

(19)日本国特許庁(JP)

(12)特許公報(B2)

(11)特許番号
特許第7361055号
(P7361055)

(45)発行日 令和5年10月13日(2023.10.13)

(24)登録日 令和5年10月4日(2023.10.4)

(51)国際特許分類

F I

C 0 7 D 333/38 (2006.01)

C 0 7 D 333/38

C S P

A 0 1 P 1/00 (2006.01)

A 0 1 P 1/00

A 0 1 P 3/00 (2006.01)

A 0 1 P 3/00

A 0 1 N 43/10 (2006.01)

A 0 1 N 43/10

F

A 0 1 N 53/04 (2006.01)

A 0 1 N 53/04

1 0 0

請求項の数 15 (全92頁) 最終頁に続く

(21)出願番号 特願2020-571824(P2020-571824)

(86)(22)出願日 令和1年7月3日(2019.7.3)

(65)公表番号 特表2021-530449(P2021-530449
A)

(43)公表日 令和3年11月11日(2021.11.11)

(86)国際出願番号 PCT/EP2019/067824

(87)国際公開番号 WO2020/007902

(87)国際公開日 令和2年1月9日(2020.1.9)

審査請求日 令和4年6月29日(2022.6.29)

(31)優先権主張番号 18181930.1

(32)優先日 平成30年7月5日(2018.7.5)

(33)優先権主張国・地域又は機関
欧州特許庁(EP)

(73)特許権者 313006625

バイエル・アクチエンゲゼルシャフト
ドイツ連邦共和国、5 1 3 7 3・レーフ
エルクーゼン、カイザー・ヴィルヘルム
－アレー・1

(74)代理人 100114188

弁理士 小野 誠

(74)代理人 100119253

弁理士 金山 賢教

(74)代理人 100124855

弁理士 坪倉 道明

(74)代理人 100129713

弁理士 重森 一輝

(74)代理人 100137213

弁理士 安藤 健司

最終頁に続く

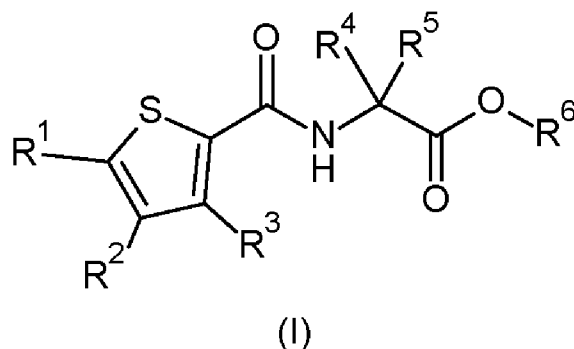
(54)【発明の名称】 抗菌剤としての置換チオフエンカルボキサミド類及び類縁体

(57)【特許請求の範囲】

【請求項1】

下記式(I)の化合物。

【化1】



【式中、

R¹及びR²は同一であり、そして塩素原子又は臭素原子であり；R³は、メチルであり；

R^4 は、水素原子、 C_1-C_6 -アルキル、アラルキル、ヒドロキシルによって置換されているアラルキル、 C_1-C_6 -アルキルスルファニルによって置換されている C_1-C_6 -アルキルからなる群から選択され、そして、 R^5 は水素原子であり；又は

R^4 及び R^5 は、それらが連結されている炭素原子と一緒にシクロプロピルを形成し；

R^6 は、水素原子、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_1-C_6 -シアノアルキル、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -アルキニル、 C_3-C_8 -シクロアルキル、アリール、アラルキル、4員、5員若しくは6員複素環、 $-C_1-C_6$ -アルキル-Si(C_1-C_6 -アルキル)₃ 及び $-C_1-C_6$ -アルキル- C_3-C_8 -シクロアルキルからなる群から選択される。]

【請求項2】

R^4 が、水素原子、 C_1-C_6 -アルキル、ベンジル、ヒドロキシルによって置換されているベンジル、 C_1-C_6 -アルキルスルファニルによって置換されている C_1-C_6 -アルキルからなる群から選択され、そして、 R^5 が水素原子であり；

又は、 R^4 及び R^5 は、それらが連結されている炭素原子と一緒にシクロプロピルを形成している、請求項1に記載の式(I)の化合物。

【請求項3】

R^6 が、水素原子、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_1-C_6 -シアノアルキル、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -アルキニル、 C_3-C_8 -シクロアルキル、フェニル、ベンジル、4員、5員若しくは6員複素環、 $-C_1-C_6$ -アルキル-Si(C_1-C_6 -アルキル)₃ 及び $-C_1-C_6$ -アルキル-シクロプロピルからなる群から選択される、請求項1又は2に記載の式(I)の化合物。

【請求項4】

R^6 が、水素原子、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_1-C_6 -シアノアルキル、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -アルキニル、 C_3-C_8 -シクロアルキル、フェニル、ベンジル、オキセタニル、チエタニル、ジオキソチエタニル、オキソラニル、オキサニル、 $-C_1-C_6$ -アルキル-Si(C_1-C_6 -アルキル)₃ 及び $-C_1-C_6$ -アルキル-シクロプロピルからなる群から選択される、請求項1、2又は3に記載の式(I)の化合物。

【請求項5】

少なくとも一つの請求項1～4のいずれか1項に記載の式(I)の化合物及び少なくとも一つの農業的に好適な補助剤を含む組成物。

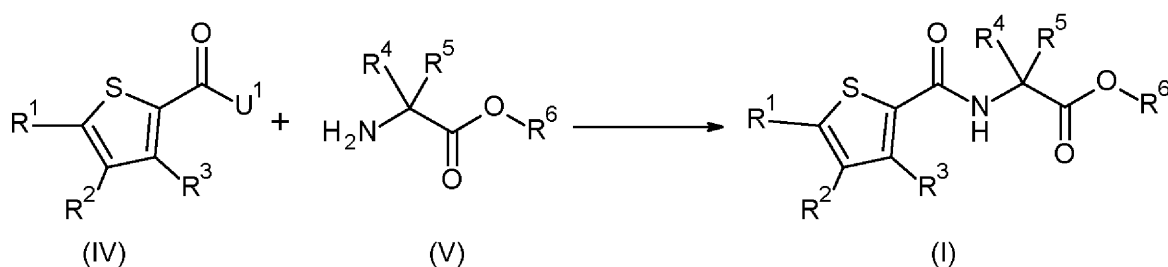
【請求項6】

少なくとも一つの請求項1～4のいずれか1項に記載の式(I)の化合物又は請求項5に記載の組成物を、植物、植物部分、種子、果実に、又はその植物が成長する土壤に施用する段階を含む、細菌性病害の防除方法。

【請求項7】

請求項1～4のいずれか1項に記載の式(I)の化合物の製造方法であって、式(IV)の化合物若しくはその塩を、式(V)の化合物若しくはその塩と反応させる段階を含む方法。

【化2】



方法 A1

〔式中、

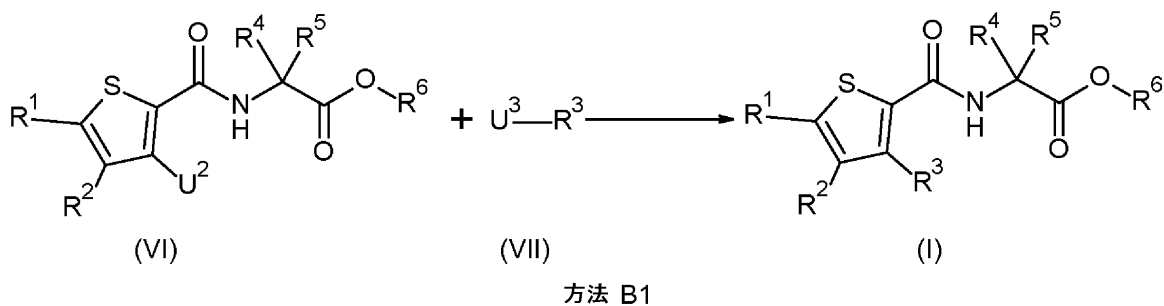
R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 及び R^6 は、請求項 1～4 で記載の通りであり；

U^1 は、ハロゲン原子、ヒドロキシ基又は $C_1 - C_6$ - アルコキシ基である。〕

【請求項 8】

請求項 1～4 のいずれか 1 項に記載の式 (I) の化合物の製造方法であって、式 (VI) の化合物若しくはその塩を、式 (VII) の化合物若しくはその塩と反応させる段階を含む方法。

【化 3】



10

〔式中、

R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 及び R^6 は、請求項 1～4 で記載の通りであり；

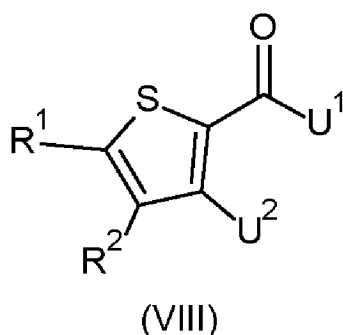
U^2 は、臭素原子、ヨウ素原子、メシレート基、トシレート基又はトリフレート基であり、そして、 U^3 は、ホウ素誘導体又はハロゲノ金属であり；

但し、 R^1 及び R^2 が臭素原子である場合、 U^2 は臭素原子ではない。〕

【請求項 9】

式 (VIII) の化合物：

【化 4】



30

〔式中、

R^1 及び R^2 は、請求項 1 に記載の通りであり；

U^1 は、ハロゲン原子、ヒドロキシ基又は $C_1 - C_6$ - アルコキシ基であり；

U^2 は、臭素原子、ヨウ素原子、メシレート基、トシレート基又はトリフレート基である。〕

を、請求項 7 に記載の式 (V) の化合物と反応させて、式 (VI) の化合物を提供する段階を含む、請求項 8 に記載の方法。

【請求項 10】

請求項 1～4 のいずれか 1 項に記載の式 (I) の化合物の製造方法であって、式 (IX) の化合物若しくはその塩の臭素化又は塩素化を行う段階を含む方法。

50

【化 5】



10

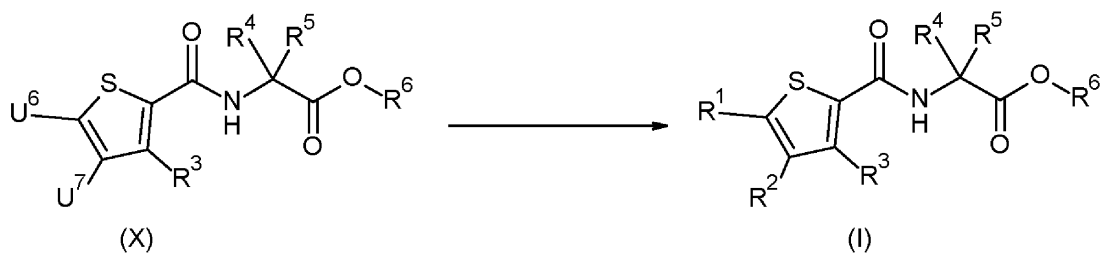
【式中、

 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 及び R^6 は、請求項 1～4 で記載の通りであり； U^4 は、水素原子、塩素原子又は臭素原子であり；そして U^5 は、水素原子、塩素原子又は臭素原子であり；但し、 U^4 又は U^5 のうちの少なくとも一つは、水素原子である。]

【請求項 1 1】

請求項 1～4 のいずれか 1 項に記載の式 (I) の化合物の製造方法であって、式 (X) の化合物若しくはその塩のジアゾ化を行い、続いて、芳香族置換を行う段階を含む方法。

【化 6】



方法 D1

20

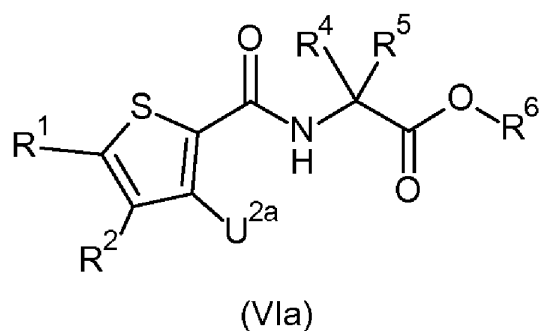
【式中、

 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 及び R^6 は、請求項 1～4 で記載の通りであり； U^6 は、アミノ基、塩素原子又は臭素原子であり； U^7 は、アミノ基、塩素原子又は臭素原子であり；但し、 U^6 又は U^7 のうちの少なくとも一つは、アミノ基である。]

【請求項 1 2】

下記式 (VI a) の化合物。

【化 7】



40

【式中、

50

R^1 及び R^2 は同一であり、そして塩素原子又は臭素原子であり；

R^4 は、水素原子、 C_1-C_6 -アルキル、アラルキル、ヒドロキシルによって置換されているアラルキル、 C_1-C_6 -アルキルスルファニルによって置換されている C_1-C_6 -アルキルからなる群から選択され、そして、 R^5 は水素原子であり；又は

R^4 及び R^5 は、それらが連結されている炭素原子と一緒にシクロプロピルを形成し；

R^6 は、水素原子、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_1-C_6 -シアノアルキル、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -アルキニル、 C_3-C_8 -シクロアルキル、アリール、アラルキル、4員、5員若しくは6員複素環、 $-C_1-C_6$ -アルキル-Si(C_1-C_6 -アルキル)₃ 及び $-C_1-C_6$ -アルキル- C_3-C_8 -シクロアルキルからなる群から選択され；

U^{2a} は、臭素原子、ヨウ素原子、メシレート基、トシレート基又はトリフレート基であり、

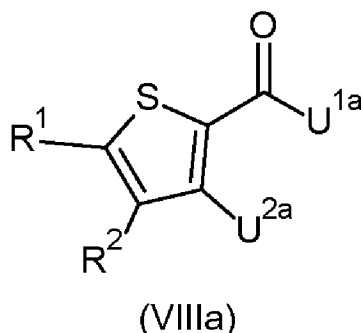
ここで、 R^6 が水素原子若しくは C_1-C_6 -アルキルである場合、 R^4 は、水素原子、 C_1-C_6 -アルキル、アラルキル、ヒドロキシルによって置換されているアラルキル、 C_1-C_6 -アルキルスルファニルによって置換されている C_1-C_6 -アルキルからなる群から選択され、そして、 R^5 は水素原子であり；

但し、 R^1 及び R^2 が臭素原子である場合、 U^{2a} は臭素原子ではない。]

【請求項 13】

下記式 (VIIIa) の化合物。

【化 8】



【式中、

R^1 及び R^2 は同一であり、そして塩素原子又は臭素原子であり；

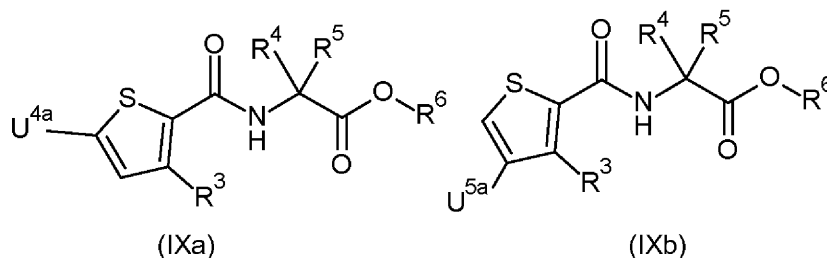
U^{1a} は、ヒドロキシ基又は C_1-C_6 -アルコキシ基であり；そして

U^{2a} は、メシレート基、トシレート基又はトリフレート基である。]

【請求項 14】

下記式 (IXa) 又は (IXb) の化合物。

【化 9】



【式中、

R^3 は、メチルであり；

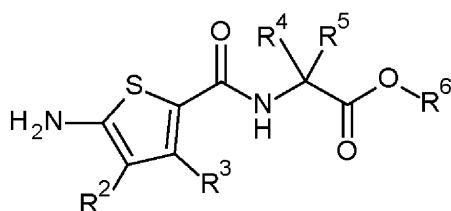
R^4 は、水素原子、 C_1-C_6 -アルキル、アラルキル、ヒドロキシルによって置換されているアラルキル、 C_1-C_6 -アルキルスルファニルによって置換されている C_1-C_6 -

C₆-アルキルからなる群から選択され、そして、R⁵は水素原子であり；又は
 R⁴及びR⁵は、それらが連結されている炭素原子と一緒にシクロプロピルを形成し；
 R⁶は、水素原子、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-シアノアルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-アルキニル、C₃-C₈-シクロアルキル、アリール、アラルキル、4員、5員若しくは6員複素環、-C₁-C₆-アルキル-Si(C₁-C₆-アルキル)₃及び-C₁-C₆-アルキル-C₃-C₈-シクロアルキルからなる群から選択され；
 U^{4a}は、塩素原子又は臭素原子であり；そして、
 U^{5a}は、塩素原子又は臭素原子である。]

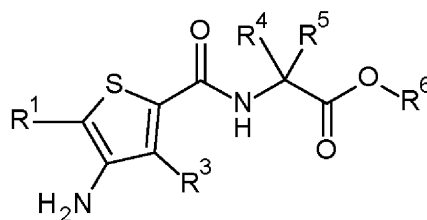
【請求項15】

下記式(Xa)又は(Xb)の化合物。

【化10】



(Xa)



(Xb)

【式中、

R¹又はR²は、塩素原子又は臭素原子であり；

R³は、メチルであり；

R⁴は、水素原子、C₁-C₆-アルキル、アラルキル、ヒドロキシルによって置換されているアラルキル、C₁-C₆-アルキルスルファニルによって置換されているC₁-C₆-アルキルからなる群から選択され、そして、R⁵は、水素原子であり；又は

R⁴及びR⁵は、それらが連結されている炭素原子と一緒にシクロプロピルを形成し；

R⁶は、水素原子、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-シアノアルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-アルキニル、C₃-C₈-シクロアルキル、アリール、アラルキル、4員、5員若しくは6員複素環、-C₁-C₆-アルキル-Si(C₁-C₆-アルキル)₃及び-C₁-C₆-アルキル-C₃-C₈-シクロアルキルからなる群から選択され；

ここで、R⁶が水素原子若しくはC₁-C₆-アルキルである場合、R⁴は、水素原子、C₁-C₆-アルキル、アラルキル、ヒドロキシルによって置換されているアラルキル、C₁-C₆-アルキルスルファニルによって置換されているC₁-C₆-アルキルからなる群から選択され、そして、R⁵は水素原子である。]

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、特にキサントモナス(Xanthomonas)属に属する細菌によって引き起こされる細菌性病害から植物を保護するのに用いることが可能な置換チオフェンカルボキサミド類及びその類縁体に関する。

【背景技術】

【0002】

植物病原性細菌は、全世界において重大な経済的損害を与える病害である。キサントモナス(Xanthomonas)属に属する細菌は、最も破壊的であると考えられている植物病原性細菌である。それは、農学的に重要な異なる宿主植物に対する各種病害の原因である。そのような病害の例には、コショウ及びトマトに影響する斑点細菌病(キサントモナス・カンペストリスp.v.ベシカトリア(Xanthomonas campestris

ris pv. vesicatoria) によって引き起こされる)、全ての栽培アブラナ属(例えば、芽キャベツ、キャベツ、カリフラワー及びブロッコリー)に影響する十字花植物の黒腐れ病(キサントモナス・カンペストリス *pv. campestris* (*Xanthomonas campestris pv. campestris*) によって引き起こされる)、柑橘類(ライム、オレンジ、グレープフルーツ、パメロ)に影響する柑橘枯れ病(キサントモナス・アコソノポジス *pv. シトリ* (*Xanthomonas axonopodis pv. citri*) によって引き起こされる)、イネに影響する白葉枯病(キサントモナス・オリザエ *pv. オリザエ* (*Xanthomonas oryzae pv. oryzae*) によって引き起こされる)、プルナス類(例えば、アプリコット、プラム、モモ)に影響する白斑病(キサントモナス・アルボリコラ *pv. プルニ* (*Xanthomonas arboricola pv. pruni*) によって引き起こされる)、マメに影響する一般的(*common*)白葉枯病(キサントモナス・ファセオリ (*Xanthomonas phaseoli*) によって引き起こされる)、キャッサバに影響するキャッサバ白葉枯病(キサントモナス・アクソノポジス *pv. マニホチス* (*Xanthomonas axonopodis pv. manihotis*) によって引き起こされる)、及びワタに影響する角斑病/白葉枯病(キサントモナス・カンペストリス *pv. マルバセアルム* (*Xanthomonas campestris pv. malvacearum*) によって引き起こされる)を含む。

【0003】

細菌性植物病害は、主として植物の病害抵抗性品種の使用及び殺細菌剤(天然又は合成)の使用を含む異なる方法で防除することができる。医学における抗生物質抵抗性の危機及びいくつかの抗生物質抵抗性植物病原体の出現が契機となって、効力を保全し、病害管理方法の範囲を拡大するための抗生物質に代わるものの開発が行われるようになった。従って、病原性細菌に直接作用しない製品、即ち直接の抗生物質効果を持たないが植物自体の防御系を刺激する製品が開発されてきた。これらの製品は、植物防御活性化剤として知られている。植物防御活性化剤の例には、アシベンゾラルーS-メチル(*Bion*(登録商標)及び*Actigard*(登録商標)として販売)、2,6-ジクロロイソニコチン酸、β-アミノ酪酸、プロベナゾール(*Oryzemat*(登録商標))、サリチル酸、リボフラビン、プロヘキサジオン-カルシウム、リン酸カリウム、ハーピンタンパク質(*Messenger*(登録商標))及びジャスモン酸メチルを含む。

【発明の概要】

【発明が解決しようとする課題】

【0004】

多くの異なる有機及び無機化合物が植物における誘発抵抗性を活性化することが明らかになっているが、商業的に販売されている製品は現在のところごくわずかである。

【0005】

従って、抵抗性発達を防止するために、細菌と直接相互作用しないようにしながら低用量で、効率的に、細菌性病害、特にキサントモナス(*Xanthomonas*)属に属する細菌によって引き起こされる病害を防除できるようにする新たな化学物質及び方法を提供する必要がある。その化学物質は細菌と直接相互作用しないことから、細菌がこれらの化学物質に対する抵抗性を発達させる可能性が低い。

【0006】

本発明者らは、置換チオフェンカルボキサミド誘導体類に属する新たな化学物質が上記問題に対する解決策を提供することを実証した。

【0007】

いくつかの置換チオフェンカルボキサミド誘導体が植物病害と闘う上で有用であることが知られている。例えば、US 5,534,541又はEP 0450355に、直接作用又は全身作用を介して、植物損傷性微生物、例えば、真菌及び細菌による攻撃から植物を保護するのに有用なハロゲノチオフェンカルボン酸誘導体が開示されている。しかしながら、本発明者らは、これらの化合物が、低用量ではキサントモナス・カンペストリス *pv*

．カンペストリス (*Xanthomonas campestris* p.v. *campestris*) に対して有効性が低いことを見出した。

【0008】

ハロゲノチオフェンカルボン酸誘導体のさらなる例が、WO2004/024692に開示されている。これらの誘導体は、真菌疾患を防除する上で有効であると言われている。それらは、望ましくない微生物に対する直接効果だけでなく、植物に対する抵抗性誘発効果によりその作用を行うものと考えられる。WO2004/024692では、これらの化合物が細菌性病害の防除において有用であり得るが、そのような活性の証拠を提供するものではないことも示唆されている。本発明者らはまた、これらの化合物が低用量ではキサントモナス・カンペストリス p.v. カンペストリス (*Xanthomonas campestris* p.v. *campestris*) に対して有効性が低いことも見出した。

10

【課題を解決するための手段】

【0009】

本発明は、本明細書及び特許請求の範囲で開示された、式 (I) の化合物に関する。

【0010】

本発明はまた、本明細書及び特許請求の範囲で開示された、細菌性病害の防除方法にも関する。

【0011】

本発明は、本明細書及び特許請求の範囲で開示された、式 (I) の化合物の製造方法及びその中間体に関する。

20

【0012】

定義

本明細書で使用される場合、「C₁－C₆－アルキル」という用語は、1、2、3、4、5又は6個の炭素原子を有する飽和で分岐若しくは直鎖の炭化水素鎖を指す。C₁－C₆－アルキルの例には、メチル、エチル、プロピル (n-プロピル)、1-メチルエチル (イソ-プロピル)、ブチル (n-ブチル)、1-メチルプロピル (sec-ブチル)、2-メチルプロピル (イソ-ブチル)、1, 1-ジメチルエチル (tert-ブチル)、ペンチル、1-メチルブチル、2-メチルブチル、3-メチルブチル、2, 2-ジメチルプロピル、1-エチルプロピル、1, 1-ジメチルプロピル、1, 2-ジメチルプロピル、ヘキシル、1-メチルペンチル、2-メチルペンチル、3-メチルペンチル、4-メチルペンチル、1, 1-ジメチルブチル、1, 2-ジメチルブチル、1, 3-ジメチルブチル、2, 2-ジメチルブチル、2, 3-ジメチルブチル、3, 3-ジメチルブチル、1-エチルブチル、2-エチルブチル、1, 1, 2-トリメチルプロピル、1, 2, 2-トリメチルプロピル、1-エチル-1-メチルプロピル及び1-エチル-2-メチルプロピルを含み、これらに限定されるものではない。特に、前記炭化水素鎖は、1、2、3又は4個の炭素原子を有し (「C₁－C₄－アルキル」)、例えば、メチル、エチル、プロピル、イソ-プロピル、ブチル、sec-ブチル、イソ-ブチル又はtert-ブチルである。

30

【0013】

本明細書で使用される場合、「アルケニル」という用語は、好ましくは分岐若しくは未分岐のアルケニル、例えば、ビニル、プロペン-1-イル、プロペン-2-イル、ブター-1-エン-1-イル、ブター-1-エン-2-イル、ブター-2-エン-1-イル、ブター-2-エン-2-イル、ブター-1-エン-3-イル、2-メチル-プロパー-2-エン-1-イル、又は2-メチル-プロパー-1-エン-1-イル基を意味するものと理解されるべきである。

40

【0014】

本明細書で使用される場合、「アルキニル」という用語は、好ましくは分岐若しくは未分岐のアルキニル、例えば、エチニル、プロパー-1-イン-1-イル、ブター-1-イン-1-イル、ブター-2-イン-1-イル、又はブター-3-イン-1-イル基を意味するものと理解されるべきである。

【0015】

50

本明細書で使用される、「 C_1-C_6 -アルキルスルファニル」という用語は、式(C_1-C_6 -アルキル)-S-の飽和の直鎖若しくは分岐基を指し、その場合に、「 C_1-C_6 -アルキル」という用語は、本明細書で定義の通りである。 C_1-C_6 -アルキルスルファニルの例には、メチルスルファニル、エチルスルファニル、プロピルスルファニル、イソプロピルスルファニル、ブチルスルファニル、sec-ブチルスルファニル、イソブチルスルファニル、tert-ブチルスルファニル、ペンチルスルファニル、イソペンチルスルファニル、ヘキシルスルファニル基を含み、これらに限定されるものではない。

【0016】

本明細書で使用される場合、「アリール」という用語は、6～12個の炭素原子、好ましくは6～10個の炭素原子を含む芳香族炭化水素環系を指す。その環系は、単環式又は縮合多環式（例えば二環式又は三環式）芳香族環系であることができる。アリールの例には、フェニル、アズレニル、ナフチル、ピフェニル及びフルオレニルを含み、これらに限定されるものではない。

10

【0017】

本明細書で使用される場合、「アラルキル」という用語は、本明細書で定義のアリールによって置換されている C_1-C_6 -アルキルを指す。アラルキルの例には、ベンジル基($-CH_2-C_6H_5$)を含む。

【0018】

本明細書で使用される場合、「シクロアルキル」という用語は、3～8個の炭素原子を有する非芳香族単環式炭素含有環を指す。飽和シクロアルキルの例には、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、シクロオクチル、シクロノニル及びシクロデシル基を含み、これらに限定されるものではない。

20

【0019】

本明細書で使用される場合、「複素環」という用語は、酸素、窒素及び硫黄の群から独立に選択される1～4個のヘテロ原子を含む4員、5員若しくは6員の飽和若しくは部分不飽和複素環を指す。その環が複数の酸素原子を含む場合、それらは直接隣接していない。

【0020】

本明細書で使用される場合、「アリール」という用語は、6～15個の炭素原子、又は6～12個の炭素原子、好ましくは6～10個の炭素原子を含む芳香族炭化水素環系を指す。その環系は、単環式又は縮合多環式（例えば二環式又は三環式）芳香族環系であることができる。アリールの例には、フェニル、アズレニル、ナフチル及びフルオレニルを含み、これらに限定されるものではない。さらに、前記アリール基が1以上の置換基で置換されている場合、当該置換基は、前記アリール環上のいかなる位置にあっても良いことは明らかである。特に、アリールがフェニル基である場合、当該置換基は、一方若しくは両方のオルト位、一方若しくは両方のメタ位、又はパラ位、又はこれらの位置のいずれかの組み合わせを占めることができる。この定義は、複合置換基（例えばアリールオキシ）の一部としてのアリールにも適用される。

30

【発明を実施するための形態】

【0021】

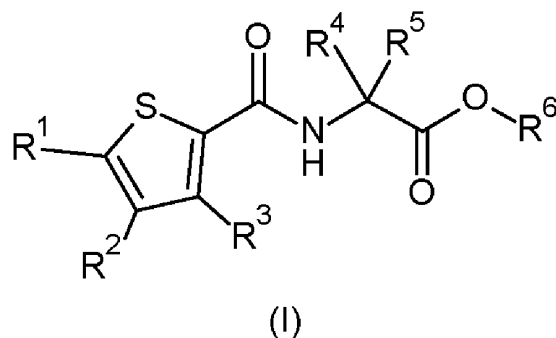
下記に示した式(I)の化合物は、直接には殺細菌剤作用を全く示さずに、低用量（即ち、31ppmの低用量）でキサントモナス(Xanthomonas)属の細菌によって引き起こされる病害を効率的に防除することが見いだされている。

40

【0022】

従って、本発明は、下記式(I)の化合物に関し：

【化 1】



10

【0023】

式中、

R^1 及び R^2 は同一であり、そして塩素原子又は臭素原子であり；

R^3 はメチルであり；

R^4 は、水素原子、 C_1-C_6 -アルキル、アラルキル、ヒドロキシルによって置換されているアラルキル、 C_1-C_6 -アルキルスルファニルによって置換されている C_1-C_6 -アルキルからなる群から選択され、そして、 R^5 は水素原子であり；又は

R^4 及び R^5 は、それらが連結されている炭素原子と一緒にシクロプロピルを形成し；

R^6 は、水素原子、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_1-C_6 -シアノアルキル、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -アルキニル、 C_3-C_8 -シクロアルキル、アリール、アラルキル、4員、5員若しくは6員複素環、 $-C_1-C_6$ -アルキル-Si(C_1-C_6 -アルキル)₃ 及び $-C_1-C_6$ -アルキル- C_3-C_8 -シクロアルキルからなる群から選択される。

20

【0024】

本発明は、式 (I) の化合物の純粋な立体異性体及びこれら異性体の任意の混合物を包含する。

【0025】

ここで、自然法則に反しているために当業者がその専門知識に基づいて除外すると考えられる組み合わせから生じる化合物は、包含されない。例えば、3個以上の隣接する酸素原子を有する環構造は除外される。

30

【0026】

置換基の性質に応じて、式 (I) の化合物は、異なる立体異性体の形態で存在し得る。これらの立体異性体は、例えば、エナンチオマー、ジアステレオマー、アトロプ異性体又は幾何異性体である。従って、本発明は、純粋な立体異性体及びこれら異性体の任意の混合物の両方を包含する。化合物が2以上の互変異型で平衡状態で存在し得る場合、一つの互変異性の記述によってその化合物に言及することは、全ての互変異型を含むものと見なされる。

【0027】

本発明の化合物のいずれも、化合物中の二重結合の数に応じて、1以上の幾何異性体でも存在し得る。一つの二重結合若しくは環の置換基の性質による幾何異性体は、シス(=Z-)又はトランス(=E-)型で存在し得る。従って本発明は、等しく全ての幾何異性体及びあらゆる比率でのあらゆる可能な混合物に関する。

40

【0028】

式 (I) の化合物は、好適には、その遊離型、塩型、N-オキサイド型又は溶媒和物型(例えば水和物)であることができる。

【0029】

置換基の性質に応じて、式 (I) の化合物は、遊離化合物及び／又はその塩、例えば農薬活性塩の形態で存在し得る。

50

【0030】

農薬活性塩には、無機及び有機酸の酸付加塩、並びに、一般的な塩基の塩を含む。無機酸の例は、ハロゲン化水素酸、例えば、フッ化水素、塩化水素、臭化水素及びヨウ化水素、硫酸、リン酸及び硝酸、及び酸性塩、例えば、重硫酸ナトリウム及び重硫酸カリウムである。有用な有機酸には、例えば、ギ酸、炭酸及びアルカン酸、例えば、酢酸、トリフルオロ酢酸、トリクロロ酢酸及びプロピオン酸、さらにはグリコール酸、チオシアン酸、乳酸、コハク酸、クエン酸、安息香酸、シンナミル酸、シュウ酸、6～20個の炭素原子を有する飽和又はモノ若しくはジ不飽和脂肪酸、アルキル硫酸モノエステル、アルキルスルホン酸（1～20個の炭素原子を有する直鎖若しくは分岐のアルキル基を有するスルホン酸）、アリールスルホン酸若しくはアリールジスルホン酸（芳香族基、例えば1以上のスルホン酸基を有するフェニル及びナフチル）、アルキルホスホン酸（1～20個の炭素原子を有する直鎖若しくは分岐のアルキル基を有するホスホン酸）、アリールホスホン酸類又はアリールジホスホン酸類（芳香族基、例えば、1個若しくは2個のホスホン酸基を有するフェニル及びナフチル）を含み、前記アルキル及びアリール基は、さらなる置換基を有することができ、例えば、p-トルエンスルホン酸、サリチル酸、p-アミノサリチル酸、2-フェノキシ安息香酸、2-アセトキシ安息香酸を含む。

10

【0031】

式（I）の化合物の溶媒和物又はその塩は、その化合物と溶媒との化学量論的組成物である。

【0032】

式（I）の化合物は、複数の結晶形態及び／又は非晶質形態で存在し得る。結晶形態には、非溶媒和結晶形態、溶媒和物及び水和物を含む。

20

【0033】

一部の実施形態では、上記式（I）において、 R^4 は、水素原子、 C_1-C_6 -アルキル、ベンジル、ヒドロキシルによって置換されているベンジル、 C_1-C_6 -アルキルスルファニルによって置換されている C_1-C_6 -アルキルからなる群から選択され、そして、 R^5 は水素原子であり；又は、 R^4 及び R^5 は、それらが連結されている炭素原子と一緒にシクロプロピルを形成している。

【0034】

一部の実施形態では、上記式（I）において、 R^4 は、水素原子、 C_1-C_6 -アルキル、ベンジル、ヒドロキシルによって置換されているベンジル、 C_1-C_6 -アルキルスルファニルによって置換されている C_1-C_6 -アルキルからなる群から選択され、そして、 R^5 は水素原子である。

30

【0035】

一部の実施形態では、上記式（I）において、 R^4 は、水素原子、 C_1-C_6 -アルキル、アラルキル又は C_1-C_6 -アルキルスルファニルによって置換されている C_1-C_6 -アルキルであり、そして、 R^5 は水素原子であり；又は、 R^4 及び R^5 は、それらが連結されている炭素原子と一緒にシクロプロピルを形成している。

【0036】

一部の実施形態では、上記式（I）において、 R^4 は、水素原子、 C_1-C_6 -アルキル、アラルキル又は C_1-C_6 -アルキルスルファニルによって置換されている C_1-C_6 -アルキルであり、そして、 R^5 は水素原子である。

40

【0037】

好適な R^4 基の非限定的な例には、表I. 1の欄「 R^4 」に開示の R^4 基のいずれかを含む。

【0038】

一部の実施形態では、上記式（I）において、 R^6 は、水素原子、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_1-C_6 -シアノアルキル、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -アルキニル、 C_3-C_8 -シクロアルキル、フェニル、ベンジル、4員、5員若しくは6員複素環、 $-C_1-C_6$ -アルキル-Si(C_1-C_6 -アルキル)₃及び $-C_1$

50

－C₆－アルキル－シクロプロピルからなる群から選択される。

【0039】

R⁶が4員、5員若しくは6員複素環である場合、それは、飽和又は部分不飽和複素環であることができる。飽和4員、5員若しくは6員複素環の例には、4員環、例えば、アゼチジニル、オキセタニル、チエタニル、ジオキソチエタニル、5員環、例えば、オキサニル、1,3-ジオキサニル、テトラヒドロチエニル、ピロリジニル、ピラゾリジニル、イミダゾリジニル、トリアゾリジニル、イソオキサリジニル、オキサゾリジニル、オキサジアゾリジニル、チアゾリジニル、イソチアゾリジニル、チアジアゾリジニル、6員環、例えば、ピペリジニル、ヘキサヒドロピリダジニル、ヘキサヒドロピリミジニル、ピペラジニル、トリアジナニル、ヘキサヒドロトリアジニル、オキサニル、ジオキサニル、テトラヒドロチオピラニル、ジチアニル、モルホリニル、1,2-オキサジナニル、オキサチアニル、チオモルホリニルを含み、これらに限定されるものではない。部分不飽和芳香族複素環の例には、5員環、ジヒドロフラニル、1,3-ジオキサソリル、ジヒドロチエニル、ピロリニル、ジヒドロイミダゾリル、ジヒドロピラゾリル、イソオキサゾリニル、ジヒドロオキサゾリル、ジヒドロチアゾリル又は6員環、例えば、ピラニル、チオピラニル、チアジニル及びチアジアジニルを含み、これらに限定されるものではない。

10

【0040】

一部の実施形態では、上記式(I)において、R⁶は、水素原子、C₁－C₆－アルキル、C₁－C₆－ハロアルキル、C₁－C₆－シアノアルキル、C₂－C₆－アルケニル、C₂－C₆－アルキニル、C₃－C₈－シクロアルキル、フェニル、ベンジル、オキセタニル、チエタニル、ジオキソチエタニル、オキサニル、オキサニル、－C₁－C₆－アルキル－Si(C₁－C₆－アルキル)₃及び－C₁－C₆－アルキル－シクロプロピルからなる群から選択される。

20

【0041】

一部の実施形態では、上記式(I)において、R⁶は、水素原子又はC₁－C₆－アルキルである。

【0042】

好適なR⁶基の非限定的な例には、表I. 1の欄「R⁶」に開示のR⁶基のいずれかがあ

る。

30

【0043】

一部の実施形態では、上記式(I)において、R¹及びR²は、塩素原子である。

【0044】

一部の実施形態では、上記式(I)において、R¹及びR²は、臭素原子である。

【0045】

R¹、R²、R⁴及びR⁶の上記記載の定義を各種方法で組み合わせて、本発明による化合物の下位分類を提供することができる。

【0046】

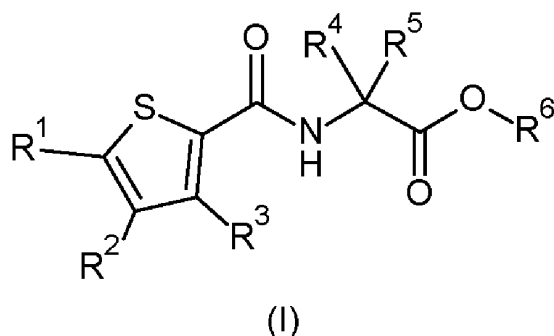
化合物の下位分類の非限定的な例には、本明細書において下記の下位分類が含まれる。

【0047】

一部の実施形態（本明細書において、実施形態I aと称する）において、本発明の化合物は、下記式(I)の化合物であり：

40

【化 2】



10

【0048】

式中、

R^1 及び R^2 は同一であり、そして塩素原子又は臭素原子であり；

R^3 は、メチルであり；

R^4 は、水素原子、 C_1-C_6 -アルキル、ベンジル、ヒドロキシルによって置換されているベンジル、 C_1-C_6 -アルキルスルファニルによって置換されている C_1-C_6 -アルキルからなる群から選択され、そして、 R^5 は水素原子であり；又は

20

R^4 及び R^5 は、それらが連結されている炭素原子と一緒にシクロプロピルを形成し；

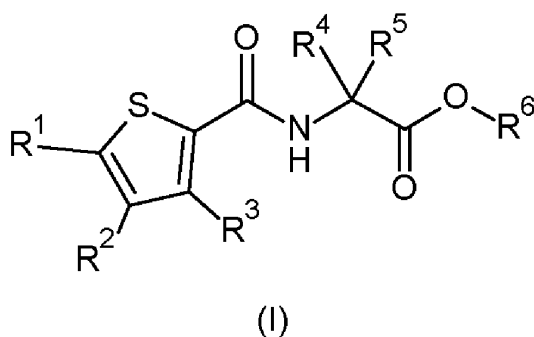
R^6 は、水素原子、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_1-C_6 -シアノアルキル、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -アルキニル、 C_3-C_8 -シクロアルキル、フェニル、ベンジル、オキセタニル、チエタニル、ジオキソチエタニル、オキソラニル、オキサニル、 $-C_1-C_6$ -アルキル-Si(C_1-C_6 -アルキル)₃ 及び $-C_1-C_6$ -アルキル-シクロプロピルからなる群から選択される。

【0049】

一部の実施形態（本明細書において、実施形態 I b と称する）において、本発明の化合物は、下記式（I）の化合物であり：

【化 3】

30



40

【0050】

式中、

R^1 及び R^2 は同一であり、そして塩素原子又は臭素原子であり；

R^3 は、メチルであり；

R^4 は、水素原子、 C_1-C_6 -アルキル、アラルキル又は C_1-C_6 -アルキルスルファニルによって置換されている C_1-C_6 -アルキルであり、そして、 R^5 は水素原子であり；又は

R^4 及び R^5 は、それらが連結されている炭素原子と一緒にシクロプロピルを形成し；

R^6 は、水素原子又は C_1-C_6 -アルキルである。

50

【0051】

実施形態Ⅰa及びⅠbによる一部の実施形態において、 R^4 及び R^5 がそれらが連結されている炭素原子と一緒にシクロプロピルを形成していない場合、 R^4 は、好ましくは、水素原子、 C_1-C_4 -アルキル、ベンジル基又は C_1-C_4 -アルキルスルファニルによって置換されている C_1-C_4 -アルキルであり、より好ましくは、 R^4 は、水素、イソプロピル、イソブチル、メチルスルファニルエチル又はベンジルである。

【0052】

実施形態Ⅰa及びⅠbによる一部の実施形態において、 R^6 は、水素原子又は C_1-C_4 -アルキルであり、好ましくは、 R^6 は、水素、メチル又はエチルである。

【0053】

実施形態Ⅰa及びⅠbによる一部の実施形態において、 R^1 及び R^2 は、塩素原子である。

【0054】

実施形態Ⅰa及びⅠbによる一部の実施形態において、 R^1 及び R^2 は、臭素原子である。

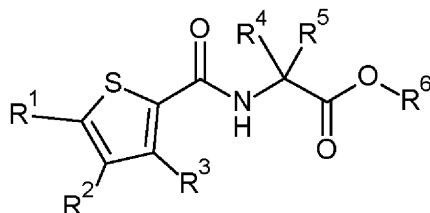
【0055】

実施形態Ⅰa及びⅠbによる一部の実施形態において、 R^1 及び R^2 が臭素原子である場合、 R^4 は、水素原子、 C_1-C_6 -アルキル、アラキル又は C_1-C_6 -アルキルスルファニルによって置換されている C_1-C_6 -アルキルであり、そして、 R^5 は水素原子である。

【0056】

一部の実施形態では、本発明による化合物は、下記式（Ⅰ）の化合物であり：

【化4】



(I)

【0057】

式中、

R^1 及び R^2 は同一であり、そして塩素原子又は臭素原子であり；

R^3 は、メチルであり；

R^4 は、水素原子、 C_1-C_4 -アルキル、ベンジル基又は C_1-C_4 -アルキルスルファニルによって置換されている C_1-C_4 -アルキルであり、好ましくは、 R^4 は水素、イソプロピル、イソブチル、メチルスルファニルエチル又はベンジルであり、そして、 R^5 は水素原子であり；又は

R^4 及び R^5 は、それらが連結されている炭素原子と一緒にシクロプロピルを形成し；

R^6 は、水素原子又は C_1-C_4 -アルキルであり、好ましくは、 R^6 は、水素、メチル又はエチルである。

【0058】

式（Ⅰ）の化合物は、細菌性病害を防除する、特にキサントモナス（*Xanthomonas*）属に属する細菌によって引き起こされる病害を防除するのに用いることができる。

【0059】

式（Ⅰ）の化合物の製造方法

本発明は、式（Ⅰ）の化合物の製造方法に関する。式（Ⅰ）の化合物は、公知の方法（このなかの参考文献参照）に類似の各種経路によって、及び下記の本明細書に記載の及び実験の部に記載の下記の合成経路の1以上によって製造することができる。

【0060】

式(I)の化合物の一般的合成経路

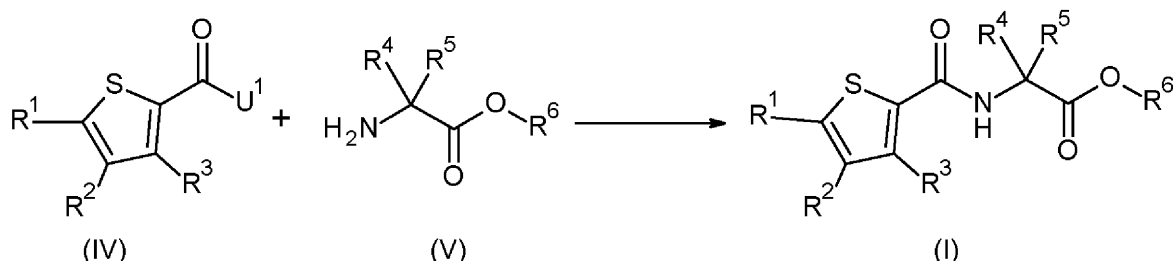
別段の断りがない限り、下記において、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 及び R^6 は、式(I)の化合物について上記で提供のものと同じ意味を有する。

【0061】

方法A1

本明細書で定義の式(I)の化合物は、下記の反応図式によって描かれたように、式(IV)の化合物又はその塩の一つを、式(V)の化合物又はその塩の一つと反応させる段階を含む方法A1によって製造することができ：

【化5】



方法 A1

【0062】

式中、 U^1 は、ハロゲン原子、ヒドロキシ基又は C_1-C_6 -アルコキシ基である。

【0063】

U^1 がヒドロキシ基を表す場合、方法A1は、縮合剤の存在下に有利に実施される。好適な縮合剤は、酸ハライド形成剤、例えば、ホスゲン、三臭化リン、三塩化リン、五塩化リン、三フッ化リンオキサイド、オキサリクロライド又は塩化チオニル；無水物形成剤、例えば、クロルギ酸エチル、クロルギ酸メチル、クロルギ酸イソプロピル、クロルギ酸イソブチル又はメタンスルホニルクロライド；カルボジイミド類、例えば、 N, N' -ジシクロヘキシルカルボジイミド(DCC)、 $N-(3-ジメチルアミノプロピル)-N'$ -エチルカルボジイミド塩酸塩(EDC)、又は、他の一般的な縮合剤、例えば、五酸化リン、ポリリン酸、ビス(2-オキソ-3-オキサゾリジニル)ホスフィニッククロライド、1-[ビス(ジメチルアミノ)メチレン]-1H-1,2,3-トリアゾロ[4,5-b]ピリジニウム3-オキサイドヘキサフルオロホスフェート(HATU)、2-(1H-ベンゾトリアゾール-1-イル)-1,1,3,3-テトラメチルアミニウムテトラフルオロボレート(TBTU)、(1-シアノ-2-エトキシ-2-オキソエチリデンアミノオキシ)ジメチルアミノ-モルホリノ-カルベニウムヘキサフルオロホスフェート、 N, N' -カルボニル-ジイミダゾール、2-エトキシ-N-エトキシカルボニル-1,2-ジヒドロキノリン(EDQ)、トリフェニルホスフィン/テトラクロロメタン、4-(4,6-ジメトキシ[1.3.5]-トリアジン-2-イル)-4-メチルモルホリニウムクロライド水和物、ビス(2-オキソ-3-オキサゾリジニル)ホスフィニッククロライド(BOP-Cl)、プロモトリピロリジノホスホニウムヘキサフルオロホスフェート(PyBroP)、2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウムクロライド(DMC)及びプロパンホスホン酸無水物(T3P)からなる非限定的リストで選択することができる。

