

(19)日本国特許庁(JP)

(12)公表特許公報(A)

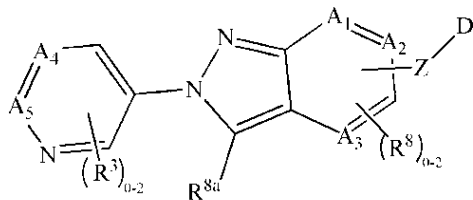
(11)公表番号
特表2025-521090
(P2025-521090A)

(43)公表日 令和7年7月8日(2025.7.8)

(51)国際特許分類		F I		テーマコード (参考)	
C 0 7 D	401/04 (2006.01)	C 0 7 D	401/04	C S P	4 C 0 8 4
A 0 1 P	7/04 (2006.01)	A 0 1 P	7/04		4 C 0 8 6
A 0 1 N	43/56 (2006.01)	A 0 1 N	43/56	G	4 H 0 1 1
A 6 1 K	31/4439(2006.01)	A 6 1 K	31/4439		
C 0 7 D	409/14 (2006.01)	C 0 7 D	409/14		
		審査請求	未請求	予備審査請求	未請求 (全168頁) 最終頁に続く
(21)出願番号	特願2024-566369(P2024-566369)		(71)出願人	519135367 ピーアイ インダストリーズ リミテッド P I I N D U S T R I E S L T D インド共和国 3 1 3 0 0 1 ラージャス ターン, ウダイプル, ウダイサガー ロ ード	
(86)(22)出願日	令和5年5月10日(2023.5.10)		(74)代理人	100103894 弁理士 家入 健	
(85)翻訳文提出日	令和7年1月8日(2025.1.8)		(72)発明者	ヤダヴ アジェイ シン インド共和国 1 2 2 0 1 8 グルガオン , ハリヤーナ, セクター-4 9, ウッパ ル サウスエンド, ファースト フロア, エス-3 0 2	
(86)国際出願番号	PCT/IN2023/050445		(72)発明者	ダッタ アミット クマール インド共和国 7 1 1 3 0 2 ハウラー, 最終頁に続く	
(87)国際公開番号	WO2023/218484				
(87)国際公開日	令和5年11月16日(2023.11.16)				
(31)優先権主張番号	202211027227				
(32)優先日	令和4年5月11日(2022.5.11)				
(33)優先権主張国・地域又は機関	インド(IN)				
(81)指定国・地域	AP(BW,CV,GH,GM,KE,LR,LS,MW,MZ ,NA,RW,SD,SL,ST,SZ,TZ,UG,ZM,ZW), EA(AM,AZ,BY,KG,KZ,RU,TJ,TM),EP(AL,AT,BE,BG,CH,CY,CZ,DE,DK,EE,ES, FI,FR,GB,GR,HR,HU,IE,IS,IT,LT,LU,LV 最終頁に続く				

(54)【発明の名称】 二環式化合物および害虫防除剤としてのそれらの使用

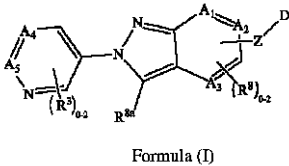
(57)【要約】
本発明は、式（I）の新規二環式化合物を提供する。



式 (I)

式中、A₁、A₂、A₃、A₄、A₅、Z、D、R³、R⁸およびR^{8a}の定義は、詳細な説明に記載されている。
。前記化合物は、高い殺虫効果を示している。本発明はまた、前記式（I）の化合物の製造方法に関する。本発明はさらに、前記式（I）の化合物の組成物、組み合わせ、使用および適用方法に関する。

【選択図】 なし



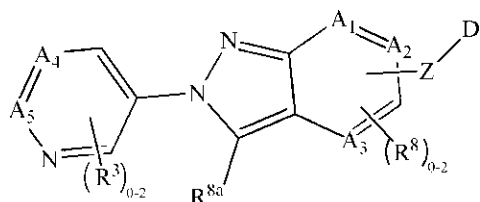
Formula (I)

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I) の化合物、

【化 1】



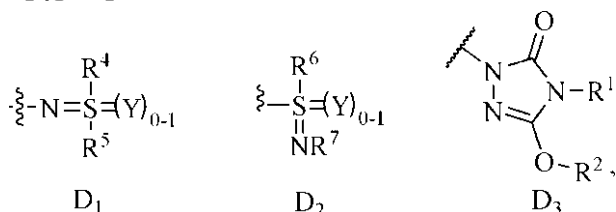
式 (I)

10

式中、

Z は直接結合または $-C(=O)-$ から選択される；D は D₁、D₂ および D₃ からなる群から選択される、

【化 2】



20

；

Y は O または NR⁷ を表す；A₁、A₂、および A₃ は独立して C または N である；A₄ および A₅ は独立して C または N であるが、A₄ および A₅ の両方が同時に N であることはできない；R¹ は、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、C₃-C₈ シクロアルキル、C₃-C₈ シクロアルキル-C₁-C₆ アルキル、フェニル、ベンジル、フェニルエチルおよび C₂-C₆ ヘテロシクリルからなる群から選択される；

30

R² は、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、および C₃-C₈ シクロアルキル-C₁-C₆ アルキルからなる群から選択される；R³ は、水素、ハロゲン、シアノ、C₁-C₆ アルキル、C₂-C₆ アルケニル、C₂-C₆ アルキニル、C₃-C₆ シクロアルキル、C₁-C₆ アルコキシ、および C₁-C₆ ハロアルキルからなる群から選択される；R⁴ は、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、C₃-C₈ シクロアルキル、C₃-C₈ シクロアルキル-C₁-C₆ アルキル、および -NR^cR^d からなる群から選択される；

40

R^c は、水素、C₁-C₆ アルキル、C₁-C₆ ハロアルキル、および C₃-C₈ シクロアルキルからなる群から選択される；R^d は、水素、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、C₃-C₈ シクロアルキル、C₃-C₆ シクロアルキル-C₁-C₄ アルキルからなる群から選択される；

または

R^c および R^d 置換基は、それらが結合している原子と一緒に、または C、N、O、C(=O)、C(=S)、および S(O)₀₋₂ からなる群から選択されるさらなる原子と一緒に、3~6 員環を形成してもよく、任意に、ハロゲン、CN、および C₁-C₆ アルキルからなる群から選択される 1 つまたは 2 つ以上の置換基によって置換されていてもよ

50

い；

R^5 は、 C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 ハロアルキル、 C_3-C_8 シクロアルキル、 C_3-C_8 シクロアルキル- C_1-C_6 アルキル、 C_2-C_6 アルケニル、 C_2-C_6 ハロアルケニル、フェニル、ベンジル、および C_2-C_6 ヘテロシクリルからなる群から選択される；

または

R^4 および R^5 置換基は、それらが結合している原子と一緒に、または C、N、O、C (=O)、C (=S)、および S (O)₀₋₂ からなる群から選択されるさらなる原子と一緒に、3~6 員環を形成してもよく、任意に、ハロゲン、CN および C_1-C_6 アルキルからなる群から選択される 1 つまたは 2 つ以上の置換基によって置換されてもよい；

10

R^6 は、 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_3-C_8 シクロアルキル、 C_3-C_8 シクロアルキル- C_1-C_6 アルキル、フェニル、ベンジル、 C_2-C_6 ヘテロシクリル、および $-NR^cR^d$ からなる群から選択される；

R^7 は、水素、シアノ、 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_1-C_6 アルコキシ、 C_3-C_8 シクロアルキル、 C_3-C_8 シクロアルキル- C_1-C_6 アルキル、フェニル、ベンジル、 C_2-C_6 ヘテロシクリル、 C_2-C_6 ヘテロシクリル- C_1-C_6 アルキル、 $-COR^5$ 、 $-CONR^cR^d$ 、 SCF_3 、および $-SO_2R^5$ からなる群から選択される；

20

R^8 および R^{8a} は、独立して、水素、ハロゲン、シアノ、 C_1-C_4 アルキル、 C_1-C_4 ハロアルキルからなる群から選択される；

R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 および R^7 の各脂肪族基は、任意に 1 つまたは 2 つ以上の R^a 基で置換されてもよい； R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 および R^7 の環状基は、任意に 1 つまたは 2 つ以上の R^b 基で置換されてもよい、ここで、

R^a は、ハロゲン、シアノ、 C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 ハロアルキル、 C_3-C_8 シクロアルキル、 C_1-C_6 アルコキシ、 C_1-C_6 アルキルチオ、フェニルおよび C_2-C_6 ヘテロシクリルからなる群から選択される；

R^b は、ハロゲン、シアノ、 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_3-C_8 シクロアルキル、 C_1-C_6 アルキルチオ、 C_1-C_6 ハロアルキルチオ、 C_1-C_6 アルコキシおよび C_1-C_6 ハロアルコキシからなる群から選択される；

30

あるいは、その塩、立体異性体、互変異性体、多形体、金属錯体または N-オキシド。

【請求項 2】

D が D_1 である、請求項 1 に記載の式 (I) の化合物。

【請求項 3】

D が D_2 である、請求項 1 に記載の式 (I) の化合物。

【請求項 4】

D が D_3 である、請求項 1 に記載の式 (I) の化合物。

【請求項 5】

Z が直接結合である、請求項 1~4 のいずれかに記載の式 (I) の化合物。

40

【請求項 6】

D が D_1 である；

Z が直接結合または $-C(=O)-$ である；

R^3 が、水素、ハロゲン、シアノ、 C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 ハロアルキルおよび C_1-C_6 アルコキシからなる群から選択される；

R^4 が、 C_1-C_6 アルキル、 C_3-C_8 シクロアルキル、 C_3-C_8 シクロアルキル- C_1-C_6 アルキルおよび $-NR^cR^d$ からなる群から選択される；

ここで、 R^c が、水素または C_1-C_6 アルキルからなる群から選択される；

R^d が、水素または C_1-C_6 アルキルからなる群から選択される；

50

R^5 が、 C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 ハロアルキル、 C_3-C_8 シクロアルキル、 C_3-C_8 シクロアルキル- C_1-C_6 アルキル、フェニル、ベンジル、および C_2-C_6 ヘテロシクリルからなる群から選択される；

または

R^4 および R^5 置換基が、それらが結合している原子と一緒に、または C、N、O、C (=O)、C (=S)、および S (O)₀₋₂ からなる群から選択されるさらなる原子と一緒に、4~6 員環を形成してもよく、その一部が、任意に、ハロゲン、CN、および C_1-C_6 アルキルからなる 1 つまたは 2 つ以上の基で置換されてもよい；

ここで、 R^4 および R^5 の各脂肪族基が、任意に、1 つまたは 2 つ以上の R^a 基で置換されてもよく、 R^4 および R^5 の環状基が、任意に、1 つまたは 2 つ以上の R^b 基で置換されてもよい；

10

R^a が、ハロゲン、シアノ、 C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 ハロアルキル、 C_3-C_8 シクロアルキル、 C_1-C_6 アルコキシ、 C_1-C_6 アルキルチオ、フェニル、および C_2-C_6 ヘテロシクリルからなる群から選択される；

R^b が、ハロゲン、シアノ、 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_3-C_8 シクロアルキル、 C_1-C_6 アルキルチオ、 C_1-C_6 ハロアルキルチオ、 C_1-C_6 アルコキシおよび C_1-C_6 ハロアルコキシからなる群から選択される；

R^8 および R^{8a} が、独立して、水素、ハロゲン、シアノ、 C_1-C_4 -アルキル、および C_1-C_4 -ハロアルキルからなる群から選択される；

20

A_1 、 A_2 、 A_3 、 A_4 、および A_5 が、請求項 1 に定義されたものと同一である；請求項 1 に記載の式 (I) の化合物、あるいはその塩、立体異性体、互変異性体、多形体、金属錯体、または N-オキシド。

【請求項 7】

D が D_2 である；Z が直接結合である；

R^3 が、水素、ハロゲン、 C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 ハロアルキル、および C_1-C_6 アルコキシからなる群から選択される；

R^6 が、 C_1-C_6 アルキル、 C_3-C_8 シクロアルキル、 C_3-C_8 シクロアルキル- C_1-C_6 アルキルおよび $-NR^cR^d$ からなる群から選択される；

ここで、 R^c が、水素または C_1-C_6 アルキルからなる群から選択される；

30

R^d が、水素または C_1-C_6 アルキルからなる群から選択される；

R^7 が、水素、 C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 ハロアルキル、 C_3-C_8 シクロアルキル、 C_3-C_8 シクロアルキル- C_1-C_6 アルキル、 $-COR^5$ 、フェニル、ベンジル、 C_2-C_6 ヘテロシクリルおよびシアノからなる群から選択される；

ここで、 R^5 が、 C_1-C_6 アルキルおよび C_3-C_8 シクロアルキルからなる群から選択される；

ここで、 R^5 、 R^6 および R^7 の各脂肪族基は、任意に、1 つまたは 2 つ以上の R^a 基で置換されていてもよく、 R^5 、 R^6 および R^7 の環状基は、任意に、1 つまたは 2 つ以上の R^b 基で置換されていてもよい、

R^a が、ハロゲン、シアノ、 C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 ハロアルキル、 C_3-C_8 シクロアルキル、 C_1-C_6 アルコキシ、 C_1-C_6 アルキルチオ、フェニルおよび C_2-C_6 ヘテロシクリルからなる群から選択される；

40

R^b が、ハロゲン、シアノ、 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_3-C_8 シクロアルキル、 C_1-C_6 アルキルチオ、 C_1-C_6 ハロアルキルチオ、 C_1-C_6 アルコキシおよび C_1-C_6 ハロアルコキシからなる群から選択される；

R^8 および R^{8a} が、独立して、水素、ハロゲン、シアノ、 C_1-C_4 -アルキルおよび C_1-C_4 -ハロアルキルからなる群から選択される；

A_1 、 A_2 、 A_3 、 A_4 、および A_5 が、請求項 1 に定義されたものと同一である；請求項 1 に記載の式 (I) の化合物、あるいはその塩、立体異性体、互変異性体、多形体

50

、金属錯体、またはN-オキシド。

【請求項8】

DがD₃である；Zが直接結合である；

R¹が、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、C₃－C₆シクロアルキル、C₃－C₆シクロアルキル－C₁－C₆アルキル、フェニル、ベンジル、フェニルエチルおよびC₂－C₆ヘテロシクリルから選択される；

ここで、R¹の各脂肪族基は、任意に、1つまたは2つ以上のR^a基で置換されていてもよく、R¹の環状基は、任意に、1つまたは2つ以上のR^b基で置換されていてもよい、

R^aが、ハロゲン、シアノ、C₁－C₆アルキル、C₁－C₆ハロアルキル、C₃－C₈シクロアルキル、C₁－C₆アルコキシ、C₁－C₆アルキルチオ、フェニルおよびC₂－C₆ヘテロシクリルからなる群から選択される；

R^bが、ハロゲン、シアノ、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、C₃－C₈シクロアルキル、C₁－C₆アルキルチオ、C₁－C₆ハロアルキルチオ、C₁－C₆アルコキシおよびC₁－C₆ハロアルコキシからなる群から選択される；

R²が、C₁－C₆アルキルである；

R³が、水素、ハロゲン、C₁－C₆アルキル、C₁－C₆ハロアルキル、およびC₁－C₆アルコキシからなる群から選択される；

R⁸およびR^{8a}は、独立して、水素、ハロゲン、シアノ、C₁－C₄アルキル、およびC₁－C₄ハロアルキルからなる群から選択される；

A₁、A₂、A₃、A₄およびA₅が、請求項1に定義されたものと同じである；請求項1に記載の式(I)の化合物、あるいはその塩、立体異性体、互変異性体、多形体、金属錯体またはN-オキシド。

【請求項9】

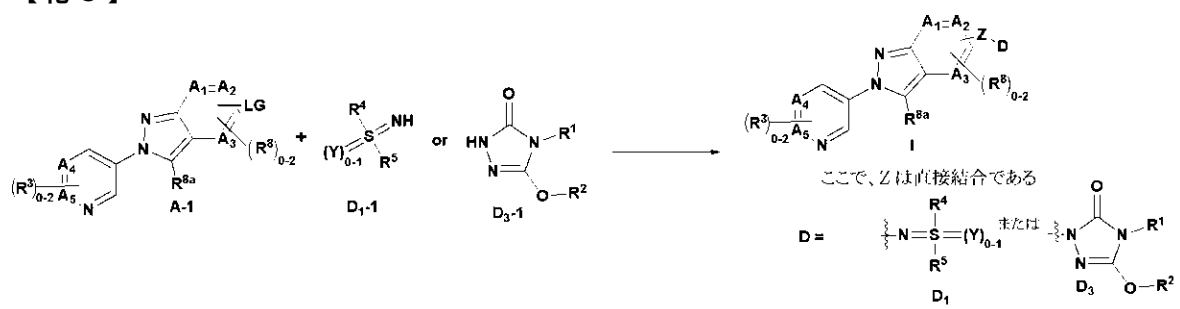
A₁、A₂、A₃、A₄およびA₅が独立してCである；またはA₁、A₂、A₃およびA₅が独立してCであり、A₄がNである；またはA₁、A₂、A₄およびA₅が独立してCであり、A₃がNである；またはA₁、A₂およびA₅が独立してCであり、A₃およびA₄が独立してNである；またはA₂、A₃、A₄およびA₅が独立してCであり、A₁がNである；またはA₂、A₃およびA₅が独立してCであり、A₁およびA₄が独立してNである；またはA₅がNであり、A₁、A₂、A₃およびA₄が独立してCである；またはA₂がNであり、A₁、A₃、A₄およびA₅が独立してCである；またはA₂およびA₄が独立してNであり、A₁、A₃およびA₅が独立してCである、請求項6、7または8に記載の式(I)の化合物。

【請求項10】

DがD₁またはD₃であり、以下のステップを含む、請求項1に記載の式(I)の化合物あるいはその塩、金属錯体、立体異性体、多形体またはN-オキシドの製造方法：

i 式(A-1)の化合物を式(D₁-1)または(D₃-1)の化合物と反応させて、式(I)の化合物を得る、ここで、Zは直接結合である；

【化3】



10

20

30

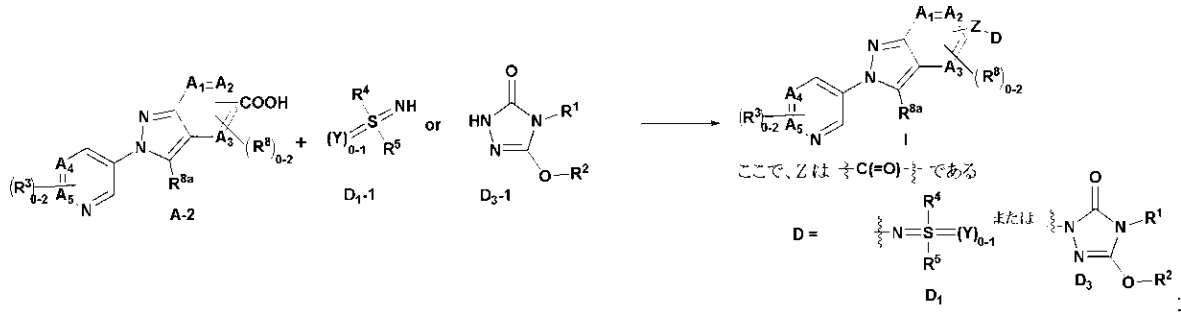
40

50

または

i 式 (A-1) の化合物を式 (D₁-1) または (D₃-1) の化合物と反応させて、式 (I) の化合物を得る、ここで、Z は -C(=O)- 結合である；

【化 4】



10

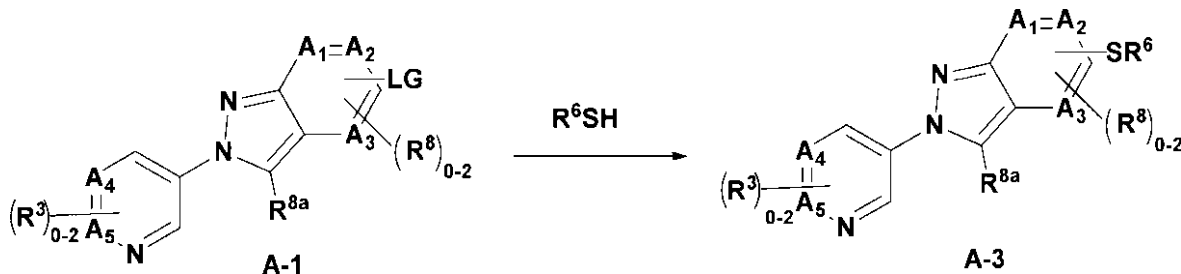
式中、LG は脱離基を表し、A₁、A₂、A₃、A₄、A₅、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁸ および R^{8a} の定義は、請求項 1 に定義したものと同一である。

【請求項 1 1】

D が D₂ であり、以下のステップを含む、請求項 1 に記載の式 (I) の化合物、あるいはその塩、金属錯体、立体異性体、多形体または N-オキシドの製造方法：

i 式 (A-1) の化合物を式 R⁶SH の化合物と反応させて、式 (A-3) の化合物を得る、ここで、Z は直接結合である；

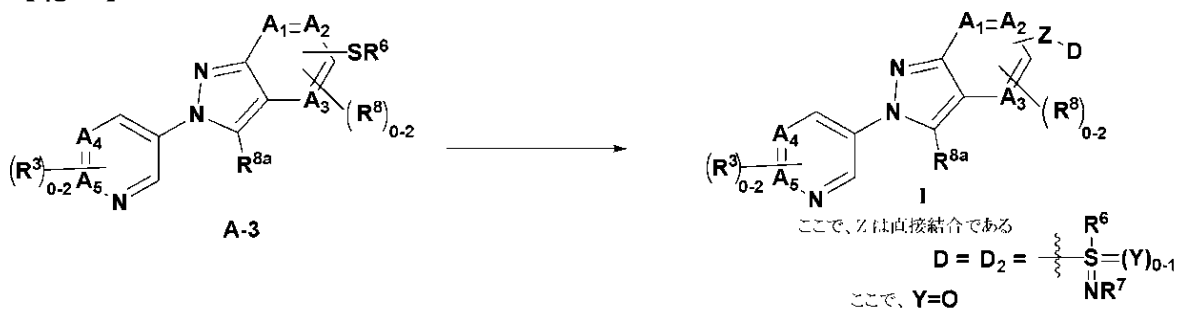
【化 5】



20

ii 式 (A-3) の化合物を、適切な酸化剤および N 源を用いて、(O) および (N) 転移により式 (I) の化合物に変換して、式 (I) の化合物を得る、

【化 6】



30

40

ここで、A₁、A₂、A₃、A₄、A₅、R³、R⁶、R⁷、R⁸ および R^{8a} の定義は、請求項 1 に定義したものと同一である。

【請求項 1 2】

請求項 1 に記載の式 (I) の化合物、その塩、金属錯体、立体異性体、多形体または N-オキシド、ならびに界面活性剤および補助剤からなる群から選択される少なくとも 1 つの追加成分を含む組成物。

【請求項 1 3】

前記組成物が、殺菌剤、殺虫剤、殺線虫剤、殺ダニ剤、生物農薬、除草剤、植物成長調節剤、生物刺激剤、抗生物質、肥料または栄養素から選択される少なくとも 1 つの生物活

50

性適合性化合物をさらに含む、請求項 1 2 に記載の組成物。

【請求項 1 4】

前記式 (I) の化合物が、前記組成物の全重量に対して、0.1～99 重量%の範囲の量で存在する、請求項 1 2 に記載の組成物。

【請求項 1 5】

請求項 1 に記載の式 (I) の化合物の生物学的有効量と、殺菌剤、殺虫剤、殺線虫剤、殺ダニ剤、生物農薬、除草剤、植物成長調節剤、生物刺激剤、抗生物質、肥料および栄養素から選択される少なくとも 1 つの追加の生物活性適合性化合物とを含む組み合わせ。

【請求項 1 6】

請求項 1、1 2 または 1 5 に記載の式 (I) の化合物、その塩、立体異性体、多形体、金属錯体、N-オキシド、組成物またはそれらの組み合わせの、生物学的有効量と、昆虫およびダニ害虫、それらの生息地、繁殖地、食料源、植物、種子、土壌、昆虫およびダニ害虫が生育しているかまたは生育する可能性のある領域、材料または環境、あるいは害虫の攻撃または侵入から保護される材料、植物、種子、土壌、表面または空間とを接触させることを含む、昆虫およびダニ害虫を駆除する方法。

10

【請求項 1 7】

請求項 1、1 2 または 1 5 に記載の式 (I) の化合物、その塩、立体異性体、多形体、金属錯体、N-オキシド、組成物またはそれらの組み合わせと、作物を接触させることを含む、

作物を昆虫およびダニ害虫による攻撃または侵入から保護するための方法。

20

【請求項 1 8】

前記方法が、農作物または園芸作物において、1 ヘクタール当たり 1～5000 ガイ (gai) の範囲の量で、前記式 (I) の化合物の有効用量を適用することを含む、請求項 1 6 または 1 7 に記載の方法。

【請求項 1 9】

播種前および／または発芽前の種子を、請求項 1、1 2 または 1 5 に記載の式 (I) の化合物、その塩、立体異性体、多形体、金属錯体、N-オキシド、組成物またはそれらの組み合わせと接触させることを含む、

種子、植物および植物部分を土壌昆虫から、ならびに苗根および新芽を土壌および葉の昆虫から保護するための方法。

30

【請求項 2 0】

請求項 1、1 2 または 1 5 に記載の式 (I) の化合物、あるいはその塩、金属錯体、N-オキシド、立体異性体、多形体、組成物、あるいはそれらの組み合わせの、農作物、園芸作物、家庭及び媒介動物の駆除における昆虫およびダニ害虫の駆除、ならびに動物の寄生虫の駆除のための使用。

【請求項 2 1】

前記農作物が、穀物、トウモロコシ、ソルガム、バジューラ、米、大豆、油糧種子およびその他のマメ科植物、果実および果樹、ブドウ、ナッツおよびナッツの木、柑橘類および柑橘類の木、任意の園芸植物、ウリ科植物、油脂性植物、タバコ、コーヒー、茶、カカオ、テンサイ、サトウキビ、綿、ジャガイモ、トマト、タマネギ、ピーマン、その他の野菜および観賞用植物である、請求項 2 0 に記載の式 (I) の化合物の使用。

40

【請求項 2 2】

種子中の前記式 (I) の化合物の量が、0.0001～1 重量%の範囲である、請求項 1、1 2 または 1 5 に記載の式 (I) の化合物、その塩、金属錯体、N-オキシド、立体異性体、多形体、組成物またはそれらの組み合わせを含む種子。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本明細書に記載される本発明は、新規な二環式化合物に関し、特に、本発明は、式 (I) の化合物、これらの化合物を含む組成物、および害虫防除剤としてのそれらの使用に関

50

する。さらに、本発明は、これらの新規な二環式化合物の製造およびそれらの有用な中間体に関する。

【背景技術】

【0002】

特定の置換二環式化合物が害虫防除特性を示すことは、先行技術、例えば、国際公開第2018/011111号、国際公開第2016/071499号、国際公開第2015/038503号、国際公開第2016/087363号、国際公開第2016/087368号、国際公開第2016/087421号および国際公開第2016/087422号から知られている。

【0003】

上記の先行技術において報告された活性化合物は、いくつかの点において欠点を有する。例えば、それらは殺虫活性の狭いスペクトルのみを示し、低適用率では満足のいく害虫防除効果がない、または所望の速効性や長期持続効果を示さない。

したがって、殺虫活性の向上、有効範囲の拡大、活性の持続時間の延長、植物適合性の向上、環境安全性の向上、製剤特性の改善、耐性発生リスクの低減などを備えた新しい害虫防除剤が常に求められている。

【0004】

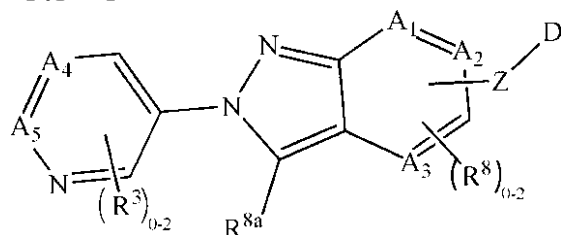
要約：

本発明は、害虫防除活性の向上、より好ましい生物学的または環境的特性、適用範囲の拡大、または植物適合性の向上のいずれかの点で、文献で報告されている類似の化合物よりも有利な効果を有することが見出されている新規二環式化合物に関する。

本発明の新規二環式化合物は、他の生物学的に活性な化合物と組み合わせて使用することもでき、これにより、特に防除が困難な昆虫に対する効力を向上できる。

したがって、本発明は、式(I)の新規二環式化合物を提供する。

【化1】

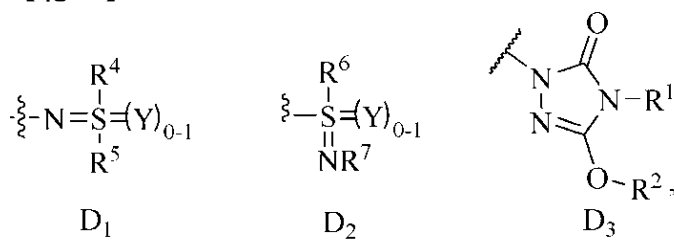


式中、

Zは直接結合または $-C(=O)-$ から選択される；

DはD₁、D₂およびD₃からなる群から選択される、

【化2】



YはOまたはNR⁷を表す；

A₁、A₂およびA₃は独立してCまたはNである；

A₄およびA₅は独立してCまたはNであり、ただし、A₄およびA₅が同時にNであることはできない；

R¹は、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、C₃-C₈シクロアルキル、C₃-C₈シクロアルキル-C₁-C₆アルキル、フェニル、ベンジル、フェニルエチルおよびC₂-C₆ヘテロシクリルからなる群

から選択される；

R^2 は、 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、および C_3-C_8 シクロアルキル- C_1-C_6 アルキルからなる群から選択される；

R^3 は、水素、ハロゲン、シアノ、 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 アルコキシ、および C_1-C_6 ハロアルキルからなる群から選択される；

R^4 は、 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_3-C_8 シクロアルキル、 C_3-C_8 シクロアルキル- C_1-C_6 アルキル、および $-NR^cR^d$ からなる群から選択される；

R^c は、水素、 C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 ハロアルキル、および C_3-C_8 シクロアルキルからなる群から選択される；

R^d は、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_3-C_8 シクロアルキル、 C_3-C_8 シクロアルキル- C_1-C_4 アルキルからなる群から選択される；

または

R^c および R^d 置換基は、それらが結合している原子と一緒に、または C、N、O、C(=O)、C(=S)、および S(O)₀₋₂ からなる群から選択されるさらなる原子と一緒に、3～6 員環を形成してもよく、任意に、ハロゲン、CN、および C_1-C_6 アルキルからなる群から選択される 1 つ以上の置換基によって置換されてもよい；

R^5 は、 C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 ハロアルキル、 C_3-C_8 シクロアルキル、 C_3-C_8 シクロアルキル- C_1-C_6 アルキル、 C_2-C_6 アルケニル、 C_2-C_6 ハロアルケニル、フェニル、ベンジル、および C_2-C_6 ヘテロシクリルからなる群から選択される；

または

R^4 および R^5 置換基は、それらが結合している原子と一緒に、または C、N、O、C(=O)、C(=S)、および S(O)₀₋₂ からなる群から選択されるさらなる原子と一緒に、3～6 員環を形成してもよく、任意に、ハロゲン、CN および C_1-C_6 アルキルからなる群から選択される 1 つ以上の置換基によって置換されてもよい；

R^6 は、 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_3-C_8 シクロアルキル、 C_3-C_8 シクロアルキル、 C_3-C_8 シクロアルキル- C_1-C_6 アルキル、フェニル、ベンジル、 C_2-C_6 ヘテロシクリルおよび $-NR^cR^d$ からなる群から選択される；

R^7 は、水素、シアノ、 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_1-C_6 アルコキシ、 C_3-C_8 シクロアルキル、 C_3-C_8 シクロアルキル- C_1-C_6 アルキル、フェニル、ベンジル、 C_2-C_6 ヘテロシクリル、 C_2-C_6 ヘテロシクリル- C_1-C_6 アルキル、 $-COR^5$ 、 $-CONR^cR^d$ 、 SCF_3 、および $-SO_2R^5$ からなる群から選択される；

R^8 および R^{8a} は、独立して、水素、ハロゲン、シアノ、 C_1-C_4 アルキルおよび C_1-C_4 ハロアルキルからなる群から選択される；

ここで、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 および R^7 の各脂肪族基は、任意に、 R^a の 1 つ以上の基で置換されてもよく、また、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 および R^7 の環状基は、任意に、 R^b の 1 つ以上の基で置換されてもよく、ここで、

R^a は、ハロゲン、シアノ、 C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 ハロアルキル、 C_3-C_8 シクロアルキル、 C_1-C_6 アルコキシ、 C_1-C_6 アルキルチオ、フェニルおよび C_2-C_6 ヘテロシクリルからなる群から選択される；

R^b は、ハロゲン、シアノ、 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_3-C_8 シクロアルキル、 C_1-C_6 アルキルチオ、 C_1-C_6 ハロアルキルチオ、 C_1-C_6 アルコキ

10

20

30

40

50

シおよびC₁ーC₆ハロアルコキシからなる群から選択される；

あるいはその塩、立体異性体、互変異性体、多形体、金属錯体またはNーオキシド。

【0005】

別の実施形態では、本発明は、式(I)の化合物、その塩、金属錯体、立体異性体、多形体またはNーオキシド、ならびに界面活性剤および補助剤からなる群から選択される少なくとも1つの追加成分を含む組成物を提供する。

【0006】

さらに別の実施形態では、本発明は、さらに、殺菌剤、殺虫剤、殺線虫剤、殺ダニ剤、生物農薬、除草剤、植物成長調節剤、生物刺激剤、抗生物質、肥料または栄養素から選択される少なくとも1つの生物活性適合性化合物を含む組成物を提供する。

【0007】

さらに別の実施形態では、本発明は、式(I)の化合物の製造方法を提供する。

以下、本発明を詳細に説明する。

【0008】

本発明の詳細な説明：

定義：

本開示で使用される用語について本明細書で提供される定義は、説明のためだけのものであり、本開示で開示される本発明の範囲を制限するものではない。

本明細書において使用される場合、用語「含む(comprise)」、「含んでいる(comprising)」、「含む(include)」、「含んでいる(including)」、「有する(has)」、「有している(having)」、「含む(contain)」、「含んでいる(Containing)」、「特徴づけられる(characterized by)」、またはそれらの任意の他のバリエーションは、明示的に示される任意の限定を条件として、非排他的な包含をカバーすることを意図している。

例えば、要素のリストを含む組成物、混合物、プロセス、または方法は、必ずしもそれらの要素のみに限定されるわけではなく、当該組成物、混合物、プロセスまたは方法に明示的に記載されていないまたは固有の他の要素を含むことができる。

移行語句「からなる(consisting of)」は、特定されていない要素、ステップまたは成分を除外する。クレームに記載されている場合、通常それに関連する不純物を除き、記載されているもの以外の材料を含めることはクレームに禁じられる。「からなる(consisting of)」という語句が、前文の直後ではなく、クレーム本文の条項に記載されている場合、その条項に記載されている要素のみを限定する。その他の要素は、クレーム全体から除外されない。

移行語句「本質的に～からなる(consisting essentially of)」は、文字通りに開示されたものに加えて、材料、ステップ、特徴、構成要素または要素を含む組成物または方法を定義するために使用される。ただし、これらの追加の材料、ステップ、特徴、構成要素または要素は、請求項に係る発明の基本的かつ新規な特徴に実質的に影響を及ぼさない。用語「本質的に～からなる」は、「含む」と「構成される」の中間に位置する。

さらに、反対のことが明示的に述べられていない限り、「または」は、排他的な「または」ではなく、包括的な「または」を指す。例えば、条件A「または」Bは、次のいずれかによって満たされる：Aが真である（または存在する）かつBが偽である（または存在しない）、Aが偽である（または存在しない）かつBが真である（または存在する）、およびAとBの両方が真である（または存在する）。

また、本発明の要素または構成要素の前の不定冠詞「a」および「an」は、要素または構成要素のインスタンス（すなわち出現）の数に関して非限定的なものである。したがって、「a」または「an」は、1つまたは少なくとも1つを含むと解釈されるべきであり、数が明らかに単数であることを意図していない限り、要素または構成要素の単数形の単語形式には、複数も含まれる。

本開示で言及されている、用語「無脊椎動物の害虫」または「無脊椎動物」は、害虫として経済的に重要な節足動物、腹足動物および線虫を含む。用語「節足動物」は、昆虫、

10

20

30

40

50

ダニ、クモ、サソリ、ムカデ、ヤスデ、ピルバグ (pill bug) およびシンフィラン (symphylan) を含む。用語「腹足動物」は、カタツムリ、ナメクジおよび他のスタイロマトフォラ (Stylommatophora) を含む。用語「線虫」は、線虫門の生物を指す。用語「蠕虫」は、回虫、心虫、植物食性線虫 (線虫門)、吸虫 (断端虫門 (Tematoda))、棘頭虫および条虫 (条虫門) を含む。

本開示の文脈において、用語「無脊椎動物害虫防除」は、無脊椎動物害虫の発生の阻害 (死亡率、摂餌量の減少、および／または交配中断を含む) を意味し、関連する表現も同様に定義される。

用語「農学的」は、食料、飼料および繊維などの圃場作物の生産を指し、トウモロコシ、大豆および他のマメ科植物、米、穀類 (例えば、小麦、オート麦、大麦、ライ麦、米、トウモロコシ)、葉野菜 (例えば、レタス、キャベツ、その他の野菜作物)、果実野菜 (例えば、トマト、ピーマン (pepper)、ナス、アブラナ科、ウリ科)、ジャガイモ、サツマイモ、ブドウ、綿花、果樹類 (例えば、ザクロ、核果 (stone)、柑橘類)、小果類 (ベリー、サクランボ) および他の特産作物 (例えば、キャノーラ、ヒマワリ、オリーブ) の栽培を含む。

用語「非農学的」は、園芸作物 (例えば、温室、苗床または野外で栽培されていない観賞用植物)、住宅、農業、商業および産業構造物、芝生 (例えば、芝地、牧草地、ゴルフ場、芝生、運動場)、木材製品、貯蔵製品、農林業および植生管理、公衆衛生 (すなわち人間) および動物衛生 (例えば、ペット、家畜、家禽などの家畜、野生動物などの非家畜) 用途のような圃場作物以外を指す。

【0009】

非農学的用途は、本発明の化合物を、典型的には獣医学的使用のために処方された組成物の形態で、殺寄生虫効果のある (すなわち、生物学的に有効な) 量を、保護されるべき動物に投与することによって、無脊椎動物寄生害虫から動物を保護することを含む。本開示および特許請求の範囲で言及されるように、用語「寄生虫駆除 (parasitocidal)」および「寄生虫駆除的に (parasitocidally)」は、動物を害虫から保護するための無脊椎動物寄生害虫に対する観察可能な効果を指す。寄生虫駆除効果は、通常、標的の無脊椎動物寄生害虫の発生または活動を減少させることに関連する。害虫に対するそのような効果には、死亡、成長の遅延、移動能力の低下、宿主動物の体表または体内にとどまる能力の低下、摂食の減少、生殖の阻害などが含まれる。無脊椎動物寄生害虫に対するこれらの効果は、動物の寄生虫感染または感染の抑制 (防止、低減または除去を含む) を提供する。

【0010】

本開示の化合物は、純粋な形態で存在してもよいし、立体異性体または構成異性体のような種々の可能な異性体形態の混合物として存在してもよい。種々の立体異性体には、エナンチオマー、ジアステレオマー、キラル異性体、アトロピソマー、配座異性体、回転異性体、互変異性体、光学異性体、多形体、および幾何異性体が含まれる。これらの異性体の任意の所望の混合物は、本開示の請求の範囲に含まれる。当業者は、ある立体異性体が、他の異性体に対して濃縮されている場合、または他の異性体から分離されている場合に、より活性であり、および／または有益な効果を示す可能性があることを理解するであろう。さらに、当業者は、前記異性体を分離、濃縮、および／または選択的に調製するためのプロセスまたは方法または技術を知っている。

【0011】

ここで、説明において使用される様々な用語の意味を説明する。

単独で、または「アルキルチオ」または「ハロアルキル」または-N (アルキル) またはアルキルカルボニルアルキルまたはアルキルスルホニルアミノなどの複合語で使用される用語「アルキル」には、直鎖または分岐 C_1-C_{12} アルキル、好ましくは C_1-C_8 アルキル、より好ましくは C_1-C_6 アルキルを含む。アルキルの代表例としては、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, 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、または様々な異性体が挙げられる。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、複合置換基の最初の部分、例えばシクロアルキルは、アルキルによって同一または異なって独立して一置換または多置換され得る。同様のことは、他のラジカル、例えばアルケニル、アルキニル、ヒドロキシル、ハロゲン、カルボニル、カルボニルオキシなどが末端にある複合置換基にも適用される。

【0012】

単独または複合語で使用される用語「アルケニル」は、直鎖または分岐した C_2-C_{12} アルケン、好ましくは C_2-C_8 アルケン、より好ましくは C_2-C_6 アルケンを含む。アルケンの代表的な例としては、エテニル、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、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-プロペニルならびに様々な異性体が挙げられる。「アルケニル」には、1, 2-プロパジエニルおよび2, 4-ヘキサジエニルなどのポリエンも含まれる。この定義は、特に別途定義されていない限り、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。

【0013】

アルキンの非限定的な例としては、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-プロピニルならびに様々な異性体が挙げられる。この定義は、他に特に定義されていない限り、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。「アルキニル」という用語は、2, 5-ヘキサジイニルなどの複数の三重結合で構成される部分も含むことができる。

【0014】

「シクロアルキル」という用語は、環を形成するために閉じられたアルキルを意味する。非限定的な例としては、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、およびシクロヘプチルが挙げられる。この定義は、他で特に定義されていない限り、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。

【0015】

「シクロアルコキシ」、「シクロアルケニルオキシ」などの用語も同様に定義される。シクロアルコキシの非限定的な例としては、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が挙げられる。この定義は、他に特に定義されていない限り、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。

【0016】

用語「ハロゲン」は、単独で、または「ハロアルキル」などの複合語でも、フッ素、塩素、臭素またはヨウ素を含む。さらに、「ハロアルキル」などの複合語で使用される場合、前記アルキルは、同一または異なるハロゲン原子で部分的または完全に置換されていてもよい。「ハロアルキル」の非限定的な例としては、クロロメチル、ブromo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romo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、1, 1-ジクロロ-2, 2, 2-トリフルオロエチル、および1, 1, 1-トリフルオロプロップ-2-イルが挙げられる。この定義は、他で特に定義されていない限り、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。

【0017】

「ハロアルケニル」、「ハロアルキニル」という用語は、アルキル基の代わりにアルケニル基およびアルキニル基が置換基の一部として存在することを除いて、同様に定義される。

【0018】

「ハロアルコキシ」という用語は、直鎖または分岐アルコキシ基を意味し、これらの基の水素原子の一部またはすべてが上記のようにハロゲン原子で置き換えられてもよい。ハロアルコキシの非限定的な例としては、クロロメトキシ、ブromo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romo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-トリフルオロプロップ-2-オキシが挙げられる。この定義は、他に特に定義されない限り、例えばハ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ハロアルコキシにも適用される。

【0019】

「ハロアルキルチオ」という用語は、直鎖または分岐アルキルチオ基を意味し、ここで、これらの基中の水素原子の一部または全部が、上記のようにハロゲン原子によって置き換えられてもよい。ハロアルキルチオの非限定的な例としては、クロロメチルチオ、ブromo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romo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し, し, し-トリフルオロプロップ-2-イルチオが挙げられる。この定義は、他で特に定義されていない限り、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。

【0020】

用語「ヒドロキシ」は $-OH$ を意味し、アミノは $-NRR$ を意味し、ここで R は H またはアルキルなどの任意の可能な置換基であり得る。カルボニルは $-C(O)-$ を意味し、カルボニルオキシは $-OC(O)-$ を意味し、スルフィニルは SO を意味し、スルホニルは $S(O)_2$ を意味する。

【0021】

単独または複合語で使用される用語「アルコキシ」は、 C_1-C_{12} アルコキシ、好ましくは C_1-C_8 アルコキシ、より好ましくは C_1-C_6 アルコキシを含む。アルコキシの例としては、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らびにこれらの種々の異性体が挙げられる。この定義は、特に定義されていない限り、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。

【0022】

「アルコシアルキル」という用語は、アルキル上のアルコキシ置換を意味する。「アルコシアルキル」の非限定的な例としては、 CH_3OCH_2 、 $CH_3OCH_2CH_2$ 、 $CH_3CH_2OCH_2$ 、 $CH_3CH_2CH_2CH_2OCH_2$ および $CH_3CH_2OCH_2CH_2$ が挙げられる。

【0023】

用語「アルキルチオ」には、以下の分岐鎖または直鎖アルキルチオ部分が含まれる：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らびにこれらの種々の異性体が挙げられる。

【0024】

ハロシクロアルキル、ハロシクロアルケニル、アルキルシクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルコシアルキル、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、ハロアルキルカルボニル、シクロアルキルカルボニル、ハロアルコシアルキル等は上記の例と同様に定義される。

「アルキルアミノ」、「ジアルキルアミノ」等は上記の例と同様に定義される。

【0025】

用語「炭素環」は、「芳香族炭素環系」および「非芳香族炭素環系」、あるいは多環式または二環式（スピロ、縮合、架橋、非縮合）環化合物が含まれ、その環は、芳香族または非芳香族であり得る（ここで、芳香族はヒュッケル則が満たされていることを示し、非芳香族はヒュッケル則が満たされないことを示す）。

【0026】

環に関連する用語「ヘテロ」は、少なくとも1つの環原子が炭素ではなく、窒素、酸素および硫黄からなる群から独立して選択される1～4個のヘテロ原子を含み得る環を指す。ただし、各環は4個以下の窒素、2個以下の酸素および2個以下の硫黄を含む。

【0027】

用語「ヘテロ環」または「複素環」は、「芳香族複素環」または「ヘテロアリアル環系」および「非芳香族複素環系」あるいは環が芳香族または非芳香族であってもよい多環式または二環式（スピロ、縮合、架橋、非縮合）環化合物が含まれ、複素環はN、O、S（O）₀₋₂から選択される少なくとも1つのヘテロ原子を含むか、または複素環のC環メンバーの1つがヘテロ原子で置き換えられてもよく、任意にC（=O）、C（=S）、C（=CR^{*}R^{*}）およびC=N R^{*}で置き換えられてもよく、*は整数を示す。

10

【0028】

用語「非芳香族複素環」または「非芳香族複素環」は、酸素、窒素および硫黄の群から1～4個のヘテロ原子を含む、3～15員、好ましくは3～10員の飽和または部分的に不飽和の複素環を意味する：炭素環メンバーに加えて、1～3個の窒素原子および／または1個の酸素原子もしくは硫黄原子、または1～2個の酸素原子および／または硫黄原子を含む単環式、二環式または三環式複素環；環が複数の酸素原子を含む場合、それらは直接隣接していない；例えば（ただしこれらに限定されないが）オキセタニル、オキシラニル、アジリジニル、チエタニル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロチエニル、ピロリジニル、イソオキサゾリジニル、イソチアゾリジニル、ピラゾリジニル、オキサゾリジニル、チアゾリジニル、イミダゾリジニル、1, 2, 4-オキサジアゾリジニル、1, 2, 4-チアゾリジニル、1, 2, 4-トリアゾリジン-1-イル、1, 2, 4-トリアゾリジン-3-イル、1, 2, 3-トリアゾリジニル、1, 3, 4-オキサジアゾリジニル、1, 3, 4-チアジアゾリジニル、1, 3, 4-トリアゾリジニル、ジヒドロフリル、ジヒドロチエニル、ピロリニル、イソオキサゾリニル、イソチアゾリニル、ジヒドロピラゾリル、ジヒドロオキサゾリル、ジヒドロチアゾリル、ピペリジニル、ピラジニル、モルホリニル、チオモルフリニル、1, 3-ジオキサ-5-イル、テトラヒドロピラニル、テトラヒドロチエニル、ヘキサヒドロピリダジニル、ヘキサヒドロピリミジニル、ピペラジニルおよびシクロセリンが挙げられる。この定義は、他で特に定義されていない限り、例えばヘテロシクリルアルキルなどの複合置換基の一部としてのヘテロシクリルにも適用される。

20

30

【0029】

「ヘテロアリアル」または「芳香族複素環」という用語は、酸素、窒素および硫黄の基からの1～4個のヘテロ原子を含む5員または6員の完全に不飽和な単環式環系を意味する。環が1つ以上の酸素原子を含む場合、それらは直接隣接していない；1～4個の窒素原子または1～3個の窒素原子および1個の硫黄原子もしくは酸素原子を含む5員ヘテロアリアル：炭素原子に加えて、環メンバーとして1～4個の窒素原子、または1～3個の窒素原子および1個の硫黄原子もしくは酸素原子を含むことができる5員ヘテロアリアル基、例えば（これらに限定されないが）、フリル、チエニル、ピロリル、イソオキサゾリル、イソチアゾリル、ピラゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、イミダゾリル、1, 2, 4-オキサジアゾリル、1, 2, 4-チアジアゾリル、1, 2, 4-トリアゾリル、1, 3, 4-オキサジアゾリル、1, 3, 4-チアジアゾリル、1, 3, 4-トリアゾリル、テトラゾリル；1～4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1～3個の窒素原子を含むベンゾ縮合窒素結合5員ヘテロアリアル：炭素原子に加えて、環メンバーとして1～4個の窒素原子または1～3個の窒素原子を含み、かつ2個の隣接する炭素環メンバーまたは1個の窒素および1個の隣接する炭素環メンバーが、1個または2個の炭素原子が窒素原子によって置換されてもよいブター-1, 3-ジエン-1, 4-ジイル基によって架橋されていてもよく、これらの環が窒素環メンバーの1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

40

50

1, 3, 4-トリアゾール-1-イルが挙げられる。

【0030】

1～4個の窒素原子を含む6員ヘテロアリアル：炭素原子に加えて、環メンバーとしてそれぞれ1～3個および1～4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（これらに限定されないが）、ピリジニル、ピリダジニル、ピリミジニル、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；1～3個の窒素原子または1個の窒素原子および1個の酸素原子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（ただしこれらに限定されないが）、インドリル、ベンズイミダゾリル、インダゾリル、ベンゾフラニル、ベンゾチオフェニル、ベンゾチアゾリルおよびベンゾオキサゾリル；1～3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（これらに限定されないが）、キノリニル、イソキノリニル、キノキサリニル、フタラジニル、キナゾリニルおよびシンノリニルが挙げられる。

10

【0031】

用語「部分的／完全飽和または不飽和複素環」は、部分的／完全飽和複素環または部分的／完全不飽和複素環を含む。

この定義は、他で特に定義されない限り、複合置換基の一部としてのヘテロアリアル、例えばヘテロアリアルアルキルなどにも適用される。

【0032】

「アルキルカルボニル」の非限定的な例は、 $C(O)CH_3$ 、 $C(O)CH_2CH_2CH_3$ および $C(O)CH(CH_3)_2$ を含む。「アルコキシカルボニル」の非限定的な例は、 $CH_3OC(=O)$ 、 $CH_3CH_2OC(=O)$ 、 $CH_3CH_2CH_2OC(=O)$ 、 $(CH_3)_2CHOC(=O)$ および様々なブトキシまたはペントキシカルボニル異性体を含む。

20

【0033】

「アミド」という用語は、 $A-R'C=ONR''-B$ を意味し、ここで、 R' および R'' は置換基を示し、 A および B は任意の基を示す。

「チオアミド」という用語は、 $A-R'C=SNR''-B$ を意味し、ここで、 R' および R'' は置換基を示し、 A および B は任意の基を示す。

【0034】

置換基中の炭素原子の総数は、接頭辞「 C_i-C_j 」によって示される。ここで、 i および j は1から18までの数である。例えば、 C_1-C_3 アルキルスルホニルは、メチルスルホニルからプロピルスルホニルまでを示す。 C_2 アルコキシアルキルは、 CH_3OCH_2 を示す。 C_3 アルコキシアルキルは、例えば、 $CH_3CH(OCH_3)$ 、 $CH_3OCH_2CH_2$ または $CH_3CH_2OCH_2$ を示す。また、 C_4 アルコキシアルキルは、合計4個の炭素原子を含むアルコキシ基で置換されたアルキル基の様々な異性体を示す。例えば、 $CH_3CH_2CH_2OCH_2$ および $CH_3CH_2OCH_2$ を含む。上記の説明において、式(I)の化合物が1つ以上の複素環から構成される場合、すべての置換基は、炭素または窒素上の水素の置換により、任意の利用可能な炭素または窒素を介してこれらの環に結合している。

30

40

【0035】

化合物が、当該置換基の数が1を超えることができることを示す添字を有する置換基で置換されている場合、当該置換基（それらが1を超える場合）は、定義された置換基の群から独立して選択される。また、 $(R)_m$ の添字 m が、例えば0から4までの整数を示す場合、置換基の数は、0から4までの整数から選択することができる。

【0036】

基が水素であり得る置換基を含む場合、この置換基を水素とすると、当該基は非置換であると認識される。

【0037】

「任意に置換された」という用語は、本明細書において、「置換または非置換」または

50

「（非）置換」という用語と互換的に使用される。別段の断りのない限り、任意に置換された基は、基の各置換可能な位置に置換基を有することができ、各置換は互いに独立している。任意に置換された基は、置換基を有さないこともできる。したがって、「任意に1つ（または2つ）以上の置換基で置換された」という用語は、置換基の数が、0から置換のために利用可能な位置の数まで変化し得ることを意味する。

【0038】

（非）置換という用語は、前記基が置換されていないか、または前記基がハロゲン、シアノ、 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、 C_1-C_6 アルコキシ、NH（アルキル）、N（アルキル）₂および-S（O）_{0~2} C_1-C_6 アルキルからなる群から選択される置換基で独立して置換されていることを意味する。

10

【0039】

単独または複合語で使用される用語「脂肪族基」は、直鎖または分岐置換基、例えば 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_1-C_6 アルキルチオ、 C_1-C_6 ハロアルキルチオ、 C_1-C_6 アルコキシまたは C_1-C_6 ハロアルコキシを含む；

単独または複合語で使用される「環状基」という用語は、完全／部分的に飽和または不飽和の環状置換基または基、例えばシクロアルキル、フェニル、 C_2-C_6 ヘテロシクリルなどを含む。

【0040】

20

本明細書の実施形態およびその種々の特徴および有利な詳細は、明細書の非限定的な実施形態を参照して説明される。周知の構成要素および加工技術の説明は、本明細書の実施形態を不必要に不明瞭にしないように省略する。本明細書で使用される例は、本明細書の実施形態が実施され得る方法の理解を容易にし、当業者が本明細書の実施形態をさらに実施できるようにすることのみを意図している。したがって、これらの例は、本明細書の実施形態の範囲を限定するものと解釈されるべきではない。

【0041】

特定の実施形態の説明は、本明細書の実施形態の一般的な性質を十分に明らかにすることで、他の者は、現在の知識を適用することによって、一般的な概念から逸脱することなく、そのような特定の実施形態を様々な用途のために容易に変更および／または適応させることができ、したがって、そのような適応および変更は、開示された実施形態の同等物の意味および範囲内で理解されるべきであり、また、理解されることが意図されている。本明細書で使用される表現または用語は、説明のためのものであり、限定のためのものではない。したがって、本明細書の実施形態は、好ましい実施形態の観点から説明されているが、当業者は、本明細書の実施形態は、本明細書に記載された実施形態の精神および範囲内で変更を加えて実施することができることを認識するであろう。

30

【0042】

本明細書に含まれている文書、行為、材料、装置、物品などのいかなる議論も、開示のための文脈を提供することのみを目的としている。これらの事項のいずれかまたはすべてが、先行技術の基礎の一部をなす、または、本願の優先日以前のどこかに存在していた開示に関連する分野における一般常識であったことを認めるものではない。

40

【0043】

明細書および明細書／特許請求の範囲に記載されている数値は、本発明の重要な部分を形成する可能性があるが、そのような数値からのいかなる逸脱も、その逸脱が本発明に開示されている本発明と同じ科学的原理に従うならば、本発明の範囲内にあるものとする。本発明の化合物は、適切な場合には、種々の可能性のある異性体形態、特に立体異性体、例えばEおよびZ、スレオおよびエリスロ、および光学異性体の混合物として存在することができるが、適切な場合には互変異性体の混合物として存在してもよい。E異性体およびZ異性体の両方、ならびにスレオ異性体およびエリスロ異性体、ならびに光学異性体、これらの異性体および可能な互変異性体の任意の所望の混合物が開示および請求される。

50

【0044】

本開示の目的のための用語「害虫」は、菌類、ストラメノパイル（卵菌類）、細菌、線虫、ダニ、マダニ、昆虫および齧歯類を含むが、これらに限定されない。

【0045】

用語「植物」は、本明細書では、望ましいおよび望ましくない野生植物または作物植物（自然に発生する作物植物を含む）などのすべての植物および植物個体群を意味すると理解される。作物植物は、従来の育種および最適化方法、またはバイオテクノロジーおよび遺伝子工学の方法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ってよく、遺伝子組み換え植物、および植物育種者の権利によって保護可能および非保護可能な植物栽培品種を含む。

10

【0046】

本開示では、用語「植物」は、樹木、低木、ハーブ、草、シダ、およびコケによって例示される種類の生物を含み、通常、ある場所で成長し、その根を通じて水および必要な物質を吸収し、光合成によってその葉で栄養を合成する。

本発明の目的のための「植物」の例には、小麦、ライ麦、大麦、ライ小麦、オート麦または米などの農業作物；ビート類、例えばテンサイまたは飼料用テンサイ；仁果類、核果類または軟果類、例えばリンゴ、梨、プラム、桃、アーモンド、チェリー、イチゴ、ラズベリー、ブラックベリーまたはグーズベリーなどの果実および果樹；レンズ豆、エンドウ豆、アルファルファまたは大豆などのマメ科植物；ナタネ、マスタード、オリーブ、ヒマワリ、ココナッツ、カカオ豆、ヒマシ油植物、アブラヤシ、落花生または大豆などの油植物；カボチャ、キュウリ、メロンなどのウリ科植物；綿、亜麻、麻、黄麻などの繊維植物；オレンジ、レモン、グレープフルーツ、みかんなどの柑橘類の果物および柑橘類の木；ハウレンソウ、レタス、アスパラガス、キャベツ、ニンジン、タマネギ、トマト、ジャガイモ、ウリ科植物、パプリカなどの園芸植物、野菜；アボカド、シナモン、樟脳などの照葉樹植物（*lauraceous plant*）；ウリ科植物；オレギナス；穀物、トウモロコシ、大豆、その他のマメ科植物、ナタネ、サトウキビ、アブラヤシなどのエネルギーおよび原料植物；タバコ；ナッツ；コーヒー；お茶；カカオ；バナナ；ペッパー；つる植物（食用ブドウとブドウジュース用のつる植物）；ホップ；芝；スイートリーフ（ステビアとも呼ばれる）；天然ゴム植物または花、低木、広葉樹または常緑樹、例えば針葉樹などの観賞用および林業用植物；および種子などの植物増殖材料、およびこれらの植物の作物材料が挙げられる。

20

30

【0047】

好ましくは、本発明の目的のための植物には、穀物、トウモロコシ、米、大豆および他のマメ科植物、果実および果樹、ブドウ、ナッツおよびナッツの木、柑橘類および柑橘類の木、任意の園芸植物、ウリ科植物、油脂性植物、タバコ、コーヒー、茶、カカオ、テンサイ、サトウキビ、綿、ジャガイモ、トマト、タマネギ、ピーマンおよび野菜、観賞用植物、任意の花弁植物、ならびに人間および動物の使用のための他の植物が含まれるが、これらに限定されない。

【0048】

「植物部分」という用語は、地上および地下の植物のすべての部分および器官を意味すると理解される。本開示の目的のために、植物部分という用語は、挿し木、葉、小枝、塊茎、花、種子、枝、主根を含む根、側根、根毛、根尖、根冠、根茎、挿し穂、新芽、果実、果実体、樹皮、茎、芽、副芽、分裂組織、節および節間を含むが、これらに限定されない。

40

【0049】

「その場所（*locus thereof*）」という用語は、土壌、植物または植物部分の周囲、および植物または植物部分の播種／植え付け前、播種中または植え付け後に使用される装置またはツールを含む。

【0050】

本開示の化合物または他の適合性化合物を任意に含む組成物中の本開示の化合物の植物

50

または植物材料またはその場所への適用には、スプレー、コーティング、浸漬、燻蒸、含浸、注入および粉塵を含むがこれらに限定されない当業者に周知の技術による適用が含まれる。

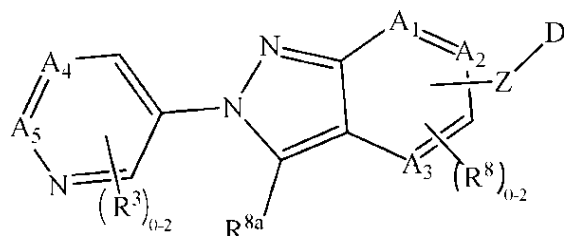
【0051】

用語「適用される」とは、物理的または化学的に植物または植物部分に付着することを意味し、含浸を含む。

【0052】

本発明は、式(I)の化合物に関する。

【化3】



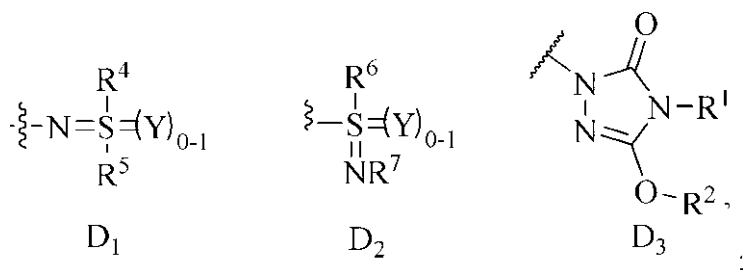
式(I)

式中、

Zは直接結合または $-C(=O)-$ から選択される；

DはD₁、D₂およびD₃からなる群から選択される、

【化4】



YはOまたはNR⁷を表す；

A₁、A₂およびA₃は独立してCまたはNを表す；

A₄およびA₅は独立してCまたはNである。ただし、A₄およびA₅の両方が同時にNであることはできない；

R¹は、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、C₃–C₈シクロアルキル、C₃–C₈シクロアルキル–C₁–C₆アルキル、フェニル、ベンジル、フェニルエチルおよびC₂–C₆ヘテロシクリルからなる群から選択される；

R²は、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、およびC₃–C₈シクロアルキル–C₁–C₆アルキルからなる群から選択される；

R³は、水素、ハロゲン、シアノ、C₁–C₆アルキル、C₂–C₆アルケニル、C₂–C₆アルキニル、C₃–C₆シクロアルキル、C₁–C₆アルコキシ、およびC₁–C₆ハロアルキルからなる群から選択される；

R⁴は、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、C₃–C₈シクロアルキル、C₃–C₈シクロアルキル–C₁–C₆アルキル、および $-NR^cR^d$ からなる群から選択される；

R^cは、水素、C₁–C₆アルキル、C₁–C₆ハロアルキル、およびC₃–C₈シクロアルキルからなる群から選択される；

R^dは、水素、C₁–C₆アルキル、C₂–C₆アルケニル、C₂–C₆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_3-C_8 シクロアルキル、 C_3-C_6 シクロアルキル- C_1-C_4 アルキルからなる群から選択される；

または

R^c および R^d 置換基は、それらが結合している原子と一緒に、または C 、 N 、 O 、 $C(=O)$ 、 $C(=S)$ 、および $S(O)_{0-2}$ からなる群から選択されるさらなる原子と一緒に、3～6員環を形成してもよく、任意に、ハロゲン、 CN 、および C_1-C_6 アルキルからなる群から選択される1つ以上の置換基によって置換されてもよい；

R^5 は、 C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 ハロアルキル、 C_3-C_8 シクロアルキル、 C_3-C_8 シクロアルキル- C_1-C_6 アルキル、 C_2-C_6 アルケニル、 C_2-C_6 ハロアルケニル、フェニル、ベンジル、および C_2-C_6 ヘテロシクリルからなる群から選択される；

10

または

R^4 および R^5 置換基は、それらが結合している原子と一緒に、または C 、 N 、 O 、 $C(=O)$ 、 $C(=S)$ 、および $S(O)_{0-2}$ からなる群から選択されるさらなる原子と一緒に、3～6員環を形成してもよく、任意に、ハロゲン、 CN 、および C_1-C_6 アルキルからなる群から選択される1つ以上の置換基によって置換されてもよい；

R^6 は、 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_3-C_8 シクロアルキル、 C_3-C_8 シクロアルキル- C_1-C_6 アルキル、フェニル、ベンジル、 C_2-C_6 ヘテロシクリルおよび $-NR^cR^d$ からなる群から選択される；

20

R^7 は、水素、シアノ、 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_1-C_6 アルコキシ、 C_3-C_8 シクロアルキル、 C_3-C_8 シクロアルキル- C_1-C_6 アルキル、フェニル、ベンジル、 C_2-C_6 ヘテロシクリル、 C_2-C_6 ヘテロシクリル- C_1-C_6 アルキル、 $-COR^5$ 、 $-CONR^cR^d$ 、 SCF_3 、および $-SO_2R^5$ からなる群から選択される；

R^8 および R^{8a} は、独立して、水素、ハロゲン、シアノ、 C_1-C_4 -アルキルおよび C_1-C_4 -ハロアルキルからなる群から選択される；

ここで、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 および R^7 の各脂肪族基は、任意に、 R^a の1つ以上の基で置換されてもよい。また、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 および R^7 の環状基は、任意に、 R^b の1つ以上の基で置換されてもよい。ここで、

30

R^a は、ハロゲン、シアノ、 C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 ハロアルキル、 C_3-C_8 シクロアルキル、 C_1-C_6 アルコキシ、 C_1-C_6 アルキルチオ、フェニルおよび C_2-C_6 ヘテロシクリルからなる群から選択される；

R^b は、ハロゲン、シアノ、 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_3-C_8 シクロアルキル、 C_1-C_6 アルキルチオ、 C_1-C_6 ハロアルキルチオ、 C_1-C_6 アルコキシおよび C_1-C_6 ハロアルコキシからなる群から選択される；

あるいはその塩、立体異性体、互変異性体、多形体、金属錯体またはN-オキシド。

40

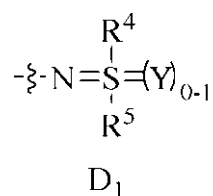
【0053】

以下の実施形態は、本発明の式(I)の化合物に関連する置換基の定義(好ましい定義を含む)を提供する。これらの置換基のいずれか1つについて、以下に示す定義のいずれかを、以下または本文書の他の箇所に示す他の置換基のいずれかの定義と組み合わせることができる。

【0054】

一実施形態において、本発明は、DがD₁である、式(I)の化合物を提供する。

【化 5】



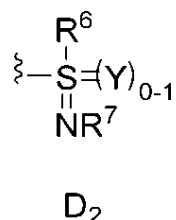
Z、Y、R³、R⁴およびR⁵は、上記で定義された通りである。

【0055】

別の実施形態において、本発明は、DがD₂である、式(I)の化合物を提供する。

10

【化 6】



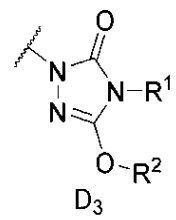
Zは直接結合であり、Y、R³、R⁶およびR⁷は、上記で定義された通りである。

【0056】

20

さらに別の実施形態において、本発明は、DがD₃である式(I)の化合物を提供する。

【化 7】



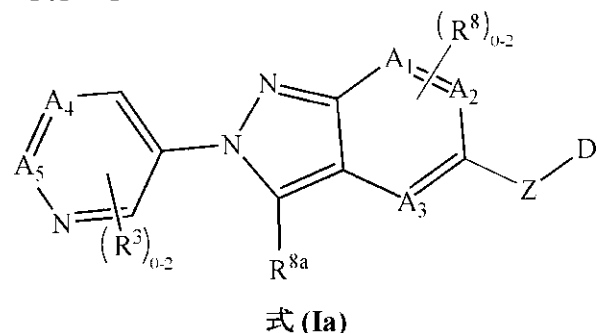
Z、R¹、R²およびR³は、上記で定義された通りである。

30

【0057】

一実施形態において、本発明は、式(Ia)の化合物を表す、式(I)の化合物を提供する。

【化 8】



40

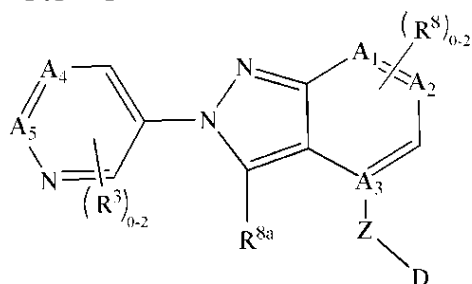
式中、A₁、A₂、A₃、A₄、A₅、Z、D、R³、R⁸およびR^{8a}は、上記で定義された通りである。

【0058】

別の実施形態において、本発明は、式(Ib)の化合物を表す、式(I)の化合物を提供する。

50

【化 9】



式 (Ib)

10

式中、 A_3 は C である； A_1 、 A_2 、 A_4 、 A_5 、 Z 、 D 、 R^3 、 R^8 および R^{8a} は上記で定義される通りである。

【0059】

一実施形態において、式 (I) の化合物の基 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 および R^7 は以下のように記載される。

R^1 は、 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、 C_3-C_8 シクロアルキル- C_1-C_6 アルキル、ベンジル、フェニルおよび C_3-C_6 ヘテロシクリルから選択される；好ましくは C_1-C_6 アルキル、 C_3-C_6 シクロアルキル、フェニル、ベンジル、および 4-6 員の芳香族または非芳香族複素環から選択される。

20

R^2 は、 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- C_1-C_6 アルキルから選択される；好ましくは C_1-C_6 アルキル、 C_3-C_6 シクロアルキル- C_1-C_6 アルキル、より好ましくは C_1-C_6 アルキル；最も好ましくはメチルまたはエチルである。

R^3 は、水素、ハロゲン、シアノ、 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 アルコキシおよび C_1-C_6 ハロアルキルからなる群から選択される；好ましくは水素、ハロゲンおよびシアノ； C_1-C_3 アルキル、 C_1-C_3 ハロアルキルおよび C_1-C_3 アルコキシ；より好ましくは水素、フッ素、塩素、メチル、エチル、メトキシおよび CF_3 である。

30

R^4 は 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_3-C_8 シクロアルキル、 C_3-C_8 シクロアルキル- C_1-C_6 アルキルおよび $-NR^cR^d$ からなる群から選択される；好ましくは C_1-C_6 アルキル、 C_3-C_6 シクロアルキル- C_1-C_6 アルキル、 C_3-C_6 シクロアルキル、 $-NR^cR^d$ および C_1-C_6 ハロアルキル；より好ましくは C_1-C_6 アルキル、 C_3-C_6 シクロアルキルおよび C_1-C_6 ハロアルキルである；

R^c は水素、 C_1-C_6 アルキル、 C_3-C_8 シクロアルキルからなる群から選択される；より好ましくは水素または C_1-C_6 アルキルである；

R^d は C_1-C_6 アルキル、 $C_1-C_6-C_3-C_8$ シクロアルキル- C_1-C_6 アルキル、フェニルおよび C_2-C_6 ヘテロシクリルからなる群から選択される；好ましくは C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 ハロアルキルおよび C_3-C_8 シクロアルキルである；または

40

R^c および R^d 置換基は、それらが結合している原子と一緒に、または C、N、O、C(=O)、C(=S)、および S(O)₀₋₂ からなる群から選択されるさらなる原子と一緒に、3~6 員環を形成してもよく、任意に、ハロゲン、CN または C_1-C_6 アルキルからなる群から選択される 1 つ以上の置換基によって置換されてもよい；

R^5 は、 C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 ハロアルキル、 C_3-C_8 シクロアルキル、 C_3-C_8 シクロアルキル- C_1-C_6 アルキル、 C_2-C_6 アルケニル、 C_2-C_6 ハロアルケニル、フェニル、ベンジル、および C_2-C_6 ヘテロシクリルからなる群から選択される；

50

任意に、 R^4 および R^5 置換基は、それらが結合している原子と共に、または C、N、O、C(=O)、C(=S)、および S(O)₀₋₂ からなる群から選択されるさらなる原子と共に、4～6員環を形成してもよく、これは任意に、ハロゲン、CN および C_1-C_6 アルキルからなる群から選択される1つ以上の置換基によって置換されてもよい；

R^6 は、 C_1-C_6 アルキル、 C_2-C_6 アルケニル、 C_1-C_6 ハロアルキル、 C_2-C_6 ハロアルケニル、 C_3-C_8 シクロアルキル、 C_3-C_8 シクロアルキル- C_1-C_6 アルキル、および C_2-C_6 ヘテロシクリルからなる群から選択される；好ましくは、 C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 ハロアルキル、 C_3-C_8 シクロアルキル および C_2-C_6 ヘテロシクリルである。

R^7 は、水素、シアノ、 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_1-C_6 アルコキシ、 C_3-C_8 シクロアルキル、 C_3-C_8 シクロアルキル- C_1-C_6 アルキル、 C_2-C_6 ヘテロシクリル および $-COR^5$ からなる群から選択される；好ましくは、水素、シアノ、 C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 ハロアルキル、 C_1-C_6 アルコキシ、 C_3-C_8 シクロアルキル C_2-C_6 ヘテロシクリル および $-COR^5$ である。

R^8 および R^{8a} は、水素、ハロゲン、シアノ、 C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 ハロアルキル、 C_3-C_8 シクロアルキル、フェニル および C_2-C_6 ヘテロシクリルからなる群から独立して選択される；好ましくは、水素、ハロゲン、シアノ、 C_1-C_6 アルキル および C_1-C_6 ハロアルキルである。

ここで、 R^1 、 R^2 、 R^4 、 R^5 、 R^6 および R^7 の各脂肪族基は、必要に応じて、1つ以上の R^a 基で置換されていてもよく、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 および R^7 の環状基は、必要に応じて、1つ以上の R^b 基で置換されていてもよい、

R^a は、ハロゲン、シアノ、 C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 ハロアルキル、 C_3-C_8 シクロアルキル、 C_1-C_6 アルコキシ、 C_1-C_6 アルキルチオ、フェニル および C_2-C_6 ヘテロシクリルからなる群から選択される；

R^b は、ハロゲン、シアノ、 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_3-C_8 シクロアルキル、 C_1-C_6 アルキルチオ、 C_1-C_6 ハロアルキルチオ、 C_1-C_6 アルコキシ および C_1-C_6 ハロアルコキシからなる群から選択される。

【0060】

さらに、本明細書に記載される本開示の実施形態は、任意の方法で組み合わせることができ、実施形態における変数の記載は、式(I)の化合物だけでなく、式(I)の化合物を調製するのに有用な出発化合物および中間化合物にも関連する。

この意味で、本発明に従って組み合わせることができる実施形態を以下に示す：

一実施形態において、本発明は、式(I)の化合物を提供し、ここで、

D は D_1 である；

Z は直接結合または $-C(=O)-$ である；好ましくは Z は直接結合である；

R^3 は、水素、ハロゲン、シアノ、 C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 ハロアルキル および C_1-C_6 アルコキシからなる群から選択される；

R^4 は、 C_1-C_6 アルキル、 C_3-C_8 シクロアルキル、 C_3-C_8 シクロアルキル- C_1-C_6 アルキル および $-NR^cR^d$ からなる群から選択される；

ここで、 R^c は、水素または C_1-C_6 アルキルからなる群から選択される；

R^d は、水素または C_1-C_6 アルキルからなる群から選択される；

R^5 は、 C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 ハロアルキル、 C_3-C_8 シクロアルキル、 C_3-C_8 シクロアルキル- C_1-C_6 アルキル、フェニル、ベンジル および C_2-C_6 ヘテロシクリルからなる群から選択される；

または

R^4 および R^5 置換基は、それらが結合している原子と一緒に、または C、N、O、C(=O)、C(=S)、および S(O)₀₋₂ からなる群から選択されるさらなる原子と一緒に、4～6員環を形成してもよく、ハロゲン、CN、および C_1-C_6 アルキルからな

10

20

30

40

50

る群から選択される1つ以上の置換基によって任意に置換されてもよい。

ここで、 R^4 および R^5 の各脂肪族基は、任意に、1つ以上の R^a 基で置換されてもよく、 R^4 および R^5 の環状基は、任意に、1つ以上の R^b 基で置換されてもよい。

R^a は、ハロゲン、シアノ、 C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 ハロアルキル、 C_3-C_8 シクロアルキル、 C_1-C_6 アルコキシ、 C_1-C_6 アルキルチオ、フェニル、および C_2-C_6 ヘテロシクリルからなる群から選択される；

R^b は、ハロゲン、シアノ、 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_3-C_8 シクロアルキル、 C_1-C_6 アルキルチオ、 C_1-C_6 ハロアルキルチオ、 C_1-C_6 アルコキシおよび C_1-C_6 ハロアルコキシからなる群から選択される；

10

R^8 および R^{8a} は、水素、ハロゲン、シアノ、 C_1-C_4 -アルキル、および C_1-C_4 -ハロアルキルからなる群から独立して選択される；

A_1 、 A_2 、 A_3 、 A_4 、 A_5 は、上記のように定義される；

あるいはその塩、立体異性体、互変異性体、多形体、金属錯体またはN-オキシドを提供する。

【0061】

別の実施形態において、本発明は、式(I)の化合物を提供する。ここで、

Dは D_2 である；

Zは直接結合である；

R^3 は、水素、ハロゲン、 C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 ハロアルキルおよび C_1-C_6 アルコキシからなる群から選択される；

20

R^6 は、 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_3-C_8 シクロアルキル、 C_3-C_8 シクロアルキル- C_1-C_6 アルキル、 $-NR^cR^d$ 、フェニル、ベンジルおよび C_2-C_6 ヘテロシクリルからなる群から選択される；好ましくは、 R^6 は、 C_1-C_6 アルキル、 C_3-C_8 シクロアルキル、 C_3-C_8 シクロアルキル- C_1-C_6 アルキルおよび $-NR^cR^d$ からなる群から選択される。

ここで、 R^c は、水素または C_1-C_6 アルキルからなる群から選択される；

R^d は、水素または C_1-C_6 アルキルからなる群から選択される；

R^7 は、独立して、水素、シアノ、 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_1-C_6 アルコキシ、 C_3-C_8 シクロアルキル、 C_3-C_8 シクロアルキル- C_1-C_6 アルキル、フェニル、ベンジル、 C_2-C_6 ヘテロシクリル、 C_2-C_6 ヘテロシクリル C_1-C_6 アルキルおよび $-COR^5$ からなる群から選択される；好ましくは、 R^7 は、水素、 C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 ハロアルキル、 C_3-C_8 シクロアルキル、 C_3-C_8 シクロアルキル- C_1-C_6 アルキル、 $-COR^5$ 、フェニル、ベンジル、 C_2-C_6 ヘテロシクリルおよびシアノからなる群から選択される；

30

ここで、 R^5 は、 C_1-C_6 アルキルおよび C_3-C_8 シクロアルキルからなる群から選択される；

ここで、 R^5 、 R^6 および R^7 の各脂肪族基は、1つ以上の R^a 基で任意に置換されてもよい；および R^5 、 R^6 および R^7 の環状基は、1つ以上の R^b 基で任意に置換されてもよい、ここで、

40

R^a は、ハロゲン、シアノ、 C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 ハロアルキル、 C_3-C_8 シクロアルキル、 C_1-C_6 アルコキシ、 C_1-C_6 アルキルチオ、フェニルおよび C_2-C_6 ヘテロシクリルからなる群から選択される；

R^b は、ハロゲン、シアノ、 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_3-C_8 シクロアルキル、 C_1-C_6 アルキルチオ、 C_1-C_6 ハロアルキルチオ、 C_1-C_6 アルコキシおよび C_1-C_6 ハロアルコキシからなる群から選択される；

A_1 、 A_2 、 A_3 、 A_4 、および A_5 は上記で定義されたとおりである；

50

あるいはその塩、立体異性体、互変異性体、多形体、金属錯体またはN-オキシドを提供する。

【0062】

さらに別の実施形態において、本発明は、式(I)の化合物を提供する。ここで、DはD₃である；

Zは直接結合である；

R₂はC₁-C₆アルキルである；

R³は、水素、ハロゲン、C₁-C₆アルキル、C₁-C₆ハロアルキル、およびC₁-C₆アルコキシからなる群から選択される；

R₁は、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、C₃-C₆シクロアルキル、C₃-C₆シクロアルキル-C₁-C₆アルキル、フェニル、ベンジル、フェニルエチルおよび4~6員ヘテロシクリルから選択される；

R¹の各脂肪族基は、1つ以上のR^a基およびR^a環状基で任意に置換されていてもよく、1つ以上のR^b基で任意に置換されていてもよい、ここで、

R^aは、ハロゲン、シアノ、C₁-C₆アルキル、C₁-C₆ハロアルキル、C₃-C₈シクロアルキル、C₁-C₆アルコキシ、C₁-C₆アルキルチオ、フェニルおよびC₂-C₆ヘテロシクリルからなる群から選択される；

R^bは、ハロゲン、シアノ、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、C₃-C₈シクロアルキル、C₁-C₆アルキルチオ、C₁-C₆ハロアルキルチオ、C₁-C₆アルコキシおよびC₁-C₆ハロアルコキシからなる群から選択される；

R⁸およびR^{8a}は、水素、ハロゲン、シアノ、C₁-C₄-アルキルおよびC₁-C₄-ハロアルキルからなる群から独立して選択される；

あるいはそれらの塩、立体異性体、互変異性体、多形体、金属錯体またはN-オキシドを提供する。

【0063】

一実施形態において、本発明は、式(I)の化合物を提供し、ここで、R¹基のC₂-C₆ヘテロシクリルは、好ましくは、部分的／完全に飽和または不飽和のフリル、チエニル、ピロリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、チアジアゾリル、ピラゾリル、オキサゾリル、イミダゾリル、オキサジアゾリル、トリアゾリル、ピリジニル、ピリダジニル、ピリミジニルまたはピラジニルから選択される。

【0064】

一実施形態において、本発明は、式(I)の化合物を提供し、ここで、R⁵基のC₂-C₆ヘテロシクリルは、好ましくは、部分的／完全に飽和または不飽和のフリル、チエニル、ピロリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、チアジアゾリル、ピラゾリル、オキサゾリル、イミダゾリル、オキサジアゾリル、トリアゾリル、ピリジニル、ピリダジニル、ピリミジニルまたはピラジニルから選択される。

【0065】

一実施形態において、本発明は、式(I)の化合物を提供し、ここで、R⁶基のC₂-C₆ヘテロシクリルは、好ましくは、オキセタニル、部分的／完全飽和または不飽和フリル、チエニル、ピロリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、チアジアゾリル、ピラゾリル、オキサゾリル、イミダゾリル、オキサジアゾリル、トリアゾリル、ピリジニル、ピリダジニル、ピリミジニルまたはピラジニルから選択される。

【0066】

一実施形態において、本発明は、式(I)の化合物を提供し、ここで、R⁷基のC₂-C₆ヘテロシクリルは、好ましくは、部分的／完全に飽和または不飽和のフリル、チエニル、ピロリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、チアジアゾリル、ピラゾリル、オキサゾリル、イミダゾリル、オキサジアゾリル、トリアゾリル、ピリジニル、ピリダジニル、ピリミジニルまたはピラジニルから選択される。

【0067】

一実施形態において、本発明は、式(I) (式中、 A_1 、 A_2 、 A_3 、 A_4 および A_5 は独立してCである)の化合物を提供する。

別の実施形態において、本発明は、式(I) (式中、 A_1 、 A_2 、 A_3 および A_5 は独立してCであり、 A_4 はNである)の化合物を提供する。

さらに別の実施形態において、本発明は、式(I) (式中、 A_1 、 A_2 、 A_3 および A_4 は独立してCであり、 A_5 はNである)の化合物を提供する。

さらに別の実施形態において、本発明は、式(I) (式中、 A_1 、 A_2 、 A_4 および A_5 は独立してCであり、 A_3 はNである)の化合物を提供する。

さらに別の実施形態において、本発明は、式(I) (式中、 A_2 、 A_3 、 A_4 および A_5 は独立してCであり、 A_1 はNである)の化合物を提供する。

さらに別の実施形態において、本発明は、式(I) (式中、 A_1 、 A_3 、 A_4 および A_5 は独立してCであり、 A_2 はNである)の化合物を提供する。

さらに別の実施形態において、本発明は、式(I) (式中、 A_1 および A_3 は独立してNであり、 A_2 、 A_4 および A_5 は独立してCである)の化合物を提供する。

さらに別の実施形態において、本発明は、式(I) (式中、 A_2 および A_3 は独立してNであり、 A_1 、 A_4 および A_5 は独立してCである)の化合物を提供する。

