

(19) 日本国特許庁 (JP)

(12) 公開特許公報 (A)

(11) 特許出願公開番号

特開2016-128458

(P2016-128458A)

(43) 公開日 平成28年7月14日 (2016.7.14)

(51) Int.Cl.	F I	テーマコード (参考)
C O 7 D 417/04 (2006.01)	C O 7 D 417/04	
C O 7 D 417/14 (2006.01)	C O 7 D 417/14	C S P
A O 1 N 43/80 (2006.01)	A O 1 N 43/80	I O I
A O 1 P 3/00 (2006.01)	A O 1 P 3/00	

審査請求 有 請求項の数 6 O L (全 109 頁)

(21) 出願番号	特願2016-5589 (P2016-5589)	(71) 出願人	512137348
(22) 出願日	平成28年1月14日 (2016.1.14)		バイエル・インテレクチュアル・プロパティ・ゲゼルシャフト・ミット・ベシュレンクテル・ハフツング
(62) 分割の表示	特願2013-535394 (P2013-535394) の分割		Bayer Intellectual Property GmbH
原出願日	平成23年10月25日 (2011.10.25)		ドイツ40789モンハイム・アム・ライン、アルフレート・ノーベル・シュトラッセ10番
(31) 優先権主張番号	61/407,200	(74) 代理人	100114188
(32) 優先日	平成22年10月27日 (2010.10.27)		弁理士 小野 誠
(33) 優先権主張国	米国 (US)	(74) 代理人	100119253
(31) 優先権主張番号	10189067.1		弁理士 金山 賢教
(32) 優先日	平成22年10月27日 (2010.10.27)	(74) 代理人	100124855
(33) 優先権主張国	欧州特許庁 (EP)		弁理士 坪倉 道明

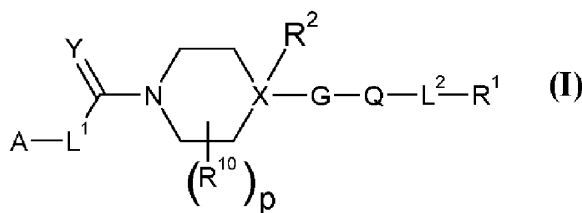
最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 殺菌剤としてのヘテロアリアルピペリジンおよびヘテロアリアルピペラジン誘導体

(57) 【要約】 (修正有)

【課題】 植物病原性有害真菌を防除するための化合物、及び方法の提供。

【解決手段】 式 (I) のヘテロアリアルピペリジン及びヘテロアリアルピペラジン誘導体、該化合物の塩、金属錯体及びN-オキサイド、並びに該化合物の製造方法。更に植物病原性真菌を防除するための該化合物に増量剤、及び／又は界面活性剤と混和した組成物並びにその組成物を植物病原性有害真菌を防除するための使用。



(Aは置換／非置換のフェニル又はヘテロアリアル等；YはO又はS；XはC又はN；R²はH、アルキル、アルケニル、シアノ等；R¹⁰はオキソ、アルキル、ヒドロキシル等；Gは5員のヘテロアリアル；Qは飽和、部分不飽和或いは完全不飽和の5員複素環；R¹は置換／非置換のベンゾ縮合していても良い5員又は6員のヘテロアリアル)

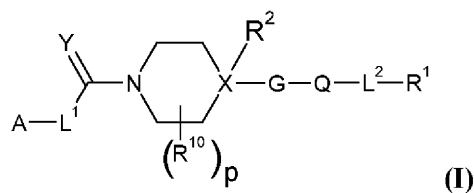
【選択図】 なし

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

下記式（I）の化合物ならびに当該式（I）の化合物の塩、金属錯体およびN-オキサイド。

【化 1】



10

[式中、

記号はそれぞれ、下記のように定義され、

Aは、5個以下の置換基を含むことができるフェニルであり、当該置換基はそれぞれ独立にZ^{A-1}から選択され、

または

Aは、4個以下の置換基を含むことができるベンゾ縮合していても良い置換されていない置換されている5員もしくは6員のヘテロアリールであり、前記炭素上の置換基はそれぞれ独立にZ^{A-2}から選択され、前記窒素上の置換基はそれぞれ独立にZ^{A-3}から選択され、

20

Z^{A-1}は同一であるか異なっており、それぞれ独立に水素、ハロゲン、ヒドロキシル、チオキシル、ニトロ、シアノ、-C(=O)H、-C(=O)OH、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルキニル、シクロアルキル、シクロアルケニル、ハロシクロアルキル、ハロシクロアルケニル、ヒドロキシアルキル、シアノアルキル、ホルミルアルキル、アルコキシアルキル、ハロアルコキシアルキル、シクロアルコキシアルキル、アルキニルオキシアルキル、アルキルチオアルキル、アルキルスルフィニルアルキル、アルキルアミノアルキル、ハロアルキルアミノアルキル、シクロアルキルアミノアルキル、ジアルキルアミノアルキル、アルキルカルボニルアルキル、アルキルスルホニルアルキル、アルキルシクロアルキル、アルキルシクロアルケニル、アルコキシ、アルキルシクロアルキルアルキル、ハロシクロアルコキシ、アルキルチオ、ハロアルキルチオ、シクロアルキルチオ、アルキニルチオ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、ハロアルコキシ、ハロアルケニルオキシ、ハロアルキニルオキシ、シクロアルコキシ、アルコキシアルコキシ、シクロアルキルアルコキシ、アルキルカルボニルオキシ、ハロアルキルカルボニルオキシ、シクロアルキルカルボニルオキシ、シクロアルキルアミノ、アルキルカルボニルアミノ、シクロアルキルカルボニルアミノ、アルコキシカルボニルアミノ、アルキルスルホニルアミノ、ハロアルキルスルホニルアミノ、フェニルスルホニルアミノ、シクロアルキルアルキル、ハロシクロアルキルアルキル、シクロアルキルシクロアルキル、アルコキシアルコキシアルキル、アルキルアミノカルボニルオキシ、アルキルカルボニルアルコキシ、シクロアルキルアミノカルボニル、シクロアルキルアルコキシカルボニル、アルキルスルフィニル、ハロアルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、ハロアルキルスルホニル、シクロアルキルスルホニル、アルキルカルボニル、ハロアルキルカルボニル、シクロアルキルカルボニル、アルコキシカルボニル、シクロアルコキシカルボニル、トリアルキルシリル、-SF₅、フェニル、-C(=O)NR³R⁴または-NR³R⁴であり、

30

40

Z^{A-2}およびR^{G-1}は同一であるか異なっており、それぞれ独立に水素、ハロゲン、ヒドロキシル、チオキシル、ニトロ、シアノ、-C(=O)H、-C(=O)OH、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルキニル、シクロアルキル、ハロシクロアルキル、ヒドロキシアルキル、ホルミルアルキル、アルコキシアルキル、アルキルカルボニルアルキル、アルキルシクロアルキル、アルコキシ、アルキルシクロアルキルアルキル、アルキルチオ、ハロアルキルチオ、アルキニルチオ、アルケ

50

ニルオキシ、アルキニルオキシ、ハロアルコキシ、アルコキシアルコキシ、アルキルカルボニルオキシ、ハロアルキルカルボニルオキシ、シクロアルキルカルボニルアミノ、アルキルスルホニルアミノ、ハロアルキルスルホニルアミノ、フェニルスルホニルアミノ、シクロアルキルアルキル、ハロシクロアルキルアルキル、シクロアルキルシクロアルキル、アルコキシカルボニルオキシ、アルキルカルボニルチオ、アルキルスルフィニル、ハロアルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、ハロアルキルスルホニル、アルキルカルボニル、ハロアルキルカルボニル、アルコキシカルボニル、アルキルアミノカルボニルオキシ、 $-C(=O)NR^3R^4$ または $-NR^3R^4$ であり、

Z^{A-3} 、 R^{G2} および Z^2 は同一であるか異なっており、それぞれ独立に水素、 $-C(=O)H$ 、 $-C(=O)NR^3R^4$ 、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルキニル、シクロアルキル、ハロシクロアルキル、アルキルシクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アルコキシアルキル、アルキルスルホニル、ハロアルキルスルホニル、シクロアルキルスルホニル、フェニルスルホニル、アルキルカルボニル、ハロアルキルカルボニル、アルコキシカルボニル、ハロアルコキシカルボニル、シクロアルコキシカルボニル、フェニルまたはベンジルであり、

R^3 および R^4 は同一であるか異なっており、それぞれ独立に水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、シクロアルキル、ベンジルまたはフェニルであり、

L^1 は、 NR^{L12} または $C(R^{L11})_2$ であり、

R^{L11} は同一であるか異なっており、独立に水素、ハロゲン、ヒドロキシル、シアノ、 $-C(=O)H$ 、 $-C(=O)OH$ 、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルキニル、アルコキシアルキル、アルキルチオアルキル、アルキルアミノアルキル、ジアルキルアミノアルキル、アルコキシ、アルキルチオ、ハロアルキルチオ、ハロアルコキシ、アルキルカルボニルオキシ、アルキルカルボニルアミノ、アルキルカルボニルチオ、アルキルスルホニル、ハロアルキルスルホニル、アルキルカルボニル、ハロアルキルカルボニル、アルコキシカルボニル、トリアルキルシリルオキシ、 $-NR^3R^4$ または $-C(=O)NR^3R^4$ であり、

または前記 2 個の R^{L11} 基が、それらが結合している炭素原子と一体となって、シクロプロピル環を形成しており、または

前記 2 個の R^{L11} 基が $=CH_2$ 、 $=COR^3$ 、 $=NOR^3$ または $=CHN(R^7)_2$ であり、

R^{L12} は、水素、 $-C(=O)H$ 、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルキニル、シクロアルキル、ハロシクロアルキル、アルキルシクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルキルアミノカルボニル、ハロアルキルアミノカルボニル、アルキルスルホニル、ハロアルキルスルホニル、シクロアルキルスルホニル、アルキルカルボニル、ハロアルキルカルボニル、アルコキシカルボニル、ハロアルコキシカルボニル、シクロアルコキシカルボニル、アルキルアミノカルボニル、ジアルキルアミノカルボニル、フェニルまたはベンジルであり、

R^7 は、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、シクロアルキル、ベンジルまたはフェニルであり、

Y は硫黄または酸素であり、

X は炭素または窒素であり、

R^2 は水素、アルキル、アルケニル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロゲン、シアノまたはヒドロキシルであり、

R^{10} はオキシ、アルキル、アルケニル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロゲン、シアノまたはヒドロキシルであり、

p は 0、1 または 2 であり、

G は、Q によって置換されていてそれ以外に置換されていないか置換されていて良い 5 員ヘテロアリールであり、前記炭素上の置換基はそれぞれ独立に R^{G1} から選択され、前記窒素上の置換基はそれぞれ独立に R^{G2} から選択され、

Q は、 L^2-R^1 によって置換されていてそれ以外に置換されていないか置換されてい

10

20

30

40

50

ても良い飽和しているか部分不飽和もしくは完全不飽和である5員複素環であり、前記置換基は、それぞれ独立に R^5 から選択され、

R^5 は同一であるか異なっており、独立に、

Qの前記5員複素環の炭素に結合している場合は、

水素、オキソ、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、ニトロ、 $-CHO$ 、 $-C(=O)$ OH、 $-C(=O)NH_2$ 、 $-C(=O)NR^3R^4$ 、 $-NR^3R^4$ 、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルキニル、シクロアルキル、ハロシクロアルキル、アルキルシクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルキルシクロアルキル、ハロシクロアルキルアルキル、アルキルシクロアルキルアルキル、シクロアルケニル、ハロシクロアルケニル、アルコキシアルキル、ハロアルコキシアルキル、シクロアルコキシアルキル、アルコキシアルコキシアルキル、アルキルチオアルキル、ホルミルアルキル、アルキルカルボニルアルキル、アルキルスルフィニルアルキル、アルキルスルホニルアルキル、アルキルアミノアルキル、ジアルキルアミノアルキル、ハロアルキルアミノアルキル、シクロアルキルアミノアルキル、アルキルカルボニル、ハロアルキルカルボニル、シクロアルキルカルボニル、アルコキシカルボニル、シクロアルコキシカルボニル、シクロアルキルアルコキシカルボニル、シクロアルキルアミノカルボニル、ヒドロキシアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、シクロアルコキシ、ハロシクロアルコキシ、シクロアルキルアルコキシ、アルケニルオキシ、ハロアルケニルオキシ、アルキニルオキシ、ハロアルキニルオキシ、アルコキシアルコキシ、アルキルカルボニルオキシ、ハロアルキルカルボニルオキシ、シクロアルキルカルボニルオキシ、アルキルカルボニルアルコキシ、アルキルチオ、ハロアルキルチオ、シクロアルキルチオ、アルキルスルフィニル、ハロアルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、ハロアルキルスルホニル、シクロアルキルスルホニル、トリアルキルシリル、アルキルスルホニルアミノ、ハロアルキルスルホニルアミノであり、

Qの前記5員複素環の窒素に結合している場合は、

水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルキニル、シクロアルキル、ハロシクロアルキル、アルキルシクロアルキル、シクロアルキルアルキル、フェニル、ベンジル、アルキルスルホニル、 $-C(=O)H$ 、アルコキシカルボニルまたはアルキルカルボニルであり、

L^2 は、直接結合、O、 $C(=O)$ 、 $S(O)_m$ 、 CHR^{20} または NR^{21} であり、
mは0、1または2であり、

R^{20} は、水素、アルキルまたはハロアルキルであり、

R^{21} は、水素、アルキル、ハロアルキル、シクロアルキル、アルキルカルボニル、ハロアルキルカルボニル、アルコキシカルボニルまたはハロアルコキシカルボニルであり、

R^1 は、 Z^4 置換基によって1回置換されており、さらに別の置換を有していても良いフェニルであり、それらの別の置換基はそれぞれ独立に Z^4 および Z^1 から選択され、

または

R^1 は、 Z^5 置換基によって1回置換されており、さらに別の置換を有していても良いナフチル、ジヒドロナフタレニル、テトラヒドロナフタレニル、ヘキサヒドロナフタレニル、オクタヒドロナフタレニルもしくはインデニルであり、それらの別の置換基はそれぞれ独立に Z^5 および Z^1 から選択され、

または

R^1 は、置換基によって、炭素上で Z^6 によってまたは窒素上で Z^7 によって1回置換されており、さらに別の置換を有していても良いベンゾ縮合していても良い置換された5員もしくは6員のヘテロアリールであり、炭素上の前記別の置換基はそれぞれ独立に Z^1 および Z^6 から選択され、窒素上の前記別の置換基はそれぞれ独立に Z^2 および Z^7 から選択され、

Z^1 は、水素、ハロゲン、ヒドロキシル、ニトロ、シアノ、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルキニル、シクロアルキル、ハロシクロアルキル、アルコキシ、アルコキシアルキル、ヒドロキシアルキル、ハロアルコキシ、

アルキルカルボニル、アルコキシカルボニル、アルキルシクロアルキル、シクロアルコキシアルキル、シクロアルキルアミノ、アルキルチオ、ハロアルキルチオ、シクロアルキルチオ、シクロアルキルアルキル、アルキルカルボニルオキシ、アルキルカルボニルアミノ、ハロアルキルカルボニルアミノ、アルキルカルボニルチオ、アルキルスルフィニル、ハロアルキルスルフィニル、アルキルスルホニルオキシ、ハロアルキルスルホニルオキシ、アルキルシクロアルキルアルキル、 $-C(=O)NR^3R^4$ 、 $-NR^3R^4$ 、または $-L^3Z^3$ であり、

L^3 は、直接結合、 $-CH_2-$ 、 $-C(=O)-$ 、硫黄、酸素、 $-C(=O)O-$ 、 $-C(=O)NH-$ 、 $-OC(=O)-$ または $-NHC(=O)-$ であり、

Z^3 は、フェニル基、ナフタレニル基または5員もしくは6員のヘテロアリール基であり、それらはそれぞれ0、1、2もしくは3個の置換基を含んでいても良く、前記置換基はそれぞれ独立に下記のリスト：

炭素上の置換基：ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、アミノ、 $-SH$ 、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルキニル、シクロアルキル、ハロシクロアルキル、アルコキシアルキル、アルキルカルボニル、ハロアルキルカルボニル、アルコキシカルボニル、アルコキシ、ハロアルコキシ、シクロアルコキシ、ハロシクロアルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アルコキシアルコキシ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アルキルチオ、ハロアルキルチオ、アルキルスルフィニル、ハロアルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、ハロアルキルスルホニル、トリシリルアルキルまたはフェニル、

窒素上の置換基：水素、 $-C(=O)H$ 、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルキニル、シクロアルキル、ハロシクロアルキル、アルキルシクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アルコキシアルキル、アルキルスルホニル、ハロアルキルスルホニル、シクロアルキルスルホニル、フェニルスルホニル、アルキルカルボニル、ハロアルキルカルボニル、アルコキシカルボニル、ハロアルコキシカルボニル、シクロアルコキシカルボニル、 $-C(=O)NR^3R^4$ 、フェニルまたはベンジル

から選択され、

Z^4 は、 SH 、 $C(=O)H$ 、 C_7-C_8 -シクロアルキル、 C_7-C_8 -ハロシクロアルキル、シクロアルキルシクロアルキル、ハロシクロアルキルアルキル、シクロアルケニル、ハロシクロアルケニル、 C_4-C_6 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキル、 C_3 -アルコキシ- C_2-C_4 -アルキル、アルコキシアルコキシアルキル、アルキルチオアルキル、アルキルスルフィニルアルキル、アルキルスルホニルアルキル、アルキルアミノアルキル、ジアルキルアミノアルキル、ハロアルキルアミノアルキル、シクロアルキルアミノアルキル、 C_4-C_6 -アルキルカルボニル、ハロアルキルカルボニル、シクロアルキルカルボニル、シクロアルコキシカルボニル、シクロアルキルアルコキシカルボニル、シクロアルキルアミノカルボニル、ハロアルコキシアルキル、 C_5-C_6 -ヒドロキシアルキル、 C_5-C_6 -アルコキシ、 C_5-C_6 -ハロアルコキシ、シクロアルコキシ、ハロシクロアルコキシ、シクロアルキルアルコキシ、アルケニルオキシ、ハロアルケニルオキシ、アルキニルオキシ、ハロアルキニルオキシ、アルコキシアルコキシ、シアノアルコキシ、ハロアルキルカルボニルオキシ、シクロアルキルカルボニルオキシ、アルキルカルボニルアルコキシ、 C_5-C_6 -アルキルチオ、 C_5-C_6 -ハロアルキルチオ、 C_5-C_6 -アルキルスルフィニル、 C_5-C_6 -ハロアルキルスルフィニル、 C_5-C_6 -アルキルスルホニル、 C_5-C_6 -ハロアルキルスルホニル、シクロアルキルスルホニル、トリ(C_3-C_4 -アルキル)シリル、アルキルスルホニルアミノまたはハロアルキルスルホニルアミノであり、

Z^5 は、トリ(C_2-C_4 -アルキル)シリル、ベンジル、フェニル、 SH 、 C_5-C_6 -アルコキシ、 C_5-C_6 -ハロアルコキシ、 C_2-C_6 -アルケニルオキシ、 C_2-C_6 -アルキニルオキシ、 C_5-C_6 -アルキルチオまたは C_5-C_6 -ハロアルキルチオであり、

10

20

30

40

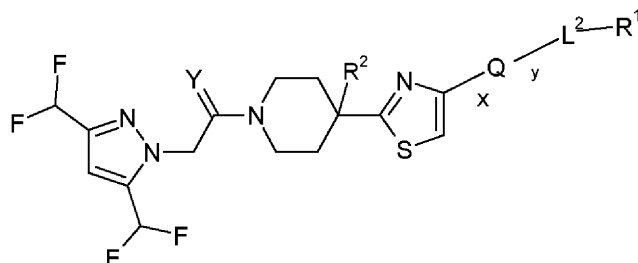
50

Z⁶ は、SH、シクロアルキルシクロアルキルまたはトリ (C₃ - C₄ - アルキル) シリルであり、

Z⁷ は、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルキニル、シクロアルキル、ハロシクロアルキル、アルキルシクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルキルシクロアルキル、アルキルスルホニル、C(=O)H、ベンジルまたはフェニルであり、

ただし、下記の化合物は除外される。

【化 2】



10

式中、記号はそれぞれ下記のように定義され、

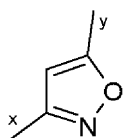
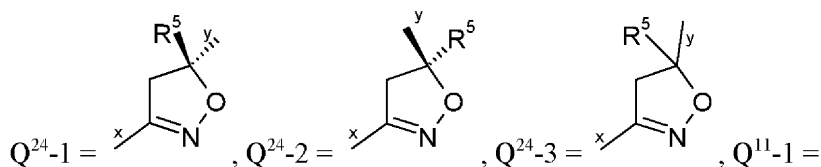
Y は酸素または硫黄であり、

R² は水素またはハロゲンであり、

Q は、

20

【化 3】



30

であり、

R⁵ は水素、シアノ、C₁ - C₃ - アルキルまたは C₁ - C₃ - ハロアルキルであり、

L² は直接結合であり、

R¹ は上記で定義の通りであり、R¹ が置換されたフェニル、ナフチル、ジヒドロナフタレニル、テトラヒドロナフタレニル、ヘキサヒドロナフタレニル、オクタヒドロナフタレニルもしくはインデニルまたはベンゾ縮合していても良い 5 員もしくは 6 員のヘテロアリアルである場合、言及される炭素環もしくは複素環上には 2 個以下の置換基が存在する。]

【請求項 2】

40

基の定義がそれぞれ下記の通りであり、

A が、2 個以下の置換基を含むことができるフェニルであり、前記置換基はそれぞれ独立に下記のリスト：

ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、-NR³R⁴、-C(=O)NR³R⁴、ニトロ、C₁ - C₆ - 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、C₁ - C₆ - ハロアルキル、C₂ - C₆ - ハロアルケニル、C₂ - C₆ - ハロアルキニル、C₃ - C₆ - ハロシクロアルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ、C₁ - C₄ - ハロアルコキシ、C₁ - C₄ - アルケニルオキシ、C₁ - C₄ - アルキニルオキシ、C₁ - C₄ - アルキルチオ、C₁ - C₄ - アルキルスルホニル、C₁ - C₄ - ハロアルキルチオ、C₁ - C₄ - ハロアルキルスルホニル、C₁ - C₄ - アルコキシ - C₁ - C

50

C_6 -アルキル、ヒドロキシ- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_6 -アルキルカルボニル、 C_1-C_6 -アルコキシカルボニル、 C_1-C_6 -アルキルカルボニルオキシまたは-C(=O)Hから選択されるか、

Aが、下記の基：フラン-2-イル、フラン-3-イル、チオフェン-2-イル、チオフェン-3-イル、イソオキサゾール-3-イル、イソオキサゾール-4-イル、イソオキサゾール-5-イル、ピロール-1-イル、ピロール-2-イル、ピロール-3-イル、オキサゾール-2-イル、オキサゾール-4-イル、オキサゾール-5-イル、チアゾール-2-イル、チアゾール-4-イル、チアゾール-5-イル、イソチアゾール-3-イル、イソチアゾール-4-イル、イソチアゾール-5-イル、ピラゾール-1-イル、ピラゾール-3-イル、ピラゾール-4-イル、イミダゾール-1-イル、イミダゾール-2-イル、イミダゾール-4-イル、1, 2, 3-トリアゾール-1-イル、1, 2, 4-トリアゾール-1-イル、ピリジン-2-イル、ピリジン-3-イル、ピリジン-4-イル、ピリダジン-3-イル、ピリダジン-4-イル、ピラジン-2-イル、ピラジン-3-イル、ピリミジン-2-イル、ピリミジン-4-イルまたはピリミジン-5-イルから選択されるヘテロ芳香族基であり、2個以下の置換基を含むことができ、前記置換基はそれぞれ独立に下記のリスト：

炭素上の置換基：

ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、ニトロ、-NR³R⁴、 C_1-C_6 -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_6 -シクロアルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_2-C_6 -ハロアルケニル、 C_2-C_6 -ハロアルキニル、 C_3-C_6 -ハロシクロアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ、 C_1-C_4 -アルキルチオ、 C_1-C_4 -アルキルスルホニル、 C_1-C_4 -ハロアルキルチオ、 C_1-C_4 -ハロアルキルスルホニル、 C_1-C_4 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキル、ヒドロキシ- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_6 -アルキルカルボニル、 C_1-C_6 -アルコキシカルボニル、 C_1-C_6 -アルキルカルボニルオキシまたはフェニル、

窒素上の置換基：

C_1-C_6 -アルキル、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -アルキニル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_2-C_6 -ハロアルケニル、 C_2-C_6 -ハロアルキニル、 C_3-C_{10} -シクロアルキル- C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキルカルボニル、フェニル、ベンジル、 C_1-C_4 -アルキルスルホニル、 C_1-C_4 -ハロアルキルスルホニル、フェニルスルホニル、-C(=O)H、または C_1-C_6 -アルキルカルボニル

から選択され；

L¹がCHR^{L11}またはNR^{L12}であり、

R^{L11}が水素、メチル、エチルまたはシクロプロピルであり、

R^{L12}が水素、 C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -ハロアルキル、 C_3-C_8 -シクロアルキル、 C_1-C_4 -アルキルスルホニル、 C_1-C_4 -アルコキシカルボニルであり、

Yが酸素であり、

Xが炭素であり、

R²が水素、フッ素、塩素、臭素またはヒドロキシルであり、

R¹⁰がオキシ、 C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルケニル、 C_1-C_4 -ハロアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、ハロゲン、シアノまたはヒドロキシルであり、

pが0または1であり、

Gが

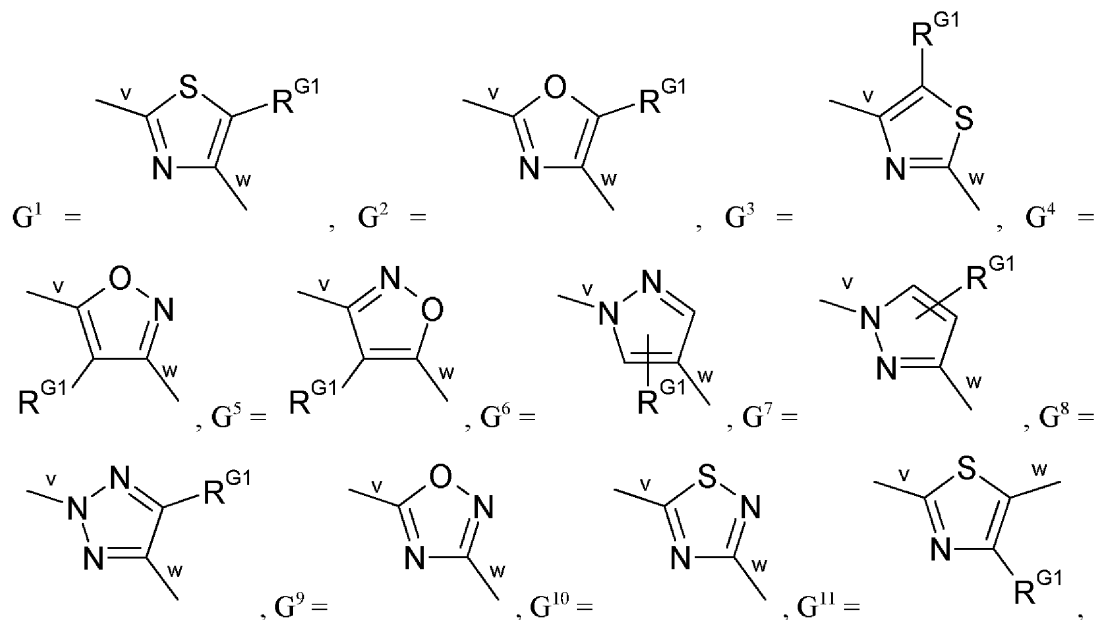
10

20

30

40

【化 4】



10

であり、

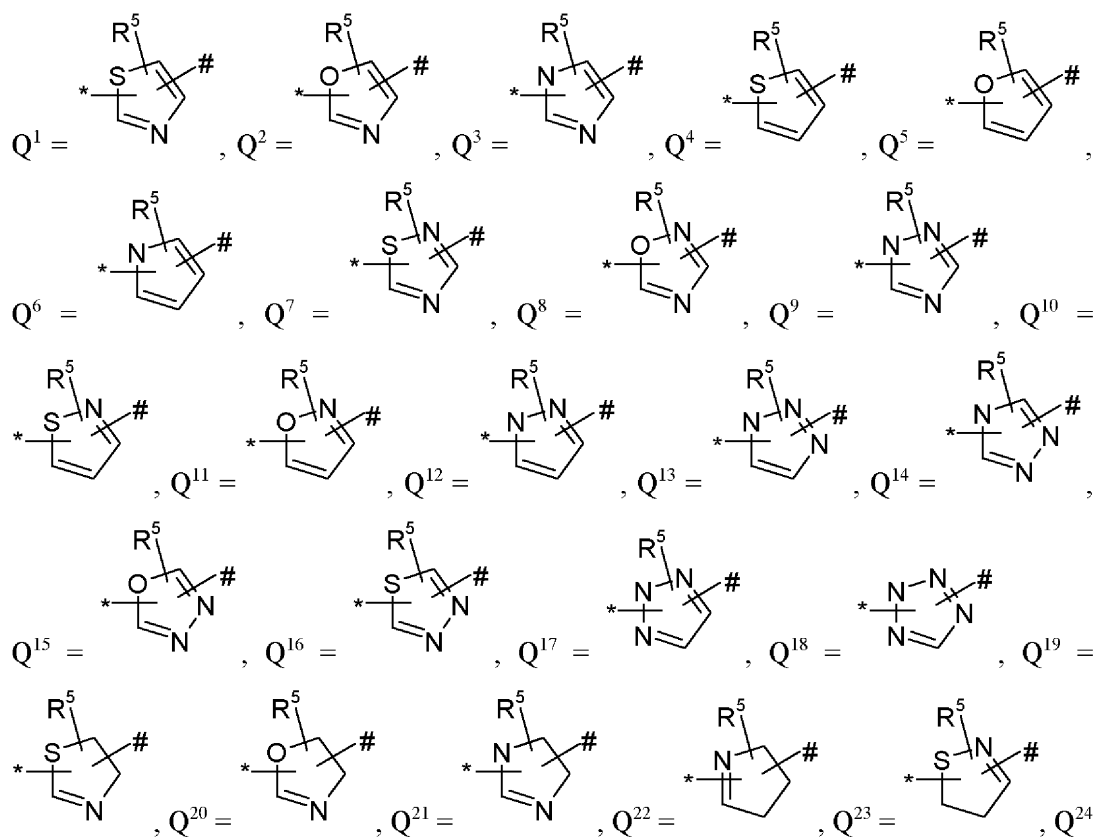
「v」によって識別される結合がXに直接結合しており、「w」によって識別される結合がQに直接結合しており、

20

R^{G1} が水素またはハロゲンであり、

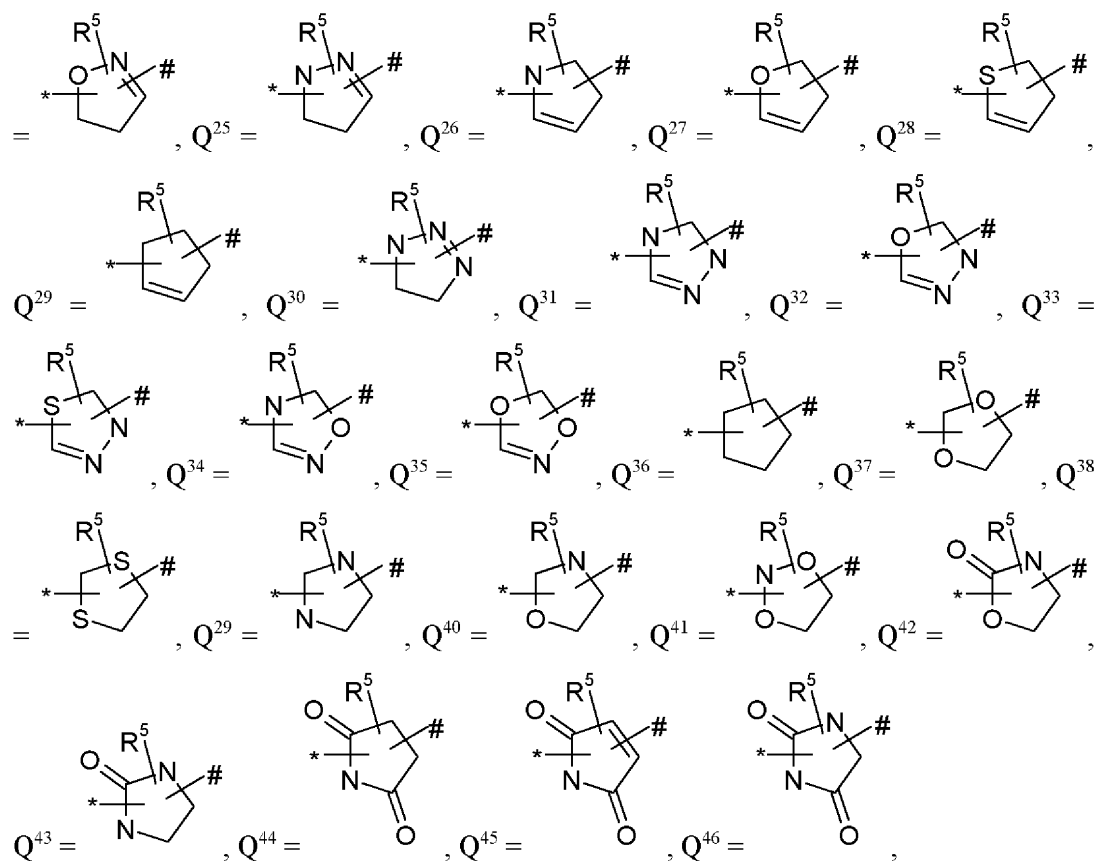
Qが、

【化 5】



30

40



10

20

であり、

「*」によって識別される結合がGに直接結合しており、「#」によって識別される結合がL²に直接結合しており、

または

「*」によって識別される結合がL²に直接結合しており、「#」によって識別される結合がGに直接結合しており、

R⁵が同一であるか異なっており、独立に、

Qの5員複素環の炭素に結合している場合は

水素、シアノ、-NR³R⁴、C₁-C₆-アルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-アルキニル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₂-C₆-ハロアルケニル、C₂-C₆-ハロアルキニル、C₃-C₈-シクロアルキル、C₃-C₈-ハロシクロアルキル、C₃-C₈-ハロシクロアルキル、C₁-C₄-アルキル-C₃-C₈-シクロアルキル、C₃-C₈-シクロアルキル-C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-アルコキシ-C₁-C₄-アルキル、C₃-C₈-シクロアルコキシ-C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-アルコキシ-C₁-C₄-アルコキシ-C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-アルキルチオ-C₁-C₄-アルキル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルコキシ、C₃-C₈-シクロアルコキシ、C₃-C₈-ハロシクロアルコキシ、C₃-C₈-シクロアルキル-C₁-C₄-アルコキシ、C₂-C₆-アルケニルオキシ、C₂-C₆-ハロアルケニルオキシ、C₂-C₆-アルキニルオキシ、C₂-C₆-ハロアルキニルオキシ、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₄-アルコキシ、C₁-C₆-アルキルカルボニルオキシ、C₁-C₆-ハロアルキルカルボニルオキシ、C₃-C₈-シクロアルキルカルボニルオキシ、C₁-C₆-アルキルカルボニル-C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-アルキルチオ、C₁-C₆-ハロアルキルチオ、C₃-C₈-シクロアルキルチオであり、

30

40

Qの5員複素環の窒素に結合している場合、

水素、-C(=O)H、C₁-C₃-アルキル、C₁-C₆-アルキルカルボニル、C₁-C₆-アルコキシカルボニルまたはベンジルであり、

50

L^2 が直接結合、 $-C(=O)-$ 、 $-CHR^{20}-$ または $-NR^{21}-$ であり、

R^{20} が水素、メチル、エチル、トリフルオロメチルであり、

R^{21} が水素またはメチルであり、

R^1 が、 Z^4 置換基によって 1 回置換されており、さらに別の置換を有していても良いフェニルであり、当該さらなる置換基はそれぞれ独立に Z^4 および Z^{1-1} から選択され、または

R^1 が、ナフタレン-1-イル、ナフタレン-2-イル、1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン-1-イル、1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン-2-イル、5, 6, 7, 8-テトラヒドロナフタレン-1-イル、5, 6, 7, 8-テトラヒドロナフタレン-2-イル、デカリン-1-イル、デカリン-2-イル、1H-インデン-1-イル、2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル、1H-インデン-2-イル、1H-インデン-3-イル、1H-インデン-4-イル、1H-インデン-5-イル、1H-インデン-6-イル、1H-インデン-7-イル、インダン-1-イル、インダン-2-イル、インダン-3-イル、インダン-4-イルまたはインダン-5-イルであり、

これらのそれぞれは、 Z^5 置換基によって 1 回置換されており、さらに別の置換を有していても良く、当該別の置換基はそれぞれ独立に Z^5 および Z^{1-2} から選択され、または

R^1 が、炭素上で Z^6 置換基によってまたは窒素上で Z^7 置換基によって 1 回置換されており、さらに別の置換を有していても良い 5 員もしくは 6 員のヘテロアリール基であり、炭素上の別の置換基はそれぞれ独立に Z^{1-3} および Z^6 から選択され、窒素上の別の置換基は独立に Z^2 から選択され、または

R^1 が、1 個の Z^4 置換基によって置換されており、さらに別の置換を有していても良いベンゾ縮合した置換された 5 員もしくは 6 員のヘテロアリールであり、炭素上の別の置換基はそれぞれ独立に Z^{1-2} から選択され、窒素上の別の置換基はそれぞれ独立に Z^2 から選択され、

Z^{1-1} が、水素、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、ニトロ、 $-C(=O)NR^3R^4$ 、 $-NR^3R^4$ 、 C_1-C_6 -アルキル、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -アルキニル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_2-C_6 -ハロアルケニル、 C_2-C_6 -ハロアルキニル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_3-C_8 -ハロシクロアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ- C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルコキシカルボニル、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ、 C_1-C_6 -アルキルカルボニルオキシ、 C_1-C_4 -アルキルチオ、 C_1-C_4 -ハロアルキルチオ、 C_3-C_6 -シクロアルキルチオまたは $-L^3Z^3$ であり、

Z^{1-2} が同一であるか異なっており、それぞれ独立に水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $-NR^3R^4$ 、 $-C(=O)NR^3R^4$ 、 C_1-C_6 -アルキル、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -アルキニル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_2-C_6 -ハロアルケニル、 C_2-C_6 -ハロアルキニル、 C_1-C_4 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_6 -アルコキシカルボニル、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ、 C_1-C_6 -アルキルカルボニルオキシ、 C_1-C_6 -アルキルカルボニルチオ、 C_1-C_4 -アルキルチオまたは C_1-C_4 -ハロアルキルチオであり、

Z^{1-3} が、水素、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、ニトロ、 $-C(=O)NR^3R^4$ 、 $-NR^3R^4$ 、 C_1-C_6 -アルキル、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -アルキニル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_2-C_6 -ハロアルケニル、 C_2-C_6 -ハロアルキニル、 C_3-C_8 -シクロアルキル、 C_3-C_8 -ハロシクロアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ- C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルキルカルボニル、 C_1-C_6 -アルコキシカルボニル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ、 C_1-C_6 -アルキルカルボニルオキシ、 C_1-C_6 -アルキルチオ、 C_1-C_6 -ハロアルキルチオまたは C_3-C_6 -シクロアルキルチオであり、

Z^2 が同一であるか異なっており、独立に水素、 C_1-C_6 -アルキル、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -アルキニル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_2-C_6 -ハロア

10

20

30

40

50

ルケニル、 C_2-C_6 -ハロアルキニル、 C_1-C_4 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキル、フェニル、ベンジル、 C_1-C_4 -ハロアルキルスルホニル、 C_1-C_6 -アルコキシカルボニル、 C_1-C_6 -ハロアルコキシカルボニル、フェニルスルホニル、 C_1-C_4 -アルキルスルホニル、 $-C(=O)H$ 、 C_1-C_3 -ハロアルキルカルボニルまたは C_1-C_3 -アルキルカルボニルであり、

L^3 が、直接結合、 $-CH_2-$ 、硫黄、酸素であり、

Z^3 が、2個以下の置換基を含んでも良いフェニル基、ナフタレニルまたは5員もしくは6員のヘテロアリール基であり、前記置換基はそれぞれ独立に下記のリスト：

炭素上の置換基：ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、アミノ、 $-SH$ 、 C_1-C_4 -アルキル、 C_2-C_4 -アルケニル、 C_2-C_4 -アルキニル、 C_1-C_4 -ハロアルキル、 C_2-C_4 -ハロアルケニル、 C_2-C_4 -ハロアルキニル、 C_2-C_4 -アルコキシアルキル、 C_1-C_6 -アルキルカルボニル、 C_1-C_6 -ハロアルキルカルボニル、 C_1-C_6 -アルコキシカルボニル、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ、 C_2-C_6 -アルケニルオキシ、 C_2-C_6 -アルキニルオキシ、 C_1-C_4 -アルキルチオ、 C_1-C_4 -ハロアルキルチオ、 C_1-C_4 -アルキルスルホニル、 C_1-C_4 -ハロアルキルスルホニルまたは C_1-C_4 -アルキルアミノ、ジ(C_1-C_4 -アルキル)アミノ、

窒素上の置換基： C_1-C_6 -アルキル、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -アルキニル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_2-C_6 -ハロアルケニル、 C_2-C_6 -ハロアルキニル、 C_1-C_4 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキル、フェニル、ベンジル、 C_1-C_4 -ハロアルキルスルホニル、 C_1-C_6 -アルコキシカルボニル、 C_1-C_6 -ハロアルコキシカルボニル、フェニルスルホニル、 C_1-C_4 -アルキルスルホニル、 $-C(=O)H$ 、または C_1-C_3 -アルキルカルボニルから選択され、

Z^4 が、 $C(=O)H$ 、 C_7-C_8 -シクロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルケニル、 C_4-C_6 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキル、 C_4-C_6 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキル、 C_3 -アルコキシ- C_2-C_4 -アルキル、 C_1-C_3 -アルコキシ- C_2-C_3 -アルコキシ- C_1-C_3 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキルチオ- C_1-C_2 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキルスルフィニル- C_1-C_2 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキルスルホニル- C_1-C_2 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキルアミノ- C_1-C_2 -アルキル、 C_1-C_2 -ジアルキルアミノ- C_1-C_2 -アルキル、 C_1-C_4 -ハロアルキルアミノ- C_1-C_2 -アルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキルアミノ- C_1-C_2 -アルキル、 C_4-C_6 -アルキルカルボニル、 C_1-C_4 -ハロアルキルカルボニル、 C_3-C_6 -シクロアルキルカルボニル、 C_3-C_6 -シクロアルコキシカルボニル、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_2 -アルコキシカルボニル、 C_3-C_6 -シクロアルキルアミノカルボニル、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ- C_1-C_2 -アルキル、 C_5-C_6 -ヒドロキシアルキル、 C_5-C_6 -アルコキシ、 C_5-C_6 -ハロアルコキシ、 C_3-C_6 -シクロアルコキシ、 C_3-C_6 -ハロシクロアルコキシ、 C_3-C_6 -シクロアルキルアルコキシ、 C_2-C_6 -アルケニルオキシ、 C_2-C_6 -ハロアルケニルオキシ、 C_2-C_6 -アルキニルオキシ、 C_2-C_6 -ハロアルキニルオキシ、 C_1-C_4 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルコキシ、シアノ- C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -ハロアルキルカルボニルオキシ、 C_3-C_6 -シクロアルキルカルボニルオキシ、 C_1-C_4 -アルキルカルボニル- C_1-C_4 -アルコキシ、 C_5-C_6 -アルキルチオ、 C_5-C_6 -ハロアルキルチオ、 C_5-C_6 -アルキルスルフィニル、 C_5-C_6 -ハロアルキルスルフィニル、 C_5-C_6 -アルキルスルホニル、 C_5-C_6 -ハロアルキルスルホニル、 C_3-C_6 -シクロアルキルスルホニル、トリ(C_3-C_4 -アルキル)シリル、 C_1-C_4 -アルキルスルホニルアミノまたは C_1-C_4 -ハロアルキルスルホニルアミノであり、

Z^5 がベンジル、フェニル、 C_2-C_6 -アルケニルオキシ、 C_2-C_6 -アルキニルオキシ、 C_5-C_6 -アルキルチオまたは C_5-C_6 -ハロアルキルチオであり、

Z^6 が C_3-C_6 -シクロアルキルシクロプロピル、 C_3-C_6 -シクロアルキルシク

10

20

30

40

50

ロヘキシルまたはトリ（ C_3-C_4 -アルキル）シリルであり、

Z^7 が C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -アルキニル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_4 -アルキル- C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキルシクロプロピル、 C_3-C_6 -シクロアルキルシクロヘキシル、シクロアルキルアルキル、 C_1-C_4 -アルキルスルホニル、 $C(=O)H$ 、ベンジルまたはフェニルである請求項 1 に記載の式（I）の化合物。

【請求項 3】

基の定義がそれぞれ下記の通りであり、

A が、2 個以下の置換基を含んでも良いフェニルであり、前記置換基がそれぞれ独立に、下記のリスト：メチル、エチル、ヨウ素、塩素、臭素、フッ素、メトキシ、エトキシ、ジフルオロメチルまたはトリフルオロメチルから選択され、または

10

A が、2 個以下の置換基を含んでも良いピラゾール-1-イルであり、前記置換基がそれぞれ独立に、下記のリスト：メチル、エチル、塩素、臭素、フッ素またはトリフルオロメチルから選択される前記請求項のうちのいずれか一項に記載の式（I）の化合物。

【請求項 4】

基の定義がそれぞれ下記の通りであり、

G が、 G^1 、 G^2 または G^3 であり、特に G^1 であり、

R^{G^1} が水素である前記請求項のうちのいずれか一項に記載の式（I）の化合物。

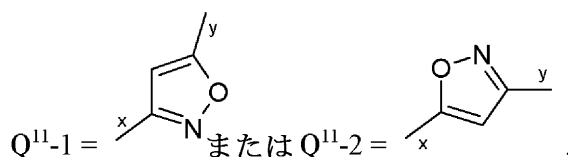
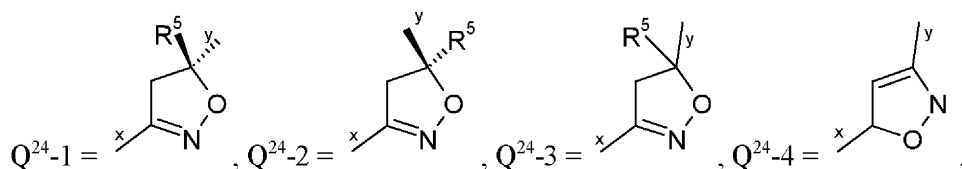
【請求項 5】

基の定義がそれぞれ下記の通りであり、

20

Q が、

【化 6】



30

であり、

「x」によって識別される結合が G に直接結合しており、「y」によって識別される結合が L^2 に直接結合している前記請求項のうちのいずれか一項に記載の式（I）の化合物。

【請求項 6】

基の定義がそれぞれ下記の通りであり、

R^1 が、1、2 もしくは 3 個の置換基を含んでも良いフェニルであり、1 個の置換基は Z^4 から選択され、別の置換基は下記のリスト：フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、アミノ、 $-SH$ 、 $-C(=O)H$ 、メチル、エチル、 n -プロピル、1-メチルエチル、 n -ブチル、1,1-ジメチルエチル、1,2-ジメチルエチル、エテニル、エチニル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、トリクロロメチル、ジクロロメチル、シクロプロピル、メトキシ、エトキシ、 n -プロポキシ、1-メチルエトキシ、1,1-ジメチルエトキシ、メチルカルボニル、エチルカルボニル、トリフルオロメチルカルボニル、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、 n -プロポキシカルボニル、1-メチルエトキシカルボニル、1,1-ジメチルエトキシカルボニル、1-エテニルオキシ、2-プロペニルオキシ、2-プロピニルオキシ、メチルカルボニルオキシ、トリフルオロアルキルカルボニルオキシ、クロロメチルカルボニルオキシ、メチルチオ、エチルチオ、メチルスルホニル、メチルスルホニルアミノ、トリフルオロメチルスルホ

40

50

ニルアミノまたは $-L^3R^3$ から選択され、または

R^1 が、ナフタレン-1-イル、ナフタレン-2-イル、1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン-1-イル、1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン-2-イル、5, 6, 7, 8-テトラヒドロナフタレン-1-イル、5, 6, 7, 8-テトラヒドロナフタレン-2-イル、デカリン-1-イル、デカリン-2-イル、1H-インデン-1-イル、2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル、1H-インデン-2-イル、1H-インデン-3-イル、1H-インデン-4-イル、1H-インデン-5-イル、1H-インデン-6-イル、1H-インデン-7-イル、インダン-1-イル、インダン-2-イル、インダン-3-イル、インダン-4-イルまたはインダン-5-イルであり、これらはそれぞれ Z^5 置換基によって少なくとも1回置換されており、さらに別の置換を有していても良く、当該別の置換基はそれぞれ独立に Z^5 ならびにメチル、メトキシ、シアノ、フッ素、塩素、臭素およびヨウ素からなる群から選択され、または

R^1 が、フラン-2-イル、フラン-3-イル、チオフェン-2-イル、チオフェン-3-イル、イソオキサゾール-3-イル、イソオキサゾール-4-イル、イソオキサゾール-5-イル、ピロール-1-イル、ピロール-2-イル、ピロール-3-イル、オキサゾール-2-イル、オキサゾール-4-イル、オキサゾール-5-イル、チアゾール-2-イル、チアゾール-4-イル、チアゾール-5-イル、イソチアゾール-3-イル、イソチアゾール-4-イル、イソチアゾール-5-イル、ピラゾール-1-イル、ピラゾール-3-イル、ピラゾール-4-イル、イミダゾール-1-イル、イミダゾール-2-イル、イミダゾール-4-イル、1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル、1, 2, 4-オキサジアゾール-5-イル、1, 3, 4-オキサジアゾール-2-イル、1, 2, 4-チアジアゾール-3-イル、1, 2, 4-チアジアゾール-5-イル、1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル、1, 2, 3-トリアゾール-1-イル、1, 2, 3-トリアゾール-2-イル、1, 2, 3-トリアゾール-4-イル、1, 2, 4-トリアゾール-1-イル、1, 2, 4-トリアゾール-3-イル、1, 2, 4-トリアゾール-4-イル、ピリジン-2-イル、ピリジン-3-イル、ピリジン-4-イル、ピリダジン-3-イル、ピリダジン-4-イル、ピリミジン-2-イル、ピリミジン-4-イル、ピリミジン-5-イルまたはピラジン-2-イルであり、それらはそれぞれ1個もしくは2個の置換基を含んでも良く、1個の置換基は炭素上にあつて Z^6 から選択されるか、窒素上にあつて Z^7 から選択され、別の置換基は下記のリスト：

炭素上の置換基：フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、メチル、エチル、 n -プロピル、1-メチルエチル、 n -ブチル、1, 1-ジメチルエチル、1, 2-ジメチルエチル、エテニル、エチニル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、トリクロロメチル、ジクロロメチル、シクロプロピル、メトキシ、エトキシ、 n -プロポキシ、1-メチルエトキシ、1, 1-ジメチルエトキシ、メチルカルボニル、エチルカルボニル、トリフルオロメチルカルボニル、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、 n -プロポキシカルボニル、1-メチルエトキシカルボニル、1, 1-ジメチルエトキシカルボニル、1-エテニルオキシ、2-プロペニルオキシ、2-プロピニルオキシ、メチルカルボニルオキシ、トリフルオロアルキルカルボニルオキシ、クロロメチルカルボニルオキシ、メチルカルボニルアミノ、トリフルオロアルキルカルボニルアミノ、クロロメチルカルボニルアミノ、メチルチオ、エチルチオ、メチルスルフィニル、メチルスルホニル、メチルスルホニルオキシ、トリフルオロアルキルスルホニルオキシ、メチルスルホニルアミノまたはトリフルオロメチルスルホニルアミノ、

窒素上の置換基：メチル、エチル、 n -プロピル、 $-C(=O)H$ 、メチルカルボニル、トリフルオロメチルカルボニル、クロロメチルカルボニル、メチルスルホニル、トリフルオロメチルスルホニル、フェニルスルホニル、フェニルまたは2-プロピニルから選択され、または

R^1 が、インドール-1-イル、インドール-2-イル、インドール-3-イル、インドール-4-イル、インドール-5-イル、インドール-6-イル、インドール-7-イル、ベンズイミダゾール-1-イル、ベンズイミダゾール-2-イル、ベンズイミダゾール-

ル-4-イル、ベンズイミダゾール-5-イル、インダゾール-1-イル、インダゾール-3-イル、インダゾール-4-イル、インダゾール-5-イル、インダゾール-6-イル、インダゾール-7-イル、インダゾール-2-イル、1-ベンゾフラン-2-イル、1-ベンゾフラン-3-イル、1-ベンゾフラン-4-イル、1-ベンゾフラン-5-イル、1-ベンゾフラン-6-イル、1-ベンゾフラン-7-イル、1-ベンゾチオフェン-2-イル、1-ベンゾチオフェン-3-イル、1-ベンゾチオフェン-4-イル、1-ベンゾチオフェン-5-イル、1-ベンゾチオフェン-6-イル、1-ベンゾチオフェン-7-イル、1, 3-ベンゾチアゾール-2-イル、1, 3-ベンゾチアゾール-4-イル、1, 3-ベンゾチアゾール-5-イル、1, 3-ベンゾチアゾール-6-イル、1, 3-ベンゾチアゾール-7-イル、1, 3-ベンゾオキサゾール-2-イル、1, 3-ベンゾオキサゾール-4-イル、1, 3-ベンゾオキサゾール-5-イル、1, 3-ベンゾオキサゾール-6-イル、1, 3-ベンゾオキサゾール-7-イル、キノリン-2-イル、キノリン-3-イル、キノリン-4-イル、キノリン-5-イル、キノリン-6-イル、キノリン-7-イル、キノリン-8-イル、イソキノリン-1-イル、イソキノリン-3-イル、イソキノリン-4-イル、イソキノリン-5-イル、イソキノリン-6-イル、イソキノリン-7-イルまたはイソキノリン-8-イルであり、それらはそれぞれ1個の置換基によって、炭素上ではZ⁶によって、または窒素上ではZ⁷によって置換されており、さらに、下記のリスト：

10

炭素上の置換基：フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メチル、メトキシ、

20

窒素上の置換基：メチル、エチル、n-プロピル、-C(=O)H、メチルカルボニル、トリフルオロメチルカルボニル、クロロメチルカルボニル、メチルスルホニル、トリフルオロメチルスルホニル、フェニルスルホニル、フェニルまたは2-プロピニルから選択される別の置換基を有していても良い前記請求項のうちのいずれか一項に記載の式(I)の化合物。

【請求項7】

基の定義がそれぞれ下記の通りであり、

Aが5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル、5-クロロ-2-メチルフェニルまたは2, 5-ビス(ジフルオロメチル)フェニルであり、

L¹が-CH₂-または-NH-であり、

L²が直接結合であり、

30

Yが酸素であり、

Xが炭素であり、

pが0であり、

GがG¹であり、

R^{G 1}が水素であり、

QがQ^{2 4}-3であり、

R²が水素であり、

R⁵が水素であり、

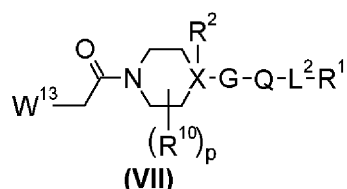
R¹が3-ホルミルフェニル、2-ホルミルフェニルまたは2-[(メチルスルホニル)アミノ]フェニルである前記請求項のうちのいずれか一項に記載の式(I)の化合物。

40

【請求項8】

下記式(VII)の化合物ならびに該化合物の塩、金属錯体およびN-オキサイド。

【化7】



[式中、記号R²、X、G、Q、L²、R¹、R¹⁰およびpはそれぞれ請求項1から

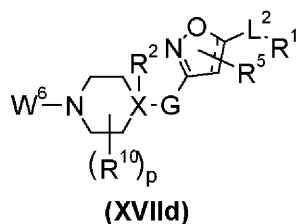
50

8のうちのいずれか一項で定義の通りであり、 $W^{1\ 3}$ は脱離基である。]

【請求項9】

下記式(XVIIId)の化合物ならびに該化合物の塩、金属錯体およびN-オキサイド。

【化8】



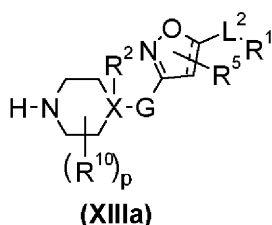
10

[式中、記号 W^6 はアセチル、 $C_1 - C_4$ アルコキシカルボニル、ベンジルまたはベンジルオキシカルボニルであり、記号X、 L^2 、p、 R^1 、 R^2 、 R^5 および R^{10} はそれぞれ請求項1から8のうちのいずれか一項で定義の通りである。]

