I P C））

Int.Cl. A01N43/12, A01C1/00, A01G7/06, A01N25/00, A01N43/36, A01N43/40, A01N43/54, A01N43/56, A01N43/80,
A01N47/02, A01N47/04, A01P21/00

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

日本国実用新案公報	1 9 2 2 - 1 9 9 6 年
日本国公開実用新案公報	1 9 7 1 - 2 0 1 4 年
日本国実用新案登録公報	1 9 9 6 - 2 0 1 4 年
日本国登録実用新案公報	1 9 9 4 - 2 0 1 4 年

国際調査で使用した電子データベース（データベースの名称、調査に使用した用語）

CAplus/REGISTRY(STN)

C. 関連すると認められる文献

引用文献の 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 請求項の番号
A	Tachibana, Shinya et al., Synthesis and physiological activity of thiophenes and furans with 3'- and 4'-methoxyacetophenone derivatives, Journal of Oleo Science, 2008, 57(2), 107-113	1-16
A	村一夫, 他 4 名, メチルアセトフェノン類から誘導されるフランおよびチオフェン化合物の合成とその生物活性, 防菌防黴, 2002, 30(12), 777-784	1-16

☒ C 欄の続きにも文献が列挙されている。

☐ パテントファミリーに関する別紙を参照。

* 引用文献のカテゴリー

「A」特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの
「E」国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの
「L」優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献（理由を付す）
「O」口頭による開示、使用、展示等に言及する文献
「P」国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献

「T」国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と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

2 8 . 0 1 . 2 0 1 4

国際調査報告の発送日

1 0 . 0 2 . 2 0 1 4

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁（I S A / J P）
郵便番号 1 0 0 - 8 9 1 5
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）

目代 博茂

電話番号 0 3 - 3 5 8 1 - 1 1 0 1 内線 3 4 4 3

4 H

9 6 3 0

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 請求項の番号
A	Hans Burström and Berit A. M. Hansen, Root Growth Effects of Indan, Indene, and Thionaphthene Derivatives, Physiologia Plantarum, 1956, 9(3), 502-514	1-16
A	Badger, G. M. et al., Thianaphthenecarboxylic acids, Journal of the Chemical Society, 1957, 2624-2630	1-16
A	WO 2007/009661 A2 (SYNGENTA PARTICIPATIONS AG) 2007.01.25, Abstract, Table 79 (ファミリーなし)	1-16
A	US 2533086 A (Frederick Franklin Blicke) 1950.12.05, 1 欄 1~29 行 (ファミリーなし)	1-16
PA	JP 2012-250978 A (住友化学株式会社) 2012.12.20, 全文 & WO 2012/153860 A1	1-16
PA	JP 2012-250979 A (住友化学株式会社) 2012.12.20, 全文 & WO 2012/153861 A1	1-16