さらに別の実施形態において、本発明は、式(I) (式中、 A_2 および A_4 は独立してNであり、 A_1 、 A_3 および A_5 は独立してCである)の化合物を提供する。

さらに別の実施形態において、本発明は、式(I) (式中、 A_1 、 A_3 および A_4 は独立してNであり、 A_2 および A_5 は独立してCである)の化合物を提供する。

さらに別の実施形態において、本発明は、式(I) (式中、 A_2 、 A_3 および A_4 は独立してNであり、 A_1 および A_5 は独立してCである)の化合物を提供する。

【0068】

好ましい実施形態において、本発明は、式(I) (式中、 A_1 、 A_2 、 A_3 、 A_4 および A_5 は独立してCである)の化合物を提供する。

さらに別の好ましい実施形態において、本発明は、式(I) (式中、 A_1 、 A_2 、 A_3 および A_5 は独立してCであり、 A_4 はNである)の化合物を提供する。

さらに別の好ましい実施形態において、本発明は、式(I) (式中、 A_1 、 A_2 、 A_4 および A_5 は独立してCであり、 A_3 はNである)の化合物を提供する。

さらに別の好ましい実施形態において、本発明は式(I) (式中、 A_1 、 A_2 、および A_5 は独立してCである； A_3 および A_4 は独立してNである。)の化合物を提供する。

さらに別の好ましい実施形態において、本発明は式(I) (式中、 A_2 、 A_3 、 A_4 、および A_5 は独立してCであり、 A_1 はNである)の化合物を提供する。

さらに別の好ましい実施形態において、本発明は式(I) (式中、 A_2 、 A_3 、および A_5 は独立してCである； A_1 および A_4 は独立してNである)の化合物を提供する。

一実施形態において、本発明は式(I) (式中、Dは D_1 であり、Zは直接結合である)の化合物を提供する。

別の実施形態において、本発明は式(I) (式中、Dは D_1 であり、Zは $-C(=O)-$ である)の化合物を提供する。

一実施形態において、本発明は式(I) (式中、Dは D_2 であり、Zは直接結合である)の化合物を提供する。

一実施形態において、本発明は式(I) (式中、Dは D_3 であり、Zは直接結合である)の化合物を提供する。

一実施形態において、本発明は式(I) (式中、Dは D_1 または D_2 であり、YはOである)の化合物を提供する。

別の実施形態において、本発明は式(I) (式中、Dは D_1 または D_2 であり、Yは NR^7 である)の化合物を提供する。

好ましい実施形態において、本発明は式(I) (式中、Dは D_1 または D_2 であり、YはOである)の化合物を提供する。

一実施形態において、本発明は、 R_1 が C_1-C_6 アルキルである式(I)の化合物を提供する。

別の実施形態において、本発明は、 R_1 が任意に置換されたフェニルによって置換された C_1-C_6 アルキルである式(I)の化合物を提供する。ここで、任意に置換された前記置換基は、ハロゲン、CN、メチルまたはメトキシから選択される。

【0069】

一実施形態において、本発明は、 R^2 が C_1-C_6 アルキルである式(I)の化合物を提供する。

好ましい実施形態において、本発明は、 R^2 がメチルまたはエチルである式(I)の化合物を提供する。

一実施形態において、本発明は、 R^3 が C_1-C_6 アルキルである式(I)の化合物を提供する。

別の実施形態において、本発明は、 R^3 が C_1-C_6 ハロアルキルである式(I)の化合物を提供する。

さらに別の実施形態において、本発明は、 R^3 がハロゲンである式(I)の化合物を提供する。

さらに別の実施形態において、本発明は、 R^3 が C_1-C_6 アルコキシである式(I)の化合物を提供する。

好ましい実施形態において、本発明は、 R^3 が CF_3 である式(I)の化合物を提供する。

別の好ましい実施形態において、本発明は、 R^3 がフルオロまたはクロロである式(I)の化合物を提供する。

好ましい実施形態において、本発明は、 R^4 が C_1-C_6 アルキルである式(I)の化合物を提供する。

好ましい実施形態において、本発明は、 R^4 が R^a で任意に置換された C_1-C_6 アルキルである式(I)の化合物を提供する。ここで、 R^a はF、CN、メチル、エチル、(n、イソ)プロピル、メトキシ、 CF_3 、シクロプロピル、 C_2-C_6 ヘテロシクリルから選択される；

好ましい実施形態において、本発明は、 R^5 が C_1-C_6 アルキルである式(I)の化合物を提供する。

好ましい実施形態において、本発明は、 R^5 が R^a で任意に置換された C_1-C_6 アルキルである式(I)の化合物を提供する。ここで、 R^a はF、CN、メチル、エチル、(n、イソ)プロピル、メトキシ、 CF_3 、シクロプロピル、 C_2-C_6 ヘテロシクリルから選択される；

好ましい実施形態において、本発明は、 R^6 が C_1-C_6 アルキルである式(I)の化合物を提供する。

好ましい実施形態において、本発明は、 R^6 が R^a で任意に置換された C_1-C_6 アルキルである式(I)の化合物を提供する。ここで、 R^a はF、CN、メチル、エチル、(n、イソ)プロピル、メトキシ、 CF_3 、シクロプロピル、 C_2-C_6 ヘテロシクリルから選択される。

好ましい実施形態において、本発明は、 R^7 が C_1-C_6 アルキル、 $-COR^5$ および C_2-C_6 ヘテロシクリルである式(I)の化合物を提供する。

一実施形態において、 R^8 および R^{8a} は、水素、ハロゲン、シアノ、 C_1-C_4 アルキル、 C_1-C_4 ハロアルキルからなる群から独立して選択される；

好ましい実施形態において、本発明は、 R^8 および R^{8a} が、水素、クロロ、フルオロ、シアノ、メチル、エチル、イソプロピルおよび CF_3 からなる群から独立して選択される式(I)の化合物を提供する；

好ましい実施形態において、本発明は、 C_3-C_6 シクロアルキルがシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチルまたはシクロヘキシルから選択される式(I)の化合物を提供する。好ましくは、シクロプロピルまたはシクロブチルである。

10

20

30

40

50

好ましい実施形態において、本発明は式（Ⅰ）の化合物を提供し、ここで、 A_1 、 A_2 、 A_3 、 A_4 および A_5 は独立してCである；または A_1 、 A_2 、 A_3 および A_5 は独立してCであり、 A_4 はNである；または A_1 、 A_2 、 A_4 および A_5 は独立してCであり、 A_3 はNである；または A_1 、 A_2 および A_5 は独立してCであり、 A_3 および A_4 は独立してNである；または A_2 、 A_3 、 A_4 および A_5 は独立してCであり、 A_1 はNである；または A_2 、 A_3 および A_5 は独立してCであり、 A_1 および A_4 は独立してNである。

【0070】

本発明はまた、式（Ⅰ）の化合物の製造方法に関する。

本発明の化合物は、1つ以上の立体異性体として存在することができる。様々な立体異性体には、エナンチオマー、ジアステレオマー、アトロプ異性体および幾何異性体が含まれる。当業者は、ある立体異性体が、他の立体異性体に対して濃縮された場合、または他の立体異性体から分離された場合に、より活性であり、および／またはより有益な効果を示すことができることを理解するであろう。さらに、当業者は、前記立体異性体を分離、濃縮、および／または選択的に調製する方法を知っている。本発明の化合物は、立体異性体の混合物、個々の立体異性体、または光学活性形態として存在してもよい。

10

【0071】

式（Ⅰ）の化合物が塩のカチオン部分として現れる場合、または塩のそのようなカチオン部分を形成できる場合、それぞれのアニオン部分は無機または有機であり得る。あるいは、式（Ⅰ）の化合物が塩のアニオン部分として現れる場合、または塩のそのようなアニオン部分を形成できる場合、それぞれのカチオン部分は無機または有機であり得る。塩の無機アニオン部の例としては、塩化物、臭化物、ヨウ化物、フッ化物、硫酸塩、リン酸塩、硝酸塩、亜硝酸塩、炭酸水素塩、硫酸水素塩が挙げられるが、これらに限定されない。塩の有機アニオン部分の例としては、ギ酸塩、アルカン酸塩、炭酸塩、酢酸塩、トリフルオロ酢酸塩、トリクロロ酢酸塩、プロピオ酸塩、グリコール酸塩、チオシアン酸塩、乳酸塩、コハク酸塩、リンゴ酸塩、クエン酸塩、安息香酸塩、桂皮酸塩、シュウ酸塩、アルキル硫酸塩、アルキルスルホン酸塩、アリールスルホン酸塩、アリールジスルホン酸塩、アルキルホスホネート、アリールホスホネート、アリールジホスホネート、p-トルエンスルホン酸塩、およびサリチル酸塩が挙げられるが、これらに限定されない。塩の無機カチオン部の例としては、アルカリ金属およびアルカリ土類金属が挙げられるが、これらに限定されない。塩の有機カチオン部の例としては、ピリジン、メチルアミン、イミダゾール、ベンズイミダゾール、ヒスチジン、ホスファゼン、テトラメチルアンモニウム、テトラブチルアンモニウム、コリンおよびトリメチルアミンに由来するカチオンが挙げられるが、これらに限定されない。

20

30

40

【0072】

式（Ⅰ）の化合物の金属錯体中の金属イオンは、特に第2主族の元素、特にカルシウムおよびマグネシウム、第3主族および第4主族の元素、特にアルミニウム、スズおよび鉛、ならびに第1～第8遷移族の元素、特にクロム、マンガン、鉄、コバルト、ニッケル、銅、亜鉛およびその他の元素のイオンである。特に、第4周期および第1～第8遷移族の元素の金属イオンが好ましい。ここで、金属は、それらが取り得る様々な原子価で存在することができる。

【0073】

本発明の別の実施形態は、式（Ⅰ）の化合物、その塩、金属錯体、立体異性体、ジアステレオ異性体、エナンチオマー、キラル異性体、アトロプ異性体、配座異性体、回転異性体、互変異性体、光学異性体、多形体、幾何異性体、またはN-オキシド、ならびに賦形剤、不活性担体、または界面活性剤、添加剤、固体希釈剤および液体希釈剤などの任意の他の必須成分を有する組成物を開示する。

【0074】

式（Ⅰ）（すべての立体異性体、N-オキシド及びその塩を含む）から選択される化合物は、通常、1つ以上の形態で存在し、式（Ⅰ）は式（Ⅰ）が表す化合物の全ての結晶形

50

態および非結晶形態を含む。非結晶形態は、ワックスおよびガムなどの固体である実施形態、ならびに溶液および融液などの液体である実施形態を含む。結晶形態は、本質的に単結晶型を表す実施形態および多形（すなわち異なる結晶型）の混合物を表す実施形態を含む。用語「多形」は、異なる結晶形態で結晶化することができる化合物の特定の結晶形態を指し、これらの形態は結晶格子内の分子の異なる配列および／または立体配座を有する。多形体は同じ化学組成を有することができるが、それらはまた、格子内で弱くまたは強く結合できる共結晶化された水または他の分子の有無により組成が異なることもある。多形体は、結晶形状、密度、硬度、色、化学的安定性、融点、吸湿性、懸濁性、溶解速度および生物学的利用性などの化学的、物理的および生物学的特性において異なり得る。当業者は、式（I）で表される化合物の多形体が、式（I）で表される同じ化合物の別の多形体または多形の混合物と比較して、有益な効果（例えば、有用な製剤の調製への適合性、生物学的性能の向上）を示すことができることを理解するであろう。式（I）で表される化合物の特定の多形の製造および単離は、例えば、選択された溶媒および温度を用いた結晶化を含む当業者に公知の方法によって達成できる。

10

【0075】

本発明はまた、昆虫およびダニの害虫を防除または予防するための組成物に関する。前記組成物は、生物学的に有効な量の式（I）の化合物と、界面活性剤および補助剤からなる群から選択される少なくとも1つの追加成分とを含む。

【0076】

本発明の別の実施形態は、式（I）の化合物またはそのN-オキシドまたは塩を、溶液、乳剤、懸濁液、粉剤、粉末、ペースト、顆粒、圧縮剤、カプセル、およびそれらの混合物などの通常のタイプの農薬組成物にすることに関する。組成タイプの例としては、懸濁液（例：SC、OD、FS）、乳化濃縮物（例：EC）、乳剤（例：EW、EO、ES、ME）、カプセル（例：CS、ZC）、ペースト、トローチ剤、湿潤性粉末または粉剤（例：WP、SP、WS、DP、DS）、圧縮剤（例：BR、TB、DT）、顆粒剤（例：WG、SG、GR、FG、GG、MG）、殺虫剤（例：LN）、並びに種子などの植物増殖材料の処理のためのゲル製剤（例えばGF）がある。これら及びその他のタイプの組成物は、‘Catalogue of pesticide formulation types and international coding system’, Technical Monograph No.2, 第6版、2008年5月、CropLife Internationalで定義されている。

20

30

【0077】

上記の組成物は、MolletおよびGrubemann, “Formulation Technology”, Wiley VCH, Weinheim, 2001; 又は Knowles, “New Developments in Crop Protection Product Formulation”, Agrow Reports DS243, T&F Informa, ロンドン, 2005年に記載されているような既知の方法で製造される。本発明による製剤および／または農薬組成物のための適切な補助剤の例は、溶媒、液体担体、固体担体または充填剤、界面活性剤、分散剤、乳化剤、湿潤剤、アジュバント、可溶化剤、浸透促進剤、保護コロイド、接着剤、増粘剤、保湿剤、忌避剤、誘引剤、摂食刺激剤、相溶化剤、殺菌剤、凍結防止剤、消泡剤、着色剤、粘着付与剤及び結合剤が挙げられる。

【0078】

この文脈における適切な溶媒及び液体担体は、例えば、水及び有機溶媒、例えば、中～高沸点の鉱油画分、例えば、灯油、ディーゼル油、植物又は動物由来の油；脂肪族、環状及び芳香族炭化水素、例えば、トルエン、パラフィン、テトラヒドロナフタレン、アルキル化ナフタレン；アルコール、例えば、エタノール、プロパノール、ブタノール、ベンジルアルコール、シクロヘキサノール；グリコール；ジメチルスルホキシド；ケトン、例えば、シクロヘキサノン；エステル、例えば、乳酸塩、炭酸塩、脂肪酸エステル、γ-ブチロラクトン；脂肪酸；ホスホネート；アミン；アミド、例えば、N-メチルピロリドン、脂肪酸ジメチルアミド；およびそれらの混合物。適切な固体担体または充填剤は、例えば、鉱物土、例えば、ケイ酸塩、シリカゲル、タルク、カオリン、石灰石、石灰、チョーク、粘土、ドロマイト、珪藻土、ベントナイト、硫酸カルシウム、硫酸マグネシウム、酸化

40

50

マグネシウム；多糖類、例えば、セルロース、デンプン；肥料、例えば、硫酸アンモニウム、リン酸アンモニウム、硝酸アンモニウム、尿素；植物由来の製品、例えば、シリアルミール、樹皮ミール、木材ミール、ナツメヤシ、およびそれらの混合物などがある。

【0079】

適切な界面活性剤は、例えば、アニオン性、カチオン性、非イオン性および両性界面活性剤、ブロックポリマー、高分子電解質、およびそれらの混合物などの表面活性化合物である。このような界面活性剤は、乳化剤、分散剤、可溶化剤、湿潤剤、浸透促進剤、保護コロイド、またはアジュバントとして使用することができる。界面活性剤の例は、McCutcheon's, Vol.1: 'Emulsifiers & Detergents', McCutcheon's Directories, Glen Rock, USA, 2008 (International Ed. または North American Ed.) に記載されている。 10

【0080】

適切な陰イオン界面活性剤は、例えば、スルホン酸塩、硫酸塩、リン酸塩、カルボン酸塩、およびそれらの混合物のアルカリ塩、アルカリ土類またはアンモニウム塩である。スルホン酸塩の例は、アルキルアリールスルホン酸塩、ジフェニルスルホン酸塩、 α -オレフィンスルホン酸塩、リグニンスルホン酸塩、脂肪酸および油のスルホン酸塩、エトキシ化アルキルフェノールのスルホン酸塩、アルコキシ化アリールフェノールのスルホン酸塩、縮合ナフタレンのスルホン酸塩、ドデシルおよびトリデシルベンゼンのスルホン酸塩、ナフタレンおよびアルキルナフタレンのスルホン酸塩、スルホコハク酸塩またはスルホコハク酸エステルである。硫酸塩の例は、脂肪酸および油の硫酸塩、エトキシ化アルキルフェノールの硫酸塩、アルコールの硫酸塩、エトキシ化アルコールの硫酸塩、または脂肪酸エステルの硫酸塩である。リン酸塩の例は、リン酸エステルが挙げられる。カルボン酸塩の例は、アルキルカルボン酸塩、およびカルボキシ化アルキルまたはアルキルフェノールエトキシレートが挙げられる。 20

【0081】

適切な非イオン界面活性剤は、例えば、アルコキシレート、N-置換脂肪酸アミド、アミノキシド、エステル、糖系界面活性剤、ポリマー界面活性剤、およびそれらの混合物である。アルコキシレートの例は、1~50当量でアルコキシ化されたアルコール、アルキルフェノール、アミン、アミド、アリールフェノール、脂肪酸または脂肪酸エステルなどの化合物である。アルコキシ化には、エチレンオキシドおよび／またはプロピレンオキシドを使用することができ、好ましくはエチレンオキシドである。 30

N-置換脂肪酸アミドの例は、脂肪酸グルカミドまたは脂肪酸アルカノールアミドである。エステルの例は、脂肪酸エステル、グリセロールエステルまたはモノグリセリドである。糖系界面活性剤の例は、ソルビタン、エトキシ化ソルビタン、スクロースおよびグルコースエステルまたはアルキルポリグルコシドである。高分子界面活性剤の例は、ビニルピロリドン、ビニルアルコールまたは酢酸ビニルのホモまたはコポリマーである。

【0082】

適切なカチオン界面活性剤は、例えば第四級界面活性剤、例えば、1つまたは2つの疎水基を有する第四アンモニウム化合物、または長鎖第一アミンの塩である。適切な両性界面活性剤は、アルキルベタンおよびイミダゾリンである。適切なブロックポリマーは、例えばポリエチレンオキシドおよびポリプロピレンオキシドのブロックを含むA-BまたはA-B-Aタイプのブロックポリマー、またはアルカノール、ポリエチレンオキシドおよびポリプロピレンオキシドを含むA-B-Cタイプのブロックポリマーである。適切な高分子電解質は、例えばポリ酸またはポリ塩基である。ポリ酸の例は、ポリアクリル酸またはポリ酸状ポリマーのアルカリ塩である。ポリ塩基の例は、ポリビニルアミンまたはポリエチレンアミンである。 40

【0083】

適切なアジュバントは、それ自体が殺虫活性がほとんどないか全くなく、標的に対する式(I)の化合物の生物学的性能を向上させる化合物である。例えば、界面活性剤、鉱物油または植物油、および他の補助剤である。さらなる例は、Knowles, "Adjuvants and 50

Additives”, Agrow Reports DS256, T&F Informa UK, 2006, 第5章に記載されている。

【0084】

適切な増粘剤は、例えば、多糖類（例えば、キサンタンガム、カルボキシメチルセルロース）、無機粘土（有機変性または非変性）、ポリカルボキシレート、およびケイ酸塩である。

適切な殺菌剤は、例えば、プロノポールおよびアルキルイソチアゾリノンおよびベンズイソチアゾリノンなどのイソチアゾリノン誘導体である。

適切な凍結防止剤は、例えば、エチレングリコール、プロピレングリコール、尿素およびグリセリンである。

10

適切な消泡剤は、例えば、シリコーン、鎖状アルコール、および脂肪酸の塩である。

適切な着色剤（例えば、赤、青、緑）としては、例えば、水溶性の低い顔料および水溶性染料がある。例としては、無機着色剤（例えば、酸化鉄、酸化チタン、ヘキサシアノ鉄）および有機着色剤（例えば、アリザリン、アゾ、フタロシアニン着色剤）である。

適切な粘着付与剤または結合剤は、例えば、ポリビニルピロリドン、ポリビニルアセテート、ポリビニルアルコール、ポリアクリレート、生物由来または合成ワックス、およびセルロースエーテルである。

【0085】

組成物の種類およびその調製の例は、次のとおりである：

20

i) 水溶性濃縮物 (SL、LS)

式(I)の化合物の10～60重量%と、湿潤剤の5～15重量%（例えば、アルコールアルコキシレート）を水および／または水溶性溶媒（例えば、アルコール類）に溶解して100重量%にする。活性物質は水で希釈すると溶解する。

【0086】

ii) 分散性濃縮物 (DC)

式(I)の化合物の5～25重量%と、分散剤の1～10重量%（例えば、ポリビニルピロリドン）を有機溶媒（例えば、シクロヘキサノン）に溶解して100重量%にする。水で希釈すると活性物質の分散液が得られる。

【0087】

iii) 乳化性濃縮物 (EC)

式(I)の化合物の15～70重量%と、乳化剤の5～10重量%（例えば、ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウムとヒマシ油エトキシレート）を水不溶性有機溶媒（例えば、芳香族炭化水素）に溶解して、100重量%にする。水で希釈すると活性物質のエマルジョンが得られる。

30

【0088】

iv) エマルジョン (EW、EO、ES)

式(I)の化合物5～40重量%および乳化剤1～10重量%（例えば、ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウムおよびヒマシ油エトキシレート）を、20～40重量%の非水溶性有機溶媒（例えば、芳香族炭化水素）に溶解する。この混合物を乳化装置を用いて100重量%になるように水に導入し、均質な乳剤とする。水で希釈すると活性物質の乳剤が得られる。

40

【0089】

v) 懸濁液 (SC、OD、FS)

攪拌ボールミル中で、式(I)の化合物の20～60重量%を、分散剤および湿潤剤（例えば、リグノスルホン酸ナトリウムとアルコールエトキシレート）を2～10重量%、増粘剤（例えば、キサンタンガム）を0.1～2重量%、水を100重量%添加して粉碎し、微細な活性物質懸濁液を得る。水で希釈すると活性物質の安定した懸濁液が得られる。FS型組成物では、バインダー（例えば、ポリビニルアルコール）を40重量%まで添加する。

【0090】

50

v i) 水分散性顆粒および水溶性顆粒 (W G、S G)

式 (I) の化合物の 50 ~ 80 重量 % を、分散剤および湿潤剤 (例えば、リグノスルホン酸ナトリウムおよびアルコールエトキシレート) を加えて 100 重量 % として細かく粉碎し、工業機器 (例えば、押出、スプレータワー、流動床) を用いて水分散性または水溶性顆粒として調製する。水で希釈すると、活性物質の安定した分散液または溶液が得られる。

【0091】

v i i) 水分散性粉末及び水溶性粉末 (W P、S P、W S)

式 (I) の化合物の 50 ~ 80 重量 % をローターステーターミル中で粉碎し、分散剤 (例えば、リグノスルホン酸ナトリウム) を 1 ~ 5 重量 %、湿潤剤 (例えば、アルコールエトキシレート) を 1 ~ 3 重量 %、固体担体 (例えば、シリカゲル) を加えて 100 重量 % とする。水で希釈すると活性物質の安定な分散液または溶液が得られる。

10

【0092】

v i i i) ゲル (G W、G F)

式 (I) の化合物の 5 ~ 25 重量 % を攪拌ボールミル中で粉碎し、分散剤 (例えば、リグノスルホン酸ナトリウム) を 3 ~ 10 重量 %、増粘剤 (例えば、カルボキシメチルセルロース) を 1 ~ 5 重量 %、水を 100 重量 % 添加して、活性物質の微細な懸濁液を得る。水で希釈すると活性物質の安定な懸濁液が得られる。

【0093】

i x) マイクロエマルジョン (M E)

式 (I) の化合物の 5 ~ 20 重量 % を、有機溶媒ブレンド (例えば、脂肪酸ジメチルアミドとシクロヘキサノン) を 5 ~ 30 重量 %、界面活性剤ブレンド (例えば、アルコールエトキシレートとアリアルフェノールエトキシレート) を 10 ~ 25 重量 %、水を 100 % 添加する。この混合物を 1 時間攪拌すると、活性物質の熱力学的に安定なマイクロエマルジョンが自然に生成する。

20

【0094】

x) マイクロカプセル (C S)

式 (I) の化合物 5 ~ 50 重量 %、水不溶性有機溶媒 (例えば、芳香族炭化水素) 0 ~ 40 重量 %、アクリル系モノマー (例えば、メチルメタクリレート、メタクリル酸およびジ-またはトリアクリレート) 2 ~ 15 重量 % を含む油相を保護コロイド (例えば、ポリビニルアルコール) の水溶液中に分散させる。ラジカル重合の結果、ポリ (メタ) アクリレートマイクロカプセルが形成される。あるいは、式 (I) の化合物 5 ~ 50 重量 %、水不溶性有機溶媒 (例えば、芳香族炭化水素) 0 ~ 40 重量 %、イソシアネート系モノマー (例えば、ジフェニルメテン-4, 4'-ジイソシアネート) を含む油相を保護コロイド (例えば、ポリビニルアルコール) の水溶液中に分散させる。ポリアミン (例えば、ヘキサメチレンジアミン) を添加すると、活性物質を含むポリウレアマイクロカプセルが形成される。モノマーの量は 1 ~ 10 重量 % である。重量 % は全 C S 組成に関係する。

30

【0095】

x i) ダスタブル粉末 (D P、D S)

式 (I) の化合物の 1 ~ 10 重量 % を細かく粉碎し、固体担体 (例えば、細分割カオリン) とよく混合して 100 重量 % にする。

40

【0096】

x i i) 顆粒剤 (G R、F G)

式 (I) の化合物の 0.5 ~ 30 重量 % を細かく粉碎し、固体担体 (例えば、ケイ酸塩) と合わせて 100 重量 % にする。造粒は、押出、噴霧乾燥または流動床によって達成される。

【0097】

x i i i) 超低容量液体 (U L)

式 (I) の化合物の 1 ~ 50 重量 % を、有機溶媒 (例えば、芳香族炭化水素) に溶解して 100 重量 % とする。

50

組成物タイプ i) ~ x i i i) は、必要に応じて、0.1 ~ 1 重量%の殺菌剤、5 ~ 15 重量%の凍結防止剤、0.1 ~ 1 重量%の消泡剤、および0.1 ~ 1 重量%の着色剤などのさらなる補助剤を含んでもよい。

【0098】

本発明の別の実施形態は、式 (I) の化合物を含む農薬組成物を提供し、この農薬組成物は、活性物質を0.01 ~ 95 重量%、好ましくは0.1 ~ 90 重量%、より好ましくは1 ~ 70 重量%、特に10 ~ 60 重量%含む。活性物質の純度は90% ~ 100%、好ましくは95% ~ 100% (NMRスペクトルによる) である。

【0099】

水溶性濃縮物 (LS)、サスポエマルジョン (SE)、流動性濃縮物 (FS)、乾燥処理用粉末 (DS)、スラリー処理用水分散性粉末 (WS)、水溶性粉末 (SS)、エマルジョン (ES)、乳化性濃縮物 (EC) およびゲル (GF) は、通常、植物増殖材料、特に種子の処理を目的として使用される。本発明の組成物は、2 ~ 10 倍に希釈した後、既製品中で0.01 ~ 60 重量%、好ましくは0.1 ~ 40 重量%の活性物質濃度を与える。播種前または播種中に適用することができる。

【0100】

式 (I) の化合物およびその組成物をそれぞれ植物の増殖材料、特に種子に適用する方法には、増殖材料のドレッシング、コーティング、ペレット化、散布、浸漬および溝内適用法が含まれる。好ましくは、それぞれ式 (I) の化合物またはその組成物は、種子処理、ペレット化、コーティング、および散布などによって、発芽が誘発されないような方法で植物繁殖材料に塗布される。

植物保護に使用される場合、適用される活性物質の量は、所望の効果の種類に応じて、0.001 ~ 2 kg / ha、好ましくは0.005 ~ 2 kg / ha、より好ましくは0.05 ~ 0.9 kg / ha、特に0.1 ~ 0.75 kg / haの範囲である。

種子などの植物繁殖材料の処理のために、例えば、種子への散布、コーティング、または浸漬のために、植物繁殖材料 (好ましくは種子) 100 kg 当たり0.1 ~ 1000 g、好ましくは1 ~ 1000 g、より好ましくは1 ~ 100 g、最も好ましくは5 ~ 100 g の範囲の活性物質の量が一般に必要とされる。

【0101】

材料または貯蔵製品の保護に使用される場合、適用される活性物質の量は、適用領域の種類および所望の効果によって異なる。材料の保護に通常適用される量は、処理された材料1立方メートル当たり0.001 g ~ 2 kg、好ましくは0.005 g ~ 1 kgの活性物質である。

様々な種類の油、湿潤剤、アジュバント、肥料または微量栄養素、および他の農薬 (例えば、除草剤、殺虫剤、殺菌剤、成長調節剤、安全剤) を、活性物質またはそれらを含む組成物にプレミックスとして、または適切であれば、使用直前まで (タンクミックス) 添加しない。これらの薬剤は、本発明の組成物と、1 : 100 ~ 100 : 1、好ましくは1 : 10 ~ 10 : 1の重量比で、混合することができる。

【0102】

使用者は、本発明による組成物を、通常、前投薬装置、背負い式噴霧器、噴霧タンク、噴霧機、または灌漑システムから塗布することができる。通常、農薬組成物は、水、緩衝液、および/またはさらなる補助剤を用いて所望の塗布濃度まで構成され、このようにして、すぐに使用できるスプレー液または本発明による農薬組成物が得られる。通常、すぐに使用できるスプレー液の20 ~ 2000 リットル、好ましくは50 ~ 400 リットルが、農業の有効面積1ヘクタール当たり適用される。

【0103】

一実施形態によれば、キットの一部または二成分または三成分混合物の一部などの本発明による組成物の個々の成分は、使用者自身がスプレータンク内で混合することができ、必要に応じてさらに補助剤を追加して使用することもできる。

【0104】

本発明の化合物および組成物は、このようにして、植物食性無脊椎動物の害虫から畑の作物を保護するために農業的に有用であり、また、植物食性無脊椎動物の害虫から他の園芸作物および植物を保護するために非農業的に有用である。この有用性には、有利な形質を提供するために遺伝子工学（すなわちトランスジェニック）によって導入された、または変異誘発によって改変された遺伝物質を含む作物および他の植物（すなわち農学的にも非農学的にも）を保護することが含まれる。

【0105】

本発明の化合物は、好ましい代謝および／または土壌残留パターンによって特徴付けられ、農業的および非農業的無脊椎動物のスペクトルを制御する活性を示す。本発明の化合物は、害虫防除の分野において、たとえ低濃度の適用であっても、予防的および／または治療的に価値のある活性成分であり、昆虫などの農薬耐性害虫に対して使用することができ、および／または非常に好ましい殺生物スペクトルを有し、温血動物種、魚類および植物によって十分に許容される。

10

【0106】

本発明の化合物は、経済的に重要な農業、森林、温室、苗床、観賞用植物、食品および繊維、公衆衛生および動物衛生、家庭および商業構造、家庭および貯蔵製品の害虫に対して活性を示す。これらには、以下のものが含まれる：ヤガ科のヨトウムシ、ヨトウムシ、ルーパー、およびヘリオトインなどの鱗翅目の幼虫（例えば、ヨトウムシ (*Spodoptera fugiperda* J. E. Smith)）、ビートヨトウムシ (*Spodoptera exigua* Hubner)、クロヨトウムシ (*Agrotis ipsilon* Hufnagel)、キャベツルーパー (*Trichoplusia ni* Hubner)、タバコバッドワーム (*Heliothis virescens* Fabricius)；メイガ科の穿孔虫、カワラヒラタムシ、ウェブワーム、イモムシ、キャベツワーム、スケルトン化虫（例：ヨーロッパアワノメイガ (*Ostrinia nubilalis* Hubner)、ネーブルオレンジワーム (*Amyelois transitella* Walker)、トウモロコシの根のウェブワーム (*Crambus caliginosellus* Clemens)、芝のウェブワーム (*Herpetogramma licarsisalis* Walker)、ハマキガ科の葉虫、芽虫、種子虫、果実虫（例：コドリナ (*Cydia pomonella* Linnaeus)、ブドウの実の蛾 (*Endopiza viteana* Clemens)、オリエントアルフルーツガ (*Grapholita molesta* Busck)）、その他、経済的に重要な多くの鱗翅目昆虫（例：コナガ (*Plutella xylostella* Linnaeus)、オオタバコガ (*Pectinophora gossypiella* Saunders)、マイマイガ (*Lymantria dispar* Linnaeus)）ゴキブリ目 (Blattodea) の幼虫および成虫 (*Blatta orientalis* Linnaeus)、アジアゴキブリ (*Blattella asahinai* Mizukubo)、チャバネゴキブリ (*Blattella germanica* Linnaeus)、チャバネゴキブリ (*Supella longipalpa* Fabricius)、ワモンゴキブリ (*Periplaneta americana* Linnaeus)、トゲゴキブリ (*Periplaneta brunnea* Burmeister)、マデイラゴキブリ (*Leucophaea maderae* Fabricius)）；コウチュウ目の葉を食べる幼虫と成虫、これには、以下のものが含まれる、アリマキゾウムシ科、ゾウムシ科、ゾウムシ科のゾウムシ（例：ワタミゾウムシ (*Anthonomus grandis* Boheman)、イネミズゾウムシ (*Lissorhoptrus oryzophilus* Kuschel)、コナゾウムシ (*Sitophilus granarius* Linnaeus)、イネゾウムシ (*Sitophilus oryzae* Linnaeus)）、ハムシ科のノミハムシ、キュウリハムシ、ルートワーム、ハムシ、ジャガイモハムシ、ハモグリバエ（コロラドハムシ (*Leptinotarsa decemlineata* Say)、ウエスタンコーンルートワーム (*Diabrotica virgifera* LeConte) など）、コガネムシ科のコガネムシおよびその他の甲虫（コガネムシ (*Popillia japonica* Newman)、ヨーロッパコガネムシ (*Rhizotrogus majalis* Razoumowsky) など）、カマキリ科のカーペットビートル、コメツキムシ科のハリガネムシ、キクイムシ科のキクイムシ、ゴミムシ科のコクゾウ。

20

30

40

さらに、以下のものを含む：ツチハサミムシ科のハサミムシを含む、ツチハサミムシ目の成虫および幼虫（例：ヨーロッパハサミムシ (*Forficula auricularia* Linnaeus)、クロハサミムシ (*Chelisoches mono* Fabricius)）；半翅目および同翅目の成虫および幼虫、例えば、カメムシ科の害虫、セミ科のセミ、ヨコバイ科のヨコバイ (*Empo*

50

asca spp. など)、フグ科およびミカン科のウンカ、ムカデ科のツノゼミ、キジラミ科のキジラミ、コナジラミ科のコナジラミ、アブラムシ科のアブラムシ、フィロキセラ科のフィロキセラ、コナカイガラムシ科のコナカイガラムシ、カイガラムシ科、ダイアスピダエ科、マルガロディダエ科のカイガラムシ、ツトガ科のヒラタムシ、カメムシ科のカメムシ、ナガカメムシ科のカメムシ (Blissus 属など) およびその他の種子カメムシ、オナガカメムシ科のツトガムシ、カメムシ科のカメムシ、コナカイガラムシ科のアカカメムシおよび綿花カメムシ。また、ダニ目 (ダニ) の成虫と幼虫も含まれ、例えば、ハダニやハダニ科 (例: ヨーロッパハダニ (*Panonychus ulmi* Koch)、ナミハダニ (*Tetranychus urticae* Koch)、マクダニエルダニ (*Tetranychus mcdanieli* McGregor))、ヒラタダニ科 (例: ミカンヒラダニ (*Brevipalpus lewisi* McGregor))、ヒラ
 10
 タダニ科のサビダニや芽ダニ、その他の葉を食べるダニ、およびヒトや動物の健康に重要なダニ、すなわちヒラタダニ科のチリダニ、デモディシダ科の毛包ダニ、グリシファギダ科の穀類ダニ、マダニ科のダニ (シカダニ (*Ixodes scapularis* Say)、オーストラリアヒラダニ (*Ixodes holocyclus* Neumann)、アメリカイヌダニ (*Dermacentor variabilis* Say)、ローンスターダニ (*Amblyomma americanum* Linnaeus) および Psoroptidae、Pyemotidae、および Sarcoptidae 科のかさぶたダニおよび痒み
 20
 ダニ、バッタ、イナゴ、コオロギを含む直翅目の成虫および幼虫 (例: 渡りバッタ (例: *Melanoplus sanguinipes* Fabricius、*M. differentis* Thomas))、アメリカバッタ (例: *Schistocerca americana* Drury)、サバクトビバッタ (*Schistocerca gregaria* Forskal)、トノサマバッタ (*Locusta migratoria* Linnaeus)、イエコ
 オロギ (*Acheta domesticus* Linnaeus)、モグラコオロギ (*Gryllotalpa* spp.)) 双翅目の成虫および幼虫、ハモグリバエ、ユスリカ、ミバエ科、ミバエ (*Oscinella frit* Linnaeus など)、土壌ウジ、イエバエ (*Musca domestica* Linnaeus など)、小型イエバエ (*Fannia canicularis* Linnaeus、*F. femoralis* Stein など)、サ
 シバエ (*Stomoxys calcitrans* Linnaeus など)、顔バエ、サシバエ、クロバエ (*Chrysomya* spp.、*Phonnia* spp. など)、その他のムスコイドハエ類の害虫、アブ (*Tabanus* spp. など)、ウマバエ (*Gastrophilus* spp.、*Oestrus* spp. など)、ウシ
 の幼虫 (*Hypoderma* spp. など)、シカバエ (*Chrysops* spp. など)、ケッド (*Melophagus ovinus* Linnaeus など) およびその他のブラキセラ属、蚊 (*Aedes* spp.、*Anopheles* spp.、*Culex* spp. など)、ブユ (*Prosimulium* spp.、*Simulium* spp. など)、ユスリカ、サシチョウバエ、コガネムシ類、その他の線虫類、タマネギア
 30
 ザミウマ (*Thrips tabaci* Lindeman) やその他の葉を食べるアザミウマ類を含むアザミウマ目の成虫と幼虫、アリ (アカオオアリ (*Camponotus ferrugineus* Fabricius)、クロオオアリ (*Camponotus pennsylvanicus* De Geer)、ファラオアリ (*Monomorium pharaonis* Linnaeus)、ヒアリ (*Wasmannia auropunctata* Roger)、ヒアリ (*Solenopsis geminata* Fabricius) などを含む膜翅目の害虫、アカヒアリ (*Solenopsis invicta* Buren)、アルゼンチンアリ (*Iridomyrmex humilis* Mayr)、クレイジーアリ (*Paratrechina longicornis* Latreille)、シロアリ (*Termitophaga* spp.、*Reticulitermes* spp. など)、シロアリ (*Coptotermes formosanus* Shiraki)、インドシロアリ (*Incisitermes im
 40
 migrans* Snyder) および経済的に重要なその他のシロアリ、シミ (*Lepisma saccharina* Linnaeus) やアカシロアリ (*Thermobia domestica* Packard) などのシロアリ目の害虫; シロジラミ目 (Mallophaga) の害虫で、アタマジラミ (*Pediculus humanus capitis* De Geer)、コロモジラミ (*Pediculus humanus* Linnaeus)、ニワトリコロモジラミ (*Menacanthus stramineus* Nitschke)、イヌシラミ (*Trichodectes canis* De Geer)、綿毛シラミ (*Goniocotes gallinae* De Geer)、ヒツジコロモジラミ (*Bovicola ovis* Schrank)、短鼻牛シラミ (*Haematopinus euryst*

10

20

30

40

50

emus Nitzsch)、長鼻牛シラミ (*Linognathus vituli* Linnaeus)、および人間や動物を襲うその他の吸血および咀嚼寄生シラミ、およびシラミ目の害虫 (キバノミ (*Xenopsylla cheopis* Rothschild)、ネコノミ (*Ctenocephalides felis* Bouche)、イヌノミ (*Ctenocephalides canis* Curtis)、ニワトリノミ (*Ceratophyllus gallinae* Schrank)、スティックタイトノミ (*Echidnophaga gallinacea* Westwood)、ヒトノミ (*Pulex irritans* Linnaeus)、および哺乳類や鳥類を苦しめるその他のノミ。対象となるその他の節足動物の害虫には、ドクイトグモ (*Loxosceles reclusa* Gertsch および Mulaik) やクロゴケグモ (*Latrodectus mactans* Fabricius) などのクモ目のクモ、およびムカデ (*Scutigera coleoptrata* Linnaeus) などのムカデ目のムカデが含まれる。活動には、線虫綱、条虫綱、吸虫綱、鉤頭綱のメンバーも含まれ、これには経済的に重要な農業害虫 (ネコブセンチュウ属のネコブセンチュウ、ネグサレセンチュウ属の病巣センチュウ、トリコドルス属のスタビールトセンチュウなど) が含まれるが、これに限定されない。および動物および人間の健康に害を及ぼす害虫 (馬の *Strongylus vulgaris*、犬の *Toxocara canis*、羊の *Haemonchus contortus*、犬の *Dirofilaria immitis* Leidy、馬の *Anoplocephala peifoliata*、反芻動物の *Fasciola hepatica* Linnaeus など、経済的に重要なすべての吸虫、条虫、回虫)。

10

【0107】

本発明の化合物は、以下を含む同翅目の害虫に対して特に活性を示す: *Acyrtosisiphi onpisum* Harris (エンドウアブラムシ)、*Aphis craccivora* Koch (ササゲアブラムシ)、*Aphis fabae* Scopoli (黒豆アブラムシ)、*Aphis gossypii* Glover (ワタアブラムシ、メロンアブラムシ)、*Aphis pomi* De Geer (リンゴアブラムシ)、*Aphis spiraeicola* Patch (*spirea* アブラムシ)、*Auracolum solani* Kaltenbach (キツネノテブアブラムシ)、*Chaetosiphon fragaefolii* Cockerell (イチゴアブラムシ)、*Diuraphis noxia* Kurdjumov/Mordvilko (ロシア小麦アブラムシ)、*Dysaphis plantaginea* Paaserini (バラ色のリンゴのアブラムシ)、*Eriosoma lanigerum* Hausmann (ケナガアブラムシ)、*Hyalopterus pruni* ジェフロワ (メイリープラムアブラムシ)、*Lipaphis erysimi* Kaltenbach (アブラムシ)、*Metopolophium dirhodum* Walker (シリアルアブラムシ)、*Macrosipum euphorbiae* Thomas (ジャガイモアブラムシ)、*Myzus persicae* Sulzer (ピーチジャガイモアブラムシ、グリーンピーチアブラムシ)、*Nasonovia ribisnigri* Mosley (レタスアブラムシ)、*Pemphigus* spp. (根アブラムシと胆虫アブラムシ)、*Rhopalosiphum maidis* Fitch (トウモロコシ葉アブラムシ)、*Rhopalosiphum padi* Linnaeus (鳥サクラエンバクアブラムシ)、*Schizaphis graminum* Rondani (アオバムシ)、*Sitobion avenae* Fabricius (イングリッシュグレインアブラムシ)、*Therioaphis maculata* Buckton (斑点アルファルファアブラムシ)、*Toxoptera aurantii*、Boyer deフォンコロンベ (黒い柑橘類のアブラムシ)、および *Toxoptera citricida* Kirkaldy (茶色の柑橘類のアブラムシ); アデルゲス属 (アデルギッド); フィロキセラ デヴァスタトリクス ペルガンデ (ピーカン フィロキセラ); *Bemisia tabaci* Gennadius (タバココナジラミ、サツマイモコナジラミ)、*Bemisia argentifolii* Bellows and Perring (シルバーリーフコナジラミ)、*Dialeurodes citri* Ashmead (ミカンコナジラミ)、*Trialeurodes vaporariorum* Westwood (温室コナジラミ)。 *Empoasca fabae* Harris、(ジャガイモヨコバイ)、*Laodelphax striatellus* Fallen (小型の茶色のウンカ)、*Macrostes quadrilineatus* Forbes (アスターヨコバイ)、*Nephotettix cincticeps* Uhler (アオウンカ)、*Nephotettix nigropictus* Stal (イネヨコバイ)、*Nilaparvata lugens* Stal (トビウンカ)、*Peregrinus maidis* Ashmead (トウモロコシウンカ)、*Sogatella furcifera* Horvath (シロバウンカ)、*Sogatodes orizicola* Muir (イネデルファシッド)、*Typhlocyba pomaria* McAfee ホワイトアップルヨコバイ、*Erythroneura* spp. (ブドウヨコバイ); *Magicidada septendecim* Linnaeus (周期的なセミ); *Icerya purchasi* Maskell (綿クッション スケール)、*Quadraspidotus perniciosus* Comstock (サンノゼ スケール); *Planococcus citri* Risso (柑橘類

20

30

40

50

のコナカイガラムシ); *Pseudococcus* spp. (その他のコナカイガラムシ群)、*Cacopsylla pyricola* Foerster (ナシキジラミ)、*Trioza diospyri* Ashmead (カキジラミ)。

【0108】

本発明の化合物はまた、鱗翅目のメンバーに対して商業的に重要な活性を有する(例: *Alabama argillacea* Hubner (綿葉虫)、*Archips argyrospila* Walker(果樹リーフローラー)、*A. rosana* Linnaeus (ヨーロップブツポウソウ) および他の *Archips* 種、*Chilo successalis* Walker (イネの茎穿孔虫)、*Cnaphalocrosis medinalis* Guenee (イネの葉のローラー)、*Crambus caliginosellus* Clemens (トウモロコシの根ウェブワーム)、*Crambus teterrellus* Zincken (ブルーグラスウェブワーム)、*Cydia pomonella* Linnaeus (コドリリングガ)、*Earias insulana* Boisduval (トゲトゲ虫)、*Earias vittella* Fabricius (ホシバミミズオオタバコガ)、*Helicoverpa armigera* Hybner (アメリカタバコガ)、*Helicoverpa zea* Boddie (トウモロコシの穂虫)、*Heliothis virescens* Fabricius (タバコバッドワーム)、*Herpetogramma licarsialis* Walker (芝のウェブワーム)、*Lobesia botrana* Denis and Schiffermüller (グレープベリーガ)、*Pectinophora gossypiella* Saunders (ピンクオオタバコガ)、*Phyllocnistis citrella* Stainton (ミカンハモグリバエ)、*Pieris brassicae* Linnaeus (オオモンシロチョウ)、*Pieris rapae* Linnaeus (コナジラミ)、*Spodoptera exigua* Hubner (シロイチモジヨトウ)、*Spodoptera litura* Fabricius (タバコハスモンヨトウ、クラスターイモムシ)、*Spodoptera fragiperda* J. E. Smith (ヨトウムシ)、*Trichoplusia ni* Hybner (キャベツのルーパー)、および *Tuta absoluta* Meyrick (トマトのハモグリバエ)。

【0109】

これらの化合物は、以下の半翅目昆虫にも作用する: *Acrostemum hilare* Say (アオカメムシ)、*Anasa tristis* De Geer (カボチャのカメムシ)、*Blissus leucopterus* Say (チンチのカメムシ)、*Corythucha gossypii* Fabricius (ワタレースのカメムシ)、*Cyrtopeltis modesta* Distant (トマトのカメムシ)、*Dysdercus suturellus* Herrich-Schäffer (綿染色剤)、*Euchistus servus* Say (茶色) カメムシ)、*Euchistus variolarius* Palisot de Beauvois (ワンスポットカメムシ)、*Graptostethus* spp. (種子昆虫の複合体)、*Leptoglossus corculus* Say (葉足松種子昆虫)、*Lygus lineolaris* Palisot de Beauvois (変色した植物の昆虫)、*Nezara viridula* Linnaeus (ミナミアオカメムシ)、*Oebalus pugnax* Fabricius (イネカメムシ)、*Oncopeltus fasciatus* Dallas (大きなトウワタのバグ)、*Pseudamoscelis seriatus* Reuter (ワタノミノミズバ)。

【0110】

本発明の化合物によって防除される他の昆虫目としては、以下のものが挙げられる: アザミウマ目 (例: *Frankliniella occidentalis* Pergande (ウエスタンミカンアザミウマ)、*Scirtothrips citri* Moulton (ミカンアザミウマ)、*Sericothrips variabilis* Beach (ダイズアザミウマ)、*Thrips tabaci* Lindeman (タマネギアザミウマ))、および鞘翅目 (例: *Leptinotarsa decemlineata* Say (コロラドハムシ)、*Epilachna varivestis* Mulsant (メキシコマメハムシ)、および *Agriotes* 属、*Atthous* 属、*Limonius* 属のハリガネムシ)。

【0111】

特に、式 (I) の化合物、それらの N-オキシド、それらの立体異性体、それらの多形体およびそれらの塩は、以下の害虫を効率的に駆除するのに特に適している: 鱗翅目 (鱗翅目) の昆虫、例えば、アグロティス・イブシロン、アグロティス・セゲトゥム、アラバマ・サルナシ、アンティカルシア・ジェマタリス、アオイグサ、オートグラファ・ガンマ、ブパルス・ピニアリウス、カコエシア・ムリナナ、カプア・レティキュラナ、ケマトビア・ブルマタ、ミナミヌマエビ、コリストネウラ・ウミフェラナ、コリストネウラ オクシデンタリス、シロチョウ、シディア・ボモネラ、デンドロリムス・ピニ、ディアファニア・ニティダリス、ディアトラエア・グランディオセラ、エアリアス・インシュラナ、エ

アリアス・ヴィッテラ、エラスモパルプス・リグノセルス、ユーポエシリア・アンビゲラ
 、エプトリア・ブーリアナ、フェルティア・サブテラネア、ガレリア・メロネラ、グラホ
 リタ・フネブラナ、グラホリタ・モレスタ、ヘリコバパ・アルミゲラ、ヘリコバパ・ヴィ
 レセンス、ヘリコバパ・ゼア、ヘルラ・ウンダリス、ヒベルニア・デフォリアリア、ハイ
 ファントリア・クネア、ヒポノメウタ・マリネルス、ケイフェリア・リコベルシセラ、ラ
 ムディナ・フィセラリア、ラフィグマ・エクシグア、コフキバエ、コバエ、リトコレティ
 ス・ブランカルデラ、ロベシア・ボトラナ、ロクソステゲ・スティクティカリス、レウシ
 ノデス・オルボナリス、マイマイガ、ライマントリア・モナカ、リオネチア・クルーエラ
 、マラコソーマ・ネウストリア、マメストラ・アブラナ科、オルギア・シュードツガタ、
 オストリニア・ヌビラリス、パノリス・フラメア、ペクチノフォラ・ゴッシピエラ、ペリ
 ドロマ・サウシア、ファレラ・ブセファラ、フトリマエア・オペラキュレラ、フィロクニ
 スティス・シトレラ、ピエリス・ブラッシカエ、プラティペナ・スカブラ、プルテラ・キ
 シロステラ、シュードブルジア含まれるもの、リャコニア・フラストラナ、シロアリ、ス
 クロビパルブラ・アブソルータ、シトトロガ・セレアレラ、スパルガノティスピレリアナ
 、スポドブテラ・フルギベルダ、ハスモンヨトウ、*Spodoptera litura*、スポドブテラ
 ・エキシグア、タウマトボエア・プトカンパ、*Tortrix viridana*、トリコブルシア・ニ
 、およびゼイラフェラ・カナデンシス、甲虫類（鞘翅目）、例えば、*Agrilus sinuatu*
s、*Agriotes lineatus*、*Agriotes obscurus*、*Amphimallus solstitialis*、*Anis*
andrus dispar、*Anthonomus grandis*、*Anthonomus pomorum*、*Aphthona e*
uphoridae、*Athous haemorrhoidalis*、*Atomaria linearis*、*Blastophagus pi*
niperda、*Blitophaga undata*、*Bruchus rufimanus*、*Bruchus pisorum*、*B*
ruchus lentis、*Byctiscus betulae*、*Cassida nebulosa*、*Cerotoma trifurc*
ata、*Cetonia aurata*、*Ceuthorrhynchus assimilis*、*Ceuthorrhynchus na*
pi、*Chaetocnema tibialis*、*Conoderus vespertinus*、*Crioceris asparagi*
 、クテニセラ ssp.、ディアプロティカ ロンギコルニス、ディアプロティカ・セミプン
 クタタ、*Diabrotica undecimpunctata* *Diabrotica speciosa*、*Diabrotica virg*
ifera、*Epilachna varivestis*、*Epitrix hirtipennis*、*Eutinobothrus brasili*
ensis、*Hylobius abietis*、*Hypera brunneipennis*、*Hypera postica*、*Ips typ*
ographus、*Lema bilineata*、*Lema melanopus*、*Leptinotarsa decemlineata*
 、*Limonius californicus*、*Lissorhoptrus oryzophilus*、*Melanotus combis*
 、*Meligethes aeneus*、*Melontha hippocastani*、メロロンタ、*Oulema oryzae*
 、*Otiorrhynchus sulcatus*、*Otiorrhynchus ovatus*、*Phaedon cochleariae*、*Phyllobius pyri*、*Phyllotreta chrysocephala*、*Phyllophaga sp.*、*Phylloper*
tha horticola、*Phyllotreta nemorum*、*Phyllotreta striolata*、*Popillia jap*
onica、シトナ・リネアトウスとシトフィルス・グラナリア、ハエ、蚊（双翅目）、例：ネ
 ッタイシマカ、ヒトスジシマカ、ネッタイシマカ、アナストレファ・ルーデンス、ハマダ
 ラカ・マキュリペニス、ハマダラカ・フナ、ハマダラカ・アルビマヌス、ガンビアハマダ
 ラカ、ハマダラカ・フリーボルニ、ハマダラカ・ロイコスフィラス、ハマダラカ・ミニム
 ス、ハマダラカ・クアドリマキュラトウス、カリフォラ・ビシーナ、*Ceratitis capita*
ta、*Chrysomya bezziana*、*Chrysomya hominivorax*、*Chrysomya macellari*
a、*Chrysops discalis*、*Chrysops silacea*、*Chrysops atlanticus*、*Cochliomy*
ia hominivorax、*Contarinia sorghicola* *Cordylobia anthropophaga*、*Culic*
oides furens、*Culex pipiens*、*Culex nigripalpus*、*Culex quinquefasciatus*
 、*Culex tarsalis*、*Culiseta inornata*、*Culiseta melanura*、*Dacus cucurbita*
e、*Dacus oleae*、*Dasineura brassicae*、*Delia Antique*、*Delia coarctata*、*D*
elia platura、*Delia radicum*、*Dermatobia hominis*、*Fannia canicularis*、*G*
eomyza Tripunctata、*Gasterophilus* 腸炎、*Glossina morsitans*、*Glossina p*
alpalis、*Glossina fuscipes*、*Glossina tachinoides*、*Haematobia irritans*、*Haplodiplosis equestris*、*Hippelates spp.*、*Hylemyia platura*、*Hypoderma*
lineata、*Leptoconops torens*、*Liriomyza sativae*、*Liriomyza trifolii*、*Luc*

10

20

30

40

50

ilia caprina、Lucilia cuprina、Lucilia sericata、Lycoria胸筋、マンソニア・ティティラヌス、マエティオラ・デストラクター、秋ノバエ、ドメスティックバエ、ムシナ・スタブランス、発情卵、オオミザ・フロラム、オシネラ・フリット、ペゴミヤ・ヒソシアミ、フォルビア・アンティクア、フォルビア・アブラナ科、フォルビア・コアクタタ、Phlebotomus argentipes、Psorophora columbiae、Psila rosae、Psorophora discolor、Prosimulium mixtum、Rhagoletis cerasi、Rhagoletis pomonella、Sarcophaga haemorrhoidalis、Sarcophaga spp.、Simulium vittatum、STOMOXYS calcitrans、Tabanus bovinus、Tabanus atratus、Tabanus lineola、および Tabanus similis、Tipula oleracea、そしてティブラ・パルドーサ。シロアリ（等翅目）、例：カロテルメス・フラビコリス、ロイコテルメス・フラビペス、ヘテロテルメス・アウレウス、レチクリテルメス・フラビペス、Reticulitermes virginicus、Reticulitermes lucifugus、Reticulitermes santonensis、Reticulitermes groundsei、Termes natalensis、Coptotermes formosanus; ゴキブリ類（Blattaria Blattodea）、例：Blattella germanica、Blattella asahinae、Periplaneta americana、Periplaneta japonica、Periplaneta brunnea、Periplaneta fuliginosa、Periplaneta australasiae、Blatta orientalis; アリ、ハチ、スズメバチ、ハバチ類（膜翅目）、例：アタリア・ロサエ、アッタ・セファロテス、アッタ・カピグアラ、アッタ・セファロテス、アッタ・ラエビガタ、アッタ・ロブスタ、アッタ・セックスデンス、アッタ・テクサナ、クレマトガステル属、ホプロカンパ・ミヌタ、ホプロカンパ・テストディネア、ラシウス・ニジェール、モノモリウム・ファラオニス、ソレノプシス・ジェミナタ、ソレノプシス・インヴィクタ、ソレノプシスリヒテリ、ソレノプシス・キシロニ、ポゴノミルメクス・バルバトゥス、ポゴノミルメクス・カリフォルニカス、フェイドール・メガセファラ、ダシムティラ・オクシデンタリス、セイヨウオオマルハナバチ、ベスプラ・スクアモサ、パラベスプラ・尋常性、パラベスプラ・ペンシルバニカ、パラベスプラ・ゲルマニカ、ドリコベスプラ・マクラタ、ベスパ・クラブロ、アシナガバチルビギノサ、カンポノトゥスフロリダヌス、ラインピテマ・フマイル。コオロギ、バッタ、バッタ（直翅目）、例：アケタ・ドメスティカ、グリロタルパ、トナカイバナ、メラノプラス・ビビッタトゥス、メラノプラス大腿骨、メラノプラス・メキシコ、メラノプラス・サンギニペス、メラノプラス・スプレットゥス、ノマダクリス・セプテムファシアタ、アメリカ住血吸虫、住血吸虫、ドシオスタウルス・マロッカヌス、タキシンス・アシナモラス、Oedaleus senegalensis、Zonozelus variegatus、Hieroglyphus daganensis、Kraussaria angulifera、Calliptamus italicus、Chortoicetes terminifera、Locustana pardalina。アラネイダ、例：Latrodectus mactans、および Loxosceles reclusa。ノミ（Siphonaptera）、例：クテノセファリデス・フェリス、クテノセファリデス・カニス、ゼノプシルラ・ケオピス、ピュレックス・イリタンス、ツンガ・ペネトランス、ノソプシルス・ファシアトゥス、シルバーフィッシュ、ファイアブラット（ティサヌラ）など。Lepisma saccharina および Thermobia domestica、ムカデ（Chilopoda）、例：Scutigera oleoptrata、ヤスデ（Diplopoda）、例：Narceus spp.、ハサミムシ（Dermaptera）、例：forficula auricularia、シラミ（Phthiraptera）、例：Pediculus humanus capitis、Pediculus humanus corporis、Pthirus pubis、Haematopinus eurysternus、Haematopinus suis、Linognathus vituli、Bovicola bovis、Menopon allinae、Menacanthus stramineus、Solenopotes capillatus。トビムシ（トビムシ）、例。オニキウルス sp.

10

20

30

40

50

【0112】

また、以下の線虫の駆除にも適している：植物寄生性線虫、例えばネコブセンチュウ、Meloidogyne hapla、Meloidogyne incognita、Meloidogyne javanica、その他の Meloidogyne 属種、嚢子形成線虫、Globodera rostochiensis、その他の Globodera 属種、Heterodera avenae、Heterodera glycines、Heterodera schachtii、Heterodera trifolii、その他の Heterodera 属種、種子えい線虫、Anguina

属種、莖葉線虫、Aphelenchoides属、刺胞線虫、Belonolaimus longicaudatus およびその他の Belonolaimus 属、マツノサイセンチュウ、Bursaphelenchus xylophilus およびその他の Bursaphelenchus属、輪状線虫、Criconema 属、Criconemella 属、Criconemoides 属、Mesocriconema属、莖および鱗莖線虫、Ditylenchus destructor、Ditylenchus dipsaci およびその他の Ditylenchus 属、千枚通し線虫、Dolichodorus 属。らせん線虫、Heliocotylenchus multicinctus およびその他の Helicotylenchus 属、鞘線虫および鞘状線虫、Hemicyclophora 属および Hemicriconemoides 属; Hirshmanniella 属; 槍状線虫 Hoploaimus 属; 偽根瘤線虫 Nacobbus 属; 針線虫 Longidorus elongatus 属およびその他の Longidorus 属; 病斑線虫 Pratylenchus neglectus、Pratylenchus penetrans、Pratylenchus curvatus、Pratylenchus goodeyi 属およびその他の Pratylenchus 属; 穿孔線虫 Radopholus similis 属およびその他の Radopholus 属; 腎形線虫 Rotylenchus robustus 属およびその他の Rotylenchus 属; Scutellonema 属; 太根線虫 Trichodorus primitivus 属およびその他の Trichodorus 属、Paratrachodorus 属; 矮小線虫、Tylenchorhynchus claytoni、Tylenchorhynchus dubius およびその他の Tylenchorhynchus 属、柑橘類線虫、Tylenchulus 属、ダガー線虫、Xiphinema 属、およびその他の植物寄生線虫種。

10

【0113】

式 (I) の化合物およびそれらの塩は、以下のクモ類 (クモ上科) を防除するのにも有用である: ダニ類 (Acarina) など、Amblyomma americanum、Amblyomma variegatum、Argas persicus、Boophilus annulatus、Boophilus decoloratus、Boophilus microplus、Dermacentor silvarum、Hyalomma truncatum、Ixodes ricinus、Ixodes robustusなどの、藻類科、マダニ科、およびサルコプチダ科の、Ornithodoros moubata、Otobius megnini、Dermanyssus gallinae、Psoroptes ovis、Rhipicephalus appendiculatus、Rhipicephalus evertsi、Sarcoptes scabiei、およびEriophyidae spp. Acarus schlechtendali、Phyllocoptera oleivora、Eriophyes sheldoniなど、タルソネミダエ spp. Phytanemus pallidus や Polyphagotarsonemus latus など、テヌイパルピダ科 spp.ブレビパルプス・フェニシスなど。テトラニキダエ属Tetranychus cinnabarinus、Tetranychus kanzai、Tetranychus pacificus、Tetranychus telarius、Tetranychus urticae、Panonychus ulmi、Panonychus citri、oligonychus pratensisなど。

20

30

【0114】

さらなる実施形態では、本発明は、式 (I) の化合物を、吸汁性または刺突性の昆虫、例えばアザミウマ属、双翅目および半翅目属の昆虫、特に以下の種から選択される昆虫を防除するための有効かつ有用な化合物として提供する: 蝶目: Frankliniella fusca、Frankliniella occidentalis、Frankliniella tritici、Scirtothrips citri、アザミウマ オリゼ、アザミウマ、アザミウマおよびアザミウマ、双翅目: 例ネッタイシマカ、ヒトスジシマカ、ネッタイシマカ、アナストレファ・ルーデンス、ハマダラカ・マキュリペニス、ハマダラカ・フナ、ハマダラカ・アルビマヌス、ガンビアハマダラカ、ハマダラカ・フリーボルニ、ハマダラカ・ロイコスフィラス、ハマダラカ・ミニムス、ハマダラカ・クアドリマキュラトウス、カリフォル・ビシーナ、Ceratitis capitata、Chrysomya bezziana、Chrysomya hominivorax、Chrysomya macellaria、Chrysops discalis、Chrysops silacea、Chrysops atlanticus、Cochliomyia hominivora x、Contarinia sorghicola Cordylobia anthropophaga、Culicoides furens、Culex pipiens、Culex nigripalpus、Culex quinquefasciatus、Culex tarsalis、Culiseta inornata、Culiseta melanura、Dacus cucurbitae、Dacus oleae、Dasineura brassicae、Delia Antique、Delia coarctata、Delia platura、Delia radicum、Dermatobia hominis、Fannia canicularis、Geomyza Tri punctata、Gasterophilus腸炎、Glossina morsitans、Glossina palpalis、Glossina fuscipes、Glossina tachinoides、Haematobia irritans、Haplodiplos

40

50

is equestris、Hippelates spp.、Hylemyia platura、Hypoderma lineata、Leptoconops torens、Liriomyza sativae、Liriomyza trifolii、Lucilia caprina、Lucilia cuprina、Lucilia sericata、Lycoria胸筋、マンソニア・ティチラヌス、マエティオラ・デストラクター、秋ノバエ、ドメスティックバエ、ムシナ・スタブランス、発情卵、オポマイザ・フロラム、オシネラ・フリット、ペゴミヤ・ヒソシアミ、フォルビア・アンティクア、フォルビア・アブラナ科、フォルビア・コアクタタ、Phlebotomus argentipes、Psorophora columbiae、Psilaバラ、Psorophora 変色、Prosimulium mixtum、Rhagoletis cerasi、Rhagoletis pomonella、Sarcophaga haemorrhoidalis、Sarcophaga spp.、Simulium vittatum、STOMOXYS calitrans、Tabanus bovinus、Tabanus atratus、Tabanus lineola、および Tabanus similis、Tipula oleracea、および Tipula paludosa、半翅目、特にアブラムシ：アシルトシフォン・オノブリキス、アデルゲス・ラリシス、アブラムシ、アブラムシ、ファバアブラムシ、フォルベシアブラムシ、アブラムシ・ポミ、アブラムシ・ゴシピイ、アブラムシ、グロシュラリアエ、シュナイデリアブラムシ、スピラエコラアブラムシ、サムアブラムシ、アシルトシフォン・ピサム、アウラコートゥム・ソラニ、ブラキカウドゥス・カルドゥイ、ブラキカウドゥス・ヘリクリシ、ブラキカウドゥス・ペルシカエ、ブラキカウドゥス・ブルニコラ、ブレビコリン・ブラシカエ、カピトフォラス・ホルニ、セロシファ・ゴシピイ、ケトシフォン・フラガエフォリ、クリプトミズス・リビス、ドレフュシア・ノルドマニアエ、ドレフュシア・ピシエ、ディサフィスラジコラ、Dysaulacorthumシュードソラニ、Dysaphis plantaginea、Dysaphis pyri、Empoasca fabae、Hyalopterus pruni、Hyperomyzus lactucae、Macrosiphum avenae、Macrosiphum euphorbiae、Macrosiphon rosae、Megoura viciae、Melanaphis pyraeius、Metopolophium dirhodum、Myzodes persicae、Myzusアスカロニクス、Myzus cerasi、Myzus varians、Nasonovia ribis-nigri、Nilaparvata lugens、Pemphigus bursarius、Perkinsiella saccharicida、Phorodon humuli、Psylla mail、Psylla piri、Rhopalomyzus ascalonicus、Rhopalosiphum Maidis、Rhopalosiphum Padi、Rhopalosiphum insertum、サッパフィス・マラ、サッパフィスマリ、Schizaphis graminum、Schizoneura lanuginosa、Sitobion avenae、Trialeurodes Vaporariorum、Toxoptera aurantiiand、および Viteus vitifolii。

10

20

30

【0115】

好ましい一実施形態では、式（I）の化合物の本発明は、例えば、以下のものを防除するのに特に有用である：西洋花アザミウマ（Frankliniella occidentalis）、ジャガイモヨコバイ（Empoasca fabae）、イネトビウンカ（Nilaparvata lugens）、イネアオヨコバイ（Nephotettix virescens）、ワタ/メロンアブラムシ（Aphis gossypii）、グリーンピーチアブラムシ（Myzus persicae）、タバコ/サツマイモコナジラミ（Bemisia tabaci）、およびシルバーリーフコナジラミ（Bemisia argentifolii）。

【0116】

一実施形態において、本発明はさらに、生物学的に有効な量の式（I）の化合物と、殺菌剤、殺虫剤、殺線虫剤、ダニ駆除剤、生物農薬、除草剤、植物成長調節剤、抗生物質、肥料および栄養素から選択される少なくとも1つの追加の生物活性適合性化合物とを含む組成物に関する。組成物において、および式（I）の化合物と組み合わせて使用される化合物は、活性適合性化合物とも呼ばれる。

40

【0117】

公知および報告された殺菌剤、殺虫剤、線虫剤、ダニ駆除剤、生物農薬、除草剤、植物成長調節剤、生物刺激剤、抗生物質および栄養素は、本開示の式（I）の少なくとも1つの化合物と組み合わせることができる。例えば、国際公開第2016/156129号および国際公開第2017/153200号に開示および報告された殺菌剤、殺虫剤、線虫剤、ダニ駆除剤、生物農薬、除草剤、植物成長調節剤、生物刺激剤、抗生物質、肥料およ

50

び栄養素は、本開示の式（I）の少なくとも1つの化合物と組み合わせることができる。

【0118】

場合によっては、同様の防除範囲を有するが異なる作用モードを有する他の無脊椎動物有害生物防除化合物または薬剤との組み合わせが、耐性管理に特に有利となる。したがって、本発明の組成物は、同様の防除範囲を有するが異なる作用モードを有する少なくとも1種の追加の無脊椎動物害虫防除化合物または薬剤の生物学的有効量をさらに含むことができる。植物保護化合物（タンパク質など）または植物の遺伝子座を発現するように遺伝子組換えされた植物と、本発明の化合物の生物学的有効量とを接触させることも、より広範な植物保護を提供でき、耐性管理に有利である。

【0119】

本発明の一実施形態において、組成物中の式（I）の化合物の生物学的有効量は、組成物の全重量に対して、0.1～99重量%の範囲であり、好ましくは組成物の全重量に対して5～50重量%の範囲である。

【0120】

本発明はさらに、昆虫およびダニ害虫を駆除する方法に関し、前記方法は、昆虫およびダニ害虫、それらの習性、繁殖地、食物供給、植物、種子、土壌、昆虫およびダニ害虫が成長しているかまたは成長する可能性のある領域、材料または環境、または害虫の攻撃または侵入から保護されるべき材料、植物、種子、土壌、表面または空間に、生物学的有効量の本発明の化合物または組成物と接触させることを含む。

【0121】

無脊椎動物害虫が駆除され、農業、園芸および特産作物、動物および人間の健康の保護は、本発明の化合物の1種または複数種を、有効量で、農業および／または非農業的な侵入場所を含む害虫の環境、保護対象領域、または防除対象害虫に直接適用することによって達成される。したがって、本発明はさらに、葉および土壌に生息する無脊椎動物の防除および農業作物および／または非農業作物の保護のための方法を含み、この方法は、無脊椎動物またはその環境を、生物学的有効量の本発明の化合物の1種または複数種、または少なくとも1種のそのような化合物を含む組成物、または少なくとも1種のそのような化合物および少なくとも1種の追加の生物学的活性化合物または薬剤の有効量を含む組成物と接触させることを含む。好ましい接触方法は、噴霧によるものである。あるいは、本発明の化合物を含む粒状組成物を、植物の葉または土壌に適用することもできる。本発明の化合物は、液体製剤の土壌灌注、土壌への粒状製剤、苗箱処理、または移植苗の浸漬として適用される本発明の化合物を含む組成物を植物に接触させることによって、植物の吸収を介した送達において効果的である。

他の接触方法としては、直接および残留噴霧、空中噴霧、種皮、マイクロカプセル化、全身摂取、餌、耳あな、ポーラス、噴霧器、燻蒸剤、エアロゾル、粉塵などによる本発明の化合物または組成物の適用が挙げられる。

【0122】

本発明の化合物は、無脊椎動物によって消費される餌またはトラップなどの装置内に組み込むことができる。0.01～5%の有効成分、0.05～10%の保湿剤および40～99%の植物粉を含む顆粒剤または餌は、非常に低い適用率で、特に直接接触ではなく摂取によって致死となる有効成分の用量で、土壌昆虫を防除するのに有効である。本発明の化合物は、純粋な状態で適用できるが、最も多くの場合、適切な担体、希釈剤、および界面活性剤を含む1つ以上の化合物を含む配合物として適用され、想定される最終用途に応じて、おそらく食品と組み合わせて適用されることもある。好ましい適用方法は、化合物の水分散液または精製油溶液の噴霧を含む。スプレーオイル、スプレーオイル濃縮物、スプレッド、ステッカー、アジュバント、他の溶媒、およびピペロニルブトキシドなどの相乗剤との組み合わせは、しばしば化合物の有効性を高める。

【0123】

効果的な防除に必要な施用量（すなわち「生物学的有効量」）は、防除される無脊椎動物の種、害虫のライフサイクル、生活段階、その大きさ、場所、時期、宿主作物または動

10

20

30

40

50

物、摂食行動、交尾行動、周囲の湿度、温度などの要因に依存する。通常の下況下では、ヘクタール当たり約0.01~2kgの有効成分の散布率は、農業生態系における害虫を防除するのに十分であるが、1ヘクタール当たり0.0001kgほどで十分な場合もあれば、または8kg程度必要になる場合もある。農業以外の用途では、有効な使用率は約1.0~50mg/平方メートルの範囲であるが、0.1mg/平方メートル程度で十分な場合もあれば、または150mg/平方メートル程度が必要になる場合もある。当業者は、無脊椎動物の望ましい防除レベルに必要な生物学的有効量を容易に決定することができる。

【0124】

動物害虫、すなわち昆虫、クモ類および線虫、植物、植物が生育している土壌または水は、当該技術分野で公知の任意の適用方法によって、式(I)の化合物、それらのN-オキシドおよび塩、またはそれらを含む組成物と接触させることができる。このように、「接触」には、直接接触(化合物/組成物を動物の害虫または植物に直接、通常は植物の葉、茎または根に適用する)と、間接触(化合物/組成物を動物害虫または植物の場所に適用する)の両方を含む。

【0125】

本発明の化合物またはそれらを含む殺虫組成物は、植物/作物を本発明の少なくとも1つの化合物の殺虫有効量と接触させることによって、成長中の植物および作物を動物害虫、特に昆虫、ダニ科またはクモ類による攻撃または侵入から保護するために使用することができる。用語「作物」は、生育中および収穫された作物の両方を指す。

したがって、本発明は、生物学的に有効な量の本発明の化合物または組成物、異性体、多形体、N-オキシドまたはその塩と、作物を接触させることを含む、昆虫およびダニ害虫による攻撃または侵入から作物を保護する方法に関する。

本発明の化合物は、殺虫有効量の活性化合物で殺虫攻撃から保護される昆虫または植物、種子、土壌、表面、材料または部屋などの植物繁殖材料を処理することによって、そのまままたは組成物の形態で使用される。適用は、昆虫による植物、種子、土壌、表面、材料または部屋などの植物繁殖材料の感染の前後の両方で実施することができる。

したがって、本発明はまた、播種前および/または発芽前後に本発明の化合物または組成物、N-オキシドまたはその塩を種子に接触させることを含む、土壌昆虫から種子を保護し、土壌および葉の昆虫から苗の根および新芽を保護するための方法に関する。

【0126】

さらに、本発明は、生物学的に有効な量の本発明の化合物または組成物、異性体、多形体、N-オキシドまたはその獣医学的に許容される塩を動物に経口的、局所的または非経口的に投与または適用することを含む、寄生虫による寄生または感染から動物を治療または保護するための方法に関する。

【0127】

作物植物の治療における使用のために、本発明の化合物の適用量(有効用量の適用量)は、農業または園芸作物において1ヘクタール当たり1~5000gの範囲であり、好ましくは1ヘクタール当たり25~600g、より好ましくは1ヘクタール当たり35~300gである。

【0128】

本発明の化合物および組成物は、穀物、根菜類、油糧作物、野菜、香辛料、観賞用植物、例えば、デュラムおよび他の小麦の種子、大麦、オート麦、ライ麦、トウモロコシ(飼料用トウモロコシおよび砂糖用トウモロコシ/スイートコーンおよびフィールドコーン)、大豆、油糧作物、アブラナ、綿、ひまわり、バナナ、米、油糧ナタネ、カブナタネ、サトウキビ、飼料用ビート、ナス、ジャガイモ、草、芝生、芝、飼料用草、トマト、ニラ、カボチャ/スクワッシュ、キャベツ、アイスバーグレタス、コショウ、キュウリ、メロン、アブラナ種、メロン、豆、エンドウ、ニンニク、タマネギ、ニンジン、塊茎植物、例えば、ジャガイモ、サトウキビ、タバコ、ブドウ、ペチュニア、ゼラニウム/ペラルゴニウム、パンジーおよびインパチェンスなどの様々な栽培植物に発生する多数の昆虫の防除に

特に有用である。

【0129】

特に、本発明の化合物または組成物は、穀物、トウモロコシ、米、大豆および他のマメ科植物、果実および果樹、ブドウ、ナッツおよびナッツの木、柑橘類および柑橘類の木、任意の園芸植物、ウリ科、イネ科植物、タバコ、コーヒー、茶、カカオ、テンサイ、サトウキビ、綿、ジャガイモ、トマト、タマネギ、コショウおよび他の野菜、ならびに観賞用植物などの農作物の保護に有用である。

【0130】

本発明はさらに、式(I)から選択される化合物の製造方法に関する。

本発明の化合物は、接触(土壌、ガラス、壁、蚊帳、カーペット、植物または動物の部分を通じて)および摂取(餌または植物部分)の両方を通じて効果的である。

【0131】

本発明の化合物は、アリ、シロアリ、スズメバチ、ハエ、蚊、コオロギまたはゴキブリなどの非作物害虫およびダニ害虫に対しても適用することができる。前記非作物害虫に対して使用するために、本発明の化合物は、好ましくは餌組成物に使用される。

餌は、液体、固体または半固体調製物(例えばゲル)とすることができる。固体餌は、それぞれの用途に適した様々な形状および形態、例えば、顆粒、ブロック、スティック、ディスクに成形できる。液体餌は、適切な適用を確実にするために、様々な装置、例えば、開放容器、スプレー装置、液滴源、または蒸発源に充填することができる。ゲルは、水性または油性マトリックスに基づくことができ、粘着性、水分保持または老化特性の点で特定のニーズに合わせて処方することができる。

【0132】

組成物に使用される餌は、アリ、シロアリ、スズメバチ、ハエ、蚊、コオロギなどの昆虫またはゴキブリがそれを食べるように刺激するのに十分な魅力をもつ製品である。魅力は、摂食刺激剤または性フェロモンを使用することによって操作することができる。摂食刺激剤は、例えば、動物および/または植物タンパク質(肉、魚、血粉、昆虫の部位、卵黄)、動物および/または植物由来の脂肪および油、またはモノ、オリゴまたはポリ有機糖類、特にスクロース、ラクトース、フルクトース、デキストロース、グルコース、デンプン、ペクチン、または糖蜜または蜂蜜から選択されるが、これらに限定されない。果物、作物、植物、動物、昆虫またはそれらの特定の部分の新鮮なまたは腐敗部分も、摂食刺激剤として役立つことができる。性フェロモンは、より昆虫に特異的であることが知られている。特定のフェロモンは、文献に記載されており、当業者には知られている。

餌組成物での使用のために、活性成分の典型的な含有量は、活性化合物の0.001~15重量%、好ましくは0.001~5重量%である。

【0133】

エアゾール(スプレー缶など)、オイルスプレーまたはポンプスプレーとしての本発明の化合物の製剤は、ハエ、ノミ、ダニ、蚊またはゴキブリなどの害虫を駆除するために、非専門的な使用者に非常に適している。エアゾール処方は、好ましくは、活性化合物、低級アルコール(例えばメタノール、エタノール、プロパノール、ブタノール)のような溶媒、ケトン(例えばアセトン、メチルエチルケトン)、約50~250℃の沸点範囲を有するパラフィン炭化水素(例えば灯油)、ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン、ジメチルスルホキシド、トルエン、キシレンなどの芳香族炭化水素、水、さらに、ソルビトールモノオレエートのような乳化剤、エチレンオキシドを3~7モル有するオレイルエトキシレート、脂肪族アルコールエトキシレート、エーテル油のような香料油、低級アルコールを有する中脂肪酸のエステル、芳香族カルボニル化合物、必要に応じて安息香酸ナトリウムのような安定剤、両性界面活性剤、低級エポキシド、トリエチルオルトホルメート、および必要に応じてプロパン、ブタン、窒素、圧縮空気、ジメチルエーテル、二酸化炭素、亜酸化窒素、またはこれらのガスの混合物のような推進剤から構成される。

【0134】

オイルスプレー製剤は、噴射剤を使用しないという点でエアゾール処方と異なる。スプ

レー組成物に使用する場合、有効成分の含有量は0.001～80重量%、好ましくは0.01～50重量%、最も好ましくは0.01～15重量%の範囲である。

【0135】

本発明の化合物およびそれらの各組成物はまた、蚊取り線香および燻蒸コイル、スモークカートリッジ、気化器プレートまたは長期気化器において、また、防虫紙、防虫パッドまたは他の熱に依存しない気化器システムにおいて使用することができる。

【0136】

式(I)の化合物およびその各組成物を用いて、昆虫によって媒介される感染症(マラリア、デング熱、黄熱病、リンパ系フィラリア症、リーシュマニア症など)を防除する方法はまた、小屋および家屋の表面の処理、カーテン、テント、衣類、蚊帳、ツェツェフライトラップなどの空気噴霧および含浸を含む。繊維、織物、ニット製品、不織布、ネット材またはホイルおよび防水シートに適用するための殺虫組成物は、好ましくは、殺虫剤、任意に忌避剤および少なくとも1つの結合剤を含む混合物を含む。例えば、適当な忌避剤は、N,N-ジエチル-メタ-トルアミド(DEET)、N,N-ジエチルフェニルアセトアミド(DEPA)、1-(3-シクロヘキサン-1-イル-カルボニル)-2-メチルピペリン、(2-ヒドロキシメチルシクロヘキシル)酢酸ラクトン、2-エチル-1,3-ヘキサジオール、インドロン、メチルネオデカンアミド(MNDA)、{(+/)-3-アリル-2-メチル-4-オキシシクロペンタ-2-(+)-エニル-(+)-トランス-クリサンテマート(エスピオトリン)のような昆虫防除に使用されないピレスロイド、リモネン、オイゲノール、(+)-ユーカマロール(1)、(-)-1-エピユーカマロールなどの植物抽出物から誘導されるか、またはそれらと同一の忌避剤、またはユーカリ、ピテックス・ロタンディフォリア、シンボポガン・マルティニ、シンボポガン・シトラス(レモングラス)、シンボポガン・ナルトゥス(シトロネラ)のような植物からの粗植物抽出物。適切な結合剤は、例えば、脂肪族酸のビニルエステル(酢酸ビニル、バーサテートビニルなど)、アクリル酸ブチル、2-エチルヘキシルアクリレート、アクリル酸メチルなどのアルコールのアクリル酸エステルおよびメタクリル酸エステル、スチレンなどのモノおよびジエチレン性不飽和炭化水素、およびブタジエンなどの脂肪族ジエンのポリマーおよびコポリマーから選択される。

【0137】

カーテンおよび蚊帳の含浸は、一般に、繊維材料を殺虫剤のエマルジョンまたは分散液に浸漬するか、それらをネット上にスプレーすることによって行われる。

本発明の化合物およびその組成物は、樹木、ボードフェンス、枕木などの木製材料および住宅、屋外、工場などの建物を保護するために使用することができるが、建築材料、家具、皮革、繊維、ビニール製品、電線およびケーブルなどをアリおよび／またはシロアリから保護し、アリおよびシロアリが農作物または人間に害を及ぼすのを防ぐためにも使用することができる(例えば、害虫が住宅や公共施設に侵入した場合)。本発明の化合物は、木製材料を保護するために周囲の土壌表面または床下土壌に適用されるだけでなく、床下コンクリートの表面、床柱、梁、合板、家具などの木材製品、パーティクルボード、ハーフボードなどの木製製品、被覆電線、ビニールシート、発泡スチロールなどの断熱材などのビニール製品にも適用することができる。

【0138】

種子処理

本発明はさらに、特に処理前の種子の約0.0001～約1重量%の範囲の量の本発明の化合物を含む種子に関する。

本発明の化合物は、土壌害虫からの種子の保護、および土壌害虫および葉虫からの結果として生じる植物の根および新芽の保護に特に有用である。結果として生じる植物の根および新芽の保護が好ましい。より好ましいのは、結果として生じる植物の新芽を穿孔虫および吸虫から保護することであり、アブラムシからの保護が最も好ましい。

したがって、本発明は、昆虫、特に土壌昆虫からの種子の保護、および昆虫、特に土壌および葉虫からの苗の根および芽の保護のための方法を含み、前記方法は、播種前および／

10

20

30

40

50

または発芽前後に本発明の化合物と種子を接触させることを含む。特に好ましいのは、植物の根および芽が保護される方法であり、より好ましくは、植物の芽が穿孔虫および吸虫から保護される方法であり、最も好ましくは、植物の芽がアブラムシから保護される方法である。

【0139】

「種子」という用語は、種子片、吸芽、球茎、球根、果実、塊茎、穀物、挿し木、切断された新芽などを含むが、これらに限定されない、あらゆる種類の種子および植物の繁殖体を包含し、好ましい実施形態においては、真の種子を意味する。