【請求項10】

下記式(XIIIIa)の化合物ならびに該化合物の塩、金属錯体およびN-オキサイド。

【化9】



20

[式中、記号X、 L^2 、p、G、 R^1 、 R^2 、 R^5 および R^{10} はそれぞれ請求項1から8のうちのいずれか一項で定義の通りである。]

【請求項11】

植物病原性有害真菌の防除方法において、請求項1から7のうちのいずれか一項に記載の式(I)の化合物を、前記植物病原性有害真菌および／または該真菌の棲息場所に施用することを特徴とする方法。

30

【請求項12】

植物病原性有害真菌を防除するための組成物において、増量剤および／または界面活性剤に加えて、少なくとも1種類の請求項1から7のうちのいずれか一項に記載の式(I)の化合物を含有することを特徴とする組成物。

【請求項13】

植物病原性有害真菌を防除するための請求項1から7のうちのいずれか一項に記載の式(I)の化合物の使用。

【請求項14】

植物病原性有害真菌を防除するための組成物の製造方法において、請求項1から7のうちのいずれか一項に記載の式(I)の化合物を増量剤および／または界面活性剤と混和することを特徴とする方法。

40

【請求項15】

トランスジェニック植物を処置するための請求項1から7のうちのいずれか一項に記載の式(I)の化合物の使用。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、ヘテロアリアルピペリジンおよびピペラジン誘導体、その農芸化学的に

50

活性な塩、その使用および植物中および／または植物上のまたは植物の種子中および／または植物の種子上の植物病原性有害真菌を防除するための方法および組成物、そのような組成物および処理された種子を製造する方法、ならびに農業、園芸および林業、動物の健康、材料の保護そして家庭分野および衛生分野での植物病原性有害真菌の防除におけるその使用に関するものである。本発明はさらに、ヘテロアリアルピペリジンおよびピペラジン誘導体の製造方法に関するものでもある。

【背景技術】

【0002】

特定の複素環置換されたチアゾール類が殺菌性作物保護剤として使用可能であることがすでに知られている（公開番号：WO07/014290、WO08/013925、WO08/013622、WO08/091594、WO08/091580、WO09/055514、WO09/094407、WO09/094445、WO09/132785、WO10/037479、WO10/065579、WO2010/066353、WO2010/149275、WO2011/051243、WO2011/051244、WO2011/076510、WO2011/018415、WO2011/018401、WO2011/076699の特許出願を参照；さらに、出願番号：DE102010000662.9、PCT/EP2011/056594、PCT/EP2011/057912、PCT/EP2011/058330、PCT/EP2011/063783、PCT/EP2011/064527の特許出願も参照）。しかしながら、具体的には比較的低施用量で、これら化合物の殺真菌効力が常に十分であるとは限らない。

【先行技術文献】

【特許文献】

【0003】

【特許文献1】WO07/014290

【特許文献2】WO08/013925

【特許文献3】WO08/013622

【特許文献4】WO08/091594

【特許文献5】WO08/091580

【特許文献6】WO09/055514

【特許文献7】WO09/094407

【特許文献8】WO09/094445

【特許文献9】WO09/132785

【特許文献10】WO10/037479

【特許文献11】WO10/065579

【特許文献12】WO2010/066353

【特許文献13】WO2010/149275

【特許文献14】WO2011/051243

【特許文献15】WO2011/051244

【特許文献16】WO2011/076510

【特許文献17】WO2011/018415

【特許文献18】WO2011/018401

【特許文献19】WO2011/076699

【特許文献20】DE102010000662.9

【特許文献21】PCT/EP2011/056594

【特許文献22】PCT/EP2011/057912

【特許文献23】PCT/EP2011/058330

【特許文献24】PCT/EP2011/063783

【特許文献25】PCT/EP2011/064527

【発明の概要】

【発明が解決しようとする課題】

【0004】

現代の作物保護剤に対する生態学および経済的要求が、例えば活性スペクトル、毒性、選択性、施用量、残留物の形成および好ましい製造に関して相変わらず高まっており、例えば抵抗性による問題が生じる可能性もあることから、少なくとも一部の領域で公知のものに勝る利点を有する新規な作物保護剤、特に殺菌剤を開発することが常に必要とされている。

【課題を解決するための手段】

【0005】

驚くべきことに、本発明のヘテロアリールピペリジンおよびピペラジン誘導体が、上記の目的のうちの少なくとも一部の側面を達成し、作物保護組成物として、特に殺菌剤としての使用に好適であることが見出された。

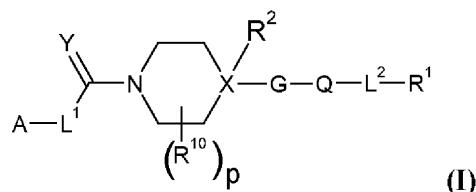
10

【0006】

本発明は、下記式(I)の化合物ならびに当該式(I)の化合物の塩、金属錯体およびN-オキサイドを提供する。

【0007】

【化1】



20

式中、

基はそれぞれ、下記のように定義され、

Aは、5個以下の置換基を含むことができるフェニルであり、当該置換基はそれぞれ独立にZ^{A-1}から選択され、

または

Aは、4個以下の置換基を含むことができるベンゾ縮合していても良い置換されていない置換されている5員もしくは6員のヘテロアリールであり、前記炭素上の置換基はそれぞれ独立にZ^{A-2}から選択され、前記窒素上の置換基はそれぞれ独立にZ^{A-3}から選択され、

30

Z^{A-1}は同一であるか異なっており、それぞれ独立に水素、ハロゲン、ヒドロキシル、チオキシ、ニトロ、シアノ、-C(=O)H、-C(=O)OH、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルキニル、シクロアルキル、シクロアルケニル、ハロシクロアルキル、ハロシクロアルケニル、ヒドロキシアルキル、シアノアルキル、ホルミルアルキル、アルコキシアルキル、ハロアルコキシアルキル、シクロアルコキシアルキル、アルキニルオキシアルキル、アルキルチオアルキル、アルキルスルフィニルアルキル、アルキルアミノアルキル、ハロアルキルアミノアルキル、シクロアルキルアミノアルキル、ジアルキルアミノアルキル、アルキルカルボニルアルキル、アルキルスルホニルアルキル、アルキルシクロアルキル、アルキルシクロアルケニル、アルコキシ、アルキルシクロアルキルアルキル、ハロシクロアルコキシ、アルキルチオ、ハロアルキルチオ、シクロアルキルチオ、アルキニルチオ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、ハロアルコキシ、ハロアルケニルオキシ、ハロアルキニルオキシ、シクロアルコキシ、アルコキシアルコキシ、シクロアルキルアルコキシ、アルキルカルボニルオキシ、ハロアルキルカルボニルオキシ、シクロアルキルカルボニルオキシ、シクロアルキルアミノ、アルキルカルボニルアミノ、シクロアルキルカルボニルアミノ、アルコキシカルボニルアミノ、アルキルスルホニルアミノ、ハロアルキルスルホニルアミノ、フェニルスルホニルアミノ、シクロアルキルアルキル、ハロシクロアルキルアルキル、シクロアルキルシクロアルキル、アルコキシアルコキシアルキル、アルキルアミノカルボニルオキシ、アルキルカルボニルアルコキシ、シクロアルキルアミノカルボニル、シクロアルキルアルコキシカ

40

50

ルボニル、アルキルスルフィニル、ハロアルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、ハロアルキルスルホニル、シクロアルキルスルホニル、アルキルカルボニル、ハロアルキルカルボニル、シクロアルキルカルボニル、アルコキシカルボニル、シクロアルコキシカルボニル、トリアルキルシリル、 $-\text{SF}_5$ 、フェニル、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^3\text{R}^4$ または $-\text{NR}^3\text{R}^4$ であり、

$\text{Z}^{\text{A}-2}$ および $\text{R}^{\text{G}1}$ は同一であるか異なっており、それぞれ独立に水素、ハロゲン、ヒドロキシル、チオキシ、ニトロ、シアノ、 $-\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルキニル、シクロアルキル、ハロシクロアルキル、ヒドロキシアルキル、ホルミルアルキル、アルコキシアルキル、アルキルカルボニルアルキル、アルキルシクロアルキル、アルコキシ、アルキルシクロアルキルアルキル、アルキルチオ、ハロアルキルチオ、アルキニルチオ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、ハロアルコキシ、アルコキシアルコキシ、アルキルカルボニルオキシ、ハロアルキルカルボニルオキシ、シクロアルキルカルボニルアミノ、アルキルスルホニルアミノ、ハロアルキルスルホニルアミノ、フェニルスルホニルアミノ、シクロアルキルアルキル、ハロシクロアルキルアルキル、シクロアルキルシクロアルキル、アルコキシカルボニルオキシ、アルキルカルボニルチオ、アルキルスルフィニル、ハロアルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、ハロアルキルスルホニル、アルキルカルボニル、ハロアルキルカルボニル、アルコキシカルボニル、アルキルアミノカルボニルオキシ、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^3\text{R}^4$ または $-\text{NR}^3\text{R}^4$ であり、

$\text{Z}^{\text{A}-3}$ 、 $\text{R}^{\text{G}2}$ および Z^2 は同一であるか異なっており、それぞれ独立に水素、 $-\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^3\text{R}^4$ 、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルキニル、シクロアルキル、ハロシクロアルキル、アルキルシクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アルコキシアルキル、アルキルスルホニル、ハロアルキルスルホニル、シクロアルキルスルホニル、フェニルスルホニル、アルキルカルボニル、ハロアルキルカルボニル、アルコキシカルボニル、ハロアルコキシカルボニル、シクロアルコキシカルボニル、フェニルまたはベンジルであり、

R^3 および R^4 は同一であるか異なっており、それぞれ独立に水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、シクロアルキル、ベンジルまたはフェニルであり、

L^1 は、 $\text{NR}^{\text{L}12}$ または $\text{C}(\text{R}^{\text{L}11})_2$ であり、

$\text{R}^{\text{L}11}$ は同一であるか異なっており、独立に水素、ハロゲン、ヒドロキシル、シアノ、 $-\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルキニル、アルコキシアルキル、アルキルチオアルキル、アルキルアミノアルキル、ジアルキルアミノアルキル、アルコキシ、アルキルチオ、ハロアルキルチオ、ハロアルコキシ、アルキルカルボニルオキシ、アルキルカルボニルアミノ、アルキルカルボニルチオ、アルキルスルホニル、ハロアルキルスルホニル、アルキルカルボニル、ハロアルキルカルボニル、アルコキシカルボニル、トリアルキルシリルオキシ、 $-\text{NR}^3\text{R}^4$ または $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^3\text{R}^4$ であり、

または前記 2 個の $\text{R}^{\text{L}11}$ 基が、それらが結合している炭素原子と一体となって、シクロプロピル環を形成しており、または

前記 2 個の $\text{R}^{\text{L}11}$ 基が $=\text{CH}_2$ 、 $=\text{COR}^3$ 、 $=\text{NOR}^3$ または $=\text{CHN}(\text{R}^7)_2$ であり、

$\text{R}^{\text{L}12}$ は、水素、 $-\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルキニル、シクロアルキル、ハロシクロアルキル、アルキルシクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルキルアミノカルボニル、ハロアルキルアミノカルボニル、アルキルスルホニル、ハロアルキルスルホニル、シクロアルキルスルホニル、アルキルカルボニル、ハロアルキルカルボニル、アルコキシカルボニル、ハロアルコキシカルボニル、シクロアルコキシカルボニル、アルキルアミノカルボニル、ジアルキルアミノカルボニル、フェニルまたはベンジルであり、

R^7 は、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、シクロアルキル、ベンジルまたはフェニルであり、

Yは硫黄または酸素であり、

Xは炭素または窒素であり、

R²は水素、アルキル、アルケニル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロゲン、シアノまたはヒドロキシルであり、

R¹⁰はオキソ、アルキル、アルケニル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロゲン、シアノまたはヒドロキシルであり、

pは0、1または2であり、

Gは、Qによって置換されていてそれ以外に置換されていないか置換されていても良い5員ヘテロアリアルであり、前記炭素上の置換基はそれぞれ独立にR^{G1}から選択され、前記窒素上の置換基はそれぞれ独立にR^{G2}から選択され、

Qは、L²-R¹によって置換されていてそれ以外に置換されていないか置換されていても良い飽和しているか部分不飽和もしくは完全不飽和である5員複素環であり、前記置換基は、それぞれ独立にR⁵から選択され、

R⁵は同一であるか異なっており、独立に、

Qの前記5員複素環の炭素に結合している場合は、

水素、オキソ、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、ニトロ、-CHO、-C(=O)OH、-C(=O)NH₂、-C(=O)NR³R⁴、-NR³R⁴、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルキニル、シクロアルキル、ハロシクロアルキル、アルキルシクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルキルシクロアルキル、ハロシクロアルキルアルキル、アルキルシクロアルキルアルキル、シクロアルケニル、ハロシクロアルケニル、アルコキシアルキル、ハロアルコキシアルキル、シクロアルコキシアルキル、アルコキシアルコキシアルキル、アルキルチオアルキル、ホルミルアルキル、アルキルカルボニルアルキル、アルキルスルフィニルアルキル、アルキルスルホニルアルキル、アルキルアミノアルキル、ジアルキルアミノアルキル、ハロアルキルアミノアルキル、シクロアルキルアミノアルキル、アルキルカルボニル、ハロアルキルカルボニル、シクロアルキルカルボニル、アルコキシカルボニル、シクロアルコキシカルボニル、シクロアルキルアルコキシカルボニル、シクロアルキルアミノカルボニル、ヒドロキシアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、シクロアルコキシ、ハロシクロアルコキシ、シクロアルキルアルコキシ、アルケニルオキシ、ハロアルケニルオキシ、アルキニルオキシ、ハロアルキニルオキシ、アルコキシアルコキシ、アルキルカルボニルオキシ、ハロアルキルカルボニルオキシ、シクロアルキルカルボニルオキシ、アルキルカルボニルアルコキシ、アルキルチオ、ハロアルキルチオ、シクロアルキルチオ、アルキルスルフィニル、ハロアルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、ハロアルキルスルホニル、シクロアルキルスルホニル、トリアルキルシリル、アルキルスルホニルアミノ、ハロアルキルスルホニルアミノであり、

Qの前記5員複素環の窒素に結合している場合は、

水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルキニル、シクロアルキル、ハロシクロアルキル、アルキルシクロアルキル、シクロアルキルアルキル、フェニル、ベンジル、アルキルスルホニル、-C(=O)H、アルコキシカルボニルまたはアルキルカルボニルであり、

L²は、直接結合、O、C(=O)、S(O)_m、CHR²⁰またはNR²¹であり、mは0、1または2であり、

R²⁰は、水素、アルキルまたはハロアルキルであり、

R²¹は、水素、アルキル、ハロアルキル、シクロアルキル、アルキルカルボニル、ハロアルキルカルボニル、アルコキシカルボニルまたはハロアルコキシカルボニルであり、

R¹は、Z⁴置換基によって1回置換されており、さらに別の置換を有していても良いフェニルであり、それらの別の置換基はそれぞれ独立にZ⁴およびZ¹から選択され、

または

R¹は、Z⁵置換基によって1回置換されており、さらに別の置換を有していても良いナフチル、ジヒドロナフタレニル、テトラヒドロナフタレニル、ヘキサヒドロナフタレニ

10

20

30

40

50

ル、オクタヒドロナフタレニルもしくはインデニルであり、それらの別の置換基はそれぞれ独立に Z^5 および Z^1 から選択され、

または

R^1 は、炭素上で Z^6 置換基によってまたは窒素上で Z^7 置換基によって 1 回置換されており、さらに別の置換基によって置換されていても良いベンゾ縮合していても良い置換された 5 員もしくは 6 員のヘテロアリールであり、炭素上の前記別の置換基はそれぞれ独立に Z^1 および Z^6 から選択され、窒素上の前記別の置換基はそれぞれ独立に Z^2 および Z^7 から選択され、

Z^1 は、水素、ハロゲン、ヒドロキシル、ニトロ、シアノ、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルキニル、シクロアルキル、ハロシクロアルキル、アルコキシ、アルコキシアルキル、ヒドロキシアルキル、ハロアルコキシ、アルキルカルボニル、アルコキシカルボニル、アルキルシクロアルキル、シクロアルコキシアルキル、シクロアルキルアミノ、アルキルチオ、ハロアルキルチオ、シクロアルキルチオ、シクロアルキルアルキル、アルキルカルボニルオキシ、アルキルカルボニルアミノ、ハロアルキルカルボニルアミノ、アルキルカルボニルチオ、アルキルスルフィニル、ハロアルキルスルフィニル、アルキルスルホニルオキシ、ハロアルキルスルホニルオキシ、アルキルシクロアルキルアルキル、 $-C(=O)NR^3R^4$ 、 $-NR^3R^4$ 、または $-L^3Z^3$ であり、

L^3 は、直接結合、 $-CH_2-$ 、 $-C(=O)-$ 、硫黄、酸素、 $-C(=O)O-$ 、 $-C(=O)NH-$ 、 $-OC(=O)-$ または $-NHC(=O)-$ であり、

Z^3 は、フェニル基、ナフタレニル基または 5 員もしくは 6 員のヘテロアリール基であり、それらはそれぞれ 0、1、2 もしくは 3 個の置換基を含んでいても良く、前記置換基はそれぞれ独立に下記のリスト：

炭素上の置換基：ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、アミノ、 $-SH$ 、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルキニル、シクロアルキル、ハロシクロアルキル、アルコキシアルキル、アルキルカルボニル、ハロアルキルカルボニル、アルコキシカルボニル、アルコキシ、ハロアルコキシ、シクロアルコキシ、ハロシクロアルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アルコキシアルコキシ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アルキルチオ、ハロアルキルチオ、アルキルスルフィニル、ハロアルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、ハロアルキルスルホニル、トリシリルアルキルまたはフェニル、

窒素上の置換基：水素、 $-C(=O)H$ 、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルキニル、シクロアルキル、ハロシクロアルキル、アルキルシクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アルコキシアルキル、アルキルスルホニル、ハロアルキルスルホニル、シクロアルキルスルホニル、フェニルスルホニル、アルキルカルボニル、ハロアルキルカルボニル、アルコキシカルボニル、ハロアルコキシカルボニル、シクロアルコキシカルボニル、 $-C(=O)NR^3R^4$ 、フェニルまたはベンジル

から選択され、

Z^4 は、 SH 、 $C(=O)H$ 、 C_7-C_8 シクロアルキル、 C_7-C_8 ハロシクロアルキル、シクロアルキルシクロアルキル、ハロシクロアルキルアルキル、シクロアルケニル、ハロシクロアルケニル、 C_4-C_6 アルコキシ- C_1-C_4 アルキル、 C_3 アルコキシ- C_2-C_4 アルキル、アルコキシアルコキシアルキル、アルキルチオアルキル、アルキルスルフィニルアルキル、アルキルスルホニルアルキル、アルキルアミノアルキル、ジアルキルアミノアルキル、ハロアルキルアミノアルキル、シクロアルキルアミノアルキル、 C_4-C_6 アルキルカルボニル、ハロアルキルカルボニル、シクロアルキルカルボニル、シクロアルコキシカルボニル、シクロアルキルアルコキシカルボニル、シクロアルキルアミノカルボニル、ハロアルコキシアルキル、 C_5-C_6 ヒドロキシアルキル、 C_5-C_6 アルコキシ、 C_5-C_6 ハロアルコキシ、シクロアルコキシ、ハロシクロアルコキシ、シクロアルキルアルコキシ、アルケニルオキシ、ハロアルケニルオキ

シ、アルキニルオキシ、ハロアルキニルオキシ、アルコキシアルコキシ、シアノアルコキシ、ハロアルキルカルボニルオキシ、シクロアルキルカルボニルオキシ、アルキルカルボニルアルコキシ、 C_5-C_6 -アルキルチオ、 C_5-C_6 -ハロアルキルチオ、 C_5-C_6 -アルキルスルフィニル、 C_5-C_6 -ハロアルキルスルフィニル、 C_5-C_6 -アルキルスルホニル、 C_5-C_6 -ハロアルキルスルホニル、シクロアルキルスルホニル、トリ (C_3-C_4 -アルキル) シリル、アルキルスルホニルアミノまたはハロアルキルスルホニルアミノであり、

Z^5 は、トリ (C_2-C_4 -アルキル) シリル、ベンジル、フェニル、SH、 C_5-C_6 -アルコキシ、 C_5-C_6 -ハロアルコキシ、 C_2-C_6 -アルケニルオキシ、 C_2-C_6 -アルキニルオキシ、 C_5-C_6 -アルキルチオまたは C_5-C_6 -ハロアルキルチオであり、

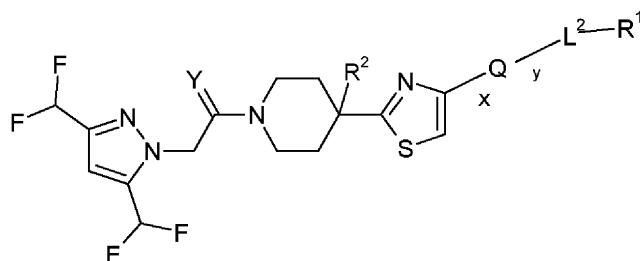
Z^6 は、SH、シクロアルキルシクロアルキルまたはトリ (C_3-C_4 -アルキル) シリルであり、

Z^7 は、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルキニル、シクロアルキル、ハロシクロアルキル、アルキルシクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルキルシクロアルキル、アルキルスルホニル、 $C(=O)H$ 、ベンジルまたはフェニルであり、

ただし、下記の化合物は除外される。

【0008】

【化2】



式中、記号は下記の意味を有し、

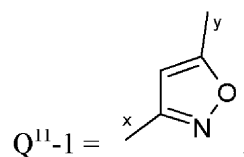
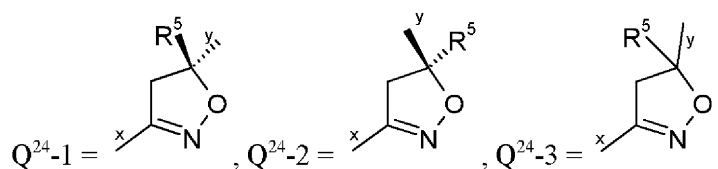
Yは酸素または硫黄であり、

R^2 は水素またはハロゲンであり、

Qは、

【0009】

【化3】



であり、

R^5 は水素、シアノ、 C_1-C_3 -アルキルまたは C_1-C_3 -ハロアルキルであり、

L^2 は直接結合であり、

R^1 は上記で定義の通りであり、 R^1 が置換されたフェニル、ナフチル、ジヒドロナフタレニル、テトラヒドロナフタレニル、ヘキサヒドロナフタレニル、オクタヒドロナフタ

10

20

30

40

50

レニルもしくはインデニルまたはベンゾ縮合していても良い5員もしくは6員のヘテロアリアルである場合、言及される炭素環もしくは複素環上には2個以下の置換基が存在する。

【0010】

本発明はさらに、式(I)の化合物の殺菌剤としての使用を提供する。

【発明を実施するための形態】

【0011】

本発明の式(I)のヘテロアリアルピペリジンおよびピペラジン誘導体ならびにその塩、金属錯体およびN-オキサイドは、植物病原性有害真菌を防除する上で非常に好適である。上記の本発明の化合物は特に、強力な殺真菌活性を示し、作物保護、家庭および衛生分野および材料保護で用いることができる。

10

【0012】

式(I)の化合物は、純粋な形でまたは異なる可能な異性体の混合物として、特にEおよびZ、トレオおよびエリスロなどの立体異性体、さらにはRおよびS異性体またはアトロプ異性体などの光学異性体、そして適切な場合には互変異体の混合物として存在し得る。EおよびZの両方の異性体、ならびにトレオおよびエリスロ異性体、さらには光学異性体、これら異性体のいずれかの所望の混合物、そして可能な互変異体の特許請求される。

【0013】

本発明の式(I)の化合物の基の定義は、好ましくは、より好ましくは、そして最も好ましくは下記の定義を有する。

20

【0014】

Aは好ましくは、2個以下の置換基を含むことができるフェニルであり、前記置換基はそれぞれ独立に下記のリスト：

ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、 $-NR^3R^4$ 、 $-C(=O)NR^3R^4$ 、ニトロ、 C_1-C_6 -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、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_2-C_6 -ハロアルケニル、 C_2-C_6 -ハロアルキニル、 C_3-C_6 -ハロシクロアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ、 C_1-C_4 -アルケニルオキシ、 C_1-C_4 -アルキニルオキシ、 C_1-C_4 -アルキルチオ、 C_1-C_4 -アルキルスルホニル、 C_1-C_4 -ハロアルキルチオ、 C_1-C_4 -ハロアルキルスルホニル、 C_1-C_4 -アルコキシ- C_1-C_6 -アルキル、ヒドロキシ- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_6 -アルキルカルボニル、 C_1-C_6 -アルコキシカルボニル、 C_1-C_6 -アルキルカルボニルオキシまたは $-C(=O)H$ から選択されるか、

30

Aは好ましくは、下記の基：フラン-2-イル、フラン-3-イル、チオフエン-2-イル、チオフエン-3-イル、イソオキサゾール-3-イル、イソオキサゾール-4-イル、イソオキサゾール-5-イル、ピロール-1-イル、ピロール-2-イル、ピロール-3-イル、オキサゾール-2-イル、オキサゾール-4-イル、オキサゾール-5-イル、チアゾール-2-イル、チアゾール-4-イル、チアゾール-5-イル、イソチアゾール-3-イル、イソチアゾール-4-イル、イソチアゾール-5-イル、ピラゾール-1-イル、ピラゾール-3-イル、ピラゾール-4-イル、イミダゾール-1-イル、イミダゾール-2-イル、イミダゾール-4-イル、1,2,3-トリアゾール-1-イル、1,2,4-トリアゾール-1-イル、ピリジン-2-イル、ピリジン-3-イル、ピリジン-4-イル、ピリダジン-3-イル、ピリダジン-4-イル、ピラジン-2-イル、ピラジン-3-イル、ピリミジン-2-イル、ピリミジン-4-イルまたはピリミジン-5-イルから選択されるヘテロ芳香族基であり、2個以下の置換基を含むことができ、前記置換基はそれぞれ独立に下記のリスト：

40

炭素上の置換基：

ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、ニトロ、 $-NR^3R^4$ 、 C_1-C_6 -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_6 -シクロアルキル、 C_1

50

—C₆—ハロアルキル、C₂—C₆—ハロアルケニル、C₂—C₆—ハロアルキニル、C₃—C₆—ハロシクロアルキル、C₁—C₄—アルコキシ、C₁—C₄—ハロアルコキシ、C₁—C₄—アルキルチオ、C₁—C₄—アルキルスルホニル、C₁—C₄—ハロアルキルチオ、C₁—C₄—ハロアルキルスルホニル、C₁—C₄—アルコキシ—C₁—C₄—アルキル、ヒドロキシ—C₁—C₄—アルキル、C₁—C₆—アルキルカルボニル、C₁—C₆—アルコキシカルボニル、C₁—C₆—アルキルカルボニルオキシまたはフェニル、

窒素上の置換基：

C₁—C₆—アルキル、C₂—C₆—アルケニル、C₂—C₆—アルキニル、C₁—C₆—ハロアルキル、C₂—C₆—ハロアルケニル、C₂—C₆—ハロアルキニル、C₃—C₁₀—シクロアルキル—C₁—C₆—アルキル、C₁—C₆—ハロアルキルカルボニル、フェニル、ベンジル、C₁—C₄—アルキルスルホニル、C₁—C₄—ハロアルキルスルホニル、フェニルスルホニル、—C(=O)H、またはC₁—C₆—アルキルカルボニル

から選択され；

Aはより好ましくは、2個以下の置換基を含んでも良いフェニルであり、前記置換基はそれぞれ独立に下記のリスト：

フッ素、臭素、ヨウ素、塩素、シアノ、ニトロ、メチル、エチル、n-プロピル、1-メチルエチル、1, 1-ジメチルエチル、クロロフルオロメチル、ジクロロメチル、ジクロロフルオロメチル、ジフルオロメチル、トリクロロメチル、トリフルオロメチル、シクロプロピル、エトキシ、1-メチルエトキシ、n-プロポキシ、メトキシ、トリフルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、1-メチルエチルチオ、メチルチオ、エチルチオ、n-プロピルチオ、ジフルオロメチルチオまたはトリフルオロメチルチオから選択されるか、

Aはより好ましくは、下記の基：フラン—2-イル、フラン—3-イル、チオフェン—2-イル、チオフェン—3-イル、イソオキサゾール—3-イル、イソオキサゾール—4-イル、イソオキサゾール—5-イル、ピロール—1-イル、ピロール—2-イル、ピロール—3-イル、オキサゾール—2-イル、オキサゾール—4-イル、オキサゾール—5-イル、チアゾール—2-イル、チアゾール—4-イル、チアゾール—5-イル、イソチアゾール—3-イル、イソチアゾール—4-イル、イソチアゾール—5-イル、ピラゾール—1-イル、ピラゾール—3-イル、ピラゾール—4-イル、イミダゾール—1-イル、イミダゾール—2-イル、イミダゾール—4-イル、1, 2, 3-トリアゾール—1-イル、1, 2, 4-トリアゾール—1-イル、ピリジン—2-イル、ピリジン—3-イル、ピリジン—4-イル、ピリダジン—3-イル、ピリダジン—4-イル、ピリミジン—2-イル、ピリミジン—4-イルまたはピリミジン—5-イルから選択されるヘテロ芳香族基であり、2個以下の置換基を含んでも良く、前記置換基は同一であるか異なっており、それぞれ独立に下記のリスト：

炭素上の置換基：

フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、メチル、エチル、n-プロピル、1-メチルエチル、1, 1-ジメチルエチル、クロロフルオロメチル、ジクロロメチル、ジクロロフルオロメチル、ジフルオロメチル、トリクロロメチル、トリフルオロメチル、シクロプロピル、エトキシ、1-メチルエトキシ、n-プロポキシ、メトキシ、トリフルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、1-メチルエチルチオ、メチルチオ、エチルチオ、n-プロピルチオ、ジフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルチオまたはフェニル、

窒素上の置換基：

メチル、エチル、n-プロピル、1-メチルエチル、メチルスルホニル、トリフルオロメチルスルホニル、メチルカルボニル、トリフルオロメチルカルボニル、クロロメチルカルボニル、2, 2-トリフルオロエチル、2, 2-ジフルオロエチル、2, 2-ジクロロ—2-フルオロエチル、2-クロロ—2-ジフルオロエチルまたは2-クロロ—2-フルオロエチル

10

20

30

40

50

から選択される。

【0015】

Aは最も好ましくは、2個以下の置換基を含んでも良いフェニルであり、前記置換基はそれぞれ独立に下記のリスト：

メチル、エチル、ヨウ素、塩素、臭素、フッ素、メトキシ、エトキシ、ジフルオロメチルまたはトリフルオロメチルから選択されるか、

Aは最も好ましくは、2個以下の置換基を含んでも良いピラゾール-1-イルであり、前記置換基はそれぞれ独立に下記のリスト：

メチル、エチル、塩素、臭素、フッ素またはトリフルオロメチルから選択され、

R^3 および R^4 は好ましくは同一であるか異なり、それぞれ独立に水素、 C_1-C_6 -アルキル、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -アルキニル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_3-C_8 -シクロアルキル、ベンジルまたはフェニル、より好ましくは水素、メチル、エチル、 n -プロピル、1-メチルエチル、 n -ブチルまたは1, 1-ジメチルエチルであり、

L^1 は好ましくは、 $C(R^{L11})_2$ (より好ましくは CHR^{L11}) または NR^{L11} であり、最も好ましくは CH_2 であり、

R^{L11} は好ましくは、水素、メチル、エチルまたはシクロプロピルであるか、

前記2個の R^{L11} 基が、それらが結合している炭素原子と一体となって、シクロプロピル環を形成しているか、

前記2個の R^{L11} 基は $=CHN(R^7)_2$ であり、

R^{L11} はより好ましくは、水素またはメチルであり、

R^{L12} は好ましくは、水素、 C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -ハロアルキル、 C_3-C_8 -シクロアルキル、 C_1-C_4 -アルキルスルホニル、 C_1-C_4 -アルコキシカルボニル、より好ましくは水素またはメチル、最も好ましくは水素であり、

R^7 は好ましくは、同一であるか異なり、独立に C_1-C_6 -アルキル、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -アルキニル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_3-C_8 -シクロアルキル、ベンジルまたはフェニル、より好ましくは水素、メチル、エチル、 n -プロピル、1-メチルエチル、 n -ブチルまたは1, 1-ジメチルエチルであり、

Yは好ましくは酸素または硫黄であり、より好ましくは酸素であり、

Xは炭素または窒素、好ましくは炭素であり、

R^2 は、好ましくは水素、 C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルケニル、 C_1-C_4 -ハロアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、ハロゲン、シアノまたはヒドロキシル、より好ましくは水素、フッ素、塩素、臭素またはヒドロキシル、最も好ましくは水素またはフッ素 (特別には水素のみ) であり、

R^{10} は、好ましくはオキソ、 C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルケニル、 C_1-C_4 -ハロアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、ハロゲン、シアノまたはヒドロキシル、より好ましくはフッ素、塩素、臭素またはヒドロキシル、最も好ましくはフッ素であり、

pは好ましくは0から1、より好ましくは0であり、

Gは好ましくは、

【0016】

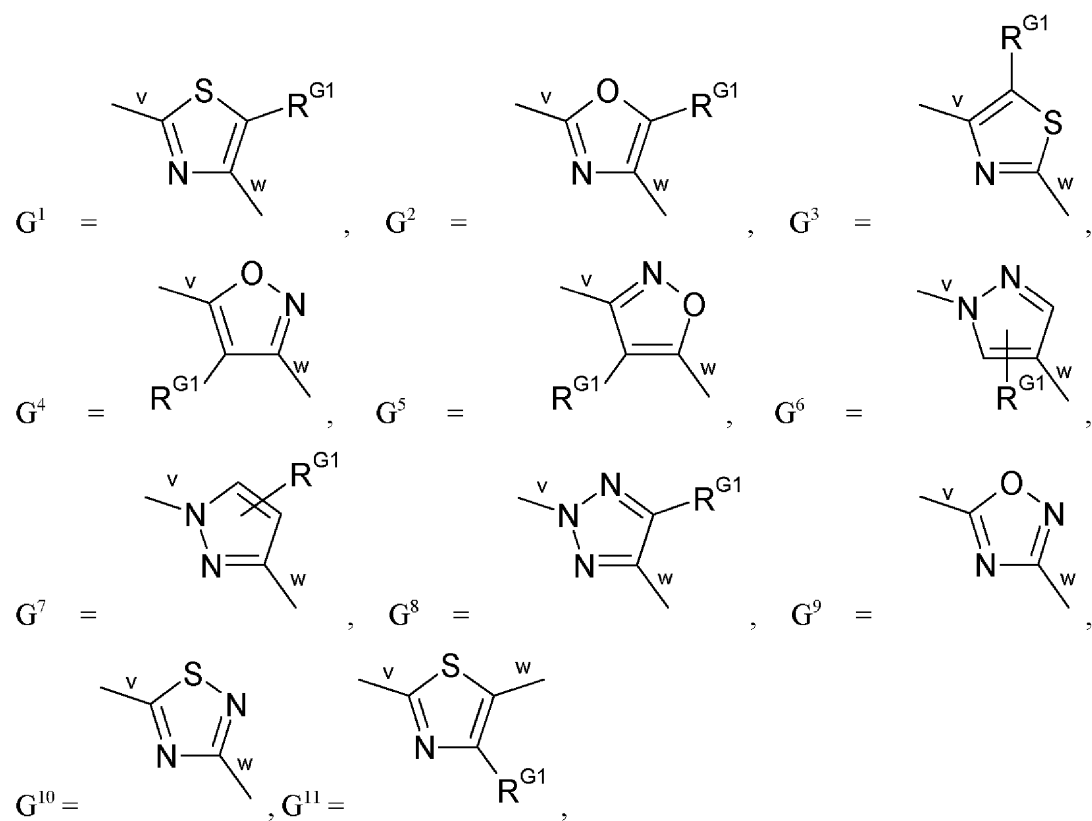
10

20

30

40

【化 4】



10

20

であり、

「v」によって識別される結合はXに直接結合しており、「w」によって識別される結合はQに直接結合しており、

Gはより好ましくは、 G^1 、 G^2 または G^3 であり、さらにより好ましくは G^1 であり

、

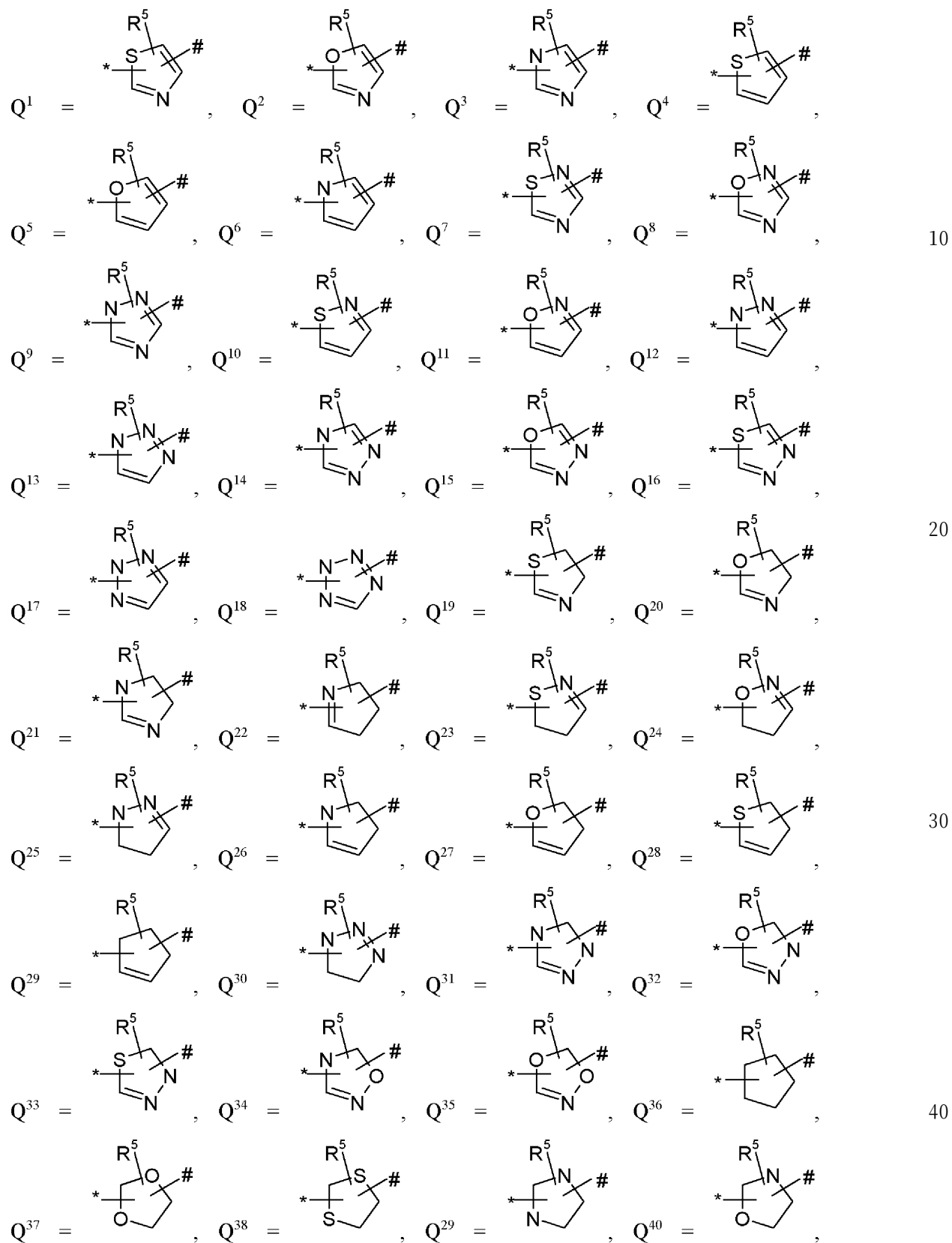
R^{G1} は好ましくは水素またはハロゲンであり、より好ましくは水素であり、

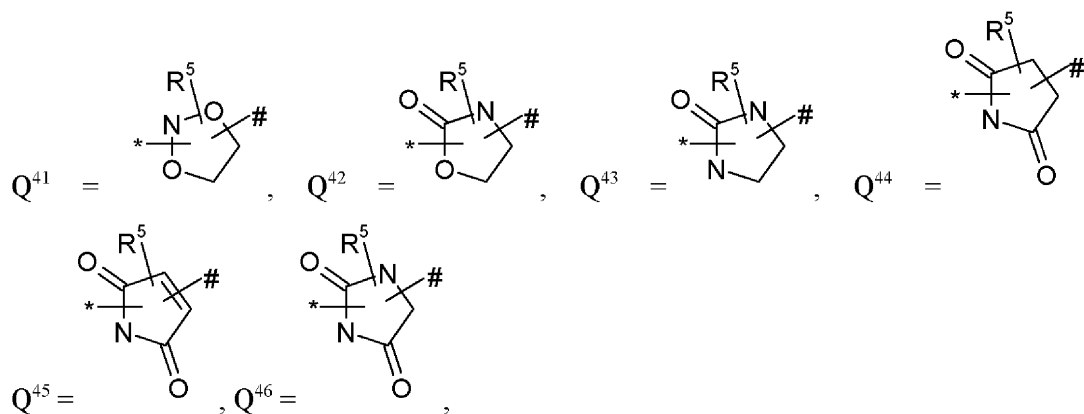
Qは好ましくは、

30

【0017】

【化 5】





10

であり、

「*」によって識別される結合はGに直接結合しており、「#」によって識別される結合はL²に直接結合しており、

または

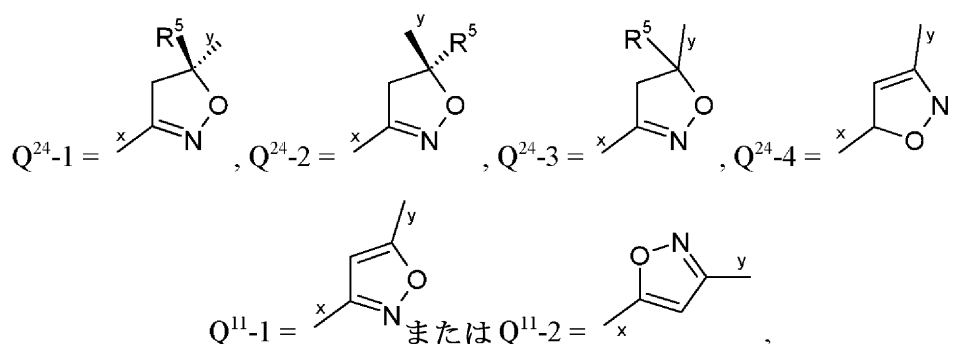
「*」によって識別される結合はL²に直接結合しており、「#」によって識別される結合はGに直接結合しており、

Qは、より好ましくは

【0018】

【化6】

20



30

であり、

「x」によって識別される結合はGに直接結合しており、「y」によって識別される結合はL²に直接結合しており、

Qは最も好ましくはQ²⁴⁻³であり、

R⁵は好ましくは同一であるか異なっており、独立に、

Qの5員複素環の炭素に結合している場合は

水素、シアノ、-NR³R⁴、C₁-C₆-アルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-アルキニル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₂-C₆-ハロアルケニル、C₂-C₆-ハロアルキニル、C₃-C₈-シクロアルキル、C₃-C₈-ハロシクロアルキル、C₃-C₈-ハロシクロアルキル、C₁-C₄-アルキル-C₃-C₈-シクロアルキル、C₃-C₈-シクロアルキル-C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-アルコキシ-C₁-C₄-アルキル、C₃-C₈-シクロアルコキシ-C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-アルコキシ-C₁-C₄-アルコキシ-C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-アルキルチオ-C₁-C₄-アルキル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルコキシ、C₃-C₈-シクロアルコキシ、C₃-C₈-ハロシクロアルコキシ、C₃-C₈-シクロアルキル-C₁-C₄-アルコキシ、C₂-C₆-アルケニルオキシ、C₂-C₆-ハロアルケニルオキシ、C₂-C₆-アルキニルオキシ、C₂-C₆-ハロアルキニルオキシ、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₄-アルコキシ、C₁-C₆-アルキルカルボニルオキシ、C₁-C₆-ハロアルキルカルボニルオキシ、C₃-C₈-シクロアルキル

40

50

カルボニルオキシ、 C_1-C_6 -アルキルカルボニル- C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -アルキルチオ、 C_1-C_6 -ハロアルキルチオ、 C_3-C_8 -シクロアルキルチオであり、

Qの5員複素環の窒素に結合している場合、

水素、 $-C(=O)H$ 、 C_1-C_3 -アルキル、 C_1-C_6 -アルキルカルボニル、 C_1-C_6 -アルコキシカルボニルまたはベンジルであり、

R^5 はより好ましくは水素、シアノ、メチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチルまたはメトキシメチルであり、または

R^5 は最も好ましくは水素であり、

L^2 は、好ましくは直接結合、 $-O-$ 、 $-C(=O)-$ 、 $-S(O)_m-$ 、 $-CHR^2$ 10
 ^{0} -または $-NR^{2,1}-$ であり、より好ましくは直接結合、 $-C(=O)-$ 、 $-CHR^2$
 ^{0} -または $-NR^{2,1}-$ であり、そして、最も好ましくは L^2 は直接結合であり、

m は好ましくは0または2であり、

$R^{2,0}$ は、好ましくは水素、 C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -ハロアルキルであり、
 、そして、より好ましくは水素、メチル、エチル、トリフルオロメチルであり、

$R^{2,1}$ は、好ましくは水素、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_1-C_6 -アルキルカルボニル、 C_1-C_6 -ハロアルキルカルボニル、 C_1-C_6 -アルコキシカルボニルまたは C_1-C_6 -ハロアルコキシカルボニルであり、そして、より好ましくは水素またはメチルであり、

R^1 は好ましくは、 Z^4 置換基によって1回置換されており、さらに別の置換を有して 20
 いても良いフェニルであり、当該さらなる置換基はそれぞれ独立に Z^4 および Z^{1-1} から選択され、または

R^1 は好ましくは、ナフタレン-1-イル、ナフタレン-2-イル、1, 2, 3, 4-
 テトラヒドロナフタレン-1-イル、1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン-2-イル、
 5, 6, 7, 8-テトラヒドロナフタレン-1-イル、5, 6, 7, 8-テトラヒドロナフタレン-2-イル、
 デカリン-1-イル、デカリン-2-イル、1H-インデン-1-イル、2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル、
 1H-インデン-2-イル、1H-インデン-3-イル、1H-インデン-4-イル、1H-インデン-5-イル、
 1H-インデン-6-イル、1H-インデン-7-イル、インダン-1-イル、インダン-2-イル、
 インダン-3-イル、インダン-4-イルまたはインダン-5-イルであり、 30

これらのそれぞれは、 Z^5 置換基によって1回置換されており、さらに別の置換を有していても良く、
 当該別の置換基はそれぞれ独立に Z^5 および Z^{1-2} から選択され、または

R^1 は好ましくは、炭素上で Z^6 置換基によってまたは窒素上で Z^7 置換基によって1
 回置換されており、さらに別の置換を有していても良い5員もしくは6員のヘテロアリール
 基であり、炭素上の別の置換基はそれぞれ独立に Z^{1-3} および Z^6 から選択され、窒
 素上の別の置換基は独立に Z^2 から選択され、または

R^1 は好ましくは、1個の Z^4 置換基によって置換されており、さらに別の置換を有して
 いても良いベンゾ縮合した置換された5員もしくは6員のヘテロアリールであり、炭素
 上の別の置換基はそれぞれ独立に Z^{1-2} から選択され、窒素上の別の置換基はそれぞれ 40
 独立に Z^2 から選択される。

【0019】

R^1 はより好ましくは、1、2もしくは3個の置換基を含んでも良いフェニルであ
 り、1個の置換基は Z^4 から選択され、別の置換基は下記のリスト：フッ素、塩素、臭素
 、ヨウ素、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、アミノ、 $-SH$ 、 $-C(=O)H$ 、メチル、
 エチル、 n -プロピル、1-メチルエチル、 n -ブチル、1, 1-ジメチルエチル、1,
 2-ジメチルエチル、エテニル、エチニル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、ト
 リクロロメチル、ジクロロメチル、シクロプロピル、メトキシ、エトキシ、 n -プロポキ
 シ、1-メチルエトキシ、1, 1-ジメチルエトキシ、メチルカルボニル、エチルカルボ
 ニル、トリフルオロメチルカルボニル、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、 n - 50

プロポキシカルボニル、1-メチルエトキシカルボニル、1, 1-ジメチルエトキシカルボニル、1-エテニルオキシ、2-プロペニルオキシ、2-プロピニルオキシ、メチルカルボニルオキシ、トリフルオロアルキルカルボニルオキシ、クロロメチルカルボニルオキシ、メチルチオ、エチルチオ、メチルスルホニル、メチルスルホニルアミノ、トリフルオロメチルスルホニルアミノまたは $-L^3 R^3$ から選択され、または

R^1 はより好ましくは、ナフタレン-1-イル、ナフタレン-2-イル、1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン-1-イル、1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン-2-イル、5, 6, 7, 8-テトラヒドロナフタレン-1-イル、5, 6, 7, 8-テトラヒドロナフタレン-2-イル、デカリン-1-イル、デカリン-2-イル、1H-インデン-1-イル、2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル、1H-インデン-2-イル、1H-インデン-3-イル、1H-インデン-4-イル、1H-インデン-5-イル、1H-インデン-6-イル、1H-インデン-7-イル、インダン-1-イル、インダン-2-イル、インダン-3-イル、インダン-4-イルまたはインダン-5-イルであり、これらはそれぞれ Z^5 置換基によって少なくとも1回置換されていていても良く、さらに別の置換を有していても良く、当該別の置換基はそれぞれ独立に Z^5 ならびにメチル、メトキシ、シアノ、フッ素、塩素、臭素およびヨウ素からなる群から選択され、特に好ましい変形形態では合計で3個以下の置換基が存在し、または

R^1 は、より好ましくはフラン-2-イル、フラン-3-イル、チオフェン-2-イル、チオフェン-3-イル、イソオキサゾール-3-イル、イソオキサゾール-4-イル、イソオキサゾール-5-イル、ピロール-1-イル、ピロール-2-イル、ピロール-3-イル、オキサゾール-2-イル、オキサゾール-4-イル、オキサゾール-5-イル、チアゾール-2-イル、チアゾール-4-イル、チアゾール-5-イル、イソチアゾール-3-イル、イソチアゾール-4-イル、イソチアゾール-5-イル、ピラゾール-1-イル、ピラゾール-3-イル、ピラゾール-4-イル、イミダゾール-1-イル、イミダゾール-2-イル、イミダゾール-4-イル、1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル、1, 2, 4-オキサジアゾール-5-イル、1, 3, 4-オキサジアゾール-2-イル、1, 2, 4-チアジアゾール-3-イル、1, 2, 4-チアジアゾール-5-イル、1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル、1, 2, 3-トリアゾール-1-イル、1, 2, 3-トリアゾール-2-イル、1, 2, 3-トリアゾール-4-イル、1, 2, 4-トリアゾール-1-イル、1, 2, 4-トリアゾール-3-イル、1, 2, 4-トリアゾール-4-イル、ピリジン-2-イル、ピリジン-3-イル、ピリジン-4-イル、ピリダジン-3-イル、ピリダジン-4-イル、ピリミジン-2-イル、ピリミジン-4-イル、ピリミジン-5-イルまたはピラジン-2-イルであり、それらはそれぞれ1個もしくは2個の置換基を含んでいても良く、1個の置換基は炭素上にあつて Z^6 から選択されるか、窒素上にあつて Z^7 から選択され、別の置換基は下記のリスト：

炭素上の置換基：フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、メチル、エチル、 n -プロピル、1-メチルエチル、 n -ブチル、1, 1-ジメチルエチル、1, 2-ジメチルエチル、エテニル、エチニル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、トリクロロメチル、ジクロロメチル、シクロプロピル、メトキシ、エトキシ、 n -プロポキシ、1-メチルエトキシ、1, 1-ジメチルエトキシ、メチルカルボニル、エチルカルボニル、トリフルオロメチルカルボニル、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、 n -プロポキシカルボニル、1-メチルエトキシカルボニル、1, 1-ジメチルエトキシカルボニル、1-エテニルオキシ、2-プロペニルオキシ、2-プロピニルオキシ、メチルカルボニルオキシ、トリフルオロアルキルカルボニルオキシ、クロロメチルカルボニルオキシ、メチルカルボニルアミノ、トリフルオロアルキルカルボニルアミノ、クロロメチルカルボニルアミノ、メチルチオ、エチルチオ、メチルスルフィニル、メチルスルホニル、メチルスルホニルオキシ、トリフルオロアルキルスルホニルオキシ、メチルスルホニルアミノまたはトリフルオロメチルスルホニルアミノ、

窒素上の置換基：メチル、エチル、 n -プロピル、 $-C(=O)H$ 、メチルカルボニル、トリフルオロメチルカルボニル、クロロメチルカルボニル、メチルスルホニル、トリ

10

20

30

40

50

フルオロメチルスルホニル、フェニルスルホニル、フェニルまたは2-プロピニルから選択され、または

R¹は、より好ましくはインドール-1-イル、インドール-2-イル、インドール-3-イル、インドール-4-イル、インドール-5-イル、インドール-6-イル、インドール-7-イル、ベンズイミダゾール-1-イル、ベンズイミダゾール-2-イル、ベンズイミダゾール-4-イル、ベンズイミダゾール-5-イル、インダゾール-1-イル、インダゾール-3-イル、インダゾール-4-イル、インダゾール-5-イル、インダゾール-6-イル、インダゾール-7-イル、インダゾール-2-イル、1-ベンゾフラン-2-イル、1-ベンゾフラン-3-イル、1-ベンゾフラン-4-イル、1-ベンゾフラン-5-イル、1-ベンゾフラン-6-イル、1-ベンゾフラン-7-イル、1-ベンゾチオフェン-2-イル、1-ベンゾチオフェン-3-イル、1-ベンゾチオフェン-4-イル、1-ベンゾチオフェン-5-イル、1-ベンゾチオフェン-6-イル、1-ベンゾチオフェン-7-イル、1, 3-ベンゾチアゾール-2-イル、1, 3-ベンゾチアゾール-4-イル、1, 3-ベンゾチアゾール-5-イル、1, 3-ベンゾチアゾール-6-イル、1, 3-ベンゾチアゾール-7-イル、1, 3-ベンゾオキサゾール-2-イル、1, 3-ベンゾオキサゾール-4-イル、1, 3-ベンゾオキサゾール-5-イル、1, 3-ベンゾオキサゾール-6-イル、1, 3-ベンゾオキサゾール-7-イル、キノリン-2-イル、キノリン-3-イル、キノリン-4-イル、キノリン-5-イル、キノリン-6-イル、キノリン-7-イル、キノリン-8-イル、イソキノリン-1-イル、イソキノリン-3-イル、イソキノリン-4-イル、イソキノリン-5-イル、イソキノリン-6-イル、イソキノリン-7-イルまたはイソキノリン-8-イルであり、それらはそれぞれ1個の置換基によって、炭素上ではZ⁶によって、または窒素上ではZ⁷によって置換されており、さらに、下記のリスト：

炭素上の置換基：フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メチル、メトキシ、

窒素上の置換基：メチル、エチル、n-プロピル、-C(=O)H、メチルカルボニル、トリフルオロメチルカルボニル、クロロメチルカルボニル、メチルスルホニル、トリフルオロメチルスルホニル、フェニルスルホニル、フェニルまたは2-プロピニルから選択される別の置換基を有していても良く、

Z¹⁻¹は、水素、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、ニトロ、-C(=O)NR³R⁴、-NR³R⁴、C₁-C₆-アルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-アルキニル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₂-C₆-ハロアルケニル、C₂-C₆-ハロアルキニル、C₃-C₆-シクロアルキル、C₃-C₈-ハロシクロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシカルボニル、C₁-C₄-アルコキシ、C₁-C₄-ハロアルコキシ、C₁-C₆-アルキルカルボニルオキシ、C₁-C₄-アルキルチオ、C₁-C₄-ハロアルキルチオ、C₃-C₆-シクロアルキルチオまたは-L³Z³であり、

Z¹⁻²は同一であるか異なっており、それぞれ独立に水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、-NR³R⁴、-C(=O)NR³R⁴、C₁-C₆-アルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-アルキニル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₂-C₆-ハロアルケニル、C₂-C₆-ハロアルキニル、C₁-C₄-アルコキシ-C₁-C₄-アルキル、C₁-C₆-アルコキシカルボニル、C₁-C₄-アルコキシ、C₁-C₄-ハロアルコキシ、C₁-C₆-アルキルカルボニルオキシ、C₁-C₆-アルキルカルボニルチオ、C₁-C₄-アルキルチオまたはC₁-C₄-ハロアルキルチオであり、

Z¹⁻³は、水素、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、ニトロ、-C(=O)NR³R⁴、-NR³R⁴、C₁-C₆-アルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-アルキニル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₂-C₆-ハロアルケニル、C₂-C₆-ハロアルキニル、C₃-C₈-シクロアルキル、C₃-C₈-ハロシクロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキルカルボニル、C₁-C₆-アルコキシカルボニル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルコキシ、C₁-C₆-アルキルカルボニルオキシ、C₁-C₆-アルキルチオ、C₁-C₆-ハロアルキ