【0064】

U^1 がハロゲン原子を表す場合、方法A1は、有利には酸結合剤の存在下に行う。方法A1を行う上での好適な酸結合剤は、各場合で、そのような反応に一般的である全ての無機及び有機塩基である。好ましいものは、アルカリ金属炭酸塩、例えば、炭酸セシウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、重炭酸カリウム、重炭酸ナトリウム、アルカリ土類金属酢酸塩、例えば、酢酸ナトリウム、酢酸カリウム、酢酸カルシウム、さらには三級アミン

類、例えば、トリメチルアミン、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、トリブチルアミン、N, N-ジメチルアニリン、N-メチルピペリジン、N, N-ジメチルピリジン-4-アミン、ジアザビシクロオクタン (DABCO)、ジアザビシクロノネン (DBN) 又はジアザビシクロウンデセン (DBU)、又は芳香族塩基、例えばピリジンである。

【0065】

U¹がC₁-C₆-アルコキシ基を表す場合、方法A1は、任意にトリメチルアルミニウムのようなルイス酸の存在下に、過剰のアミン成分によって行うことができる。

【0066】

適切な場合、方法A1は、塩基の存在下に及び適切な場合は溶媒の存在下に、好ましくは無水条件下に行うことができる。

【0067】

方法A1を実施するのに好適な溶媒は特に限定されない。それは、化合物を溶解させてそれと反応するか、又は、それと何らかの特定の相互作用を示さない限りは、一般の不活性有機溶媒であることができる。好ましくは、ハロゲン化されていても良い脂肪族、脂環式又は芳香族炭化水素、例えば、石油エーテル、ペンタン、ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン、メチルシクロヘキサン、ベンゼン、トルエン、キシレン、デカリン、ISOPAR (商標名) E 又は ISOPAR (商標名) G、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1, 2-ジクロロエタン又はトリクロロエタン；エーテル類、例えば、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、メチルtert-ブチルエーテル、メチルtert-アミルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、2-メチルテトラヒドロフラン、1, 2-ジメトキシエタン、1, 2-ジエトキシエタン又はアニソール；ニトリル類、例えば、アセトニトリル、プロピオニトリル、n-又はイソ-ブチロニトリル又はベンゾニトリル；アミド類、例えば、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-メチルホルムアニリド、N-メチルピロリドン又はヘキサメチルホスホリックトリアミド；尿素類、例えば、1, 3-ジメチル-3, 4, 5, 6-テトラヒドロ-2 (1H)-ピリミジノン；エステル類、例えば、酢酸メチル又は酢酸エチル、スルホキシド類、例えば、ジメチルスルホキシド、又はスルホン類、例えば、スルホラン；及びこれらの混合物を用いる。

【0068】

方法A1は、アルゴン又は窒素雰囲気のような不活性雰囲気下で行うことができる。方法A1を行う場合、1モル又は過剰の式(V)の化合物及び1~5モルの塩基を、式(IV)の化合物1モル当たり用いることができる。他の比率で反応成分を用いることも可能である。後処理は、公知の方法によって行う。

【0069】

式(V)の化合物は、市販されているか公知の方法によって製造することができる。

【0070】

U¹がヒドロキシ基を表す式(IV)の化合物は、市販されているか、塩基性加水分解のような公知の方法によってU¹がC₁-C₆-アルコキシ基を表す式(IV)の化合物から製造することができるか、公知の方法によって製造することができる (Beilstein J. Org. Chem. 2007, 3, No. 23)。

【0071】

U¹がハロゲンを表す式(IV)の化合物は、市販されているか、公知の方法によってU¹がヒドロキシ基を表す式(IV)の化合物から製造することができる。

【0072】

U¹がC₁-C₆-アルコキシ基を表す式(IV)の化合物は、公知の方法によってU¹がヒドロキシ基を表す式(IV)の化合物から製造することができる。

【0073】

方法B1

本明細書で定義の式(I)の化合物は、下記の反応図式によって描かれたように、式(

10

20

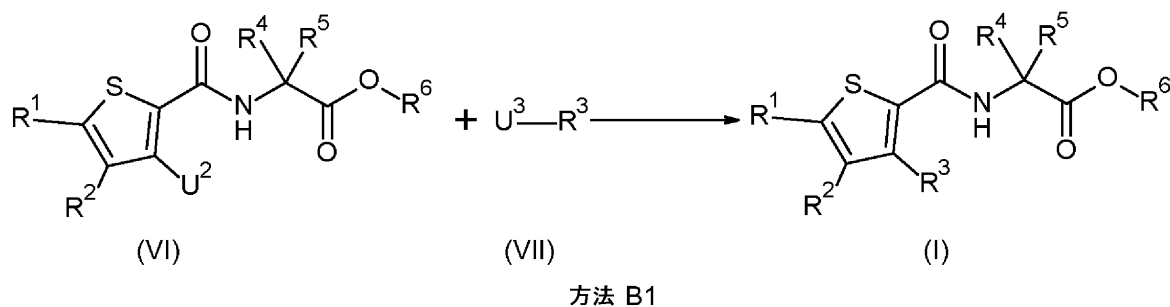
30

40

50

VI) の化合物又はその塩の一つを式 (VII) の化合物又はその塩の一つと反応させる段階を含む、方法 B1 によって製造することができ：

【化 6】



10

【0074】

式中、 U^2 は、臭素原子、ヨウ素原子、メシレート基、トシレート基又はトリフレート基であり、 U^3 は、ボロン誘導体、例えば、ボロン酸、ボロン酸エステル誘導体、カリウムトリフルオロボレート誘導体又はハロゲノマグネシウム若しくはハロゲノ亜鉛のような 1～2 個の配位子によって錯形成され得るハロゲノ金属である。但し、 R^1 及び R^2 が臭素原子である場合、 U^2 は、臭素原子ではない。

【0075】

方法 B1 は、遷移金属触媒、例えばパラジウムの存在下、適切であれば、ホスフィン配位子若しくは N-複素環カルベン配位子の存在下、適切な場合、塩基の存在下、適切な場合、公知の方法による溶媒の存在下に行うことができる (WO2012054721、Angew. Chem. Int. Ed. 2017, 56, 1581、Angew. Chem. Int. Ed. 2017, 56, 7078, 及びそれらでの引用文献)。

【0076】

方法 B1 は、触媒、例えば金属塩若しくは錯体の存在下に行うことができる。この目的に好適な金属誘導体は、遷移金属触媒、例えばパラジウムである。この目的に好適な金属塩又は錯体は、例えば、塩化パラジウム、酢酸パラジウム、テトラキス (トリフェニルホスフィン) パラジウム (0)、ビス (ジベンジリデンアセトン) パラジウム (0)、トリス (ジベンジリデンアセトン) ジパラジウム (0)、ビス (トリフェニルホスフィン) パラジウム (II) ジクロライド、[1, 1'-ビス (ジフェニルホスフィノ) フェロセン] ジクロロパラジウム (II)、ビス (シンナミル) ジクロロジパラジウム (II)、ビス (アリル) -ジクロロジパラジウム (II)、[1, 1'-ビス (ジ-tert-ブチルホスフィノ) フェロセン] ジクロロパラジウム (II)、ジ-μ-ヨードビス (トリ-tert-ブチルホスフィノ) ジパラジウム (I) 又はジ-μ-ブロモビス (トリ-tert-ブチルホスフィノ) ジパラジウム (I) である。

【0077】

パラジウム塩及び配位子又は塩、例えば、トリエチルホスフィン、トリ-tert-ブチルホスフィン、トリ-tert-ブチルホスホニウムテトラフルオロボレート、トリシクロヘキシルホスフィン、2- (ジシクロヘキシルホスフィノ) ビフェニル、2- (ジ-tert-ブチルホスフィノ) ビフェニル、2- (ジシクロヘキシルホスフィノ) -2'- (N, N-ジメチルアミノ) ビフェニル、2- (tert-ブチルホスフィノ) -2'- (N, N-ジメチルアミノ) ビフェニル、2-ジ-tert-ブチルホスフィノ-2', 4', 6'-トリイソプロピルビフェニル、2-ジシクロヘキシルホスフィノ-2', 4', 6'-トリイソプロピルビフェニル、2-ジシクロヘキシルホスフィノ-2', 6'-ジイソプロポキシビフェニル、トリフェニル-ホスフィン、トリス- (o-トリル) ホスフィン、ナトリウム 3- (ジフェニルホスフィノ) ベンゼンスルホネート、トリス-2- (メトキシフェニル) ホスフィン、2, 2'-ビス (ジフェニルホスフィノ) -1, 1'-ビナフチル

20

30

40

50

、1, 4-ビス(ジフェニルホスフィノ)ブタン、1, 2-ビス(ジフェニルホスフィノ)エタン、1, 4-ビス(ジシクロヘキシルホスフィノ)ブタン、1, 2-ビス(ジシクロヘキシルホスフィノ)エタン、2-(ジシクロヘキシルホスフィノ)-2'-(N, N-ジメチルアミノ)-ビフェニル、1, 1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)-フェロセン、(R)-(R)-1-[(S)-2-ジフェニルホスフィノ]フェロセニル]エチルジシクロヘキシルホスフィン、トリス-(2, 4-tert-ブチルフェニル)ホスファイト、ジ(1-アダマンチル)-2-モルホリノフェニルホスフィン又は1, 3-ビス(2, 4, 6-トリメチルフェニル)イミダゾリウムクロライドを反応液に別個に加えることで、反応混合物中でパラジウム錯体を発生させることも可能である。

【0078】

Strem Chemicalsによる"Metal Catalysts for Organic Synthesis"又はStrem Chemicalsによる"Phosphorous Ligands and Compounds"のような商業的カタログから適切な触媒及び／又は配位子を選択することも有利である。

【0079】

方法B1を行うのに好適な塩基は、そのような反応に一般的である無機及び有機塩基であることができる。好ましくは、アルカリ土類金属又はアルカリ金属水酸化物、例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カルシウム、水酸化カリウム又は他の水酸化アンモニウム誘導体；アルカリ土類金属、アルカリ金属又はフッ化アンモニウム、例えば、フッ化カリウム、フッ化セシウム又はフッ化テトラブチルアンモニウム；アルカリ土類金属又はアルカリ金属炭酸塩、例えば、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、重炭酸カリウム、重炭酸ナトリウム又は炭酸セシウム；アルカリ金属又はアルカリ土類金属酢酸塩、例えば、酢酸ナトリウム、酢酸リチウム、酢酸カリウム又は酢酸カルシウム；アルカリ金属又はアルカリ土類金属リン酸塩、例えば、リン酸アルカリトリカリウム；アルカリ金属アルコレート、例えば、カリウムtert-ブトキシド又はナトリウムtert-ブトキシド；三級アミン類、例えば、トリメチルアミン、トリエチルアミン、トリブチルアミン、N, N-ジメチルアニリン、N, N-ジシクロヘキシルメチルアミン、N, N-ジイソプロピルエチルアミン、N-メチルピペリジン、N, N-ジメチルアミノピリジン、ジアザビシクロオクタン(DABCO)、ジアザビシクロノネン(DBN)又はジアザビシクロウンデセン(DBU)；さらには芳香族塩基、例えば、ピリジン、ピコリン類、ルチジン類又はコリジン類を使用する。

【0080】

方法B1を行うのに好適な溶媒は、一般的な不活性有機溶媒であることができる。好ましくは、ハロゲン原子化されていても良い脂肪族、脂環式又は芳香族炭化水素、例えば、石油エーテル、ペンタン、ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン、メチルシクロヘキサン、ベンゼン、トルエン、キシレン又はデカリン；クロロベンゼン、ジクロロベンゼン、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、ジクロロエタン又はトリクロロエタン；エーテル類、例えば、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、メチルtert-ブチルエーテル、メチルtert-アミルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、2-メチルテトラヒドロフラン、1, 2-ジメトキシエタン、1, 2-ジエトキシエタン又はアニソール；ニトリル類、例えば、アセトニトリル、プロピオニトリル、n-又はイソブチロニトリル又はベンゾニトリル；アミド類、例えば、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-メチルホルムアニリド、N-メチルピロリドン又はヘキサメチルホスホリクトリアミド；尿素類、例えば、1, 3-ジメチル-3, 4, 5, 6-テトラヒドロ-2(1H)-ピリミジノン；エステル類、例えば、酢酸メチル又は酢酸エチル、スルホキシド類、例えば、ジメチルスルホキシド又はスルホン類、例えば、スルホラン；及びこれらの混合物を用いる。

【0081】

共溶媒、例えば、水又はアルコール、例えば、メタノール、エタノール、プロパノール、イソプロパノール若しくはtert-ブタノールを用いて方法B1を行うことが有利で

10

20

30

40

50

あり得る。

【0082】

方法B1は、アルゴン又は窒素雰囲気のような不活性雰囲気で行うことができる。方法B1を行う場合、式(VI)の化合物1モル当たり、1モル又は過剰の式(VII)の化合物及び1～5モルの塩基及び0.01～20モルパーセントのパラジウム錯体を用いることができる。反応成分を他の比率で用いることも可能である。後処理は公知の方法によって行う。

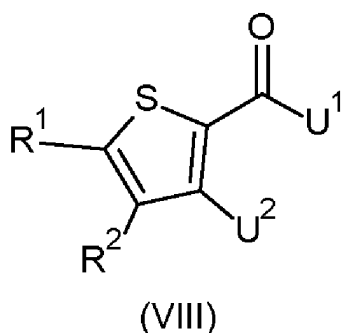
【0083】

式(VII)の化合物は、市販されているか、公知の方法によって製造することができる。

【0084】

式(VI)の化合物は、方法A1との関連で記載の条件で式(VIII)の化合物を式(V)の化合物と反応させることによって製造することができ：

【化7】



【0085】

式中、 U^2 及び U^1 は、本明細書で定義の通りである。

【0086】

U^2 が塩素原子、臭素原子又はヨウ素原子である式(VIII)の化合物は、市販されているか、式(IV)の化合物を製造するために開示されたものと同様の反応条件で公知の方法によって製造することができる。

【0087】

U^2 がメシレート基、トシレート基又はトリフレート基である式(VIII)の化合物は、 U^2 位置にヒドロキシ基を有する相当する化合物から公知の方法によって製造することができる。

【0088】

方法C1

本明細書で定義の式(I)の化合物は、下記の反応図式に描いたように、臭素化若しくは塩素化反応を行うことで、式(IX)の化合物又はその塩の一つから方法C1によって製造することができ：

【化8】



方法C1

10

20

30

40

50

【0089】

式中、 U^4 は、水素原子、塩素原子若しくは臭素原子であり、 U^5 は、水素原子、塩素原子若しくは臭素原子であり、但し U^4 又は U^5 のうちの少なくとも一つは、水素である。

【0090】

方法C1は、公知の方法（WO2008109786、WO2007098356）に従って行うことができる。

【0091】

方法C1は、臭素化剤若しくは塩素化剤の存在下に、適切であれば溶媒の存在下に行う。

【0092】

方法C1を行うために好適な臭素化又は塩素化剤は、臭素化又は塩素化に使用されるものであれば、特に制限されるものではない。臭素化剤の例には、臭素、N-ブロモコハク酸イミド及び1,3-ジブromo-5,5-ジメチル-2,4-イミダゾリジンジオンを含む。塩素化剤の例には、N-クロロコハク酸イミド、塩化スルフリル及び1,3-ジクロロ-5,5-ジメチル-2,4-イミダゾリジンジオンを含む。

【0093】

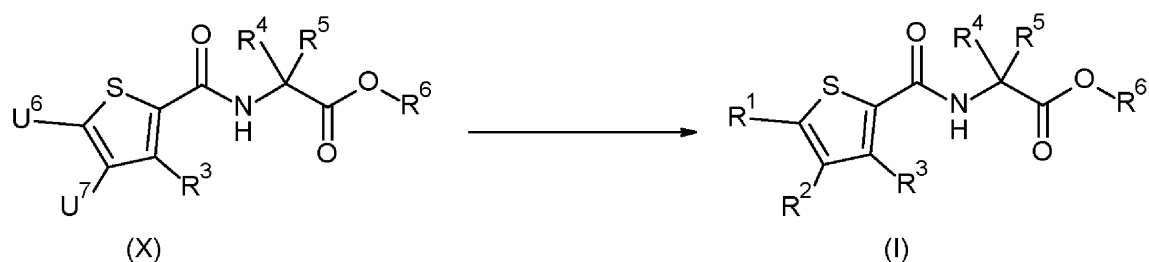
方法C1を行うのに好適な溶媒は、特に制限されない。それらは、化合物を溶解させてそれと反応し、又は、それと何らかの特定の相互作用を示さない限りは、一般の不活性有機溶媒であることができる。好適な溶媒は、例えば、方法A1に関連して開示されている溶媒であることができる。方法C1を行うため、溶媒又は共溶媒として酢酸のような有機酸を用いることも有利であり得る。

【0094】

方法D1

本明細書で定義の式(I)の化合物は、下記の反応図式に描いたように、式(X)の化合物又はその塩の一つのジアゾ化を行い、次に芳香族置換を行って式(I)の化合物を提供する段階を含む方法D1によって製造することができ：

【化9】



【0095】

式中、 U^6 は、アミノ基、塩素原子又は臭素原子であり、 U^7 は、アミノ基、塩素原子又は臭素原子であり、但し、 U^6 又は U^7 のうちの少なくとも一つは、アミノ基である。

【0096】

方法D1は、公知の方法に従って行うことができる（The Chemistry of diazonium and diazo groups; Saul Patai; Wiley-Interscience; 1978; 288-280 and 645-657; Account of Chemical Research (2018), 51, 496及びそれらに引用の参考文献）。

【0097】

本明細書で定義の式(X)の化合物又はその塩の一つは、下記の反応図式に描いたように、式(XI)の化合物又はその塩の一つを脱保護する段階を含む方法によって製造することができ：

10

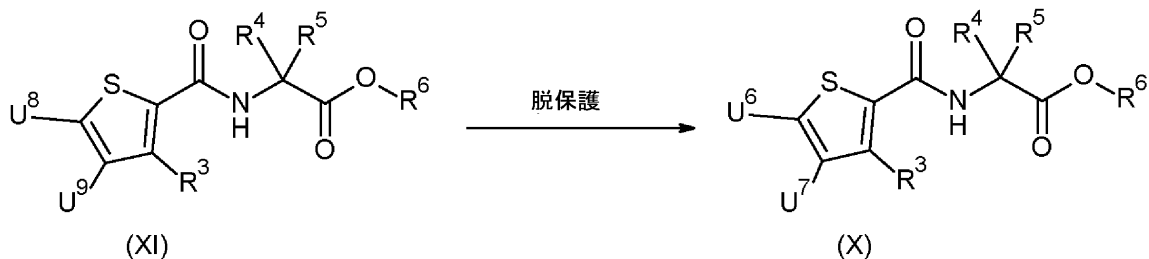
20

30

40

50

【化 10】



【0098】

式中、 U^8 は、保護されたアミノ基、塩素原子又は臭素原子であり、 U^7 は、保護されたアミノ基、塩素原子又は臭素原子であり、但し U^8 又は U^9 のうちの少なくとも一方は、保護されたアミノ基であり、 U^6 は、アミノ基、塩素原子又は臭素原子であり、 U^7 は、アミノ基、塩素原子又は臭素原子であり、但し U^6 又は U^7 のうちの少なくとも一方は、アミノ基である。

【0099】

アミノ基の保護基の例には、ベンジル基、4-メトキシベンジル基、アリル基、置換されていない若しくは置換されている C_1-C_6 -アルキルスルホニル、トリフルオロメチルスルホニル、置換されていない若しくは置換されているフェニルスルホニル、置換されていない若しくは置換されている C_1-C_6 -アルコキシカルボニル、置換されていない若しくは置換されているベンジルオキシカルボニル、アリルオキシカルボニル、アセチル基又はトリフルオロアセチル基を含む。

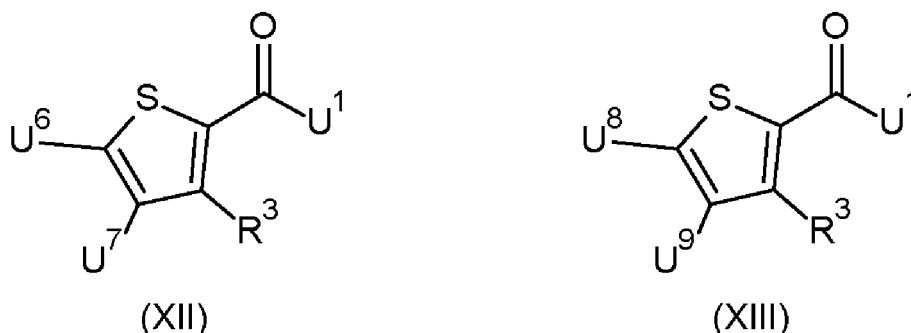
【0100】

脱保護プロセスは、保護基を除去する公知の方法に従って行うことができる (Greene's Protective Groups in Organic Synthesis; Peter G. M. Wuts; Wiley; Fifth Edition; 2014; 895-1194)。例えば、tert-ブトキシカルボニル及びベンジルオキシカルボニル保護基は、酸性媒体 (例えば、塩酸又はトリフルオロ酢酸により) 中で除去することができる。ベンジル保護基は、触媒 (例えばパラジウム／活性炭) の存在下に水素によって水素分解的に除去することができる。トリフルオロアセチル基は、塩基性媒体 (例えば炭酸カリウム又は水酸化リチウムにより) 中で除去することができる。

【0101】

式 (X) の化合物は式 (XII) の化合物又はその塩の一つから製造することができ、式 (XI) の化合物は、方法 A1 に記載の条件で式 (V) の化合物との反応によって、式 (XIII) の化合物若しくはその塩の一つから製造することができ：

【化 11】



【0102】

式中、 U^6 、 U^7 、 U^8 及び U^9 は、本明細書で定義の通りであり、 U^1 は、ハロゲン原子、ヒドロキシ基又は C_1-C_6 -アルコキシ基である。

【0103】

式 (XII) の化合物及び式 (XIII) の化合物は、市販されているか、式 (IV) の化合物を製造するために開示のものと同様の反応条件で公知の方法によって製造することができる。

【0104】

R^6 が水素原子を表す式 (I) の化合物又はその塩の一つは、塩基性加水分解のような公知の方法によって、 R^6 が C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_1-C_6 -シアノアルキル、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -アルキニル、 C_3-C_8 -シクロアルキル、アリール、アラルキル、4員、5員若しくは6員複素環、 $-C_1-C_6$ -アルキル-Si(C_1-C_6 -アルキル)₃又は $-C_1-C_6$ -アルキル-シクロプロピルを表す式 (I) の化合物から製造することができる。

10

【0105】

R^6 が C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_1-C_6 -シアノアルキル、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -アルキニル、 C_3-C_8 -シクロアルキル、アリール、アラルキル、4員、5員若しくは6員複素環、 $-C_1-C_6$ -アルキル-Si(C_1-C_6 -アルキル)₃又は $-C_1-C_6$ -アルキル-シクロプロピルを表す式 (I) の化合物は、公知の方法によって、 R^6 が水素原子を表す式 (I) の化合物又はその塩の一つから製造することができる。

【0106】

本明細書で開示の中間体は、細菌及び／又は真菌の防除において有効であり得る。

20

【0107】

式 (I) の化合物の製造のための中間体

別段の断りがない限り、下記において、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 及び R^6 は、式 (I) の化合物について上記のものと同じ意味を有する。

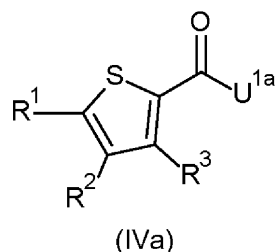
【0108】

本発明は、式 (I) の化合物の製造のための中間体に関する。

【0109】

式 (IVa) の化合物が提供され：

【化12】



30

【0110】

式中、

R^1 及び R^2 は同一であり、そして塩素原子又は臭素原子であり；

40

R^3 は、メチルであり；

U^{1a} は、ヒドロキシ基又は C_1-C_6 -アルコキシ基であり、

但し、式 (IVa) の化合物は、

－エチル 4, 5-ジブromo-3-メチルチオフエン-2-カルボキシレート [2088 257-63-8]、

－4, 5-ジクロロ-3-メチルチオフエン-2-カルボン酸 [854626-34-9]、

－4, 5-ジブromo-3-メチルチオフエン-2-カルボン酸 [854626-32-7]、

－メチル 4, 5-ジクロロ-3-メチルチオフエン-2-カルボキシレート [8546

50

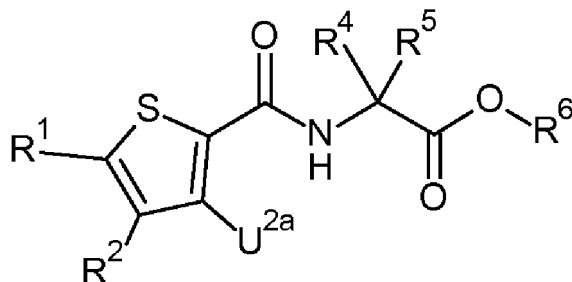
26-27-0] 及び

—メチル4,5-ジブromo-3-メチルチオフェン-2-カルボキシレート [648412-53-7] を表さない。

【0111】

式(VIa)の化合物が提供され：

【化13】



(VIa)

【0112】

式中、

R^1 及び R^2 は同一であり、そして塩素原子又は臭素原子であり；

R^4 は、水素原子、 C_1-C_6 -アルキル、アラルキル、ヒドロキシルによって置換されているアラルキル、 C_1-C_6 -アルキルスルファニルによって置換されている C_1-C_6 -アルキルからなる群から選択され、そして、 R^5 は水素原子であり；又は

R^4 及び R^5 は、それらが連結されている炭素原子と一緒にシクロプロピルを形成し；

R^6 は、水素原子、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_1-C_6 -シアノアルキル、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -アルキニル、 C_3-C_8 -シクロアルキル、アリール、アラルキル、4員、5員若しくは6員複素環、 $-C_1-C_6$ -アルキル-Si(C_1-C_6 -アルキル)₃ 及び $-C_1-C_6$ -アルキル- C_3-C_8 -シクロアルキルからなる群から選択され；

U^{2a} は、臭素原子、ヨウ素原子、メシレート基、トシレート基又はトリフレート基であり、

R^6 が水素原子又は C_1-C_6 -アルキルである場合は、 R^4 は、水素原子、 C_1-C_6 -アルキル、アラルキル、ヒドロキシルによって置換されているアラルキル、 C_1-C_6 -アルキルスルファニルによって置換されている C_1-C_6 -アルキルからなる群から選択され、そして、 R^5 は、水素原子であり；

但し、 R^1 及び R^2 が臭素原子である場合、 U^{2a} は、臭素原子ではない。

【0113】

U^{2a} が臭素原子又はヨウ素原子である式(VIa)の化合物は、真菌及び／又は細菌を防除する上で有効であることが認められている。

【0114】

式(VIIIa)の化合物が提供され：

10

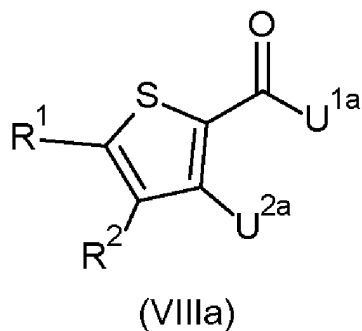
20

30

40

50

【化 1 4】



10

【0 1 1 5】

式中、

 R^1 及び R^2 は同一であり、そして塩素原子又は臭素原子であり； U^{1a} は、ヒドロキシ基又は C_1-C_6 -アルコキシ基であり； U^{2a} は、臭素原子、ヨウ素原子、メシレート基、トシレート基又はトリフレート基であり、但し、 R^1 及び R^2 が臭素原子である場合、 U^{2a} は臭素原子ではなく；

但し、式 (V I I I a) の化合物は、

-メチル 4, 5-ジブromo-3-クロロチオフェン-2-カルボキシレート [1 5 0 1 7 8 9-4 7-4]、

20

-4, 5-ジブromo-3-ヨードチオフェン-2-カルボン酸 [8 5 4 6 2 6-4 6-3]、

-4, 5-ジブromo-3-クロロチオフェン-2-カルボン酸 [5 0 3 3 0 8-9 9-4] 及び

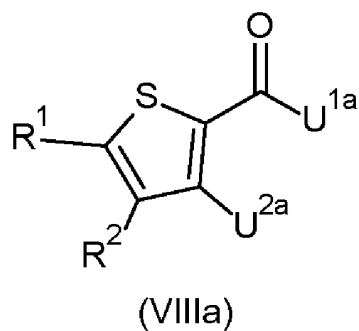
-エチル 4, 5-ジブromo-3-クロロチオフェン-2-カルボキシレート [5 0 3 3 0 8-9 8-3] を表さない。

【0 1 1 6】

式 (V I I I a) の化合物が提供され：

【化 1 5】

30



40

【0 1 1 7】

式中、

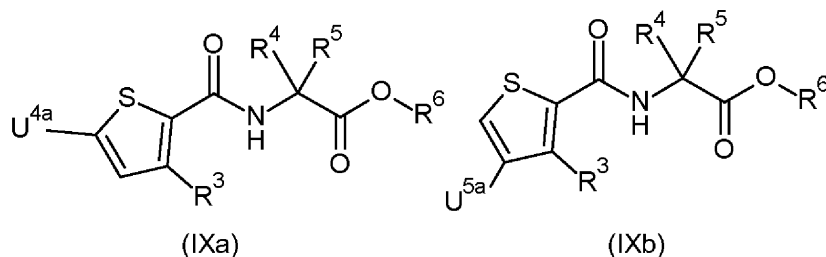
 R^1 及び R^2 は同一であり、そして塩素原子又は臭素原子であり； U^{1a} は、ヒドロキシ基又は C_1-C_6 -アルコキシ基であり； U^{2a} は、メシレート基、トシレート基又はトリフレート基である。

【0 1 1 8】

式 (I X a) 及び (I X b) の化合物が提供され：

50

【化 1 6】



【 0 1 1 9】

式中、

R³ は、メチルであり；

R⁴ は、水素原子、C₁－C₆－アルキル、アラルキル、ヒドロキシルによって置換されているアラルキル、C₁－C₆－アルキルスルファニルによって置換されているC₁－C₆－アルキルからなる群から選択され、そして、R⁵ は水素原子であり；又は

R⁴ 及び R⁵ は、それらが連結されている炭素原子と一緒にシクロプロピルを形成し；
R⁶ は、水素原子、C₁－C₆－アルキル、C₁－C₆－ハロアルキル、C₁－C₆－シアノアルキル、C₂－C₆－アルケニル、C₂－C₆－アルキニル、C₃－C₈－シクロアルキル、アリール、アラルキル、4員、5員若しくは6員複素環、－C₁－C₆－アルキル－Si(C₁－C₆－アルキル)₃ 及び－C₁－C₆－アルキル－C₃－C₈－シクロアルキルからなる群から選択され；

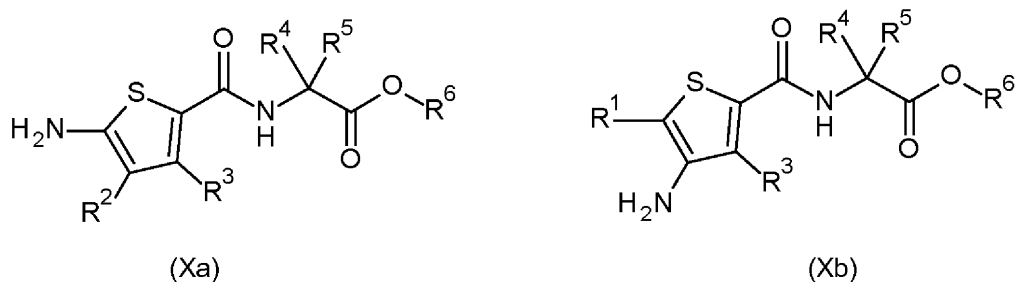
U^{4a} は、塩素原子又は臭素原子であり；

U⁵ は、塩素原子又は臭素原子である。

【 0 1 2 0】

式 (X a) 及び (X b) の化合物が提供され：

【化 1 7】



【 0 1 2 1】

R¹ 又は R² は、塩素原子又は臭素原子であり；

R³ はメチルであり；

R⁴ は、水素原子、C₁－C₆－アルキル、アラルキル、ヒドロキシルによって置換されているアラルキル、C₁－C₆－アルキルスルファニルによって置換されているC₁－C₆－アルキルからなる群から選択され、そして、R⁵ は水素原子であり；又は

R⁴ 及び R⁵ は、それらが連結されている炭素原子と一緒にシクロプロピルを形成し；

R⁶ は、水素原子、C₁－C₆－アルキル、C₁－C₆－ハロアルキル、C₁－C₆－シアノアルキル、C₂－C₆－アルケニル、C₂－C₆－アルキニル、C₃－C₈－シクロアルキル、アリール、アラルキル、4員、5員若しくは6員複素環、－C₁－C₆－アルキル－Si(C₁－C₆－アルキル)₃ 及び－C₁－C₆－アルキル－C₃－C₈－シクロアルキルからなる群から選択され；

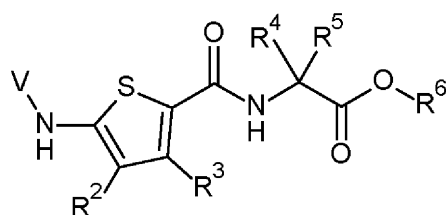
但し、R⁶ が水素原子又はC₁－C₆－アルキルである場合、R⁴ は、水素原子、C₁－C₆－アルキル、アラルキル、ヒドロキシルによって置換されているアラルキル、C₁－C₆－アルキルスルファニルによって置換されているC₁－C₆－アルキルからなる群から選

択され、 R^5 は、水素原子である。

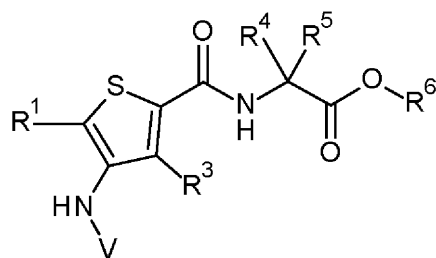
【0122】

式(XIa)及び(XIb)の化合物が提供され：

【化18】



(XIa)



(XIb)

10

【0123】

式中、

R^1 又は R^2 は、塩素原子又は臭素原子であり；

R^3 は、メチルであり；

R^4 は、水素原子、 C_1-C_6 -アルキル、アラルキル、ヒドロキシルによって置換されているアラルキル、 C_1-C_6 -アルキルスルファニルによって置換されている C_1-C_6 -アルキルからなる群から選択され、そして、 R^5 は水素原子であり；又は

20

R^4 及び R^5 は、それらが連結されている炭素原子と一緒にシクロプロピルを形成し；

R^6 は、水素原子、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_1-C_6 -シアノアルキル、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -アルキニル、 C_3-C_8 -シクロアルキル、アリール、アラルキル、4員、5員若しくは6員複素環、 $-C_1-C_6$ -アルキル-Si(C_1-C_6 -アルキル)₃及び $-C_1-C_6$ -アルキル- C_3-C_8 -シクロアルキルからなる群から選択され；

Vは、ベンジル基、4-メトキシベンジル基、アリル基、置換されていない若しくは置換されている C_1-C_6 -アルコキシカルボニル、置換されていない若しくは置換されているベンジルオキシカルボニル、アリルオキシカルボニル、アセチル基又はトリフルオロアセチル基であり；

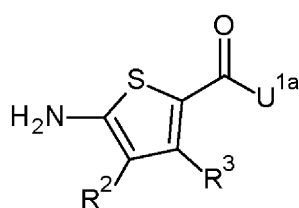
30

但し、 R^6 が水素原子又は C_1-C_6 -アルキルである場合、 R^4 は、水素原子、 C_1-C_6 -アルキル、アラルキル、ヒドロキシルによって置換されているアラルキル、 C_1-C_6 -アルキルスルファニルによって置換されている C_1-C_6 -アルキルからなる群から選択され、 R^5 は、水素原子である。

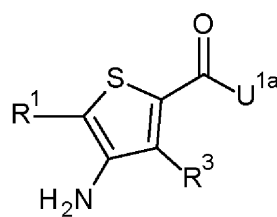
【0124】

式(XIIa)及び(XIIb)の化合物が提供され：

【化19】



(XIIa)



(XIIb)

40

【0125】

式中、

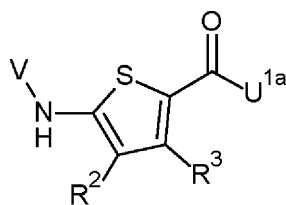
R^1 又は R^2 は、塩素原子又は臭素原子；

50

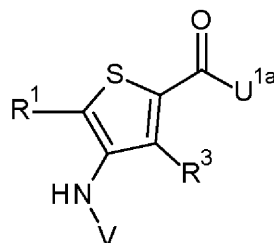
R^3 は、メチルであり；
 U^{1a} は、ヒドロキシ基又は $C_1 - C_6$ - アルコキシ基であり、
 但し、式 (XIIa) の化合物は、
 - エチル 5 - アミノ - 4 - ブロモ - 3 - メチルチオフエン - 2 - カルボキシレート [851443-15-7] を表さない。

【0126】

式 (XIIIa) 及び (XIIIb) の化合物が提供され：
 【化20】



(XIIIa)



(XIIIb)

【0127】

式中、

R^1 又は R^2 は、塩素原子又は臭素原子であり；

R^3 は、メチルであり；

V は、ベンジル基、4 - メトキシベンジル基、アリル基、置換されていない若しくは置換されている $C_1 - C_6$ - アルコキシカルボニル、置換されていない若しくは置換されているベンジルオキシカルボニル、アリルオキシカルボニル、アセチル基又はトリフルオロアセチル基であり；

U^{1a} は、ヒドロキシ基又は $C_1 - C_6$ - アルコキシ基であり、

但し、式 (XIIIa) の化合物は、

- エチル 5 - アセトアミド - 4 - ブロモ - 3 - メチルチオフエン - 2 - カルボキシレート [851444-63-8] を表さない。

【0128】

開示の中間体は、細菌及び／又は真菌を防除する上で有効であり得る。

【0129】

組成物及び製剤

本発明はさらに、本明細書において上記で開示の 1 以上の式 (I) の化合物及びそれらのいずれかの混合物を含む、組成物、特にキサントモナス (*Xanthomonas*) 属の細菌によって引き起こされる植物病害を防除するための組成物に関する。

【0130】

組成物は、典型的には、少なくとも一つの式 (I) の化合物及び少なくとも一つの農業的に好適な補助剤、例えば担体 (類) 及び／又は界面活性剤 (類) を含む。

【0131】

担体は、通常は不活性である固体若しくは液体の天然若しくは合成有機若しくは無機物質である。担体は通常、例えば、植物、植物部分又は種子への化合物の施用を改善する。好適な固体担体の例には、アンモニウム塩、天然岩粉、例えば、カオリン類、粘土、タルク、チョーク、石英、アタパルガイト、モンモリロナイト及び珪藻土、及び合成岩粉、例えば、微粉碎シリカ、アルミナ及びシリケート類を含み、これらに限定されるものではない。顆粒を製造するのに通常有用な固体担体の例には、破碎及び分別天然岩石、例えば、方解石、大理石、軽石、海泡石及び苦灰石、無機及び有機粉の合成顆粒及び紙、おが屑、ヤシ殻、トウモロシの穂軸及びタバコ茎のような有機材料の顆粒を含み、これらに限定されるものではない。好適な液体担体の例には、有機溶媒及びそれらの組み合わせを含み、

10

20

30

40

50

これらに限定されるものではない。好適な溶媒の例には、例えば、芳香族及び非芳香族炭化水素（例えば、シクロヘキサン、パラフィン類、アルキルベンゼン類、キシレン、トルエンアルキルナフタレン類、塩素化芳香族若しくは塩素化脂肪族炭化水素、例えばクロロベンゼン類、クロロエチレン類又は塩化メチレン）、アルコール類及び多価アルコール類（置換、エーテル化及び／又はエステル化されていても良い；例えば、ブタノール又はグリコール）、ケトン類（例えば、アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン又はシクロヘキサノン）、エステル類（脂肪及びオイルを含む）及び（ポリ）エーテル類、置換されていない及び置換されたアミン類、アミド類（例えば、ジメチルホルムアミド）、ラクタム類（例えば、N-アルキルピロリドン類）及びラクトン類、スルホン類及びスルホキシド類（例えば、ジメチルスルホキシド）の種類からの極性及び非極性有機化学液体を含む。担体は、液化ガス増量剤、即ち、常温及び常圧下では気体である液体、例えば、ハロゲン化水素、ブタン、プロパン、窒素及び二酸化炭素のようなエアロゾル噴霧剤であることもできる。担体の量は、典型的には、組成物の1～99.99重量%、より好ましくは10～99.5重量%、最も好ましくは20～99重量%の範囲である。

【0132】

界面活性剤は、イオン性（カチオン性若しくはアニオン性）又は非イオン性界面活性剤、例えば、イオン性若しくは非イオン性乳化剤（類）、発泡剤（類）、分散剤（類）、湿展剤（類）及びそれらの何れかの混合物であることができる。好適な界面活性剤の例には、ポリアクリル酸の塩、リグノスルホン酸の塩、フェノールスルホン酸若しくはナフタレンスルホン酸の塩、エチレン及び／又はプロピレンオキシドと脂肪アルコールの重縮合体、脂肪酸又は脂肪族アミン類（ポリオキシエチレン脂肪酸エステル類、ポリオキシエチレン脂肪アルコールエーテル類、例えば、アルキルアリールポリグリコールエーテル類）、置換されたフェノール類（好ましくはアルキルフェノール類又はアリールフェノール類）、スルホコハク酸エステル類の塩、タウリン誘導体（好ましくはアルキルタウレート類）、ポリエトキシ化アルコール類若しくはフェノール類のリン酸エステル、多価アルコール類の脂肪エステル類及びサルフェート類、スルホネート類、ホスフェート類を含む化合物の誘導体（例えば、アルキルスルホネート類、アルキルサルフェート類、アリールスルホネート類）及びタンパク質加水分解物、リグノサルファイト廃液及びメチルセルロースを含み、これらに限定されるものではない。界面活性剤は代表的には、本発明の化合物及び／又は担体が水に不溶であり、施用を水で行う場合に用いられる。次に、界面活性剤の量は、典型的には、組成物の5～40重量%の範囲である。

【0133】

好適な補助剤のさらなる例には、撥水剤、乾燥剤、結合剤（接着剤、粘着付与剤、固定剤、例えば、カルボキシメチルセルロース、粉末、顆粒若しくはラテックスの形態の天然及び合成ポリマー、例えば、アラビアガム、ポリビニルアルコール及びポリ酢酸ビニル、天然リン脂質、例えば、セファリン類及びレシチン類及び合成リン脂質、ポリビニルピロリドン及びチロース）、増粘剤、安定剤（例えば、低温安定剤、保存剤、酸化防止剤、光安定剤、又は化学的及び／又は物理的安定性を改善する他の薬剤）、色素又は顔料（例えば、無機顔料、例えば、酸化鉄、酸化チタン及びブルシアンプルー；有機色素、例えば、アリザリン、アゾ及び金属フタロシアニン色素）、消泡剤（例えば、シリコーン系消泡剤及びステアリン酸マグネシウム）、保存剤（例えば、ジクロロフェン及びベンジルアルコールヘミホルマル）、二次増粘剤（セルロース誘導体、アクリル酸誘導体、キサンタン、改質粘土及び微粉碎シリカ）、展着剤、ジベレリン類及び加工補助剤、鉱油及び植物油、香料、ロウ類、栄養素（例えば微量栄養素、例えば、鉄、マンガン、ホウ素、銅、コバルト、モリブデン及び亜鉛の塩）、保護コロイド、チキソトロピー物質、浸透剤、金属イオン封鎖剤及び錯形成剤を含む。

【0134】

補助剤の選択は、本発明の化合物の所期の施用形態及び／又はその物理特性に関係する。さらに、補助剤は、組成物に特定の性質（技術的、物理的及び／又は生理的特性）又はそれから製造される使用形態を提供するように選択することができる。補助剤の選択に

より、特定のニーズに対して組成物をカスタマイズすることができる。

【0135】

本発明の組成物は、任意の一般的な形態、例えば液剤（例えば、水溶液）、乳濁液、水和剤、水系及び油系懸濁液、粉剤、ダスト剤、ペースト、可溶性粉剤、可溶性粒剤、散布用粒剤、サスポエマルジョン濃縮物、本発明の化合物を含浸させた天然及び合成製造物、肥料、更にはポリマー物質中のマイクロカプセルであることができる。本発明の化合物は、懸濁形態、乳濁形態又は溶解形態で存在することができる。

【0136】

本発明の組成物は、末端ユーザーに、即時使用製剤として提供することができ、即ち、当該組成物は、好適な機器、例えば噴霧装置又は散粉装置によって植物又は種子に直接施用することができる。或いは、当該組成物は、末端ユーザーに、使用前に好ましくは水によって希釈しなければならない濃厚液の形態で提供することができる。

【0137】

本発明の組成物は、従来の方法で、例えば本発明の化合物（類）を、本明細書で上記で開示のような1以上の好適な補助剤と混合することで製造することができる。

【0138】

本発明による組成物は、概して、0.01～99重量%、0.05～98重量%、好ましくは0.1～95重量%、より好ましくは0.5～90重量%、最も好ましくは10～80重量%の本発明の化合物を含む。組成物が2以上の本発明の化合物を含むことが可能である。そのような場合、記載の範囲は、本発明の化合物の総量を指す。

【0139】

混合物／組み合わせ

本発明の化合物（類）及び組成物は、殺菌剤、殺細菌剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺虫剤、除草剤、肥料、成長調節剤、薬害軽減剤及び／又は情報物質のような他の有効成分と混合することができる。これによって、活性スペクトルを拡大することができ、又は抵抗性の発達を防止することができる。公知の殺菌剤、殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤及び殺細菌剤の例が、Pesticide Manual、17th editionに開示されている。

【0140】

本発明の化合物（類）及び組成物と混合できると考えられる特別に好ましい殺菌剤の例は、次のものである。

【0141】

1) エルゴステロール生合成の阻害薬、例えば、(1.001) シプロコナゾール、(1.002) ジフェノコナゾール、(1.003) エポキシコナゾール、(1.004) フェンヘキサミド、(1.005) フェンプロピジン、(1.006) フェンプロピモルフ、(1.007) フェンピラザミン、(1.008) フルキンコナゾール、(1.009) フルトリアホル、(1.010) イマザリル、(1.011) 硫酸イマザリル、(1.012) イプロコナゾール、(1.013) メトコナゾール、(1.014) ミクロブタニル、(1.015) パクロブトラゾール、(1.016) プロクロラズ、(1.017) プロピコナゾール、(1.018) プロチオコナゾール、(1.019) ピリソキサゾール (pyrisoxazole)、(1.020) スピロキサミン、(1.021) テブコナゾール、(1.022) テトラコナゾール、(1.023) トリアジメノール、(1.024) トリデモルフ、(1.025) トリチコナゾール、(1.026) (1R, 2S, 5S) - 5 - (4-クロロベンジル) - 2 - (クロロメチル) - 2 - メチル - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イルメチル) シクロペンタノール、(1.027) (1S, 2R, 5R) - 5 - (4-クロロベンジル) - 2 - (クロロメチル) - 2 - メチル - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イルメチル) シクロペンタノール、(1.028) (2R) - 2 - (1-クロロシクロプロピル) - 4 - [(1R) - 2, 2 - ジクロロシクロプロピル] - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) ブタン - 2 - オール、(1.029) (2R) - 2 - (1-クロロシクロプロピル) - 4