【0140】

「シード処理」という用語は、種子粉衣、種子コーティング、種子散布、種子浸漬および種子ペレットなど、当技術分野で公知のすべての適切な種子処理技術を含む。

本発明は、活性化合物でコーティングされた、または活性化合物を含む種子も含む。種子は、本発明の化合物を含む種子コーティング組成物でコーティングすることができる。例えば、EP 3 165 092、EP 3 158 864、WO 2 016 198 644、WO 2 016 039 623、WO 2 015 192 923、CA 2 940 002、US 2 006 150 489、US 2 004 237 395、WO 2 011 028 115、EP 2 229 808、WO 2 007 067 042、EP 1 795 071、EP 1 273 219、WO 2 001 785 07、EP 1 247 436、NL 1 012 918 および CA 2 083 415 に報告されているシードコーティング組成物が挙げられる。

【0141】

「被覆および／または含有する」という用語は、一般に、有効成分の大部分が適用時に増殖生成物の表面にあることを意味するが、適用方法によっては、成分の大部分または小部分が増殖生成物に浸透することがある。前記増殖生成物を（再）植栽すると、有効成分を吸収することがある。

好適な種子は、穀物、根菜類、油糧作物、野菜、香辛料、装飾品の種子であり、例えば、デュラムおよび他の小麦の種子、大麦、オート麦、ライ麦、トウモロコシ（飼料用トウモロコシおよび砂糖用トウモロコシ／スイートおよびフィールドコーン）、大豆、油糧作物、アブラナ、綿、ヒマワリ、バナナ、米、油糧ナタネ、カブナタネ、サトウキビ、飼料用ビート、ナス、ジャガイモ、草、牧草、芝生、芝、飼料草、トマト、ニラ、カボチャ／スクワッシュ、キャベツ、アイスバーグレタス、コショウ、キュウリ、メロン、アブラナ種、メロン、豆、エンドウ豆、ニンニク、タマネギ、ニンジン、ジャガイモ、サトウキビ、タバコ、ブドウ、ペチュニア、ゼラニウム／ペラルゴニウム、パンジーおよびインパチェンスなどの塊茎植物である。

【0142】

さらに、本発明の化合物は、遺伝子工学的方法を含む育種による除草剤または殺菌剤または殺虫剤の作用に耐性を有する植物からの種子の処理に使用することができる。

例えば、本発明の化合物は、スルホニルウレア類、イミダゾリノン類、グルホシネートアンモニウムまたはグリホサートイソプロピルアンモニウムおよび類似の活性物質（EP 2 422 36、EP 2 422 46などを参照）からなる群からの除草剤に耐性を有する植物からの種子の処理に使用することができる（EP 2 579 93、US 5 013 659を参照）、または、植物を特定の害虫に耐性にするバチルス・チューリンゲンシス毒素（Bt毒素）を産生する能力を有する遺伝子組み換え作物、例えば、ワタなどに使用することができる（EP 1 429 24、EP 1 932 59）。

さらに、本発明の化合物は、例えば、伝統的な育種方法および／または突然変異体の生成または組換え手順によって生成され得る、既存の植物と比較して改変された特性を有する植物からの種子の処理に使用することができる。例えば、植物で合成されるデンプンを改変することを目的とした作物の組換え改変（例：WO 92／11376、WO 92／14827、WO 91／19806）または改変された脂肪酸組成を有する遺伝子組み換え作物の多くの事例が記載されている（WO 91／13972）。

【0143】

本発明の化合物の種子処理適用は、植物の播種前および植物の発芽前に、種子を噴霧または散布することによって行われる。

【0144】

種子処理に特に有用な組成物は、例えば、以下の通りである：

- A 可溶性濃縮物 (SL、LS)
- B エマルジョン (EW、EO、ES)
- C 懸濁液 (SC、OD、FS)
- D 水分散性顆粒および水溶性顆粒 (WG、SG)
- E 水分散性粉末および水溶性粉末 (WP、SP、WS)
- F ゲル製剤 (GF)
- G 散布可能な粉末 (DP、DS)

10

【0145】

従来の種子処理製剤には、例えば、流動性濃縮物 FS、溶液 LS、乾燥処理用粉末 DS、スラリー処理用水分散性粉末 WS、水溶性粉末 SS および エマルジョン ES および EC、ならびにゲル製剤 GF が含まれる。これらの製剤は、希釈または未希釈の種子に適用することができる。種子への適用は、播種前に、種子に直接、または種子を事前に発芽させた後に行われる。

【0146】

一実施形態では、FS 製剤が種子処理に使用される。典型的には、FS 製剤は、1～800 g/l の活性成分、1～200 g/l の界面活性剤、0～200 g/l の凍結防止剤、0～400 g/l のバインダー、0～200 g/l の顔料および 1 リットル以下の溶媒、好ましくは水を含むことができる。

20

特に、種子処理のための本発明の化合物の FS 製剤は、通常、0.1～80 重量% (1～800 g/l) の活性成分、0.1～20 重量% (1～200 g/l) の少なくとも 1 つの界面活性剤、例えば、0.05～5 重量%の湿式剤および 0.5～15 重量%の分散剤、最大 20 重量%まで、例えば 5～20 %の凍結防止剤、0～15 重量%、例えば 1～15 重量%の顔料および／または染料、0～40 重量%、例えば 1～40 重量%のバインダー (ステッカー／接着剤)、任意に最大 5 重量%まで、例えば 0.1～5 重量%の増粘剤、任意に 0.1～2 %の消泡剤、および任意に、0.01～1 重量%の殺生物剤、酸化防止剤などの防腐剤、および最大 100 重量%までの充填剤／賦形剤を含む。

30

【0147】

種子処理製剤は、さらに結合剤および任意に着色剤を含んでもよい。

結合剤は、処理後の種子への活性物質の付着を改善するために添加することができる。適切な結合剤は、エチレンオキシドまたはプロピレンオキシドのようなアルキレンオキシドのホモポリマーおよびコポリマー、ポリビニルアセテート、ポリビニルアルコール、ポリビニルピロリドンおよびそれらのコポリマー、エチレンービニルアセテートコポリマー、アクリルホモポリマーおよびコポリマー、ポリエチレンアミン、ポリエチレンアミドおよびポリエチレンピリミジン、セルロース、タイロースおよびデンプンのような多糖類、オレフィン／無水マレイン酸コポリマーのようなポリオレフィンホモポリマーおよびコポリマー、ポリウレタン、ポリエステル、ポリスチレンホモポリマーおよびコポリマーである。

40

【0148】

任意に、着色剤も製剤に含めることができる。種子処理製剤に適した着色剤または色素は、ローダミン B、C、I、ピグメントレッド 1、12、C、I、ソルベントレッド 1、ピグメントブルー 15：4、ピグメントブルー 15：3、ピグメントブルー 15：2、ピグメントブルー 15：1、ピグメントブルー 80、ピグメントイエロー 1、ピグメントイエロー 13、ピグメントレッド 1、12、ピグメントレッド 48：2、ピグメントレッド 48：1、ピグメントレッド 57：1、ピグメントレッド 53：1、ピグメントオレンジ 43、ピグメントオレンジ 34、ピグメントオレンジ 5、ピグメントグリーン 36、ピグメントグリーン 7、ピグメントホワイト 6、ピグメントブラウン 25、ベーシックバイオ

50

レット10、ベーシックバイオレット49、アシッドレッド51、アシッドレッド52、アシッドレッド14、アシッドブルー9、アシッドイエロー23、ベーシックレッド10、ベーシックレッド108である。

【0149】

ゲル化剤の例は、カラジーン（S a t i a g e l登録商標）がある。

種子の処理において、本発明の化合物の適用量は、一般に、種子100kg当たり0.1g～10kgであり、好ましくは、種子100kg当たり1g～5kgであり、より好ましくは、種子100kg当たり1g～1kgであり、特に、種子100kg当たり1g～200gである。したがって、本発明は、本明細書に定義される式（I）の化合物、または式（I）の農業上有用な塩を含む種子も提供する。式（I）の化合物またはその農業上有用な塩の量は、一般に、種子100kg当たり0.1g～10kgであり、好ましくは、種子100kg当たり1g～5kgであり、特に、種子100kg当たり1g～1kgである。レタスのような特定の作物については、容量はより高くすることができる。

10

【0150】

動物の健康

本発明はまた、本発明の少なくとも1つの化合物を含む農業用および／または獣医用組成物を提供する。

本発明はさらに、本発明の化合物、そのN-オキシド、またはその獣医学的に許容される塩、または本発明の組成物を、昆虫およびダニの害虫または寄生虫による寄生または感染から動物を治療または保護するための薬剤の製造に使用することに関する。

20

式（I）の化合物、それらのN-オキシドおよび／またはその獣医学的に許容される塩もまた、動物の体内および体表の寄生虫を駆除するために使用するのに特に適している。

したがって、本発明の目的の1つは、動物の体内および体表に寄生する寄生虫を駆除するための新しい方法を提供することである。本発明の別の目的は、動物のためのより安全な殺虫剤を提供することである。本発明の別の目的は、既存の殺虫剤よりも低用量で利用できる動物用殺虫剤を提供することである。本発明の別の目的は、寄生虫を長期間防除できる動物用殺虫剤を提供することである。

【0151】

本発明はまた、動物の体内および体表の寄生虫を駆除するための、式（I）の化合物、N-オキシドまたはその獣医学的に許容される塩の少なくとも1種の殺虫有効量、および許容される担体を含む組成物に関する。

30

本発明はまた、寄生虫による寄生および感染から動物を治療、制御、予防および保護するための方法を提供する。この方法は、本発明の化合物またはそれを含む組成物の寄生虫駆除有効量を、動物に経口的、局所的または非経口的に投与または適用することを含む。

【0152】

本発明はまた、本発明の化合物またはそれを含む組成物の寄生虫駆除有効量を含む、動物の寄生虫による寄生または感染を治療、制御、予防または保護するための組成物の製造方法を提供する。

農業害虫に対する化合物の活性は、例えば、経口投与の場合、低用量で非嘔吐性であること、動物との代謝適合性、低毒性および安全な取り扱いを必要とする、動物の内部および外部寄生虫の防除に対するそれらの適合性を示唆しない。

40

驚くべきことに、本発明の化合物は、動物の内部および外部寄生虫と駆除するのに適していることが分かった。

【0153】

本発明の化合物およびそれらを含む組成物は、好ましくは、温血動物（ヒトを含む）および魚を含む動物の寄生および感染を防除および予防するために使用される。それらは、例えば、ウシ、ヒツジ、ブタ、ラクダ、シカ、ウマ、豚、家禽、ウサギ、ヤギ、イヌおよびネコ、水牛、ロバ、ダマジカおよびトナカイのような哺乳動物、ミンク、チンチラおよびアライグマのような毛皮を持つ動物、鶏、ガチョウ、七面鳥およびアヒルのような鳥類、およびマス、コイおよびウナギのような淡水および海水魚のような魚類における寄生お

50

よび感染を防除および予防するのに適している。

【0154】

本発明の化合物およびそれらを含む組成物は、好ましくは、イヌまたはネコのような家畜における寄生および感染を防除および予防するために使用される。

温血動物および魚における寄生虫には、シラミ、咬性シラミ、ダニ、鼻茸、ケド、咬性ハエ、ジャコウバエ、ハエ、ヒメハエの幼虫、ツツガムシ、ブヨ、蚊およびノミが含まれるが、これらに限定されない。

【0155】

本発明の化合物およびそれらを含む組成物は、外部および／または内部寄生虫の全身および／または非全身防除に適している。それらは、発生のすべてまたはいくつかの段階に対して活性であり得る。

本発明の化合物は、外部寄生虫の駆除に特に有用である。

本発明の化合物は、以下の目および種の寄生虫を駆除するために特に有用である。

ノミ (*Siphonaptera*)、例えばクテノセファリデス フェリス、クテノセファリデス カム、ゼノプシルラ ケオピス、ピュレックス イリタンス、ツンガ ペネトランス、およびノソプシルス ファシアトゥス、ゴキブリ (ブラッターリア・ブラットデア)、例: ゴキブリ、チャバネゴキブリ、アサヒナエ、アメリカワニナ、ワモンゴキブリ、*Periplaneta brunnea*、*Periplaneta fuliginosa*、ワモンアザミ、およびブラッタ・オリエンタリス、ハエ、蚊 (双翅目) ネットアイシマカ、ヒトスジシマカ、ネットアイシマカ、アナストレファ・ルーデンス、ハマダラカ・マキュリペニス、ハマダラカ・フナ、ハマダラカ・アルビマヌス、ガンビアハマダラカ、ハマダラカ・フリーボルニ、ハマダラカ・ロイコスフィラス、ハマダラカ・ミニムス、ハマダラカ・クアドリマキュラトゥス、カリフォル・ビシーナ、*Chrysomya bezziana*、*Chrysomya hominivorax*、*Chrysomya macellaria*、*Chrysops discalis*、*Chrysops silacea*、*Chrysops atlanticus*、*Cochliomyia hominivorax*、*Cordylobia anthropophaga*、*Culicoides furens*、*Culex piens*、*Culex nigripalpus*、*Culex quinquefasciatus*、*Culex tarsalis*、*Culiseta inornata*、*Culiseta melanura*、*Dermatobia hominis*、*Fannia canicularis*、*Gasterophilus intestinalis*、*Glossina morsitans*、*Glossina palpalis*、*Glossina fuscipes*、*Glossina tachinoides*、*Haematobia irritans*、*Haplodiplosis equestris*、*Hippelates* spp.、*Hypoderma lineata*、*Leptoconops torens*、*Lucilia caprina*、*Lucilia cuprina*、*Lucilia Sericata*、*Lycoria pectoralis*、*Mansonia* spp.、*Muscadomestica*、ムッシーナ・スタブランス、発情卵、*Phlebotomus argentipes*、*Psorophora columbiae*、*Psorophora discolor*、*Prosimulium mixtum*、*Sarcophaga haemorrhoidalis*、*Sarcophaga* sp.、*Simulium vittatum*、*STOMOXYS calcitrans*、*Tabanus bovinus*、*Tabanus at ratur*、*Tabanus lineola*、および *Tabanus similis*、シラミ (フチラプテラ)、例: 頭茎、体部茎、*Pthirus pubis*、*Haematopinus eurytsternus*、*Haematopinus suis*、*Linognathus vituli*、*Bovicola bovis*、*Menopon gallinae*、*Menacanthus stramineus*、*Solenopotes capillatus*。マダニおよび寄生ダニ (Parasitiformes): マダニ (マダニ)、例: マダニ *Ixodes scapularis*、*Ixodes holocyclus*、*Ixodes pacificus*、*Rhifcephalus Sanguineus*、*Dermacentor andersoni*、*Dermacentor variabilis*、*Amblyomma americanum*、*Ambryomma maculatum*、*Ornithodoros hermsi*、*Ornithodoros turicata*、および寄生ダニ (Mesostigmata)、例: ダニ *Ornithonyssus bacoti* および *Dermanyssus gallinae*、Actiniedida (Prostigmata) および Acaridida (Astigmata) など。アカラピス属、ケレティエラ属、オルニトケレティエラ属、ミオピア属、プソレルガテス属、デモデックス属、ツツガムシ属、リストロフォラス属、アカルス属、コナダニ属、カログリフス属、ヒポデクテス属、プテロリクス属.、*Psoroptes* 属、*Chorioptes* 属、*Otodectes* 属、*Sarcoptes* 属、*Notoedres* 属、*Knemidocoptes* 属、*Cytodites* 属、および *Laminosioptes* 属、カメムシ類 (異翅目): *Cimex lectularius*、*Cimex hemipterus*、*Reduvius senilis*

10

20

30

40

50

、*Triatoma* 属、*Rhodnius* spp.、*Panstrongylus* spp.、*Arilus critatus*、*Anoplurida* 属、例：*Haematopinus* spp.、*Linognathus* spp.、*Pediculus* spp.、*Phtirus* spp.、*Solenopotes* spp.、*Mallophagida* (亜目 *Arnblycerina* および *Ischnocerina*)、例：*Trimenopon* spp.、*Menopon* spp.。例えば、トリノトン属、ボビコラ属、ウェルネッキエラ属、レピケントロン属、トリコデクテス属、フェリコラ属。

【0156】

回虫線虫類：

ワイプワームおよび旋毛虫症 (*Trichosyringida*)、例：旋毛虫科 (*Trichinella* spp.)、(*Trichuridae*)、*Trichuris* spp.、*Capillaria* spp.、*Rhabditida*、例：*Rhabditis* spp.、*Strongyloides* spp.、*Helicephalobus* spp.、*Strongylida*、例：*Strongylus* spp.、*Ancylostoma* spp.、*Necator americanus*、*Bunostomum* spp.。(鉤虫)、*Trichostrongylus* spp.、*Haemonchus contortus*、*Ostertagia* spp.、*Cooperia* spp.、*Nematodirus* spp.、*Dictyocaulus* spp.、*Cyathostoma* spp.、*Oesophagostomum* spp.、*Stephanurus dentatus*、*Ollulanus* spp.、*Chabertia* spp.、*Stephanurus* 菌状菌、気管合虫属、アンシロストーマ属、ウンシナリア属、グロボセファルス属、ネカトル属、メタストロンギルス属、ムレリウス・キャピラリス、プロトストロンギルス属、アンジオストロンギルス属、パレラフォストロンギルス属。*Aleurostrongylus abstrusus*、および *Dioctophyma renale*、腸回虫 (*Ascaridida*)、例：*Ascaris lumbricoides*、*Ascaris suum*、*Ascaridia galli*、*Pascaris equorum*、*Enterobius vermicularis* (糸状虫)、*Toxocara canis*、*Toxascaris leonine*、*Skrjabinema* spp.、および *Oxyuris equi*、*Camallanida*、例：*Dracunculus medinensis* (ギニアワーム) *Spirurida*、例：セラジア属 *Wuchereria* spp.、*Brugia* spp.、*Onchocerca* spp.、*Dirofilari* spp. a、*Dipetalonema* spp.、*Setaria* spp.、*Elaeophora* spp.、*Spirocerca lupi*、および *Habronema* spp.、棘頭虫類 (*Acanthocephala*)、例：*Acanthocephalus* spp.、*Macracanthorhynchus hirudinaceus*、*Oncicola* spp.、プラナリア類 (*Plathelminthes*)：吸虫類 (*Trematoda*)、例：*Faciola* spp.、*Fascioloides magna*、*Paragonimus* spp.、*Dicrocoelium* spp.、*Fasciolopsis buski*、*Clonorchis sinensis*、*Schistosoma* spp.、*Trichobilharzia* spp.、*Alaria alata*、*Paragonimus* spp.、および *Nanocyetes* spp.、*Cercomeromorpha*、特に条虫 (サナダムシ)、例：*ディフィロボトリウム* 属、*テニア* 属、*エキノコックス* 属、*ディピリジウム・カニナム* 属、*マルチセプス* 属、*ヒメノレピス* 属、*メソセストイデス* 属、*バンピロレピス* 属、*モニエジア* 属、*アノプロケファラ* 属、*シロメトラ* 属、*アノプロケファラ* 属、*ヒメノレピス* 属。

【0157】

式 (I) の化合物およびそれを含む組成物は、双翅目、ノミ目およびマダニ目の害虫の防除に特に有用である。

さらに、式 (I) の化合物およびそれらを含む組成物の蚊の防除への使用は、本発明の一実施形態である。

本発明の化合物およびそれらを含む組成物のハエの防除への使用は、本発明の別の実施形態である。

さらに、本発明の化合物およびそれらを含む組成物のノミの防除への使用は、本発明のさらに別の実施形態である。

本発明の化合物およびそれらを含む組成物のダニ駆除への使用は、本発明のさらに別の実施形態である。

【0158】

本発明の化合物はまた、内部寄生虫 (回虫の線虫、とげ頭虫、プラナリア) の駆除にも特に有用である。

投与は、予防的にも治療的にも行うことができる。

本発明の化合物の投与は、直接的に、または適切な製剤の形態で、経口的に、局所的／

経皮的に、または非経口的に行われる。

【0159】

温血動物への経口投与の場合、本発明の化合物は、動物飼料、動物飼料プレミックス、動物飼料濃縮物、丸薬、溶液、ペースト、懸濁液、ドレンチ、ゲル、錠剤、ボラスおよびカプセルとして製剤化することができる。さらに、本発明の化合物は、飲料水に入れて動物に投与することができる。経口投与の場合、選択された投与形態は、本発明の化合物を1日あたり0.01mg/kg体重～100mg/kg体重、好ましくは0.5mg/kg体重～100mg/kg体重を動物に与えるべきである。

あるいは、本発明の化合物は、非経口的に、例えば、管腔内、筋肉内、静脈内または皮下注射によって動物に投与することができる。本発明の化合物は、皮下注射のために生理学的に許容される担体に分散または溶解することができる。あるいは、本発明の化合物は、皮下投与のためにインプラントに製剤化することができる。さらに、本発明の化合物は、動物に経皮投与することができる。非経口投与の場合、選択された投与剤形は、動物に1日あたり本発明の化合物を0.01mg/kg体重～100mg/kg体重の濃度で与えるべきである。

【0160】

本発明の化合物は、浸漬剤、散剤、粉末、首輪、メダリオン、スプレー、シャンプー、スポットオンおよびポアオン製剤の形態で、また、軟膏または水中油型または油中水型エマルジョンの形態で、動物に局所的に適用することもできる。局所適用の場合、浸漬剤およびスプレーは、通常、0.5ppm～5,000ppm、好ましくは1ppm～3,000ppmの本発明の化合物を含有する。さらに、本発明の化合物は、動物、特にウシおよびヒツジのような四足動物の耳タグとして製剤化することができる。

【0161】

適切な製剤は、経口服液剤、希釈後の経口投与用濃縮液、皮膚または体腔内で使用するための液剤、ポアオン製剤、ゲルなどの溶液；経口または経皮投与用のエマルジョンおよび懸濁液；半固体制剤；活性化合物が軟膏基剤または水中油または油中水エマルジョン基剤で処理される製剤；粉末、プレミックスまたは濃縮物、顆粒、ペレット、錠剤、ボラス、カプセルなどの固体制剤；エアゾールおよび吸入剤、ならびに活性化合物含有成形品である。

【0162】

注射に適した組成物は、活性成分を適切な溶媒に溶解し、必要に応じて酸、塩基、緩衝塩、防腐剤、および可溶化剤などのさらなる成分を添加することによって調製される。溶液は濾過され、滅菌充填される。

【0163】

適切な溶媒は、水、エタノール、ブタノール、ベンジルアルコールなどのアルカノール、グリセロール、プロピレングリコール、ポリエチレングリコール、N-メチルピロリドン、2-ピロリドン、およびそれらの混合物などの生理的に許容される溶媒である。

活性化合物は、必要に応じて、注射に適した生理的に許容される植物油または合成油に溶解することができる。

可溶化剤としては、活性化合物の主溶媒への溶解を促進するか、沈殿を防止する溶媒が適当である。例えば、ポリビニルピロリドン、ポリビニルアルコール、ポリオキシエチル化ヒマシ油、およびポリオキシエチル化ソルビタンエステルである。

保存剤としては、ベンジルアルコール、トリクロロブタノール、p-ヒドロキシ安息香酸エステル、およびn-ブタノールが適当である。

経口溶液は直接投与される。濃縮液は、使用濃度まで事前に希釈した後、経口投与される。経口溶液および濃縮液は、最新の技術に従って、上記の注射溶液と同様に製造され、滅菌操作は必要ない。

皮膚に使用する溶液は、滴下、塗布、擦り込み、散布またはスプレーされる。

皮膚に使用する溶液は、最新の技術に従って、また注射溶液について上述した方法に従って調製され、滅菌操作は必要ない。

10

20

30

40

50

【0164】

さらに適切な溶媒は、ポリプロピレングリコール、フェニルエタノール、フェノキシエタノール、酢酸エチルまたは酢酸ブチルのようなエステル、安息香酸ベンジル、アルキレングリコールアルキルエーテルのようなエーテル、例えばジプロピレングリコールモノメチルエーテル、アセトン、メチルエチルケトンのようなケトン、芳香族炭化水素、植物油および合成油、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、トランスキュトール、ソルケタール、プロピレンカーボネートおよびそれらの混合物である。

【0165】

調製中に増粘剤を添加することが有利な場合がある。適切な増粘剤は、ベントナイト、コロイド状ケイ酸、モノステアリン酸アルミニウムなどの無機増粘剤、セルロース誘導体、ポリビニルアルコールおよびそれらの共重合体、アクリレートおよびメタクリレートなどの有機増粘剤である。

10

【0166】

ゲルは、皮膚に塗布または塗布するか、体腔内に導入する。ゲルは、注射液の場合に記載されたように調製された溶液を、軟膏様の粘稠度を有する透明な物質が得られるのに、十分な増粘剤で処理することによって調製される。使用される増粘剤は、上記の増粘剤である。

【0167】

ポアオン製剤は、皮膚の限られた領域に注いだり、スプレーしたりする。活性化合物は、皮膚に浸透し、全身的に作用する。ポアオン製剤は、活性化合物を適切な皮膚適合性溶媒または溶媒混合物に溶解、懸濁または乳化することによって調製される。必要に応じて、着色剤、生体吸収促進物質、酸化防止剤、光安定剤、接着剤などの他の補助剤が添加される。

20

【0168】

適切な溶媒は、水、アルカノール、グリコール、ポリエチレングリコール、ポリプロピレングリコール、グリセロール、ベンジルアルコール、フェニルエタノール、フェノキシエタノールなどの芳香族アルコール、酢酸エチル、酢酸ブチル、安息香酸ベンジルなどのエステル、ジプロピレングリコールモノメチルエーテル、ジエチレングリコールモノブチルエーテルなどのアルキレングリコールアルキルエーテルなどのエーテル、アセトン、メチルエチルケトンなどのケトン、プロピレンカーボネート、エチレンカーボネートなどの環状炭酸塩、芳香族および／または脂肪族炭化水素、植物油または合成油、DMF、ジメチルアセトアミド、メチルピロリドン、*n*-ブチルピロリドンまたはノクチルピロリドンなどの*n*-アルキルピロリドン、*N*-メチルピロリドン、2-ピロリドン、2,2-ジメチル-4-オキシ-メチレン-1,3-ジオキソランおよびグリセロールホルマーである。

30

【0169】

適切な着色剤は、動物への使用が許可されているすべての着色剤であり、溶解または懸濁させることができる。

適切な吸収促進物質は、例えば、DMSO、ミリスチン酸イソプロピル、ペラルゴン酸ジプロピレングリコール、シリコーン油、およびそれらとポリエーテル、脂肪酸エステル、トリグリセリド、脂肪アルコールとのコポリマーなどの拡散油である。

40

【0170】

適切な酸化防止剤は、亜硫酸塩またはメタ重亜硫酸塩、例えば、メタ重亜硫酸カリウム、アスコルビン酸、ブチルヒドロキシトルエン、ブチルヒドロキシアニソール、トコフェロールである。

【0171】

適切な光安定剤は、例えば、ノバンアンチソール酸である。適切な接着剤は、例えば、セルロース誘導体、デンプン誘導体、ポリアクリレート、アルギン酸塩、ゼラチンなどの天然ポリマーである。エマルジョンは、経口、皮膚または注射として投与することができる。エマルジョンは、油中水型または水中油型のいずれかである。

50

それらは、活性化合物を疎水性または親水性相のいずれかに溶解し、適切な乳化剤および必要に応じて着色剤、吸収促進物質、防腐剤、酸化防止剤、光安定剤、粘度向上物質などの他の補助剤の助けを借りて、他方の相の溶媒と均質化することによって調製される。

【0172】

適切な疎水性相（油）は、以下の通りである：

液状パラフィン、シリコン油、ゴマ油、アーモンド油、ヒマシ油などの天然植物油、カプリル／カプリン酸ビグリセリドなどの合成トリグリセリド、鎖長C₈－C₁₂の植物性脂肪酸または他の特別に選択された天然脂肪酸とのトリグリセリド混合物、ヒドロキシル基を含むことがある飽和脂肪酸または不飽和脂肪酸の部分グリセリド混合物、C₈－C₁₈脂肪酸のモノおよびジグリセリド、ステアリン酸エチル、アジピン酸ジ-n-ブチル、ラウリン酸ヘキシル、ジプロピレングリコールパーラルゴネートなどの脂肪酸エステル、鎖長C₁₆－C₁₈の飽和脂肪酸アルコールとの中鎖長の分岐脂肪酸のエステル、ミリスチン酸イソプロピル、パルミチン酸イソプロピル、鎖長C₁₂－C₁₈の飽和脂肪酸のカプリル／カプリン酸エステル、ステアリン酸イソプロピル、オレイン酸オレイル、オレイン酸デシル、オレイン酸エチル、乳酸エチル、合成アヒル尾骨腺脂肪などのワックス脂肪酸エステル、フタル酸ジブチル、アジピン酸ジイソプロピル、および後者に関連するエステル混合物、イソトリデシルアルコール、2-オクチルドデカノール、セチルステアリルアルコール、オレイルアルコールなどの脂肪酸、およびオレイン酸などの脂肪酸およびそれらの混合物。適切な親水性相は、水、プロピレングリコール、グリセロール、ソルビトールなどのアルコールおよびそれらの混合物である。

【0173】

適切な乳化剤は、非イオン界面活性剤、例えばポリエトキシ化ヒマシ油、ポリエトキシ化ソルビタンモノオレート、ソルビタンモノステアレート、グリセロールモノステアレート、ポリオキシエチルステアレート、アルキルフェノールポリグリコールエーテル、両性界面活性剤、例えば、N-ラウリル-p-イミノジプロピオン酸ジナトリウムやレシチンなどである。

【0174】

適切なアニオン界面活性剤は、ラウリル硫酸ナトリウム、脂肪アルコールエーテル硫酸塩、モノ／ジアルキルポリグリコールエーテルオルトリン酸エステルモノエタノールアミン塩であり、適切なカチオン活性界面活性剤は、塩化セチルトリメチルアンモニウムである。

【0175】

適切なさらなる助剤は、カルボキシメチルセルロース、メチルセルロースおよび他のセルロースおよびデンプン誘導体、ポリアクリレート、アルギン酸塩、ゼラチン、アラビアゴム、ポリビニルピロリドン、ポリビニルアルコール、メチルビニルエーテルと無水マレイン酸の共重合体、ポリエチレングリコール、ワックス、コロイド状ケイ酸、または上記の物質の混合物など、粘度を高めてエマルジョンを安定化する物質である。

【0176】

懸濁液は、経口または局所／皮膚に投与することができる。これらは、必要に応じて、湿潤剤、着色剤、生体吸収促進物質、防腐剤、酸化防止剤、光安定剤などの他の助剤を添加して、活性化合物を懸濁剤に懸濁させることによって調製される。

液体懸濁剤は、すべて均一な溶媒および溶媒混合物である。

適切な湿潤剤（分散剤）は、上記の乳化剤である。

言及され得る他の助剤は、上記のものである。

半固形製剤は、経口または局所／皮膚に投与することができる。それらは、より高い粘度のみが上記の懸濁液および乳剤と異なる。

固形製剤の製造には、活性化合物を適切な賦形剤と混合し、必要に応じて助剤を添加し、所望の形態にする。

【0177】

適切な賦形剤は、生理的に許容される全ての固体不活性物質である。使用されるものは

、無機および有機物質である。無機物質は、例えば、塩化ナトリウム、炭酸カルシウムなどの炭酸塩、炭酸水素塩、酸化アルミニウム、酸化チタン、ケイ酸、粘土質土、沈降またはコロイド状シリカ、またはリン酸塩である。有機物質は、例えば、砂糖、セルロース、粉乳、動物ミール、穀物ミールおよび細片、デンプンなどの食品および飼料である。

【0178】

適切な助剤は、上述した防腐剤、酸化防止剤および／または着色剤である。

他の適切な助剤は、ステアリン酸マグネシウム、ステアリン酸、タルク、ベントナイトなどの潤滑剤および滑剤、デンプンまたは架橋ポリビニルピロリドンなどの崩壊促進物質、デンプン、ゼラチンまたは線状ポリビニルピロリドンなどの結合剤、および微結晶セルロースなどの乾燥結合剤である。

10

【0179】

一般に、「寄生虫駆除有効量」とは、標的生物の死亡、遅延、予防、除去および破壊、またはその他の方法での発生および活性の減少を含む、成長に対する観察可能な効果を達成するために必要な有効成分の量を意味する。寄生虫駆除有効量は、本発明で使用される様々な化合物／組成物に対して変化することができる。組成物の寄生虫駆除有効量は、所望の寄生虫駆除効果および持続時間、標的種、適用方法などの一般的な条件によっても変化する。本発明において使用できる組成物は、通常、約0.001～95%の本発明の化合物を含む。

【0180】

一般に、一日当たり0.5mg/kg～100mg/kg、好ましくは1mg/kg～50mg/kgの総量で本発明の化合物を適用することが好ましい。既製製剤は、10ppm～80重量%、好ましくは0.1～65重量%、より好ましくは1～50重量%、最も好ましくは5～40重量%の濃度で、寄生虫、好ましくは外部寄生虫に対して作用する化合物を含む。製剤は、0.5～90重量%、好ましくは1～50重量%の濃度で、外部寄生虫に対して作用する化合物を含み、使用前に希釈される。さらに、製剤は、10ppm～2重量%、好ましくは0.05～0.9重量%、特に好ましくは0.005～0.25重量%の濃度で、内部寄生虫に対して本発明の化合物を含む。

20

一実施形態では、本発明の化合物を含む組成物は、経皮／局所に適用される。

【0181】

別の実施形態では、局所適用は、首輪、メダリオン、耳タグ、体の一部に固定するためのバンド、接着ストリップおよびホイルのような化合物を含む成形品の形態で行われる。

30

一般に、本発明の化合物、を合計量で、10mg/kg～300mg/kg、好ましくは20mg/kgから200mg/kg、最も好ましくは25mg/kgから160mg/kg体重の治療動物に三週間の間に放出する固体製剤を適用することが好ましい。

成形品の製造には、熱可塑性プラスチックおよび柔軟性プラスチック、ならびにエラストマーおよび熱可塑性エラストマーが使用される。適切なプラスチックおよびエラストマーは、本発明の化合物と十分に適合するポリビニル樹脂、ポリウレタン、ポリアクリレート、エポキシ樹脂、セルロース、セルロース誘導体、ポリアミドおよびポリエステルである。プラスチックおよびエラストマーの詳細なリストならびに成形品の製造手順は、例えばWO2003/086075に示されている。

40

【0182】

デジタル技術

本発明の化合物は、例えば、サイト固有の作物管理、衛星農業、精密農業または精密農業のためのコンピュータプログラムに組み込まれたモデルと組み合わせて使用することができる。そのようなモデルは、収益性、持続可能性および環境保護を最適化する目的で、土壌、天候、作物（種類、生育段階、植物の健康状態など）、雑草（種類、成長段階など）、病気、病害虫、栄養素、水、水分、バイオマス、衛星データ、収穫量などの様々なソースからのデータを用いて、農業サイトのサイト固有の管理をサポートする。特に、そのようなモデルは、農業上の決定を最適化し、農薬散布の精度を制御し、実行された作業を記録するのに役立つ。

50

【0183】

一例として、モデルが害虫の発生をモデル化し、本発明の化合物を作物に適用することが推奨される閾値に達したと計算した場合、本発明の化合物は、適切な用量体系に従って作物に適用することができる。

農業モデルを含む市販のシステムは、例えば、The Climate CorporationのFieldScripts™, BASFのXarvio™, John DeereのAGLogic™などがある。

【0184】

本発明の化合物は、例えば、トラクター、ロボット、ヘリコプター、飛行機、ドローンなどの無人航空機（UAV）などの農業車両に取り付けられたか、またはその中に収容されたスポット散布または精密散布装置などのスマート散布装置と組み合わせて使用することもできる。そのような装置は、通常、入力センサ（例えばカメラなど）と、入力データを分析し、入力データの分析に基づいて、本発明の化合物を特定かつ正確な方法で作物（または雑草）に適用する決定を与えるように構成された処理ユニットとを含む。このようなスマート散布装置の使用には、通常、記録されたデータを特定し、農業車両を誘導または制御するための位置システム（例えばGPS受信機）も必要である。理解しやすい地図上に情報を表すための地理情報システム（GIS）、および散布などの必要な農業活動を実行するための適切な農業車両も必要となる。

10

【0185】

一例として、害虫は、カメラによって取得された画像から検出することができる。一例において、害虫は、その画像に基づいて識別および／または分類することができる。そのような識別および／または分類は、画像処理アルゴリズムを利用することができる。そのような画像処理アルゴリズムは、訓練されたニューラルネットワーク、決定木および人工知能アルゴリズムなどの機械学習アルゴリズムを利用することができる。このようにして、本明細書に記載される化合物は、必要な場合にのみ適用することができる。

20

【0186】

正の作物応答：

本発明の化合物は、昆虫およびダニの害虫を効果的に防除するだけでなく、根の成長の強化、干ばつ、高塩分、高温、低温、霜または光照射に対する耐性の強化、開花の改善、栄養素の利用の強化（窒素同化の改善など）、高品質の植物製品、生産性の高い分けつの数の増加、害虫に対する抵抗性が強化され、その結果、収穫量が増加し、正の作物応答を示す。

30

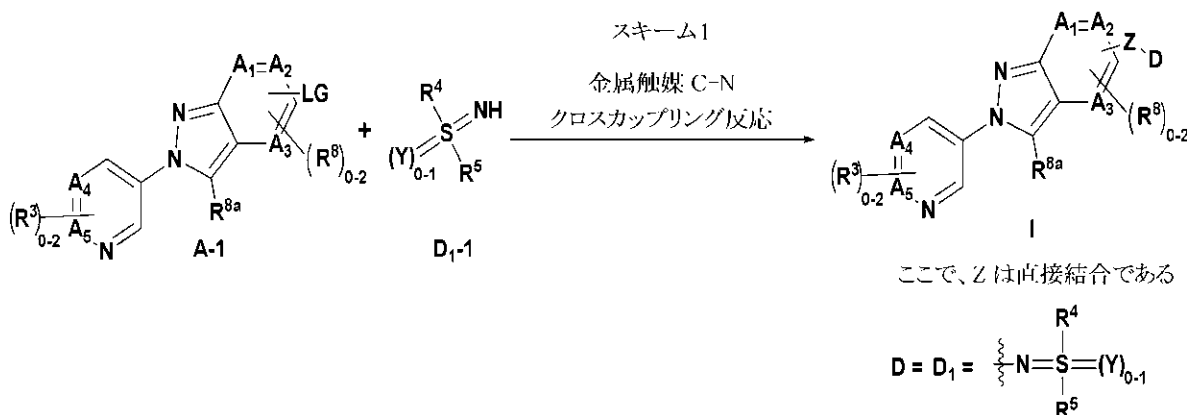
【0187】

一般的な合成スキーム：

次に、本発明を以下の例によってさらに詳細に説明するが、これらに限定されるものではない。

【化10】

スキーム1：



40

【0188】

50

好ましい実施形態の一つにおいて、式 (I) (式中、D は D₁ を表し、Z は直接結合である) の化合物は、式 A-1 (式中、LG は脱離基を表す) の化合物と、式 D₁-1 の化合物との間の金属触媒クロスカップリング反応によって、文献 US 20190297887 およびそこに引用されたさらなる文献に記載された手順に従って、調製することができる。式 D₁-1 の化合物は、市販されているか、または Chem Eur. J. 2021, 27, 17293-17321, European Journal of Medicinal Chemistry 2017, 126, 225-245, Chem. Commun., 2017, 53, 348-351, J. Am. Chem. Soc. 2020, 142 (36), 15445-15453 およびそこに引用されたさらなる文献に記載されている方法によって合成することができる。特に明記しない限り、各変数の定義は式 (I) の化合物について上記で定義された通りである。

10

【0189】

C-N カップリング反応は通常、溶媒の存在下で行われ、反応に悪影響を及ぼさない限り、この反応に使用できる溶媒は特に限定されない。例えば、ジオキサン、テトラヒドロフラン、エチレングリコール、ジメチルエーテルおよびジエチレングリコールジメチルエーテルのようなエーテル；ベンゼン、トルエンおよびキシレンのような芳香族炭化水素；N, N-ジメチルホルムアミド、N-ジメチルアセトアミドおよび1-メチル-2-ピロリドンのようなN-アミド；メタノール、エタノール、プロパノール、ブタノール、2-プロパノールおよび2-メチル-2-プロパノールのようなアルコール；アセトニトリルのようなニトリル；または水またはその混合物がこの目的に役立つ。好ましい溶媒には、トルエンおよびキシレンのような芳香族炭化水素、N, N-ジメチルホルムアミド、N, N-ジメチルアセトアミドおよび1-メチル-2-ピロリドンのようなアミドが挙げられ、N, N-ジメチルホルムアミドおよびトルエンが最も好ましい。反応は、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウムtert-ブトキシドおよびナトリウムtert-ブトキシドのような金属アルコキシド、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウム、リン酸ナトリウム、リン酸カリウム、リン酸水素カリウムおよび水素化カリウムのような無機塩基；トリエチルアミン、N, N-ジイソプロピルエチルアミンおよびピリジンのような有機塩基から選択される塩基の存在下で行われるが、これらに限定されない。好ましい塩基としては、カリウムtert-ブトキシド、ナトリウムtert-ブトキシドのような金属アルコキシドが挙げられる。この反応に使用できるパラジウム触媒としては、パラジウム-炭素、塩化パラジウムのような無機パラジウム塩；酢酸パラジウムのような有機パラジウム錯体；テトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(0)、ビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(II)クロリド、1, 1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)フェニルパラジウム(II)クロリドおよびトリス(ジベンジリデンアセトン)ジパラジウム(0)；およびポリマー担持ビス(アセタート)トリフェニルホスフィンパラジウム(II)、ポリマー担持ジ(アセタート)ジシクロヘキシルホスフィンパラジウム(II)などのポリマー固定化有機パラジウム錯体などが挙げられるが、これらに限定されない。パラジウム触媒としては、塩化パラジウム、酢酸パラジウム、テトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(0)、ビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(II)クロリド、1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)フェニルパラジウム(II)クロリドおよびトリス(ジベンジリデンアセトン)ジパラジウム(0)などがより好ましい。この反応に使用することができるリガンドの例としては、限定されるものではないが、トリス(o-トリル)ホスフィン、トリシクロヘキシルホスフィン、トリ-tert-ブチルホスホニウムテトラフルオロボレート、(オキシジ-2, 1-フェニレン)ビス[ジシクロヘキシル]ホスフィン、4, 5-ビス(ジフェニルホスフィノ)-9, 9-ジメチルキサンテン、2-ジシクロヘキシルホスフィノ-2', 4', 6'-トリイソプロピルビフェニル、2-ジシクロヘキシルホスフィノ-2', 6'-ジイソプロポキシビフェニル、2-ジ-tert-ブチルホスフィノ-2', 4', 6'-トリイソプロピルビフェニル、2-ジ-tert-ブチルホスフィノ-3, 4, 5, 6-テトラメ

20

30

40

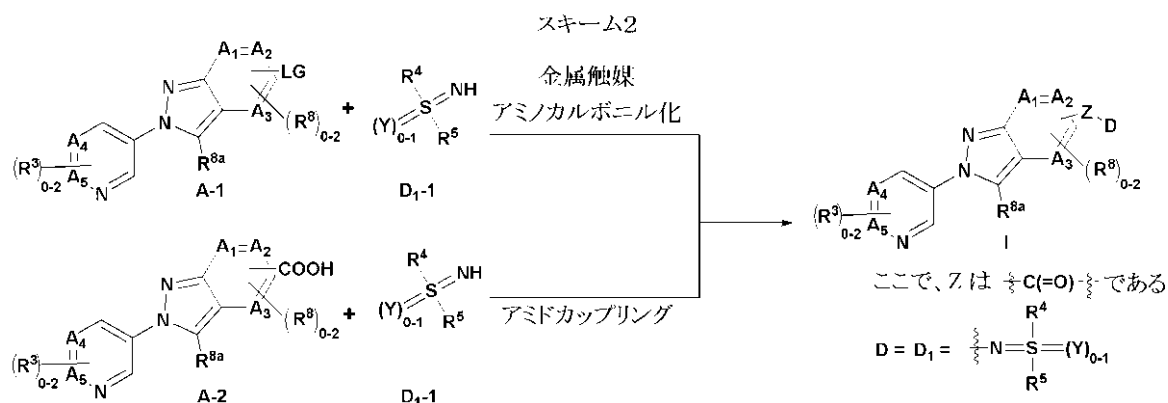
50

チル-2', 4', 6'-トリイソプロピル-1, 1'-ビフェニル、(2-ビフェニル)ジ-tert-ブチルホスフィン、2-(ジ-tert-ブチルホスフィノ)ビフェニル、2-ジ-tert-ブチルホスフィノ-3, 4, 5, 6-テトラメチル-2', 4', 6'-トリイソプロピル-1, 1'-ビフェニル、1, 1'-フェロセンジイル-ビス(ジフェニルホスフィン)、2-ジ-tert-ブチルホスフィノ-2'-メチルビフェニル、2'-メチル-2'-ジシクロヘキシルホスフィノビフェニルおよび[1, 1'-ビフェニル]-3-スルホン酸、2'-(ジシクロヘキシルホスフィノ)-2, 6-ジメトキシナトリウム塩が挙げられるが、これらに限定されない。好ましいリガンドとしては、2-(ジ-tert-ブチルホスフィノ)ビフェニル、2-ジ-tert-ブチルホスフィノ-3, 4, 5, 6-テトラメチル-2', 4', 6'-トリイソプロピル-1, 1'-ビフェニル (0)、オキシジ-2, 1-フェニレン)ビス[ジシクロヘキシル]ホスフィン、1, 1'-フェロセンジイル-ビス(ジフェニルホスフィンおよび4, 5-ビス(ジフェニルホスフィノ))-9, 9-ジメチルキサンテンが挙げられる。反応は、0~200℃の範囲の温度で、好ましくは50~150℃の範囲の温度で、30分~24時間の範囲の期間で行うことができる。

【0190】

【化11】

スキーム2:



20

30

【0191】

別の好ましい実施形態では、式(I) (式中、DはD₁を表し、Zは-C=Oである)の化合物は、金属触媒アミノカルボニル化反応によって、または式A-1 (アミドカップリング反応についてはA-2) (式中、LGは脱離基を表す)の化合物と式D₁-1の化合物との間のアミドカップリング反応によって、WO2016144351, Chem. Eur. J. 2021, 27, 17293-17321およびそこに引用されたさらなる文献に記載されている手順に従って製造することができる。式D₁-1の化合物は、市販されているか、またはChem. Eur. J. 2021, 27, 17293-17321, European Journal of Medicinal Chemistry 2017, 126, 225-245, Chem. Commun., 2017, 53, 348-351, J. Am. Chem. Soc. 2020, 142, 36, 15445-15453およびそこに引用されたさらなる文献に記載の方法によって合成できる。別段の記載がない限り、各変数の定義は式(I)の化合物について上記で定義された通りである。

40

【0192】

スキーム2に示されているような金属触媒アミノカルボニル化反応は、N-アミドなどの溶媒の存在下で行われるが、これらに限定されない。例えば、N, N-ジメチルホルムアミド、N-ジメチルアセトアミドおよび1-メチル-2-ピロリドンが挙げられる。N, N-ジメチルホルムアミドが好ましい溶媒である。この反応において「CO代替物」として機能する金属ヘキサカルボニルは、モリブデンヘキサカルボニルおよびタングステンヘキサカルボニルから選択されるが、これらに限定されない。反応は、限定されないが、水素化ナトリウム、水素化リチウムおよび水素化カリウムなどの金属水素化物、炭酸ナト

50

リウム、炭酸カリウム、炭酸セシウムなどの金属炭酸塩；トリエチルアミン、N，N－ジイソプロピルエチルアミン、1，8－ジアザビシクロ〔5．4．0〕ウンデカ－7－エンなどの有機アミン塩基；および好ましくは、N，N－ジイソプロピルエチルアミンおよび1，8－ジアザビシクロ〔5．4．0〕ウンデカ－7－エンなどの有機アミンから選択される塩基の存在下で行われる。この反応に使用できる触媒としては、限定されるものではないが、例えば、ポリマー担持ビス（アセタト）トリフェニルホスフィンパラジウム（II）、trans－ジμ－アセタトビス〔2－〔ビス（2－メチルフェニル）ホスフィノ〕ベンジル〕ジパラジウム、およびポリマー担持（アセタト）ジシクロヘキシルホスフィンパラジウム（II）などの有機パラジウム錯体が挙げられる。この反応に使用される配位子の一例は、テトラフルオロホウ酸トリ－tert－ブチルホスホニウムである。この反応は、典型的には0～200℃、好ましくは50～180℃の温度範囲で30分～24時間の範囲で行われる。この反応は、マイクロ波照射条件下でも任意に行うことができる。

10

【0193】

スキーム2に示すようなアミドカップリング反応は、通常、N－アミド、例えばN，N－ジメチルホルムアミド、N－ジメチルアセトアミドおよび1－メチル－2－ピロリドンなどの溶媒の存在下で行われるが、これらに限定されない。N，N－ジメチルホルムアミドが好ましい溶媒である。さらに、これらの反応は、トリエチルアミン、N，N－ジイソプロピルエチルアミン、1，8－ジアザビシクロ〔5．4．0〕ウンデカ－7－エンなどの有機アミン塩基から選択される塩基の存在下で行われるが、これらに限定されるものではなく、トリエチルアミンおよびN，N－ジイソプロピルエチルアミンが好ましい塩基である。この反応に使用できるカップリング試薬は、N，N’－ジシクロヘキシルカルボジイミド、1－〔3－（ジメチルアミノ）プロピル〕－3－エチルカルボジイミドメチオジド、1－ヒドロキシベンゾトリアゾール水和物、1－〔ビス（ジメチルアミノ）メチレン〕－1H－1，2，3トリアゾロ〔4，5－b〕ピリジニウム3－オキシドヘキサフルオロホスファート、およびN－〔（ジメチルアミノ）－1H－1，2，3トリアゾロー〔4，5－b〕ピリジン－1－イルメチレン〕－N－メチルメタナミニウムヘキサフルオロホスファートN－オキシドであるが、これらに限定されない。この反応は、0～200℃の範囲の温度で、好ましくは0～50℃で、30分～24時間の範囲で行うことができる。

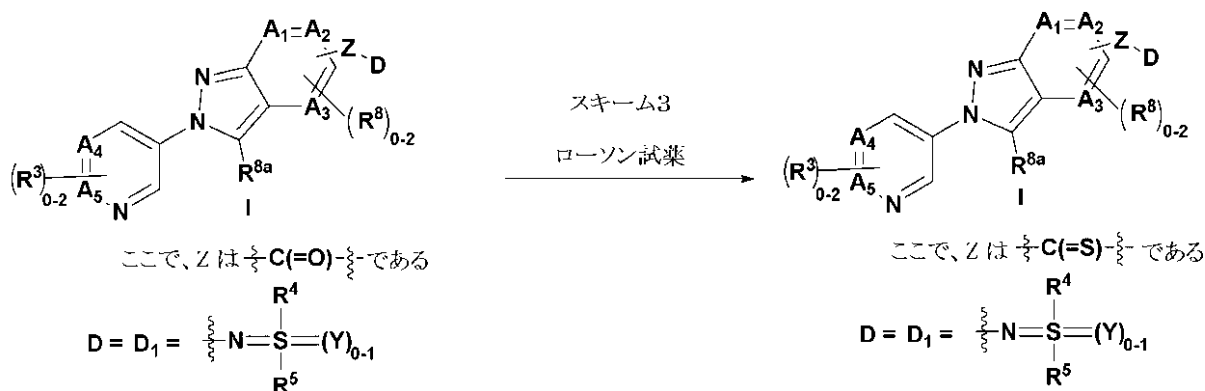
20

【0194】

【化12】

スキーム3:

30



40

【0195】

別の好ましい実施形態では、式（I）（式中、DはD₁を表し、Zは－C＝Sである）の化合物は、文献Chem.Sci., 2021, 12, 6393-6405およびそこに引用されているさらなる文献に記載されているように、適切なチオアシル化反応条件下で、ローソン試薬の存在下製造することができる。別段の記載がない限り、各変数の定義は、式（I）の化合物について上記で定義されているとおりである。スキーム3に示す、チオアシル化反応は、ベンゼン、トルエンおよびキシレンのような芳香族炭化水素のような溶媒の存在下で

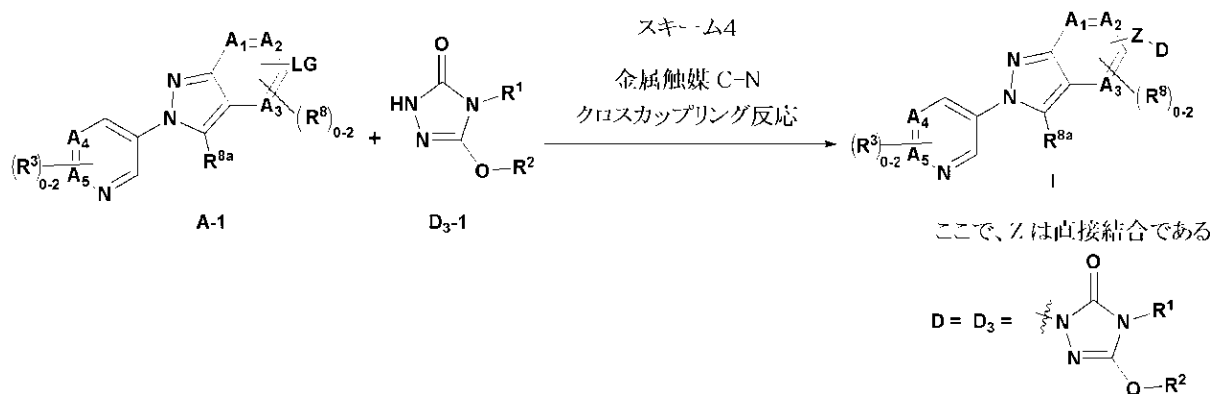
50

行われるが、これらに限定されない。好ましくはトルエン中で行われる。この反応は、0～200℃の範囲の温度で、好ましくは50～150℃の温度で、30分～24時間の範囲で行うことができる。

【0196】

【化13】

スキーム4:



10

【0197】

別の好ましい実施形態では、式(I) (式中、DはD₃を表し、Zは直接結合を表す)の化合物は、式A-1 (式中、LGは脱離基を表す)の化合物と式D₃-1のアルコキシトリゾロンとの間の金属触媒クロスカップリング反応によって、US 20190297887の文献およびそこに引用されたさらなる文献に記載された手順に従って製造することができる。式D₃-1のアルコキシトリゾロンは、市販されているか、またはUS 005606070Aおよびそこに引用されたさらなる文献に記載されている方法によって合成することができる。別段の記載がない限り、各変数の定義は、式(I)の化合物について上述したとおりである。

20

【0198】

反応は、限定されるものではないが、ジオキサン、テトラヒドロフラン、2-メチル-テトラヒドロフラン、エチレングリコールジメチルエーテルおよびジエチレングリコールジメチルエーテルなどのエーテル、ベンゼン、トルエンおよびキシレンなどの芳香族炭化水素；N，N-ジメチルホルムアミド、N-ジメチルアセトアミドおよび1-メチル-2-ピロリドンのようなN-アミド；メタノール、エタノール、プロパノール、ブタノール、2-プロパノール、2-メチル-2-プロパノールおよび2-メチル-2-ブタノールのようなアルコール；アセトニトリルのようなニトリル；および水またはそれらの混合物などの溶媒の存在下で行われる。好ましい溶媒には、N，N-ジメチルホルムアミド、N，N-ジメチルアセトアミドおよび1-メチル-2-ピロリドンのようなアミドおよびメタノール、エタノール、プロパノール、ブタノール、2-プロパノール、2-メチル-2-ブタノールおよび2-メチル-2-プロパノールのようなアルコール、N，N-ジメチルホルムアミド、および2-メチル-2-ブタノールなどが挙げられる。

30

この反応に使用できる塩基としては、限定されないが、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウムtert-ブトキシドおよびナトリウムtert-ブトキシドのような金属アルコキシド、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウム、リン酸ナトリウム、リン酸カリウム、リン酸水素カリウムおよび水素化カリウムのような無機塩基、およびトリエチルアミン、N，N-ジイソプロピルエチルアミンおよびピリジンのような有機塩基等が挙げられるが、これらに限定されない。好ましい塩基としては、リン酸ナトリウム、リン酸カリウム、リン酸水素カリウムなどのリン酸塩、炭酸ナトリウム、炭酸カリウムおよび炭酸セシウムなどの炭酸塩が挙げられる。

40

【0199】

ここで、炭酸ナトリウム、炭酸カリウムおよび炭酸セシウムのような炭酸塩がより好ま

50

しい塩基である。この反応に使用できるパラジウム触媒には、パラジウム-炭素、塩化パラジウムのような無機パラジウム塩；酢酸パラジウムのような有機パラジウム錯体；テトラキス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（0）、ビス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（II）クロリド、1, 1'-ビス（ジフェニルホスフィノ）フェニルパラジウム（II）クロリドおよびトリス（ジベンジリデンアセトン）ジパラジウム（0）；ポリマー担持ビス（アセタート）トリフェニルホスフィンパラジウム（II）およびポリマー担持ジ（アセタート）ジシクロヘキシルホスフィンパラジウム（II）のようなポリマー固定化有機パラジウム錯体が挙げられるが、これらに限定されない。パラジウム触媒としては、塩化パラジウム、酢酸パラジウム、テトラキス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（0）、ビス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（II）クロリド、1'-ビス（ジフェニルホスフィノ）フェニルパラジウム（II）クロリドおよびトリス（ジベンジリデンアセトン）ジパラジウム（0）などのパラジウム触媒がより好ましい。

10

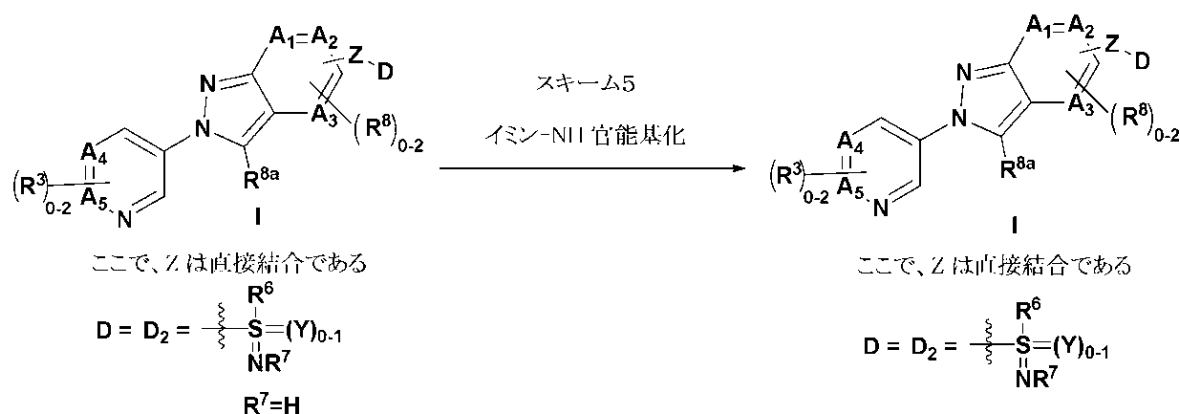
【0200】

この反応に使用することができるリガンドの例としては、トリス（o-トリル）ホスフィン、トリシクロヘキシルホスフィン、トリ-tert-ブチルホスホニウムテトラフルオロボレート、（オキシジ-2, 1-フェニレン）ビス[ジシクロヘキシル]ホスフィン、4, 5-ビス（ジフェニルホスフィノ）-9, 9-ジメチルキサンテン、2-ジシクロヘキシルホスフィノ-2'-（N, N-ジメチルアミノ）ビフェニル、2-ジシクロヘキシルホスフィノ-2', 4', 6'-トリイソプロピルビフェニル、2-ジシクロヘキシルホスフィノ-2', 6'-ジメトキシビフェニル、5-（ジ-tert-ブチルホスフィノ）-1', 3', 5'-トリフェニル-1'-H-[1, 4']ビピラゾール、5-（ジシクロヘキシルホスフィノ）-1', 3', 5'-トリフェニル-1'-H-[1, 4']ビピラゾール、5-[ジ（1-アダマンチル）ホスフィノ]-1', 3', 5'-トリフェニル-1'-H-[1, 4']ビピラゾール、2-ジシクロヘキシルホスフィノ-2', 6'-ジイソプロポキシビフェニル、2-ジ-tert-ブチルホスフィノ-2', 4', 6'-トリイソプロピルビフェニル、2-ジ-tert-ブチルホスフィノ-3, 4, 5, 6-テトラメチル-2', 4', 6'-トリイソプロピル-1, 1'-ビフェニル、（2-ビフェニルイル）ジ-tert-ブチルホスフィン、2-（ジ-tert-ブチルホスフィノ）ビフェニル、2-ジ-tert-ブチルホスフィノ-3, 4, 5, 6-テトラメチル-2', 4', 6'-トリイソプロピル-1, 1'-ビフェニル、1, 1'-フェロセンジイル-ビス（ジフェニルホスフィン）、2-ジ-tert-ブチルホスフィノ-2'-メチルビフェニル、2-メチル-2'-ジシクロヘキシルホスフィノビフェニル、[1, 1'-ビフェニル]-3-スルホン酸、2'-（ジシクロヘキシルホスフィノ）-2, 6-ジメトキシ-ナトリウム塩などが挙げられるがこれらに限定されない。好ましいリガンドは、2-（ジ-tert-ブチルホスフィノ）ビフェニル、5-（ジ-tert-ブチルホスフィノ）-1', 3', 5'-トリフェニル-1'-H-[1, 4']ビピラゾール、5-（ジシクロヘキシルホスフィノ）-1', 3', 5'-トリフェニル-1'-H-[1, 4']ビピラゾール、5-[1, 4']-1', 3', 5'-トリフェニル-1'-H-（ジ（1-アダマンチル）ホスフィノ、1, 1'-フェロセンジイル-ビス（ジフェニルホスフィン及び4, 5-イス（ジフェニルホスフィノ）-9, 9-ジメチルキサンテンが挙げられる。反応は、0～200℃の範囲の温度、好ましくは50～150℃で、30分～24時間の範囲の持続時間で行われる。

40

【0201】

【化 1 4】
スキーム 5:



10

【0202】

別の好ましい実施形態において、DがD₂を表し、Zが直接結合を表し、そしてR⁷が水素を表す式(I)の化合物は、N-(ハロ)アルキル化、N-(ヘテロ)アリアル化、N-アシル化、N-アミド化、N-ハロゲン化、およびN-シアン化などの反応を使用して、限定されるものではないが、イミン-NH官能基でさらに誘導体化され、DがD₂を表し、Zが直接結合を表し、そしてR⁷が水素を除くその通常の意味を表す式(I)の化合物を、例えば、European Journal of Medicinal Chemistry 2017, 126, 225-245, Org. Lett. 2015, 17, 12, 3166-3169, Tetrahedron Letters 56 (2015) 7056-7058, Eur. J. Org. Chem. 2012, 20, 3737-3741、およびWO 2019/150219、およびそこに引用されたさらなる文献に記載されている適切な方法に従って形成することができる。別段の記載がない限り、各変数の定義は上記のように定義される。

20

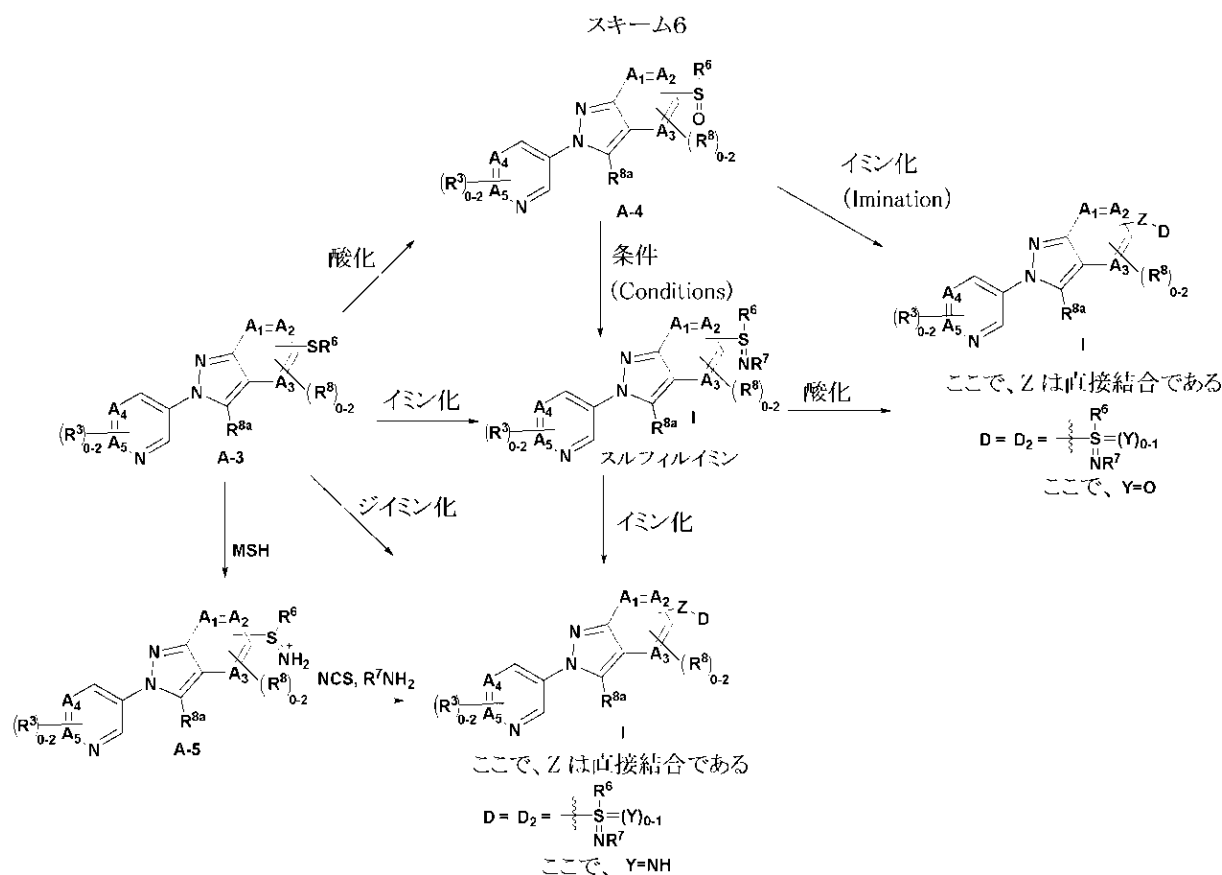
【0203】

30

40

50

【化 1 5】
スキーム-6:



10

20

30

40

50

【0204】

別の好ましい実施形態では、式（I）で表される化合物の様々な硫黄含有代表物、例えば、限定されないが、スルホキシイミン、スルフィリイミン、およびスルホンジイミド（式中、DはD₂を表し、Zは直接結合であり、R⁷は本明細書で上記に定義される通りである）は、文献、例えばEuropean Journal of Medicinal Chemistry 2017, 126, 225-245およびChem. Commun., 2017, 53, 348-351、およびそこに引用されるさらなる文献に記載された手順に従って、式A-3の化合物から出発して製造することができる。特に明記しない限り、各変数の定義は、式（I）の化合物について上記で定義された通りである。式（I）のスルホキシイミンは、式A-3の硫化物から出発して、アンモニウムカルバメートおよびジアセトキシヨードベンゼンの存在下で製造することができる（例えば、Angew. Chem. Int. Ed. 2016, 55, 7203-7207を参照）。あるいは、スルホキシイミン（I）は、スルフィリイミン（I）の酸化によっても合成することができる（例えば、Chem. Rev. 1977, 77, 409-435を参照）。一方、式（I）のスルフィリイミンは、文献、例えばAngew. Chem. Int. Ed. 2012, 51, 4440-4443およびそこに引用されているさらなる文献に記載されている手順に従い、求電子アミノ化試薬、例えばO-（メチルスルホニル）ヒドロキシルアミン（MSH）またはO-（2,4-ジニトロフェニル）ヒドロキシルアミン（DPH）を用いたイミノ化反応によって、式（A-3）の硫化物から得ることができる。式（I）のスルフィリイミンは、式（A-4）のスルホキシドから、a) 文献、例えばAdv. Synth. Catal. 2013, 355, 3363-3368およびそこに引用されているさらなる文献に記載されているバージェス型試薬、またはb) 文献、例えばChem. Commun., 2014, 50, 9687-9689およびそこに引用されているさらなる文献に記載されているO-（メチルスルホニル）ヒドロキシルアミン（MSH）またはO-（2,4-ジニトロフェニル）ヒドロキシルアミン（DPH）などの求電子アミノ化試薬の存在下でのロジウム触媒条件のいずれかを使用したイミン化によっても調製で

きる。式 (I) のスルホンジイミドは、a) 文献、例えば Chem. Ber. 1984, 117, 2779-2784 およびそこに引用されているさらなる文献に記載されているように、式 A-3 の硫化物の直接イミノ化、または b) 文献、例えば Angew. Chem. Int. Ed. 2012, 51, 4440-4443 およびそこに引用されているさらなる文献に記載されているように、式 (I) のスルフィリイミンのイミノ化、または c) 文献、例えば Angew. Chem. Int. Ed. 2012, 51, 4440-4443 およびそこに引用されているさらなる文献に記載されているように、N-クロロスクシンイミドおよびアミンを使用して、式 A-5 で表されるスルフィリミニウム塩のイミノ化のいずれかを使用して合成することができる。

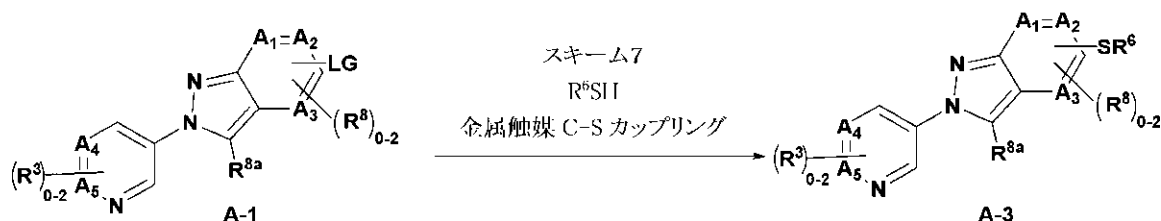
【0205】

本発明の特徴によれば、すべての置換基が先に定義されたとおりである式 A-3 の化合物は、スキーム 7、スキーム 8、スキーム 9 に示される方法または実験例に開示されている方法によって製造することができる。代表的な手順を以下に示す。しかしながら、この開示は、式 A-3 の化合物を合成するための本発明の範囲を限定するものとして解釈されるべきではない。

【0206】

【化 16】

スキーム-7:



【0207】

スキーム 7 によれば、式 A-3 で表される化合物は、WO 2020 257145 およびそこに引用されたさらなる文献に記載されているように、式 A-1 の化合物と式 R⁶SH のチオールとの間の塩基媒介金属触媒 C-S カップリング反応によって調製することができる。式 R⁶SH のチオールは市販されている。別段の記載がない限り、変数 A₁、A₂、A₃、A₄、A₅、R³、R⁶、R⁸ および R^{8a} の各々の定義は上記のとおりである。LG は、ハロゲンまたはトシラートなどの脱離基を表す。

【0208】

C-S カップリングの一般的なプロトコル：反応は通常、ジオキサン、テトラヒドロフラン、2-メチル-テトラヒドロフラン、メチレングリコールジメチルエーテルおよびジエチレングリコールジメチルエーテルなどのエーテル；ベンゼン、トルエンおよびキシレンなどの芳香族炭化水素；N，N-ジメチルホルムアミド、N-ジメチルアセトアミドおよび1-メチル-2-ピロリドンなどのN-アミド；メタノール、エタノール、プロパノール、ブタノール、2-プロパノール、2-メチル-2-プロパノールおよび2-メチル-2-ブタノールなどのアルコール；アセトニトリルなどのニトリル；および水またはそれらの混合物などの溶媒の存在下で行われる。好ましい溶媒には、N，N-ジメチルホルムアミド、N，N-ジメチルアセトアミドおよび1-メチル-2-ピロリドンなどのアミド、およびベンゼン、トルエンおよびキシレンなどの芳香族炭化水素が含まれる。N，N-ジメチルホルムアミドおよびトルエンが最も好ましい溶媒である。反応は、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウムtert-ブトキシド、およびナトリウムtert-ブトキシドなどの金属アルコキシド、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウム、リン酸ナトリウム、リン酸カリウム、リン酸水素カリウム、および水素化カリウムなどの無機塩基、およびトリエチルアミン、N，N-ジイソプロピルエチルアミンおよびピリジンなどの有機塩基から非限定的に選択される塩基の存在下で行われる。好ましい塩基には、ナトリウムメトキシド、

ナトリウムエトキシド、カリウム *tert*-ブトキシド、ナトリウム *tert*-ブトキシドなどの金属アルコキシド、および炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、および炭酸セシウムなどの炭酸塩が含まれる。ここで、炭酸セシウムなどの炭酸塩およびナトリウム *tert*-ブトキシドおよびカリウム *tert*-ブトキシドなどの金属アルコキシドが最も好ましい。この反応に使用できるパラジウム触媒は、例えば、パラジウム-炭素；塩化パラジウムなどの無機パラジウム塩；酢酸パラジウムなどの有機パラジウム錯体；テトラキス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（0）、ビス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（II）クロリド、1, 1'-ビス（ジフェニルホスフィノ）フェニルパラジウム（II）クロリドおよびトリス（ジベンジリデンアセトン）ジパラジウム（0）；などの有機パラジウム錯体およびポリマー担持ビス（アセタート）トリフェニルホスフィンパラジウム（II）およびポリマー担持ジ（アセタート）ジシクロヘキシルホスフィンパラジウム（II）などのポリマー固定化有機パラジウム錯体が挙げられる。塩化パラジウム、酢酸パラジウム、テトラキス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（0）、ビス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（II）クロリド、1'-ビス（ジフェニルホスフィノ）フェニルパラジウム（II）クロリドおよびトリス（ジベンジリデンアセトン）ジパラジウム（0）などのパラジウム触媒がより好ましい。この反応に使用することができるリガンドは、限定されるものではないが、トリス（*o*-トリル）ホスフィン、トリシクロヘキシルホスフィン、トリ-*tert*-ブチルホスホニウムテトラフルオロボレート、（オキシジ-2, 1-フェニレン）ビス〔ジシクロヘキシル〕ホスフィン、4, 5-ビス（ジフェニルホスフィノ）-9, 9-ジメチルキサンテン、2-ジシクロヘキシルホスフィノ-2', 2'-（N, N-ジメチルアミノ）ビフェニル、2-ジシクロヘキシルホスフィノ-2', 4', 6'-トリイソプロピルビフェニル、2-ジシクロヘキシルホスフィノ-2', 6'-ジメトキシビフェニル、5-（ジ-*tert*-ブチルホスフィノ）-1', 3', 5'-トリフェニル-1'-H-〔1, 4'〕ビピラゾール、5-（ジシクロヘキシルホスフィノ）-1', 3', 5'-トリフェニル-1'-H-〔1, 4'〕ビピラゾール、5-〔ジ（1-アダマンチル）ホスフィノ〕-1', 3', 5'-トリフェニル-1'-H-〔1, 4'〕ビピラゾール、2-ジシクロヘキシルホスフィノ-2', 6'-ジイソプロポキシビフェニル、2-ジ-*tert*-ブチルホスフィノ-2', 4', 6'-トリイソプロピルビフェニル、2-ジ-*tert*-ブチルホスフィノ-3, 4, 5, 6-テトラメチル-2', 4', 6'-トリイソプロピル-1, 1'-ビフェニル、（2-ビフェニルイル）ジ-*tert*-ブチルホスフィン、2-（ジ-*tert*-ブチルホスフィノ）ビフェニル、2-ジ-*tert*-ブチルホスフィノ-3, 4, 5, 6-テトラメチル-2', 4', 6'-トリイソプロピル-1, 1'-ビフェニル、1, 1'-フェロセンジイル-ビス（ジフェニルホスフィン）、2-ジ-*tert*-ブチルホスフィノ-2'-メチルビフェニル、2-メチル-2'-ジシクロヘキシルホスフィノビフェニル、〔1, 1'-ビフェニル〕-3-スルホン酸、2'-（ジシクロヘキシルホスフィノ）-2, 6-ジメトキシナトリウム塩が挙げられるが、これらに限定されない。好ましいリガンドは、2-（ジ-*tert*-ブチルホスフィノ）ビフェニル、5-（ジ-*tert*-ブチルホスフィノ）-1', 3', 5'-トリフェニル-1'-H-〔1, 4'〕ビピラゾール、5-（ジシクロヘキシルホスフィノ）-1', 3', 5'-トリフェニル-1'-H-〔1, 4'〕ビピラゾール、5-〔1, 4'〕-1', 3', 5'-トリフェニル-1'-H-ビピラゾール、1, 1'-フェロセンジイル-ビス（ジフェニルホスフィン）、および4, 5-ビス（ジフェニルホスフィノ）-9, 9-ジメチルキサンテンが挙げられる。反応は、典型的には0～200℃、好ましくは50～150℃の温度範囲で、30分～24時間の範囲の持続時間で行われる。

【0209】

【化 1 7】
スキーム 8:



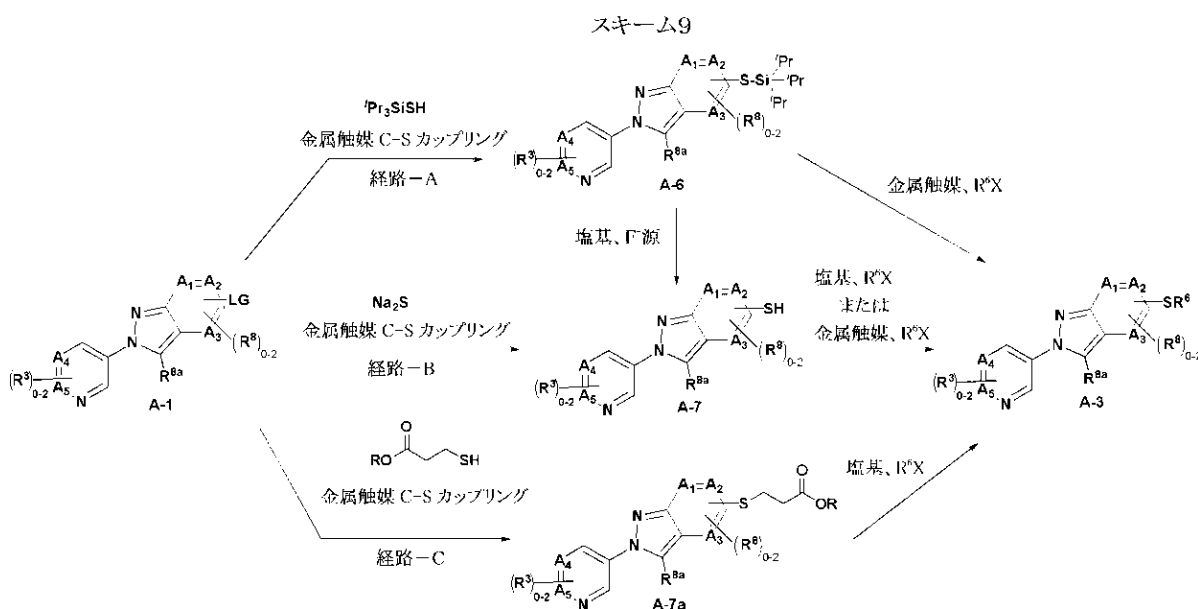
【0 2 1 0】

あるいは、式 A-3 の化合物は、スキーム 8 に示されているように、上述の「C-S カップリングのための一般的プロトコル」に従うことによって調製することもできる。式 A-1 の化合物および式 R⁶SM の適切な金属チオラートは、WO 2 0 2 0 2 5 7 1 4 5 の文献およびそこに引用されたさらなる文献に記載されているように、式 A-3 の化合物を得ることができる。式 R⁶SM の金属チオラートは、M がナトリウムまたはカリウムであることができるが、これに限定されないが、市販されているか、または対応するチオールを有機および無機塩基で処理してその場で生成することができる。別段の記載がない限り、変数 A₁、A₂、A₃、A₄、A₅、R³、R⁶、R⁸ および R^{8a} の各々の定義は、上述のとおりである。LG は、ハロゲンまたはトシラートのような脱離基を表す。

10

【0 2 1 1】

【化 1 8】
スキーム 9:



30

【0 2 1 2】

本発明のさらなる実施形態において、式 A-3 の化合物は、すべての置換基が先に定義したとおりであり、反応スキーム 9 に示す方法によって調製することができる。式 A-1 の化合物は、トリイソプロピルシランチオールのようなトリアルキルシランチオールの存在下で、C-S カップリングのための一般的なプロトコルで上述したような金属触媒 C-S カップリング反応を行い、式 A-6 のチオシリル化合物（経路-A）を得ることができる。次いで、式 A-6 のチオシリルを脱保護して、式 A-7 の化合物を得るために、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウムなどの適切な塩基、または水素化ナトリウム、水素化カリウムなどの金属水素化物塩基、および金属フッ化物源、例えばフッ化セシウム、フッ化ナトリウム、または、フッ化テトラメチルアンモニウム、フッ化テトラブチルアンモニウムなどのトリアルキルアンモニウムカチオンによって金属イオンが交換される試薬などを使用することができるが、これらに限定されない。例えば、WO 2 0 2 0 2

40

50

57145の文献およびそこに引用されたさらなる文献に記載されている。式A-7のチオールは、触媒量の1, 2-エタンジチオール（経路B；例えばSynlett2017；28(17)2272-2276およびそこに引用されたさらなる文献）を使用して、式A-1の化合物と市販の硫化ナトリウム（ $\text{Na}_2\text{S} \cdot 9\text{H}_2\text{O}$ ）との間の金属触媒カップリング反応によっても得ることができる。式A-7のチオールは、適切な無機および有機塩基および適切な式 R^6X のハロゲン化アルキルの存在下でさらにアルキル化されて、式A-3の化合物を得ることができる。式 R^6X のハロゲン化アルキルは、市販されている。あるいは、式A-6のチオシリル化合物は、適切な（ヘテロ）アリールハライド、またはトリフラート、または式 R^6X のトシラートの存在下で、適切な金属触媒C-Cクロスカップリング反応条件を用いて（ヘテロ）アリール化されて、WO2011087712、WO2004087156およびそこに引用されたさらなる文献に記載されているように、式A-3の化合物を得ることができる。さらに、式A-1の化合物は、上記の一般的なプロトコルに記載されているように、メルカプトエステルの存在下で金属触媒C-Sカップリング反応を受けて、式A-7a（経路-C）のスルフィドを得ることができる（式中、Rはアルキル基を表す）。塩基媒介レトロマイケル反応をさらに考案して、適切なアルキルハライドを用いて様々なS-アルキル化を受けて、文献J. Med. Chem. 2020, 63, 2308-2324および本明細書に引用された文献に記載されているように、様々なA-3スルフィドを得ることができるinsitu金属スルフィドを生成することができる。特に明記されない限り、各変数の定義は上記で定義された通りである。Xはハロゲン、トリフラート、メシラートまたはトシラートなどの脱離基を表す。

10

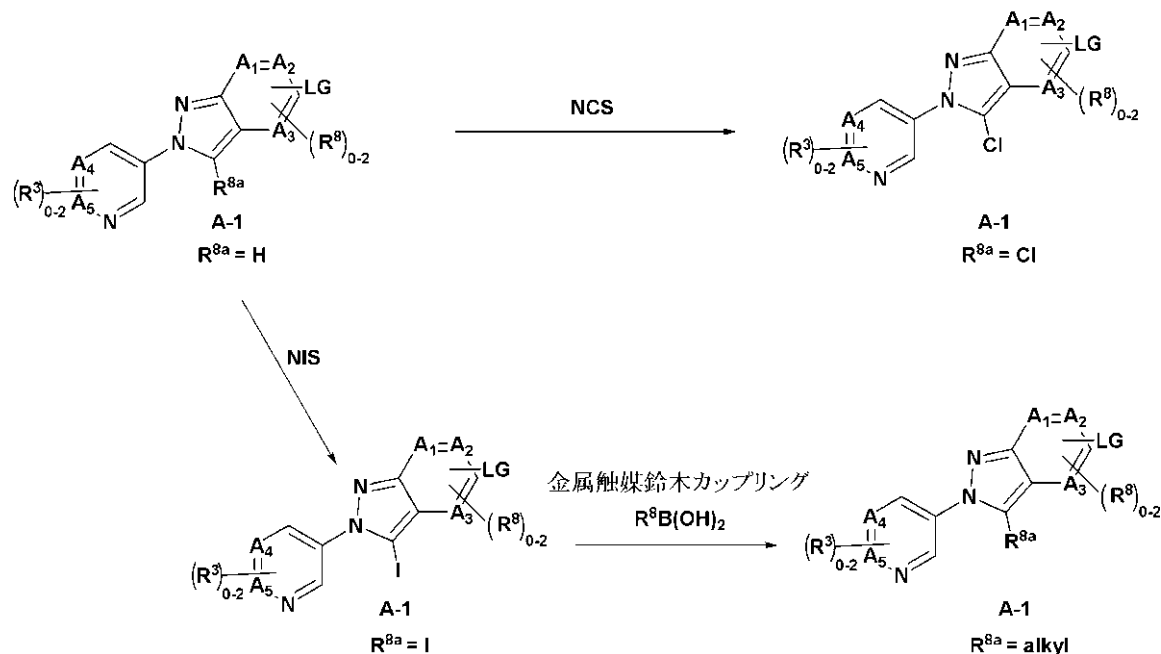
20

【0213】

【化19】

スキーム-10:

スキーム10



30

40

【0214】

スキーム10によれば、本発明は、式A-1の中央ピラゾール環のR⁸における選択的C-H官能化のための方法を提供する。ここで、同じR⁸は水素を表し、他のすべての変数はそれらの通常の意味を有する。N-クロロスクシンイミド（NCS）の存在下で、A-1は、中央ピラゾール環でR⁸塩素化を選択的に受けて、式A-1の化合物を形成することができる。ここで、ピラゾール-R⁸はClを表す。さらに、A-1の同じR⁸水素は、二つの連続したステップでアルキル化することもできる。最初に、N-ヨードスクシ

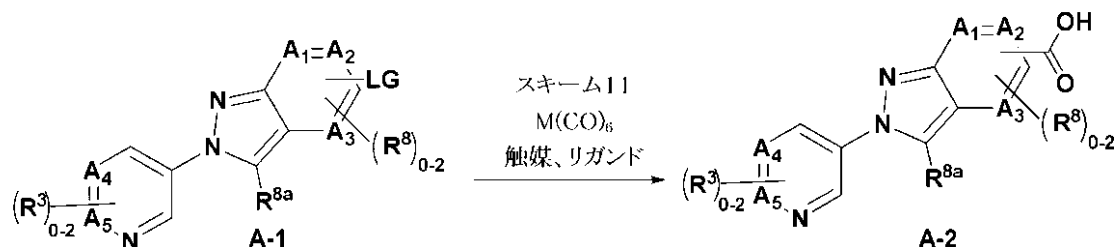
50

ンイミドの存在下で同様の R 8 ヨウ素化を行い、続いて、式 R 8 B (OH) 2 で表される様々なアルキルボロン酸の存在下で金属触媒スズキカップリング反応を行い、式 A - 1 の化合物を形成する。ここで、ピラゾール R 8 は異なるアルキル基を表す (Indazole R 8 における C - H 官能化の包括的な概要については、Org. Biomol. Chem., 2022, 20, 7746)。

【0215】

【化20】

スキーム 11:



10

【0216】

スキーム 11 による更なる実施形態において、本発明は、式 A - 2 の化合物の製造方法を提供し、ここで、全ての置換基は、先に定義した通りである。式 A - 1 の化合物 (式中、A 1、A 2、A 3、A 4、A 5、R 3、R 8 および R 8 a は、上記で定義した通常の意味を有し、LG は脱離基、好ましくはハロゲンを表す) は、WO 2016144351 およびそこに引用された更なる文献に記載された手順に従って、式 A - 2 のカルボン酸に変換することができる。この反応において「CO 源」として働く金属ヘキサカルボニルは、モリブデンヘキサカルボニルおよびタングステンヘキサカルボニルから選択されるが、これらに限定されない。反応は、水素化ナトリウム、水素化リチウムおよび水素化カリウムなどの金属水素化物、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウムなどの金属炭酸塩；トリエチルアミン、N，N - ジイソプロピルエチルアミン、1，8 - ジアザビシクロ [5.4.0] ウンデクー 7 - エンなどの有機アミン塩基；および N，N - ジイソプロピルエチルアミン、1，8 - ジアザビシクロ [5.4.0] ウンデクー 7 - エンなどの有機アミンが好ましい塩基として挙げられるが、これらに限定されない塩基の存在下で行われるが、これらに限定されない塩基の存在下で行われる。この反応に用いることができる触媒には、例えば、ポリマー担持ビス (アセタート) トリフェニルホスフィンパラジウム (II)、trans - ジ - μ - アセタトビス [2 - [ビス (2 - メチルフェニル) ホスフィノ] ベンジル] ジパラジウム、およびポリマー担持ジ (アセタート) ジシクロヘキシルホスフィンパラジウム (II) などの有機パラジウム錯体が含まれるが、これらに限定されない。この反応に用いる配位子の例は、トリタートブチルホスホニウムテトラフルオロボレートから選択されるが、これらに限定されない。この反応は、典型的には 0 ~ 200 °C、好ましくは 50 ~ 180 °C の温度範囲で 30 分 ~ 24 時間の範囲で行われる。この反応は、マイクロ波照射条件下で任意に行うこともできる。

20

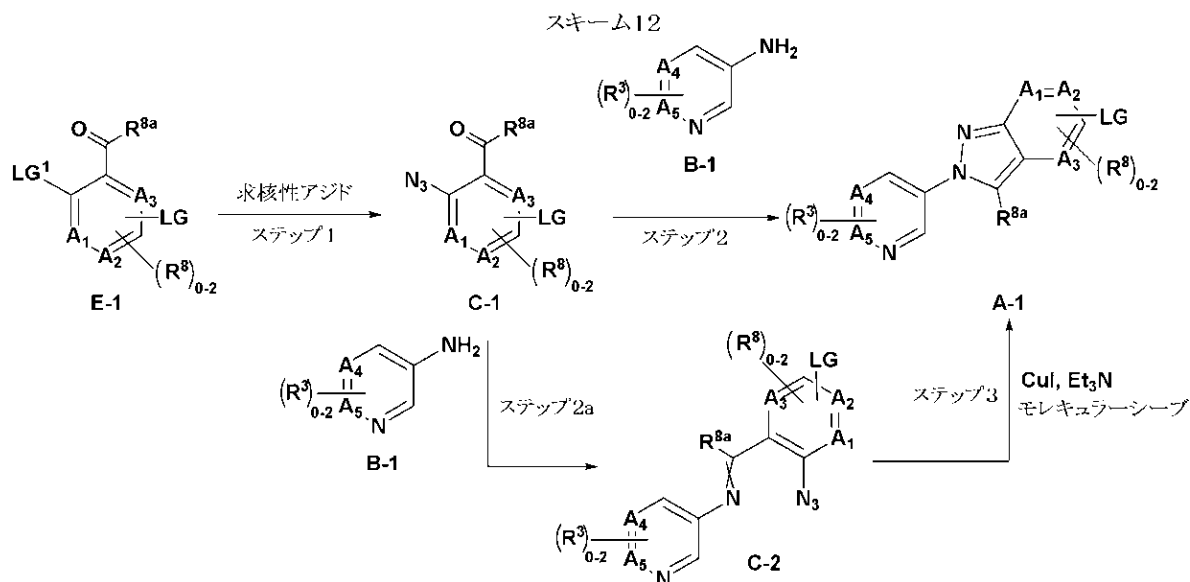
30

【0217】

40

50

【化 2 1】
スキーム 12:



10

【0 2 1 8】

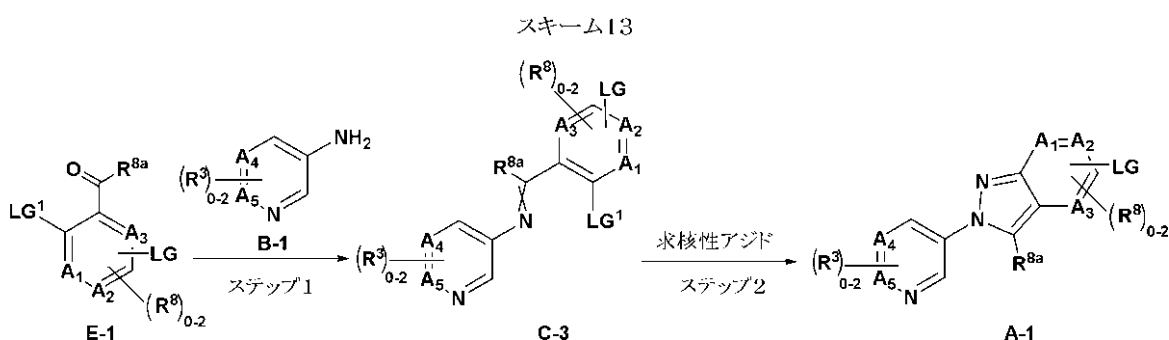
スキーム 12 によれば、本発明は、式 E-1 の置換ベンズアルデヒドから式 A-1 の化合物を調製するための方法を提供し、A₁、A₂、A₃、R⁸ および R^{8a} は、上述の通りである。LG および LG¹ は脱離基、好ましくはハロゲン置換基を表す。式 E-1 の適切に置換されたベンズアルデヒドは、求核性の有機または無機アジドの存在下、室温または高温のいずれかで求核置換反応を行い、式 C-1 のアリールアジドを得ることができる。式 C-1 を有するアリールアジドは、さらに、式 B-1 のヘテロアリールアミンと反応させることができ、A₄、A₅ および R³ は上述の通りであり、高温で *in situ* 環化を行い、式 A-1 の所望の二環式生成物（たとえば、WO2016144351 を参照してください。）を与えるイミン中間体を形成する。しかしながら、基質の性質によっては、このような高温の *in situ* 環化方法は、さらなる課題をもたらす可能性がある。これを回避するために、文献 Chem. Commun., 2011, 47, 10133-10135 およびそこに引用されている文献に記載されているように、C-2 を環化するための低温 Cu/リガンド媒介法を実施することができる（ステップ 3）。

20

30

【0 2 1 9】

【化 2 2】
スキーム 13:



40

【0 2 2 0】

あるいは、式 A-1 の化合物をスキーム 13 に記載されているように調製することができる。式 E-1 の置換ベンズアルデヒド（式中、A₁、A₂、A₃、R⁸ および R^{8a} は上述の通りであり、LG および LG¹ は脱離基、好ましくはハロゲン置換基を表す）を、式

50

B-1のヘテロアリールアミン（式中、 A_4 、 A_5 および R^3 は上述の通りである）と室温または高温のいずれかで反応させて、式C-3のイミンを生成する。式C-3のイミンは、求核性の有機または無機アジドの存在下、室温または高温のいずれかで、最初に分子間置換反応を起こし、続いてその場で分子内環化反応を起こし、式A-1の二環式生成物を生成することができる（たとえば、WO2016144351を参照してください。）

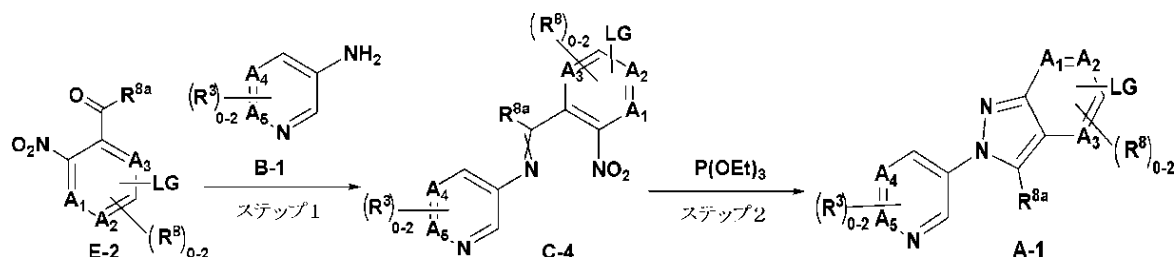
。

【0221】

【化23】

スキーム-14:

スキーム14



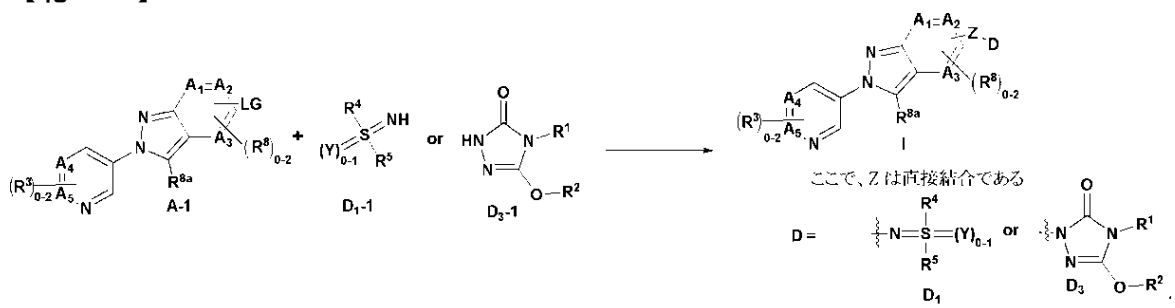
【0222】

あるいは、式A-1の化合物は、スキーム14に記載のように調製することができる。式E-2の適切に置換された2-ニトロベンズアルデヒド（式中、 A_1 、 A_2 、 A_3 、 R^8 および R^{8a} は上記の通りである）は、式B-1の複素環アミン（式中、 A_4 、 A_5 および R^3 は上記の通りである）と反応させてイミンC-4を生成することができる。したがって、適切なリン（III）試薬、例えば亜リン酸トリエチルの存在下、高温での第二反応段階における還元的環化により、式A-1（たとえば、US2019029788を参照してください。）の二環式化合物を得ることができる。いくつかの代替的な還元的環化方法が利用可能であり、Org. Lett. 2014, 16, 3114-3117およびそこに引用された文献に示されているように実施することができる。

一実施形態において、本発明は、式(I)（式中、DはD₁またはD₃である）の化合物の調製のための方法を提供し、以下のステップを含む：

i 式(A-1)の化合物を式(D₁-1)または(D₃-1)の化合物と反応させて式(I)（式中、Zは直接結合である）の化合物を得る；

【化24】



または

i 式(A-2)の化合物を式(D₁-1)または式(D₃-1)の化合物と反応させて式(I)の化合物を得る（式中、Zは-C(=O)-結合である）；

10

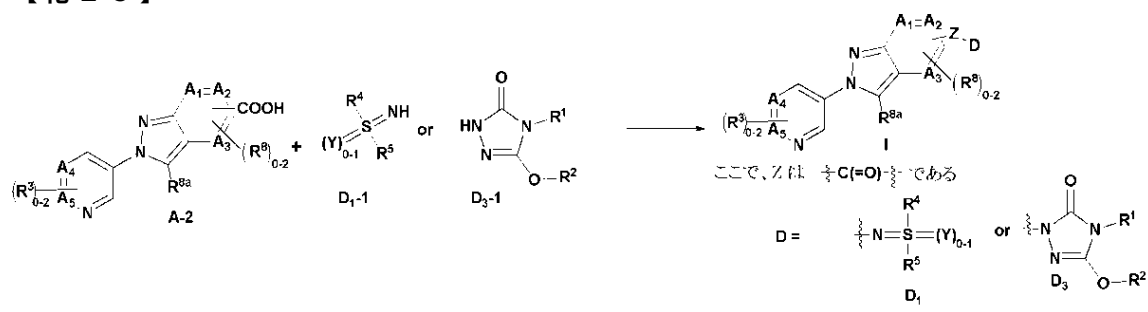
20

30

40

50

【化 2 5】



10

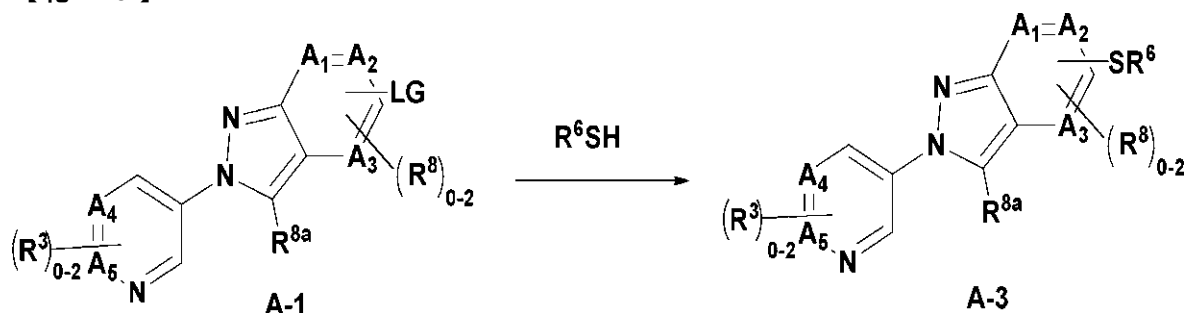
式中、LG、A₁、A₂、A₃、A₄、A₅、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁸およびR^{8a}の定義は、明細書に定義されたものと同じである。

別の実施形態において、本発明は、DがD₂である式(I)の化合物の製造方法を提供し、以下のステップを含む：

【0223】

i 式(A-1)の化合物を式R⁶SHの化合物と反応させて式(A-3)の化合物を得る(式中、Zは直接結合である)；

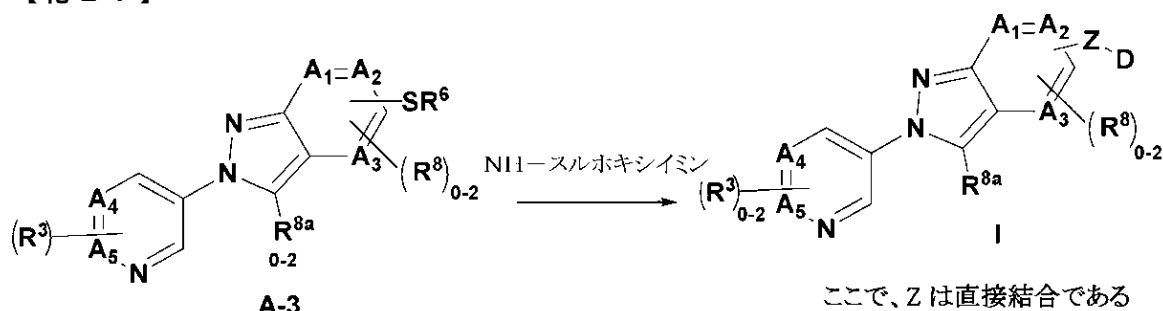
【化 2 6】



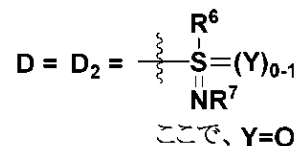
20

ii 式(A-3)の化合物を、適切な酸化剤およびN源を用いてO-およびNH-転移により式(I)の化合物に変換する、

【化 2 7】



30



40

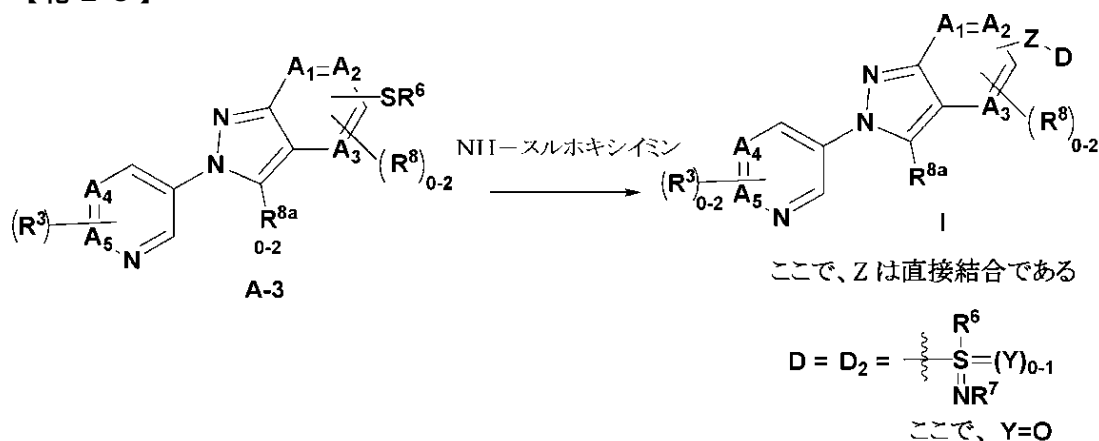
【0224】

1つの実施形態において、本発明は、DがD₂である式(I)の化合物の製造方法を提供する。ステップiiは、以下に述べるように単一のステップで実施することができる。

ii 式(A-3)の化合物を、適切な酸化剤およびN源を用いてO-およびNH-移動により式(I)の化合物に変換する、

50

【化 2 8】



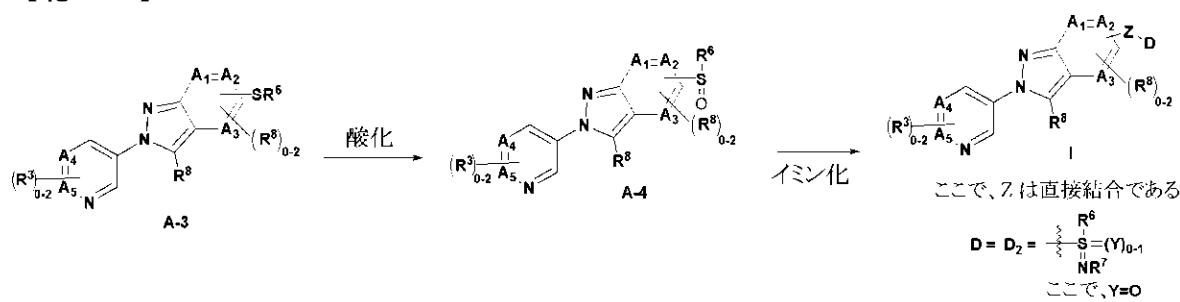
10

【0225】

一実施形態において、本発明は、式（I）（式中、DはD₂である）の化合物の製造方法を提供し、工程 i i は、以下に述べるように2つの工程で実施することができる。

i i 適当な酸化試薬を用いて式（A-3）の化合物を酸化して式（A-4）の化合物を得る。この化合物は、適当なN源またはイミノ化試薬を用いてイミノ化することにより、さらに式（I）の化合物に変換される。

【化 2 9】

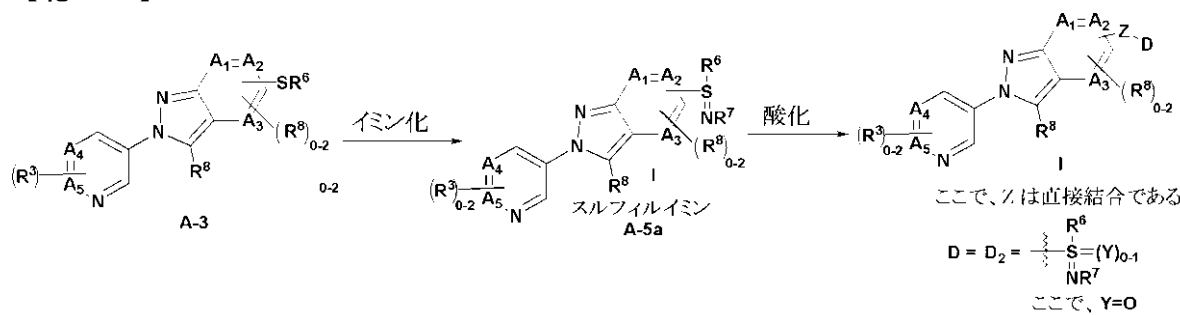


20

または

i i 適当なN源またはイミノ化試薬を用いて式（A-3）の化合物をイミノ化して式（A-5a）の化合物を得る。この化合物は、適当な酸化剤を用いて酸化することにより、さらに式（I）の化合物に変換される。

【化 3 0】



30

40

【0226】

ここで、LGは脱離基を表し、A₁、A₂、A₃、A₄、A₅、R³、R⁶、R⁷、R⁸およびR^{8a}は、請求項1に記載のものと同一である。

ステップ（i i）における適当な酸化剤は、H₂O₂；H₂O₂、FeCl₃（触媒）；H₂O₂、酸化モリブデンセリウム（触媒）；H₂O₂、トリフルオロメタンスルホン酸、酸化タングステンナトリウム（Na₂WO₄）；m-クロロ過安息香酸；過ヨウ素酸ナトリウム；フェニルヨウ素（III）二酢酸（PIDA）；塩酸または酢酸、過酸化水素

50

；過酢酸；トリフェニルメチルヒドロペルオキシド、触媒：ビス（アセチルアセトナト）ジオキソモリブデン； H_2O_2 、臭化テトラフェニルホスホニウム（PB-7-23-111'1'2）-ジアクアオキソジペルオキシモリブデン1H-イミダゾリウム、1,3-ビス〔（1S）-1-カルボキシ-2-メチルプロピル〕-、内塩；2-（1-ヒドロペルオキシ-1-メチルエチル）フラン、触媒：酒石酸ジエチル、チタンイソプロポキシド； H_2O_2 、触媒：五塩化タンタル；tert-ブチルヒドロペルオキシド；酸素；触媒：二酸化窒素；酸素；触媒：テトラフルオロホウ酸ニトロソニウム；次亜塩素酸tert-ブチル；クロロトリメチルシラン、 H_2O_2 ；硝酸テトラブチルアンモニウム、触媒：硝酸第二銅、テトラカルボニルビス（トリフェニルホスフィン）モリブデン；または H_2O_2 、塩化ジルコニウム（ $ZrCl_4$ ）。

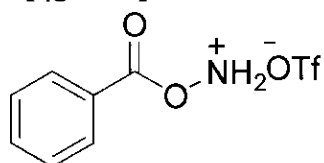
10

【0227】

ステップiの適切なN源またはイミノ化試薬は以下から選択される。

カルバミン酸アンモニウム；アジ化ナトリウム、重炭酸ナトリウム、

【化31】



； $FeSO_4$ 、フェナントリンおよびMeCN（0.4mL）；アジ化ナトリウム、濃 H_2SO_4 ；トリフルオロアセトアミド、MgO、 $Rh_2(OAc)_4$ 、 $PhI(OAc)_2$ ；（O-（メチルスルホニル）ヒドロキシルアミン）； $Ph-I=N-Ts$ （Ts＝トルエンスルホニル）； $Ph-I=N-Ns$ （Ns＝N-アルキルニトロベンゼンスルホンアミド）； $Ph-I=N-Ses$ （2-（トリメチルシリル）エタンスルホニル）；または $Rh_2(esp)_2$ およびO-（2,4-ジニトロフェニル）ヒドロキシルアミン。

20

【0228】

一実施形態では、酸化剤およびN源またはイミノ化試薬は、ワンポットで、または段階的な反応で個別に使用することができる。

一実施形態では、酸化剤およびN源またはイミノ化試薬は、個別に、またはそれらの組み合わせで使用することができる。

30

さらに詳細に説明することなく、前述の説明を使用する当業者は、本発明を最大限に利用することができると思ふのが妥当である。

【0229】

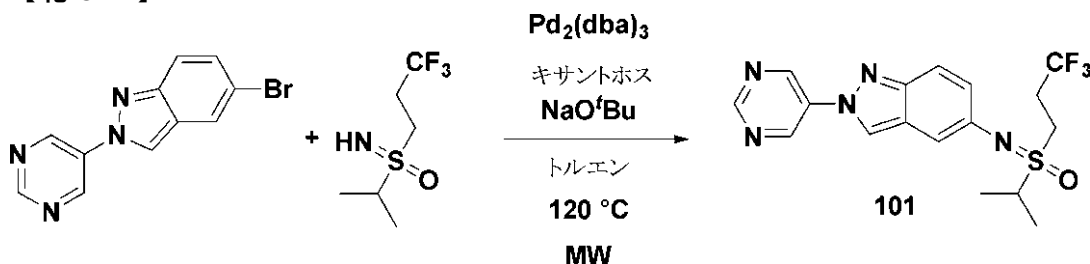
化学的実験例：

以下の実験例は、本発明を限定することなく、本発明の化合物を製造する方法およびプロセスを説明し、本発明を実施するために本発明者により意図された最良のモードを含む。

【0230】

実験手順：

例1：イソプロピル（（2-（ピリジン-5-イル）-2H-インダゾール-5-イル）イミノ）（3,3,3-トリフルオロプロピル）-λ⁶-スルファノン101の合成【化32】



40

50

トルエン（5 mL）中の5-ブロモ-2-（ピリミジン-5-イル）-2H-インダゾール（0.25 g、0.909ミリモル）、イミノ（イソプロピル）（3,3,3-トリフルオロプロピル）- λ^6 -スルファノン（0.185 g、0.909ミリモル）の溶液を、トリス（ジベンジリデンアセトン）ジパラジウム（0）（ $\text{Pd}_2(\text{dba})_3$ ）（0.042 g、0.045ミリモル）、（9,9-ジメチル-9H-キサンテン-4,5-ジイル）ビス（ジフェニルホスファン）（Xantphos）（0.053 g、0.091ミリモル）、ナトリウムtert-ブトキシド（ NaO^tBu ）（0.087 g、0.909ミリモル）で処理し、マイクロ波装置（MW）中で120°Cで1時間照射した。反応終了後、水（10 mL）を加えて反応混合物をクエンチし、酢酸エチル（2×25 mL）で抽出した。合わせた有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下で濃縮して油状残渣を得た。この残渣を逆相分取高速液体クロマトグラフィー（HPLC）（グラジエント法：-10 mM 酢酸アンモニウム水性緩衝液：アセトニトリル19：1～0：100）で精製し、目的のイソプロピル（（2-（ピリミジン-5-イル）-2H-インダゾール-5-イル）イミノ）（3,3,3-トリフルオロプロピル）- λ^6 -スルファノン101（209 mg、0.526ミリモル、収率58%）を得た。

【0231】

表1：本開示の代表的な化合物を、例1に記載の適切な出発物質および方法に従って調製した。

注：特定の基質については、ナトリウムtert-ブトキシドの代わりに炭酸セシウム（ Cs_2CO_3 ）またはリン酸三塩基カリウム（ K_3PO_4 ）を使用した場合に、より良い結果が観察された。

10

20

30

40

50

【表 1 - 1】

化合物 番号	化合物名	分析データ
1	ジメチル((2-(ピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)イミノ)- λ^6 -スルファノン	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{DMSO-}d_6$) δ 9.27 (d, $J = 2.2$ Hz, 1H), 8.93 (d, $J = 0.7$ Hz, 1H), 8.60 (dd, $J = 4.8, 1.3$ Hz, 1H), 8.41 (dq, $J = 8.3, 1.4$ Hz, 1H), 7.62-7.57 (m, 2H), 7.16 (q, $J = 1.0$ Hz, 1H), 6.97 (dd, $J = 9.2, 2.1$ Hz, 1H), 3.23 (s, 6H); ESI MS (m/z): 286.95 [$M+1$].
2	エチル(メチル)((2-(ピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)イミノ)- λ^6 -スルファノン	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{DMSO-}d_6$) δ 9.27 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 8.92 (d, $J = 0.9$ Hz, 1H), 8.60 (dd, $J = 4.7, 1.4$ Hz, 1H), 8.41 (dq, $J = 8.3, 1.4$ Hz, 1H), 7.62-7.56 (m, 2H), 7.17 (q, $J = 0.9$ Hz, 1H), 6.98 (dd, $J = 9.2, 2.1$ Hz, 1H), 3.37 (q, $J = 7.3$ Hz, 2H), 3.12 (s, 3H), 1.29 (t, $J = 7.3$ Hz, 3H); ESI MS (m/z): 300.9 [$M+1$].
3	ジエチル((2-(ピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)イミノ)- λ^6 -スルファノン	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{DMSO-}d_6$) δ 9.26 (d, $J = 2.8$ Hz, 1H), 8.91 (d, $J = 0.9$ Hz, 1H), 8.60 (dd, $J = 4.7, 1.4$ Hz, 1H), 8.41 (dq, $J = 8.4, 1.3$ Hz, 1H), 7.61 (ddd, $J = 8.3, 4.7, 0.7$ Hz, 1H), 7.56 (dt, $J = 9.2, 0.9$ Hz, 1H), 7.17 (q, $J = 0.9$ Hz, 1H), 7.00 (dd, $J = 9.2, 2.1$ Hz, 1H), 3.34 (s, 2H), 3.29 (d, $J = 7.3$ Hz, 2H), 1.26 (t, $J = 7.3$ Hz, 6H); ESI MS (m/z): 314.9 [$M+1$].
4	1-((2-(ピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)イミノ)テトラヒドロ-1 <i>H</i> - λ^6 -チオフェン-1-オキシド	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{DMSO-}d_6$) δ 9.27 (d, $J = 2.8$ Hz, 1H), 8.94 (d, $J = 0.9$ Hz, 1H), 8.60 (dd, $J = 4.6, 1.5$ Hz, 1H), 8.41 (dq, $J = 8.3, 1.4$ Hz, 1H), 7.62-7.58 (m, 2H), 7.11 (q, $J = 0.9$ Hz, 1H), 6.98 (dd, $J = 9.2, 2.1$ Hz, 1H), 3.41-3.35 (m, 2H), 3.27-3.20 (m, 2H), 2.26-2.18 (m, 2H), 2.14-2.07 (m, 2H); ESI MS (m/z): 312.9 [$M+1$].
5	エチル((2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)イミノ)(メチル)- λ^6 -スルファノン	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{DMSO-}d_6$) δ 9.20 (d, $J = 1.2$ Hz, 1H), 8.96 (d, $J = 0.9$ Hz, 1H), 8.63 (d, $J = 2.4$ Hz, 1H), 8.42 (dt, $J = 10.1, 2.3$ Hz, 1H), 7.57 (d, $J = 9.2$ Hz, 1H), 7.15 (t, $J = 0.9$ Hz, 1H), 7.00 (dd, $J = 9.2, 1.8$ Hz, 1H), 3.37 (q, $J = 7.3$ Hz, 2H), 3.13 (s, 3H), 1.29 (t, $J = 7.3$ Hz, 3H); ESI MS (m/z): 318.9 [$M+1$].
6	ジエチル((2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)イミノ)- λ^6 -スルファノン	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{DMSO-}d_6$) δ 9.19 (d, $J = 1.5$ Hz, 1H), 8.95 (d, $J = 0.9$ Hz, 1H), 8.63 (d, $J = 2.8$ Hz, 1H), 8.41 (dt, $J = 10.2, 2.4$ Hz, 1H), 7.56 (dd, $J = 9.2, 0.9$ Hz, 1H), 7.16 (q, $J = 0.9$ Hz, 1H), 7.02 (dd, $J = 9.2, 2.1$ Hz, 1H), 3.33 (d, $J = 7.3$ Hz, 2H), 3.30 (d, $J = 7.6$ Hz, 2H), 1.25 (t, $J = 7.5$ Hz, 6H); ESI MS (m/z): 332.85 [$M+1$].
7	1-((2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)イミノ)テトラヒドロ-1 <i>H</i> - λ^6 -チオフェン-1-オキシド	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{DMSO-}d_6$) δ 9.20 (t, $J = 1.4$ Hz, 1H), 8.98 (d, $J = 0.9$ Hz, 1H), 8.63 (d, $J = 2.4$ Hz, 1H), 8.42 (dt, $J = 10.1, 2.3$ Hz, 1H), 7.59 (dd, $J = 9.2, 0.9$ Hz, 1H), 7.09 (q, $J = 1.0$ Hz, 1H), 7.00 (dd, $J = 9.2, 2.1$ Hz, 1H), 3.42-3.35 (m, 2H), 3.28-3.21 (m, 2H), 2.28-2.18 (m, 2H), 2.14-2.05 (m, 2H); ESI MS (m/z): 330.85 [$M+1$].
8	((2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)イミノ)ジメチル- λ^6 -スルファノン	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{DMSO-}d_6$) δ 9.20 (d, $J = 1.5$ Hz, 1H), 8.97 (d, $J = 0.9$ Hz, 1H), 8.63 (d, $J = 2.0$ Hz, 1H), 8.42 (dt, $J = 10.1, 2.3$ Hz, 1H), 7.57 (dt, $J = 9.2, 0.9$ Hz, 1H), 7.14 (q, $J = 0.9$ Hz, 1H), 6.98 (dd, $J = 9.2, 2.1$ Hz, 1H), 3.22 (d, $J = 7.3$ Hz, 6H); ESI MS (m/z): 304.85 [$M+1$].
9	ジメチル((2-(ピリミジン-5-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)イミノ)- λ^6 -スルファノン	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{DMSO-}d_6$) δ 9.48 (s, 2H), 9.21 (s, 1H), 8.99 (d, $J = 0.9$ Hz, 1H), 7.59 (dt, $J = 9.2, 0.9$ Hz, 1H), 7.16 (q, $J = 0.9$ Hz, 1H), 6.99 (dd, $J = 9.2, 2.1$ Hz, 1H), 3.24 (s, 6H); ESI MS (m/z): 287.85 [$M+1$].
10	エチル(メチル)((2-(ピリミジン-5-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イ	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{DMSO-}d_6$) δ 9.47 (s, 2H), 9.21 (s, 1H), 8.98 (d, $J = 0.9$ Hz, 1H), 7.59 (d, $J = 9.2$ Hz, 1H), 7.17 (q, $J = 0.9$ Hz,

10

20

30

40

50

【表 1 - 2】

	ル)イミノ)-λ ⁶ -スル ファノン	¹ H), 7.01 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.38 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 3.13 (s, 3H), 1.29 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 301.9 [M+1].
11	ジエチル ((2-(ピリミ ジン-5-イル)-2H-イン ダゾール-5-イル)イミ ノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.47 (s, 2H), 9.21 (s, 1H), 8.97 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 7.58 (dt, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.17 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.03 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 3.35-3.29 (m, 4H), 1.26 (t, J = 7.3 Hz, 6H); ESI MS (m/z): 315.9 [M+1].
12	1-((2-(ピリミジン-5- イル)-2H-インダゾー ル-5-イル)イミノ)テ トラヒドロ-1H-λ ⁶ -チ オフエン-1-オキシド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.48 (s, 2H), 9.21 (s, 1H), 9.00 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 7.61 (dt, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.10 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.01 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.42-3.35 (m, 2H), 3.28-3.22 (m, 2H), 2.26-2.08 (m, 4H); ESI MS (m/z): 313.85 [M+1].
13	ベンジル ((2-(5-フル オロピリジン-3-イ ル)-2H-インダゾール- 5-イル)イミノ)(メチ ル)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.18 (s, 1H), 8.90 (s, 1H), 8.59 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.36 (dt, J = 9.9, 2.3 Hz, 1H), 7.56 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.46-7.44 (m, 2H), 7.39-7.36 (m, 3H), 7.19 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 7.00 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 4.74 (d, J = 13.8 Hz, 1H), 4.66 (d, J = 14.1 Hz, 1H), 3.08 (s, 3H); ESI MS (m/z): 380[M+1].
14	((2-(5-フルオロピリ ジン-3-イル)-2H-イン ダゾール-5-イル)イミ ノ)(メチル)(フェニ ル)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.13 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 8.88 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.61-8.60 (m, 1H), 8.35 (dt, J = 10.2, 2.3 Hz, 1H), 7.98-7.95 (m, 2H), 7.67-7.58 (m, 3H), 7.52 (dt, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.04 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 6.97 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 3.41 (s, 3H); ESI MS (m/z): 367 [M+1].
15	(4-フルオロフェニ ル)((2-(5-フルオロピ リジン-3-イル)-2H-イン ダゾール-5-イル)イミ ノ)(イソプロピル)- λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.13 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.88 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.61 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.35 (dt, J = 10.0, 2.3 Hz, 1H), 7.93-7.84 (m, 2H), 7.53 (dt, J = 9.1, 0.9 Hz, 1H), 7.48-7.42 (m, 2H), 7.08-7.04 (m, 1H), 6.97 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 3.70-3.59 (m, 1H), 1.33 (dd, J = 14.4, 6.6 Hz, 3H), 1.18 (dd, J = 15.2, 6.8 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 413.05 [M+1].
16	ベンジル(メチル)((2- (ピリミジン-5-イル)- 2H-インダゾール-5-イ ル)イミノ)-λ ⁶ -スル ファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.48 (s, 2H), 9.21 (s, 1H), 9.00 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 7.60 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.43-7.36 (m, 5H), 7.22 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 6.98 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 4.79 (d, J = 13.7 Hz, 1H), 4.70 (d, J = 13.7 Hz, 1H), 3.03 (s, 3H); ESI MS (m/z): 364 [M+1].
17	メチル(フェニル)((2- (ピリミジン-5-イル)- 2H-インダゾール-5-イ ル)イミノ)-λ ⁶ -スル ファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.41 (s, 2H), 9.19 (s, 1H), 8.90 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 7.97-7.95 (m, 2H), 7.67-7.58 (m, 3H), 7.54 (dt, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.05 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 6.98 (q, J = 1.0 Hz, 1H), 3.42 (s, 3H); ESI MS (m/z): 350 [M+1].
18	(4-フルオロフェニ ル)(イソプロピ ル)((2-(ピリミジン- 5-イル)-2H-インダゾ ール-5-イル)イミノ)- λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.41 (s, 2H), 9.19 (s, 1H), 8.89 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 7.92-7.89 (m, 2H), 7.55 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.45 (t, J = 8.8 Hz, 2H), 7.12-7.06 (m, 1H), 6.98-6.96 (m, 1H), 3.70-3.60 (m, 1H), 1.36-1.32 (m, 3H), 1.20 (d, J = 6.8 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 396.05 [M+1].
19	tert-ブチル(メチ ル)((2-(ピリミジン- 5-イル)-2H-インダゾ ール-5-イル)イミノ)- λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.47 (s, 2H), 9.21 (s, 1H), 8.99 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 7.58 (dt, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.18 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.04 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 3.01 (s, 3H), 1.44 (s, 9H); ESI MS (m/z): 330 [M+1].
20	ベンジル(メチル)((2- (ピリジン-3-イル)-	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.27 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.94 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 8.60 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.42 (dq, J =

10

20

30

40

50

【表 1 - 3】

	2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.63-7.58 (m, 2H), 7.43-7.35 (m, 5H), 7.22 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 6.96 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 4.78 (d, J = 14.1 Hz, 1H), 4.69 (d, J = 13.8 Hz, 1H), 3.02 (s, 3H); ESI MS (m/z): 363.05 [M+1].
21	メチル(フェニル)((2-(ピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.20 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 8.84 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 8.58 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.35 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.98-7.95 (m, 2H), 7.67-7.56 (m, 4H), 7.53-7.51 (m, 1H), 7.02 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 6.99 (q, J = 1.0 Hz, 1H), 3.41 (s, 3H); ESI MS (m/z): 349.05 [M+1].
22	(3-フルオロフェニル)(メチル)((2-(ピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.21 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.87 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.58 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.35 (dq, J = 8.5, 1.4 Hz, 1H), 7.82-7.77 (m, 2H), 7.67 (td, J = 8.0, 5.6 Hz, 1H), 7.60-7.50 (m, 3H), 7.05-7.01 (m, 2H), 3.47 (s, 3H); ESI MS (m/z): 367.05 [M+1].
23	メチル((2-(ピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)イミノ)(<i>p</i> -トリル)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.20 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 8.84 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.58 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.35 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.83 (d, J = 8.6 Hz, 2H), 7.59-7.56 (m, 1H), 7.52 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.41-7.35 (m, 2H), 7.32-7.09 (m, 1H), 7.05-7.00 (m, 1H), 6.97 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 3.37 (s, 3H), 2.36 (d, J = 17.1 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 363.05 [M+1].
24	エチル(フェニル)((2-(ピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.20 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.84 (s, 1H), 8.57 (d, J = 3.7 Hz, 1H), 8.35 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.90 (d, J = 7.0 Hz, 2H), 7.68-7.51 (m, 5H), 7.05 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 7.00 (s, 1H), 3.56-3.46 (m, 2H), 1.17 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 363.05 [M+1].
25	tert-ブチル(メチル)((2-(ピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.27 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.92 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.60 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.41 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.61 (ddd, J = 8.3, 4.6, 0.7 Hz, 1H), 7.56 (dt, J = 9.1, 0.9 Hz, 1H), 7.18 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.01 (dd, J = 9.0, 2.0 Hz, 1H), 3.00 (s, 3H), 1.44 (s, 9H); ESI MS (m/z): 363.05 [M+1].
26	(4-クロロフェニル)(メチル)((2-(ピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.21 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.85 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.58 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.35 (dq, J = 8.4, 1.3 Hz, 1H), 7.96 (dt, J = 9.1, 2.2 Hz, 2H), 7.68 (dt, J = 9.1, 2.3 Hz, 2H), 7.60-7.52 (m, 2H), 7.03-6.98 (m, 2H), 3.44 (s, 3H); ESI MS (m/z): 382.95 [M+1].
27	メチル(ペンチル)((2-(ピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.27 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.92 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.60 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.41 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.61 (ddd, J = 8.3, 4.8, 0.6 Hz, 1H), 7.57 (dt, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.16 (q, J = 1.0 Hz, 1H), 6.97 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.34 (dd, J = 9.9, 6.0 Hz, 2H), 3.13 (s, 3H), 1.80-1.72 (m, 2H), 1.39-1.24 (m, 4H), 0.85 (t, J = 7.2 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 342.6 [M+1].
28	ジイソプロピル((2-(ピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.26-9.20 (m, 1H), 8.89 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.59 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.40 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.60 (ddd, J = 8.3, 4.6, 0.7 Hz, 1H), 7.54-7.52 (m, 1H), 7.20 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.09 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.66-3.55 (m, 2H), 1.34 (d, J = 6.6 Hz, 6H), 1.27 (d, J = 6.8 Hz, 6H); ESI MS (m/z): 342.55 [M+1].
29	エチル(イソプロピル)((2-(ピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.26 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.90 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.60 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.40 (dq, J = 8.4, 1.3 Hz, 1H), 7.60 (ddd, J = 8.4, 4.8, 0.7 Hz, 1H), 7.57-7.54 (m, 1H), 7.18 (q, J = 1.0 Hz, 1H), 7.03 (dd, J = 9.0, 2.0 Hz, 1H), 3.57-3.50 (m, 1H), 3.27 (t, J = 7.3 Hz, 2H), 1.37 (d, J = 6.8 Hz, 3H),

10

20

30

40

50

【表 1 - 4】

		1.30 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 1.24 (t, J = 7.5 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 328.55 [M+1].
30	メチル(ピリジン-3-イル)((2-(ピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.21 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 9.09 (dd, J = 2.3, 0.6 Hz, 1H), 8.87 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.80 (dd, J = 4.9, 1.5 Hz, 1H), 8.58 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.34 (tdd, J = 8.1, 2.5, 1.6 Hz, 2H), 7.64 (ddd, J = 8.1, 4.8, 0.9 Hz, 1H), 7.60-7.53 (m, 2H), 7.05-7.02 (m, 2H), 3.53 (s, 3H) ESI MS (m/z): 349.6 [M+1].
31	ジイソプロピル((2-(ピリミジン-5-イル)-2H-インダゾール-5-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.46 (s, 2H), 9.20 (s, 1H), 8.95 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 7.56-7.54 (m, 1H), 7.56-7.10 (m, 2H), 7.20 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.11 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 3.65-3.58 (m, 2H), 1.30 (dd, J = 27.0, 6.7 Hz, 12H); ESI MS (m/z): 343.65 [M+1].
32	エチル(イソプロピル)((2-(ピリミジン-5-イル)-2H-インダゾール-5-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.47 (s, 2H), 9.21 (t, J = 4.8 Hz, 1H), 8.97 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 7.59-7.56 (m, 1H), 7.18 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.05 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.58-3.51 (m, 1H), 3.28 (t, J = 7.3 Hz, 2H), 1.37 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 1.30 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 1.24 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 329.6 [M+1].
33	メチル(ベンチル)((2-(ピリミジン-5-イル)-2H-インダゾール-5-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.47 (s, 2H), 9.21 (s, 1H), 8.99 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 7.59 (dt, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.16 (q, J = 1.0 Hz, 1H), 7.00 (dd, J = 9.0, 2.0 Hz, 1H), 3.36 (dd, J = 10.0, 6.1 Hz, 2H), 3.15 (s, 3H), 1.80-1.72 (m, 2H), 1.38-1.26 (m, 4H), 0.84 (t, J = 7.1 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 343.6 [M+1].
34	エチル(フェニル)((2-(ピリミジン-5-イル)-2H-インダゾール-5-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.40 (s, 2H), 9.19 (s, 1H), 8.90 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 7.92-7.89 (m, 2H), 7.69-7.59 (m, 3H), 7.55 (dt, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.07 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 6.99 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 3.57-3.47 (m, 2H), 1.17 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 363.6 [M+1].
35	メチル((2-(ピリミジン-5-イル)-2H-インダゾール-5-イル)イミノ)(p-トリル)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.41 (s, 2H), 9.19 (s, 1H), 8.90 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 7.83 (d, J = 8.3 Hz, 2H), 7.55-7.52 (m, 1H), 7.40 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.03 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 6.96 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 3.38 (s, 3H), 2.34 (s, 3H); ESI MS (m/z): 363.6 [M+1].
36	(3-フルオロフェニル)(メチル)((2-(ピリミジン-5-イル)-2H-インダゾール-5-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.41 (s, 2H), 9.19 (s, 1H), 8.93 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 7.82-7.77 (m, 2H), 7.69-7.64 (m, 1H), 7.57-7.52 (m, 2H), 7.06-7.00 (m, 2H), 3.48 (s, 3H) ESI MS (m/z): 367.6 [M+1].
37	(4-クロロフェニル)(メチル)((2-(ピリミジン-5-イル)-2H-インダゾール-5-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.41 (s, 2H), 9.19 (s, 1H), 8.92 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 7.96 (dt, J = 9.1, 2.3 Hz, 2H), 7.69 (dt, J = 9.1, 2.3 Hz, 2H), 7.57-7.54 (m, 1H), 7.03 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 6.98 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 3.45 (s, 3H); ESI MS (m/z): 383.7 [M+1].
38	(4-フルオロフェニル)(イソプロピル)((2-(ピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.20 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.84 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.58 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.35 (dq, J = 8.5, 1.3 Hz, 1H), 7.93-7.88 (m, 2H), 7.57 (ddd, J = 8.3, 4.6, 0.7 Hz, 1H), 7.54-7.52 (m, 1H), 7.48-7.42 (m, 2H), 7.06 (dd, J = 9.0, 2.0 Hz, 1H), 6.99 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 3.67-3.60 (m, 1H), 1.35 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 1.19 (d, J = 6.6 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 395.25 [M+1].

10

20

30

40

50

【表 1 - 5】

39	メチル(ピリジン-3-イル)((2-(ピリミジン-5-イル)-2H-インダゾール-5-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.43 (s, 2H), 9.21 (s, 1H), 9.10 (d, J = 1.7 Hz, 1H), 8.94 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.82 (dd, J = 4.9, 1.5 Hz, 1H), 8.35 (dt, J = 8.1, 2.0 Hz, 1H), 7.66 (dd, J = 7.7, 4.5 Hz, 1H), 7.58 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.09-7.05 (m, 2H), 3.55 (s, 3H); ESI MS (m/z): 351.05 [M+1].
40	((2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル)イミノ)(メチル)(ピリジン-3-イル)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.13 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 9.09 (dd, J = 2.4, 0.7 Hz, 1H), 8.90 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.80 (dd, J = 4.8, 1.6 Hz, 1H), 8.61 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.37-8.32 (m, 2H), 7.64 (ddd, J = 8.1, 4.8, 0.9 Hz, 1H), 7.56-7.53 (m, 1H), 7.06-7.01 (m, 2H), 3.53 (s, 3H); ESI MS (m/z): 368.10 [M+1].
41	エチル((2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル)イミノ)(イソプロピル)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.19 (s, 1H), 8.95 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.63 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.41 (dt, J = 10.0, 2.3 Hz, 1H), 7.55 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.16 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.04 (dd, J = 9.0, 2.0 Hz, 1H), 3.54 (td, J = 13.7, 6.8 Hz, 1H), 3.28 (t, J = 7.3 Hz, 2H), 1.37 (dd, J = 15.2, 8.3 Hz, 3H), 1.32-1.28 (m, 3H), 1.26-1.19 (m, 3H); ESI MS (m/z): 347.10 [M+1].
42	((2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル)イミノ)(メチル)(ベンチル)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.20 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 8.96 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.63 (d, J = 2.9 Hz, 1H), 8.42 (dt, J = 10.0, 2.3 Hz, 1H), 7.57 (dt, J = 9.1, 0.9 Hz, 1H), 7.14 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 6.99 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.35 (dd, J = 9.8, 6.1 Hz, 2H), 3.14 (s, 3H), 1.80-1.72 (m, 2H), 1.38-1.26 (m, 4H), 0.84 (t, J = 7.1 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 361.10 [M+1].
43	ジエチル((2-(ピリダジン-4-イル)-2H-インダゾール-5-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.99 (q, J = 1.2 Hz, 1H), 9.36 (dd, J = 5.9, 1.0 Hz, 1H), 9.11 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.26 (q, J = 2.9 Hz, 1H), 7.58 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.14 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.04 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.35 (d, J = 7.3 Hz, 3H), 3.30 (s, 1H), 1.25 (q, J = 7.5 Hz, 6H); ESI MS (m/z): 316.05 [M+1].
44	ベンジル(メチル)((2-(ピリダジン-4-イル)-2H-インダゾール-5-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 10.00 (dd, J = 2.9, 1.0 Hz, 1H), 9.36 (dd, J = 5.7, 0.9 Hz, 1H), 9.13 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.27 (q, J = 2.9 Hz, 1H), 7.60 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.43-7.36 (m, 5H), 7.18 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 6.99 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 4.80 (d, J = 13.7 Hz, 1H), 4.72 (d, J = 13.7 Hz, 1H), 3.04 (s, 3H); ESI MS (m/z): 364.10 [M+1].
45	メチル(フェニル)((2-(ピリダジン-4-イル)-2H-インダゾール-5-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.92 (dd, J = 2.9, 1.0 Hz, 1H), 9.33 (dd, J = 5.9, 1.0 Hz, 1H), 9.04 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.20 (q, J = 2.9 Hz, 1H), 7.96 (dt, J = 6.6, 1.7 Hz, 2H), 7.68-7.59 (m, 3H), 7.54 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.06 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 6.94 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 3.43 (s, 3H); ESI MS (m/z): 350.15 [M+1].
46	(4-フルオロフェニル)(イソプロピル)((2-(ピリダジン-4-イル)-2H-インダゾール-5-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.92 (dd, J = 2.9, 1.0 Hz, 1H), 9.33 (dd, J = 5.9, 1.0 Hz, 1H), 9.03 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.20 (q, J = 2.9 Hz, 1H), 7.92-7.87 (m, 2H), 7.55 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.48-7.41 (m, 2H), 7.10 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 6.94 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 3.69-3.63 (m, 1H), 1.36-1.32 (m, 3H), 1.21-1.17 (m, 3H); ESI MS (m/z): 396.20 [M+1].
47	メチル(ベンチル)((2-(ピリダジン-4-イル)-2H-インダゾール-5-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.99 (q, J = 1.2 Hz, 1H), 9.36 (dd, J = 5.9, 1.0 Hz, 1H), 9.11 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.27 (q, J = 2.9 Hz, 1H), 7.60-7.57 (m, 1H), 7.13 (q, J = 1.0 Hz, 1H), 7.01 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 3.37 (dd, J = 10.1, 5.7 Hz, 2H), 3.16 (s, 3H), 1.79-1.72 (m, 2H), 1.38-1.26 (m, 4H), 0.84 (t, J = 7.1 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 344.20 [M+1].
48	エチル(イソプロピル)((2-(ピリダジン-	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.99 (dd, J = 2.9, 1.0 Hz, 1H), 9.36 (dd, J = 5.9, 1.0 Hz, 1H), 9.10 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.26 (q, J

10

20

30

40

50

【表 1 - 6】

	4-イル)-2H-インダゾール-5-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	= 2.9 Hz, 1H), 7.57 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.15 (q, J = 1.0 Hz, 1H), 7.07 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 3.59-3.52 (m, 1H), 3.33-3.29 (m, 2H), 1.37 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 1.30 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 1.24 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 330.20 [M+1].
49	メチル((2-(ピリダジン-4-イル)-2H-インダゾール-5-イル)イミノ)(ピリジン-3-イル)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.93 (dd, J = 2.9, 1.0 Hz, 1H), 9.34 (dd, J = 5.9, 1.0 Hz, 1H), 9.09 (dd, J = 2.3, 0.6 Hz, 1H), 9.06 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.81 (dd, J = 4.8, 1.6 Hz, 1H), 8.34 (ddd, J = 8.1, 2.3, 1.6 Hz, 1H), 8.21 (q, J = 2.9 Hz, 1H), 7.65 (ddd, J = 8.1, 4.9, 0.7 Hz, 1H), 7.57 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.07 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 6.99 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 3.54 (s, 3H); ESI MS (m/z): 351.10 [M+1].
50	(4-クロロフェニル)(メチル)((2-(ピリダジン-4-イル)-2H-インダゾール-5-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.93 (dd, J = 2.9, 1.0 Hz, 1H), 9.34 (dd, J = 5.9, 1.0 Hz, 1H), 9.05 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.21 (q, J = 2.9 Hz, 1H), 7.96 (dt, J = 9.0, 2.3 Hz, 2H), 7.69 (dt, J = 9.0, 2.3 Hz, 2H), 7.55 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.05 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 6.94 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 3.46 (s, 3H); ESI MS (m/z): 384.15 [M+1].
51	((2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル)イミノ)(メチル)(p-トリル)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.13 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.88 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.61 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.35 (dt, J = 10.1, 2.3 Hz, 1H), 7.83 (dd, J = 6.6, 1.7 Hz, 2H), 7.52 (dt, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.40 (d, J = 7.9 Hz, 2H), 7.03 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 6.95 (q, J = 1.0 Hz, 1H), 3.38 (s, 3H), 2.34 (s, 3H); ESI MS (m/z): 380.9 [M+1].
52	メチル((2-(ピリダジン-4-イル)-2H-インダゾール-5-イル)イミノ)(p-トリル)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.93 (dd, J = 2.9, 1.0 Hz, 1H), 9.33 (dd, J = 5.9, 1.0 Hz, 1H), 9.03 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.20 (q, J = 2.9 Hz, 1H), 7.83 (d, J = 8.3 Hz, 2H), 7.54 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.40 (d, J = 7.8 Hz, 2H), 7.05 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 6.92 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 3.39 (s, 3H), 2.34 (s, 3H); ESI MS (m/z): 364.3 [M+1].
53	エチル((2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル)イミノ)(フェニル)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.12 (s, 1H), 8.88 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.61 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.35 (dt, J = 10.2, 2.3 Hz, 1H), 7.92-7.89 (m, 2H), 7.68-7.59 (m, 3H), 7.53 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.06 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 6.97 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 3.56-3.47 (m, 2H), 1.19-1.15 (m, 3H); ESI MS (m/z): 380.9 [M+1].
54	エチル(メチル)((2-(ピリダジン-4-イル)-2H-インダゾール-5-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 10.00 (q, J = 1.2 Hz, 1H), 9.36 (dd, J = 5.9, 1.0 Hz, 1H), 9.11 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.27 (q, J = 2.9 Hz, 1H), 7.59 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.14 (q, J = 1.0 Hz, 1H), 7.02 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 3.39 (q, J = 7.4 Hz, 2H), 3.14 (s, 3H), 1.29 (t, J = 7.5 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 301.9 [M+1].
55	(4-クロロフェニル)((2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル)イミノ)(メチル)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.13 (s, 1H), 8.90 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.61 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.36 (dt, J = 10.0, 2.3 Hz, 1H), 7.96 (dt, J = 9.0, 2.3 Hz, 2H), 7.69 (dt, J = 9.1, 2.2 Hz, 2H), 7.54 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.02 (dd, J = 9.2, 2.0 Hz, 1H), 6.96 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 3.45 (s, 3H); ESI MS (m/z): 400.9 [M+1].
56	1-((2-(ピリダジン-4-イル)-2H-インダゾール-5-イル)イミノ)テトラヒドロ-1H-λ ⁶ -チオフェン-1-オキシド	¹ H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 9.85 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 9.30 (t, J = 5.9 Hz, 1H), 8.38 (s, 1H), 8.03-8.00 (m, 1H), 7.63 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.24 (s, 1H), 7.14 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 3.53-3.46 (m, 2H), 3.26-3.19 (m, 2H), 2.39-2.29 (m, 5H), 1.33-1.25 (m, 3H); ESI MS (m/z): 313.9 [M+1].
57	(3-フルオロフェニル)(メチル)((2-(ピリダジン-4-イル)-2H-イ	¹ H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 9.78 (q, J = 1.2 Hz, 1H), 9.26 (dd, J = 5.9, 1.0 Hz, 1H), 8.29 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 7.93 (q, J = 2.9 Hz, 1H), 7.78 (dq, J = 7.8, 0.9 Hz, 1H), 7.72-7.69 (m,

10

20

30

40

50

【表 1 - 7】

	ンダゾール-5-イル)イミ ノ)-λ ⁶ -スルファノ ン	¹ H, 7.59-7.50 (m, 2H), 7.29 (tdd, J = 8.3, 2.5, 0.9 Hz, 1H), 7.16 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 7.12 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 3.30 (s, 3H); ESI MS (m/z): 368 [M+1].
58	(3-フルオロフェニ ル)((2-(5-フルオロピ リジン-3-イル)-2 <i>H</i> イン ダゾール-5-イル)イミ ノ)(メチル)-λ ⁶ -ス ルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 8.92-8.19 (m, 2H), 8.91 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.46 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.20 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.02 (dt, J = 9.4, 2.4 Hz, 1H), 7.79 (dq, J = 7.8, 0.9 Hz, 1H), 7.72 (dt, J = 7.8, 2.1 Hz, 1H), 7.59 (dt, J = 9.0, 1.0 Hz, 1H), 7.52 (td, J = 8.1, 5.1 Hz, 1H), 7.31-7.27 (m, 1H), 7.17-7.14 (m, 2H), 3.30 (s, 3H); ESI MS (m/z): 384.9 [M+1].
59	フェニル((2-(ピリジ ン-3-イル)-2 <i>H</i> インダ ゾール-5-イル)イミ ノ)(3,3,3-トリフルオ ロプロピル)-λ ⁶ -スル ファノン	¹ H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 9.09 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.60 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.21-8.18 (m, 2H), 7.98-7.96 (m, 2H), 7.66-7.55 (m, 4H), 7.46-7.42 (m, 1H), 7.18-7.14 (m, 2H), 3.61-3.55 (m, 1H), 3.49-3.41 (m, 1H), 2.78-2.64 (m, 2H); ESI MS (m/z): 431 [M+1].
60	(4-メトキシフェニ ル)((2-(ピリジン-3- イル)-2 <i>H</i> インダゾー ル-5-イル)イミ ノ)(3,3,3-トリフルオ ロプロピル)-λ ⁶ -スル ファノン	¹ H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 9.09 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.60 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.19 (ddd, J = 8.6, 2.9, 1.3 Hz, 2H), 8.00 (dd, J = 7.8, 1.7 Hz, 1H), 7.57-7.52 (m, 2H), 7.43 (ddd, J = 8.3, 4.9, 0.7 Hz, 1H), 7.15 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.09-7.05 (m, 2H), 7.01-6.99 (m, 1H), 3.96 (s, 3H), 3.89-3.72 (m, 2H), 2.86-2.75 (m, 1H), 2.62-2.51 (m, 1H); ESI MS (m/z): 461 [M+1].
61	(4-フルオロフェニ ル)((2-(ピリジン-3- イル)-2 <i>H</i> インダゾー ル-5-イル)イミ ノ)(3,3,3-トリフルオ ロプロピル)-λ ⁶ -スル ファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.21 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.88 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.59 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.36 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 8.06-8.02 (m, 2H), 7.60-7.55 (m, 2H), 7.50-7.44 (m, 2H), 7.08-7.04 (m, 2H), 3.90-3.76 (m, 2H), 2.82-2.72 (m, 2H); ESI MS (m/z): 449 [M+1].
62	フェニル((2-(ピリミ ジン-5-イル)-2 <i>H</i> イン ダゾール-5-イル)イミ ノ)(3,3,3-トリフルオ ロプロピル)-λ ⁶ -スル ファノン	¹ H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 9.25 (s, 2H), 9.19 (s, 1H), 8.18 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 7.98-7.95 (m, 2H), 7.67-7.55 (m, 4H), 7.19-7.15 (m, 2H), 3.63-3.41 (m, 2H), 2.83-2.61 (m, 2H); ESI MS (m/z): 432 [M+1].
63	(4-メトキシフェニ ル)((2-(ピリミジン- 5-イル)-2 <i>H</i> インダゾ ール-5-イル)イミ ノ)(3,3,3-トリフルオ ロプロピル)-λ ⁶ -スル ファノン	¹ H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 9.25 (s, 2H), 9.19 (s, 1H), 8.17 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.00 (dd, J = 8.1, 1.7 Hz, 1H), 7.57-7.52 (m, 2H), 7.13-7.06 (m, 3H), 7.01-6.99 (m, 1H), 3.96 (s, 3H), 3.89-3.71 (m, 2H), 2.82-2.77 (m, 1H), 2.61-2.55 (m, 1H); ESI MS (m/z): 462.2 [M+1].
64	(4-フルオロフェニ ル)((2-(ピリミジン- 5-イル)-2 <i>H</i> インダゾ ール-5-イル)イミ ノ)(3,3,3-トリフルオ ロプロピル)-λ ⁶ -スル ファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.42 (s, 2H), 9.20 (s, 1H), 8.94 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.04 (dd, J = 8.9, 5.3 Hz, 2H), 7.58 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.47 (t, J = 8.9 Hz, 2H), 7.09 (dd, J = 9.0, 2.0 Hz, 1H), 7.04 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 3.88-3.81 (m, 2H), 2.81-2.73 (m, 2H); ESI MS (m/z): 450 [M+1].

10

20

30

40

50

【表 1 - 8】

65	((2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)イミノ)(フェニル)(3,3,3-トリフルオロプロピル)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 8.91 (d, J = 1.7 Hz, 1H), 8.46 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.18 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.03-7.95 (m, 3H), 7.66-7.55 (m, 4H), 7.16 (dd, J = 8.8, 2.0 Hz, 2H), 3.62-3.41 (m, 2H), 2.82-2.60 (m, 2H); ESI MS (m/z): 449 [M+1].
66	((2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)イミノ)(4-メトキシフェニル)(3,3,3-トリフルオロプロピル)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 8.91 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.46 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.18 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.03-7.99 (m, 2H), 7.57-7.52 (m, 2H), 7.12 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.09-7.05 (m, 2H), 7.00 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 3.95 (d, J = 10.5 Hz, 3H), 3.89-3.71 (m, 2H), 2.82-2.52 (m, 2H); ESI MS (m/z): 478.9 [M+1].
67	(4-フルオロフェニル)((2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)イミノ)(3,3,3-トリフルオロプロピル)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 8.91 (t, J = 0.8 Hz, 1H), 8.47 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.19 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.04-7.95 (m, 3H), 7.61-7.59 (m, 1H), 7.26-7.21 (m, 2H), 7.15-7.12 (m, 2H), 3.63-3.55 (m, 1H), 3.48-3.40 (m, 1H), 2.83-2.61 (m, 2H); ESI MS (m/z): 466.9 [M+1].
68	フェニル((2-(ピリダジン-4-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)イミノ)(3,3,3-トリフルオロプロピル)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 9.77 (dd, J = 2.9, 1.0 Hz, 1H), 9.26 (dd, J = 5.9, 1.0 Hz, 1H), 8.27 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 7.98-7.92 (m, 3H), 7.67-7.63 (m, 1H), 7.60-7.56 (m, 3H), 7.17 (dd, J = 9.3, 2.2 Hz, 1H), 7.10 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 3.63-3.41 (m, 2H), 2.83-2.60 (m, 2H); ESI MS (m/z): 432.2 [M+1].
69	(4-メトキシフェニル)((2-(ピリダジン-4-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)イミノ)(3,3,3-トリフルオロプロピル)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 9.78 (q, J = 1.3 Hz, 1H), 9.26 (dd, J = 5.6, 1.0 Hz, 1H), 8.29 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.00-7.93 (m, 3H), 7.59 (dt, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.25-7.22 (m, 2H), 7.15 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 7.09 (q, J = 1.0 Hz, 1H), 3.63-3.40 (m, 2H), 2.84-2.61 (m, 2H); ESI MS (m/z): 462.3 [M+1].
70	(4-フルオロフェニル)((2-(ピリダジン-4-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)イミノ)(3,3,3-トリフルオロプロピル)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 9.78 (q, J = 1.3 Hz, 1H), 9.26 (dd, J = 5.6, 1.0 Hz, 1H), 8.29 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.00-7.93 (m, 3H), 7.59 (dt, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.25-7.22 (m, 2H), 7.15 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 7.09 (q, J = 1.0 Hz, 1H), 3.63-3.40 (m, 2H), 2.84-2.61 (m, 2H); ESI MS(m/z): 450.3 [M+1].
71	エチル(イソプロピル)((2-(ピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-4-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.34 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.02 (s, 1H), 8.61 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.51-8.48 (m, 1H), 7.61-7.58 (m, 1H), 7.17-7.08 (m, 2H), 6.61 (d, J = 6.4 Hz, 1H), 3.64-3.57 (m, 1H), 3.40-3.34 (m, 2H), 1.44 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 1.36 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 1.27 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 329.3 [M+1].
72	ジメチル((2-(ピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-4-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.32 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.99 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.60 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.50-8.47 (m, 1H), 7.61-7.58 (m, 1H), 7.20-7.12 (m, 2H), 6.58 (dd, J = 6.8, 0.7 Hz, 1H), 3.32 (s, 6H); ESI MS (m/z): 287.1 [M+1].

10

20

30

40

50

【表 1 - 9】

73	ジエチル((2-(ピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-4-イル)イミノ)- λ^6 -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.33 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 9.01 (s, 1H), 8.60 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.51-8.48 (m, 1H), 7.61-7.58 (m, 1H), 7.18-7.10 (m, 2H), 6.59 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 3.39 (q, J = 7.4 Hz, 4H), 1.30 (t, J = 7.3 Hz, 6H) ESI MS (m/z): 315.15 [M+1].
74	イソプロピル((2-(ピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-4-イル)イミノ)- λ^6 -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 9.19 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.63 (dd, J = 4.9, 1.5 Hz, 1H), 8.59 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.30-8.27 (m, 1H), 7.48-7.45 (m, 1H), 7.37 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.21 (dd, J = 8.8, 7.1 Hz, 1H), 6.79-6.77 (m, 1H), 3.55-3.48 (m, 1H), 3.02 (s, 3H), 1.58 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 1.54 (d, J = 6.8 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 315.3 [M+1].
75	((2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-4-イル)イミノ)ジイソブチル- λ^6 -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 9.01 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.56 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.48 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.10 (dt, J = 9.3, 2.3 Hz, 1H), 7.32-7.29 (m, 1H), 7.20 (dd, J = 8.8, 7.1 Hz, 1H), 6.74 (dd, J = 7.3, 0.5 Hz, 1H), 3.25 (dd, J = 14.2, 6.1 Hz, 2H), 3.08 (td, J = 13.8, 6.6 Hz, 2H), 2.49-2.39 (m, 2H), 1.16-1.11 (m, 12H); ESI MS (m/z): 389.4 [M+1].
76	ジプロピル((2-(ピリミジン-5-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-4-イル)イミノ)- λ^6 -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 9.35 (s, 2H), 9.22 (s, 1H), 8.59 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 7.35 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.21 (dd, J = 8.8, 7.1 Hz, 1H), 6.76 (dd, J = 7.1, 0.5 Hz, 1H), 3.30-3.16 (m, 4H), 1.97-1.88 (m, 4H), 1.07 (q, J = 7.3 Hz, 6H) ESI MS (m/z): 344.3 [M+1].
77	((2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-4-イル)イミノ)ジプロピル- λ^6 -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 9.02 (d, J = 1.7 Hz, 1H), 8.59 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.49 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.11 (dt, J = 9.3, 2.3 Hz, 1H), 7.34 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.20 (dd, J = 8.8, 7.1 Hz, 1H), 6.76-6.74 (m, 1H), 3.30-3.16 (m, 4H), 2.96 (s, 1H), 2.88 (d, J = 0.5 Hz, 1H), 1.98-1.88 (m, 4H), 1.08 (t, J = 7.5 Hz, 6H); ESI MS (m/z): 361 [M+1].
78	ジプロピル((2-(ピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-4-イル)イミノ)- λ^6 -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.33 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.98 (s, 1H), 8.61 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.50-8.47 (m, 1H), 7.60 (dd, J = 8.1, 4.6 Hz, 1H), 7.17-7.09 (m, 2H), 6.58 (d, J = 6.1 Hz, 1H), 3.42-3.33 (m, 4H), 1.81 (dt, J = 23.6, 7.4 Hz, 4H), 0.98 (t, J = 7.5 Hz, 6H); ESI MS (m/z): 343.3 [M+1].
79	ジイソブチル((2-(ピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)イミノ)- λ^6 -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.27 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.92 (s, 1H), 8.60 (d, J = 3.4 Hz, 1H), 8.41 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 7.62-7.55 (m, 4H), 7.16 (s, 1H), 6.98 (dd, J = 9.0, 2.0 Hz, 1H), 3.24-3.17 (m, 4H), 2.29 (t, J = 6.6 Hz, 2H), 1.09-1.01 (m, 12H); ESI MS (m/z): 371.1 [M+1].
80	((2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)イミノ)ジイソブチル- λ^6 -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.19 (s, 1H), 8.97 (s, 1H), 8.63 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.41 (dt, J = 10.1, 2.3 Hz, 1H), 7.56 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.14 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 7.00 (dd, J = 9.0, 2.0 Hz, 1H), 3.27-3.18 (m, 4H), 2.32-2.24 (m, 2H), 1.09-1.01 (m, 12H); ESI MS (m/z): 389.2 [M+1].
81	1-((2-(ピリミジン-5-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-4-イル)イミノ)テトラヒドロ-1 <i>H</i> - λ^6 -チオフェン 1-オキシド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.54 (s, 2H), 9.21 (s, 1H), 9.13 (s, 1H), 7.22-7.16 (m, 2H), 6.52 (dd, J = 6.4, 1.2 Hz, 1H), 3.48-3.33 (m, 4H), 2.32-2.10 (m, 4H); ESI MS (m/z): 314 [M+1].
82	ジメチル((2-(ピリミジン-5-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-4-イル)イミノ)- λ^6 -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.53 (s, 2H), 9.21 (s, 1H), 9.09 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 7.19-7.15 (m, 2H), 6.60 (dd, J = 6.5, 1.3 Hz, 1H), 3.33 (s, 6H); ESI MS (m/z): 287.9 [M+1].

10

20

30

40

50

【表 1 - 10】

83	ジエチル((2-(ピリミジン-5-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-4-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.54 (s, 2H), 9.21 (s, 1H), 9.11 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 7.19-7.12 (m, 2H), 6.61 (dd, J = 6.6, 1.0 Hz, 1H), 3.40 (q, J = 7.4 Hz, 4H), 1.31 (t, J = 7.3 Hz, 6H) ESI MS (m/z): 316.1 [M+1].
84	イソプロピル(メチル)((2-(ピリミジン-5-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-4-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.54 (d, J = 3.7 Hz, 2H), 9.21 (s, 1H), 9.11 (d, J = 0.5 Hz, 1H), 7.19-7.13 (m, 2H), 6.62 (dd, J = 6.1, 1.5 Hz, 1H), 3.63-3.56 (m, 1H), 3.15 (s, 3H), 1.48 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 1.42 (d, J = 6.8 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 315.9 [M+1].
85	エチル(イソプロピル)((2-(ピリミジン-5-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-4-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.55 (s, 2H), 9.21 (s, 1H), 9.12 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 7.18-7.11 (m, 2H), 6.62 (dd, J = 6.5, 1.3 Hz, 1H), 3.65-3.58 (m, 1H), 3.41-3.34 (m, 2H), 1.45 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 1.36 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 1.28 (t, J = 7.5 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 330[M+1].
86	1-((2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-4-イル)イミノ)テトラヒドロ-1 <i>H</i> -λ ⁶ -チオフェン 1-オキシド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.26 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 9.10 (d, J = 0.5 Hz, 1H), 8.63-8.63 (m, 1H), 8.53 (dt, J = 10.0, 2.3 Hz, 1H), 7.20-7.15 (m, 2H), 6.51 (dd, J = 6.0, 1.8 Hz, 1H), 3.47-3.34 (m, 4H), 2.31-2.10 (m, 4H); ESI MS (m/z): 331[M+1].
87	((2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-4-イル)イミノ)ジメチル-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.25 (t, J = 1.3 Hz, 1H), 9.06 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.63-8.63 (m, 1H), 8.52 (dt, J = 10.0, 2.3 Hz, 1H), 7.20-7.14 (m, 2H), 6.59 (dd, J = 6.2, 1.6 Hz, 1H), 3.32 (s, 6H); ESI MS (m/z): 305[M+1].
88	1-((2-(ピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-4-イル)イミノ)テトラヒドロ-1 <i>H</i> -λ ⁶ -チオフェン 1-オキシド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.33 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 9.03 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.60 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.49 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.60 (ddd, J = 8.4, 4.8, 0.7 Hz, 1H), 7.21-7.13 (m, 2H), 6.51 (dd, J = 6.7, 0.9 Hz, 1H), 3.47-3.41 (m, 2H), 3.36-3.33 (m, 2H), 2.29-2.21 (m, 2H), 2.20-2.14 (m, 2H), 1.90 (s, 1H), 1.22 (s, 1H); ESI MS (m/z): 389.2 [M+1].
89	ジエチル((2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-4-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.27 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 9.08 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.63-8.63 (m, 1H), 8.53 (dt, J = 10.0, 2.3 Hz, 1H), 7.17-7.11 (m, 2H), 6.59 (dd, J = 6.5, 1.3 Hz, 1H), 3.39 (q, J = 7.4 Hz, 4H), 1.31 (t, J = 7.3 Hz, 6H); ESI MS (m/z): 333 [M+1].
90	((2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-4-イル)イミノ)(イソプロピル)(メチル)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.27 (t, J = 1.3 Hz, 1H), 9.08 (s, 1H), 8.64-8.63 (m, 1H), 8.54 (dt, J = 10.1, 2.4 Hz, 1H), 7.17-7.12 (m, 2H), 6.61 (dd, J = 5.7, 2.1 Hz, 1H), 3.62-3.55 (m, 1H), 3.14 (s, 3H), 1.48 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 1.42 (d, J = 6.8 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 333 [M+1].
91	エチル((2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-4-イル)イミノ)(イソプロピル)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.27 (q, J = 1.0 Hz, 1H), 9.09 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.63-8.63 (m, 1H), 8.54 (dt, J = 10.1, 2.4 Hz, 1H), 7.16-7.10 (m, 2H), 6.61 (dd, J = 6.2, 1.6 Hz, 1H), 3.64-3.58 (m, 1H), 3.41-3.35 (m, 2H), 1.45 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 1.36 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 1.28 (t, J = 7.5 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 347.2 [M+1].
99	イソプロピル((2-(ピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)イ	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.27 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.94 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 8.60 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.41 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.62-7.58 (m, 2H), 7.21 (q, J = 0.9 Hz, 1H),

10

20

30

40

50

【表 1 - 1 1】

	ミノ) (3, 3, 3-トリフル オロプロピル)-λ ⁶ -ス ルファノン	7.04 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.70-3.63 (m, 1H), 3.52-3.48 (m, 2H), 2.85-2.73 (m, 2H), 1.40 (d, J = 6.7 Hz, 3H), 1.34 (d, J = 6.7 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 397 [M+1].
100	((2-(5-フルオロピリ ジン-3-イル)-2 <i>H</i> -イン ダゾール-5-イル)イミ ノ) (イソプロピ ル) (3, 3, 3-トリフルオ ロプロピル)-λ ⁶ -スル ファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.20 (s, 1H), 8.99 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.64 (d, J = 2.8 Hz, 1H), 8.43 (dt, J = 10.1, 2.4 Hz, 1H), 7.59 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 7.20 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.06 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 3.71-3.61 (m, 1H), 3.53-3.49 (m, 2H), 2.85-2.72 (m, 2H), 1.40 (d, J = 6.7 Hz, 3H), 1.34 (d, J = 7.0 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 415 [M+1].
101	イソプロピル((2-(ピ リジン-5-イル)-2 <i>H</i> - インダゾール-5-イル) イミノ) (3, 3, 3-トリフ ルオロプロピル)-λ ⁶ - スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.47 (s, 2H), 9.22 (s, 1H), 9.00 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.22 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.06 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.71-3.64 (m, 1H), 3.53-3.49 (m, 2H), 2.85-2.73 (m, 2H), 1.40 (d, J = 6.7 Hz, 3H), 1.34 (d, J = 6.7 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 398 [M+1].
102	イソプロピル((2-(ピ リジン-3-イル)-2 <i>H</i> - インダゾール-4-イル)イ ミノ) (3, 3, 3-トリフル オロプロピル)-λ ⁶ -ス ルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.34 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 9.07 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.62 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.49 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.61 (ddd, J = 8.3, 4.7, 0.7 Hz, 1H), 7.21 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.13 (dd, J = 8.6, 7.0 Hz, 1H), 6.63-6.61 (m, 1H), 3.78-3.71 (m, 1H), 3.58 (q, J = 5.2 Hz, 2H), 2.92-2.79 (m, 2H), 1.47 (d, J = 6.7 Hz, 3H), 1.39 (d, J = 6.7 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 397 [M+1].
103	イソプロピル((2-(ピ リジン-5-イル)-2 <i>H</i> - インダゾール-4-イル)イ ミノ) (3, 3, 3-トリフル オロプロピル)-λ ⁶ - スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.55 (d, J = 3.1 Hz, 2H), 9.23 (s, 1H), 9.16 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 7.22 (dd, J = 7.9, 0.9 Hz, 1H), 7.15 (dd, J = 8.7, 6.9 Hz, 1H), 6.64 (dd, J = 7.0, 0.6 Hz, 1H), 3.79-3.72 (m, 1H), 3.61-3.57 (m, 2H), 2.91-2.79 (m, 2H), 1.48 (d, J = 6.7 Hz, 3H), 1.39 (d, J = 6.7 Hz, 3H) ESI MS (m/z): 398 [M+1].
104	((2-(5-フルオロピリ ジン-3-イル)-2 <i>H</i> -イン ダゾール-4-イル)イミ ノ) (イソプロピ ル) (3, 3, 3-トリフルオ ロプロピル)-λ ⁶ -スル ファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.27 (s, 1H), 9.13 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.65 (d, J = 2.8 Hz, 1H), 8.53 (dt, J = 10.2, 2.4 Hz, 1H), 7.20 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.14 (dd, J = 8.7, 6.9 Hz, 1H), 6.62 (dd, J = 6.9, 0.8 Hz, 1H), 3.78-3.71 (m, 1H), 3.61-3.57 (m, 2H), 2.91-2.79 (m, 2H), 1.48 (d, J = 6.7 Hz, 3H), 1.39 (d, J = 7.0 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 415 [M+1].
108	エチル((7-フルオロ- 2-(ピリジン-3-イル)- 2 <i>H</i> -インダゾール-4-イ ル)イミノ) (イソプロ ピル)-λ ⁶ -スルファノ ン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.35 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 9.12 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.65 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.52 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.62 (ddd, J = 8.3, 4.6, 0.7 Hz, 1H), 6.91 (dd, J = 11.7, 7.8 Hz, 1H), 6.48 (dd, J = 7.9, 3.3 Hz, 1H), 3.62-3.55 (m, 1H), 2.97-2.87 (m, 1H), 1.43 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 1.35 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 1.26 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 1.22-1.17 (m, 4H); ESI MS (m/z): 347 [M+1].
109	エチル((7-フルオロ- 2-(ピリジン-3-イル)- 2 <i>H</i> -インダゾール-4-イ ル)イミノ) (メチル)- λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.33 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 9.11 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.64 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.51 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.62 (ddd, J = 8.4, 4.8, 0.7 Hz, 1H), 6.93 (dd, J = 11.9, 7.9 Hz, 1H), 6.46 (dd, J = 7.9, 3.3 Hz, 1H), 3.42 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 3.19 (s, 3H), 1.35 (t, J = 7.3 Hz, 3H) ESI MS (m/z): 319 [M+1].
136	エチル(プロピル)((2- ピリジン-3-イル)- 2 <i>H</i> -インダゾール-4-イ	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.33 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.99 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.61 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.49 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.60 (ddd, J = 8.3, 4.6, 0.7 Hz, 1H), 7.17 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.11 (dd, J = 8.7, 7.0 Hz, 1H), 6.59 (dd, J = 6.8, 1.0

10

20

30

40

50

【表 1 - 1 2】

	ル)イミノ)-λ ⁶ -スル ファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.26 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.91 (s, 1H), 8.60 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.40 (dq, J = 8.4, 1.3 Hz, 1H), 7.62-7.55 (m, 2H), 7.17 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 6.99 (dd, J = 9.0, 2.0 Hz, 1H), 3.33 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 3.29-3.25 (m, 3H), 1.75 (q, J = 7.8 Hz, 2H), 1.28-1.15 (m, 5H), 0.97 (t, J = 7.5 Hz, 3H); ESI MS(m/z): 328.55 [M+1].
137	エチル(プロピル)((2- (ピリジン-3-イル)- 2 <i>H</i> インダゾール 5 イ ル)イミノ)-λ ⁶ -スル ファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.26 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.91 (s, 1H), 8.60 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.40 (dq, J = 8.4, 1.3 Hz, 1H), 7.62-7.55 (m, 2H), 7.17 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 6.99 (dd, J = 9.0, 2.0 Hz, 1H), 3.33 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 3.29-3.25 (m, 3H), 1.75 (q, J = 7.8 Hz, 2H), 1.28-1.15 (m, 5H), 0.97 (t, J = 7.5 Hz, 3H); ESI MS(m/z): 328.95 [M+1].
138	エチル((2-(5-フルオ ロピリジン-3-イル)- 2 <i>H</i> インダゾール-4-イ ル)イミノ)(プロピ ル)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.27 (s, 1H), 9.07 (d, J = 0.5 Hz, 1H), 8.63 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.54 (dt, J = 10.2, 2.3 Hz, 1H), 7.17-7.11 (m, 2H), 6.59 (dd, J = 6.2, 1.6 Hz, 1H), 3.43-3.34 (m, 4H), 1.81 (dt, J = 23.5, 7.3 Hz, 2H), 1.31 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 0.99 (t, J = 7.5 Hz, 3H); ESI MS(m/z): 346.55 [M+1].
139	((2-(5-フルオロピリ ジン-3-イル)-2 <i>H</i> ピラ ゾロ[3, 4- <i>b</i>]ピリジン- 5-イル)イミノ)ジプロ ピル-λ ⁶ -スルファノ ン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.21 (s, 1H), 9.00 (s, 1H), 8.67 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.46 (dt, J = 10.1, 2.4 Hz, 1H), 8.33 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 7.55 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 3.37-3.33 (m, 4H), 1.77 (dt, J = 23.8, 7.3 Hz, 4H), 0.97 (t, J = 7.3 Hz, 6H) ESI MS (m/z):361.55 [M+1].
140	(3-フルオロピリジン- 2-イル)((2-(5-フルオ ロピリジン-3-イル)- 2 <i>H</i> ピラゾロ[3, 4- <i>b</i>]ピ リジン-5-イル)イミ ノ)(メチル)-λ ⁶ -スル ファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.17 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 9.00 (s, 1H), 8.66 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.58 (td, J = 3.0, 1.4 Hz, 1H), 8.43 (dt, J = 9.9, 2.3 Hz, 1H), 8.34 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.03-7.98 (m, 1H), 7.81-7.77 (m, 1H), 7.49 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 3.66 (s, 3H); ESI MS (m/z):386.4 [M+1].
141	((2-(5-フルオロピリ ジン-3-イル)-2 <i>H</i> ピラ ゾロ[3, 4- <i>b</i>]ピリジン- 5-イル)イミノ)(メチ ル)(ピリジン-3-イ ル)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.15-9.13 (m, 2H), 8.94 (s, 1H), 8.83 (dd, J = 4.9, 1.5 Hz, 1H), 8.66 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.42-8.36 (m, 3H), 7.66 (ddd, J = 8.2, 4.8, 0.7 Hz, 1H), 7.40 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 3.61 (s, 3H); ESI MS(m/z):368.45 [M+1].
142	(2-クロロピリジン-3- イル)((2-(5-フルオロ ピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> ピラゾロ[3, 4- <i>b</i>]ピリ ジン-5-イル)イミ ノ)(メチル)-λ ⁶ -スル ファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.14 (s, 1H), 8.94 (s, 1H), 8.65 (td, J = 4.7, 2.0 Hz, 2H), 8.60 (dd, J = 7.8, 2.0 Hz, 1H), 8.42-8.39 (m, 2H), 7.71 (dd, J = 7.8, 4.6 Hz, 1H), 7.38 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 3.71 (s, 3H); ESI MS(m/z):402.4 [M+1].
143	(5-フルオロピリジン- 3-イル)((2-(5-フルオ ロピリジン-3-イル)- 2 <i>H</i> ピラゾロ[3, 4- <i>b</i>]ピ リジン-5-イル)イミ ノ)(メチル)-λ ⁶ -スル ファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.16 (s, 1H), 8.95 (s, 1H), 8.85-8.81 (m, 1H), 8.68-8.66 (m, 1H), 8.42 (dt, J = 10.0, 2.3 Hz, 1H), 8.33 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.29 (q, J = 4.3 Hz, 1H), 8.03 (td, J = 8.6, 2.9 Hz, 1H), 7.43 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 3.56 (s, 3H); ESI MS(m/z):386.45 [M+1].
144	(5-クロロピリジン-3- イル)((2-(5-フルオロ ピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> ピラゾロ[3, 4- <i>b</i>]ピリ	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.16 (s, 1H), 8.95 (s, 1H), 8.85-8.81 (m, 1H), 8.68-8.66 (m, 1H), 8.42 (dt, J = 10.0, 2.3 Hz, 1H), 8.33 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.29 (q, J = 4.3 Hz, 1H), 8.03 (td, J = 8.6, 2.9 Hz, 1H), 7.43 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 3.56 (s, 3H); ESI MS(m/z):402.45 [M+1].