10

20

30

40

50

ルチオまたは C_3-C_6 -シクロアルキルチオであり、

Z^2 は同一であるか異なっており、好ましくは独立に水素、 C_1-C_6 -アルキル、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -アルキニル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_2-C_6 -ハロアルケニル、 C_2-C_6 -ハロアルキニル、 C_1-C_4 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキル、フェニル、ベンジル、 C_1-C_4 -ハロアルキルスルホニル、 C_1-C_6 -アルコキシカルボニル、 C_1-C_6 -ハロアルコキシカルボニル、フェニルスルホニル、 C_1-C_4 -アルキルスルホニル、 $-C(=O)H$ 、 C_1-C_3 -ハロアルキルカルボニルまたは C_1-C_3 -アルキルカルボニルであり、

L^3 は好ましくは、直接結合、 $-CH_2-$ 、硫黄、酸素であり、より好ましくは直接結合であり、

Z^3 は、好ましくは2個以下の置換基を含んでも良いフェニル基、ナフタレニルまたは5員もしくは6員のヘテロアリール基であり、前記置換基はそれぞれ独立に下記のリスト：

炭素上の置換基：ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、アミノ、 $-SH$ 、 C_1-C_4 -アルキル、 C_2-C_4 -アルケニル、 C_2-C_4 -アルキニル、 C_1-C_4 -ハロアルキル、 C_2-C_4 -ハロアルケニル、 C_2-C_4 -ハロアルキニル、 C_2-C_4 -アルコキシアルキル、 C_1-C_6 -アルキルカルボニル、 C_1-C_6 -ハロアルキルカルボニル、 C_1-C_6 -アルコキシカルボニル、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ、 C_2-C_6 -アルケニルオキシ、 C_2-C_6 -アルキニルオキシ、 C_1-C_4 -アルキルチオ、 C_1-C_4 -ハロアルキルチオ、 C_1-C_4 -アルキルスルホニル、 C_1-C_4 -ハロアルキルスルホニルまたは C_1-C_4 -アルキルアミノ、ジ(C_1-C_4 -アルキル)アミノ、

窒素上の置換基： C_1-C_6 -アルキル、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -アルキニル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_2-C_6 -ハロアルケニル、 C_2-C_6 -ハロアルキニル、 C_1-C_4 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキル、フェニル、ベンジル、 C_1-C_4 -ハロアルキルスルホニル、 C_1-C_6 -アルコキシカルボニル、 C_1-C_6 -ハロアルコキシカルボニル、フェニルスルホニル、 C_1-C_4 -アルキルスルホニル、 $-C(=O)H$ 、または C_1-C_3 -アルキルカルボニルから選択され、

Z^3 は、より好ましくは2個以下の置換基を含んでも良いフェニル基であり、前記置換基はそれぞれ独立に下記のリスト：

塩素、臭素、ヨウ素、フッ素、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、アミノ、 $-SH$ 、メチル、エチル、 n -プロピル、1-メチルエチル、1, 1-ジメチルエチル、エテニル、プロペン-2-イル、エチニル、プロピン-2-イル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、メトキシメチル、メチルカルボニル、エチルカルボニル、トリフルオロメチルカルボニル、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、 n -プロポキシカルボニル、1-メチルエトキシカルボニル、1, 1-ジメチルエトキシカルボニル、メトキシ、エトキシ、 n -プロポキシ、1-メチルエトキシ、1, 1-ジメチルエトキシ、トリフルオロメトキシ、エテニルオキシ、2-プロペニルオキシ、エチニルオキシ、2-プロピニルオキシ、メチルチオ、エチルチオ、トリフルオロメチルチオ、メチルスルホニル、エチルスルホニル、プロピルチオニル、1-メチルエチルチオ、トリフルオロメチルスルホニル、メチルアミノ、エチルアミノ、 n -プロピルアミノ、1-メチルエチルアミノ、1, 1-ジメチルエチルアミノまたはジメチルアミノから選択され、

Z^4 は好ましくは、 $C(=O)H$ 、 C_7-C_8 -シクロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルケニル、 C_4-C_6 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキル、 C_4-C_6 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキル、 C_3 -アルコキシ- C_2-C_4 -アルキル、 C_1-C_3 -アルコキシ- C_2-C_3 -アルコキシ- C_1-C_3 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキルチオ- C_1-C_2 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキルスルフィニル- C_1-C_2 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキルスルホニル- C_1-C_2 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキルアミノ- C_1-C_2 -アルキル、 C_1-C_2 -ジアルキルアミノ- C_1-C_2 -アルキル、 C_1-C_4 -ハロアルキルアミノ

10

20

30

40

50

C_1-C_2 - アルキル、 C_3-C_6 - シクロアルキルアミノ- C_1-C_2 - アルキル、
 C_4-C_6 - アルキルカルボニル、 C_1-C_4 - ハロアルキルカルボニル、 C_3-C_6 -
シクロアルキルカルボニル、 C_3-C_6 - シクロアルコキシカルボニル、 C_3-C_6 - シ
クロアルキル- C_1-C_2 - アルコキシカルボニル、 C_3-C_6 - シクロアルキルアミノ
カルボニル、 C_1-C_4 - ハロアルコキシ- C_1-C_2 - アルキル、 C_5-C_6 - ヒドロ
キシアルキル、 C_5-C_6 - アルコキシ、 C_5-C_6 - ハロアルコキシ、 C_3-C_6 - シ
クロアルコキシ、 C_3-C_6 - ハロシクロアルコキシ、 C_3-C_6 - シクロアルキルアル
コキシ、 C_2-C_6 - アルケニルオキシ、 C_2-C_6 - ハロアルケニルオキシ、 C_2-C_6 -
アルキニルオキシ、 C_2-C_6 - ハロアルキニルオキシ、 C_1-C_4 - アルコキシ-
 C_1-C_4 - アルコキシ、シアノ- C_1-C_4 - アルコキシ、 C_1-C_4 - ハロアルキル
カルボニルオキシ、 C_3-C_6 - シクロアルキルカルボニルオキシ、 C_1-C_4 - アルキ
ルカルボニル- C_1-C_4 - アルコキシ、 C_5-C_6 - アルキルチオ、 C_5-C_6 - ハロ
アルキルチオ、 C_5-C_6 - アルキルスルフィニル、 C_5-C_6 - ハロアルキルスルフィ
ニル、 C_5-C_6 - アルキルスルホニル、 C_5-C_6 - ハロアルキルスルホニル、 C_3-C_6 -
シクロアルキルスルホニル、トリ (C_3-C_4 - アルキル) シリル、 C_1-C_4 -
アルキルスルホニルアミノまたは C_1-C_4 - ハロアルキルスルホニルアミノであり、

Z^4 はより好ましくは、 $C(=O)H$ 、シクロヘプチル、シクロプロピルシクロプロピ
ル、シクロヘキセニル、 n -ブトキシメチル、 n -プロポキシエチル、メトキシエトキシ
メチル、エトキシエトキシメチル、メチルチオメチル、エチルチオメチル、メチルスルフ
ィニルメチル、エチルスルフィニルメチル、メチルスルホニルメチル、エチルスルホニル
メチル、メチルアミノメチル、エチルアミノメチル、ジメチルアミノメチル、トリフルオ
ロメチルアミノメチル、シクロプロピルアミノメチル、 n -ブチルカルボニル、 n -ペン
チルカルボニル、トリフルオロメチルカルボニル、シクロプロピルカルボニル、シクロヘ
キシルカルボニル、シクロプロポキシカルボニル、シクロペンチルオキシカルボニル、シ
クロヘキシルオキシカルボニル、シクロプロピルアミノカルボニル、シクロペンチルアミ
ノカルボニル、シクロヘキシルアミノカルボニル、ジフルオロメトキシメチル、トリフル
オロメトキシメチル、 n -ペントキシ、ハロ- n -ペントキシ、シクロプロポキシ、シク
ロペンチルオキシ、シクロヘキシルオキシ、シクロプロピルメトキシ、アリル、3-メチ
ルブト-2-エン-1-イルオキシ、プロプ-2-イン-1-イルオキシ、ブト-2-イ
ン-1-イルオキシ、ペント-2-イン-1-イルオキシ、ハロアルキニルオキシ、メト
キシエトキシ、メトキシプロポキシ、エトキシエトキシ、3, 3, 3-トリフルオロプロ
パニルオキシ、シアノメトキシ、トリフルオロメチルカルボニルオキシ、シクロプロピル
カルボニルオキシ、シクロペンチルカルボニルオキシ、シクロヘキシルカルボニルオキシ
、メチルカルボニルメトキシ、ペンチルスルホニル、メチルスルホニルアミノ、エチルス
ルホニルアミノまたはトリフルオロメチルスルホニルアミノであり、

Z^5 は好ましくは、ベンジル、フェニル、 C_2-C_6 - アルケニルオキシ、 C_2-C_6 -
アルキニルオキシ、 C_5-C_6 - アルキルチオまたは C_5-C_6 - ハロアルキルチオで
あり、

Z^6 は好ましくは、 C_3-C_6 - シクロアルキルシクロプロピル、 C_3-C_6 - シクロ
アルキルシクロヘキシルまたはトリ (C_3-C_4 - アルキル) シリルであり、

Z^7 は好ましくは、 C_2-C_6 - アルケニル、 C_2-C_6 - アルキニル、 C_1-C_6 -
ハロアルキル、 C_3-C_6 - シクロアルキル、 C_1-C_4 - アルキル- C_3-C_6 - シク
ロアルキル、 C_3-C_6 - シクロアルキルシクロプロピル、 C_3-C_6 - シクロアルキル
シクロヘキシル、シクロアルキルアルキル、 C_1-C_4 - アルキルスルホニル、 $C(=O)$
 H 、ベンジルまたはフェニルである。

【0020】

本発明に従って使用可能なヘテロアリールピペリジンおよびピペラジン誘導体は、概
括的に言えば、式 (I) によって定義される。式 (I) の上記および下記で具体的に記載
された基の定義の基の定義は、式 (I) の最終生成物、および全ての中間体にも等しく当
てはまる (「方法および中間体の説明」の項で下記でも説明している)。

10

20

30

40

50

【0021】

概括的にまたは好ましいものの範囲内で上記および下記に挙げた基の定義および説明は、所望に応じて互いに組み合わせることもでき、すなわち特定の範囲と好ましい範囲との間で組み合わせることができる。それらは、最終生成物とそれに応じて前駆体および中間体との両方に適用されるものである。さらに、個々の定義は適用されない場合がある。

【0022】

好ましいものは、全ての基が上記の好ましい定義を有する式 (I) の化合物である。

【0023】

特に好ましいものは、全ての基が上記のより好ましい定義を有する式 (I) の化合物である。

10

【0024】

非常に好ましいものは、全ての基が上記の最も好ましい定義を有する式 (I) の化合物である。

【0025】

好ましいものはさらに、

A が、5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル、5-クロロ-2-メチルフェニルまたは2, 5-ビス(ジフルオロメチル)フェニルであり、

L¹ が、-CH₂-または-NH-であり、

L² が直接結合であり、

Y が酸素であり、

X が炭素であり、

p が0であり、

G がG¹であり、

R^{G 1} が水素であり、

Q がQ^{2 4}-3であり、

R² が水素であり、

R⁵ が水素であり、

R¹ が3-ホルミルフェニル、2-ホルミルフェニルまたは2-[(メチルスルホニル)アミノ]フェニルである式 (I) の化合物ならびにその農芸化学的に活性な塩、金属錯体およびN-オキサイドである。

20

30

【0026】

上記で言及した基の定義は、所望に応じて互いに組み合わせることができる。さらに、個々の定義は適用されない場合がある。

【0027】

上記で定義の置換基の種類に応じて、式 (I) の化合物は酸性または塩基性を有し、無機もしくは有機の酸もしくは塩基または金属イオンと塩、可能であればさらに分子内塩もしくは付加物を形成することができる。式 (I) の化合物がアミノ、アルキルアミノその他の塩基性をもたらす基を有する場合、これらの化合物を酸と反応させて塩を得ることができるか、それらは合成によって直接塩として得ることができる。式 (I) の化合物がヒドロキシル、カルボキシルその他の酸性をもたらす基を有する場合、これらの化合物は塩基と反応して塩を与えることができる。好適な塩基には、例えばアルカリ金属およびアルカリ土類金属の水酸化物、炭酸塩、炭酸水素塩、特にナトリウム、カリウム、マグネシウムおよびカルシウムのもの、さらにはアンモニア、C₁-C₄-アルキル基を有する1級、2級および3級アミン、C₁-C₄-アルカノールのモノ-、ジ-およびトリアルカノールアミン、コリンおよびクロロコリンのものがある。

40

【0028】

このようにして得ることができる塩も同様に、殺菌剤特性を有する。

【0029】

無機酸の例には、フッ化水素、塩化水素、臭化水素およびヨウ化水素などのヒドロハロ酸、硫酸、リン酸および硝酸ならびにNaHSO₄およびKHSO₄などの酸性塩がある

50

。有用な有機酸には、例えば、ギ酸、炭酸および酢酸、トリフルオロ酢酸、トリクロロ酢酸およびプロピオン酸などのアルカン酸、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、桂皮酸、シュウ酸、飽和またはモノもしくはジ不飽和 C_6-C_{20} 脂肪酸、アルキル硫酸モノエステル類、アルキルスルホン酸類（1 から 20 個の炭素原子を有する直鎖もしくは分岐のアルキル基を有するスルホン酸類）、アリールスルホン酸またはアリールジスルホン酸類（1 個もしくは 2 個のスルホン酸基を有するフェニルおよびナフチルなどの芳香族基）、アルキルホスホン酸類（1 から 20 個の炭素原子を有する直鎖もしくは分岐のアルキル基を有するホスホン酸類）、アリールホスホン酸類またはアリールジホスホン酸類（1 個もしくは 2 個のホスホン酸基を有するフェニルおよびナフチルなどの芳香族基）などがあり、前記のアルキルおよびアリール基はさらに別の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などがある。

10

【0030】

有用な金属イオンは、特には第 2 主族の元素、特にはカルシウムおよびマグネシウム、第 3 および第 4 主族の元素、特にはアルミニウム、スズおよび鉛、そして第 1 から第 8 遷移族の金属、特にはクロム、マンガン、鉄、コバルト、ニッケル、銅、亜鉛等である。特に好ましいものは、第 4 周期の元素の金属イオンである。この場合、その金属は、それが取り得る各種価数で存在することができる。

【0031】

置換されていても良い基は、モノ置換または多置換されていても良く、多置換の場合の置換基は同一でも異なっても良い。

20

【0032】

上記の式で示した記号の定義においては、一般に下記の置換基を代表する総称を用いた。

【0033】

ハロゲン：フッ素、塩素、臭素およびヨウ素および好ましくはフッ素、塩素、臭素およびより好ましくはフッ素、塩素。

【0034】

アルキル：1 から 8 個、好ましくは 1 から 6 個、より好ましくは 1 から 3 個の炭素原子を有する飽和の直鎖もしくは分岐のヒドロカルビル基、例えば（これらに限定されるものではない）メチル、エチル、プロピル、1-メチルエチル、ブチル、1-メチルプロピル、2-メチルプロピル、1, 1-ジメチルエチル、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、ヘキシル、1, 1-ジメチルプロピル、1, 2-ジメチルプロピル、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-メチルプロピルおよび 1-エチル-2-メチルプロピルなどの C_1-C_6 -アルキル。この定義は、複合置換基の一部としてのアルキルにも適用され、例えばシクロアルキルアルキル、ヒドロキシアルキルなど、別段で定義されない限りは、例えばアルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、ハロアルキルまたはハロアルキルチオなどがある。例えばアルキルシクロアルキルのように、アルキルが複合置換基の末端にある場合、最初にその複合置換基、例えばシクロアルキルのその部分は、同一にもしくは異なって、そして各場合で独立にアルキルでモノ置換または多置換されていても良い。他の基、例えばアルケニル、アルキニル、ヒドロキシル、ハロゲン、ホルミルなどが末端にある複合置換基でも同じことが当てはまる。

30

40

【0035】

アルケニル：2 から 8 個、好ましくは 2 から 6 個の炭素原子およびいずれかの位置の 1 個の二重結合を有する不飽和の直鎖もしくは分岐のヒドロカルビル基、例えばエテニル、

50

1-プロペニル、2-プロペニル、1-メチルエテニル、1-ブテニル、2-ブテニル、3-ブテニル、1-メチル-1-プロペニル、2-メチル-1-プロペニル、1-メチル-2-プロペニル、2-メチル-2-プロペニル、1-ペンテニル、2-ペンテニル、3-ペンテニル、4-ペンテニル、1-メチル-1-ブテニル、2-メチル-1-ブテニル、3-メチル-1-ブテニル、1-メチル-2-ブテニル、2-メチル-2-ブテニル、3-メチル-2-ブテニル、1-メチル-3-ブテニル、2-メチル-3-ブテニル、3-メチル-3-ブテニル、1, 1-ジメチル-2-プロペニル、1, 2-ジメチル-1-プロペニル、1, 2-ジメチル-2-プロペニル、1-エチル-1-プロペニル、1-エチル-2-プロペニル、1-ヘキセニル、2-ヘキセニル、3-ヘキセニル、4-ヘキセニル、5-ヘキセニル、1-メチル-1-ペンテニル、2-メチル-1-ペンテニル、3-メチル-1-ペンテニル、4-メチル-1-ペンテニル、1-メチル-2-ペンテニル、2-メチル-2-ペンテニル、3-メチル-2-ペンテニル、4-メチル-2-ペンテニル、1-メチル-3-ペンテニル、2-メチル-3-ペンテニル、3-メチル-3-ペンテニル、4-メチル-3-ペンテニル、1-メチル-4-ペンテニル、2-メチル-4-ペンテニル、3-メチル-4-ペンテニル、4-メチル-4-ペンテニル、1, 1-ジメチル-2-ブテニル、1, 1-ジメチル-3-ブテニル、1, 2-ジメチル-1-ブテニル、1, 2-ジメチル-2-ブテニル、1, 2-ジメチル-3-ブテニル、1, 3-ジメチル-1-ブテニル、1, 3-ジメチル-2-ブテニル、1, 3-ジメチル-3-ブテニル、2, 2-ジメチル-3-ブテニル、2, 3-ジメチル-1-ブテニル、2, 3-ジメチル-2-ブテニル、2, 3-ジメチル-3-ブテニル、3, 3-ジメチル-1-ブテニル、3, 3-ジメチル-2-ブテニル、1-エチル-1-ブテニル、1-エチル-2-ブテニル、1-エチル-3-ブテニル、2-エチル-1-ブテニル、2-エチル-2-ブテニル、2-エチル-3-ブテニル、1, 1, 2-トリメチル-2-プロペニル、1-エチル-1-メチル-2-プロペニル、1-エチル-2-メチル-1-プロペニルおよび1-エチル-2-メチル-2-プロペニルなどのC₂-C₆-アルケニル（これらに限定されるものではない）。この定義は、別段の定義がない限り、例えばハロアルケニルなどの複合置換基の一部としてのアルケニルにも適用される。

10

20

30

40

50

【0036】

アルキニル：2から8個、好ましくは2から6個の炭素原子およびいずれかの位置の1個の三重結合を有する直鎖もしくは分岐のヒドロカルビル基、例えばエチニル、1-プロピニル、2-プロピニル、1-ブチニル、2-ブチニル、3-ブチニル、1-メチル-2-プロピニル、1-ペンチニル、2-ペンチニル、3-ペンチニル、4-ペンチニル、1-メチル-2-ブチニル、1-メチル-3-ブチニル、2-メチル-3-ブチニル、3-メチル-1-ブチニル、1, 1-ジメチル-2-プロピニル、1-エチル-2-プロピニル、1-ヘキシニル、2-ヘキシニル、3-ヘキシニル、4-ヘキシニル、5-ヘキシニル、1-メチル-2-ペンチニル、1-メチル-3-ペンチニル、1-メチル-4-ペンチニル、2-メチル-3-ペンチニル、2-メチル-4-ペンチニル、3-メチル-1-ペンチニル、3-メチル-4-ペンチニル、4-メチル-1-ペンチニル、4-メチル-2-ペンチニル、1, 1-ジメチル-2-ブチニル、1, 1-ジメチル-3-ブチニル、1, 2-ジメチル-3-ブチニル、2, 2-ジメチル-3-ブチニル、3, 3-ジメチル-1-ブチニル、1-エチル-2-ブチニル、1-エチル-3-ブチニル、2-エチル-3-ブチニルおよび1-エチル-1-メチル-2-プロピニルなどのC₂-C₆-アルキニル（これらに限定されるものではない）。この定義は、別段の定義がない限り、例えばハロアルキニルなどの複合置換基の一部としてのアルキニルにも適用される。

【0037】

アルコキシ：1から8個、好ましくは1から6個、より好ましくは1から3個の炭素原子を有する飽和の直鎖もしくは分岐のアルコキシ基、例えばメトキシ、エトキシ、プロポキシ、1-メチルエトキシ、ブトキシ、1-メチルプロポキシ、2-メチルプロポキシ、1, 1-ジメチルエトキシ、ペントキシ、1-メチルブトキシ、2-メチルブトキシ、3-メチルブトキシ、2, 2-ジメチルプロポキシ、1-エチルプロポキシ、ヘキソキシ、

1, 1-ジメチルプロポキシ、1, 2-ジメチルプロポキシ、1-メチルペントキシ、2-メチルペントキシ、3-メチルペントキシ、4-メチルペントキシ、1, 1-ジメチルブトキシ、1, 2-ジメチルブトキシ、1, 3-ジメチルブトキシ、2, 2-ジメチルブトキシ、2, 3-ジメチルブトキシ、3, 3-ジメチルブトキシ、1-エチルブトキシ、2-エチルブトキシ、1, 1, 2-トリメチルプロポキシ、1, 2, 2-トリメチルプロポキシ、1-エチル-1-メチルプロポキシおよび1-エチル-2-メチルプロポキシなどのC₁-C₆-アルコキシ（これらに限定されるものではない）。この定義は、別段の定義がない限り、例えばハロアルコキシ、アルキニルアルコキシなどの複合置換基の一部としてのアルコキシにも適用される。

【0038】

アルキルチオ：1から8個、好ましくは1から6個、より好ましくは1から3個の炭素原子を有する飽和の直鎖もしくは分岐のアルキルチオ基、例えばメチルチオ、エチルチオ、プロピルチオ、1-メチルエチルチオ、ブチルチオ、1-メチルプロピルチオ、2-メチルプロピルチオ、1, 1-ジメチルエチルチオ、ペンチルチオ、1-メチルブチルチオ、2-メチルブチルチオ、3-メチルブチルチオ、2, 2-ジメチルプロピルチオ、1-エチルプロピルチオ、ヘキシルチオ、1, 1-ジメチルプロピルチオ、1, 2-ジメチルプロピルチオ、1-メチルペンチルチオ、2-メチルペンチルチオ、3-メチルペンチルチオ、4-メチルペンチルチオ、1, 1-ジメチルブチルチオ、1, 2-ジメチルブチルチオ、1, 3-ジメチルブチルチオ、2, 2-ジメチルブチルチオ、2, 3-ジメチルブチルチオ、3, 3-ジメチルブチルチオ、1-エチルブチルチオ、2-エチルブチルチオ、1, 1, 2-トリメチルプロピルチオ、1, 2, 2-トリメチルプロピルチオ、1-エチル-1-メチルプロピルチオおよび1-エチル-2-メチルプロピルチオなどのC₁-C₆-アルキルチオ（これらに限定されるものではない）。この定義は、別段の定義がない限り、例えばハロアルキルチオなどの複合置換基の一部としてのアルキルチオにも適用される。

【0039】

アルコキシカルボニル：1から6個、好ましくは1から3個の炭素原子を有し（具体的に記載のもの）、カルボニル基（-C=O-）を介して骨格に結合しているアルコキシ基。この定義は、別段の定義がない限り、例えばシクロアルキルアルコキシカルボニルなどの複合置換基の一部としてのアルコキシカルボニルにも適用される。

【0040】

アルキルスルフィニル：1から8個、好ましくは1から6個、より好ましくは1から3個の炭素原子を有する飽和の直鎖もしくは分岐のアルキルスルフィニル基、例えばメチルスルフィニル、エチルスルフィニル、プロピルスルフィニル、1-メチルエチルスルフィニル、ブチルスルフィニル、1-メチルプロピルスルフィニル、2-メチルプロピルスルフィニル、1, 1-ジメチルエチルスルフィニル、ペンチルスルフィニル、1-メチルブチルスルフィニル、2-メチルブチルスルフィニル、3-メチルブチルスルフィニル、2, 2-ジメチルプロピルスルフィニル、1-エチルプロピルスルフィニル、ヘキシルスルフィニル、1, 1-ジメチルプロピルスルフィニル、1, 2-ジメチルプロピルスルフィニル、1-メチルペンチルスルフィニル、2-メチルペンチルスルフィニル、3-メチルペンチルスルフィニル、4-メチルペンチルスルフィニル、1, 1-ジメチルブチルスルフィニル、1, 2-ジメチルブチルスルフィニル、1, 3-ジメチルブチルスルフィニル、2, 2-ジメチルブチルスルフィニル、2, 3-ジメチルブチルスルフィニル、3, 3-ジメチルブチルスルフィニル、1-エチルブチルスルフィニル、2-エチルブチルスルフィニル、1, 1, 2-トリメチルプロピルスルフィニル、1, 2, 2-トリメチルプロピルスルフィニル、1-エチル-1-メチルプロピルスルフィニルおよび1-エチル-2-メチルプロピルスルフィニルなどのC₁-C₆-アルキルスルフィニル（これらに限定されるものではない）。この定義は、別段の定義がない限り、例えばハロアルキルスルフィニルなどの複合置換基の一部としてのアルキルスルフィニルにも適用される。

【0041】

アルキルスルホニル：1から8個、好ましくは1から6個、より好ましくは1から3個の炭素原子を有する飽和の直鎖もしくは分岐のアルキルスルホニル基、例えばメチルスルホニル、エチルスルホニル、プロピルスルホニル、1-メチルエチルスルホニル、ブチルスルホニル、1-メチルプロピルスルホニル、2-メチルプロピルスルホニル、1, 1-ジメチルエチルスルホニル、ペンチルスルホニル、1-メチルブチルスルホニル、2-メチルブチルスルホニル、3-メチルブチルスルホニル、2, 2-ジメチルプロピルスルホニル、1-エチルプロピルスルホニル、ヘキシルスルホニル、1, 1-ジメチルプロピルスルホニル、1, 2-ジメチルプロピルスルホニル、1-メチルペンチルスルホニル、2-メチルペンチルスルホニル、3-メチルペンチルスルホニル、4-メチルペンチルスルホニル、1, 1-ジメチルブチルスルホニル、1, 2-ジメチルブチルスルホニル、1, 3-ジメチルブチルスルホニル、2, 2-ジメチルブチルスルホニル、2, 3-ジメチルブチルスルホニル、3, 3-ジメチルブチルスルホニル、1-エチルブチルスルホニル、2-エチルブチルスルホニル、1, 1, 2-トリメチルプロピルスルホニル、1, 2, 2-トリメチルプロピルスルホニル、1-エチル-1-メチルプロピルスルホニルおよび1-エチル-2-メチルプロピルスルホニルなどのC₁-C₆-アルキルスルホニル（これらに限定されるものではない）。この定義は、別段の定義がない限り、例えばアルキルスルホニルアルキルなどの複合置換基の一部としてのアルキルスルホニルにも適用される。

【0042】

シクロアルキル：3から10個、好ましくは3から8個、より好ましくは3から6個の炭素環員を有する単環式飽和ヒドロカルビル基、例えばシクロプロピル、シクロペンチルおよびシクロヘキシル（これらに限定されるものではない）。この定義は、別段の定義がない限り、例えばシクロアルキルアルキルなどの複合置換基の一部としてのシクロアルキルにも適用される。

【0043】

シクロアルケニル：3から10個、好ましくは3から8個、より好ましくは3から6個の炭素環員を有する単環式部分不飽和ヒドロカルビル基、例えばシクロプロペニル、シクロペンテニルおよびシクロヘキセニル（これらに限定されるものではない）。この定義は、別段の定義がない限り、例えばシクロアルケニルアルキルなどの複合置換基の一部としてのシクロアルケニルにも適用される。

【0044】

シクロアルコキシ：3から10個、好ましくは3から8個、より好ましくは3から6個の炭素環員を有する単環式飽和シクロアルキルオキシ基、例えばシクロプロピルオキシ、シクロペンチルオキシおよびシクロヘキシルオキシ（これらに限定されるものではない）。この定義は、別段の定義がない限り、例えばシクロアルコキシアルキルなどの複合置換基の一部としてのシクロアルコキシにも適用される。

【0045】

ハロアルキル：1から8個、好ましくは1から6個、より好ましくは1から3個の炭素原子を有する直鎖または分岐のアルキル基（上記で記載の通り）であって、それらの基における水素原子の一部または全てが上記で記載のようにハロゲン原子によって置き換わっていても良いもの、例えばクロロメチル、ブロモメチル、ジクロロメチル、トリクロロメチル、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロフルオロメチル、ジクロロフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、1-クロロエチル、1-ブロモエチル、1-フルオロエチル、2-フルオロエチル、2, 2-ジフルオロエチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、2-クロロ-2-フルオロエチル、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエチル、2, 2-ジクロロ-2-フルオロエチル、2, 2, 2-トリクロロエチル、ペンタフルオロエチルおよび1, 1, 1-トリフルオロプロプ-2-イルなどのC₁-C₃-ハロアルキル（これらに限定されるものではない）。この定義は、別段の定義がない限り、例えばハロアルキルアミノアルキルなどの複合置換基の一部としてのハロアルキルにも適用される。

【0046】

ハロアルケニルおよびハロアルキニルは、アルキル基ではなく、置換基の一部としてアルケニル基およびアルキニル基が存在する以外はハロアルキルと同様に定義される。

【0047】

ハロアルコキシ：1から8個、好ましくは1から6個、より好ましくは1から3個の炭素原子を有する直鎖または分岐のアルコキシ基（上記で記載のもの）であって、それらの基における水素原子の一部または全てが上記で記載のようにハロゲン原子によって置き換わっていても良いもの、例えばクロロメトキシ、ブロモメトキシ、ジクロロメトキシ、トリクロロメトキシ、フルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、クロロフルオロメトキシ、ジクロロフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、1-クロロエトキシ、1-ブロモエトキシ、1-フルオロエトキシ、2-フルオロエトキシ、2, 2-ジフルオロエトキシ、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ、2-クロロ-2-フルオロエトキシ、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエトキシ、2, 2-ジクロロ-2-フルオロエトキシ、2, 2, 2-トリクロロエトキシ、ペンタフルオロエトキシおよび1, 1, 1-トリフルオロプロプ-2-オキシなどの C_1-C_3 -ハロアルコキシ（これらに限定されるものではない）。この定義は、別段の定義がない限り、例えばハロアルコシアルキルなどの複合置換基の一部としてのハロアルコキシにも適用される。

10

【0048】

ハロアルキルチオ：1から8個、好ましくは1から6個、より好ましくは1から3個の炭素原子を有する直鎖または分岐のアルキルチオ基（上記で記載のもの）であって、それらの基における水素原子の一部または全てが上記で記載のようにハロゲン原子によって置き換わっていても良いもの、例えばクロロメチルチオ、ブロメチルチオ、ジクロロメチルチオ、トリクロロメチルチオ、フルオロメチルチオ、ジフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、クロロフルオロメチルチオ、ジクロロフルオロメチルチオ、クロロジフルオロメチルチオ、1-クロロエチルチオ、1-ブロモエチルチオ、1-フルオロエチルチオ、2-フルオロエチルチオ、2, 2-ジフルオロエチルチオ、2, 2, 2-トリフルオロエチルチオ、2-クロロ-2-フルオロエチルチオ、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエチルチオ、2, 2-ジクロロ-2-フルオロエチルチオ、2, 2, 2-トリクロロエチルチオ、ペンタフルオロエチルチオおよび1, 1, 1-トリフルオロプロプ-2-イルチオなどの C_1-C_3 -ハロアルキルチオ（これらに限定されるものではない）。この定義は、別段の定義がない限り、例えばハロアルキルチオアルキルなどの複合置換基の一部としてのハロアルキルチオにも適用される。

20

30

【0049】

ヘテロアリール：酸素、窒素および硫黄の群の1から4個のヘテロ原子を含む5もしくは6員の完全不飽和単環式環系；環が複数の酸素原子を含む場合、それらが直接隣接しないもの。

【0050】

1から4個の窒素原子または1から3個の窒素原子と1個の硫黄もしくは酸素原子を含む5員ヘテロアリール：環員として、炭素原子以外に、1から4個の窒素原子または1から3個の窒素原子と1個の硫黄もしくは酸素原子を含むことができる5員ヘテロアリール基、例えば2-フリル、3-フリル、2-チエニル、3-チエニル、2-ピロリル、3-ピロリル、3-イソオキサゾリル、4-イソオキサゾリル、5-イソオキサゾリル、3-イソチアゾリル、4-イソチアゾリル、5-イソチアゾリル、3-ピラゾリル、4-ピラゾリル、5-ピラゾリル、2-オキサゾリル、4-オキサゾリル、5-オキサゾリル、2-チアゾリル、4-チアゾリル、5-チアゾリル、2-イミダゾリル、4-イミダゾリル、1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル、1, 2, 4-オキサジアゾール-5-イル、1, 2, 4-チアジアゾール-3-イル、1, 2, 4-チアジアゾール-5-イル、1, 2, 4-トリアゾール-3-イル、1, 3, 4-オキサジアゾール-2-イル、1, 3, 4-チアジアゾール-2-イルおよび1, 3, 4-トリアゾール-2-イル（これらに限定されるものではない）。

40

【0051】

50

1 から 4 個の窒素原子を含む窒素結合 5 員ヘテロアリアル、または 1 から 3 個の窒素原子を含むベンゾ縮合した窒素結合 5 員ヘテロアリアル：環員として、炭素原子以外に、1 から 4 個の窒素原子または 1 から 3 個の窒素原子を含むことができ、2 個の隣接する炭素環員または 1 個の窒素と 1 個の隣接する炭素環員がブター 1, 3-ジエン-1, 4-ジイル基（1 個もしくは 2 個の炭素原子が窒素原子によって置き換わっていても良く、1 個もしくは 2 個の炭素原子が窒素原子によって置き換わっていても良い）によって架橋されていても良く、これらの環が窒素環員のうちの一つを介して骨格に結合している 5 員ヘテロアリアル基、例えば 1-ピロリル、1-ピラゾリル、1, 2, 4-トリアゾール-1-イル、1-イミダゾリル、1, 2, 3-トリアゾール-1-イルおよび 1, 3, 4-トリアゾール-1-イル（これらに限定されるものではない）。

10

【0052】

1 から 4 個の窒素原子を含む 6 員ヘテロアリアル：環員として、炭素原子以外に、それぞれ 1 から 3 個および 1 から 4 個の窒素原子を含むことができる 6 員ヘテロアリアル基、例えば 2-ピリジニル、3-ピリジニル、4-ピリジニル、3-ピリダジニル、4-ピリダジニル、2-ピリミジニル、4-ピリミジニル、5-ピリミジニル、2-ピラジニル、1, 3, 5-トリアジン-2-イル、1, 2, 4-トリアジン-3-イルおよび 1, 2, 4, 5-テトラジン-3-イル（これらに限定されるものではない）。

【0053】

1 から 3 個の窒素原子または 1 個の窒素原子と 1 個の酸素もしくは硫黄原子を含むベンゾ縮合 5 員ヘテロアリアル：例えばインドール-1-イル、インドール-2-イル、インドール-3-イル、インドール-4-イル、インドール-5-イル、インドール-6-イル、インドール-7-イル、ベンズイミダゾール-1-イル、ベンズイミダゾール-2-イル、ベンズイミダゾール-4-イル、ベンズイミダゾール-5-イル、インダゾール-1-イル、インダゾール-3-イル、インダゾール-4-イル、インダゾール-5-イル、インダゾール-6-イル、インダゾール-7-イル、インダゾール-2-イル、1-ベンゾフラン-2-イル、1-ベンゾフラン-3-イル、1-ベンゾフラン-4-イル、1-ベンゾフラン-5-イル、1-ベンゾフラン-6-イル、1-ベンゾフラン-7-イル、1-ベンゾチオフェン-2-イル、1-ベンゾチオフェン-3-イル、1-ベンゾチオフェン-4-イル、1-ベンゾチオフェン-5-イル、1-ベンゾチオフェン-6-イル、1-ベンゾチオフェン-7-イル、1, 3-ベンゾチアゾール-2-イル、1, 3-ベンゾチアゾール-4-イル、1, 3-ベンゾチアゾール-5-イル、1, 3-ベンゾチアゾール-6-イル、1, 3-ベンゾチアゾール-7-イル、1, 3-ベンゾキサゾール-2-イル、1, 3-ベンゾキサゾール-4-イル、1, 3-ベンゾキサゾール-5-イル、1, 3-ベンゾキサゾール-6-イルおよび 1, 3-ベンゾキサゾール-7-イル（これらに限定されるものではない）。

20

30

【0054】

1 から 3 個の窒素原子を含むベンゾ縮合 6 員ヘテロアリアル：例えばキノリン-2-イル、キノリン-3-イル、キノリン-4-イル、キノリン-5-イル、キノリン-6-イル、キノリン-7-イル、キノリン-8-イル、イソキノリン-1-イル、イソキノリン-3-イル、イソキノリン-4-イル、イソキノリン-5-イル、イソキノリン-6-イル、イソキノリン-7-イルおよびイソキノリン-8-イル（これらに限定されるものではない）。

40

【0055】

この定義は、別段の定義がない限り、例えばヘテロアリアルアルキルなどの複合置換基の一部としてのヘテロアリアルにも適用される。

【0056】

複素環：酸素、窒素および硫黄の群からの 1 から 4 個のヘテロ原子を含む 3 から 15 員、好ましくは 3 から 9 員の飽和または部分不飽和複素環：炭素環員以外に、1 から 3 個の窒素原子および／または 1 個の酸素もしくは硫黄原子または 1 個もしくは 2 個の酸素および／または硫黄原子を含む単環式、二環式もしくは三環式複素環；環が複数の酸素原子を

50

含む場合、これらは直接隣接することではなく；例えばオキシラニル、アジリジニル、2-テトラヒドロフラニル、3-テトラヒドロフラニル、2-テトラヒドロチエニル、3-テトラヒドロチエニル、2-ピロリジニル、3-ピロリジニル、3-イソオキサゾリジニル、4-イソオキサゾリジニル、5-イソオキサゾリジニル、3-イソチアゾリジニル、4-イソチアゾリジニル、5-イソチアゾリジニル、3-ピラゾリジニル、4-ピラゾリジニル、5-ピラゾリジニル、2-オキサゾリジニル、4-オキサゾリジニル、5-オキサゾリジニル、2-チアゾリジニル、4-チアゾリジニル、5-チアゾリジニル、2-イミダゾリジニル、4-イミダゾリジニル、1, 2, 4-オキサジアゾリジン-3-イル、1, 2, 4-オキサジアゾリジン-5-イル、1, 2, 4-チアジアゾリジン-3-イル、1, 2, 4-チアジアゾリジン-5-イル、1, 2, 4-トリアゾリジン-3-イル、1, 3, 4-オキサジアゾリジン-2-イル、1, 3, 4-チアジアゾリジン-2-イル、1, 3, 4-トリアゾリジン-2-イル、2, 3-ジヒドロフル-2-イル、2, 3-ジヒドロフル-3-イル、2, 4-ジヒドロフル-2-イル、2, 4-ジヒドロフル-3-イル、2, 3-ジヒドロチエン-2-イル、2, 3-ジヒドロチエン-3-イル、2, 4-ジヒドロチエン-2-イル、2, 4-ジヒドロチエン-3-イル、2-ピロリン-2-イル、2-ピロリン-3-イル、3-ピロリン-2-イル、3-ピロリン-3-イル、2-イソオキサゾリン-3-イル、3-イソオキサゾリン-3-イル、4-イソオキサゾリン-3-イル、2-イソオキサゾリン-4-イル、3-イソオキサゾリン-4-イル、4-イソオキサゾリン-4-イル、2-イソオキサゾリン-5-イル、3-イソオキサゾリン-5-イル、4-イソオキサゾリン-5-イル、2-イソチアゾリン-3-イル、3-イソチアゾリン-3-イル、4-イソチアゾリン-3-イル、2-イソチアゾリン-4-イル、3-イソチアゾリン-4-イル、4-イソチアゾリン-4-イル、2-イソチアゾリン-5-イル、3-イソチアゾリン-5-イル、4-イソチアゾリン-5-イル、2, 3-ジヒドロピラゾール-1-イル、2, 3-ジヒドロピラゾール-2-イル、2, 3-ジヒドロピラゾール-3-イル、2, 3-ジヒドロピラゾール-4-イル、2, 3-ジヒドロピラゾール-5-イル、3, 4-ジヒドロピラゾール-1-イル、3, 4-ジヒドロピラゾール-3-イル、3, 4-ジヒドロピラゾール-4-イル、3, 4-ジヒドロピラゾール-5-イル、4, 5-ジヒドロピラゾール-1-イル、4, 5-ジヒドロピラゾール-3-イル、4, 5-ジヒドロピラゾール-4-イル、4, 5-ジヒドロピラゾール-5-イル、2, 3-ジヒドロオキサゾール-2-イル、2, 3-ジヒドロオキサゾール-3-イル、2, 3-ジヒドロオキサゾール-4-イル、2, 3-ジヒドロオキサゾール-5-イル、3, 4-ジヒドロオキサゾール-2-イル、3, 4-ジヒドロオキサゾール-3-イル、3, 4-ジヒドロオキサゾール-4-イル、3, 4-ジヒドロオキサゾール-5-イル、3, 4-ジヒドロオキサゾール-2-イル、3, 4-ジヒドロオキサゾール-3-イル、3, 4-ジヒドロオキサゾール-4-イル、2-ピペリジニル、3-ピペリジニル、4-ピペリジニル、1, 3-ジオキサ-5-イル、2-テトラヒドロピラニル、4-テトラヒドロピラニル、2-テトラヒドロチエニル、3-ヘキサヒドロピリダジニル、4-ヘキサヒドロピリダジニル、2-ヘキサヒドロピリミジニル、4-ヘキサヒドロピリミジニル、5-ヘキサヒドロピリミジニル、2-ピペラジニル、1, 3, 5-ヘキサヒドロトリアジン-2-イルおよび1, 2, 4-ヘキサヒドロトリアジン-3-イルなど（これらに限定されるものではない）。この定義は、別段の定義がない限り、例えば複素環アルキルなどの複合置換基の一部としての複素環にも適用される。

【0057】

脱離基：S_N1またはS_N2脱離基、例えば塩素、臭素、ヨウ素、アルキルスルホネート（-OSO₂-アルキル、例えば-OSO₂CH₃、-OSO₂CF₃）またはアリールスルホネート（-OSO₂-アリール、例えば-OSO₂Ph、-OSO₂PhMe）。

【0058】

自然法則に反していることから、当業者がその専門的知識に基づいて除外すると考えられる組み合わせは含まれない。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

10

20

30

40

50

される。

【0059】

製造方法および中間体の説明

式(I)のヘテロアリアルピペリジンおよびピペラジン誘導体は、各種方法で製造することができる。最初に、実行可能な方法を下記に模式的に示している。別段の断りがない限り、基はそれぞれ上記で定義の通りである。

【0060】

式(I)の化合物を製造するための本発明による方法は、1以上の反応補助剤を用いて行っても良い。

【0061】

必要であれば、有用な反応補助剤は無機または有機の塩基または酸受容体である。これらには好ましくは、アルカリ金属またはアルカリ土類金属の酢酸塩、アミド、炭酸塩、重炭酸塩、水素化物、水酸化物またはアルコキシド、例えば酢酸ナトリウム、酢酸カリウムまたは酢酸カルシウム、リチウムアミド、ナトリウムアミド、カリウムアミドまたはカルシウムアミド、炭酸ナトリウム、炭酸カリウムまたは炭酸カルシウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウムまたは炭酸水素カルシウム、水素化リチウム、水素化ナトリウム、水素化カリウムまたは水素化カルシウム、水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウムまたは水酸化カルシウム、ナトリウムメトキシド、エトキシド、*n*-または*i*-プロポキシド、*n*-、*i*-、*s*-または*t*-ブトキシドまたはカリウムメトキシド、エトキシド、*n*-または*i*-プロポキシド、*n*-、*i*-、*s*-または*t*-ブトキシド；さらには塩基性有機窒素化合物、例えばトリメチルアミン、トリエチルアミン、トリプロピルアミン、トリブチルアミン、エチルジイソプロピルアミン、*N*，*N*-ジメチルシクロヘキシルアミン、ジシクロヘキシルアミン、エチルジシクロヘキシルアミン、*N*，*N*-ジメチルアニリン、*N*，*N*-ジメチルベンジルアミン、ピリジン、2-メチルー、3-メチルー、4-メチルー、2，4-ジメチルー、2，6-ジメチルー、3，4-ジメチルーおよび3，5-ジメチルピリジン、5-エチルー2-メチルピリジン、4-ジメチルアミノピリジン、*N*-メチルピペリジン、1，4-ジアザビシクロ[2.2.2]オクタン(DABCO)、1，5-ジアザビシクロ[4.3.0]ノン-5-エン(DBN)、または1，8-ジアザビシクロ[5.4.0]-ウンデクー7-エン(DBU)などがある。

【0062】

本発明による方法は、1以上の希釈液を用いて行っても良い。有用な希釈液には、実質的に全ての不活性有機溶媒などがある。それには好ましくは、ペンタン、ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン、石油エーテル、ベンジン、リグロイン、ベンゼン、トルエン、キシレン、塩化メチレン、塩化エチレン、クロロホルム、四塩化炭素、クロロベンゼンおよび*o*-ジクロロベンゼンなどの脂肪族および芳香族のハロゲン化されていても良い炭化水素、ジエチルエーテルおよびジブチルエーテル、グリコールジメチルエーテルおよびジグリコールジメチルエーテル、テトラヒドロフランおよびジオキサンなどのエーテル類、アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソプロピルケトンおよびメチルイソブチルケトンなどのケトン類、酢酸メチルおよび酢酸エチルなどのエステル類、例えばアセトニトリルおよびプロピオニトリルなどのニトリル類、例えばジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミドおよび*N*-メチルピロリドンなどのアミド類、さらにはジメチルスルホキシド、テトラメチレンスルホンおよびヘキサメチルホスホルアミドおよびDMPUなどがある。

【0063】

本発明による方法において、反応温度は、比較的広い範囲内で変動し得る。概して、用いられる温度は、0℃から250℃であり、好ましくは10℃から185℃の温度である。

【0064】

反応時間は、反応の規模および反応温度の関数として変動するが、通常は数分から48時間である。

【0065】

本発明による方法は、通常、標準圧で行う。しかしながら、高圧または減圧下で行うことも可能である。

【0066】

本発明による方法を行うため、各場合に必要な原料は、通常はほぼ等モル量で用いる。しかしながら、各場合において比較的大過剰で、構成成分の一つを用いることも可能である。

【0067】

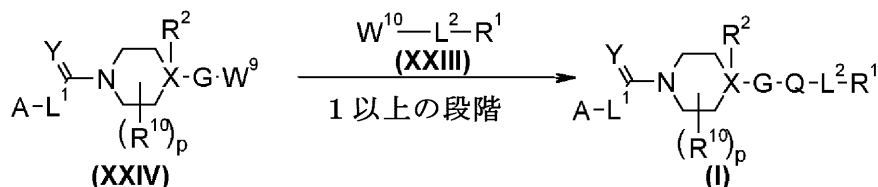
方法 A

図式 1：方法 A

【0068】

10

【化 7】



W⁹ および W¹⁰ は、所望の複素環の形成に好適な官能基であり、記号 A、G、Y、X、p、L¹、L²、R¹、R² および R¹⁰ はそれぞれ本記載で定義の通りである。

20

【0069】

概して、好適な官能基 W⁹ および W¹⁰ (I) を有する相当する化合物 (XXIII) および (XXIV) から式 (I) の化合物を製造することが可能である (図式 1 方法 A を参照)。W⁹ および W¹⁰ についての可能な官能基は、例えばアルデヒド類、ケトン類、エステル類、カルボン酸類、アミド類、チオアミド類、ニトリル類、アルコール類、チオール類、ヒドラジン類、オキシム類、アミジン類、アミドオキシム類、オレフィン類、アセチレン類、ハライド類、アルキルハライド類、メタンスルホネート類、トリフルオロメタンスルホネート類、ボロン酸類またはボロン酸エステル類であり、それらは好適な反応条件下で所望の複素環 Q を形成することができる。複素環製造については文献法が多くある (WO 2008/013622; Comprehensive Heterocyclic Chemistry Vol. 4-6, A. R. Katritzky and C. W. Rees 編者, Pergamon Press, New York, 1984; Comprehensive Heterocyclic Chemistry II, Vol. 2-4, A. R. Katritzky, C. W. Rees and E. F. Scriven 編者, Pergamon Press, New York, 1996; The Chemistry of Heterocyclic Compounds, E. C. Taylor 編者, Wiley, New York; Rodd's Chemistry of Carbon Compounds, Vol. 2-4, Elsevier, New York; Synthesis, 1982, 6, 508-509; Tetrahedron, 2000, 56, 1057-1094、ならびにこれらで引用の文献を参照)。

30

40

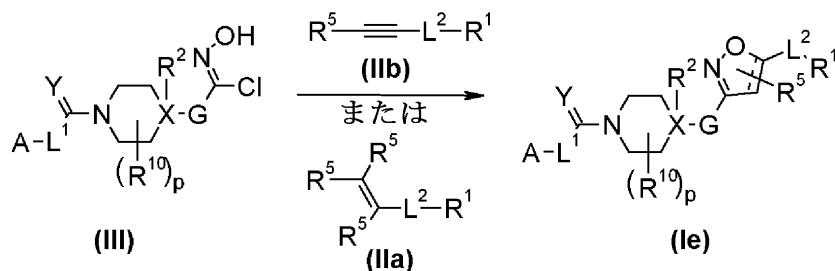
【0070】

方法 B

図式 2：方法 B

【0071】

【化 8】



記号 A、G、X、Y、p、L¹、L²、R¹、R²、R⁵ および R¹⁰ はそれぞれ本説明で定義の通りである。 10

【0072】

化合物 (IIa) または (IIb) との反応による相当する化合物 (III) からの式 (Ie) の化合物製造の特定の手段を図式 2 に示してある。

【0073】

アルケンおよびアルキンである (IIa) および (IIb) は市販されているか、文献に記載の方法によって市販の前駆体から製造することができる (例えばウィティッヒまたはホーナー・ワズワース・エモンズオレフィン化 (Chem. Rev. 1989, 89, 863-927) およびジュリアオレフィン化 (Tetrahedron Lett., 1973, 14, 4833-4836)、ピーターソンオレフィン化 (J. Org. Chem. 1968, 33, 780) によって、ベストマン-大平試薬 (Synthesis 2004, 1, 59-62) を用いて、ケトン類またはアルデヒド類から)。 20

【0074】

一般式 (Ie) の化合物は、一般式 (IIa) のアルケンから、または式 (IIb) のアルキンおよび化合物 (III) から環状付加反応によって得られる (例えば、WO 08/013622 および Synthesis, 1987, 11, 998-1001 参照)。

【0075】

方法 B は、好適な塩基の存在下に行う。好ましい塩基は、三級アミン類 (例えばトリエチルアミン)、およびアルカリ金属またはアルカリ土類金属の炭酸塩、重炭酸塩およびリン酸塩である。 30

【0076】

方法 B は好ましくは、1 以上の希釈剤を用いて行う。方法 B の実施において、不活性有機溶媒 (例えばトルエンおよびヘキサン) が好ましい選択肢である。水も同様に可能な溶媒である。あるいは、方法 A は、過剰のアルケン (IIa) またはアルキン (IIb) 中で行うことができる。

【0077】

後処理は一般的な方法によって行う。必要な場合、化合物は再結晶またはクロマトグラフィーによって精製するか、事前に精製せずに次の段階で用いても良い。 40

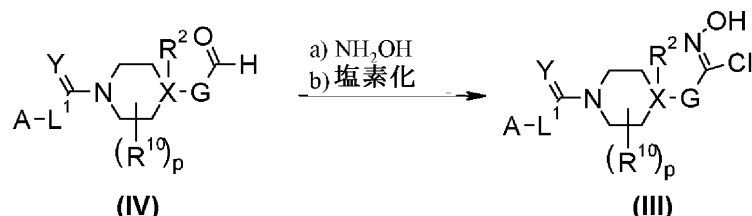
【0078】

方法 C

図式 3：方法 C

【0079】

【化 9】



記号 A、G、Y、X、p、L¹、R¹、R²、R⁵ および R¹⁰ はそれぞれ、本説明で定義の通りである。

10

【0080】

化合物 (IV) から中間体 (III) を製造する一つの手段を図式 3 に示してある (方法 C)。

【0081】

一般式 (III) の化合物は、式 (IV) のアルデヒドのヒドロキシルアミンとの縮合およびその後の塩素化によって得られる (例えば、WO 05/0040159、WO 08/013622 および Synthesis, 1987, 11, 998-1001 参照)。

【0082】

方法 C では、アルデヒド (IV) およびヒドロキシルアミンを最初に反応させる (図式 4、段階 (a))。次に、好適な塩素化剤の存在下に相当するオキシムを塩素化する。好ましい塩素化試薬は N-クロロコハク酸イミド、HClO および塩素である。方法 C の段階 (a) の後、反応混合物を一般的な方法によって後処理することができるか、段階 (b) で直接さらに変換することができる。

20

【0083】

方法 C は好ましくは、1 以上の希釈剤を用いて行う。本発明による方法の段階 (a) では、溶媒としてプロトン性溶媒、例えばエタノールを用いることができる。化合物 (IV) からの相当するオキシムの生成後、段階 (b) において、さらなる溶媒、例えばテトラヒドロフランで反応混合物を希釈し、次に、次亜塩素酸ナトリウム水溶液を加える。塩素化は同様に、DMF 中にて N-クロロコハク酸イミドを用いて行うことができる。

30

【0084】

後処理は一般的な方法によって行う。必要に応じて、化合物は再結晶またはクロマトグラフィーによって精製するか、事前に精製せずに次の段階に用いても良い。

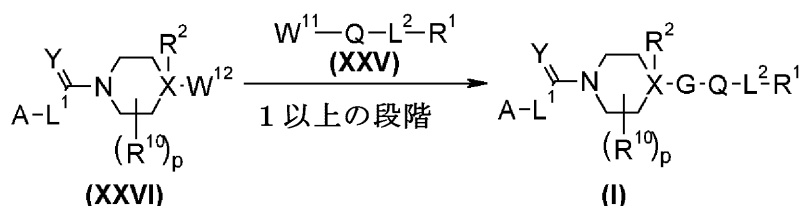
【0085】

方法 D

図式 4：方法 D

【0086】

【化 10】



40

W¹¹ および W¹² はそれぞれ所望の複素環の形成に好適な官能基であり、記号 A、G、Q、Y、p、L¹、L²、R¹、R²、R⁵ および R¹⁰ はそれぞれ、本説明で定義の通りである。

【0087】

概して、好適な官能基 W¹¹ および W¹² (I) を有する相当する化合物 (XXVI)

50

および (X X V) から式 (I) の中間体を製造することができる (図式 4、方法 D を参照)。W^{1 1} および W^{1 2} についての可能な官能基は、例えばアルデヒド類、ケトン類、エステル類、カルボン酸類、アミド類、チオアミド類、ニトリル類、アルコール類、チオール類、ヒドラジン類、オキシム類、アミジン類、アミドオキシム類、オレフィン類、アセチレン類、ハライド類、アルキルハライド類、メタンスルホネート類、トリフルオロメタンスルホネート類、ホウ酸、ボロン酸エステルなどである。それらは、好適な反応条件下に所望の 5 員複素環 G を形成することができる。複素環の製造については多くの文献法がある (WO 2008/013622; Comprehensive Heterocyclic Chemistry Vol. 4-6, 編者: A. R. Katritzky and C. W. Rees, Pergamon Press, New York, 1984; Comprehensive Heterocyclic Chemistry II, Vol. 2-4, 編者: A. R. Katritzky, C. W. Rees and E. F. Scriven, Pergamon Press, New York, 1996; The Chemistry of Heterocyclic Compounds, 編者: E. C. Taylor, Wiley, New York; Rodd's Chemistry of Carbon Compounds, Vol. 2-4, Elsevier, New York を参照)。