10

20

30

40

50

- [(1S) - 2, 2-ジクロロシクロプロピル] - 1 - (1H - 1, 2, 4-トリアゾール-1-イル) ブタン-2-オール、(1.030) (2R) - 2 - [4 - (4-クロロフェノキシ) - 2 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 1 - (1H - 1, 2, 4-トリアゾール-1-イル) プロパン-2-オール、(1.031) (2S) - 2 - (1-クロロシクロプロピル) - 4 - [(1R) - 2, 2-ジクロロシクロプロピル] - 1 - (1H - 1, 2, 4-トリアゾール-1-イル) ブタン-2-オール、(1.032) (2S) - 2 - (1-クロロシクロプロピル) - 4 - [(1S) - 2, 2-ジクロロシクロプロピル] - 1 - (1H - 1, 2, 4-トリアゾール-1-イル) ブタン-2-オール、(1.033) (2S) - 2 - [4 - (4-クロロフェノキシ) - 2 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 1 - (1H - 1, 2, 4-トリアゾール-1-イル) プロパン-2-オール、(1.034) (R) - [3 - (4-クロロ-2-フルオロフェニル) - 5 - (2, 4-ジフルオロフェニル) - 1, 2-オキサゾール-4-イル] (ピリジン-3-イル) メタノール、(1.035) (S) - [3 - (4-クロロ-2-フルオロフェニル) - 5 - (2, 4-ジフルオロフェニル) - 1, 2-オキサゾール-4-イル] (ピリジン-3-イル) メタノール、(1.036) [3 - (4-クロロ-2-フルオロフェニル) - 5 - (2, 4-ジフルオロフェニル) - 1, 2-オキサゾール-4-イル] (ピリジン-3-イル) メタノール、(1.037) 1 - ({(2R, 4S) - 2 - [2-クロロ-4 - (4-クロロフェノキシ) フェニル] - 4-メチル-1, 3-ジオキサラン-2-イル} メチル) - 1H - 1, 2, 4-トリアゾール、(1.038) 1 - ({(2S, 4S) - 2 - [2-クロロ-4 - (4-クロロフェノキシ) フェニル] - 4-メチル-1, 3-ジオキサラン-2-イル} メチル) - 1H - 1, 2, 4-トリアゾール、(1.039) 1 - {[3 - (2-クロロフェニル) - 2 - (2, 4-ジフルオロフェニル) オキシラン-2-イル] メチル} - 1H - 1, 2, 4-トリアゾール-5-イルチオシアネート、(1.040) 1 - {[rel (2R, 3R) - 3 - (2-クロロフェニル) - 2 - (2, 4-ジフルオロフェニル) オキシラン-2-イル] メチル} - 1H - 1, 2, 4-トリアゾール-5-イルチオシアネート、(1.041) 1 - {[rel (2R, 3S) - 3 - (2-クロロフェニル) - 2 - (2, 4-ジフルオロフェニル) オキシラン-2-イル] メチル} - 1H - 1, 2, 4-トリアゾール-5-イルチオシアネート、(1.042) 2 - [(2R, 4R, 5R) - 1 - (2, 4-ジクロロフェニル) - 5-ヒドロキシ-2, 6, 6-トリメチルヘプタン-4-イル] - 2, 4-ジヒドロ-3H - 1, 2, 4-トリアゾール-3-チオン、(1.043) 2 - [(2R, 4R, 5S) - 1 - (2, 4-ジクロロフェニル) - 5-ヒドロキシ-2, 6, 6-トリメチルヘプタン-4-イル] - 2, 4-ジヒドロ-3H - 1, 2, 4-トリアゾール-3-チオン、(1.044) 2 - [(2R, 4S, 5R) - 1 - (2, 4-ジクロロフェニル) - 5-ヒドロキシ-2, 6, 6-トリメチルヘプタン-4-イル] - 2, 4-ジヒドロ-3H - 1, 2, 4-トリアゾール-3-チオン、(1.045) 2 - [(2R, 4S, 5S) - 1 - (2, 4-ジクロロフェニル) - 5-ヒドロキシ-2, 6, 6-トリメチルヘプタン-4-イル] - 2, 4-ジヒドロ-3H - 1, 2, 4-トリアゾール-3-チオン、(1.046) 2 - [(2S, 4R, 5R) - 1 - (2, 4-ジクロロフェニル) - 5-ヒドロキシ-2, 6, 6-トリメチルヘプタン-4-イル] - 2, 4-ジヒドロ-3H - 1, 2, 4-トリアゾール-3-チオン、(1.047) 2 - [(2S, 4R, 5S) - 1 - (2, 4-ジクロロフェニル) - 5-ヒドロキシ-2, 6, 6-トリメチルヘプタン-4-イル] - 2, 4-ジヒドロ-3H - 1, 2, 4-トリアゾール-3-チオン、(1.048) 2 - [(2S, 4S, 5R) - 1 - (2, 4-ジクロロフェニル) - 5-ヒドロキシ-2, 6, 6-トリメチルヘプタン-4-イル] - 2, 4-ジヒドロ-3H - 1, 2, 4-トリアゾール-3-チオン、(1.049) 2 - [(2S, 4S, 5S) - 1 - (2, 4-ジクロロフェニル) - 5-ヒドロキシ-2, 6, 6-トリメチルヘプタン-4-イル] - 2, 4-ジヒドロ-3H - 1, 2, 4-トリアゾール-3-チオン、(1.050) 2 - [1 - (2, 4-ジクロロフェニル) - 5-ヒドロキシ-2, 6, 6-トリメチルヘプタン-4-イル] - 2, 4-ジヒドロ-3H - 1, 2, 4-トリアゾール-3-チオン、(1.051) 2

10

20

30

40

50

- [2-クロロ-4-(2,4-ジクロロフェノキシ)フェニル]-1-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)プロパン-2-オール、(1.052)2-[2-クロロ-4-(4-クロロフェノキシ)フェニル]-1-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)ブタン-2-オール、(1.053)2-[4-(4-クロロフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)フェニル]-1-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)ブタン-2-オール、(1.054)2-[4-(4-クロロフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)フェニル]-1-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)ペンタン-2-オール、(1.055)メフェントリフルコナゾール、(1.056)2-{[3-(2-クロロフェニル)-2-(2,4-ジフルオロフェニル)オキシラン-2-イル]メチル}-2,4-ジヒドロ-3H-1,2,4-トリアゾール-3-チオン、(1.057)2-{[rel(2R,3R)-3-(2-クロロフェニル)-2-(2,4-ジフルオロフェニル)オキシラン-2-イル]メチル}-2,4-ジヒドロ-3H-1,2,4-トリアゾール-3-チオン、(1.058)2-{[rel(2R,3S)-3-(2-クロロフェニル)-2-(2,4-ジフルオロフェニル)オキシラン-2-イル]メチル}-2,4-ジヒドロ-3H-1,2,4-トリアゾール-3-チオン、(1.059)5-(4-クロロベンジル)-2-(クロロメチル)-2-メチル-1-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イルメチル)シクロペンタノール、(1.060)5-(アリルスルファニル)-1-{[3-(2-クロロフェニル)-2-(2,4-ジフルオロフェニル)オキシラン-2-イル]メチル}-1H-1,2,4-トリアゾール、(1.061)5-(アリルスルファニル)-1-{[rel(2R,3R)-3-(2-クロロフェニル)-2-(2,4-ジフルオロフェニル)オキシラン-2-イル]メチル}-1H-1,2,4-トリアゾール、(1.062)5-(アリルスルファニル)-1-{[rel(2R,3S)-3-(2-クロロフェニル)-2-(2,4-ジフルオロフェニル)オキシラン-2-イル]メチル}-1H-1,2,4-トリアゾール、(1.063)N'-(2,5-ジメチル-4-{[3-(1,1,2,2-テトラフルオロエトキシ)フェニル]スルファニル}フェニル)-N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(1.064)N'-(2,5-ジメチル-4-{[3-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)フェニル]スルファニル}フェニル)-N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(1.065)N'-(2,5-ジメチル-4-{[3-(2,2,3,3-テトラフルオロプロボキシ)フェニル]スルファニル}フェニル)-N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(1.066)N'-(2,5-ジメチル-4-{[3-(ペンタフルオロエトキシ)フェニル]スルファニル}フェニル)-N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(1.067)N'-(2,5-ジメチル-4-{[3-[(1,1,2,2-テトラフルオロエチル)スルファニル]フェノキシ]フェニル)-N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(1.068)N'-(2,5-ジメチル-4-{[3-[(2,2,2-トリフルオロエチル)スルファニル]フェノキシ]フェニル)-N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(1.069)N'-(2,5-ジメチル-4-{[3-[(2,2,3,3-テトラフルオロプロピル)スルファニル]フェノキシ]フェニル)-N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(1.070)N'-(2,5-ジメチル-4-{[3-[(ペンタフルオロエチル)スルファニル]フェノキシ]フェニル)-N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(1.071)N'-(2,5-ジメチル-4-フェノキシフェニル)-N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(1.072)N'-(4-{[3-(ジフルオロメトキシ)フェニル]スルファニル}-2,5-ジメチルフェニル)-N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(1.073)N'-(4-{[3-[(ジフルオロメチル)スルファニル]フェノキシ]-2,5-ジメチルフェニル)-N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(1.074)N'-[5-プロモ-6-(2,3-ジヒドロ-1H-インデン-2-イルオキシ)-2-メチルピリジン-3-イル]-N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(1.075)N'-[4-[(4,5-ジクロロ-1,3-チアゾール-2-イル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル]-N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、

10

20

30

40

50

(1.076) N' - {5-ブromo-6-[(1R)-1-(3,5-ジフルオロフェニル)エトキシ]-2-メチルピリジン-3-イル} - N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(1.077) N' - {5-ブromo-6-[(1S)-1-(3,5-ジフルオロフェニル)エトキシ]-2-メチルピリジン-3-イル} - N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(1.078) N' - {5-ブromo-6-[(シス-4-イソプロピルシクロヘキシル)オキシ]-2-メチルピリジン-3-イル} - N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(1.079) N' - {5-ブromo-6-[(トランス-4-イソプロピルシクロヘキシル)オキシ]-2-メチルピリジン-3-イル} - N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(1.080) N' - {5-ブromo-6-[1-(3,5-ジフルオロフェニル)エトキシ]-2-メチルピリジン-3-イル} - N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(1.081) イプフェントリフルコナゾール (I p f e n t r i f l u c o n a z o l e)。

【0142】

2) 複合体IまたはIIでの呼吸鎖の阻害薬、例えば、(2.001) ベンゾビンジフルピル、(2.002) ビキサフェン、(2.003) ボスカリド、(2.004) カルボキシ、(2.005) フルオピラム、(2.006) フルトラニル、(2.007) フルキサピロキサド、(2.008) フラメトピル、(2.009) イソフェタミド、(2.010) イソピラザム (アンチ-エピマー性エナンチオマー1R, 4S, 9S)、(2.011) イソピラザム (アンチ-エピマー性エナンチオマー1S, 4R, 9R)、(2.012) イソピラザム (アンチ-エピマー性ラセミ体1RS, 4SR, 9SR)、(2.013) イソピラザム (シン-エピマー性ラセミ体1RS, 4SR, 9RS及びアンチ-エピマー性ラセミ体1RS, 4SR, 9SRの混合物)、(2.014) イソピラザム (シン-エピマー性エナンチオマー1R, 4S, 9R)、(2.015) イソピラザム (シン-エピマー性エナンチオマー1S, 4R, 9S)、(2.016) イソピラザム (シン-エピマー性ラセミ体1RS, 4SR, 9RS)、(2.017) ペンフルフェン、(2.018) ペンチオピラド、(2.019) ピジフルメトフェン、(2.020) ピラジフルミド、(2.021) セダキサン、(2.022) 1,3-ジメチル-N-(1,1,3-トリメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル)-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.023) 1,3-ジメチル-N-[(3R)-1,1,3-トリメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル]-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.024) 1,3-ジメチル-N-[(3S)-1,1,3-トリメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル]-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.025) 1-メチル-3-(トリフルオロメチル)-N-[2'-(トリフルオロメチル)ピフェニル-2-イル]-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.026) 2-フルオロ-6-(トリフルオロメチル)-N-(1,1,3-トリメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル)ベンズアミド、(2.027) 3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-N-(1,1,3-トリメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル)-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.028) 3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-N-[(3R)-1,1,3-トリメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル]-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.029) 3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-N-[(3S)-1,1,3-トリメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル]-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.030) フルインダピル、(2.031) 3-(ジフルオロメチル)-N-[(3R)-7-フルオロ-1,1,3-トリメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル]-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.032) 3-(ジフルオロメチル)-N-[(3S)-7-フルオロ-1,1,3-トリメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル]-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.033) 5,8-ジフルオロ-N-[2-(2-フルオロ-4-{[4-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-イル]オキシ}フェニル)エチル]キナゾリン-4-アミン、(2.034) N-(2-シクロペンチ

10

20

30

40

50

ルー５－フルオロベンジル）－Ｎ－シクロプロピル－３－（ジフルオロメチル）－５－フル
 オロ－１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－カルボキサミド、（２．０３５）Ｎ－（２
 ーtert－ブチル－５－メチルベンジル）－Ｎ－シクロプロピル－３－（ジフルオロメ
 チル）－５－フルオロ－１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－カルボキサミド、（２．０
 ３６）Ｎ－（２－tert－ブチルベンジル）－Ｎ－シクロプロピル－３－（ジフルオロ
 メチル）－５－フルオロ－１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－カルボキサミド、（２．
 ０３７）Ｎ－（５－クロロ－２－エチルベンジル）－Ｎ－シクロプロピル－３－（ジフル
 オロメチル）－５－フルオロ－１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－カルボキサミド、（
 ２．０３８）イソフルシプラム、（２．０３９）Ｎ－〔（１Ｒ，４Ｓ）－９－（ジクロロ
 メチレン）－１，２，３，４－テトラヒドロ－１，４－メタノナフタレン－５－イル〕－
 ３－（ジフルオロメチル）－１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－カルボキサミド、（２
 ．０４０）Ｎ－〔（１Ｓ，４Ｒ）－９－（ジクロロメチレン）－１，２，３，４－テトラ
 ヒドロ－１，４－メタノナフタレン－５－イル〕－３－（ジフルオロメチル）－１－メチ
 ル－１Ｈ－ピラゾール－４－カルボキサミド、（２．０４１）Ｎ－〔１－（２，４－ジク
 ロロフェニル）－１－メトキシプロパン－２－イル〕－３－（ジフルオロメチル）－１－
 メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－カルボキサミド、（２．０４２）Ｎ－〔２－クロロ－６
 －（トリフルオロメチル）ベンジル〕－Ｎ－シクロプロピル－３－（ジフルオロメチル）
 －５－フルオロ－１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－カルボキサミド、（２．０４３）
 Ｎ－〔３－クロロ－２－フルオロ－６－（トリフルオロメチル）ベンジル〕－Ｎ－シクロ
 プロピル－３－（ジフルオロメチル）－５－フルオロ－１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－
 ４－カルボキサミド、（２．０４４）Ｎ－〔５－クロロ－２－（トリフルオロメチル）ベ
 ンジル〕－Ｎ－シクロプロピル－３－（ジフルオロメチル）－５－フルオロ－１－メチル
 －１Ｈ－ピラゾール－４－カルボキサミド、（２．０４５）Ｎ－シクロプロピル－３－（
 ジフルオロメチル）－５－フルオロ－１－メチル－Ｎ－〔５－メチル－２－（トリフルオ
 ロメチル）ベンジル〕－１Ｈ－ピラゾール－４－カルボキサミド、（２．０４６）Ｎ－シ
 クロプロピル－３－（ジフルオロメチル）－５－フルオロ－Ｎ－（２－フルオロ－６－イ
 ソプロピルベンジル）－１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－カルボキサミド、（２．０
 ４７）Ｎ－シクロプロピル－３－（ジフルオロメチル）－５－フルオロ－Ｎ－（２－イソ
 プロピル－５－メチルベンジル）－１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－カルボキサミド
 、（２．０４８）Ｎ－シクロプロピル－３－（ジフルオロメチル）－５－フルオロ－Ｎ－
 （２－イソプロピルベンジル）－１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－カルボチオアミド
 、（２．０４９）Ｎ－シクロプロピル－３－（ジフルオロメチル）－５－フルオロ－Ｎ－
 （２－イソプロピルベンジル）－１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－カルボキサミド、
 （２．０５０）Ｎ－シクロプロピル－３－（ジフルオロメチル）－５－フルオロ－Ｎ－（
 ５－フルオロ－２－イソプロピルベンジル）－１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－カル
 ボキサミド、（２．０５１）Ｎ－シクロプロピル－３－（ジフルオロメチル）－Ｎ－（２
 －エチル－４，５－ジメチルベンジル）－５－フルオロ－１－メチル－１Ｈ－ピラゾール
 －４－カルボキサミド、（２．０５２）Ｎ－シクロプロピル－３－（ジフルオロメチル）
 －Ｎ－（２－エチル－５－フルオロベンジル）－５－フルオロ－１－メチル－１Ｈ－ピラ
 ザール－４－カルボキサミド、（２．０５３）Ｎ－シクロプロピル－３－（ジフルオロメ
 チル）－Ｎ－（２－エチル－５－メチルベンジル）－５－フルオロ－１－メチル－１Ｈ－
 ピラゾール－４－カルボキサミド、（２．０５４）Ｎ－シクロプロピル－Ｎ－（２－シク
 ロプロピル－５－フルオロベンジル）－３－（ジフルオロメチル）－５－フルオロ－１－
 メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－カルボキサミド、（２．０５５）Ｎ－シクロプロピル－
 Ｎ－（２－シクロプロピル－５－メチルベンジル）－３－（ジフルオロメチル）－５－フ
 ルオロ－１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－カルボキサミド、（２．０５６）Ｎ－シク
 ロプロピル－Ｎ－（２－シクロプロピルベンジル）－３－（ジフルオロメチル）－５－フ
 ルオロ－１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－カルボキサミド、（２．０５７）ピラプロ
 ポイン。

【０１４３】

10

20

30

40

50

3) 複合体ⅠⅠⅠでの呼吸鎖の阻害薬、例えば、(3.001) アメトクトラジン、(3.002) アミスルブロム、(3.003) アゾキシストロビン、(3.004) クメトキシストロビン (coumethoxystrobin)、(3.005) クモキシストロビン、(3.006) シアゾファミド、(3.007) ジモキシストロビン、(3.008) エノキサストロビン、(3.009) ファモキサドン、(3.010) フェンアミドン、(3.011) フルフェノキシストロビン (flufenoxystrobin)、(3.012) フルオキサストロビン、(3.013) クレソキシム-メチル、(3.014) メトミノストロビン、(3.015) オリサストロビン、(3.016) ピコキシストロビン、(3.017) ピラクロストロビン、(3.018) ピラメトストロビン、(3.019) ピラオキシストロビン、(3.020) トリフロキシストロビン、(3.021) (2E)-2-{2-[(1E)-1-(3-{[(E)-1-フルオロ-2-フェニルビニル] オキシ} フェニル) エチリデン] アミノ} オキシ} メチル} フェニル}-2-(メトキシイミノ)-N-メチルアセトアミド、(3.022) (2E, 3Z)-5-{[1-(4-クロロフェニル)-1H-ピラゾール-3-イル] オキシ}-2-(メトキシイミノ)-N, 3-ジメチルペンター-3-エンアミド、(3.023) (2R)-2-{2-[(2, 5-ジメチルフェノキシ) メチル] フェニル}-2-メトキシ-N-メチルアセトアミド、(3.024) (2S)-2-{2-[(2, 5-ジメチルフェノキシ) メチル] フェニル}-2-メトキシ-N-メチルアセトアミド、(3.025) (3S, 6S, 7R, 8R)-8-ベンジル-3-[(3-[(イソブチリルオキシ) メトキシ]-4-メトキシピリジン-2-イル] カルボニル) アミノ}-6-メチル-4, 9-ジオキソ-1, 5-ジオキソナン-7-イル-2-メチルプロパノエート、(3.026) マンデストロビン、(3.027) N-(3-エチル-3, 5, 5-トリメチルシクロヘキシル)-3-ホルムアミド-2-ヒドロキシベンズアミド、(3.028) (2E, 3Z)-5-{[1-(4-クロロ-2-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-3-イル] オキシ}-2-(メトキシイミノ)-N, 3-ジメチルペンター-3-エンアミド、(3.029) メチル {5-[3-(2, 4-ジメチルフェニル)-1H-ピラゾール-1-イル]-2-メチルベンジル} カーバメート、(3.030) メチルテトラプロール、(3.031) フロリルピコキサミド (florylpicoxamid)。

【0144】

4) 有糸分裂および細胞分裂の阻害薬、例えば、(4.001) カルベンダジム、(4.002) ジエトフェンカルブ、(4.003) エタボキサム、(4.004) フルオピコリド、(4.005) ペンシクロン、(4.006) チアベンダゾール、(4.007) チオファネート-メチル、(4.008) ゾキサミド、(4.009) 3-クロロ-4-(2, 6-ジフルオロフェニル)-6-メチル-5-フェニルピリダジン、(4.010) 3-クロロ-5-(4-クロロフェニル)-4-(2, 6-ジフルオロフェニル)-6-メチルピリダジン、(4.011) 3-クロロ-5-(6-クロロピリジン-3-イル)-6-メチル-4-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル) ピリダジン、(4.012) 4-(2-ブロモ-4-フルオロフェニル)-N-(2, 6-ジフルオロフェニル)-1, 3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン、(4.013) 4-(2-ブロモ-4-フルオロフェニル)-N-(2-ブロモ-6-フルオロフェニル)-1, 3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン、(4.014) 4-(2-ブロモ-4-フルオロフェニル)-N-(2-ブロモフェニル)-1, 3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン、(4.015) 4-(2-ブロモ-4-フルオロフェニル)-N-(2-クロロ-6-フルオロフェニル)-1, 3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン、(4.016) 4-(2-ブロモ-4-フルオロフェニル)-N-(2-クロロフェニル)-1, 3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン、(4.017) 4-(2-ブロモ-4-フルオロフェニル)-N-(2-フルオロフェニル)-1, 3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン、(4.018) 4-(2-クロロ-4-フルオロフェニル)-N-(2, 6-ジフルオロフェニル)-1, 3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン、

(4.019) 4-(2-クロロ-4-フルオロフェニル)-N-(2-クロロ-6-フルオロフェニル)-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン、(4.020) 4-(2-クロロ-4-フルオロフェニル)-N-(2-クロロフェニル)-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン、(4.021) 4-(2-クロロ-4-フルオロフェニル)-N-(2-フルオロフェニル)-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン、(4.022) 4-(4-クロロフェニル)-5-(2,6-ジフルオロフェニル)-3,6-ジメチルピリダジン、(4.023) N-(2-ブromo-6-フルオロフェニル)-4-(2-クロロ-4-フルオロフェニル)-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン、(4.024) N-(2-ブromoフェニル)-4-(2-クロロ-4-フルオロフェニル)-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン、(4.025) N-(4-クロロ-2,6-ジフルオロフェニル)-4-(2-クロロ-4-フルオロフェニル)-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン。

10

【0145】

5) 多部位作用を有する化合物、例えば、(5.001) ボルドー液、(5.002) カブタホール、(5.003) キャプタン、(5.004) クロロタロニル、(5.005) 水酸化銅、(5.006) ナフテン酸銅、(5.007) 酸化銅、(5.008) 塩基性塩化銅、(5.009) 硫酸銅(2+)、(5.010) ジチアノン、(5.011) ドジン、(5.012) ホルペット、(5.013) マンコゼブ、(5.014) マネブ、(5.015) メチラム、(5.016) メチラム亜鉛、(5.017) オキシネー銅(oxine-copper)、(5.018) プロピネブ、(5.019) 硫黄および硫黄剤、例えば、多硫化カルシウム、(5.020) チラム、(5.021) ジネブ、(5.022) ジラム、(5.023) 6-エチル-5,7-ジオキソ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3',4':5,6][1,4]ジチイノ[2,3-c][1,2]チアゾール-3-カルボニトリル。

20

【0146】

6) 宿主防御を誘発する化合物、例えば、(6.001) アシベンゾラル-S-メチル、(6.002) イソチアニル、(6.003) プロベナゾール、(6.004) チアジニル。

【0147】

7) アミノ酸及び／又はタンパク質の生合成の阻害薬、例えば、(7.001) シプロジニル、(7.002) カスガマイシン、(7.003) カスガマイシン塩酸塩水和物、(7.004) オキシテトラサイクリン、(7.005) ピリメタニル、(7.006) 3-(5-フルオロ-3,3,4,4-テトラメチル-3,4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン。

30

【0148】

8) ATP産生の阻害薬、例えば、(8.001) シルチオファム。

【0149】

9) 細胞壁合成の阻害薬、例えば、(9.001) ベンチアバリカルブ、(9.002) ジメトモルフ、(9.003) フルモルフ、(9.004) イプロバリカルブ、(9.005) マンジプロパミド、(9.006) ピリモルフ、(9.007) バリフェナレート、(9.008) (2E)-3-(4-tert-ブチルフェニル)-3-(2-クロロピリジン-4-イル)-1-(モルホリン-4-イル)プロパー-2-エン-1-オン、(9.009) (2Z)-3-(4-tert-ブチルフェニル)-3-(2-クロロピリジン-4-イル)-1-(モルホリン-4-イル)プロパー-2-エン-1-オン。

40

【0150】

10) 脂質および膜の合成の阻害薬、例えば、(10.001) プロパモカルブ、(10.002) プロパモカルブ塩酸塩、(10.003) トルクロホス-メチル。

【0151】

11) メラニン生合成の阻害薬、例えば、(11.001) トリシクラゾール、(11.002) 2,2,2-トリフルオロエチル{3-メチル-1-[(4-メチルベンゾイ

50

ル) アミノ] ブタン-2-イル} カーバメート。

【0152】

12) 核酸合成の阻害薬、例えば、(12.001) ベナラキシール、(12.002) ベナラキシール-M (キララキシール (kiralaxy l))、(12.003) メタラキシール、(12.004) メタラキシール-M (メフェノキサム)。

【0153】

13) シグナル伝達の阻害薬、例えば、(13.001) フルジオキソニル、(13.002) イブロジオン、(13.003) プロシミドン、(13.004) プロキナジド、(13.005) キノキシフェン、(13.006) ピンクロゾリン。

【0154】

14) アンカプラーとして作用する化合物、例えば、(14.001) フルアジナム、(14.002) メプチルジノカップ。

【0155】

15) さらなる化合物、例えば、(15.001) アブシジン酸、(15.002) ベンチアゾール、(15.003) ベトキサジン、(15.004) カプシマイシン (capsimycin)、(15.005) カルボン、(15.006) キノメチオネート、(15.007) クフラネブ、(15.008) シフルフェナミド、(15.009) シモキサニル、(15.010) シプロスルファミド、(15.011) フルチアニル、(15.012) ホセチル-アルミニウム、(15.013) ホセチル-カルシウム、(15.014) ホセチル-ナトリウム、(15.015) メチルイソチオシアネート、(15.016) メトラフェノン、(15.017) ミルディオマイシン、(15.018) ナタマイシン、(15.019) ジメチルジチオカルバミン酸ニッケル、(15.020) ニトロタル-イソプロピル、(15.021) オキサモカルブ (oxamocarb)、(15.022) オキサチアピプロリン、(15.023) オキシフェンチン (oxyfenthin)、(15.024) ペンタクロロフェノール及び塩、(15.025) リン酸およびその塩、(15.026) プロパモカルブ-ホセチレート (propamocarb-fosetate)、(15.027) ビリオフェノン (クラザフェノン (chlazafenone))、(15.028) テブフロキン、(15.029) テクロフタラム、(15.030) トルニファニド、(15.031) 1-(4-{4-[(5R)-5-(2,6-ジフルオロフェニル)-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル]-1,3-チアゾール-2-イル} ピペリジン-1-イル)-2-[5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル] エタノン、(15.032) 1-(4-{4-[(5S)-5-(2,6-ジフルオロフェニル)-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル]-1,3-チアゾール-2-イル} ピペリジン-1-イル)-2-[5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル] エタノン、(15.033) 2-(6-ベンジルピリジン-2-イル) キナゾリン、(15.034) ジピメチトロネ (dipymetitron)、(15.035) 2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[2-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル]-1,3-チアゾール-2-イル} ピペリジン-1-イル) エタノン、(15.036) 2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[2-クロロ-6-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル]-1,3-チアゾール-2-イル} ピペリジン-1-イル) エタノン、(15.037) 2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[2-フルオロ-6-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル]-1,3-チアゾール-2-イル} ピペリジン-1-イル) エタノン、(15.038) 2-[6-(3-フルオロ-4-メトキシフェニル)-5-メチルピリジン-2-イル] キナゾリン、(15.039) 2-{(5R)-3-[2-(1-{[3,5-ビス(ジフルオロメチ

10

20

30

40

50

ル) - 1H-ピラゾール-1-イル] アセチル} ピペリジン-4-イル) - 1, 3-チアゾール-4-イル] - 4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-5-イル} - 3-クロロフェニルメタンスルホネート、(15.040) 2- {(5S) - 3- [2- (1- { [3, 5-ビス(ジフルオロメチル) - 1H-ピラゾール-1-イル] アセチル} ピペリジン-4-イル) - 1, 3-チアゾール-4-イル] - 4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-5-イル} - 3-クロロフェニルメタンスルホネート、(15.041) イプフルフェノキン (Ipflufenquin)、(15.042) 2- {2-フルオロ-6- [(8-フルオロ-2-メチルキノリン-3-イル) オキシ] フェニル} プロパン-2-オール、(15.043) 2- {3- [2- (1- { [3, 5-ビス(ジフルオロメチル) - 1H-ピラゾール-1-イル] アセチル} ピペリジン-4-イル) - 1, 3-チアゾール-4-イル] - 4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-5-イル} フェニルメタンスルホネート、(15.044) 2- {3- [2- (1- { [3, 5-ビス(ジフルオロメチル) - 1H-ピラゾール-1-イル] アセチル} ピペリジン-4-イル) - 1, 3-チアゾール-4-イル] - 4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-5-イル} フェニルメタンスルホネート、(15.045) 2-フェニルフェノール及び塩、(15.046) 3- (4, 4, 5-トリフルオロ-3, 3-ジメチル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル) キノリン、(15.047) キノフメリン (quinofumelin)、(15.048) 4-アミノ-5-フルオロピリミジン-2-オール (互変異体型: 4-アミノ-5-フルオロピリミジン-2 (1H) -オン)、(15.049) 4-オキソ-4- [(2-フェニルエチル) アミノ] ブタン酸、(15.050) 5-アミノ-1, 3, 4-チアジアゾール-2-チオール、(15.051) 5-クロロ-N'-フェニル-N'- (プロパー-2-イン-1-イル) チオフェン-2-スルホノヒドラジド、(15.052) 5-フルオロ-2- [(4-フルオロベンジル) オキシ] ピリミジン-4-アミン、(15.053) 5-フルオロ-2- [(4-メチルベンジル) オキシ] ピリミジン-4-アミン、(15.054) 9-フルオロ-2, 2-ジメチル-5- (キノリン-3-イル) -2, 3-ジヒドロ-1, 4-ベンゾオキサゼピン、(15.055) ブター-3-イン-1-イル {6- [({ [(Z) - (1-メチル-1H-テトラゾール-5-イル) (フェニル) メチレン] アミノ} オキシ) メチル] ピリジン-2-イル} カーバメート、(15.056) エチル (2Z) - 3-アミノ-2-シアノ-3-フェニルアクリレート、(15.057) フェナジン-1-カルボン酸、(15.058) プロピル3, 4, 5-トリヒドロキシベンゾエート、(15.059) キノリン-8-オール、(15.060) キノリン-8-オールサルフェート (2:1)、(15.061) tert-ブチル {6- [({ [(1-メチル-1H-テトラゾール-5-イル) (フェニル) メチレン] アミノ} オキシ) メチル] ピリジン-2-イル} カーバメート、(15.062) 5-フルオロ-4-イミノ-3-メチル-1- [(4-メチルフェニル) スルホニル] -3, 4-ジヒドロピリミジン-2 (1H) -オン、(15.063) アミノピリフェン (aminopyrifen)。

【0156】

本明細書において上記の分類(1) ~ (15)の全ての列挙された混合相手は、遊離化合物の形態で、及び／又は、官能基によって可能である場合は、その農業的に許容される塩の形態で存在することができる。

【0157】

一部の実施形態では、化合物組み合わせは、下記の成分を含む。

【0158】

(I.01) + (1.001)、(I.01) + (1.002)、(I.01) + (1.003)、(I.01) + (1.004)、(I.01) + (1.005)、(I.01) + (1.006)、(I.01) + (1.007)、(I.01) + (1.008)、(I.01) + (1.009)、(I.01) + (1.010)、(I.01) + (1.011)、(I.01) + (1.012)、(I.01) + (1.013)、(I.01) + (1.014)、(I.01) + (1.015)、(I.01) + (1.016)

50

1) + (3. 008)、(I. 01) + (3. 009)、(I. 01) + (3. 010)
 、(I. 01) + (3. 011)、(I. 01) + (3. 012)、(I. 01) + (3.
 013)、(I. 01) + (3. 014)、(I. 01) + (3. 015)、(I. 0
 1) + (3. 016)、(I. 01) + (3. 017)、(I. 01) + (3. 018)
 、(I. 01) + (3. 019)、(I. 01) + (3. 020)、(I. 01) + (3.
 021)、(I. 01) + (3. 022)、(I. 01) + (3. 023)、(I. 0
 1) + (3. 024)、(I. 01) + (3. 025)、(I. 01) + (3. 026)
 、(I. 01) + (3. 027)、(I. 01) + (3. 028)、(I. 01) + (3.
 029)、(I. 01) + (3. 030)、(I. 01) + (4. 001)、(I. 0
 1) + (4. 002)、(I. 01) + (4. 003)、(I. 01) + (4. 004)
 、(I. 01) + (4. 005)、(I. 01) + (4. 006)、(I. 01) + (4.
 007)、(I. 01) + (4. 008)、(I. 01) + (4. 009)、(I. 0
 1) + (4. 010)、(I. 01) + (4. 011)、(I. 01) + (4. 012)
 、(I. 01) + (4. 013)、(I. 01) + (4. 014)、(I. 01) + (4.
 015)、(I. 01) + (4. 016)、(I. 01) + (4. 017)、(I. 0
 1) + (4. 018)、(I. 01) + (4. 019)、(I. 01) + (4. 020)
 、(I. 01) + (4. 021)、(I. 01) + (4. 022)、(I. 01) + (4.
 023)、(I. 01) + (4. 024)、(I. 01) + (4. 025)、(I. 0
 1) + (5. 001)、(I. 01) + (5. 002)、(I. 01) + (5. 003)
 、(I. 01) + (5. 004)、(I. 01) + (5. 005)、(I. 01) + (5.
 006)、(I. 01) + (5. 007)、(I. 01) + (5. 008)、(I. 0
 1) + (5. 009)、(I. 01) + (5. 010)、(I. 01) + (5. 011)
 、(I. 01) + (5. 012)、(I. 01) + (5. 013)、(I. 01) + (5.
 014)、(I. 01) + (5. 015)、(I. 01) + (5. 016)、(I. 0
 1) + (5. 017)、(I. 01) + (5. 018)、(I. 01) + (5. 019)
 、(I. 01) + (5. 020)、(I. 01) + (5. 021)、(I. 01) + (5.
 022)、(I. 01) + (5. 023)、(I. 01) + (6. 001)、(I. 0
 1) + (6. 002)、(I. 01) + (6. 003)、(I. 01) + (6. 004)
 、(I. 01) + (7. 001)、(I. 01) + (7. 002)、(I. 01) + (7.
 003)、(I. 01) + (7. 004)、(I. 01) + (7. 005)、(I. 0
 1) + (7. 006)、(I. 01) + (8. 001)、(I. 01) + (9. 001)
 、(I. 01) + (9. 002)、(I. 01) + (9. 003)、(I. 01) + (9.
 004)、(I. 01) + (9. 005)、(I. 01) + (9. 006)、(I. 0
 1) + (9. 007)、(I. 01) + (9. 008)、(I. 01) + (9. 009)
 、(I. 01) + (10. 001)、(I. 01) + (10. 002)、(I. 01) +
 (10. 003)、(I. 01) + (11. 001)、(I. 01) + (11. 002)
 、(I. 01) + (12. 001)、(I. 01) + (12. 002)、(I. 01) +
 (12. 003)、(I. 01) + (12. 004)、(I. 01) + (13. 001)
 、(I. 01) + (13. 002)、(I. 01) + (13. 003)、(I. 01) +
 (13. 004)、(I. 01) + (13. 005)、(I. 01) + (13. 006)
 、(I. 01) + (14. 001)、(I. 01) + (14. 002)、(I. 01) +
 (15. 001)、(I. 01) + (15. 002)、(I. 01) + (15. 003)
 、(I. 01) + (15. 004)、(I. 01) + (15. 005)、(I. 01) +
 (15. 006)、(I. 01) + (15. 007)、(I. 01) + (15. 008)
 、(I. 01) + (15. 009)、(I. 01) + (15. 010)、(I. 01) +
 (15. 011)、(I. 01) + (15. 012)、(I. 01) + (15. 013)
 、(I. 01) + (15. 014)、(I. 01) + (15. 015)、(I. 01) +
 (15. 016)、(I. 01) + (15. 017)、(I. 01) + (15. 018)
 、(I. 01) + (15. 019)、(I. 01) + (15. 020)、(I. 01) +
 (15. 021)、(I. 01) + (15. 022)、(I. 01) + (15. 023)

10

20

30

40

50

、(I. 01) + (15. 024)、(I. 01) + (15. 025)、(I. 01) + (15. 026)、(I. 01) + (15. 027)、(I. 01) + (15. 028)、(I. 01) + (15. 029)、(I. 01) + (15. 030)、(I. 01) + (15. 031)、(I. 01) + (15. 032)、(I. 01) + (15. 033)、(I. 01) + (15. 034)、(I. 01) + (15. 035)、(I. 01) + (15. 036)、(I. 01) + (15. 037)、(I. 01) + (15. 038)、(I. 01) + (15. 039)、(I. 01) + (15. 040)、(I. 01) + (15. 041)、(I. 01) + (15. 042)、(I. 01) + (15. 043)、(I. 01) + (15. 044)、(I. 01) + (15. 045)、(I. 01) + (15. 046)、(I. 01) + (15. 047)、(I. 01) + (15. 048)、(I. 01) + (15. 049)、(I. 01) + (15. 050)、(I. 01) + (15. 051)、(I. 01) + (15. 052)、(I. 01) + (15. 053)、(I. 01) + (15. 054)、(I. 01) + (15. 055)、(I. 01) + (15. 056)、(I. 01) + (15. 057)、(I. 01) + (15. 058)、(I. 01) + (15. 059)、(I. 01) + (15. 060)、(I. 01) + (15. 061)、(I. 01) + (15. 062)、(I. 01) + (15. 063)、(I. 01) + (15. 064)、(I. 01) + (15. 065)、(I. 01) + (15. 066)、(I. 01) + (15. 067)、(I. 01) + (15. 068)、(I. 01) + (15. 069)、(I. 01) + (15. 070)、(I. 01) + (15. 071)、(I. 01) + (15. 072)、(I. 01) + (15. 073)、(I. 01) + (15. 074)、(I. 01) + (15. 075)、(I. 01) + (15. 076)、(I. 01)、(I. 01) + (15. 077)、(I. 01) + (15. 078)、(I. 01) + (15. 079)、(I. 01) + (15. 080)、(I. 01) + (15. 081)、(I. 01) + (15. 082)、(I. 01) + (15. 083)、(I. 01) + (15. 084)、(I. 01) + (15. 085)、(I. 01) + (15. 086)、(I. 01) + (15. 087)、(I. 01) + (15. 088)、(I. 01) + (15. 089)、(I. 01) + (15. 090)、(I. 01) + (15. 091)、(I. 01) + (15. 092)、(I. 01) + (15. 093)、(I. 01) + (15. 094)、(I. 01) + (15. 095)、(I. 01) + (15. 096)、(I. 01) + (15. 097)、(I. 01) + (15. 098)、(I. 01) + (15. 099)、(I. 01) + (15. 100)、(I. 01) + (15. 101)、(I. 01) + (15. 102)、(I. 01) + (15. 103)、(I. 01) + (15. 104)、(I. 01) + (15. 105)、(I. 01) + (15. 106)、(I. 01) + (15. 107)、(I. 01) + (15. 108)、(I. 01) + (15. 109)、(I. 01) + (15. 110)、(I. 01) + (15. 111)、(I. 01) + (15. 112)。

【0159】

これらの組み合わせにおいて、第1の成分は、表I. 1で定義の式(I)の化合物(例えばI. 01)であり、第2の成分は、本明細書で定義の群1～15で選ばれる殺菌剤である。例えば、組み合わせ(I. 01) + (1. 001)は、表I. 1における化合物I. 01及びシプロコナゾール(1. 001)を含む組み合わせに相当する。

【0160】

一部の他の実施形態において、化合物の組み合わせは、化合物(I. 01)が表I. 1で列挙された化合物のいずれか一つに置き換わっている上記の組み合わせに相当する。

【0161】

式(I)の化合物、及び群(1)～(15)から選択される殺菌剤は、100:1～1:100(式(I)の化合物:群(1)～(15)から選択される殺菌剤)の範囲の、又は50:1～1:50の範囲の、又は20:1～1:20の範囲の重量比で存在し得る。重量比範囲のさらなる例には、95:1～1:95、90:1～1:90、85:1～1:85、80:1～1:80、75:1～1:75、70:1～1:70、65:1～1

10

20

30

40

50

：65、60：1～1：60、55：1～1：55、45：1～1：45、40：1～1：40、35：1～1：35、30：1～1：30、25：1～1：25、15：1～1：15、10：1～1：10、5：1～1：5、4：1～1：4、3：1～1：3、2：1～1：2を含む。

【0162】

本明細書で定義の群1～15で選択されるさらなる殺菌剤を、化合物の組み合わせに加えることができる。

【0163】

本発明の化合物（類）及び組成物は、1以上の生物農薬と組み合わせることもできる。

【0164】

本発明の化合物（類）及び組成物と組み合わせることができる生物農薬の例には、次のものがある。

【0165】

(A) 下記の群から選択される抗細菌剤：

(A1) 細菌、例えば、(A1.1) バチルス・サブティリス (*Bacillus subtilis*)、特に株QST713/AQ713 (Bayer Crop Science LP, USからSERENADE OPTI又はSERENADE ASOとして入手可能、NRRL寄託番号B21661、米国特許第6,060,051号に記載)；(A1.2) バチルス・アミロリクエファシエンス (*Bacillus amyloliquefaciens*)、特に株D747 (Certis, USからDouble Nickel (商標名)として入手可能、寄託番号FERMBP-8234、米国特許第7,094,592号に開示)；(A1.3) バチルス・プミルス (*Bacillus pumilus*)、特に株BUF-33 (NRRL寄託番号50185)；(A1.4) バチルス・サブティリス (*Bacillus subtilis*) 変種アミロリクエファシエンス (*Amyroliquefaciens*) 株FZB24 (Novozymes, USからTaegro (登録商標)として入手可能)；(A1.5) パエニバチルス (*Paenibacillus*) 株、寄託番号NRRLB-50972又は寄託番号NRRLB-67129、国際特許公開番号WO2016/154297に記載；及び

(A2) 真菌、例えば、(A2.1) アウレオバシジウム・プルランス (*Aureobasidium pullulans*)、特に株DSM14940の出芽胞子；(A2.2) 株DSM14941のアウレオバシジウム・プルランス (*Aureobasidium pullulans*) 出芽胞子；(A2.3) アウレオバシジウム・プルランス (*Aureobasidium pullulans*)、特に株DSM14940及びDSM14941の出芽胞子の混合物；

(B) 下記の群から選択される殺菌剤：

(B1) 細菌、例えば、(B1.1) バチルス・サブティリス (*Bacillus subtilis*)、特に株QST713/AQ713 (Bayer Crop Science LP, USからSERENADE OPTI又はSERENADE ASOとして入手可能、NRRL寄託番号B21661、米国特許第6,060,051号に記載)；(B1.2) バチルス・プミルス (*Bacillus pumilus*)、特に株QST2808 (Bayer Crop Science LP, USからSONATA (登録商標)として入手可能、寄託番号NRRLB-30087、米国特許第6,245,551号に記載)；(B1.3) バチルス・プミルス (*Bacillus pumilus*)、特に株GB34 (Bayer AG, DEからYield Shield (登録商標)として入手可能)；(B1.4) バチルス・プミルス (*Bacillus pumilus*)、特に株BUF-33 (NRRL寄託番号50185)；(B1.5) バチルス・アミロリクエファシエンス (*Bacillus Amyroliquefaciens*)、特に株D747 (Certis, USからDouble Nickel (商標名)として入手可能、寄託番号FERMBP-8234、米国特許第7,094,592号に開示)；(B1.6) バチルス・サブティリス (*Bacillus subtilis*) Y

10

20

30

40

50

1336 (Bion-Tec, TaiwanからBIOBAC (登録商標) WPとして入手可能、登録番号4764、5454、5096及び5277下に台湾で生物殺菌剤として登録) ; (B1.7) バチルス・アミロリクエファシエンス (*Bacillus Amyroliquefaciens*) 株MBI600 (BASF SEからSUBTILEXとして入手可能) ; (B1.8) バチルス・サブティリス (*Bacillus subtilis*) 株GB03 (Bayer AG, DEからKodiak (登録商標)として入手可能) ; (B1.9) バチルス・サブティリス (*Bacillus subtilis*) 変種アミロリクエファシエンス (*Amyroliquefaciens*) 株FZB24 (殺菌剤TAEGRO (登録商標) 又はTAEGRO (登録商標) ECO (EPA登録番号70127-5)としてNovozymes Biologicals Inc., Salem, Virginia又はSyngenta Crop Protection, LLC, Greensboro, North Carolinaから入手可能) ; (B1.10) バチルス・ミコイデス (*Bacillus mycoides*)、分離株J (Certs USAからBmJ TGA I又はWGとして入手可能) ; (B1.11) バチルス・リチェニホルミス (*Bacillus licheniformis*)、特には株SB3086 (NovozymesからEcoGuard TM Biofungicide及びGreen Releaseとして入手可能) ; (B1.12) パエニバチルス (*Paenibacillus*) 株、寄託番号NRRLB-50972又は寄託番号NRRLB-67129、国際特許公開番号WO2016/154297に記載。

[0166]

一部の実施形態において、当該生物農薬は、フェンギシン (fengycin) 若しくはプリパスタチン (plipastatin) 型化合物、イツリン型化合物、及び／又はサーファクチン型化合物を産生するバチルス・サブティリス (*Bacillus subtilis*) 又はバチルス・アミロリクエファシエンス (*Bacillus Amyroliquefaciens*) 株である。背景二関しては、次の総覧論文: Ongena, M.ら、"Bacillus Lipopeptides: Versatile Weapons for Plant Disease Biocontrol," *Trends in Microbiology*, Vol16, No. 3, March 2008, pp. 115-125を参照する。リポペプチド類を産生する能力を有するバチルス株には、バチルス・サブティリス (*Bacillus subtilis*) QST713 (Bayer Crop Science LP、USからSERENADE OPTI又はSERENADE ASOとして入手可能、NRRL寄託番号B21661、米国特許第6,060,051号に記載)、バチルス・アミロリクエファシエンス (*Bacillus Amyroliquefaciens*) 株D747 (Certs, USからDouble Nickel (商標名)として入手可能、寄託番号FERMBP-8234、米国特許第7,094,592号に開示) ; バチルス・サブティリス (*Bacillus subtilis*) MBI600 (Becker Underwood, USからSUBTILEX (登録商標)として入手可能、EPA登録番号71840-8) ; バチルス・サブティリス (*Bacillus subtilis*) Y1336 (Bion-Tec, TaiwanからBIOBAC (登録商標) WPとして入手可能、登録番号4764、5454、5096及び5277下に台湾で生物殺菌剤として登録) ; バチルス・アミロリクエファシエンス (*Bacillus Amyroliquefaciens*)、特には株FZB42 (ABITEP, DEからRHI ZOVITAL (登録商標)として入手可能) ; 及びバチルス・サブティリス (*Bacillus subtilis*) 変種アミロリクエファシエンス (*Amyroliquefaciens*) FZB24 (Novozymes Biologicals Inc., Salem, Virginia又はSyngenta Crop Protection, LLC, Greensboro, North Carolinaから、殺菌剤TAEGRO (登録商標) 又はTAEGRO (登録商標) ECO (EPA登録番号70127-5)として入手可能) を含み ;