10

20

30

40

50

【表 1 - 13】

	ジン-5-イル)イミノ(メチル)- λ^6 -スルファノン	
145	((2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-5-イル)イミノ(メチル)(6-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル)- λ^6 -スルファノン	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9.33 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 9.15 (s, 1H), 8.96 (d, J = 3.9 Hz, 1H), 8.67 (dd, J = 6.8, 2.4 Hz, 2H), 8.44-8.39 (m, 2H), 8.18 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.47 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 3.69 (s, 3H); ESI MS(m/z):437.05 [M+1].
146	ジメチル((2-(ピリジン-3-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-5-イル)イミノ)- λ^6 -スルファノン	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9.29 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.98 (s, 1H), 8.64 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.45 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 8.31 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 7.65-7.62 (m, 1H), 7.57 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 3.29 (s, 6H); ESI MS(m/z):287.5 [M+1].
147	エチル(メチル)((2-(ピリジン-3-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-5-イル)イミノ)- λ^6 -スルファノン	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9.29 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.97 (s, 1H), 8.64 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.44 (dq, J = 8.4, 1.3 Hz, 1H), 8.32 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 7.65-7.62 (m, 1H), 7.57 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 3.48-3.41 (m, 2H), 3.20 (s, 3H), 1.31 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS(m/z):301.5 [M+1].
148	エチル(イソプロピル)((2-(ピリジン-3-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-5-イル)イミノ)- λ^6 -スルファノン	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9.28 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.96 (s, 1H), 8.64 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.43 (dq, J = 8.4, 1.3 Hz, 1H), 8.34 (dd, J = 11.7, 2.7 Hz, 1H), 7.64 (dd, J = 8.3, 4.9 Hz, 1H), 7.59-7.57 (m, 1H), 3.66-3.56 (m, 1H), 3.40-3.33 (m, 2H), 1.39 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 1.32 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 1.25 (q, J = 7.1 Hz, 3H); ESI MS(m/z):329.55 [M+1].
149	ジプロピル((2-(ピリジン-3-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-5-イル)イミノ)- λ^6 -スルファノン	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9.28 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.96 (s, 1H), 8.64 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.44 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 8.32 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 7.63 (dd, J = 8.1, 4.4 Hz, 1H), 7.57 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 3.34 (dd, J = 9.7, 6.0 Hz, 4H), 1.77 (dt, J = 23.6, 7.4 Hz, 4H), 0.97 (t, J = 7.5 Hz, 6H); ESI MS(m/z):343.55 [M+1].
150	ジイソブチル((2-(ピリジン-3-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-5-イル)イミノ)- λ^6 -スルファノン	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9.28 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 8.97 (d, J = 4.0 Hz, 1H), 8.64 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.44 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 8.32 (d, J = 2.8 Hz, 1H), 7.65-7.62 (m, 1H), 7.56 (d, J = 2.8 Hz, 1H), 3.31-3.24 (m, 4H), 2.36-2.26 (m, 2H), 1.21-0.98 (m, 12H); ESI MS(m/z):371.65 [M+1].
151	(3-メトキシピリジン-2-イル)(メチル)((2-(ピリジン-3-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-5-イル)イミノ)- λ^6 -スルファノン	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9.25 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.93 (s, 1H), 8.62 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.40 (dq, J = 8.4, 1.3 Hz, 1H), 8.33 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.23 (dd, J = 4.4, 1.2 Hz, 1H), 7.74 (dd, J = 8.6, 1.2 Hz, 1H), 7.66-7.60 (m, 2H), 7.43 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 3.81 (s, 3H), 3.56 (s, 3H); ESI MS(m/z):380.45 [M+1].
152	(3-フルオロピリジン-2-イル)(メチル)((2-(ピリジン-3-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-5-イル)イミノ)- λ^6 -スルファノン	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9.24 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.97 (s, 1H), 8.63 (dd, J = 4.6, 1.2 Hz, 1H), 8.58 (d, J = 4.4 Hz, 1H), 8.40 (dq, J = 8.4, 1.3 Hz, 1H), 8.32 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.01 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 7.81-7.77 (m, 1H), 7.65-7.60 (m, 1H), 7.50 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 3.66 (s, 3H); ESI MS(m/z):368.45 [M+1].
153	(2-クロロピリジン-3-イル)(メチル)((2-(ピリジン-3-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-5-イル)イミノ)- λ^6 -スルファノン	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9.19 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.88 (t, J = 3.8 Hz, 1H), 8.62-8.59 (m, 2H), 8.56 (dd, J = 7.6, 1.8 Hz, 1H),

10

20

30

40

50

【表 1 - 1 4】

	リジン-3-イル)-2H-ピ ラゾロ [3, 4-b] ピリジ ン-5-イル) イミノ)- λ ⁶ -スルファノン	8.37-8.34 (m, 2H), 7.68 (dd, J = 7.8, 4.7 Hz, 1H), 7.58 (ddd, J = 8.4, 4.7, 0.6 Hz, 1H), 7.36 (d, J = 2.8 Hz, 1H), 3.68 (s, 3H); ESI MS(m/z):384.5 [M+1].
154	(5-クロロピリジン-3- イル) (メチル) ((2-(ピ リジン-3-イル)-2H-ピ ラゾロ [3, 4-b] ピリジ ン-5-イル) イミノ) - λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.24 (dd, J = 7.3, 2.8 Hz, 1H), 9.07 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 8.93-8.88 (m, 2H), 8.64-8.61 (m, 1H), 8.52 (t, J = 2.1 Hz, 1H), 8.41-8.37 (m, 2H), 7.64-7.60 (m, 1H), 7.46 (d, J = 2.8 Hz, 1H), 3.65 (d, J = 8.3 Hz, 3H) ESI MS(m/z):384.45 [M+1].
155	1-((2-(ピリジン-3-イ ル)-2H-ピラゾロ [3, 4- b] ピリジン-5-イル) イ ミノ) テトラヒドロ- 1H-λ ⁶ -チオフエン 1- オキシド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.29 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.98 (d, J = 4.0 Hz, 1H), 8.64 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.45 (dq, J = 8.4, 1.3 Hz, 1H), 8.33 (d, J = 2.8 Hz, 1H), 7.66-7.62 (m, 1H), 7.51 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 3.50-3.41 (m, 2H), 3.34 (s, 1H), 3.29 (t, J = 7.0 Hz, 1H), 2.32-2.19 (m, 2H), 2.18-2.08 (m, 2H); ESI MS(m/z):313.5 [M+1].
156	イソプロピル (メチ ル) ((2-(ピリジン-3- イル)-2H-ピラゾロ [3, 4-b] ピリジン-5-イ ル) イミノ)-λ ⁶ -スル ファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.29 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.97 (s, 1H), 8.64 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.44 (dq, J = 8.4, 1.3 Hz, 1H), 8.33 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 7.64 (dd, J = 8.6, 5.1 Hz, 1H), 7.59 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 3.58 (t, J = 6.8 Hz, 1H), 3.12 (s, 3H), 1.41 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 1.37 (d, J = 6.8 Hz, 3H) ESI MS(m/z):315.5 [M+1].
157	メチル ((2-(ピリジン- 3-イル)-2H-ピラゾロ [3, 4-b] ピリジン-5-イ ル) イミノ) (6-(トリフ ルオロメチル) ピリジ ン-3-イル)-λ ⁶ -スル ファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.33 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 9.22 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.91 (d, J = 4.0 Hz, 1H), 8.68-8.62 (m, 2H), 8.42 (d, J = 2.8 Hz, 1H), 8.39 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 8.18 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.63-7.60 (m, 1H), 7.48 (d, J = 2.8 Hz, 1H), 3.67 (d, J = 14.4 Hz, 3H); ESI MS(m/z):418.5 [M+1].
158	メチル (ピリジン-2-イ ル) ((2-(ピリジン-3- イル)-2H-ピラゾロ [3, 4-b] ピリジン-5-イ ル) イミノ)-λ ⁶ -スル ファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.23 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.91 (s, 1H), 8.78 (d, J = 3.9 Hz, 1H), 8.62 (dd, J = 4.6, 1.2 Hz, 1H), 8.39 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 8.30 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.18 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 8.11 (td, J = 7.7, 1.7 Hz, 1H), 7.68 (ddd, J = 7.5, 4.7, 1.2 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 8.1, 4.6 Hz, 1H), 7.43 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 3.55 (s, 3H); ESI MS(m/z): 350.5 [M+1].
159	(5-フルオロピリジン- 3-イル) (メチル) ((2- (ピリジン-3-イル)- 2H-ピラゾロ [3, 4-b] ピ リジン-5-イル) イミ ノ) λ ⁶ スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.23 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.91 (s, 1H), 8.82 (d, J = 2.8 Hz, 1H), 8.63 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.39 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 8.31 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.27 (q, J = 4.4 Hz, 1H), 8.03 (td, J = 8.7, 2.9 Hz, 1H), 7.62 (ddd, J = 8.3, 4.8, 0.6 Hz, 1H), 7.44 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 5.75 (s, 1H), 3.56 (s, 2H); ESI MS(m/z):368.45 [M+1].
160	1-((2-(5-クロロピリ ジン-3-イル)-2H-イン ダゾール-5-イル) イミ ノ) テトラヒドロ-1H- λ ⁶ -チオフエン 1-オキ シド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.26 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 8.99 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.66 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 8.60 (t, J = 2.2 Hz, 1H), 7.58 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.08 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.00 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.41-3.35 (m, 2H), 3.28-3.21 (m, 2H), 2.24- 2.18 (m, 2H), 2.14-2.06 (m, 2H) ESI MS(m/z):368.45 [M+1].
161	1-((2-(2-メチルピリ ジン-3-イル)-2H-イン ダゾール-5-イル) イミ	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.60 (dd, J = 4.8, 1.6 Hz, 1H), 8.48 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 7.91 (dd, J = 7.8, 1.5 Hz, 1H), 7.57 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.46 (dd, J = 7.7, 4.8 Hz, 1H), 7.14 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 6.98 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.41-3.34 (m, 2H), 3.25-3.18

10

20

30

40

50

【表 1 - 15】

	ノ)テトラヒドロ-1H- λ^6 -チオフェン 1-オキシド	(m, 2H), 2.42 (s, 3H), 2.24-2.19 (m, 2H), 2.15-2.07 (m, 3H); ESI MS(m/z):326.95 [M+1].
162	1-((2-(4-メチルピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル)イミノ)テトラヒドロ-1H- λ^6 -チオフェン 1-オキシド	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8.65 (s, 1H), 8.56 (d, J = 4.9 Hz, 1H), 8.50 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 7.57 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.51 (d, J = 5.1 Hz, 1H), 7.15 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 6.98 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.41-3.34 (m, 2H), 3.25-3.18 (m, 2H), 2.29 (s, 3H), 2.24-2.18 (m, 2H), 2.15-2.08 (m, 2H); ESI MS(m/z):326.95 [M+1].
163	1-((2-(6-メチルピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル)イミノ)テトラヒドロ-1H- λ^6 -チオフェン 1-オキシド	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9.11 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.87 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.28 (dd, J = 8.6, 2.7 Hz, 1H), 7.58 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.45 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.10 (t, J = 1.0 Hz, 1H), 6.97 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.41-3.34 (m, 2H), 3.26-3.16 (m, 2H), 2.54 (s, 3H), 2.27-2.05 (m, 4H); ESI MS(m/z):327.05 [M+1].
164	1-((2-(5-メチルピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル)イミノ)テトラヒドロ-1H- λ^6 -チオフェン 1-オキシド	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9.06 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.90 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.45 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.27-8.26 (m, 1H), 7.58 (dt, J = 9.1, 0.9 Hz, 1H), 7.10 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 6.98 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.41-3.34 (m, 2H), 3.26-3.20 (m, 2H), 2.42 (d, J = 0.5 Hz, 3H), 2.26-2.07 (m, 4H); ESI MS(m/z):326.65 [M+1].
165	((2-(5-クロロピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル)イミノ)ジメチル- λ^6 -スルファノン	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9.26 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.98 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 8.66 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 8.60 (t, J = 2.3 Hz, 1H), 7.57 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.14 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 6.98 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.23 (s, 6H); ESI MS(m/z):320.9 [M+1].
166	ジメチル((2-(5-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル)イミノ)- λ^6 -スルファノン	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9.60 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.10 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 9.00 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.78 (t, J = 1.8 Hz, 1H), 7.59 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.15 (t, J = 0.9 Hz, 1H), 7.00 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 3.24 (s, 6H); ESI MS(m/z):354.85 [M+1].
167	((2-(5-メトキシピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル)イミノ)ジメチル- λ^6 -スルファノン	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8.96 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.87 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 8.33 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 7.99 (t, J = 2.3 Hz, 1H), 7.59-7.56 (m, 1H), 7.15-7.14 (m, 1H), 6.97 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.94 (s, 3H), 3.23 (s, 6H); ESI MS(m/z):316.5 [M+1].
168	ジメチル((2-(5-メチルピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル)イミノ)- λ^6 -スルファノン	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9.06 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.90 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.45 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.27-8.26 (m, 1H), 7.56 (dt, J = 9.1, 0.9 Hz, 1H), 7.16-7.15 (m, 1H), 6.96 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.22 (s, 6H), 2.42 (d, J = 0.5 Hz, 3H); ESI MS(m/z):300.55 [M+1].
169	1-((2-(2,6-ジメチルピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル)イミノ)テトラヒドロ-1H- λ^6 -チオフェン 1-オキシド	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8.43 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 7.77 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 7.56 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.29 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.14 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 6.97 (dd, J = 9.0, 2.0 Hz, 1H), 3.41-3.34 (m, 2H), 3.24-3.18 (m, 2H), 2.53 (s, 3H), 2.35 (s, 3H), 2.25-2.19 (m, 2H), 2.16-2.05 (m, 2H); ESI MS(m/z):341 [M+1].
170	1-((2-(5-メトキシピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル)イ	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8.96 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.88 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 8.33 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 7.99 (t, J = 2.4 Hz, 1H), 7.59 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.09 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 6.98 (dd, J

10

20

30

40

【表 1 - 16】

	ミノ)テトラヒドロ- 1H-λ ⁶ -チオフェン 1- オキシド	= 9.2, 1.8 Hz, 1H), 3.98-3.91 (m, 3H), 3.41-3.35 (m, 2H), 3.27- 3.20 (m, 2H), 2.28-2.05 (m, 5H); ESI MS(m/z):342.95 [M+1].
171	1-((2-(5-(トリフルオ ロメチル)ピリジン-3- イル)-2H-インダゾール- 5-イル)イミノ)テ トラヒドロ-1H-λ ⁶ -チ オフェン 1-オキシド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.60 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.10 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 9.00 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.79 (t, J = 1.8 Hz, 1H), 7.61 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 7.09 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.01 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 3.42-3.35 (m, 2H), 3.29-3.22 (m, 2H), 2.26- 2.06 (m, 4H); ESI MS(m/z):380.85 [M+1].
173	ジメチル((2-(2-メチ ルピリジン-3-イル)- 2H-インダゾール-5-イ ル)イミノ)-λ ⁶ -スル ファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.60 (dd, J = 4.9, 1.5 Hz, 1H), 8.48 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 7.91 (dd, J = 7.9, 1.5 Hz, 1H), 7.56 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.45 (q, J = 4.1 Hz, 1H), 7.19 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 6.97 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 3.22 (s, 6H), 2.43 (s, 3H); ESI MS(m/z):300.55 [M+1].
174	ジメチル((2-(6-メチ ルピリジン-3-イル)- 2H-インダゾール-5-イ ル)イミノ)-λ ⁶ -スル ファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.11 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.87 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.28 (dd, J = 8.3, 2.7 Hz, 1H), 7.56 (dt, J = 9.1, 0.9 Hz, 1H), 7.45 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.15 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 6.96 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.22 (s, 6H), 2.52 (d, J = 9.5 Hz, 3H); ESI MS(m/z):300.5 [M+1].
175	ジメチル((2-(4-メチ ルピリジン-3-イル)- 2H-インダゾール-5-イ ル)イミノ)-λ ⁶ -スル ファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.64 (s, 1H), 8.56 (d, J = 4.9 Hz, 1H), 8.49 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 7.57-7.55 (m, 1H), 7.51 (d, J = 4.9 Hz, 1H), 7.19 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 6.97 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.22 (s, 6H), 2.30 (d, J = 5.5 Hz, 3H) ESI MS(m/z):300.55 [M+1].
176	((2-(2,6-ジメチルピ リジン-3-yl)-2H-イン ダゾール-5-イル)イミ ノ)ジメチル-λ ⁶ -スル ファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.42 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 7.77 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 7.55 (dt, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.29 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 7.18 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 6.96 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.21 (s, 6H), 2.53 (s, 3H), 2.36 (s, 3H); ESI MS(m/z):314.95 [M+1].
177	((3-クロロ-2-(ピリ ジン-5-イル)-2H-イン ダゾール-5-イル)イミ ノ)ジメチル-λ ⁶ -スル ファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.37 (s, 1H), 9.29 (s, 2H), 7.61 (dd, J = 9.3, 0.8 Hz, 1H), 7.05 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 6.99 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 3.28-3.22 (m, 6H); ESI MS(m/z):321.7 [M+1].
178	((3-クロロ-2-(ピリ ジン-5-イル)-2H-イン ダゾール-5-イル)イミ ノ)(イソプロピル)(メ チル)-λ ⁶ -スルファノ ン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.33 (d, J = 32.7 Hz, 2H), 7.61-7.59 (m, 1H), 7.08 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 7.02 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 3.56 (s, 1H), 3.08 (s, 3H), 1.40 (d, J = 6.7 Hz, 3H), 1.35 (d, J = 7.0 Hz, 3H); ESI MS(m/z):349.95 [M+1].
179	1-((3-クロロ-2-(ピリ ジン-5-イル)-2H-イン ダゾール-5-イル)イ ミノ)テトラヒドロ- 1H-λ ⁶ -チオフェン 1- オキシド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.37 (s, 1H), 9.29 (s, 2H), 7.62 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.06 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 6.93 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 3.43-3.36 (m, 2H), 3.27 (t, J = 7.0 Hz, 1H), 2.28- 2.19 (m, 2H), 2.15-2.08 (m, 2H); ESI MS(m/z):347.9 [M+1].
180	((3-クロロ-2-(ピリ ジン-5-イル)-2H-イン ダゾール-5-イル)イミ ノ)	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.37 (s, 1H), 9.29 (s, 2H), 7.60 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.06 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 7.00 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 3.37 (dd, J = 9.9, 6.0 Hz, 2H), 3.17 (s, 3H), 1.79 (dd, J = 16.8, 7.5 Hz, 2H), 0.98 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS(m/z):349.9 [M+1].

10

20

30

40

50

【表 1 - 17】

	ノ) (メチル) (プロピル) - λ ⁶ -スルファノン	
181	((3-クロロ-2-(ピリミジン-5-イル)-2H-インダゾール-5-イル)イミノ)ジイソブチル-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.37 (s, 1H), 9.30-9.26 (m, 2H), 7.59 (dd, J = 9.2, 0.6 Hz, 1H), 7.07 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 7.00 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 3.28-3.21 (m, 4H), 2.34-2.27 (m, 2H), 1.06-1.00 (m, 12H); ESI MS(m/z):406.05 [M+1].
184	ジプロピル((2-(ピリミジン-5-イル)-2H-ピラゾロ[3, 4-b]ピリジン-5-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.49 (s, 2H), 9.25 (s, 1H), 9.02 (s, 1H), 8.34 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 7.57 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 3.38-3.34 (m, 4H), 1.77 (dt, J = 23.6, 7.2 Hz, 4H), 0.97 (t, J = 7.5 Hz, 6H); ESI MS(m/z):345.05 [M+1].
185	ジイソブチル((2-(ピリミジン-5-イル)-2H-ピラゾロ[3, 4-b]ピリジン-5-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.51 (d, J = 10.0 Hz, 2H), 9.25 (t, J = 4.9 Hz, 1H), 9.02 (d, J = 4.6 Hz, 1H), 8.34 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 7.57 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 3.35 (d, J = 6.1 Hz, 1H), 3.28 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 2.36-2.26 (m, 2H), 1.06-0.98 (m, 12H); ESI MS(m/z):373.05 [M+1].
186	1-((2-(ピリミジン-5-イル)-2H-ピラゾロ[3, 4-b]ピリジン-5-イル)イミノ)テトラヒドロ-1H-λ ⁶ -チオフェン1-オキシド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.51 (s, 2H), 9.25 (s, 1H), 9.04 (s, 1H), 8.36 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 7.52 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 3.48-3.42 (m, 2H), 3.35 (d, J = 7.1 Hz, 1H), 3.29 (s, 1H), 2.26-2.10 (m, 4H); ESI MS(m/z):314.85[M+1].
187	((2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2H-ピラゾロ[3, 4-b]ピリジン-5-イル)イミノ)ジメチル-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.22 (s, 1H), 9.02 (s, 1H), 8.68 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.48 (dt, J = 10.1, 2.4 Hz, 1H), 8.32 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 7.55 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 3.30 (s, 6H); ESI MS(m/z):305.905[M+1].
188	1-((2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2H-ピラゾロ[3, 4-b]ピリジン-5-イル)イミノ)テトラヒドロ-1H-λ ⁶ -チオフェン1-オキシド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.22 (s, 1H), 9.02 (s, 1H), 8.68 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.48 (dt, J = 10.0, 2.3 Hz, 1H), 8.35 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 7.50 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 3.48-3.41 (m, 2H), 3.34 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 3.28 (s, 1H), 2.26-2.20 (m, 2H), 2.17-2.11 (m, 2H); ESI MS(m/z):376.9[M+1].
189	((3-クロロ-2-(ピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル)イミノ)ジプロピル-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.92 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 8.74 (dd, J = 4.9, 1.5 Hz, 1H), 8.20-8.17 (m, 1H), 7.67 (dd, J = 7.9, 4.6 Hz, 1H), 7.56 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.05 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 6.99 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 3.30-3.26 (m, 4H), 1.78-1.70 (m, 4H), 0.96 (t, J = 7.5 Hz, 6H); ESI MS(m/z): 320.8[M+1].
190	((3-クロロ-2-(ピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル)イミノ)ジメチル-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.95 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 8.76 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.22-8.19 (m, 1H), 7.68 (dd, J = 8.2, 4.8 Hz, 1H), 7.59 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.03 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 6.99 (t, J = 1.0 Hz, 1H), 3.25 (s, 6H); ESI MS(m/z):331.9[M+1].
191	1-((3-クロロ-2-(ピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル)イミノ)テトラヒドロ-1H-λ ⁶ -チオフェン1-オキシド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.95-8.95 (m, 1H), 8.76 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.21 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.68 (ddd, J = 8.3, 4.9, 0.6 Hz, 1H), 7.60 (dd, J = 9.3, 0.8 Hz, 1H), 7.04 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 6.93 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 3.39 (td, J = 13.1, 6.6 Hz, 2H), 3.26 (t, J = 7.2 Hz, 2H), 2.28-2.19 (m, 2H), 2.15-2.08 (m, 2H); ESI MS(m/z):346.85[M+1].

10

20

30

40

50

【表 1 - 18】

192	((3-クロロ-2-(5-フル オロピリジン-3-イ ル)-2H-インダゾール- 5-イル)イミノ)ジプロ ビル-λ ⁶ -スルファノ ン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.89 (t, J = 1.4 Hz, 1H), 8.82 (d, J = 3.1 Hz, 1H), 8.30 (dt, J = 9.5, 2.3 Hz, 1H), 7.57 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.06 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 6.99 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 3.35 (s, 1H), 3.29 (s, 3H), 1.81-1.71 (m, 4H), 0.98 (q, J = 7.5 Hz, 6H); ESI MS(m/z):394.9[M+1].
193	エチル(イソプロピ ル)((2-(ピリミジン- 5-イル)-2H-ピラゾロ [3,4-b]ピリジン-5-イ ル)イミノ)-λ ⁶ -スル ファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.49 (s, 2H), 9.25 (s, 1H), 9.01 (s, 1H), 8.38 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 7.59 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 3.62 (t, J = 6.9 Hz, 1H), 3.37 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.39 (d, J = 6.7 Hz, 3H), 1.32 (d, J = 6.7 Hz, 3H), 1.26 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS(m/z):331.05[M+1].
194	ブチル((3-クロロ-2-(5-フルオロピリジン- 3-イル)-2H-インダゾ ール-5-イル)イミ ノ)(エチル)-λ ⁶ -スル ファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.89 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 8.82 (d, J = 2.8 Hz, 1H), 8.31 (dt, J = 9.4, 2.3 Hz, 1H), 7.58 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.07 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 6.99 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 3.36 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 3.30 (s, 1H), 1.76-1.68 (m, 2H), 1.39 (td, J = 14.7, 7.4 Hz, 2H), 1.29-1.22 (m, 3H), 0.88 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS(m/z):394.9[M+1].
195	ブチル((3-クロロ-2-(ピリジン-3-イル)- 2H-インダゾール-5-イ ル)イミノ)(エチル)- λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.95 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 8.75 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.20 (dq, J = 8.2, 1.3 Hz, 1H), 7.70-7.66 (m, 1H), 7.58-7.56 (m, 1H), 7.06 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 7.00 (t, J = 0.9 Hz, 1H), 3.35 (d, J = 7.6 Hz, 2H), 3.27-3.23 (m, 2H), 1.76-1.68 (m, 2H), 1.39 (td, J = 14.8, 7.5 Hz, 2H), 1.26 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 0.88 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS(m/z):377.1[M+1].
196	((3-クロロ-2-(ピリジ ン-3-イル)-2H-インダ ゾール-5-イル)イミ ノ)(エチル)(イソプロ ビル)-λ ⁶ -スルファノ ン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.95 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 8.75 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.20 (dq, J = 8.2, 1.3 Hz, 1H), 7.68 (ddd, J = 8.3, 4.9, 0.6 Hz, 1H), 7.57 (dd, J = 9.2, 0.6 Hz, 1H), 7.09 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 7.02 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 3.60-3.54 (m, 1H), 3.35-3.32 (m, 1H), 3.29 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 1.38 (d, J = 6.7 Hz, 3H), 1.31 (d, J = 6.7 Hz, 3H), 1.25 (t, J = 7.5 Hz, 3H); ESI MS(m/z):363[M+1].
197	((3-クロロ-2-(ピリジ ン-3-イル)-2H-インダ ゾール-5-イル)イミ ノ)(メチル)(プロピ ル)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.95 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.75 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.20 (dq, J = 8.3, 1.3 Hz, 1H), 7.68 (dd, J = 7.8, 5.1 Hz, 1H), 7.59-7.57 (m, 1H), 7.04 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 7.00 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 3.37 (dd, J = 9.8, 6.1 Hz, 2H), 3.16 (s, 3H), 1.82-1.74 (m, 2H), 1.00-0.91 (m, 3H); ESI MS(m/z):348.95[M+1].
198	((3-クロロ-2-(ピリジ ン-3-イル)-2H-インダ ゾール-5-イル)イミ ノ)(イソプロビル)(メ チル)-λ ⁶ -スルファノ ン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.95 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 8.75 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.20 (dq, J = 8.3, 1.3 Hz, 1H), 7.72-7.66 (m, 1H), 7.58 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.06 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 7.01 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 3.58-3.52 (m, 1H), 3.07 (s, 3H), 1.40 (d, J = 6.7 Hz, 3H), 1.35 (d, J = 7.0 Hz, 3H); ESI MS(m/z):348.95[M+1].
199	((3-クロロ-2-(5-フル オロピリジン-3-イ ル)-2H-インダゾール- 5-イル)イミノ)(エチ ル)(イソプロビル)- λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.89 (s, 1H), 8.82 (d, J = 2.8 Hz, 1H), 8.30 (dt, J = 9.4, 2.3 Hz, 1H), 7.57 (dd, J = 9.2, 0.6 Hz, 1H), 7.11 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 7.01 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 3.61-3.54 (m, 1H), 3.33 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 3.29 (s, 1H), 1.38 (d, J = 6.7 Hz, 3H), 1.34-1.29 (m, 3H), 1.27-1.21 (m, 3H); ESI MS(m/z):380.95[M+1].
200	((3-クロロ-2-(5-フル オロピリジン-3-イ ル)-2H-インダゾール- 5-イル)イミノ)(メチ ル)	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.89 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 8.82 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.33-8.29 (m, 1H), 7.58 (dd, J = 9.3, 0.8 Hz, 1H), 7.05 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 6.99 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 3.37

10

20

30

40

50

【表 1 - 19】

	ル) (プロピル)- λ^6 -スルファノン	(dd, J = 9.6, 6.0 Hz, 2H), 3.17 (s, 3H), 1.79 (dd, J = 16.7, 7.5 Hz, 2H), 0.98 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS(m/z):366.95[M+1].
201	((3-クロロ-2-(ピリミジン-5-イル)-2H-インダゾール-5-イル)イミノ)ジエチル- λ^6 -スルファノン	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9.37 (s, 1H), 9.29 (s, 2H), 7.59 (dd, J = 9.2, 0.6 Hz, 1H), 7.09 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 7.00 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 3.36 (t, J = 7.3 Hz, 4H), 1.25 (q, J = 7.4 Hz, 6H); ESI MS(m/z):349.9[M+1].
202	((7-クロロ-2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-4-イル)イミノ)ジメチル- λ^6 -スルファノン	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9.25 (s, 1H), 9.18 (s, 1H), 8.68 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.52 (dt, J = 10.0, 2.2 Hz, 1H), 7.25 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 6.56 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 3.34 (s, 6H); ESI MS(m/z):338.85[M+1].
203	((3-クロロ-2-(ピリダジン-4-イル)-2H-インダゾール-5-イル)イミノ)(メチル)(プロピル)- λ^6 -スルファノン	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9.79 (s, 1H), 9.49 (d, J = 5.2 Hz, 1H), 8.23 (s, 1H), 7.61 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.07 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 6.97 (s, 1H), 3.38 (t, J = 7.5 Hz, 2H), 3.18 (s, 3H), 1.79 (d, J = 7.0 Hz, 2H), 0.98 (t, J = 7.2 Hz, 3H); ESI MS(m/z):349.95[M+1].
204	((3-クロロ-2-(ピリダジン-4-イル)-2H-インダゾール-5-イル)イミノ)ジエチル- λ^6 -スルファノン	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9.79 (q, J = 1.2 Hz, 1H), 9.49 (dd, J = 5.7, 1.1 Hz, 1H), 8.23 (q, J = 2.8 Hz, 1H), 7.60 (dd, J = 9.3, 0.8 Hz, 1H), 7.10 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 6.98 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 3.36 (q, J = 7.4 Hz, 4H), 1.26 (t, J = 7.5 Hz, 6H); ESI MS(m/z):350[M+1].
205	((3-クロロ-2-(ピリダジン-4-イル)-2H-インダゾール-5-イル)イミノ)(エチル)(イソプロピル)- λ^6 -スルファノン	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9.79 (q, J = 1.2 Hz, 1H), 9.49 (dd, J = 5.8, 0.9 Hz, 1H), 8.23 (q, J = 2.8 Hz, 1H), 7.59 (dd, J = 9.3, 0.8 Hz, 1H), 7.14-7.10 (m, 1H), 7.00-6.98 (m, 1H), 3.58 (td, J = 13.7, 6.8 Hz, 1H), 3.35 (d, J = 7.3 Hz, 2H), 1.41-1.37 (m, 3H), 1.34-1.30 (m, 3H), 1.29-1.20 (m, 3H); ESI MS(m/z):363.9[M+1].
206	((7-クロロ-2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-4-イル)イミノ)(イソプロピル)(メチル)- λ^6 -スルファノン	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9.27 (s, 1H), 9.20 (s, 1H), 8.68 (d, J = 2.8 Hz, 1H), 8.55 (dt, J = 10.0, 2.4 Hz, 1H), 7.23 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 6.59 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 3.60 (t, J = 6.9 Hz, 1H), 3.17 (s, 3H), 1.48 (d, J = 6.7 Hz, 3H), 1.42 (d, J = 7.0 Hz, 3H); ESI MS(m/z):366.9[M+1].
207	ジエチル((2-(2-メチルピリミジン-5-イル)-2H-インダゾール-5-イル)イミノ)- λ^6 -スルファノン	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9.34 (d, J = 7.9 Hz, 2H), 8.93 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 7.57 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.17 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 7.01 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.35-3.32 (m, 2H), 3.30-3.27 (m, 2H), 2.70 (s, 3H), 1.31-1.17 (m, 6H); ESI MS(m/z):329.95[M+1].
208	シクロヘキシル(メチル)((2-(2-メチルピリミジン-5-イル)-2H-インダゾール-5-イル)イミノ)- λ^6 -スルファノン	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9.35 (d, J = 14.2 Hz, 2H), 8.93 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 7.58-7.55 (m, 1H), 7.17 (q, J = 1.0 Hz, 1H), 7.01 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.03 (s, 3H), 2.76 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 2.70 (s, 3H), 2.10-2.04 (m, 1H), 1.64 (d, J = 12.2 Hz, 2H), 1.58-1.39 (m, 2H), 1.36-1.09 (m, 6H); ESI MS(m/z):370.0[M+1].
209	イソプロピル(メチル)((2-(ピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-7-イル)イミノ)- λ^6 -スルファノン	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9.29 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 9.06 (s, 1H), 8.62 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.43 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.63 (ddd, J = 8.3, 4.6, 0.7 Hz, 1H), 7.24 (dd, J = 8.3, 0.7 Hz, 1H), 6.92 (dd, J = 8.3, 7.1 Hz, 1H), 6.83 (dd, J = 7.2, 0.9 Hz, 1H), 3.16 (d, J = 4.9 Hz, 4H), 1.46 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 1.40 (d, J = 6.8 Hz, 3H); ESI MS(m/z):315.0[M+1].

10

20

30

40

50

【表 1 - 20】

210	ジイソブチル((2-(2-メチルピリミジン-5-イル)-2 <i>H</i> インダゾール-5-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.33 (s, 2H), 8.93 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 7.56 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.16 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.00 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 3.28-3.15 (m, 4H), 2.70 (s, 3H), 2.32-2.24 (m, 2H), 1.03 (dd, J = 8.4, 6.7 Hz, 12H) ESI MS(m/z):386.2[M+1].
211	(2-メトキシエチル)(メチル)((2-(2-メチルピリミジン-5-イル)-2 <i>H</i> インダゾール-5-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.34 (s, 2H), 8.94 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 7.59 (dt, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.16 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.00 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 3.74 (t, J = 5.6 Hz, 2H), 3.61 (t, J = 5.4 Hz, 2H), 3.28 (s, 3H), 3.17 (s, 3H), 2.70 (s, 3H) ESI MS(m/z):346.05[M+1].
212	3-(5-(((2-メトキシエチル)(メチル)(オキソ)-λ ⁶ -スルファニリデン)アミノ)-2 <i>H</i> インダゾール-2-イル)イソニコチノニトリル	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.26 (s, 1H), 8.87 (d, J = 5.1 Hz, 1H), 8.84 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.12 (dd, J = 5.0, 0.6 Hz, 1H), 7.61 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.21 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 7.03 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 3.74 (t, J = 5.5 Hz, 2H), 3.64 (d, J = 5.4 Hz, 2H), 3.29 (s, 3H), 3.18 (s, 3H); ESI MS(m/z): 356.0[M+1].
213	イソプロピル(メチル)((2-(ピリミジン-5-イル)-2 <i>H</i> ピラゾロ[4, 3- <i>b</i>]ピリジン-5-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.47 (s, 2H), 9.21 (s, 1H), 9.08 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 7.96 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 6.81 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 3.82 (t, J = 6.9 Hz, 1H), 3.36 (s, 3H), 1.39 (dd, J = 11.9, 7.0 Hz, 6H); ESI MS (m/z):317.00[M+1].
214	ブチル(エチル)((2-(ピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> ピラゾロ[4, 3- <i>b</i>]ピリジン-5-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.27 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.01 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 8.60 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.41 (dq, J = 8.5, 1.4 Hz, 1H), 7.94 (dd, J = 9.2, 0.6 Hz, 1H), 7.62-7.58 (m, 1H), 6.79 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 3.62-3.53 (m, 4H), 1.76-1.66 (m, 2H), 1.41 (q, J = 7.2 Hz, 2H), 1.28 (t, J = 7.3 Hz, 3H), 0.89 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z):344.05[M+1].
215	ジイソブチル((2-(ピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> ピラゾロ[4, 3- <i>b</i>]ピリジン-5-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.28 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.02 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.59 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.42 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.94 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.61-7.58 (m, 1H), 6.79 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 3.60 (dd, J = 13.9, 6.3 Hz, 2H), 3.42 (dd, J = 14.1, 6.4 Hz, 2H), 2.34-2.27 (m, 2H), 1.05-0.97 (m, 12H); ESI MS (m/z):356.10[M+1].
216	シクロヘキシル(メチル)((2-(ピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> ピラゾロ[4, 3- <i>b</i>]ピリジン-5-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.27 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.03 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 8.60 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.42 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.94 (dd, J = 9.3, 0.8 Hz, 1H), 7.62-7.59 (m, 1H), 6.78 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 3.57-3.51 (m, 1H), 3.36 (s, 3H), 2.23 (d, J = 12.2 Hz, 1H), 2.14 (d, J = 12.5 Hz, 1H), 1.87 (d, J = 7.9 Hz, 2H), 1.67 (d, J = 12.5 Hz, 1H), 1.58-1.47 (m, 2H), 1.35-1.27 (m, 2H), 1.24-1.16 (m, 1H); ESI MS (m/z):356.10 [M+1].
217	((7-クロロ-2-(ピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> インダゾール-4-イル)イミノ)ジメチル-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.32 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.11 (s, 1H), 8.64 (dd, J = 4.6, 1.2 Hz, 1H), 8.50 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.64-7.60 (m, 1H), 7.24 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 6.56 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 3.33 (s, 6H); ESI MS(m/z):320.85[M+1].
218	((7-クロロ-2-(ピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> インダゾール-4-イル)イミノ)(イソプロピル)(メチル)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.34 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.12 (d, J = 11.7 Hz, 1H), 8.65 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.51 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.64-7.61 (m, 1H), 7.22 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 6.59 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 3.63-3.56 (m, 1H), 3.16 (s, 3H), 1.47 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 1.41 (d, J = 6.6 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 348.9 [M+1].

10

20

30

40

50

【表 1 - 2 1】

219	ジエチル((2-(ピリミジン-5-イル)-2H-ピラゾロ[4,3-b]ピリジン-5-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.46 (s, 2H), 9.21 (s, 1H), 9.07 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 7.96 (dd, J = 9.3, 1.0 Hz, 1H), 6.82 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 3.58 (q, J = 7.3 Hz, 4H), 1.28 (t, J = 7.5 Hz, 6H); ESI MS (m/z):317.00[M+1].
220	ブチル(エチル)((2-(ピリミジン-5-イル)-2H-ピラゾロ[4,3-b]ピリジン-5-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.47 (s, 2H), 9.21 (s, 1H), 9.07 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 7.96 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 6.81 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 3.62-3.54 (m, 4H), 1.78-1.65 (m, 2H), 1.45-1.38 (m, 2H), 1.28 (t, J = 7.3 Hz, 3H), 0.89 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z):345.10[M+1].
221	ジオソブチル((2-(ピリミジン-5-イル)-2H-ピラゾロ[4,3-b]ピリジン-5-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.47 (s, 2H), 9.20 (s, 1H), 9.07 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 7.96 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 6.81 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 3.61 (dd, J = 13.9, 6.4 Hz, 2H), 3.42 (dd, J = 13.9, 6.4 Hz, 2H), 2.36-2.26 (m, 2H), 1.08-1.02 (m, 12H); ESI MS (m/z):373.15[M+1].
222	メチル(プロピル)((2-(ピリミジン-5-イル)-2H-ピラゾロ[4,3-b]ピリジン-5-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.43-9.51 (2H), 9.18-9.24 (1H), 9.05-9.12 (1H), 7.92-8.01 (1H), 6.75-6.85 (1H), 3.48-3.66 (2H), 3.35-3.43 (3H), 1.66-1.91 (2H), 0.93-1.07 (3H); ESI MS (m/z):317.00[M+1].
223	シクロヘキシル(メチル)((2-(ピリミジン-5-イル)-2H-ピラゾロ[4,3-b]ピリジン-5-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.47 (s, 2H), 9.21 (s, 1H), 9.09 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 7.96 (dd, J = 9.3, 0.8 Hz, 1H), 6.80 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 3.58-3.52 (m, 1H), 3.36 (s, 3H), 2.18 (dd, J = 34.4, 12.4 Hz, 2H), 1.86 (s, 2H), 1.67 (d, J = 11.9 Hz, 1H), 1.56-1.48 (m, 2H), 1.34-1.16 (m, 3H); ESI MS (m/z):357.10 [M+1].
224	ジメチル((2-(ピリジン-3-イル)-2H-ピラゾロ[4,3-b]ピリジン-5-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.27 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.03 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.60 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.41 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.96 (dd, J = 9.3, 1.0 Hz, 1H), 7.61 (ddd, J = 8.4, 4.7, 0.6 Hz, 1H), 6.76 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 3.43 (s, 6H); ESI MS (m/z):287.95[M+1].
229	ジメチル((2-(ピリジン-3-イル)-6-(トリフルオロメチル)-2H-インダゾール-5-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.29 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 9.08 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.66 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.44 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 8.08 (s, 1H), 7.65 (ddd, J = 8.3, 4.8, 0.6 Hz, 1H), 7.46 (s, 1H), 3.22 (s, 6H); ESI MS(m/z):355.0 [M+1].
232	ジメチル((2-(ピリジン-3-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-c]ピリジン-5-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 9.19 (d, J = 2.8 Hz, 1H), 9.17 (s, 1H), 8.71 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.34 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 8.29 (dq, J = 8.3, 1.3 Hz, 1H), 7.52 (q, J = 4.2 Hz, 1H), 7.01 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 3.40 (s, 6H); ESI MS (m/z):288.0[M+1].
233	ジオソブチル((2-(ピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-7-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.28 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.04 (s, 1H), 8.62 (dd, J = 4.6, 1.2 Hz, 1H), 8.43-8.40 (m, 1H), 7.63 (dd, J = 8.4, 4.8 Hz, 1H), 7.22 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 6.93-6.90 (m, 1H), 6.81 (d, J = 7.1 Hz, 1H), 3.39 (dd, J = 14.2, 6.1 Hz, 2H), 3.30-3.26 (m, 2H), 2.35 (d, J = 6.6 Hz, 2H), 1.05 (q, J = 6.5 Hz, 12H); ESI MS(m/z):371.10[M+1].
234	(2-メトキシエチル)(メチル)((2-(ピリジン-3-イル)-6-(トリ	¹ H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 9.17 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.68 (d, J = 3.7 Hz, 1H), 8.32 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.25 (dq, J = 8.3, 1.3 Hz, 1H), 8.14 (s, 1H), 7.60 (s, 1H), 7.50 (q, J = 4.2 Hz,

10

20

30

40

50

【表 1 - 2 2】

	フルオロメチル)-(2#- インダゾール-5-イル) イミノ)-λ ⁶ -スルファ ノン	¹ H, 3.97-3.92 (m, 1H), 3.88-3.81 (m, 1H), 3.45 (t, J = 5.0 Hz, 2H), 3.41-3.39 (m, 3H), 3.15 (s, 3H) ESI MS(m/z):399.10[M+1].
235	イソプロピル(メチ ル)((2-(ピリジン-3- イル)-2#ピラゾロ [3,4-c]ピリジン-5-イ ル)イミノ)-λ ⁶ -スル ファノン	¹ H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 9.19 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.15 (s, 1H), 8.70 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.31 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 8.28 (dq, J = 8.3, 1.3 Hz, 1H), 7.51 (dd, J = 8.3, 4.9 Hz, 1H), 7.02 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 3.80-3.73 (m, 1H), 3.22 (s, 3H), 1.57 (dd, J = 12.4, 5.3 Hz, 3H), 1.52 (d, J = 7.0 Hz, 3H); ESI MS (m/z):316.1[M+1].
236	(2-メトキシエチ ル)(メチル)((2-(ピリ ジン-3-イル)-2#ピラ ゾロ[4,3-b]ピリジン- 5-イル)イミノ)-λ ⁶ - スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 9.27 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.04 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 8.60 (dd, J = 4.6, 1.2 Hz, 1H), 8.41 (dq, J = 8.4, 1.3 Hz, 1H), 7.97 (dd, J = 9.2, 0.6 Hz, 1H), 7.60 (dd, J = 8.6, 4.9 Hz, 1H), 6.79 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 3.97-3.85 (m, 2H), 3.83-3.75 (m, 2H), 3.37 (s, 3H), 3.31 (s, 3H) ESI MS (m/z):332.00[M+1].
237	(2-メトキシエチ ル)(メチル)((2-(ピリ ミジン-5-イル)-2#ピ ラゾロ[4,3-b]ピリジ ン-5-イル)イミノ)- λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 9.47 (s, 2H), 9.21 (s, 1H), 9.09 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 7.99 (dd, J = 9.2, 0.6 Hz, 1H), 6.82 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 3.98-3.85 (m, 2H), 3.84-3.77 (m, 2H), 3.37 (s, 3H), 3.31 (s, 3H); ESI MS (m/z):333.00[M+1].
238	イソプロピル(メチ ル)((2-(ピリジン-3- イル)-2#ピラゾロ [4,3-b]ピリジン-5-イ ル)イミノ)-λ ⁶ -スル ファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 9.27 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.03 (s, 1H), 8.60 (dd, J = 4.6, 1.2 Hz, 1H), 8.41 (dq, J = 8.4, 1.3 Hz, 1H), 7.95 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.60 (dd, J = 8.4, 4.7 Hz, 1H), 6.79 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 3.86-3.79 (m, 1H), 3.37 (d, J = 8.9 Hz, 3H), 1.41-1.31 (m, 6H); ESI MS (m/z):316.00[M+1].
239	メチル(プロピル)((2- (ピリジン-3-イル)- 2#ピラゾロ[4,3-b]ピ リジン-5-イル)イミ ノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 9.27 (d, J = 2.8 Hz, 1H), 9.03 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 8.60 (dd, J = 4.6, 1.2 Hz, 1H), 8.42 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.95 (dd, J = 9.2, 0.6 Hz, 1H), 7.60 (q, J = 4.3 Hz, 1H), 6.77 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 3.59-3.54 (m, 2H), 3.38 (s, 3H), 1.83-1.76 (m, 2H), 1.00 (t, J = 7.5 Hz, 3H); ESI MS (m/z):316.05[M+1].
240	エチル(イソプロピ ル)((2-(ピリジン-3- イル)-2#ピラゾロ [4,3-b]ピリジン-5-イ ル)イミノ)-λ ⁶ -スル ファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 9.27 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.01 (s, 1H), 8.59 (dd, J = 4.6, 1.2 Hz, 1H), 8.41 (dq, J = 8.3, 1.3 Hz, 1H), 7.94 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.60 (dd, J = 8.3, 4.9 Hz, 1H), 6.81 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 3.94-3.87 (m, 1H), 3.69-3.59 (m, 2H), 1.37 (dd, J = 9.2, 7.0 Hz, 6H), 1.28 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z):330.05[M+1].
241	エチル(イソプロピ ル)((2-(ピリミジン- 5-イル)-2#ピラゾロ [4,3-b]ピリジン-5-イ ル)イミノ)-λ ⁶ -スル ファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 9.46 (s, 2H), 9.21 (s, 1H), 9.06 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 7.96 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 6.83 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 3.90 (t, J = 6.9 Hz, 1H), 3.64 (qd, J = 7.2, 4.5 Hz, 2H), 1.37 (dd, J = 8.6, 6.7 Hz, 6H), 1.28 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z):331.00[M+1].
242	ジメチル((2-(ピリミ ジン-5-イル)-2#ピラ ゾロ[3,4-c]ピリジン- 5-イル)イミノ)-λ ⁶ - スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 9.54 (s, 2H), 9.29 (s, 1H), 9.10 (t, J = 1.1 Hz, 1H), 9.08 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 6.81 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 3.36 (s, 6H); ESI MS (m/z):288.9[M+1].

10

20

30

40

50

【表 1 - 2 3】

243	((2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-c]ピリジン-5-イル)イミノ)ジメチル-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.25 (s, 1H), 9.07 (dd, J = 10.0, 1.0 Hz, 2H), 8.72 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.51 (dt, J = 9.9, 2.3 Hz, 1H), 6.79 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 3.36 (s, 6H) ESI MS(m/z):305.9[M+1].
244	((2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-c]ピリジン-5-イル)イミノ)(イソプロピル)(メチル)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.25 (s, 1H), 9.07 (dd, J = 5.1, 1.0 Hz, 2H), 8.72 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.53 (dt, J = 9.9, 2.3 Hz, 1H), 6.83 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 3.70 (t, J = 6.8 Hz, 1H), 3.24 (s, 3H), 1.41 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 1.36 (d, J = 6.8 Hz, 3H) ESI MS(m/z):334.15[M+1].
245	ジエチル((2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-c]ピリジン-5-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.25 (s, 1H), 9.06 (s, 2H), 8.72 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.52 (dt, J = 9.9, 2.3 Hz, 1H), 6.83 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 3.52-3.41 (m, 4H), 1.29-1.22 (m, 6H) ESI MS(m/z):334.15[M+1].
246	((2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-c]ピリジン-5-イル)イミノ)(メチル)(プロピル)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.25 (s, 1H), 9.08-9.06 (m, 2H), 8.72 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.52 (dt, J = 9.9, 2.3 Hz, 1H), 6.80 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 3.49 (t, J = 7.9 Hz, 2H), 3.31 (s, 3H), 1.84-1.73 (m, 2H), 0.99 (t, J = 7.5 Hz, 3H); ESI MS(m/z):334.15[M+1].
247	1-((2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-c]ピリジン-5-イル)イミノ)テトラヒドロ-1H-λ ⁶ -チオフェン 1-オキシド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.26 (s, 1H), 9.10-9.08 (m, 2H), 8.73 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.53 (dt, J = 9.8, 2.3 Hz, 1H), 6.85 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 3.56-3.49 (m, 2H), 3.35 (d, J = 6.7 Hz, 1H), 3.30 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 2.24-2.06 (m, 4H) ESI MS(m/z):331.9[M+1].
248	エチル(メチル)((2-(ピリジン-3-イル)-2H-ピラゾロ[4,3-b]ピリジン-5-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.27 (d, J = 2.8 Hz, 1H), 9.03 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 8.60 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.41 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.95 (dd, J = 9.2, 0.6 Hz, 1H), 7.60 (dd, J = 8.4, 4.7 Hz, 1H), 6.78 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 3.60 (q, J = 7.4 Hz, 2H), 3.36 (s, 3H), 1.31 (t, J = 7.5 Hz, 3H) ESI MS(m/z):301.910[M+1].
249	ジエチル((2-(ピリジン-3-イル)-2H-ピラゾロ[4,3-b]ピリジン-5-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.27 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.02 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 8.60 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.41 (dq, J = 8.4, 1.3 Hz, 1H), 7.95 (dd, J = 9.3, 0.8 Hz, 1H), 7.60 (dd, J = 8.4, 4.7 Hz, 1H), 6.79 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 3.57 (q, J = 7.4 Hz, 4H), 1.28 (t, J = 7.3 Hz, 6H); ESI MS(m/z):315.9 [M+1].
250	1-((2-(ピリジン-3-イル)-2H-ピラゾロ[4,3-b]ピリジン-5-イル)イミノ)テトラヒドロ-1H-λ ⁶ -チオフェン 1-オキシド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.28 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.06 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 8.60 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.43 (dq, J = 8.5, 1.4 Hz, 1H), 7.98 (dd, J = 9.2, 0.6 Hz, 1H), 7.61 (q, J = 4.3 Hz, 1H), 6.83 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 3.67-3.60 (m, 2H), 3.35 (q, J = 6.7 Hz, 2H), 2.24-2.19 (m, 2H), 2.15-2.10 (m, 2H); ESI MS(m/z):313.9[M+1].
251	イソプロピル(メチル)((2-(ピリジン-5-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-c]ピリジン-5-イ	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.54 (s, 2H), 9.29 (s, 1H), 9.10-9.09 (m, 2H), 6.84 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 3.74-3.67 (m, 1H), 3.25 (s, 3H), 1.41 (d, J = 7.0 Hz, 3H), 1.36 (d, J = 6.7 Hz, 3H); ESI MS(m/z):317[M+1].

10

20

30

40

50

【表 1 - 2 4】

	ル)イミノ)-λ ⁶ -スル ファノン	
252	メチル(プロピル)((2- (ピリミジン-5-イル)- 2H-ピラゾロ[3,4-c]ピ リジン-5-イル)イミ ノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.54 (d, J = 3.1 Hz, 2H), 9.30 (d, J = 10.7 Hz, 1H), 9.09 (dd, J = 5.0, 1.1 Hz, 2H), 6.82 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 3.51-3.46 (m, 2H), 3.29 (s, 3H), 1.84-1.73 (m, 2H), 1.01-0.96 (m, 3H); ESI MS(m/z):317.05[M+1].
253	ジメチル((2-(ピリミ ジン-5-イル)-6-(トリ フルオロメチル)-2H- インダゾール-5-イル) イミノ)-λ ⁶ -スルファ ノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.50 (s, 2H), 9.28 (s, 1H), 9.14 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.11 (s, 1H), 7.46 (s, 1H), 3.24 (d, J = 4.9 Hz, 6H); ESI MS(m/z):355.85[M+1].
254	イソプロピル(プロピ ル)((2-(ピリジン-3- イル)-2H-ピラゾロ [4,3-b]ピリジン-5-イ ル)イミノ)-λ ⁶ -スル ファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.27 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.02 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.59 (dd, J = 4.6, 1.2 Hz, 1H), 8.41 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.94 (dd, J = 9.2, 0.6 Hz, 1H), 7.60 (dd, J = 8.4, 4.7 Hz, 1H), 6.80 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 3.97-3.90 (m, 1H), 3.63-3.49 (m, 2H), 1.85-1.69 (m, 2H), 1.37 (dd, J = 8.9, 7.0 Hz, 6H), 0.99 (t, J = 7.3 Hz, 3H) ESI MS(m/z):344.05[M+1].
255	ジイソプロピル((2- (ピリジン-3-イル)- 2H-ピラゾロ[4,3-b]ピ リジン-5-イル)イミ ノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.27 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.00 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 8.59 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.42 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.93 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.60 (dd, J = 8.4, 4.7 Hz, 1H), 6.85 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 3.97-3.91 (m, 2H), 1.40 (q, J = 7.1 Hz, 12H); ESI MS(m/z):344.05 [M+1].
256	イソプロピル(プロピ ル)((2-(ピリジン-3- イル)-2H-インダゾー ル-5-イル)イミノ)- λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.26 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.91 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 8.60 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.40 (dq, J = 8.4, 1.3 Hz, 1H), 7.62-7.59 (m, 1H), 7.55 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.17 (t, J = 0.9 Hz, 1H), 7.02 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.56-3.49 (m, 1H), 3.28-3.21 (m, 2H), 1.78-1.69 (m, 2H), 1.37 (d, J = 7.0 Hz, 3H), 1.30 (d, J = 7.0 Hz, 3H), 0.96 (td, J = 7.3, 3.4 Hz, 3H); ESI MS(m/z):343.1[M+1].
257	イソプロピル(プロピ ル)((2-(ピリミジン- 5-イル)-2H-インダゾ ール-5-イル)イミノ)- λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.47 (s, 2H), 9.21 (s, 1H), 8.97 (s, 1H), 7.57 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.18 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 7.04 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.53 (t, J = 6.7 Hz, 1H), 3.25 (dd, J = 16.0, 7.5 Hz, 2H), 1.74 (q, J = 7.7 Hz, 2H), 1.37 (d, J = 6.7 Hz, 3H), 1.30 (d, J = 6.7 Hz, 3H), 0.95 (t, J = 7.5 Hz, 3H); ESI MS(m/z):344.1[M+1].
258	((2-(5-フルオロピリ ジン-3-イル)-2H-イン ダゾール-5-イル)イミ ノ)(イソプロピル)(ブ ロピル)-λ ⁶ -スルファ ノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.19 (s, 1H), 8.95 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.63 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.41 (dt, J = 10.2, 2.4 Hz, 1H), 7.55 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.16 (t, J = 0.9 Hz, 1H), 7.03 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.56-3.49 (m, 1H), 3.25-3.21 (m, 2H), 1.79-1.69 (m, 2H), 1.36 (t, J = 6.7 Hz, 3H), 1.31 (t, J = 6.4 Hz, 3H), 0.97-0.93 (m, 3H); ESI MS(m/z):360.95[M+1].
259	((4-クロロ-2-(ピリミ ジン-5-イル)-2H-イン ダゾール-5-イル)イミ ノ)ジエチル-λ ⁶ -スル ファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.54 (s, 2H), 9.24 (s, 1H), 9.14 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 7.59 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.38 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 3.34 (d, J = 7.3 Hz, 2H), 3.29 (d, J = 7.0 Hz, 2H), 1.29 (t, J = 7.3 Hz, 6H); ESI MS (m/z):349.80[M+1].
260	((4-クロロ-2-(ピリミ ジン-5-イル)-2H-イン ダゾール-5-イル)イミ ノ)(エチル)(イソプロ	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.53 (s, 2H), 9.23 (s, 1H), 9.13 (s, 1H), 7.57 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.41 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 3.57-3.50 (m, 1H), 3.29-3.27 (m, 2H), 1.40 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 1.32 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 1.26 (t, J = 7.5 Hz, 3H)

10

20

30

40

【表 1 - 25】

	ビル)-λ ⁶ -スルファノン	ESI MS (m/z):363.90[M+1].
261	((4-クロロ-2-(ピリミジン-5-イル)-2H-インダゾール-5-イル)イミノ)(メチル)(プロピル)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.54 (s, 2H), 9.24 (s, 1H), 9.15 (s, 1H), 7.60 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.36 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 3.36 (dd, J = 9.7, 6.2 Hz, 2H), 3.16 (s, 3H), 1.87-1.79 (m, 2H), 0.99 (t, J = 7.5 Hz, 3H); ESI MS (m/z):349.80[M+1].
262	((4-クロロ-2-(ピリミジン-5-イル)-2H-インダゾール-5-イル)イミノ)(2-メトキシエチル)(メチル)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.54 (s, 2H), 9.24 (s, 1H), 9.17 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.36 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 3.85-3.80 (m, 1H), 3.77-3.72 (m, 1H), 3.69-3.56 (m, 2H), 3.29 (s, 3H), 3.19 (s, 3H); ESI MS (m/z):366.00 [M+1].
263	((4-クロロ-2-(ピリミジン-5-イル)-2H-インダゾール-5-イル)イミノ)ジメチル-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.54 (s, 2H), 9.24 (s, 1H), 9.16 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 8.9, 0.9 Hz, 1H), 7.34 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 3.25 (s, 6H); ESI MS (m/z):321.80[M+1].
264	ジエチル((2-(ピリジン-3-イル)-6-(トリフルオロメチル)-2H-インダゾール-5-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.28 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.05 (s, 1H), 8.66 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.45-8.42 (m, 1H), 8.08 (s, 1H), 7.65 (dd, J = 8.4, 5.0 Hz, 1H), 7.45 (s, 1H), 3.35 (q, J = 7.4 Hz, 4H), 1.26 (t, J = 7.5 Hz, 6H); ESI MS(m/z): 382.85[M+1].
265	エチル(イソプロピル)((2-(ピリジン-3-イル)-6-(トリフルオロメチル)-2H-インダゾール-5-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.28 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 9.04 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.66 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.43 (dq, J = 8.4, 1.3 Hz, 1H), 8.08 (s, 1H), 7.65 (q, J = 4.6 Hz, 1H), 7.46 (s, 1H), 3.57 (q, J = 6.8 Hz, 1H), 3.36 (dd, J = 15.4, 7.3 Hz, 2H), 1.36 (q, J = 6.7 Hz, 6H), 1.27-1.21 (m, 3H) ESI MS(m/z):397.05[M+1].
266	エチル(イソプロピル)((2-(ピリジン-5-イル)-6-(トリフルオロメチル)-2H-インダゾール-5-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.49 (s, 2H), 9.27 (s, 1H), 9.10 (s, 1H), 8.10 (s, 1H), 7.46 (s, 1H), 3.62-3.55 (m, 1H), 3.37 (q, J = 7.5 Hz, 2H), 1.36 (q, J = 6.7 Hz, 6H), 1.27-1.22 (m, 4H); ESI MS(m/z):397.95[M+1].
267	(3-フルオロフェニル)(メチル)((2-(ピリジン-3-イル)-2H-ピラゾロ[4,3-b]ピリジン-5-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.31 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.21 (s, 1H), 8.64 (dd, J = 4.6, 1.2 Hz, 1H), 8.45 (dq, J = 8.4, 1.3 Hz, 1H), 8.14 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.69 (dd, J = 7.9, 2.8 Hz, 1H), 7.64 (dd, J = 7.9, 5.2 Hz, 3H), 7.49-7.47 (m, 1H), 6.91 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 3.38-3.39 (3H); ESI MS(m/z):367.95[M+1].
268	エチル((2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-6-(トリフルオロメチル)-2H-インダゾール-5-イル)イミノ)(イソプロピル)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.21 (s, 1H), 9.08 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.70 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.46 (dt, J = 10.0, 2.3 Hz, 1H), 8.08 (s, 1H), 7.44 (s, 1H), 3.58 (t, J = 6.7 Hz, 1H), 3.36 (t, J = 7.6 Hz, 2H), 1.36 (q, J = 6.7 Hz, 6H), 1.23 (t, J = 7.5 Hz, 3H); ESI MS(m/z):415[M+1].

10

20

30

40

50

【表 1 - 26】

269	ジエチル((2-(5-フル オロピリジン-3-イ ル)-6-(トリフルオロ メチル)-2 <i>H</i> -インダゾ ール-5-イル)イミノ)- λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.21 (s, 1H), 9.09 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.70 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.46 (dt, J = 9.9, 2.3 Hz, 1H), 8.08 (s, 1H), 7.43 (s, 1H), 3.36 (q, J = 7.3 Hz, 4H), 1.26 (t, J = 7.3 Hz, 6H); ESI MS(m/z):401.05[M+1].
270	((2-(5-フルオロピリ ジン-3-イル)-6-(トリ フルオロメチル)-2 <i>H</i> - インダゾール-5-イル) イミノ)ジメチル-λ ⁶ - スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.22 (s, 1H), 9.12 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.71 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.47 (dt, J = 9.9, 2.3 Hz, 1H), 8.09 (s, 1H), 7.44 (s, 1H), 3.23 (s, 6H); ESI MS(m/z):373[M+1].
271	ジブロビル((2-(ピリ ジン-3-イル)-7-(トリ フルオロメチル)-2 <i>H</i> - インダゾール-5-イル) イミノ)-λ ⁶ -スルファ ノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.26 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.13 (s, 1H), 8.66 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.42 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.65 (dd, J = 8.3, 5.4 Hz, 1H), 7.46 (s, 1H), 7.33 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 3.33 (d, J = 6.1 Hz, 2H), 3.30 (s, 2H), 1.80-1.72 (m, 4H), 0.97 (t, J = 7.5 Hz, 6H); ESI MS(m/z):411 [M+1].
272	ジメチル((2-(ピリジ ン-3-イル)-7-(トリフ ルオロメチル)-2 <i>H</i> イン ダゾール-5-イル)イ ミノ)-λ ⁶ -スルファノ ン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.27 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 9.14 (s, 1H), 8.66 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.43 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.65 (dd, J = 8.3, 4.6 Hz, 1H), 7.47 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 7.31 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 3.27 (s, 6H); ESI MS(m/z): 354.85 [M+1].
273	ジメチル((3-メチル- 2-(ピリジン-3-イル)- 2 <i>H</i> -インダゾール-5-イ ル)イミノ)-λ ⁶ -スル ファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.89 (s, 1H), 8.70 (d, J = 4.6 Hz, 1H), 8.12 (dt, J = 8.2, 1.2 Hz, 1H), 7.64 (dd, J = 7.5, 4.7 Hz, 1H), 7.47 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.10 (s, 1H), 6.96 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 3.21 (dd, J = 17.3, 16.0 Hz, 6H), 2.59 (s, 3H) ESI MS(m/z):301.05[M+1].
274	ジブロビル((2-(ピリ ジン-3-イル)-6-(トリ フルオロメチル)-2 <i>H</i> - インダゾール-5-イル) イミノ)-λ ⁶ -スルファ ノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.28 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 9.05 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.66 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.44 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 8.08 (s, 1H), 7.66-7.63 (m, 1H), 7.45 (s, 1H), 3.33 (d, J = 7.6 Hz, 2H), 3.28 (s, 2H), 1.81-1.71 (m, 4H), 0.96 (t, J = 7.5 Hz, 6H); ESI MS(m/z):410.95[M+1].
275	((2-(5-フルオロピリ ジン-3-イル)-6-(トリ フルオロメチル)-2 <i>H</i> - インダゾール-5-イル) イミノ)ジブロビル- λ ⁶ スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.21 (s, 1H), 9.09 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.70 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.46 (dt, J = 10.0, 2.3 Hz, 1H), 8.08 (s, 1H), 7.43 (s, 1H), 3.33 (s, 2H), 3.28 (d, J = 7.1 Hz, 2H), 1.81-1.71 (m, 4H), 0.96 (t, J = 7.3 Hz, 6H) ESI MS(m/z):428.95[M+1].
276	エチル(イソプロピ ル)((3-メチル-2-(ピ リジン-3-イル)-2 <i>H</i> イン ダゾール-5-イル)イ ミノ)-λ ⁶ -スルファノ ン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.90 (s, 1H), 8.70 (d, J = 4.6 Hz, 1H), 8.13 (d, J = 6.7 Hz, 1H), 7.64 (dd, J = 7.6, 4.3 Hz, 1H), 7.46 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.11 (s, 1H), 7.03 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 3.56-3.49 (m, 1H), 3.26 (t, J = 7.3 Hz, 2H), 2.62 (d, J = 30.3 Hz, 3H), 1.38-1.22 (m, 9H); ESI MS(m/z):343.15[M+1].
277	イソプロビル((3-メチ ル-2-(ピリジン-3-イ ル)-2 <i>H</i> -インダゾール-	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.89 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.69 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.14-8.11 (m, 1H), 7.63 (dd, J = 8.1, 4.7 Hz, 1H), 7.45 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.11 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 7.02 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 3.54-3.47 (m, 1H), 3.26-3.19 (m, 2H),

10

20

30

40

50

【表 1 - 27】

	5-イル)イミノ)(プロピル)-λ ⁶ -スルファノン	2.58 (s, 3H), 1.74 (dt, J = 23.1, 7.4 Hz, 2H), 1.37 (d, J = 6.7 Hz, 3H), 1.31 (d, J = 7.0 Hz, 3H), 0.97 (t, J = 7.2 Hz, 3H); ESI MS(m/z):357.05[M+1].
278	ジブロビル((2-(ピリジン-5-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-c]ピリジン-5-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.53 (s, 2H), 9.29 (s, 1H), 9.08-9.07 (m, 2H), 6.83 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 3.48-3.41 (m, 4H), 1.84-1.68 (m, 4H), 0.98 (t, J = 7.5 Hz, 6H) ESI MS(m/z):345.15[M+1].
279	((2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-c]ピリジン-5-イル)イミノ)ジブロビル-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.25 (s, 1H), 9.07-9.05 (m, 2H), 8.72 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.52 (dt, J = 9.9, 2.4 Hz, 1H), 6.81 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 3.48-3.40 (m, 4H), 1.84-1.68 (m, 4H), 0.98 (t, J = 7.3 Hz, 6H); ESI MS (m/z):362.1[M+1].
280	ジイソプロビル((3-メチル-2-(ピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.89 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 8.69 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.13 (dq, J = 8.1, 1.4 Hz, 1H), 7.65-7.61 (m, 1H), 7.43 (dd, J = 9.0, 0.8 Hz, 1H), 7.12-7.08 (m, 2H), 3.62-3.56 (m, 2H), 2.57 (s, 3H), 1.34 (d, J = 7.0 Hz, 6H), 1.27 (d, J = 6.7 Hz, 6H); ESI MS(m/z):357.05[M+1].
281	((3-メチル-2-(ピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル)イミノ)ジブロビル-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.89 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.70 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.13 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.65-7.62 (m, 1H), 7.46 (dd, J = 9.2, 0.6 Hz, 1H), 7.09 (t, J = 0.9 Hz, 1H), 6.99 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 3.28-3.24 (m, 4H), 2.58 (s, 3H), 1.79-1.71 (m, 4H), 0.96 (t, J = 7.3 Hz, 6H) ESI MS(m/z):357.10[M+1].
282	ジエチル((3-メチル-2-(ピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.89 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 8.70 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.14-8.11 (m, 1H), 7.64 (dd, J = 8.1, 4.7 Hz, 1H), 7.46 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.11 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 7.00 (dd, J = 9.0, 2.0 Hz, 1H), 3.34-3.25 (m, 4H), 2.58 (s, 3H), 1.26 (t, J = 7.5 Hz, 6H); ESI MS(m/z):328.9[M+1].
283	イソプロビル(メチル)((3-メチル-2-(ピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.89 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 8.70 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.13 (dq, J = 8.1, 1.4 Hz, 1H), 7.64 (dd, J = 8.1, 4.7 Hz, 1H), 7.47 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.11 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 7.00 (dd, J = 9.0, 2.0 Hz, 1H), 3.50 (t, J = 6.9 Hz, 1H), 3.02 (s, 3H), 2.59 (s, 3H), 1.37 (dd, J = 19.7, 6.9 Hz, 6H); ESI MS(m/z):328.9[M+1].
284	エチル(メチル)((3-メチル-2-(ピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.89 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.70 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.13 (dq, J = 8.1, 1.4 Hz, 1H), 7.64 (dd, J = 8.3, 4.9 Hz, 1H), 7.48-7.46 (m, 1H), 7.10 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 6.98 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 3.35 (q, J = 7.2 Hz, 2H), 3.10 (s, 3H), 2.59 (s, 3H), 1.29 (t, J = 7.3 Hz, 3H) ESI MS(m/z):315.0[M+1].
285	ジブロビル((2-(ピリジン-3-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-c]ピリジン-5-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.32 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.05 (t, J = 1.2 Hz, 1H), 9.01 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.68 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.48 (dq, J = 8.4, 1.3 Hz, 1H), 7.65 (q, J = 4.3 Hz, 1H), 6.82 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 3.44 (t, J = 7.9 Hz, 4H), 1.82-1.70 (m, 4H), 0.98 (t, J = 7.5 Hz, 6H); ESI MS(m/z):344.05 [M+1].
286	メチル(プロピル)((2-(ピリジン-3-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-c]ピリジン-5-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.32 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.06 (t, J = 1.1 Hz, 1H), 9.01 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.68 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.49 (dq, J = 8.4, 1.3 Hz, 1H), 7.67-7.63 (m, 1H), 6.81 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 3.51-3.45 (m, 2H), 3.28 (s, 3H), 1.84-1.73 (m, 2H), 0.99 (t, J = 7.5 Hz, 3H); ESI MS(m/z): 316[M+1].

10

20

30

40

50

【表 1 - 28】

287	sec-ブチル(イソプロピル)((2-(ピリジン-3-イル)-2H-ピラゾロ[4,3-b]ピリジン-5-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.27 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.00 (s, 1H), 8.59 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.42 (dq, J = 8.4, 1.3 Hz, 1H), 7.92 (dd, J = 9.2, 0.6 Hz, 1H), 7.60 (dd, J = 8.3, 4.9 Hz, 1H), 6.84 (dd, J = 9.2, 0.6 Hz, 1H), 3.87 (td, J = 13.0, 6.4 Hz, 1H), 3.78-3.71 (m, 1H), 2.15-2.05 (m, 1H), 1.68-1.53 (m, 1H), 1.43-1.37 (m, 9H), 0.98 (q, J = 7.1 Hz, 3H) ESI MS(m/z):357.95[M+1].
288	(シクロプロピルメチル)(イソプロピル)((2-(ピリジン-3-イル)-2H-ピラゾロ[4,3-b]ピリジン-5-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.27 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 9.02 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 8.60 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.41 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.94 (dd, J = 9.2, 0.6 Hz, 1H), 7.62-7.58 (m, 1H), 6.81 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 3.82 (t, J = 6.9 Hz, 1H), 3.70 (dq, J = 25.9, 7.2 Hz, 2H), 1.39 (dd, J = 8.4, 6.9 Hz, 6H), 1.07-1.05 (m, 1H), 0.62-0.54 (m, 2H), 0.40-0.31 (m, 2H) ESI MS(m/z):355.95[M+1].
289	(シクロブチルメチル)(イソプロピル)((2-(ピリジン-3-イル)-2H-ピラゾロ[4,3-b]ピリジン-5-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.27 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.02 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.59 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.41 (dq, J = 8.4, 1.3 Hz, 1H), 7.93 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.60 (ddd, J = 8.4, 4.7, 0.6 Hz, 1H), 6.78 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 3.85-3.67 (m, 3H), 2.12-2.02 (m, 2H), 1.90-1.73 (m, 5H), 1.35 (dd, J = 6.7, 4.9 Hz, 6H); ESI MS(m/z):370 [M+1].
290	1-((2-(ピリジン-3-イル)-2H-ピラゾロ[4,3-b]ピリジン-5-イル)イミノ)ヘキサヒドロ-λ ⁶ -チオピラン 1-オキシド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.26 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.01 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 8.60 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.40 (dq, J = 8.5, 1.4 Hz, 1H), 7.96 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 8.4, 4.7 Hz, 1H), 6.81 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 3.75-3.71 (m, 2H), 3.49-3.43 (m, 2H), 1.99-1.81 (m, 2H), 1.63-1.58 (m, 2H), 1.25-1.22 (m, 2H); ESI MS(m/z):327.9[M+1].
291	sec-ブチル(イソプロピル)((2-(ピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.25 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.89 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 8.59 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.40 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.60 (dd, J = 8.1, 5.0 Hz, 1H), 7.53 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.18 (t, J = 2.0 Hz, 1H), 7.07 (dt, J = 9.2, 2.4 Hz, 1H), 3.37 (qd, J = 6.8, 3.2 Hz, 1H), 3.27-3.17 (m, 1H), 1.35-1.32 (m, 5H), 1.27 (t, J = 7.0 Hz, 3H), 1.20-1.17 (m, 3H), 0.98-0.90 (m, 3H); ESI MS(m/z):356.95[M+1].
292	1-((2-(ピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル)イミノ)ヘキサヒドロ-λ ⁶ -チオピラン 1-オキシド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.26 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.91 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 8.60 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.41 (dq, J = 8.4, 1.3 Hz, 1H), 7.62-7.60 (m, 1H), 7.58 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.17 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 7.03 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 3.38 (t, J = 6.7 Hz, 2H), 3.27-3.19 (m, 2H), 1.90 (q, J = 5.5 Hz, 4H), 1.64-1.55 (m, 2H); ESI MS(m/z):326.9 [M+1].
293	tert-ブチル((2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル)イミノ)(メチル)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.20 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 8.97 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.63 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.42 (dt, J = 10.2, 2.3 Hz, 1H), 7.56 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.16 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.03 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.01 (s, 3H), 1.43 (s, 9H) ESI MS(m/z):346.9[M+1].
294	イソペンチル(イソプロピル)((2-(ピリミジン-5-イル)-2H-インダゾール-5-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.47 (s, 2H), 9.21 (s, 1H), 8.97 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 7.57 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.18 (t, J = 1.1 Hz, 1H), 7.05 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 3.54 (t, J = 6.7 Hz, 1H), 3.26-3.23 (m, 2H), 1.65-1.52 (m, 3H), 1.37 (d, J = 6.7 Hz, 3H), 1.21 (q, J = 3.3 Hz, 3H), 0.84 (dd, J = 7.8, 6.3 Hz, 6H) ESI MS(m/z):371.95[M+1].
295	エチル(メチル)((2-(ピリジン-3-イル)-7-	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.27 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 9.14 (s, 1H), 8.66 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.42 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.65 (dd, J = 8.3, 5.4 Hz, 1H), 7.47 (s, 1H), 7.33 (s, 1H),

10

20

30

40

50

【表 1 - 2 9】

	(トリフルオロメチル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	3.41 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 3.17 (s, 3H), 1.31 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS(m/z):369[M+1].
296	ジエチル((2-(ピリジン-3-イル)-7-(トリフルオロメチル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)イミノ) λ ⁶ スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.26 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.13 (s, 1H), 8.66 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.42 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.66-7.63 (m, 1H), 7.47 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 7.35 (t, J = 0.9 Hz, 1H), 3.36 (q, J = 7.4 Hz, 4H), 1.27 (t, J = 7.5 Hz, 6H); ESI MS(m/z):383[M+1].
297	エチル(メチル)((2-(ピリミジン-5-イル)-6-(トリフルオロメチル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.50 (s, 2H), 9.28 (s, 1H), 9.13 (s, 1H), 8.11 (s, 1H), 7.46 (s, 1H), 3.40 (q, J = 7.4 Hz, 2H), 3.14 (s, 3H), 1.30 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS(m/z):369.9[M+1].
298	エチル(メチル)((2-(ピリジン-3-イル)-6-(トリフルオロメチル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.29 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 9.07 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.66 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.44 (dq, J = 8.5, 1.3 Hz, 1H), 8.09 (s, 1H), 7.67-7.63 (m, 1H), 7.46 (s, 1H), 3.39 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 3.13 (s, 3H), 1.31 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS(m/z):368.85[M+1].
299	4-((2-(ピリジン-3-イル)-6-(トリフルオロメチル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)イミノ)-1, 4 λ ⁶ -オキサチアン 4-オキシド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.29 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.08 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 8.67 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.44 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 8.13 (s, 1H), 7.65 (dd, J = 8.4, 4.7 Hz, 1H), 7.47 (s, 1H), 4.11-4.07 (m, 2H), 3.84 (t, J = 10.4 Hz, 2H), 3.63 (d, J = 13.1 Hz, 2H), 3.49-3.42 (m, 2H); ESI MS(m/z):396.9[M+1].
300	エチル((2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-6-(トリフルオロメチル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)イミノ)(メチル)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.22 (s, 1H), 9.11 (s, 1H), 8.70 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.47 (dt, J = 10.0, 2.3 Hz, 1H), 8.09 (s, 1H), 7.44 (s, 1H), 3.40 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 3.14 (s, 3H), 1.30 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS(m/z):386.85[M+1].
301	((2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-6-(トリフルオロメチル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)イミノ)(2-メトキシエチル)(メチル)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.22 (s, 1H), 9.12 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.71 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.47 (dt, J = 9.9, 2.4 Hz, 1H), 8.10 (s, 1H), 7.45 (s, 1H), 3.80-3.62 (m, 4H), 3.27 (s, 3H), 3.18 (s, 3H); ESI MS(m/z):416.9[M+1].
302	4-((2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-6-(トリフルオロメチル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)イミノ)-1, 4 λ ⁶ -オキサチアン 4-オキシド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.22 (s, 1H), 9.12 (s, 1H), 8.71 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.49-8.45 (m, 1H), 8.13 (s, 1H), 7.45 (s, 1H), 4.11-4.08 (m, 2H), 3.84 (t, J = 10.4 Hz, 2H), 3.64 (d, J = 13.7 Hz, 2H), 3.50-3.43 (m, 2H); ESI MS(m/z):414.9[M+1].
303	1-((2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-6-(トリフルオロメチル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.22 (s, 1H), 9.13 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.71 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.47 (dt, J = 10.0, 2.3 Hz, 1H), 8.10

10

20

30

40

50

【表 1 - 30】

	リフルオロメチル)- 2H-インダゾール-5-イ ル)イミノ)テトラヒド ロ-1H-λ ⁶ -チオフェン 1-オキシド	(s, 1H), 7.36 (s, 1H), 3.37 (q, J = 6.6 Hz, 2H), 3.29-3.24 (m, 2H), 2.26-2.19 (m, 2H), 2.11-2.05 (m, 2H) ESI MS(m/z):398.9[M+1].
304	1-((3-メチル-2-(ピリ ジジン-3-イル)-2H-イン ダゾール-5-イル)イミ ノ)テトラヒドロ 1H λ ⁶ -チオフェン 1-オキ シド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.90 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 8.70 (d, J = 3.7 Hz, 1H), 8.13 (dq, J = 8.3, 1.3 Hz, 1H), 7.64 (dd, J = 8.3, 4.9 Hz, 1H), 7.49 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.06 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 6.97 (dd, J = 9.0, 2.0 Hz, 1H), 3.36 (q, J = 6.5 Hz, 2H), 3.26-3.20 (m, 2H), 2.60 (s, 3H), 2.24-2.10 (m, 4H) ESI MS(m/z):327.00[M+1].
305	ジブロビル((2-(ピリ ミジン-5-イル)-6-(トリ フルオロメチル)- 2H-インダゾール-5-イ ル)イミノ)-λ ⁶ -スル ファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.50 (s, 2H), 9.27 (s, 1H), 9.11 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.10 (s, 1H), 7.45 (s, 1H), 3.34-3.32 (m, 4H), 1.79-1.71 (m, 4H), 0.96 (t, J = 7.3 Hz, 6H) ESI MS(m/z):411.9[M+1].
306	((2-(5-フルオロピリ ジジン-3-イル)-2H-ピラ ゾロ[4, 3-b]ピリジン- 5-イル)イミノ)ジメチ ル-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.20 (s, 1H), 9.07 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.63 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.41 (dt, J = 10.2, 2.3 Hz, 1H), 7.96 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 6.78 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 3.44 (s, 6H); ESI MS (m/z):305.75[M+1].
307	エチル((2-(5-フルオ ロピリジン-3-イル)- 2H-ピラゾロ[4, 3-b]ピ リジン-5-イル)イミ ノ)(メチル)-λ ⁶ -スル ファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.20 (s, 1H), 9.06 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.63 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.41 (dt, J = 10.0, 2.3 Hz, 1H), 7.95 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 6.79 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 3.60 (q, J = 7.4 Hz, 2H), 3.36 (s, 3H), 1.31 (t, J = 7.5 Hz, 3H);p ESI MS (m/z):319.80[M+1].
308	ジエチル((2-(5-フル オロピリジン-3-イ ル)-2H-ピラゾロ[4, 3- b]ピリジン-5-イル)イ ミノ)-λ ⁶ -スルファノ ン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.19 (s, 1H), 9.05 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.63 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.41 (dt, J = 10.0, 2.3 Hz, 1H), 7.95 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 6.81 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 3.58 (q, J = 7.3 Hz, 4H), 1.28 (t, J = 7.3 Hz, 6H) ESI MS (m/z):333.85[M+1].
309	((2-(5-フルオロピリ ジジン-3-イル)-2H-ピラ ゾロ[4, 3-b]ピリジン- 5-イル)イミノ)(メチ ル)(プロビル)-λ ⁶ -ス ルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.20 (s, 1H), 9.07 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.63 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.41 (dt, J = 10.2, 2.3 Hz, 1H), 7.95 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 6.78 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 3.61-3.53 (m, 2H), 3.38 (s, 3H), 1.85-1.73 (m, 2H), 1.00 (t, J = 7.5 Hz, 3H); ESI MS (m/z):333.80[M+1].
310	((2-(5-フルオロピリ ジジン-3-イル)-2H-ピラ ゾロ[4, 3-b]ピリジン- 5-イル)イミノ)ジブロ ビル-λ ⁶ -スルファノ ン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.20 (s, 1H), 9.07 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.63 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.42 (dt, J = 10.3, 2.3 Hz, 1H), 7.94 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 6.79 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 3.59-3.50 (m, 4H), 1.85-1.69 (m, 4H), 0.99 (t, J = 7.5 Hz, 6H); ESI MS (m/z):362.20[M+1].
311	((2-(5-フルオロピリ ジジン-3-イル)-2H-ピラ ゾロ[4, 3-b]ピリジン- 5-イル)イミノ)(イソ	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.19 (s, 1H), 9.07 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.63 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.41 (dt, J = 10.2, 2.3 Hz, 1H), 7.94 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 6.80 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 3.37 (d, J = 8.8 Hz, 3H), 1.45-1.37 (m, 6H); ESI MS (m/z):333.80[M+1].