10

【0088】

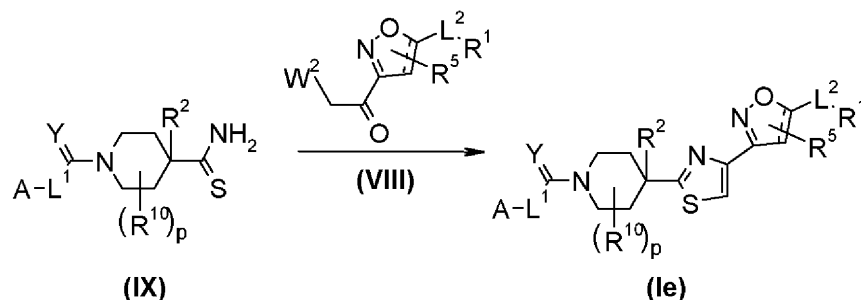
方法 E

図式 5: 方法 E

20

【0089】

【化 11】



30

W² は脱離基であり、記号 A、Y、p、L¹、L²、R¹、R²、R⁵ および R¹⁰ はそれぞれ、本説明で定義の通りである。

【0090】

化合物 (V I I I) を用いて化合物 (I X) から式 (I e) の化合物を合成する特定の手段を図式 5 に示してある (方法 E)。

【0091】

チオカルボキサミド (I X) は、文献から公知の方法によって、例えばローソン試薬を用いることで、例えば市販の相当するカルボキサミドをチオ化することによって得ることができる (WO 2008/013622、Org. Synth. Vol. 7, 1990, 372)。

40

【0092】

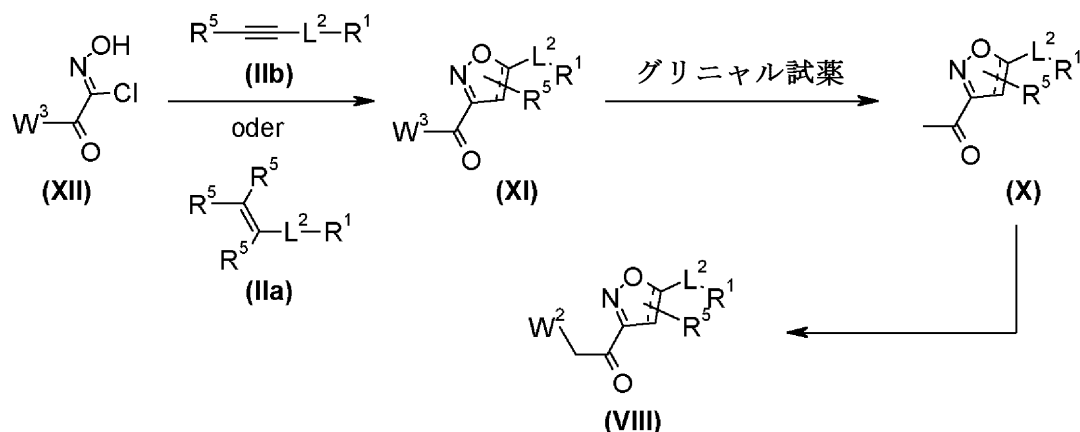
α-ハロケトンまたは脱離基を有する相当するケトン (例えば、トルエンスルホニルオキシケトン類) は、文献から公知の方法によって得ることもできる (例えば、WO 2008/013622 参照) (図式 6)。

【0093】

図式 6

【0094】

【化 1 2】



10

W² は脱離基であり、W³ はN、N-ジメチルアミノ、N-メトキシ-N-メチルアミノまたはモルホリン-1-イルであり、記号L²、R¹、R²およびR⁵はそれぞれ、本説明で定義の通りである。

【0095】

チアゾール (I e) は、ハンチチアゾール合成によって、チオカルボキサミド (I X) およびα-ハロケトンまたは脱離基を有する相当するケトン (V I I I) から得られる (例えば、"Comprehensive Heterocyclic Chemistry", Pergamon Press, 1984; vol. 6, pages 235-363, "Comprehensive Heterocyclic Chemistry II", Pergamon Press, 1996; vol. 3, pages 373-474およびそれらに引用の参考文献、ならびにWO 07/014290を参照)。

20

【0096】

方法Eは好ましくは、1以上の希釈剤を用いて行う。方法Eの実施において、不活性有機溶媒が好ましい選択肢である (例えばN、N-ジメチルホルムアミドおよびエタノール)。

【0097】

適切であれば、補助塩基を用い、例えばトリエチルアミンである。

30

【0098】

必要に応じて、化合物は再結晶またはクロマトグラフィーによって精製されるか、事前の精製を行わずに次の段階で用いても良い。

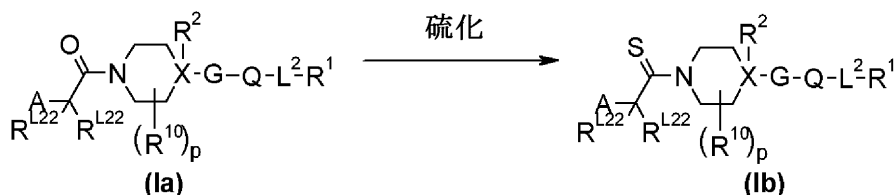
【0099】

方法F

図式7：方法F

【0100】

【化 1 3】



40

記号A、Q、G、L²、p、R¹、R²、R^{L 2 2}およびR^{1 0}はそれぞれ、本説明で定義の通りである。

【0101】

本発明による方法Gの実施で得られるアミド (I a) (図式8) は、文献に記載の方法によって相当するチオアミド (I b) に変換することができる (例えば、Bioorga

50

nic & Medicinal Chemistry Letters, 2009, 19 (2), 462-468)。この方法では、式 (I a) の化合物を代表的には五硫化リンまたは 2, 4-ビス (4-メトキシフェニル) -1, 3-ジチア-2, 4-ジホスフェタン 2, 4-ジスルフィド (ローソン試薬) と反応させる (図式 7、方法 F 参照)。

【0102】

本発明による方法 F は好ましくは、1 以上の希釈剤を用いて行う。好ましい溶媒はトルエン、テトラヒドロフランおよび 1, 2-ジメトキシエタンである。

【0103】

反応終了後、一般的な分離技術の一つによって、化合物 (I b) を反応混合物から分離する。必要に応じて、化合物を再結晶またはクロマトグラフィーによって精製する。

10

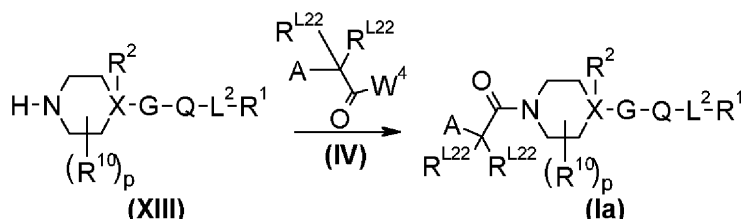
【0104】

方法 G

図式 8：方法 G

【0105】

【化 14】



20

$W^4 = OH$ または Cl であり、記号 A、Q、G、 L^2 、p、 R^1 、 R^2 、 R^{L22} および R^{10} はそれぞれ、本説明で定義の通りである。

【0106】

化合物 (IV) を用いて相当する化合物 (XIII) から式 (I a) の化合物を製造する一つの手段を図式 8 に示してある (方法 G)。

【0107】

化合物 (IV) は市販されているか、文献に記載の方法によって製造することができる (例えば、WO 2008/013622 および WO 2008/013925 を参照)。

30

【0108】

一般式 (I a) を有する化合物は、相当する一般式 (XIII) を有する化合物を W^4 が塩素である一般式 (IV) の基質と、適宜に酸捕捉剤/塩基の存在下にカップリング反応させることで、文献に記載の方法と同様にして合成することができる (例えば WO 2007/147336 参照)。

【0109】

一般式 (XIII) の原料に対して、少なくとも 1 当量の酸捕捉剤/塩基 (例えばヒューニッヒ塩基、トリエチルアミンまたは市販のポリマー酸捕捉剤) を用いる。原料が塩である場合、少なくとも 2 当量の酸捕捉剤が必要である。

40

【0110】

あるいは、式 (I a) の化合物は、文献に記載の方法と同様にして、カップリング試薬の存在下に、 W^4 がヒドロキシルである式 (IV) の基質を用いて式 (XIII) の相当する化合物から合成することもできる (例えば、Tetrahedron, 2005, 61, 10827-10852 およびそこに引用の参考文献)。

【0111】

好適なカップリング試薬は例えば、ペプチドカップリング試薬である (例えば、4-ジメチルアミノピリジンと混合した N-(3-ジメチルアミノプロピル)-N'-エチルカルボジイミド、1-ヒドロキシベンゾトリアゾールと混合した N-(3-ジメチルアミノ

50

プロピル) - N' - エチルカルボジイミド、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、O - (7 - アザベンゾトリアゾール - 1 - イル) - N, N, N', N' - テトラメチルウロニウム・ヘキサフルオロホスフェート)。

【0112】

反応終了後、化合物 (I a) は、一般的な分離技術の一つによって反応混合物から分離される。必要に応じて、その化合物は、再結晶またはクロマトグラフィーによって精製する。

【0113】

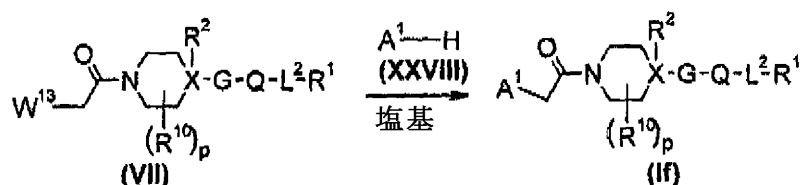
方法 H

図式 9：方法 H

10

【0114】

【化15】



A¹ は、4 個以下の置換基を含むことができる 5 員ヘテロアリールであり、炭素上の置換基はそれぞれ独立に Z^{A-2} から選択され、A¹ - H における水素は窒素原子を介して結合しており、W¹³ = 脱離基であり、記号 A¹、Q、G、L²、p、R¹、R²、R⁵ および R¹⁰ はそれぞれ、本説明で定義の通りである。

20

【0115】

化合物 (XXVII) を用いて相当する化合物 (VII) から式 (If) の化合物を製造する一つの手段を、図式 9 に示してある (方法 H)。

【0116】

W¹³ が脱離基である原料 (VII) は、化合物 (V)、(XVIIe) から (図 1) または (XIII) から文献に記載の方法によって製造することができる (例えば、メシル化: Organic Letters, 2003, 2539-2541; トシル化: JP60156601; ハロゲン化: Australian Journal of Chemistry, 1983, 2095-2110 参照)。代表的には、式 (VII) の化合物 (W¹³ = 塩素) は、式 (XIII) のアミンおよびクロロアセチルクロライドを原料として製造する。(図 1) における化合物 (V) は、グリコール酸または (XIII) からのヒドロキシアセチルクロライドを用いて方法 G と同様にして製造される (例えば、WO2007103187、WO 2006117521、Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters, 2007, 6326-6329 を参照)。

30

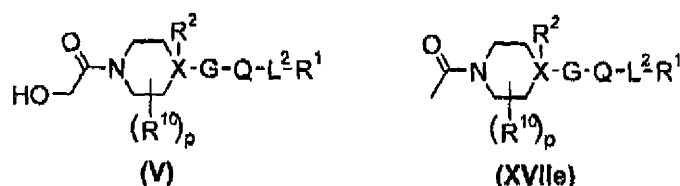
【0117】

図 1

【0118】

40

【化16】



記号 Q、G、L²、p、R¹、R²、R⁵ および R¹⁰ はそれぞれ、本説明で定義の通りである。

【0119】

50

一般式 (X X V I I I) の原料に対して少なくとも 1 当量の塩基 (例えば、水素化ナトリウム、炭酸カリウム) を用いる。

【0120】

反応終了後、化合物 (I f) を、一般的な分離技術の一つによって反応混合物から分離する。必要に応じて、その化合物は、再結晶またはクロマトグラフィーによって精製するか、事前の精製を行わずに次の段階で用いても良い。

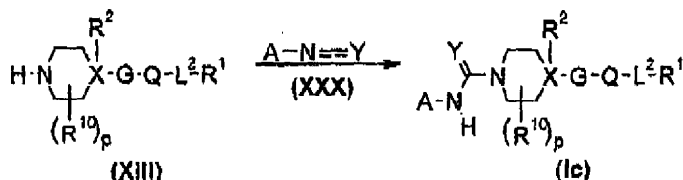
【0121】

方法 I

図式 10 : 方法 I

【0122】

【化 17】



10

記号 A、Q、G、Y、L²、p、R¹、R²、R⁵ および R¹⁰ はそれぞれ、本説明で定義の通りである。

【0123】

化合物 (X X X) を用いて相当する化合物 (X I I I) から式 (I c) の化合物を製造する一つの手段を図式 10 に示してある (方法 I)。

20

【0124】

一般式 (I c) を有する化合物は、文献に記載の方法と同様にして、適宜に酸捕捉剤/塩基、例えばトリエチルアミン、1, 8-ジアザビシクロ [5. 4. 0] ウンデクー 7-エンまたはヒューニッヒ塩基の存在下に、一般式 (X X X) の基質との相当する一般式 (X I I I) を有する化合物のカップリング反応によって合成することができる (例えば W O 2009/055514 を参照)。

【0125】

反応終了後、化合物 (I c) を、一般的な分離技術の一つによって反応混合物から分離する。必要に応じて、その化合物は、再結晶またはクロマトグラフィーによって精製する。

30

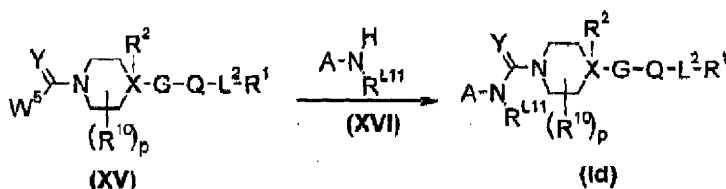
【0126】

方法 J

図式 11 : 方法 J

【0127】

【化 18】



40

W⁵ は塩素またはイミダゾール-1-イルであり、記号 A、G、Q、Y、L²、p、R¹、R²、R^{L11} および R¹⁰ はそれぞれ、本説明で定義の通りである。

【0128】

化合物 (X V I) を用いて相当する化合物 (X V a、図 2 参照) または (X V b、図 2 参照) から式 (I d) の化合物を製造する一つの手段 (を図式 11 に示してある (方法 J))。

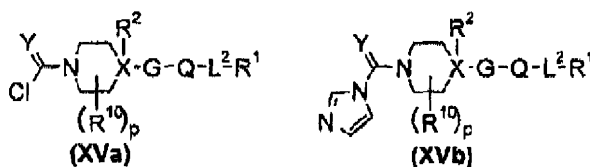
【0129】

図 2

50

【0130】

【化19】



記号Q、G、L²、p、R¹、R²、R⁵およびR¹⁰はそれぞれ、本説明で定義の通りである。

【0131】

10

原料である式(XVa)のカルバモイルおよびチオカルバモイルクロライドは、化合物(XIII)から文献に記載の方法によって製造することができる(例えば、Tetrahedron, 2008, 7605; Journal of Organic Chemistry, 2004, 3787; Journal of Organic Chemistry, 1983, 4750; European Journal of Organic Chemistry, 2006, 1177参照)。代表的には、式(XVa)の化合物は、式(XIII)のアミンとホスゲン、チオホスゲンもしくはそれらの等価物を原料として製造される。

【0132】

20

代替の原料である式(XVb)のカルバモイルおよびチオカルバモイルイミダゾールは、文献に記載の方法によって製造することができる(例えば、Tetrahedron Letters, 2008, 5279; Tetrahedron, 2005, 7153参照)。代表的には、式(XVb、W⁵=イミダゾール-1-イル)の化合物は、式(XIII)のアミンおよび1, 1'-カルボニルジイミダゾールまたは1, 1'-チオカルボニルジイミダゾールを原料として製造される。

【0133】

方法Jは、好適な酸受容体の存在下に行っても良い。

【0134】

30

本発明による方法Jの実施で得られる化合物(Id)はあるいは、場合によって、酸受容体を用いずに、相当する酸塩化物[(Id)-HCl]として得ることもできる。必要に応じて、化合物(Id)は一般的な方法によって遊離される。

【0135】

反応終了後、化合物(Id)を、一般的な分離技術の一つによって反応混合物から分離する。必要に応じて、その化合物を再結晶またはクロマトグラフィーによって精製する。

【0136】

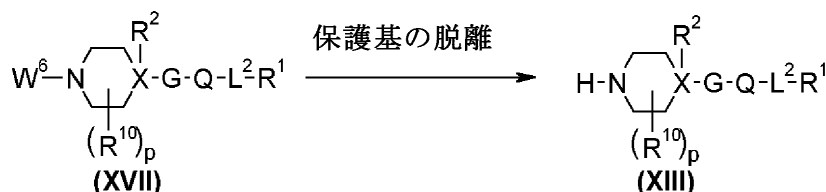
方法K

図式12：方法K

【0137】

【化20】

40



W⁶はアセチル、C₁-C₄-アルコシカルボニル、ベンジルまたはベンジルオシカルボニルであり、記号Q、L²、p、R¹、R²およびR¹⁰はそれぞれ、本説明で定義の通りである。

【0138】

相当する化合物(XVII)から式(XIII)の化合物を製造する一つの手段を図式

50

12に示してある（方法K）。

【0139】

式（XVII）の化合物は、文献に記載の保護基脱離についての好適な方法によって、式（XIII）の化合物に変換する（"Protective Groups in Organic Synthesis"; Theodora W. Greene, Peter G. M. Wuts; Wiley-Interscience: Third Edition; 1999, 494-653）。

【0140】

tert-ブトキシカルボニルおよびベンジルオキシカルボニル保護基は、酸性媒体中で脱離させることができる（例えば、塩酸またはトリフルオロ酢酸で）。アセチル保護基は、塩基性条件下で脱離させることができる（例えば炭酸カリウムまたは炭酸セシウム）。ベンジル保護基は、触媒（例えばパラジウム／活性炭）の存在下に水素で水素化分解的に脱離させることができる。

【0141】

このtert-ブトキシカルボニルおよびベンジルオキシカルボニル基の脱保護の反応に用いることができる酸は、例えばトリフルオロ酢酸、塩酸または文献（例えば"Protective Groups in Organic Synthesis"; Theodora W. Greene, Peter G. M. Wuts; Wiley-Interscience; Third Edition; 1999; 494-653）に記載の他の酸である。

【0142】

反応終了後、化合物（XIII）を、一般的な分離技術の一つによって反応混合物から分離する。必要に応じて、その化合物は再結晶またはクロマトグラフィーによって精製するか、所望に応じて、事前の精製を行わずに次の段階で用いることもできる。一般式（XIII）の化合物を塩として、例えば塩酸塩またはトリフルオロ酢酸塩として単離することも可能である。

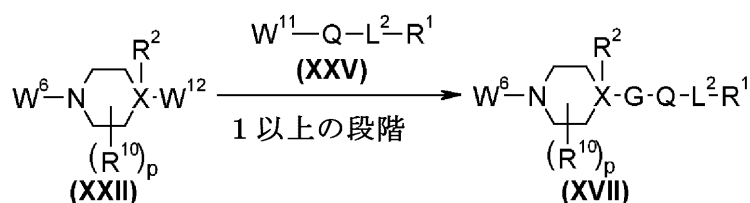
【0143】

方法L

図式13：方法L

【0144】

【化21】



W⁶はアセチル、C₁－C₄－アルコキシカルボニル、ベンジルまたはベンジルオキシカルボニルであり、W¹¹およびW¹²は、所望の複素環の形成に好適な官能基であり、記号Q、L²、p、R¹、R²およびR¹⁰はそれぞれ、本説明で定義の通りである。

【0145】

概して、化合物（XXV）を用いて相当する化合物（XXII）から中間体（XVII）を製造することが可能である。方法L（図式13）は、方法Dと同様にして行う（図式4）。

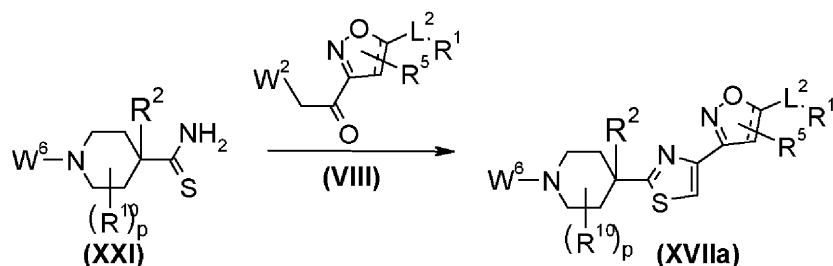
【0146】

方法M

図式14：方法M

【0147】

【化 2 2】



W² は脱離基であり、W⁶ はアセチル、C₁ - C₄ - アルコキシカルボニル、ベンジルまたはベンジルオキシカルボニルであり、記号 L²、p、R¹、R²、R⁵ および R¹⁰ はそれぞれ、本説明で定義の通りである。

10

【0148】

相当する化合物 (XXI) から式 (XVIIa) の中間体を製造する別の手段を図式 14 に示してある (方法 M)。化合物 (XXI) は市販されているか、文献に記載の方法によって製造することができる (例えば、WO 2008/013622 および WO 2007/014290 参照)。方法 M は、方法 E と同様にして行う (図式 5)。

【0149】

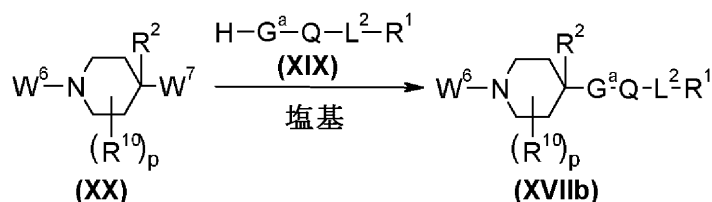
方法 N

図式 15：方法 N

20

【0150】

【化 2 3】



G^a は 5 員ヘテロアリアルであり；式 (XVIIb) の化合物では、その 5 員ヘテロアリアルは窒素原子を介してピペリジン基に結合しており、W⁶ はアセチル、C₁ - C₄ - アルコキシカルボニル、ベンジルまたはベンジルオキシカルボニルであり、W⁷ は脱離基であり、記号 Q、L²、p、R¹、R² および R¹⁰ はそれぞれ、本説明で定義の通りである。

30

【0151】

一般式 (XVIIb) を有する化合物は、適宜に塩基の存在下に相当する一般式 (XX) を有する化合物の一般式 (XIX) の基質とのカップリング反応により、文献に記載の方法と同様にして合成することができる (図式 15、方法 N) (例えば、Zn/Pd カップリングの場合：WO 2008/147831、WO 2006/106423 (ピリジン)、Shakespeare, W. C. et al Chem. Biol.

40

Drug Design 2008, 71, 97-105 (ピリジン誘導体)、Pasternak, A. et al Bioorg. Med. Chem. Lett. 2008, 18, 994-998 (ジアジン類)；Coleridge, B. M.；Bello, C. S.；Leitner, A. Tetrahedron Lett. 2009, 50, 4475-4477；Bach, T., Heuser, S. Angew. Chem. Int. Ed. 2001, 40, 3184-3185 (チアゾール類)；求核置換の場合：WO 2008/104077；WO 2006/084015 (N-置換を有するピラゾール) を参照)。

【0152】

一般式 (XX) の原料に対して、少なくとも 1 当量の塩基 (例えば、水素化ナトリウム

50

、炭酸カリウム）を用いる。

【0153】

反応終了後、化合物（XVIIb）を、一般的な分離技術の一つによって反応混合物から分離する。必要に応じて、その化合物を再結晶またはクロマトグラフィーによって精製するか、所望に応じて、やはり事前の精製を行わずに次の段階で用いることができる。

【0154】

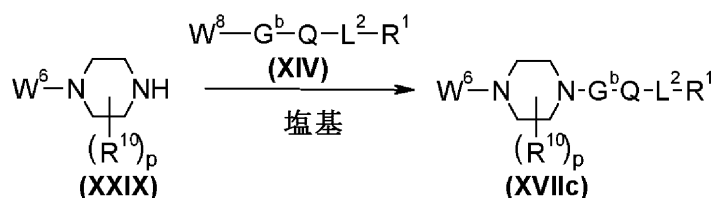
方法O

図式16：方法O

【0155】

【化24】

10



G^bは5員ヘテロアリアルであり；式（XVIIc）の化合物では、その5員ヘテロアリアルは炭素原子を介してピペラジン基に結合しており、W⁶はアセチル、C₁－C₄－アルコキシカルボニル、ベンジルまたはベンジロキシカルボニルであり、W⁸は脱離基であり、記号Q、L²、p、R¹およびR¹⁰はそれぞれ、本説明で定義の通りである。

20

【0156】

一般式（XVIIc）を有する化合物は、適宜に塩基の存在下に相当する一般式（XXIX）を有する化合物の一般式（XIV）の基質とのカップリング反応により（図式16、方法O）、文献に記載の方法と同様にして合成することができる（例えば、求核置換の場合：Li, C. S., Belair, L., Guay, J. et al Bioorg. Med. Chem. Lett. 2009, 19, 5214-5217; WO2008/062276; for copper couplings: Yeh, V. S. C.; Wiedeman, P. E. Tetrahedron Lett. 2006, 47, 6011-6016; パラジウムカップリングの場合：WO2008/157500を参照）。

30

【0157】

一般式（XXIX）の原料に対して少なくとも1当量の塩基（例えば、水素化ナトリウム、炭酸カリウム）を用いる。

【0158】

反応終了後、化合物（XVIIc）を、一般的な分離技術の一つによって反応混合物から分離する。必要に応じて、その化合物は再結晶またはクロマトグラフィーによって精製するか、所望に応じて、やはり事前の精製を行わずに次の段階で用いることもできる。

【0159】

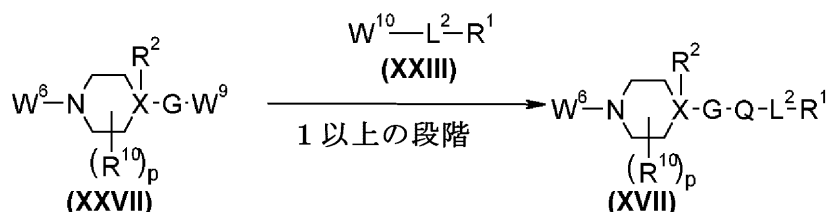
方法P

図式17：方法P

40

【0160】

【化25】



W⁶はアセチル、C₁－C₄－アルコキシカルボニル、ベンジルまたはベンジロキシカルボニルであり、W⁹およびW¹⁰は、上記で定義の所望の複素環の形成に好適な官能

50

基であり、記号 Q 、 L^2 、 G 、 p 、 R^1 、 R^2 および R^{10} はそれぞれ、本説明で定義の通りである。

【0161】

概して、相当する化合物 (XXVII) および (XXIII) から中間体 (XVII) を製造することが可能である。方法 P (図式 17) は、方法 A と同様にして行う (図式 1)。

【0162】

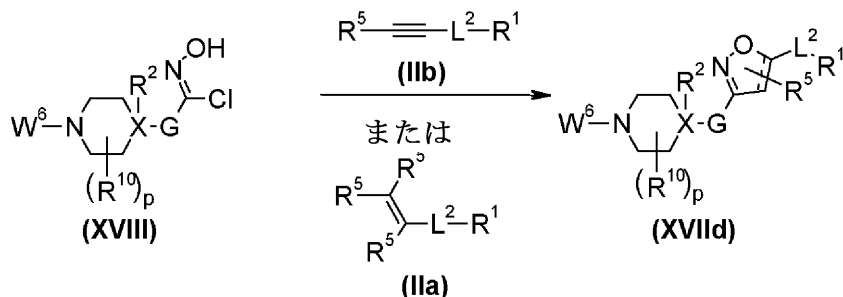
方法 Q

図式 18 : 方法 Q

【0163】

【化 26】

10



W^6 は、アセチル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシカルボニル、ベンジルまたはベンジロキシカルボニルであり、記号 X 、 L^2 、 G 、 p 、 R^1 、 R^2 、 R^5 および R^{10} はそれぞれ、本説明で定義の通りである。

20

【0164】

相当する化合物 (XVIIII) から中間体 (XVIIId) を製造する特定の手段を図式 18 に示してある (方法 Q)。式 (XVIIII) の原料は、文献に記載の方法によって製造することができ (例えば、WO 2008/013622 参照)、方法 Q は方法 B と同様にして行う (図式 2)。

【0165】

本発明はさらに、望ましくない微生物の防除のための、本発明の式 (I) のヘテロアリールピペリジンおよびピペラジン誘導体の非医療的使用を提供する。

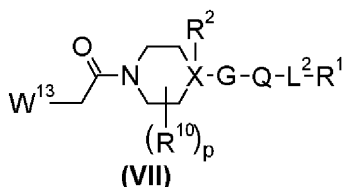
30

【0166】

下記式 (VII) の化合物：

【0167】

【化 27】



40

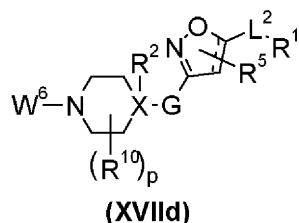
ならびにその塩、金属錯体および N-オキサイドは新規化合物である (記号 R^2 、 X 、 G 、 Q 、 L^2 、 R^1 、 R^{10} および p はそれぞれ上記で記載の一般的、好ましい、より好ましいまたは最も好ましい定義を有し、 W^{13} は脱離基である。)。

【0168】

下記式 (XVIIId) の化合物：

【0169】

【化 2 8】

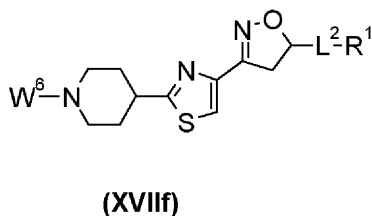


例えば (XVIIIf) の化合物：

【0170】

【化 2 9】

10



ならびにその金属錯体およびN-オキサイド（記号 W^6 はアセチル、 C_1-C_4 -アルコキシカルボニル、ベンジルまたはベンジロキシカルボニルであり、 X 、 L^2 、 p 、 R^1 、 R^2 、 R^5 および R^{10} 基はそれぞれ上記で記載の一般的、好ましい、より好ましいまたは最も好ましい定義を有する。）は新規化合物である。

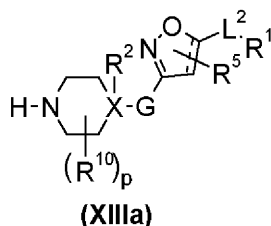
20

【0171】

下記式 (XIIIa) の化合物：

【0172】

【化 3 0】

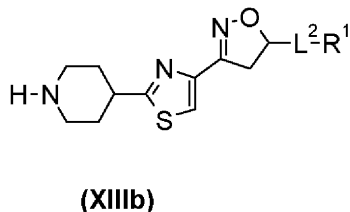


30

例えば (XIIIb) の化合物：

【0173】

【化 3 1】



40

ならびにその塩、金属錯体およびN-オキサイド（記号 X 、 L^2 、 p 、 G 、 R^1 、 R^2 、 R^5 および R^{10} は上記で記載の一般的、好ましい、より好ましいまたは最も好ましい定義を有する。）は新規化合物である。

【0174】

本発明はさらに、少なくとも一つの本発明によるヘテロアリアルピペリジンおよびーピペラジン誘導体を含む、望ましくない微生物を防除するための組成物を提供する。

【0175】

本発明はさらに、本発明のヘテロアリアルピペリジンおよびーピペラジン誘導体を微生物および／またはその棲息場所に施用することを特徴とする望ましくない微生物の防除

50

方法に関するものである。

【0176】

本発明はさらに、少なくとも一つの本発明のヘテロアリアルピペリジンおよびーピペラジン誘導体で処理した種子に関するものである。

【0177】

本発明は最後に、少なくとも一つの本発明によるヘテロアリアルピペリジンおよびーピペラジン誘導体で処理した種子を用いることで、望ましくない微生物に対する種子の保護方法を提供する。

【0178】

本発明の物質は、強力な殺微生物活性を有しており、作物保護および材料の保護における、真菌および細菌などの望ましくない微生物の防除に用いることができる。

10

【0179】

本発明の式(I)のヘテロアリアルピペリジンおよびーピペラジン誘導体は、非常に良好な殺真菌特性を有し、作物保護において、例えばネコブカビ綱、卵菌綱、ツボカビ綱、接合菌綱、子囊菌綱、担子菌綱および不完全菌綱の防除に用いることができる。

【0180】

殺細菌剤は、作物保護で、例えばシュードモナス科、リゾビウム科、腸内細菌科、コリネバクテリウム科およびストレプトマイセス科の防除に用いることができる。

【0181】

本発明の殺菌剤組成物は、植物病原菌の治療的または保護的防除に用いることができる。従って本発明は、種子、植物または植物部分、果実またはその植物が成長する土壤に施用される本発明の有効成分もしくは組成物を用いて植物病原菌を治療的および保護的に防除する方法に関するものでもある。

20

【0182】

作物保護における植物病原菌を防除するための本発明の組成物は、有効だが非植物毒性の量の本発明の有効成分を含む。「有効だが、非植物毒性の量」とは、満足できる形で植物の真菌疾患を防止したり、真菌疾患を完全に根絶するのに十分であって、同時に植物毒性の症状をほとんど引き起こさない本発明の組成物の量を意味する。この施用量は、一般的には比較的広い範囲で変動し得るものである。それはいくつかの因子、例えば防除対照の真菌、植物、気候条件および本発明の組成物の成分によって決まる。

30

【0183】

本発明に従って、全ての植物および植物部分を処理することができる。植物とは、本発明においては、望ましいおよび望ましくない野生植物または作物（天然作物を含む。）のような全ての植物および植物集団を意味する。作物は、従来の品種改良および至適化法によって、またはバイオテクノロジーおよび遺伝子工学法によって、またはこれらの方法の組み合わせによって得ることができる植物であることができ、遺伝子導入植物を含み、品種保護権利によって保護され得るまたは保護され得ない植物品種を含む。植物部分は、芽、葉、花および根のような、地上および地下の植物のあらゆる部分および器官を意味するものと理解すべきであり、例として、葉、針葉、柄、茎、花、子実体、果実および種子、そしてさらには根、塊茎および地下茎などがある。植物部分には、収穫物ならびに栄養増殖物および生殖増殖物、例えば、切り枝、塊茎、地下茎、挿し木および種子などもある。

40

【0184】

本発明に従って処理可能な植物には、次の植物などがある。すなわちワタ、アマ、ブドウ、果実、野菜、例えばバラ科属種(Rosaceae sp.) (例えば、梨果果実、例えばリンゴおよびナシだけでなく、石果果実、例えば、アンズ、サクランボ、アーモンドおよびモモおよび柔らかい果物、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(Acti

50

n i d a c e a e s p .) 、 ク ス ノ キ 科 属 種 (L a u r a c e a e s p .) 、 バ シ ョ
 ウ 科 属 種 (M u s a c e a e s p .) (例 え ば 、 バ ナ ナ の 木 お よ び バ ナ ナ 植 林 地) 、 ア
 カ ネ 科 属 種 (R u b i a c e a e s p .) (例 え ば 、 コ ー ヒ ー) 、 ツ バ キ 科 属 種 (T h
 e a c e a e s p .) 、 ア オ ギ リ 科 属 種 (S t e r c u l i c e a e s p .) 、 ミ カ
 ン 科 属 種 (R u t a c e a e s p .) (例 え ば 、 レ モ ン 、 オ レ ン ジ お よ び グ レ ー プ フ ル
 ー ツ) 、 ナ ス 科 属 種 (S o l a n a c e a e s p .) (例 え ば 、 ト マ ト) 、 ユ リ 科 属 種
 (L i l i a c e a e s p .) 、 キ ク 科 属 種 (A s t e r a c e a e s p .) (例 え
 ば 、 レ タ ス) 、 セ リ 科 属 種 (U m b e l l i f e r a e s p .) 、 十 字 花 科 属 種 (C r
 u c i f e r a e s p .) 、 ア カ ザ 科 属 種 (C h e n o p o d i a c e a e s p .)
 、 ウ リ 科 属 種 (C u c u r b i t a c e a e s p) (例 え ば 、 キ ュ ウ リ) 、 ネ ギ 科 属 種 10
 (A l l i a c e a e s p .) (例 え ば 、 ネ ギ 、 タ マ ネ ギ) 、 マ メ 科 属 種 (P a p i l
 i o n a c e a e s p .) (例 え ば 、 エ ン ド ウ マ メ) ； 主 要 作 物 、 例 え ば イ ネ 科 属 種 (G r a m i n e a e
 s p .) (例 え ば 、 ト ウ モ ロ コ シ 、 芝 生 、 例 え ば コ ム ギ 、 ラ イ ム ギ
 、 イ ネ 、 オ オ ム ギ 、 カ ラ ス ム ギ 、 キ ビ お よ び ラ イ コ ム ギ な の 穀 物) 、 キ ク 科 属 種 (A s
 t e r a c e a e s p .) (例 え ば 、 ヒ マ ワ リ) 、 ア ブ ラ ナ 科 属 種 (B r a s s i c a
 c e a e s p .) (例 え ば 、 キ ャ ベ ツ 、 紫 キ ャ ベ ツ 、 ブ ロ ッ コ リ ー 、 カ リ フ ラ ウ ー 、 芽
 キ ャ ベ ツ 、 青 梗 菜 、 コ ー ル ラ ビ 、 ラ デ ィ ッ シ ュ な ら び に セ イ ヨ ウ ア ブ ラ ナ 、 カ ラ シ 、 セ イ
 ヨ ウ ワ サ ビ お よ び ク レ ソ ン) 、 マ メ 科 属 種 (F a b a c a e s p .) (例 え ば 、 マ メ 、
 エ ン ド ウ 豆 、 落 花 生) 、 マ メ 科 属 種 (P a p i l i o n a c e a e s p .) (例 え ば 、
 ダ イ ズ) 、 ナ ス 科 属 種 (S o l a n a c e a e s p .) (例 え ば 、 ジ ャ ガ イ モ) 、 ア カ 20
 ザ 科 属 種 (C h e n o p o d i a c e a e s p .) (例 え ば 、 サ ト ウ ダイ コ ン 、 飼 料 用
 ビ ー ト 、 フ ダ ン ソ ウ 、 ア オ ゲ イ ト ウ) ； 庭 お よ び 森 に お け る 有 用 植 物 お よ び 観 賞 用 植 物 ；
 な ら び に こ れ ら の 各 植 物 の 遺 伝 子 改 変 型 で あ る 。

【0185】

本発明に従って処理可能な真菌病の病原体の例としては、下記のものなどがあるが、これらに限定されるものではない。

【0186】

ウドンコ病の病原体によって引き起こされる病害、例えばブルメリア・グラミニス (B
 l u m e r i a g r a m i n i s) などのブルメリア (B l u m e r i a) 種；ポドス
 ファエラ・ロイコトリカ (P o d o s p h a e r a l e u c o t r i c h a) などのポ 30
 ドスファエラ (P o d o s p h a e r a) 種；スファエロセカ・フリギネア (S p h a e
 r o t h e c a f u l i g i n e a) などのスファエロセカ (S p h a e r o t h e c
 a) 種；ウンシヌラ・ネケータ (U n c i n u l a n e c a t o r) などのウンシヌラ
 (U n c i n u l a) 種；

さび病病原体によって引き起こされる病害、例えばギムノスポランギウム・サビナエ (G
 y m n o s p o r a n g i u m s a b i n a e) などのギムノスポランギウム (G y
 m n o s p o r a n g i u m) 種；ヘミレイア・バスタトリックス (H e m i l e i a
 v a s t a t r i x) などのヘミレイア (H e m i l e i a) 種；ファコプソラ・パチラ
 イジ (P h a k o p s o r a p a c h y r h i z i) またはファコプソラ・マイボミア
 エ (P h a k o p s o r a m e i b o m i a e) などのファコプソラ (P h a k o p 40
 s o r a) 種；プクシニア・レコンディタ (P u c c i n i a r e c o n d i t a) ま
 たはプクシニア・グラミニス (P u c c i n i a g r a m i n i s) またはプクシニア
 ・ストリイホルミス (P u c c i n i a s t r i i f o r m i s) などのプクシニア (P u c c i n i a)
 種；ウロミセス・アッペンディキュラタス (U r o m y c e s a p
 p e n d i c u l a t u s) などのウロミセス (U r o m y c e s) 種；

卵菌類 (O o m y c e t e s) 群の病原体によって引き起こされる病害、例えばアルブ
 ゴ・カンジダ (A l b u g o c a n d i d a) などのアルブゴ (A l b u g o) 種；ブ
 レミア・ラクチュカエ (B r e m i a l a c t u c a e) などのブレミア (B r e m i
 a) 種；ペロノスポラ・ピシ (P e r o n o s p o r a p i s i) または P . ブラッシ
 カエ (P . b r a s s i c a e) などのペロノスポラ (P e r o n o s p o r a) 種； 50

フィトフソラ・インフェスタンス (*Phytophthora infestans*) などのフィトフソラ (*Phytophthora*) 種; プラスモパラ・ビチコラ (*Plasmopara viticola*) などのプラスモパラ (*Plasmopara*) 種; シュードペロノスポラ・フムリ (*Pseudoperonospora humuli*) またはシュードペロノスポラ・キューベンシス (*Pseudoperonospora cubensis*) などのシュードペロノスポラ (*Pseudoperonospora*) 種; ピチウム・ウルティマム (*Pythium ultimum*) などのピチウム (*Pythium*) 種;

以下のものによって引き起こされる葉枯病 (*leaf blotch diseases*) および葉萎凋病 (*leaf wilt diseases*)、例えばアルテルナリア・ソラニ (*Alternaria solani*) などのアルテルナリア (*Alternaria*) 種; セルコスボラ・ベチコラ (*Cercospora beticola*) などのセルコスボラ (*Cercospora*) 種; クラドスポリウム・キュキュメリナム (*Cladosporium cucumerinum*) などのクラドスポリウム (*Cladosporium*) 種; コクリオボラス・サティブス (*Cochliobolus sativus*) (分生子型: ドレクスレラ (*Drechslera*), 同義語: ヘルミントスポリウム (*Helminthosporium*)) またはコクリオボラス・ミヤベアヌス (*Cochliobolus miyabeanus*) などのコクリオボラス (*Cochliobolus*) 種; コレトトリカム・リンデムサニウム (*Colletotrichum lindemuthianum*) などのコレトトリカム (*Colletotrichum*) 種; シクロコニウム・オレアギナム (*Cycloconium oleaginum*) などのシクロコニウム (*Cycloconium*) 種; ディアポルテ・シトリ (*Diaporthe citri*) などのディアポルテ (*Diaporthe*) 種; エルシノエ・フォーセッティイ (*Elsinoe fawcettii*) などのエルシノエ (*Elsinoe*) 種; グレオスポリウム・ラエティカラー (*Gloeosporium laeticolor*) などのグレオスポリウム種 (*Gloeosporium*); グロメラ・シンギュラータ (*Glomerella cingulata*) などのグロメラ (*Glomerella*) 種; ギニャルディア・ビドウェリ (*Guignardia bidwellii*) などのギニャルディア (*Guignardia*) 種; レプトスファエリア・マキュランズ (*Leptosphaeria maculans*) などのレプトスファエリア (*Leptosphaeria*) 種; マグナポルテ・グリージー (*Magnaporthe grisea*) などのマグナポルテ (*Magnaporthe*) 種; ミクロドチウム・ニバル (*Microdochium nivale*) などのミクロドチウム (*Microdochium*) 種; マイコスファエレラ・グラミニコラ (*Mycosphaerella graminicola*), マイコスファエレラ・アラキジコラ (*Mycosphaerella arachidicola*) またはマイコスファエレラ・フィジエンシス (*Mycosphaerella fijiensis*) などのマイコスファエレラ (*Mycosphaerella*) 種; フェオスファエリア・ノドラム (*Phaeosphaeria nodorum*) などのフェオスファエリア (*Phaeosphaeria*) 種; ピレノフォラ・テレス (*Pyrenophora teres*) またはピレノフォラ・トリチシ・レペンティス (*Pyrenophora tritici repentis*) などのピレノフォラ (*Pyrenophora*) 種; ラムラリア・コロシグニ (*Ramularia collo-cygni*) またはラムラリア・アレオラ (*Ramularia areola*) などのラムラリア (*Ramularia*) 種; リンコスボリウム・セカリス (*Rhynchosporium secalis*) などのリンコスボリウム (*Rhynchosporium*) 種; セプトリア・アピイ (*Septoria apii*) またはセプトリア・リコベルシシ (*Septoria lycopersici*) などのセプトリア (*Septoria*) 種; スタゴノスポラ・ノドルム (*Stagonospora nodorum*) などのスタゴノスポラ (*Stagonospora*) 種; チフラ・インカルナータ (*Typhula incarnata*) などのチ

フラ (*Typhula*) 種; ベンチュリア・イナエキュアリス (*Venturia inaequalis*) などのベンチュリア (*Venturia*) 種;

以下のものによって引き起こされる根および茎の病害、例えばコルチシウム・グラミネアラム (*Corticium graminearum*) などのコルチシウム (*Corticium*) 種; フサリウム・オキシスポラム (*Fusarium oxysporum*) などのフサリウム (*Fusarium*) 種; ゲウマノミセス・グラミニス (*Gaeumannomyces graminis*) などのゲウマノミセス (*Gaeumannomyces*) 種; プラスモジオフォラ・ブラシカエ (*Plasmodiophora brassicae*) などのプラスモジオフォラ (*Plasmodiophora*) 種; リゾクトニア・ソラニ (*Rhizoctonia solani*) などのリゾクトニア (*Rhizoctonia*) 種; サロクラジウム・オリザエ (*Sarocladium oryzae*) などのサロクラジウム (*Sarocladium*) 種; スクレロチウム・オリザエ (*Sclerotium oryzae*) などのスクレロチウム (*Sclerotium*) 種; タペシア・アキュフォルミス (*Tapesia acuformis*) などのタペシア (*Tapesia*) 種; チエラビオプシス・バシコラ (*Thielaviopsis basicola*) などのチエラビオプシス (*Thielaviopsis*) 種;

以下のものによって引き起こされる穂および円錐花序の病害 (トウモロコシ穂軸など)、例えばアルテルナリア属 (*Alternaria* spp.) などのアルテルナリア (*Alternaria*) 種; アスペルギルス・フラバス (*Aspergillus flavus*) などのアスペルギルス (*Aspergillus*) 種; クラドスポリウム・クラドスポリオイデス (*Cladosporium cladosporioides*) などのクラドスポリウム (*Cladosporium*) 種; クラビセプス・パープレア (*Claviceps purpurea*) などのクラビセプス (*Claviceps*) 種; フサリウム・クルモラム (*Fusarium culmorum*) などのフサリウム (*Fusarium*) 種; ギッベレラ・ゼアエ (*Gibberella zeae*) などのギッベレラ (*Gibberella*) 種; モノグラフェラ・ニバリス (*Monographella nivalis*) などのモノグラフェラ (*Monographella*) 種; スタグノスポラ・ノドラム (*Stagnospora nodorum*) などのスタグノスポラ (*Stagnospora*) 種;

以下の黒穂菌 (*smut fungi*) によって引き起こされる病害、例えばスファセロセカ・ライリアナ (*Sphacelotheca reiliana*) などのスファセロセカ (*Sphacelotheca*) 種; ティレチア・カリエス (*Tilletia caries*)、ティレチア・コントロベルサ (*Tilletia controversa*) などのティレチア (*Tilletia*) 種; ウロシスティス・オキュラータ (*Urocystis occulta*) などのウロシスティス (*Urocystis*) 種; ウスティラゴ・ヌーダ (*Ustilago nuda*) などのウスティラゴ (*Ustilago*) 種;

以下のものによって引き起こされる果実腐敗、例えばアスペルギルス・フラバス (*Aspergillus flavus*) などのアスペルギルス (*Aspergillus*) 種; ボトリティス・シネレア (*Botrytis cinerea*) などのボトリティス (*Botrytis*) 種; ペニシリウム・エクспанサム (*Penicillium expansum*) およびペニシリウム・プルプロゲナム (*Penicillium purpurogenum*) などのペニシリウム (*Penicillium*) 種; リゾプス・ストロニフェル (*Rhizopus stolonifer*) などのリゾプス (*Rhizopus*) 種; スクレロティニア・スクレロティオラム (*Sclerotinia sclerotiorum*) などのスクレロティニア (*Sclerotinia*) 種; ベルティシリウム・アルボアトラム (*Verticillium albo-atrum*) などのベルティシリウム (*Verticillium*) 種;

以下のものによって引き起こされる種子および土壌伝染性の腐敗病および枯れ病ならびに苗の病害、例えばアルタナリア・ブラシシコラ (*Alternaria brassi*

cicola) などのアルタナリア (*Alternaria*) 種; アファノミセス・ユー
 テイセス (*Aphanomyces euteiches*) などのアファノミセス (*Ap*
hanomyces) 種; アスコチタ・レンティス (*Ascochyta lentis*
) などのアスコチタ (*Ascochyta*) 種; アスペルギルス・フラブス (*Asper*
gillus flavus) などのアスペルギルス (*Aspergillus*) 種; ク
 ラドスポリウム・ヘルバルム (*Cladosporium herbarum*) などのク
 ラドスポリウム (*Cladosporium*) 種; コクリオボラス・サティブス (*Coc*
hliobolus sativus) (分生子型: ドレクスレラ (*Drechsler*
a))、ビポラリス (*Bipolaris*) 同義語: ヘルミントスポリウム (*Helmin*
thosporium) などのコクリオボラス (*Cochliobolus*) 種; コレ 10
 トトリカム・ココデス (*Colletotrichum coccodes*) などのコレ
 トトリカム (*Colletotrichum*) 種; フサリウム・カルモラム (*Fusar*
ium culmorum) などのフサリウム (*Fusarium*) 種; ギッベレラ・ゼ
 アエ (*Gibberella zeae*) などのギッベレラ (*Gibberella*) 種
 ; マクロホミナ・ファセオリナ (*Macrophomina phaseolina*) な
 どのマクロホミナ (*Macrophomina*) 種; ミクロドキウム・ニバレ (*Micr*
odochium nivale) などのミクロドキウム (*Microdochium*)
 種; モノグラフェラ・ニバリス (*Monographella nivalis*) などの
 モノグラフェラ (*Monographella*) 種; ペニシリウム・エキスパンスム (*P*
enicillium expansum) などのペニシリウム (*Penicillium* 20
m) 種; ホマ・リングム (*Phoma lingam*) などのホマ (*Phoma*) 種; ホ
 モプシス・ソジャエ (*Phomopsis sojae*) などのホモプシス (*Phomo*
psis) 種; フィトフトラ・カクトルム (*Phytophthora cactoru*
m) などのフィトフトラ (*Phytophthora*) 種; ピレノホラ・グラミネア (*P*
pyrenophora graminea) などのピレノホラ (*Pyrenophora*
a) 種; ピリクラリア・オリザエ (*Pyricularia oryzae*) などのピリク
 ラリア (*Pyricularia*) 種; ピチウム・ウルチムム (*Pythium ult*
imum) などのピチウム (*Pythium*) 種; リゾクトニア・ソラニ (*Rhizoc*
tonia solani) などのリゾクトニア (*Rhizoctonia*) 種; リゾプ
 ス・オリザエ (*Rhizopus oryzae*) などのリゾプス (*Rhizopus*) 30
 種; スクレロチウム・ロルフシイ (*Sclerotium rolfsii*) などのスク
 レロチウム (*Sclerotium*) 種; セプトリア・ノドルム (*Septoria n*
odorum) などのセプトリア (*Septoria*) 種; チフラ・インカルナタ (*Ty*
phula incarnata) などのチフラ (*Typhula*) 種; ベルチシリウム
 ・ダーリアエ (*Verticillium dahliae*) などのベルチシリウム (*V*
erticillium) 種;
 以下のものによって引き起こされる癌、こぶ病およびてんぐ巢病、例えばネクトリア・
 ガリゲナ (*Nectria galligena*) などのネクトリア (*Nectria*)
 種;
 以下のものによって引き起こされる枯れ病、例えばモニリニア・ラクサ (*Monili*
nia laxa) などのモニリニア (*Monilinia*) 種; 40
 以下のものによって引き起こされる葉、花および果実の奇形、例えばエキソバシジウム
 ・ベキサンス (*Exobasidium vexans*) などのエキソバシジウム (*Ex*
obasidium) 種; タフリナ・デフォルマンズ (*Taphrina deform*
ans) などのタフリナ (*Taphrina*) 種;
 以下のものによって引き起こされる木材植物における変性病、例えばファエモニエラ・
 クラミドスポラ (*Phaemoniella clamydospora*)、ファエオア
 クレモニウム・アレオフィラム (*Phaeoacremonium aleophilum*) またはフォミチポリタ・メジテラネア (*Fomitiporia mediterr*
anea) などのエスカ (*Esca*) 種; ガノデルマ・ボニネンセ (*Ganoderma* 50

boninense) などのガノデルマ (*Ganoderma*) 種;

以下のものによって引き起こされる花および種子の病害、例えばボトリティス・シネレア (*Botrytis cinerea*) などのボトリティス (*Botrytis*) 種;

以下のものによって引き起こされる植物塊茎の病害、例えばリゾクトニア・ソラニ (*Rhizoctonia solani*) などのリゾクトニア (*Rhizoctonia*) 種; ヘルミントスポリウム・ソラニ (*Helminthosporium solani*) などのヘルミントスポリウム (*Helminthosporium*) 種;

下記のような細菌性病原体によって引き起こされる病害、例えばキサントモナス・キャンベストリス *p.v.* オリザエ (*Xanthomonas campestris p.v. oryzae*) などのキサントモナス (*Xanthomonas*) 種; シュードモナス・シリングア *p.v.* ラクリマンス (*Pseudomonas syringae p.v. lachrymans*) などのシュードモナス (*Pseudomonas*) 種; エルウィニア・アミロボラ (*Erwinia amylovora*) などのエルウィニア (*Erwinia*) 種。

【0187】

下記の大豆病害を好ましく防除することができる。

【0188】

以下のものによって引き起こされる葉、茎、鞘および種子に対する真菌病害、例えばアルテルナリア葉斑点病 (*Alternaria leaf spot*) (アルテルナリア属種アトランス・テニュイッシマ (*Alternaria spec. atrans tenuissima*))、炭疽病 (コレトトリカム・グロエオスポロイデス・デマティウム亜種トランケイタム (*Colletotrichum gloeosporoides dematium var. truncatum*))、褐斑病 (*brown spot*) (セプトリア・グリシネス (*Septoria glycines*))、セルコスボラ葉斑点病 (*cercospora leaf spot*) および焼枯れ病 (*blight*) (セクロスボラ・キクチイ (*Cercospora kikuchii*))、コアネフォラ葉焼枯れ病 (*choanephora leaf blight*) (コアネフォラ・インファンディブリフェラ・トリスポラ (*Choanephora infundibulifera trispora*) (同義))、ダクチュリオフォラ葉斑点病 (*dactuliophora leaf spot*) (ダクチュリオフォラ・グリシネス (*Dactuliophora glycines*))、べと病 (*downy mildew*) (ペロノスポラ・マンシュリカ (*Peronospora manshurica*))、ドレクスレラ焼枯れ病 (*drechslera blight*) (ドレクスレラ・グリシニ (*Drechslera glycinii*))、葉輪紋病 (*frogeye leaf spot*) (セルコスボラ・ソジナ (*Cercospora sojae*))、レプトスファエルリナ葉斑点病 (*leptosphaerulina leaf spot*) (レプトスファエルリナ・トリフォリイ (*Leptosphaerulina trifolii*))、フィロスティカ葉斑点病 (*phyllostica leaf spot*) (フィロスティカ・ソジャエコラ (*Phyllosticta sojaecola*))、鞘および茎の焼枯れ病 (フォモプシス・ソジャエ (*Phomopsis sojae*))、うどんこ病 (*powdery mildew*) (ミクロスファエラ・ディフューザ (*Microsphaera diffusa*))、ピレノチャエタ葉斑点病 (*pyrenochaeta leaf spot*) (ピレノチャエタ・グリシネス (*Pyrenochaeta glycines*))、リゾクトニア・エリアル (*rhizoctonia aerial*)、葉および膜の焼枯れ病 (リゾクトニア・ソラニ (*Rhizoctonia solani*))、さび病 (ファコプソラ・パチライジ (*Phakopsora pachyrhizi*))、ファコプソラ・メイドミエ (*Phakopsora maidomiaae*))、黒星病 (スファセロマ・グリシネス (*Sphaceloma glycines*))、ステムフィリウム葉焼枯れ病 (*stemphylium leaf blight*) (ステムフィリウム・ボトリオサム (*Stemphylium bot*