[0167]

(B2) 真菌、例えば：(B2.1) コニオチリウム・ミニタンス (*Coniothyrium minitans*)、特に株 CON/M/91-8 (寄託番号 DSM-9660；例えば、Bayer からの Contans (登録商標))；(B2.2) メッシュニコウィア・フルクチコラ (*Metschnikowia fructicola*)、特に株 NRRLY-30752 (例えば Shemer (登録商標))；(B2.3) ミクロスファエロプシス・オクラセア (*Microsphaeropsis ochracea*) (例えば、Prophyta からの Microx (登録商標))；(B2.5) トリコデルマ属種 (*Trichoderma* spp.)、例えば、トリコデルマ・アトロビリデ (*Trichoderma atroviride*)、国際特許出願番号 PCT/IT2008/000196 に記載の株 SC1)；(B2.6) トリコデルマ・ハルジアヌム・リファイ (*Trichoderma harzianum rifai*) 株 KRL-AG2 (株 T-22 としても知られる、/ATCC208479、例えば、PLANTSHIELD T-22G、Rootshield (登録商標)、及び BioWorks, US からの TurfShield)；(B2.14) グリオクラジウム・ロセウム (*Gliocladium roseum*)、W. F. Stoneman Company LLC からの株 321U；(B2.35) タラロミセス・フラブス (*Talaromyces flavus*)、株 V117b；(B2.36) トリコデルマ・アスペレルム (Isagro からの *Trichoderma asperellum*)、株 ICC012；(B2.37) トリコデルマ・アスペレルム (Isagro からの *Trichoderma asperellum*)、株 SKT-1 (例えば Kumiai Chemical Industry からの ECO-HOPE (登録商標))；(B2.38) トリコデルマ・アトロビリデ (*Trichoderma atroviride*)、株 CNCMI-1237 (例えば Agrauxine, FR からの Esquive (登録商標) WP)；(B2.39) トリコデルマ・アトロビリデ (*Trichoderma atroviride*)、株番号 V08/002387；(B2.40) トリコデルマ・アトロビリデ (*Trichoderma atroviride*)、株 NMI 番号 V08/002388；(B2.41) トリコデルマ・アトロビリデ (*Trichoderma atroviride*)、株 NMI 番号 V08/002389；(B2.42) トリコデルマ・アトロビリデ (*Trichoderma atroviride*)、株 NMI 番号 V08/002390；(B2.43) トリコデルマ・アトロビリデ (*Trichoderma atroviride*)、株 LC52 (例えば Agrimm Technologies Limited による Tenet)；(B2.44) トリコデルマ・アトロビリデ (*Trichoderma atroviride*)、株 ATCC20476 (IMI206040)；(B2.45) トリコデルマ・アトロビリデ (*Trichoderma atroviride*)、株 T11 (IMI352941/CECT20498)；(B2.46) トリコデルマ・ハルマツム (*Trichoderma harmatum*)；(B2.47) トリコデルマ・ハルジアヌム (*Trichoderma harzianum*)；(B2.48) トリコデルマ・ハルジアヌム・リファイ (*Trichoderma harzianum rifai*) T39 (例えば Makhteshim, US からの Trichodex (登録商標))；(B2.49) トリコデルマ・ハルジアヌム (*Trichoderma harzianum*)、特に株 KD (例えば Biological Control Products, SA からの Trichoplus (Becker Underwood によって取得))；(B2.50) トリコデルマ・ハルジアヌム (*Trichoderma harzianum*)、株 ITEM908 (例えば Koppert からの Trianum-P)；(B2.51) トリコデルマ・ハルジアヌム (*Trichoderma harzianum*)、株 TH35 (例えば Mycontrol による Root-Pro)；(B2.52) トリコデルマ・ビレンス (*Trichoderma virens*) (*Gliocladium virens* としても知られる)、特に株 GL-21 (例えば Certis, US による SoilGard12G)；(B2.53) *Trichoderma viride*、株 TV1 (例えば Koppert による Trianum-P)；

10

20

30

40

50

(B2.54) アムペロミセス・クイスクアリス (*Ampelomyces quisqualis*)、特に株AQ10 (例えばIntrachem Bio ItaliaによるAQ10 (登録商標)) ; (B2.56) アウレオバシジウム・プルランス (*Aureobasidium pullulans*)、特に株DSM14940の出芽胞子 ; (B2.57) アウレオバシジウム・プルランス (*Aureobasidium pullulans*)、特に株DSM14941の出芽胞子 ; (B2.58) アウレオバシジウム・プルランス (*Aureobasidium pullulans*)、特に株DSM14940及びDSM14941の出芽胞子の混合物 (例えばbio-ferm, CHによるBotector (登録商標)) ; (B2.64) クラドスポリウム・クラドスポリオイデス (*Cladosporium cladosporioides*)、株H39 (Stichting Dienst Landbouwkundig Onderzoekによる) ; (B2.69) グリオクラジウム・カテヌラツム (*Gliocladium catenulatum*) (同義語: クロノスタキス・ロセア・f・カテヌラテ (*Clonostachys rosea* f. *catenulate*)) 株J1446 (例えばAgBio Inc. によるPrestop (登録商標)、さらには例えばKemira Agro OyによるPrimastop (登録商標)) ; (B2.70) レカニシリウム・レカニイ (*Lecanicillium lecanii*) (以前は、ベルチシリウム・レカニイ (*Verticillium lecanii*) と称された) 株KV01の分生子 (例えばKoppert/ArystaによるVertalec (登録商標)) ; (B2.71) ペニシリウム・ベルミクラツム (*Penicillium vermiculatum*) ; (B2.72) ピチア・アノマラ (*Pichia anomala*)、株WRL-076 (NRRL Y-30842) ; (B2.75) トリコデルマ・アトロビリデ (*Trichoderma atroviride*)、株SKT-1 (FERM P-16510) ; (B2.76) トリコデルマ・アトロビリデ (*Trichoderma atroviride*)、株SKT-2 (FERM P-16511) ; (B2.77) トリコデルマ・アトロビリデ (*Trichoderma atroviride*)、株SKT-3 (FERM P-17021) ; (B2.78) トリコデルマ・ガムシル (*Trichoderma gamsii*) (以前は、T. ビリデ (*T. viride*))、株ICC080 (IMI CC 392151 CABI、例えばAGROBIOSOL DE MEXICO, S. A. DE C. V. によるBioDerma) ; (B2.79) トリコデルマ・ハルジアヌム (*Trichoderma harzianum*) 株DB 103 (例えば、Dagutat BiolabによるT-Gro 7456) ; (B2.80) トリコデルマ・ポリスפורム (*Trichoderma polysporum*)、株IMI206039 (例えばBINAB Bio-Innovation AB, SwedenによるBinab TF WP) ; (B2.81) トリコデルマ・ストロマチクム (*Trichoderma stromaticum*) (例えば、Ceplac, BrazilによるTricovab) ; (B2.83) ウロクラジウム・オウデマンシイ (*Ulocladium oudemansii*)、特に株HRU3 (例えばBotry-Zen Ltd, NZによるBotry-Zen (登録商標)) ; (B2.84) ベルチシリウム・アルボーアトルム (*Verticillium albo-atrum*) (以前は、V. ダーリアエ (*V. dahliae*))、株WCS850 (CBS276.92 ; 例えばTree Care InnovationsによるDutch Trig) ; (B2.86) ベルチシリウム・クラミドスポリウム (*Verticillium chlamydosporium*) ; (B2.87) トリコデルマ・アスペレルム (*Trichoderma asperellum*) 株ICC 012及びトリコデルマ・ガムシイ (*Trichoderma gamsii*) 株ICC080 (例えばBayer CropScience LP, USからのBIO-TAM (商標名) として知られる製品) の混合物。

【0168】

本発明の化合物 (類) 及び組成物と組み合わせることができる生物農薬のさらなる例は、次のものである：

10

20

30

40

50

【0169】

バチルス・セレウス (*Bacillus cereus*)、特に、バチルス・セレウス (*B. cereus*) 株 CNCM I-1562 及びバチルス・フィルムス (*Bacillus firmus*) 株 I-1582 (受託番号 CNCM I-1582)、バチルス・スブチリス (*Bacillus subtilis*) 株 OST 30002 (受託番号 NRRL B-50421)、バチルス・ツリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*)、特に、バチルス・ツリングエンシス 亜種 イスラエレンシス (*B. thuringiensis subspecies israelensis*) (血清型 H-14)、株 AM65-52 (受託番号 ATCC 1276)、バチルス・ツリングエンシス 亜種 アイザワイ (*B. thuringiensis subsp. aizawai*)、特に、株 ABTS-1857 (SD-1372)、バチルス・ツリングエンシス 亜種 クルスタキ (*B. thuringiensis subsp. kurstaki*) 株 HD-1、バチルス・ツリングエンシス 亜種 テネブリオニス (*B. thuringiensis subsp. tenebrionis*) 株 NB 176 (SD-5428)、パステウリア・ペネトランス (*Pasteuria penetrans*)、パステウリア属種 (*Pasteuria spp.*) (ロチレンクルス・レニホルミス (*Rotylenchulus reniformis*) 線虫) - PR3 (受託番号 ATCC SD-5834)、ストレプトミセス・ミクロフラブス (*Streptomyces microflavus*) 株 AQ6121 (=QRD 31.013、NRRL B-50550)、及びストレプトミセス・ガルブス (*Streptomyces galbus*) 株 AQ 6047 (受託番号 NRRL 30232) からなる群から選択される細菌；

ベアウベリア・バシアナ (*Beauveria bassiana*)、特に、株 ATCC 74040、レカニシリウム属種 (*Lecanicillium spp.*)、特に、株 HRO LEC 12、メタリジウム・アニソプリアエ (*Metarhizium anisopliae*)、特に、株 F52 (DSM3884 又は ATCC 90448)、パエシロミセス・フモソロセウス (*Paecilomyces fumosoroseus*) (現在：イサリア・フモソロセア (*Isaria fumosorosea*))、特に、株 IFPC 200613 又は株 Apopka 97 (受託番号 ATCC 20874)、及びパエシロミセス・リラシヌス (*Paecilomyces lilacinus*)、特に、パエシロミセス・リラシヌス (*P. lilacinus*) 株 251 (AGAL 89/030550) からなる群から選択される真菌類及び酵母類；

リンゴコカクモンハマキ (*Adoxophyes orana*) 顆粒病ウイルス (GV)、コドリガ (*Cydia pomonella*) 顆粒病ウイルス (GV)、オオタバコガ (*Helicoverpa armigera*) 核多角体病ウイルス (NPV)、シロイチモジヨトウ (*Spodoptera exigua*) mNPV、ツマジロクサヨトウ (*Spodoptera frugiperda*) mNPV、及びエジプトヨトウ (*Spodoptera littoralis*) (African cotton leaf worm) NPV からなる群から選択されるウイルス；

【0170】

植物又は植物の部分又は植物の器官に対して「接種源」として加えることができ、それらの特定に特性によって植物の成長及び植物の健康を増進する細菌類及び真菌類。例としては：

アグロバクテリウム属種 (*Agrobacterium spp.*)、アゾリゾビウム・カウリノダンス (*Azorhizobium caulinodans*)、アゾスピリillum属種 (*Azospirillum spp.*)、アゾトバクテル属種 (*Azotobacter spp.*)、ブラジリゾビウム属種 (*Bradyrhizobium spp.*)、ブルクホルデリア属種 (*Burkholderia spp.*)、特に、ブルクホルデリア・セパシア (*Burkholderia cepacia*) (以前は、プセウドモナス・セパシア (*Pseudomonas cepacia*) として知られていた)、ギガスポラ属種 (*Gigaspora spp.*) 又はギガスポラ・モノスポルム (*Gi*

gaspura monosporum)、グロムス属種 (Glomus spp.)、ラッカリア属種 (Laccaria spp.)、ラクトバチルス・ブクネリ (Lactobacillus buchneri)、パラグロムス属種 (Paraglomus spp.)、ピソリthus・チンクトルス (Pisolithus tinctorius)、プセウドモナス属種 (Pseudomonas spp.)、リゾビウム属種 (Rhizobium spp.)、特に、リゾビウム・トリホリイ (Rhizobium trifolii)、リゾポゴン属種 (Rhizopogon spp.)、スクレロデルマ属種 (Scleroderma spp.)、スイルス属種 (Suillus spp.)、及びストレプトミセス (Streptomyces spp.) がある。

【0171】

生物農薬として使用可能な、植物抽出物及び微生物によって形成される産生物（これは、タンパク質及び二次代謝産物を包含する）、例えば、ニンニク (Allium sativum)、ニガヨモギ (Artemisia absinthium)、アザジラクチン (azadirachtin)、Biokeeper WP、カシヤ・ニグリカンス (Cassia nigricans)、セラストルス・アングラツス (Celastus angulatus)、アメリカアリタソウ (Chenopodium anthelminticum)、キチン、Armour-Zen、セイヨウオシダ (Dryopteris filix-mas)、スギナ (Equisetum arvense)、Fortune Aza、Fungastop、Heads Up (キノア (Chenopodium quinoa) サポニン抽出物)、除虫菊 (Pyrethrum) / ピレトリン類、スリナムニガキ (Quassia amara)、コナラ属 (Quercus)、キラヤ属 (Quillaja)、Regalia、(「Requiem (商標名) Insecticide」)、ロテノン、リアニア / リアノジン、ヒレハリソウ (Symphytum officinale)、ヨモギギク (Tanacetum vulgare)、チモール、Triact 70、TriCon、キンレンカ (Tropaeolum majus)、セイヨウイラクサ (Urtica dioica)、Veratrin、セイヨウヤドリギ (Viscum album)、アブラナ科 (Brassicaceae) 抽出物、特に、ナタネ粉末又はカラシナ粉末である。

【0172】

本発明の化合物（類）及び組成物と混合できると考えられる殺虫剤、殺ダニ剤及び殺線虫剤、それぞれの例は、次の通りである：

【0173】

(1) アセチルコリンエステラーゼ (AChE) 阻害薬、例えば、カーバメート系、例えば、アラニカルブ、アルジカルブ、ベンジオカルブ、ベンフラカルブ、ブトカルボキシム、ブトキシカルボキシム、カルバリル、カルボフラン、カルボスルファン、エチオフェンカルブ、フェノブカルブ、ホルメタネート、フラチオカルブ、イソプロカルブ、メチオカルブ、メソミル、メトルカルブ、オキサミル、ピリミカルブ、プロボクスル、チオジカルブ、チオフアノックス、トリアザメート、トリメタカルブ、XMC、及び、キシリルカルブ；又は、有機リン酸エステル系、例えば、アセフェート、アザメチホス、アジンホスーエチル、アジンホスーメチル、カズサホス、クロルエトキシホス、クロルフェンビンホス、クロルメホス、クロルピリホスーメチル、クマホス、シアノホス、ジメトンーSーメチル、ダイアジノン、ジクロルボス / DDVP、ジクロトホス、ジメトエート、ジメチルビンホス、ダイスルホトン、EPN、エチオン、エトプロホス、ファミフル、フェナミホス、フェントロチオン、フェンチオン、ホスチアゼート、ヘプテノホス、イミシアホス、イソフェンホス、オー (メトキシアミノチオホスホリル) サリチル酸イソプロピル、イソキサチオン、マラチオン、メカルバム、メタミドホス、メチダチオン、メビンホス、モノクロトホス、ナレド、オメトエート、オキシジメトンーメチル、パラチオンーメチル、フェントエート、ホレート、ホサロン、ホスメット、ホスファミドン、ホキシム、ピリミホスーメチル、プロフェノホス、プロペタムホス、プロチオホス、ピラクロホス、ピリダフェンチオン、キナルホス、スルホテップ、テブピリムホス、テメホス、テルブホス、テ

トラクロルビンホス、チオメトン、トリアゾホス、トリクロルホン、及び、バミドチオン；

(2) GABA依存性クロライドチャンネル遮断薬、例えば、シクロジエン有機塩素系、例えば、クロルダン、及び、エンドスルファン；又は、フェニルピラゾール系（フィプロール系）、例えば、エチプロール、及び、フィプロニル；

(3) ナトリウムチャンネル調節剤、例えば、ピレスロイド系、例えば、アクリナトリン、アレスリン、d-シス-トランスアレスリン、d-トランスアレスリン、ピフェントリン、ピオアレスリン、ピオアレスリンs-シクロペンテニル異性体、ピオレスメトリン、シクロプロトリン、シフルトリン、ベーターシフルトリン、シハロトリン、ラムダーシハロトリン、ガンマーシハロトリン、シペルメトリン、アルファ-シペルメトリン、ベーターシペルメトリン、シーターシペルメトリン、ゼーターシペルメトリン、シフェノトリン〔(1R)-トランス異性体〕、デルタメトリン、エムペントリン〔(E Z)-(1R)異性体〕、エスフェンバレレート、エトフェンプロックス、フェンプロパトリン、フェンバレレート、フルシトリネート、フルメトリン、タウ-フルバリネート、ハルフェンプロックス、イミプロトリン、カデトリン、モンフルオロトリン、ペルメトリン、フェノトリン〔(1R)-トランス異性体〕、プラレトリン、ピレトリン類（除虫菊（pyrethrum））、レスメトリン、シラフルオフエン、テフルトリン、テトラメトリン、テトラメトリン〔(1R)異性体〕、トラロメトリン、及び、トランスフルトリン；又は、DDT；又は、メトキシクロル；

(4) ニコチン性アセチルコリン受容体（nAChR）競争的調節剤、例えば、ネオニコチノイド系、例えば、アセタミプリド、クロチアニジン、ジノテフラン、イミダクロプリド、ニテンピラム、チアクロプリド、及び、チアメトキサム；又は、ニコチン；又は、スルホキサフロル若しくはフルピラジフロル；

(5) ニコチン性アセチルコリン受容体（nAChR）アロステリック調節剤、例えば、スピノシン系、例えば、スピネトラム、及び、スピノサド；

(6) グルタミン酸依存性クロライドチャンネル（GluCl）アロステリック調節剤、例えば、アベルメクチン系／ミルベマイシン系、例えば、アバメクチン、エマメクチン安息香酸塩、レピメクチン、及び、ミルベメクチン；

(7) 幼若ホルモン模倣剤、例えば、幼若ホルモン類似体、例えば、ハイドロブレン、キノブレン、及び、メトブレン；又は、フェノキシカルブ；又は、ピリプロキシフェン；

(8) 各種非特異的（多部位）阻害剤、例えば、ハロゲン化アルキル系、例えば、臭化メチル、及び、別のハロゲン化アルキル、又はクロロピクリン、又はフッ化スルフルル、又はホウ砂、又は吐酒石、又はメチルイソシアネート発生剤、例えば、ダゾメット（diazomet）及びメタム；

(9) 弦音器官調節剤、例えば、ピメトロジン又はフロニカミド；

(10) ダニ成長阻害薬、例えば、クロフェンテジン、ヘキシチアゾクス、及び、ジフロピダジン；又は、エトキサゾール；

(11) 昆虫腸膜の微生物ディスラプター、例えば、バシルス・ツリングエンシス・亜種・イスラエレンシス（*Bacillus thuringiensis subspecies israelensis*）、バシルス・スファエリクス（*Bacillus sp. haericus*）、バシルス・ツリングエンシス・亜種・アイザワイ（*Bacillus thuringiensis subspecies aizawai*）、バシルス・ツリングエンシス・亜種・クルスタキ（*Bacillus thuringiensis subspecies kurstaki*）、バシルス・ツリングエンシス・亜種・テネブリオニス（*Bacillus thuringiensis subspecies tenebrionis*）、及び、Bt植物タンパク質：Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1Fa、Cry1A.105、Cry2Ab、Vip3A、mCry3A、Cry3Ab、Cry3Bb、Cry34Ab1／35Ab1；又は

(12) ミトコンドリアATPシンターゼの阻害薬、例えば、ATPディスラプター、例えばジアフェンチウロン；又は、有機スズ化合物、例えば、アゾシクロチン、シヘキサチン、及び、酸化フェンブタスズ；又は、プロパルギット；又は、テトラジホン；

10

20

30

40

50

(13) プロトン勾配破壊による酸化的リン酸化の脱共役剤、例えば、クロルフェナピル、DNO₂C、及び、スルフルアミド；

(14) ニコチン性アセチルコリン受容体チャンネル遮断剤、例えば、ベンスルタップ、カルタップ塩酸塩、チオシラム (thiocylam)、及び、チオスルタップーナトリウム；

(15) キチン生合成の阻害薬 (タイプ0)、例えば、ビストリフルロン、クロルフルアズロン、ジフルベンズロン、フルシクロクスロン、フルフェノクスロン、ヘキサフルムロン、ルフェヌロン、ノバルロン、ノビフルムロン、テフルベンズロン、及び、トリフルムロン；

(16) キチン生合成の阻害薬 (タイプ1)、例えば、ブプロフェジン；

(17) 脱皮ディスラプター (特に、双翅目、即ち双翅類の場合)、例えば、シロマジン；

(18) エクジソン受容体作動薬、例えば、クロマフェノジド、ハロフェノジド、メトキシフェノジド、及び、テブフェノジド；

(19) オクトパミン受容体作動薬、例えば、アミトラズ；

(20) ミトコンドリア複合体ⅠⅠⅠ電子伝達阻害薬、例えば、ヒドラメチルノン；又は、アセキノシル；又は、フルアクリピリム；

(21) ミトコンドリア複合体Ⅰ電子伝達阻害薬、例えば、METI殺ダニ剤の群からのもの、例えば、フェナザキン、フェンピロキシメート、ピリミジフェン、ピリダベン、テブフェンピラド、及び、トルフェンピラド；又は、ロテノン (Derris)；

(22) 電位依存性ナトリウムチャンネル遮断薬、例えば、インドキサカルブ；又は、メタフルミゾン；

(23) アセチルCoAカルボキシラーゼの阻害薬、例えば、テトロネ酸誘導体及びテトラミン酸誘導体、例えば、スピロジクロフェン、スピロメシフェン、及び、スピロテトラマト；

(24) ミトコンドリア複合体ⅠⅤ電子伝達阻害薬、例えば、ホスフィン系、例えば、リン化アルミニウム、リン化カルシウム、ホスフィン、及び、リン化亜鉛；又は、シアン化物、例えば、シアン化カルシウム、シアン化カリウム及びシアン化ナトリウム；

(25) ミトコンドリア複合体ⅠⅠ電子伝達阻害薬、例えば、β-ケトニトリル誘導体、例えばシエノピラフェン及びシフルメトフェン、並びにカルボキシアニリド類、例えばピフルブミド；

(28) リアノジン受容体調節剤、例えば、ジアミド系、例えば、クロラントラニリプロール、シアントラニリプロール、及び、フルベンジアミド；

さらなる活性化合物、例えば、アフィドピロペン、アフォキシレイナー、アサジラクチン、ベンクロチアズ、ベンゾキシメート、ビフェナゼート、プロフラニリド、プロモプロピレート、キノメチオナート、クロロプラレトリン (Chloroprallethrin)、氷晶石 (Cryolite)、シクラニリプロール、シクロキサプリド、シハロジアミド (Cyhalodiamide)、ジクロロメゾチアズ、ジコホル、ε-メトフルトリン (epsilon Metofluthrin)、ε-モムフルトリン (epsilon Momfluthrin)、フロメトキン、フルアザインドリジン、フルエンシルホン、フルフェネリム、フルフェノキシストロビン、フルフィプロール、フルヘキサホン (Fluhexafon)、フルオピラム、フルララネル、フルキサメタミド、フフェノジド (Fufenozide)、グアジピル、ヘプタフルトリン、イミダクロチズ、イプロジオン、κ-ビフェントリン、κ-テフルトリン、ロチラネル (Lotilaner)、メペルフルトリン、パイコングディング (Paichongding)、ピリダリル、ピリフルキナゾン、ピリミノストロビン、スピロブジクロフェン (Spirobudiclofen)、テトラメチルフルトリン、テトラニリプロール、テトラクロルアントラニリプロール (Tetrachlorantraniliprole)、チゴラネル (Tigolaner)、チオキサザフェン、チオフルオキシメート (Thiofluoximate)、トリフルメゾピリム (Triflumezopyrim) 及び、ヨードメタ

10

20

30

40

50

ン；さらには、バシルス・フィルムス (*Bacillus firmus*) に基づく調製物 (I-1582, BioNeem, Votivo)、さらには以下の化合物：1- {2-フルオロ-4-メチル-5- [(2, 2, 2-トリフルオロエチル) スルフィニル] フェニル} -3- (トリフルオロメチル) -1H-1, 2, 4-トリアゾール-5-アミン (WO2006/043635 から公知) (CAS 885026-50-6)、{1'- [(2E)-3- (4-クロロフェニル) プロパ-2-エン-1-イル] -5-フルオロスピロ [インドール-3, 4'-ピペリジン] -1 (2H)-イル} (2-クロロピリジン-4-イル) メタノン (WO2003/106457 から公知) (CAS 637360-23-7)、2-クロロ-N- [2- {1- [(2E)-3- (4-クロロフェニル) プロパ-2-エン-1-イル] ピペリジン-4-イル} -4- (トリフルオロメチル) フェニル] イソニコチンアミド (WO2006/003494 から公知) (CAS 872999-66-1)、3- (4-クロロ-2, 6-ジメチルフェニル) -4-ヒドロキシ-8-メトキシ-1, 8-ジアザスピロ [4. 5] デカ-3-エン-2-オン (WO2010052161 から公知) (CAS 1225292-17-0)、3- (4-クロロ-2, 6-ジメチルフェニル) -8-メトキシ-2-オキソ-1, 8-ジアザスピロ [4. 5] デカ-3-エン-4-イルエチルカーボネート (EP2647626 から公知) (CAS-1440516-42-6)、4- (ブタ-2-イン-1-イルオキシ) -6- (3, 5-ジメチルピペリジン-1-イル) -5-フルオロピリミジン (WO2004/099160 から公知) (CAS 792914-58-0)、PF1364 (JP2010/018586 から公知) (CAS 1204776-60-2)、N- [(2E)-1- [(6-クロロピリジン-3-イル) メチル] ピリジン-2 (1H)-イリデン] -2, 2, 2-トリフルオロアセトアミド (WO2012/029672 から公知) (CAS 1363400-41-2)、(3E)-3- [1- [(6-クロロ-3-ピリジル) メチル] -2-ピリジリデン] -1, 1, 1-トリフルオロプロパン-2-オン (WO2013/144213 から公知) (CAS 1461743-15-6)、N- [3- (ベンジルカルバモイル) -4-クロロフェニル] -1-メチル-3- (ペンタフルオロエチル) -4- (トリフルオロメチル) -1H-ピラゾール-5-カルボキサミド (WO2010/051926 から公知) (CAS 1226889-14-0)、5-ブromo-4-クロロ-N- [4-クロロ-2-メチル-6- (メチルカルバモイル) フェニル] -2- (3-クロロ-2-ピリジル) ピラゾール-3-カルボキサミド (CN103232431 から公知) (CAS 1449220-44-3)、4- [5- (3, 5-ジクロロフェニル) -4, 5-ジヒドロ-5- (トリフルオロメチル) -3-イソオキサゾリル] -2-メチル-N- (シス-1-オキシド-3-チエタニル) ベンズアミド、4- [5- (3, 5-ジクロロフェニル) -4, 5-ジヒドロ-5- (トリフルオロメチル) -3-イソオキサゾリル] -2-メチル-N- (トランス-1-オキシド-3-チエタニル) ベンズアミド及び4- [(5S)-5- (3, 5-ジクロロフェニル) -4, 5-ジヒドロ-5- (トリフルオロメチル) -3-イソオキサゾリル] -2-メチル-N- (シス-1-オキシド-3-チエタニル) ベンズアミド (WO2013/050317 A1 から公知) (CAS 1332628-83-7)、N- [3-クロロ-1- (3-ピリジニル) -1H-ピラゾール-4-イル] -N-エチル-3- [(3, 3, 3-トリフルオロプロピル) スルフィニル] プロパンアミド、(+) -N- [3-クロロ-1- (3-ピリジニル) -1H-ピラゾール-4-イル] -N-エチル-3- [(3, 3, 3-トリフルオロプロピル) スルフィニル] プロパンアミド及び(-) -N- [3-クロロ-1- (3-ピリジニル) -1H-ピラゾール-4-イル] -N-エチル-3- [(3, 3, 3-トリフルオロプロピル) スルフィニル] プロパンアミド (WO2013/162715 A2、WO2013/162716 A2、US2014/0213448 A1 から公知) (CAS 1477923-37-7)、5- [[(2E)-3-クロロ-2-プロペン-1-イル] アミノ] -1- [2, 6-ジクロロ-4- (トリフルオロメチル) フェニル] -4- [(トリフルオロメチル) スルフィニル] -1H-ピラゾール-3-カルボニトリル (CN101337937 A から公知) (CAS 1105672-77-2)

10

20

30

40

50

、3-ブromo-N-[4-クロロ-2-メチル-6-[(メチルアミノ) チオキソメチル] フェニル] -1-(3-クロロ-2-ピリジニル) -1H-ピラゾール-5-カルボキ
サミド、(Liudaibenji axuanan、CN103109816Aから公知)
(CAS 1232543-85-9) ; N-[4-クロロ-2-[(1, 1-ジメ
チルエチル) アミノ] カルボニル] -6-メチルフェニル] -1-(3-クロロ-2-ピ
リジニル) -3-(フルオロメトキシ) -1H-ピラゾール-5-カルボキサミド (WO
2012/034403A1から公知) (CAS 1268277-22-0)、N-[
2-(5-アミノ-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル) -4-クロロ-6-メチル
フェニル] -3-ブromo-1-(3-クロロ-2-ピリジニル) -1H-ピラゾール-5
-カルボキサミド (WO2011/085575A1から公知) (CAS 123388
2-22-8)、4-[3-[2, 6-ジクロロ-4-[(3, 3-ジクロロ-2-プロ
ペン-1-イル) オキシ] フェノキシ] プロボキシ] -2-メトキシ-6-(トリフルオ
ロメチル) ピリミジン (CN101337940Aから公知) (CAS 1108184
-52-6) ; (2E) -及び2(Z) -2-[2-(4-シアノフェニル) -1-[3
-(トリフルオロメチル) フェニル] エチリデン] -N-[4-(ジフルオロメトキシ)
フェニル] ヒドラジンカルボキサミド (CN101715774Aから公知) (CAS
1232543-85-9) ; 3-(2, 2-ジクロロエテニル) -2, 2-ジメチル-
4-(1H-ベンゾイミダゾール-2-イル) フェニル-シクロプロパンカルボン酸エス
テル (CN103524422Aから公知) (CAS 1542271-46-4) ; (4a S) -7-クロロ-2, 5-ジヒドロ-2-[(メトキシカルボニル) [4-[(トリフルオロメチル) チオ] フェニル] アミノ] カルボニル] インデノ [1, 2-e] [1, 3, 4] オキサジアジン-4a (3H) -カルボン酸メチルエステル (CN102391261Aから公知) (CAS 1370358-69-2) ; 6-デオキシ-3-O-エチル-2, 4-ジ-O-メチル-1-[N-[4-[1-[4-(1, 1, 2, 2, 2-ペンタフルオロエトキシ) フェニル] -1H-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル] フェニル] カーバメート] - α -L-マンノピラノース (US2014/0275503A1から公知) (CAS 1181213-14-8) ; 8-(2-シクロプロピルメトキシ-4-トリフルオロメチル-フェノキシ) -3-(6-トリフルオロメチル-ピリダジン-3-イル) -3-アザ-ビシクロ [3. 2. 1] オクタン (CAS 1253850-56-4)、(8-アンチ) -8-(2-シクロプロピルメトキシ-4-トリフルオロメチル-フェノキシ) -3-(6-トリフルオロメチル-ピリダジン-3-イル) -3-アザ-ビシクロ [3. 2. 1] オクタン (CAS 933798-27-7)、(8-シン) -8-(2-シクロプロピルメトキシ-4-トリフルオロメチル-フェノキシ) -3-(6-トリフルオロメチル-ピリダジン-3-イル) -3-アザ-ビシクロ [3. 2. 1] オクタン (WO2007040280A1、WO2007040282A1から公知) (CAS 934001-66-8) 及びN-[3-クロロ-1-(3-ピリジニル) -1H-ピラゾール-4-イル] -N-エチル-3-[(3, 3, 3-トリフルオロプロピル) チオ] プロパンアミド (WO2015/058021A1、WO2015/058028A1から公知) (CAS 1477919-27-9) 及びN-[4-(アミノチオキソメチル) -2-メチル-6-[(メチルアミノ) カルボニル] フェニル] -3-ブromo-1-(3-クロロ-2-ピリジニル) -1H-ピラゾール-5-カルボキサミド (CN103265527Aから公知) (CAS 1452877-50-7)、5-(1, 3-ジオキサ-2-イル) -4-[[4-(トリフルオロメチル) フェニル] メトキシ] -ピリミジン (WO2013/115391A1から公知) (CAS 1449021-97-9)、3-(4-クロロ-2, 6-ジメチルフェニル) -4-ヒドロキシ-8-メトキシ-1-メチル-1, 8-ジアザスピロ [4. 5] デカ-3-エン-2-オン (WO2010/066780A1、WO2011/151146A1から公知) (CAS 1229023-34-0)、3-(4-クロロ-2, 6-ジメチルフェニル) -8-メトキシ-1-メチル-1, 8-ジアザスピロ [4. 5] デカン-2, 4-ジオン (WO2014/187846A1から公知) (CAS 1638765-58-8)、3-(4-クロロ

10

20

30

40

50

－2，6－ジメチルフェニル）－8－メトキシ－1－メチル－2－オキソ－1，8－ジアザスピロ〔4．5〕デカ－3－エン－4－イル－炭酸エチルエステル（WO2010／066780A1、WO2011151146A1から公知）（CAS1229023－00－0）、N－〔1－〔（6－クロロ－3－ピリジニル）メチル〕－2（1H）－ピリジニリデン〕－2，2，2－トリフルオロ－アセトアミド（DE3639877A1、WO2012029672A1から公知）（CAS1363400－41－2）、〔N（E）〕－N－〔1－〔（6－クロロ－3－ピリジニル）メチル〕－2（1H）－ピリジニリデン〕－2，2，2－トリフルオロ－アセトアミド（WO2016005276A1から公知）（CAS1689566－03－7）、〔N（Z）〕－N－〔1－〔（6－クロロ－3－ピリジニル）メチル〕－2（1H）－ピリジニリデン〕－2，2，2－トリフルオロ－アセトアミド、（CAS1702305－40－5）、3－エンド－3－〔2－プロポキシ－4－（トリフルオロメチル）フェノキシ〕－9－〔〔5－（トリフルオロメチル）－2－ピリジニル〕オキシ〕－9－アザビシクロ〔3．3．1〕ノナン（WO2011／105506A1、WO2016／133011A1から公知）（CAS1332838－17－1）。

【0174】

本発明の化合物（類）及び組成物と混合することができると考えられる薬害軽減剤の例は、例えば、ペノキサコール、クロキントセット（－メキシル）、シオメトリニル、シプロスルファミド、ジクロロミド、フェンクロラゾール（－エチル）、フェンクロリム、フルラゾール、フルキソフェニム、フリラゾール、イソキサジフェン（－エチル）、メフェンピル（－ジエチル）、ナフタル酸無水物、オキサベトリニル、2－メトキシ－N－（〔4－〔（メチルカルバモイル）アミノ〕フェニル〕スルホニル）ベンズアミド（CAS129531－12－0）、4－（ジクロロアセチル）－1－オキサ－4－アザスピロ〔4．5〕デカン（CAS71526－07－3）、2，2，5－トリメチル－3－（ジクロロアセチル）－1，3－オキサゾリジン（CAS52836－31－4）である。

【0175】

本発明の化合物（類）及び組成物と混合することができると考えられる除草剤の例は、次のものである。

【0176】

アセトクロル、アシフルオルフェン、アシフルオルフェン－ナトリウム、アクロニフェン、アラクロール、アリドクロル、アロキシジム、アロキシジム－ナトリウム、アメトリン、アミカルバゾン、アミドクロル、アミドスルフロ、4－アミノ－3－クロロ－6－（4－クロロ－2－フルオロ－3－メチルフェニル）－5－フルオロピリジン－2－カルボン酸、アミノシクロピラクロル、アミノシクロピラクロル－カリウム、アミノシクロピラクロル－メチル、アミノピラリド、アミトロール、スルファミン酸アンモニウム、アンシミドール、アニロホス、アスラム、アトラジン、アザフェニジン、アジムスルフロ、ベフルブタミド、ベナゾリン－エチル、ベンフルラリン、ベンフレサート、ベンスルフロ、ベンスルフロ－メチル、ベンスリド、ベントゾン、ベンゾビシクロ、ベンゾフェナブ、ビシクロピロン、ピフェノックス、ピラナホス、ピラナホス－ナトリウム、ビスピリバク、ビスピリバク－ナトリウム、ブロマシル、ブロモブチド、ブロモフェノキシム、ブロモキシニル、ブロモキシニル－ブチレート、－カリウム、－ヘプタノエート、及び－オクタノエート、ブソキシノン、ブタクロール、ブタフェナシル、ブタミホス、ブテナクロル、ブトラリン、ブトロキシジム、ブチレート、カフェンストロール、カルベタミド、カルフェントラゾン、カルフェントラゾン－エチル、クロランベン、クロルブロムロン、クロルフェナク、クロルフェナク－ナトリウム、クロルフェンプロップ、クロルフルレノール、クロルフルレノール－メチル、クロリダゾン、クロリムロン、クロリムロン－エチル、クロロフタリム、クロロトルロン、クロルタル－ジメチル、クロルスルフロ、シニドン、シニドン－エチル、シンメチリン、シノスルフロ、クラシホス（clacyfos）、クレトジム、クロジナホップ、クロジナホップ－プロパルギル、クロマゾン、クロメプロップ、クロピラリド、クロランスラム、クロランスラム－メチル、クミルロン、シ

10

20

30

40

50

アナミド、シアナジン、シクロエート、シクロピリモレート、シクロスルファミロン、シ
 クロキシジム、シハロホップ、シハロホップーブチル、シブラジン、2, 4-D、2, 4
 -D-ブチル、ーブチル、ージメチルアンモニウム、ージオールアミン、ーエチル、ー
 2-エチルヘキシル、ーイソブチル、ーイソオクチル、ーイソプロピルアンモニウム、ー
 カリウム、ートリイソプロパノールアンモニウム及びートロールアミン、2, 4-D B、
 2, 4-D B-ブチル、ージメチルアンモニウム、ーイソオクチル、ーカリウム及びーナ
 トリウム、ダイムロン（ジムロン）、ダラボン、ダゾメット、n-デカノール、デスメジ
 ファム、デスメトリン、デトシルーピラゾラート（DTP）、ジカンバ、ジクロベニル、
 2-（2, 4-ジクロロベンジル）-4, 4-ジメチル-1, 2-オキサゾリジン-3-
 オン、2-（2, 5-ジクロロベンジル）-4, 4-ジメチル-1, 2-オキサゾリジン
 -3-オン、ジクロルプロップ、ジクロルプロップーP、ジクロホップ、ジクロホップー
 メチル、ジクロホップーP-メチル、ジクロスラム、ジフェンゾクアット、ジフルフェニ
 カン、ジフルフェンゾピル、ジフルフェンゾピルーナトリウム、ジメフロン、ジメピペレ
 ート、ジメタクロル、ジメタメトリン、ジメテナミド、ジメテナミドーP、ジメトラスル
 フロン、ジニトラミン、ジノテルブ、ジフェナミド、ジクアット、ジクアットジプロミド
 、ジチオピル、ジウロン、DNOC、エンドタール、EPTC、エスプロカルブ、エタル
 フルラリン、エタメツルフロン、エタメツルフロンーメチル、エチオジン、エトフメサート
 、エトキシフェン、エトキシフェンーエチル、エトキシスルフロン、エトベンザニド、
 F-9600、F-5331、即ちN-〔2-クロロ-4-フルオロ-5-〔4-（3-
 フルオロプロピル）-5-オキソ-4, 5-ジヒドロ-1H-テトラゾール-1-イル〕
 -フェニル〕-エタンスルホンアミド、F-7967、即ち3-〔7-クロロ-5-フル
 オロ-2-（トリフルオロメチル）-1H-ベンゾイミダゾール-4-イル〕-1-メチ
 ル-6-（トリフルオロメチル）ピリミジン-2, 4（1H, 3H）-ジオン、フェノキ
 サプロップ、フェノキサプロップーP、フェノキサプロップーエチル、フェノキサプロッ
 プーP-エチル、フェノキサスルホン、フェンキノトリオン、フェントラザミド、フラム
 プロップ、フラムプロップーM-イソプロピル、フラムプロップーM-メチル、フラザス
 ルフロン、フロラスラム、フルアジホップ、フルアジホップーP、フルアジホップーブチ
 ル、フルアジホップーP-ブチル、フルカルバゾン、フルカルバゾンーナトリウム、フル
 セトスルフロン、フルクロラリン、フルフェナセット、フルフェンピル、フルフェンピル
 -エチル、フルメツラム、フルミクロラク、フルミクロラクーペンチル、フルミオキサジ
 ン、フロオメツロン、フルレノール、フルレノールーブチル、ージメチルアンモニウム及
 びーメチル、フルオログリコフェン、フルオログリコフェンーエチル、フルプロパナート
 （flupropionate）、フルピルスルフロン、フルピルスルフロンーメチルーナ
 トリウム、フルリドン、フルロクロリドン、フルロキシピル、フルロキシピルーメブチル
 、フルルタモン、フルチアセット、フルチアセットーメチル、ホメサフェン、ホメサフェ
 ンーナトリウム、ホラムスルフロン、ホサミン、グルホシナート、グルホシナートーアン
 モニウム、グルホシナートーP-ナトリウム、グルホシナートーP-アンモニウム、グル
 ホシナートーP-ナトリウム、グリホサート、グリホサートーアンモニウム、ーイソプロ
 ピルアンモニウム、ージオン、ージメチルアンモニウム、ーカリウム、ーナトリ
 ウム及びートリメシウム、H-9201、即ちO-（2, 4-ジメチル-6-ニトロフェ
 ニル）-O-エチルイソプロピルホスホルアミドチオエート、ハロウキシフェン、ハロウ
 キシフェンーメチル、ハロサフェン、ハロスルフロン、ハロスルフロンーメチル、ハロキ
 シホップ、ハロキシホップーP、ハロキシホップーエトキシエチル、ハロキシホップーP
 -エトキシエチル、ハロキシホップーメチル、ハロキシホップーP-メチル、ヘキサジノ
 ン、HW-02、即ち（2, 4-ジクロルフェノキシ）酢酸1-（ジメトキシホスホリル）
 -エチル、イマザメタベンズ、イマザメタベンズーメチル、イマザモックス、イマザモ
 ックスーアンモニウム、イマザピック、イマザピックーアンモニウム、イマザピル、イマ
 ザピルーイソプロピルアンモニウム、イマザキン、イマザキンーアンモニウム、イマゼタ
 ピル、イマゼタピルーアンモニウム、イマゾスルフロン、インダノファン、インダジフラ
 ム、ヨードスルフロン、ヨードスルフロンーメチルーナトリウム、イオキシニル、イオキ

10

20

30

40

50

シニル-オクタノエート、-カリウム、及び-ナトリウム、イブフェンカルバゾン、イソ
 プロツロン、イソウロン、イソキサベン、イソキサフルトール、カルブチラート、KUH
 -043、即ち3-（{[5-（ジフルオロメチル）-1-メチル-3-（トリフルオロ
 メチル）-1H-ピラゾール-4-イル]メチル}スルホニル）-5，5-ジメチル-4
 ，5-ジヒドロ-1，2-オキサゾール、ケトスピラドックス、ラクトフェン、レナシル
 、リヌロン、MC PA-ブトチル、-ジメチルアンモニウム、-2-エチルヘキシル、-
 イソプロピルアンモニウム、-カリウム及び-ナトリウム、MCPB、MCPB-メチル
 、-エチル及び-ナトリウム、メコプロップ、メコプロップ-ナトリウム及び-ブトチル
 、メコプロップ-P、メコプロップ-P-ブトチル、-ジメチルアンモニウム、-2-エ
 チルヘキシル及び-カリウム、メフェナセット、メフルイジド、メソスルフロニ、メソス
 ルフロニ-メチル、メソトリオン、メタベンズチアズロン、メタム、メタミホップ、メタ
 ミトロン、メタザクロール、メタゾスルフロニ、メタベンズチアズロン、メチオピリスル
 フロニ（methiopyrisulfuron）、メチオゾリン、メチルイソチオシア
 ナート、メトブロムロン、メトラクロール、S-メトラクロール、メトスラム、メトクス
 ロニ、メトリブジン、メツルフロニ、メツルフロニ-メチル、モリネート、モノリヌロン
 、モノスルフロニ、モノスルフロニエステル類、MT-5950、即ちN-（3-クロロ
 -4-イソプロピルフェニル）-2-メチルペンタンアミド、NGGC-011、ナプロ
 パミド、NC-310、即ち[5-（ベンジルオキシ）-1-メチル-1H-ピラゾール
 -4-イル]（2，4-ジクロロフェニル）メタノン、ネブロン、ニコスルフロニ、ノナ
 ン酸（ペラルゴン酸）、ノルフルラゾン、オレイン酸（脂肪酸）、オルベンカルブ、オル
 ソスルファミロニ、オリザリン、オキサジアルギル、オキサジアゾン、オキサスルフロニ
 、オキサジクロメホン、オキシフルオルフェン、パラコート、パラコートジクロリド、ペ
 ブレート、ペンジメタリン、ペノキススラム、ペンタノクロロフェノール、ペントキサゾ
 ン、ペトキサミド、石油、フェンメジファミ、ピクロラム、ピコリナフェン、ピノキサデ
 ン、ピペロホス、プレチラクロール、プリミスルフロニ、プリミスルフロニ-メチル、プ
 ロジアミン、プロホキシジム、プロメトン、プロメトリン、プロパクロル、プロパニル、
 プロパキサホップ、プロパジン、プロファミ、プロピソクロール、プロボキシカルバゾン
 、プロボキシカルバゾン-ナトリウム、プロピリスルフロニ、プロピザミド、プロスルホ
 カルブ、プロスルフロニ、ピラクロニル、ピラフルフェン、ピラフルフェン-エチル、ピ
 ラスルホトール、ピラゾリナート（ピラゾラート）、ピラゾスルフロニ、ピラゾスルフロ
 ニ-エチル、ピラゾキシフェン、ピリバムベンズ（pyribambenz）、ピリバム
 ベンズ-イソプロピル、ピリバムベンズ-プロピル、ピリベンゾキシム、ピリブチカルブ
 、ピリダホール、ピリダート、ピリフタリド、ピリミノバック、ピリミノバック-メチル
 、ピリミスルファン、ピリチオバック、ピリチオバック-ナトリウム、ピロキサスルホン
 、ピロキシスラム（pyroxulam）、キンクロラック、キンメラック、キノクラ
 ミン、キサロホップ、キサロホップ-エチル、キサロホップ-P、キサロホップ-P-エ
 チル、キサロホップ-P-テフリル、リムスルフロニ、サフルフェナシル、セトキシジム
 、シデュロン、シマジン、シメトリン、SL-261、スルコトリオン、スルフェントラ
 ザン、スルホメツロン、スルホメツロン-メチル、スルホスルフロニ、SYN-523、
 SYP-249、即ち5-[2-クロロ-4-（トリフルオロメチル）フェノキシ]-2
 -ニトロ安息香酸1-エトキシ-3-メチル-1-オキソブト-3-エン-2-イル、S
 YP-300、即ち1-[7-フルオロ-3-オキソ-4-（プロブ-2-イン-1-イル）-3，4-ジヒドロ-2H-1，4-ベンゾオキサジン-6-イル]-3-プロピル
 -2-チオキソイミダゾリジン-4，5-ジオン、2，3，6-TBA、TCA（トリク
 ロロ酢酸）、TCA-ナトリウム、テブチウロン、テフリルトリオン、テンボトリオン、
 テブラロキシジム、テルバシル、テルブカルブ、テルブメトン、テルブチラジン、テルブ
 トリン、テニルクロール、チアゾピル、チエンカルバゾン、チエンカルバゾン-メチル、
 チフェンスルフロニ、チフェンスルフロニ-メチル、チオベンカルブ、チアフェナシル、
 トルピラレート、トブラメゾン、トラルコキシジム、トリアファモン、トリアラート、ト
 リアスルフロニ、トリアジファミ、トリベヌロン、トリベヌロン-メチル、トリクロピル