10

20

30

40

50

【表 1 - 3 1】

	プロピル(メチル)- λ ⁶ -スルファノン	
312	エチル((2-(5-フルオ ロピリジン-3-イル)- 2 <i>H</i> -ピラゾロ[4,3- <i>b</i>]ピ リジン-5-イル)イミ ノ)(イソプロピル)- λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.19 (s, 1H), 9.06 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.63 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.41 (dt, J = 10.3, 2.3 Hz, 1H), 7.94 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 6.82 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 3.93-3.87 (m, 1H), 3.69-3.59 (m, 2H), 1.37 (dd, J = 9.3, 6.8 Hz, 6H), 1.28 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z):348.00[M+1].
313	tert-ブチル((2-(5-フ ルオロピリジン-3-イ ル)-2 <i>H</i> -ピラゾロ[4,3- <i>b</i>]ピリジン-5-イル)イ ミノ)(メチル)-λ ⁶ -ス ルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.20 (s, 1H), 9.08 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.63 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.42 (dt, J = 10.2, 2.4 Hz, 1H), 7.95-7.92 (m, 1H), 6.80 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 3.46 (s, 3H), 1.46 (s, 9H); ESI MS (m/z):347.85[M+1].
314	エチル(メチル)((2- (ピリミジン-5-イル)- 2 <i>H</i> -ピラゾロ[4,3- <i>b</i>]ピ リジン-5-イル)イミ ノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.47 (s, 2H), 9.21 (s, 1H), 9.08 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 7.97 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 6.80 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 3.61 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 3.37 (s, 3H), 1.31 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z):302.80[M+1].
315	イソプロピル(プロピ ル)((2-(ピリミジン- 5-イル)-2 <i>H</i> -ピラゾロ [4,3- <i>b</i>]ピリジン-5-イ ル)イミノ)-λ ⁶ -スル ファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.47 (s, 2H), 9.20 (d, J = 4.9 Hz, 1H), 9.08 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 7.96 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 6.83 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 3.97-3.90 (m, 1H), 3.63-3.50 (m, 2H), 1.87-1.68 (m, 2H), 1.37 (dd, J = 8.6, 6.8 Hz, 6H), 0.99 (t, J = 7.5 Hz, 3H); ESI MS (m/z):344.85[M+1].
316	ジイソプロピル((2- (ピリミジン-5-イル)- 2 <i>H</i> -ピラゾロ[4,3- <i>b</i>]ピ リジン-5-イル)イミ ノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.47 (s, 2H), 9.20 (s, 1H), 9.05 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 7.94 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 6.87 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 3.97-3.91 (m, 2H), 1.40 (dd, J = 16.4, 6.8 Hz, 12H); ESI MS (m/z):344.85[M+1].
317	tert-ブチル(メチ ル)((2-(ピリミジン- 5-イル)-2 <i>H</i> -ピラゾロ [4,3- <i>b</i>]ピリジン-5-イ ル)イミノ)-λ ⁶ -スル ファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.48 (s, 2H), 9.21 (s, 1H), 9.10 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 7.96 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 6.81 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 3.46 (s, 3H), 1.46 (s, 9H) ESI MS (m/z):330.85[M+1].
318	((2-(5-フルオロピリ ジン-3-イル)-2 <i>H</i> -ピラ ゾロ[4,3- <i>b</i>]ピリジン- 5-イル)イミノ)(2-メ トキシエチル)(メチ ル)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.20 (s, 1H), 9.08 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.64 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.42 (dt, J = 10.2, 2.3 Hz, 1H), 7.97 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 6.81 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 3.99-3.83 (m, 2H), 3.82-3.75 (m, 2H), 3.37 (s, 3H), 3.33 (s, 3H); ESI MS (m/z):349.80[M+1].
493	(シクロブチルメチ ル)(イソプロピ ル)((2-(ピリジン-3- イル)-2 <i>H</i> -インダゾー ル-5-イル)イミノ)- λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.26 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.91 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.60 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.41 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.60 (dd, J = 8.1, 5.0 Hz, 1H), 7.55 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.16 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 7.00 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 3.45-3.35 (m, 3H), 2.81-2.77 (m, 1H), 2.04 (t, J = 7.8 Hz, 2H), 1.84-1.72 (m, 5H), 1.33 (dd, J = 26.6, 6.7 Hz, 7H) ESI MS (m/z): 368.95 [M+1]
494	sec-ブチル(イソプロ ピル)((2-(ピリミジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.46 (d, J = 2.1 Hz, 2H), 9.20 (s, 1H), 8.95 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 7.55 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.19 (t,

10

20

30

40

50

【表 1 - 3 2】

	-5-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)イミノ)- λ^6 -スルファノン	J = 2.0 Hz, 1H), 7.10 (dt, J = 9.3, 2.4 Hz, 1H), 3.65-3.59 (m, 1H), 3.38 (tt, J = 10.2, 3.5 Hz, 1H), 2.07-2.00 (m, 1H), 1.35-1.32 (m, 5H), 1.29-1.22 (m, 5H), 0.94 (dt, J = 16.5, 7.5 Hz, 3H) ESI MS (m/z): 357.9 [M+1]
495	(シクロブチルメチル)(イソプロピル)((2-(ピリジン-5-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)イミノ)- λ^6 -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.47 (s, 2H), 9.21 (s, 1H), 8.97 (s, 1H), 7.57 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.16 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 7.02 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 3.42 (dt, J = 18.8, 6.7 Hz, 3H), 2.79 (s, 1H), 2.05 (d, J = 7.6 Hz, 2H), 1.84-1.73 (m, 4H), 1.33 (dd, J = 26.6, 6.7 Hz, 6H); ESI MS (m/z): 369.9 [M+1].
496	<i>sec</i> -ブチル((2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)イミノ)(イソプロピル)- λ^6 -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.18 (s, 1H), 8.93 (s, 1H), 8.62 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.40 (dt, J = 10.2, 2.4 Hz, 1H), 7.53 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.17 (t, J = 2.0 Hz, 1H), 7.09 (dt, J = 9.2, 2.3 Hz, 1H), 3.65-3.58 (m, 1H), 3.38 (qd, J = 6.8, 3.4 Hz, 1H), 2.06-2.00 (m, 1H), 1.56-1.37 (m, 1H), 1.35-1.32 (m, 4H), 1.27 (t, J = 7.0 Hz, 5H), 0.94 (dt, J = 16.2, 7.5 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 375.1 [M+1]
497	((2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)イミノ)(イソペンチル)(イソプロピル)- λ^6 -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.19 (s, 1H), 8.95 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 8.62 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.41 (dt, J = 10.1, 2.3 Hz, 1H), 7.55 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.16 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 7.04 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.58-3.51 (m, 1H), 3.26-3.22 (m, 2H), 1.63-1.59 (m, 2H), 1.34 (dd, J = 26.9, 6.7 Hz, 6H), 0.84 (dd, J = 7.8, 6.3 Hz, 6H); ESI MS (m/z): 389.1 [M+1]
498	(シクロブチルメチル)((2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)イミノ)(イソプロピル)- λ^6 -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.19 (s, 1H), 8.95 (s, 1H), 8.62 (d, J = 2.8 Hz, 1H), 8.41 (dt, J = 10.1, 2.3 Hz, 1H), 7.55 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.14 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 7.01 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 3.41 (dt, J = 19.4, 6.7 Hz, 3H), 2.79 (t, J = 8.1 Hz, 1H), 2.04 (t, J = 7.8 Hz, 2H), 1.84-1.72 (m, 4H), 1.39-1.29 (m, 6H) ESI MS (m/z): 386.95 [M+1].
499	1-((2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)イミノ)ヘキサヒドロ- λ^6 -チオピラン 1-オキシド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.19 (s, 1H), 8.96 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 8.63 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.42 (dt, J = 10.1, 2.3 Hz, 1H), 7.58 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.15 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 7.04 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.40-3.37 (m, 2H), 3.27-3.20 (m, 2H), 1.93-1.88 (m, 4H), 1.66-1.54 (m, 2H); ESI MS (m/z): 344.95 [M+1].
500	1-((2-(ピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -ピラゾロ[3,4- <i>c</i>]ピリジン-5-イル)イミノ)テトラヒドロ-1 <i>H</i> - λ^6 -チオフエン 1-オキシド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.33 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.09 (t, J = 1.1 Hz, 1H), 9.04 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.68 (dd, J = 4.6, 1.2 Hz, 1H), 8.50 (dq, J = 8.4, 1.3 Hz, 1H), 7.66 (dd, J = 8.3, 4.9 Hz, 1H), 6.85 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 3.56-3.49 (m, 2H), 3.34 (d, J = 6.7 Hz, 1H), 3.30 (d, J = 6.7 Hz, 1H), 2.23-2.16 (m, 2H), 2.14-2.07 (m, 2H); ESI MS (m/z): 314.1 [M+1].
501	4-((2-(ピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -ピラゾロ[3,4- <i>c</i>]ピリジン-5-イル)イミノ)-1,4- λ^6 -オキサチアン 4-オキシド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.33 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.05 (s, 2H), 8.68 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.49 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.66 (dd, J = 8.4, 4.7 Hz, 1H), 6.90 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 4.07 (qd, J = 6.3, 3.2 Hz, 2H), 3.99-3.93 (m, 2H), 3.72 (dt, J = 14.6, 3.1 Hz, 2H), 3.55-3.49 (m, 2H); ESI MS (m/z): 330.05 [M+1]
502	ジエチル((2-(ピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -ピラゾロ[3,4- <i>c</i>]ピリジン-5-イル)イミノ)- λ^6 -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.32 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.03 (d, J = 13.0 Hz, 2H), 8.68 (d, J = 3.7 Hz, 1H), 8.49 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.65 (dd, J = 8.3, 4.6 Hz, 1H), 6.83 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 3.52-3.41 (m, 4H), 1.27 (t, J = 7.3 Hz, 6H); ESI MS (m/z): 315.9 [M+1]

10

20

30

40

50

【表 1 - 3 3】

503	1-((2-(ピリミジン-5-イル)-2 <i>H</i> -ピラゾロ[3,4- <i>c</i>]ピリジン-5-イル)イミノ)テトラヒドロ-1 <i>H</i> - λ^6 -チオフェン1-オキシド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.54 (s, 2H), 9.29 (d, <i>J</i> = 4.9 Hz, 1H), 9.12 (t, <i>J</i> = 1.1 Hz, 1H), 9.10 (d, <i>J</i> = 1.0 Hz, 1H), 6.87 (d, <i>J</i> = 1.5 Hz, 1H), 3.56-3.49 (m, 2H), 3.35 (d, <i>J</i> = 6.6 Hz, 1H), 3.29 (s, 1H), 2.24-2.16 (m, 2H), 2.14-2.05 (m, 2H) ESI MS (<i>m/z</i>): 314.95 [M+1]
504	4-((2-(ピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)イミノ)-1,4- λ^6 -オキサチアン 4-オキシド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.26 (d, <i>J</i> = 2.4 Hz, 1H), 8.91 (d, <i>J</i> = 0.9 Hz, 1H), 8.60 (dd, <i>J</i> = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.41 (dq, <i>J</i> = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.60 (dd, <i>J</i> = 8.1, 5.0 Hz, 1H), 7.55 (d, <i>J</i> = 9.2 Hz, 1H), 7.16 (d, <i>J</i> = 1.2 Hz, 1H), 7.00 (dd, <i>J</i> = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 4.1-4.05 (m, 2H), 3.98-3.90 (m, 2H), 3.52-3.45 (m, 2H), 3.41-3.32 (m, 2H); ESI MS (<i>m/z</i>): 329 [M+1]
505	イソプロピル((2-(ピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)イミノ)(ピリジン-4-イルメチル)- λ^6 -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.27 (d, <i>J</i> = 2.4 Hz, 1H), 8.93 (d, <i>J</i> = 0.6 Hz, 1H), 8.60 (dd, <i>J</i> = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.53 (dd, <i>J</i> = 4.3, 1.5 Hz, 2H), 8.42 (dq, <i>J</i> = 8.4, 1.3 Hz, 1H), 7.61 (q, <i>J</i> = 4.3 Hz, 1H), 7.56 (d, <i>J</i> = 9.2 Hz, 1H), 7.40-7.38 (m, 2H), 7.19 (t, <i>J</i> = 0.9 Hz, 1H), 6.99 (dd, <i>J</i> = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 4.73 (q, <i>J</i> = 13.6 Hz, 1H), 3.37 (t, <i>J</i> = 6.7 Hz, 1H), 2.53 (d, <i>J</i> = 2.4 Hz, 1H), 1.40 (d, <i>J</i> = 6.7 Hz, 3H), 1.34 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 3H) ESI MS (<i>m/z</i>): 392.05 [M+1].
506	イソプロピル(ピリジン-2-イルメチル)((2-(ピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)イミノ)- λ^6 -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.28 (d, <i>J</i> = 2.4 Hz, 1H), 8.95 (d, <i>J</i> = 0.9 Hz, 1H), 8.58 (ddd, <i>J</i> = 17.7, 4.6, 1.2 Hz, 2H), 8.42 (t, <i>J</i> = 1.4 Hz, 1H), 7.76 (d, <i>J</i> = 1.8 Hz, 1H), 7.61 (q, <i>J</i> = 4.4 Hz, 1H), 7.56 (d, <i>J</i> = 9.2 Hz, 1H), 7.36-7.30 (m, 2H), 7.24 (d, <i>J</i> = 1.2 Hz, 1H), 6.95 (dd, <i>J</i> = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 4.78 (dd, <i>J</i> = 31.5, 14.1 Hz, 2H), 3.50 (s, 1H), 1.43 (d, <i>J</i> = 6.7 Hz, 3H), 1.38 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 3H); ESI MS (<i>m/z</i>): 392 [M+1]
507	エチル((2-(ピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)イミノ)(ピリジン-4-イル)- λ^6 -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.20 (d, <i>J</i> = 2.1 Hz, 1H), 8.87-8.86 (m, 3H), 8.58 (dd, <i>J</i> = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.35 (dq, <i>J</i> = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.86 (dd, <i>J</i> = 4.3, 1.5 Hz, 2H), 7.60-7.54 (m, 2H), 7.05-7.02 (m, 2H), 3.63 (td, <i>J</i> = 7.6, 7.0 Hz, 2H), 1.20 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (<i>m/z</i>): 364.05 [M+1]
508	4-((2-(ピリミジン-5-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)イミノ)-1,4- λ^6 -オキサチアン 4-オキシド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.47 (s, 2H), 9.21 (s, 1H), 8.97 (d, <i>J</i> = 0.6 Hz, 1H), 7.57 (d, <i>J</i> = 9.2 Hz, 1H), 7.19 (d, <i>J</i> = 1.2 Hz, 1H), 7.06 (dd, <i>J</i> = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 4.1-4.02 (m, 2H), 3.98-3.88 (m, 2H), 3.52-3.45 (m, 2H), 3.44-3.34 (m, 2H). ESI MS (<i>m/z</i>): 330 [M+1].
509	(3-メトキシフェニル)(メチル)((2-(ピリミジン-5-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)イミノ)- λ^6 -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.47-9.41 (m, 2H), 9.18 (d, <i>J</i> = 10.1 Hz, 1H), 8.91 (s, 1H), 7.56-7.44 (m, 4H), 7.38-7.19 (m, 1H), 7.09-7.00 (m, 2H), 3.79-3.76 (m, 3H), 3.42 (s, 3H) ESI MS (<i>m/z</i>): 379.95 [M+1]
510	メチル(ピリジン-2-イル)((2-(ピリミジン-5-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)イミノ)- λ^6 -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.28 (d, <i>J</i> = 2.4 Hz, 1H), 8.95 (d, <i>J</i> = 0.9 Hz, 1H), 8.58 (ddd, <i>J</i> = 17.7, 4.6, 1.2 Hz, 1H), 8.42 (t, <i>J</i> = 1.4 Hz, 1H), 7.76 (d, <i>J</i> = 1.8 Hz, 1H), 7.61 (q, <i>J</i> = 4.4 Hz, 1H), 7.56 (d, <i>J</i> = 9.2 Hz, 1H), 7.36-7.30 (m, 2H), 7.24 (d, <i>J</i> = 1.2 Hz, 1H), 6.95 (dd, <i>J</i> = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.50 (s, 3H) ESI MS (<i>m/z</i>): 350.9 [M+1]
511	エチル(ピリジン-4-イル)((2-(ピリミジン-5-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)イミノ)- λ^6 -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.20 (d, <i>J</i> = 2.1 Hz, 1H), 8.87-8.86 (m, 2H), 8.58 (dd, <i>J</i> = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.35 (dq, <i>J</i> = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.86 (dd, <i>J</i> = 4.3, 1.5 Hz, 2H), 7.60-7.54 (m, 2H), 7.05-7.02 (m, 2H), 3.63 (td, <i>J</i> = 7.6, 7.0 Hz, 2H), 1.20 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (<i>m/z</i>): 364.95 [M+1]

10

20

30

40

50

【表 1 - 3 4】

	ール-5-イル)イミノ)- λ ⁶ -スルファノン	
512	(シクロプロピルメチル) (イソプロピル) ((2-(ピリジン-5-イル)-2H-インダゾール-5-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.47 (s, 2H), 9.21 (s, 1H), 8.97 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 7.57 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.19 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 7.06 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.57 (t, J = 6.9 Hz, 1H), 3.28 (d, J = 6.7 Hz, 2H), 1.39 (d, J = 6.7 Hz, 3H), 1.33 (d, J = 7.0 Hz, 3H), 1.04 (s, 1H), 0.56-0.54 (m, 2H), 0.30 (dd, J = 4.9, 3.1 Hz, 2H); ESI MS (m/z): 356 [M+1].
513	((2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル)イミノ) (3-メトキシフェニル) (メチル)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.13 (s, 1H), 8.89 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.61 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.35 (dt, J = 10.1, 2.3 Hz, 1H), 7.54-7.51 (m, 3H), 7.44 (t, J = 1.4 Hz, 1H), 7.21 (td, J = 4.7, 2.6 Hz, 1H), 7.04 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 6.98 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 3.80 (d, J = 5.5 Hz, 3H), 3.42 (s, 3H); ESI MS (m/z): 396.95 [M+1]
514	(2-メトキシエチル) (メチル) ((2-(ピリジン-3-イル)-2H-ピラゾロ [3, 4- <i>c</i>]ピリジン-5-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.32 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.04 (dd, J = 12.1, 0.8 Hz, 2H), 8.68 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.49 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.65 (dd, J = 8.3, 4.9 Hz, 1H), 6.84 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 3.86-3.74 (m, 4H), 3.28 (d, J = 1.5 Hz, 6H) ESI MS (m/z): 331.9 [M+1]
515	1-((3-メチル-2-(ピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル)イミノ)ヘキサヒドロ-λ ⁶ -チオピラン 1-オキシド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.89 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 8.70 (dd, J = 4.9, 1.5 Hz, 1H), 8.12 (dq, J = 8.1, 1.3 Hz, 1H), 7.66-7.62 (m, 1H), 7.48 (dd, J = 9.0, 0.7 Hz, 1H), 7.10 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 7.02 (dd, J = 9.0, 2.0 Hz, 1H), 3.38-3.34 (m, 2H), 3.25-3.18 (m, 2H), 2.59 (s, 3H), 1.91-1.87 (m, 4H), 1.65-1.54 (m, 2H); ESI MS (m/z): 341.0 [M+1]
516	4-((2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2H-ピラゾロ [3, 4- <i>c</i>]ピリジン-5-イル)イミノ)-1, 4 λ ⁶ -オキサチアン 4-オキシド	¹ H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 9.11 (s, 1H), 9.05-8.98 (m, 1H), 8.58 (dd, J = 6.4, 2.4 Hz, 1H), 8.35 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 8.11 (dt, J = 9.0, 2.4 Hz, 1H), 7.01 (s, 1H), 4.27-4.15 (m, 4H), 3.77 (dt, J = 14.7, 2.8 Hz, 2H), 3.54-3.48 (m, 2H) ESI MS (m/z): 347.9 [M+1]
517	エチル ((2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-3-メチル-2H-インダゾール-5-イル)イミノ) (イソプロピル)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.83 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.74 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.20 (dt, J = 9.5, 2.3 Hz, 1H), 7.46 (dd, J = 9.0, 0.7 Hz, 1H), 7.11 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.04 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.56-3.49 (m, 2H), 3.33-3.24 (m, 2H), 2.62 (s, 3H), 1.37 (d, J = 6.8 Hz, 2H), 1.31 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 1.24 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 360.95 [M+1]
518	1-((2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-3-メチル-2H-インダゾール-5-イル)イミノ)テトラヒドロ-1H-λ ⁶ -チオフェン 1-オキシド	¹ H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 8.73 (s, 1H), 8.59 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 7.78 (dt, J = 8.7, 2.3 Hz, 1H), 7.60 (dd, J = 9.0, 0.7 Hz, 1H), 7.25 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 7.15 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 3.62-3.53 (m, 2H), 3.25-3.18 (m, 2H), 2.69 (s, 3H), 2.42-2.28 (m, 4H); ESI MS (m/z): 344.9 [M+1].
519	1-((2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-3-メチル-2H-インダゾール-5-イル)イミノ)ヘキサヒドロ-λ ⁶ -チオピラン 1-オキシド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.82 (s, 1H), 8.75 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.20 (dt, J = 9.8, 2.3 Hz, 1H), 7.48 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.10 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 7.03 (dd, J = 9.0, 2.0 Hz, 1H), 3.42-3.33 (m, 2H), 3.26-3.19 (m, 2H), 2.63 (s, 3H), 1.92-1.88 (m, 4H), 1.64-1.57 (m, 2H); ESI MS (m/z): 358.9 [M+1]

10

20

30

40

50

【表 1 - 3 5】

520	ジエチル(2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-3-メチル-2H-インダゾール-5-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.83 (s, 1H), 8.75 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.20 (dt, J = 9.7, 2.3 Hz, 1H), 7.47 (dd, J = 9.2, 0.6 Hz, 1H), 7.10 (t, J = 1.0 Hz, 1H), 7.01 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.35-3.32 (m, 1H), 3.31-3.25 (m, 3H), 2.62 (s, 3H), 1.25 (t, J = 7.5 Hz, 6H); ESI MS (m/z): 346.95 [M+1]
521	4-((3-メチル-2-(ピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル)イミノ)-1,4 λ ⁶ -オキサチアン 4-オキシド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.89 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 8.70 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.12 (dq, J = 8.2, 1.3 Hz, 1H), 7.66-7.59 (m, 1H), 7.50 (dd, J = 9.2, 0.6 Hz, 1H), 7.16 (t, J = 1.0 Hz, 1H), 7.08-7.03 (m, 1H), 4.10-4.02 (m, 2H), 3.98-3.92 (m, 2H), 3.49-3.45 (m, 2H), 3.40-3.34 (m, 2H), 2.60 (s, 3H); ESI MS (m/z): 342.95 [M+1]
522	((2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2H-ピラゾロ[4,3- <i>b</i>]ピリジン-5-イル)イミノ)(イソプロピル)(2-メトキシエチル)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.19 (s, 1H), 9.07 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.63 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.41 (dt, J = 10.1, 2.3 Hz, 1H), 7.95 (dd, J = 9.0, 0.7 Hz, 1H), 6.83 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 4.08-4.02 (m, 1H), 3.93-3.86 (m, 1H), 3.82-3.73 (m, 2H), 3.72-3.63 (m, 1H), 3.25 (d, J = 12.2 Hz, 3H), 1.45-1.37 (m, 6H); ESI MS (m/z): 378.1 [M+1]
523	(シクロプロピルメチル)((2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2H-ピラゾロ[4,3- <i>b</i>]ピリジン-5-イル)イミノ)(イソプロピル)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.19 (s, 1H), 9.06 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.63 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.40 (dt, J = 10.2, 2.3 Hz, 1H), 7.95-7.93 (m, 1H), 6.82 (q, J = 4.6 Hz, 1H), 3.85-3.78 (m, 1H), 3.71 (dq, J = 25.5, 7.2 Hz, 2H), 1.39 (dd, J = 8.1, 6.8 Hz, 6H), 1.10-1.04 (m, 1H), 0.64-0.54 (m, 2H), 0.41-0.28 (m, 2H); ESI MS (m/z): 374.00 [M+1]
524	1-((2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2H-ピラゾロ[4,3- <i>b</i>]ピリジン-5-イル)イミノ)テトラヒドロ-1H-λ ⁶ -チオフェン 1-オキシド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.21 (s, 1H), 9.10 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.63 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.43 (dt, J = 10.2, 2.3 Hz, 1H), 7.98 (dd, J = 9.3, 0.7 Hz, 1H), 6.84 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 3.67-3.60 (m, 2H), 3.36 (q, J = 6.8 Hz, 2H), 2.26-2.19 (m, 2H), 2.15-2.06 (m, 2H); ESI MS (m/z): 331.85 [M+1]
525	1-((2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2H-ピラゾロ[4,3- <i>b</i>]ピリジン-5-イル)イミノ)ヘキサヒドロ-λ ⁶ -チオピラン 1-オキシド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.19 (s, 1H), 9.04 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.63 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.40 (dt, J = 10.0, 2.3 Hz, 1H), 7.96 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 6.83 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 3.74 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 3.50-3.43 (m, 2H), 1.99-1.86 (m, 4H), 1.63-1.58 (m, 2H); ESI MS (m/z): 345.95 [M+1]
526	4-((2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2H-ピラゾロ[4,3- <i>b</i>]ピリジン-5-イル)イミノ)-1,4 λ ⁶ -オキサチアン 4-オキシド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.20 (s, 1H), 9.08 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.64 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.41 (dt, J = 10.1, 2.4 Hz, 1H), 8.00 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 6.87 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 4.11 (ddd, J = 12.6, 5.7, 3.3 Hz, 2H), 3.96-3.86 (m, 4H), 3.60-3.54 (m, 2H); ESI MS (m/z): 347.95 [M+1]
527	((2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2H-ピラゾロ[4,3- <i>b</i>]ピリジン-5-イル)イミノ)(イソプロピル)(ピリジン-2-イルメチル)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.23 (s, 1H), 9.17 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.65 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.59-8.58 (m, 1H), 8.45 (dt, J = 10.2, 2.3 Hz, 1H), 7.96 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.76 (td, J = 7.7, 1.8 Hz, 1H), 7.38-7.33 (m, 2H), 6.77 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 5.26 (s, 2H), 3.66 (t, J = 6.8 Hz, 1H), 1.43 (dd, J = 15.6, 6.8 Hz, 6H); ESI MS (m/z): 410.95 [M+1]

10

20

30

40

50

【表 1 - 3 6】

528	((2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2#ピラゾロ[4,3- <i>b</i>]ピリジン-5-イル)イミノ)(イソプロピル)(ピリジン-3-イルメチル)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.21 (s, 1H), 9.12 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.64 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.56-8.54 (m, 2H), 8.43 (dt, J = 10.0, 2.3 Hz, 1H), 7.98 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.82 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.42 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 6.81 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 5.13 (d, J = 13.7 Hz, 1H), 5.05 (d, J = 13.9 Hz, 1H), 3.77 (t, J = 6.8 Hz, 1H), 1.41 (dd, J = 18.6, 6.8 Hz, 6H) ESI MS (m/z): 411.0 [M+1]
529	((2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2#ピラゾロ[4,3- <i>b</i>]ピリジン-5-イル)イミノ)(イソプロピル)(ピリジン-4-イルメチル)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.22 (s, 1H), 9.13 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.64 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.58 (d, J = 6.1 Hz, 2H), 8.46-8.42 (m, 1H), 7.99 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.43-7.42 (m, 2H), 6.83 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 5.15 (d, J = 13.4 Hz, 1H), 5.08 (d, J = 13.4 Hz, 1H), 3.69 (t, J = 6.8 Hz, 1H), 1.40 (dd, J = 14.8, 6.7 Hz, 6H); ESI MS (m/z): 411.00 [M+1]
530	((2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2#ピラゾロ[4,3- <i>b</i>]ピリジン-5-イル)イミノ)(3-メトキシフェニル)(メチル)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.16 (s, 1H), 8.98 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.61 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.39 (dt, J = 10.2, 2.3 Hz, 1H), 7.98 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.58-7.52 (m, 2H), 7.51 (t, J = 1.5 Hz, 1H), 7.25 (td, J = 4.7, 2.4 Hz, 1H), 6.93 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 3.83-3.81 (m, 3H), 3.52 (s, 3H); ESI MS (m/z): 397.95 [M+1]
531	((2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2#ピラゾロ[4,3- <i>b</i>]ピリジン-5-イル)イミノ)(イソプロピル)(プロピル)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.19 (s, 1H), 9.05 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.63 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.41 (dt, J = 10.0, 2.3 Hz, 1H), 7.94 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 6.81 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 3.96-3.89 (m, 1H), 3.64-3.49 (m, 2H), 1.84-1.69 (m, 2H), 1.37 (dd, J = 8.2, 7.0 Hz, 6H), 0.99 (t, J = 7.5 Hz, 3H) ESI MS (m/z): 362.00 [M+1]
532	(シクロブチルメチル)((2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2#ピラゾロ[4,3- <i>b</i>]ピリジン-5-イル)イミノ)(イソプロピル)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.20 (s, 1H), 9.06 (s, 1H), 8.63 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.41 (d, J = 10.3 Hz, 1H), 7.93 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 6.79 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 3.81-3.71 (m, 3H), 2.73-2.94 (1H), 1.96-2.20 (2H), 1.87-1.85 (m, 4H), 1.35 (dd, J = 6.8, 5.1 Hz, 6H); ESI MS (m/z): 388.00 [M+1]
533	4-((2-(ピリミジン-5-イル)-2#ピラゾロ[3,4- <i>c</i>]ピリジン-5-イル)イミノ)-1,4 λ ⁶ -オキサチアン 4-オキシド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.54 (s, 2H), 9.30 (s, 1H), 9.11 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 9.09 (t, J = 1.2 Hz, 1H), 6.92 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 4.08 (qd, J = 6.3, 3.2 Hz, 2H), 4.00-3.94 (m, 2H), 3.72 (dt, J = 14.8, 3.1 Hz, 2H), 3.56-3.50 (m, 2H) ESI MS (m/z): 330.9[M+1].
534	((2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-3-メチル-2#インダゾール-5-イル)イミノ)(イソプロピル)(メチル)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.83 (s, 1H), 8.75 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.21 (dt, J = 9.8, 2.3 Hz, 1H), 7.47 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.11 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 7.01 (dd, J = 9.0, 2.0 Hz, 1H), 3.54-3.47 (m, 1H), 3.01 (s, 3H), 2.63 (s, 3H), 1.40 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 1.35 (d, J = 6.8 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 346.90 [M+1].
535	((2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-3-メチル-2#インダゾール-5-イル)イミノ)(メチル)	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.83 (t, J = 1.3 Hz, 1H), 8.75 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.21 (dt, J = 9.5, 2.3 Hz, 1H), 7.47 (dd, J = 9.0, 0.7 Hz, 1H), 7.09 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 6.98 (dd, J = 9.0, 2.0 Hz, 1H), 3.40-3.33 (m, 2H), 3.12 (s, 3H), 2.64 (s, 3H), 1.83-1.74 (m, 2H), 0.98 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 346.90[M+1].

10

20

30

40

50

【表 1 - 3 7】

	ル) (プロピル)- λ^6 -スルファノン	
536	((2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-3-メチル-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)イミノ)ジメチル- λ^6 -スルファノン	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8.83 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 8.75 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.21 (dt, J = 9.6, 2.3 Hz, 1H), 7.48 (dd, J = 9.2, 0.6 Hz, 1H), 7.09 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 6.97 (dd, J = 9.0, 2.0 Hz, 1H), 3.22 (s, 6H), 2.63 (s, 3H); ESI MS (m/z): 318.90[M+1].
537	<i>tert</i> -ブチル(メチル)((2-(ピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -ピラゾロ[4,3- <i>b</i>]ピリジン-5-イル)イミノ)- λ^6 -スルファノン	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9.28 (d, J = 2.8 Hz, 1H), 9.05 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 8.60 (dd, J = 4.6, 1.2 Hz, 1H), 8.42 (dq, J = 8.3, 1.3 Hz, 1H), 7.95-7.92 (m, 1H), 7.61 (dd, J = 8.4, 4.7 Hz, 1H), 6.78 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 3.45 (s, 3H), 1.44 (d, J = 14.4 Hz, 9H); ESI MS (m/z): 330.1 [M+1].
538	((6-クロロピリジン-3-イル)メチル)(イソプロピル)((2-(ピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -ピラゾロ[4,3- <i>b</i>]ピリジン-5-イル)イミノ)- λ^6 -スルファノン	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9.29 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.06 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.61 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.45-8.41 (m, 2H), 7.99 (dd, J = 9.2, 0.6 Hz, 1H), 7.91 (dd, J = 8.3, 2.4 Hz, 1H), 7.63-7.60 (m, 1H), 7.58 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 6.80 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 5.11 (d, J = 13.8 Hz, 1H), 5.03 (d, J = 13.8 Hz, 1H), 3.85-3.79 (m, 1H), 1.41 (dd, J = 12.4, 6.9 Hz, 6H) ESI MS (m/z): 427 [M+1].
539	((2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)イミノ)(イソプロピル)(ピリジン-4-イルメチル)- λ^6 -スルファノン	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9.20 (s, 1H), 8.96 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.63 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.53 (dd, J = 4.5, 1.6 Hz, 2H), 8.42 (dt, J = 10.0, 2.3 Hz, 1H), 7.55 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.39 (dd, J = 4.5, 1.6 Hz, 2H), 7.17 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.00 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 4.73 (dd, J = 26.2, 13.7 Hz, 2H), 3.40-3.33 (m, 1H), 1.40 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 1.34 (d, J = 6.8 Hz, 3H) ESI MS (m/z): 410 [M+1].
540	((2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)イミノ)(イソプロピル)(ピリジン-2-イルメチル)- λ^6 -スルファノン	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9.21 (s, 1H), 8.99 (s, 1H), 8.63 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.56 (d, J = 4.2 Hz, 1H), 8.43 (dt, J = 10.3, 2.3 Hz, 1H), 7.76 (td, J = 7.7, 1.8 Hz, 1H), 7.56 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.36-7.30 (m, 2H), 7.22 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 6.96 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 4.79 (dd, J = 31.8, 13.9 Hz, 2H), 3.50 (t, J = 6.8 Hz, 1H), 1.43 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 1.38 (d, J = 6.8 Hz, 3H) ESI MS (m/z): 410.05 [M+1].
541	メチル(ピリジン-2-イル)((2-(ピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)イミノ)- λ^6 -スルファノン	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9.21 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.86 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.76 (dq, J = 4.7, 0.8 Hz, 1H), 8.58 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.36 (dq, J = 8.4, 1.3 Hz, 1H), 8.13-8.06 (m, 2H), 7.66 (ddd, J = 7.3, 4.6, 1.5 Hz, 1H), 7.58 (dd, J = 8.7, 5.0 Hz, 1H), 7.50 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.04 (t, J = 1.0 Hz, 1H), 6.95 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.47 (s, 3H) ESI MS (m/z): 349.9 [M+1].
542	イソプロピル((2-(ピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -ピラゾロ[4,3- <i>b</i>]ピリジン-5-イル)イミノ)(ピリジン-4-イルメチル)- λ^6 -スルファノン	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9.29 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.09 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.61 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.57 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 2H), 8.43 (dq, J = 8.4, 1.4 Hz, 1H), 7.99 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.63-7.60 (m, 1H), 7.42 (dd, J = 4.3, 1.5 Hz, 2H), 6.81 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 5.11 (dd, J = 29.5, 13.6 Hz, 2H), 3.73-3.66 (m, 1H), 1.40 (dd, J = 15.1, 6.9 Hz, 6H) ESI MS (m/z): 392.95 [M+1].
543	((2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)イミノ)(プロピル)(ピリジン-2-イル)- λ^6 -スルファノン	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9.14 (s, 1H), 8.89 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.76 (dq, J = 4.6, 0.8 Hz, 1H), 8.61 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.36 (dt, J = 10.2, 2.3 Hz, 1H), 8.14-8.06 (m, 2H), 7.65 (ddd, J = 7.3, 4.6, 1.5 Hz, 1H), 7.49 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.01 (q, J = 1.0 Hz, 1H), 6.98 (dd, J = 9.0, 2.0 Hz, 1H), 3.66-3.60 (m, 2H), 1.80-1.71 (m, 1H), 1.66-1.56 (m, 1H), 0.94 (t, J = 7.5 Hz, 3H)

10

20

30

40

50

【表 1 - 38】

		ESI MS (m/z): 396 [M+1].
544	イソプロピル(ピリジン-2-イルメチル)((2-(ピリジン-3-イル)-2H-ピラゾロ[4,3-b]ピリジン-5-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.30 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.13 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.61 (dd, J = 4.6, 1.2 Hz, 1H), 8.58 (td, J = 2.9, 1.9 Hz, 1H), 8.44 (dq, J = 8.5, 1.4 Hz, 1H), 7.96 (dd, J = 9.2, 0.6 Hz, 1H), 7.76 (td, J = 7.8, 1.8 Hz, 1H), 7.64-7.60 (m, 1H), 7.35 (dd, J = 7.6, 4.9 Hz, 2H), 6.76 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 5.24 (d, J = 14.4 Hz, 2H), 3.69-3.62 (m, 1H), 1.47-1.40 (m, 6H) ESI MS (m/z): 393.05 [M+1].
545	((2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル)イミノ)(メチル)(ピリジン-2-イル)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.14 (s, 1H), 8.90 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.76 (dq, J = 4.7, 0.8 Hz, 1H), 8.61 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.37 (dt, J = 10.2, 2.3 Hz, 1H), 8.14-8.06 (m, 2H), 7.66 (ddd, J = 7.3, 4.6, 1.5 Hz, 1H), 7.50 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.02 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 6.96 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.47 (s, 3H) ESI MS (m/z): 367.95 [M+1].
546	(3-メトキシフェニル)(メチル)((2-(ピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.20 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.85 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 8.58 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.35 (dq, J = 8.3, 1.3 Hz, 1H), 7.58 (q, J = 4.3 Hz, 1H), 7.54-7.49 (m, 3H), 7.44 (s, 1H), 7.21 (td, J = 4.6, 2.9 Hz, 1H), 7.04-7.00 (m, 2H), 3.81-3.74 (m, 3H), 3.40 (d, J = 9.5 Hz, 3H) ESI MS (m/z): 378.9 [M+1].
547	イソペンチル(イソプロピル)((2-(ピリミジン-5-イル)-2H-ピラゾロ[4,3-b]ピリジン-5-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.47 (s, 2H), 9.21 (s, 1H), 9.06 (s, 1H), 7.96 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 6.82 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 3.93-3.86 (m, 1H), 3.65-3.60 (m, 2H), 1.73-1.62 (m, 2H), 1.59-1.51 (m, 1H), 1.39-1.34 (m, 6H), 0.87 (t, J = 6.0 Hz, 6H) ESI MS (m/z): 373.00 [M+1].
548	イソプロピル(2-メトキシエチル)((2-(ピリミジン-5-イル)-2H-ピラゾロ[4,3-b]ピリジン-5-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.49-9.45 (m, 2H), 9.21 (s, 1H), 9.08 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 7.97 (dd, J = 9.3, 0.8 Hz, 1H), 6.84 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 4.08-4.02 (m, 1H), 3.93-3.86 (m, 1H), 3.82-3.65 (m, 3H), 3.26 (s, 3H), 1.39 (dd, J = 8.6, 7.0 Hz, 6H) ESI MS (m/z): 361.05[M+1].
549	((4-クロロ-2-(ピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル)イミノ)ジエチル-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.33 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.06 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.63 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.49 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.62 (qd, J = 4.3, 0.6 Hz, 1H), 7.57 (dd, J = 8.9, 0.9 Hz, 1H), 7.36 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 3.35 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 3.30-3.25 (m, 3H), 1.29 (t, J = 7.3 Hz, 6H) ESI MS (m/z): 348.85[M+1].
550	((4-クロロ-2-(ピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル)イミノ)(エチル)(イソプロピル)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.33 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 9.04 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.62 (dd, J = 4.6, 1.2 Hz, 1H), 8.49 (dq, J = 8.4, 1.4 Hz, 1H), 7.61 (ddd, J = 8.3, 4.9, 0.6 Hz, 1H), 7.55 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.39-7.36 (m, 1H), 3.56-3.49 (m, 1H), 3.28-3.24 (m, 2H), 1.40 (d, J = 6.7 Hz, 3H), 1.32 (d, J = 7.0 Hz, 3H), 1.29-1.22 (m, 3H); ESI MS (m/z): 362.90 [M+1].
551	1-((4-クロロ-2-(ピリミジン-5-イル)-2H-インダゾール-5-イル)イミノ)テトラヒドロ-1H-λ ⁶ -チオフェン 1-オキシド	¹ H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 9.36-9.34 (m, 2H), 9.26 (s, 1H), 8.43 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 9.0, 1.0 Hz, 1H), 7.44 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 3.60-3.54 (m, 2H), 3.24-3.19 (m, 2H), 2.43-2.37 (m, 4H); ESI MS (m/z): 347.90 [M+1].
552	((4-クロロ-2-(5-フルオロピリジン-3-イ	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.25 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 9.11 (s, 1H), 8.66 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.52 (dt, J = 10.1, 2.3 Hz, 1H),

10

20

30

40

50

【表 1 - 3 9】

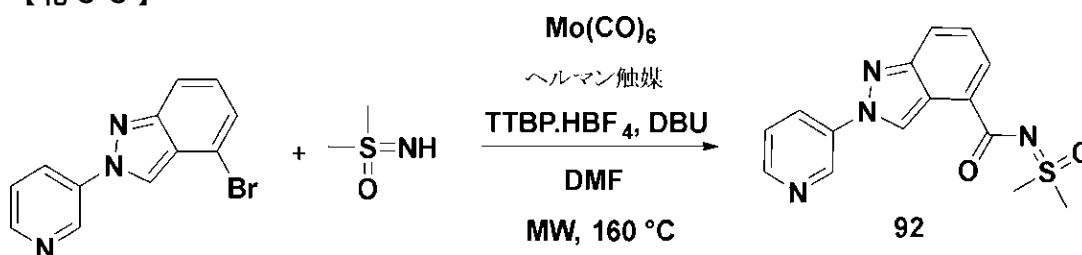
	ル)-2H-インダゾール-5-イル)イミノ)ジエチル-λ ⁶ -スルファノン	7.57 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.38 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 3.35 (t, J = 7.1 Hz, 2H), 3.28 (t, J = 7.2 Hz, 2H), 1.29 (t, J = 7.5 Hz, 6H) ESI MS (m/z): 366.85[M+1].
553	((4-クロロ-2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル)イミノ)(エチル)(イソプロピル)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 9.02 (d, J = 1.7 Hz, 1H), 8.51 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.41-8.38 (m, 1H), 8.10 (dt, J = 9.0, 2.3 Hz, 1H), 7.54-7.46 (m, 2H), 3.53-3.46 (m, 1H), 3.31 (td, J = 14.4, 7.2 Hz, 1H), 3.18 (td, J = 14.4, 7.2 Hz, 1H), 1.56 (t, J = 7.0 Hz, 3H), 1.50 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 1.44 (t, J = 7.5 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 380.90[M+1].

10

【0 2 3 2】

例 2 : N-(ジメチル(オキソ)-λ⁶-スルファネリデン)-2-(ピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-4-カルボキサミド 92 の合成

【化 3 3】



20

ジメチルホルムアミド (DMF) (5 mL) 中の 4-ブロモ-2-(ピリジン-3-イル)-2H-インダゾール (0.3 g、1.094 ミリモル)、イミノジメチル-λ⁶-スルファノン (0.306 g、3.28 ミリモル) の溶液を、モリブデンヘキサカルボニル (Mo(CO)₆) (0.144 g、0.547 ミリモル)、トリ-tert-ブチルホスフィンテトラフルオロボレート (TTBP.HBF₄) (0.016 g、0.055 ミリモル)、trans-ジ(μ-アセタート)ビス[ο-(ジオ-トリルホスフィノ)ベンジル]ジパラジウム (II) (Herrmann 触媒) (0.026 g、0.027 ミリモル) および 1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]ウンデカ-7-エン (DBU) (0.330 mL、2.189 ミリモル) で処理し、マイクロ波装置 (MW) 中で 160 °C で 1 時間照射した。反応終了後、水 (10 mL) を加えて反応混合物をクエンチし、酢酸エチル (2 × 25 mL) で抽出した。合わせた有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧濃縮して油状残渣を得た。この残渣を逆相分取 HPLC で精製し、所望の N-(ジメチル(オキソ)-λ⁶-スルファネリデン)-2-(ピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-4-カルボキサミド 92 (220 mg、0.700 ミリモル、収率 63.9%) を得た。

30

【0 2 3 3】

表 2 : 本開示の代表的な化合物を例 2 に記載の方法に従って調製した。

40

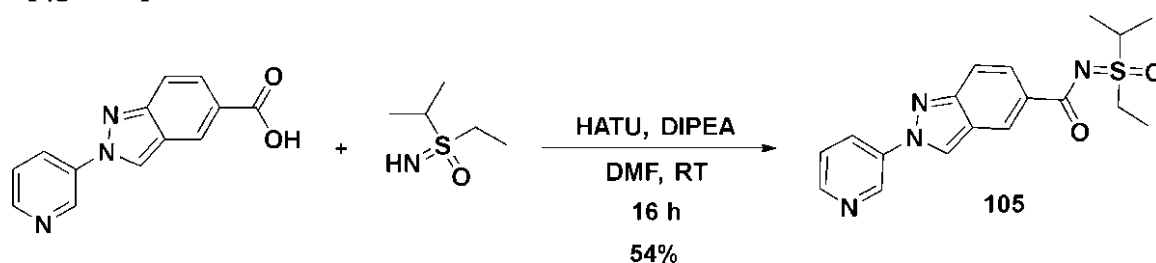
50

【表 2】

化合物番号	化合物名	分析データ
92	<i>N</i> -(ジメチル(オキソ)- λ^6 -スルファニリデン)-2-(ピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-4-カルボキサミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.37 (d, <i>J</i> = 1.0 Hz, 2H), 8.67 (dd, <i>J</i> = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.55 (dq, <i>J</i> = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.95 (dt, <i>J</i> = 8.6, 0.9 Hz, 1H), 7.88 (dd, <i>J</i> = 7.1, 0.7 Hz, 1H), 7.64 (ddd, <i>J</i> = 8.4, 4.8, 0.7 Hz, 1H), 7.43 (dd, <i>J</i> = 8.6, 7.0 Hz, 1H), 3.55 (s, 6H); ESI MS (<i>m/z</i>): 315 [M+1].
225	<i>N</i> -(ブチル(エチル)(オキソ)- λ^6 -スルファニリデン)-2-(ピリミジン-5-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-カルボキサミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.54 (s, 2H), 9.45 (d, <i>J</i> = 0.7 Hz, 1H), 9.28 (s, 1H), 8.55 (t, <i>J</i> = 1.1 Hz, 1H), 7.95 (dd, <i>J</i> = 9.2, 1.6 Hz, 1H), 7.77-7.74 (m, 1H), 3.68-3.52 (m, 4H), 1.83-1.72 (m, 2H), 1.46 (td, <i>J</i> = 14.7, 7.4 Hz, 2H), 1.34 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 0.93 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H); ESI MS(<i>m/z</i>):372.1 [M+1].
226	<i>N</i> -(シクロヘキシル(メチル)(オキソ)- λ^6 -スルファニリデン)-2-(ピリミジン-5-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール 5 カルボキサミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.54 (s, 2H), 9.45 (d, <i>J</i> = 0.7 Hz, 1H), 9.28 (s, 1H), 8.55 (s, 1H), 7.95 (dd, <i>J</i> = 9.2, 1.6 Hz, 1H), 7.76 (d, <i>J</i> = 9.3 Hz, 1H), 3.58-3.52 (m, 1H), 3.44 (s, 3H), 2.25-2.18 (m, 2H), 1.90 (d, <i>J</i> = 12.5 Hz, 2H), 1.69 (d, <i>J</i> = 13.0 Hz, 1H), 1.60-1.54 (m, 2H), 1.36 (dd, <i>J</i> = 13.0, 3.2 Hz, 2H), 1.23-1.20 (m, 1H); ESI MS(<i>m/z</i>):384.05[M+1].
227	<i>N</i> -(メチル(オキソ)(ブロビル)- λ^6 -スルファニリデン)-2-(ピリミジン-5-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-カルボキサミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.55 (d, <i>J</i> = 8.6 Hz, 2H), 9.46-9.44 (m, 1H), 9.28 (s, 1H), 8.54 (t, <i>J</i> = 1.2 Hz, 1H), 7.94 (dd, <i>J</i> = 9.2, 1.6 Hz, 1H), 7.76-7.74 (m, 1H), 3.65-3.52 (m, 2H), 3.45 (s, 3H), 1.92-1.80 (m, 2H), 1.05 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H) ESI MS(<i>m/z</i>):344.0[M+1].
228	<i>N</i> -(ジメチル(オキソ)- λ^6 -スルファニリデン)-2-(ピリミジン-5-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-カルボキサミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.54 (s, 2H), 9.45 (d, <i>J</i> = 0.9 Hz, 1H), 9.28 (s, 1H), 8.54 (d, <i>J</i> = 0.9 Hz, 1H), 7.94 (dd, <i>J</i> = 9.2, 1.5 Hz, 1H), 7.76 (d, <i>J</i> = 9.2 Hz, 1H), 3.48 (s, 6H) ESI MS(<i>m/z</i>):316.05[M+1].
230	<i>N</i> -(ジイソブチル(オキソ)- λ^6 -スルファニリデン)-2-(ピリミジン-5-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-カルボキサミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.54 (s, 2H), 9.46 (s, 1H), 9.28 (s, 1H), 8.54 (s, 1H), 7.94 (dd, <i>J</i> = 9.2, 1.6 Hz, 1H), 7.76 (d, <i>J</i> = 9.3 Hz, 1H), 3.62 (dd, <i>J</i> = 14.1, 6.5 Hz, 2H), 3.47 (dd, <i>J</i> = 14.2, 6.4 Hz, 2H), 2.36 (q, <i>J</i> = 6.7 Hz, 2H), 1.08 (q, <i>J</i> = 3.3 Hz, 12H); ESI MS(<i>m/z</i>): 400.1[M+1].
231	<i>N</i> -(ジエチル(オキソ)- λ^6 -スルファニリデン)-2-(ピリミジン-5-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-カルボキサミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.54 (s, 2H), 9.44 (d, <i>J</i> = 1.0 Hz, 1H), 9.28 (s, 1H), 8.56 (t, <i>J</i> = 1.2 Hz, 1H), 7.95 (dd, <i>J</i> = 9.2, 1.6 Hz, 1H), 7.77-7.74 (m, 1H), 3.67-3.56 (m, 4H), 1.34 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 6H); ESI MS(<i>m/z</i>): 344.0[M+1].

【 0 2 3 4 】

例 3 : *N*-(エチル(イソブロピル)(オキソ)- λ^6 -スルファニリデン)-2-(ピリジン-3-イル)-2*H*-インダゾール-5-カルボキサミド 105 の合成
【化 3 4】



10

20

30

40

50

ジメチルホルムアミド (DMF) (2 mL) 中の 2-(ピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-カルボン酸 (0.1 g、0.418 ミリモル)、エチル (イミノ) (イソプロピル)- λ^6 -スルファノン (0.057 g、0.418 ミリモル) の溶液を、1-[ビス (ジメチルアミノ) メチレン]-1H-1,2,3-トリアゾロ [4,5-b] ピリジニウム 3-オキシドヘキサフルオロホスファート (HATU) (0.159 g、0.418 ミリモル) および N-エチル-N-(プロパン-2-イル) プロパン-2-アミン (DIPEA) (0.110 mL、0.627 ミリモル) で処理し、25 °C で 16 時間撹拌した。反応終了後、反応混合物を水 (5 mL) を加えてクエンチし、酢酸エチル (2 × 25 mL) で抽出した。合わせた有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧濃縮して油性残渣を得た。この残渣を Combiflash (登録商標) クロマトグラフィー (正常相; 100% 酢酸エチルによる等速試験) で精製し、所望の N-(エチル (イソプロピル) (オキシ)- λ^6 -スルファネリデン)-2-(ピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-カルボキサミド 105 (80 mg、0.224 ミリモル、収率 53.7%) を得た。

10

【0235】

表 3: 本開示の代表的な化合物を、例 3 に記載の適切な出発物質および方法に従って調製した。

【表 3】

化合物番号	化合物名	分析データ
105	N-(エチル (イソプロピル) (オキシ)- λ^6 -スルファネリデン)-2-(ピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-カルボキサミド	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9.38 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 9.33 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.67 (dd, J = 4.6, 1.2 Hz, 1H), 8.55 (q, J = 0.8 Hz, 1H), 8.49 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.93 (dd, J = 9.2, 1.6 Hz, 1H), 7.74-7.72 (m, 1H), 7.66 (ddd, J = 8.3, 4.8, 0.6 Hz, 1H), 3.89-3.82 (m, 1H), 3.74-3.59 (m, 2H), 1.45-1.38 (m, 6H), 1.37-1.27 (m, 4H); ESI MS (m/z): 357 [M+1].
106	N-(イソプロピル (メチル) (オキシ)- λ^6 -スルファネリデン)-2-(ピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-カルボキサミド	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9.38 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 9.33 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.67 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.54 (q, J = 0.8 Hz, 1H), 8.48 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.93 (dd, J = 9.2, 1.6 Hz, 1H), 7.74 (dt, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.66 (ddd, J = 8.4, 4.8, 0.7 Hz, 1H), 3.79-3.72 (m, 1H), 3.44 (s, 3H), 1.43 (q, J = 3.3 Hz, 6H); ESI MS (m/z): 343 [M+1].
107	N-(ジエチル (オキシ)- λ^6 -スルファネリデン)-2-(ピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-カルボキサミド	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9.38 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 9.33 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.67 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.55 (q, J = 0.8 Hz, 1H), 8.49 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.93 (dd, J = 9.2, 1.6 Hz, 1H), 7.73 (dt, J = 9.1, 0.9 Hz, 1H), 7.66 (ddd, J = 8.3, 4.6, 0.7 Hz, 1H), 3.67-3.55 (m, 4H), 1.34 (t, J = 7.3 Hz, 7H); ESI MS (m/z): 343 [M+1].

20

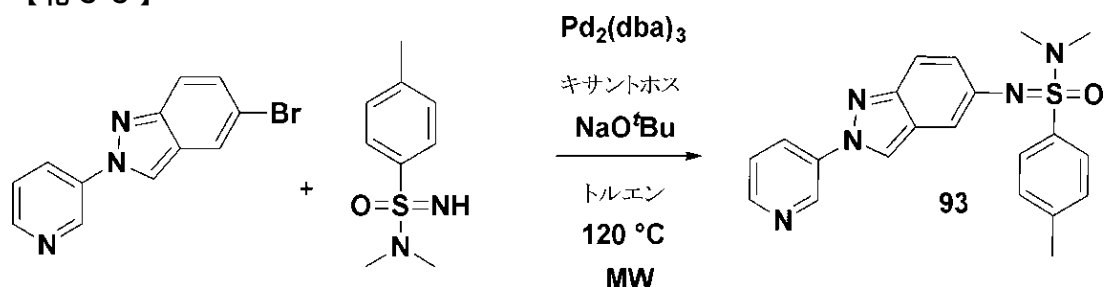
30

【0236】

例 4: N, N4-トリメチル-N'-(2-(ピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル) ベンゼンスルホンイミダミド 93 の合成

40

【化 35】



50

トルエン（5 mL）中の5-ブロモ-2-（ピリジン-3-イル）-2H-インダゾール（0.27 g、0.985ミリモル）、N,N4-トリメチルベンゼンスルホンイミダミド（0.195 g、0.985ミリモル）の溶液をトリス（ジベンジリデンアセトン）ジパラジウム（0）（Pd₂（dba）₃）（0.045 g、0.049ミリモル）、（9,9-ジメチル-9H-キサンテン-4,5-ジイル）ビス（ジフェニルホスファン）（Xantphos）（0.057 g、0.098ミリモル）およびナトリウムtert-ブトキシド（0.095 g、0.985ミリモル）で処理し、120°Cで1時間マイクロ波（MW）で照射した。反応終了後、反応混合物を水（10 mL）を加えてクエンチし、酢酸エチル（2×25 mL）で抽出した。合わせた有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧濃縮して油性残渣を得た。この残渣をCombiFlash（登録商標）クロマトグラフィーで精製し、N,N4-トリメチル-N'-（2-（ピリジン-3-イル）-2H-インダゾール-5-イル）ベンゼンスルホンイミダミド93（133 mg、0.340ミリモル、収率34.5%）を得た。

10

【0237】

表4：本開示の代表的な化合物を、例4に記載の適切な出発物質および方法に従って調製した。

20

30

40

50

【表 4】

化合物番号	化合物名	分析データ
93	<i>N, N, 4</i> -トリメチル- <i>N'</i> -(2-(ピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> インダゾール-5-イル)ベンゼンスルホンイミダミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.27 (d, <i>J</i> = 2.4 Hz, 1H), 8.98 (d, <i>J</i> = 0.7 Hz, 1H), 8.61 (dd, <i>J</i> = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.42 (dq, <i>J</i> = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.85 (d, <i>J</i> = 8.3 Hz, 2H), 7.64-7.60 (m, 2H), 7.47 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 2H), 7.34 (d, <i>J</i> = 1.2 Hz, 1H), 7.21 (dd, <i>J</i> = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 2.61 (s, 6H), 2.42 (s, 3H) ESI MS (<i>m/z</i>): 392 [M+1].
94	<i>N'</i> -(2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> インダゾール-5-イル)- <i>N, N, 4</i> -トリメチルベンゼンスルホンイミダミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.20 (s, 1H), 9.03 (d, <i>J</i> = 0.7 Hz, 1H), 8.64 (d, <i>J</i> = 2.4 Hz, 1H), 8.43 (dt, <i>J</i> = 10.1, 2.4 Hz, 1H), 7.85 (d, <i>J</i> = 8.3 Hz, 2H), 7.63 (d, <i>J</i> = 9.3 Hz, 1H), 7.47 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 2H), 7.33 (t, <i>J</i> = 1.0 Hz, 1H), 7.22 (dd, <i>J</i> = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 2.61 (s, 6H), 2.42 (s, 3H); ESI MS (<i>m/z</i>): 410 [M+1].
95	<i>N, N, 4</i> -トリメチル- <i>N'</i> -(2-(ピリミジン-5-イル)-2 <i>H</i> インダゾール-5-イル)ベンゼンスルホンイミダミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.48 (s, 2H), 9.22 (s, 1H), 9.04 (d, <i>J</i> = 0.7 Hz, 1H), 7.85 (d, <i>J</i> = 8.3 Hz, 2H), 7.65 (d, <i>J</i> = 9.3 Hz, 1H), 7.47 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 2H), 7.34 (d, <i>J</i> = 1.2 Hz, 1H), 7.23 (dd, <i>J</i> = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 2.61 (s, 6H), 2.42 (s, 3H) ESI MS (<i>m/z</i>): 393[M+1].
96	<i>N, N, 4</i> -トリメチル- <i>N'</i> -(2-(ピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> インダゾール-4-イル)ベンゼンスルホンイミダミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.41 (d, <i>J</i> = 2.4 Hz, 1H), 9.31 (s, 1H), 8.63 (dd, <i>J</i> = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.55 (dq, <i>J</i> = 8.4, 1.3 Hz, 1H), 7.97 (d, <i>J</i> = 8.3 Hz, 2H), 7.63 (dd, <i>J</i> = 8.4, 4.8 Hz, 1H), 7.49 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 2H), 7.25 (d, <i>J</i> = 8.8 Hz, 1H), 7.16 (dd, <i>J</i> = 8.6, 7.1 Hz, 1H), 6.76 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 1H), 2.63 (s, 6H), 2.44 (d, <i>J</i> = 7.6 Hz, 3H); ESI MS (<i>m/z</i>): 392[M+1].
97	<i>N, N, 4</i> -トリメチル- <i>N'</i> -(2-(ピリミジン-5-イル)-2 <i>H</i> インダゾール-4-イル)ベンゼンスルホンイミダミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.60 (s, 2H), 9.39 (d, <i>J</i> = 0.7 Hz, 1H), 9.24 (s, 1H), 7.97 (d, <i>J</i> = 8.3 Hz, 2H), 7.49 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 2H), 7.26 (d, <i>J</i> = 8.6 Hz, 1H), 7.18 (dd, <i>J</i> = 8.6, 7.1 Hz, 1H), 6.76 (d, <i>J</i> = 6.8 Hz, 1H), 2.65 (d, <i>J</i> = 10.0 Hz, 6H), 2.45 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 3H); ESI MS (<i>m/z</i>): 393[M+1].
98	<i>N'</i> -(2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> インダゾール-4-イル)- <i>N, N, 4</i> -トリメチルベンゼンスルホンイミダミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.36 (s, 1H), 9.33 (s, 1H), 8.66 (d, <i>J</i> = 2.4 Hz, 1H), 8.58 (dt, <i>J</i> = 10.2, 2.3 Hz, 1H), 7.97 (d, <i>J</i> = 8.3 Hz, 2H), 7.50 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 2H), 7.24 (d, <i>J</i> = 8.6 Hz, 1H), 7.17 (dd, <i>J</i> = 8.7, 7.0 Hz, 1H), 6.76 (d, <i>J</i> = 6.8 Hz, 1H), 2.63 (s, 6H), 2.44 (s, 3H); ESI MS (<i>m/z</i>): 410[M+1].
134	<i>N</i> -エチル- <i>N</i> -メチル- <i>N'</i> -(2-(ピリミジン-5-イル)-2 <i>H</i> インダゾール-4-イル)エタンスルホンイミダミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.55 (s, 2H), 9.22 (s, 1H), 9.15 (d, <i>J</i> = 0.7 Hz, 1H), 7.21-7.13 (m, 2H), 6.65 (dd, <i>J</i> = 6.8, 1.0 Hz, 1H), 3.33 (s, 2H), 3.27 (dd, <i>J</i> = 7.2, 5.7 Hz, 2H), 2.81 (s, 3H), 1.39 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.01 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H); ESI MS (<i>m/z</i>): 345.1 [M+1].
135	<i>N</i> -エチル- <i>N</i> -メチル- <i>N'</i> -(2-(ピリミジン-5-イル)-2 <i>H</i> インダゾール-5-イル)シクロプロパンスルホンイミダミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.47 (s, 2H), 9.21 (s, 1H), 9.01 (d, <i>J</i> = 0.9 Hz, 1H), 7.59-7.57 (m, 1H), 7.18 (q, <i>J</i> = 0.9 Hz, 1H), 7.06 (dd, <i>J</i> = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 3.28-3.20 (m, 3H), 2.81-2.77 (m, 4H), 1.11-0.97 (m, 6H); ESI MS (<i>m/z</i>): 356.55 [M+1].

10

20

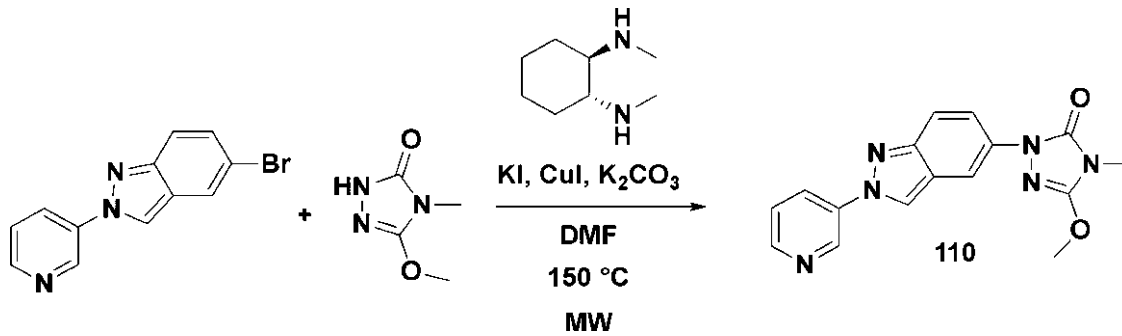
30

40

【0238】

例5：5-メトキシ-4-メチル-2-(2-(ピリジン-3-イル)-2*H*-インダゾール-5-イル)-2,4-ジヒドロ-3*H*-1,2,4-トリアゾール-3-オン110の合成

【化 3 6】



10

ジメチルホルムアミド（DMF）（6 mL）中の5-ブロモ-2-（ピリジン-3-イル）-2H-インダゾール（0.6 g、2.189ミリモル）、5-メトキシ-4-メチル-2,4-ジヒドロ-3H-1,2,4-トリアゾール-3-オン（0.791 g、6.13ミリモル）の溶液に、ヨウ化銅（I）（CuI）（0.083 g、0.438ミリモル）、*trans*-1,2-ビス（メチルアミノ）シクロヘキサン（0.249 g、0.876ミリモル）ヨウ化カリウム（KI）（0.109 g、0.657ミリモル）および炭酸カリウム（K₂CO₃）（0.908 g、6.57ミリモル）を添加し、混合物をマイクロ波装置（MW）中で150 °Cで1時間照射した。反応終了後、水（20 mL）を加えて反応混合物をクエンチし、酢酸エチル（3×25 mL）で抽出した。合わせた有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧濃縮してグミ状残渣を得た。この残渣をCombiFlash（登録商標）クロマトグラフィーで精製し、5-メトキシ-4-メチル-2-（2-（ピリジン-3-イル）-2H-インダゾール-5-イル）-2,4-ジヒドロ-3H-1,2,4-トリアゾール-3-オン110（0.184 g、0.571ミリモル、収率26.1%）を得た。

20

【0239】

表5：本開示の代表的な化合物を、例5に記載の適切な出発物質および方法に従って調製した。

30

40

50

【表 5 - 1】

化合物番号	化合物名	分析データ
110	5-メトキシ-4-メチル-2-(2-(ピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル)-2,4-ジヒドロ-3H-1,2,4-トリアゾール-3-オン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.33 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.27 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.67 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.49 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.87-7.84 (m, 1H), 7.77 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.66 (ddd, J = 8.3, 4.7, 0.7 Hz, 1H), 7.38 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.04 (s, 3H), 3.01 (s, 3H); ESI MS (m/z): 322.6 [M+1].
111	5-メトキシ-4-メチル-2-(2-(5-メチルピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル)-2,4-ジヒドロ-3H-1,2,4-トリアゾール-3-オン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.25 (s, 1H), 9.09-9.20 (m, 1H), 8.58 (s, 1H), 8.35 (s, 1H), 7.84 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.76 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 7.37 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 3.02 (d, J = 10.5 Hz, 6H), 2.44 (s, 3H); ESI MS (m/z): 336.7 [M+1].
112	2-(2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル)-5-メトキシ-4-メチル-2,4-ジヒドロ-3H-1,2,4-トリアゾール-3-オン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.31 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 9.26 (s, 1H), 8.70 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.52 (dt, J = 9.9, 2.3 Hz, 1H), 7.85 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.76 (t, J = 1.0 Hz, 1H), 7.40 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 3.04 (s, 3H), 3.01 (s, 3H); ESI MS (m/z): 341 [M+1].
113	5-メトキシ-4-メチル-2-(2-(2-メチルピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル)-2,4-ジヒドロ-3H-1,2,4-トリアゾール-3-オン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.84 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.65 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 7.97 (dd, J = 7.9, 1.5 Hz, 1H), 7.85-7.82 (m, 1H), 7.80 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.51-7.48 (m, 1H), 7.36 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 3.04 (d, J = 5.2 Hz, 3H), 3.01 (s, 3H), 2.42 (s, 3H); ESI MS (m/z): 336.9 [M+1].
114	5-メトキシ-4-メチル-2-(2-(4-メチルピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル)-2,4-ジヒドロ-3H-1,2,4-トリアゾール-3-オン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.85 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.69 (s, 1H), 8.61 (d, J = 4.9 Hz, 1H), 7.87-7.83 (m, 1H), 7.80 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.55 (d, J = 5.1 Hz, 1H), 7.36 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.04 (s, 3H), 3.01 (s, 3H), 2.29 (s, 3H); ESI MS (m/z): 336.9 [M+1].
115	5-メトキシ-4-メチル-2-(2-(6-メチルピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル)-2,4-ジヒドロ-3H-1,2,4-トリアゾール-3-オン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.21 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 9.17 (d, J = 2.8 Hz, 1H), 8.36 (dd, J = 8.6, 2.8 Hz, 1H), 7.85-7.83 (m, 1H), 7.75 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.50 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.36 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 3.03 (s, 3H), 3.01 (s, 3H), 2.56 (s, 3H); ESI MS (m/z): 336.9 [M+1].
116	2-(2-(2,6-ジメチルピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル)-5-メトキシ-4-メチル-2,4-ジヒドロ-3H-1,2,4-トリアゾール-3-オン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.78 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 7.84 (t, J = 1.1 Hz, 1H), 7.82-7.81 (m, 1H), 7.78 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.36-7.31 (m, 2H), 3.04 (d, J = 5.8 Hz, 3H), 3.01 (s, 3H), 2.55 (s, 3H), 2.36 (s, 3H); ESI MS (m/z): 350.9 [M+1].
117	5-メトキシ-2-(2-(5-メトキシピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル)-4-メチル-2,4-	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.30 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.94 (s, 1H), 8.40 (s, 1H), 8.07 (t, J = 2.4 Hz, 1H), 7.87-7.84 (m, 1H), 7.76 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.38 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 3.96 (s, 3H), 3.04 (s, 3H), 3.01 (s, 3H); ESI MS (m/z): 353 [M+1].

10

20

30

40

【表 5 - 2】

	ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-オン	
118	5-メトキシ-4-メチル-2-(2-(5-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル)-2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-オン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.66 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.44 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 9.07 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.89 (t, J = 1.8 Hz, 1H), 7.88-7.86 (m, 1H), 7.78 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.41 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.03 (d, J = 5.9 Hz, 3H), 3.01 (s, 3H) ESI MS (m/z): 391 [M+1].
119	5-メトキシ-4-メチル-2-(2-(ピリジン-5-イル)-2H-インダゾール-5-イル)-2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-オン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.54 (s, 2H), 9.33 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 9.28 (s, 1H), 7.87 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.79 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 7.41 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 3.04 (s, 3H), 3.01 (s, 3H); ESI MS (m/z): 324 [M+1].
120	2-(2-(5-クロロピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル)-5-メトキシ-4-メチル-2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-オン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.99 (q, J = 1.2 Hz, 1H), 9.36 (dd, J = 5.9, 1.0 Hz, 1H), 9.11 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.27 (q, J = 2.9 Hz, 1H), 7.60-7.57 (m, 1H), 7.13 (q, J = 1.0 Hz, 1H), 7.01 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 3.37 (dd, J = 10.1, 5.7 Hz, 2H), 3.16 (s, 3H), 1.79-1.72 (m, 2H), 1.38-1.26 (m, 4H), 0.84 (t, J = 7.1 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 356.6 [M+1].
121	4-ベンジル-5-メトキシ-2-(2-(ピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル)-2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-オン	¹ H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 9.20 (s, 1H), 8.71 (s, 1H), 8.50 (s, 1H), 8.29 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.86 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.68 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 7.53-7.48 (m, 3H), 7.38-7.28 (m, 4H), 4.78 (s, 2H), 3.16 (s, 3H); ESI MS (m/z): 399.00 [M+1].
122	4-(2-フルオロベンジル)-5-メトキシ-2-(2-(ピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル)-2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-オン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.33 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.28 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.67 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.49 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.87 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.82 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 7.66 (dd, J = 8.1, 4.4 Hz, 1H), 7.41-7.35 (m, 3H), 7.24-7.19 (m, 2H), 4.75 (s, 2H), 3.07 (s, 3H); ESI MS (m/z): 417.15 [M+1].
123	4-エチル-5-メトキシ-2-(2-(ピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル)-2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-オン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.35 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.29 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.69 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.51 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.89-7.86 (m, 1H), 7.80 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.69-7.66 (m, 1H), 7.39 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 3.56 (q, J = 7.2 Hz, 2H), 3.06 (s, 3H), 1.21 (t, J = 7.2 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 337.00 [M+1].
124	4-(4-フルオロベンジル)-5-メトキシ-2-(2-(ピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル)-2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-オン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.33 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.28 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.67 (d, J = 4.6 Hz, 1H), 8.49 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.87-7.85 (m, 1H), 7.81 (q, J = 1.0 Hz, 1H), 7.66 (q, J = 4.3 Hz, 1H), 7.42-7.36 (m, 3H), 7.22-7.17 (m, 2H), 4.68 (s, 2H), 3.06 (s, 3H); ESI MS (m/z): 417.15 [M+1].

10

20

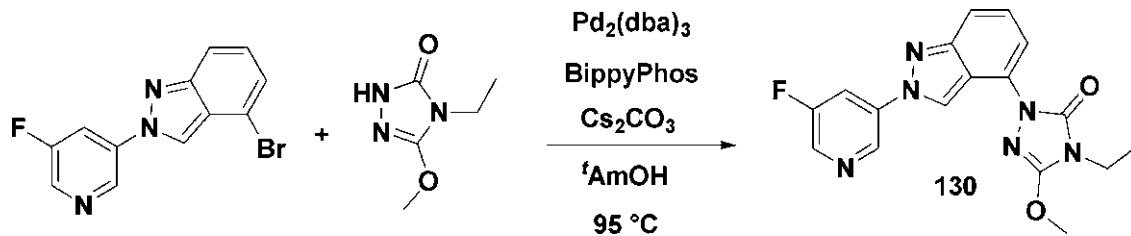
30

40

【 0 2 4 0 】

例 6 : 4-エチル-2-(2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-4-イル)-5-メトキシ-2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-オン 130 の合成

【化 3 7】



4-ブromo-2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2H-インダゾール (300 mg、1.027ミリモル)、4-エチル-5-メトキシ-2,4-ジヒドロ-3H-1,2,4-トリアゾール-3-オン (162 mg、1.130ミリモル)、トリス (ジベンジリデンアセトン) ジパラジウム ($\text{Pd}_2(\text{dba})_3$) (103 mg、0.113ミリモル)、5-(ジ-tert-ブチルホスフィノ)-1',3',5'-トリフェニル-1'H-[1,4']ビピラゾール (BippyPhos) (97 mg、0.191ミリモル)、および炭酸セシウム (Cs_2CO_3) (970 mg、2.98ミリモル)を、 N_2 雰囲気下、コンデンサーを備えたフラスコに入れ、攪拌した。第三級アミルアルコール (20 mL)を加え、得られた溶液を N_2 下、 95°C で16時間加熱した。反応終了後、反応混合物を減圧濃縮して暗残渣を得、これをCombiflash (登録商標)クロマトグラフィーで精製して4-エチル-2-(2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-4-イル)-5-メトキシ-2,4-ジヒドロ-3H-1,2,4-トリアゾール-3-オン 130 (132.5 mg、0.374ミリモル、収率36.4%)を得た。

【0241】

表6：本開示の代表的な化合物を、例6に記載の適切な出発物質および方法に従って調製した。

10

20

30

40

50

【表 6 - 1】

化合物番号	化合物名	分析データ
125	5-メトキシ-4-メチル-2-(2-(ピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-4-イル)-2,4-ジヒドロ-3 <i>H</i> -1,2,4-トリアゾール-3-オン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.33 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 9.29 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.67 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.50 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.71 (dd, J = 7.3, 0.5 Hz, 1H), 7.65 (ddd, J = 8.3, 4.8, 0.6 Hz, 1H), 7.56-7.54 (m, 1H), 7.37 (dd, J = 8.6, 7.3 Hz, 1H), 4.18 (s, 3H), 3.15 (s, 3H); ESI MS (m/z): 322.40 [M+1].
126	4-(3-フルオロベンジル)-5-メトキシ-2-(2-(ピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)-2,4-ジヒドロ-3 <i>H</i> -1,2,4-トリアゾール-3-オン	¹ H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 9.18 (s, 1H), 8.68 (s, 1H), 8.49 (s, 1H), 8.26 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.84 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.67 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 7.50 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 7.34-7.27 (m, 2H), 7.24 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.18 (dd, J = 9.4, 2.1 Hz, 1H), 7.02-6.97 (m, 1H), 4.75 (s, 2H), 3.16-3.14 (m, 3H); ESI MS (m/z): 417.00 [M+1].
127	4-シクロプロピル-5-メトキシ-2-(2-(ピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)-2,4-ジヒドロ-3 <i>H</i> -1,2,4-トリアゾール-3-オン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.31 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.20 (s, 1H), 8.65 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.46 (dq, J = 8.4, 1.3 Hz, 1H), 8.12 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 7.94 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 7.81 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.64 (dd, J = 8.4, 4.8 Hz, 1H), 4.05 (d, J = 5.9 Hz, 3H), 2.82-2.77 (m, 1H), 0.97-0.89 (m, 4H); ESI MS (m/z): 349.900[M+1].
128	4-シクロプロピル-5-メトキシ-2-(2-(ピリミジン-5-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-4-イル)-2,4-ジヒドロ-3 <i>H</i> -1,2,4-トリアゾール-3-オン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.55 (s, 2H), 9.36 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 9.28 (s, 1H), 7.72 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 7.55 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.39 (dd, J = 8.7, 7.5 Hz, 1H), 4.17 (s, 3H), 2.84 (s, 1H), 0.95 (dd, J = 9.4, 2.8 Hz, 4H); ESI MS (m/z): 350.20 [M+1].
129	4-エチル-5-メトキシ-2-(2-(ピリミジン-5-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-4-イル)-2,4-ジヒドロ-3 <i>H</i> -1,2,4-トリアゾール-3-オン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.56 (s, 2H), 9.38 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 9.29 (s, 1H), 7.74 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 7.56 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.40 (dd, J = 8.7, 7.5 Hz, 1H), 4.20 (s, 3H), 3.65 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.24 (t, J = 7.2 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 338.05 [M+1].
130	4-エチル-2-(2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-4-イル)-5-メトキシ-2,4-ジヒドロ-3 <i>H</i> -1,2,4-トリアゾール-3-オン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.34 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 9.27 (s, 1H), 8.71 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.55 (dt, J = 9.9, 2.4 Hz, 1H), 7.71 (d, J = 6.6 Hz, 1H), 7.55 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.39 (dd, J = 8.8, 7.3 Hz, 1H), 4.20 (s, 3H), 3.65 (q, J = 7.2 Hz, 2H), 1.24 (t, J = 7.2 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 355.20 [M+1].
131	4-エチル-5-メトキシ-2-(2-(ピリミジン-5-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)-2,4-ジヒドロ-3 <i>H</i> -1,2,4-トリアゾール-3-オン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.52 (s, 2H), 9.27 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 9.26 (s, 1H), 8.15 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.98 (dd, J = 9.5, 2.0 Hz, 1H), 7.85 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 4.07 (s, 3H), 3.61 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.22 (t, J = 7.2 Hz, 4H); ESI MS (m/z): 338.20 [M+1].
132	4-シクロプロピル-2-(2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)-5-メト	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.24 (d, J = 0.7 Hz, 2H), 8.68 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.49-8.47 (m, 1H), 8.11 (t, J = 1.0 Hz, 1H), 7.95 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 7.81 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 4.04 (s, 3H), 2.80 (s, 1H), 0.95-0.91 (m, 4H); ESI MS (m/z): 367.20 [M+1].