10

20

30

40

50

ryosum))、輪紋病(コリネスボラ・カッシイコラ(*Corynespora cassiicola*))。

【0189】

下記のものによって引き起こされる根および茎基部の真菌病、例えば黒根腐病(black root rot)(カロネクトリア・クロタラリアエ(*Calonectria crotalariae*))、炭腐病(マクロフォミナ・ファセオリナ(*Macrophomina phaseolina*))、フザリウム焼枯病(*fusarium blight*)または萎凋病(wilt)、根腐れ病ならびに鞘および頸部腐れ病(rot)(フザリウム・オキシスポラム(*Fusarium oxysporum*))、フザリウム・オルトセラス(*Fusarium orthoceras*)、フザリウム・セミテクタム(*Fusarium semitectum*)、フザリウム・エクイセチ(*Fusarium equiseti*)、マイコレプトディスカス根腐れ病(*mycoleptodiscus root rot*)(マイコレプトディスカス・テレストリス(*Mycol*
10
eptodiscus terrestris))、ネオコスモスポラ(*neocosmospora*)(ネオコスモスポラ・バスイنفেকタ(*Neocosmopspora vasinfecta*))、鞘および茎の焼枯病(blight)(ディアポルセ・ファセオロラム(*Diaporthe phaseolorum*))、枝枯れ病(ディアポ
20
ルセ・ファセオロラム亜種カウリボラ(*Diaporthe phaseolorum*
var. caulivora))、フィトフトラ腐れ病(*phytophthora*
rot)(フィトフトラ・メガスペルマ(*Phytophthora megasper*
ma))、褐色茎腐れ病(brown stem rot)(フィアロフォラ・グレガー
30
タ(*Phialophora gregata*))、ピチウム腐れ病(*pythium*
rot)(ピチウム・アフアニデルマタム(*Pythium aphanidermat*
um))、ピチウム・イレギュラーレ(*Pythium irregulaere*)、ピチ
ウム・デバリアナム(*Pythium debaryanum*)、ピチウム・ミリオチラ
ム(*Pythium myriotylum*)、ピチウム・ウルティマム(*Pythiu*
m ultimum))、リゾクトニア根腐れ病(*rhizoctonia root*
rot)、茎腐敗および立枯病(リゾクトニア・ソラニ(*Rhizoctonia so*
lani))、スクレロティニア茎腐敗病(*sclerotinia stem dec*
ay)(スクレロティニア・スクレロティオラム(*Sclerotinia scler*
40
otiorum))、スクレロティニア白絹病(*sclerotinia Southe*
rn blight)(スクレロティニア・ロルフシイ(*Sclerotinia rol*
fsii))、チエラビオプシス根腐れ病(*thielaviopsis root*
rot)(チエラビオプシス・バシコラ(*Thielaviopsis basicol*
a))。

【0190】

本発明による有効成分は、植物において非常に良好な強化作用も有する。従って、それらは、望ましくない微生物による攻撃に対して植物自体の防御を動員させるのに用いることができる。

【0191】

本発明に関連して、植物強化性(抵抗性誘発性)物質は、処理された植物が、その後に望ましくない微生物を接種されたときに、それら微生物に対して高度な抵抗性を生じるように、植物の防御システムを刺激することができる物質を意味するものと理解される。

【0192】

この場合、望ましくない微生物は、植物病原性の真菌および細菌を意味するものと理解される。従って、本発明の物質を用いて、処理後ある一定の期間、上記病原体による攻撃から植物を保護することができる。保護が提供される期間は、植物が有効成分で処理されてから、一般に、1から10日間、好ましくは、1から7日間に及ぶ。

【0193】

植物病害を防除する上で必要とされる濃度で有効成分が植物によって良好に耐容される

10

20

30

40

50

ことから、植物の地上部の処理、栄養繁殖器官および種子の処理、ならびに土壌の処理が可能となる。

【0194】

本発明の有効成分を用いて、ブドウ栽培における病害ならびにジャガイモ、果実および野菜の成長における病害を特に良好に防除することができ、例えば特にはべと病菌類、卵菌類に対して、例えばフィトフトラ (Phytophthora)、プラスモパラ (Plasmopara)、シュードペロノスポラ (Pseudoperonospora) およびピシウム (Pythium) 種に対してである。

【0195】

本発明の有効成分はさらに、作物の収量を増大させるのにも適している。さらに、それは、毒性も低く、植物によって良好に耐容される。

10

【0196】

適切な場合、本発明の化合物は、ある一定の濃度または施用量において、除草剤、葉害軽減剤、成長調節剤もしくは植物の特性を改善する作用薬としても使用し得るか、殺微生物剤として、例えば、殺菌剤、抗真菌剤、殺細菌剤、殺ウイルス剤（これは、ウイロイドに対する薬剤も包含する）としても使用し得るか、MLO（マイコプラズマ様生物）およびRLO（リケッチア様生物）に対する薬剤としても使用し得る。適切な場合には、それらは、殺虫剤としても使用することができる。適切な場合には、それらは、他の有効成分を合成するための中間体または前駆体としても使用することができる。

【0197】

20

本発明の有効成分は、植物によって良好に耐容される場合、好ましい恒温動物毒性を有し、環境によって良好に耐容され、植物および植物器官の保護に、収穫量増加に、農業、園芸、畜産、森林、庭およびレジャー施設での収穫物の品質の改善に、貯蔵製品および材料の保護で、および衛生部門で適している。それらは好ましくは、作物保護剤として使用することができる。これらは、通常、感受性種および耐性種に対して活性であり、発達の全段階または一部の段階に対して有効である。

【0198】

有効成分または組成物による植物および植物部分の本発明の処理は、一般的な処理方法により、例えば浸漬、噴霧、霧化、灌水、蒸発、散粉、雲霧、散布、発泡、塗布、展着、散水（灌注）、細流灌漑によって、そして繁殖物の場合、特には種子の場合はさらに乾式種子処理、湿式種子処理、スラリー処理、被覆、1以上のコート剤によるコーディングによる等で、直接行うか、その周辺、生育場所または保管場所への作用によって行う。超微量法によって有効成分を分散するか、有効成分の製剤／有効成分自体を土壌に注入することも可能である。

30

【0199】

さらに、材料の保護においては、望ましくない微生物（例えば、真菌）による攻撃および破壊から工業材料を保護するために、本発明の有効成分または組成物を用いることもできる。

【0200】

本発明の文脈での工業材料は、工業用に作られた非生物材料を意味するものと理解すべきである。例えば、本発明の有効成分によって微生物による変化または破壊から保護されるべき工業材料は、接着剤、サイズ、紙およびボール紙、テキスタイル、皮革、木材、塗料およびプラスチック品、冷却潤滑剤および微生物によって感染もしくは破壊を受け得る他の材料である。保護すべき材料の範囲には、微生物の繁殖によって害を受け得る製造工場の一部、例えば冷却水循環路も含まれる。本発明の範囲内の工業材料には好ましくは、接着剤、サイズ、紙およびボール紙、皮革、木材、塗料、冷却潤滑剤および熱伝達液などがあり、より好ましいものは木材である。本発明の有効成分または組成物は、腐敗、劣化、退色、脱色またはかび形成のような不利な作用を防止することができる。

40

【0201】

望ましくない真菌を防除するための本発明の方法は、貯蔵品保護にも用いることができ

50

る。貯蔵品とは、長期間の保護が望まれる植物もしくは動物起源の天然物質または天然起源のその加工製品を意味するものと理解される。例えば植物もしくは植物部分などの植物由来の貯蔵品、例えば茎、葉、塊茎、種子、果実、穀粒は、収穫されたばかりで、または（前）乾燥、加湿、破碎、粉碎、加圧または焙焼による加工形態後に保護することができる。貯蔵品には、建築用材木、電柱および柵などの粗材木であるか家具などの完成製品の形態であるかを問わず、材木などもある。動物由来の貯蔵品は、例えば獣皮、皮革、毛皮および毛髪である。本発明の有効成分は、腐食、劣化、変色、退色またはかび形成などの不利な作用を防ぐことができる。

【0202】

工業材料を劣化または変性させることができる微生物には、例えば、細菌、真菌、酵母、藻類および粘菌類などがある。本発明の有効成分は好ましくは、真菌、特にカビ類、材木を変色させる菌類および材木を破壊する菌類（担子菌類）に対して、ならびに粘菌類および藻類に対して作用する。例としては、以下の属の微生物：アルテルナリア（*Alternaria*）、例えば、アルテルナリア・テヌイス（*Alternaria tenuis*）；アスペルギルス（*Aspergillus*）、例えば、アスペルギルス・ニゲル（*Aspergillus niger*）；カエトミウム（*Chaetomium*）、例えば、カエトミウム・グロボスム（*Chaetomium globosum*）；コニオホラ（*Coniophora*）、例えば、コニオホラ・プエタナ（*Coniophora puetana*）；レンチヌス（*Lentinus*）、例えば、レンチヌス・チグリヌス（*Lentinus tigrinus*）；ペニシリウム（*Penicillium*）、例えば、ペニシリウム・グラウカム（*Penicillium glaucum*）；ポリポルス（*Polyporus*）、例えば、ポリポルス・ベルシコロール（*Polyporus versicolor*）；アウレオバシジウム（*Aureobasidium*）、例えば、アウレオバシジウム・プルランス（*Aureobasidium pullulans*）；スクレロホマ（*Sclerophoma*）、例えば、スクレロホマ・ピチオフィラ（*Sclerophoma pityophila*）；トリコデルマ（*Trichoderma*）、例えば、トリコデルマ・ビリデ（*Trichoderma viride*）；エシェリキア（*Escherichia*）、例えば、エシェリキア・コリ（*Escherichia coli*）；シュードモナス（*Pseudomonas*）、例えば、シュードモナス・アエルギノサ（*Pseudomonas aeruginosa*）；スタフィロコッカス（*Staphylococcus*）、例えば、スタフィロコッカス・アウレウス（*Staphylococcus aureus*）などがある。

【0203】

本発明は、さらに、本発明のヘテロアリールピペリジンおよびーピペラジン誘導体のうちの少なくとも1種類を含む、望ましくない微生物を防除するための組成物に関するものでもある。これらは、好ましくは、農業において好適な補助剤、溶媒、担体、界面活性剤または増量剤を含む殺菌剤組成物である。

【0204】

本発明によれば、担体は、特に植物もしくは植物部分または種子への施用に関して、より良好な施用性を得るために、有効成分と混合または組み合わせる天然または合成の有機物質または無機物質である。その担体は、固体または液体であることができ、一般に不活性であり、そして、農業での使用に好適であるべきである。

【0205】

有用な固体担体には、例えばアンモニウム塩およびカオリン類、粘土類、タルク、チョーク、石英、アタパルガイト、モンモリロナイトまたは珪藻土などの天然岩粉および微粉碎シリカ、アルミナおよびシリケート類などの合成岩粉であり；粒剤用の有用な固体担体には、例えば方解石、大理石、軽石、海泡石およびドロマイトなどの破碎および分別された天然岩石ならびに無機および有機ミールの合成顆粒および紙、おがくず、ヤシ殻、トウモロコシ穂軸およびタバコ茎などの有機材料の顆粒などがあり；有用な乳化剤および／または発泡剤には、例えば、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、アルキルスルホネート類、硫酸アルキル類、アリールスルホネート類およびタンパク質加水分解物などのノニオン系およびアニオン系乳化剤などがあり；好適な分散剤は、ノニオン系および／またはイオン性物質、例えばアルコール－P O E－および／または－P O P－エーテル類、酸および／またはP O P－P O Eエステル類、アルキルアリールおよび／またはP O P－P O Eエーテル類、脂肪－および／またはP O P－P O E付加物、P O E－および／またはP O P－多価アルコール誘導体、P O E－および／またはP O P－ソルビタン－または－糖付加物、硫酸アルキルもしくはアリール類、アルキル－またはアリールスルホネート類およびリン酸アルキルもしくはアリール類または相当するP O－エーテル付加物の群からのものである。さらに、オリゴマーまたはポリマーも好適であり、例えばビニル系モノマーから、アクリル酸から、E Oおよび／またはP Oから誘導されたもの単独または例えば（ポリ）アルコール類もしくは（ポリ）アミン類と組み合わせたものである。リグニンおよびそのスルホン酸誘導体、未変性および変性セルロース、芳香族および／または脂肪族スルホン酸類、さらにはホルムアルデヒドとの付加物を用いることも可能である。

【0206】

その有効成分は、液剤、乳濁液、水和剤、水系および油系懸濁液、粉剤、ダスト剤、ペースト、可溶性粉末、可溶性粒剤、散布用粒剤、懸濁乳濁濃縮液、有効成分を含浸させた天然物、有効成分を含浸させた合成物質、肥料およびポリマー基材中のマイクロカプセルなどの一般的な製剤に変換することができる。

【0207】

本発明の有効成分は、そのまま施用することができるし、その製剤の形態またはそれから調製される使用形態、例えば、即時使用液剤、乳濁液、水系懸濁液、油系懸濁液、粉末、水和剤、ペースト、可溶性粉体、ダスト剤、可溶性粒剤、散布用粒剤、懸濁乳濁濃縮液、有効成分を含浸させた天然物、有効成分を含浸させた合成物質、肥料、さらにはポリマー物質中にマイクロカプセル化したものなどの形態でも施用することができる。施用は、一般的な方法で、例えば、灌水、噴霧、霧化、散布、散粉、泡散布、塗布などにより行う。さらに、本発明の有効成分を、超微量法により施用することも可能であり、またはその有効成分の製剤もしくは有効成分自体を土壌に注入することも可能である。植物の種子を処理することも可能である。

【0208】

上記製剤は、それ自体公知の方法で、例えば、その有効成分を少なくとも1種類の一般的な増量剤、溶媒もしくは希釈剤、乳化剤、分散剤および／または結合剤もしくは固定剤、湿展剤、撥水剤と混合させ、適切な場合には乾燥剤およびUV安定剤と混合させ、適切な場合には染料および顔料、消泡剤、防腐剤、二次増粘剤、粘着剤、ジベレリン類、さらには他の加工助剤と混合することによって調製することができる。

【0209】

本発明は、植物または種子に対して使用準備が出来ており、好適な装置を用いて施用可能である製剤だけでなく、使用前に水で希釈する必要がある市販の濃厚物も包含する。

【0210】

本発明による有効成分は、そのままで、または、その（商業的）製剤中に、および、その製剤から調製された使用形態中に、殺虫剤、誘引剤、不妊剤、殺細菌剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤、成長調節剤、除草剤、肥料、薬害軽減剤および／または情報化学物質などの別の（既知）有効成分との混合物として存在し得る。

【0211】

使用される補助剤は、組成物自体および／またはそれから誘導された製剤（例えば、噴霧液、種子粉衣）に、特定の特性、例えばある種の技術的特性および／または特定の生理特性などを付与する上で好適な物質であることができる。代表的な補助剤には、増量剤、溶媒および担体などがある。

【0212】

10

20

30

40

50

好適な増量剤は、例えば、水、極性および非極性の有機化学液、例えば、芳香族および非芳香族の炭化水素類（例えば、パラフィン類、アルキルベンゼン類、アルキルナフタレン類、クロロベンゼン類）、アルコール類および多価アルコール類（これらは、置換されていてもよく、エーテル化されていてもよく、および／またはエステル化されていてもよい）、ケトン類（例えば、アセトン、シクロヘキサノン）、エステル類（脂肪類および油類など）および（ポリ）エーテル類、置換されていないおよび置換されているアミン類、アミド類、ラクタム類（例えば、N-アルキルピロリドン類）およびラクトン類、スルホン類およびスルホキシド類（例えば、ジメチルスルホキシド）の種類からのものである。

【0213】

液化ガス増量剤または担体は、標準温度および大気圧下では気体である液体、例えば、エアロゾル推進剤、例えば、ハロゲン化炭化水素類、さらにブタン、プロパン、窒素および二酸化炭素を意味するものと理解される。

10

【0214】

上記製剤において、粘着付与剤、例えば、カルボキシメチルセルロース、粉末、顆粒またはラテックスの形態にある天然ポリマーおよび合成ポリマー、例えば、アラビアゴム、ポリビニルアルコールおよびポリ酢酸ビニル、または、天然のリン脂質、例えばセファリン類およびレシチン類、および合成リン脂質などを使用することができる。別の添加剤は、鉱油および植物油であることができる。

【0215】

使用される増量剤が水である場合、例えば、補助溶媒として有機溶媒を用いることも可能である。実質的に、有用な液体溶媒は、キシレン、トルエンまたはアルキルナフタレン類などの芳香族化合物、そしてクロロベンゼン類、クロロエチレン類または塩化メチレンなどの塩素化芳香族化合物または塩素化脂肪族炭化水素基、シクロヘキサンまたはパラフィン類などの脂肪族炭化水素基、例えば石油留分、ブタノールもしくはグリコールなどのアルコール類およびそれらのエーテル類およびエステル類、アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトンもしくはシクロヘキサノンなどのケトン類、ジメチルホルムアミドおよびジメチルスルホキシドなどの強極性溶媒、または水である。

20

【0216】

本発明の組成物は、例えば界面活性剤などの別の成分をさらに含むことができる。好適な界面活性剤は、乳化剤および／または発泡剤、分散剤またはイオン性もしくはノニオン性を有する湿展剤、またはこれら界面活性剤の混合物である。その例は、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またはナフタレンスルホン酸の塩、エチレンオキサイドと脂肪族アルコール類もしくは脂肪酸もしくは脂肪族アミン類との重縮合物、置換フェノール類（好ましくはアルキルフェノール類またはアリールフェノール類）、スルホコハク酸エステルの塩、タウリン誘導体（好ましくはタウリン酸アルキル）、ポリエトキシ化アルコール類またはフェノールのリン酸エステル、多価アルコールの脂肪族エステル、および硫酸エステル、スルホン酸エステルおよびリン酸エステルを含む化合物の誘導体、例えばアルキルアリールポリグリコールエーテル類、スルホン酸アルキル類、硫酸アルキル類、スルホン酸アリール類、タンパク質加水分解物、リグノ亜硫酸廃液およびメチルセルロースである。有効成分のうちのひとつおよび／または不活性担体のうちのひとつが水に不溶であり、施用を水系で行う場合には、界面活性剤が存在する必要がある。界面活性剤の割合は、本発明の組成物の5から40重量%である。

30

40

【0217】

無機顔料、例えば酸化鉄、酸化チタンおよびプルシアンブルーなどの色素およびアリザリン色素、アゾ色素および金属フタロシアニン色素などの有機色素および鉄、マンガン、ホウ素、銅、コバルト、モリブデンおよび亜鉛の塩などの微量栄養素を用いることが可能である。

【0218】

別の添加剤は、芳香剤、鉱油または植物油、改質されていてもよいオイル類、ロウ類ならびに栄養素（微量栄養素を包含する）、例えば、鉄塩、マンガン塩、ホウ素塩、銅塩、

50

コバルト塩、モリブデン塩および亜鉛塩などであることができる。

【0219】

別の成分には、安定剤（例えば、低温安定剤）、防腐剤、酸化防止剤、光安定剤、または化学的および／または物理的安定性を向上させる他の作用剤があっても良い。

【0220】

適切であれば、他の別の成分が存在していても良く、例えば保護コロイド、結合剤、接着剤、増粘剤、チキソトロピー物質、浸透剤、安定剤、金属イオン封鎖剤、錯体形成剤である。概して、有効成分は、製剤用に一般に使用される固体もしくは液体添加剤と組み合わせることができる。

【0221】

その製剤は、0.05から99重量%、0.01から98重量%、好ましくは0.1から95重量%、より好ましくは0.5から90%の有効成分、最も好ましくは10から70重量%を含む。

【0222】

上記製剤は、望ましくない微生物を防除するために、本発明の方法で使用方法が可能であり、その際、本発明によるヘテロアリアルピペリジンおよびピペラジン誘導体は、当該微生物および／またはそれらの棲息場所に施用される。

【0223】

本発明による有効成分は、そのまま、またはその製剤で、例えば活性スペクトルを拡大するためにまたは抵抗性の発達を防止するために、既知の殺菌剤、殺細菌剤、殺ダニ剤、殺線虫剤もしくは殺虫剤と混合して使用することもできる。

【0224】

適切な混合相手剤には、例えば、既知の殺菌剤、殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤または殺細菌剤などがある（「Pesticide Manual, 14th ed.」も参照）。

【0225】

除草剤のような他の公知の有効成分との混合物、または、肥料および成長調節剤、葉害軽減剤および／または情報化学物質との混合物も可能である。

【0226】

施用は、その使用形態に適した一般的な方法で実施する。

【0227】

本発明は、さらに、種子を処理する方法も包含する。

【0228】

本発明のさらなる態様は、特に、本発明のヘテロアリアルピペリジンおよびピペラジン誘導体のうちの少なくとも1種類で処理された種子に関する。本発明による種子は、植物病原性の有害真菌から種子を保護するための方法において使用される。これらの方法においては、少なくとも1種類の本発明の有効成分で処理された種子を使用する。

【0229】

本発明による有効成分または組成物は、種子の処理にも適している。有害な生物に起因する作物植物に対する被害の大部分は、貯蔵中または播種後、植物の発芽中および発芽後の両方で、種子の感染によって起こる。この時期は特に重要である。それは、生長している植物の根および苗条は特に感受性が高く、軽度の損傷であってもその植物が死に至り得るからである。従って、適切な組成物を用いることで、種子および発芽中の植物を保護することに、大きな関心が持たれている。

【0230】

植物の種子を処理することによる植物病原性の有害真菌の防除についてはかなり以前から知られており、現在もなお改善が続いているテーマである。しかしながら、種子の処理には、常に満足な形で解決できるとは限らない一連の問題が伴う。例えば、植物の植え付け後もしくは発芽後の作物保護剤の追加施用を行わずに済みますか、少なくとも大幅に減らす、種子および発芽植物の保護方法を開発することが望ましい。そのようにして用いる有

10

20

30

40

50

効成分の量を至適化することで、使用される有効成分による植物自体に対する損傷を生じることなく、植物病原菌による攻撃から種子および発芽植物を可能な限り最高の保護を行うことがさらに望ましい。特に、種子の処理方法では、遺伝子組み換え植物の固有の殺菌特性も考慮して、作物保護剤の消費量を最小限としながら、種子および発芽植物の保護を最大とすることを考慮すべきである。

【0231】

従って本発明は、本発明の組成物で種子を処理することで、種子および発芽植物を有害動物および／または植物病原性有害真菌による攻撃から保護する方法に関するものでもある。本発明はさらに、植物病原菌に対する種子および発芽植物の保護するために種子を処理する上での本発明の組成物の使用に関するものでもある。さらに本発明は、植物病原菌に対する保護のために本発明の組成物で処理した種子に関するものでもある。

10

【0232】

発芽後に植物に損傷を与える有害動物および／または植物病原性有害真菌の防除は、主として土壌および植物の露出部を作物保護剤で処理することで防除する。作物保護剤が環境ならびにヒトおよび動物の健康に与える可能性がある影響に関して懸念があるために、施用される有効成分の量を減らすための努力がなされている。

【0233】

本発明の利点の一つは、本発明の組成物の特定の全身的性質のために、これら組成物による種子の処理が、有害動物および／または植物病原性有害真菌から、種子自体を保護するだけでなく、発芽後の得られた植物も保護するという点である。このようにして、播種時またはその直後の時点での作物の直接処理を行わずに済ますことができる。

20

【0234】

本発明の有効成分または組成物を特に、種子から成長する植物が病害生物に対して作用するタンパク質を発現する能力を有する遺伝子組み換え種子にも用いることが可能であることも有利であると考えられる。そのような種子を本発明の有効成分もしくは組成物で処理することで、単にタンパク質、例えば殺虫性タンパク質の発現によって、ある種の病害生物を防除することができる。驚くべきことに、この場合にはさらなる相乗効果が認められる可能性があり、加えて、その場合には病害生物による攻撃に対する保護の有効性が高くなる。

【0235】

本発明の組成物は、農業、温室、森林、造園において使用されるあらゆる種類の植物品種の種子を保護するのに適している。より詳細には、種子は、穀類（小麦、大麦、ライ麦、キビおよびカラス麦など）、トウモロコシ、棉、大豆、イネ、ジャガイモ、ヒマワリ、豆類、コーヒー、ビート（例えば、テンサイおよび飼料用ビート）、ピーナッツ、野菜（例えば、トマト、キュウリ、タマネギおよびレタスなど）、芝生および観賞植物の種子である。特に重要なものは、穀類（小麦、大麦、ライ麦、カラス麦など）、トウモロコシおよびイネの種子の処理である。

30

【0236】

下記でも述べるように、本発明の有効成分または組成物を用いて遺伝子組み換え種子を処理することは、特に重要である。これは、殺虫特性を有するポリペプチドまたはタンパク質の発現を可能とする少なくとも1種の異種遺伝子を含む植物種子を指すものである。遺伝子組み換え種子中の異種遺伝子は、例えばバチルス種（*Bacillus*）、リゾビウム種（*Rhizobium*）、シュドモナス種（*Pseudomonas*）、セッタティア種（*Serratia*）、トリコデルマ種（*Trichoderma*）、クラウイバクテル種（*Clavibacter*）、グロムス種（*Glomus*）またはグリオクラディウム種（*Gliocladium*）などの微生物由来であることができる。この異種遺伝子は好ましくは、バチルス種由来であり、その場合に、その遺伝子産物はヨーロッパアンコーンボラー（*European corn borer*）および／またはウエスタンコーンルートワーム（*Western corn rootworm*）に対して有効である。より好ましくは、異種遺伝子はバチルス・トゥリングエンシス（*Bacillus t*

40

50

hurugiensis) 由来である。

【0237】

本発明の文脈において、本発明の組成物は、単独でまたは好適な製剤で種子に施用される。好ましくは、種子は、処理中に損傷が起こらないようにする上で十分安定である状態で処理される。概して、種子の処理は、収穫と播種の間のいずれかの時点で行うことができる。植物から分離され、穂軸、殻、茎、外被、毛または果実の実を含まない種子を用いるのが一般的である。例えば収穫、浄化および乾燥させて含水率15重量%未満とした種子を用いることが可能である。あるいは、乾燥後に、例えば水で処理し、次に再乾燥した種子を用いることも可能である。

【0238】

種子を処理する場合、種子に施用される本発明の組成物の量および／または別の添加剤の量を、種子の発芽に悪影響がないか、得られる植物に損傷がないように選択するようしなければならない。これは特に、ある一定の施用量で植物毒性効果を示し得る有効成分の場合には確実に行われなければならない。

【0239】

本発明の組成物は直接施用することができる、すなわち他の成分を含んだり、希釈せずに施用することができる。通常、好適な製剤の形で種子に組成物を施用することが好ましい。好適な製剤および種子処理方法は当業者には公知であり、例えば下記の文書US4, 272, 417、US4, 245, 432、US4, 808, 430、US5, 876, 739、US2003/0176428、WO2002/080675、WO2002/028186に記載されている。

【0240】

本発明に従って使用することができる有効成分は、液剤、乳濁液、懸濁液、粉剤、泡剤、スラリーまたは種子用の他のコーティング組成物などの一般的な種子被覆製剤およびULV製剤に変換することができる。

【0241】

これらの製剤は、公知の方法で、有効成分または有効成分の組み合わせを例えば、一般的な増量剤などの一般的な添加剤、そして溶媒もしくは希釈剤、色素、湿展剤、分散剤、乳化剤、消泡剤、保存剤、二次増粘剤、接着剤、ジベレリン類および水と混合することで製造される。

【0242】

本発明に従って用いることができる種子被覆製剤中に存在させることができる有用な色素には、そのような目的に一般的な全ての色素がある。水溶解度が非常に低い顔料または水に可溶性色素を用いることができる。例としては、ローダミンB、C、I、ピグメントレッド112およびC、I、ソルベントレッド1の名称で知られる色素などがある。

【0243】

本発明に従って用いることができる種子被覆製剤中に存在させることができる有用な湿展剤には、濡れを促進し、活性な農芸化学成分の製剤に従来使用される物質がある。好ましく使用可能なものは、ナフタレンスルホン酸アルキル類、例えばナフタレンスルホン酸ジイソプロピルもしくはジイソブチルである。

【0244】

本発明に従って用いることができる種子被覆製剤中に存在させることができる有用な分散剤および／または乳化剤には、活性農芸化学成分の製剤で従来使用される全てのノニオン系、アニオン系およびカチオン系の分散剤である。好ましく使用可能なものは、ノニオン系もしくはアニオン系分散剤またはノニオン系もしくはアニオン系分散剤の混合物である。有用なノニオン系分散剤には特に、エチレンオキシド／プロピレンオキシドブロックポリマー類、アルキルフェノールポリグリコールエーテル類およびトリスチリルフェノールポリグリコールエーテル類およびそれらのリン酸化もしくは硫酸化誘導体などがある。好適なアニオン系分散剤は特に、リグノスルホネート類、ポリアクリル酸塩およびアリールスルホネート／ホルムアルデヒド縮合物である。

【0245】

本発明に従って用いることができる種子被覆製剤中に存在させることができる消泡剤には、活性農芸化学成分の製剤に従来使用される全ての発泡禁止化合物がある。好ましくはシリコン系消泡剤およびステアリン酸マグネシウムを用いることができる。

【0246】

本発明に従って使用することができる種子被覆製剤中に存在させることができる保存剤には、農芸化学組成物中でそのような目的で使用可能な全ての物質がある。例としては、ジクロロフェンおよびベンジルアルコールヘミホルマルなどがある。

【0247】

本発明に従って使用することができる種子被覆製剤中に存在させることができる二次増粘剤には、農芸化学組成物中でそのような目的で使用可能な全ての物質がある。好ましい例には、セルロース誘導体、アクリル酸誘導体、キサントラン、改質粘土および微粉碎シリカなどがある。

【0248】

本発明に従って使用することができる種子被覆製剤中に存在させることができる接着剤には、種子被覆製品で使用可能な全ての一般的な結合剤がある。好ましい例には、ポリビニルピロリドン、ポリ酢酸ビニル、ポリビニルアルコールおよびチロースなどがある。

【0249】

本発明に従って使用することができる種子被覆製剤中に存在させることができるジベレリン類は、好ましくはジベレリンA1、A3（＝ジベレリン酸）、A4およびA7であることができ、ジベレリン酸を使用するのが特に好ましい。ジベレリン類は公知である（R. Wegler "Chemie der Pflanzenschutz- und Schaedlingsbekämpfungsmittel" [Chemistry of Crop Protection Agents and Pesticides], vol. 2, Springer Verlag, 1970, pp. 401-412 参照）。

【0250】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤は、極めて広範な各種のうちのいずれかの種子を処理するために、直接使用することができるか、予め水で希釈した後に使用することができる。例えば、濃厚製剤または水で希釈することによって濃厚製剤から得ることができる調製物を、穀類、例えば、コムギ、オオムギ、ライムギ、エンバクおよびライコムギなどの種子を粉衣するのに使用可能であり、さらにはトウモロコシ、イネ、ナタネ、エンドウマメ、インゲンマメ、ワタ、ヒマワリおよびビートの種子を粉衣するのに使用可能であり、または極めて広範な各種野菜の種子を粉衣するのに使用可能である。本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤またはそれらの希釈された調製物は、トランスジェニック植物の種子を粉衣するのにも使用することも可能である。この場合、発現により形成された物質との相互作用において、さらなる相乗効果が生じることもあり得る。

【0251】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤または水を加えることでその種子粉衣製剤から調製される調製物を用いて種子を処理するには、種子粉衣に関して一般的に使用可能な全ての混合装置が有用である。具体的には、粉衣での手順は、種子を混合機の中に入れ、特定の所望量の種子粉衣製剤を、そのまま添加するかまたは予め水で希釈した後に添加し、そして製剤が種子の表面に均一に分配されるまで混合を行うというものである。適切であれば、続いて乾燥操作を行う。

【0252】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤の施用量は、比較的広い範囲内で変えることができる。それは、当該製剤中の有効成分の特定の含有量および種子によって決まる。一般に、有効成分組合せの施用量は、種子1kg当たり0.001から50gであり、好ましくは、種子1kg当たり0.01から15gである。

【0253】

さらに、本発明の式（I）の化合物は、極めて優れた抗真菌効果も有する。それらは、極めて広い抗真菌活性スペクトルを有しており、特に、皮膚糸状菌ならびに酵母菌、カビおよび二相性真菌類に対して〔例えば、カンジダ（*Candida*）種、例えば、カンジダ・アルビカンス（*Candida albicans*）、カンジダ・グラブラタ（*Candida glabrata*）に対して）、ならびに、エピデルモフィトン・フロコスム（*Epidermophyton floccosum*）、アスペルギルス（*Aspergillus*）種、例えばアスペルギルス・ニゲル（*Aspergillus niger*）およびアスペルギルス・フミガツス（*Aspergillus fumigatus*）、トリコフィトン（*Trichophyton*）種、例えばトリコフィトン・メンタグロフィテス（*Trichophyton mentagrophytes*）、ミクロスポロン（*Microsporon*）種、例えば、ミクロスポロン・カニス（*Microsporon canis*）およびミクロスポロン・アウドウイニイ（*Microsporon audouinii*）などに対して、極めて広い抗真菌活性スペクトルを有している。これら菌類の列挙は、包含される真菌スペクトルを決して限定するものではなく、単に例示的なものである。

10

【0254】

従って、本発明による式（I）の有効成分は、医薬用途と非医薬用途の両方で使用することができる。

【0255】

20

本発明の有効成分は、そのままでも使用することができるし、その製剤の形態およびそれから調製される使用形態、例えば、即時使用液剤、懸濁液、水和剤、ペースト剤、可溶性粉剤、粉剤および粒剤などの形態でも使用することができる。施用は、一般的な方法で、例えば、灌水、噴霧、霧化、散布、散粉、泡状散布、塗布などにより行う。有効成分を、超微量法により施用することも可能であり、または有効成分の調製物もしくは有効成分自体を土壤中に注入することも可能である。植物の種子を処理することも可能である。

【0256】

本発明の有効成分を殺菌剤として使用する場合、その施用量は、施用の種類に応じて、比較的広範囲内で変えることができる。本発明の有効成分の施用量は、以下の通りである。

30

【0257】

・植物の部分、例えば葉の処理の場合：0.1から10000 g/h a、好ましくは10から1000 g/h a、より好ましくは50から300 g/h a（当該施用が灌水または滴下による場合、特に、ロックウールまたはパーライトなどの不活性基質を用いる場合は、上記施用量はさらに低減させることもできる。）；

・種子処理の場合：種子100 kg当たり2から200 g、好ましくは種子100 kg当たり3から150 g、より好ましくは種子100 kg当たり2.5から25 g、さらに好ましくは種子100 kg当たり2.5から12.5 g；

・土壌処理の場合：0.1から10000 g/h a、好ましくは1から5000 g/h a。

40

【0258】

上記施用量は、例としてのみ挙げられており、本発明に関して限定するものではない。

【0259】

本発明の有効成分は、獣医学の分野で、そして動物の飼育で、既知の方法で、例えば、錠剤、カプセル、頓服、水薬、粒剤、ペースト剤、ボラス剤、フィードスルー法および坐剤などの形態で腸内投与することにより、例えば、注射（筋肉注射、皮下注射、静脈注射、腹腔内注射など）、インプラントなどにより非経口投与することにより、経鼻投与することにより、例えば、浸漬または薬浴、噴霧、ボアオンおよびスポットオン、洗浄および散粉の形態で経皮施用することにより、ならびに、有効成分を含有する成形品、例えば、首輪、耳標、尾標、足バンド、端綱、マーキング装置などを利用して用いられる。

50

【0260】

家畜、家禽、家庭動物などに使用する場合、式（I）の有効成分は、1から80重量%の量の有効成分を含有する製剤（例えば、粉剤、乳濁液、フロアブル剤など）として、直接使用することができるか、100倍から10000倍に希釈した後に使用することができるか、それらを薬浴として使用することができる。

【0261】

即時使用組成物には、他の殺虫剤を含ませても良く、1以上の殺菌剤を含ませても良い。

【0262】

可能な追加の混合相手に関しては、上記で挙げた殺虫剤および殺菌剤を参照する。

10

【0263】

同時に、本発明の化合物は、さらにまた、海水または淡海水と接触するもの（例えば、船体、スクリーン、網、建造物、係船設備および信号システム）を汚染に対して保護するのに使用することができる。

【0264】

さらに、本発明の化合物は、単独でまたは他の有効成分と組み合わせて、防汚剤組成物として用いることができる。

【0265】

本発明の処理方法は、遺伝子改変した生物（GMO）、例えば、植物または種子の処理で使用することができる。遺伝子改変した植物（またはトランスジェニック植物）は、異種遺伝子がゲノム中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、植物の外側で提供または組み立てられ、かつ、細胞核ゲノム、クロロプラストゲノムまたはミトコンドリアゲノムに導入すると、形質転換された植物に、対象となるタンパク質もしくはポリペプチドを発現することで、またはその植物に存在する他の遺伝子を低下また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、共抑制技術またはRNA i干渉—RNA i—を用いる）、新たなもしくは改善された農学的その他の特性を与える遺伝子を意味する。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。

20

【0266】

植物種または植物品種、それらの場所および成長条件（土壌、天候、生育期間、栄養）によっては、本発明の処理は、超加算的（「相乗」）効果をもたらすこともある。従って、例えば、実際に起こると予想される効果を超える、施用量の低減および／または活性スペクトルの拡大および／または本発明に従って使用することができる有効成分および組成物の活性の向上、植物成長の改善、高温もしくは低温に対する耐性の向上、干魃または水もしくは土壌の塩含有量に対する耐性向上、開花能の向上、収穫の簡易化、成熟の加速、収穫高の増大、より大きい果実、より高い植物、より濃い緑色の葉、より容易な開花、収穫物の品質向上および／または栄養価の上昇、収穫物の保存安定性および／または加工性の向上が可能である。

30

【0267】

一定の施用量では、本発明による有効成分の組み合わせは、植物における増強効果を有する可能性もある。したがって、それらは、望ましくない植物病原菌類および／または微生物および／またはウィルスによる攻撃に対する植物の防御システムの動員に適している。これは、適切である場合、例えば真菌に対する本発明による組み合わせの向上した活性の理由の一つであり得る。植物増強性（抵抗性誘発性）物質は、本願の関連において、続いて望ましくない植物病原菌および／または微生物および／またはウィルスを接種された場合に、処理される植物が、かなりの程度の望ましくない植物病原菌および／または微生物および／またはウィルスに対する抵抗性を示すように植物の防御システムを刺激することができる物質または物質の組み合わせも意味するものと理解すべきである。この場合、望ましくない植物病原菌および／または微生物および／またはウィルスとは、植物病原性

40

50

の真菌、細菌およびウィルスを意味するものと理解される。従って、本発明による物質は、処理後のある一定の時間内に、上記の病原体による攻撃に対して植物を保護するのに使用できる。保護が行われる期間は、有効成分で植物を処理してから、一般には1から10日間、好ましくは1から7日間に及ぶ。

【0268】

好ましくは本発明に従って処理される植物および植物品種には、その植物（育種および／またはバイオテクノロジー的手段によって得られたか否かとは無関係に）に特に有利で有用な形質を付与する遺伝物質を有する全ての植物が含まれる。

【0269】

やはり好ましくは本発明に従って処理される植物および植物品種は、1以上の生物ストレスに対して抵抗性である。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、ウィルスおよび／またはウィロイドなどの有害動物および有害微生物に対するより良好な防御を示す。

【0270】

やはり本発明に従って処理可能な植物および植物品種は、1以上の非生物ストレスに対して抵抗性である植物である。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、浸水、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、日陰忌避などがあり得る。

【0271】

やはり本発明に従って処理することができる植物および植物品種は、収穫特性向上を特徴とする植物である。例えば改善された植物の生理、成長および発達、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、発芽効率上昇および成熟加速の結果、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（ストレス条件およ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、節間の数および間隔、根の成長、種子の大きさ、果実の大きさ、鞘の大きさ、鞘および穂の数、鞘また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および倒伏耐性などがあるが、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、タンパク質含有量、油の含有量および組成、栄養価、非栄養化合物の減少、加工性改善および貯蔵安定性の向上などがある。

【0272】

本発明により処理され得る植物は、既にヘテロシスまたはハイブリッド活力の特徴を発現するハイブリッド植物であり、それによって、収量、活力、健康および生物ストレスおよび非生物ストレスに対する抵抗性がより高くなる。そのような植物は代表的には、同系交配雄性不稔親株（雌親）と別の同系交配雄性稔性親株（雄親）を交雑させることにより作られる。ハイブリッド種子は代表的には、雄性不稔植物から収穫され、栽培者に販売される。雄性不稔植物は、（例えばトウモロコシでは）、雄穂除去、すなわち雄性生殖器（または雄花）の物理的除去により作ることができる場合があるが、より代表的には、雄性不稔性は、植物ゲノムにおける遺伝的決定基の結果である。この場合、そして特に種子がハイブリッド植物から収穫するのが望まれる産物である場合に、雄性不稔性の原因となる遺伝的決定因子を含むハイブリッド植物での雄性不稔性が十分に回復されるようにすることが有用であるのが普通である。これは、雄性不稔性を担う遺伝的決定基を含むハイブリッド植物で雄性稔性を回復することができる適切な稔性回復遺伝子を雄親が有するようにすることで達成される。雄性不稔性の遺伝的決定基は細胞質に局在化していることができる。細胞質雄性不稔性（CMS）の例としては、例えばアブラナ種で記載されていた。しかしながら、雄性不稔性の遺伝的決定基は、細胞核ゲノムに局在化していることもできる。雄性不稔性植物は、遺伝子工学などの植物バイオテクノロジー法によっても得ることができる。雄性不稔性植物を得る上で特に好ましい手段は、WO 89/10396に記載されており、そこでは、例えば、バルナーゼなどのリボヌクレアーゼが、雄しべにあるタペタム細胞で選択的に発現される。次に稔性は、バルスターなどのリボヌクレアーゼ阻

10

20

30

40

50

害剤のタペータム細胞での発現によって回復することができる。

【0273】

本発明に従って処理することができる植物または植物品種（遺伝子工学などの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、また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。

【0274】

除草剤耐性植物は、例えばグリホセート耐性植物、すなわち除草剤であるグリホセートまたはその塩に対して耐性とされた植物である。例えば、グリホセート耐性植物は、酵素5-エノールピルビルシキマート-3-ホスファート合成酵素（EPSPS）をコードする遺伝子で植物を形質転換することで得ることができる。そのようなEPSPS遺伝子の例は、細菌サルモネラ・チフィムリウム（*Salmonella typhimurium*）のAroA遺伝子（突然変異CT7）、細菌アグロバクテリウム属種（*Agrobacterium* sp）のCP4遺伝子、ペチュニアEPSPS、トマトEPSPSもしくはオヒシバ（*eleusine*）EPSPSをコードする遺伝子である。それは、変異EPSPSであることもできる。グリホセート耐性植物は、グリホセートオキシドーレクターゼ酵素をコードする遺伝子を発現させることによって得ることもできる。グリホセート耐性植物は、グリホセートアセチルトランスフェラーゼ酵素をコードする遺伝子を発現させることによって得ることもできる。グリホセート耐性植物は、上述の遺伝子の天然突然変異を含む植物を選択することによっても得ることができる。

【0275】

他の除草剤耐性植物は、例えば酵素であるグルタミン合成酵素を阻害する除草剤、例えばピアラホス、ホスフィノトリシンまたはグルホシネートに対して耐性とされた植物である。そのような植物は、除草剤を解毒する酵素または阻害に対して耐性である酵素グルタミン合成酵素の突然変異体を発現させることによって得ることができる。一つのそのような有効な解毒性酵素は、ホスフィノトリシンアセチルトランスフェラーゼ（ストレプトミセス（*Streptomyces*）種からのbarまたはpatタンパク質など）をコードする酵素である。外来ホスフィノトリシンアセチルトランスフェラーゼを発現する植物も記載されている。

【0276】

さらに別の除草剤耐性植物は、酵素ヒドロキシフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼ（HPPD）を阻害する除草剤に対して耐性にされている植物でもある。ヒドロキシフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼは、パラヒドロキシフェニルピルビン酸（HPP）がホモゲンチジン酸に転換される反応を触媒する酵素である。天然の耐性HPPD酵素をコードする遺伝子または突然変異HPPD酵素をコードする遺伝子を用いて、HPPD阻害剤に対して耐性の植物を形質転換することができる。HPPD阻害剤に対する耐性はまた、HPPD阻害剤による天然HPPD酵素の阻害にもかかわらずホモゲンチジン酸の形成を可能にする、ある種の酵素をコードする遺伝子を用いて植物を形質転換することによっても得ることができる。HPPD耐性酵素をコードする遺伝子に加えて、プレフェン酸デヒドロゲナーゼをコードする遺伝子を用いて植物を形質転換することによって、HPPD阻害剤に対する植物の耐性を改善させることもできる。

【0277】

さらに別の除草剤抵抗性植物は、アセト乳酸合成酵素（ALS）阻害剤に対して耐性とされた植物である。公知のALS阻害剤には、例えばスルホニル尿素、イミダゾリノン、トリアゾロピリミジン類、プリミジニルオキシ（チオ）安息香酸化合物および／またはスルホニルアミノカルボニルトリアゾリノン系除草剤などがある。ALS酵素（アセトヒドロキシ酸合成酵素、AHASとも称される）における各種突然変異が、各種の除草剤または除草剤群に対する耐性を付与することが知られている。スルホニル尿素耐性植物およびイミダゾリノン耐性植物の製造は、国際特許公開WO1996/033270に記載されている。さらに別のスルホニル尿素およびイミダゾリノン耐性植物も、例えばWO200

7/024782に記載されている。

【0278】

イミダゾリノンおよび／またはスルホニル尿素に対して耐性である他の植物は、突然変異誘発、除草剤存在下での細胞培地での選別、または突然変異育種によって得ることができる。

【0279】

やはり本発明に従って処理することができる植物または植物品種（遺伝子工学などの植物バイオテクノロジー法によって得られる）は、昆虫耐性トランスジェニック植物、すなわち、ある種の標的昆虫による攻撃に対して耐性とした植物である。そのような植物は、形質転換によってまたはそのような昆虫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。

10

【0280】

本明細書で使用される場合、「昆虫耐性トランスジェニック植物」とは、次のものをコードするコード配列を含む少なくとも一つのトランス遺伝子を含む植物などがある。

【0281】

1) バチルス・チューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) 由来の殺虫性結晶タンパク質またはその殺虫性部分、例えば http://www.lifesci.sussex.ac.uk/Home/Neil_Crickmore/Bt/ にオンラインに記載された殺虫性結晶タンパク質またはその殺虫性部分、例えば Cry タンパク質分類 Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry2Ab、Cry3Aa または Cry3Bb のタンパク質またはそれらの殺虫性部分；または

20

2) バチルス・チューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) 由来の結晶タンパク質またはバチルス・チューリングエンシスからの第二の他の結晶タンパク質またはその部分の存在下で殺虫性であるその部分、例えば Cry34 および Cry35 結晶タンパク質から構成される二元毒素；または

3) バチルス・チューリングエンシス由来の2つの異なる殺虫性結晶タンパク質の部分を含むハイブリッド殺虫性タンパク質、例えば、上記1) のタンパク質のハイブリッドまたは上記2) のタンパク質のハイブリッド、例えば、コーン・イベント (maize event) MON98034 により産生される Cry1A.105 タンパク質 (WO2007/027777)；または

30

4) 標的昆虫種に対するより高い殺虫活性を得るために、および／または、影響を受ける標的昆虫種の範囲を拡大するために、および／またはクローニングもしくは形質転換時にコードDNAに導入される変化のために、いくつか、特に1から10のアミノ酸が別のアミノ酸により置換されている上記項目1) から3) のいずれか一つのタンパク質、例えばコーン・イベントMON863またはMON88017におけるCry3Bb1タンパク質またはコーン・イベントMIR604におけるCry3Aタンパク質；または

5) バチルス・チューリングエンシスまたはバチルス・セレウス (*Bacillus cereus*) 由来の殺虫性分泌タンパク質またはその殺虫性部分、例えば http://www.lifesci.sussex.ac.uk/home/Neil_Crickmore/Bt/vip.html で列挙される植物殺虫性タンパク質 (VIP)、例えば、VIP3Aa タンパク質分類からのタンパク質；または

40

6) バチルス・チューリングエンシスまたはB. セレウス由来の第二の分泌タンパク質存在下で殺虫性であるバチルス・チューリングエンシスまたはバチルス・セレウス由来の分泌タンパク質、例えば、VIP1A およびVIP2A タンパク質から構成される二元毒素；

7) バチルス・チューリングエンシスまたはバチルス・セレウス由来の異なる分泌タンパク質からの部分を含むハイブリッド殺虫性タンパク質、例えば上記1) におけるタンパク質のハイブリッドまたは上記2) におけるタンパク質のハイブリッド；または

8) 標的昆虫種に対するより高い殺虫活性を得るために、および／または、影響を受ける標的昆虫種の範囲を拡大するために、および／またはクローニングもしくは形質転換時にコードDNAで誘発される変化のために、いくつか、特に1から10のアミノ酸が別の

50

アミノ酸により置換されている上記項目1)から3)のいずれかのタンパク質（なおも殺虫性タンパク質をコードしている）、例えば、コットン・イベントCOT102におけるVIP3Aタンパク質。

【0282】

当然のことながら、本明細書で使用される場合の昆虫耐性トランスジェニック植物には、上記の分類1から8のいずれか一つのタンパク質をコードする遺伝子の組み合わせを含む植物が含まれる。1実施態様において、昆虫耐性植物は、影響を受ける標的昆虫種の範囲を拡大するため、または同じ標的昆虫種に対して殺虫性があるが異なる作用機序（例えば、昆虫での異なる受容体結合部位に結合する等）を有する異なるタンパク質を使用することによって植物に対する昆虫の抵抗性発達を遅延させるために、上記の分類1から8のいずれか一つのタンパク質をコードする複数のトランス遺伝子を含む。

10

【0283】

やはり本発明によって処理することができる植物または植物品種（遺伝子工学などの植物バイオテクノロジー法によって得たもの）は、非生物ストレスに対して耐性である。そのような植物は、形質転換によりまたはそのようなストレス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。特に有用なストレス耐性植物には以下のものなどがある。

【0284】

a. 植物細胞または植物においてポリ（ADP-リボース）ポリメラーゼ（PARP）遺伝子の発現および／または活性を低下させることができるトランス遺伝子を含む植物、
b. 植物または植物細胞のPARGコード遺伝子の発現および／または活性を低下させることができるストレス耐性促進トランス遺伝子を含む植物、
c. ニコチンアミダーゼ、ニコチネートホスホリボシルトランスフェラーゼ、ニコチン酸モノヌクレオチドアデニルトランスフェラーゼ、ニコチンアミドアデニンジヌクレオチド合成酵素またはニコチンアミドホスホリボシルトランスフェラーゼなどのニコチンアミドアデニンジヌクレオチドサルベージ生合成経路の植物機能性酵素をコードするストレス耐性促進トランス遺伝子を含む植物。

20

【0285】

やはり本発明によって処理することができる植物または植物品種（遺伝子工学などの植物バイオテクノロジー法によって得たもの）は、収穫産物の量、品質および／または貯蔵安定性の変化および／または収穫産物の具体的な成分の特性変化も示し、それには下記のものなどがある。

30

【0286】

1) 物理化学的特性、特にアミロース含有量またはアミロース／アミロペクチン比、分枝度、平均鎖長、側鎖分布、粘性挙動、ゲル化強度、デンプン粒度および／またはデンプン粒子形態において、野生型植物細胞または植物で合成されるデンプンと比較して変化していることで、特殊な用途により適したものとなる改質デンプンを合成するトランスジェニック植物、

2) 非デンプン炭水化物ポリマーを合成する、または遺伝子組み換えなしに野生型植物と比較して特性が変わっている非デンプン炭水化物ポリマーを合成するトランスジェニック植物。例としては、特にイヌリン型およびレバン型のポリフルクトースを産生する植物、 α -1, 4-グルカン類を産生する植物、 α -1, 6-分枝 α -1, 4-グルカン類を産生する植物、アルテルナンを産生する植物がある。

40

【0287】

3) ヒアルロナンを産生するトランスジェニック植物。

【0288】

やはり本発明によって処理することができる植物または植物品種（遺伝子工学などの植物バイオテクノロジー法によって得たもの）は、繊維特性が変化したワタ植物などの植物である。そのような植物は、形質転換によりまたはそのような繊維特性を変化させる突然変異を含む植物の選択により得ることができ、それには下記のものなどがある。

50

【0289】

- a) 改変型のセルロース合成酵素遺伝子を含むワタ植物などの植物、
- b) 改変型の *rs w 2* または *rs w 3* 相同性核酸を含むワタ植物などの植物、
- c) ショ糖リン酸合成酵素の発現が高くなったワタ植物などの植物、
- d) ショ糖合成酵素の発現が高くなったワタ植物などの植物、
- e) 繊維細胞の根底での原形質連絡制御のタイミングが、例えば繊維選択的 $\beta - 1, 3$ -グルカナーゼの低下によって変化しているワタ植物などの植物、
- f) 例えば *nod C* などの N-アセチルグルコサミントランスフェラーゼ遺伝子およびキチン合成遺伝子の発現により、反応性が変わった繊維を有するワタ植物などの植物。

【0290】

10

やはり本発明によって処理することができる植物または植物品種（遺伝子工学などの植物バイオテクノロジー法によって得たもの）は、油分プロファイルの特徴が変わったセイヨウアブラナまたは関連するアブラナ (*Brassica*) 植物などの植物である。そのような植物は、形質転換によりまたはそのような油分の特徴を変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、それには下記のものなどがある。

【0291】

- a) 高いオレイン酸含有量を有する油を産生するセイヨウアブラナ植物などの植物；
- b) 低いリノレン酸含有量を有する油を産生するセイヨウアブラナ植物などの植物；
- c) 低レベルの飽和脂肪酸を有する油を産生するセイヨウアブラナ植物などの植物。

【0292】

20

本発明によって処理することができる特に有用なトランスジェニック植物は、1以上の毒素をコードする1以上の遺伝子を有する植物であり、そして次の商品名 *YIELD GARD*（登録商標）（例えば、トウモロコシ、ワタ、ダイズ）、*Knock Out*（登録商標）（例えば、トウモロコシ）、*Bite Gard*（登録商標）（例えば、トウモロコシ）、*Bt-Xtra*（登録商標）（例えば、トウモロコシ）、*StarLink*（登録商標）（例えば、トウモロコシ）、*Bollgard*（登録商標）（ワタ）、*Nucotn*（登録商標）（ワタ）、*Nucotn 33B*（登録商標）（ワタ）、*Nature Gard*（登録商標）（例えば、トウモロコシ）、*Protecta*（登録商標）および *NewLeaf*（登録商標）（ジャガイモ）で販売されているトランスジェニック植物である。挙げておきべき除草剤耐性植物の例には、次の商品名 *Roundup Ready*（登録商標）（グリホセート耐性、例えば、トウモロコシ、ワタ、ダイズ）、*Liberty Link*（登録商標）（ホスフィノトリシン耐性、例えば、セイヨウアブラナ）、*IMI*（登録商標）（イミダゾリノン耐性）および *SCS*（登録商標）（スルホニル尿素耐性、例えばトウモロコシ）で販売されているトウモロコシ品種、ワタ品種およびダイズ品種がある。挙げておくべき除草剤耐性植物（除草剤耐性となるよう従来の方法で育種された植物）には、*Clearfield*（登録商標）の名称（例えばトウモロコシ）で販売されている品種などがある。

30

【0293】

本発明により処理することができる特に有用なトランスジェニック植物は、形質転換事象または形質転換事象の組み合わせを含む植物であり、それは例えば各種の国または地域の規制当局からのデータベースに列記されたものである（例えば、http://gmoinfo.jrc.it/gmp_browser.aspx および <http://www.agbios.com/database.php> を参照する）。

40

【0294】

本発明によれば、上記で挙げられている植物は、本発明による一般式 (I) の化合物および／または有効成分混合物を用いて、特に有利に処理することができる。有効成分または混合物に関して上記で言及されている好ましい範囲は、これら植物の処理にも当てはまる。特に強調すべき点は、本明細書中において具体的に言及されている化合物または混合物を用いた植物の処理である。

【0295】

50

従って本発明の有効成分または組成物は、処理してから一定期間にわたり言及した病原体による攻撃から植物を保護するのに用いることができる。保護を提供する期間は、通常は有効成分で植物を処理してから1から28日間、好ましくは1から14日間、特に好ましくは1から10日間、非常に好ましくは1から7日間、または種子処理から200日以内にわたる。

【0296】

本発明の式(I)の有効成分の製造および使用を、下記の実施例で説明する。しかしながら本発明は、これらの実施例に限定されるものではない。

【0297】

一般的注記：別段の断りがない限り、全てのクロマトグラフィー精製および分離は、シリカゲルで、0:100酢酸エチル/シクロヘキサンから100:0酢酸エチル/シクロヘキサンの溶媒勾配を用いて行われる。

【0298】

化合物(I-5)の製造

段階1

4-[4-(5-{2-[(メチルスルホニル)アミノ]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-カルボン酸 tert-ブチル(XVIIIf-1)

4-{4-[(Z/E) -(ヒドロキシイミノ)メチル]-1,3-チアゾール-2-イル}ピペリジン-1-カルボン酸 tert-ブチル(1.35g)およびN-(2-ビニルフェニル)メタンスルホンアミド(1.11g)の酢酸エチル(20mL)中溶液に、室温で炭酸水素カリウム(2.17g)およびN-クロロコハク酸イミド(0.58g)を加え、次に水3滴を加えた。反応混合物を50℃で終夜攪拌し、酢酸エチルおよび水を加え、混合物を酢酸エチルで抽出した。有機抽出液を硫酸ナトリウムで脱水し、減圧下に濃縮した。残留物をクロマトグラフィーによって精製した。これにより、4-[4-(5-{2-[(メチルスルホニル)アミノ]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-カルボン酸 tert-ブチル(0.94g)が得られた。

【0299】

段階2

4-[4-(5-{2-[(メチルスルホニル)アンモニオ]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]ピペリジニウム・ジクロライド(XIIIf-1)

4-[4-(5-{2-[(メチルスルホニル)アミノ]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-カルボン酸 tert-ブチル(900mg)の1,4-ジオキサン(10mL)中溶液に0℃で、4Mの塩化水素/1,4-ジオキサン溶液(6.66mL)を滴下した。反応混合物を0℃で攪拌し、徐々に昇温させて室温とした。終夜攪拌後、溶媒および過剰の塩化水素を除去した。これによって、4-[4-(5-{2-[(メチルスルホニル)アンモニオ]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]ピペリジニウム・ジクロライド(1.00g)を得た。