10

20

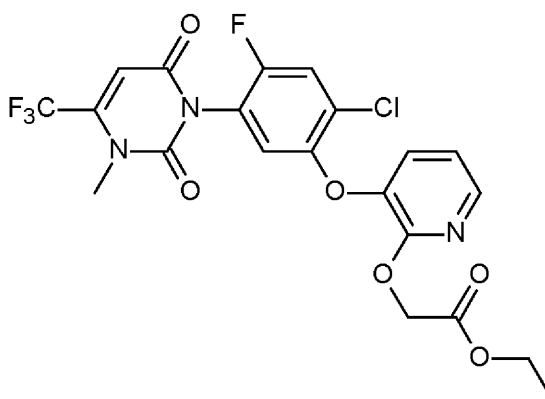
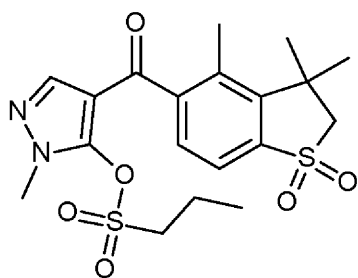
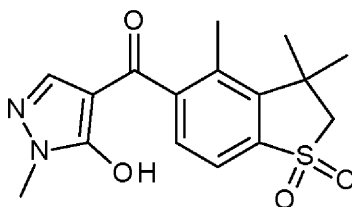
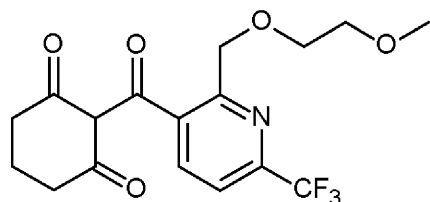
30

40

50

、トリエタジン、トリフロキシスルフロ、トリフロキシスルフロソーナトリウム、トリフルジモキサジン、トリフルラリン、トリフルスルフロ、トリフルスルフロメチル、トリトスルフロ（*tritofluron*）、硫酸尿素、ベルノレート、XDE-848、ZJ-0862、即ち3,4-ジクロロ-N-{2-[(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)オキシ]ベンジル}アニリンであり、そして、下記の化合物である。

【化21】



【0177】

植物成長調節剤の例には、次のものがある：

【0178】

アシベンゾラル、アシベンゾラル-S-メチル、5-アミノレブリン酸、アンシミドール、6-ベンジルアミノプリン、ブラシノリド、カテキン、クロロメクワットクロライド、クロプロップ、シクラニリド、3-(シクロプロプ-1-エンイル)プロピオン酸、ダミノジド、ダゾメット、n-デカノール、ジケグラック、ジケグラック-ナトリウム、エンドタール、エンドタール-ニカリウム、-ニナトリウム及びモノ(N,N-ジメチルアルキルアンモニウム)、エテホン、フルメトラリン、フルレノール、フルレノールブチル、フルルプリミドール、ホルクロルフェニユロン、ジベレリン酸、イナベンフィド、インドール-3-酢酸(IAA)、4-インドール-3-イル酪酸、イソプロチオラン、プロベナゾール、ジャスモン酸、マレイン酸ヒドラジド、メピコートクロライド、1-メチルシクロプロペン、ジャスモン酸メチル、2-(1-ナフチル)アセトアミド、1-ナフチル酢酸、2-ナフチルオキシ酢酸、ニトロフェノレート混合物、パクロブトラゾール、N-(2-フェニルエチル)-β-アラニン、N-フェニルフタルアミド酸、プロヘキサジオン、プロヘキサジオン-カルシウム、プロヒドロジャスモン、サリチル酸、ストリゴラクトン、テクナゼン、チジアズロン、トリアコンタノール、トリネキサパック、トリネキサパック-エチル、チトデフ(*tsitodef*)、ウニコナゾール、ウニコナゾール-P。

【0179】

方法及び使用

本発明の化合物(類)及び組成物は、強力な植物防御調節能力を有する。それらは、望ましくない細菌、特にキサントモナス(*Xanthomonas*)属の細菌を防除するの

に用いることができる。本発明の化合物（類）及び組成物を、種子、発芽種子、出芽苗、植物、植物部分、果実、収穫物及び／又は植物が成長する土壌を保護するのに用いることができる。

【0180】

本明細書で使用される「防除」又は「防除する」は、望ましくない微生物の予防的、保護的、治療的及び根絶処理を包含する。

【0181】

従って、本発明は、キサントモナス（*Xanthomonas*）属の細菌によって引き起こされる細菌性病害の防除方法であって、少なくとも一つの本発明の化合物又は少なくとも一つの本発明の組成物を、植物、植物部分、種子、果実に、又は植物が成長する土壌に施用する段階を含む方法に関する。

【0182】

代表的には、本発明の化合物（類）及び組成物を細菌病害の治療的又は保護的防除方法で使用する場合、その有効で植物適合性の量を、植物、植物部分、果実、種子、又は植物が成長する土壌若しくは基質に施用する。植物を栽培するのに用いることができる好適な基質には、無機系基質、例えば、ミネラルウール、特にはストーンウール、パーライト、砂又は砂利；有機基質、例えば、泥炭、松樹皮又はおがくず；及び石油系基質、例えば、高分子発泡体又はプラスチックビーズを含む。有効で植物適合性の量は、耕作地に存在するかそこで見られる可能性が高い細菌を防除するのに十分であり、その作物において植物毒性の感知可能な症状を伴わない量を意味する。そのような量は、防除される病原体、作物の種類、作物の成長段階、気候条件及び使用される個々の本発明の化合物（類）若しくは組成物に応じて、広い範囲内で変動可能である。この量は、当業者の能力の範囲内である系統的圃場試験によって決定することができる。細菌病原体、例えば、キサントモナス（*Xanthomonas*）種（例えば、キサントモナス・カンペストリス *p.v.* オリザエ（*Xanthomonas campestris p.v. Oryzae*）、シュードモナス種（例えばシュードモナス・シリंगाエ *p.v.* ラクリマンズ（*Pseudomonas syringae p.v. Lachrymans*）、エルウィニア種（例えば、エルウィニア・アミロボラ（*Erwinia amylovora*）によって引き起こされる病害を、本発明の化合物によって防除することができる。式（I）の化合物も、植物での植物病原性真菌を防除するのに有効であり得る。

【0183】

植物及び植物部分

本発明の化合物（類）及び組成物は、あらゆる植物又は植物部分に適用することができる。

【0184】

植物は、所望及び非所望の野生植物若しくは作物植物（天然作物植物を含む）のような全ての植物及び植物群を意味する。作物植物は、従来の育種及び至適化法によって、又はバイオテクノロジー法及び遺伝子工学法又はこれらの方法の組み合わせ、例えば、遺伝子組換え植物（GMO又はトランスジェニック植物）並びに植物育種家の権利によって保護可能及び保護できない植物栽培品種によって得ることができる植物であり得る。

【0185】

遺伝子組換え植物（GMO）

遺伝子組み換え植物（GMO又はトランスジェニック植物）は、異種遺伝子がゲノムに安定に組み込まれている植物である。「異種遺伝子」という表現は本質的に、植物外で提供又はアセンブルされる遺伝子であり、核に導入された場合は、葉緑体ゲノム又はミトコンドリアゲノムを意味する。この遺伝子は、対象となるタンパク質若しくはポリペプチドを発現することで、又はその植物に存在する他の遺伝子を低下又はサイレンシングすることにより（例えば、アンチセンス技術、共抑制技術、RNA干渉－RNAi－技術又はマイクロRNA－miRNA－技術を用いる）、新たな若しくは改善された農学的その他の特性を形質転換植物に与える。ゲノム中に存在する異種遺伝子は、同様にトランス遺伝子

と呼ばれる。植物のゲノム中でのその特定の位置によって定義されるトランス遺伝子は、形質転換またはトランスジェニック事象と呼ばれる。

【0186】

植物品種は、新規な特性（「形質」）を有し、従来の品種改良、突然変異誘発又は組換えDNA技術によって得られた植物を意味するものと理解すべきである。これらは、栽培品種、生物型又は遺伝子型であることができる。

【0187】

植物部分は、芽、葉、針葉、莖、幹、花、子実体、果実、種子、根、塊茎及び地下茎のような、地上及び地下の植物のあらゆる部分及び器官を意味するものと理解される。植物部分には、収穫物並びに栄養増殖物及び生殖増殖物、例えば、苗木、塊茎、地下茎、切り枝及び種子を含む。

【0188】

本発明の方法に従って処理可能な植物には、次のもの：ワタ、アマ、ブドウの木、果実、野菜、例えば、バラ科属種（*Rosaceae* sp.）（例えば、仁果、例えば、リンゴ及びナシ、さらに、核果、例えば、アンズ、サクラの木、アーモンド及びモモ、並びに、小果樹、例えば、イチゴ）、リベシオイダエ科属種（*Ribesioideae* sp.）、クルミ科属種（*Juglandaceae* sp.）、カバノキ科属種（*Betulaceae* sp.）、ウルシ科属種（*Anacardiaceae* sp.）、ブナ科属種（*Fagaceae* sp.）、クワ科属種（*Moraceae* sp.）、モクセイ科属種（*Oleaceae* sp.）、マタタビ科属種（*Actinidaceae* sp.）、クスノキ科属種（*Lauraceae* sp.）、バショウ科属種（*Musaceae* sp.）（例えば、バナナの木及びプランテーション）、アカネ科属種（*Rubiaceae* sp.）（例えば、コーヒー）、ツバキ科属種（*Theaceae* sp.）、アオギリ科属種（*Sterculiaceae* sp.）、ミカン科属種（*Rutaceae* sp.）（例えば、レモン、オレンジ及びグレープフルーツ）、ナス科属種（*Solanaceae* sp.）（例えば、トマト）、ユリ科属種（*Liliaceae* sp.）、キク科属種（*Asteraceae* sp.）（例えば、レタス）、セリ科属種（*Umbelliferae* sp.）、アブラナ科属種（*Cruciferae* sp.）、アカザ科属種（*Chenopodiaceae* sp.）、ウリ科属種（*Cucurbitaceae* sp.）（例えば、キュウリ）、ネギ科属種（*Alliaceae* sp.）（例えば、リーキ、タマネギ）、マメ科属種（*Papilionaceae* sp.）（例えば、エンドウ）；主要作物植物、例えば、イネ科属種（*Gramineae* sp.）（例えば、トウモロコシ、芝、禾穀類、例えば、コムギ、ライムギ、イネ、オオムギ、エンバク、アワ、及び、ライコムギ）、キク科属種（*Asteraceae* sp.）（例えば、ヒマワリ）、アブラナ科属種（*Brassicaceae* sp.）（例えば、白キャベツ、赤キャベツ、ブロッコリー、カリフラワー、芽キャベツ、タイサイ、コールラビ、ハツカダイコン、及びナタネ、カラシナ、セイヨウワサビ、及び、コショウソウ）、マメ科属種（*Fabaceae* sp.）（例えば、マメ、ピーナッツ）、マメ科属種（*Papilionaceae* sp.）（例えば、ダイズ）、ナス科属種（*Solanaceae* sp.）（例えば、ジャガイモ）、アカザ科属種（*Chenopodiaceae* sp.）（例えば、テンサイ、飼料用ビート、フダンソウ、ビートルート）；庭園及び森林における有用植物及び観賞植物；及びこれら植物のそれぞれの遺伝子組み換え品種を含む。

【0189】

上記で開示の方法によって処理することができる植物及び植物栽培品種には、1以上の生物ストレスに対して抵抗性である植物及び植物栽培品種を含み、すなわち、その植物は、例えば、線虫、昆虫、ダニ、植物病原菌、細菌、ウイルス及び／又はウィロイドのような有害動物及び有害微生物に対するより良好な防御を示す。

【0190】

上記で開示の方法によって処理することができる植物及び植物栽培品種には、1以上の

10

20

30

40

50

非生物ストレスに対して抵抗性である植物を含む。非生物ストレス条件には、例えば、乾燥、低温曝露、熱曝露、浸透圧ストレス、洪水、土壌塩濃度上昇、ミネラル曝露増加、オゾン曝露、高露光、窒素栄養素利用能の制限、リン栄養素利用能の制限、日陰の忌避を含み得る。

【0191】

上記で開示の方法によって処理することができる植物及び植物栽培品種には、収穫特性改善を特徴とする植物を含む。例えば、改善された植物の生理、成長及び発達、例えば水利用効率、水保持効率、窒素利用の改善、炭素同化向上、光合成向上、発芽効率上昇及び成熟加速の結果、その植物での収量増加につながり得る。収量はさらに、改善された植物構造（ストレス条件及び非ストレス条件下）によって影響され得るものであり、それには、早期開花、ハイブリッド種子製造のための開花制御、苗の元気、植物の大きさ、節間の数及び間隔、根の成長、種子の大きさ、果実の大きさ、鞘の大きさ、鞘及び穂の数、鞘又は穂当たりの種子数、種子の質量、種子充填度の強化、種子裂開の低減、減少した鞘裂開の低減及び倒伏耐性を含み、これらに限定されるものではない。さらなる収量関係の形質には、種子組成、例えば炭水化物含有量及び組成、例えばワタ若しくはデンプン、タンパク質含有量、油の含有量及び組成、栄養価、非栄養化合物の減少、加工性改善及び貯蔵安定性の向上を含む。

10

【0192】

上記で開示の方法によって処理することができる植物及び植物栽培品種には、収量増加、活力向上、健康増進及び生物及び非生物ストレスに対する抵抗性を生じる雑種強勢（heterosis）又は雑種強勢（hybrid vigor）の特徴を既に発現する交配植物である植物及び植物栽培品種を含む。

20

【0193】

上記で開示の方法によって処理することができる植物及び植物栽培品種（遺伝子工学のような植物バイオテクノロジー法によって得られる）は、除草剤耐性植物、すなわち、1以上の所定の除草剤に対して耐性とされた植物である。そのような植物は、形質転換により、又はそのような除草剤耐性を付与する突然変異を含む植物の選択によって得ることができる。

【0194】

上記で開示の方法によって処理することができる植物及び植物栽培品種（遺伝子工学のような植物バイオテクノロジー法によって得られる）には、昆虫抵抗性トランスジェニック植物、即ちある種の標的昆虫による攻撃に対して抵抗性とされた植物及び植物栽培品種を含む。そのような植物は、形質転換によって、又はそのような昆虫抵抗性を与える突然変異を含む植物の選択によって得ることができる。

30

【0195】

上記で開示の方法によって処理することができる植物及び植物栽培品種（遺伝子工学のような植物バイオテクノロジー法によって得られる）には、病害抵抗性トランスジェニック植物、即ちある種の標的昆虫による攻撃に対して抵抗性とされた植物である植物及び植物栽培品種を含む。そのような植物は、形質転換によって、又はそのような昆虫抵抗性を与える突然変異を含む植物の選択によって得ることができる。

40

【0196】

上記で開示の方法によって処理することができる植物及び植物栽培品種（遺伝子工学のような植物バイオテクノロジー法によって得られる）には、非生物ストレスに対して耐性である植物及び植物栽培品種を含む。そのような植物は、形質転換によって、又はそのようなストレス抵抗性を与える突然変異を含む植物の選択によって得ることができる。

【0197】

上記で開示の方法によって処理することができる植物及び植物栽培品種（遺伝子工学のような植物バイオテクノロジー法によって得られる）には、収穫物の量、質及び／又は貯蔵安定性の変化及び／又は収穫物の特定成分の性質変化を示す植物及び植物栽培品種を含む。

50

【0198】

上記で開示の方法によって処理することができる植物及び植物栽培品種（遺伝子工学のような植物バイオテクノロジー法によって得られる）には、繊維特性が変わった植物及び植物栽培品種、例えばワタの木を含む。そのような植物は、形質転換によって、そのような変化した繊維特性を与える突然変異を含む植物の選択によって得ることができる。

【0199】

上記で開示の方法によって処理することができる植物及び植物栽培品種（遺伝子工学のような植物バイオテクノロジー法によって得られる）には、オイルプロファイル特性が変わった植物及び植物栽培品種、例えば、アブラナ又は関連するアブラナ属（*Brassica*）植物を含む。そのような植物は、形質転換によって、又はそのような変わったオイルプロファイル特性を与える突然変異を含む植物の選択によって得ることができる。

10

【0200】

上記で開示の方法によって処理することができる植物及び植物栽培品種（遺伝子工学のような植物バイオテクノロジー法によって得られる）には、種子脱粒特性が変化した植物及び植物栽培品種、例えば、アブラナ又は関連するアブラナ属（*Brassica*）植物を含む。そのような植物は、形質転換によって、又はそのような変わった種子脱粒特性を与える突然変異を含む植物の選択によって得ることができ、種子脱粒が遅延若しくは減少した植物、例えばアブラナ植物を含む。

【0201】

上記で開示の方法によって処理することができる植物及び植物栽培品種（遺伝子工学のような植物バイオテクノロジー法によって得られる）には、翻訳後タンパク質修飾パターンが変わった植物及び植物栽培品種、例えばタバコ植物を含む。

20

【0202】

下記の実施例を考慮すると、本内容の態様についての理解をさらに深めることができるが、それらはいかなる形であっても本内容の範囲を限定するものと解釈すべきではない。

【0203】

実施例

式（I）の化合物の合成

製造例1：エチルN-〔（4，5-ジクロロ-3-メチル-2-チエニル）カルボニル〕グリシネート（化合物I. 03）の製造

30

段階1：メチル3-アミノ-4，5-ジクロロチオフェン-2-カルボキシレートの製造

メチル3-アセトアミド-4，5-ジクロロチオフェン-2-カルボキシレート1.35g（5.04mmol）を、37重量％塩酸水溶液2.1mL（25.18mmol）及びメタノール8.2mLの混合物に溶かした。混合物を75℃で3時間加熱した。冷却した反応混合物を、0℃で30重量％水酸化ナトリウム溶液によって処理した。得られた溶液を酢酸エチルで抽出した。合わせた有機層を硫酸マグネシウムで脱水し、濾過し、減圧下に濃縮して、メチル3-アミノ-4，5-ジクロロチオフェン-2-カルボキシレート812mg（純度98%、収率70%）を褐色固体として得て、そのまま次の段階で用いた。LogP=3.11。（M+H）=226。

【0204】

段階2：メチル3-ブロモ-4，5-ジクロロチオフェン-2-カルボキシレートの製造

臭化銅（II）763mg（3.41mmol）及び亜硝酸tert-ブチル0.53mL（純度90%、3.99mmol）の無水アセトニトリル（10.5mL）中溶液に、メチル3-アミノ-4，5-ジクロロチオフェン-2-カルボキシレート600mg（純度88%、2.33mmol）を0℃で少量ずつ加えた。ガス発生後、溶液を室温で18時間攪拌した。反応混合物を酢酸エチルで希釈し、1M塩酸水溶液で酸性とした。水層を酢酸エチルで3回抽出した。合わせた有機層を硫酸マグネシウムで脱水し、濾過し、減圧下に濃縮した。残留物をシリカゲルでのカラムクロマトグラフィー（勾配n-ヘプタン／酢酸エチル）によって精製して、メチル3-ブロモ-4，5-ジクロロチオフェン-2-カルボキシレート563mg（純度98%、収率82%）を黄色固体として得た。Lo

40

50

$\text{g P} = 3.99$ 。 ($\text{M} + \text{H}$) = 288。

【0205】

段階3: 3-ブロモ-4, 5-ジクロロチオフエン-2-カルボン酸 (化合物VII Ia. 03) の製造

メチル3-ブロモ-4, 5-ジクロロチオフエン-2-カルボキシレート250mg (0.86mmol) のテトラヒドロフラン (5mL) 中溶液に、1.9M水酸化カリウム水溶液1mL (1.9mmol) を滴下した。反応液を室温で18時間攪拌した。反応混合物を、酢酸エチル、水及び飽和重炭酸ナトリウム水溶液で希釈した。有機層を飽和重炭酸ナトリウム水溶液で2回洗浄した。合わせた水層を0℃で37重量%塩酸水溶液で注意深く酸性とし、酢酸エチルで抽出した。合わせた有機層を硫酸マグネシウムで脱水し、濾過し、減圧下に濃縮して、3-ブロモ-4, 5-ジクロロチオフエン-2-カルボン酸219mg (純度96%、収率88%) を白色固体として得た。 $\text{Log P} = 2.51$ 。 ($\text{M} - \text{H}$) = 273。

【0206】

段階4: エチルN- [(3-ブロモ-4, 5-ジクロロ-2-チエニル) カルボニル] グリシネート (化合物VI a. 01) の製造

不活性雰囲気下の5mLマイクロ波バイアル中、ジクロロメタン3mLに溶かした2-クロロ-1, 3-ジメチルイミダゾリジニウムクロライド157mg (0.93mmol) の溶液を、ジクロロメタン7mLに溶かした3-ブロモ-4, 5-ジクロロチオフエン-2-カルボン酸197mg (0.72mmol) 及びN, N-ジイソプロピルエチルアミン0.54mL (3.07mmol) の溶液に加えた。5分間攪拌した後、エチルグリシネート塩酸塩 (1:1) 200mg (1.43mmol) を加え、反応混合物を室温で20時間攪拌した。反応混合物を水で反応停止し、ジクロロメタンで抽出した。合わせた有機層を、硫酸マグネシウムで脱水し、濾過し、減圧下に濃縮した。残留物をシリカゲルでのカラムクロマトグラフィー (n-ヘプタン/酢酸エチル勾配) によって精製して、エチルN- [(3-ブロモ-4, 5-ジクロロ-2-チエニル) カルボニル] グリシネート209mg (純度100%、収率81%) を白色固体として得た。 $\text{Log P} = 3.33$ 。 ($\text{M} + \text{H}$) = 360。

【0207】

段階5: エチルN- [(4, 5-ジクロロ-3-メチル-2-チエニル) カルボニル] グリシネート (化合物I. 03) の製造

不活性雰囲気下の5mLマイクロ波バイアル中、エチルN- [(3-ブロモ-4, 5-ジクロロ-2-チエニル) カルボニル] グリシネート100mg (0.27mmol)、メチルボロン酸25mg (0.41mmol)、酢酸パラジウム (II) 3.1mg (0.01mmol)、トリシクロヘキシルホスフィン7.8mg (0.02mmol) 及び三塩基性リン酸カリウム206mg (0.96mmol) をその順に加え、続いて、脱気トルエン (1.25mL) 及び水 (0.13mL) を加えた。バイアルを密閉し、反応混合物を100℃で18時間攪拌した。反応混合物を水で希釈し、ジクロロメタンで抽出した。合わせた有機層をChem E lut (商標名) カートリッジで濾過し、減圧下に濃縮した。残留物を分取高速液体クロマトグラフィー (アセトニトリル/ギ酸水溶液 (1% 勾配) によって精製して、エチルN- [(4, 5-ジクロロ-3-メチル-2-チエニル) カルボニル] グリシネート38mg (純度100%、収率46%) を白色固体として得た。 $\text{Log P} = 2.95$ 。 ($\text{M} + \text{H}$) = 296。

【0208】

製造例2: エチルN- [(4, 5-ジブロモ-3-メチル-2-チエニル) カルボニル] -バリネート (化合物I. 04) の製造

テトラヒドロフラン3mLに溶かした4, 5-ジブロモ-3-メチルチオフエン-2-カルボン酸154mg (0.50mmol) 及びDL-バリンエチルエステル塩酸塩183mg (1.00mmol) の溶液に、トリエチルアミン0.21mL (1.51mmol) を加え、続いて、酢酸エチル中の0.45mL (0.75mmol) の50重量%ブ

10

20

30

40

50

ロパンホスホン酸無水物の溶液を加えた。反応混合物を室温で2時間攪拌した。反応混合物を重炭酸ナトリウム水溶液で反応停止し、酢酸エチルで抽出した。合わせた有機層を硫酸マグネシウムで脱水し、濾過し、減圧下に濃縮した。残留物をシリカゲルでのカラムクロマトグラフィー（*n*-ヘプタン／酢酸エチル勾配）によって精製して、エチル N-〔（4，5-ジブromo-3-メチル-2-チエニル）カルボニル〕-バリネート 103 mg（純度 95%、収率 45%）を白色固体として得た。Log P = 4.32。（M+H）= 426。

【0209】

製造例 3：N-〔（4，5-ジブromo-3-メチル-2-チエニル）カルボニル〕-バリニン（化合物 I.07）の製造

エチル N-〔（4，5-ジブromo-3-メチル-2-チエニル）カルボニル〕-バリネート 164 mg（0.38 mmol）のテトラヒドロフラン（3 mL）中溶液に、1 M 水酸化リチウム溶液 0.81 mL（0.81 mmol）を滴下した。反応液を室温で 18 時間攪拌した。反応混合物を酢酸エチル及び飽和重炭酸ナトリウム水溶液で希釈した。有機層を飽和重炭酸ナトリウム水溶液で 2 回洗浄した。合わせた水層を、注意深く 0℃で 37 重量%塩酸水溶液で酸性とし、酢酸エチルで抽出した。合わせた有機層を硫酸マグネシウムで脱水し、濾過し、減圧下に濃縮して、N-〔（4，5-ジブromo-3-メチル-2-チエニル）カルボニル〕-バリニン 151 mg（純度 98%、収率 96%）を白色固体として得た。Log P = 2.92。（M+H）= 398。

【0210】

製造例 4：エチル 1-〔〔（4，5-ジブromo-3-メチル-2-チエニル）カルボニル〕アミノ〕シクロプロパンカルボキシレート（化合物 I.01）の製造

エチル 1-〔〔（4-ブromo-3-メチル-2-チエニル）カルボニル〕アミノ〕シクロプロパンカルボキシレート（化合物 IXa.01）200 mg（0.60 mmol）の無水 N，N-ジメチルホルムアミド（6 mL）中溶液に、N-ブromoコハク酸イミド 129 mg（0.72 mmol）を加えた。反応液を 50℃で 18 時間攪拌した。反応混合物を酢酸エチルと水の間で分配し、酢酸エチルで抽出した。合わせた有機層を Chem E lut（商標名）カートリッジで濾過し、減圧下に濃縮した。残留物を分取高速液体クロマトグラフィー（アセトニトリル／ギ酸水溶液（1%）勾配）によって精製して、エチル 1-〔〔（4，5-ジブromo-3-メチル-2-チエニル）カルボニル〕アミノ〕シクロプロパンカルボキシレート 148 mg（純度 100%、収率 60%）を白色固体として得た。Log P = 3.22。（M+H）= 410。

【0211】

製造例 5：エチル 1-〔〔（4，5-ジブromo-3-メチル-2-チエニル）カルボニル〕アミノ〕シクロプロパンカルボキシレート（化合物 I.01）の製造

段階 1：エチル 1-〔〔（4-ブromo-5-〔（tert-ブトキシカルボニル）アミノ〕-3-メチル-2-チエニル）カルボニル〕アミノ〕シクロプロパンカルボキシレート（化合物 XIa.01）の製造

ジクロロメタン 1.4 mL に溶かした 4-ブromo-5-〔（tert-ブトキシカルボニル）アミノ〕-3-メチルチオフェン-2-カルボン酸（化合物 XIIIIa.02）92 mg（0.27 mmol）及びエチル 1-アミノシクロプロパンカルボキシレート塩酸塩 67 mg（0.41 mmol）の溶液に、N，N-ジイソプロピルエチルアミン 0.14 mL（0.82 mmol）と、続いて 1-〔ビス（ジメチルアミノ）メチレン〕-1H-1，2，3-トリアゾロ〔4，5-b〕ピリジニウム 3-オキサイドヘキサフルオロホスフェート 135 mg（0.35 mmol）を加えた。反応混合物を室温で 3.5 時間攪拌した。反応混合物を水で反応停止し、ジクロロメタンで抽出した。合わせた有機層を、Chem E lut（商標名）カートリッジで濾過し、減圧下に濃縮した。残留物をシリカゲルでのカラムクロマトグラフィー（*n*-ヘプタン／酢酸エチル勾配）によって精製して、エチル 1-〔〔（4-ブromo-5-〔（tert-ブトキシカルボニル）アミノ〕-3-メチル-2-チエニル）カルボニル）アミノ〕シクロプロパンカルボキシレート 95

10

20

30

40

50

mg (純度 93%、収率 72%) を橙赤色固体として得た。Log P = 3.28。 (M + H) = 447。

【0212】

段階2: エチル 1- { [(5-アミノ-4-ブロモ-3-メチル-2-チエニル) カルボニル] アミノ} シクロプロパンカルボキシレート (化合物 Xa. 01) の製造

1- [(tert-ブトキシカルボニル) アミノ] -3-メチル-2-チエニル} カルボニル] アミノ} シクロプロパンカルボキシレート 60 mg (0.13 mmol) のクロロホルム (0.60 mL) 中溶液に、トリフルオロ酢酸 0.62 mL を加えた。反応液を室温で 18 時間攪拌した。反応混合物をトルエンで希釈し、減圧下に濃縮した。残留物を分取高速液体クロマトグラフィー (アセトニトリル/酢酸アンモニウム水溶液 (1 mM) 勾配) によって精製して、エチル 1- { [(5-アミノ-4-ブロモ-3-メチル-2-チエニル) カルボニル] アミノ} シクロプロパンカルボキシレート 35 mg (純度 100%、収率 74%) を白色固体として得た。Log P = 1.92。 (M + H) = 347。

【0213】

段階3: エチル 1- { [(4, 5-ジブロモ-3-メチル-2-チエニル) カルボニル] アミノ} シクロプロパンカルボキシレート (化合物 I. 01) の製造

臭化銅 (II) (28.9 mg、0.13 mmol) の無水アセトニトリル (0.5 mL) 中溶液に、亜硝酸 tert-ブチル (17 μL、0.13 mmol) を 0°C で滴下した。反応混合物を昇温させて室温としてから、エチル 1- { [(5-アミノ-4-ブロモ-3-メチル-2-チエニル) カルボニル] アミノ} シクロプロパンカルボキシレート 30 mg (0.08 mmol) の無水アセトニトリル (0.7 mL) 中溶液を滴下した。反応混合物を室温で 2 時間攪拌した。反応混合物を酢酸エチルで希釈し、注意深く 1 M 塩酸水溶液で酸性とした。水層を酢酸エチルで 3 回抽出した。合わせた有機層を硫酸マグネシウムで脱水し、濾過し、減圧下に濃縮した。残留物を、シリカゲルでのカラムクロマトグラフィー (n-ヘプタン/酢酸エチル勾配) によって精製して、エチル 1- { [(4, 5-ジブロモ-3-メチル-2-チエニル) カルボニル] アミノ} シクロプロパンカルボキシレート 11 mg (純度 100%、収率 31%) を白色固体として得た。Log P = 3.19。 (M + H) = 410。

【0214】

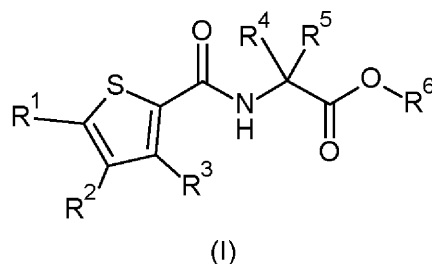
例示的化合物

表 I. 1、I. 2、I. 3、I. 4、I. 5、I. 6 及び I. 7 に示した本発明による例示的化合物を、上記で提供の実施例と同様にして、及び/又は本明細書で開示の方法の一般的説明に従って製造した。それらの例示的化合物は、異なって指定されていない限りはラセミ体である。

【0215】

下記の表 I. 1 に、式 (I) による化合物の例を非限定的に示している。

【化 22】



【0216】

表 I. 1:

【表 1】

実施例 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	LogP	エナンチオマ ー	旋光度*
I.01	Br	Br	Me	-CH ₂ -CH ₂ -		Et	3.19 ^[a]		
I.02	Br	Br	Me	H	H	Et	3.02 ^[a]		
I.03	Cl	Cl	Me	H	H	Et	2.90 ^[a]		
I.04	Br	Br	Me	イソプロピル	H	Et	4.32 ^[a]		
I.05	Br	Br	Me	2-メチルプロピル	H	Et	4.56 ^[a]		
I.06	Br	Br	Me	-CH ₂ -CH ₂ -		H	2.25 ^[a]		
I.07	Br	Br	Me	イソプロピル	H	H	2.92 ^[a]		
I.08	Br	Br	Me	プロパン-2-イル	H	Et	4.32 ^[a]	(S)	+22.1° (c=0.99, CH ₂ Cl ₂ , 20°C)
I.09	Br	Br	Me	H	H	Me	2.64 ^[a]		
I.10	Br	Br	Me	H	H	H	2.05 ^[a]		
I.11	Br	Br	Me	プロパン-2-イル	H	Me	3.87 ^[a]	(S)	+3.6° (c=1.13, MeOH, 25°C)
I.12	Br	Br	Me	イソプロピル	H	(Z)-ヘキサ-3-エン-1-イル	5.75 ^[a]		
I.13	Br	Br	Me	イソプロピル	H	プロパン-2-イル-1-イル	4.06 ^[a]		
I.14	Br	Br	Me	イソプロピル	H	2-メチルプロピル	5.22 ^[a]		
I.15	Br	Br	Me	イソプロピル	H	シアノメチル	3.69 ^[a]		
I.16	Br	Br	Me	イソプロピル	H	オキセタン-3-イル	3.58 ^[a]		

10

20

30

40

50

実施例 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	LogP	エナンチオマ ー	旋光度*
I.17	Br	Br	Me	イソプロピル	H	チエタン-3-イル	4.67 ^[a]		
I.18	Br	Br	Me	イソプロピル	H	1,1-ジオキソチエタン -3-イル	3.42 ^[a]		
I.19	Br	Br	Me	イソプロピル	H	オキソラン-3-イル	3.78 ^[a]		
I.20	Br	Br	Me	イソプロピル	H	トリメチルシリルメチ ル	5.78 ^[a]		
I.21	Br	Br	Me	Me	H	Et	3.39 ^[a]		
I.22	Br	Br	Me	ブタン-2-イル	H	Me	4.30 ^[a]	(2S,3S)	
I.23	Br	Br	Me	(4-ヒドロキシフェニル)メチ ル	H	Et	3.33 ^[a]		
I.24	Cl	Cl	Me	2-メチルスルファニルエチ ル	H	Et	3.94 ^[a]	(S)	+26.4° (c=1.06, CDCl ₃ , 25°C)
I.25	Cl	Cl	Me	イソプロピル	H	Et	4.23 ^[a]	(S)	+44.7° (c=1.08, CDCl ₃ , 25°C)
I.26	Cl	Cl	Me	ベンジル	H	Et	4.46 ^[a]	(S)	+91° (c=1.06, CDCl ₃ , 25°C)
I.27	Cl	Cl	Me	Me	H	Et	3.31 ^[a]		
I.28	Cl	Cl	Me	H	H	tert-ブチル	3.77 ^[a]		
I.29	Cl	Cl	Me	イソプロピル	H	Me	3.79 ^[a]	(S)	+40° (c=1, CDCl ₃ , 25°C)

【 0 2 1 7 】

10

20

30

40

50

実施例 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	LogP	エナンチオマ ー	旋光度*
I.30	Cl	Cl	Me	2-メチルスルファニルエチ ル	H	Me	3.55 ^[a]	(S)	+30.8° (c=1.04, CDCl ₃ , 25°C)
I.31	Cl	Cl	Me	H	H	Me	2.51 ^[a]		
I.32	Cl	Cl	Me	ブタン-2-イル	H	Me	4.23 ^[a]	(2S,3S)	+46.9° (c=1.07, CDCl ₃ , 25°C)
I.33	Cl	Cl	Me	2-メチルプロピル	H	Et	4.54 ^[a]	(S)	+29.4° (c=1.02, CDCl ₃ , 25°C)
I.34	Cl	Cl	Me	H	H	ベンジル	3.76 ^[a]		
I.35	Cl	Cl	Me	2-メチルスルファニルエチ ル	H	Me	3.55 ^[a]		
I.36	Cl	Cl	Me	2-メチルスルファニルエチ ル	H	Me	3.55 ^[a]	(R)	
I.37	Cl	Cl	Me	2-メチルプロピル	H	Et	4.51 ^[a]		
I.38	Cl	Cl	Me	ベンジル	H	Et	4.46 ^[a]		
I.39	Cl	Cl	Me	(4-ヒドロキシフェニル)メチ ル	H	Et	3.29 ^[a]		
I.40	Cl	Cl	Me	イソプロピル	H	Et	4.23 ^[a]		
I.41	Cl	Cl	Me	H	H	イソプロピル	3.29 ^[a]		
I.42	Cl	Cl	Me	Me	H	Et	3.31 ^[a]	(R)	
I.43	Cl	Cl	Me	-CH ₂ -CH ₂ -		Et	3.08 ^[a]		

10

20

30

40

50

実施例 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	LogP	エナンチオマ ー	旋光度*
I.44	Cl	Cl	Me	イソプロピル	H	Et	4.23 ^[a]	(R)	-48.4° (c=1.08, CDCl ₃ , 25°C)
I.45	Cl	Cl	Me	ベンジル	H	Et	4.46 ^[a]	(R)	-91.2° (c=1.08, CDCl ₃ , 25°C)
I.46	Cl	Cl	Me	イソプロピル	H	Me	3.79 ^[a]	(R)	
I.47	Cl	Cl	Me	2-メチルスルファニルエチ ル	H	Et	3.94 ^[a]		
I.48	Cl	Cl	Me	H	H	プロピル	3.35 ^[a]		
I.49	Br	Br	Me	イソプロピル	H	イソプロピル	4.77 ^[a]		
I.50	Cl	Cl	Me	-CH ₂ -CH ₂ -	H	Me	2.75 ^[a]		
I.51	Cl	Cl	Me	-CH ₂ -CH ₂ -		H	2.26 ^[a]		
I.52	Br	Br	Me	イソプロピル	H	シクロプロピルメチル	4.80 ^[a]		
I.53	Br	Br	Me	イソプロピル	H	シクロブチル	4.98 ^[a]		
I.54	Br	Br	Me	イソプロピル	H	プロピル	4.77 ^[a]		
I.55	Br	Br	Me	イソプロピル	H	ブチル	5.25 ^[a]		
I.56	Br	Br	Me	イソプロピル	H	シクロプロピル	4.37 ^[a]		
I.57	Br	Br	Me	イソプロピル	H	ベンジル	5.03 ^[a]		
I.58	Br	Br	Me	イソプロピル	H	アリル	4.46 ^[a]		
I.59	Br	Br	Me	イソプロピル	H	2,2,2-トリフルオロエ チル	4.51 ^[a]		

【 0 2 1 8 】

10

20

30

40

50

実施例 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	LogP	エナンチオマ ー	旋光度*
I.60	Br	Br	Me	イソプロピル	H	フェニル	4.85 ^[a]		
I.61	Br	Br	Me	イソプロピル	H	tert-ブチル	5.25 ^[a]		
I.62	Br	Br	Me	プロパン-2-イル	H	Et	4.37 ^[a]	(R)	-44.4° (c=1.04, CDCl ₃ , 25°C)
I.63	Br	Br	Me	プロパン-2-イル	H	Me	3.91 ^[a]	(R)	
I.64	Br	Br	Me	イソプロピル	H	Me	3.91 ^[a]		
I.65	Br	Br	Me	ベンジル	H	Et	4.59 ^[a]	(R)	-64.1° (c=1.41, CDCl ₃ , 25°C)
I.66	Br	Br	Me	ベンジル	H	Et	4.59 ^[a]	(S)	+58° (c=1, CDCl ₃ , 25°C)
I.67	Br	Br	Me	ベンジル	H	Et	4.59 ^[a]		
I.68	Br	Br	Me	2-メチルプロピル	H	Et	4.66 ^[a]	(R)	-28° (c=1, CDCl ₃ , 25°C)
I.69	Br	Br	Me	2-メチルプロピル	H	Et	4.66 ^[a]	(S)	+26° (c=1, CDCl ₃ , 25°C)
I.70	Br	Br	Me	2-メチルスルファニルエチ ル	H	Me	3.69 ^[a]	(R)	
I.71	Br	Br	Me	2-メチルスルファニルエチ ル	H	Me	3.69 ^[a]	(S)	+26° (c=1, CDCl ₃ , 25°C)
I.72	Br	Br	Me	2-メチルスルファニルエチ ル	H	Me	3.69 ^[a]		
I.73	Cl	Cl	Me	ベンジル	H	Me	4.12 ^[a]	(S)	
I.74	Cl	Cl	Me	2-メチルプロピル	H	Et	4.59 ^[a]	(R)	

【 0 2 1 9 】

10

20

30

40

50

実施例 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	LogP	エナンチオマ ー	旋光度*
I.75	Cl	Cl	Me	フェニル	H	Et	4.37 ^[a]		
I.76	Br	Br	Me	フェニル	H	Et	4.44 ^[a]		
I.77	Br	Br	Me	H	H	oxan-4-イル	2.86 ^[a]		
I.78	Br	Br	Me	H	H	イソプロピル	3.40 ^[a]		
I.79	Br	Br	Me	Me	H	H	2.39 ^[a]		
I.80	Cl	Cl	Me	H	H	H	2.05 ^[a]		
I.81	Cl	Cl	Me	Me	H	H	2.28 ^[a]		
I.82	Cl	Cl	Me	イソプロピル	H	H	2.96 ^[a]		
I.83	Cl	Cl	Me	ブタン-2-イル	H	H	3.31 ^[a]	(2S,3S)	+12.9 °C (c=1.4, DMSO, 25 °C)
I.84	Cl	Cl	Me	2-メチルプロピル	H	H	3.31 ^[a]		
I.85	Cl	Cl	Me	2-メチルスルファニルエチ ル	H	H	2.80 ^[a]		
I.86	Cl	Cl	Me	ベンジル	H	H	3.31 ^[a]		
I.87	Br	Br	Me	2-メチルスルファニルエチ ル	H	H	2.89 ^[a]		
I.88	Br	Br	Me	ベンジル	H	H	3.30 ^[a]		
I.89	Br	Br	Me	ブタン-2-イル	H	H	3.37 ^[a]	(2S,3S)	+14.3 °C (c=1.40, MeOH, 20 °C)
I.90	Br	Br	Me	2-メチルプロピル	H	H	3.34 ^[a]		

10

20

30

40

50

実施例 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	LogP	エナンチオマ ー	旋光度*
I.91	Cl	Cl	Me	イソプロピル	H	Me	4.34 ^[a]		
I.92	Br	Br	Me	-CH ₂ -CH ₂ -		Me	2.86 ^[a]		

注: Me: メチル, Et: エチル
*旋光度: 濃度 c は g/100 mL で表される

【 0 2 2 0 】
下記の表 I . 2 に、式 (I V a) による中間体の例を非限定的に示している。

10

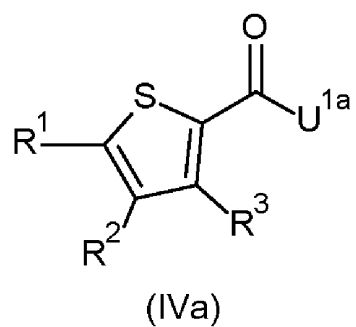
20

30

40

50

【化 2 3】



10

【 0 2 2 1】

表 I . 2 :

【表 2】

実施例番号	R ¹	R ²	R ³	U ^{1a}	LogP
IVa.01	Br	Br	Me	2-メチルプロポキシ	6.12 ^[a]
IVa.02	Cl	Cl	Me	OEt	4.80 ^[a]
IVa.03	Cl	Cl	Me	2-メチルプロポキシ	6.05 ^[a]

20

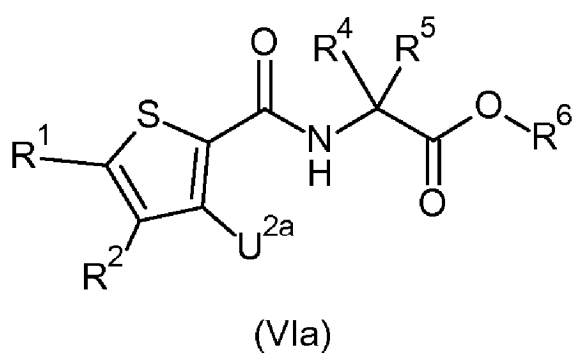
注: Me: メチル, Et: エチル

【 0 2 2 2】

下記の表 I . 3 に、式 (V I a) による中間体の例を非限定的に示している。

【化 2 4】

30



40

【 0 2 2 3】

表 I . 3 :

50

【表 3】

実施例番号	R ¹	R ²	R ⁴	R ⁵	R ⁶	U ^{2a}	LogP
Vla.01	Cl	Cl	H	H	Et	Br	3.33 ^[a]
Vla.02	Cl	Cl	H	H	Me	I	2.90 ^[a]
Vla.03	Br	Br	H	H	Me	I	2.96 ^[a]
Vla.04	Cl	Cl	-CH ₂ -CH ₂ -		Et	Br	3.45 ^[a]
Vla.05	Cl	Cl	-CH ₂ -CH ₂ -		Et	I	3.39 ^[a]
Vla.06	Cl	Cl	-CH ₂ -CH ₂ -		H	I	2.34 ^[a]
Vla.07	Br	Br	-CH ₂ -CH ₂ -		Et	I	3.41 ^[a]
Vla.08	Br	Br	-CH ₂ -CH ₂ -		Me	I	3.06 ^[a]
Vla.09	Br	Br	-CH ₂ -CH ₂ -		H	I	2.43 ^[a]
Vla.10	Br	Br	H	H	Et	I	3.35 ^[a]
Vla.11	Br	Br	イソプロピル	H	Et	I	4.78 ^[a]
Vla.12	Cl	Cl	H	H	Et	I	3.31 ^[a]
Vla.13	Cl	Cl	H	H	H	I	2.21 ^[a]
Vla.14	Br	Br	ベンジル	H	Et	I	4.93 ^[a]
Vla.15	Br	Br	2-メチルプロピル	H	Et	I	5.01 ^[a]
Vla.16	Br	Br	2-メチルスルファニルエチル	H	Et	I	4.37 ^[a]
Vla.17	Cl	Cl	イソプロピル	H	Et	Br	4.88 ^[a]

実施例番号	R ¹	R ²	R ⁴	R ⁵	R ⁶	U ^{2a}	LogP
Vla.18	Cl	Cl	2-メチルプロピル	H	Et	Br	5.17 ^[a]
Vla.19	Cl	Cl	2-メチルスルファニルエチル	H	Et	Br	4.46 ^[a]
Vla.20	Cl	Cl	ベンジル	H	Et	Br	5.01 ^[a]
Vla.21	Cl	Cl	イソプロピル	H	Et	I	4.85 ^[a]
Vla.22	Cl	Cl	2-メチルプロピル	H	Et	I	5.08 ^[a]
Vla.23	Cl	Cl	2-メチルスルファニルエチル	H	Et	I	4.40 ^[a]
Vla.24	Cl	Cl	ベンジル	H	Et	I	5.00 ^[a]