10

20

30

40

50

【表 6 - 2】

	キシ-2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-オン	
133	4-エチル-2-(2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル)-5-メトキシ-2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-オン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.25-9.24 (m, 2H), 8.68 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.48 (dt, J = 9.9, 2.3 Hz, 1H), 8.13 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.97 (dd, J = 9.4, 2.1 Hz, 1H), 7.82 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 4.07 (s, 3H), 3.61 (q, J = 7.2 Hz, 2H), 1.21 (t, J = 7.2 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 355.00 [M+1].
319	2-(2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル)-5-メトキシ-4-(3-メチルブタン-2-イル)-2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-オン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.25 (t, J = 1.3 Hz, 2H), 8.69-8.68 (m, 1H), 8.49 (dt, J = 10.0, 2.3 Hz, 1H), 8.14 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.97 (dd, J = 9.4, 2.1 Hz, 1H), 7.83-7.81 (m, 1H), 4.06 (s, 3H), 3.72 (td, J = 7.0, 2.9 Hz, 1H), 2.17-2.12 (m, 1H), 1.40 (d, J = 7.1 Hz, 3H), 0.97 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.80 (d, J = 6.8 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 397.10 [M+1].
320	4-シクロプロピル-2-(2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-4-イル)-5-メトキシ-2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-オン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.31 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 9.27 (s, 1H), 8.71 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.54 (dd, J = 10.0, 2.2 Hz, 1H), 7.69 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 7.54 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.38 (dd, J = 8.8, 7.3 Hz, 1H), 4.17 (s, 3H), 2.84 (s, 1H), 0.96 (d, J = 6.6 Hz, 4H); ESI MS (m/z): 367.05 [M+1].
321	4-シクロプロピル-5-メトキシ-2-(2-(ピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-4-イル)-2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-オン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.33 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 9.27 (s, 1H), 8.67 (d, J = 3.4 Hz, 1H), 8.51-8.48 (m, 1H), 7.69 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 7.65 (dd, J = 8.4, 4.8 Hz, 1H), 7.54 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.38-7.34 (m, 1H), 4.16 (s, 3H), 2.84 (s, 1H), 0.97-0.94 (m, 4H); ESI MS (m/z): 349.05 [M+1].
322	5-メトキシ-4-(3-メチルブタン-2-イル)-2-(2-(ピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル)-2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-オン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.32 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 9.21 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.65 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.47 (dq, J = 8.5, 1.3 Hz, 1H), 8.15 (q, J = 1.0 Hz, 1H), 7.96 (dd, J = 9.5, 2.0 Hz, 1H), 7.82 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 7.66-7.63 (m, 1H), 4.06 (s, 3H), 3.72 (dd, J = 9.9, 7.0 Hz, 1H), 2.17-2.12 (m, 1H), 1.40 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 0.97 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 0.80 (d, J = 6.6 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 379.25 [M+1].
323	4-シクロプロピル-5-メトキシ-2-(2-(ピリミジン-5-イル)-2H-インダゾール-5-イル)-2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-オン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.52 (s, 2H), 9.27-9.26 (m, 2H), 8.13 (t, J = 1.1 Hz, 1H), 7.96 (dd, J = 9.5, 2.0 Hz, 1H), 7.83 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 4.04 (s, 3H), 2.81-2.78 (m, 1H), 0.95-0.91 (m, 4H); ESI MS (m/z): 350.20 [M+1].
324	4-エチル-5-メトキシ-2-(2-(ピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-4-イル)-2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-オン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.34 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 9.30 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.67 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.50 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.72-7.70 (m, 1H), 7.65 (ddd, J = 8.3, 4.6, 0.7 Hz, 1H), 7.55 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.37 (dd, J = 8.7, 7.5 Hz, 1H), 4.19 (s, 3H), 3.65 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.24 (t, J = 7.2 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 337.25 [M+1].
325	2-(2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2H-イン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.28 (s, 1H), 9.25 (s, 1H), 8.69 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.49 (dt, J = 9.9, 2.3 Hz, 1H), 8.13 (d, J = 1.0

10

20

30

40

50

【表 6 - 3】

	ダゾール-5-イル)-5-メ トキシ-4-(2, 2, 2-トリ フルオロエチル)-2, 4- ジヒドロ-3#1, 2, 4-ト リアゾール-3-オン	Hz, 1H), 7.94 (dd, J = 9.4, 2.1 Hz, 1H), 7.86 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 4.50 (q, J = 9.1 Hz, 2H), 4.09 (d, J = 9.8 Hz, 3H) ESI MS (m/z): 408.60 [M+1].
326	5-エトキシ-2-(2-(ピリ ミジン-5-イル)-2#イン ダゾール-5-イル)-4- (3-(トリフルオロメチ ル)ベンジル)-2, 4-ジヒ ドロ-3#1, 2, 4-トリア ゾール-3-オン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.53 (s, 2H), 9.28 (s, 1H), 8.15 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 7.98 (dd, J = 9.4, 2.1 Hz, 1H), 7.85 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 7.72 (d, J = 8.3 Hz, 2H), 7.63 (d, J = 5.1 Hz, 2H), 4.89 (s, 2H), 4.45 (q, J = 7.1 Hz, 2H), 1.36 (t, J = 7.0 Hz, 3H), 1.18-1.29 (1H); ESI MS (m/z): 481.5 [M+1].
327	5-エトキシ-2-(2-(ピリ ジン-3-イル)-2#イン ダゾール-4-イル)-4- (3-(トリフルオロメチ ル)ベンジル)-2, 4-ジヒ ドロ-3#1, 2, 4-トリア ゾール-3-オン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.32 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 9.27 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.67 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.49 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.75-7.71 (m, 3H), 7.66-7.63 (m, 3H), 7.57 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.38 (dd, J = 8.7, 7.5 Hz, 1H), 4.93 (s, 2H), 4.59 (q, J = 7.0 Hz, 2H), 1.39 (t, J = 7.1 Hz, 3H) ESI MS (m/z): 480.55 [M+1].
328	5-エトキシ-2-(2-(5-フ ルオロピリジン-3-イ ル)-2#インダゾール- 4-イル)-4-(3-(トリフ ルオロメチル)ベンジ ル)-2, 4-ジヒドロ-3# 1, 2, 4-トリアゾール-3- オン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.31 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 9.26 (s, 1H), 8.71 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.55-8.52 (m, 1H), 7.73 (t, J = 7.1 Hz, 3H), 7.64 (d, J = 5.6 Hz, 2H), 7.56 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.40 (dd, J = 8.7, 7.5 Hz, 1H), 4.93 (s, 2H), 4.60 (q, J = 7.0 Hz, 2H), 1.39 (t, J = 7.1 Hz, 3H) ESI MS (m/z): 498.55 [M+1].
329	5-エトキシ-2-(2-(ピリ ミジン-5-イル)-2#イン ダゾール-4-イル)-4- (3-(トリフルオロメチ ル)ベンジル)-2, 4-ジヒ ドロ-3#1, 2, 4-トリア ゾール-3-オン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.55 (s, 2H), 9.35 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 9.28 (s, 1H), 7.76-7.71 (m, 3H), 7.65-7.63 (m, 2H), 7.58 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.40 (dd, J = 8.7, 7.5 Hz, 1H), 4.93 (s, 2H), 4.61 (q, J = 7.1 Hz, 2H), 1.39 (t, J = 7.1 Hz, 3H) ESI MS (m/z): 482.15 [M+1].
330	5-エトキシ-2-(2-(ピリ ジン-3-イル)-2#イン ダゾール-5-イル)-4- (3-(トリフルオロメチ ル)ベンジル)-2, 4-ジヒ ドロ-3#1, 2, 4-トリア ゾール-3-オン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.32 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.22 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.65 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.48-8.45 (m, 1H), 8.14 (t, J = 1.0 Hz, 1H), 7.95 (dd, J = 9.5, 2.0 Hz, 1H), 7.83 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 7.73-7.70 (m, 2H), 7.66-7.63 (m, 3H), 4.89 (s, 2H), 4.45 (q, J = 7.0 Hz, 2H), 1.36 (t, J = 7.1 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 481.05 [M+1].
331	5-エトキシ-2-(2-(ピリ ジン-3-イル)-2#イン ダゾール-4-イル)-4- (4-(トリフルオロメト キシ)ベンジル)-2, 4-ジ ヒドロ-3#1, 2, 4-トリ アゾール-3-オン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.31 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.21 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.65 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.46 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 8.14 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.95 (dd, J = 9.5, 2.1 Hz, 1H), 7.84-7.81 (m, 1H), 7.66-7.63 (m, 1H), 7.48-7.45 (m, 2H), 7.39-7.37 (m, 2H), 4.81 (s, 2H), 4.45 (q, J = 7.0 Hz, 2H), 1.37 (t, J = 7.0 Hz, 3H) ESI MS (m/z): 497.10[M+1].
332	5-エトキシ-2-(2-(ピリ ミジン-5-イル)-2#イ	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.52 (s, 2H), 9.28-9.26 (m, 2H), 8.15 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.97 (dd, J = 9.5, 2.1 Hz, 1H), 7.85 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 7.47 (d, J = 8.9 Hz, 2H), 7.38 (d, J = 7.9 Hz, 2H),

10

20

30

40

50

【表 6 - 4】

	ンダゾール-4-イル)-4-(4-(トリフルオロメトキシ)ベンジル)-2,4-ジヒドロ-3 <i>H</i> -1,2,4-トリアゾール-3-オン	4.81 (s, 2H), 4.45 (q, J = 7.0 Hz, 2H), 1.37 (t, J = 7.0 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 497.95[M+1].
333	5-メトキシ-2-(2-(ピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-4-イル)-4-(4-(トリフルオロメトキシ)ベンジル)-2,4-ジヒドロ-3 <i>H</i> -1,2,4-トリアゾール-3-オン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.34 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.31 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.67 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.50 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.72 (dd, J = 7.3, 0.6 Hz, 1H), 7.66-7.63 (m, 1H), 7.57 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.49-7.47 (m, 2H), 7.40-7.36 (m, 3H), 4.86 (s, 2H), 4.18 (s, 3H) ESI MS (m/z): 482.90[M+1].
334	5-メトキシ-2-(2-(ピリミジン-5-yl)-2 <i>H</i> -インダゾール-4-イル)-4-(4-(トリフルオロメトキシ)ベンジル)-2,4-ジヒドロ-3 <i>H</i> -1,2,4-トリアゾール-3-オン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.56 (s, 2H), 9.39 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 9.28 (s, 1H), 7.75 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.58 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.48 (dd, J = 9.2, 2.4 Hz, 2H), 7.41-7.37 (m, 3H), 4.87 (s, 2H), 4.19 (s, 3H); ESI MS (m/z): 483.85[M+1].
335	5-メトキシ-2-(2-(ピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)-4-(3-(トリフルオロメチル)ベンジル)-2,4-ジヒドロ-3 <i>H</i> -1,2,4-トリアゾール-3-オン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.32 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.22 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.65 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.47 (dq, J = 8.3, 1.3 Hz, 1H), 8.16 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.96 (dd, J = 9.5, 2.1 Hz, 1H), 7.84 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 7.72-7.69 (m, 2H), 7.66-7.62 (m, 3H), 4.90 (s, 2H), 4.06 (s, 3H) ESI MS (m/z): 467.00[M+1].
336	4-(4-フルオロベンジル)-5-メトキシ-2-(2-(ピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-4-イル)-2,4-ジヒドロ-3 <i>H</i> -1,2,4-トリアゾール-3-オン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.34 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.30 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.67 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.50 (dq, J = 8.4, 1.3 Hz, 1H), 7.72 (dd, J = 7.3, 0.6 Hz, 1H), 7.66-7.63 (m, 1H), 7.56 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.42-7.38 (m, 3H), 7.21 (tt, J = 9.3, 2.5 Hz, 2H), 4.81 (s, 2H), 4.18 (s, 3H) ESI MS (m/z): 417.00[M+1].
337	5-エトキシ-4-(4-フルオロベンジル)-2-(2-(ピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)-2,4-ジヒドロ-3 <i>H</i> -1,2,4-トリアゾール-3-オン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.31 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.21 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.65 (dd, J = 4.6, 1.2 Hz, 1H), 8.46 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 8.13 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.94 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 7.82 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 7.64 (q, J = 4.2 Hz, 1H), 7.41-7.36 (m, 2H), 7.23-7.18 (m, 2H), 4.76 (s, 2H), 4.44 (q, J = 7.0 Hz, 2H), 1.37 (t, J = 7.0 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 431.30[M+1].
338	5-エトキシ-2-(2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-4-イル)-4-(4-(トリフルオロメトキシ)ベンジル)-2,4-ジヒドロ-3 <i>H</i> -1,2,4-トリアゾール-3-オン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.26-9.24 (m, 2H), 8.68 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.49 (dt, J = 10.0, 2.3 Hz, 1H), 8.13 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.96 (dd, J = 9.5, 1.8 Hz, 1H), 7.83 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 7.47 (d, J = 8.9 Hz, 2H), 7.38 (d, J = 8.3 Hz, 2H), 4.81 (s, 2H), 4.45 (q, J = 7.1 Hz, 2H), 1.37 (t, J = 7.0 Hz, 3H) ESI MS (m/z): 515.15[M+1].
339	4-(4-フルオロベンジル)-5-メトキシ-2-(2-	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 10.05 (q, J = 1.3 Hz, 1H), 9.42-9.41 (m, 2H), 8.34 (q, J = 2.9 Hz, 1H), 8.15 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 8.01 (dd, J = 9.5, 2.0 Hz, 1H), 7.86 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 7.39 (dd, J

10

20

30

40

50

【表 6 - 5】

	(ピリミジン-5-イル)- 2 <i>H</i> -インダゾール-5-イ ル)-2, 4-ジヒ ドロ-3 <i>H</i> - 1, 2, 4-トリアゾール-3- オン	= 8.8, 5.4 Hz, 2H), 7.22-7.18 (m, 2H), 4.77 (s, 2H), 4.06 (s, 3H); ESI MS (m/z): 418.15[M+1].
340	4-(4-フルオロベンジ ル)-2-(2-(5-フルオロ ピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> - インダゾール-4-イル)- 5-メ トキシ-2, 4-ジヒ ド ロ-3 <i>H</i> -1, 2, 4-トリアゾ ール-3-オン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.35 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 9.27 (s, 1H), 8.71 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.54 (dt, J = 9.9, 2.3 Hz, 1H), 7.72 (d, J = 7.1 Hz, 1H), 7.56 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.41-7.37 (m, 3H), 7.21 (t, J = 8.9 Hz, 2H), 4.81 (s, 2H), 4.18 (s, 3H); ESI MS (m/z): 435.10[M+1].
341	5-エトキシ-4-(4-フル オロベンジル)-2-(2- (ピリミジン-5-イル)- 2 <i>H</i> -インダゾール-5-イ ル)-2, 4-ジヒ ドロ-3 <i>H</i> - 1, 2, 4-トリアゾール-3- オン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 10.05 (dd, J = 2.9, 1.0 Hz, 1H), 9.42-9.41 (m, 2H), 8.33 (q, J = 2.9 Hz, 1H), 8.13 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 8.00 (dd, J = 9.5, 2.0 Hz, 1H), 7.85 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.41- 7.37 (m, 2H), 7.23-7.18 (m, 2H), 4.76 (s, 2H), 4.45 (q, J = 7.0 Hz, 2H), 1.37 (t, J = 7.1 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 432.35[M+1].
342	5-エトキシ-4-(4-フル オロベンジル)-2-(2- (5-フルオロピリジン- 3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾー ル-5-イル)-2, 4-ジヒ ド ロ-3 <i>H</i> -1, 2, 4-トリアゾ ール-3-オン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.25-9.24 (m, 2H), 8.68 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.49 (dt, J = 10.0, 2.3 Hz, 1H), 8.12 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.96 (dd, J = 9.5, 2.0 Hz, 1H), 7.82 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 7.41- 7.37 (m, 2H), 7.23-7.18 (m, 2H), 4.76 (s, 2H), 4.44 (q, J = 7.0 Hz, 2H), 1.37 (t, J = 7.1 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 449.20[M+1].
343	5-エトキシ-4-(4-フル オロベンジル)-2-(2- (ピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> - インダゾール-4-イル)- 2, 4-ジヒ ドロ-3 <i>H</i> - 1, 2, 4-トリアゾール-3- オン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.32 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 9.26 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.67 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.49 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.72-7.70 (m, 1H), 7.66-7.63 (m, 1H), 7.56 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.43-7.35 (m, 3H), 7.24-7.19 (m, 2H), 4.80 (s, 2H), 4.58 (q, J = 7.1 Hz, 2H), 1.40 (t, J = 7.1 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 431.25[M+1].
344	5-エトキシ-4-(4-フル オロベンジル)-2-(2- (ピリミジン-5-イル)- 2 <i>H</i> -インダゾール-4-イ ル)-2, 4-ジヒ ドロ-3 <i>H</i> - 1, 2, 4-トリアゾール-3- オン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.55 (s, 2H), 9.34 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 9.28 (s, 1H), 7.74 (dd, J = 7.5, 0.6 Hz, 1H), 7.57 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.43-7.38 (m, 3H), 7.24-7.19 (m, 2H), 4.80 (s, 2H), 4.60 (q, J = 7.0 Hz, 2H), 1.40 (t, J = 7.1 Hz, 3H) ESI MS (m/z): 432.40[M+1].
345	5-エトキシ-4-(4-フル オロベンジル)-2-(2- (5-フルオロピリジン- 3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾー ル-4-イル)-2, 4-ジヒ ド ロ-3 <i>H</i> -1, 2, 4-トリアゾ ール-3-オン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.30 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 9.26 (s, 1H), 8.71 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.53 (dt, J = 9.9, 2.4 Hz, 1H), 7.72-7.70 (m, 1H), 7.56 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.43-7.37 (m, 3H), 7.25-7.19 (m, 2H), 4.80 (s, 2H), 4.59 (q, J = 7.1 Hz, 2H), 1.40 (t, J = 7.1 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 449.04[M+1].
346	2-(2-(5-フルオロピリ ジン-3-イル)-2 <i>H</i> -イン ダゾール-5-イル)-5-メ	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.26-9.25 (m, 2H), 8.69 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.49 (dt, J = 10.0, 2.3 Hz, 1H), 8.15 (q, J = 1.0 Hz, 1H), 7.98 (dd, J = 9.5, 2.0 Hz, 1H), 7.84 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 7.72-

10

20

30

40

50

【表 6 - 6】

	トキシ-4-(3-(トリフル オロメチル)ベンジル)- 2,4-ジヒドロ-3# 1,2,4-トリアゾール-3- オン	7.69 (m, 2H), 7.65-7.62 (m, 2H), 4.90 (s, 2H), 4.06 (s, 3H); ESI MS (m/z): 485.25[M+1].
347	2-(3-クロロ-2-(ピリジ ン-3-イル)-2H-インダ ゾール-5-イル)-5-メト キシ-4-メチル-2,4-ジ ヒドロ-3#1,2,4-トリア ゾール-3-オン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.00 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.81 (dd, J = 4.9, 1.5 Hz, 1H), 8.26 (dq, J = 8.2, 1.3 Hz, 1H), 7.87 (dd, J = 9.3, 0.7 Hz, 1H), 7.72 (ddd, J = 8.2, 4.8, 0.7 Hz, 1H), 7.64 (q, J = 1.0 Hz, 1H), 7.47 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 3.04 (d, J = 4.4 Hz, 3H), 3.01 (s, 3H); ESI MS (m/z): 356.85 [M+1].
348	4-(4-クロロベンジル)- 5-メトキシ-2-(2-(ピリ ミジン-5-イル)-2H-イン ダゾール-5-イル)- 2,4-ジヒドロ-3# 1,2,4-トリアゾール-3- オン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 10.05 (q, J = 1.2 Hz, 1H), 9.42- 9.41 (m, 2H), 8.34 (q, J = 2.9 Hz, 1H), 8.15 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 8.01 (dd, J = 9.5, 2.1 Hz, 1H), 7.86 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 7.45-7.42 (m, 2H), 7.36 (d, J = 8.6 Hz, 2H), 4.78 (s, 2H), 4.05 (s, 3H); ESI MS (m/z): 434.15[M+1].
349	4-(4-クロロベンジル)- 5-メトキシ-2-(2-(ピリ ミジン-5-イル)-2H-イン ダゾール-4-イル)- 2,4-ジヒドロ-3# 1,2,4-トリアゾール-3- オン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.56 (s, 2H), 9.39 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 9.28 (s, 1H), 7.75 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.58 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.46-7.36 (m, 5H), 4.83 (s, 2H), 4.19 (s, 3H) ESI MS (m/z): 434.20[M+1].
350	4-(4-クロロベンジル)- 5-エトキシ-2-(2-(ピリ ミジン-5-イル)-2H-イン ダゾール-4-イル)- 2,4-ジヒドロ-3# 1,2,4-トリアゾール-3- オン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.55 (s, 2H), 9.34 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 9.28 (s, 1H), 7.74 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.57 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.47-7.44 (m, 2H), 7.42-7.36 (m, 3H), 4.83-4.77 (m, 2H), 4.60 (q, J = 7.0 Hz, 2H), 1.40 (t, J = 7.0 Hz, 3H) ESI MS (m/z): 447.95[M+1].
351	4-(4-クロロベンジル)- 5-エトキシ-2-(2-(5-フル オロピリジン-3-イル)- 2H-インダゾール- 4-イル)-2,4-ジヒドロ- 3#1,2,4-トリアゾール- 3-オン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.30 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 9.26 (s, 1H), 8.71 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.53 (dt, J = 10.0, 2.4 Hz, 1H), 7.71 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.56 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.47-7.44 (m, 2H), 7.41-7.37 (m, 3H), 4.81 (s, 2H), 4.59 (q, J = 7.0 Hz, 2H), 1.40 (t, J = 7.0 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 464.95[M+1].
352	5-メトキシ-2-(2-(ピリ ジン-3-イル)-2H-イン ダゾール-4-イル)-4- (3-(トリフルオロメチ ル)ベンジル)-2,4-ジヒ ドロ-3#1,2,4-トリア ゾール-3-オン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.34 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.31 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 8.67 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.50 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.74-7.70 (m, 3H), 7.66-7.63 (m, 3H), 7.57 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.38 (dd, J = 8.7, 7.5 Hz, 1H), 4.94 (s, 2H), 4.18 (s, 3H); ESI MS (m/z): 467.00[M+1].
353	2-(2-(5-フルオロピリ ジン-3-イル)-2H-イン ダゾール-4-イル)-5-メ トキシ-4-(4-(トリフル	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.35 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 9.28 (s, 1H), 8.71 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.55 (dt, J = 10.0, 2.4 Hz, 1H), 7.72 (d, J = 6.7 Hz, 1H), 7.57 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.48 (d, J = 8.9 Hz, 2H), 7.40 (t, J = 8.1 Hz, 3H), 4.87 (s, 2H), 4.19 (s, 3H); ESI MS (m/z): 501.20[M+1].

10

20

30

40

50

【表 6 - 7】

	オロメトキシ)ベンジ ル)-2,4-ジヒドロ-3# 1,2,4-トリアゾール-3- オン	
354	4-(4-クロロベンジル)- 5-メトキシ-2-(2-(ピリ ジン-3-イル)-2#イン ダゾール-5-イル)-2,4- ジヒドロ-3#1,2,4-ト リアゾール-3-オン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.32 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.22 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.65 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.47 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 8.15 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.96 (dd, J = 9.5, 2.1 Hz, 1H), 7.83 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 7.66-7.63 (m, 1H), 7.45-7.42 (m, 2H), 7.37-7.34 (m, 2H), 4.78 (s, 2H), 4.05 (s, 3H); ESI MS (m/z): 433.10[M+1].
355	4-(2-フルオロベンジ ル)-2-(2-(5-フルオロ ピリジン-3-イル)-2# インダゾール-5-イル)- 5-メトキシ-2,4-ジヒド ロ-3#1,2,4-トリアゾ ール-3-オン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.26-9.25 (m, 2H), 8.69 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.49 (dt, J = 9.9, 2.3 Hz, 1H), 8.14 (t, J = 1.0 Hz, 1H), 7.97 (dd, J = 9.5, 2.0 Hz, 1H), 7.84 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 7.41-7.33 (m, 2H), 7.26-7.19 (m, 2H), 4.84 (s, 2H), 4.05 (s, 3H); ESI MS (m/z): 434.90[M+1].
356	4-(2-フルオロベンジ ル)-5-メトキシ-2-(2- (ピリジン-3-イル)-2# インダゾール-4-イル)- 2,4-ジヒドロ-3# 1,2,4-トリアゾール-3- オン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.34 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 9.31 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.67 (dd, J = 4.6, 1.2 Hz, 1H), 8.50 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.72 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 7.64 (dd, J = 8.1, 4.4 Hz, 1H), 7.56 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.41-7.35 (m, 3H), 7.27-7.20 (m, 2H), 4.88 (s, 2H), 4.17 (s, 3H) ESI MS (m/z): 416.90[M+1].
357	4-(2-フルオロベンジ ル)-5-メトキシ-2-(2- (ピリミジン-5-イル)- 2#インダゾール-4-イ ル)-2,4-ジヒドロ-3# 1,2,4-トリアゾール-3- オン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.56 (s, 2H), 9.39 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 9.28 (s, 1H), 7.75 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 7.57 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.42-7.35 (m, 3H), 7.26-7.20 (m, 2H), 4.88 (s, 2H), 4.18 (s, 3H); ESI MS (m/z): 417.95[M+1].
358	5-エトキシ-4-(2-フル オロベンジル)-2-(2- (ピリジン-3-イル)-2# インダゾール-5-イル)- 2,4-ジヒドロ-3# 1,2,4-トリアゾール-3- オン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.31 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.21 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.65 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.47 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 8.13 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.94 (dd, J = 9.4, 2.1 Hz, 1H), 7.82 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 7.64 (dd, J = 8.3, 4.9 Hz, 1H), 7.41-7.35 (m, 2H), 7.26-7.19 (m, 2H), 4.83 (s, 2H), 4.43 (q, J = 7.0 Hz, 2H), 1.34 (t, J = 7.1 Hz, 3H) ESI MS (m/z): 430.90[M+1].
359	5-エトキシ-4-(2-フル オロベンジル)-2-(2- (ピリジン-3-イル)-2# インダゾール-4-イル)- 2,4-ジヒドロ-3# 1,2,4-トリアゾール-3- オン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.32 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.26 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.67 (dd, J = 4.6, 1.2 Hz, 1H), 8.49 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.71 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 7.64 (q, J = 4.2 Hz, 1H), 7.56 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.42-7.35 (m, 3H), 7.27-7.20 (m, 2H), 4.87 (s, 2H), 4.57 (q, J = 7.1 Hz, 2H), 1.37 (t, J = 7.1 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 430.90[M+1].
360	5-エトキシ-4-(2-フル オロベンジル)-2-(2- (ピリミジン-5-イル)- 2#インダゾール-4-イ ル)-2,4-ジヒドロ-3#	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.55 (s, 2H), 9.35 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 9.28 (s, 1H), 7.74 (d, J = 7.1 Hz, 1H), 7.57 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.42-7.37 (m, 3H), 7.27-7.20 (m, 2H), 4.87 (s, 2H), 4.59 (q, J = 7.0 Hz, 2H), 1.37 (t, J = 7.0 Hz, 3H) ESI MS (m/z): 431.95[M+1].

10

20

30

40

50

【表 6 - 8】

	1, 2, 4-トリアゾール-3-オン	
361	5-エトキシ-4-(2-フルオロベンジル)-2-(2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル)-2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-オン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.25-9.24 (m, 2H), 8.68 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.49 (dt, J = 10.0, 2.3 Hz, 1H), 8.13 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 7.96 (dd, J = 9.5, 2.0 Hz, 1H), 7.83 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 7.41-7.35 (m, 2H), 7.26-7.19 (m, 2H), 4.83 (s, 2H), 4.43 (q, J = 7.0 Hz, 2H), 1.34 (t, J = 7.0 Hz, 3H) ESI MS (m/z): 449.25[M+1].
362	4-(3-フルオロベンジル)-2-(2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル)-5-メトキシ-2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-オン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.20-9.32 (2H), 8.63-8.75 (1H), 8.41-8.55 (1H), 8.09-8.20 (1H), 7.94-8.03 (1H), 7.79-7.89 (1H), 7.36-7.48 (1H), 7.09-7.23 (3H), 4.76-4.85 (2H), 4.02-4.09 (3H); ESI MS (m/z): 435.25[M+1].
363	4-(3-フルオロベンジル)-5-メトキシ-2-(2-(ピリジン-5-イル)-2H-インダゾール-4-イル)-2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-オン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.56 (s, 2H), 9.40 (s, 1H), 9.28 (s, 1H), 7.75 (d, J = 7.1 Hz, 1H), 7.58 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.46-7.39 (m, 2H), 7.19-7.14 (m, 3H), 4.85 (s, 2H), 4.19 (s, 3H); ESI MS (m/z): 418.15[M+1].
364	5-エトキシ-4-(3-フルオロベンジル)-2-(2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル)-2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-オン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.25 (d, J = 5.9 Hz, 2H), 8.69 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.49 (dt, J = 9.9, 2.3 Hz, 1H), 8.14 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 7.97 (dd, J = 9.5, 2.0 Hz, 1H), 7.83 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 7.43 (dd, J = 14.1, 8.2 Hz, 1H), 7.18-7.14 (m, 3H), 4.80 (s, 2H), 4.45 (q, J = 7.0 Hz, 2H), 1.37 (t, J = 7.1 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 449.15[M+1].
365	4-(3-フルオロベンジル)-5-メトキシ-2-(2-(ピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-4-イル)-2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-オン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.34 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.32 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.67 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.51 (dq, J = 8.3, 1.3 Hz, 1H), 7.72 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 7.65 (dd, J = 8.1, 4.4 Hz, 1H), 7.57 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.46-7.36 (m, 2H), 7.19-7.14 (m, 3H), 4.85 (s, 2H), 4.18 (s, 3H) ESI MS (m/z): 417.05[M+1].
366	5-エトキシ-4-(3-フルオロベンジル)-2-(2-(ピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-4-イル)-2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-オン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.33 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 9.27 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.67 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.49 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.71 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 7.65 (q, J = 4.2 Hz, 1H), 7.56 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.46-7.36 (m, 2H), 7.19-7.14 (m, 3H), 4.84 (s, 2H), 4.59 (q, J = 7.0 Hz, 2H), 1.40 (t, J = 7.1 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 431.00[M+1].
367	4-(2-クロロベンジル)-5-メトキシ-2-(2-(ピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル)-2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-オン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.32 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.22 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.65 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.47 (dq, J = 8.4, 1.3 Hz, 1H), 8.17 (t, J = 0.9 Hz, 1H), 7.98 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 7.84 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 7.66-7.63 (m, 1H), 7.52-7.50 (m, 1H), 7.38-7.34 (m, 2H), 7.27-7.25 (m, 1H), 4.87 (s, 2H), 4.04 (s, 3H); ESI MS (m/z): 433.05[M+1].

10

20

30

40

50

【表 6 - 9】

368	4-(3,4-ジクロロベンジル)-5-メトキシ-2-(2-(ピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)-2,4-ジヒドロ-3 <i>H</i> -1,2,4-トリアゾール-3-オン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.32 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.22 (s, 1H), 8.65 (dd, J = 4.9, 1.2 Hz, 1H), 8.48-8.46 (m, 1H), 8.15 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 7.96 (dd, J = 9.5, 1.8 Hz, 1H), 7.84 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 7.65 (q, J = 4.2 Hz, 3H), 7.32 (dd, J = 8.3, 1.8 Hz, 1H), 4.80 (s, 2H), 4.06 (s, 3H); ESI MS (m/z): 467.00[M+1].
369	4-(2,4-ジクロロベンジル)-5-メトキシ-2-(2-(ピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)-2,4-ジヒドロ-3 <i>H</i> -1,2,4-トリアゾール-3-オン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.32 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 9.22 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.65 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.47 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 8.16 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 7.97 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 7.84 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 7.69 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.67-7.63 (m, 1H), 7.45 (dd, J = 8.6, 2.1 Hz, 1H), 7.33 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 4.85 (s, 2H), 4.04 (s, 3H); ESI MS (m/z): 467.00[M+1].
370	5-メトキシ-4-メチル-2-(2-(ピリミジン-5-イル)-2 <i>H</i> -ピラゾロ[3,4- <i>c</i>]ピリジン-5-イル)-2,4-ジヒドロ-3 <i>H</i> -1,2,4-トリアゾール-3-オン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.55 (s, 2H), 9.34-9.30 (m, 3H), 8.06 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 4.05 (s, 3H), 3.14 (s, 3H); ESI MS (m/z): 425.1[M+1].
371	2-(2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -ピラゾロ[3,4- <i>c</i>]ピリジン-5-イル)-5-メトキシ-4-メチル-2,4-ジヒドロ-3 <i>H</i> -1,2,4-トリアゾール-3-オン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.40 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 9.31-9.29 (m, 2H), 8.78 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.58 (dt, J = 9.8, 2.3 Hz, 1H), 8.07 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 4.03 (s, 3H), 3.12 (s, 3H); ESI MS (m/z): 341.9[M+1].
374	4-(2-クロロベンジル)-5-メトキシ-2-(2-(ピリミジン-5-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)-2,4-ジヒドロ-3 <i>H</i> -1,2,4-トリアゾール-3-オン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 10.05 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 9.42 (d, J = 6.1 Hz, 2H), 8.34 (q, J = 3.0 Hz, 1H), 8.16 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 8.03 (dd, J = 9.5, 1.8 Hz, 1H), 7.87 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 7.51 (t, J = 4.6 Hz, 1H), 7.37-7.35 (m, 2H), 7.27 (d, J = 4.9 Hz, 1H), 4.87 (s, 2H), 4.04 (s, 3H); ESI MS (m/z): 434.00[M+1].
375	4-(3,4-ジクロロベンジル)-5-メトキシ-2-(2-(ピリミジン-5-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)-2,4-ジヒドロ-3 <i>H</i> -1,2,4-トリアゾール-3-オン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 10.05 (q, J = 1.2 Hz, 1H), 9.43-9.41 (m, 2H), 8.34 (q, J = 2.9 Hz, 1H), 8.15 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 8.02 (dd, J = 9.5, 1.8 Hz, 1H), 7.86 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 7.65-7.63 (m, 2H), 7.32 (dd, J = 8.4, 2.0 Hz, 1H), 4.80 (s, 2H), 4.06 (s, 3H); ESI MS (m/z): 468.00[M+1].
379	4-(4-クロロベンジル)-5-エトキシ-2-(2-(ピリミジン-5-イル)-2 <i>H</i> -ピラゾロ[4,3- <i>b</i>]ピリジン-5-イル)-2,4-ジヒドロ-3 <i>H</i> -1,2,4-トリアゾール-3-オン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.56 (d, J = 4.9 Hz, 2H), 9.48 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 9.29 (s, 1H), 8.36 (dd, J = 9.5, 1.0 Hz, 1H), 8.13 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 7.45 (dd, J = 6.6, 2.2 Hz, 2H), 7.38-7.35 (m, 2H), 4.78 (s, 2H), 4.46 (q, J = 7.1 Hz, 2H), 1.37 (t, J = 7.1 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 449.10[M+1].

10

20

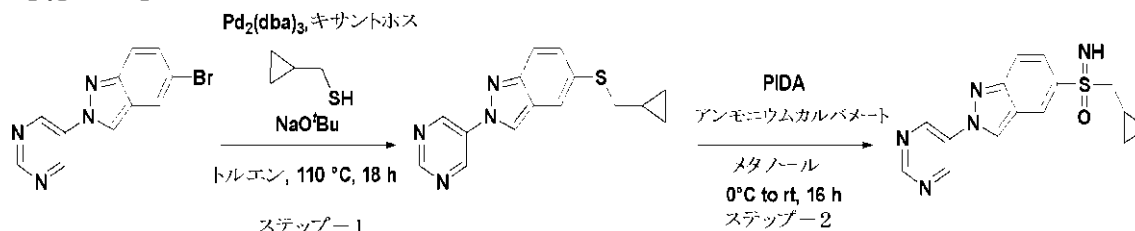
30

40

【0242】

例 7: (シクロプロピルメチル) (イミノ) (2-(ピリミジン-5-イル)-2*H*-インダゾール-5-イル)-λ⁶-スルファノン 450 の合成

【化 3 8】



450

ステップ1：5－（（シクロプロピルメチル）チオ）－2－（ピリミジン－5－イル）－2H－インダゾールの合成

トルエン（200 mL）中の5－ブromo－2－（ピリミジン－5－イル）－2H－インダゾール（15 g、54.5ミリモル）の攪拌溶液に、N₂雰囲気下でXantphos（9.46 g、16.36ミリモル）およびナトリウムtert-ブトキシド（10.48 g、109ミリモル）を加え、反応混合物を窒素で15分間脱気した。トリス（ジベンジリデンアセトン）ジパラジウム（9.99 g、10.90ミリモル）およびシクロプロピルメタンチオール（5.77 mL、65.4ミリモル）を加え、得られた混合物を110 °Cで18時間加熱した。反応終了後、セライト上でろ過し、酢酸エチルで洗浄した。ろ液を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、ろ過後、減圧濃縮して粗半固体を得た。Combiflash（登録商標）クロマトグラフィーで精製し、5－（（シクロプロピルメチル）チオ）－2－（ピリミジン－5－イル）－2H－インダゾール（15 g、53.1ミリモル、収率97%）を得た。

ステップ2：（シクロプロピルメチル）（イミノ）（2－（ピリミジン－5－イル）－2H－インダゾール－5－イル）－λ⁶－スルファノン450の合成

5－（（シクロプロピルメチル）チオ）－2－（ピリミジン－5－イル）－2H－インダゾール（15 g、53.1ミリモル）のメタノール攪拌溶液（230 mL）に、0 °Cでカルバミン酸アンモニウム（18.66 g、239ミリモル）を加えた。反応混合物を室温（25 °C）にし、この温度で1時間攪拌した。反応混合物を再び0 °Cに冷却し、（ジアセトキシヨード）ベンゼン（PIDA、37.6 g、117ミリモル）を加えた。得られた溶液を25 °Cで16時間攪拌した。反応終了後、メタノールを減圧濃縮し、粗残渣を最少の水（1 X 50 mL）で希釈した。この溶液を濃塩酸（pH = 1－2）でさらに酸性化し、水層を酢酸エチル（3 X 200 mL）で抽出して残留非極性有機不純物を除去した。水層を炭酸水素ナトリウム溶液（pH = 8）で塩基化し、クロロホルム（3 X 250 mL）で抽出した。合わせた有機層をさらにブライン溶液（1 X 250 mL）で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過し、減圧下で濃縮して粗固体を得た。この粗固体をさらにメチルtert-ブチルエーテルでトリチュレートして、（シクロプロピルメチル）（イミノ）（2－（ピリミジン－5－イル）－2H－インダゾール－5－イル）－λ⁶－スルファノン450（10 g、31.9ミリモル、収率60%）を得た。

【0243】

表7：本開示の代表的な化合物を、例7に記載の適切な出発物質および方法に従って調製した。

10

20

30

40

【表 7 - 1】

化合物番号	化合物名	分析データ
380	イミノ(イソプロビル)(2-(ピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> インダゾール-4-イル)- λ^6 -スルファノン	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9.38 (d, $J = 2.4$ Hz, 1H), 9.29 (d, $J = 1.0$ Hz, 1H), 8.69 (dd, $J = 4.8, 1.3$ Hz, 1H), 8.57 (dq, $J = 8.3, 1.4$ Hz, 1H), 8.07-8.05 (m, 1H), 7.67-7.64 (m, 2H), 7.54 (dd, $J = 8.7, 7.0$ Hz, 1H), 4.41 (s, 1H), 3.52-3.45 (m, 1H), 1.18 (q, $J = 3.3$ Hz, 6H); ESI MS (m/z): 300.55 [$M+1$].
381	イミノ(イソプロビル)(2-(ピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> インダゾール-5-イル)- λ^6 -スルファノン	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9.48 (d, $J = 0.6$ Hz, 1H), 9.36-9.33 (m, 1H), 8.71-8.68 (m, 1H), 8.50 (dq, $J = 8.3, 1.4$ Hz, 1H), 8.39 (d, $J = 0.9$ Hz, 1H), 7.90 (d, $J = 9.2$ Hz, 1H), 7.72-7.66 (m, 2H), 4.16 (s, 1H), 3.29-3.24 (m, 1H), 1.20-1.11 (m, 6H); ESI MS (m/z): 301.25 [$M+1$].
384	tert-ブチル(イミノ)(2-(ピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> インダゾール-5-イル)- λ^6 -スルファノン	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9.47 (d, $J = 0.9$ Hz, 1H), 9.33 (d, $J = 2.4$ Hz, 1H), 8.70 (dd, $J = 4.7, 1.4$ Hz, 1H), 8.50 (dq, $J = 8.3, 1.4$ Hz, 1H), 8.39 (d, $J = 0.6$ Hz, 1H), 7.89 (d, $J = 9.2$ Hz, 1H), 7.72-7.66 (m, 2H), 1.24 (d, $J = 12.8$ Hz, 1H); ESI MS (m/z): 314.55 [$M+1$].
385	ブチル(イミノ)(2-(ピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> インダゾール-5-イル)- λ^6 -スルファノン	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9.39 (s, 1H), 9.32 (d, $J = 2.8$ Hz, 1H), 8.69 (d, $J = 3.7$ Hz, 1H), 8.48 (d, $J = 8.3$ Hz, 1H), 8.44 (s, 1H), 7.88 (d, $J = 9.2$ Hz, 1H), 7.76 (dd, $J = 9.0, 1.7$ Hz, 1H), 7.66 (q, $J = 4.2$ Hz, 1H), 3.92 (d, $J = 1.5$ Hz, 1H), 3.17 (t, $J = 7.8$ Hz, 2H), 1.56 (dd, $J = 15.6, 8.3$ Hz, 2H), 1.32 (q, $J = 7.4$ Hz, 2H), 0.82 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H); ESI MS (m/z): 315.2 [$M+1$].
386	(シクロプロビルメチル)(イミノ)(2-(ピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> インダゾール-5-イル)- λ^6 -スルファノン	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9.43-9.53 (1H), 9.30-9.40 (1H), 8.65-8.74 (1H), 8.47-8.57 (1H), 8.39-8.47 (1H), 7.85-7.94 (1H), 7.73-7.78 (1H), 7.65-7.71 (1H), 4.09-4.26 (1H), 3.07-3.20 (2H), 0.73-1.02 (1H), 0.24-0.45 (2H), -0.10-0.14 (2H); ESI MS (m/z): 313 [$M+1$].
387	エチル(イミノ)(2-(ピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> インダゾール-5-イル)- λ^6 -スルファノン	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9.48 (d, $J = 0.7$ Hz, 1H), 9.34 (d, $J = 2.4$ Hz, 1H), 8.70 (dd, $J = 4.8, 1.3$ Hz, 1H), 8.51 (dq, $J = 8.3, 1.4$ Hz, 1H), 8.41 (d, $J = 0.7$ Hz, 1H), 7.91 (d, $J = 9.0$ Hz, 1H), 7.73 (dd, $J = 9.0, 1.7$ Hz, 1H), 7.68 (dd, $J = 8.1, 4.9$ Hz, 1H), 4.20 (s, 1H), 3.17 (q, $J = 7.3$ Hz, 2H), 1.08 (t, $J = 7.3$ Hz, 3H); ESI MS (m/z): 286.85 [$M+1$].
393	(2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> ピラゾロ[3,4- <i>b</i>]ピリジン-5-イル)(イミノ)(イソプロビル)- λ^6 -スルファノン	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9.55 (s, 1H), 9.30 (s, 1H), 9.02 (d, $J = 2.4$ Hz, 1H), 8.85 (d, $J = 2.4$ Hz, 1H), 8.78 (d, $J = 2.7$ Hz, 1H), 8.61 (dt, $J = 9.9, 2.4$ Hz, 1H), 4.51 (s, 1H), 3.43-3.36 (m, 1H), 1.19 (dd, $J = 6.6, 4.2$ Hz, 6H); ESI MS (m/z): 319.5 [$M+1$].
395	(2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)(イミ	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9.52 (d, $J = 0.7$ Hz, 1H), 9.27 (s, 1H), 8.74 (d, $J = 2.4$ Hz, 1H), 8.55 (dt, $J = 9.8, 2.3$ Hz, 1H), 8.39 (d, $J = 0.7$ Hz, 1H), 7.90 (d, $J = 9.3$ Hz, 1H), 7.72 (dd, $J = 9.3, 1.7$ Hz, 1H), 4.18 (s, 1H), 3.26 (t, $J = 6.7$ Hz, 1H), 1.16 (q, $J = 3.3$ Hz, 6H); ESI MS (m/z): 318.5 [$M+1$].

10

20

30

40

【表 7-2】

	ノ) (イソプロピル)-λ ⁶ -スルファノン	
409	(シクロプロピルメチル) (2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル) (イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.52 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 9.28 (s, 1H), 8.74 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.55 (dt, J = 9.9, 2.3 Hz, 1H), 8.44 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 7.89 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.77 (dd, J = 9.0, 1.7 Hz, 1H), 4.20 (s, 1H), 3.19-3.10 (m, 2H), 0.94-0.87 (m, 1H), 0.38-0.34 (m, 2H), 0.04-0.01 (m, 2H); ESI MS (m/z): 330.5 [M+1].
410	イミノ (イソプロピル) (2-(ピリミジン-5-イル)-2H-インダゾール-5-イル)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.56-9.54 (m, 3H), 9.31 (s, 1H), 8.42 (q, J = 0.8 Hz, 1H), 7.92 (dt, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.73 (dd, J = 9.2, 1.5 Hz, 1H), 4.18 (s, 1H), 3.28 (d, J = 6.7 Hz, 1H), 1.18-1.14 (m, 6H); ESI MS (m/z): 301.5 [M+1].
450	(シクロプロピルメチル) (イミノ) (2-(ピリミジン-5-イル)-2H-インダゾール-5-イル)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.56-9.53 (m, 3H), 9.31 (s, 1H), 8.46 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 7.91 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.78 (dd, J = 9.2, 1.5 Hz, 1H), 4.21 (s, 1H), 3.18-3.12 (m, 2H), 0.93-0.86 (m, 1H), 0.38-0.33 (m, 2H), 0.01 (dd, J = 4.6, 3.1 Hz, 2H) ESI MS (m/z): 313.9 [M+1].
454	(3-クロロ-2-(ピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル) (シクロプロピルメチル) (イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.03 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 8.82 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.32-8.29 (m, 2H), 7.91 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.83 (dd, J = 9.2, 1.5 Hz, 1H), 7.74 (ddd, J = 8.3, 4.9, 0.6 Hz, 1H), 4.29 (s, 1H), 3.19 (d, J = 7.3 Hz, 2H), 0.91 (s, 1H), 0.38 (dq, J = 8.0, 1.5 Hz, 2H), 0.05-0.03 (m, 2H) ESI MS (m/z): 346.9 [M+1].

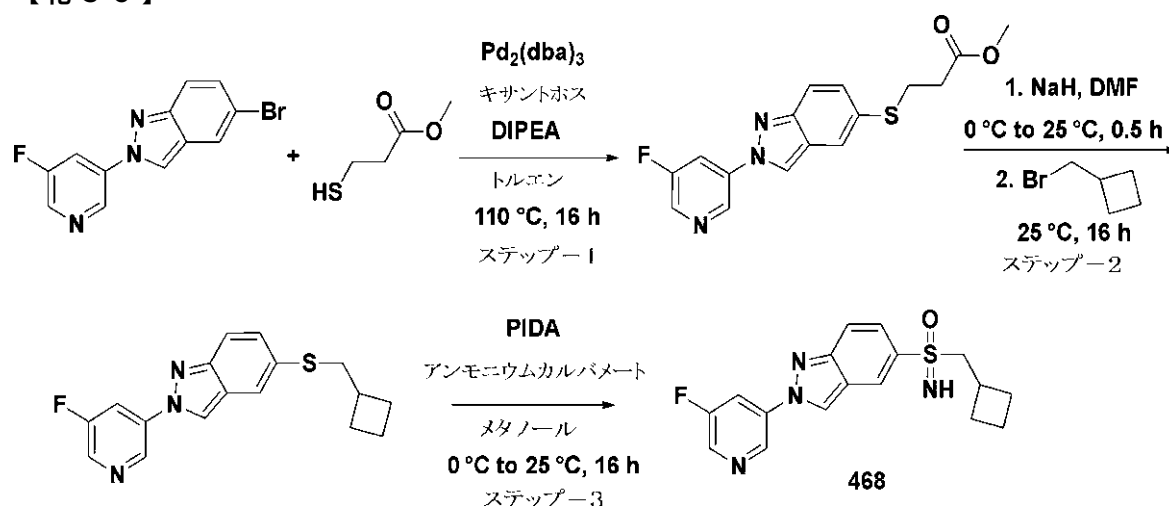
10

20

30

【0244】

例 8 : (シクロプロピルメチル) (2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル) (イミノ)-λ⁶-スルファノン 468 の合成
【化 39】



40

【0245】

ステップ 1 : 3 - ((2 - (5 - フルオロピリジン - 3 - イル) - 2 H - インダゾール

50

ー 5 ー イル) チオ) プロパン酸メチルの合成

トルエン (150 mL) 中の 5-ブロモ-2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2H-インダゾール (10 g、34.2 ミリモル) の脱ガス溶液に、Xantphos (9.90 g、17.12 ミリモル)、N,N-ジイソプロピルエチルアミン (11.93 mL、68.5 ミリモル)、トリス (ジベンジリデンアセトン) ジパラジウム (9.40 g、10.27 ミリモル) および 3-メルカプトプロパン酸メチル (4.55 mL、41.1 ミリモル) を N₂ 雰囲気下に加え、得られた反応混合物を 110 °C で 16 時間加熱した。反応終了後、室温に冷却し、セライト上で濾過し、酢酸エチルで洗浄した。濾液を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過し、減圧濃縮して粗残渣を得、これを Combiflash (登録商標) クロマトグラフィーで精製し、目的の 3-(2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル) チオ) プロパン酸メチル (10 g、30.2 ミリモル、収率 88 %) を淡黄色固体として得た。

10

【0246】

ステップ 2: 5-(シクロブチルメチル) チオ)-2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2H-インダゾールの合成

3-(2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル) チオ) プロパン酸メチル (4 g、12.07 ミリモル) の N,N-ジメチルホルムアミド攪拌溶液 (20 mL) に、水素化ナトリウム (60 % を鉱物油に分散させ、0.966 g、24.14 ミリモル) を 0 °C で加えて 0.5 時間攪拌した後、同温度で (プロモメチル) シクロブタン (2.71 mL、24.14 ミリモル) を加え、得られた反応混合物を 25 °C で 16 時間攪拌した。反応終了後、水 (100 mL) で急冷し、酢酸エチル (3 X 100 mL) で抽出した。混合した有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過し、減圧濃縮して粗化合物 5-(シクロブチルメチル) チオ)-2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2H-インダゾール (3.5 g、11.17 ミリモル、収率 93 %) を得た。これは次の工程で直接使用する。

20

【0247】

ステップ 3: (シクロブチルメチル) (2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル) (イミノ)-λ⁶-スルファノン 468 の合成

5-(シクロブチルメチル) チオ)-2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2H-インダゾール (3.78 g、12.06 ミリモル) のメタノール攪拌溶液 (50 mL) に、0 °C でカルバミン酸アンモニウム (4.24 g、54.3 ミリモル) を加え、25 °C で 0.5 時間攪拌した。0 °C でヨードベンゼンジアセテート (8.55 g、26.5 ミリモル) を少量ずつ加え、25 °C で 16 時間攪拌した。反応終了後、反応混合物を減圧濃縮し、炭酸水素ナトリウムで中和し、ジクロロメタン (3 X 50 mL) で抽出した。合わせた有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過し、減圧濃縮して粗固体を得た。粗化合物を Combiflash (登録商標) クロマトグラフィーにより精製し、(シクロブチルメチル) (2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル) (イミノ)-λ⁶-スルファノン 468 (2.3 g、6.68 ミリモル、収率 55 %) を得た。

30

【0248】

表 8: 本開示の代表的な化合物を、例 8 に記載の適切な出発物質および方法に従って調製した。

40

【表 8 - 1】

化合物番号	化合物名	分析データ
455	エチル(イミノ)(2-(ピリミジン-5-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)- λ^6 -スルファノン	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{DMSO-}d_6$) δ 9.56-9.54 (m, 3H), 9.30 (d, $J = 3.4$ Hz, 1H), 8.43 (t, $J = 0.8$ Hz, 1H), 7.93 (d, $J = 9.2$ Hz, 1H), 7.75 (dd, $J = 9.2, 1.8$ Hz, 1H), 4.23 (s, 1H), 3.20-3.15 (m, 2H), 1.08 (t, $J = 7.3$ Hz, 3H); ESI MS (m/z): 288 [$M+1$].
458	イミノ(2-(ピリミジン-5-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)(2, 2, 2-トリフルオロエチル)- λ^6 -スルファノン	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{DMSO-}d_6$) δ 9.58-9.56 (m, 3H), 9.32 (d, $J = 4.9$ Hz, 1H), 8.56 (d, $J = 0.6$ Hz, 1H), 7.95 (d, $J = 9.2$ Hz, 1H), 7.84 (dd, $J = 9.2, 1.8$ Hz, 1H), 5.03 (s, 1H), 4.64 (q, $J = 10.1$ Hz, 2H); ESI MS (m/z): 342.05 [$M+1$].
460	エチル(2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)(イミノ)- λ^6 -スルファノン	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{DMSO-}d_6$) δ 9.52 (d, $J = 0.7$ Hz, 1H), 9.27 (s, 1H), 8.74 (d, $J = 2.4$ Hz, 1H), 8.55 (dt, $J = 9.9, 2.3$ Hz, 1H), 8.41 (d, $J = 0.7$ Hz, 1H), 7.90 (d, $J = 9.0$ Hz, 1H), 7.74 (dd, $J = 9.0, 1.7$ Hz, 1H), 4.22 (s, 1H), 3.17 (q, $J = 7.3$ Hz, 2H), 1.08 (t, $J = 7.3$ Hz, 3H); ESI MS (m/z): 304.85 [$M+1$].
465	(シクロブチルメチル)(イミノ)(2-(ピリミジン-5-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)- λ^6 -スルファノン	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{DMSO-}d_6$) δ 9.52 (s, 2H), 9.46 (d, $J = 0.9$ Hz, 1H), 9.28 (s, 1H), 8.44 (s, 1H), 7.89 (d, $J = 9.2$ Hz, 1H), 7.77 (dd, $J = 9.2, 1.8$ Hz, 1H), 3.89 (s, 1H), 3.32 (d, $J = 7.3$ Hz, 2H), 2.66-2.58 (m, 1H), 1.93-1.86 (m, 2H), 1.82-1.62 (m, 4H); ESI MS (m/z): 328.1 [$M+1$].
468	(シクロブチルメチル)(2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)(イミノ)- λ^6 -スルファノン	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{DMSO-}d_6$) δ 9.51 (d, $J = 0.5$ Hz, 1H), 9.27 (s, 1H), 8.74 (d, $J = 2.4$ Hz, 1H), 8.54 (dt, $J = 9.9, 2.3$ Hz, 1H), 8.39 (d, $J = 0.7$ Hz, 1H), 7.89 (d, $J = 9.0$ Hz, 1H), 7.74 (dd, $J = 9.2, 1.6$ Hz, 1H), 4.15 (s, 1H), 3.32 (s, 1H), 2.59-2.51 (m, 1H), 1.87-1.78 (m, 2H), 1.76-1.68 (m, 1H), 1.66-1.57 (m, 3H); ESI MS (m/z): 344.9 [$M+1$].
470	イミノ(メチル)(2-(ピリミジン-5-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)- λ^6 -スルファノン	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{DMSO-}d_6$) δ 9.56 (s, 2H), 9.55-9.54 (m, 1H), 9.31 (s, 1H), 8.47 (q, $J = 0.8$ Hz, 1H), 7.93 (dt, $J = 9.2, 0.9$ Hz, 1H), 7.82 (dd, $J = 9.2, 1.8$ Hz, 1H), 4.25 (s, 1H), 3.11 (s, 3H); ESI MS (m/z): 274 [$M+1$].
478	(2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)(イミノ)(プロピル)- λ^6 -スルファノン	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{DMSO-}d_6$) δ 9.52 (d, $J = 0.7$ Hz, 1H), 9.27 (s, 1H), 8.74 (d, $J = 2.7$ Hz, 1H), 8.55 (dt, $J = 9.9, 2.3$ Hz, 1H), 8.41 (q, $J = 0.8$ Hz, 1H), 7.90 (d, $J = 9.3$ Hz, 1H), 7.75 (dd, $J = 9.3, 1.7$ Hz, 1H), 4.22 (s, 1H), 3.17-3.13 (m, 2H), 1.59-1.50 (m, 2H), 0.87 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H); ESI MS (m/z): 319 [$M+1$].
479	sec-ブチル(2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)(イミノ)- λ^6 -スルファノン	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{DMSO-}d_6$) δ 9.51-9.49 (m, 1H), 9.27 (s, 1H), 8.74 (d, $J = 2.4$ Hz, 1H), 8.54 (dt, $J = 9.8, 2.3$ Hz, 1H), 8.39 (d, $J = 1.0$ Hz, 1H), 7.90 (d, $J = 9.0$ Hz, 1H), 7.73-7.69 (m, 1H), 4.18 (d, $J = 8.8$ Hz, 1H), 3.05 (qd, $J = 6.9, 3.2$ Hz, 1H), 1.94-1.86 (m, 1H), 1.33-1.24 (m, 1H), 1.14 (dd, $J = 9.3, 6.8$ Hz, 3H), 0.87 (dd, $J = 16.4, 7.6$ Hz, 3H); ESI MS (m/z): 333 [$M+1$].
480	(2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)(イミノ)(ペンタ	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{DMSO-}d_6$) δ 9.51 (s, 1H), 9.27 (s, 1H), 8.74 (d, $J = 2.4$ Hz, 1H), 8.54 (d, $J = 9.8$ Hz, 1H), 8.40 (s, 1H), 7.90 (d, $J = 9.0$ Hz, 1H), 7.73 (d, $J = 9.0$ Hz, 1H), 4.18 (s, 1H), 2.92-2.89 (m, 1H), 1.85-1.75 (m, 2H), 1.63-1.52 (m, 2H), 0.92-0.86 (m, 6H); ESI MS (m/z): 347.05 [$M+1$].

10

20

30

40

50

【表 8 - 2】

	ン-3-イル)-λ ⁶ -スル ファノン	
482	(3-フルオロプロピ ル)(2-(5-フルオロピ リジン-3-イル)-2 <i>H</i> - インダゾール-5-イ ル)(イミノ)-λ ⁶ -スル ファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.53 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 9.27 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.74 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.55 (dt, J = 9.9, 2.4 Hz, 1H), 8.44 (q, J = 0.8 Hz, 1H), 7.93-7.91 (m, 1H), 7.76 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 4.52 (t, J = 5.9 Hz, 1H), 4.41-4.38 (m, 2H), 3.27 (dd, J = 9.4, 6.2 Hz, 2H), 1.99-1.87 (m, 2H); ESI MS (m/z): 336.85 [M+1].
484	(2-(5-フルオロピリ ジン-3-イル)-2 <i>H</i> -イ ンダゾール-5-イ ル)(イミノ)((3-メチ ルオキセタン-3-イ ル)メチル)-λ ⁶ -スル ファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.52 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 9.28 (s, 1H), 8.74 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.55 (dt, J = 9.8, 2.3 Hz, 1H), 8.42 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 7.92 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.78 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 4.62 (d, J = 5.9 Hz, 1H), 4.46 (d, J = 5.9 Hz, 1H), 4.30 (s, 1H), 4.12 (d, J = 6.1 Hz, 1H), 4.07 (d, J = 5.9 Hz, 1H), 3.73 (d, J = 14.2 Hz, 1H), 3.60 (d, J = 14.4 Hz, 1H), 1.47 (s, 3H); ESI MS (m/z): 361 [M+1].
488	シクロブチル(2-(5- フルオロピリジン-3- イル)-2 <i>H</i> -インダゾー ル-5-イル)(イミノ)- λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.51 (td, J = 7.3, 0.7 Hz, 1H), 9.27 (s, 1H), 8.74 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.57-8.53 (m, 1H), 8.39 (q, J = 0.8 Hz, 1H), 7.89 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.70 (ddd, J = 9.1, 5.1, 1.8 Hz, 1H), 4.19 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 4.01-3.93 (m, 1H), 2.39-2.29 (m, 2H), 2.12-1.93 (m, 2H), 1.90-1.73 (m, 2H); ESI MS (m/z): 331 [M+1].
554	シクロブチル(イミ ノ)(2-(ピリジン-3- イル)-2 <i>H</i> -インダゾー ル-5-イル)-λ ⁶ -スル ファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.48 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 9.33 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.70 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.50 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 8.39 (s, 1H), 7.89 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.70-7.66 (m, 2H), 4.18 (s, 1H), 4.00-3.92 (m, 1H), 2.39-2.29 (m, 2H), 2.11-1.94 (m, 2H), 1.88-1.76 (m, 2H); ESI MS (m/z): 312.9 [M+1]
555	(シクロヘキシルメチ ル)(イミノ)(2-(ピリ ジン-3-イル)-2 <i>H</i> -イ ンダゾール-5-イル)- λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.47 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 9.34 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.70 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.51 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 8.42 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 7.90 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.75 (dd, J = 9.3, 1.7 Hz, 1H), 7.68 (dd, J = 8.3, 4.9 Hz, 1H), 4.20 (s, 1H), 3.13-3.04 (m, 2H), 1.88-1.68 (m, 3H), 1.57-1.49 (m, 3H), 1.19-0.92 (m, 5H); ESI MS (m/z): 355.05 [M+1]
556	イミノ(ペンタン-3- イル)(2-(ピリジン- 3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾ ール-5-イル)-λ ⁶ -ス ルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.47 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 9.34 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.70 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.50 (dq, J = 8.4, 1.3 Hz, 1H), 8.40 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 7.90 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.72 (dd, J = 9.0, 1.7 Hz, 1H), 7.68 (q, J = 4.4 Hz, 1H), 4.16 (s, 1H), 2.91-2.88 (m, 1H), 1.85-1.75 (m, 2H), 1.63-1.52 (m, 2H), 0.92-0.86 (m, 6H); ESI MS (m/z): 329 [M+1]
557	イミノ(イソブチ ル)(2-(ピリジン-3- イル)-2 <i>H</i> -インダゾー ル-5-イル)-λ ⁶ -スル ファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.47 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 9.34 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.70 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.51 (dq, J = 8.4, 1.3 Hz, 1H), 8.43 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 7.90 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.75 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 7.69-7.66 (m, 1H), 4.20 (s, 1H), 3.14-3.05 (m, 2H), 2.08-2.01 (m, 1H), 0.91 (dd, J = 6.7, 1.5 Hz, 6H); ESI MS (m/z): 314.95 [M+1]
558	シクロペンチル(イミ ノ)(2-(ピリジン-3- イル)-2 <i>H</i> -インダゾー ル-5-イル)-λ ⁶ -スル ファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.46 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 9.34 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.70 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.50 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 8.42 (t, J = 0.8 Hz, 1H), 7.90 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.74 (dd, J = 9.2, 1.5 Hz, 1H), 7.69-7.66 (m, 1H), 4.10 (s, 1H), 3.67-3.63 (m, 1H), 1.93-1.70 (m, 4H), 1.60-1.48 (m, 4H); ESI MS (m/z): 326.9 [M+1]
559	シクロヘプチル(イミ ノ)(2-(ピリジン-3- イル)-2 <i>H</i> -インダゾー	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.46 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 9.33 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.70 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.50 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 8.39 (q, J = 0.8 Hz, 1H), 7.89 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.73-

10

20

30

40

50

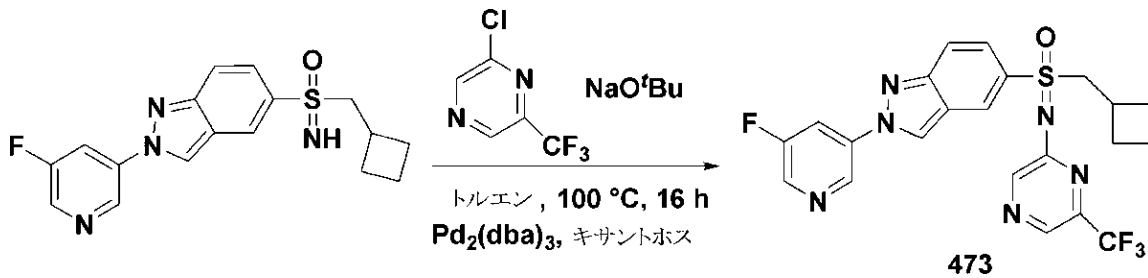
【表 8 - 3】

	ル-5-イル)-λ ⁶ -スル ファノン	7.66 (m, 2H), 4.11 (s, 1H), 3.19-3.12 (m, 1H), 2.10-2.01 (m, 2H), 1.68-1.33 (m, 10H); ESI MS (m/z): 355 [M+1]
560	シクロヘキシル(イミ ノ)(2-(ピリジン-3- イル)-2 <i>H</i> -インダゾ ール-5-イル)-λ ⁶ -スル ファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.47 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 9.33 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.70 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.50 (dq, J = 8.4, 1.3 Hz, 1H), 8.36 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 7.89 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.70-7.66 (m, 2H), 4.16 (s, 1H), 3.01-2.96 (m, 1H), 1.99-1.91 (m, 2H), 1.72 (d, J = 9.5 Hz, 2H), 1.55 (d, J = 12.2 Hz, 1H), 1.31-1.16 (m, 4H), 1.06- 0.99 (m, 1H); ESI MS (m/z): 340.95 [M+1]
561	(2-シクロヘキシルエ チル)(イミノ)(2-(ピ リジン-3-イル)-2 <i>H</i> - インダゾール-5-イ ル)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.47 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 9.34 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.70 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.51 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 8.41 (q, J = 0.8 Hz, 1H), 7.90 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.74 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 7.69-7.66 (m, 1H), 4.19 (s, 1H), 3.16 (t, J = 8.3 Hz, 2H), 1.59-1.52 (m, 5H), 1.44-1.38 (m, 2H), 1.22 (s, 1H), 1.14- 1.02 (m, 3H), 0.81-0.72 (m, 2H); ESI MS (m/z): 369.05 [M+1]
562	イミノ(ペンタン-2- イル)(2-(ピリジン- 3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾ ール-5-イル)-λ ⁶ -ス ルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.48 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 9.34 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.70 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.51 (dq, J = 8.4, 1.3 Hz, 1H), 8.39 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 7.90 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.72-7.66 (m, 2H), 4.17 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 3.13-3.08 (m, 1H), 1.84-1.78 (m, 1H), 1.41-1.12 (m, 6H), 0.81 (q, J = 7.2 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 328.95 [M+1]
563	イミノ(イソベンチ ル)(2-(ピリジン-3- イル)-2 <i>H</i> -インダゾ ール-5-イル)-λ ⁶ -スル ファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.48 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 9.34 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.70 (dd, J = 4.6, 1.2 Hz, 1H), 8.51 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 8.41 (t, J = 0.7 Hz, 1H), 7.91 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.74 (dd, J = 9.0, 1.7 Hz, 1H), 7.68 (ddd, J = 8.3, 4.8, 0.6 Hz, 1H), 4.21 (s, 1H), 3.16 (t, J = 8.2 Hz, 2H), 1.58-1.52 (m, 1H), 1.44-1.38 (m, 2H), 0.79 (d, J = 6.6 Hz, 6H); ESI MS (m/z): 328.95 [M+1]
564	4-(2-(ピリジン-3-イ ル)-2 <i>H</i> -インダゾ ール-5-スルホンイミドイ ル)ブタンニトリル	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.49 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 9.34 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.70 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.51 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 8.44 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 7.93 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.74 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 7.68 (dd, J = 8.3, 4.6 Hz, 1H), 4.46 (s, 1H), 3.26 (dd, J = 8.7, 5.3 Hz, 2H), 2.61 (t, J = 7.3 Hz, 2H), 1.88-1.80 (m, 2H); ESI MS (m/z): 326.05 [M+1]
569	イミノ(2-(ピリジン- 3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾ ール-5-イル)((テト ラヒドロフラン-2-イ ル)メチル)-λ ⁶ -スル ファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.48 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 9.34 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.70 (d, J = 3.7 Hz, 1H), 8.51 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 8.43 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 7.88 (dd, J = 9.2, 2.8 Hz, 1H), 7.78-7.75 (m, 1H), 7.68 (dd, J = 8.3, 4.6 Hz, 1H), 4.27 (s, 1H), 4.12 (dt, J = 17.0, 6.4 Hz, 1H), 3.62-3.37 (m, 4H), 1.94-1.87 (m, 1H), 1.79-1.68 (m, 2H), 1.56-1.46 (m, 1H); ESI MS (m/z): 342.9 [M+1].
580	イミノ(2-(ピリジン- 3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾ ール-5-イル)(3,3,3- トリフルオロプロピ ル)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.51 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 9.35 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.70 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.53-8.48 (m, 2H), 7.93 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.79 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 7.68 (ddd, J = 8.3, 4.6, 0.7 Hz, 1H), 4.65 (s, 1H), 3.47-3.43 (m, 2H), 2.62-2.55 (m, 2H); ESI MS (m/z): 354.9 [M+1].
602	イミノ(ネオベンチ ル)(2-(ピリジン-3- イル)-2 <i>H</i> -インダゾ ール-5-イル)-λ ⁶ -スル ファノン	¹ H-NMR (400 MHz, MeOD) δ 9.31 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 9.22 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.68 (dd, J = 4.9, 1.5 Hz, 1H), 8.57 (q, J = 0.8 Hz, 1H), 8.52 (dq, J = 8.5, 1.3 Hz, 1H), 7.91 (dt, J = 9.3, 0.9 Hz, 1H), 7.84 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 7.69 (ddd, J = 8.4, 4.8, 0.7 Hz, 1H), 3.43-3.36 (m, 2H), 1.15-1.03 (m, 9H); ESI MS (m/z): 329 [M+1].
609	イミノ(プロピル)(2- (ピリジン-3-イル)- 2 <i>H</i> -インダゾール-5- イル)-λ ⁶ -スルファノ ン	¹ H-NMR (400 MHz, MeOD) δ 9.31 (s, 1H), 9.23-9.22 (m, 1H), 8.67 (d, J = 4.4 Hz, 1H), 8.55-8.51 (m, 2H), 7.91 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.82 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 7.69 (dd, J = 8.3, 4.9 Hz, 1H), 3.30 (t, J = 1.6 Hz, 2H), 1.75-1.66 (m, 2H), 0.99-0.95 (m, 3H) ESI MS (m/z): 301.1 [M+1].

【表 8 - 4】

619	イミノ(イソプロピ ル)(2-(ピリジン-3- イル)-2 <i>H</i> -ピラゾロ [4,3- <i>b</i>]ピリジン-5- イル)-λ ⁶ -スルファノ ン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.78 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 9.39 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.74 (dd, J = 4.9, 1.5 Hz, 1H), 8.56 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 8.50 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 8.02 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.71 (ddd, J = 8.3, 4.9, 0.6 Hz, 1H), 4.49 (s, 1H), 3.76-3.69 (m, 1H), 1.20 (dd, J = 16.0, 6.9 Hz, 6H); ESI MS (m/z): 302.0 [M+1].
-----	---	---

例 9：（シクロブチルメチル）（2-（5-フルオロピリジン-3-イル）-2H-インダゾール-5-イル）（（6-（トリフルオロメチル）ピラジン-2-イル）イミノ）- λ^6 -スルファノン 473 の合成
【化 40】



10

（シクロブチルメチル）（2-（5-フルオロピリジン-3-イル）-2H-インダゾール-5-イル）（イミノ）- λ^6 -スルファノン（300 mg、0.871ミリモル）のトルエン中の脱気溶液（10 mL）に、ナトリウム *tert*-ブトキシド（184 mg、1.916ミリモル）、キサントホス（252 mg、0.436ミリモル）、2-クロロ-6-（トリフルオロメチル）ピラジン（0.159 mL、1.307ミリモル）およびトリス（ジベンジリデンアセトン）ニパラジウム（239 mg、0.261ミリモル）を加え、得られた反応混合物を還流条件下で16時間攪拌した。反応終了後、反応混合物をセライトを通して濾過し、追加容量の酢酸エチル（3 X 10 mL）で洗浄した。集合上清を減圧下で濃縮して粗残渣を得、これを分取HPLCで精製して所望の（シクロブチルメチル）（2-（5-フルオロピリジン-3-イル）-2H-インダゾール-5-イル）（（6-（トリフルオロメチル）ピラジン-2-イル）イミノ）- λ^6 -スルファノン 473（130 mg、0.265ミリモル、収率30.4%）を得た。

20

【0250】

表 9：本開示の代表的な化合物を、例 9 に記載の適切な出発物質および方法に従って調製した。

30

40

50

【表 9 - 1】

化合物番号	化合物名	分析データ
448	(シクロプロピルメチル)(2-(ピリミジン-5-イル)-2 <i>H</i> インダゾール-5-イル)((2,4,5-トリフルオロフェニル)イミノ)- λ^6 -スルファノン	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9.54 (d, J = 8.6 Hz, 3H), 9.31 (s, 1H), 8.56 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 7.97 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 7.72 (dd, J = 9.3, 1.7 Hz, 1H), 7.41 (td, J = 10.7, 7.9 Hz, 1H), 6.99-6.92 (m, 1H), 3.66 (dq, J = 23.8, 7.3 Hz, 2H), 1.00-0.94 (m, 1H), 0.50-0.38 (m, 2H), 0.23-0.02 (m, 2H); ESI MS (m/z): 444.05 [$M+1$].
451	(シクロプロピルメチル)(5-フルオロピリジン-2-イル)イミノ(2-(ピリミジン-5-イル)-2 <i>H</i> インダゾール-5-イル)- λ^6 -スルファノン	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9.55-9.53 (m, 3H), 9.31 (s, 1H), 8.54 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 7.94-7.91 (m, 2H), 7.73 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 7.49 (td, J = 8.7, 3.1 Hz, 1H), 6.85 (dd, J = 9.0, 3.8 Hz, 1H), 3.64 (d, J = 7.0 Hz, 2H), 0.91 (dd, J = 11.9, 7.0 Hz, 1H), 0.44-0.34 (m, 2H), 0.10 (q, J = 4.7 Hz, 1H), -0.03 (q, J = 4.8 Hz, 1H); ESI MS (m/z): 409.05 [$M+1$].
452	(シクロプロピルメチル)(ピリジン-2-イルイミノ)(2-(ピリミジン-5-イル)-2 <i>H</i> インダゾール-5-イル)- λ^6 -スルファノン	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9.54 (d, J = 5.8 Hz, 3H), 9.31 (s, 1H), 8.55 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 7.93-7.91 (m, 2H), 7.74 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 7.56-7.51 (m, 1H), 6.82 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 6.73 (ddd, J = 7.2, 5.0, 0.9 Hz, 1H), 3.67 (dd, J = 7.2, 1.7 Hz, 2H), 0.91-0.88 (m, 1H), 0.44-0.32 (m, 2H), 0.11-0.06 (m, 1H), 0.05-0.0 (m, 1H); ESI MS (m/z): 391.1 [$M+1$].
453	(シクロプロピルメチル)((2-メトキシピリミジン-5-イル)イミノ)(2-(ピリミジン-5-イル)-2 <i>H</i> インダゾール-5-イル)- λ^6 -スルファノン	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9.53 (d, J = 1.7 Hz, 3H), 9.32 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 8.57 (s, 1H), 8.15 (d, J = 5.1 Hz, 2H), 7.95 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.74 (dd, J = 9.3, 1.7 Hz, 1H), 3.76-3.71 (m, 3H), 3.69-3.61 (m, 2H), 1.00 (t, J = 7.6 Hz, 1H), 0.53-0.46 (m, 1H), 0.43-0.36 (m, 1H), 0.23 (td, J = 9.5, 4.8 Hz, 1H), 0.04 (td, J = 9.7, 4.7 Hz, 1H); ESI MS (m/z): 422.1 [$M+1$].
459	エチル(2-(ピリミジン-5-イル)-2 <i>H</i> インダゾール-5-イル)((6-(トリフルオロメチル)ピラジン-2-イル)イミノ)- λ^6 -スルファノン	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9.56 (s, 3H), 9.31 (s, 1H), 8.63 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.46 (s, 1H), 8.39 (s, 1H), 7.96 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.73 (dd, J = 9.3, 1.7 Hz, 1H), 3.88-3.80 (m, 2H), 1.25-1.16 (m, 3H); ESI MS (m/z): 434.1 [$M+1$].
463	エチル(2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> インダゾール-5-イル)((6-(トリフルオロメチル)ピラジン-2-イル)イミノ)- λ^6 -スルファノン	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9.54 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 9.27 (s, 1H), 8.75 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.60 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.56 (dt, J = 9.9, 2.3 Hz, 1H), 8.45 (s, 1H), 8.39 (s, 1H), 7.93 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.72 (dd, J = 9.3, 1.7 Hz, 1H), 3.88-3.78 (m, 2H), 1.20 (t, J = 7.2 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 451.1 [$M+1$].
464	エチル(2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> インダゾール-5-イル)((2-メチルピリジン-4-イル)イミノ)- λ^6 -スルファノン	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9.52 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 9.24 (s, 1H), 8.75 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.54-8.51 (m, 2H), 7.97 (t, J = 5.5 Hz, 1H), 7.93 (s, 1H), 7.68-7.65 (m, 1H), 6.70 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 6.60 (dd, J = 5.5, 2.1 Hz, 1H), 3.67-3.57 (m, 2H), 2.21 (d, J = 14.4 Hz, 3H), 1.22-1.16 (m, 3H); ESI MS (m/z): 396.05 [$M+1$].

10

20

30

40

50

【表 9 - 2】

469	(シクロブチルメチル) (2-(ピリミジン-5-イル)-2H-インダゾール-5-イル) ((6-(トリフルオロメチル)ピラジン-2-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.55 (s, 3H), 9.31 (s, 1H), 8.62 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.44 (s, 1H), 8.39 (s, 1H), 7.95 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.74 (dd, J = 9.5, 1.8 Hz, 1H), 4.03-3.93 (m, 2H), 2.71-2.65 (m, 1H), 1.99-1.93 (m, 1H), 1.85-1.57 (m, 5H) ESI MS (m/z): 474 [M+1].
473	(シクロブチルメチル) (2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル) ((6-(トリフルオロメチル)ピラジン-2-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 9.05 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 8.72 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.61 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.59 (q, J = 0.8 Hz, 1H), 8.38 (s, 1H), 8.28 (s, 1H), 8.14 (dt, J = 8.9, 2.4 Hz, 1H), 7.90-7.87 (m, 1H), 7.69 (dd, J = 9.3, 1.7 Hz, 1H), 3.82 (q, J = 7.0 Hz, 1H), 3.71 (q, J = 7.2 Hz, 1H), 2.84 (t, J = 7.2 Hz, 1H), 2.14 (q, J = 4.2 Hz, 1H), 1.95-1.77 (m, 5H), 1.64 (t, J = 8.3 Hz, 1H); ESI MS (m/z): 491.25 [M+1].
476	(シクロブチルメチル) (2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル) ((6-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.51 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 9.24 (s, 1H), 8.75 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.56 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.52 (dt, J = 9.7, 2.3 Hz, 1H), 8.27 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 7.95 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.71 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 7.55 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.34 (dd, J = 8.3, 2.2 Hz, 1H), 3.86 (d, J = 7.1 Hz, 2H), 2.71 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 2.06-2.00 (m, 1H), 1.86-1.79 (m, 3H), 1.69 (dd, J = 16.4, 7.6 Hz, 2H); ESI MS (m/z): 490.2 [M+1].
477	(シクロブチルメチル) (2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル) ((6-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-イル)イミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.53 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 9.27 (s, 1H), 8.74 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.57-8.53 (m, 2H), 7.91 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.78-7.70 (m, 2H), 7.17 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 7.03 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 3.92 (d, J = 7.1 Hz, 2H), 2.66-2.59 (m, 1H), 1.98-1.93 (m, 1H), 1.80-1.70 (m, 3H), 1.66-1.55 (m, 2H) ESI MS (m/z): 490.05 [M+1].
481	(シクロブチルメチル) ((2-メチルピリジン-4-イル)イミノ) (2-(ピリミジン-5-イル)-2H-インダゾール-5-イル)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.52 (s, 3H), 9.31 (s, 1H), 8.53 (s, 1H), 7.98-7.94 (m, 2H), 7.69-7.66 (m, 1H), 6.68 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 6.58 (d, J = 5.5 Hz, 1H), 3.77 (d, J = 7.0 Hz, 2H), 2.73-2.65 (m, 1H), 2.23 (s, 3H), 1.98-1.95 (m, 1H), 1.85-1.80 (m, 3H), 1.72-1.62 (m, 2H); ESI MS (m/z): 419.1 [M+1].