【0300】

段階3

N-(2-{3-[2-(1-{[5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-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)メタンスルホンアミド(I-5)

4-[4-(5-{2-[(メチルスルホニル)アンモニオ]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]ピペリジニウム・ジクロライド(201mg)、[5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1

10

20

30

40

50

H-ピラゾール-1-イル] 酢酸 (104 mg) およびトリエチルアミン (51 mg) をジクロロメタン (10 mL) に溶かし、混合物を10分間攪拌する。混合物をさらに10分間攪拌してから、ヘキサフルオロリン酸ブモトリス (ピロリジノ) ホスホニウム (254 mg) を加える。反応混合物を室温で2時間攪拌する。減圧下に溶媒を除去した後、残留物をクロマトグラフィーによって精製する。これによって、N-(2-{3-[2-(1-{[5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-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) メタンスルホンアミド (107 mg) が得られる。

【0301】

化合物 (I-4) の製造

段階 1

N-(2-{3-[2-(1-{[2, 5-ビス (ジフルオロメチル) フェニル] 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) メタンスルホンアミド (I-4)

I-5 (段階 3) と同様にして、4-[4-(5-{2-[(メチルスルホニル) アンモニオ] 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] ピペリジニウム・ジクロライド (298 mg) および [2, 5-ビス (ジフルオロメチル) フェニル] 酢酸 (175 mg) を変換した。これによって、N-(2-{3-[2-(1-{[2, 5-ビス (ジフルオロメチル) フェニル] 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) メタンスルホンアミド (170 mg) を得た。

【0302】

化合物 (I-6) の製造

段階 1

N-[2, 5-ビス (ジフルオロメチル) フェニル]-4-[4-(5-{2-[(メチルスルホニル) アミノ] 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-カルボキサミド (I-6)

4-[4-(5-{2-[(メチルスルホニル) アンモニオ] 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] ピペリジニウム・ジクロライド (202 mg) のジクロロメタン (5 mL) およびトリエチルアミン (51 mg) 中懸濁液に室温で、1, 4-ビス (ジフルオロメチル)-2-イソシアナトベンゼン (100 mg) および 1, 8-ジアザビシクロ [5. 4. 0] ウンデク-7-エン (DBU) 1 滴を加えた。混合物を室温で2時間攪拌し、飽和塩化アンモニウム溶液を加えた。水相を除去し、酢酸エチルによって抽出した。合わせた有機相を硫酸ナトリウムで脱水し、減圧下に濃縮した。残留物をクロマトグラフィーによって精製した。これによって、N-[2, 5-ビス (ジフルオロメチル) フェニル]-4-[4-(5-{2-[(メチルスルホニル) アミノ] 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-カルボキサミド (150 mg) を得た。

【0303】

式 (I-3) の化合物の製造

段階 1

4-{4-[5-(2-ホルミルフェニル)-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-カルボン酸 tert-ブチル (XVIIIf-2)

4-{4-[(Z/E)-(ヒドロキシイミノ) メチル]-1, 3-チアゾール-2-イル} ピペリジン-1-カルボン酸 tert-ブチル (5.6 g) および 2-ビニルベンズアルデヒド (2.61 g) の酢酸エチル (70 mL) 中溶液に室温で、炭酸水素カリウム (7.23 g) および N-クロロコハク酸イミド (2.31 g) を加え、次に水 3 滴を

10

20

30

40

50

加えた。反応混合物を60℃で3日間攪拌し、酢酸エチルおよび水を加え、混合物を酢酸エチルで抽出した。有機抽出液を硫酸ナトリウムで脱水し、減圧下に濃縮した。残留物をクロマトグラフィーによって精製した。展開された生成物は、4-〔4-〔5-(2-ホルミルフェニル)-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-カルボン酸tert-ブチル(5.69g)である。

【0304】

段階2

4-〔4-〔5-(2-ホルミルフェニル)-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〕ピペリジニウムクロライド(XIIIb-2)

10

I-5(段階2)と同様にして、4-〔4-〔5-(2-ホルミルフェニル)-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-カルボン酸tert-ブチル(5.1g)を変換した。これによって、4-〔4-〔5-(2-ホルミルフェニル)-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〕ピペリジニウムクロライド(4.35g)を得た。

【0305】

段階3

N-(5-クロロ-2-メチルフェニル)-4-〔4-〔5-(2-ホルミルフェニル)-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-カルボキサミド(I-3)

20

4-〔4-〔5-(2-ホルミルフェニル)-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〕ピペリジニウムクロライド(1.44g)のジクロロメタン(30mL)およびジイソプロピルエチルアミン(0.73mL)中懸濁液に室温で、4-クロロ-2-イソシアナト-1-メチルベンゼン(700mg)および1, 8-ジアザビシクロ[5.4.0]ウンデク-7-エン(DBU)1滴を加えた。混合物を室温で終夜攪拌し、水を加えた。水相を除去し、酢酸エチルで抽出した。合わせた有機相を硫酸ナトリウムで脱水し、減圧下に濃縮した。残留物をクロマトグラフィーによって精製した。これによって、N-(5-クロロ-2-メチルフェニル)-4-〔4-〔5-(2-ホルミルフェニル)-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-カルボキサミド(1.23g)を得た。

30

【0306】

化合物(I-7)の精製

2-〔3-〔2-(1-〔5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-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〕ベンズアルデヒド(I-7)

〔5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル〕酢酸(900mg)のジクロロメタン(20mL)中溶液に、0℃で、オキサリクロライド(1.50g)およびN,N-ジメチルホルムアミド1滴を加える。反応混合物を室温で2時間攪拌する。溶媒および過剰の試薬を減圧下に除去する。固体残留物を再度ジクロロメタンに溶かし、0℃で4-〔4-〔5-(2-ホルミルフェニル)-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〕ピペリジニウムクロライド(1.49g)およびジイソプロピルエチルアミン(2.05mL)のジクロロメタン(20mL)中溶液に滴下する。反応混合物を室温で終夜攪拌する。次に、濃炭酸水素ナトリウムをそれに加え、水相を除去し、酢酸エチルで抽出する。合わせた有機相を硫酸ナトリウムで脱水し、濃縮する。カラムクロマトグラフィーによる精製によって、2-〔3-〔2-(1-〔5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-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,

40

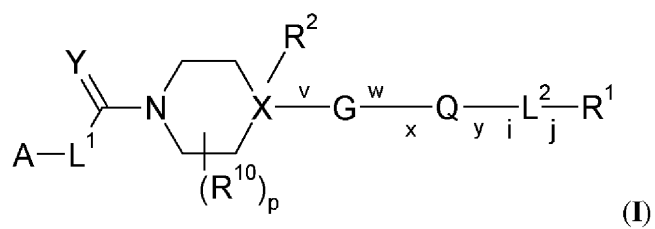
50

5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-5-イル}ベンズアルデヒド(2.00g)が得られる。

【実施例】

【0307】

【化32】

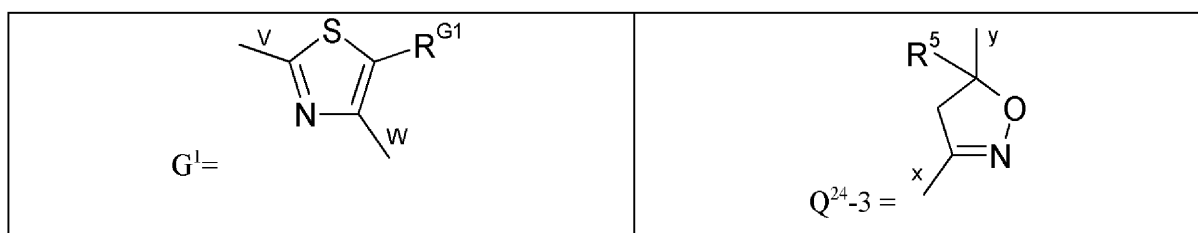


10

表1に挙げた構造要素 G^1 および Q^{24-3} は下記のように定義される。

【0308】

【化33】



20

表1に挙げた全ての化合物について、 $p = 0$ および $L^2 =$ 直接結合、 $R^2 = H$ である。

【0309】

表1

【0310】

【表 1】

実施例	A	L ¹	Y	X	G	R ⁶¹	Q	R ⁵	R ¹	LogP
1	5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル	CH ₂	0	C	G ¹	H	Q ²⁴ -3	H	3-ホルミルフェニル	2.83[a]
2	5-クロロ-2-メチルフェニル	NH	0	C	G ¹	H	Q ²⁴ -3	H	3-ホルミルフェニル	3.05[a]
3	5-クロロ-2-メチルフェニル	NH	0	C	G ¹	H	Q ²⁴ -3	H	2-ホルミルフェニル	3.35[a]
4	2,5-ビス(ジフルオロメチル)フェニル	CH ₂	0	C	G ¹	H	Q ²⁴ -3	H	2-[(メチルスルホニル)アミノ]フェニル	2.81[a]
5	5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル	CH ₂	0	C	G ¹	H	Q ²⁴ -3	H	2-[(メチルスルホニル)アミノ]フェニル	
6	2,5-ビス(ジフルオロメチル)フェニル	NH	0	C	G ¹	H	Q ²⁴ -3	H	2-[(メチルスルホニル)アミノ]フェニル	2.72[a]
7	5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル	CH ₂	0	C	G ¹	H	Q ²⁴ -3	H	2-ホルミルフェニル	3.12[a]
8	5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル	CH ₂	0	C	G ¹	H	Q ²⁴ -3	H	2,6-ジフルオロ-3-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル	
9	5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル	CH ₂	0	C	G ¹	H	Q ²⁴ -3	H	3-フルオロ-2-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル	
10	5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル	CH ₂	0	C	G ¹	H	Q ²⁴ -3	H	3-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル	3.49[a]; 3.3[b]
11	5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル	CH ₂	0	C	G ¹	H	Q ²⁴ -3	H	2-クロロ-6-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル	3.62[a]; 3.53[b]
12	5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル	CH ₂	0	C	G ¹	H	Q ²⁴ -3	H	2-フルオロ-6-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル	3.35[a]; 3.27[b]
13	5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル	CH ₂	0	C	G ¹	H	Q ²⁴ -3	H	2-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル	3.47[a]; 3.37[b]
14	3,5-ビス(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル	CH ₂	0	C	G ¹	H	Q ²⁴ -3	H	2-[(シクロプロピルカルボニル)オキシ]フェニル	4.04[a]
15	3-(ジフルオロメチル)-5-メチル-1H-ピラゾール-1-イル	CH ₂	0	C	G ¹	H	Q ²⁴ -3	H	2-(プロト-2-イン-1-イルオキシ)-4-メトキシフェニル	3.28[a]
16	3,5-ビス(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル	CH ₂	0	C	G ¹	H	Q ²⁴ -3	H	2-(シクロプロピルメトキシ)フェニル	4.59[a]
17	5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル	CH ₂	0	C	G ¹	H	Q ²⁴ -3	H	2-(シクロプロピルメトキシ)フェニル	4.03[a]
18	5-(ジフルオロメチル)-3-メチル-1H-ピラゾール-1-イル	CH ₂	0	C	G ¹	H	Q ²⁴ -3	H	2-(アリルオキシ)フェニル	3.42[a]; 3.33[b]
19	5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル	CH ₂	0	C	G ¹	H	Q ²⁴ -3	H	3-(アリルオキシ)-2,6-ジフルオロフェニル	

10

20

30

40

実施例	A	L ¹	Y	X	G	R ^{G1}	Q	R ⁵	R ¹	LogP
20	3-(ジフルオロメチル)-5-メチル-1H-ピラゾール-1-イル	CH ₂	0	C	G ¹	H	Q ²⁴⁻³	H	4-クロロ-2-(プロップ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル	3.37[a];3.36[b]
21	3-(ジフルオロメチル)-5-メチル-1H-ピラゾール-1-イル	CH ₂	0	C	G ¹	H	Q ²⁴⁻³	H	2,4-ジクロロ-6-(プロップ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル	3.66[a];3.57[b]
22	3-(ジフルオロメチル)-5-メチル-1H-ピラゾール-1-イル	CH ₂	0	C	G ¹	H	Q ²⁴⁻³	H	2-(アリルオキシ)-4-メチルフェニル	3.62[a];3.66[b];
23	3-(ジフルオロメチル)-5-メチル-1H-ピラゾール-1-イル	CH ₂	0	C	G ¹	H	Q ²⁴⁻³	H	4-メチル-2-(プロップ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル	3.23[a];3.23[b];
24	3-(ジフルオロメチル)-5-メチル-1H-ピラゾール-1-イル	CH ₂	0	C	G ¹	H	Q ²⁴⁻³	H	2-(アリルオキシ)-4,6-ジクロロフェニル	3.95[a];3.97[b];
25	2,5-ジメチルフェニル	NH	0	C	G ¹	H	Q ²⁴⁻³	H	2-(アリルオキシ)-6-フルオロフェニル	3.64[a];3.62[b]
26	5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル	CH ₂	0	C	G ¹	H	Q ²⁴⁻³	H	4-メチル-2-(プロップ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル	3.67[a];3.61[b]
27	3-(ジフルオロメチル)-5-メチル-1H-ピラゾール-1-イル	CH ₂	0	C	G ¹	H	Q ²⁴⁻³	H	2-(シクロプロピルメトキシ)-4-メトキシフェニル	3.5[a]
28	3-(ジフルオロメチル)-5-メチル-1H-ピラゾール-1-イル	CH ₂	0	C	G ¹	H	Q ²⁴⁻³	H	2-(シクロプロピルメトキシ)-6-フルオロフェニル	3.44[a]
29	5-(ジフルオロメチル)-3-メチル-1H-ピラゾール-1-イル	CH ₂	0	C	G ¹	H	Q ²⁴⁻³	H	2-(プロップ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル	3.03[a]
30	5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル	CH ₂	0	C	G ¹	H	Q ²⁴⁻³	H	2-(アリルオキシ)フェニル	3.86[a];3.73[b]
31	3-(ジフルオロメチル)-5-メチル-1H-ピラゾール-1-イル	CH ₂	0	C	G ¹	H	Q ²⁴⁻³	H	2-フルオロ-6-(プロップ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル	2.92[a]
32	3,5-ビス(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル	CH ₂	0	C	G ¹	H	Q ²⁴⁻³	H	2-(プロップ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル	3.91[a]
33	3,5-ビス(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル	CH ₂	0	C	G ¹	H	Q ²⁴⁻³	H	2-(アリルオキシ)フェニル	4.38[a]
34	5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル	CH ₂	0	C	G ¹	H	Q ²⁴⁻³	H	2-[(メチルスルホニル)メチル]フェニル	2.6[a]
35	5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル	CH ₂	0	C	G ¹	H	Q ²⁴⁻³	H	2-[(メチルスルフィニル)メチル]フェニル	2.34[a]
36	5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル	CH ₂	0	C	G ¹	H	Q ²⁴⁻³	H	2-[(エチルスルフィニル)メチル]フェニル	2.53[a]
37	5-(ジフルオロメチル)-3-メチル-1H-ピラゾール-1-イル	CH ₂	0	C	G ¹	H	Q ²⁴⁻³	CH ₃	2-フルオロ-6-(プロップ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル	3.11[a];3.12[b];
38	2,5-ジメチルフェニル	NH	0	C	G ¹	H	Q ²⁴⁻³	H	2-クロロ-6-(プロップ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル	3.68[a];3.57[b]

10

20

30

40

実施例	A	L ¹	Y	X	G	R ⁶¹	Q	R ⁵	R ¹	LogP
39	5-クロロ-2-メチルフェニル	NH	0	C	G ¹	H	Q ²⁴⁻³	H	2-(アリルオキシ)-6-クロロフェニル	4.21[a];4.11[b]
40	5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル	CH ₂	0	C	G ¹	H	Q ²⁴⁻³	H	3-[(シクロプロピルカルボニル)オキシ]フェニル	3.53[a];3.47[b]
41	5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル	CH ₂	0	C	G ¹	H	Q ²⁴⁻³	H	3-(アリルオキシ)フェニル	3.62[a];3.68[b];
42	2,5-ジメチルフェニル	NH	0	C	G ¹	H	Q ²⁴⁻³	H	2-(アリルオキシ)-6-クロロフェニル	3.98[a];3.91[b]
43	5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル	CH ₂	0	C	G ¹	H	Q ²⁴⁻³	H	2-[(2,2,2-トリフルオロエトキシ)メチル]フェニル	3.77[a]
44	5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル	CH ₂	0	C	G ¹	H	Q ²⁴⁻³	H	2-[(2-メトキシエトキシ)メチル]フェニル	3.28[a]
45	2,5-ジメチルフェニル	NH	0	C	G ¹	H	Q ²⁴⁻³	H	2-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル	3.43[a];3.41[b]
46	2,5-ジメチルフェニル	NH	0	C	G ¹	H	Q ²⁴⁻³	H	2-(アリルオキシ)フェニル	3.91[a];3.81[b]
47	5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル	CH ₂	0	C	G ¹	H	Q ²⁴⁻³	H	4-[(シクロプロピルカルボニル)オキシ]フェニル	3.49[a];3.4[b]
48	5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル	CH ₂	0	C	G ¹	H	Q ²⁴⁻³	H	2-クロロ-6-[(シクロプロピルカルボニル)オキシ]フェニル	3.73[a];3.64[b]
49	5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル	CH ₂	0	C	G ¹	H	Q ²⁴⁻³	H	2-フルオロ-6-(2-メトキシエトキシ)フェニル	3.28[a];3.17[b]
50	5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル	CH ₂	0	C	G ¹	H	Q ²⁴⁻³	H	2-(アリルオキシ)-6-クロロフェニル	3.94[a];3.83[b]
51	5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル	CH ₂	0	C	G ¹	H	Q ²⁴⁻³	H	2-(アリルオキシ)-6-フルオロフェニル	3.7[a];3.61[b]
52	5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル	CH ₂	0	C	G ¹	H	Q ²⁴⁻³	H	2-(アリルオキシ)-3-フルオロフェニル	3.97[a];3.84[b]
53	5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル	CH ₂	0	C	G ¹	H	Q ²⁴⁻³	H	2-フルオロ-6-ホルミルフェニル	3.03[a];2.95[b]
54	5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル	CH ₂	0	C	G ¹	H	Q ²⁴⁻³	H	2-[(シクロプロピルカルボニル)オキシ]-3-フルオロフェニル	3.62[a];3.5[b]
55	5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル	CH ₂	0	C	G ¹	H	Q ²⁴⁻³	H	2-(2-メトキシエトキシ)フェニル	3.37[a];3.25[b]
56	5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル	CH ₂	0	C	G ¹	H	Q ²⁴⁻³	H	2-[(シクロプロピルカルボニル)オキシ]フェニル	3.52[a];3.41[b]

10

20

30

40

log P値は、下記の方法を用いて逆相カラム (C18) でのHPLC (高速液体クロマトグラフィー) によって、EEC通達79/831補遺V. A8に従って測定した。

50

【0311】

〔a〕酸性範囲内でのLC-MS測定は、溶離液として0.1%ギ酸水溶液およびアセトニトリル（0.1%ギ酸を含む）；10%アセトニトリルから95%アセトニトリルの直線勾配を用いてpH2.7で行う。

【0312】

〔b〕中性範囲内でのLC-MS測定は、溶離液として0.001M炭酸水素アンモニウム水溶液およびアセトニトリル；10%アセトニトリルから95%アセトニトリルの直線勾配を用いてpH7.8で行う。

【0313】

較正は、log P値が既知である（二つの連続するアルカノン間の線形補間によって保持時間に基づいて求めたlog P値）未分岐のアルカン-2-オン類（3から16個の炭素原子を有する）を用いて行う。

10

【0314】

$\lambda_{\max}$ 値は、200nmから400nmのUVスペクトラムを用いてクロマトグラフィーシグナルの最大値で求めた。

【0315】

選択された実施例のNMRデータNMRピークリスト方法

選択された実施例の ^1H NMRデータを、 ^1H NMRピークのリストの形で示す。各シグナルピークについて、最初にppm単位での δ 値と次に小括弧内のシグナル強度を列記している。異なるシグナルピークについての δ 値-シグナル強度値のペアを、セミコロンによって互いに隔てて列記している。

20

【0316】

従って、一つの実施例についてのピークリストは、

δ_1 （強度 $_1$ ）； δ_2 （強度 $_2$ ）；．．．．．； δ_i （強度 $_i$ ）；．．．．．； δ_n （強度 $_n$ ）
の形を取る。

【0317】

【表 2】

実施例 1、溶媒:DMSO、分光計:399.95MHz

10.0344(6.63); 8.0579(0.79); 8.0400(6.68); 7.9295(3.74); 7.8988(2.27); 7.8831(2.00);
 7.8801(2.32); 7.7478(1.88); 7.7285(2.24); 7.6635(2.24); 7.6446(2.92); 7.6255(1.19);
 6.4922(4.46); 5.8980(1.40); 5.8784(1.71); 5.8708(1.52); 5.8515(1.21); 5.3605(0.36);
 5.3405(0.97); 5.2983(2.90); 5.2496(2.81); 5.2072(0.87); 4.3847(1.15); 4.3527(1.13);
 4.0571(0.96); 4.0393(2.31); 4.0216(2.35); 4.0036(1.55); 3.9837(2.26); 3.9560(2.66);
 3.9405(1.98); 3.9130(1.45); 3.4474(1.79); 3.4278(2.00); 3.4041(2.39); 3.3845(3.03);
 3.3262(49.36); 3.3125(313.38); 3.2424(1.57); 2.8718(0.91); 2.8449(1.44); 2.8143(0.81);
 2.6743(0.45); 2.6701(0.49); 2.5053(62.03); 2.5010(65.38); 2.3326(0.53); 2.3277(0.56);
 2.2097(16.00); 2.1319(1.48); 2.1068(2.42); 2.0766(1.41); 2.0049(1.06); 2.0012(1.21);
 1.9971(1.55); 1.9870(8.57); 1.8437(0.61); 1.8238(1.08); 1.7936(0.95); 1.7640(0.44);
 1.6093(0.63); 1.5889(1.03); 1.5799(1.02); 1.5581(0.98); 1.5287(0.44); 1.1930(2.83);
 1.1854(0.97); 1.1752(4.77); 1.1574(2.31); -0.0002(1.06);

実施例 2、溶媒:DMSO、分光計:399.95MHz

10.0350(7.37); 9.9023(0.41); 8.6412(0.39); 8.1288(3.28); 8.0347(7.77); 7.9318(3.17);
 7.9024(1.25); 7.8992(1.80); 7.8956(1.04); 7.8836(1.44); 7.8803(2.04); 7.8768(1.27);
 7.7490(1.35); 7.7328(1.52); 7.7297(1.99); 7.6636(1.95); 7.6446(2.84); 7.6256(1.17);
 7.3336(3.23); 7.3281(3.30); 7.1991(2.18); 7.1786(2.94); 7.0833(2.27); 7.0777(2.14);
 7.0630(1.58); 7.0574(1.50); 5.8976(1.13); 5.8781(1.35); 5.8703(1.29); 5.8507(1.16);
 4.1731(1.81); 4.1396(1.90); 4.0578(1.32); 4.0400(3.70); 4.0222(3.72); 4.0044(1.30);
 3.9854(1.31); 3.9578(1.48); 3.9421(1.68); 3.9147(1.44); 3.4505(1.74); 3.4309(1.76);
 3.4073(1.67); 3.3878(1.85); 3.3567(1.71); 3.3193(212.77); 3.0448(1.07); 3.0392(1.19);
 3.0104(2.19); 2.9815(1.25); 2.5411(0.60); 2.5108(12.77); 2.5065(22.65); 2.5021(28.64);
 2.4977(19.62); 2.4934(9.27); 2.1877(0.40); 2.1557(15.50); 2.0936(1.51); 2.0679(1.65);
 1.9877(16.00); 1.7197(0.52); 1.7101(0.66); 1.6880(1.28); 1.6799(1.42); 1.6579(1.27);
 1.6495(1.19); 1.6282(0.48); 1.6190(0.39); 1.1935(4.47); 1.1757(8.72); 1.1579(4.30);
 -0.0002(0.43);

実施例 3、溶媒:DMSO、分光計:399.95MHz

10.1834(6.76); 8.1195(3.33); 8.0328(1.90); 8.0289(1.95); 8.0231(0.70); 8.0126(2.50);
 8.0099(2.53); 8.0020(8.12); 7.7367(0.79); 7.7335(0.83); 7.7178(2.01); 7.6990(1.52);
 7.6957(1.42); 7.6241(1.99); 7.6159(2.62); 7.6074(2.57); 7.5974(1.90); 7.5894(1.20);
 7.3298(3.23); 7.3243(3.27); 7.1963(2.20); 7.1758(2.98); 7.0813(2.24); 7.0758(2.11);
 7.0610(1.60); 7.0554(1.51); 6.4452(1.19); 6.4290(1.35); 6.4174(1.33); 6.4011(1.21);
 4.1613(1.78); 4.1278(1.89); 4.0899(1.41); 4.0620(1.65); 4.0462(1.79); 4.0401(1.35);
 4.0222(1.56); 4.0185(1.60); 4.0045(0.46); 3.3155(190.78); 3.2923(3.19); 3.2755(1.02);
 3.2660(0.58); 3.2268(1.72); 3.2106(1.68); 3.1831(1.57); 3.1669(1.55); 3.0251(1.23);
 2.9958(2.25); 2.9668(1.27); 2.5107(11.92); 2.5065(21.69); 2.5020(27.90); 2.4977(19.76);
 2.4935(9.77); 2.1503(16.00); 2.0743(1.51); 2.0485(1.71); 1.9879(4.94); 1.6994(0.51);
 1.6904(0.61); 1.6686(1.31); 1.6612(1.39); 1.6386(1.30); 1.6311(1.21); 1.6090(0.50);
 1.5996(0.40); 1.1935(1.36); 1.1758(2.65); 1.1580(1.31); -0.0002(2.28);

実施例 4、溶媒:DMSO、分光計:399.95MHz

9.2859(0.81); 8.0295(0.39); 8.0173(6.58); 7.7187(1.27); 7.6986(1.91); 7.6011(1.48);
 7.5812(1.08); 7.5052(2.29); 7.4373(1.17); 7.4208(1.52); 7.4168(1.40); 7.4057(0.47);
 7.3939(0.45); 7.3784(1.58); 7.3680(2.66); 7.3618(4.78); 7.3593(4.89); 7.3491(1.42);
 7.3429(1.39); 7.3367(1.18); 7.3266(0.51); 7.3204(0.50); 7.2856(1.04); 7.2187(1.17);
 7.1489(2.16); 7.0796(2.37); 7.0128(1.09); 6.9403(1.18); 6.1207(0.97); 6.0995(1.21);
 6.0927(1.20); 6.0723(1.00); 5.7464(4.98); 4.4407(0.61); 4.4116(0.63); 4.0778(0.63);
 4.0485(0.87); 4.0392(0.98); 4.0115(2.08); 3.9904(1.99); 3.9505(1.30); 3.9228(1.16);
 3.9068(1.34); 3.8789(1.04); 3.3752(1.57); 3.3642(2.39); 3.3080(1524.29); 3.2856(11.89);
 3.2635(3.70); 3.2426(2.20); 3.2286(1.24); 3.2084(0.77); 3.1559(0.42); 3.1400(0.52);
 3.0603(1.03); 3.0358(16.00); 2.9393(0.46); 2.8903(1.36); 2.8331(0.56); 2.7997(0.92);
 2.7683(0.57); 2.7316(1.19); 2.6739(1.32); 2.6692(1.64); 2.6647(1.30); 2.5392(2.28);
 2.5221(7.36); 2.5090(93.05); 2.5046(173.22); 2.5002(226.03); 2.4958(157.39);
 2.4914(75.79); 2.3316(1.14); 2.3269(1.48); 2.3224(1.12); 2.0849(1.22); 2.0691(1.99);
 1.9867(1.36); 1.9079(0.38); 1.7282(0.53); 1.7038(0.50); 1.5642(0.54); 1.5398(0.53);

10

20

30

40

1. 2373(0.48); 1.1925(0.44); 1.1749(0.77); 1.1571(0.41); -0.0002(4.82);

実施例 5、溶媒:DMSO、分光計:399.95MHz

9.2895(1.04); 8.0347(0.61); 8.0224(6.52); 7.4399(1.29); 7.4356(0.88); 7.4228(1.56);
7.4191(1.32); 7.4070(0.46); 7.4029(0.38); 7.3981(0.62); 7.3923(0.44); 7.3782(1.60);
7.3679(3.08); 7.3624(5.05); 7.3596(4.74); 7.3499(1.29); 7.3461(0.94); 7.3426(1.20);
7.3366(0.93); 7.3268(0.41); 7.3205(0.35); 6.4907(3.72); 6.1225(1.00); 6.1019(1.23);
6.0951(1.18); 6.0744(1.01); 5.3418(0.63); 5.2993(2.10); 5.2489(2.11); 5.2062(0.63);
4.3833(0.64); 4.3517(0.68); 4.0571(0.33); 4.0393(0.99); 4.0216(1.04); 4.0036(0.56);
3.9893(0.65); 3.9556(1.68); 3.9278(1.16); 3.9117(1.37); 3.8841(1.04); 3.6914(0.58);
3.4098(0.54); 3.3999(0.46); 3.3897(0.68); 3.3809(1.08); 3.3716(0.76); 3.3639(0.87);
3.3518(0.89); 3.3415(0.94); 3.3111(259.73); 3.2902(3.79); 3.2674(2.30); 3.2469(1.47);
3.2388(0.80); 3.1410(0.38); 3.0627(1.24); 3.0367(16.00); 2.8689(0.47); 2.8397(0.83);
2.8127(0.49); 2.5227(0.93); 2.5094(15.18); 2.5051(28.85); 2.5006(38.17); 2.4962(26.96);
2.4919(13.31); 2.2395(0.55); 2.2089(13.78); 2.1942(1.10); 2.1356(0.66); 2.1070(1.31);
2.0692(0.96); 1.9868(4.35); 1.8229(0.53); 1.8181(0.54); 1.7939(0.54); 1.5861(0.53);
1.5774(0.55); 1.5554(0.54); 1.5469(0.49); 1.1928(1.19); 1.1750(2.37); 1.1572(1.17);
-0.0002(3.61);

10

実施例 6、溶媒:DMSO、分光計:399.95MHz

9.2891(0.72); 8.6090(2.11); 8.0212(5.44); 7.7010(1.17); 7.6808(1.36); 7.5331(1.79);
7.4826(1.13); 7.4629(0.95); 7.4392(0.99); 7.4219(1.32); 7.3812(0.58); 7.3765(1.02);
7.3737(0.84); 7.3657(2.95); 7.3610(4.08); 7.3486(1.19); 7.3386(0.95); 7.3329(0.62);
7.3231(0.41); 7.3165(0.33); 7.2175(1.04); 7.2125(0.84); 7.0783(2.26); 6.9389(1.27);
6.1220(0.82); 6.1014(1.01); 6.0944(0.95); 6.0738(0.82); 5.7462(2.07); 4.1756(1.13);
4.1420(1.16); 4.0571(1.24); 4.0392(3.64); 4.0215(3.66); 4.0037(1.25); 3.9569(0.80);
3.9293(0.95); 3.9132(1.04); 3.8857(0.86); 3.3658(0.95); 3.3562(1.26); 3.3115(379.65);
3.2929(3.24); 3.2881(3.63); 3.2699(1.15); 3.2492(0.96); 3.0674(0.78); 3.0335(14.21);
3.0093(0.89); 2.6696(0.36); 2.5395(0.51); 2.5227(1.67); 2.5094(21.20); 2.5050(39.09);
2.5006(50.66); 2.4961(34.76); 2.4917(16.36); 2.3273(0.33); 2.2178(0.36); 2.1093(0.96);
2.0839(1.04); 2.0692(0.85); 1.9868(16.00); 1.7223(0.39); 1.7017(0.78); 1.6925(0.89);
1.6709(0.81); 1.6622(0.78); 1.6401(0.32); 1.1928(4.42); 1.1750(8.83); 1.1572(4.29);
-0.0002(3.01);

20

実施例 7、溶媒:DMSO、分光計:399.95MHz

10.1836(3.67); 8.0340(1.04); 8.0300(1.06); 8.0234(0.39); 8.0136(1.65); 8.0089(4.95);
7.7370(0.43); 7.7337(0.44); 7.7181(1.11); 7.6992(0.83); 7.6958(0.77); 7.6247(1.02);
7.6151(1.42); 7.6082(1.43); 7.5965(0.99); 7.5902(0.70); 6.4891(2.20); 6.4455(0.64);
6.4295(0.73); 6.4178(0.72); 6.4016(0.65); 5.3357(0.39); 5.2934(1.36); 5.2448(1.33);
5.2022(0.40); 4.3745(0.40); 4.3415(0.42); 4.0904(0.73); 4.0623(0.98); 4.0582(1.38);
4.0465(1.15); 4.0403(3.76); 4.0225(3.92); 4.0047(1.32); 3.9801(0.39); 3.9464(0.42);
3.3867(0.33); 3.3675(0.44); 3.3582(0.71); 3.3486(0.53); 3.3119(67.25); 3.2901(1.13);
3.2567(0.61); 3.2245(1.14); 3.2083(0.92); 3.1808(0.82); 3.1646(0.81); 2.8299(0.49);
2.5242(0.45); 2.5109(5.48); 2.5066(9.98); 2.5022(12.87); 2.4978(8.97); 2.4934(4.35);
2.2075(8.36); 2.1937(0.49); 2.1142(0.38); 2.0859(0.79); 2.0539(0.45); 1.9879(16.00);
1.8041(0.33); 1.5593(0.33); 1.1937(4.44); 1.1759(8.69); 1.1581(4.32); -0.0002(1.14);

30

実施例 8、溶媒:DMSO、分光計:399.95MHz

8.0325(7.66); 7.3371(0.58); 7.3239(0.66); 7.3135(1.27); 7.3006(1.28); 7.2903(0.80);
7.2774(0.69); 7.1557(0.88); 7.1517(0.92); 7.1310(1.53); 7.1282(1.53); 7.1075(0.72);
7.1039(0.75); 6.4985(4.27); 6.0167(1.08); 5.9957(1.29); 5.9867(1.24); 5.9655(1.13);
5.7569(5.74); 5.3556(0.89); 5.3130(2.67); 5.2626(2.59); 5.2199(0.87); 4.8983(6.61);
4.8924(6.85); 4.3934(0.74); 4.3595(0.79); 4.0554(0.42); 4.0376(1.27); 4.0198(1.32);
4.0018(0.93); 3.9614(0.79); 3.9404(0.88); 3.9094(0.93); 3.8967(1.11); 3.8666(0.96);
3.6481(1.57); 3.6423(3.36); 3.6365(1.60); 3.5741(1.15); 3.5528(1.15); 3.5305(0.96);
3.5096(0.94); 3.4245(0.50); 3.4152(0.35); 3.4055(0.61); 3.3964(1.06); 3.3870(0.61);
3.3773(0.38); 3.3676(0.56); 3.3225(46.65); 3.3203(44.06); 3.2718(1.05); 3.2434(0.58);
2.8715(0.52); 2.8411(0.95); 2.8131(0.55); 2.6702(0.42); 2.5056(48.88); 2.5012(65.94);

40

2.4967(48.92); 2.3322(0.35); 2.3279(0.48); 2.3234(0.37); 2.2090(16.00); 2.1483(0.73);
2.1167(1.47); 2.0843(0.81); 1.9886(5.44); 1.8305(0.63); 1.8063(0.59); 1.5951(0.59);
1.5861(0.66); 1.5648(0.62); 1.5551(0.59); 1.2350(0.41); 1.1921(1.52); 1.1744(2.98);
1.1565(1.49); -0.0002(0.53);

実施例 9、溶媒:DMSO、分光計:601.6MHz

8.7986(0.66); 8.0310(8.32); 7.2995(0.69); 7.2946(0.76); 7.2881(0.78); 7.2832(1.00);
7.2804(0.82); 7.2719(1.20); 7.2640(0.95); 7.1948(0.36); 7.1816(1.61); 7.1749(4.74);
7.1700(3.35); 7.1620(0.57); 6.5053(4.59); 5.9817(1.40); 5.9695(1.56); 5.9631(1.51);
5.9508(1.40); 5.3490(1.22); 5.3206(2.49); 5.2629(2.73); 5.2345(1.36); 4.8465(6.64);
4.8425(6.72); 4.3803(0.78); 4.3586(0.79); 4.0454(0.50); 4.0335(1.51); 4.0217(1.53);
4.0099(0.52); 3.9788(0.77); 3.9559(0.83); 3.9467(1.50); 3.9279(1.43); 3.9180(1.55);
3.8993(1.28); 3.6568(1.85); 3.6528(3.82); 3.6489(1.79); 3.4028(0.55); 3.3968(0.89);
3.3901(0.81); 3.3837(1.25); 3.3774(2.09); 3.3501(362.44); 3.3314(3.04); 3.3265(6.83);
3.3192(2.05); 3.2812(0.72); 3.2610(1.14); 3.2424(0.63); 3.2383(0.57); 2.8500(0.59);
2.8293(1.02); 2.8118(0.58); 2.6180(0.80); 2.6150(1.06); 2.6119(0.84); 2.5955(0.79);
2.5427(0.99); 2.5242(3.13); 2.5211(3.99); 2.5180(4.63); 2.5091(55.45); 2.5062(113.82);
2.5032(153.80); 2.5002(112.48); 2.4973(52.77); 2.3904(0.76); 2.3874(1.01); 2.3844(0.75);
2.2050(16.00); 2.1921(0.42); 2.1267(1.03); 2.1005(1.11); 2.0964(1.11); 2.0782(2.13);
1.9905(6.69); 1.8367(0.34); 1.8301(0.39); 1.8160(0.72); 1.8101(0.76); 1.7955(0.72);
1.7897(0.64); 1.5690(0.67); 1.5625(0.69); 1.5483(0.68); 1.5424(0.63); 1.3968(0.37);
1.2335(0.74); 1.1860(1.93); 1.1741(4.07); 1.1623(2.09); 1.0380(0.32); 1.0270(0.34);
0.0052(1.52); -0.0002(35.42); -0.0058(1.08);

実施例 10、溶媒:CDC13、分光計:601.6MHz

7.6273(0.91); 7.4326(0.47); 7.3245(1.12); 7.3113(2.15); 7.2984(1.22); 7.2614(79.66);
7.0850(0.46); 7.0266(1.81); 7.0149(3.61); 6.9414(1.96); 6.9281(1.90); 6.3350(6.11);
5.7351(0.78); 5.0298(0.59); 5.0034(1.60); 4.9737(1.59); 4.9498(0.67); 4.7006(6.62);
4.6971(6.67); 4.5817(0.75); 4.5629(0.74); 4.0571(0.70); 4.0394(0.71); 3.8349(0.45);
3.8052(0.32); 3.7893(0.48); 3.6444(0.47); 3.4187(0.48); 3.3067(1.20); 2.9123(0.46);
2.8936(0.76); 2.8745(0.47); 2.5105(2.38); 2.5071(4.68); 2.5036(2.42); 2.3239(16.00);
2.2858(0.44); 2.2145(0.77); 2.1812(0.75); 2.1629(0.73); 1.7957(0.89); 1.7805(0.92);
1.5858(3.62); 1.4787(0.49); 1.4746(0.46); 1.4321(1.33); 1.4270(0.89); 1.3860(0.35);
1.3330(0.38); 1.2928(0.37); 1.2844(0.63); 1.2542(3.05); 0.8801(0.63); 0.8683(0.37);
0.0695(1.41); 0.0051(0.53); -0.0002(16.59); -0.0057(0.63);

実施例 11、溶媒:DMSO、分光計:399.95MHz

7.9670(8.64); 7.4133(1.85); 7.3924(3.34); 7.3720(2.70); 7.1610(3.06); 7.1564(4.00);
7.1394(2.50); 7.1365(3.63); 6.5060(4.36); 6.4950(0.39); 6.2328(1.37); 6.2083(1.80);
6.2020(1.66); 6.1773(1.43); 5.7627(11.00); 5.3613(0.91); 5.3188(2.57); 5.2700(2.50);
5.2274(0.88); 5.2032(0.65); 4.8393(0.34); 4.8331(0.35); 4.7990(2.74); 4.7910(3.74);
4.7843(2.83); 4.7503(0.35); 4.7444(0.36); 4.3942(0.68); 4.3599(0.74); 4.0366(0.92);
4.0188(0.97); 4.0009(0.80); 3.9622(0.72); 3.7667(1.02); 3.7357(1.26); 3.7247(1.76);
3.6937(1.42); 3.5797(1.57); 3.5551(1.60); 3.5376(1.16); 3.5132(1.16); 3.4596(1.33);
3.4540(3.13); 3.4482(1.65); 3.4179(0.79); 3.3720(137.80); 3.3689(145.30); 3.3659(149.76);
3.3644(142.87); 3.3627(145.05); 3.3600(158.31); 3.3560(182.12); 3.3095(0.97);
3.3026(0.97); 3.2719(1.19); 3.2437(0.75); 3.0425(1.70); 2.8727(0.55); 2.8540(1.66);
2.8448(0.94); 2.8151(0.55); 2.6774(0.52); 2.6728(0.75); 2.6682(0.55); 2.5431(0.37);
2.5262(1.22); 2.5215(1.91); 2.5128(37.79); 2.5083(83.02); 2.5037(112.86); 2.4991(80.19);
2.4945(37.37); 2.3350(0.54); 2.3304(0.75); 2.3258(0.59); 2.2082(16.00); 2.1945(0.98);
2.1899(1.51); 2.1522(0.65); 2.1249(1.35); 2.0903(0.76); 2.0774(1.61); 1.9902(4.31);
1.8271(0.61); 1.8026(0.55); 1.5943(0.55); 1.5852(0.62); 1.5638(0.59); 1.5543(0.58);
1.1920(1.20); 1.1742(2.43); 1.1564(1.18); 0.0080(0.86); -0.0002(29.91); -0.0085(1.06);

実施例 12、溶媒:DMSO、分光計:399.95MHz

7.9807(7.00); 7.9525(2.03); 7.4372(0.62); 7.4201(0.81); 7.4161(1.37); 7.3992(1.36);
7.3953(0.92); 7.3783(0.71); 7.0116(2.03); 6.9903(1.83); 6.9152(1.03); 6.8897(1.23);
6.8681(0.97); 6.5040(3.54); 6.0725(0.87); 6.0502(1.06); 6.0421(1.05); 6.0198(0.93);
5.7619(3.47); 5.3612(0.79); 5.3185(2.23); 5.2681(2.18); 5.2254(0.77); 5.2021(0.39);

10

20

30

40

4.8549(2.83); 4.8494(4.94); 4.8440(2.89); 4.3947(0.60); 4.3602(0.65); 3.9953(0.56);
3.9617(0.63); 3.8129(0.58); 3.7816(0.67); 3.7697(0.84); 3.7394(0.76); 3.5560(1.45);
3.5502(3.42); 3.5443(1.54); 3.5246(1.00); 3.5023(1.02); 3.4818(0.82); 3.4598(0.76);
3.4187(0.44); 3.4089(0.41); 3.3998(0.66); 3.3913(1.02); 3.3798(0.82); 3.3704(1.02);
3.3457(545.02); 3.3221(4.34); 3.3102(1.10); 3.3056(1.13); 3.3023(1.08); 3.2853(0.48);
3.2711(1.05); 3.2430(0.56); 3.0425(0.81); 2.8905(16.00); 2.8710(0.48); 2.8540(0.86);
2.8400(0.81); 2.8132(0.46); 2.7305(13.08); 2.6765(0.51); 2.6719(0.75); 2.6675(0.56);
2.5251(1.29); 2.5116(41.13); 2.5073(87.25); 2.5029(117.49); 2.4984(86.16); 2.4940(42.72);
2.3339(0.59); 2.3295(0.81); 2.3250(0.63); 2.2085(13.04); 2.1948(1.13); 2.1521(0.59);
2.1218(1.21); 2.0879(0.69); 2.0769(1.06); 1.8268(0.53); 1.8037(0.49); 1.5934(0.48);
1.5834(0.56); 1.5624(0.51); 1.5537(0.50); 1.2342(0.40); -0.0002(8.23); -0.0082(0.39);

10

実施例 13、溶媒：DMSO、分光計：399.95MHz

14.0244(0.35); 8.7870(0.54); 8.0352(0.87); 8.0139(7.56); 7.9916(0.41); 7.4835(0.44);
7.3543(0.48); 7.3427(0.95); 7.3228(3.44); 7.3042(2.77); 7.2237(0.37); 7.1506(1.98);
7.1313(1.63); 7.0188(1.03); 7.0022(2.00); 6.9812(0.94); 6.4963(4.60); 6.4409(0.35);
5.8865(0.96); 5.8680(1.10); 5.8584(1.12); 5.8418(0.94); 5.7554(7.99); 5.3481(0.81);
5.3051(2.51); 5.2549(2.40); 5.2126(0.97); 4.9731(0.39); 4.8801(5.11); 4.8742(5.27);
4.8150(0.71); 4.3826(0.80); 4.3501(0.83); 4.0743(0.38); 4.0556(0.68); 4.0374(1.57);
4.0200(1.64); 4.0020(0.67); 3.9809(0.75); 3.9478(1.00); 3.9202(0.45); 3.8988(1.16);
3.8703(1.18); 3.8556(1.32); 3.8277(1.08); 3.6664(0.48); 3.5857(1.80); 3.5799(3.73);
3.5739(1.64); 3.4875(0.36); 3.4448(0.36); 3.3987(0.82); 3.3776(1.05); 3.3700(1.49);
3.3581(1.33); 3.3228(817.78); 3.2695(1.87); 3.2515(1.78); 3.2263(1.66); 3.2089(1.19);
2.8589(0.68); 2.8302(1.05); 2.8000(0.72); 2.6750(1.40); 2.6704(2.12); 2.6660(1.35);
2.5407(1.00); 2.5236(3.21); 2.5096(115.86); 2.5056(225.44); 2.5012(312.93);
2.4970(220.11); 2.4928(110.70); 2.3323(1.37); 2.3278(1.83); 2.3232(1.36); 2.2160(1.34);
2.2057(16.00); 2.1935(1.07); 2.1279(0.79); 2.0993(1.48); 2.0918(1.41); 2.0733(1.50);
2.0630(0.99); 1.9884(6.91); 1.9085(0.84); 1.8351(0.38); 1.8160(0.73); 1.7837(0.64);
1.6017(0.35); 1.5716(0.65); 1.5643(0.65); 1.5516(0.49); 1.5420(0.71); 1.5104(0.36);
1.2338(0.91); 1.1922(1.92); 1.1745(3.72); 1.1567(1.78); -0.0002(5.87);

20

実施例 14、溶媒：DMSO、分光計：399.95MHz

8.3198(0.45); 8.0443(16.00); 7.6053(8.46); 7.4479(2.82); 7.4440(3.38); 7.4289(3.83);
7.4249(4.61); 7.4157(1.89); 7.4115(1.78); 7.3965(3.75); 7.3921(3.24); 7.3771(3.07);
7.3727(2.56); 7.3116(2.76); 7.3090(3.00); 7.2927(4.30); 7.2903(4.41); 7.2742(1.69);
7.2714(1.67); 7.1953(0.33); 7.1890(0.37); 7.1773(4.76); 7.1747(4.70); 7.1646(0.64);
7.1572(4.19); 7.1547(3.90); 7.0597(0.56); 7.0538(0.44); 6.9641(0.42); 6.9357(0.32);
5.7610(2.36); 5.7415(2.76); 5.7327(2.75); 5.7131(2.43); 5.6385(1.87); 5.5956(4.12);
5.5268(4.32); 5.4837(1.93); 5.2693(1.37); 5.1452(0.97); 4.3548(1.53); 4.3219(1.65);
4.2712(0.57); 4.2535(0.57); 4.1720(0.81); 4.1542(0.81); 4.0376(0.50); 4.0198(0.52);
3.9738(1.43); 3.9402(1.61); 3.8975(2.31); 3.8689(2.63); 3.8543(2.98); 3.8258(2.50);
3.4591(6.28); 3.4189(2.28); 3.4100(1.64); 3.3991(1.84); 3.3896(2.54); 3.3804(1.64);
3.3705(1.13); 3.3608(1.37); 3.3524(0.85); 3.3033(1.33); 3.2908(3.27); 3.2715(5.00);
3.2551(1.06); 3.2475(3.40); 3.2283(2.80); 2.8827(1.10); 2.8529(1.97); 2.8254(1.12);
2.6763(0.67); 2.6719(0.93); 2.6674(0.70); 2.5251(2.77); 2.5116(51.56); 2.5073(103.29);
2.5028(137.32); 2.4983(103.49); 2.4940(53.38); 2.3383(0.39); 2.3341(0.72); 2.3296(0.98);
2.3250(0.76); 2.1282(1.37); 2.0962(2.94); 2.0665(1.68); 1.9896(2.19); 1.8721(0.77);
1.8557(1.68); 1.8402(2.83); 1.8344(2.00); 1.8291(2.06); 1.8213(2.02); 1.8092(1.64);
1.8011(1.32); 1.7709(1.16); 1.7423(0.46); 1.5818(0.52); 1.5725(0.61); 1.5514(1.21);
1.5424(1.31); 1.5208(1.42); 1.5096(1.32); 1.5013(0.75); 1.4976(0.58); 1.4893(1.15);
1.4832(0.66); 1.4775(0.66); 1.4697(0.52); 1.3973(6.91); 1.3362(0.81); 1.2837(0.58);
1.2659(1.15); 1.2587(0.35); 1.2486(1.33); 1.2341(0.81); 1.2155(0.95); 1.1977(1.80);
1.1929(0.73); 1.1798(1.22); 1.1751(1.33); 1.1611(0.85); 1.1573(0.83); 1.1435(0.42);
1.0719(0.82); 1.0639(1.00); 1.0562(1.20); 1.0509(2.43); 1.0454(3.02); 1.0299(5.26);
1.0181(3.59); 1.0131(5.32); 1.0065(4.05); 1.0009(2.53); 0.9945(2.60); 0.9852(2.73);
0.9784(2.29); 0.9715(1.96); 0.9603(2.81); 0.9461(1.55); 0.9397(1.46); 0.9268(0.72);
0.9190(0.42); 0.8188(0.79); 0.8116(1.69); 0.8057(0.80); 0.7989(0.71); 0.7916(1.70);

30

40

0.7858(1.34); 0.7792(1.57); 0.7723(1.40); 0.7679(1.82); 0.7604(0.79); 0.7031(0.49);
0.6996(0.42); 0.6916(0.93); 0.6717(0.48); 0.1459(0.40); 0.0080(3.19); -0.0002(88.57);
-0.0083(4.15); -0.1498(0.41);

実施例 15、溶媒:DMSO、分光計:399.95MHz

8.0022(6.06); 7.2119(2.20); 7.1906(2.38); 7.0017(1.16); 6.8645(2.76); 6.7274(1.32);
6.6819(2.46); 6.6761(2.69); 6.5676(1.45); 6.5618(1.32); 6.5464(1.38); 6.5405(1.27);
6.2950(2.93); 5.8001(0.91); 5.7812(1.08); 5.7726(1.04); 5.7536(0.91); 5.2633(0.66);
5.2211(2.00); 5.1739(1.99); 5.1317(0.66); 4.7914(3.28); 4.7856(3.33); 4.3874(0.60);
4.3555(0.64); 4.0550(0.61); 4.0372(1.88); 4.0194(2.07); 4.0016(1.16); 3.9720(0.63);
3.8129(0.51); 3.8030(0.90); 3.7752(1.07); 3.7601(1.52); 3.7498(16.00); 3.7327(1.19);
3.3994(0.46); 3.3898(0.41); 3.3804(0.62); 3.3705(1.06); 3.3443(19.58); 3.2887(1.45);
3.2698(1.23); 3.2462(1.44); 3.2269(1.21); 2.8478(0.42); 2.8168(0.73); 2.7894(0.42);
2.6759(0.35); 2.6714(0.50); 2.6667(0.36); 2.5246(1.35); 2.5111(28.23); 2.5067(57.28);
2.5022(77.36); 2.4977(59.44); 2.4933(31.35); 2.3335(0.45); 2.3290(0.59); 2.3246(0.45);
2.1850(11.90); 2.1215(0.63); 2.0914(1.22); 2.0625(0.73); 1.9894(8.21); 1.9090(6.30);
1.8492(0.43); 1.8437(0.49); 1.8203(4.10); 1.8147(8.12); 1.8090(4.37); 1.7947(0.89);
1.7870(0.79); 1.7650(0.65); 1.7334(0.36); 1.7090(0.40); 1.5650(0.52); 1.5556(0.57);
1.5342(0.54); 1.5248(0.51); 1.3972(4.83); 1.1924(2.19); 1.1746(4.35); 1.1568(2.16);
-0.0002(4.21);

10

実施例 16、溶媒:DMSO、分光計:399.95MHz

8.0006(2.31); 7.6034(1.53); 7.2960(0.90); 7.2769(1.11); 7.2613(0.46); 7.0222(0.79);
7.0014(0.64); 6.9487(0.48); 6.9297(0.81); 6.9115(0.38); 5.8714(0.37); 5.8527(0.45);
5.8428(0.41); 5.8247(0.38); 5.6335(0.34); 5.5902(0.75); 5.5240(0.77); 5.4812(0.35);
4.0375(0.46); 4.0198(0.47); 3.9353(0.34); 3.9227(0.42); 3.9055(0.37); 3.8967(0.66);
3.8798(0.68); 3.8683(0.49); 3.8608(0.68); 3.8417(0.85); 3.8254(0.59); 3.8173(0.39);
3.7974(0.51); 3.3817(0.40); 3.3519(0.84); 3.3277(40.80); 3.3089(0.72); 3.2908(0.55);
3.2726(0.39); 2.8544(0.37); 2.5065(34.94); 2.5021(44.66); 2.4978(32.56); 2.0951(0.53);
1.9892(1.91); 1.7901(0.47); 1.3975(16.00); 1.1926(0.65); 1.1748(1.22); 1.1635(0.38);
1.1569(0.69); 0.4971(0.47); 0.4926(0.48); 0.4770(0.35); 0.4719(0.39); 0.4383(0.41);
0.4355(0.42); 0.4156(0.53); 0.3161(0.39); 0.3042(1.21); 0.2920(1.16); 0.2798(0.33);
0.0074(0.34); -0.0002(6.70);

20

実施例 17、溶媒:DMSO、分光計:399.95MHz

7.9983(5.82); 7.2945(1.82); 7.2899(1.35); 7.2782(2.10); 7.2749(2.41); 7.2605(1.12);
7.2564(0.65); 7.0215(1.85); 7.0012(1.44); 6.9475(1.09); 6.9288(1.88); 6.9100(0.90);
6.4963(3.32); 5.8720(0.89); 5.8540(1.03); 5.8439(1.00); 5.8256(0.91); 5.3524(0.74);
5.3099(2.04); 5.2561(2.05); 5.2139(0.74); 4.3815(0.61); 4.3486(0.65); 4.0554(1.24);
4.0376(3.73); 4.0198(3.80); 4.0020(1.38); 3.9778(0.62); 3.9512(0.66); 3.9230(0.77);
3.9060(0.81); 3.8974(1.53); 3.8805(1.59); 3.8675(1.14); 3.8613(1.62); 3.8436(1.73);
3.8396(1.60); 3.8247(1.40); 3.8181(0.87); 3.7966(1.17); 3.4009(0.48); 3.3909(0.41);
3.3814(0.57); 3.3722(0.95); 3.3627(0.70); 3.3497(1.79); 3.3276(79.63); 3.3070(1.34);
3.2891(1.39); 3.2626(0.80); 3.2345(0.46); 2.8634(0.46); 2.8364(0.77); 2.8052(0.44);
2.6755(0.35); 2.6711(0.48); 2.6666(0.37); 2.5413(0.36); 2.5242(1.94); 2.5109(26.73);
2.5066(52.99); 2.5020(70.08); 2.4975(51.35); 2.4931(24.86); 2.3334(0.36); 2.3287(0.49);
2.3242(0.35); 2.2060(12.17); 2.1946(1.38); 2.1218(0.64); 2.0943(1.15); 2.0628(0.65);
1.9889(16.00); 1.8140(0.48); 1.8048(0.53); 1.7901(0.65); 1.7831(0.48); 1.7735(0.44);
1.5719(0.45); 1.5629(0.48); 1.5414(0.44); 1.3975(3.38); 1.2981(0.32); 1.2585(0.46);
1.1928(4.73); 1.1823(0.70); 1.1750(9.35); 1.1655(0.93); 1.1572(4.79); 1.1484(0.55);
0.5290(0.41); 0.5213(0.46); 0.5172(0.45); 0.5093(0.62); 0.5002(1.09); 0.4953(1.09);
0.4799(0.79); 0.4747(0.87); 0.4435(0.90); 0.4399(0.93); 0.4232(1.00); 0.4197(1.14);
0.4111(0.52); 0.3980(0.53); 0.3912(0.48); 0.3410(0.34); 0.3288(0.49); 0.3178(0.85);
0.3058(2.78); 0.2987(1.55); 0.2937(2.71); 0.2884(0.99); 0.2816(0.72); 0.2705(0.33);
0.0079(0.51); -0.0002(13.14); -0.0084(0.45);