注: Me: メチル, Et: エチル

【0224】

下記の表 I . 4 に、式 (V I I I a) による中間体の例を非限定的に示している。

10

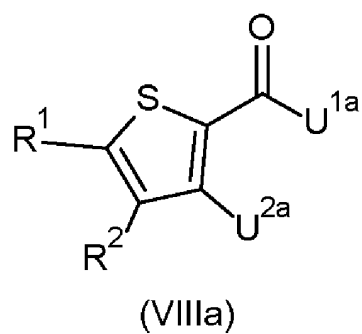
20

30

40

50

【化 2 5】



【 0 2 2 5】

表 I . 4 :

【表 4】

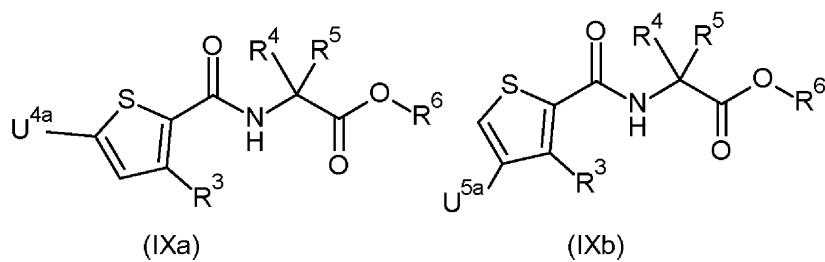
実施例番号	R ¹	R ²	U ^{2a}	U ^{1a}	LogP
VIIIa.01	Cl	Cl	I	OEt	4.73 ^[b]
VIIIa.02	Cl	Cl	Br	OMe	4.11 ^[a]
VIIIa.03	Cl	Cl	Br	OH	2.52 ^[a]
VIIIa.04	Br	Br	I	OMe	4.20 ^[a]
VIIIa.05	Cl	Cl	I	OMe	4.15 ^[a]
VIIIa.06	Cl	Cl	I	OH	2.64 ^[a]
VIIIa.07	Br	Br	I	OEt	4.78 ^[a]
VIIIa.08	Cl	Cl	Br	OEt	4.58 ^[a]

注 Me: メチル, Et: エチル

【 0 2 2 6】

下記の表 I . 5 に、式 (I X a) 及び (I X b) による中間体の例を非限定的に示している。

【化 2 6】



【 0 2 2 7】

表 I . 5 :

10

20

30

40

50

【表 5】

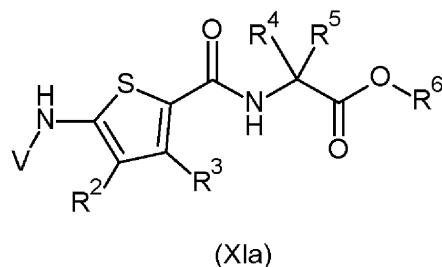
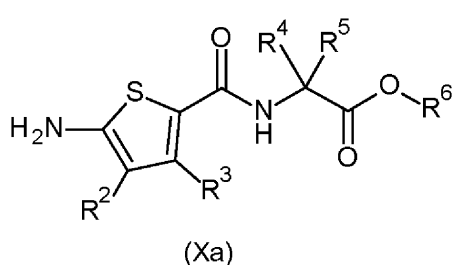
実施例 番号	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	U ^{4a}	U ^{5a}	LogP
IXa.01	Me	-CH ₂ -CH ₂ -		Et	Br		2.57 ^[a]
IXa.02	Me	H	H	Et	Br		2.39 ^[a]
IXa.03	Me	イソプロ ピル	H	Et	Br		3.65 ^[a]
IXa.04	Me	ベンジル	H	Et	Br		3.90 ^[a]
IXb.01	Me	-CH ₂ -CH ₂ -		Et		Br	2.49 ^[a]

注: Me: メチル, Et: エチル

【0228】

下記の表 I . 6 に、式 (X a) 及び (X I b) による中間体の例を非限定的に示している。

【化 27】



【0229】

表 I . 6 :

【表 6】

実施例 番号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	V	LogP
Xa.01	Br	Me	-CH ₂ -CH ₂ -		Et		1.97 ^[a]
XIa.01	Br	Me	-CH ₂ -CH ₂ -		Et	<i>tert</i> -ブトキシカルボ ニル	3.44 ^[b]

注: Me: メチル, Et: エチル

【0230】

下記の表 I . 7 に、式 (X I I I a) による中間体の例を非限定的に示している。

10

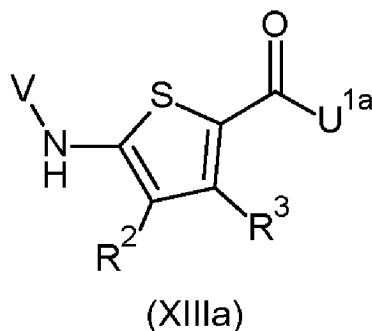
20

30

40

50

【化 2 8】



10

【 0 2 3 1】

表 I . 7 :

【表 7】

実施例番号	R ²	R ³	U ^{1a}	V	LogP
XIIIa.01	Br	Me	OEt	<i>tert</i> -ブトキシカルボ ニル	4.62 ^[a]
XIIIa.02	Br	Me	OH	<i>tert</i> -ブトキシカルボ ニル	2.86 ^[a]

20

注: Me: メチル, Et: エチル

【 0 2 3 2】

上記の表において、Log P 値の測定は、E E C 指針 7 9 / 8 3 1 補遺 V . A 8 に従い、下記の方法を用いて、逆相カラムでの H P L C（高速液体クロマトグラフィー）によって実施した。

30

【 0 2 3 3】

〔a〕 Log P 値は、溶離液として 0 . 1 % ギ酸水溶液及びアセトニトリル（1 0 % アセトニトリルから 9 5 % アセトニトリルの直線勾配）を使用し、酸性範囲での L C - U V 測定によって求める。

【 0 2 3 4】

〔b〕 Log P 値は、溶離液として 0 . 0 0 1 M 酢酸アンモニウム水溶液及びアセトニトリル（1 0 % アセトニトリルから 9 5 % アセトニトリルの直線勾配）を使用し、中性範囲での L C - U V 測定によって求める。

【 0 2 3 5】

〔c〕 Log P 値は、0 . 1 % リン酸及びアセトニトリルを溶離液として用いる（1 0 % アセトニトリルから 9 5 % アセトニトリルの直線勾配）、酸性範囲での L C - U V の測定によって求める。

40

【 0 2 3 6】

同じ方法内で複数の Log P 値が使える場合、全ての値を提供し、「+」によって分離しておく。

【 0 2 3 7】

較正は、Log P 値が既知である直鎖アルカン-2-オン類（炭素数 3 から 1 6）を用いて実施した（連続するアルカノン間の線形補間を行って保持時間を用いて Log P 値を測定）。ラムダマックス値は、2 0 0 nm から 4 0 0 nm の U V スペクトラム及びクロマトグラフィーシグナルのピーク値を用いて決定した。

50

【0238】

NMRピークリスト

表Aに、上記の表で開示のいくつかの化合物のNMRデータ (^1H) を提供している。

【0239】

選択された実施例の ^1H -NMRデータは、 ^1H -NMRピークリストの形で列記している。各シグナルピークについて、ppm単位での δ 値及びシグナル強度を小括弧内に記載している。 δ 値-シグナル強度のペア間には、区切り記号としてセミコロンがある。

【0240】

従って、実施例のピークリストは次のような形態：

δ_1 (強度 $_1$) ; δ_2 (強度 $_2$) ; . . . ; δ_i (強度 $_i$) ; . . . , δ_n (強度 $_n$) を有する。

10

【0241】

鋭いシグナルの強度は、NMRスペクトラムのプリントされた例におけるシグナルの高さ (cm) と相関し、シグナル強度の真の関係を示している。幅が広いシグナルからは、いくつかのピーク又はシグナルの中央及びスペクトラムにおける最も強いシグナルと比較したそれらの相対的強度を示すことができる。

【0242】

^1H スペクトラムについての化学シフトを較正するため、テトラメチルシラン及び／又は特にDMSO中で測定されるスペクトラムの場合には使用される溶媒の化学シフトを用いている。従って、NMRピークリストには、テトラメチルシランのピークがあり得るが、必ずあるとは限らない。

20

【0243】

^1H -NMRピークリストは、従来の ^1H -NMRプリントと同様であることから、通常、従来のNMR解釈で列記された全てのピークを含んでいる。

【0244】

さらに、それらは、従来の ^1H -NMRプリントのように、溶媒のシグナル、標的化合物の立体異性体 (これも、本発明の対象である) のシグナル及び／又は不純物のピークのシグナルも示すことができる。

【0245】

溶媒及び／又は水の δ 範囲内における化合物シグナルを示すため、溶媒の通常のピーク、例えば、DMSO- D_6 中のDMSOのピーク及び水のピークを ^1H -NMRピークリストに挙げており、それらは、通常平均して高い強度を有している。

30

【0246】

標的化合物の立体異性体のピーク及び／又は不純物のピークは、通常、平均して、標的化合物 (例えば、純度>90%を有する) のピークよりも低い強度を有している。

【0247】

そのような立体異性体及び／又は不純物は、特定の製造方法には典型的なものであり得る。従って、それらのピークは、本発明者らの製造方法の再現性を「副生成物フィンガープリント」によって認識するのに役立ち得る。

【0248】

公知の方法 (Mestrec, ACDシミュレーション、さらには経験的に評価される期待値の使用によっても) によって標的化合物のピークを計算する専門家であれば、必要に応じて、適宜に別の強度フィルターを用いて、標的化合物のピークを分離することができる。この分離は、従来の ^1H -NMR解釈での関連するピーク選別と同様であろう。

40

【0249】

ピークリストを用いたNMRデータの記載についてのさらなる詳細な説明は、刊行物 "Citation of NMR Peaklist Data within Patent Applications" of the Research Disclosure Database Number 564025にある。

【0250】

50

表A：NMRピークリスト

【表8】

I.01: ¹ H-NMR(300.2 MHz, CDCl ₃): δ= 7.2983 (5.4); 6.3048 (1.0); 4.2377 (1.2); 4.2139 (3.8); 4.1901 (3.8); 4.1664 (1.2); 2.5728 (16.0); 1.7079 (1.0); 1.6912 (2.9); 1.6804 (3.0); 1.6651 (1.3); 1.6024 (1.2); 1.3339 (1.3); 1.3188 (3.0); 1.3079 (3.1); 1.2970 (4.3); 1.2912 (1.6); 1.2732 (8.2); 1.2495 (3.9); 0.0356 (6.8)
I.02: ¹ H-NMR(300.2 MHz, CDCl ₃): δ= 7.2987 (2.8); 6.3702 (0.5); 5.3358 (1.0); 4.3360 (1.1); 4.3122 (3.4); 4.2884 (3.5); 4.2646 (1.2); 4.2258 (4.6); 4.2093 (4.5); 2.5934 (16.0); 1.6227 (3.3); 1.3760 (4.2); 1.3522 (8.4); 1.3284 (4.0); 0.0353 (3.4)
I.03: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.6720 (0.4); 8.6579 (0.9); 8.6436 (0.4); 4.1518 (1.3); 4.1340 (4.0); 4.1163 (4.0); 4.0985 (1.3); 3.9757 (3.9); 3.9610 (3.9); 3.3498 (56.9); 2.5264 (0.4); 2.5215 (0.6); 2.5129 (6.9); 2.5085 (13.6); 2.5040 (17.5); 2.4994 (12.6); 2.4949 (6.0); 2.4038 (16.0); 1.2386 (0.4); 1.2239 (4.5); 1.2061 (9.2); 1.1883 (4.4)
I.04: ¹ H-NMR(499.9 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.5246 (2.1); 8.5091 (2.1); 4.2262 (2.0); 4.2121 (2.9); 4.2044 (0.6); 4.1971 (2.1); 4.1901 (1.4); 4.1827 (0.9); 4.1759 (1.4); 4.1684 (2.7); 4.1617 (0.5); 4.1542 (2.7); 4.1448 (0.9); 4.1400 (0.9); 4.1306 (2.7); 4.1231 (0.5); 4.1164 (2.7); 4.1089 (1.4); 4.1023 (0.9); 4.0947 (1.4); 4.0805 (0.4); 3.3228 (2.7); 2.5144 (1.0); 2.5109 (2.1); 2.5073 (2.8); 2.5037 (2.0); 2.5002 (0.9); 2.4121 (26.4); 2.1959 (0.3); 2.1822 (1.0); 2.1686 (1.8); 2.1550 (1.8); 2.1414 (1.1); 2.1278 (0.4); 1.2263 (7.8); 1.2120 (16.0); 1.1978 (7.7); 0.9722 (10.8); 0.9585 (11.5); 0.9537 (11.5); 0.9401 (10.5)

10

【0251】

20

30

40

50

I.05: ¹ H-NMR(300.2 MHz, CDCl ₃): δ= 7.2984 (1.5); 6.3390 (0.7); 6.3132 (0.9); 4.8070 (0.6); 4.7792 (1.2); 4.7623 (0.9); 4.7517 (0.7); 4.7355 (0.5); 4.2892 (1.4); 4.2654 (4.3); 4.2417 (4.4); 4.2179 (1.5); 2.5719 (4.2); 2.5621 (16.0); 1.7908 (0.9); 1.7725 (1.3); 1.7611 (1.3); 1.7538 (1.5); 1.7462 (1.9); 1.7253 (1.4); 1.7062 (0.9); 1.6863 (1.3); 1.6608 (1.0); 1.6564 (1.0); 1.6324 (0.7); 1.4570 (1.0); 1.3543 (5.0); 1.3305 (10.0); 1.3067 (5.1); 1.2917 (1.0); 1.2857 (1.0); 1.0435 (0.3); 1.0202 (6.9); 1.0065 (10.3); 0.9871 (6.6); 0.9283 (0.3); 0.9064 (0.7); 0.8832 (0.4); 0.0297 (0.4); 0.0254 (0.7)	
I.06: ¹ H-NMR(499.9 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 12.4961 (2.0); 8.7878 (13.5); 3.3226 (11.2); 2.5437 (0.5); 2.5119 (15.4); 2.5084 (22.0); 2.5049 (17.8); 2.4800 (0.4); 2.4158 (70.6); 2.2841 (0.4); 2.0928 (6.3); 1.4392 (0.4); 1.4307 (0.4); 1.4239 (0.5); 1.4083 (5.6); 1.3989 (14.1); 1.3924 (16.0); 1.3839 (6.4); 1.3521 (0.6); 1.3056 (0.4); 1.2658 (0.7); 1.2420 (3.2); 1.2155 (0.4); 1.2021 (0.4); 1.1883 (0.6); 1.1763 (0.6); 1.1716 (0.8); 1.1622 (0.6); 1.1572 (1.2); 1.1482 (0.7); 1.1433 (0.7); 1.1222 (6.5); 1.1135 (14.8); 1.1070 (15.3); 1.0976 (5.6); 1.0670 (0.4); 0.8609 (0.5)	10
I.07: ¹ H-NMR(499.9 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 12.7425 (0.4); 8.3639 (2.1); 8.3478 (2.1); 4.2207 (2.0); 4.2080 (2.3); 4.2047 (2.2); 4.1920 (2.0); 3.5752 (2.1); 3.3269 (0.8); 2.5162 (1.6); 2.5125 (2.7); 2.5088 (3.6); 2.5052 (2.5); 2.5016 (1.1); 2.4179 (28.8); 2.2015 (0.3); 2.1880 (1.0); 2.1745 (1.6); 2.1612 (1.6); 2.1477 (1.0); 2.1342 (0.3); 0.9629 (16.0); 0.9494 (15.5)	
I.08: ¹ H-NMR(499.9 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.5386 (2.0); 8.5233 (2.0); 4.2147 (2.1); 4.2001 (3.4); 4.1854 (3.2); 4.1777 (1.0); 4.1709 (1.5); 4.1635 (2.7); 4.1567 (0.6); 4.1493 (2.7); 4.1398 (1.0); 4.1351 (1.0); 4.1257 (2.7); 4.1182 (0.6); 4.1115 (2.6); 4.1040 (1.4); 4.0973 (0.9); 4.0898 (1.3); 4.0756 (0.4); 3.3185 (58.2); 2.5358 (0.4); 2.5125 (2.9); 2.5090 (5.5); 2.5054 (7.2); 2.5018 (5.0); 2.4983 (2.3); 2.4080 (27.6); 2.1877 (0.4); 2.1741 (1.1); 2.1605 (1.8); 2.1469 (1.8); 2.1333 (1.1); 2.1197 (0.4); 1.2360 (0.5); 1.2208 (8.0); 1.2065 (16.0); 1.1923 (7.5); 0.9677 (11.8); 0.9540 (12.5); 0.9494 (11.9); 0.9357 (10.5)	
I.09: ¹ H-NMR(300.2 MHz, CDCl ₃): δ= 7.2988 (3.8); 6.3470 (0.4); 4.2461 (4.5); 4.2294 (4.4); 3.8469 (14.9); 2.5954 (16.0); 1.6069 (3.2); 0.0363 (4.7)	20
I.10: ¹ H-NMR(499.9 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 12.6968 (0.6); 8.5442 (2.2); 8.5326 (4.3); 8.5209 (2.3); 3.8971 (15.9); 3.8854 (16.0); 3.3973 (0.4); 3.3833 (0.6); 3.3296 (14.9); 2.5810 (0.5); 2.5466 (0.4); 2.5207 (9.4); 2.5166 (4.5); 2.5129 (8.3); 2.5093 (11.3); 2.5056 (8.3); 2.5020 (4.1); 2.4530 (64.6); 2.3213 (0.3)	
I.11: ¹ H-NMR(400.1 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.5820 (1.4); 8.5628 (1.4); 4.2506 (1.2); 4.2323 (2.1); 4.2141 (1.3); 3.6755 (16.0); 3.3300 (2.1); 2.5111 (1.7); 2.5071 (1.4); 2.4136 (15.3); 2.1826 (0.6); 2.1656 (1.1); 2.1486 (1.2); 2.1316 (0.7); 0.9701 (6.7); 0.9531 (7.3); 0.9458 (7.6); 0.9287 (6.8)	
I.12: ¹ H-NMR(300.2 MHz, CDCl ₃): δ= 7.2989 (1.9); 6.3630 (0.6); 6.3356 (0.6); 5.5734 (0.5); 5.5680 (0.4); 5.5618 (0.4); 5.5427 (0.5); 5.5375 (0.7); 5.5331 (0.4); 5.5134 (0.4); 5.3759 (0.4); 5.3567 (0.4); 5.3518 (0.7); 5.3465 (0.5); 5.3278 (0.4); 5.3216 (0.4); 5.3160 (0.5); 4.7510 (1.2); 4.7362 (1.2); 4.7229 (1.2); 4.7082 (1.2); 4.2548 (0.5); 4.2426 (0.9); 4.2197 (2.5); 4.1976 (2.5); 4.1753 (0.9); 4.1626 (0.5); 2.6800 (0.3); 2.5914 (16.0); 2.4882 (0.6); 2.4650 (1.6); 2.4419 (1.6); 2.4304 (0.4); 2.4199 (0.6); 2.3411 (0.4); 2.3347 (0.5); 2.3197 (0.5); 2.3116 (0.6); 2.2967 (0.6); 2.2887 (0.5); 2.2738 (0.5); 2.1186 (1.0); 2.1163 (1.0); 2.0919 (1.6); 2.0674 (1.1); 2.0652 (1.1); 1.0424 (6.3); 1.0322 (4.4); 1.0195 (6.3); 1.0066 (12.2); 0.9822 (9.5); 0.0339 (2.3)	
I.13: ¹ H-NMR(499.9 MHz, CDCl ₃): δ= 7.2615 (4.4); 6.2659 (0.6); 6.2495 (0.6); 4.8504 (1.1); 4.8456 (1.1); 4.8194 (1.9); 4.8146 (1.8); 4.7644 (1.3); 4.7552 (1.4); 4.7474 (1.4); 4.7382 (1.4); 4.7332 (2.0); 4.7283 (1.9); 4.7022 (1.1); 4.6973 (1.1); 2.5805 (0.5); 2.5592 (16.0); 2.5139 (1.6); 2.5090 (2.9); 2.5042 (1.4); 2.3363 (0.6); 2.3270 (0.6); 2.3225 (0.8); 2.3133 (0.8); 2.3088 (0.6); 2.2995 (0.5); 1.5613 (3.2); 1.0303 (6.9); 1.0166 (6.6); 0.9933 (6.8); 0.9796 (6.5); 0.0061 (0.4); -0.0002 (5.9)	30
I.14: ¹ H-NMR(300.2 MHz, CDCl ₃): δ= 7.2990 (2.7); 6.3761 (0.5); 6.3487 (0.6); 4.7741 (1.2); 4.7593 (1.2); 4.7461 (1.2); 4.7313 (1.2); 4.0464 (0.3); 4.0242 (0.4); 4.0111 (2.2); 3.9996 (2.3); 3.9889 (2.3); 3.9779 (2.3); 3.9644 (0.4); 3.9426 (0.4); 2.5955 (16.0); 2.3537 (0.4); 2.3388 (0.5); 2.3307 (0.6); 2.3158 (0.6); 2.3078 (0.5); 2.2929 (0.5); 2.0557 (0.4); 2.0334 (0.8); 2.0111 (1.1); 1.9888 (0.9); 1.9665 (0.5); 1.6273 (0.4); 1.0542 (6.5); 1.0313 (6.3); 1.0153 (7.2); 1.0063 (13.8); 0.9923 (7.1); 0.9839 (13.1); 0.0350 (3.2)	
I.15: ¹ H-NMR(300.2 MHz, CDCl ₃): δ= 7.2991 (6.3); 6.1941 (0.5); 6.1676 (0.5); 4.9561 (1.9); 4.9041 (3.7); 4.8023 (1.6); 4.7985 (4.0); 4.7863 (1.3); 4.7747 (1.2); 4.7583 (1.2); 4.7465 (2.0); 2.5955 (16.0); 2.3810 (0.5); 2.3644 (0.5); 2.3581 (0.6); 2.3417 (0.6); 2.3353 (0.5); 2.3187 (0.5); 1.5948 (3.9); 1.1005 (6.3); 1.0776 (6.1); 1.0599 (6.4); 1.0369 (6.2); 0.0370 (8.1)	40

[0 2 5 2]

I.16: ¹ H-NMR(499.9 MHz, CDCl ₃): δ= 7.2637 (2.6); 6.2129 (0.6); 6.1966 (0.7); 5.5218 (0.8); 5.5198 (0.8); 5.5092 (1.4); 5.4987 (0.8); 5.4966 (0.8); 5.4860 (0.3); 4.9335 (0.9); 4.9220 (1.8); 4.9203 (1.8); 4.9087 (1.8); 4.9072 (1.9); 4.8955 (0.9); 4.8944 (0.9); 4.7470 (1.3); 4.7378 (1.4); 4.7302 (1.3); 4.7210 (1.2); 4.7023 (1.0); 4.7010 (1.0); 4.6918 (1.0); 4.6904 (1.1); 4.6868 (1.0); 4.6856 (1.0); 4.6763 (0.8); 4.6751 (0.8); 4.6535 (1.0); 4.6525 (0.9); 4.6430 (1.0); 4.6418 (1.0); 4.6381 (1.0); 4.6368 (0.9); 4.6276 (0.8); 4.6264 (0.8); 2.5771 (0.4); 2.5532 (16.0); 2.3467 (0.5); 2.3373 (0.6); 2.3329 (0.7); 2.3236 (0.7); 2.3192 (0.6); 2.3099 (0.5); 1.1183 (0.4); 1.1051 (0.3); 1.0472 (6.5); 1.0335 (6.3); 1.0025 (6.6); 0.9887 (6.4); -0.0002 (2.6)	
I.17: ¹ H-NMR(300.2 MHz, CDCl ₃): δ= 7.2987 (1.9); 6.2581 (0.6); 6.2303 (0.6); 5.7442 (0.9); 5.7176 (1.5); 5.6914 (1.0); 4.7086 (1.2); 4.6935 (1.3); 4.6806 (1.2); 4.6654 (1.2); 3.6013 (0.9); 3.5733 (1.3); 3.5692 (1.2); 3.5538 (0.8); 3.5412 (1.1); 3.5216 (1.6); 3.4940 (1.2); 3.3963 (0.4); 3.3906 (0.9); 3.3852 (1.1); 3.3760 (0.9); 3.3706 (0.6); 3.3662 (1.3); 3.3591 (1.7); 3.3512 (1.3); 3.3420 (0.8); 3.3329 (0.8); 3.3298 (0.6); 3.3268 (0.6); 3.3213 (0.4); 2.6073 (0.4); 2.5850 (16.0); 2.3404 (0.5); 2.3250 (0.5); 2.3175 (0.7); 2.3022 (0.6); 2.2946 (0.5); 2.2793 (0.5); 1.0560 (6.4); 1.0331 (6.3); 1.0120 (6.6); 0.9890 (6.3); 0.0323 (2.0)	10
I.18: ¹ H-NMR(300.2 MHz, CDCl ₃): δ= 7.2990 (5.6); 6.1603 (0.7); 6.1337 (0.7); 5.3964 (0.6); 5.3828 (0.8); 5.3705 (1.2); 5.3579 (0.8); 5.3445 (0.7); 5.3379 (0.7); 5.3329 (0.4); 4.7278 (1.2); 4.7115 (1.3); 4.7008 (1.2); 4.6845 (1.2); 4.6621 (1.3); 4.6520 (0.5); 4.6363 (1.3); 4.6257 (0.5); 4.6204 (0.7); 4.6100 (1.8); 4.5946 (0.6); 4.5841 (1.7); 4.3368 (0.6); 4.3244 (1.1); 4.3163 (0.6); 4.3125 (0.6); 4.3056 (0.4); 4.2846 (0.4); 4.2782 (0.4); 4.2720 (0.6); 4.2665 (0.4); 4.2594 (0.4); 4.2350 (0.5); 4.2278 (0.5); 4.2223 (0.9); 4.2096 (0.6); 4.1818 (0.5); 4.1771 (0.4); 4.1695 (0.8); 4.1576 (0.4); 2.6387 (0.3); 2.5896 (16.0); 2.3726 (0.5); 2.3563 (0.5); 2.3502 (0.7); 2.3336 (0.7); 2.3275 (0.6); 2.3107 (0.5); 1.6050 (3.6); 1.0994 (6.4); 1.0765 (6.2); 1.0514 (6.6); 1.0284 (6.4); 0.0360 (5.9)	
I.19: ¹ H-NMR(300.2 MHz, CDCl ₃): δ= 7.2984 (4.7); 6.3045 (0.7); 6.2825 (0.7); 5.4320 (0.8); 5.4246 (0.8); 5.4169 (1.2); 5.4116 (1.2); 5.4052 (0.8); 5.3966 (0.8); 4.7447 (1.2); 4.7298 (1.3); 4.7168 (1.2); 4.7019 (1.2); 3.9980 (1.1); 3.9833 (1.2); 3.9624 (3.6); 3.9472 (2.9); 3.9364 (1.9); 3.9166 (2.2); 3.9020 (1.0); 3.8785 (1.5); 3.8410 (0.6); 2.6112 (1.0); 2.5932 (16.0); 2.3510 (0.4); 2.3283 (0.7); 2.3227 (0.6); 2.3128 (0.6); 2.3070 (0.8); 2.2912 (0.8); 2.2847 (0.6); 2.2738 (0.8); 2.2633 (0.4); 2.2546 (0.6); 2.2457 (0.7); 2.2363 (0.4); 2.2282 (0.8); 2.2176 (0.4); 2.2082 (0.5); 2.2003 (0.4); 2.1286 (0.5); 2.1059 (0.3); 2.0819 (0.5); 2.0660 (0.6); 2.0421 (0.3); 1.1396 (0.5); 1.1356 (0.5); 1.1176 (0.6); 1.0578 (7.3); 1.0349 (7.1); 1.0149 (7.3); 0.9919 (7.0); 0.0343 (5.8)	20
I.20: ¹ H-NMR(499.9 MHz, CDCl ₃): δ= 7.1612 (2.7); 6.2456 (0.7); 6.2292 (0.7); 4.6155 (1.2); 4.6065 (1.3); 4.5987 (1.2); 4.5897 (1.2); 3.8048 (1.3); 3.7765 (3.7); 3.7478 (3.7); 3.7196 (1.3); 2.4560 (16.0); 2.1647 (0.5); 2.1556 (0.6); 2.1510 (0.7); 2.1419 (0.7); 2.1373 (0.6); 2.1281 (0.5); 1.4819 (1.1); 0.8965 (6.7); 0.8828 (6.5); 0.8665 (6.8); 0.8527 (6.5); 0.0062 (3.1); -0.0002 (47.4); -0.0068 (2.2); -0.1019 (3.3)	
I.21: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.6718 (0.9); 8.6545 (0.9); 8.3154 (0.7); 4.4049 (0.9); 4.3869 (1.4); 4.3689 (1.0); 4.1414 (0.6); 4.1346 (0.7); 4.1236 (2.1); 4.1170 (2.1); 4.1058 (2.2); 4.0993 (2.1); 4.0881 (0.8); 4.0816 (0.6); 3.3277 (9.2); 2.5207 (0.5); 2.5121 (5.4); 2.5077 (10.9); 2.5031 (14.3); 2.4985 (10.4); 2.4940 (5.1); 2.4192 (16.0); 1.3773 (6.7); 1.3590 (6.6); 1.2384 (0.6); 1.2116 (4.7); 1.1939 (9.7); 1.1761 (4.5); -0.0002 (2.1)	30
I.22: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.5812 (1.1); 8.5623 (1.1); 8.3154 (1.4); 4.2932 (1.0); 4.2750 (1.8); 4.2569 (1.0); 3.6617 (16.0); 3.3265 (9.6); 3.3025 (0.6); 2.5069 (12.7); 2.5026 (16.6); 2.4982 (12.5); 2.3981 (15.4); 1.9313 (0.5); 1.9270 (0.4); 1.9208 (0.5); 1.9152 (0.6); 1.9098 (0.6); 1.8990 (0.5); 1.8927 (0.4); 1.4939 (0.3); 1.4831 (0.4); 1.4756 (0.4); 1.4602 (0.6); 1.4493 (0.5); 1.4415 (0.5); 1.4307 (0.5); 1.2860 (0.5); 1.2674 (0.7); 1.2461 (0.7); 1.2339 (0.7); 1.2119 (0.4); 0.8990 (6.5); 0.8817 (7.1); 0.8596 (6.7); 0.8409 (2.8); -0.0002 (1.9)	
I.23: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.2313 (3.1); 8.6161 (1.3); 8.5969 (1.3); 8.3148 (0.4); 7.0655 (3.6); 7.0444 (4.0); 6.6837 (0.5); 6.6767 (4.5); 6.6556 (4.1); 6.6487 (0.4); 4.4879 (0.4); 4.4746 (0.5); 4.4688 (0.6); 4.4629 (0.7); 4.4555 (0.6); 4.4497 (0.6); 4.4437 (0.6); 4.4304 (0.4); 4.1286 (0.8); 4.1257 (0.9); 4.1109 (2.6); 4.1081 (2.7); 4.0930 (2.8); 4.0905 (2.6); 4.0750 (1.0); 3.3321 (12.1); 3.0456 (0.6); 3.0325 (0.7); 3.0110 (1.1); 2.9980 (1.0); 2.9317 (1.1); 2.9063 (1.1); 2.8972 (0.7); 2.8717 (0.7); 2.5252 (0.4); 2.5203 (0.6); 2.5117 (8.5); 2.5073 (17.0); 2.5028 (22.1); 2.4982 (16.0); 2.4937 (7.7); 2.2707 (16.0); 1.2386 (0.5); 1.1761 (5.0); 1.1583 (10.4); 1.1406 (4.8); -0.0002 (3.3)	40

【 0 2 5 3 】

I.24: ¹H-NMR(400.2 MHz, d₆-DMSO): δ= 8.6736 (0.8); 8.6549 (0.8); 8.3120 (1.2); 4.4937 (0.6); 4.4788 (0.6); 4.1601 (0.4); 4.1506 (0.6); 4.1423 (1.5); 4.1326 (1.6); 4.1245 (1.6); 4.1149 (1.5); 4.1064 (0.7); 4.0972 (0.4); 3.3267 (13.5); 3.3028 (0.4); 2.5808 (0.7); 2.5639 (0.9); 2.5578 (0.7); 2.5463 (0.7); 2.5378 (1.2); 2.5124 (6.7); 2.5079 (13.4); 2.5033 (17.5); 2.4987 (12.5); 2.4942 (6.1); 2.3832 (13.1); 2.0569 (16.0); 2.0468 (1.3); 2.0318 (0.8); 2.0268 (0.9); 2.0218 (0.5); 2.0130 (0.3); 2.0062 (0.4); 1.2188 (3.6); 1.2010 (7.6); 1.1833 (3.4); -0.0002 (1.6)	
I.25: ¹H-NMR(400.2 MHz, d₆-DMSO): δ= 8.5474 (0.8); 8.5281 (0.8); 8.3108 (0.3); 4.2166 (1.2); 4.1979 (1.6); 4.1898 (0.8); 4.1803 (1.6); 4.1721 (0.7); 4.1627 (1.6); 4.1451 (2.0); 4.1277 (2.0); 4.1101 (1.6); 4.1008 (0.7); 4.0924 (0.5); 4.0831 (0.7); 3.3279 (24.7); 2.5256 (0.4); 2.5209 (0.7); 2.5123 (8.8); 2.5079 (17.6); 2.5033 (23.1); 2.4987 (16.8); 2.4942 (8.2); 2.3701 (16.0); 2.1824 (0.6); 2.1653 (1.0); 2.1483 (1.0); 2.1312 (0.6); 1.2397 (0.5); 1.2244 (4.4); 1.2067 (9.0); 1.1889 (4.3); 0.9701 (6.1); 0.9520 (8.5); 0.9337 (5.7); -0.0002 (1.7)	10
I.26: ¹H-NMR(400.2 MHz, d₆-DMSO): δ= 8.6908 (0.9); 8.6716 (1.0); 8.3114 (3.3); 7.3143 (0.4); 7.3005 (0.7); 7.2952 (2.7); 7.2865 (3.3); 7.2799 (10.4); 7.2695 (0.6); 7.2654 (0.8); 7.2379 (0.7); 7.2323 (0.8); 7.2226 (0.8); 7.2164 (0.9); 7.2080 (0.4); 7.2015 (0.4); 4.5934 (0.4); 4.5803 (0.5); 4.5741 (0.5); 4.5679 (0.6); 4.5610 (0.5); 4.5549 (0.5); 4.5486 (0.5); 4.5354 (0.4); 4.1404 (1.0); 4.1228 (3.3); 4.1052 (3.5); 4.0875 (1.2); 3.3323 (29.2); 3.3081 (1.3); 3.1845 (0.7); 3.1713 (0.7); 3.1501 (1.2); 3.1369 (1.0); 3.0625 (1.2); 3.0367 (1.2); 3.0282 (0.8); 3.0024 (0.7); 2.5259 (0.5); 2.5212 (0.8); 2.5126 (9.6); 2.5081 (19.2); 2.5035 (25.0); 2.4989 (18.0); 2.4944 (8.7); 2.2049 (16.0); 1.2393 (0.4); 1.1781 (4.6); 1.1604 (9.8); 1.1426 (4.5); -0.0002 (1.9)	
I.27: ¹H-NMR(400.2 MHz, d₆-DMSO): δ= 8.6725 (0.7); 8.6556 (0.7); 8.3103 (3.2); 4.4126 (0.8); 4.3946 (1.2); 4.3766 (0.8); 4.1439 (0.6); 4.1374 (0.7); 4.1261 (2.0); 4.1198 (2.0); 4.1083 (2.0); 4.1021 (2.0); 4.0906 (0.7); 4.0844 (0.6); 3.3335 (26.6); 3.3092 (1.4); 2.5262 (0.4); 2.5213 (0.6); 2.5128 (8.0); 2.5084 (15.6); 2.5038 (20.0); 2.4993 (14.3); 2.4948 (6.9); 2.3830 (16.0); 1.3841 (6.6); 1.3658 (6.6); 1.2396 (0.3); 1.2146 (4.4); 1.1968 (9.0); 1.1791 (4.3); -0.0002 (1.2)	
I.28: ¹H-NMR(400.1 MHz, CDCl₃): δ= 7.2614 (9.2); 6.3149 (1.0); 4.0958 (5.6); 4.0843 (5.5); 2.5044 (16.0); 1.5556 (11.5); 1.5030 (47.7); -0.0002 (4.5)	20
I.29: ¹H-NMR(400.2 MHz, d₆-DMSO): δ= 8.5780 (0.8); 8.5588 (0.8); 8.3113 (0.6); 4.2438 (1.1); 4.2254 (1.7); 4.2071 (1.1); 3.6688 (16.0); 3.3268 (16.9); 2.5256 (0.4); 2.5208 (0.6); 2.5121 (8.0); 2.5077 (15.9); 2.5032 (20.6); 2.4986 (14.8); 2.4941 (7.2); 2.3703 (15.7); 2.1803 (0.5); 2.1632 (0.9); 2.1461 (1.0); 2.1291 (0.6); 1.2396 (0.4); 0.9656 (6.1); 0.9487 (6.1); 0.9403 (6.0); 0.9232 (5.6); -0.0002 (1.7)	
I.30: ¹H-NMR(400.2 MHz, d₆-DMSO): δ= 8.6808 (0.6); 8.6624 (0.7); 8.3101 (2.2); 4.5280 (0.5); 4.5140 (0.5); 3.6707 (12.6); 3.3296 (16.6); 3.3054 (0.9); 2.5788 (0.7); 2.5627 (0.8); 2.5605 (0.8); 2.5507 (0.6); 2.5448 (0.7); 2.5311 (1.2); 2.5264 (0.5); 2.5127 (7.3); 2.5083 (13.5); 2.5037 (17.2); 2.4991 (12.5); 2.4947 (6.0); 2.3847 (13.0); 2.0697 (0.6); 2.0662 (0.5); 2.0549 (16.0); 2.0466 (0.9); 2.0367 (0.8); 2.0303 (0.8); 2.0246 (0.5); 2.0178 (0.3); 2.0094 (0.4); -0.0002 (1.3)	
I.31: ¹H-NMR(400.2 MHz, d₆-DMSO): δ= 8.6854 (0.5); 8.6711 (1.0); 8.6571 (0.5); 3.9968 (4.2); 3.9822 (4.2); 3.6650 (15.9); 3.3779 (94.9); 2.5282 (0.4); 2.5234 (0.5); 2.5148 (6.6); 2.5105 (13.2); 2.5060 (17.3); 2.5016 (12.8); 2.4973 (6.5); 2.4053 (16.0); -0.0002 (0.5)	30
I.32: ¹H-NMR(400.2 MHz, d₆-DMSO): δ= 8.5931 (0.9); 8.5741 (0.9); 4.2961 (1.1); 4.2779 (1.9); 4.2596 (1.1); 3.6636 (16.0); 3.3571 (87.2); 2.5264 (0.4); 2.5217 (0.8); 2.5130 (9.0); 2.5087 (17.6); 2.5042 (22.6); 2.4996 (16.2); 2.4951 (7.8); 2.3625 (15.7); 1.9388 (0.4); 1.9341 (0.4); 1.9281 (0.4); 1.9226 (0.4); 1.9168 (0.5); 1.9108 (0.4); 1.9062 (0.4); 1.4875 (0.3); 1.4797 (0.4); 1.4689 (0.4); 1.4644 (0.5); 1.4537 (0.5); 1.4457 (0.5); 1.4350 (0.4); 1.2889 (0.5); 1.2704 (0.7); 1.2542 (0.6); 1.2486 (0.8); 1.2367 (1.1); 1.2147 (0.4); 0.9019 (6.1); 0.8847 (6.3); 0.8805 (3.8); 0.8617 (6.3); 0.8431 (2.6)	
I.33: ¹H-NMR(400.2 MHz, d₆-DMSO): δ= 8.6403 (1.0); 8.6209 (1.0); 4.4022 (0.4); 4.3909 (0.6); 4.3830 (0.5); 4.3768 (0.6); 4.3718 (0.7); 4.3647 (0.6); 4.3578 (0.5); 4.3454 (0.5); 4.1580 (0.4); 4.1488 (0.6); 4.1400 (0.5); 4.1370 (0.7); 4.1310 (1.8); 4.1193 (1.9); 4.1132 (1.9); 4.1016 (1.8); 4.0954 (0.7); 4.0927 (0.5); 4.0839 (0.6); 4.0746 (0.4); 3.3276 (22.3); 2.5256 (0.5); 2.5120 (9.8); 2.5079 (18.5); 2.5034 (23.5); 2.4989 (16.9); 2.4945 (8.1); 2.3741 (16.0); 1.7675 (0.3); 1.7556 (0.5); 1.7409 (0.4); 1.7350 (0.5); 1.7289 (0.6); 1.7237 (0.7); 1.6986 (0.8); 1.6871 (0.5); 1.6708 (0.5); 1.6666 (0.5); 1.6540 (0.5); 1.5904 (0.7); 1.5780 (0.5); 1.5687 (0.5); 1.5575 (0.9); 1.5464 (0.5); 1.5365 (0.4); 1.2396 (0.5); 1.2126 (4.5); 1.1949 (9.2); 1.1771 (4.3); 0.9290 (5.8); 0.9130 (5.5); 0.8934 (5.6); 0.8774 (5.5); -0.0002 (1.6)	40

【 0 2 5 4 】

I.34: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.6967 (0.7); 8.3111 (5.2); 7.3868 (4.2); 7.3838 (2.7); 7.3755 (11.1); 7.3660 (1.0); 7.3570 (1.2); 7.3488 (1.0); 7.3437 (0.6); 7.3355 (0.8); 5.1644 (8.1); 4.0530 (1.8); 4.0439 (1.9); 3.3322 (22.9); 3.3081 (1.6); 2.5258 (0.4); 2.5210 (0.7); 2.5125 (7.8); 2.5080 (15.4); 2.5034 (19.9); 2.4987 (14.3); 2.4942 (6.8); 2.3883 (16.0); -0.0002 (1.6)	
I.35: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.6811 (0.8); 8.6624 (0.8); 8.3098 (1.3); 4.5482 (0.3); 4.5332 (0.4); 4.5281 (0.6); 4.5136 (0.6); 4.5087 (0.5); 4.4937 (0.3); 3.6706 (12.7); 3.3308 (24.4); 3.3071 (0.6); 2.5787 (0.7); 2.5626 (0.8); 2.5606 (0.8); 2.5507 (0.7); 2.5448 (0.8); 2.5311 (1.3); 2.5266 (0.6); 2.5127 (7.6); 2.5083 (14.0); 2.5038 (18.0); 2.4992 (13.3); 2.4949 (6.5); 2.3847 (13.1); 2.0694 (0.6); 2.0663 (0.6); 2.0549 (16.0); 2.0366 (0.9); 2.0302 (0.9); 2.0245 (0.5); 2.0179 (0.4); 2.0093 (0.4); -0.0002 (1.1)	
I.36: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.6905 (0.7); 8.6725 (0.7); 4.5269 (0.5); 4.5119 (0.5); 3.6693 (12.7); 3.3460 (49.0); 2.5791 (0.7); 2.5629 (0.8); 2.5608 (0.8); 2.5511 (0.6); 2.5448 (0.7); 2.5315 (1.2); 2.5260 (0.5); 2.5124 (7.7); 2.5080 (14.1); 2.5034 (18.2); 2.4988 (13.4); 2.4944 (6.4); 2.3833 (13.0); 2.0680 (0.6); 2.0646 (0.6); 2.0542 (16.0); 2.0448 (0.9); 2.0351 (0.8); 2.0285 (0.8); 2.0229 (0.5); 2.0163 (0.4); 2.0078 (0.4); 1.2386 (0.4); -0.0002 (0.4)	10
I.37: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.6536 (0.9); 8.6345 (1.0); 4.4017 (0.4); 4.3903 (0.5); 4.3824 (0.4); 4.3761 (0.5); 4.3711 (0.6); 4.3639 (0.5); 4.3570 (0.4); 4.3448 (0.5); 4.1578 (0.4); 4.1486 (0.5); 4.1399 (0.5); 4.1369 (0.7); 4.1308 (1.8); 4.1192 (1.9); 4.1130 (1.9); 4.1015 (1.8); 4.0952 (0.7); 4.0924 (0.5); 4.0838 (0.6); 4.0745 (0.4); 3.3596 (80.0); 2.5271 (0.4); 2.5223 (0.6); 2.5137 (8.1); 2.5092 (16.2); 2.5046 (21.0); 2.5000 (15.2); 2.4955 (7.4); 2.3732 (16.0); 1.7672 (0.3); 1.7554 (0.4); 1.7408 (0.4); 1.7349 (0.4); 1.7288 (0.6); 1.7234 (0.7); 1.6978 (0.8); 1.6850 (0.4); 1.6808 (0.4); 1.6686 (0.4); 1.6641 (0.4); 1.6518 (0.4); 1.6480 (0.4); 1.5908 (0.7); 1.5784 (0.5); 1.5689 (0.4); 1.5580 (0.8); 1.5468 (0.5); 1.5368 (0.4); 1.2391 (0.5); 1.2101 (4.5); 1.1923 (9.3); 1.1746 (4.3); 0.9281 (5.5); 0.9121 (5.2); 0.8920 (5.2); 0.8760 (5.2)	
I.38: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.6900 (1.0); 8.6708 (1.0); 8.3115 (1.5); 7.3142 (0.4); 7.2950 (2.7); 7.2864 (3.3); 7.2799 (10.4); 7.2693 (0.6); 7.2654 (0.8); 7.2378 (0.7); 7.2321 (0.8); 7.2226 (0.8); 7.2162 (0.9); 7.2080 (0.4); 7.2014 (0.4); 4.5933 (0.4); 4.5803 (0.5); 4.5740 (0.5); 4.5678 (0.7); 4.5608 (0.6); 4.5547 (0.6); 4.5484 (0.6); 4.5352 (0.4); 4.1405 (1.0); 4.1229 (3.3); 4.1053 (3.5); 4.0875 (1.2); 3.3295 (22.9); 3.3055 (0.6); 3.1844 (0.7); 3.1712 (0.7); 3.1499 (1.2); 3.1369 (1.0); 3.0624 (1.2); 3.0367 (1.2); 3.0281 (0.8); 3.0024 (0.7); 2.5257 (0.5); 2.5209 (0.8); 2.5123 (10.1); 2.5079 (19.9); 2.5034 (25.7); 2.4988 (18.5); 2.4943 (8.9); 2.2050 (16.0); 1.2397 (0.4); 1.1782 (4.6); 1.1605 (9.6); 1.1427 (4.4); -0.0002 (1.9)	20
I.39: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.2514 (2.6); 8.6265 (1.2); 8.6072 (1.3); 7.0685 (3.3); 7.0473 (3.6); 6.6844 (0.5); 6.6774 (4.2); 6.6727 (1.3); 6.6610 (1.2); 6.6562 (3.9); 6.6491 (0.4); 4.4934 (0.4); 4.4802 (0.5); 4.4742 (0.5); 4.4684 (0.6); 4.4610 (0.6); 4.4551 (0.5); 4.4491 (0.6); 4.4358 (0.4); 4.1303 (0.7); 4.1273 (0.8); 4.1125 (2.3); 4.1096 (2.4); 4.0947 (2.5); 4.0920 (2.3); 4.0767 (0.9); 3.3686 (95.7); 3.3653 (83.9); 3.3630 (90.8); 3.0518 (0.6); 3.0386 (0.6); 3.0172 (1.0); 3.0041 (0.9); 2.9377 (1.0); 2.9124 (1.0); 2.9032 (0.7); 2.8779 (0.6); 2.5268 (0.7); 2.5219 (1.1); 2.5135 (14.1); 2.5090 (28.2); 2.5044 (36.7); 2.4998 (26.4); 2.4953 (12.7); 2.2313 (16.0); 1.2389 (0.6); 1.1761 (4.7); 1.1584 (10.0); 1.1406 (4.5); -0.0002 (2.0)	
I.40: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.5609 (0.8); 8.5416 (0.8); 4.2142 (1.2); 4.1967 (1.6); 4.1954 (1.6); 4.1894 (0.8); 4.1779 (1.3); 4.1716 (0.7); 4.1623 (1.6); 4.1446 (2.0); 4.1272 (2.1); 4.1095 (1.6); 4.1002 (0.7); 4.0918 (0.5); 4.0824 (0.7); 3.3649 (92.0); 2.5272 (0.4); 2.5222 (0.7); 2.5138 (8.6); 2.5093 (17.2); 2.5047 (22.3); 2.5001 (16.0); 2.4956 (7.6); 2.3690 (16.0); 2.1804 (0.5); 2.1634 (0.9); 2.1463 (0.9); 2.1293 (0.6); 1.2387 (0.6); 1.2217 (4.5); 1.2040 (9.3); 1.1862 (4.4); 0.9695 (5.9); 0.9522 (7.3); 0.9500 (7.0); 0.9326 (5.5)	30
I.41: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.6430 (0.4); 8.6288 (0.8); 8.6146 (0.4); 8.3108 (1.2); 4.9724 (0.4); 4.9567 (1.1); 4.9411 (1.5); 4.9255 (1.1); 4.9099 (0.4); 3.9385 (3.3); 3.9240 (3.3); 3.3286 (18.1); 3.3045 (0.5); 2.5261 (0.4); 2.5212 (0.6); 2.5126 (7.2); 2.5082 (14.4); 2.5037 (18.6); 2.4991 (13.4); 2.4947 (6.5); 2.4037 (16.0); 1.2153 (15.9); 1.1996 (15.7); -0.0002 (1.4)	
I.42: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.6724 (0.8); 8.6551 (0.8); 8.3108 (0.7); 4.4126 (1.0); 4.3946 (1.6); 4.3766 (1.0); 4.1439 (0.6); 4.1374 (0.7); 4.1261 (2.0); 4.1198 (2.0); 4.1083 (2.0); 4.1021 (2.0); 4.0905 (0.7); 4.0844 (0.6); 3.3317 (29.5); 3.3081 (0.3); 2.5260 (0.4); 2.5127 (7.7); 2.5083 (15.0); 2.5037 (19.4); 2.4991 (14.0); 2.4947 (6.8); 2.3830 (16.0); 1.3839 (6.5); 1.3657 (6.4); 1.2144 (4.3); 1.1967 (8.9); 1.1789 (4.2); -0.0002 (1.3)	40

【 0 2 5 5 】

I.43: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.9195 (2.0); 4.0933 (1.3); 4.0756 (4.2); 4.0579 (4.2); 4.0401 (1.3); 3.3493 (68.1); 2.5263 (0.4); 2.5215 (0.6); 2.5128 (7.5); 2.5084 (15.0); 2.5038 (19.5); 2.4992 (14.1); 2.4947 (6.8); 2.3689 (16.0); 1.4425 (1.1); 1.4304 (2.9); 1.4221 (3.1); 1.4112 (1.3); 1.2388 (0.3); 1.1749 (1.5); 1.1689 (4.9); 1.1641 (3.3); 1.1556 (3.4); 1.1513 (9.6); 1.1436 (1.3); 1.1335 (4.3); -0.0002 (1.1)	
I.44: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.5590 (0.9); 8.5399 (0.9); 4.2145 (1.2); 4.1967 (1.8); 4.1894 (0.8); 4.1783 (1.4); 4.1715 (0.7); 4.1622 (1.6); 4.1446 (2.0); 4.1271 (2.0); 4.1095 (1.6); 4.1002 (0.7); 4.0918 (0.5); 4.0824 (0.7); 3.3452 (65.9); 2.5258 (0.5); 2.5124 (9.5); 2.5080 (18.5); 2.5034 (23.6); 2.4988 (16.9); 2.4944 (8.1); 2.3691 (16.0); 2.1803 (0.6); 2.1633 (1.0); 2.1462 (1.0); 2.1292 (0.6); 1.2390 (0.5); 1.2216 (4.5); 1.2038 (9.1); 1.1861 (4.3); 0.9695 (6.3); 0.9521 (8.1); 0.9326 (5.8); -0.0002 (1.2)	
I.45: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.7008 (1.4); 8.6815 (1.4); 7.3164 (0.6); 7.2970 (3.2); 7.2872 (4.4); 7.2816 (11.0); 7.2667 (1.0); 7.2400 (0.8); 7.2346 (1.0); 7.2253 (1.0); 7.2186 (1.1); 7.2102 (0.6); 7.2034 (0.5); 4.5939 (0.5); 4.5806 (0.7); 4.5746 (0.7); 4.5684 (0.8); 4.5614 (0.7); 4.5551 (0.7); 4.5490 (0.7); 4.5358 (0.5); 4.1390 (1.2); 4.1214 (3.7); 4.1037 (3.8); 4.0860 (1.3); 3.3510 (98.3); 3.1844 (0.8); 3.1713 (0.8); 3.1501 (1.3); 3.1371 (1.2); 3.0614 (1.3); 3.0356 (1.3); 3.0271 (0.9); 3.0013 (0.8); 2.5081 (23.1); 2.5037 (28.5); 2.4993 (20.7); 2.2039 (16.0); 1.2383 (0.7); 1.1746 (4.7); 1.1568 (9.5); 1.1391 (4.5); -0.0002 (0.7)	10
I.46: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.5881 (0.8); 8.5689 (0.8); 4.2420 (1.1); 4.2241 (1.6); 4.2053 (1.1); 3.6681 (16.0); 3.3468 (61.3); 2.5260 (0.4); 2.5213 (0.5); 2.5126 (7.2); 2.5081 (14.4); 2.5035 (18.7); 2.4989 (13.4); 2.4944 (6.4); 2.3693 (15.6); 2.1785 (0.5); 2.1613 (0.9); 2.1443 (0.9); 2.1272 (0.6); 1.2390 (0.4); 0.9649 (5.8); 0.9479 (5.8); 0.9390 (5.6); 0.9220 (5.3); -0.0002 (0.9)	
I.47: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.6834 (0.8); 8.6646 (0.8); 4.5130 (0.3); 4.4978 (0.4); 4.4931 (0.6); 4.4781 (0.6); 4.4738 (0.5); 4.4584 (0.3); 4.1593 (0.4); 4.1497 (0.6); 4.1415 (1.5); 4.1317 (1.6); 4.1237 (1.6); 4.1140 (1.5); 4.1056 (0.6); 4.0963 (0.4); 3.3489 (62.0); 2.5813 (0.6); 2.5646 (0.8); 2.5580 (0.6); 2.5468 (0.6); 2.5381 (1.2); 2.5258 (0.5); 2.5128 (7.1); 2.5083 (14.3); 2.5037 (18.8); 2.4990 (13.4); 2.4945 (6.4); 2.3820 (13.0); 2.0563 (16.0); 2.0458 (1.2); 2.0420 (0.8); 2.0308 (0.8); 2.0257 (0.9); 2.0205 (0.5); 2.0118 (0.3); 2.0050 (0.4); 1.2388 (0.4); 1.2161 (3.6); 1.1984 (7.6); 1.1807 (3.4); -0.0002 (0.9)	20
I.48: ¹ H-NMR(499.9 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.6674 (1.4); 8.6559 (2.3); 8.6444 (1.1); 4.0600 (5.2); 4.0468 (10.0); 4.0337 (5.0); 3.9915 (8.4); 3.9798 (8.1); 3.7102 (7.3); 3.3215 (9.0); 3.1463 (13.6); 2.5364 (0.4); 2.5114 (2.7); 2.5079 (3.3); 2.5044 (2.4); 2.4418 (7.3); 2.4083 (30.6); 1.6384 (0.9); 1.6239 (2.7); 1.6103 (5.0); 1.5957 (5.0); 1.5821 (2.5); 1.5677 (0.6); 0.9091 (8.4); 0.8943 (16.0); 0.8794 (7.2)	
I.49: ¹ H-NMR(300.2 MHz, CDCl ₃): δ= 7.4923 (0.3); 7.2989 (3.9); 6.3916 (0.5); 6.3644 (0.6); 5.1699 (0.4); 5.1490 (1.0); 5.1282 (1.4); 5.1073 (1.0); 5.0864 (0.4); 4.7153 (1.2); 4.7009 (1.3); 4.6875 (1.2); 4.6730 (1.2); 2.6476 (1.2); 2.5976 (16.0); 2.4411 (0.9); 2.3587 (1.0); 2.3402 (0.5); 2.3256 (0.5); 2.3172 (0.7); 2.3026 (0.7); 2.2943 (0.5); 2.2797 (0.5); 1.6249 (0.8); 1.3363 (7.6); 1.3316 (8.1); 1.3153 (7.7); 1.3108 (8.1); 1.0442 (6.6); 1.0213 (6.5); 1.0071 (6.8); 0.9841 (6.5); 0.0359 (4.1)	
I.50: ¹ H-NMR(300.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.9269 (2.0); 3.6346 (16.0); 3.3469 (6.1); 2.5345 (0.6); 2.5286 (1.2); 2.5225 (1.7); 2.5165 (1.2); 2.5106 (0.6); 2.3931 (15.8); 1.4833 (1.0); 1.4668 (2.6); 1.4557 (3.0); 1.4414 (1.3); 1.2147 (1.4); 1.2003 (2.9); 1.1892 (2.7); 1.1726 (1.0); 0.0193 (1.2)	30
I.51: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.7996 (2.3); 2.8919 (0.8); 2.7333 (0.7); 2.7322 (0.7); 2.5210 (0.4); 2.5125 (4.1); 2.5081 (8.4); 2.5035 (11.0); 2.4989 (7.9); 2.4944 (3.8); 2.3887 (1.7); 2.3706 (16.0); 1.4114 (1.1); 1.3996 (2.7); 1.3914 (2.9); 1.3807 (1.3); 1.3753 (0.8); 1.3568 (0.6); 1.1254 (1.3); 1.1147 (2.8); 1.1065 (2.8); 1.0946 (1.0); -0.0002 (7.8)	
I.52: ¹ H-NMR(400.1 MHz, CDCl ₃): δ= 7.2604 (9.4); 6.3394 (1.0); 6.3189 (1.0); 4.7313 (1.4); 4.7205 (1.4); 4.7103 (1.4); 4.6995 (1.3); 4.0842 (1.0); 4.0656 (1.2); 4.0560 (1.9); 4.0374 (1.8); 3.9951 (1.8); 3.9769 (1.8); 3.9669 (1.0); 3.9485 (0.9); 2.5620 (16.0); 2.5133 (0.8); 2.3211 (0.6); 2.3042 (0.9); 2.2925 (0.9); 2.2754 (0.7); 1.5420 (6.0); 1.1955 (0.4); 1.1832 (0.7); 1.1754 (0.7); 1.1640 (1.1); 1.1521 (0.8); 1.1448 (1.1); 1.1272 (0.6); 1.0202 (7.9); 1.0029 (8.0); 0.9934 (8.3); 0.9760 (7.7); 0.9527 (0.5); 0.6225 (0.8); 0.6097 (3.0); 0.5900 (2.9); 0.5778 (0.8); 0.3245 (1.1); 0.3128 (3.3); 0.3008 (3.1); 0.2885 (0.8); -0.0002 (9.8)	40

【 0 2 5 6 】

I.53: ¹ H-NMR(400.1 MHz, CDCl ₃): δ= 7.2594 (9.0); 6.3038 (0.9); 6.2837 (0.9); 5.0683 (1.1); 5.0498 (1.6); 5.0313 (1.1); 4.6842 (1.3); 4.6733 (1.4); 4.6633 (1.3); 4.6524 (1.3); 2.5560 (16.0); 2.3975 (1.2); 2.3796 (1.4); 2.3660 (1.3); 2.3489 (0.7); 2.3056 (0.7); 2.2938 (0.7); 2.2887 (0.9); 2.2770 (0.9); 2.2718 (0.8); 2.2601 (0.6); 2.1539 (0.7); 2.1338 (0.9); 2.1293 (0.9); 2.1108 (1.0); 2.0925 (0.9); 2.0861 (0.9); 2.0614 (0.6); 1.8789 (0.4); 1.8527 (0.9); 1.8269 (0.9); 1.8018 (0.3); 1.6862 (0.6); 1.6655 (1.0); 1.6396 (0.9); 1.6187 (0.4); 1.5406 (7.5); 1.0083 (7.6); 0.9912 (7.7); 0.9728 (7.8); 0.9555 (7.3); -0.0002 (9.5)	
I.54: ¹ H-NMR(400.1 MHz, CDCl ₃): δ= 7.3486 (0.6); 7.2595 (9.4); 6.3215 (1.0); 6.3020 (1.0); 4.7145 (1.4); 4.7036 (1.4); 4.6942 (1.4); 4.6833 (1.3); 4.2074 (0.3); 4.1913 (0.9); 4.1739 (0.9); 4.1635 (1.2); 4.1475 (3.3); 4.1308 (3.3); 4.1149 (1.2); 4.1047 (0.6); 3.4468 (0.3); 3.4310 (0.4); 2.5587 (16.0); 2.5143 (1.7); 2.3009 (0.7); 2.2843 (1.0); 2.2724 (1.0); 2.2552 (0.7); 1.7407 (0.6); 1.7247 (1.7); 1.7073 (3.2); 1.6898 (3.2); 1.6721 (1.7); 1.6535 (0.4); 1.5408 (6.9); 1.1159 (0.9); 1.0986 (0.9); 1.0107 (8.1); 0.9933 (8.5); 0.9875 (6.5); 0.9749 (9.2); 0.9687 (10.0); 0.9583 (8.6); 0.9492 (5.6); 0.9293 (1.8); 0.9107 (0.5); -0.0002 (9.7); -0.0016 (9.7)	10
I.55: ¹ H-NMR(400.1 MHz, CDCl ₃): δ= 7.2596 (8.2); 6.3204 (0.9); 6.3002 (0.9); 4.7089 (1.4); 4.6979 (1.4); 4.6880 (1.3); 4.6769 (1.3); 4.2144 (0.6); 4.2044 (1.2); 4.1879 (3.2); 4.1715 (3.2); 4.1554 (1.1); 4.1449 (0.5); 2.5843 (0.7); 2.5583 (16.0); 2.2961 (0.6); 2.2792 (0.9); 2.2675 (0.9); 2.2504 (0.6); 1.6899 (0.5); 1.6739 (1.6); 1.6532 (2.2); 1.6359 (2.0); 1.6192 (0.8); 1.5483 (2.3); 1.4477 (0.4); 1.4294 (1.4); 1.4108 (2.4); 1.3918 (2.3); 1.3732 (1.3); 1.3551 (0.3); 1.2491 (0.5); 1.2322 (0.5); 1.0085 (7.7); 0.9913 (7.6); 0.9712 (8.4); 0.9662 (6.2); 0.9540 (8.3); 0.9471 (8.9); 0.9285 (3.7); -0.0002 (8.6)	
I.56: ¹ H-NMR(400.1 MHz, CDCl ₃): δ= 7.2595 (8.6); 6.2836 (1.1); 6.2640 (1.1); 4.6642 (1.4); 4.6531 (1.5); 4.6435 (1.4); 4.6322 (1.4); 4.2198 (1.1); 4.2102 (1.4); 4.1985 (1.0); 4.1893 (0.4); 2.5737 (0.6); 2.5578 (16.0); 2.2586 (0.7); 2.2413 (1.0); 2.2270 (1.0); 2.2122 (0.7); 1.5416 (4.5); 1.0866 (0.4); 1.0705 (0.3); 0.9966 (7.9); 0.9795 (7.7); 0.9540 (7.9); 0.9368 (7.6); 0.7910 (0.9); 0.7732 (3.7); 0.7574 (6.2); 0.7336 (1.8); -0.0002 (9.0)	
I.57: ¹ H-NMR(400.1 MHz, CDCl ₃): δ= 7.3962 (0.5); 7.3643 (13.9); 7.3411 (0.8); 7.3280 (0.3); 7.2583 (9.0); 6.2948 (1.0); 6.2743 (1.0); 5.2567 (1.6); 5.2264 (3.5); 5.1808 (3.5); 5.1505 (1.5); 4.7627 (1.3); 4.7516 (1.4); 4.7417 (1.3); 4.7305 (1.3); 2.5374 (16.0); 2.3031 (0.6); 2.2859 (0.9); 2.2743 (0.9); 2.2689 (0.8); 2.2575 (0.6); 1.5387 (6.1); 0.9786 (7.4); 0.9614 (7.2); 0.9198 (7.5); 0.9026 (7.2); -0.0002 (9.5)	20
I.58: ¹ H-NMR(400.1 MHz, CDCl ₃): δ= 7.2593 (8.8); 6.2970 (1.0); 6.2770 (1.0); 5.9603 (0.6); 5.9466 (0.6); 5.9330 (0.9); 5.9176 (1.0); 5.9037 (0.6); 5.8914 (0.7); 5.8768 (0.4); 5.3842 (2.0); 5.3414 (1.7); 5.2997 (2.1); 5.2737 (1.9); 4.7448 (1.4); 4.7338 (1.5); 4.7238 (1.8); 4.7126 (1.6); 4.6907 (1.9); 4.6732 (3.1); 4.6573 (1.7); 4.6395 (0.4); 4.6249 (0.4); 2.5760 (0.7); 2.5570 (16.0); 2.3172 (0.7); 2.3005 (1.0); 2.2862 (1.0); 2.2711 (0.7); 1.5410 (5.1); 1.1011 (0.4); 1.0846 (0.5); 1.0155 (7.8); 0.9985 (7.7); 0.9767 (7.9); 0.9594 (7.6); -0.0002 (9.0)	
I.59: ¹ H-NMR(300.2 MHz, CDCl ₃): δ= 7.2986 (11.6); 6.2315 (0.4); 6.2038 (0.5); 4.8488 (1.2); 4.8334 (1.2); 4.8206 (1.2); 4.8053 (1.3); 4.7793 (0.8); 4.7649 (0.4); 4.7516 (0.8); 4.7372 (1.0); 4.7095 (1.0); 4.6818 (0.4); 4.5314 (0.3); 4.5037 (1.0); 4.4760 (1.1); 4.4616 (0.8); 4.4483 (0.4); 4.4339 (0.8); 2.9948 (0.7); 2.9227 (0.6); 2.9210 (0.6); 2.5940 (16.0); 2.3853 (0.4); 2.3698 (0.4); 2.3624 (0.6); 2.3469 (0.6); 2.3396 (0.5); 2.3239 (0.4); 1.5881 (7.6); 1.0855 (6.1); 1.0627 (5.9); 1.0411 (6.2); 1.0181 (6.0); 0.0484 (0.4); 0.0376 (12.4); 0.0284 (0.4); 0.0267 (0.5)	30
I.60: ¹ H-NMR(300.2 MHz, CDCl ₃): δ= 7.4710 (1.0); 7.4693 (1.1); 7.4629 (0.5); 7.4448 (2.5); 7.4231 (0.9); 7.4177 (2.0); 7.3292 (1.1); 7.3254 (0.6); 7.3102 (0.6); 7.3046 (1.6); 7.2981 (4.8); 7.2833 (0.4); 7.2798 (0.5); 7.1597 (2.2); 7.1558 (2.9); 7.1487 (0.7); 7.1309 (2.2); 7.1277 (1.8); 6.3872 (0.6); 6.3590 (0.6); 5.0168 (1.2); 5.0017 (1.3); 4.9888 (1.2); 4.9736 (1.2); 2.6094 (16.0); 2.5512 (0.4); 2.5359 (0.5); 2.5282 (0.6); 2.5130 (0.6); 2.5054 (0.5); 2.4901 (0.5); 2.0430 (0.4); 1.5985 (1.6); 1.1772 (6.2); 1.1538 (10.8); 1.1296 (6.0); 0.0381 (5.3)	
I.61: ¹ H-NMR(300.2 MHz, CDCl ₃): δ= 7.2987 (0.6); 4.6463 (0.5); 4.6324 (0.5); 4.6188 (0.5); 4.6049 (0.5); 2.5964 (6.0); 1.5260 (16.0); 1.0332 (2.4); 1.0101 (2.5); 1.0044 (2.7); 0.9813 (2.3); 0.0320 (0.7)	
I.62: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.5464 (1.0); 8.5272 (1.0); 4.2137 (1.1); 4.2053 (0.3); 4.1950 (1.6); 4.1876 (0.8); 4.1777 (1.6); 4.1698 (0.8); 4.1605 (1.7); 4.1428 (2.2); 4.1253 (2.2); 4.1076 (1.7); 4.0983 (0.8); 4.0899 (0.5); 4.0806 (0.7); 3.3247 (9.9); 2.5119 (4.5); 2.5074 (9.4); 2.5028 (12.4); 2.4982 (8.8); 2.4937 (4.2); 2.4047 (16.0); 2.1760 (0.5); 2.1590 (1.0); 2.1420 (1.0); 2.1250 (0.6); 1.2215 (4.8); 1.2038 (9.9); 1.1860 (4.6); 0.9661 (6.2); 0.9485 (9.7); 0.9305 (5.7); -0.0002 (7.1)	40

【 0 2 5 7 】

I.63: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.5741 (0.9); 8.5548 (0.9); 4.2417 (1.0); 4.2235 (1.6); 4.2051 (1.1); 3.6668 (16.0); 3.3250 (9.2); 2.5120 (3.8); 2.5075 (7.9); 2.5030 (10.4); 2.4983 (7.4); 2.4938 (3.5); 2.4052 (15.2); 2.1743 (0.5); 2.1572 (0.9); 2.1401 (0.9); 2.1231 (0.6); 0.9616 (5.9); 0.9446 (6.1); 0.9372 (5.8); 0.9202 (5.4); -0.0002 (6.8)	
I.64: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.5740 (0.9); 8.5547 (0.9); 4.2421 (1.1); 4.2240 (1.6); 4.2055 (1.1); 3.6671 (16.0); 3.3246 (6.8); 2.5121 (3.6); 2.5076 (7.4); 2.5030 (9.7); 2.4984 (6.9); 2.4939 (3.2); 2.4054 (15.3); 2.1745 (0.5); 2.1574 (0.9); 2.1404 (1.0); 2.1233 (0.6); 1.2382 (0.4); 0.9617 (6.1); 0.9448 (6.2); 0.9374 (6.0); 0.9203 (5.5); -0.0002 (7.1)	
I.65: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.6889 (1.4); 8.6696 (1.4); 7.3148 (0.6); 7.2956 (3.1); 7.2857 (4.2); 7.2801 (10.8); 7.2688 (0.9); 7.2650 (1.1); 7.2381 (0.8); 7.2328 (1.0); 7.2236 (1.0); 7.2167 (1.1); 7.2083 (0.6); 7.2016 (0.5); 4.5907 (0.5); 4.5775 (0.6); 4.5713 (0.6); 4.5652 (0.8); 4.5583 (0.7); 4.5520 (0.7); 4.5458 (0.7); 4.5326 (0.5); 4.1380 (1.2); 4.1205 (3.8); 4.1028 (3.9); 4.0850 (1.3); 3.3278 (8.7); 3.1798 (0.7); 3.1668 (0.8); 3.1455 (1.3); 3.1324 (1.2); 3.0573 (1.3); 3.0315 (1.3); 3.0230 (0.9); 2.9972 (0.8); 2.5117 (5.2); 2.5075 (10.1); 2.5030 (12.9); 2.4985 (9.3); 2.4943 (4.5); 2.2451 (16.0); 1.2380 (0.3); 1.1750 (4.9); 1.1573 (10.1); 1.1395 (4.7); -0.0002 (7.1)	10
I.66: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.6890 (1.4); 8.6696 (1.4); 7.3172 (0.4); 7.3148 (0.6); 7.3010 (0.9); 7.2959 (3.0); 7.2858 (3.9); 7.2800 (10.6); 7.2688 (0.8); 7.2648 (1.0); 7.2382 (0.8); 7.2329 (0.9); 7.2238 (0.9); 7.2167 (1.0); 7.2083 (0.6); 7.2015 (0.5); 4.5903 (0.5); 4.5771 (0.6); 4.5709 (0.6); 4.5648 (0.7); 4.5579 (0.6); 4.5516 (0.6); 4.5454 (0.6); 4.5322 (0.5); 4.1379 (1.1); 4.1204 (3.7); 4.1027 (3.9); 4.0849 (1.3); 3.3277 (9.7); 3.1797 (0.7); 3.1665 (0.8); 3.1453 (1.2); 3.1322 (1.1); 3.0570 (1.2); 3.0312 (1.2); 3.0227 (0.8); 2.9969 (0.7); 2.5205 (0.4); 2.5120 (5.3); 2.5076 (10.5); 2.5030 (13.7); 2.4984 (9.7); 2.4939 (4.6); 2.2451 (16.0); 1.2379 (0.3); 1.1750 (5.1); 1.1573 (10.6); 1.1395 (4.9); -0.0002 (8.7)	
I.67: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.6895 (1.3); 8.6701 (1.3); 7.3174 (0.4); 7.3148 (0.6); 7.3012 (0.8); 7.2961 (2.8); 7.2945 (2.6); 7.2859 (3.6); 7.2801 (9.9); 7.2689 (0.7); 7.2647 (1.0); 7.2383 (0.8); 7.2331 (0.9); 7.2240 (0.8); 7.2168 (1.0); 7.2083 (0.6); 7.2016 (0.5); 4.5901 (0.4); 4.5769 (0.6); 4.5707 (0.6); 4.5645 (0.7); 4.5576 (0.6); 4.5513 (0.6); 4.5451 (0.6); 4.5319 (0.5); 4.1375 (1.1); 4.1200 (3.5); 4.1025 (3.8); 4.0847 (1.3); 3.3276 (10.1); 3.1794 (0.7); 3.1662 (0.8); 3.1450 (1.2); 3.1319 (1.0); 3.0567 (1.2); 3.0309 (1.2); 3.0224 (0.8); 2.9966 (0.7); 2.5206 (0.4); 2.5120 (5.0); 2.5075 (10.4); 2.5029 (13.8); 2.4983 (9.8); 2.4937 (4.7); 2.2448 (16.0); 1.1746 (5.2); 1.1569 (11.0); 1.1391 (5.0); 0.0080 (0.3); -0.0002 (9.7)	20
I.68: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.6356 (1.1); 8.6165 (1.1); 4.3980 (0.3); 4.3867 (0.5); 4.3787 (0.4); 4.3725 (0.5); 4.3675 (0.6); 4.3604 (0.5); 4.3535 (0.4); 4.3412 (0.4); 4.1565 (0.4); 4.1473 (0.6); 4.1387 (0.5); 4.1352 (0.7); 4.1296 (1.9); 4.1175 (2.0); 4.1117 (2.0); 4.0998 (1.9); 4.0939 (0.7); 4.0906 (0.5); 4.0821 (0.6); 4.0728 (0.4); 3.3259 (11.2); 2.5125 (4.5); 2.5080 (9.2); 2.5035 (12.0); 2.4988 (8.5); 2.4943 (4.0); 2.4106 (16.0); 2.2451 (0.4); 1.7486 (0.4); 1.7339 (0.4); 1.7281 (0.4); 1.7220 (0.6); 1.7166 (0.7); 1.6962 (0.6); 1.6911 (0.6); 1.6845 (0.5); 1.6683 (0.5); 1.6641 (0.5); 1.6517 (0.4); 1.6479 (0.4); 1.5861 (0.6); 1.5736 (0.4); 1.5645 (0.5); 1.5534 (0.8); 1.5422 (0.5); 1.5325 (0.3); 1.2381 (0.5); 1.2104 (4.6); 1.1926 (9.7); 1.1749 (4.5); 0.9266 (5.5); 0.9106 (5.3); 0.8916 (5.2); 0.8756 (5.1); -0.0002 (6.0)	30
I.69: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.6361 (1.1); 8.6169 (1.1); 4.3976 (0.4); 4.3864 (0.6); 4.3785 (0.5); 4.3723 (0.6); 4.3673 (0.7); 4.3601 (0.6); 4.3533 (0.4); 4.3409 (0.5); 4.1564 (0.4); 4.1472 (0.6); 4.1385 (0.5); 4.1350 (0.8); 4.1294 (1.9); 4.1174 (2.0); 4.1116 (2.0); 4.0997 (1.9); 4.0938 (0.7); 4.0904 (0.5); 4.0820 (0.6); 4.0726 (0.4); 3.3262 (12.2); 2.5124 (5.0); 2.5079 (10.0); 2.5034 (13.0); 2.4988 (9.2); 2.4943 (4.3); 2.4104 (16.0); 1.7603 (0.3); 1.7484 (0.4); 1.7337 (0.4); 1.7279 (0.4); 1.7217 (0.7); 1.7164 (0.7); 1.6910 (0.6); 1.6843 (0.6); 1.6681 (0.5); 1.6638 (0.5); 1.6514 (0.4); 1.6477 (0.4); 1.5860 (0.6); 1.5735 (0.4); 1.5643 (0.5); 1.5533 (0.9); 1.5420 (0.5); 1.5324 (0.4); 1.2384 (0.4); 1.2101 (4.7); 1.1924 (9.7); 1.1746 (4.5); 0.9264 (5.7); 0.9105 (5.4); 0.8915 (5.4); 0.8755 (5.3); -0.0002 (5.1)	
I.70: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.6774 (0.9); 8.6585 (0.9); 4.5419 (0.3); 4.5273 (0.4); 4.5216 (0.6); 4.5075 (0.6); 4.5021 (0.5); 4.4873 (0.3); 3.6684 (12.4); 3.3256 (8.1); 2.5763 (0.7); 2.5602 (0.8); 2.5580 (0.8); 2.5496 (0.6); 2.5421 (0.6); 2.5299 (1.1); 2.5207 (0.4); 2.5120 (4.2); 2.5076 (7.7); 2.5030 (9.9); 2.4984 (7.2); 2.4939 (3.4); 2.4207 (12.4); 2.0538 (16.0); 2.0441 (1.2); 2.0390 (0.8); 2.0297 (0.8); 2.0229 (0.8); 2.0173 (0.5); 2.0109 (0.3); 2.0021 (0.4); -0.0002 (6.5)	40

[0 2 5 8]

I.71: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.6773 (0.8); 8.6585 (0.8); 4.5421 (0.3); 4.5275 (0.4); 4.5218 (0.6); 4.5073 (0.6); 4.5023 (0.5); 4.4875 (0.3); 3.6686 (12.3); 3.3254 (6.8); 2.5765 (0.7); 2.5604 (0.8); 2.5582 (0.8); 2.5499 (0.6); 2.5423 (0.6); 2.5302 (1.1); 2.5207 (0.4); 2.5121 (3.8); 2.5077 (6.9); 2.5031 (9.0); 2.4985 (6.6); 2.4940 (3.1); 2.4208 (12.4); 2.0540 (16.0); 2.0444 (1.2); 2.0392 (0.8); 2.0299 (0.8); 2.0232 (0.8); 2.0175 (0.5); 2.0111 (0.3); 2.0024 (0.4); -0.0002 (6.4)	
I.72: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.6773 (0.9); 8.6585 (0.9); 4.5422 (0.4); 4.5275 (0.4); 4.5219 (0.6); 4.5075 (0.6); 4.5024 (0.5); 4.4876 (0.4); 3.6687 (12.3); 3.3252 (6.8); 2.5765 (0.7); 2.5603 (0.8); 2.5582 (0.8); 2.5499 (0.6); 2.5423 (0.6); 2.5302 (1.2); 2.5121 (4.0); 2.5077 (7.3); 2.5031 (9.4); 2.4985 (6.9); 2.4940 (3.3); 2.4209 (12.5); 2.0540 (16.0); 2.0445 (1.3); 2.0393 (0.8); 2.0300 (0.8); 2.0233 (0.8); 2.0176 (0.5); 2.0112 (0.4); 2.0025 (0.4); 1.2384 (0.3); -0.0002 (6.7)	10
I.73: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.6973 (1.1); 8.6777 (1.1); 7.3172 (0.3); 7.3146 (0.5); 7.3010 (0.6); 7.2958 (2.6); 7.2946 (2.5); 7.2865 (3.3); 7.2802 (9.7); 7.2696 (0.6); 7.2654 (0.9); 7.2365 (0.7); 7.2310 (0.8); 7.2214 (0.7); 7.2149 (0.9); 7.2117 (0.5); 7.2065 (0.5); 7.1999 (0.4); 4.6336 (0.4); 4.6213 (0.5); 4.6140 (0.5); 4.6073 (0.6); 4.6017 (0.6); 4.5950 (0.5); 4.5877 (0.6); 4.5753 (0.4); 3.6676 (16.0); 3.3296 (11.4); 3.2021 (0.7); 3.1898 (0.7); 3.1677 (1.1); 3.1554 (1.0); 3.0565 (1.1); 3.0301 (1.1); 3.0221 (0.8); 2.9957 (0.7); 2.5121 (3.9); 2.5076 (8.2); 2.5030 (10.8); 2.4984 (7.7); 2.4939 (3.7); 2.1967 (15.4); -0.0002 (6.7)	
I.74: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.6444 (1.0); 8.6252 (1.0); 4.4023 (0.4); 4.3909 (0.5); 4.3830 (0.4); 4.3769 (0.5); 4.3719 (0.6); 4.3647 (0.5); 4.3577 (0.4); 4.3454 (0.4); 4.1579 (0.4); 4.1487 (0.5); 4.1400 (0.5); 4.1371 (0.7); 4.1309 (1.8); 4.1194 (1.9); 4.1131 (1.9); 4.1017 (1.8); 4.0953 (0.7); 4.0927 (0.6); 4.0840 (0.6); 4.0747 (0.4); 3.3277 (25.7); 2.5204 (0.5); 2.5119 (6.1); 2.5074 (12.8); 2.5029 (17.2); 2.4983 (12.8); 2.4938 (6.4); 2.3735 (16.0); 1.7554 (0.4); 1.7407 (0.4); 1.7350 (0.4); 1.7289 (0.6); 1.7234 (0.7); 1.6980 (0.8); 1.6861 (0.5); 1.6822 (0.4); 1.6696 (0.5); 1.6654 (0.5); 1.6530 (0.4); 1.6490 (0.4); 1.5908 (0.6); 1.5785 (0.5); 1.5691 (0.4); 1.5580 (0.8); 1.5469 (0.5); 1.5370 (0.4); 1.2393 (0.4); 1.2108 (4.4); 1.1930 (9.1); 1.1753 (4.2); 0.9281 (5.5); 0.9121 (5.3); 0.8924 (5.2); 0.8764 (5.2); -0.0002 (7.9)	20
I.75: ¹ H-NMR(300.2 MHz, CDCl ₃): δ= 7.4618 (0.5); 7.4535 (0.9); 7.4487 (0.7); 7.4404 (1.6); 7.4274 (4.3); 7.4159 (1.2); 7.4097 (3.3); 7.4075 (3.3); 7.4003 (1.1); 7.3918 (1.7); 7.3836 (2.3); 7.3776 (1.2); 7.3640 (0.8); 7.2981 (0.5); 6.9778 (0.7); 6.9559 (0.7); 5.7106 (2.2); 5.6880 (2.2); 4.3311 (0.6); 4.3191 (0.5); 4.3073 (0.6); 4.2953 (1.4); 4.2713 (1.8); 4.2469 (1.8); 4.2230 (1.4); 4.2109 (0.6); 4.1993 (0.5); 4.1872 (0.6); 2.5318 (16.0); 1.2899 (4.2); 1.2661 (8.5); 1.2423 (4.1); 0.0395 (0.5)	
I.76: ¹ H-NMR(300.2 MHz, CDCl ₃): δ= 7.4610 (0.5); 7.4526 (0.8); 7.4484 (0.7); 7.4396 (1.7); 7.4266 (4.5); 7.4191 (1.4); 7.4158 (1.4); 7.4097 (3.4); 7.4075 (3.2); 7.4001 (1.2); 7.3921 (1.8); 7.3838 (2.2); 7.3644 (0.8); 7.2980 (0.6); 6.9659 (0.7); 6.9439 (0.7); 5.7084 (2.2); 5.6858 (2.2); 4.3301 (0.6); 4.3182 (0.5); 4.3063 (0.7); 4.2943 (1.4); 4.2703 (1.8); 4.2460 (1.8); 4.2221 (1.4); 4.2100 (0.6); 4.1984 (0.5); 4.1862 (0.6); 2.5863 (16.0); 1.2899 (4.2); 1.2661 (8.4); 1.2423 (4.0); 0.0392 (0.6)	
I.77: ¹ H-NMR(400.1 MHz, CDCl ₃): δ= 7.2631 (10.2); 6.2910 (1.2); 5.0930 (0.4); 5.0824 (0.7); 5.0715 (1.0); 5.0609 (1.4); 5.0504 (1.0); 5.0388 (0.7); 5.0302 (0.3); 4.2055 (5.5); 4.1933 (5.4); 3.9529 (1.2); 3.9418 (2.2); 3.9248 (1.7); 3.9121 (2.5); 3.9010 (1.4); 3.5810 (1.5); 3.5745 (1.7); 3.5517 (2.8); 3.5288 (1.4); 3.5229 (1.4); 2.9579 (1.3); 2.8850 (1.2); 2.5625 (16.0); 1.9798 (1.4); 1.9710 (1.5); 1.9590 (1.4); 1.9462 (1.9); 1.9388 (1.9); 1.7726 (0.8); 1.7629 (0.9); 1.7502 (1.6); 1.7401 (2.1); 1.7290 (1.4); 1.7179 (1.9); 1.7077 (1.2); 1.6958 (0.6); 1.6852 (0.6); 1.5625 (7.0); -0.0002 (6.7)	30
I.78: ¹ H-NMR(400.1 MHz, CDCl ₃): δ= 7.2612 (10.3); 6.3202 (1.0); 5.1470 (0.5); 5.1315 (1.2); 5.1155 (1.5); 5.1001 (1.2); 5.0845 (0.5); 4.1574 (5.4); 4.1453 (5.3); 2.5608 (15.4); 1.5538 (12.7); 1.3017 (16.0); 1.2862 (15.8); -0.0002 (5.0)	
I.79: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.5272 (1.0); 8.5092 (1.0); 4.3603 (1.0); 4.3420 (1.6); 4.3238 (1.0); 2.8918 (0.4); 2.7333 (0.3); 2.7321 (0.3); 2.5124 (4.4); 2.5079 (8.9); 2.5033 (11.7); 2.4987 (8.3); 2.4941 (3.9); 2.4250 (16.0); 1.3709 (6.1); 1.3526 (6.0); -0.0002 (8.9)	
I.80: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.5409 (0.5); 8.5268 (1.0); 8.5123 (0.5); 7.9522 (0.5); 3.8951 (4.0); 3.8805 (4.0); 3.7792 (0.5); 3.6363 (1.2); 3.5437 (1.6); 3.3131 (0.5); 2.8944 (3.4); 2.7358 (2.8); 2.7347 (2.8); 2.5181 (3.6); 2.5137 (7.4); 2.5091 (9.8); 2.5045 (7.2); 2.5000 (3.5); 2.4085 (16.0); -0.0002 (4.1)	40

【 0 2 5 9 】

I.81: ¹H-NMR(400.2 MHz, d₆-DMSO): δ= 8.5222 (0.9); 8.5043 (0.9); 7.9535 (1.9); 4.3621 (1.0); 4.3439 (1.5); 4.3257 (1.0); 2.8922 (13.5); 2.7335 (11.5); 2.7324 (11.0); 2.5458 (0.5); 2.5211 (0.3); 2.5126 (4.2); 2.5081 (8.4); 2.5035 (11.0); 2.4989 (7.8); 2.4944 (3.6); 2.3890 (16.0); 1.3757 (6.0); 1.3574 (5.9); -0.0002 (7.0)	
I.82: ¹H-NMR(400.2 MHz, d₆-DMSO): δ= 8.3653 (1.0); 8.3452 (1.0); 7.9534 (0.4); 4.2186 (1.1); 4.2028 (1.2); 4.1985 (1.2); 4.1827 (1.1); 2.8922 (2.8); 2.7336 (2.3); 2.7323 (2.3); 2.5477 (0.5); 2.5211 (0.4); 2.5125 (4.6); 2.5080 (9.3); 2.5034 (12.2); 2.4988 (8.8); 2.4943 (4.2); 2.4457 (1.1); 2.3771 (16.0); 2.3708 (1.7); 2.1931 (0.5); 2.1763 (0.8); 2.1597 (0.8); 2.1429 (0.5); 0.9605 (10.5); 0.9434 (10.2); 0.9305 (0.5); 0.9183 (0.4); 0.9143 (0.5); 0.9025 (0.6); 0.8973 (0.4); 0.8862 (0.3); 0.0080 (0.3); -0.0002 (8.8)	
I.83: ¹H-NMR(400.1 MHz, d₆-DMSO): δ= 8.2727 (2.2); 8.2525 (2.1); 7.9603 (1.5); 4.4433 (1.6); 4.4275 (2.1); 4.4112 (1.5); 3.3334 (18.0); 3.0685 (0.3); 2.8999 (6.7); 2.7406 (6.3); 2.5101 (8.9); 2.3781 (16.0); 1.9992 (1.2); 1.9830 (1.6); 1.9674 (1.3); 1.4459 (0.6); 1.4294 (1.0); 1.4122 (1.4); 1.3949 (1.3); 1.3786 (0.9); 1.2528 (0.9); 1.2359 (1.4); 1.2186 (1.4); 1.2015 (1.1); 1.1829 (0.6); 0.9330 (8.6); 0.9156 (12.1); 0.8961 (8.5); 0.8780 (4.0)	10
I.84: ¹H-NMR(400.2 MHz, d₆-DMSO): δ= 8.5037 (1.1); 8.4838 (1.1); 7.9536 (0.7); 4.3579 (0.5); 4.3482 (0.4); 4.3427 (0.5); 4.3381 (0.6); 4.3315 (0.5); 4.3232 (0.4); 4.3116 (0.4); 2.8924 (4.8); 2.7338 (3.9); 2.7327 (4.1); 2.5475 (0.5); 2.5127 (4.9); 2.5083 (10.1); 2.5037 (13.4); 2.4991 (9.7); 2.4946 (4.7); 2.4386 (0.8); 2.3790 (16.0); 2.3711 (1.4); 1.7447 (0.4); 1.7289 (0.4); 1.7238 (0.4); 1.7174 (0.7); 1.7137 (0.7); 1.6983 (0.5); 1.6870 (0.8); 1.6709 (0.5); 1.6663 (0.5); 1.6545 (0.4); 1.6502 (0.4); 1.6027 (0.6); 1.5907 (0.4); 1.5809 (0.4); 1.5706 (0.8); 1.5600 (0.4); 0.9239 (5.3); 0.9080 (5.2); 0.8901 (5.0); 0.8743 (4.9); -0.0002 (8.0)	
I.85: ¹H-NMR(400.1 MHz, d₆-DMSO): δ= 8.5180 (1.9); 8.4991 (1.9); 7.9602 (0.8); 4.4520 (1.4); 4.4400 (1.4); 3.3307 (19.0); 2.8989 (3.5); 2.7400 (3.2); 2.5779 (1.5); 2.5580 (2.4); 2.5368 (2.6); 2.5103 (10.0); 2.3957 (13.6); 2.0614 (16.0); 2.0039 (0.8); 1.2642 (0.4); 1.2477 (0.4)	
I.86: ¹H-NMR(400.2 MHz, d₆-DMSO): δ= 8.5160 (1.3); 8.4958 (1.3); 7.9534 (1.4); 7.2874 (7.4); 7.2764 (12.3); 7.2659 (0.7); 7.2241 (0.8); 7.2130 (1.2); 7.2024 (1.3); 7.1948 (0.5); 7.1907 (0.7); 4.5618 (0.4); 4.5507 (0.5); 4.5414 (0.5); 4.5351 (0.7); 4.5310 (0.6); 4.5244 (0.5); 4.5152 (0.5); 4.5041 (0.4); 3.2195 (0.8); 3.2084 (0.9); 3.1850 (1.1); 3.1740 (1.0); 3.0347 (1.1); 3.0080 (1.1); 3.0003 (0.9); 2.9736 (0.8); 2.8909 (10.4); 2.7331 (8.7); 2.7320 (8.6); 2.5451 (0.6); 2.5209 (0.5); 2.5123 (6.5); 2.5078 (13.6); 2.5033 (18.0); 2.4987 (13.0); 2.4941 (6.3); 2.4423 (0.5); 2.1912 (16.0); 0.0080 (0.4); -0.0002 (11.9); -0.0085 (0.4)	20
I.87: ¹H-NMR(400.1 MHz, d₆-DMSO): δ= 8.5093 (2.0); 8.4904 (2.0); 7.9600 (1.2); 4.4403 (1.5); 4.4292 (1.4); 3.5729 (0.4); 3.5582 (0.4); 3.3284 (60.1); 3.0720 (0.4); 2.8997 (5.2); 2.7405 (4.9); 2.5733 (1.7); 2.5542 (2.8); 2.5106 (17.5); 2.4335 (13.7); 2.0606 (16.0); 1.9943 (1.0); 1.2598 (0.5); 1.2435 (0.5)	
I.88: ¹H-NMR(400.1 MHz, d₆-DMSO): δ= 8.5092 (2.3); 8.4901 (2.3); 7.9603 (2.4); 7.2839 (14.4); 7.2212 (2.1); 4.5415 (1.7); 3.3304 (51.8); 3.2177 (2.5); 3.1836 (2.6); 3.0679 (0.4); 3.0349 (1.8); 3.0061 (2.2); 2.9731 (1.3); 2.8984 (10.5); 2.7397 (10.0); 2.5105 (13.6); 2.2400 (16.0)	
I.89: ¹H-NMR(499.9 MHz, d₆-DMSO): δ= 12.7827 (1.0); 8.2866 (2.9); 8.2699 (2.9); 4.4317 (2.5); 4.4215 (2.7); 4.4150 (2.6); 4.4047 (2.5); 3.3170 (3.0); 2.5116 (5.3); 2.5081 (11.0); 2.5046 (15.1); 2.5010 (11.0); 2.4975 (5.2); 2.4072 (38.2); 1.9991 (0.6); 1.9856 (1.4); 1.9731 (1.7); 1.9605 (1.4); 1.9470 (0.7); 1.4296 (0.9); 1.4162 (1.4); 1.4020 (2.0); 1.3877 (1.7); 1.3743 (1.2); 1.3597 (0.3); 1.2397 (1.2); 1.2249 (2.0); 1.2104 (1.7); 1.1975 (1.6); 1.1827 (1.0); 0.9221 (15.5); 0.9083 (15.9); 0.9035 (9.2); 0.8886 (16.0); 0.8738 (6.7)	30
I.90: ¹H-NMR(300.2 MHz, d₆-DMSO): δ= 12.7133 (0.7); 8.5333 (2.7); 8.5069 (2.8); 4.3890 (0.6); 4.3748 (1.2); 4.3624 (0.9); 4.3484 (1.5); 4.3400 (1.2); 4.3284 (0.7); 4.3136 (0.9); 3.3524 (16.0); 2.5339 (5.4); 2.5280 (11.2); 2.5219 (15.3); 2.5159 (11.2); 2.5101 (5.4); 2.4326 (33.0); 2.0956 (0.3); 1.7793 (0.5); 1.7648 (0.9); 1.7283 (2.0); 1.6984 (1.8); 1.6821 (1.5); 1.6639 (1.0); 1.6432 (0.8); 1.6170 (1.5); 1.5912 (0.8); 1.5778 (1.5); 1.5638 (0.9); 1.5513 (0.5); 0.9422 (10.2); 0.9217 (10.2); 0.9083 (10.3); 0.8876 (10.0); 0.0304 (0.4); 0.0194 (9.8); 0.0083 (0.4)	
I.91: ¹H-NMR(300.2 MHz, CDCl₃): δ= 7.2994 (2.8); 6.3458 (0.5); 6.3191 (0.5); 4.7660 (1.2); 4.7507 (1.2); 4.7379 (1.1); 4.7226 (1.1); 3.8211 (16.0); 2.5383 (15.5); 2.3377 (0.5); 2.3220 (0.5); 2.3148 (0.7); 2.2994 (0.7); 2.2919 (0.6); 2.2765 (0.5); 1.0442 (6.6); 1.0213 (6.6); 1.0101 (6.9); 0.9871 (6.5); 0.0350 (0.9)	
I.92: ¹H-NMR(300.2 MHz, CDCl₃): δ= 7.2990 (0.8); 6.4532 (1.3); 3.7374 (16.0); 2.5560 (15.5); 1.7066 (1.0); 1.7009 (1.2); 1.6839 (3.2); 1.6730 (3.4); 1.6578 (1.4); 1.3263 (1.4); 1.3108 (3.4); 1.3001 (3.3); 1.2833 (1.2); 0.0278 (1.0)	40