30

40

実施例 18、溶媒:DMSO、分光計:399.95MHz

8.0100(7.83); 7.3118(1.40); 7.3083(1.78); 7.3041(1.62); 7.2943(2.33); 7.2897(2.40);
7.2853(1.75); 7.2763(1.44); 7.2721(0.74); 7.2072(1.33); 7.0725(3.05); 7.0619(2.31);

7.0512(0.40); 7.0415(1.80); 6.9747(1.29); 6.9548(2.22); 6.9378(2.47); 6.3833(3.14);
 6.0804(0.38); 6.0679(0.83); 6.0545(0.62); 6.0414(0.95); 6.0372(0.50); 6.0289(0.50);
 6.0246(1.01); 6.0117(0.70); 5.9981(1.01); 5.9857(0.48); 5.9181(1.13); 5.9002(1.30);
 5.8903(1.27); 5.8723(1.15); 5.7570(3.27); 5.4432(0.61); 5.4389(1.72); 5.4346(1.75);
 5.4303(0.63); 5.3999(0.53); 5.3956(1.50); 5.3913(1.52); 5.3870(0.54); 5.2461(1.93);
 5.2421(2.23); 5.2232(0.68); 5.2196(1.65); 5.2156(1.65); 5.2119(0.72); 5.1988(2.50);
 5.1594(2.44); 5.1170(0.61); 4.6326(2.29); 4.6277(2.51); 4.6207(2.41); 4.6155(2.15);
 4.3629(0.64); 4.3301(0.66); 4.0380(0.34); 4.0201(0.36); 4.0020(0.38); 3.9912(0.60);
 3.9560(0.65); 3.8912(1.23); 3.8632(1.40); 3.8483(1.59); 3.8205(1.34); 3.3920(0.47);
 3.3822(0.34); 3.3726(0.57); 3.3633(1.01); 3.3540(0.59); 3.3439(0.40); 3.3344(0.69);
 3.3217(20.52); 3.2980(1.00); 3.2864(1.56); 3.2684(1.90); 3.2434(1.82); 3.2358(0.93);
 3.2257(1.60); 3.2068(0.46); 2.8344(0.45); 2.8070(0.80); 2.7767(0.45); 2.5239(0.38);
 2.5104(8.89); 2.5060(18.38); 2.5015(24.50); 2.4969(17.47); 2.4925(8.24); 2.1608(16.00);
 2.1069(0.59); 2.0769(1.25); 2.0475(0.69); 1.9888(1.44); 1.7741(0.52); 1.7658(0.56);
 1.7431(0.51); 1.7356(0.48); 1.5590(0.50); 1.5502(0.54); 1.5283(0.51); 1.5194(0.49);
 1.1923(0.40); 1.1745(0.79); 1.1567(0.39); -0.0002(2.77);

実施例 19、溶媒：DMSO、分光計：399.95MHz

8.0312(8.75); 7.2693(0.58); 7.2561(0.65); 7.2458(1.28); 7.2329(1.27); 7.2224(0.79);
 7.2095(0.70); 7.1053(0.91); 7.1011(0.94); 7.0806(1.50); 7.0776(1.46); 7.0573(0.72);
 7.0529(0.72); 6.4986(4.24); 6.0692(0.43); 6.0559(0.90); 6.0428(0.88); 6.0295(1.08);
 6.0261(0.60); 6.0129(2.13); 5.9996(1.15); 5.9927(1.37); 5.9862(1.78); 5.9732(0.64);
 5.9624(1.15); 5.7570(0.58); 5.4267(0.69); 5.4226(1.94); 5.4184(1.98); 5.4144(0.73);
 5.3836(0.61); 5.3795(1.70); 5.3752(1.75); 5.3711(0.66); 5.3554(0.86); 5.3128(2.63);
 5.2955(0.92); 5.2922(1.94); 5.2882(1.83); 5.2621(4.13); 5.2201(0.87); 4.6447(2.44);
 4.6414(4.03); 4.6380(2.54); 4.6315(2.56); 4.6281(3.94); 4.6248(2.36); 4.3925(0.70);
 4.3596(0.74); 4.0555(0.72); 4.0377(2.18); 4.0199(2.24); 4.0020(1.21); 3.9612(0.74);
 3.9377(0.84); 3.9073(0.91); 3.8944(1.09); 3.8642(0.96); 3.5677(3.27); 3.5469(1.17);
 3.5247(0.95); 3.5037(0.94); 3.4241(0.52); 3.4148(0.36); 3.4049(0.61); 3.3955(1.10);
 3.3863(0.63); 3.3760(0.41); 3.3667(0.58); 3.3573(0.34); 3.3203(81.65); 3.2966(3.58);
 3.2716(0.97); 3.2433(0.53); 3.0430(0.53); 2.8705(0.50); 2.8545(0.64); 2.8441(0.89);
 2.8134(0.52); 2.6748(0.40); 2.6703(0.56); 2.6657(0.41); 2.5237(1.15); 2.5102(29.77);
 2.5058(61.50); 2.5012(81.81); 2.4966(58.12); 2.4922(27.28); 2.3328(0.40); 2.3279(0.56);
 2.3233(0.41); 2.2095(16.00); 2.1930(0.82); 2.1485(0.67); 2.1195(1.36); 2.0862(0.74);
 1.9886(9.64); 1.8292(0.58); 1.8061(0.53); 1.5944(0.55); 1.5857(0.61); 1.5651(0.56);
 1.5559(0.55); 1.3975(1.01); 1.1922(2.65); 1.1744(5.35); 1.1566(2.61); -0.0002(8.47);

実施例 20、溶媒：DMSO、分光計：601.6MHz

8.0151(9.12); 7.3155(3.02); 7.3017(3.39); 7.2357(3.79); 7.2325(3.96); 7.0807(2.16);
 7.0775(2.10); 7.0671(1.98); 7.0639(1.94); 6.9503(1.30); 6.8591(3.31); 6.7680(1.51);
 6.2923(3.51); 5.8374(1.29); 5.8259(1.41); 5.8191(1.38); 5.8074(1.30); 5.7541(10.11);
 5.2465(1.00); 5.2183(2.32); 5.1637(2.28); 5.1354(0.99); 4.9420(6.32); 4.9380(6.43);
 4.3777(0.68); 4.3555(0.71); 4.0469(0.32); 4.0350(1.02); 4.0232(1.03); 4.0113(0.38);
 3.9959(0.64); 3.9729(0.69); 3.8884(1.32); 3.8699(1.56); 3.8599(1.67); 3.8414(1.38);
 3.6384(1.82); 3.6345(4.09); 3.6305(1.81); 3.3844(0.56); 3.3781(0.34); 3.3717(0.62);
 3.3654(1.17); 3.3590(0.65); 3.3526(0.40); 3.3463(0.61); 3.3401(0.36); 3.3188(83.66);
 3.2697(0.51); 3.2545(2.10); 3.2430(1.81); 3.2303(0.59); 3.2261(1.89); 3.2145(1.53);
 2.8372(0.48); 2.8168(0.86); 2.7989(0.49); 2.6162(0.34); 2.6131(0.51); 2.6102(0.37);
 2.5224(0.87); 2.5194(1.10); 2.5163(1.02); 2.5074(23.48); 2.5044(53.22); 2.5014(75.43);
 2.4984(54.67); 2.4954(25.33); 2.3887(0.34); 2.3856(0.49); 2.3826(0.36); 2.1853(16.00);
 2.1700(0.43); 2.1154(0.59); 2.0879(0.88); 2.0601(0.65); 1.9884(4.41); 1.7835(0.53);
 1.7779(0.58); 1.7633(0.55); 1.7572(0.54); 1.5559(0.55); 1.5496(0.60); 1.5358(0.57);
 1.5295(0.54); 1.3359(0.43); 1.2588(0.34); 1.2497(0.56); 1.1870(1.23); 1.1751(2.46);
 1.1633(1.19); 0.0052(1.80); -0.0002(65.36); -0.0058(2.16);

実施例 21、溶媒：DMSO、分光計：399.95MHz

8.3164(0.44); 7.9600(8.55); 7.3175(3.41); 7.3128(4.35); 7.2756(4.09); 7.2709(3.55);
 7.0001(1.52); 6.8629(3.61); 6.7258(1.69); 6.2950(3.72); 6.1875(1.31); 6.1633(1.68);

10

20

30

40

6.1568(1.59); 6.1324(1.36); 5.7567(11.60); 5.2624(0.81); 5.2202(2.75); 5.1767(2.65);
 5.1344(0.80); 4.8983(0.34); 4.8920(0.36); 4.8581(2.93); 4.8500(3.96); 4.8434(2.94);
 4.8094(0.35); 4.8036(0.37); 4.3907(0.77); 4.3577(0.81); 4.0374(0.66); 4.0195(1.15);
 4.0022(0.65); 3.9783(0.79); 3.7710(1.02); 3.7399(1.26); 3.7287(1.71); 3.6977(1.38);
 3.5613(1.55); 3.5370(1.55); 3.5191(1.13); 3.4949(1.14); 3.4743(1.69); 3.4685(3.90);
 3.4627(1.72); 3.4108(0.56); 3.4015(0.45); 3.3911(0.69); 3.3820(1.22); 3.3725(0.78);
 3.3628(0.64); 3.3258(206.04); 3.3006(0.81); 3.2947(0.77); 3.2641(1.06); 3.2355(0.57);
 2.8630(0.55); 2.8332(0.98); 2.8054(0.54); 2.6753(0.82); 2.6708(1.17); 2.6663(0.88);
 2.5236(6.05); 2.5106(61.29); 2.5062(121.93); 2.5017(162.84); 2.4972(123.45);
 2.4930(63.26); 2.3374(0.43); 2.3329(0.86); 2.3285(1.16); 2.3240(0.88); 2.1878(16.00);
 2.1455(0.75); 2.1151(1.49); 2.0825(0.81); 1.9887(2.69); 1.7973(0.64); 1.7738(0.59);
 1.5841(0.59); 1.5759(0.65); 1.5544(0.62); 1.5458(0.58); 1.3354(0.34); 1.2981(0.40);
 1.2586(0.57); 1.2493(0.45); 1.2332(0.51); 1.1925(0.74); 1.1747(1.43); 1.1569(0.71);
 0.1460(0.49); 0.0159(0.96); 0.0079(4.30); -0.0002(106.55); -0.0083(4.46); -0.1498(0.50);

実施例 22、溶媒:DMSO、分光計:601.6MHz

8.3142(0.34); 7.9946(7.84); 7.1678(2.89); 7.1549(3.09); 6.9506(1.27); 6.8763(3.42);
 6.8594(3.09); 6.7684(3.08); 6.7568(1.77); 6.2920(3.60); 6.0513(0.42); 6.0431(0.92);
 6.0340(0.71); 6.0254(0.99); 6.0226(0.56); 6.0170(0.53); 6.0143(1.04); 6.0053(0.74);
 5.9966(1.03); 5.9884(0.49); 5.8617(1.21); 5.8495(1.34); 5.8433(1.28); 5.8310(1.21);
 5.7546(5.26); 5.4194(0.67); 5.4167(1.81); 5.4138(1.84); 5.4110(0.69); 5.3879(1.61);
 5.3850(1.63); 5.3822(0.61); 5.2475(1.04); 5.2255(1.92); 5.2228(2.29); 5.2197(2.66);
 5.2079(1.69); 5.2053(1.70); 5.1630(2.28); 5.1348(1.00); 4.6045(1.74); 4.5967(3.07);
 4.5888(1.72); 4.5750(0.34); 4.3765(0.70); 4.3542(0.74); 4.0348(0.33); 4.0230(0.35);
 3.9958(0.66); 3.9733(0.72); 3.8315(1.31); 3.8130(1.54); 3.8032(1.64); 3.7847(1.38);
 3.7377(0.60); 3.3858(0.59); 3.3795(0.38); 3.3729(0.67); 3.3666(1.18); 3.3605(0.69);
 3.3536(0.45); 3.3475(0.71); 3.3222(44.05); 3.3190(116.77); 3.2722(0.53); 3.2596(1.82);
 3.2475(2.02); 3.2313(1.88); 3.2191(1.46); 2.8397(0.50); 2.8194(0.91); 2.8017(0.50);
 2.6159(0.57); 2.6129(0.82); 2.6098(0.57); 2.5222(1.54); 2.5191(1.95); 2.5160(1.99);
 2.5071(40.12); 2.5042(87.09); 2.5011(121.31); 2.4981(87.79); 2.4951(40.80); 2.3885(0.58);
 2.3853(0.79); 2.3822(0.55); 2.2873(14.22); 2.1847(16.00); 2.1701(0.64); 2.1169(0.68);
 2.0884(0.99); 2.0612(0.69); 1.9883(1.39); 1.7829(0.56); 1.7775(0.60); 1.7631(0.57);
 1.7575(0.52); 1.5568(0.55); 1.5504(0.59); 1.5360(0.55); 1.5300(0.54); 1.2586(0.33);
 1.2494(0.42); 1.2351(0.37); 1.1867(0.40); 1.1748(0.77); 1.1630(0.39); 1.1387(0.54);
 0.0840(0.56); 0.0704(0.41); 0.0052(0.60); -0.0002(18.89); -0.0057(0.67);

実施例 23、溶媒:DMSO、分光計:600.13MHz

8.3129(0.35); 7.9980(8.12); 7.1849(2.82); 7.1720(3.04); 6.9642(3.46); 6.9516(1.32);
 6.8602(3.12); 6.8177(1.81); 6.8048(1.77); 6.7688(1.43); 6.2935(3.75); 5.8333(1.17);
 5.8212(1.30); 5.8150(1.26); 5.8027(1.20); 5.7541(9.04); 5.2463(0.99); 5.2179(2.31);
 5.1632(2.30); 5.1350(1.00); 4.8484(6.15); 4.8445(6.19); 4.3766(0.70); 4.3548(0.73);
 4.0350(0.63); 4.0232(0.64); 3.9961(0.66); 3.9727(0.71); 3.8409(1.23); 3.8224(1.43);
 3.8124(1.51); 3.7940(1.30); 3.5695(1.85); 3.5656(3.91); 3.5617(1.77); 3.3964(0.35);
 3.3923(0.56); 3.3852(0.84); 3.3793(0.75); 3.3719(1.08); 3.3667(1.90); 3.3611(1.61);
 3.3534(2.07); 3.3324(1876.28); 3.3130(1.81); 3.3099(1.34); 3.3001(0.44); 3.2903(0.39);
 3.2756(0.58); 3.2711(0.58); 3.2515(1.06); 3.2438(1.67); 3.2315(2.00); 3.2152(1.45);
 3.2031(1.41); 2.8391(0.48); 2.8184(0.91); 2.8009(0.50); 2.6199(0.75); 2.6170(1.59);
 2.6140(2.18); 2.6110(1.56); 2.6080(0.72); 2.5412(0.38); 2.5230(3.90); 2.5199(4.77);
 2.5168(4.61); 2.5079(123.47); 2.5050(264.64); 2.5019(362.99); 2.4989(259.62);
 2.4960(118.63); 2.3888(1.53); 2.3858(2.11); 2.3828(1.48); 2.3007(13.79); 2.1852(16.00);
 2.1711(0.66); 2.1187(0.61); 2.0909(0.94); 2.0644(0.69); 1.9885(2.71); 1.7854(0.55);
 1.7792(0.58); 1.7644(0.57); 1.7587(0.53); 1.5569(0.56); 1.5507(0.61); 1.5363(0.57);
 1.5305(0.56); 1.3354(0.58); 1.2981(0.40); 1.2586(0.54); 1.2494(0.71); 1.1867(0.75);
 1.1748(1.46); 1.1630(0.72); 0.0969(0.58); 0.0053(4.51); -0.0001(144.35); -0.0057(4.44);
 -0.1002(0.61);

実施例 24、溶媒:DMSO、分光計:399.95MHz

7.9487(9.14); 7.2585(3.72); 7.2537(4.34); 7.2009(3.95); 7.1961(3.40); 7.0001(1.54);

10

20

30

40

6.8629(3.75); 6.7258(1.74); 6.2956(3.55); 6.2149(1.35); 6.1918(1.71); 6.1839(1.57);
 6.1607(1.42); 5.7985(0.35); 5.7847(0.74); 5.7717(0.69); 5.7574(14.11); 5.7415(0.99);
 5.7283(0.83); 5.7152(0.96); 5.7015(0.48); 5.2670(1.27); 5.2629(2.06); 5.2589(1.98);
 5.2552(0.77); 5.2269(2.61); 5.2196(1.95); 5.2156(1.76); 5.2119(0.71); 5.1747(2.44);
 5.1324(0.84); 5.0184(1.75); 5.0150(1.72); 4.9921(1.62); 4.9887(1.61); 4.6251(0.50);
 4.6117(0.52); 4.5934(1.42); 4.5800(1.39); 4.5623(1.42); 4.5481(1.38); 4.5305(0.54);
 4.5162(0.50); 4.3903(0.70); 4.3565(0.74); 4.0375(0.76); 4.0196(1.20); 4.0021(0.60);
 3.9793(0.72); 3.7660(1.06); 3.7348(1.32); 3.7238(1.78); 3.6927(1.43); 3.5552(1.55);
 3.5320(1.56); 3.5130(1.14); 3.4899(1.13); 3.4182(0.50); 3.4088(0.34); 3.3989(0.59);
 3.3896(1.07); 3.3802(0.60); 3.3707(0.38); 3.3608(0.60); 3.3509(0.37); 3.3264(87.67);
 3.2992(0.64); 3.2682(0.96); 3.2394(0.52); 2.8672(0.49); 2.8375(0.88); 2.8104(0.50);
 2.6753(0.41); 2.6707(0.57); 2.6662(0.41); 2.5242(1.47); 2.5193(2.32); 2.5108(31.82);
 2.5063(63.80); 2.5017(83.72); 2.4971(60.62); 2.4926(28.73); 2.3331(0.43); 2.3285(0.59);
 2.3238(0.42); 2.1880(16.00); 2.1385(0.65); 2.1047(1.35); 2.0757(0.75); 1.9889(3.17);
 1.8040(0.56); 1.7956(0.60); 1.7732(0.58); 1.7656(0.53); 1.5815(0.56); 1.5726(0.61);
 1.5505(0.58); 1.5420(0.56); 1.3356(0.49); 1.2584(0.42); 1.2492(0.63); 1.2338(0.37);
 1.1924(0.89); 1.1746(1.72); 1.1568(0.85); 1.1382(0.62); 0.0079(1.93); -0.0002(59.95);
 -0.0085(1.93);

実施例 25、溶媒:DMSO、分光計:399.95MHz

8.0279(3.87); 7.9601(9.47); 7.3975(0.92); 7.3802(1.19); 7.3765(1.97); 7.3594(2.01);
 7.3557(1.30); 7.3385(1.02); 7.0489(2.67); 7.0297(3.22); 6.9979(3.52); 6.9363(2.80);
 6.9151(2.60); 6.8606(2.26); 6.8413(3.43); 6.8191(1.39); 6.1066(1.31); 6.0846(1.60);
 6.0760(1.51); 6.0540(1.37); 5.9311(0.45); 5.9178(0.95); 5.9047(0.93); 5.8915(1.12);
 5.8882(0.67); 5.8782(0.65); 5.8747(1.25); 5.8615(1.08); 5.8482(1.20); 5.8352(0.57);
 5.7593(6.99); 5.3448(0.79); 5.3410(2.09); 5.3369(2.15); 5.3330(0.85); 5.2977(1.81);
 5.2936(1.86); 5.2898(0.74); 5.1204(2.05); 5.1168(2.04); 5.0941(1.91); 5.0904(1.92);
 4.6232(0.44); 4.6102(0.41); 4.5907(2.08); 4.5780(3.26); 4.5707(1.59); 4.5669(1.99);
 4.5480(0.36); 4.5344(0.33); 4.1790(1.94); 4.1451(2.08); 4.1246(0.54); 4.1109(1.03);
 4.1069(0.47); 4.0195(0.32); 3.8018(0.92); 3.7708(1.07); 3.7589(1.35); 3.7289(1.23);
 3.5378(1.52); 3.5157(1.59); 3.5033(0.37); 3.4946(1.62); 3.4734(1.16); 3.3594(0.67);
 3.3299(55.60); 3.3119(0.73); 3.3021(0.80); 3.2932(0.41); 3.0164(1.33); 2.9868(2.49);
 2.9582(1.39); 2.6708(0.39); 2.5240(1.44); 2.5105(23.49); 2.5062(46.51); 2.5017(60.90);
 2.4971(44.34); 2.4928(21.71); 2.3331(0.33); 2.3284(0.42); 2.3240(0.32); 2.2329(16.00);
 2.1107(15.92); 2.0623(1.95); 1.9891(1.38); 1.7104(0.55); 1.7005(0.69); 1.6794(1.45);
 1.6707(1.63); 1.6485(1.53); 1.6407(1.42); 1.6187(0.63); 1.6094(0.50); 1.2152(0.41);
 1.1974(0.79); 1.1920(0.42); 1.1795(0.40); 1.1742(0.75); 1.1564(0.39); 1.0734(0.43);
 1.0561(0.43); -0.0002(1.81);

実施例 26、溶媒:DMSO、分光計:399.95MHz

8.0044(8.17); 7.1884(2.93); 7.1691(3.29); 6.9645(3.82); 6.8199(2.03); 6.8005(1.84);
 6.4986(4.42); 5.8416(1.17); 5.8235(1.36); 5.8141(1.34); 5.7957(1.22); 5.7589(1.32);
 5.3524(0.97); 5.3098(2.81); 5.2586(2.78); 5.2160(0.98); 4.8515(6.30); 4.8457(6.52);
 4.3839(0.79); 4.3506(0.83); 4.0554(0.99); 4.0376(3.04); 4.0198(3.09); 4.0020(1.13);
 3.9834(0.74); 3.9487(0.81); 3.8553(1.21); 3.8275(1.40); 3.8124(1.59); 3.7847(1.32);
 3.5799(1.54); 3.5741(3.36); 3.5683(1.55); 3.3983(0.53); 3.3890(0.37); 3.3788(0.65);
 3.3696(1.11); 3.3605(0.68); 3.3502(0.45); 3.3406(0.78); 3.3264(27.97); 3.3027(1.83);
 3.2875(0.62); 3.2541(2.36); 3.2356(1.71); 3.2111(1.44); 3.1929(1.37); 2.8556(0.60);
 2.8258(0.99); 2.7983(0.57); 2.5240(0.54); 2.5104(14.51); 2.5061(30.55); 2.5016(42.55);
 2.4972(32.69); 2.4931(16.62); 2.3331(0.34); 2.3283(0.36); 2.3001(13.88); 2.2054(16.00);
 2.1934(1.03); 2.1257(0.70); 2.0918(1.50); 2.0643(0.82); 1.9891(12.98); 1.8182(0.63);
 1.8094(0.68); 1.7873(0.62); 1.7788(0.58); 1.5707(0.60); 1.5614(0.67); 1.5404(0.63);
 1.5310(0.61); 1.3972(0.35); 1.2582(0.37); 1.1922(3.50); 1.1744(6.96); 1.1566(3.45);
 0.0080(0.98); -0.0002(31.85); -0.0084(1.34);

実施例 27、溶媒:DMSO、分光計:600.13MHz

7.9752(5.68); 7.1878(2.27); 7.1737(2.38); 6.9533(0.98); 6.8618(2.31); 6.7705(1.08);
 6.5563(2.43); 6.5524(2.73); 6.5035(1.49); 6.4997(1.31); 6.4895(1.43); 6.4856(1.29);

10

20

30

40

6. 2946(2.97); 5. 7876(0.95); 5. 7750(1.07); 5. 7689(1.05); 5. 7561(0.99); 5. 2512(0.82);
 5. 2229(1.82); 5. 1646(1.72); 5. 1363(0.80); 4. 3757(0.58); 4. 3538(0.62); 4. 0472(0.33);
 4. 0353(0.98); 4. 0234(1.01); 4. 0115(0.42); 3. 9985(0.58); 3. 9781(0.66); 3. 8896(0.83);
 3. 8784(0.88); 3. 8726(1.31); 3. 8614(1.28); 3. 8251(0.53); 3. 8178(1.20); 3. 8059(1.26);
 3. 8008(0.88); 3. 7889(0.83); 3. 7765(0.42); 3. 7713(0.94); 3. 7523(1.13); 3. 7426(2.44);
 3. 7381(16.00); 3. 7241(1.06); 3. 3894(0.46); 3. 3831(0.34); 3. 3766(0.55); 3. 3703(0.93);
 3. 3640(0.57); 3. 3550(1.29); 3. 3423(1.27); 3. 3254(75.46); 3. 3141(1.28); 3. 2785(0.47);
 3. 2587(0.83); 3. 2393(0.45); 2. 8902(2.01); 2. 8476(0.43); 2. 8276(0.75); 2. 8094(0.44);
 2. 7313(1.69); 2. 5226(0.40); 2. 5196(0.50); 2. 5164(0.55); 2. 5046(24.76); 2. 5016(33.47);
 2. 4987(24.64); 2. 1971(0.62); 2. 1869(11.90); 2. 1769(0.73); 2. 1141(0.58); 2. 0870(0.88);
 2. 0616(0.61); 1. 9888(4.15); 1. 7792(0.49); 1. 7767(0.49); 1. 7618(0.46); 1. 7564(0.43);
 1. 5543(0.49); 1. 5344(0.46); 1. 3971(1.43); 1. 1867(1.12); 1. 1748(2.20); 1. 1629(1.09);
 1. 1303(0.48); 1. 1266(0.45); 1. 1186(0.74); 1. 1106(0.48); 1. 1069(0.50); 0. 4787(0.33);
 0. 4766(0.35); 0. 4704(0.57); 0. 4684(0.53); 0. 4629(0.74); 0. 4573(0.64); 0. 4508(0.44);
 0. 4483(0.49); 0. 4445(0.38); 0. 3860(0.37); 0. 3824(0.50); 0. 3806(0.50); 0. 3766(0.47);
 0. 3735(0.54); 0. 3672(0.75); 0. 3604(0.58); 0. 3524(0.38); 0. 3467(0.37); 0. 2926(0.41);
 0. 2853(0.67); 0. 2771(1.19); 0. 2721(1.47); 0. 2688(1.34); 0. 2649(1.55); 0. 2602(1.06);
 0. 2519(0.61); 0. 2448(0.36); 0. 0053(0.32); -0. 0001(7.89);

実施例 28、溶媒:DMSO、分光計:399.95MHz

7. 9638(7.36); 7. 3700(0.76); 7. 3492(1.67); 7. 3319(1.71); 7. 3111(0.82); 7. 0001(1.52);
 6. 8633(4.36); 6. 8462(2.41); 6. 8378(1.50); 6. 8131(1.71); 6. 7911(1.22); 6. 7259(1.68);
 6. 2950(3.99); 6. 0878(1.17); 6. 0666(1.43); 6. 0570(1.34); 6. 0360(1.20); 5. 2707(0.96);
 5. 2284(2.60); 5. 1725(2.60); 5. 1300(0.96); 4. 3861(0.85); 4. 3540(0.91); 4. 0552(0.55);
 4. 0373(1.66); 4. 0195(2.13); 4. 0018(1.14); 3. 9758(0.92); 3. 9028(1.21); 3. 8858(1.35);
 3. 8773(1.72); 3. 8606(1.63); 3. 7919(0.92); 3. 7547(1.94); 3. 7504(1.87); 3. 7364(1.68);
 3. 7301(1.42); 3. 7187(1.47); 3. 7115(1.31); 3. 6042(1.39); 3. 5831(1.39); 3. 5620(0.94);
 3. 5412(1.00); 3. 4136(0.63); 3. 4040(0.49); 3. 3938(0.78); 3. 3847(1.22); 3. 3754(0.83);
 3. 3650(0.65); 3. 3556(0.93); 3. 3272(76.50); 3. 3019(0.92); 3. 2641(1.16); 3. 2353(0.64);
 2. 8622(0.60); 2. 8337(1.08); 2. 8044(0.62); 2. 6754(0.57); 2. 6707(0.75); 2. 6665(0.57);
 2. 5061(82.21); 2. 5017(106.35); 2. 4974(80.71); 2. 3331(0.68); 2. 3285(0.80); 2. 3241(0.62);
 2. 1873(16.00); 2. 1616(0.34); 2. 1234(0.87); 2. 0923(1.72); 2. 0629(0.98); 1. 9890(6.69);
 1. 8252(0.35); 1. 8156(0.36); 1. 7896(0.95); 1. 7628(0.71); 1. 7556(0.67); 1. 7450(0.44);
 1. 5902(0.34); 1. 5619(0.70); 1. 5334(0.66); 1. 1924(1.85); 1. 1746(3.58); 1. 1567(1.78);
 1. 0251(0.36); 1. 0100(0.71); 0. 9934(0.97); 0. 9767(0.83); 0. 9598(0.43); 0. 3804(0.36);
 0. 3721(0.52); 0. 3545(0.94); 0. 3450(1.17); 0. 3397(0.98); 0. 3306(0.59); 0. 3261(0.66);
 0. 3208(0.53); 0. 2060(0.47); 0. 1965(0.59); 0. 1787(2.77); 0. 1712(2.46); 0. 1613(4.41);
 0. 1471(1.81); 0. 1306(0.69); 0. 1239(0.52); -0. 0002(18.65);

実施例 29、溶媒:DMSO、分光計:399.95MHz

8. 0135(7.84); 7. 3476(0.67); 7. 3434(0.92); 7. 3236(4.06); 7. 3047(3.74); 7. 2072(1.33);
 7. 1516(2.20); 7. 1317(1.88); 7. 0725(2.95); 7. 0206(1.25); 7. 0019(2.21); 6. 9833(1.03);
 6. 9380(1.52); 6. 3834(3.20); 5. 8869(1.10); 5. 8691(1.27); 5. 8593(1.24); 5. 8414(1.13);
 5. 7569(7.59); 5. 2407(0.62); 5. 1983(2.49); 5. 1598(2.44); 5. 1435(0.40); 5. 1174(0.61);
 4. 8819(6.04); 4. 8760(5.98); 4. 3626(0.64); 4. 3296(0.68); 4. 0378(0.65); 4. 0200(0.68);
 4. 0021(0.48); 3. 9904(0.61); 3. 9553(0.67); 3. 8993(1.18); 3. 8714(1.36); 3. 8563(1.52);
 3. 8286(1.27); 3. 5890(1.60); 3. 5831(3.49); 3. 5772(1.54); 3. 3906(3.30); 3. 3733(1.28);
 3. 3630(1.26); 3. 3537(0.71); 3. 3437(0.44); 3. 3342(0.58); 3. 2694(1.85); 3. 2515(1.58);
 3. 2327(0.95); 3. 2266(1.72); 3. 2086(1.62); 2. 8326(0.45); 2. 8049(0.82); 2. 7747(0.46);
 2. 5235(0.47); 2. 5103(10.63); 2. 5059(21.60); 2. 5013(28.45); 2. 4968(20.20); 2. 4923(9.50);
 2. 1611(16.00); 2. 1079(0.61); 2. 0790(1.27); 2. 0498(0.70); 1. 9888(2.84); 1. 7766(0.52);
 1. 7681(0.55); 1. 7455(0.52); 1. 7377(0.48); 1. 5600(0.52); 1. 5504(0.56); 1. 5287(0.52);
 1. 5202(0.50); 1. 1922(0.79); 1. 1744(1.56); 1. 1566(0.77); -0. 0002(2.27);

実施例 30、溶媒:DMSO、分光計:399.95MHz

8. 0106(9.66); 7. 3122(1.38); 7. 3070(1.86); 7. 3034(1.80); 7. 2943(2.51); 7. 2886(2.37);
 7. 2843(2.01); 7. 2764(1.66); 7. 2723(0.83); 7. 0618(2.49); 7. 0508(0.46); 7. 0417(1.89);
 6. 9745(1.36); 6. 9548(2.36); 6. 9377(1.12); 6. 4962(4.47); 6. 0804(0.43); 6. 0677(0.97);

10

20

30

40

6.0547(0.71); 6.0413(1.09); 6.0370(0.58); 6.0288(0.60); 6.0245(1.18); 6.0115(0.82);
 5.9980(1.18); 5.9855(0.55); 5.9178(1.18); 5.8999(1.37); 5.8903(1.39); 5.8721(1.23);
 5.7554(3.77); 5.4426(0.62); 5.4384(1.88); 5.4341(1.98); 5.4300(0.73); 5.3993(0.58);
 5.3952(1.62); 5.3909(1.68); 5.3871(0.62); 5.3490(0.87); 5.3064(2.59); 5.2534(2.66);
 5.2461(2.16); 5.2420(2.00); 5.2195(1.83); 5.2153(2.05); 5.2117(1.56); 4.6321(2.51);
 4.6276(2.73); 4.6198(2.65); 4.6153(2.44); 4.3814(0.71); 4.3488(0.71); 4.0557(0.89);
 4.0380(2.66); 4.0202(2.74); 4.0024(1.04); 3.9835(0.69); 3.9517(0.73); 3.8909(1.34);
 3.8629(1.47); 3.8482(1.72); 3.8203(1.43); 3.3995(0.56); 3.3894(0.39); 3.3797(0.67);
 3.3702(1.17); 3.3609(0.78); 3.3268(115.28); 3.3247(244.25); 3.3015(0.91); 3.2864(2.05);
 3.2682(2.05); 3.2607(1.05); 3.2435(1.55); 3.2256(1.84); 2.8595(0.57); 2.8298(0.90);
 2.7999(0.55); 2.6748(0.44); 2.6703(0.54); 2.6664(0.41); 2.5237(0.95); 2.5058(64.08);
 2.5015(86.96); 2.4974(61.07); 2.3329(0.35); 2.3282(0.54); 2.2059(16.00); 2.1941(0.82);
 2.1281(0.63); 2.0918(1.32); 2.0736(0.76); 2.0642(0.77); 1.9885(11.91); 1.8144(0.55);
 1.8073(0.61); 1.7843(0.55); 1.7789(0.51); 1.5723(0.55); 1.5625(0.61); 1.5404(0.55);
 1.5319(0.53); 1.2345(0.56); 1.1924(3.16); 1.1746(6.25); 1.1568(3.04); 0.0079(0.33);
 -0.0002(11.83); -0.0085(0.37);

実施例 31、溶媒:DMSO、分光計:399.95MHz

8.3169(0.34); 7.9747(8.93); 7.9522(0.97); 7.4350(0.80); 7.4180(1.07); 7.4139(1.72);
 7.3971(1.75); 7.3930(1.11); 7.3762(0.89); 7.0110(2.57); 7.0008(1.74); 6.9899(2.33);
 6.9122(1.26); 6.8907(1.42); 6.8870(1.50); 6.8637(4.65); 6.7266(1.72); 6.2950(3.82);
 6.0724(1.10); 6.0500(1.32); 6.0419(1.26); 6.0194(1.13); 5.2657(0.82); 5.2232(2.61);
 5.1774(2.57); 5.1348(0.81); 4.8525(3.55); 4.8470(6.21); 4.8414(3.66); 4.3937(0.74);
 4.3602(0.80); 4.0551(0.76); 4.0373(2.39); 4.0195(2.94); 4.0018(1.14); 3.9812(0.77);
 3.8099(0.72); 3.7790(0.84); 3.7698(0.99); 3.7669(1.02); 3.7372(0.91); 3.5476(1.82);
 3.5417(4.04); 3.5358(1.85); 3.5253(1.31); 3.5026(1.25); 3.4824(0.95); 3.4600(0.95);
 3.4161(0.53); 3.4070(0.38); 3.3965(0.62); 3.3873(1.11); 3.3783(0.68); 3.3685(0.47);
 3.3585(0.75); 3.3498(0.69); 3.3283(104.73); 3.2962(0.61); 3.2647(0.99); 3.2365(0.56);
 2.8903(8.29); 2.8628(0.53); 2.8318(0.94); 2.8049(0.53); 2.7307(6.62); 2.6753(0.50);
 2.6709(0.72); 2.6662(0.52); 2.5406(0.38); 2.5384(0.40); 2.5241(2.78); 2.5193(4.33);
 2.5107(39.51); 2.5063(79.45); 2.5018(104.79); 2.4972(76.32); 2.4928(37.44); 2.3332(0.55);
 2.3286(0.74); 2.3241(0.57); 2.1883(16.00); 2.1484(0.75); 2.1130(1.45); 2.0836(0.83);
 1.9888(10.32); 1.8011(0.62); 1.7797(0.58); 1.5861(0.59); 1.5773(0.65); 1.5554(0.62);
 1.5467(0.60); 1.3974(2.06); 1.1925(2.75); 1.1747(5.55); 1.1569(2.69); 0.0079(0.70);
 -0.0002(20.09); -0.0085(0.85);

実施例 32、溶媒:DMSO、分光計:399.95MHz

8.0176(3.53); 7.6012(1.82); 7.3438(0.44); 7.3239(1.89); 7.3050(1.73); 7.1513(1.01);
 7.1313(0.86); 7.0203(0.58); 7.0018(1.01); 6.9830(0.46); 5.8875(0.50); 5.8696(0.59);
 5.8598(0.57); 5.8420(0.53); 5.6352(0.42); 5.5923(0.93); 5.5228(0.92); 5.4798(0.41);
 4.8815(2.80); 4.8756(2.78); 4.3512(0.34); 4.3165(0.35); 3.9344(0.35); 3.9003(0.52);
 3.8724(0.60); 3.8573(0.67); 3.8295(0.57); 3.5881(0.71); 3.5822(1.50); 3.5764(0.68);
 3.3790(0.49); 3.3500(0.35); 3.3277(40.02); 3.2700(1.02); 3.2523(0.72); 3.2272(0.67);
 3.2094(0.60); 2.8910(2.35); 2.8506(0.43); 2.7317(1.82); 2.6713(0.43); 2.5246(1.46);
 2.5198(2.36); 2.5112(24.23); 2.5068(48.55); 2.5023(63.46); 2.4977(45.99); 2.4933(22.44);
 2.3289(0.43); 2.0945(0.63); 2.0639(0.35); 1.3977(16.00); -0.0002(1.78);

実施例 33、溶媒:DMSO、分光計:399.95MHz

8.3173(0.68); 8.0139(16.00); 7.6009(9.09); 7.3088(4.66); 7.3047(4.26); 7.2943(5.83);
 7.2901(6.33); 7.2765(3.38); 7.0614(5.55); 7.0397(4.29); 6.9733(3.12); 6.9546(5.42);
 6.9358(2.50); 6.0796(0.81); 6.0671(1.68); 6.0536(1.40); 6.0405(1.96); 6.0366(1.26);
 6.0280(1.17); 6.0238(2.13); 6.0105(1.61); 5.9973(2.06); 5.9849(1.00); 5.9180(2.65);
 5.9001(3.04); 5.8902(3.03); 5.8722(2.72); 5.6336(2.15); 5.5908(4.85); 5.5228(4.85);
 5.4798(2.17); 5.4387(3.78); 5.4344(3.96); 5.4155(0.38); 5.3954(3.29); 5.3911(3.43);
 5.3759(0.33); 5.2445(3.75); 5.2407(3.86); 5.2180(3.49); 5.2142(3.58); 4.6664(0.38);
 4.6541(0.44); 4.6318(5.77); 4.6274(6.54); 4.6202(6.39); 4.6156(5.84); 4.5935(0.50);
 4.5812(0.41); 4.3499(1.84); 4.3167(1.94); 3.9705(1.72); 3.9352(1.91); 3.8923(2.66);
 3.8643(2.99); 3.8494(3.43); 3.8215(2.94); 3.4082(1.20); 3.3989(0.91); 3.3887(1.47);

10

20

30

40

3. 3795(2. 48); 3. 3704(1. 57); 3. 3599(1. 12); 3. 3504(1. 69); 3. 3269(87. 89); 3. 3030(7. 09);
 3. 2871(3. 80); 3. 2691(5. 63); 3. 2441(3. 72); 3. 2264(3. 21); 2. 8786(1. 28); 2. 8514(2. 32);
 2. 8211(1. 31); 2. 6757(0. 86); 2. 6713(1. 15); 2. 6670(0. 87); 2. 5414(0. 76); 2. 5066(123. 19);
 2. 5022(163. 13); 2. 4979(124. 07); 2. 3335(0. 90); 2. 3290(1. 20); 2. 3248(0. 94); 2. 1240(1. 68);
 2. 0916(3. 54); 2. 0619(1. 97); 1. 9891(0. 84); 1. 8341(0. 60); 1. 8240(0. 72); 1. 8030(1. 46);
 1. 7945(1. 59); 1. 7721(1. 44); 1. 7641(1. 35); 1. 7424(0. 61); 1. 7329(0. 47); 1. 5797(0. 59);
 1. 5699(0. 72); 1. 5492(1. 44); 1. 5399(1. 58); 1. 5186(1. 47); 1. 5092(1. 41); 1. 4889(0. 62);
 1. 4785(0. 50); 1. 3976(8. 31); 1. 3512(0. 60); 1. 3361(1. 33); 1. 2587(0. 34); 1. 2495(0. 99);
 1. 2251(1. 13); 1. 1750(0. 46); 0. 1460(0. 57); 0. 0079(5. 94); -0. 0002(128. 33); -0. 0083(6. 23);
 -0. 1496(0. 60);

実施例 34、溶媒:CD3CN、分光計:399. 95MHz

7. 7083(6. 06); 7. 5436(1. 24); 7. 5244(2. 00); 7. 4725(0. 75); 7. 4677(0. 83); 7. 4555(1. 21);
 7. 4509(1. 48); 7. 4360(0. 76); 7. 4314(1. 48); 7. 4274(1. 02); 7. 4129(2. 75); 7. 4081(1. 86);
 7. 4023(2. 05); 7. 3989(1. 79); 7. 3852(1. 24); 7. 3825(1. 31); 7. 3662(0. 41); 7. 3628(0. 37);
 6. 3912(3. 38); 6. 0855(1. 21); 6. 0633(1. 45); 6. 0581(1. 40); 6. 0359(1. 26); 5. 4478(5. 74);
 5. 1282(0. 63); 5. 0861(3. 18); 5. 0549(3. 16); 5. 0129(0. 64); 4. 5808(1. 36); 4. 5455(2. 82);
 4. 4959(0. 73); 4. 4847(3. 37); 4. 4639(0. 73); 4. 4494(1. 65); 3. 9738(1. 43); 3. 9462(2. 02);
 3. 9303(1. 85); 3. 9137(0. 75); 3. 9028(1. 91); 3. 3696(0. 71); 3. 3643(1. 81); 3. 3508(0. 73);
 3. 3420(2. 72); 3. 3317(0. 72); 3. 3208(1. 99); 3. 3123(1. 18); 3. 2988(1. 58); 3. 2815(0. 95);
 3. 2526(0. 53); 3. 2460(0. 49); 2. 9728(0. 42); 2. 9425(16. 00); 2. 8825(0. 46); 2. 8759(0. 51);
 2. 8498(0. 86); 2. 8452(0. 88); 2. 8188(0. 51); 2. 8123(0. 47); 2. 2256(16. 31); 2. 1817(12. 52);
 2. 1786(12. 84); 2. 1203(0. 72); 1. 9638(0. 83); 1. 9575(0. 80); 1. 9519(5. 16); 1. 9457(9. 51);
 1. 9396(13. 00); 1. 9333(8. 89); 1. 9272(4. 50); 1. 8732(0. 60); 1. 8635(0. 62); 1. 8421(0. 57);
 1. 8324(0. 55); 1. 7053(0. 63); 1. 6953(0. 64); 1. 6740(0. 59); 1. 6643(0. 56); -0. 0002(3. 21);

実施例 35、溶媒:CD3CN、分光計:399. 95MHz

7. 7009(3. 52); 7. 6949(4. 85); 7. 5121(1. 27); 7. 5082(1. 60); 7. 4918(2. 04); 7. 4223(0. 34);
 7. 4175(0. 72); 7. 4104(0. 57); 7. 4006(1. 27); 7. 3950(1. 13); 7. 3861(1. 41); 7. 3812(1. 44);
 7. 3763(1. 15); 7. 3677(2. 28); 7. 3640(2. 54); 7. 3617(1. 79); 7. 3585(2. 13); 7. 3522(2. 26);
 7. 3487(2. 27); 7. 3418(1. 45); 7. 3377(1. 01); 7. 3235(0. 47); 6. 3904(4. 15); 6. 0731(0. 94);
 6. 0512(1. 11); 6. 0456(1. 19); 6. 0237(1. 08); 6. 0196(0. 87); 6. 0142(0. 75); 5. 9917(0. 66);
 5. 4467(3. 81); 5. 1259(0. 73); 5. 0839(3. 90); 5. 0530(3. 81); 5. 0317(0. 67); 5. 0109(0. 74);
 4. 4964(0. 77); 4. 4626(0. 80); 4. 2284(1. 10); 4. 1947(1. 44); 4. 1428(0. 66); 4. 1094(3. 41);
 4. 0957(3. 50); 4. 0623(0. 68); 3. 9871(1. 62); 3. 9533(1. 80); 3. 9362(1. 72); 3. 9104(1. 93);
 3. 9087(2. 05); 3. 8950(1. 38); 3. 8929(1. 62); 3. 8654(1. 49); 3. 3778(0. 36); 3. 3664(1. 37);
 3. 3556(1. 62); 3. 3489(0. 89); 3. 3437(1. 36); 3. 3395(1. 57); 3. 3337(1. 73); 3. 3228(1. 26);
 3. 3121(2. 35); 3. 3008(1. 28); 3. 2903(1. 64); 3. 2817(1. 12); 3. 2527(0. 60); 3. 2462(0. 56);
 2. 8823(0. 50); 2. 8759(0. 55); 2. 8456(0. 98); 2. 8188(0. 56); 2. 8124(0. 52); 2. 5676(16. 00);
 2. 5203(10. 63); 2. 2257(18. 95); 2. 2113(1. 50); 2. 2100(1. 47); 2. 1508(8. 92); 2. 1450(7. 66);
 2. 1193(0. 89); 2. 1068(0. 44); 1. 9635(1. 26); 1. 9573(1. 46); 1. 9516(10. 81); 1. 9454(20. 09);
 1. 9392(27. 69); 1. 9330(18. 99); 1. 9268(9. 78); 1. 9026(0. 38); 1. 8925(0. 39); 1. 8717(0. 71);
 1. 8624(0. 72); 1. 8409(0. 66); 1. 8313(0. 65); 1. 7249(0. 36); 1. 7047(0. 71); 1. 6945(0. 74);
 1. 6736(0. 67); 1. 6638(0. 65); -0. 0002(6. 43);

実施例 36、溶媒:CD3CN、分光計:399. 95MHz

7. 6978(9. 56); 7. 6946(9. 81); 7. 5034(2. 47); 7. 4953(1. 98); 7. 4871(3. 22); 7. 4786(2. 25);
 7. 4120(1. 37); 7. 4058(1. 29); 7. 4041(1. 31); 7. 3961(2. 49); 7. 3894(3. 75); 7. 3832(1. 79);
 7. 3780(2. 98); 7. 3709(3. 94); 7. 3642(5. 25); 7. 3592(7. 40); 7. 3502(4. 68); 7. 3463(4. 48);
 7. 3432(4. 31); 7. 3389(3. 50); 7. 3255(0. 77); 7. 3199(0. 36); 6. 3904(9. 09); 6. 0559(2. 04);
 6. 0490(1. 54); 6. 0337(2. 46); 6. 0279(3. 38); 6. 0213(1. 74); 6. 0064(2. 11); 5. 9989(1. 53);
 5. 4461(6. 12); 5. 1259(1. 72); 5. 0837(8. 68); 5. 0527(8. 53); 5. 0108(1. 70); 4. 4966(1. 86);
 4. 4630(1. 92); 4. 1672(2. 48); 4. 1336(3. 50); 4. 0704(16. 00); 3. 9820(3. 65); 3. 9483(4. 37);
 3. 9368(3. 21); 3. 9335(3. 07); 3. 9090(4. 03); 3. 9059(3. 83); 3. 8938(2. 76); 3. 8900(2. 90);
 3. 8659(2. 47); 3. 8624(2. 68); 3. 3719(4. 90); 3. 3580(1. 20); 3. 3497(5. 82); 3. 3392(3. 46);
 3. 3289(5. 33); 3. 3192(2. 12); 3. 3068(4. 84); 3. 2814(2. 60); 3. 2524(1. 42); 3. 2458(1. 31);
 2. 8770(1. 70); 2. 8581(2. 13); 2. 8442(3. 34); 2. 8396(3. 03); 2. 8252(3. 07); 2. 8203(2. 47);
 2. 8172(2. 63); 2. 8064(3. 31); 2. 8032(2. 20); 2. 7871(1. 40); 2. 7842(1. 81); 2. 7653(0. 57);

10

20

30

40

2.7494(0.72); 2.7307(2.29); 2.7121(2.41); 2.6978(1.98); 2.6937(0.98); 2.6795(2.88);
 2.6611(2.11); 2.6468(1.21); 2.6427(0.66); 2.6283(1.11); 2.6097(0.36); 2.2254(41.56);
 2.2087(1.66); 2.2029(1.75); 2.1611(2.89); 2.1390(18.09); 2.1203(2.04); 1.9630(1.87);
 1.9511(16.20); 1.9450(29.63); 1.9388(40.14); 1.9327(27.43); 1.9265(14.03); 1.9023(0.82);
 1.8919(0.82); 1.8718(1.68); 1.8617(1.74); 1.8404(1.58); 1.8309(1.54); 1.8101(0.64);
 1.7999(0.57); 1.7351(0.72); 1.7243(0.80); 1.7045(1.69); 1.6944(1.75); 1.6737(1.59);
 1.6637(1.55); 1.6429(0.64); 1.6325(0.58); 1.3112(7.82); 1.2978(7.09); 1.2924(15.87);
 1.2792(12.26); 1.2737(8.02); 1.2605(5.50); 0.0078(0.36); -0.0002(8.65); -0.0086(0.33);

実施例 37、溶媒:DMSO、分光計:399.95MHz

8.0640(0.47); 7.9724(5.06); 7.9511(0.92); 7.3757(0.61); 7.3547(1.09); 7.3396(1.18);
 7.3184(0.67); 7.0292(1.63); 7.0201(0.65); 7.0080(1.47); 7.0004(1.26); 6.8829(1.40);
 6.8633(2.63); 6.8505(0.94); 6.8289(0.81); 6.7465(0.55); 6.7262(1.23); 6.3413(1.14);
 6.3002(3.02); 5.3924(0.49); 5.2614(0.62); 5.2194(1.88); 5.1719(1.92); 5.1299(0.63);
 5.1053(3.31); 4.9229(3.83); 4.9172(3.95); 4.3945(0.59); 4.3594(0.64); 4.2667(0.94);
 4.2556(1.08); 4.2437(1.05); 4.0560(0.58); 4.0383(1.66); 4.0204(2.05); 4.0029(0.99);
 3.9777(0.72); 3.7070(1.48); 3.7025(1.60); 3.6939(2.25); 3.6801(3.32); 3.6706(2.57);
 3.6521(5.30); 3.5928(2.49); 3.5858(2.97); 3.3779(5389.76); 2.8920(7.63); 2.8662(0.93);
 2.8312(1.23); 2.8031(0.88); 2.7325(6.18); 2.6785(3.59); 2.6739(4.83); 2.6694(3.59);
 2.5409(3.16); 2.5272(16.53); 2.5224(24.16); 2.5137(251.32); 2.5094(502.31);
 2.5049(656.43); 2.5003(472.57); 2.4960(230.06); 2.3692(1.31); 2.3360(3.51); 2.3315(4.73);
 2.3269(3.82); 2.2414(5.87); 2.2071(0.91); 2.1905(12.67); 2.1730(1.01); 2.1055(1.36);
 2.0721(16.00); 1.9889(6.86); 1.9101(1.98); 1.7874(0.66); 1.7687(0.63); 1.6120(1.12);
 1.5918(6.80); 1.5472(0.60); 1.4104(0.83); 1.2356(0.72); 1.1928(1.94); 1.1750(3.75);
 1.1572(1.90); -0.0002(2.02);

実施例 38、溶媒:DMSO、分光計:399.95MHz

8.0193(3.81); 7.9536(9.31); 7.9287(0.71); 7.4111(1.90); 7.3903(3.70); 7.3699(2.77);
 7.1618(3.41); 7.1554(4.01); 7.1404(2.83); 7.1355(3.52); 7.0500(2.52); 7.0308(3.07);
 6.9990(3.46); 6.8590(1.95); 6.8395(1.66); 6.2332(1.49); 6.2085(1.94); 6.2024(1.88);
 6.1777(1.58); 5.7531(5.37); 4.8383(0.39); 4.8325(0.42); 4.7981(3.37); 4.7912(5.19);
 4.7841(3.81); 4.7499(0.40); 4.7439(0.43); 4.1809(1.91); 4.1469(2.02); 4.0379(0.72);
 4.0201(0.75); 3.7672(1.17); 3.7363(1.43); 3.7251(2.07); 3.6943(1.70); 3.5841(1.95);
 3.5593(1.99); 3.5420(1.43); 3.5173(1.40); 3.5040(0.41); 3.4453(2.54); 3.4396(4.79);
 3.4338(2.75); 3.3583(517.73); 3.3548(636.88); 3.3514(650.80); 3.3476(856.85);
 3.1850(0.58); 3.1755(0.57); 3.1584(0.59); 3.1523(0.69); 3.0153(1.49); 2.9857(2.67);
 2.9568(1.50); 2.9081(0.89); 2.6766(1.32); 2.6721(1.80); 2.6676(1.36); 2.5393(1.01);
 2.5254(5.57); 2.5206(8.48); 2.5119(93.76); 2.5075(189.89); 2.5030(252.19); 2.4984(187.91);
 2.4941(94.93); 2.3343(1.28); 2.3297(1.75); 2.3252(1.31); 2.2726(0.33); 2.2336(15.38);
 2.1124(16.00); 2.0727(3.08); 1.9886(3.35); 1.7027(0.68); 1.6747(1.49); 1.6473(1.35);
 1.6187(0.51); 1.2360(0.51); 1.1925(0.89); 1.1747(1.77); 1.1569(0.86); -0.0002(4.40);

実施例 39、溶媒:DMSO、分光計:399.95MHz

8.1588(3.15); 7.9410(9.29); 7.3715(1.93); 7.3509(4.10); 7.3300(4.13); 7.3227(3.11);
 7.2026(2.15); 7.1817(3.00); 7.1038(2.36); 7.1016(3.27); 7.0883(2.72); 7.0832(6.50);
 7.0681(1.94); 7.0626(3.65); 6.2591(1.36); 6.2356(1.73); 6.2282(1.60); 6.2046(1.40);
 5.8317(0.37); 5.8181(0.77); 5.8051(0.72); 5.7917(0.90); 5.7888(0.58); 5.7782(0.52);
 5.7748(0.98); 5.7617(0.88); 5.7533(7.80); 5.7488(1.23); 5.7350(0.48); 5.2725(0.61);
 5.2686(1.79); 5.2645(1.88); 5.2607(0.73); 5.2291(0.52); 5.2253(1.53); 5.2212(1.58);
 5.2173(0.60); 5.0153(1.67); 5.0116(1.68); 4.9889(1.55); 4.9852(1.59); 4.5819(0.45);
 4.5687(0.48); 4.5502(1.39); 4.5369(1.39); 4.5231(1.42); 4.5090(1.36); 4.4913(0.49);
 4.4809(0.36); 4.4771(0.45); 4.1741(1.49); 4.1408(1.58); 4.0559(0.39); 4.0381(1.22);
 4.0202(1.23); 4.0025(0.42); 3.7617(1.06); 3.7306(1.30); 3.7197(1.87); 3.6887(1.52);
 3.5785(1.71); 3.5549(1.74); 3.5365(1.20); 3.5130(1.25); 3.3616(206.47); 3.3582(217.30);
 3.3552(181.25); 3.3479(336.94); 3.0516(1.16); 3.0221(2.01); 2.9935(1.15); 2.9264(0.94);
 2.6768(0.56); 2.6722(0.78); 2.6677(0.55); 2.5257(2.16); 2.5210(3.11); 2.5123(41.85);
 2.5078(87.47); 2.5032(117.61); 2.4986(86.11); 2.4940(42.20); 2.3344(0.60); 2.3299(0.82);
 2.3253(0.61); 2.1553(16.00); 2.1044(1.29); 2.0730(1.96); 1.9887(5.62); 1.7272(0.42);

10

20

30

40

1. 7174(0.54); 1. 6955(1.13); 1. 6874(1.27); 1. 6656(1.19); 1. 6575(1.10); 1. 6361(0.48);
1. 6262(0.40); 1. 2350(0.36); 1. 1926(1.55); 1. 1748(3.07); 1. 1570(1.50); -0.0002(2.02);