【 0 2 6 0 】

IVa.01: 1H-NMR(300.2 MHz, d6-DMSO): δ= 4.0799 (5.3); 4.0586 (5.4); 3.3415 (4.9); 2.5524 (17.9); 2.5343 (0.7); 2.5282 (1.2); 2.5221 (1.7); 2.5160 (1.2); 2.5100 (0.6); 2.0454 (0.4); 2.0232 (0.8); 2.0010 (1.0); 1.9789 (0.8); 1.9568 (0.4); 1.2627 (0.6); 0.9753 (16.0); 0.9529 (15.3); 0.8761 (0.6); 0.0180 (1.3)	
IVa.02: 1H-NMR(499.9 MHz, CDCl3): δ= 7.2622 (1.9); 4.3528 (1.2); 4.3385 (4.0); 4.3242 (4.3); 4.3100 (1.9); 2.5262 (16.0); 2.4981 (1.1); 1.3792 (4.2); 1.3650 (8.5); 1.3507 (5.1); 1.3366 (1.2); 1.2972 (0.6); 1.2845 (0.7); 1.2536 (5.5); 1.1056 (0.3); 0.8885 (0.6); 0.8799 (0.9); 0.8739 (0.8); 0.8656 (0.9); 0.8558 (1.0); 0.8412 (0.9); -0.0002 (1.7)	
IVa.03: 1H-NMR(400.1 MHz, d6-DMSO): δ= 4.0712 (5.4); 4.0552 (5.4); 3.3163 (4.8); 2.5139 (1.6); 2.5096 (2.2); 2.5053 (1.6); 2.4861 (17.1); 2.0251 (0.5); 2.0085 (0.9); 1.9919 (1.2); 1.9753 (1.0); 1.9587 (0.5); 0.9630 (16.0); 0.9462 (15.5)	
Vla.01: 1H-NMR(300.2 MHz, CDCl3): δ= 7.7266 (0.9); 7.2983 (1.8); 4.3473 (2.2); 4.3235 (6.6); 4.2997 (6.8); 4.2799 (9.4); 4.2639 (8.9); 1.6684 (1.5); 1.3796 (8.0); 1.3558 (16.0); 1.3319 (7.7); 0.0290 (2.0)	10
Vla.02: 1H-NMR(300.2 MHz, CDCl3): δ= 7.6832 (0.5); 7.2980 (1.8); 4.3203 (5.0); 4.3043 (4.9); 3.8640 (16.0); 1.6217 (0.6); 0.0330 (2.2)	
Vla.03: 1H-NMR(300.2 MHz, CDCl3): δ= 7.6908 (0.5); 7.2986 (3.4); 4.3181 (4.8); 4.3021 (4.8); 3.8644 (16.0); 2.0812 (0.4); 1.6018 (1.6); 0.0358 (4.1)	
Vla.04: 1H-NMR(400.2 MHz, d6-DMSO): δ= 9.0297 (2.9); 4.1005 (2.1); 4.0828 (6.7); 4.0651 (6.7); 4.0473 (2.1); 3.3285 (11.9); 2.5220 (0.4); 2.5133 (6.0); 2.5088 (12.5); 2.5042 (16.6); 2.4995 (12.0); 2.4950 (5.9); 1.4637 (1.8); 1.4515 (4.4); 1.4431 (4.8); 1.4322 (2.0); 1.1946 (2.2); 1.1820 (10.0); 1.1753 (4.9); 1.1641 (16.0); 1.1463 (7.1); -0.0002 (0.4)	
Vla.05: 1H-NMR(499.9 MHz, d6-DMSO): δ= 9.1058 (3.8); 4.1569 (2.1); 4.1426 (6.5); 4.1284 (6.6); 4.1143 (2.1); 3.3757 (1.0); 2.5650 (0.4); 2.5615 (0.8); 2.5579 (1.0); 2.5543 (0.8); 2.5508 (0.4); 1.5126 (1.8); 1.5030 (4.7); 1.4964 (5.0); 1.4875 (2.0); 1.2481 (7.1); 1.2338 (16.0); 1.2238 (5.6); 1.2196 (9.1); 1.2076 (1.9)	20
Vla.06: 1H-NMR(300.2 MHz, d6-DMSO): δ= 12.5912 (0.3); 12.5704 (0.3); 8.9622 (5.6); 3.3582 (16.0); 2.5348 (7.3); 2.5289 (15.6); 2.5228 (21.8); 2.5167 (15.8); 2.5108 (7.3); 1.4582 (2.0); 1.4422 (5.0); 1.4314 (5.7); 1.4172 (2.5); 1.1587 (2.6); 1.1445 (5.5); 1.1336 (5.4); 1.1178 (2.0); 0.0317 (1.0); 0.0207 (30.4); 0.0098 (1.1)	
Vla.07: 1H-NMR(400.2 MHz, d6-DMSO): δ= 9.0605 (4.1); 8.3150 (0.5); 4.1032 (2.2); 4.0855 (7.1); 4.0677 (7.1); 4.0500 (2.3); 3.3287 (15.8); 2.8923 (0.7); 2.7326 (0.6); 2.5263 (0.4); 2.5216 (0.6); 2.5128 (8.7); 2.5084 (18.0); 2.5038 (23.9); 2.4992 (17.7); 2.4948 (8.9); 1.4546 (1.8); 1.4425 (4.6); 1.4343 (5.1); 1.4233 (2.1); 1.1961 (7.7); 1.1783 (16.0); 1.1693 (2.6); 1.1604 (9.6); 1.1499 (5.1); 1.1378 (1.8); -0.0002 (0.5)	
Vla.08: 1H-NMR(300.2 MHz, d6-DMSO): δ= 9.0801 (2.6); 3.6446 (16.0); 3.3477 (11.1); 2.5279 (2.3); 2.5220 (3.1); 2.5161 (2.2); 1.4960 (1.0); 1.4795 (2.8); 1.4685 (3.1); 1.4541 (1.3); 1.2106 (1.4); 1.1961 (3.1); 1.1851 (2.9); 1.1685 (1.1); 0.0189 (2.7)	
Vla.09: 1H-NMR(300.2 MHz, d6-DMSO): δ= 12.6292 (0.5); 12.5891 (0.6); 12.5706 (0.6); 12.5368 (0.5); 8.9512 (15.1); 6.8906 (0.3); 3.3471 (16.0); 2.5343 (14.3); 2.5283 (29.9); 2.5222 (40.7); 2.5161 (28.9); 2.5102 (13.1); 2.2042 (0.5); 2.0093 (1.1); 1.9289 (0.4); 1.4951 (0.3); 1.4457 (5.1); 1.4297 (12.6); 1.4189 (14.1); 1.4050 (6.2); 1.3753 (4.2); 1.3509 (0.6); 1.2561 (0.6); 1.2184 (0.5); 1.2012 (1.5); 1.1949 (1.1); 1.1708 (0.7); 1.1518 (6.7); 1.1379 (14.3); 1.1271 (13.5); 1.1112 (5.0); 0.0308 (1.6); 0.0200 (45.4); 0.0090 (1.5)	30
Vla.10: 1H-NMR(400.2 MHz, d6-DMSO): δ= 8.7446 (0.8); 8.7304 (1.7); 8.7161 (0.8); 4.1608 (2.2); 4.1430 (7.0); 4.1252 (7.1); 4.1075 (2.3); 4.0177 (6.3); 4.0032 (6.3); 3.3296 (12.4); 2.8929 (0.6); 2.7342 (0.5); 2.7332 (0.5); 2.5270 (0.4); 2.5223 (0.6); 2.5135 (7.2); 2.5091 (14.7); 2.5045 (19.2); 2.4999 (13.9); 2.4954 (6.7); 1.2357 (8.0); 1.2179 (16.0); 1.2001 (7.6); -0.0002 (0.4)	
Vla.11: 1H-NMR(400.2 MHz, d6-DMSO): δ= 8.5453 (1.5); 8.5258 (1.5); 4.3175 (1.6); 4.3022 (1.8); 4.2980 (1.8); 4.2826 (1.6); 4.2026 (1.0); 4.1934 (0.8); 4.1849 (1.0); 4.1757 (2.7); 4.1664 (1.2); 4.1579 (2.9); 4.1485 (2.9); 4.1399 (1.2); 4.1308 (2.8); 4.1215 (1.1); 4.1131 (0.9); 4.1037 (1.1); 4.0860 (0.3); 3.3279 (12.9); 2.8931 (0.9); 2.7344 (0.7); 2.7330 (0.7); 2.5268 (0.4); 2.5221 (0.6); 2.5134 (8.1); 2.5089 (16.5); 2.5043 (21.5); 2.4996 (15.3); 2.4951 (7.2); 2.2143 (0.8); 2.1976 (1.2); 2.1813 (1.3); 2.1645 (0.8); 1.2379 (7.9); 1.2201 (16.0); 1.2023 (7.4); 0.9932 (9.5); 0.9770 (14.5); 0.9607 (8.7); -0.0002 (0.5)	40

【 0 2 6 1 】

Vla.12: 1H-NMR(499.9 MHz, d6-DMSO): δ= 8.7100 (1.0); 8.6988 (1.8); 8.6874 (0.9); 4.1628 (2.4); 4.1486 (7.0); 4.1343 (7.0); 4.1201 (2.2); 4.0351 (6.9); 4.0236 (6.7); 3.3227 (1.6); 2.5139 (0.4); 2.5104 (0.7); 2.5067 (0.9); 2.5031 (0.6); 1.2367 (8.0); 1.2224 (16.0); 1.2082 (7.6)	
Vla.13: 1H-NMR(300.2 MHz, d6-DMSO): δ= 8.5980 (0.5); 3.9800 (1.7); 3.9611 (1.7); 3.3447 (16.0); 2.5345 (3.3); 2.5285 (7.1); 2.5224 (9.9); 2.5164 (7.2); 2.5104 (3.3); 2.0099 (0.4); 0.0317 (0.4); 0.0208 (14.2); 0.0098 (0.5)	
Vla.14: 1H-NMR(400.2 MHz, d6-DMSO): δ= 8.7570 (1.9); 8.7380 (2.0); 7.3230 (0.9); 7.3202 (1.4); 7.3165 (0.6); 7.3022 (4.0); 7.2996 (3.1); 7.2899 (1.2); 7.2846 (5.3); 7.2719 (4.3); 7.2678 (6.6); 7.2614 (1.1); 7.2511 (2.6); 7.2465 (2.4); 7.2426 (1.6); 7.2375 (0.8); 7.2308 (0.9); 7.2248 (2.4); 7.2178 (0.5); 7.2120 (0.5); 7.2075 (0.8); 7.2034 (0.4); 4.6413 (0.6); 4.6273 (0.8); 4.6188 (1.1); 4.6081 (1.0); 4.6050 (1.0); 4.5998 (0.9); 4.5857 (0.7); 4.1411 (1.5); 4.1235 (4.8); 4.1064 (5.2); 4.0887 (1.8); 3.3294 (20.9); 3.1759 (0.9); 3.1620 (1.0); 3.1414 (1.8); 3.1277 (1.6); 3.0775 (1.7); 3.0546 (1.7); 3.0431 (1.0); 3.0202 (0.9); 2.8913 (1.0); 2.7333 (0.8); 2.7322 (0.8); 2.5258 (0.6); 2.5210 (0.8); 2.5124 (11.3); 2.5080 (22.9); 2.5034 (29.8); 2.4988 (21.4); 2.4942 (10.2); 1.1871 (7.6); 1.1693 (16.0); 1.1515 (7.3); -0.0002 (0.6)	10
Vla.15: 1H-NMR(400.2 MHz, d6-DMSO): δ= 8.7592 (1.8); 8.7404 (1.9); 4.4041 (0.7); 4.3918 (0.7); 4.3852 (0.9); 4.3786 (1.1); 4.3731 (0.9); 4.3669 (0.8); 4.3599 (0.9); 4.3479 (0.6); 4.1667 (0.6); 4.1575 (1.0); 4.1488 (0.8); 4.1459 (1.2); 4.1397 (3.2); 4.1282 (3.4); 4.1219 (3.4); 4.1104 (3.3); 4.1041 (1.3); 4.1015 (1.0); 4.0927 (1.0); 4.0835 (0.7); 3.3280 (13.4); 2.8930 (1.0); 2.7334 (0.9); 2.5267 (0.4); 2.5219 (0.6); 2.5132 (9.0); 2.5088 (18.2); 2.5043 (23.9); 2.4997 (17.3); 2.4952 (8.4); 1.7758 (0.5); 1.7706 (0.5); 1.7624 (0.8); 1.7563 (1.1); 1.7469 (1.5); 1.7284 (1.2); 1.7211 (1.6); 1.7085 (0.8); 1.6956 (1.1); 1.6830 (0.8); 1.6100 (0.6); 1.6055 (0.5); 1.5938 (1.0); 1.5838 (0.9); 1.5721 (1.6); 1.5606 (0.8); 1.5480 (0.4); 1.5380 (0.5); 1.2249 (7.8); 1.2072 (16.0); 1.1894 (7.5); 0.9325 (9.4); 0.9165 (9.4); 0.9040 (9.2); 0.8879 (8.8); -0.0002 (0.5)	20
Vla.16: 1H-NMR(400.2 MHz, d6-DMSO): δ= 8.8160 (1.0); 8.7974 (1.0); 4.5250 (0.4); 4.5112 (0.5); 4.5045 (0.7); 4.4913 (0.6); 4.4853 (0.5); 4.4715 (0.4); 4.1686 (0.5); 4.1583 (0.7); 4.1508 (1.6); 4.1404 (1.7); 4.1329 (1.7); 4.1227 (1.6); 4.1146 (0.7); 4.1049 (0.5); 3.3280 (6.7); 2.6263 (0.7); 2.6105 (1.3); 2.5910 (1.7); 2.5721 (0.7); 2.5662 (0.4); 2.5566 (0.6); 2.5128 (4.9); 2.5084 (9.7); 2.5039 (12.6); 2.4993 (9.2); 2.4949 (4.5); 2.0655 (16.0); 2.0549 (1.0); 2.0455 (0.9); 2.0413 (0.8); 2.0300 (0.7); 2.0253 (0.6); 2.0095 (0.4); 1.2317 (3.8); 1.2242 (0.6); 1.2139 (7.7); 1.1961 (3.6)	30
Vla.17: 1H-NMR(400.2 MHz, d6-DMSO): δ= 8.4679 (1.4); 8.4484 (1.4); 4.3306 (1.8); 4.3155 (2.0); 4.3111 (2.0); 4.2960 (1.8); 4.2263 (0.3); 4.2085 (1.1); 4.1993 (0.9); 4.1908 (1.1); 4.1815 (2.9); 4.1701 (1.1); 4.1637 (3.0); 4.1523 (3.0); 4.1460 (1.1); 4.1346 (3.0); 4.1253 (1.2); 4.1169 (0.9); 4.1076 (1.1); 4.0898 (0.4); 3.3272 (13.7); 2.5269 (0.4); 2.5222 (0.6); 2.5135 (7.8); 2.5091 (15.6); 2.5045 (20.3); 2.4999 (14.6); 2.4954 (7.0); 2.2189 (0.9); 2.2021 (1.4); 2.1861 (1.4); 2.1693 (0.9); 1.2350 (8.1); 1.2172 (16.0); 1.1995 (7.6); 0.9813 (10.9); 0.9679 (12.2); 0.9644 (12.1); 0.9509 (10.0); -0.0002 (0.4)	40
Vla.18: 1H-NMR(400.2 MHz, d6-DMSO): δ= 8.7118 (1.5); 8.6928 (1.5); 4.4275 (0.5); 4.4158 (0.9); 4.4087 (0.7); 4.4029 (0.8); 4.3968 (1.0); 4.3907 (0.9); 4.3840 (0.6); 4.3717 (0.7); 4.1696 (0.6); 4.1605 (1.0); 4.1500 (1.2); 4.1427 (3.1); 4.1322 (3.3); 4.1248 (3.3); 4.1144 (3.2); 4.1069 (1.2); 4.0968 (1.0); 4.0874 (0.6); 3.3279 (16.2); 2.8936 (1.4); 2.7345 (1.2); 2.7333 (1.1); 2.5269 (0.4); 2.5221 (0.6); 2.5134 (7.8); 2.5090 (15.8); 2.5044 (20.5); 2.4997 (14.6); 2.4952 (6.9); 1.7756 (0.5); 1.7632 (0.8); 1.7497 (0.5); 1.7377 (1.5); 1.7310 (1.5); 1.7139 (1.9); 1.7012 (1.0); 1.6850 (0.4); 1.6146 (0.7); 1.6003 (0.8); 1.5888 (1.5); 1.5772 (0.8); 1.2332 (0.3); 1.2201 (7.7); 1.2024 (16.0); 1.1846 (7.4); 0.9318 (8.4); 0.9160 (8.0); 0.9001 (8.0); 0.8841 (7.6); -0.0002 (0.4)	50
Vla.19: 1H-NMR(400.2 MHz, d6-DMSO): δ= 8.7776 (0.7); 8.7591 (0.8); 4.5404 (0.4); 4.5346 (0.6); 4.5210 (0.5); 4.5154 (0.4); 4.5011 (0.3); 4.1724 (0.4); 4.1634 (0.7); 4.1545 (1.5); 4.1454 (1.7); 4.1367 (1.6); 4.1277 (1.5); 4.1187 (0.8); 4.1100 (0.5); 3.3275 (6.3); 2.8934 (0.8); 2.7345 (0.7); 2.7331 (0.7); 2.6019 (0.6); 2.5865 (1.1); 2.5834 (0.9); 2.5671 (1.6); 2.5518 (0.4); 2.5487 (0.6); 2.5134 (3.5); 2.5088 (7.0); 2.5042 (9.2); 2.4996 (6.6); 2.4950 (3.2); 2.0904 (0.4); 2.0854 (0.4); 2.0764 (0.5); 2.0714 (0.9); 2.0602 (16.0); 2.0491 (0.8); 2.0451 (0.6); 2.0389 (0.4); 2.0286 (0.4); 1.2275 (3.7); 1.2189 (0.3); 1.2098 (7.6); 1.1920 (3.5)	

[0 2 6 2]

Vla.20: 1H-NMR(400.2 MHz, d6-DMSO): δ= 8.6332 (1.6); 8.6144 (1.6); 7.3226 (0.8); 7.3198 (1.3); 7.3160 (0.6); 7.3018 (3.7); 7.2993 (3.2); 7.2900 (1.2); 7.2843 (5.4); 7.2746 (4.6); 7.2706 (6.8); 7.2641 (1.0); 7.2541 (2.4); 7.2498 (1.4); 7.2465 (1.6); 7.2428 (1.5); 7.2374 (0.8); 7.2312 (0.9); 7.2251 (2.3); 7.2180 (0.5); 7.2128 (0.5); 7.2080 (0.8); 7.2038 (0.4); 4.6760 (0.7); 4.6622 (0.9); 4.6569 (1.0); 4.6537 (1.2); 4.6432 (1.0); 4.6401 (1.0); 4.6348 (1.0); 4.6209 (0.7); 4.1481 (1.5); 4.1317 (4.6); 4.1304 (4.6); 4.1138 (5.0); 4.0959 (1.7); 3.3305 (17.0); 3.2003 (0.9); 3.1866 (1.0); 3.1658 (1.8); 3.1522 (1.7); 3.1031 (1.8); 3.0805 (1.8); 3.0687 (1.0); 3.0461 (1.0); 2.8916 (1.0); 2.7338 (0.8); 2.7327 (0.9); 2.5264 (0.4); 2.5216 (0.6); 2.5129 (8.5); 2.5085 (17.0); 2.5039 (22.1); 2.4993 (15.9); 2.4947 (7.6); 1.1861 (7.7); 1.1684 (16.0); 1.1506 (7.4); -0.0002 (0.4)	
Vla.21: 1H-NMR(400.2 MHz, d6-DMSO): δ= 8.5103 (1.4); 8.4908 (1.4); 4.3318 (1.4); 4.3166 (1.7); 4.3124 (1.6); 4.2971 (1.4); 4.2063 (0.8); 4.1970 (0.7); 4.1885 (0.8); 4.1793 (2.2); 4.1704 (1.0); 4.1615 (2.3); 4.1526 (2.3); 4.1436 (1.0); 4.1348 (2.3); 4.1256 (0.8); 4.1171 (0.7); 4.1078 (0.8); 3.3229 (19.1); 2.5250 (0.5); 2.5117 (10.5); 2.5073 (21.4); 2.5028 (28.2); 2.4983 (20.2); 2.4938 (9.7); 2.2231 (0.7); 2.2063 (1.2); 2.1900 (1.2); 2.1733 (0.8); 1.2391 (6.6); 1.2214 (13.0); 1.2036 (6.0); 0.9988 (8.7); 0.9816 (16.0); 0.9643 (8.0); -0.0002 (5.3)	10
Vla.22: 1H-NMR(400.2 MHz, d6-DMSO): δ= 8.7477 (2.1); 8.7289 (2.1); 4.4118 (0.8); 4.3994 (0.8); 4.3928 (1.0); 4.3867 (1.2); 4.3809 (0.9); 4.3749 (0.8); 4.3680 (1.0); 4.3560 (0.6); 4.1690 (0.6); 4.1597 (1.0); 4.1486 (1.3); 4.1420 (3.2); 4.1308 (3.4); 4.1242 (3.4); 4.1131 (3.2); 4.1062 (1.3); 4.0954 (1.0); 4.0861 (0.6); 3.3229 (26.7); 2.5250 (0.7); 2.5113 (14.8); 2.5070 (30.5); 2.5026 (40.5); 2.4981 (29.6); 2.4937 (14.6); 1.7949 (0.3); 1.7786 (0.6); 1.7621 (1.3); 1.7531 (1.4); 1.7303 (2.0); 1.7178 (0.9); 1.7047 (1.3); 1.6920 (0.8); 1.6176 (0.6); 1.6015 (1.0); 1.5916 (0.9); 1.5799 (1.7); 1.5684 (0.8); 1.5549 (0.4); 1.5458 (0.5); 1.2389 (0.7); 1.2251 (7.8); 1.2074 (16.0); 1.1896 (7.6); 0.9345 (9.8); 0.9186 (9.9); 0.9051 (9.7); 0.8891 (9.4); -0.0002 (7.2)	
Vla.23: 1H-NMR(400.2 MHz, d6-DMSO): δ= 8.8083 (1.0); 8.7898 (1.0); 4.5337 (0.3); 4.5137 (0.6); 4.4998 (0.6); 4.4947 (0.5); 4.4804 (0.3); 4.1713 (0.5); 4.1613 (0.6); 4.1535 (1.5); 4.1433 (1.6); 4.1356 (1.6); 4.1256 (1.5); 4.1174 (0.7); 4.1079 (0.5); 3.3232 (10.4); 2.6291 (0.7); 2.6137 (1.3); 2.5945 (1.7); 2.5761 (0.7); 2.5613 (0.3); 2.5115 (6.4); 2.5071 (13.2); 2.5026 (17.5); 2.4981 (12.8); 2.4937 (6.3); 2.0813 (0.5); 2.0662 (16.0); 2.0485 (0.8); 2.0389 (0.8); 2.0304 (0.4); 2.0185 (0.4); 1.2323 (3.7); 1.2146 (7.5); 1.1968 (3.5); -0.0002 (3.4)	20
Vla.24: 1H-NMR(400.2 MHz, d6-DMSO): δ= 8.7327 (2.0); 8.7139 (2.0); 7.3206 (1.4); 7.3025 (4.2); 7.2902 (1.4); 7.2847 (5.6); 7.2683 (7.1); 7.2515 (2.8); 7.2471 (2.6); 7.2432 (1.8); 7.2312 (1.0); 7.2254 (2.4); 7.2187 (0.5); 7.2126 (0.5); 7.2082 (0.8); 4.6559 (0.7); 4.6418 (1.0); 4.6337 (1.2); 4.6227 (1.1); 4.6199 (1.1); 4.6146 (1.0); 4.6006 (0.7); 4.1446 (1.6); 4.1374 (0.3); 4.1271 (5.3); 4.1096 (5.6); 4.0996 (0.3); 4.0919 (1.9); 3.3249 (32.0); 3.1832 (1.0); 3.1692 (1.1); 3.1487 (2.0); 3.1349 (1.8); 3.0878 (1.9); 3.0651 (1.9); 3.0534 (1.1); 3.0307 (1.0); 2.8912 (0.4); 2.7321 (0.3); 2.5246 (0.8); 2.5113 (17.7); 2.5070 (35.1); 2.5025 (45.5); 2.4979 (32.5); 2.4935 (15.5); 1.2389 (0.6); 1.1887 (7.7); 1.1709 (16.0); 1.1532 (7.4); -0.0002 (7.0)	
VIIa.01: 1H-NMR(499.9 MHz, CDCl ₃): δ= 7.2672 (1.2); 4.4055 (2.5); 4.3912 (7.7); 4.3769 (7.8); 4.3627 (2.6); 2.0088 (0.9); 1.4065 (8.0); 1.3922 (16.0); 1.3780 (8.0); 1.2628 (0.4); 1.2538 (1.0); -0.0002 (1.4)	
VIIa.02: 1H-NMR(300.2 MHz, CDCl ₃): δ= 7.6041 (0.4); 7.2984 (2.1); 3.9506 (16.0); 3.9244 (1.2); 1.5852 (1.8); 0.0364 (2.4)	
VIIa.03: 1H-NMR(499.9 MHz, d6-DMSO): δ= 15.1027 (0.3); 14.9975 (0.4); 14.9759 (0.4); 14.9509 (0.4); 14.9312 (0.4); 14.8896 (0.4); 14.8671 (0.5); 14.8450 (0.5); 14.7865 (0.6); 14.7539 (0.7); 14.6142 (1.0); 14.5943 (1.2); 14.5485 (1.4); 14.5271 (1.5); 14.5236 (1.5); 14.2968 (4.7); 14.1541 (7.0); 14.0699 (5.8); 13.9449 (3.2); 13.8394 (2.0); 13.5699 (0.8); 13.5440 (0.8); 13.4921 (0.6); 13.4731 (0.6); 13.4502 (0.6); 13.4216 (0.6); 13.3628 (0.5); 13.3451 (0.5); 13.3306 (0.4); 13.2703 (0.5); 13.2252 (0.4); 13.2010 (0.4); 13.1591 (0.4); 13.1269 (0.3); 13.0464 (0.3); 7.7544 (8.9); 7.4284 (1.4); 4.5359 (0.3); 4.4060 (0.3); 4.3940 (0.3); 4.3632 (0.4); 4.3500 (0.4); 4.3401 (0.4); 4.2742 (0.4); 4.2369 (0.4); 4.2278 (0.5); 4.2094 (0.5); 4.1782 (0.5); 4.1293 (0.5); 4.1189 (0.6); 4.1132 (0.6); 4.1025 (0.6); 4.0515 (0.6); 4.0446 (0.7); 4.0191 (0.7); 3.9836 (0.8); 3.9763 (0.8); 3.9301 (0.9); 3.8612 (1.0); 3.4109 (6.4); 3.3496 (7.0); 3.1621 (3.7); 2.8672 (1.0); 2.8488 (1.0); 2.8394 (0.9); 2.8120 (0.8); 2.8052 (0.8); 2.7588 (0.9); 2.7233 (0.7); 2.7027 (0.7); 2.6458 (1.7); 2.6421 (2.1); 2.6172 (0.7); 2.5952 (0.7); 2.5818 (0.7); 2.5143 (96.0); 2.5108 (196.0); 2.5072 (264.8); 2.5037 (189.8); 2.5002 (88.3); 2.3720 (1.1); 2.3683 (1.6); 2.3644 (1.2); 2.1856 (0.5); 2.0896 (16.0); 2.0780 (0.4); 1.9135 (0.5); 1.3579 (3.0); 1.3421 (1.0); 1.3177 (0.4); 1.3006 (1.0); 1.2736 (0.5); 1.2600 (1.1); 1.2307 (1.5); 1.2053 (0.4); 1.1833 (2.4); 1.1716 (1.1); 1.0969 (0.4); 0.8541 (0.5)	30
VIIa.04: 1H-NMR(499.9 MHz, d6-DMSO): δ= 3.8598 (16.0); 3.3560 (0.5); 2.5322 (0.6); 2.5288 (1.2); 2.5253 (1.7); 2.5217 (1.2); 2.5184 (0.6)	
VIIa.05: 1H-NMR(300.2 MHz, CDCl ₃): δ= 7.2983 (1.3); 3.9521 (16.0); 1.5875 (0.4); 0.0350 (1.7)	40

【 0 2 6 3 】

VIIIa.06: 1H-NMR(300.2 MHz, d6-DMSO): δ= 19.6514 (1.2); 19.4242 (1.2); 14.4211 (1.5); 14.2144 (4.5); 14.0488 (9.5); 13.9419 (4.6); 13.7837 (1.7); 13.6736 (1.2); 13.6487 (1.2); 13.5662 (1.3); 9.3511 (1.3); 5.7749 (3.0); 4.0838 (1.6); 4.0599 (3.6); 4.0367 (3.6); 4.0129 (1.4); 3.7199 (1.5); 3.6986 (1.4); 3.6881 (1.6); 3.6447 (2.0); 3.5905 (2.2); 3.5604 (2.8); 3.3605 (11.6); 3.1076 (1.9); 3.0934 (1.9); 3.0852 (2.0); 3.0078 (1.6); 2.9717 (1.3); 2.9121 (1.4); 2.8858 (1.6); 2.7479 (1.7); 2.5339 (95.7); 2.5278 (198.8); 2.5217 (271.4); 2.5157 (195.8); 2.5096 (91.8); 2.4429 (1.8); 2.4204 (1.3); 2.2912 (2.1); 2.0080 (16.0); 1.2510 (7.5); 1.2177 (5.6); 1.1940 (10.0); 1.1702 (5.6); 0.8674 (1.7); 0.8481 (1.5); 0.8110 (1.2); 0.0286 (13.0); 0.0178 (337.9); 0.0069 (13.0); -0.0500 (1.4); -0.1807 (1.7)	
VIIIa.07: 1H-NMR(499.9 MHz, CDCl3): δ= 7.2630 (2.8); 4.4029 (2.5); 4.3887 (7.6); 4.3744 (7.7); 4.3601 (2.6); 2.0073 (0.6); 1.5552 (2.0); 1.4026 (8.0); 1.3883 (16.0); 1.3740 (7.8); 1.2543 (0.5); -0.0002 (3.2)	10
VIIIa.08: 1H-NMR(499.9 MHz, CDCl3): δ= 7.2606 (15.4); 5.2995 (3.1); 4.3996 (2.5); 4.3853 (7.7); 4.3710 (7.8); 4.3568 (2.6); 1.5458 (28.2); 1.3998 (8.0); 1.3856 (16.0); 1.3713 (7.9); 1.2560 (0.6); -0.0002 (15.9)	
IXb.01: 1H-NMR(300.2 MHz, CDCl3): δ= 7.3562 (4.5); 7.2987 (4.8); 6.3762 (1.1); 4.2401 (1.4); 4.2163 (4.4); 4.1925 (4.5); 4.1688 (1.5); 2.5394 (16.0); 1.7118 (1.3); 1.6952 (3.6); 1.6843 (3.8); 1.6692 (1.7); 1.6163 (0.3); 1.3412 (1.7); 1.3261 (3.7); 1.3153 (3.7); 1.2979 (6.0); 1.2740 (9.6); 1.2502 (4.6); 0.0354 (6.2)	
IXa.01: 1H-NMR(600.1 MHz, d6-DMSO): δ= 8.6444 (2.5); 8.3131 (4.9); 7.1174 (6.0); 4.0758 (1.6); 4.0640 (5.0); 4.0522 (5.0); 4.0404 (1.6); 3.3303 (5.5); 3.3257 (16.0); 3.3238 (13.3); 3.3012 (1.6); 2.5080 (5.1); 2.5052 (10.5); 2.5022 (14.0); 2.4993 (9.8); 2.4967 (4.5); 2.3608 (18.4); 2.1549 (0.4); 1.4162 (1.5); 1.4084 (3.9); 1.4029 (4.2); 1.3955 (1.6); 1.2397 (0.5); 1.1588 (5.3); 1.1469 (11.0); 1.1405 (1.8); 1.1350 (7.0); 1.1276 (3.7); 1.1196 (1.3)	
IXa.02: 1H-NMR(600.1 MHz, d6-DMSO): δ= 8.3748 (0.6); 8.3652 (1.2); 8.3555 (0.6); 7.1387 (5.8); 4.1343 (1.6); 4.1225 (5.0); 4.1106 (5.0); 4.0988 (1.6); 3.9322 (5.2); 3.9224 (5.2); 3.3259 (16.0); 2.8913 (0.4); 2.5081 (4.3); 2.5052 (9.3); 2.5021 (12.9); 2.4991 (9.2); 2.4961 (4.2); 2.3919 (18.2); 2.1680 (0.4); 1.2393 (0.5); 1.2146 (5.6); 1.2100 (0.3); 1.2027 (11.6); 1.1981 (0.6); 1.1909 (5.5)	20
IXa.03: 1H-NMR(600.1 MHz, d6-DMSO): δ= 8.2288 (0.6); 8.2159 (0.6); 7.1279 (2.7); 7.1274 (2.6); 4.1797 (0.7); 4.1717 (0.6); 4.1677 (1.1); 4.1599 (0.6); 4.1547 (1.0); 4.1538 (1.1); 4.1418 (0.9); 4.1131 (0.9); 4.1013 (0.9); 4.0951 (0.5); 4.0832 (0.5); 3.3309 (5.8); 3.3227 (16.0); 2.8917 (0.5); 2.7326 (0.4); 2.7318 (0.4); 2.5081 (2.6); 2.5051 (5.9); 2.5020 (8.3); 2.4990 (6.1); 2.4960 (3.0); 2.3704 (8.8); 2.1646 (0.4); 2.1532 (0.6); 2.1418 (0.6); 2.1304 (0.4); 1.2129 (2.9); 1.2010 (6.0); 1.1957 (0.4); 1.1892 (2.8); 0.9602 (3.8); 0.9489 (3.8); 0.9372 (3.7); 0.9259 (3.7)	
IXa.04: 1H-NMR(600.1 MHz, d6-DMSO): δ= 8.3807 (0.4); 8.3678 (0.4); 7.2942 (1.0); 7.2836 (2.3); 7.2809 (1.8); 7.2706 (0.3); 7.2189 (0.4); 7.0902 (1.6); 4.1169 (0.7); 4.1141 (0.7); 4.1050 (0.7); 4.1023 (0.7); 3.3462 (5.2); 3.3412 (15.2); 3.3404 (16.0); 3.1372 (0.4); 3.1285 (0.3); 3.0677 (0.4); 3.0507 (0.4); 2.5147 (1.5); 2.5118 (3.3); 2.5088 (4.6); 2.5058 (3.4); 2.5029 (1.6); 2.2220 (4.5); 1.1714 (1.4); 1.1596 (3.0); 1.1478 (1.4)	30
Xa.01: 1H-NMR(300.2 MHz, d6-DMSO): δ= 8.1387(1.3); 6.3153(1.9); 4.0968(0.6); 4.0731(2.1); 4.0495(2.1); 4.0259(0.7); 3.3400(16.0); 2.5351(0.6); 2.5291(1.4); 2.5230(1.9); 2.5169(1.4); 2.5108(0.6); 2.3046(7.5); 1.4114(0.5); 1.3953(1.2); 1.3843(1.4); 1.3703(0.6); 1.1820(2.2); 1.1583(4.8); 1.1347(2.2); 1.1258(0.7); 1.1115(1.4); 1.1005(1.3); 1.0842(0.5); 0.0217(1.9)	
XIa.01: 1H-NMR(300.2 MHz, CDCl3): δ= 7.2987 (3.5); 6.2815 (0.7); 4.2225 (0.6); 4.1988 (2.1); 4.1750 (2.1); 4.1513 (0.7); 3.8296 (0.9); 3.4388 (1.6); 2.8084 (2.5); 2.5446 (1.6); 2.5326 (7.3); 1.6725 (0.7); 1.6561 (1.6); 1.6453 (1.6); 1.6302 (0.8); 1.5840 (16.0); 1.2824 (2.2); 1.2587 (4.7); 1.2501 (1.4); 1.2350 (2.6); 1.2229 (0.5); 0.0341 (3.4)	
XIIIa.01: 1H-NMR(499.9 MHz, d6-DMSO): δ= 4.2571 (0.5); 4.2430 (1.6); 4.2288 (1.6); 4.2146 (0.5); 3.3173 (2.7); 2.5080 (0.7); 2.5046 (1.0); 2.5012 (0.8); 2.4380 (5.9); 1.4974 (16.0); 1.2924 (1.6); 1.2782 (3.4); 1.2640 (1.7)	
XIIIa.02: 1H-NMR(499.9 MHz, d6-DMSO): δ= 3.3167 (18.1); 2.5081 (8.0); 2.5046 (11.3); 2.5011 (8.8); 2.4215 (5.9); 1.4920 (16.0); 1.2394 (1.8)	40

【0264】

生物データ

実施例A：キサントモナス・カンペストリス p.v. カンペストリス (*Xanthomonas campestris* p.v. *campestris*) イン・ビトロ細胞試験

溶媒：DMSO

培地：LB肉汁培地 (Luria Broth Miller) Sigma

接種物：細菌懸濁液

【0265】

被験化合物をDMSOに溶かし、その溶液を用いて必要な範囲の濃縮液を調製した。ア

10

20

30

40

50

ッセイで使用したDMSOの最終濃度は $\leq 1\%$ であった。

【0266】

液体培地で増殖した細菌の前培養物から接種物を得て、所望の光学密度(OD)まで希釈した。

【0267】

化合物を、液体培養アッセイでの細菌増殖を阻害する能力について評価した。化合物を、細菌懸濁液を含む培地に所望の濃度で加えた。24時間インキュベーションした後、化合物の効力を、細菌増殖の分光測光的測定によって求めた。化合物を含むウェルでの吸収値を、化合物を含まない対照ウェルでの吸収値と比較することで、阻害を求めた。

【0268】

この試験では、本発明による下記の化合物I. 01; I. 02; I. 03; I. 04; I. 05; I. 06; I. 07; I. 08; I. 09; I. 10; I. 11; I. 12; I. 13; I. 14; I. 15; I. 17; I. 18; I. 19; I. 20; I. 21; I. 22; I. 23; I. 24; I. 25; I. 26; I. 27; I. 28; I. 29; I. 30; I. 31; I. 32; I. 33; I. 34; I. 35; I. 36; I. 37; I. 38; I. 39; I. 40; I. 41; I. 42; I. 43; I. 44; I. 45; I. 46; I. 47; I. 48; I. 49; I. 50; I. 51; I. 52; I. 53; I. 54; I. 55; I. 56; I. 57; I. 58; I. 59; I. 60; I. 61は、20ppmの被験化合物濃度で直接の活性を全く示さなかった：

【0269】

実施例B：キサントモナス・カンペストリス p.v. カンペストリス (Xanthomonas campestris p.v. campestris) (キャベツでの黒斑病)でのイン・ビボ予防試験

被験化合物を、アセトン／ジメチルスルホキシド／tween (登録商標)の混合物中での均質化によって調製し、水で希釈して所望の濃度を得た。

【0270】

キャベツの若木を、上記のように調製した化合物を噴霧することで処理した。対照植物は、アセトン／ジメチルスルホキシド／tween (登録商標)の水溶液のみで処理した。

【0271】

72時間後、葉にキサントモナス・カンペストリス p.v. カンペストリス (Xanthomonas campestris p.v. campestris)の水系細菌懸濁液を噴霧することで、植物を汚染させた。汚染したキャベツ植物を、27℃及び95%相対湿度で8日間又は10日間インキュベートした。

【0272】

接種から8日後又は10日後に試験の評価を行った。0%は対照植物の効力に相当する効力を意味し、100%の効力は病害が全く認められなかったことを意味する。

【0273】

この試験では、本発明による次の化合物：I. 08; I. 11; I. 32; I. 34; I. 44; I. 45; I. 50; I. 59; I. 60; I. 68; I. 74; I. 79; I. 80; I. 81; I. 82; I. 90; I. 58は、31ppmの被験化合物濃度で70%～79%の効力を示した。

【0274】

この試験では、本発明による次の化合物：I. 02; I. 15; I. 16; I. 20; I. 25; I. 33; I. 36; I. 40; I. 42; I. 43; I. 52; I. 53; I. 57は、31ppmの被験化合物濃度で80%～89%の効力を示した。

【0275】

この試験では、本発明による次の化合物：I. 03; I. 04; I. 21; I. 31; I. 41; I. 55; I. 56は、31ppmの被験化合物濃度で90%～100%の効力を示した。

【0276】

10

20

30

40

50

実施例 C：比較例

化合物 CMP 3、CMP 4、CMP 5 及び CMP 6 を、実施例 B に記載のものと同じ条件で、キサントモナス・カンペストリス pv. カンペストリス (*Xanthomonas campestris* pv. *campestris*) (キャベツでの黒斑病) に対するイン・ビボ予防試験で試験した。

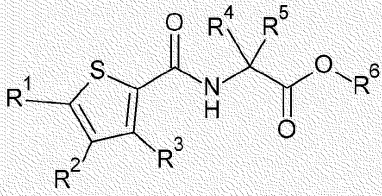
【0277】

化合物 CMP 3、CMP 4、CMP 5 及び CMP 6 は、US 5, 534, 541 の記述に従って製造した。

【0278】

結果は、下記の表に示した通りである。

【表 9】

							
実施例	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	効力 (%)
CMP3*	Br	Br	Br	イソプロピル	H	Et	33
I.04	Br	Br	Me	イソプロピル	H	Et	>90
CMP4	Br	Br	H	H	H	Et	0
I.02	Br	Br	Me	H	H	Et	>80
CMP5*	Br	Br	H	メチル	H	H	0
I.79	Br	Br	Me	メチル	H	H	>70
CMP6*	Br	Br	H	2-メチルプロピル	H	H	15
I.90	Br	Br	Me	2-メチルプロピル	H	H	>70

*S エナンチオマー

【0279】

実施例 D：シロイヌナズナ (*Arabidopsis thaliana*) での防御遺伝子の誘発

PR1 (病原性関連タンパク質 I) 遺伝子 (AT2G14610) のサリチル酸応答性プロモーター配列に連結された緑色蛍光タンパク質 (GFP) のコード配列を含むシロイヌナズナ (*Arabidopsis thaliana*) レポーター植物を 5 日間成長させ、化合物を噴霧した。噴霧後第 3 日に、Leica Microsystems (Wetzlar, ドイツ) からの MacroFluo 装置によって、植物蛍光を評価した。Meta-Morph Microscopy Automation & Image Analysis Software (Molecular Devices, Sunnyvale, Calif., United States) を用いて、蛍光を定量した。

【0280】

疑似処理葉でのバックグラウンド蛍光を 1.00 に設定した。サリチル酸処理 (300 ppm) によって、2.70 の相対蛍光値となり、それは試験システムの妥当性を証明する。

【0281】

この試験において、本発明による次の化合物：I. 01；I. 03；I. 04；I. 05；I. 06；I. 07；I. 08；I. 09；I. 11；I. 13；I. 16；I. 1

9 ; I . 2 0 ; I . 2 1 ; I . 2 3 ; I . 2 4 ; I . 2 6 ; I . 2 9 ; I . 3 0 ; I . 3 2 ; I . 3 3 ; I . 3 5 ; I . 3 6 ; I . 3 7 ; I . 3 9 ; I . 4 3 ; I . 4 6 ; I . 4 7 ; I . 4 8 ; I . 4 9 ; I . 5 0 ; I . 5 1 ; I . 5 2 ; I . 5 3 ; I . 5 4 ; I . 5 5 ; I . 5 7 ; I . 5 8 ; I . 5 9 ; I . 6 0 ; I . 6 1 ; I . 6 3 ; I . 6 4 ; I . 6 5 ; I . 6 6 ; I . 6 7 ; I . 6 8 ; I . 7 1 ; I . 7 2 ; I . 7 3 ; I . 7 5 ; I . 7 6 ; I . 7 7 ; I . 7 8 ; I . 7 9 ; I . 8 0 ; I . 8 1 ; I . 8 2 ; I . 8 3 ; I . 8 4 ; I . 8 5 ; I . 8 6 ; I . 8 7 ; I . 8 8 ; I . 8 9 ; I . 9 0 ; I . 9 1 は、3 0 0 p p m の化合物濃度で少なくとも 2 より高い相対蛍光値を示した。

【 0 2 8 2 】

この試験において、本発明による次の化合物：I . 0 2 ; I . 1 0 ; I . 1 8 ; I . 2 5 ; I . 2 7 ; I . 3 1 ; I . 3 4 ; I . 4 0 ; I . 4 1 ; I . 5 6 ; I . 6 9 ; I . 7 0 ; I . 1 5 ; I . 2 2 は、7 5 p p m の化合物濃度で少なくとも 2 より高い相対蛍光値を示した。

【 0 2 8 3 】

サリチル酸は、植物病原体に対する腫瘍な防御ホルモンである。上記の化合物は全て、サリチル酸経路を刺激することから、広い範囲の病原体に対して植物を保護でき得る。

10

20

30

40

50

フロントページの続き

(51)国際特許分類

A 0 1 N 43/20 (2006.01)
 A 0 1 N 55/10 (2006.01)
 C 0 7 F 7/12 (2006.01)
 A 0 1 N 43/16 (2006.01)
 C 0 7 D 409/12 (2006.01)
 C 0 7 D 333/40 (2006.01)

F I

A 0 1 N 43/20
 A 0 1 N 55/10 3 0 0
 C 0 7 F 7/12 T
 A 0 1 N 43/16 A
 C 0 7 D 409/12
 C 0 7 D 333/40

(74)代理人 100143823

弁理士 市川 英彦

(74)代理人 100183519

弁理士 櫻田 芳恵

(74)代理人 100196483

弁理士 川崎 洋祐

(74)代理人 100203035

弁理士 五味淵 琢也

(74)代理人 100160749

弁理士 飯野 陽一

(74)代理人 100160255

弁理士 市川 祐輔

(74)代理人 100202267

弁理士 森山 正浩

(74)代理人 100182132

弁理士 河野 隆

(74)代理人 100146318

弁理士 岩瀬 吉和

(74)代理人 100127812

弁理士 城山 康文

(72)発明者 ベルニエ, ダヴィド

フランス国、6 9 0 0 4・リヨン、ケ・ジョゼフ・ジレ・3 8

(72)発明者 ブリュネ, ステファン

フランス国、0 1 3 9 0・サン・タンドレ・ドゥ・コルシー、リュ・デ・ドンブ・4 4

(72)発明者 デュフル, ジェレミー

フランス国、6 9 0 0 3・リヨン、リュ・デュグ克蘭・2 8 9

(72)発明者 クノーブロッホ, トーマス

フランス国、6 9 3 8 0・シャルネ、シュマン・ヌフ・2 2 0

(72)発明者 ニコラス, リオネル

フランス国、6 9 0 0 9・リヨン、ケ・ピエール・シーズ・1 3・ティー

(72)発明者 土屋 知己

フランス国、6 9 4 5 0・リヨン、ロティスモン・ル・ミラボー・3

審査官 宮田 透

(56)参考文献 米国特許第0 5 5 3 4 5 4 1 (US, A)

国際公開第2 0 0 4/0 2 4 6 9 2 (WO, A 1)

特開平0 9-0 3 1 0 6 9 (JP, A)

特開2 0 0 9-0 7 8 9 9 1 (JP, A)

(58)調査した分野 (Int.Cl., DB名)

C 0 7 D、C 0 7 F、A 0 1 P、A 0 1 N

CAp l u s/REGISTRY (STN)