実施例 40、溶媒:DMSO、分光計:399.95MHz

8. 0340(9.26); 7. 4541(1.53); 7. 4344(3.45); 7. 4147(2.25); 7. 2915(1.97); 7. 2722(1.59);
7. 1628(1.73); 7. 1577(2.93); 7. 1533(2.10); 7. 1184(1.43); 7. 1162(1.62); 7. 1127(1.30);
7. 1104(1.26); 7. 0983(1.34); 7. 0961(1.38); 7. 0927(1.25); 7. 0903(1.15); 6. 4980(4.43);
5. 7802(1.13); 5. 7604(1.37); 5. 7531(1.33); 5. 7332(1.17); 5. 3497(0.88); 5. 3073(2.72);
5. 2577(2.67); 5. 2151(0.88); 5. 1965(0.85); 4. 3847(0.72); 4. 3507(0.77); 4. 0557(0.72);
4. 0379(2.19); 4. 0201(2.25); 4. 0023(0.93); 3. 9883(0.68); 3. 9532(0.75); 3. 9232(1.23);
3. 8957(1.41); 3. 8800(1.64); 3. 8527(1.33); 3. 4089(1.99); 3. 3998(0.57); 3. 3890(2.04);
3. 3807(1.25); 3. 3707(0.96); 3. 3655(1.83); 3. 3456(3.26); 3. 3292(241.15); 3. 3261(302.53);
3. 2659(1.26); 3. 2371(0.70); 3. 0429(1.96); 2. 8659(0.52); 2. 8546(1.70); 2. 8352(0.92);
2. 8076(0.53); 2. 6753(0.51); 2. 6707(0.71); 2. 6662(0.53); 2. 5409(0.35); 2. 5241(1.21);
2. 5192(1.89); 2. 5106(36.46); 2. 5061(78.71); 2. 5015(111.02); 2. 4969(83.92); 2. 4925(41.55);
2. 3329(0.55); 2. 3283(0.77); 2. 3238(0.58); 2. 2070(16.00); 2. 1924(1.81); 2. 1325(0.67);
2. 1004(1.39); 2. 0735(1.03); 1. 9885(9.76); 1. 9183(0.43); 1. 9063(0.85); 1. 8989(0.95);
1. 8956(0.73); 1. 8870(1.65); 1. 8813(0.75); 1. 8750(0.97); 1. 8676(1.00); 1. 8557(0.74);
1. 8447(0.33); 1. 8248(0.61); 1. 8157(0.64); 1. 7930(0.58); 1. 7849(0.55); 1. 5824(0.56);
1. 5734(0.62); 1. 5523(0.58); 1. 5439(0.58); 1. 3976(0.58); 1. 2355(0.40); 1. 1923(2.67);
1. 1745(5.40); 1. 1567(2.63); 1. 0807(0.55); 1. 0670(1.78); 1. 0595(3.41); 1. 0558(1.68);
1. 0530(1.79); 1. 0470(1.69); 1. 0392(3.51); 1. 0334(2.18); 1. 0311(2.14); 1. 0249(3.40);
1. 0179(3.09); 1. 0139(3.90); 1. 0060(1.80); 0. 9919(0.44); 0. 0080(1.09); -0.0002(35.44);
-0.0085(1.38);

実施例 41、溶媒:DMSO、分光計:399.95MHz

8. 0259(9.47); 7. 3231(1.61); 7. 3190(0.50); 7. 3027(3.67); 7. 2952(0.37); 7. 2825(2.20);
6. 9632(4.18); 6. 9580(3.28); 6. 9534(2.20); 6. 9445(1.95); 6. 9304(1.59); 6. 9278(1.49);
6. 9245(1.19); 6. 9221(1.11); 6. 9097(1.41); 6. 9079(1.39); 6. 9036(1.22); 6. 4980(4.40);
6. 0822(0.43); 6. 0692(0.96); 6. 0560(0.94); 6. 0428(1.11); 6. 0390(0.59); 6. 0298(0.60);
6. 0259(1.19); 6. 0128(1.05); 5. 9996(1.20); 5. 9866(0.57); 5. 7179(1.17); 5. 6978(1.40);
5. 6911(1.37); 5. 6706(1.21); 5. 4168(0.67); 5. 4126(1.94); 5. 4082(2.03); 5. 4039(0.75);
5. 3737(0.62); 5. 3694(1.73); 5. 3650(1.80); 5. 3607(0.77); 5. 3504(0.89); 5. 3076(2.74);
5. 2632(2.49); 5. 2590(4.21); 5. 2407(0.78); 5. 2370(1.73); 5. 2328(1.74); 5. 2294(0.81);
5. 2153(0.92); 5. 1968(0.86); 4. 5810(2.25); 4. 5772(4.03); 4. 5735(2.51); 4. 5680(2.46);
4. 5642(4.01); 4. 5606(2.36); 4. 3853(0.73); 4. 3525(0.77); 4. 0377(0.73); 4. 0200(0.78);
4. 0021(0.45); 3. 9890(0.69); 3. 9532(0.73); 3. 8941(1.27); 3. 8670(1.46); 3. 8512(1.69);
3. 8239(1.42); 3. 4095(0.54); 3. 3929(1.96); 3. 3809(1.27); 3. 3725(2.16); 3. 3619(0.42);
3. 3500(2.09); 3. 3262(194.10); 3. 3243(226.61); 3. 3220(303.73); 3. 2983(3.23); 3. 2653(1.26);
3. 2367(0.64); 3. 2314(0.57); 3. 0428(2.05); 2. 8659(0.53); 2. 8544(1.75); 2. 8381(0.92);
2. 8086(0.52); 2. 6792(0.39); 2. 6748(0.88); 2. 6702(1.21); 2. 6657(0.89); 2. 6612(0.41);
2. 5406(0.42); 2. 5237(2.26); 2. 5188(3.67); 2. 5102(61.32); 2. 5057(131.73); 2. 5011(185.44);
2. 4966(139.12); 2. 4921(67.67); 2. 3326(0.93); 2. 3280(1.24); 2. 3234(0.94); 2. 3188(0.50);
2. 2068(16.00); 2. 1923(1.83); 2. 1313(0.66); 2. 1023(1.37); 2. 0736(1.16); 1. 9884(3.47);
1. 8230(0.57); 1. 8150(0.63); 1. 7916(0.57); 1. 7835(0.54); 1. 5831(0.57); 1. 5736(0.63);
1. 5521(0.59); 1. 5421(0.57); 1. 3976(0.32); 1. 2583(0.39); 1. 2493(0.59); 1. 2354(0.71);
1. 1922(0.94); 1. 1744(1.90); 1. 1566(0.93); 0. 0080(2.08); -0.0002(68.81); -0.0085(2.53);

実施例 42、溶媒:DMSO、分光計:601.6MHz

8. 0198(3.29); 7. 9396(10.59); 7. 3640(2.27); 7. 3503(4.58); 7. 3366(2.94); 7. 1002(2.64);
7. 0987(3.30); 7. 0868(2.70); 7. 0852(2.96); 7. 0813(2.45); 7. 0671(2.24); 7. 0451(2.24);
7. 0324(2.55); 6. 9980(2.70); 6. 8566(1.49); 6. 8547(1.50); 6. 8439(1.31); 6. 8421(1.31);
6. 2494(1.52); 6. 2337(1.82); 6. 2287(1.73); 6. 2131(1.56); 5. 8156(0.47); 5. 8065(0.92);
5. 7978(0.85); 5. 7890(1.03); 5. 7869(0.64); 5. 7799(0.59); 5. 7777(1.10); 5. 7690(0.94);
5. 7602(1.06); 5. 7555(1.13); 5. 7512(0.57); 5. 2645(0.67); 5. 2618(2.03); 5. 2591(2.05);
5. 2564(0.74); 5. 2357(0.62); 5. 2331(1.79); 5. 2303(1.85); 5. 2277(0.64); 5. 0126(0.70);
5. 0104(1.86); 5. 0079(1.83); 5. 0057(0.74); 4. 9951(0.68); 4. 9929(1.76); 4. 9904(1.76);
4. 9882(0.71); 4. 5755(0.35); 4. 5732(0.62); 4. 5708(0.38); 4. 5667(0.38); 4. 5644(0.63);

10

20

30

40

4.5621(0.37); 4.5544(0.78); 4.5521(1.36); 4.5497(0.85); 4.5456(0.80); 4.5433(1.33);
 4.5410(0.78); 4.5214(0.78); 4.5192(1.35); 4.5170(0.83); 4.5120(0.80); 4.5098(1.34);
 4.5077(0.79); 4.5004(0.38); 4.4981(0.66); 4.4958(0.40); 4.4910(0.37); 4.4887(0.63);
 4.4865(0.37); 4.1690(1.42); 4.1468(1.48); 4.0466(1.14); 4.0348(3.48); 4.0229(3.47);
 4.0111(1.16); 3.7493(1.28); 3.7286(1.61); 3.7214(1.98); 3.7008(1.62); 3.5691(1.84);
 3.5535(1.86); 3.5413(1.45); 3.5257(1.45); 3.3579(0.37); 3.3517(0.85); 3.3481(0.61);
 3.3454(0.84); 3.3251(591.42); 3.3079(1.11); 3.3012(4.55); 3.0160(0.87); 3.0123(1.06);
 2.9927(1.95); 2.9738(1.08); 2.9701(0.92); 2.6190(0.40); 2.6160(0.88); 2.6130(1.25);
 2.6099(0.90); 2.6069(0.41); 2.5405(0.37); 2.5223(3.07); 2.5192(3.82); 2.5161(3.46);
 2.5074(64.00); 2.5043(141.18); 2.5012(196.75); 2.4981(141.80); 2.4951(65.39);
 2.3915(0.37); 2.3885(0.85); 2.3854(1.21); 2.3823(0.86); 2.3793(0.38); 2.2327(12.96);
 2.1103(13.21); 2.0890(1.16); 2.0837(1.23); 2.0734(1.26); 2.0670(1.33); 1.9884(16.00);
 1.6966(0.39); 1.6905(0.47); 1.6763(1.08); 1.6704(1.18); 1.6561(1.12); 1.6504(1.09);
 1.6365(0.44); 1.6299(0.37); 1.3976(0.40); 1.1862(4.45); 1.1744(9.23); 1.1626(4.25);
 0.0053(0.64); -0.0002(24.12); -0.0057(0.68);

実施例 43、溶媒:CD₃CN、分光計:399.95MHz

7.7017(16.00); 7.5291(2.62); 7.5095(4.66); 7.4599(1.87); 7.4556(2.02); 7.4419(3.09);
 7.4379(4.17); 7.4302(2.69); 7.4189(4.14); 7.4148(6.16); 7.3934(4.06); 7.3899(3.96);
 7.3753(3.19); 7.3569(1.29); 7.3536(1.16); 6.4212(7.95); 6.0279(2.81); 6.0066(3.23);
 6.0002(3.19); 5.9789(2.93); 5.1548(1.55); 5.1129(7.73); 5.0841(7.77); 5.0630(0.76);
 5.0419(1.47); 4.8696(4.32); 4.8408(6.69); 4.7412(7.05); 4.7123(4.54); 4.5215(1.52);
 4.4876(1.67); 4.1147(1.76); 4.0968(5.36); 4.0790(5.57); 4.0678(1.89); 4.0612(2.11);
 4.0560(2.15); 4.0534(1.43); 4.0451(5.27); 4.0334(5.47); 4.0225(5.45); 4.0107(5.47);
 4.0023(1.59); 3.9998(2.14); 3.9880(2.51); 3.9798(2.25); 3.9570(0.81); 3.9327(4.54);
 3.9049(3.73); 3.8896(4.22); 3.8619(4.00); 3.4070(0.67); 3.3974(1.35); 3.3878(0.87);
 3.3783(1.53); 3.3687(2.87); 3.3591(1.67); 3.3494(2.09); 3.3407(2.44); 3.3303(1.21);
 3.3227(4.99); 3.3136(2.36); 3.3017(4.58); 3.2797(4.61); 3.2586(3.78); 2.9157(1.05);
 2.9093(1.15); 2.8782(2.03); 2.8520(1.17); 2.8454(1.08); 2.4976(0.34); 2.2545(40.20);
 2.2208(828.11); 2.2177(745.43); 2.1497(2.66); 2.1436(2.69); 2.1374(2.27); 2.1312(1.52);
 2.1250(0.99); 2.0912(0.59); 2.0015(24.43); 1.9943(7.48); 1.9880(7.97); 1.9823(68.62);
 1.9762(130.30); 1.9700(182.81); 1.9638(126.48); 1.9576(65.15); 1.9303(1.19); 1.9197(1.10);
 1.8997(1.68); 1.8900(1.75); 1.8680(1.55); 1.8584(1.52); 1.8382(0.87); 1.8278(0.69);
 1.8108(0.60); 1.8046(0.94); 1.7984(1.25); 1.7922(0.94); 1.7861(0.56); 1.7660(0.75);
 1.7553(0.82); 1.7355(1.55); 1.7253(1.60); 1.7042(1.49); 1.6942(1.45); 1.6744(0.70);
 1.6635(0.66); 1.4653(1.05); 1.3891(0.33); 1.2986(1.87); 1.2504(6.62); 1.2326(12.99);
 1.2147(6.49);

実施例 44、溶媒:CD₃CN、分光計:399.95MHz

7.6732(4.41); 7.4745(0.94); 7.4565(1.13); 7.4523(1.04); 7.3852(0.53); 7.3812(0.64);
 7.3687(1.08); 7.3640(1.38); 7.3565(1.61); 7.3526(1.54); 7.3477(1.18); 7.3262(1.14);
 7.3226(1.11); 7.3066(0.84); 6.3930(2.25); 6.0032(0.78); 5.9814(0.93); 5.9756(0.90);
 5.9538(0.80); 5.1262(0.46); 5.0841(2.18); 5.0558(2.16); 5.0139(0.41); 4.6676(1.34);
 4.6387(2.06); 4.5397(2.16); 4.5108(1.47); 4.4929(0.48); 4.4592(0.51); 4.0683(0.55);
 4.0504(0.54); 3.9493(1.39); 3.9217(1.31); 3.9062(1.51); 3.8785(1.11); 3.6257(0.85);
 3.6130(1.73); 3.6025(3.17); 3.5924(1.34); 3.5316(2.71); 3.5217(2.79); 3.5177(1.62);
 3.5106(1.21); 3.5076(1.14); 3.3701(0.38); 3.3510(0.45); 3.3413(0.82); 3.3317(0.51);
 3.3194(0.56); 3.3126(0.88); 3.2965(16.00); 3.2833(1.32); 3.2790(1.78); 3.2675(0.34);
 3.2573(1.34); 3.2482(0.40); 3.2357(1.04); 3.2141(1.01); 2.8782(0.34); 2.8476(0.60);
 2.8214(0.34); 2.8155(0.32); 2.4691(0.44); 2.2258(12.47); 2.2245(12.61); 2.2048(274.24);
 2.1995(217.79); 2.1214(0.81); 2.1153(0.79); 2.1091(0.70); 2.1029(0.44); 1.9729(2.73);
 1.9659(2.55); 1.9540(26.83); 1.9478(51.05); 1.9417(70.86); 1.9355(49.44); 1.9293(25.39);
 1.9048(0.46); 1.8942(0.37); 1.8736(0.51); 1.8642(0.53); 1.8424(0.46); 1.8331(0.47);
 1.7763(0.36); 1.7701(0.48); 1.7639(0.36); 1.7087(0.45); 1.6988(0.48); 1.6775(0.44);
 1.6675(0.44); 1.2699(0.61); 1.2218(0.68); 1.2040(1.33); 1.1862(0.67); -0.0002(0.39);

実施例 45、溶媒:DMSO、分光計:399.95MHz

8.0061(9.48); 7.9826(0.77); 7.6598(0.38); 7.3440(1.15); 7.3246(5.02); 7.3058(4.59);

10

20

30

40

7.1517(2.63); 7.1318(2.19); 7.0473(2.59); 7.0283(2.99); 7.0207(2.26); 7.0000(4.37);
6.9832(1.47); 6.8561(1.85); 6.8393(1.79); 5.8864(1.24); 5.8686(1.50); 5.8588(1.54);
5.8407(1.30); 5.7552(11.14); 4.8813(6.84); 4.8756(7.31); 4.1688(1.86); 4.1351(1.96);
4.0375(0.44); 4.0198(0.43); 3.9005(1.28); 3.8727(1.45); 3.8576(1.70); 3.8298(1.38);
3.5843(1.93); 3.5785(3.88); 3.5727(1.85); 3.3549(49.56); 3.3360(230.21); 3.3284(217.08);
3.3256(287.42); 3.2867(2.54); 3.2724(2.74); 3.2544(2.19); 3.2403(0.76); 3.2293(1.76);
3.2115(1.70); 3.1978(0.45); 3.1549(0.35); 3.1491(0.47); 2.9978(1.36); 2.9676(2.48);
2.9391(1.36); 2.9078(7.08); 2.6750(0.71); 2.6706(0.96); 2.6662(0.71); 2.5408(0.63);
2.5060(108.78); 2.5015(142.02); 2.4971(107.62); 2.3326(0.81); 2.3282(1.05); 2.3239(0.84);
2.2620(0.49); 2.2319(14.26); 2.1266(0.83); 2.1063(16.00); 2.0734(2.22); 2.0429(2.16);
1.9884(1.83); 1.6864(0.67); 1.6787(0.78); 1.6565(1.51); 1.6485(1.61); 1.6261(1.49);
1.6187(1.39); 1.5966(0.58); 1.5873(0.47); 1.2581(0.37); 1.2346(1.05); 1.1923(0.52);
1.1745(0.99); 1.1567(0.51); 0.0079(1.58); -0.0002(26.90); -0.0083(1.28);

実施例 46、溶媒:DMSO、分光計:399.95MHz

8.0114(3.98); 8.0029(11.23); 7.3168(0.64); 7.3102(2.52); 7.3057(2.06); 7.2948(3.13);
7.2911(3.67); 7.2869(2.38); 7.2770(1.89); 7.2727(1.12); 7.0621(2.97); 7.0470(3.07);
7.0424(2.86); 7.0400(2.62); 7.0278(3.25); 6.9937(3.44); 6.9741(1.81); 6.9554(2.92);
6.9385(1.31); 6.9367(1.32); 6.8563(1.94); 6.8404(1.62); 6.8372(1.60); 6.0807(0.50);
6.0682(1.08); 6.0546(0.80); 6.0417(1.23); 6.0374(0.69); 6.0293(0.63); 6.0249(1.34);
6.0114(0.91); 5.9984(1.32); 5.9860(0.64); 5.9166(1.45); 5.8987(1.67); 5.8889(1.66);
5.8708(1.52); 5.4429(0.74); 5.4386(2.25); 5.4343(2.36); 5.4300(0.91); 5.3996(0.64);
5.3953(1.95); 5.3910(2.07); 5.3867(0.80); 5.2483(0.83); 5.2445(2.18); 5.2405(2.21);
5.2369(0.89); 5.2218(0.75); 5.2180(2.01); 5.2140(2.08); 5.2104(0.84); 4.6375(1.28);
4.6331(2.95); 4.6284(3.27); 4.6249(2.68); 4.6210(3.20); 4.6161(3.05); 4.1680(1.90);
4.1345(1.99); 4.0556(1.04); 4.0378(3.12); 4.0200(3.15); 4.0022(1.05); 3.8925(1.59);
3.8645(1.82); 3.8497(2.08); 3.8218(1.73); 3.3907(0.37); 3.3748(0.51); 3.3267(710.58);
3.2892(3.58); 3.2791(1.56); 3.2711(2.91); 3.2574(0.53); 3.2464(2.07); 3.2284(2.00);
3.0001(1.35); 2.9703(2.48); 2.9418(1.39); 2.6795(0.44); 2.6752(0.98); 2.6706(1.42);
2.6660(1.05); 2.6614(0.52); 2.5408(0.73); 2.5240(2.28); 2.5193(3.48); 2.5105(71.10);
2.5060(152.70); 2.5014(209.79); 2.4969(155.79); 2.4924(77.49); 2.3373(0.50); 2.3328(1.07);
2.3282(1.49); 2.3237(1.12); 2.3191(0.57); 2.2321(15.82); 2.1056(16.00); 2.0735(3.20);
2.0413(1.86); 1.9885(13.82); 1.6890(0.55); 1.6799(0.66); 1.6586(1.41); 1.6501(1.59);
1.6278(1.45); 1.6193(1.40); 1.5978(0.57); 1.5879(0.48); 1.3976(1.15); 1.2978(0.39);
1.2583(0.59); 1.2348(1.38); 1.1923(3.77); 1.1745(7.51); 1.1567(3.71); -0.0002(6.96);

実施例 47、溶媒:DMSO、分光計:399.95MHz

8.7845(0.35); 8.0356(1.18); 8.0319(7.37); 8.0173(0.49); 7.5869(0.42); 7.4420(0.59);
7.4347(3.88); 7.4182(1.40); 7.4133(4.68); 7.3994(0.34); 7.3507(0.44); 7.1707(0.68);
7.1642(5.09); 7.1593(1.82); 7.1477(1.45); 7.1427(4.51); 7.1361(0.67); 6.4984(4.27);
5.7729(1.07); 5.7530(1.32); 5.7460(1.23); 5.7256(1.00); 5.3488(0.82); 5.3061(2.51);
5.2560(2.62); 5.2135(0.86); 4.3851(0.72); 4.3514(0.78); 4.0558(0.62); 4.0380(1.84);
4.0202(1.89); 4.0024(0.80); 3.9879(0.71); 3.9524(0.75); 3.9109(1.03); 3.8837(1.26);
3.8679(1.39); 3.8406(1.14); 3.4604(0.37); 3.4400(0.63); 3.4132(2.35); 3.3927(3.49);
3.3525(353.69); 3.3485(459.15); 3.3461(516.01); 3.3421(735.82); 3.2661(2.04);
3.2380(1.15); 3.2318(1.10); 3.1922(0.43); 2.8668(0.59); 2.8363(0.98); 2.8095(0.58);
2.6807(0.41); 2.6763(0.84); 2.6717(1.18); 2.6672(0.88); 2.6628(0.45); 2.5419(0.62);
2.5251(2.21); 2.5204(3.20); 2.5117(56.02); 2.5072(119.61); 2.5027(163.85); 2.4981(121.68);
2.4936(60.83); 2.3385(0.42); 2.3340(0.83); 2.3294(1.15); 2.3249(0.87); 2.3202(0.44);
2.2069(16.00); 2.1340(0.75); 2.1017(1.45); 2.0861(1.25); 2.0729(1.73); 1.9886(8.30);
1.9241(0.45); 1.9123(0.85); 1.9045(0.99); 1.9016(0.74); 1.8929(1.48); 1.8887(0.92);
1.8812(0.96); 1.8732(0.96); 1.8615(0.56); 1.8252(0.61); 1.8148(0.66); 1.7924(0.59);
1.7839(0.57); 1.7603(0.33); 1.6043(0.33); 1.5838(0.59); 1.5743(0.65); 1.5525(0.63);
1.5443(0.61); 1.3976(1.15); 1.2349(0.77); 1.1925(2.26); 1.1747(4.49); 1.1569(2.23);
1.1158(0.39); 1.0957(0.36); 1.0830(0.77); 1.0704(1.81); 1.0631(3.57); 1.0553(2.15);
1.0505(1.85); 1.0431(2.83); 1.0368(1.75); 1.0246(1.74); 1.0175(3.08); 1.0106(3.01);
1.0063(3.12); 0.9984(2.10); 0.9854(0.50); 0.0080(0.33); -0.0002(11.67); -0.0084(0.46);

10

20

30

40

実施例 48、溶媒：DMSO、分光計：399.95MHz

8.0329(7.22); 7.4658(0.49); 7.4552(8.31); 7.4454(4.85); 7.4417(4.76); 7.4214(0.51);
 7.2027(0.35); 7.1921(2.05); 7.1817(1.81); 7.1789(1.98); 7.1687(1.79); 6.5052(4.35);
 6.1109(1.31); 6.0867(1.67); 6.0798(1.60); 6.0555(1.36); 5.7630(9.67); 5.3651(0.98);
 5.3226(2.46); 5.2634(2.42); 5.2208(0.98); 4.3907(0.71); 4.3580(0.75); 4.0544(0.35);
 4.0367(1.07); 4.0189(1.11); 4.0010(0.69); 3.9922(0.67); 3.9571(0.72); 3.9209(1.11);
 3.8896(1.34); 3.8776(1.54); 3.8464(1.23); 3.4331(1.62); 3.4211(0.73); 3.4089(1.99);
 3.4016(1.17); 3.3900(3.25); 3.3692(105.50); 3.3662(108.97); 3.3627(125.98);
 3.3573(125.25); 3.3535(153.94); 3.3133(0.59); 3.2996(0.80); 3.2691(1.11); 3.2411(0.58);
 3.0424(0.57); 2.8682(0.53); 2.8540(0.58); 2.8380(0.90); 2.8106(0.52); 2.6772(0.44);
 2.6726(0.62); 2.6680(0.44); 2.5261(1.16); 2.5214(1.66); 2.5126(31.65); 2.5081(69.43);
 2.5035(94.42); 2.4989(67.38); 2.4944(31.70); 2.3347(0.46); 2.3303(0.64); 2.3257(0.48);
 2.2067(16.00); 2.1915(0.73); 2.1337(0.69); 2.1264(0.52); 2.1033(1.36); 2.0774(1.16);
 1.9902(4.94); 1.8206(0.56); 1.8121(0.62); 1.7897(0.56); 1.7816(0.52); 1.6306(0.37);
 1.6183(0.69); 1.6112(0.91); 1.6056(0.71); 1.5993(1.52); 1.5876(1.00); 1.5796(1.26);
 1.5678(1.05); 1.5464(0.60); 1.5370(0.58); 1.1920(1.38); 1.1742(2.75); 1.1564(1.35);
 0.9614(0.64); 0.9531(0.62); 0.9425(2.08); 0.9294(1.10); 0.9219(2.04); 0.9102(0.90);
 0.9030(0.72); 0.8210(0.39); 0.8110(0.77); 0.8005(0.70); 0.7932(0.89); 0.7835(0.72);
 0.7686(0.74); 0.7586(0.60); 0.7470(0.93); 0.7375(0.80); 0.7268(0.86); 0.7176(0.60);
 0.0080(0.72); -0.0002(27.69); -0.0085(1.03);

10

実施例 49、溶媒：DMSO、分光計：399.95MHz

7.9775(7.21); 7.9529(0.74); 7.3985(0.59); 7.3812(0.71); 7.3775(1.25); 7.3604(1.27);
 7.3567(0.82); 7.3395(0.66); 6.9326(1.66); 6.9116(1.52); 6.8657(0.89); 6.8415(1.10);
 6.8200(0.86); 6.5035(3.21); 6.0604(0.81); 6.0378(1.02); 6.0299(0.96); 6.0070(0.85);
 5.3679(0.77); 5.3253(1.93); 5.2637(1.85); 5.2211(0.75); 4.3962(0.51); 4.3632(0.54);
 4.1114(1.81); 4.1006(2.89); 4.0887(1.95); 4.0548(0.57); 4.0370(1.71); 4.0192(1.75);
 4.0013(0.96); 3.9626(0.51); 3.7633(0.56); 3.7322(0.67); 3.7208(0.99); 3.6903(0.88);
 3.5957(1.03); 3.5730(1.06); 3.5536(0.67); 3.5309(0.66); 3.4820(1.31); 3.4783(1.25);
 3.4727(2.14); 3.4652(2.14); 3.4542(1.04); 3.4264(0.43); 3.4069(0.40); 3.3973(0.75);
 3.3870(0.38); 3.3688(0.48); 3.3607(0.74); 3.3419(218.73); 3.3183(1.43); 3.3079(0.72);
 3.3033(0.71); 3.2721(0.80); 3.2654(0.64); 3.2445(0.46); 3.0407(0.36); 3.0169(16.00);
 2.8906(6.62); 2.8700(0.39); 2.8386(0.74); 2.8125(0.39); 2.7310(5.14); 2.6763(0.36);
 2.6718(0.52); 2.6673(0.37); 2.5252(0.78); 2.5206(1.20); 2.5118(26.94); 2.5073(58.44);
 2.5028(78.90); 2.4982(55.83); 2.4937(26.07); 2.3342(0.39); 2.3295(0.54); 2.3249(0.40);
 2.2087(12.09); 2.1393(0.48); 2.1331(0.49); 2.1257(0.45); 2.1104(0.99); 2.0768(0.66);
 1.9899(7.95); 1.9076(0.84); 1.8267(0.44); 1.8211(0.47); 1.7982(0.43); 1.7900(0.40);
 1.5843(0.41); 1.5753(0.46); 1.5538(0.44); 1.5450(0.43); 1.1920(2.10); 1.1742(4.23);
 1.1564(2.04); 0.0080(0.40); -0.0002(14.85); -0.0085(0.51);

20

30

実施例 50、溶媒：DMSO、分光計：399.95MHz

7.9530(8.91); 7.3744(1.93); 7.3538(4.10); 7.3332(2.69); 7.1062(2.47); 7.1041(3.28);
 7.0859(4.76); 7.0839(4.63); 7.0648(2.13); 6.5062(4.45); 6.2598(1.34); 6.2363(1.75);
 6.2289(1.61); 6.2053(1.41); 5.8253(0.33); 5.8117(0.67); 5.7985(0.66); 5.7852(0.82);
 5.7684(0.90); 5.7616(0.80); 5.7552(0.78); 5.7420(0.86); 5.7285(0.44); 5.3676(1.03);
 5.3250(2.60); 5.2642(3.94); 5.2243(2.34); 5.2207(2.27); 5.0140(1.59); 5.0105(1.62);
 4.9877(1.50); 4.9843(1.52); 4.5816(0.47); 4.5687(0.49); 4.5500(1.39); 4.5367(1.37);
 4.5208(1.37); 4.5066(1.34); 4.4889(0.48); 4.4748(0.47); 4.3923(0.71); 4.3596(0.76);
 4.0547(0.87); 4.0369(2.63); 4.0191(2.70); 4.0012(1.40); 3.9622(0.72); 3.7620(1.05);
 3.7309(1.29); 3.7201(1.84); 3.6890(1.47); 3.5752(1.59); 3.5516(1.58); 3.5332(1.13);
 3.5097(1.10); 3.4242(0.83); 3.3788(255.26); 3.3768(255.06); 3.3727(209.45);
 3.3699(232.41); 3.3125(1.04); 3.3074(1.07); 3.2773(1.18); 3.2489(0.69); 3.2435(0.63);
 2.8774(0.54); 2.8465(0.94); 2.8206(0.55); 2.6783(0.38); 2.6737(0.53); 2.6691(0.39);
 2.5271(0.84); 2.5224(1.36); 2.5136(27.60); 2.5092(60.18); 2.5046(80.99); 2.5000(57.47);
 2.4955(26.85); 2.3358(0.40); 2.3313(0.55); 2.3267(0.40); 2.2088(16.00); 2.1502(0.67);
 2.1123(1.37); 2.0865(0.77); 2.0771(0.87); 1.9903(12.30); 1.8314(0.58); 1.8229(0.64);
 1.8004(0.59); 1.7919(0.55); 1.5907(0.55); 1.5814(0.64); 1.5603(0.59); 1.5511(0.58);

40

1. 1921(3.28); 1.1743(6.54); 1.1565(3.22); -0.0002(4.51);

実施例 51、溶媒:DMSO、分光計:399.95MHz

7.9706(8.74); 7.3989(0.78); 7.3817(0.97); 7.3779(1.64); 7.3609(1.66); 7.3571(1.04);
7.3400(0.84); 6.9372(2.31); 6.9160(2.12); 6.8675(1.21); 6.8422(1.42); 6.8207(1.13);
6.5037(4.21); 6.1077(1.07); 6.0857(1.30); 6.0770(1.24); 6.0548(1.13); 5.9293(0.34);
5.9160(0.74); 5.9029(0.73); 5.8895(0.86); 5.8864(0.53); 5.8729(0.95); 5.8596(0.86);
5.8465(0.92); 5.8334(0.45); 5.3659(1.00); 5.3406(1.76); 5.3366(1.84); 5.3327(0.85);
5.3235(2.65); 5.3012(0.59); 5.2974(1.51); 5.2933(1.53); 5.2895(0.62); 5.2665(2.53);
5.2239(0.98); 5.2032(0.61); 5.1221(1.65); 5.1185(1.63); 5.0957(1.55); 5.0922(1.53);
4.5906(1.63); 4.5869(1.21); 4.5786(2.74); 4.5662(1.56); 4.3942(0.70); 4.3609(0.75);
4.0550(1.00); 4.0372(3.03); 4.0194(3.09); 4.0015(1.49); 3.9625(0.71); 3.8005(0.77);
3.7702(0.88); 3.7578(1.10); 3.7280(1.01); 3.5352(1.27); 3.5132(1.28); 3.4928(0.96);
3.4709(0.98); 3.4237(0.44); 3.4120(0.35); 3.4037(0.62); 3.3943(1.11); 3.3854(0.68);
3.3772(0.39); 3.3744(0.40); 3.3657(0.78); 3.3620(0.95); 3.3602(0.99); 3.3556(1.40);
3.3418(302.46); 3.3264(1.23); 3.3180(1.55); 3.3079(0.78); 3.3038(0.71); 3.2744(0.93);
3.2461(0.52); 3.2401(0.47); 3.0429(1.33); 2.8736(0.50); 2.8543(1.43); 2.8467(0.90);
2.8166(0.51); 2.6763(0.42); 2.6719(0.59); 2.6673(0.42); 2.5253(0.96); 2.5206(1.55);
2.5119(31.01); 2.5074(66.11); 2.5029(88.42); 2.4984(62.76); 2.4940(29.40); 2.3344(0.41);
2.3297(0.58); 2.3251(0.42); 2.2091(16.00); 2.1913(1.25); 2.1498(0.67); 2.1466(0.63);
2.1125(1.31); 2.0862(0.71); 2.0776(0.71); 1.9900(13.71); 1.8331(0.55); 1.8264(0.66);
1.8031(0.54); 1.7952(0.52); 1.5914(0.55); 1.5826(0.61); 1.5608(0.58); 1.5508(0.56);
1.2349(0.34); 1.1921(3.53); 1.1743(7.13); 1.1564(3.43); 0.0081(0.47); -0.0002(15.63);
-0.0084(0.51);

実施例 52、溶媒:DMSO、分光計:601.6MHz

8.0358(7.61); 7.2774(0.74); 7.2742(0.77); 7.2644(0.94); 7.2612(1.03); 7.2580(0.86);
7.2551(0.81); 7.2446(0.93); 7.2418(0.95); 7.1645(0.94); 7.1617(1.01); 7.1515(2.51);
7.1487(1.98); 7.1409(1.34); 7.1331(1.26); 7.1279(1.36); 7.1200(1.37); 7.1150(0.49);
7.1069(0.50); 6.5053(4.35); 6.0851(0.60); 6.0763(0.47); 6.0669(0.85); 6.0568(0.89);
6.0476(0.52); 6.0393(0.68); 6.0293(0.35); 5.9261(1.26); 5.9136(1.43); 5.9074(1.36);
5.8949(1.27); 5.3966(1.73); 5.3940(1.69); 5.3915(0.67); 5.3681(1.60); 5.3654(1.56);
5.3630(0.64); 5.3509(1.29); 5.3225(2.53); 5.2618(2.61); 5.2407(1.82); 5.2382(1.83);
5.2361(1.33); 5.2336(1.44); 5.2235(1.62); 4.6113(2.93); 4.6016(2.75); 4.3806(0.76);
4.3588(0.79); 4.0335(0.46); 4.0217(0.46); 3.9801(0.75); 3.9567(0.77); 3.9224(1.21);
3.9035(1.38); 3.8938(1.51); 3.8750(1.27); 3.3986(0.64); 3.3926(0.49); 3.3855(0.79);
3.3793(1.41); 3.3493(580.12); 3.3257(12.73); 3.3089(1.64); 3.2826(0.66); 3.2634(1.08);
3.2439(0.62); 3.2396(0.52); 2.8516(0.54); 2.8309(0.97); 2.8134(0.56); 2.6178(1.20);
2.6149(1.62); 2.6119(1.14); 2.5426(0.65); 2.5241(2.96); 2.5211(4.06); 2.5179(4.89);
2.5087(96.04); 2.5061(192.28); 2.5031(255.09); 2.5002(185.23); 2.4804(1.02); 2.4773(0.92);
2.3903(1.26); 2.3873(1.66); 2.3843(1.20); 2.2055(16.00); 2.1928(0.47); 2.1259(0.69);
2.0981(1.15); 2.0783(2.81); 1.9905(2.01); 1.8291(0.33); 1.8150(0.64); 1.8090(0.69);
1.7944(0.66); 1.7890(0.62); 1.5684(0.65); 1.5622(0.69); 1.5482(0.67); 1.5419(0.64);
1.3969(0.47); 1.2337(1.34); 1.1860(0.57); 1.1741(1.09); 1.1623(0.56); 1.1365(0.56);
0.0052(2.96); -0.0002(72.51); -0.0057(2.46);

実施例 53、溶媒:DMSO、分光計:601.6MHz

10.2595(5.04); 8.0507(7.33); 7.7701(1.91); 7.7685(2.00); 7.7574(2.47); 7.7558(2.50);
7.6824(0.70); 7.6738(0.84); 7.6690(1.38); 7.6607(1.40); 7.6562(0.94); 7.6476(0.77);
7.6120(1.19); 7.5949(1.38); 7.5811(0.83); 6.5807(1.13); 6.5629(1.65); 6.5441(1.15);
6.5072(4.42); 5.3547(1.33); 5.3263(2.70); 5.2687(2.59); 5.2404(1.30); 4.3893(0.87);
4.3673(0.90); 3.9893(0.85); 3.9787(1.05); 3.9761(1.10); 3.9663(0.96); 3.9589(1.23);
3.9501(1.01); 3.9476(0.99); 3.9280(0.85); 3.5858(1.07); 3.5688(1.10); 3.5567(0.95);
3.5400(0.94); 3.4250(0.34); 3.4189(0.62); 3.4124(0.47); 3.4059(0.76); 3.3998(1.23);
3.3935(0.82); 3.3865(0.63); 3.3799(1.01); 3.3550(256.99); 3.3314(3.80); 3.2926(0.68);
3.2728(1.16); 3.2537(0.62); 3.2502(0.55); 2.8615(0.60); 2.8411(1.10); 2.8235(0.61);
2.6182(0.47); 2.6154(0.64); 2.6125(0.50); 2.5244(1.20); 2.5214(1.70); 2.5065(75.93);

10

20

30

40

2.5036(101.45); 2.5007(79.23); 2.3906(0.48); 2.3877(0.64); 2.3850(0.50); 2.2082(16.00);
2.1456(0.76); 2.1201(1.12); 2.0913(0.88); 2.0788(6.21); 1.8307(0.72); 1.8107(0.69);
1.5836(0.67); 1.5643(0.66); 0.0049(0.68); -0.0002(13.17);

実施例 54、溶媒:DMSO、分光計:601.6MHz

8.7986(0.80); 8.0657(0.34); 8.0560(7.35); 7.3883(0.52); 7.3857(0.58); 7.3745(1.21);
7.3720(1.50); 7.3582(1.39); 7.3556(1.99); 7.3466(1.11); 7.3429(1.41); 7.3341(1.38);
7.3293(0.67); 7.3204(0.56); 7.2762(1.73); 7.2643(1.25); 6.5057(4.67); 5.8076(1.23);
5.7950(1.39); 5.7886(1.33); 5.7758(1.19); 5.3525(1.24); 5.3241(2.42); 5.2606(2.46);
5.2323(1.29); 4.3835(0.74); 4.3617(0.79); 4.0454(0.50); 4.0336(1.54); 4.0217(1.56);
4.0099(0.53); 3.9806(0.75); 3.9577(0.78); 3.9189(1.07); 3.8997(1.30); 3.8902(1.38);
3.8711(1.15); 3.4091(0.41); 3.4028(0.65); 3.3964(0.51); 3.3898(0.91); 3.3834(1.46);
3.3753(1.49); 3.3504(474.54); 3.3268(8.13); 3.3000(1.54); 3.2873(1.89); 3.2713(1.56);
3.2588(1.98); 3.2438(0.60); 3.2396(0.53); 2.8542(0.55); 2.8505(0.58); 2.8296(1.00);
2.8122(0.55); 2.8083(0.49); 2.6209(0.40); 2.6179(0.83); 2.6150(1.11); 2.6120(0.79);
2.6090(0.36); 2.5427(0.68); 2.5242(2.84); 2.5212(3.66); 2.5180(4.29); 2.5092(64.10);
2.5062(130.48); 2.5032(174.29); 2.5002(125.86); 2.4973(57.51); 2.4799(0.46); 2.4766(0.46);
2.4738(0.44); 2.3933(0.43); 2.3904(0.86); 2.3874(1.12); 2.3844(0.81); 2.3814(0.39);
2.2201(0.42); 2.2057(16.00); 2.1901(0.44); 2.1246(0.69); 2.0965(1.20); 2.0782(2.29);
2.0713(0.77); 1.9905(6.90); 1.8821(0.38); 1.8742(0.72); 1.8695(0.72); 1.8640(0.95);
1.8612(1.12); 1.8566(0.62); 1.8537(0.68); 1.8502(0.75); 1.8406(0.54); 1.8104(0.60);
1.8039(0.62); 1.7922(0.72); 1.7867(0.78); 1.7849(0.70); 1.7792(0.77); 1.7736(0.34);
1.7716(0.49); 1.7660(0.46); 1.7354(1.68); 1.5793(0.35); 1.5662(0.72); 1.5589(0.80);
1.5456(0.75); 1.5391(0.65); 1.3969(0.44); 1.2338(0.92); 1.1860(1.90); 1.1741(3.78);
1.1623(1.83); 1.0889(0.49); 1.0841(0.52); 1.0818(1.11); 1.0767(1.64); 1.0716(0.99);
1.0687(1.20); 1.0636(1.59); 1.0587(1.07); 1.0513(0.99); 1.0481(0.88); 1.0438(1.23);
1.0381(1.09); 1.0305(0.91); 1.0247(0.56); 1.0183(0.45); 1.0128(1.07); 1.0103(0.64);
1.0053(2.12); 1.0003(1.42); 0.9975(0.90); 0.9918(2.06); 0.9789(1.26); 0.9693(0.47);
0.9641(0.41); 0.0052(1.72); -0.0002(43.02); -0.0057(1.34);

実施例 55、溶媒:DMSO、分光計:399.95MHz

7.9900(5.11); 7.9528(0.50); 7.3211(0.55); 7.3176(0.67); 7.2998(3.31); 7.2812(2.93);
7.0705(1.58); 7.0499(1.35); 6.9729(0.99); 6.9546(1.73); 6.9355(0.83); 6.4972(3.18);
5.8503(0.83); 5.8310(0.97); 5.8223(0.94); 5.8027(0.85); 5.7551(4.32); 5.3500(0.66);
5.3070(1.88); 5.2535(1.78); 5.2112(0.63); 4.3837(0.53); 4.3514(0.57); 4.1549(1.74);
4.1435(2.88); 4.1318(1.83); 3.9877(0.51); 3.9499(0.57); 3.8507(0.85); 3.8225(0.88);
3.8079(1.06); 3.7800(0.93); 3.6311(1.80); 3.6195(2.15); 3.6085(1.44); 3.4026(0.53);
3.3942(0.34); 3.3750(0.87); 3.3652(0.66); 3.3274(220.17); 3.2923(1.45); 3.2735(1.17);
3.2628(0.82); 3.2288(16.00); 2.8907(2.87); 2.8654(0.38); 2.8617(0.39); 2.8323(0.69);
2.8040(0.40); 2.7315(2.65); 2.6709(0.42); 2.5018(70.79); 2.3284(0.42); 2.2064(11.12);
2.1227(0.49); 2.0958(1.01); 2.0736(0.61); 2.0630(0.58); 1.9887(0.52); 1.8156(0.47);
1.8063(0.47); 1.7840(0.43); 1.7776(0.42); 1.5733(0.45); 1.5657(0.46); 1.5433(0.45);
1.5368(0.43); 1.2357(0.62); -0.0002(10.11); -0.0082(0.34);

実施例 56、溶媒:DMSO、分光計:399.95MHz

8.7868(0.75); 8.0463(0.81); 8.0388(8.80); 7.4462(1.28); 7.4419(1.52); 7.4270(1.61);
7.4229(2.06); 7.4147(0.94); 7.4104(0.83); 7.3957(1.69); 7.3911(1.41); 7.3761(1.48);
7.3717(1.20); 7.3397(0.34); 7.3110(1.23); 7.3082(1.42); 7.2922(1.83); 7.2893(1.97);
7.2736(0.78); 7.2706(0.76); 7.1763(2.17); 7.1735(2.19); 7.1562(1.87); 7.1534(1.78);
6.4972(4.64); 5.7554(11.20); 5.7402(1.29); 5.7311(1.31); 5.7115(1.10); 5.3515(0.79);
5.3091(2.37); 5.2551(2.53); 5.2130(0.86); 4.3857(0.69); 4.3536(0.72); 4.0558(0.33);
4.0379(1.00); 4.0201(1.05); 4.0023(0.53); 3.9867(0.68); 3.9522(0.71); 3.8958(1.11);
3.8672(1.30); 3.8526(1.44); 3.8241(1.19); 3.4178(0.34); 3.4083(0.53); 3.3985(0.40);
3.3893(0.64); 3.3796(1.07); 3.3705(0.66); 3.3608(0.54); 3.3515(0.79); 3.3267(95.06);
3.3230(198.62); 3.2903(1.88); 3.2705(1.95); 3.2471(1.43); 3.2359(0.69); 3.2276(1.64);
2.8628(0.55); 2.8356(0.90); 2.8060(0.51); 2.6750(0.40); 2.6705(0.54); 2.6658(0.41);
2.5406(0.34); 2.5238(0.95); 2.5191(1.43); 2.5098(30.88); 2.5057(60.00); 2.5013(83.80);
2.4971(58.45); 2.4928(29.21); 2.3329(0.41); 2.3281(0.52); 2.3236(0.39); 2.2066(16.00);

10

20

30

40

2.1936(0.85); 2.1291(0.65); 2.0990(1.32); 2.0734(1.01); 1.9884(4.67); 1.8725(0.41);
 1.8566(0.73); 1.8468(0.87); 1.8412(1.36); 1.8356(0.87); 1.8301(0.85); 1.8223(0.97);
 1.8105(0.93); 1.7848(0.54); 1.5759(0.57); 1.5668(0.59); 1.5442(0.58); 1.5355(0.54);
 1.2344(0.35); 1.1923(1.29); 1.1745(2.61); 1.1567(1.28); 1.0728(0.54); 1.0647(0.67);
 1.0578(0.73); 1.0521(1.19); 1.0467(1.39); 1.0304(2.30); 1.0194(1.51); 1.0140(2.46);
 1.0076(1.75); 1.0021(1.05); 0.9962(0.99); 0.9871(1.16); 0.9824(0.83); 0.9742(0.89);
 0.9631(1.22); 0.9488(0.63); 0.9430(0.61); -0.0002(3.06);

鋭いピークの強度は、c m単位でのNMRスペクトラムの印刷例におけるシグナルの高さに相関し、シグナル強度の真の比率を示すものである。広いシグナルの場合、いくつかのピークまたはシグナルの中央部およびそれらの相対的な強度を、スペクトラム中の最も強いシグナルと比較して示すことができる。

10

【0318】

^1H NMRスペクトラムの化学シフトの計算には、本発明者らは、テトラメチルシランおよび／または特にDMSO中で測定したスペクトラムの場合は溶媒の化学シフトを用いている。従って、テトラメチルシランのピークをNMRピークリストに挙げる必要はないと考えられる。

【0319】

^1H NMRピークのリストは、従来の ^1H NMRプリントアウトと同様であることから、通常は従来のNMR解釈で列記される全てのピークを含むものである。

20

【0320】

さらに、従来の ^1H NMRプリントアウトと同様に、それらは溶媒シグナル、標的化合物の立体異性体（同様に本発明の主題の一部を形成する）のシグナルおよび／または不純物のピークを示す場合がある。

【0321】

溶媒および／または水の δ 値範囲での化合物シグナルを報告する際には、 ^1H NMRピークの本願人らのリストは、通常、溶媒ピーク、例えばDMSO- d_6 中のDMSOのピークおよび水のピークを示しており、それらは通常、平均すると高い強度を有する。

【0322】

標的化合物の立体異性体のピークおよび／または不純物のピークは通常、標的化合物（例えば、 $>90\%$ の純度を有するもの）のピークより平均して低い強度を有する。

30

【0323】

そのような立体異性体および／または不純物は、特定の製造方法に特有のものであり得る。従って、それらのピークは、「副生成物フィンガープリント」を参照する本願人らの製造方法の再現を確認する上で役立ち得るものである。

【0324】

公知の方法（Mestrelab C、ACDシミュレーションと、経験的に評価される期待値も使用）によって標的化合物のピークを計算する専門家は、必要に応じて、適宜に追加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解釈における関連ピーク選択と同様であると考えられる。

40

【0325】

^1H NMRピークリストについてのさらなる詳細は、Research Disclosure Database Number 564025にある。

【0326】

使用例

実施例A

疫病菌（Phytophthora）試験（トマト）／保護的

溶媒：N，N-ジメチルホルムアミド49重量部

乳化剤：アルキルアリールポリグリコールエーテル1重量部

好適な有効成分製剤を製造するため、有効成分1重量部を指定量の溶媒および乳化剤と

50

混和し、濃縮液を水で希釈して所望の濃度とする。

【0327】

保護効力について調べるため、若いトマト植物に有効成分製剤を指定施用量で噴霧する。処理1日後、植物にフィトフトラ・インフェスタンス（*Phytophthora infestans*）の孢子懸濁液を接種し、100%相対湿度および22℃で24時間放置する。次に、植物を約96%相対空気湿度および温度約20℃の人工気象室に入れる。

【0328】

接種から7日後に評価を行う。0%は対照の効力に相当する効力を意味し、100%の効力は感染が全く観察されないことを意味する。

【0329】

この試験では、下記の本発明の化合物が、有効成分濃度100ppmで70%以上の効力を示す。

【0330】

表2

【0331】

【表3】

実施例番号	効力%	実施例番号	効力%	実施例番号	効力%
1	100	25	100	43	97
2	100	26	100	44	94
3	100	29	100	45	100
4	95	30	97	46	100
5	95	34	100	47	100
6	95	35	100	48	70
7	100	36	100	49	90
8	100	37	94	50	70
9	94	38	94	51	85
11	85	39	94	52	97
12	75	40	100	53	98
13	89	41	98	54	94
18	100	41	97	55	92
19	98	42	94	56	89

実施例 B

プラスモパラ（*Plasmopara*）試験（ブドウ）／保護的

溶媒：アセトン24.5重量部

ジメチルアセトアミド24.5重量部

乳化剤：アルキルアリアルポリグリコールエーテル1重量部

好適な有効成分製剤を製造するため、有効成分1重量部を指定量の溶媒および乳化剤と混和し、濃縮液を水で希釈して所望の濃度とする。

【0332】

保護効力について調べるため、若い植物に有効成分の製剤を指定施用量で噴霧する。噴霧コーティングが乾いた後、植物にプラスモパラ・ビチコラ（*Plasmopara viticola*）の孢子水系懸濁液を接種し、約20℃および100%相対空気湿度のインキュベーションキャビン中で1日間保持する。次に、植物を、約21℃および約90%相対空気湿度の温室に4日間入れる。次に、植物を濡らし、インキュベーションキャビンに1日間入れる。

【0333】

接種から6日後に評価を行う。0%は対照の効力に相当する効力を意味し、100%の効力は感染が全く観察されないことを意味する。

【0334】

この試験では、下記の本発明の化合物が、有効成分濃度10ppmで70%以上の効力

を示す。

【0335】

表3

【0336】

【表4】

実施例番号	効力%
1	98
2	100
3	100
4	95
5	84
6	98
7	100
8	100
9	100
11	100
12	100
13	100
16	96

実施例番号	効力%
17	92
18	95
19	98
25	100
29	100
30	100
34	84
37	96
38	100
39	100
40	85
41	78
42	96

実施例番号	効力%
43	83
45	96
46	98
47	86
48	95
49	100
50	100
51	100
52	98
53	100
54	91
55	93
56	98

10

【手続補正書】

【提出日】平成28年2月9日(2016.2.9)

【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

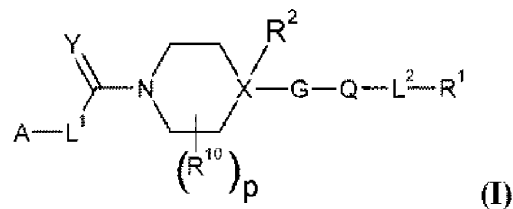
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

下記式(I)の化合物。

【化1】



〔式中、

記号はそれぞれ、下記のように定義され、

Aは、5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル、5-クロロ-2-メチルフェニル、2, 5-ビス(ジフルオロメチル)フェニル、3, 5-ビス(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル、3-(ジフルオロメチル)-5-メチル-1H-ピラゾール-1-イル、5-(ジフルオロメチル)-3-メチル-1H-ピラゾール-1-イル又は2, 5-ジメチルフェニルであり、

L¹は、-CH₂-または-NH-であり、

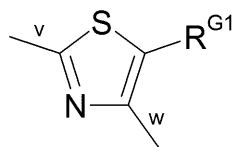
L²は、直接結合であり、

Yは、酸素であり、

Xは、炭素であり、

pは、0であり、

G は、



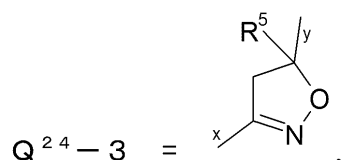
$G^1 =$,

であり、

「v」によって識別される結合がXに直接結合しており、「w」によって識別される結合がQに直接結合しており、

R^{G^1} は、水素であり、

Q は、



$Q^{24-3} =$,

であり、

「x」によって識別される結合がGに直接結合しており、「y」によって識別される結合が L^2 に直接結合しており、

R^2 は、水素であり、

R^5 は、水素であり、

R^1 は、 Z^4 置換基によって1回置換されており、さらに別の置換を有していても良いフェニルであり、当該さらなる置換基はそれぞれ独立に Z^4 および Z^{1-1} から選択され、

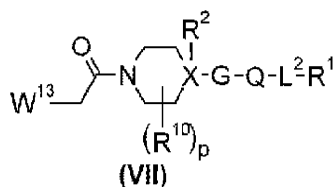
Z^4 は、アリルオキシであり、そして

Z^{1-1} は、水素、ハロゲン、 C_1-C_6 -アルキルまたは C_1-C_6 -ハロアルキルである。]

【請求項2】

下記式(VII)の化合物、または該化合物の塩、金属錯体もしくはN-オキサイド。

【化7】

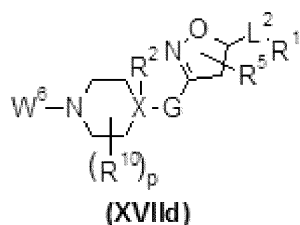


[式中、記号 R^2 、X、G、Q、 L^2 、 R^1 、 R^{10} およびpはそれぞれ請求項1で定義の通りであり、 W^{13} は脱離基である。]

【請求項3】

下記式(XVII d)の化合物、または該化合物の塩、金属錯体もしくはN-オキサイド。

【化 8】

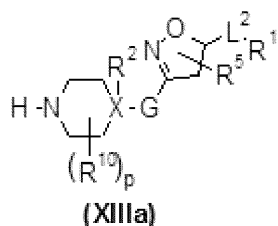


[式中、記号 W^6 はアセチル、 $C_1 - C_4$ アルコキシカルボニル、ベンジルまたはベンジルオキシカルボニルであり、記号 X 、 L^2 、 p 、 R^1 、 R^2 、 R^5 および R^{10} はそれぞれ請求項 1 で定義の通りである。]

【請求項 4】

下記式 (XIIIIa) の化合物、または該化合物の塩、金属錯体もしくは N -オキサイド。

【化 9】



[式中、記号 X 、 L^2 、 p 、 G 、 R^1 、 R^2 、 R^5 および R^{10} はそれぞれ請求項 1 で定義の通りである。]

【請求項 5】

植物病原性有害真菌を防除するための組成物において、増量剤および／または界面活性剤に加えて、少なくとも 1 種類の請求項 1 に記載の式 (I) の化合物を含有することを特徴とする組成物。

【請求項 6】

植物病原性有害真菌を防除するための組成物の製造方法において、請求項 1 に記載の式 (I) の化合物を増量剤および／または界面活性剤と混和することを特徴とする方法。

フロントページの続き

- (74)代理人 100129713
弁理士 重森 一輝
- (74)代理人 100137213
弁理士 安藤 健司
- (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 ヒルブランド, ステファン
ドイツ国、4 1 4 6 2・ノイス、ローリンガー・シュトラセ・2 2
- (72)発明者 クリストー, ピエール
フランス国、エフー6 9 0 0 9・リヨン、リュ・マリートン・4、セ／オ・アンジェラ・ロペス・
ジラル
- (72)発明者 ホフマン, セバスチアン
ドイツ国、4 1 4 7 0・ノイス、フアーヴエーク・7
- (72)発明者 クルト・ヨアヒム
ドイツ国、4 0 7 6 4・ランゲンフェルト、フィルネブルクシュトラセ・6 9
- (72)発明者 ザイツ, トーマス
ドイツ国、4 0 7 6 4・ランゲンフェルト、リーテルバツハ・1 0・ペー
- (72)発明者 バスナイレ, ピエール
ドイツ国、4 0 2 2 5・デュツセルドルフ、クリストフシュトラセ・5 5
- (72)発明者 土屋 知己
フランス国、6 9 0 0 9・リヨン、リュ・ジャン・マリー・ルクレール・1 6
- (72)発明者 ベンテイング, ユルゲン
ドイツ国、4 2 7 9 9・ライヒリンゲン、アムゼルシュトラセ・7
- (72)発明者 ヴアツヘンドルフ・ノイマン, ウルリケ
ドイツ国、5 6 5 6 6・ノイヴィート、オーバー・マーケンベグ・8 5