10

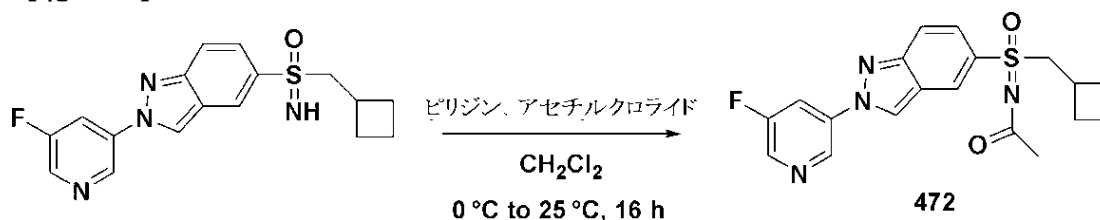
20

30

【0251】

例 10 : N - ((シクロブチルメチル) (2 - (5 - フルオロピリジン - 3 - イル) - 2 H - インダゾール - 5 - イル) (オキソ) - λ⁶ - スルファネリデン) アセトアミド 472 の合成

【化 4 1】



40

50

ジクロロメタン（6 mL）中の（シクロブチルメチル）（2-（5-フルオロピリジン-3-イル）-2H-インダゾール-5-イル）（イミノ）- λ^6 -スルファノン（250 mg、0.726ミリモル）の攪拌溶液にピリジン（0.088 mL、1.089ミリモル）を加え、得られた反応混合物を10分間攪拌した。反応混合物を0°Cに冷却し、25°Cで16時間攪拌した反応混合物に塩化アセチル（0.057 mL、0.798ミリモル）を加えた。反応終了後、反応混合物を水（10 mL）に注ぎ、水層をジクロロメタン（3 X 20 mL）で抽出した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過し、減圧下で濃縮して粗固体を得た。粗化合物を分取HPLCで精製し、所望のN-（（シクロブチルメチル）（2-（5-フルオロピリジン-3-イル）-2H-インダゾール-5-イル）（オキソ）- λ^6 -スルファネリデン）アセトアミド472（110 mg、0.285ミリモル、収率39.2%）を得た。

10

【0252】

表10：本開示の代表的な化合物を、例10に記載の適切な出発物質および方法に従って調製した。

20

30

40

50

【表 10-1】

化合物番号	化合物名	分析データ
389	<i>N</i> -(イソプロピル(オキシ)-(2-(ピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> インダゾール-5-イル)- λ^6 -スルファニリデン)アセトアミド	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9.49 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 9.33 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 8.71 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.51 (dq, J = 8.4, 1.3 Hz, 1H), 8.44 (t, J = 0.9 Hz, 1H), 7.97 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.71-7.67 (m, 1H), 7.61 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 3.77-3.70 (m, 1H), 2.01 (s, 3H), 1.30 (d, J = 6.7 Hz, 3H), 1.25-1.22 (m, 1H), 1.12 (d, J = 6.7 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 343.15 [$M+1$].
394	2, 2, 2-トリフルオロ- <i>N</i> -(イソプロピル(オキシ)-(2-(ピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> インダゾール-5-イル)- λ^6 -スルファニリデン)アセトアミド	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9.56 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 9.34 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.73 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.59 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.52 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 8.07 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.72-7.63 (m, 2H), 4.13-4.06 (m, 1H), 1.41 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 1.22-1.18 (m, 3H); ESI MS (m/z): 396.5 [$M+1$].
396	2, 2-ジフルオロ- <i>N</i> -(イソプロピル(オキシ)-(2-(ピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> インダゾール-5-イル)- λ^6 -スルファニリデン)アセトアミド	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9.54 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 9.34 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.72 (dd, J = 4.6, 1.2 Hz, 1H), 8.54-8.50 (m, 2H), 8.04 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.71-7.68 (m, 1H), 7.64 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 6.22 (t, J = 54.3 Hz, 1H), 3.99-3.93 (m, 1H), 1.37 (d, J = 6.7 Hz, 3H), 1.17 (d, J = 6.7 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 378.45 [$M+1$].
398	2, 2, 2-トリフルオロ- <i>N</i> -((2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> インダゾール-5-イル)(イソプロピル)(オキシ)- λ^6 -スルファニリデン)アセトアミド	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9.60 (s, 1H), 9.27 (s, 1H), 8.78 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.61 (d, J = 1.7 Hz, 1H), 8.57 (dd, J = 9.8, 2.2 Hz, 1H), 8.07 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.66 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 4.10 (t, J = 6.8 Hz, 1H), 1.41 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 1.22 (s, 1H), 1.18 (d, J = 6.6 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 414.95 [$M+1$].
399	<i>N</i> -((2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> インダゾール-5-イル)(イソプロピル)(オキシ)- λ^6 -スルファニリデン)アセトアミド	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9.53 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 9.27 (s, 1H), 8.76 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.56 (dt, J = 9.8, 2.3 Hz, 1H), 8.45 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 7.97 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 3.77-3.70 (m, 1H), 2.01 (s, 3H), 1.31 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 1.12 (d, J = 6.6 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 361.1 [$M+1$].
401	2, 2, 2-トリフルオロ- <i>N</i> -((2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> ピラゾロ[3, 4- <i>b</i>]ピリジン-5-イル)(イソプロピル)(オキシ)- λ^6 -スルファニリデン)アセトアミド	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9.63 (s, 1H), 9.31 (s, 1H), 9.16 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.01 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.82 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.64 (dt, J = 9.8, 2.3 Hz, 1H), 4.22 (m, J = 6.7 Hz, 1H), 1.44 (d, J = 6.7 Hz, 3H), 1.24 (d, J = 6.7 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 415.45 [$M+1$].
402	<i>N</i> -((2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -ピラゾロ[3, 4- <i>b</i>]ピリジン-5-イル)(イソプロピル)(オキシ)- λ^6 -スルファニリデン)アセトアミド	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9.55 (s, 1H), 9.30 (s, 1H), 8.97 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.93 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.80 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.62 (dt, J = 9.7, 2.3 Hz, 1H), 3.84 (q, J = 6.7 Hz, 1H), 2.04 (s, 3H), 1.34 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 1.18 (d, J = 6.6 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 361.95 [$M+1$].
403	2, 2-ジフルオロ- <i>N</i> -((2-(5-フルオロピリジン-	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9.58 (s, 1H), 9.27 (s, 1H), 8.77 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.59-8.56 (m, 2H), 8.03 (d, J = 9.3 Hz, 1H),

10

20

30

40

50

【表 10-2】

	3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)(イソプロピル)(オキシ)-λ ⁶ -スルファニリデン)アセトアミド	7.65 (dd, <i>J</i> = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 6.22 (t, <i>J</i> = 54.3 Hz, 1H), 4.00-3.93 (m, 1H), 1.37 (d, <i>J</i> = 6.8 Hz, 3H), 1.17 (d, <i>J</i> = 6.6 Hz, 3H); ESI MS (<i>m/z</i>): 396.9 [M+1].
404	2,2-ジフルオロ- <i>N</i> -(2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -ピラゾロ[3,4- <i>b</i>]ピリジン-5-イル)(イソプロピル)(オキシ)-λ ⁶ -スルファニリデン)アセトアミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.61 (s, 1H), 9.31 (s, 1H), 9.09 (d, <i>J</i> = 2.4 Hz, 1H), 8.99 (d, <i>J</i> = 2.4 Hz, 1H), 8.81 (d, <i>J</i> = 2.4 Hz, 1H), 8.63 (dt, <i>J</i> = 9.8, 2.3 Hz, 1H), 6.25 (t, <i>J</i> = 54.2 Hz, 1H), 4.08 (q, <i>J</i> = 6.8 Hz, 1H), 1.40 (d, <i>J</i> = 6.8 Hz, 3H), 1.23 (d, <i>J</i> = 6.6 Hz, 3H); ESI MS (<i>m/z</i>): 397.95 [M+1].
413	<i>N</i> -((シクロプロピルメチル)(2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)(オキシ)-λ ⁶ -スルファニリデン)-2,2,2-トリフルオロアセトアミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.62 (d, <i>J</i> = 0.7 Hz, 1H), 9.28 (d, <i>J</i> = 1.0 Hz, 1H), 8.78-8.77 (m, 1H), 8.66 (q, <i>J</i> = 0.8 Hz, 1H), 8.57 (dt, <i>J</i> = 9.8, 2.3 Hz, 1H), 8.08-8.05 (m, 1H), 7.75 (dd, <i>J</i> = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 3.99 (ddd, <i>J</i> = 26.4, 14.7, 7.1 Hz, 2H), 0.92-0.84 (m, 1H), 0.56-0.40 (m, 2H), 0.28 (td, <i>J</i> = 9.8, 4.6 Hz, 1H), 0.12 (td, <i>J</i> = 9.7, 4.5 Hz, 1H); ESI MS (<i>m/z</i>): 426.9 [M+1].
415	<i>N</i> -((シクロプロピルメチル)(2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)(オキシ)-λ ⁶ -スルファニリデン)アセトアミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-D ₆) δ 9.55 (s, 1H), 9.28 (s, 1H), 8.76 (d, <i>J</i> = 2.4 Hz, 1H), 8.58-8.53 (m, 2H), 7.97 (d, <i>J</i> = 9.3 Hz, 1H), 7.72 (dd, <i>J</i> = 9.3, 1.7 Hz, 1H), 3.64 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 2H), 2.01 (s, 3H), 0.85-0.81 (m, 1H), 0.45-0.36 (m, 2H), 0.15-0.02 (m, 2H); ESI MS (<i>m/z</i>): 372.95 [M+1].
416	<i>N</i> -((シクロプロピルメチル)(2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)(オキシ)-λ ⁶ -スルファニリデン)-2,2-ジフルオロアセトアミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.60 (d, <i>J</i> = 1.0 Hz, 1H), 9.28 (s, 1H), 8.77 (d, <i>J</i> = 2.7 Hz, 1H), 8.62 (t, <i>J</i> = 1.0 Hz, 1H), 8.57 (dt, <i>J</i> = 9.8, 2.3 Hz, 1H), 8.03 (d, <i>J</i> = 9.3 Hz, 1H), 7.74 (dd, <i>J</i> = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 6.21 (t, <i>J</i> = 54.2 Hz, 1H), 3.91-3.81 (m, 2H), 0.91-0.84 (m, 1H), 0.52-0.38 (m, 2H), 0.22 (td, <i>J</i> = 9.5, 4.8 Hz, 1H), 0.09 (td, <i>J</i> = 9.6, 4.6 Hz, 1H); ESI MS (<i>m/z</i>): 408.95 [M+1].
417	2,2,2-トリフルオロ- <i>N</i> -(イソプロピル(オキシ)(2-(ピリミジン-5-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)-λ ⁶ -スルファニリデン)アセトアミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.62 (d, <i>J</i> = 1.0 Hz, 1H), 9.56 (s, 2H), 9.34 (s, 1H), 8.64 (t, <i>J</i> = 1.0 Hz, 1H), 8.09 (d, <i>J</i> = 9.3 Hz, 1H), 7.67 (dd, <i>J</i> = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 4.14-4.07 (m, 1H), 1.41 (d, <i>J</i> = 6.6 Hz, 3H), 1.18 (d, <i>J</i> = 6.6 Hz, 3H); ESI MS (<i>m/z</i>): 398.0 [M+1].
418	<i>N</i> -(イソプロピル(オキシ)(2-(ピリミジン-5-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)-λ ⁶ -スルファニリデン)アセトアミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-D ₆) δ 9.56-9.55 (m, 3H), 9.33 (s, 1H), 8.48 (t, <i>J</i> = 0.9 Hz, 1H), 7.99 (d, <i>J</i> = 9.2 Hz, 1H), 7.63 (dd, <i>J</i> = 9.3, 1.7 Hz, 1H), 3.77-3.71 (m, 1H), 2.00 (d, <i>J</i> = 4.9 Hz, 3H), 1.30 (d, <i>J</i> = 6.7 Hz, 3H), 1.12 (d, <i>J</i> = 6.7 Hz, 3H); ESI MS (<i>m/z</i>): 343.5 [M+1].
421	2,2-ジフルオロ- <i>N</i> -(イソプロピル(オキシ)(2-(ピリミジン-5-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)-λ ⁶ -スルファニリデン)アセトアミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.60 (d, <i>J</i> = 0.9 Hz, 1H), 9.56 (s, 2H), 9.33 (s, 1H), 8.59 (q, <i>J</i> = 0.8 Hz, 1H), 8.05 (d, <i>J</i> = 9.2 Hz, 1H), 7.66 (dd, <i>J</i> = 9.5, 1.8 Hz, 1H), 6.22 (t, <i>J</i> = 54.3 Hz, 1H), 4.00-3.93 (m, 1H), 1.37 (d, <i>J</i> = 6.4 Hz, 3H), 1.17 (d, <i>J</i> = 6.7 Hz, 3H); ESI MS (<i>m/z</i>): 379.9 [M+1].

10

20

30

40

50

【表 10-3】

422	2, 2, 3, 3, 3-ペンタフル オロ- <i>N</i> -(イソプロピル (オキシ)) (2-(ピリミジ ン-5-イル)-2 <i>H</i> -インダ ゾール-5-イル)- λ^6 -ス ルファニリデン)プロパ ンアミド	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9.63 (d, $J = 0.9$ Hz, 1H), 9.56 (s, 2H), 9.34 (s, 1H), 8.62 (t, $J = 0.9$ Hz, 1H), 8.10 (d, $J = 9.2$ Hz, 1H), 7.63 (dd, $J = 9.2, 1.8$ Hz, 1H), 4.11 (t, $J = 6.7$ Hz, 1H), 1.41 (d, $J = 6.7$ Hz, 3H), 1.19 (d, $J = 6.7$ Hz, 3H); ESI MS (m/z): 447.9 [M+1].
456	<i>N</i> -(エチル(オキシ)) (2-(ピリミジン-5-イル)- 2 <i>H</i> -インダゾール-5-イ ル)- λ^6 -スルファニリデ ン)アセトアミド	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- D_6) δ 9.56 (s, 3H), 9.32 (s, 1H), 8.53 (t, $J = 0.9$ Hz, 1H), 8.00 (d, $J = 9.2$ Hz, 1H), 7.70 (dd, $J = 9.3, 1.7$ Hz, 1H), 3.67-3.57 (m, 2H), 2.01 (s, 3H), 1.10 (t, $J = 7.3$ Hz, 3H); ESI MS (m/z): 330 [M+1].
462	<i>N</i> -(エチル(2-(5-フルオ ロピリジン-3-イル)- 2 <i>H</i> -インダゾール-5-イ ル)(オキシ))- λ^6 -スルファ ニリデン)アセトアミ ド	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- D_6) δ 9.54 (d, $J = 1.0$ Hz, 1H), 9.27 (s, 1H), 8.76 (d, $J = 2.7$ Hz, 1H), 8.56 (dt, $J = 9.9, 2.3$ Hz, 1H), 8.50 (d, $J = 1.0$ Hz, 1H), 7.98 (d, $J = 9.3$ Hz, 1H), 7.69 (dd, $J = 9.3, 1.7$ Hz, 1H), 3.65-3.58 (m, 2H), 2.00 (s, 3H), 1.10 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H); ESI MS (m/z): 346.9 [M+1].
467	<i>N</i> -((シクロブチルメチ ル)(オキシ)) (2-(ピリミ ジン-5-イル)-2 <i>H</i> -イン ダゾール-5-イル)- λ^6 - スルファニリデン)アセ トアミド	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- D_6) δ 9.56 (t, $J = 1.2$ Hz, 3H), 9.32 (s, 1H), 8.52 (q, $J = 0.8$ Hz, 1H), 7.99 (d, $J = 9.2$ Hz, 1H), 7.70 (dd, $J = 9.5, 1.8$ Hz, 1H), 3.78 (d, $J = 7.0$ Hz, 2H), 2.58-2.54 (m, 1H), 1.99 (s, 3H), 1.93-1.89 (m, 1H), 1.79-1.57 (m, 5H); ESI MS (m/z): 369.95 [M+1].
472	<i>N</i> -((シクロブチルメチ ル)(2-(5-フルオロピリ ジン-3-イル)-2 <i>H</i> -イン ダゾール-5-イル)(オキ ソ))- λ^6 -スルファニリデ ン)アセトアミド	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CHLOROFORM- D) δ 9.05 (s, 1H), 8.72 (s, 1H), 8.61 (d, $J = 1.8$ Hz, 1H), 8.53 (t, $J = 0.8$ Hz, 1H), 8.14 (dt, $J = 8.9, 2.3$ Hz, 1H), 7.92 (d, $J = 9.2$ Hz, 1H), 7.69 (dd, $J = 9.2, 1.8$ Hz, 1H), 3.73 (dd, $J = 14.2, 6.6$ Hz, 1H), 3.59 (q, $J = 7.3$ Hz, 1H), 2.71 (q, $J = 7.6$ Hz, 1H), 2.17 (s, 3H), 2.09-2.05 (m, 1H), 1.91-1.74 (m, 4H), 1.64-1.60 (m, 1H); ESI MS (m/z): 387.1 [M+1].
475	<i>N</i> -(メチル(オキシ)) (2-(ピリミジン-5-イル)- 2 <i>H</i> -インダゾール-5-イ ル)- λ^6 -スルファニリデ ン)アセトアミド	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CHLOROFORM- D) δ 9.38 (s, 2H), 9.33 (s, 1H), 8.74 (d, $J = 0.9$ Hz, 1H), 8.60 (q, $J = 0.8$ Hz, 1H), 7.97 (dd, $J = 8.6, 0.9$ Hz, 1H), 7.75 (dd, $J = 9.2, 1.8$ Hz, 1H), 3.40 (s, 3H), 2.19 (s, 3H); ESI MS (m/z): 316.05 [M+1].
483	<i>N</i> -((2-(5-フルオロピリ ジン-3-イル)-2 <i>H</i> -イン ダゾール-5-イル)(オキ ソ)(プロピル))- λ^6 -スル ファニリデン)アセトア ミド	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- D_6) δ 9.54 (d, $J = 1.0$ Hz, 1H), 9.27 (s, 1H), 8.76 (d, $J = 2.4$ Hz, 1H), 8.56 (dt, $J = 9.8, 2.3$ Hz, 1H), 8.50 (t, $J = 0.9$ Hz, 1H), 7.98 (d, $J = 9.0$ Hz, 1H), 7.69 (dd, $J = 9.3, 1.7$ Hz, 1H), 3.66-3.52 (m, 2H), 2.00 (s, 3H), 1.63-1.45 (m, 2H), 0.89 (t, $J = 7.3$ Hz, 3H); ESI MS (m/z): 361 [M+1].
485	<i>N</i> -((2-(5-フルオロピリ ジン-3-イル)-2 <i>H</i> -イン ダゾール-5-イル)(オキ ソ)(ペンタン-3-イル))- λ^6 -スルファニリデン) アセトアミド	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- D_6) δ 9.52 (s, 1H), 9.27 (s, 1H), 8.76 (d, $J = 2.4$ Hz, 1H), 8.56 (dd, $J = 7.5, 2.3$ Hz, 1H), 8.47 (s, 1H), 7.97 (d, $J = 9.3$ Hz, 1H), 7.64 (dd, $J = 9.3, 1.7$ Hz, 1H), 3.39 (d, $J = 6.6$ Hz, 1H), 2.01-1.96 (m, 4H), 1.76 (td, $J = 14.7, 7.7$ Hz, 2H), 1.49 (t, $J = 7.2$ Hz, 1H), 0.99 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 0.85 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H); ESI MS (m/z): 389.05 [M+1].
486	<i>N</i> -(sec-ブチル(2-(5-フ ルオロピリジン-3-イ ル)-2 <i>H</i> -インダゾール-	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- D_6) δ 9.45 (dd, $J = 13.0, 5.0$ Hz, 1H), 9.24 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 8.72 (q, $J = 2.4$ Hz, 1H), 8.50-8.45 (m, 2H), 7.95 (q, $J = 4.6$ Hz, 1H), 7.65-7.62 (m, 1H), 3.58-3.54

10

20

30

40

50

【表 10-4】

	5-イル)(オキシ)- λ^6 -スルファニリデン)アセトアミド	(m, 1H), 2.18-1.80 (m, 4H), 1.48-1.15 (m, 4H), 0.94 (dtd, J = 32.3, 7.4, 4.1 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 375.05 [M+1].
487	<i>N</i> -((3-フルオロプロピル)(2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)(オキシ)- λ^6 -スルファニリデン)アセトアミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.55 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 9.28 (s, 1H), 8.76 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.58-8.54 (m, 2H), 7.99 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.71 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 4.54-4.39 (m, 2H), 3.80-3.63 (m, 2H), 2.06-1.86 (m, 5H) ESI MS (m/z): 379.1 [M+1].
565	<i>N</i> -(シクロブチル(オキシ)(2-(ピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)- λ^6 -スルファニリデン)アセトアミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.48 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 9.34 (q, J = 2.5 Hz, 1H), 8.71 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.53-8.49 (m, 1H), 8.45 (q, J = 0.8 Hz, 1H), 7.98-7.94 (m, 1H), 7.72-7.67 (m, 1H), 7.60 (dd, J = 9.3, 1.7 Hz, 1H), 4.37 (t, J = 7.9 Hz, 1H), 2.56-2.53 (m, 1H), 2.32-2.20 (m, 2H), 1.97 (d, J = 7.3 Hz, 3H), 1.93-1.81 (m, 3H); ESI MS (m/z): 354.9 [M+1].
566	<i>N</i> -((シクロヘキシルメチル)(オキシ)(2-(ピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)- λ^6 -スルファニリデン)アセトアミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.50 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 9.34 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.71 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.53-8.50 (m, 2H), 7.97 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.72-7.67 (m, 2H), 3.54 (dd, J = 19.6, 5.8 Hz, 2H), 1.97 (s, 3H), 1.79 (s, 2H), 1.61-1.51 (m, 4H), 1.08 (dd, J = 15.7, 8.4 Hz, 5H); ESI MS (m/z): 396.95 [M+1].
570	<i>N</i> -(エチル(2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)(オキシ)- λ^6 -スルファニリデン)プロピオンアミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.55 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 9.27 (s, 1H), 8.76 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.56 (dt, J = 9.9, 2.3 Hz, 1H), 8.50 (q, J = 0.8 Hz, 1H), 7.99-7.96 (m, 1H), 7.68 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 3.69-3.58 (m, 2H), 2.30 (q, J = 7.5 Hz, 2H), 1.10 (t, J = 7.3 Hz, 3H), 0.99 (t, J = 7.6 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 361 [M+1].
571	<i>N</i> -(エチル(2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)(オキシ)- λ^6 -スルファニリデン)イソブチルアミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.56 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 9.27 (s, 1H), 8.76 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.56 (dt, J = 9.9, 2.4 Hz, 1H), 8.49 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.98 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.67 (dd, J = 9.3, 1.7 Hz, 1H), 3.63 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 2.46 (s, 1H), 1.09 (q, J = 7.0 Hz, 9H); ESI MS (m/z): 375.05 [M+1].
572	<i>N</i> -((シクロブチルメチル)(オキシ)(2-(ピリミジン-5-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)- λ^6 -スルファニリデン)シクロプロパンカルボキサミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.56 (d, J = 2.4 Hz, 3H), 9.32 (s, 1H), 8.50 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 7.99 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 7.68 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 3.79 (d, J = 7.3 Hz, 2H), 2.56 (d, J = 6.4 Hz, 1H), 1.93-1.90 (m, 1H), 1.79-1.73 (m, 3H), 1.69-1.59 (m, 3H), 0.80-0.73 (m, 4H); ESI MS (m/z): 396 [M+1].
573	<i>N</i> -((シクロブチルメチル)(オキシ)(2-(ピリミジン-5-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)- λ^6 -スルファニリデン)プロピオンアミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.56 (s, 3H), 9.32 (s, 1H), 8.52 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 7.99 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 7.70 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 3.78 (d, J = 7.3 Hz, 2H), 2.57-2.53 (m, 1H), 2.29 (q, J = 7.5 Hz, 2H), 1.94-1.89 (m, 1H), 1.79-1.58 (m, 5H), 0.99 (t, J = 7.5 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 384 [M+1].
574	<i>N</i> -((シクロブチルメチル)(2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)(オキシ)- λ^6 -スルファニリデン)アセトアミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.55 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 9.27 (s, 1H), 8.76 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.56 (dt, J = 9.7, 2.3 Hz, 1H), 8.47 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.97 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.67 (dd, J = 9.3, 1.7 Hz, 1H), 3.83-3.74 (m, 2H), 2.59-2.51 (m, 1H), 1.96-1.87 (m, 1H), 1.80-1.57 (m, 6H), 0.84-0.73 (m, 4H) ESI MS (m/z): 413.05 [M+1].

10

20

30

40

50

【表 10-5】

	ン)シクロプロパンカルボキサミド	
575	<i>N</i> -((シクロブチルメチル)(2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)(オキシ)-λ ⁶ -スルファニリデン)ブチルアミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.54 (d, <i>J</i> = 1.0 Hz, 1H), 9.27 (t, <i>J</i> = 1.1 Hz, 1H), 8.75 (d, <i>J</i> = 2.2 Hz, 1H), 8.56 (dt, <i>J</i> = 9.8, 2.3 Hz, 1H), 8.48 (q, <i>J</i> = 0.8 Hz, 1H), 7.97 (d, <i>J</i> = 9.3 Hz, 1H), 7.68 (dd, <i>J</i> = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 3.82-3.73 (m, 2H), 2.58-2.51 (m, 1H), 2.27-2.20 (m, 2H), 1.95-1.87 (m, 1H), 1.81-1.60 (m, 5H), 1.58-1.48 (m, 2H), 0.87 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H); ESI MS (<i>m/z</i>): 415.05 [<i>M</i> +1].
576	<i>N</i> -((シクロブチルメチル)(2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)(オキシ)-λ ⁶ -スルファニリデン)イソブチルアミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.55 (d, <i>J</i> = 1.0 Hz, 1H), 9.27 (s, 1H), 8.76 (d, <i>J</i> = 2.2 Hz, 1H), 8.56 (dt, <i>J</i> = 9.7, 2.3 Hz, 1H), 8.48 (t, <i>J</i> = 0.9 Hz, 1H), 7.97 (d, <i>J</i> = 9.0 Hz, 1H), 7.67 (dd, <i>J</i> = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 3.78 (d, <i>J</i> = 7.3 Hz, 2H), 2.54 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H), 2.46 (d, <i>J</i> = 6.8 Hz, 1H), 1.95-1.90 (m, 1H), 1.78-1.60 (m, 5H), 1.06 (d, <i>J</i> = 7.3 Hz, 6H); ESI MS (<i>m/z</i>): 415.1 [<i>M</i> +1].
577	<i>N</i> -(エチル(2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)(オキシ)-λ ⁶ -スルファニリデン)シクロプロパンカルボキサミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.55 (d, <i>J</i> = 1.0 Hz, 1H), 9.27 (d, <i>J</i> = 1.0 Hz, 1H), 8.76 (d, <i>J</i> = 2.2 Hz, 1H), 8.56 (dt, <i>J</i> = 9.8, 2.3 Hz, 1H), 8.48 (q, <i>J</i> = 0.8 Hz, 1H), 7.98 (dt, <i>J</i> = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.67 (dd, <i>J</i> = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 3.68-3.56 (m, 2H), 1.68-1.62 (m, 1H), 1.10 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 0.82-0.71 (m, 4H); ESI MS (<i>m/z</i>): 373 [<i>M</i> +1].
578	<i>N</i> -(エチル(2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)(オキシ)-λ ⁶ -スルファニリデン)ブチルアミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.55 (d, <i>J</i> = 1.0 Hz, 1H), 9.27 (d, <i>J</i> = 1.2 Hz, 1H), 8.75 (d, <i>J</i> = 2.2 Hz, 1H), 8.55 (dt, <i>J</i> = 9.9, 2.4 Hz, 1H), 8.49 (q, <i>J</i> = 0.9 Hz, 1H), 7.99-7.96 (m, 1H), 7.67 (dd, <i>J</i> = 9.3, 1.7 Hz, 1H), 3.69-3.56 (m, 2H), 2.29-2.22 (m, 2H), 1.53 (td, <i>J</i> = 14.7, 7.3 Hz, 2H), 1.11-1.04 (m, 3H), 0.93-0.85 (m, 3H); ESI MS (<i>m/z</i>): 375 [<i>M</i> +1].
579	<i>N</i> -((シクロブチルメチル)(2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)(オキシ)-λ ⁶ -スルファニリデン)プロピオンアミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.54 (d, <i>J</i> = 0.5 Hz, 1H), 9.27 (s, 1H), 8.75 (d, <i>J</i> = 2.4 Hz, 1H), 8.55 (dt, <i>J</i> = 9.8, 2.3 Hz, 1H), 8.49 (d, <i>J</i> = 1.0 Hz, 1H), 7.96 (d, <i>J</i> = 9.3 Hz, 1H), 7.68 (dd, <i>J</i> = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 3.82-3.73 (m, 2H), 2.57-2.52 (m, 1H), 2.28 (q, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.95-1.87 (m, 1H), 1.79-1.58 (m, 5H), 0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H); ESI MS (<i>m/z</i>): 401 [<i>M</i> +1].
581	<i>N</i> -(シクロペンチル(オキシ)(2-(ピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)-λ ⁶ -スルファニリデン)アセトアミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.48 (s, 1H), 9.33 (d, <i>J</i> = 2.4 Hz, 1H), 8.71 (dd, <i>J</i> = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.52-8.49 (m, 1H), 8.47 (s, 1H), 7.96 (d, <i>J</i> = 9.0 Hz, 1H), 7.69 (dd, <i>J</i> = 8.8, 4.9 Hz, 1H), 7.64 (dd, <i>J</i> = 9.3, 1.7 Hz, 1H), 4.04 (t, <i>J</i> = 7.9 Hz, 1H), 2.13-2.04 (m, 2H), 1.97 (s, 3H), 1.75 (dd, <i>J</i> = 13.0, 7.6 Hz, 1H), 1.66-1.50 (m, 5H); ESI MS (<i>m/z</i>): 369 [<i>M</i> +1].
582	<i>N</i> -(イソペンチル(オキシ)(2-(ピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)-λ ⁶ -スルファニリデン)アセトアミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.50 (s, 1H), 9.34 (d, <i>J</i> = 2.4 Hz, 1H), 8.71 (dd, <i>J</i> = 4.6, 1.2 Hz, 1H), 8.53-8.50 (m, 2H), 7.98 (d, <i>J</i> = 9.3 Hz, 1H), 7.72-7.67 (m, 2H), 3.68-3.55 (m, 2H), 2.00 (s, 3H), 1.57 (td, <i>J</i> = 13.3, 6.7 Hz, 1H), 1.52-1.43 (m, 1H), 1.36-1.27 (m, 1H), 0.80 (dd, <i>J</i> = 6.5, 4.3 Hz, 6H); ESI MS (<i>m/z</i>): 371 [<i>M</i> +1].
583	<i>N</i> -((3-シアノプロピル)(オキシ)(2-(ピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)-λ ⁶ -スルファニリデン)アセトアミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.51 (s, 1H), 9.34 (d, <i>J</i> = 2.4 Hz, 1H), 8.72 (dd, <i>J</i> = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.53-8.50 (m, 2H), 8.00 (d, <i>J</i> = 9.3 Hz, 1H), 7.71-7.68 (m, 2H), 3.77-3.60 (m, 2H), 2.61 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 2H), 2.03 (s, 3H), 1.94-1.79 (m, 2H); ESI MS (<i>m/z</i>): 368 [<i>M</i> +1].
584	<i>N</i> -((3-シアノプロピル)(オキシ)(2-(ピリジ	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.52 (s, 1H), 9.34 (d, <i>J</i> = 2.4 Hz, 1H), 8.72-8.71 (m, 1H), 8.51 (d, <i>J</i> = 7.3 Hz, 2H), 8.00 (d, <i>J</i> = 9.3

10

20

30

40

50

【表 10-6】

	ン-3-イル)-2 <i>H</i> インダ ゾール-5-イル)-λ ⁶ -ス ルファニリデン)シクロ プロパンカルボキサミ ド	Hz, 1H), 7.71-7.65 (m, 2H), 3.79-3.61 (m, 2H), 2.61 (t, J = 7.2 Hz, 2H), 1.93-1.78 (m, 2H), 1.65 (dd, J = 13.0, 6.8 Hz, 1H), 0.83-0.77 (m, 4H); ESI MS (m/z): 394 [M+1].
590	<i>N</i> -(オキソ(ペンタン-3- イル)(2-(ピリジン-3- イル)-2 <i>H</i> インダゾール -5-イル)-λ ⁶ -スルファ ニリデン)アセトアミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.48 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 9.33 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.71 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.51 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 8.46 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 7.97 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.69 (dd, J = 8.3, 4.9 Hz, 1H), 7.63 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 3.38 (t, J = 7.1 Hz, 1H), 2.03-1.96 (m, 4H), 1.80-1.68 (m, 2H), 1.53-1.46 (m, 1H), 0.99 (t, J = 7.6 Hz, 3H), 0.85 (t, J = 7.6 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 370.95 [M+1].
591	<i>N</i> -(イソブチル(オキ ソ)(2-(ピリジン-3-イ ル)-2 <i>H</i> インダゾール- 5-イル)-λ ⁶ -スルファニ リデン)アセトアミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.49 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 9.34 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.71 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.52-8.49 (m, 2H), 7.98 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.72-7.67 (m, 2H), 3.59 (dd, J = 14.4, 6.4 Hz, 1H), 3.49 (dd, J = 14.4, 6.4 Hz, 1H), 2.02 (t, J = 6.6 Hz, 1H), 1.98 (s, 3H), 0.98 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 0.88 (d, J = 6.8 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 356.9 [M+1].
592	<i>N</i> -(シクロペンチル(オ キソ)(2-(ピリジン-3- イル)-2 <i>H</i> インダゾール -5-イル)-λ ⁶ -スルファ ニリデン)アセトアミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.48 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 9.33 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.71 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.51 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 8.45 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 7.96 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.69 (q, J = 4.2 Hz, 1H), 7.63 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 3.69-3.64 (m, 1H), 2.30-2.27 (m, 1H), 2.00 (s, 3H), 1.95-1.90 (m, 1H), 1.68-1.60 (m, 3H), 1.53-1.34 (m, 7H); ESI MS (m/z): 397.05 [M+1].
593	<i>N</i> -((2-シクロヘキシル エチル)(オキソ)(2-(ピ リジン-3-イル)-2 <i>H</i> イ ンダゾール-5-イル)- λ ⁶ -スルファニリデン) アセトアミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.50 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 9.34 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.71 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.53-8.50 (m, 2H), 7.97 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.71-7.67 (m, 2H), 3.67-3.60 (m, 2H), 1.99 (s, 3H), 1.59-1.51 (m, 5H), 1.50-1.44 (m, 1H), 1.34-1.21 (m, 2H), 1.11-1.01 (m, 3H), 0.78 (dd, J = 21.5, 9.9 Hz, 2H); ESI MS (m/z): 411.1 [M+1].
594	<i>N</i> -(オキソ(ペンタン-2- イル)(2-(ピリジン-3- イル)-2 <i>H</i> インダゾール -5-イル)-λ ⁶ -スルファ ニリデン)アセトアミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.48 (s, 1H), 9.33 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.71 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.51 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 8.44 (s, 1H), 7.97 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.69 (dd, J = 8.2, 4.8 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 9.3, 1.2 Hz, 1H), 3.62-3.58 (m, 1H), 2.00 (d, J = 6.6 Hz, 4H), 1.35-1.11 (m, 6H), 0.83 (dt, J = 36.4, 7.2 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 370.85 [M+1].
596	<i>N</i> -(オキソ(2-(ピリジン -3-イル)-2 <i>H</i> インダゾ ール-5-イル)((テトラ ヒドロフラン-2-イル) メチル)-λ ⁶ -スルファニ リデン)アセトアミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.50 (d, J = 4.2 Hz, 1H), 9.34 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.71 (d, J = 4.6 Hz, 1H), 8.51 (d, J = 10.8 Hz, 2H), 7.95 (dd, J = 9.3, 4.2 Hz, 1H), 7.74-7.67 (m, 2H), 4.16-4.05 (m, 1H), 3.93-3.82 (m, 2H), 3.59-3.42 (m, 2H), 2.00 (d, J = 16.6 Hz, 3H), 1.96-1.84 (m, 1H), 1.80-1.66 (m, 2H), 1.63-1.50 (m, 1H); ESI MS (m/z): 384.9 [M+1].
598	<i>N</i> -((シクロヘキシルメ チル)(オキソ)(2-(ピ リジン-3-イル)-2 <i>H</i> イ ンダゾール-5-イル)-λ ⁶ - スルファニリデン)シク ロプロパンカルボキサ ミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.50 (s, 1H), 9.34 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.71 (d, J = 3.4 Hz, 1H), 8.51 (d, J = 9.5 Hz, 2H), 7.97 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.70-7.67 (m, 2H), 3.58 (d, J = 5.9 Hz, 1H), 3.52 (d, J = 5.9 Hz, 1H), 1.79 (s, 2H), 1.63-1.51 (m, 5H), 1.11-1.00 (m, 5H), 0.76-0.73 (m, 4H); ESI MS (m/z): 423.15 [M+1].
599	<i>N</i> -((シクロヘキシルメ チル)(オキソ)(2-(ピ リジン-3-イル)-2 <i>H</i> イ ンダゾール-5-イル)-λ ⁶ -	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.50 (s, 1H), 9.34 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.71 (d, J = 3.4 Hz, 1H), 8.52 (s, 2H), 7.97 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.72-7.67 (m, 2H), 3.57 (d, J = 5.9 Hz, 1H), 3.52 (d, J = 5.9 Hz, 1H), 2.27 (q, J = 7.5 Hz, 2H), 1.79 (s, 2H), 1.61-1.51 (m, 4H), 1.11-1.05 (m, 4H), 0.97 (t, J = 7.6 Hz, 4H); ESI MS (m/z): 411 [M+1].

10

20

30

40

50

【表 10-7】

	スルファニリデン)プロ ピオンアミド	
600	<i>N</i> -(イソブチル(オキ ソ)(2-(ピリジン-3-イ ル)-2 <i>H</i> インダゾール- 5-イル)- λ^6 -スルファニ リデン)シクロプロパン カルボキサミド	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9.50 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 9.34 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.71 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.52-8.49 (m, 2H), 7.98 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.71-7.67 (m, 2H), 3.60 (dd, J = 14.5, 6.2 Hz, 1H), 3.51 (dd, J = 14.4, 6.4 Hz, 1H), 2.01 (t, J = 6.7 Hz, 1H), 1.61 (d, J = 6.6 Hz, 1H), 0.98 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.89 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 0.78-0.74 (m, 4H); ESI MS (m/z): 383 [M+1].
601	<i>N</i> -(オキソ(ペンタン-2- イル)(2-(ピリジン-3- イル)-2 <i>H</i> インダゾール- 5-イル)- λ^6 -スルファ ニリデン)シクロプロパ ンカルボキサミド	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 9.32 (s, 1H), 8.77-8.74 (m, 2H), 8.46-8.45 (m, 2H), 7.89 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.68-7.62 (m, 2H), 3.59-3.49 (m, 1H), 2.21-2.16 (m, 1H), 1.82-1.77 (m, 1H), 1.48-1.23 (m, 6H), 1.02-0.98 (m, 2H), 0.96-0.80 (m, 5H); ESI MS (m/z): 397.05 [M+1].
605	<i>N</i> -(オキソ(ペンタン-3- イル)(2-(ピリジン-3- イル)-2 <i>H</i> インダゾール- 5-イル)- λ^6 -スルファ ニリデン)シクロプロパ ンカルボキサミド	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 9.28 (s, 1H), 8.81-8.73 (m, 2H), 8.48 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.41 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.86 (dd, J = 15.0, 8.7 Hz, 1H), 7.67-7.58 (m, 2H), 3.28-3.22 (m, 1H), 2.19-2.08 (m, 1H), 1.92-1.75 (m, 3H), 1.68-1.57 (m, 1H), 1.13-1.07 (m, 3H), 1.04-0.94 (m, 5H), 0.85-0.77 (m, 2H); ESI MS (m/z): 397.2 [M+1].
606	<i>N</i> -(シクロヘキシル(オ キソ)(2-(ピリジン-3- イル)-2 <i>H</i> インダゾール- 5-イル)- λ^6 -スルファ ニリデン)アセトアミド	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, MeOD) δ 9.34 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 9.27 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.71 (dd, J = 4.9, 1.5 Hz, 1H), 8.57-8.53 (m, 2H), 7.97 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.73-7.69 (m, 2H), 4.60 (s, 1H), 3.51-3.45 (m, 1H), 2.35 (s, 1H), 2.14 (s, 3H), 1.94 (d, J = 15.2 Hz, 2H), 1.86 (d, J = 11.7 Hz, 1H), 1.69 (s, 1H), 1.49-1.30 (m, 4H); ESI MS (m/z): 382.9 [M+1].
607	<i>N</i> -(オキソ(ペンタン-2- イル)(2-(ピリジン-3- イル)-2 <i>H</i> インダゾール- 5-イル)- λ^6 -スルファ ニリデン)プロピオンア ミド	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, MeOD) δ 9.31 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 9.25 (s, 1H), 8.68 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.54-8.51 (m, 2H), 7.95-7.92 (m, 1H), 7.70-7.66 (m, 2H), 4.57 (s, 1H), 3.60-3.53 (m, 1H), 2.44-2.38 (m, 2H), 2.16-1.80 (m, 1H), 1.41 (d, J = 6.8 Hz, 2H), 1.24 (d, J = 6.8 Hz, 2H), 1.15-1.09 (m, 3H), 0.95 (t, J = 7.2 Hz, 2H), 0.86 (t, J = 7.2 Hz, 2H); ESI MS (m/z): 385.05 [M+1].
608	<i>N</i> -(オキソ(ペンタン-3- イル)(2-(ピリジン-3- イル)-2 <i>H</i> インダゾール- 5-イル)- λ^6 -スルファ ニリデン)プロピオンア ミド	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 9.29 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 8.76-8.74 (m, 2H), 8.49 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 8.44 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.88 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.66-7.62 (m, 2H), 3.30-3.24 (m, 1H), 2.44 (q, J = 7.5 Hz, 2H), 2.19-2.09 (m, 1H), 1.90-1.79 (m, 2H), 1.68-1.57 (m, 1H), 1.17-1.07 (m, 6H), 0.95 (t, J = 7.5 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 384.95 [M+1].
611	<i>N</i> -(オキソ(2-(ピリジン- 3-イル)-2 <i>H</i> インダゾ ール-5-イル)(3,3,3-トリ フルオロプロピル)- λ^6 -スルファニリデン) アセトアミド	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 9.21 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.73-8.71 (m, 2H), 8.66 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 8.30 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.89 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.72 (dd, J = 9.3, 1.7 Hz, 1H), 7.55-7.52 (m, 1H), 4.16-4.11 (m, 1H), 4.00-3.94 (m, 1H), 3.55-3.48 (m, 1H), 3.44-3.37 (m, 1H), 2.61-2.54 (m, 1H), 2.41-2.34 (m, 1H); ESI MS (m/z): 396.85 [M+1].
613	<i>N</i> -(ネオペンチル(オキ ソ)(2-(ピリジン-3-イ ル)-2 <i>H</i> インダゾール- 5-イル)- λ^6 -スルファニ リデン)アセトアミド	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, METHANOL-D4) δ 9.30 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.24 (s, 1H), 8.68 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.59 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 8.52 (dq, J = 8.4, 1.3 Hz, 1H), 7.94 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.76 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 7.69 (dd, J = 8.3, 4.9 Hz, 1H), 3.71 (d, J = 14.7 Hz, 1H), 3.47 (d, J = 14.7 Hz, 1H), 2.05 (d, J = 14.7 Hz, 3H), 1.12 (t, J = 14.7 Hz, 9H); ESI MS (m/z): 370.95 [M+1].
614	<i>N</i> -(ネオペンチル(オキ ソ)(2-(ピリジン-3-イ	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, METHANOL-D4) δ 9.30 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.24 (s, 1H), 8.67 (dd, J = 4.9, 1.2 Hz, 1H), 8.56 (d, J = 1.5 Hz, 1H),

10

20

30

40

50

【表 10-8】

	ル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)-λ ⁶ -スルファネリデン)シクロプロパンカルボキサミド	8.52 (dq, J = 8.3, 1.3 Hz, 1H), 7.93 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 7.74 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 7.69 (dd, J = 8.3, 4.9 Hz, 1H), 3.68 (d, J = 14.4 Hz, 1H), 3.42 (d, J = 14.5 Hz, 1H), 1.70-1.65 (m, 1H), 1.12 (d, J = 14.7 Hz, 9H), 0.98-0.81 (m, 4H); ESI MS (m/z): 397.1 [M+1].
616	<i>N</i> -(オキソ(プロピル)(2-(ピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)-λ ⁶ -スルファネリデン)アセトアミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.50 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 9.34 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.71 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.53-8.49 (m, 2H), 7.98 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.71-7.67 (m, 2H), 3.66-3.52 (m, 2H), 2.00 (s, 3H), 1.64-1.44 (m, 2H), 0.89 (t, J = 7.5 Hz, 3H) ESI MS (m/z): 343.05 [M+1].

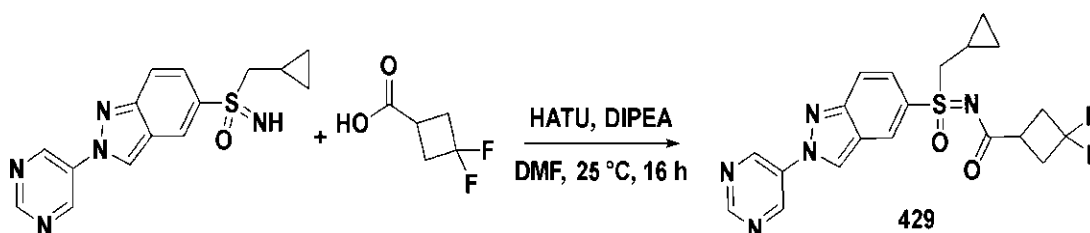
10

フッ素化アシル類似体については、対応する酸無水物を用いた。

【0253】

例 11：N-((シクロプロピルメチル)(オキソ)(2-(ピリミジン-5-イル)-2*H*-インダゾール-5-イル)-λ⁶-スルファネリデン)-3,3-ジフルオロシクロブタン-1-カルボキサミド 429 の合成

【化 42】



20

N, N-ジメチルホルムアミド (3 mL) 中の (シクロプロピルメチル) (イミノ) (2-(ピリミジン-5-イル)-2*H*-インダゾール-5-イル)-λ⁶-スルファノン (250 mg、0.798 ミリモル) の攪拌溶液に、3,3-ジフルオロシクロブタン-1-カルボン酸 (130 mg、0.957 ミリモル) および 1-[ビス(ジメチルアミノ)メチレン]-1*H*-1,2,3-トリアゾロ[4,5-*b*]ピリジニウム 3-オキシドヘキサフルオロリン酸 (455 mg、1.197 ミリモル) を 25 °C で加えた。次に、N, N-ジイソプロピルエチルアミン (0.278 mL、1.596 ミリモル) を加え、得られた混合物を 25 °C で 16 時間攪拌した。反応終了後、反応混合物を水 (10 mL) を加えてクエンチし、酢酸エチル (3 X 25 mL) で抽出し、食塩水 (1 X 25 mL) で洗浄した。有機層をさらに無水硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過し、減圧下で濃縮して粗ゴムを得た。粗化合物を分取 HPLC で精製し、所望の N-((シクロプロピルメチル)(オキソ)(2-(ピリミジン-5-イル)-2*H*-インダゾール-5-イル)-λ⁶-スルファネリデン)-3,3-ジフルオロシクロブタン-1-カルボキサミド 429 (88 mg、0.204 ミリモル、収率 26%) を得た。

30

【0254】

表 11：本開示の代表的な化合物を、例 11 に記載の適切な出発物質および方法に従って調製した。

40

50

【表 1 1 - 1】

化合物番号	化合物名	分析データ
420	1-シアノ-N-(イソプロピル(オキシ)(2-(ピリミジン-5-イル)-2H-インダゾール-5-イル)-λ ⁶ -スルファニリデン)シクロプロパン-1-カルボキサミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.58-9.56 (m, 3H), 9.33 (s, 1H), 8.53 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.03 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.64 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 3.91-3.85 (m, 1H), 1.64-1.46 (m, 4H), 1.36 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 1.17 (d, J = 6.6 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 394.6 [M+1].
423	N-(イソプロピル(オキシ)(2-(ピリミジン-5-イル)-2H-インダゾール-5-イル)-λ ⁶ -スルファニリデン)-1-メチルシクロプロパン-1-カルボキサミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.57-9.56 (m, 3H), 9.32 (s, 1H), 8.42 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 8.01-7.98 (m, 1H), 7.57 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 3.71 (q, J = 6.7 Hz, 1H), 1.28 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 1.21 (s, 3H), 1.15 (q, J = 2.8 Hz, 2H), 1.12 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.65 (dd, J = 9.0, 6.1 Hz, 2H); ESI MS (m/z): 384.1 [M+1].
425	1-シアノ-N-((2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル)(イソプロピル)(オキシ)-λ ⁶ -スルファニリデン)シクロプロパン-1-カルボキサミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.56 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 9.27 (s, 1H), 8.77 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.56 (dt, J = 9.8, 2.4 Hz, 1H), 8.50 (t, J = 0.9 Hz, 1H), 8.01 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.63 (dd, J = 9.3, 1.7 Hz, 1H), 3.91-3.85 (m, 1H), 1.62-1.46 (m, 4H), 1.36 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 1.17 (d, J = 6.6 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 412 [M+1].
426	1-シアノ-N-((シクロプロピルメチル)(オキシ)(2-(ピリミジン-5-イル)-2H-インダゾール-5-イル)-λ ⁶ -スルファニリデン)シクロプロパン-1-カルボキサミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.62 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 9.56 (d, J = 12.0 Hz, 2H), 9.33 (s, 1H), 8.61 (t, J = 0.9 Hz, 1H), 8.04 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.75 (dd, J = 9.3, 1.7 Hz, 1H), 3.77 (t, J = 7.6 Hz, 2H), 1.65-1.49 (m, 4H), 0.88-0.82 (m, 1H), 0.50-0.40 (m, 2H), 0.23-0.09 (m, 2H); ESI MS (m/z): 406.9 [M+1].
427	N-((シクロプロピルメチル)(オキシ)(2-(ピリミジン-5-イル)-2H-インダゾール-5-イル)-λ ⁶ -スルファニリデン)-3,3,3-トリフルオロ-2,2-ジメチルプロパンアミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.62 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 9.57 (s, 2H), 9.33 (s, 1H), 8.57 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.03 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.71 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 3.79-3.68 (m, 2H), 1.37 (d, J = 8.6 Hz, 6H), 0.83 (t, J = 7.6 Hz, 1H), 0.44-0.39 (m, 2H), 0.18-0.08 (m, 2H); ESI MS (m/z): 452.1 [M+1].
428	N-((シクロプロピルメチル)(オキシ)(2-(ピリミジン-5-イル)-2H-インダゾール-5-イル)-λ ⁶ -スル	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.59 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 9.56 (s, 2H), 9.32 (s, 1H), 8.54 (t, J = 0.9 Hz, 1H), 7.99 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.71 (dd, J = 9.3, 1.7 Hz, 1H), 3.65 (dq, J = 23.5, 7.3 Hz, 2H), 2.25-2.19 (m, 1H), 1.86 (d, J = 4.2 Hz, 2H), 1.70-1.58 (m, 3H), 1.38-1.13 (m, 5H), 0.81 (t, J = 7.3 Hz, 1H), 0.45-0.35 (m, 2H), 0.13-0.03 (m, 2H); ESI MS (m/z): 424.2 [M+1].

10

20

30

40

50

【表 1 1 - 2】

	ファニリデン)シクロヘキサンカルボキサミド	
429	<i>N</i> -((シクロプロピルメチル)(オキシ)(2-(ピリミジン-5-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)- λ^6 -スルファニリデン)-3,3-ジフルオロシクロブタン-1-カルボキサミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.59 (d, <i>J</i> = 1.0 Hz, 1H), 9.57 (s, 2H), 9.33 (s, 1H), 8.58 (d, <i>J</i> = 1.0 Hz, 1H), 8.01 (d, <i>J</i> = 9.3 Hz, 1H), 7.73 (dd, <i>J</i> = 9.3, 1.7 Hz, 1H), 3.72 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 2H), 3.03-2.99 (m, 1H), 2.84-2.74 (m, 4H), 0.83 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 0.47-0.37 (m, 2H), 0.16 (q, <i>J</i> = 4.7 Hz, 1H), 0.07-0.03 (m, 1H); ESI MS (<i>m/z</i>): 431.9 [M+1].
430	<i>N</i> -((シクロプロピルメチル)(オキシ)(2-(ピリミジン-5-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)- λ^6 -スルファニリデン)ブチルアミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.58-9.55 (m, 3H), 9.32 (d, <i>J</i> = 4.2 Hz, 1H), 8.55 (t, <i>J</i> = 0.9 Hz, 1H), 7.99 (d, <i>J</i> = 9.3 Hz, 1H), 7.72 (dd, <i>J</i> = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 3.66 (d, <i>J</i> = 7.3 Hz, 2H), 2.26 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 1.54 (td, <i>J</i> = 14.7, 7.4 Hz, 2H), 0.92-0.80 (m, 4H), 0.47-0.34 (m, 2H), 0.13 (td, <i>J</i> = 9.3, 4.9 Hz, 1H), 0.07-0.02 (m, 1H); ESI MS (<i>m/z</i>): 383.95 [M+1].
431	<i>N</i> -((シクロプロピルメチル)(オキシ)(2-(ピリミジン-5-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)- λ^6 -スルファニリデン)-1-フルオロシクロプロパン-1-カルボキサミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.60 (d, <i>J</i> = 1.0 Hz, 1H), 9.57 (s, 2H), 9.32 (d, <i>J</i> = 4.2 Hz, 1H), 8.58 (t, <i>J</i> = 0.9 Hz, 1H), 8.02 (d, <i>J</i> = 9.3 Hz, 1H), 7.72 (dd, <i>J</i> = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 3.72 (d, <i>J</i> = 7.3 Hz, 2H), 1.36-1.30 (m, 4H), 0.86-0.80 (m, 1H), 0.50-0.37 (m, 2H), 0.17 (td, <i>J</i> = 9.4, 4.8 Hz, 1H), 0.07 (td, <i>J</i> = 9.4, 4.8 Hz, 1H); ESI MS (<i>m/z</i>): 399.9 [M+1].
432	<i>N</i> -((シクロプロピルメチル)(オキシ)(2-(ピリミジン-5-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)- λ^6 -スルファニリデン)-2,2-ジフルオロシクロプロパン-1-カルボキサミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.60 (t, <i>J</i> = 1.2 Hz, 1H), 9.57 (d, <i>J</i> = 4.2 Hz, 2H), 9.33-9.30 (m, 1H), 8.58 (dq, <i>J</i> = 5.9, 0.8 Hz, 1H), 8.01 (dd, <i>J</i> = 9.0, 3.7 Hz, 1H), 7.73 (dt, <i>J</i> = 9.2, 1.5 Hz, 1H), 3.78-3.69 (m, 2H), 2.77-2.67 (m, 1H), 1.94-1.82 (m, 2H), 0.87-0.81 (m, 1H), 0.49-0.36 (m, 2H), 0.19-0.12 (m, 1H), 0.10-0.03 (m, 1H); ESI MS (<i>m/z</i>): 417.9 [M+1].
433	<i>N</i> -((シクロプロピルメチル)(オキシ)(2-(ピリミジン-5-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)- λ^6 -スルファニリデン)-2-フルオロシクロプロパン-1-カルボキサミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.58 (s, 1H), 9.56 (d, <i>J</i> = 0.7 Hz, 2H), 9.32 (d, <i>J</i> = 4.4 Hz, 1H), 8.56 (t, <i>J</i> = 0.9 Hz, 1H), 8.01-7.99 (m, 1H), 7.73 (dd, <i>J</i> = 9.3, 1.0 Hz, 1H), 4.98 (s, 1H), 3.69 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 2H), 2.17-2.08 (m, 1H), 1.49-1.41 (m, 1H), 1.19 (dt, <i>J</i> = 18.2, 6.4 Hz, 1H), 0.83 (s, 1H), 0.48-0.38 (m, 2H), 0.15 (dd, <i>J</i> = 8.8, 5.1 Hz, 1H), 0.07 (s, 1H); ESI MS (<i>m/z</i>): 399.85 [M+1].
434	<i>N</i> -((シクロプロピルメチル)(オキシ)(2-(ピリミジン-5-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)- λ^6 -スルファニリデン)-2-フルオロシクロプロパン-1-カルボキサミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.59 (d, <i>J</i> = 1.0 Hz, 1H), 9.57 (s, 2H), 9.32 (d, <i>J</i> = 4.4 Hz, 1H), 8.53 (d, <i>J</i> = 1.0 Hz, 1H), 8.00 (d, <i>J</i> = 9.3 Hz, 1H), 7.71 (qd, <i>J</i> = 4.6, 1.9 Hz, 1H), 3.66 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 2H), 2.98-2.89 (m, 1H), 2.32-2.29 (m, 1H), 2.27-2.20 (m, 2H), 1.77-1.68 (m, 2H), 1.08 (d, <i>J</i> = 6.4 Hz, 1H), 0.98 (d, <i>J</i> = 5.9 Hz,

10

20

30

40

50

【表 1 1 - 3】

	ル-5-イル)-λ ⁶ -スル ファニリデン)-3-メ チルシクロブタン- 1-カルボキサミド	2H), 0.83-0.78 (m, 1H), 0.47-0.34 (m, 2H), 0.17-0.11 (m, 1H), 0.07-0.02 (m, 1H); ESI MS (m/z): 410 [M+1].
435	N-((シクロプロピル メチル)(オキシ)(2- (ピリミジン-5-イ ル)-2H-インダゾ ル-5-イル)-λ ⁶ -スル ファニリデン)-2, 2- ジフルオロプロパンア ミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.62 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 9.57 (s, 2H), 9.33 (s, 1H), 8.63 (q, J = 0.8 Hz, 1H), 8.05 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.74 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 3.91-3.81 (m, 2H), 2.15-2.01 (m, 2H), 0.94 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 0.89-0.82 (m, 1H), 0.52-0.38 (m, 2H), 0.23 (td, J = 9.5, 4.8 Hz, 1H), 0.09 (td, J = 9.7, 4.5 Hz, 1H); ESI MS (m/z): 419.95 [M+1].
436	N-((シクロプロピル メチル)(オキシ)(2- (ピリミジン-5-イ ル)-2H-インダゾ ル-5-イル)-λ ⁶ -スル ファニリデン)シク ロペンタンカルボキ キサミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.59 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 9.56 (s, 2H), 9.32 (d, J = 4.2 Hz, 1H), 8.54 (q, J = 0.8 Hz, 1H), 8.00 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.71 (dd, J = 9.3, 1.7 Hz, 1H), 3.71-3.61 (m, 2H), 2.77-2.69 (m, 1H), 1.82-1.70 (m, 4H), 1.61-1.48 (m, 4H), 0.84- 0.78 (m, 1H), 0.46-0.34 (m, 2H), 0.15-0.03 (m, 2H); ; ESI MS (m/z): 409.9 [M+1].
437	N-((シクロプロピル メチル)(オキシ)(2- (ピリミジン-5-イ ル)-2H-インダゾ ル-5-イル)-λ ⁶ -スル ファニリデン)-2, 2- ジメチルシクロプロ パン-1-カルボキサ ミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.57 (dd, J = 6.9, 1.1 Hz, 3H), 9.32 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.53 (qd, J = 1.9, 0.9 Hz, 1H), 8.01-7.96 (m, 1H), 7.71 (dt, J = 9.2, 1.7 Hz, 1H), 3.65 (d, J = 7.0 Hz, 2H), 1.67-1.62 (m, 1H), 1.13 (d, J = 2.8 Hz, 3H), 1.08 (d, J = 22.9 Hz, 3H), 0.86-0.81 (m, 2H), 0.72 (q, J = 3.8 Hz, 1H), 0.46-0.35 (m, 2H), 0.15-0.11 (m, 1H), 0.03 (q, J = 4.7 Hz, 1H); ESI MS (m/z): 410 [M+1].
438	3-シアノ-N-((シク ロプロピルメチ ル)(オキシ)(2-(ピ リミジン-5-イル)- 2H-インダゾール-5- イル)-λ ⁶ -スルファ ニリデン)プロパン アミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.58-9.53 (m, 3H), 9.32 (d, J = 4.6 Hz, 1H), 8.60 (t, J = 0.9 Hz, 1H), 7.99 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.76 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 3.75-3.65 (m, 2H), 2.69-2.60 (m, 4H), 0.90-0.83 (m, 1H), 0.47-0.36 (m, 2H), 0.16-0.04 (m, 2H) ESI MS (m/z): 394.75 [M+1].
439	N-((シクロプロピル メチル)(オキシ)(2- (ピリミジン-5-イ ル)-2H-インダゾ ル-5-イル)-λ ⁶ -スル ファニリデン)-2- (イソプロピルチオ) アセトアミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.60 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 9.57 (s, 2H), 9.32 (d, J = 4.4 Hz, 1H), 8.58 (q, J = 0.8 Hz, 1H), 8.01 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.77-7.73 (m, 1H), 3.71-3.63 (m, 2H), 3.28-3.23 (m, 2H), 3.06-3.00 (m, 1H), 1.25-1.14 (m, 6H), 0.89-0.82 (m, 1H), 0.47-0.35 (m, 2H), 0.17-0.03 (m, 2H); ESI MS (m/z): 430.1 [M+1].
440	N-((シクロプロピル メチル)(オキシ)(2- (ピリミジン-5-イ ル)-2H-インダゾ ル-5-イル)-λ ⁶ -スル	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.59 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 9.57 (s, 2H), 9.32 (d, J = 4.4 Hz, 1H), 8.58 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.00 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.75 (dd, J = 9.3, 1.7 Hz, 1H), 3.73-3.63 (m, 2H), 3.22 (dd, J = 18.6, 13.9 Hz, 2H), 2.47 (d, J = 6.8 Hz, 2H), 1.82- 1.72 (m, 1H), 0.94-0.83 (m, 7H), 0.47-0.35 (m, 2H), 0.10 (tq, J = 18.1, 4.8 Hz, 2H); ESI MS (m/z): 444.3 [M+1].

10

20

30

40

50

【表 1 1 - 4】

	ファニリデン)-2-(イソブチルチオ)アセトアミド	
441	<i>N</i> -((シクロプロピルメチル)(オキシ)(2-(ピリミジン-5-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)- λ^6 -スルファニリデン)-1-メチルシクロプロパン-1-カルボキサミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.59 (d, <i>J</i> = 0.7 Hz, 1H), 9.56 (s, 2H), 9.32 (s, 1H), 8.52 (d, <i>J</i> = 1.0 Hz, 1H), 8.00 (d, <i>J</i> = 9.3 Hz, 1H), 7.70 (dd, <i>J</i> = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 3.67-3.58 (m, 2H), 1.25-1.20 (m, 3H), 1.16 (d, <i>J</i> = 2.9 Hz, 2H), 0.82-0.77 (m, 1H), 0.70-0.64 (m, 2H), 0.47-0.36 (m, 2H), 0.15-0.04 (m, 2H); ESI MS (<i>m/z</i>): 396.15 [<i>M</i> +1].
442	1-シアノ- <i>N</i> -((シクロプロピルメチル)(オキシ)(2-(ピリミジン-5-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)- λ^6 -スルファニリデン)シクロブタン-1-カルボキサミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.63 (d, <i>J</i> = 1.0 Hz, 1H), 9.57 (s, 2H), 9.33 (s, 1H), 8.63 (t, <i>J</i> = 0.9 Hz, 1H), 8.05 (d, <i>J</i> = 9.3 Hz, 1H), 7.76 (dd, <i>J</i> = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 3.82 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 2H), 2.66-2.52 (m, 4H), 2.15-1.96 (m, 2H), 0.87-0.82 (m, 1H), 0.50-0.39 (m, 2H), 0.21 (td, <i>J</i> = 9.2, 4.9 Hz, 1H), 0.14-0.08 (m, 1H); ESI MS (<i>m/z</i>): 421 [<i>M</i> +1].
443	<i>N</i> -((シクロプロピルメチル)(オキシ)(2-(ピリミジン-5-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)- λ^6 -スルファニリデン)-3,3-ジメチルシクロブタン-1-カルボキサミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.59 (d, <i>J</i> = 1.0 Hz, 1H), 9.57 (s, 2H), 9.32 (d, <i>J</i> = 4.4 Hz, 1H), 8.54 (q, <i>J</i> = 0.9 Hz, 1H), 7.99 (d, <i>J</i> = 9.3 Hz, 1H), 7.70 (dd, <i>J</i> = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 3.66 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 2H), 3.11-3.02 (m, 1H), 1.98-1.85 (m, 4H), 1.13 (s, 3H), 1.02 (t, <i>J</i> = 12.2 Hz, 3H), 0.83-0.79 (m, 1H), 0.45-0.36 (m, 2H), 0.16-0.11 (m, 1H), 0.07-0.02 (m, 1H); ESI MS (<i>m/z</i>): 424.4 [<i>M</i> +1].
444	<i>N</i> -((シクロプロピルメチル)(オキシ)(2-(ピリミジン-5-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)- λ^6 -スルファニリデン)-1-メチルシクロブタン-1-カルボキサミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.60 (d, <i>J</i> = 0.7 Hz, 1H), 9.57 (s, 2H), 9.32 (d, <i>J</i> = 4.4 Hz, 1H), 8.54 (q, <i>J</i> = 0.9 Hz, 1H), 8.00 (d, <i>J</i> = 9.3 Hz, 1H), 7.72 (dd, <i>J</i> = 9.3, 1.7 Hz, 1H), 3.73-3.62 (m, 2H), 2.44-2.36 (m, 2H), 1.93-1.84 (m, 1H), 1.76-1.69 (m, 3H), 1.36 (d, <i>J</i> = 9.8 Hz, 3H), 0.83-0.78 (m, 1H), 0.46-0.36 (m, 2H), 0.15-0.05 (m, 2H); ESI MS (<i>m/z</i>): 410.45 [<i>M</i> +1].
445	<i>N</i> -((2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)(イソプロピル)(オキシ)- λ^6 -スルファニリデン)シクロヘキササンカルボキサミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.55 (d, <i>J</i> = 0.9 Hz, 1H), 9.27 (s, 1H), 8.76 (d, <i>J</i> = 2.8 Hz, 1H), 8.56 (dt, <i>J</i> = 9.8, 2.3 Hz, 1H), 8.41 (d, <i>J</i> = 0.9 Hz, 1H), 7.97 (d, <i>J</i> = 9.2 Hz, 1H), 7.58 (dd, <i>J</i> = 9.3, 1.7 Hz, 1H), 3.79-3.72 (m, 1H), 2.22 (qd, <i>J</i> = 7.2, 3.6 Hz, 1H), 1.89-1.82 (m, 2H), 1.68 (t, <i>J</i> = 4.4 Hz, 2H), 1.59 (d, <i>J</i> = 11.6 Hz, 1H), 1.37-1.12 (m, 11H); ESI MS (<i>m/z</i>): 429.3 [<i>M</i> +1].
449	<i>N</i> -((シクロプロピルメチル)(2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)(オキ	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.58 (s, 1H), 9.28 (s, 1H), 8.76 (d, <i>J</i> = 2.4 Hz, 1H), 8.58-8.54 (m, 1H), 8.49 (s, 1H), 7.98 (d, <i>J</i> = 9.0 Hz, 1H), 7.69 (dd, <i>J</i> = 9.3, 1.7 Hz, 1H), 3.63-3.61 (m, 2H), 1.24 (d, <i>J</i> = 8.8 Hz, 3H), 1.16 (d, <i>J</i> = 2.9 Hz, 2H), 0.79 (t, <i>J</i> = 7.6 Hz, 1H), 0.65 (d, <i>J</i> = 3.2 Hz, 2H), 0.44-0.40 (m, 2H), 0.14-0.06 (m, 2H); ESI MS (<i>m/z</i>): 413 [<i>M</i> +1].

10

20

30

40

【表 1 1 - 5】

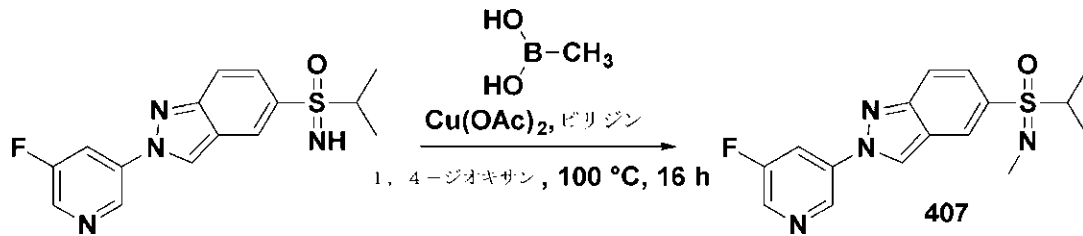
	ソ)- λ^6 -スルファニリデン)-1-メチルシクロプロパン-1-カルボキサミド	
--	---	--

【0 2 5 5】

例 1 2 : (2 - (5 - フルオロピリジン - 3 - イル) - 2 *H* - インダゾール - 5 - イル) (イソプロピル) (メチルイミノ) - λ^6 - スルファノン 4 0 7 の合成

50

【化 4 3】



(2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル)(イミノ)(イソプロピル)-λ⁶-スルファノン(300mg、0.942ミリモル)の1,4-ジオキサン(15mL)中の脱気攪拌溶液に、酢酸銅(II)(257mg、1.413ミリモル)、ピリジン(0.183mL、2.262ミリモル)およびメチルボロン酸(282mg、4.71ミリモル)を加えた。得られた混合物を還流条件下(100°C)で16時間攪拌した。反応終了後、1,4-ジオキサンを減圧除去し、反応混合物を酢酸エチル(60mL)で希釈した。有機層を水(3×20mL)で抽出し、食塩水(1×25mL)で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。その後、減圧下で濃縮して粗固体を得た。粗物質をさらに分取HPLCで精製して、所望の2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル)(イソプロピル)(メチルイミノ)-λ⁶-スルファノン407(175mg、0.526ミリモル、収率56%)を得た。

10

20

【0256】

表12：本開示の代表的な化合物を、例12に記載の適切な出発物質および方法に従って調製した。

30

40

50

【表 1 2 - 1】

化合物番号	化合物名	分析データ
405	(シクロプロピルイミノ) (2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル) (イソプロピル)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.50 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 9.26 (s, 1H), 8.75 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.54 (dt, J = 9.8, 2.3 Hz, 1H), 8.38 (s, 1H), 7.93 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.63 (dd, J = 9.0, 1.7 Hz, 1H), 3.44-3.38 (m, 1H), 2.33-2.28 (m, 1H), 1.24 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 1.07 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.41-0.34 (m, 2H), 0.32-0.21 (m, 2H); ESI MS (m/z): 358.55 [M+1].
406	(シクロプロピルイミノ) (イソプロピル) (2-(ピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.46 (s, 1H), 9.33 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.70 (dd, J = 4.6, 1.2 Hz, 1H), 8.50 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 8.38 (s, 1H), 7.93 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.68 (q, J = 4.3 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 3.43-3.37 (m, 1H), 2.32-2.28 (m, 1H), 1.24 (d, J = 6.7 Hz, 3H), 1.07 (d, J = 6.7 Hz, 3H), 0.41-0.34 (m, 2H), 0.32-0.22 (m, 2H); ESI MS (m/z): 341.35 [M+1].
407	(2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル) (イソプロピル) (メチルイミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.50 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 9.26 (q, J = 0.7 Hz, 1H), 8.75 (d, J = 3.1 Hz, 1H), 8.55 (dt, J = 9.8, 2.3 Hz, 1H), 8.31 (q, J = 0.8 Hz, 1H), 7.93 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.57 (dd, J = 9.2, 1.5 Hz, 1H), 3.43-3.36 (m, 1H), 2.53 (s, 3H), 1.25 (d, J = 6.7 Hz, 3H), 1.10 (d, J = 7.0 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 333.1 [M+1].
408	イソプロピル(メチルイミノ) (2-(ピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.45 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 9.33 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.70 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.50 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 8.31 (q, J = 0.8 Hz, 1H), 7.94 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.68 (ddd, J = 8.3, 4.6, 0.7 Hz, 1H), 7.56 (dd, J = 9.0, 1.7 Hz, 1H), 3.42-3.35 (m, 1H), 2.53 (s, 3H), 1.26-1.22 (m, 3H), 1.11 (d, J = 6.8 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 315.35 [M+1].
412	(シクロプロピルイミノ) (シクロプロピルメチル) (2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.51 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 9.27 (s, 1H), 8.74 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.55 (dt, J = 9.8, 2.3 Hz, 1H), 8.43 (q, J = 0.8 Hz, 1H), 7.92 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.69 (dd, J = 9.3, 1.7 Hz, 1H), 3.26 (d, J = 7.1 Hz, 2H), 2.35-2.30 (m, 1H), 0.90-0.83 (m, 1H), 0.44-0.35 (m, 3H), 0.34-0.22 (m, 3H), 0.12 (td, J = 9.7, 4.8 Hz, 1H), -0.06 (dt, J = 14.9, 4.6 Hz, 1H); ESI MS (m/z): 371 [M+1].
414	(シクロプロピルメチル) (2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル) (メチルイミノ)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.50 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 9.27 (s, 1H), 8.75 (q, J = 2.8 Hz, 1H), 8.55 (dt, J = 9.9, 2.3 Hz, 1H), 8.38 (q, J = 0.8 Hz, 1H), 7.92 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.64 (dd, J = 9.0, 1.7 Hz, 1H), 3.26-3.24 (m, 2H), 2.54 (s, 3H), 0.93-0.86 (m, 1H), 0.45-0.30 (m, 2H), 0.04 (dtd, J = 55.2, 9.6, 4.8 Hz, 2H); ESI MS (m/z): 344.9 [M+1].
446	(シクロプロピルイミノ) (シクロプロピルメチル) (2-(ピリミジン-5-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.55 (s, 2H), 9.54-9.53 (m, 1H), 9.31 (s, 1H), 8.46 (s, 1H), 7.94 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.69 (dd, J = 9.2, 1.5 Hz, 1H), 3.26 (d, J = 7.3 Hz, 2H), 2.36-2.31 (m, 1H), 0.90-0.84 (m, 1H), 0.44-0.21 (m, 6H), 0.11 (td, J = 9.7, 4.8 Hz, 1H), -0.07 (td, J = 9.7, 4.9 Hz, 1H); ESI MS (m/z): 354 [M+1].
447	(シクロプロピルメチル) (メチルイミ	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.55 (d, J = 4.3 Hz, 2H), 9.52 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 9.31-9.29 (m, 1H), 8.40 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 7.93 (q, J = 4.7 Hz, 1H), 7.65 (dd, J = 9.2, 1.5 Hz, 1H), 3.27-3.24

10

20

30

40

【表 1 2 - 2】

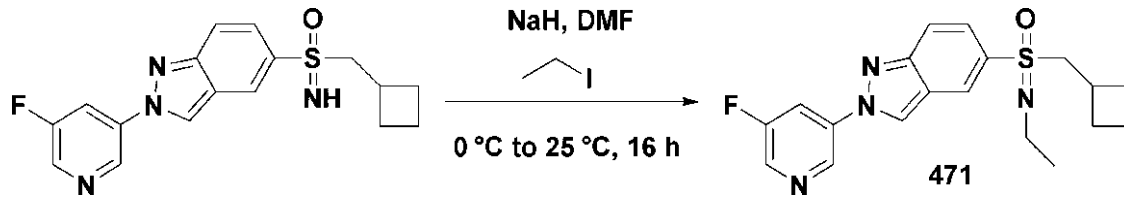
ノ) (2-(ピリミジン-5-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-yl)-λ ⁶ -スルファノン	(m, 2H), 2.53 (d, J = 3.7 Hz, 3H), 0.94-0.87 (m, 1H), 0.45-0.30 (m, 2H), 0.11 (td, J = 9.5, 4.9 Hz, 1H), -0.03 (td, J = 9.6, 4.8 Hz, 1H); ESI MS (m/z): 328.1 [M+1].
--	--

【0 2 5 7】

例 1 3 : (シクロブチルメチル) (エチルイミノ) (2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2*H*-インダゾール-5-イル)-λ⁶-スルファノン 4 7 1 の合成

50

【化 4 4】



(シクロブチルメチル) (2- (5-フルオロピリジン-3-イル) -2H-インダゾール-5-イル) (イミノ) -λ⁶-スルファノン (250 mg、0.726ミリモル) のN,N-ジメチルホルムアミド中攪拌溶液 (6 mL) に、窒素雰囲気下、0 °Cで水素化ナトリウム (鉱物油中60%分散液、58.1 mg、1.452ミリモル) を加え、さらに25 °Cで15分間攪拌した。その後、0 °Cに冷却し、同温度でさらに1-ヨードエタン (0.117 mL、1.452ミリモル) を加えた。得られた反応混合物を25 °Cで16時間攪拌した。反応終了後、反応塊を水に注ぎ、水層を酢酸エチル (3 X 20 mL) で抽出した。有機層を分離し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過し、減圧濃縮して粗固体を得た。粗物質を分取HPLCで精製し、所望の(シクロブチルメチル) (エチルイミノ) (2- (5-フルオロピリジン-3-イル) -2H-インダゾール-5-イル) -λ⁶-スルファノン 471 (167 mg、0.448ミリモル、収率62%) を得た。

【0258】

表13：本開示の代表的な化合物を、例13に記載の適切な出発物質および方法に従って調製した。

10

20

30

40

50

【表 13-1】

化合物番号	化合物名	分析データ
382	(エチルイミノ)(イソプロピル)(2-(ピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-4-イル)- λ^6 -スルファノン	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{DMSO-}d_6$) δ 9.33 (d, $J = 2.4$ Hz, 1H), 9.16 (d, $J = 0.9$ Hz, 1H), 8.69 (dd, $J = 4.7, 1.4$ Hz, 1H), 8.51 (dq, $J = 8.3, 1.4$ Hz, 1H), 8.05 (d, $J = 8.6$ Hz, 1H), 7.66-7.60 (m, 2H), 7.54 (dd, $J = 8.6, 7.0$ Hz, 1H), 3.56-3.49 (m, 1H), 2.99-2.92 (m, 1H), 2.89-2.83 (m, 1H), 1.32 (t, $J = 7.0$ Hz, 3H), 1.11-1.02 (m, 6H); ESI MS (m/z): 329.15 [$M+1$].
383	(エチルイミノ)(イソプロピル)(2-(ピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)- λ^6 -スルファノン	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{DMSO-}d_6$) δ 9.45 (d, $J = 0.7$ Hz, 1H), 9.33 (d, $J = 2.4$ Hz, 1H), 8.70 (dd, $J = 4.8, 1.3$ Hz, 1H), 8.50 (dq, $J = 8.3, 1.4$ Hz, 1H), 8.32 (s, 1H), 7.93 (d, $J = 9.3$ Hz, 1H), 7.68 (dd, $J = 8.3, 4.6$ Hz, 1H), 7.58 (dd, $J = 9.2, 1.6$ Hz, 1H), 3.41-3.34 (m, 1H), 2.94-2.86 (m, 1H), 2.84-2.75 (m, 1H), 1.26-1.22 (m, 3H), 1.10-1.05 (m, 6H); ESI MS (m/z): 328.55 [$M+1$].
388	(シクロプロピルメチル)(エチルイミノ)(2-(ピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)- λ^6 -スルファノン	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{DMSO-}d_6$) δ 9.46 (s, 1H), 9.34 (s, 1H), 8.70 (d, $J = 4.6$ Hz, 1H), 8.50 (d, $J = 7.1$ Hz, 1H), 8.38 (s, 1H), 7.91 (d, $J = 9.0$ Hz, 1H), 7.70-7.64 (m, 2H), 3.24 (d, $J = 7.1$ Hz, 2H), 2.94-2.79 (m, 2H), 1.07 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H), 0.87 (d, $J = 7.6$ Hz, 1H), 0.43-0.38 (m, 1H), 0.33 (dd, $J = 13.8, 4.5$ Hz, 1H), 0.14-0.09 (m, 1H), -0.02--0.07 (m, 1H); ESI MS (m/z): 341.05 [$M+1$].
390	ブチル(エチルイミノ)(2-(ピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)- λ^6 -スルファノン	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{DMSO-}d_6$) δ 9.45 (d, $J = 0.9$ Hz, 1H), 9.33 (d, $J = 2.4$ Hz, 1H), 8.70 (dd, $J = 4.7, 1.4$ Hz, 1H), 8.50 (dq, $J = 8.3, 1.4$ Hz, 1H), 8.36 (d, $J = 0.9$ Hz, 1H), 7.93 (d, $J = 9.2$ Hz, 1H), 7.70-7.66 (m, 1H), 7.62 (dd, $J = 9.2, 1.8$ Hz, 1H), 3.27-3.21 (m, 2H), 2.93-2.85 (m, 1H), 2.81-2.72 (m, 1H), 1.63-1.52 (m, 1H), 1.50-1.39 (m, 1H), 1.34-1.25 (m, 2H), 1.10-1.04 (m, 3H), 0.86-0.77 (m, 3H); ESI MS (m/z): 343.1 [$M+1$].
391	エチル(エチルイミノ)(2-(ピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)- λ^6 -スルファノン	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{DMSO-}d_6$) δ 9.46 (d, $J = 1.0$ Hz, 1H), 9.33 (d, $J = 2.4$ Hz, 1H), 8.70 (dd, $J = 4.6, 1.5$ Hz, 1H), 8.44-8.56 (1H), 8.35 (t, $J = 0.9$ Hz, 1H), 7.93 (d, $J = 9.0$ Hz, 1H), 7.61 (dd, $J = 9.3, 1.7$ Hz, 2H), 3.26 (dd, $J = 7.5, 5.7$ Hz, 2H), 2.89 (s, 1H), 2.80 (d, $J = 7.3$ Hz, 1H), 1.07 (td, $J = 7.2, 5.4$ Hz, 6H); ESI MS (m/z): 315.05 [$M+1$].
397	(エチルイミノ)(2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-5-イル)(イソプロピル)- λ^6 -スルファノン	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{DMSO-}d_6$) δ 9.50 (s, 1H), 9.26 (s, 1H), 8.75 (d, $J = 2.4$ Hz, 1H), 8.54 (dt, $J = 9.7, 2.3$ Hz, 1H), 8.32 (s, 1H), 7.93 (d, $J = 9.0$ Hz, 1H), 7.59 (dd, $J = 9.3, 1.7$ Hz, 1H), 3.39 (t, $J = 6.8$ Hz, 1H), 2.93-2.86 (m, 1H), 2.83-2.77 (m, 1H), 1.26 (d, $J = 6.8$ Hz, 3H), 1.07 (dd, $J = 13.0, 6.8$ Hz, 6H); ESI MS (m/z): 347 [$M+1$].
400	(エチルイミノ)(2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -ピラゾロ[3,4- <i>b</i>]ピリジン-5-イル)(イソプロピル)- λ^6 -スルファノン	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{DMSO-}d_6$) δ 9.52 (s, 1H), 9.29 (s, 1H), 8.90 (d, $J = 2.2$ Hz, 1H), 8.79 (d, $J = 2.2$ Hz, 2H), 8.60 (dd, $J = 9.8, 2.4$ Hz, 1H), 3.50 (t, $J = 6.7$ Hz, 1H), 2.96-2.89 (m, 1H), 2.87-2.80 (m, 1H), 1.27 (d, $J = 6.6$ Hz, 3H), 1.13 (d, $J = 6.8$ Hz, 3H), 1.08 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H); ESI MS (m/z): 348 [$M+1$].
411	(シクロプロピルメチル)(エチルイミノ)(2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2 <i>H</i> -インダゾール-	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{DMSO-}d_6$) δ 9.50 (d, $J = 0.9$ Hz, 1H), 9.27 (s, 1H), 8.74 (d, $J = 2.4$ Hz, 1H), 8.54 (dt, $J = 9.9, 2.4$ Hz, 1H), 8.38 (d, $J = 0.6$ Hz, 1H), 7.91 (d, $J = 9.2$ Hz, 1H), 7.66 (dd, $J = 9.2, 1.5$ Hz, 1H), 3.24 (d, $J = 7.3$ Hz, 2H), 2.96-2.88 (m, 1H), 2.86-2.77 (m, 1H), 1.07 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H), 0.91-0.85 (m, 1H), 0.45-0.38 (m, 1H),

10

20

30

40

50

【表 13-2】

	5-イル)-λ ⁶ -スルファノン	0.35-0.29 (m, 1H), 0.11 (td, J = 9.6, 4.9 Hz, 1H), -0.05 (td, J = 9.9, 4.8 Hz, 1H); ESI MS (m/z): 358.95 [M+1].
419	(エチルイミノ)(イソプロピル)(2-(ピリミジン-5-イル)-2H-インダゾール-5-イル)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.54 (s, 2H), 9.51 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 9.31 (s, 1H), 8.34 (t, J = 0.8 Hz, 1H), 7.94 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.60 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 3.42-3.36 (m, 1H), 2.94-2.86 (m, 1H), 2.83-2.75 (m, 1H), 1.26-1.21 (m, 3H), 1.10-1.03 (m, 6H); ESI MS (m/z): 329.5 [M+1].
457	エチル(エチルイミノ)(2-(ピリミジン-5-イル)-2H-インダゾール-5-イル)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.55 (s, 2H), 9.52 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 9.31 (s, 1H), 8.38 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 7.95 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.64 (dd, J = 9.2, 1.5 Hz, 1H), 3.30-3.23 (m, 2H), 2.92-2.86 (m, 1H), 2.83-2.76 (m, 1H), 1.07 (dd, J = 13.3, 7.2 Hz, 6H); ESI MS (m/z): 316 [M+1].
461	エチル(エチルイミノ)(2-(5-フルオロシクロピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.50 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 9.26 (s, 1H), 8.74 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.54 (dt, J = 9.9, 2.3 Hz, 1H), 8.35 (t, J = 0.7 Hz, 1H), 7.93 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 9.0, 1.7 Hz, 1H), 3.30-3.21 (m, 2H), 2.94-2.86 (m, 1H), 2.83-2.74 (m, 1H), 1.07 (q, J = 7.1 Hz, 6H); ESI MS (m/z): 332.95 [M+1].
466	(シクロブチルメチル)(エチルイミノ)(2-(ピリミジン-5-イル)-2H-インダゾール-5-イル)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.55 (s, 2H), 9.51 (s, 1H), 9.31 (s, 1H), 8.37 (s, 1H), 7.93 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.63 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 3.42 (td, J = 14.0, 7.2 Hz, 2H), 2.90-2.83 (m, 1H), 2.80-2.73 (m, 1H), 2.59 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 1.95-1.92 (m, 1H), 1.73-1.64 (m, 4H), 1.56-1.51 (m, 1H), 1.05 (t, J = 7.2 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 356.05 [M+1].
471	(シクロブチルメチル)(エチルイミノ)(2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 9.05 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 8.68 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.59 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.43 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 8.13 (dt, J = 9.0, 2.4 Hz, 1H), 7.89 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.68 (dd, J = 9.2, 1.5 Hz, 1H), 3.45-3.34 (m, 2H), 3.10-3.01 (m, 1H), 2.94-2.86 (m, 1H), 2.81-2.73 (m, 1H), 2.14-2.06 (m, 1H), 1.92-1.71 (m, 4H), 1.58-1.50 (m, 1H), 1.20 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 373.2 [M+1].
474	(エチルイミノ)(メチル)(2-(ピリミジン-5-イル)-2H-インダゾール-5-イル)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 9.38 (d, J = 3.4 Hz, 2H), 9.33 (s, 1H), 8.71 (s, 1H), 8.54 (s, 1H), 7.96 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.77 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 3.25 (s, 3H), 3.12-3.02 (m, 1H), 2.92 (dt, J = 19.8, 7.0 Hz, 1H), 1.22 (q, J = 6.7 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 302.15 [M+1].
489	(エチルイミノ)(2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル)(プロピル)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.50 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 9.26 (s, 1H), 8.74 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.54 (dt, J = 9.8, 2.3 Hz, 1H), 8.36 (q, J = 0.8 Hz, 1H), 7.93 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.63 (dd, J = 9.0, 1.7 Hz, 1H), 3.23 (t, J = 7.9 Hz, 2H), 2.93-2.85 (m, 1H), 2.81-2.73 (m, 1H), 1.66-1.46 (m, 2H), 1.05 (t, J = 7.1 Hz, 3H), 0.87 (t, J = 7.5 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 346.95 [M+1].
490	sec-ブチル(エチルイミノ)(2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.49 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 9.26 (s, 1H), 8.75 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.54 (dt, J = 9.9, 2.4 Hz, 1H), 8.32 (s, 1H), 7.92 (dd, J = 9.0, 0.7 Hz, 1H), 7.59 (dd, J = 9.3, 1.7 Hz, 1H), 3.20-3.12 (m, 1H), 2.94-2.86 (m, 1H), 2.84-2.76 (m, 1H), 1.40-1.27 (m, 1H), 1.24 (d, J = 6.8 Hz, 2H), 1.09-1.05 (m, 5H), 0.89 (dt, J = 32.4, 7.5 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 361 [M+1].

10

20

30

40

50

【表 13-3】

491	(エチルイミノ)(3-フルオロプロピル)(2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.51 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 9.27 (s, 1H), 8.75 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.55 (dt, J = 9.9, 2.3 Hz, 1H), 8.39 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 7.94 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.65 (dd, J = 9.0, 1.7 Hz, 1H), 4.47 (dt, J = 47.1, 6.0 Hz, 2H), 3.38-3.33 (m, 2H), 2.95-2.76 (m, 2H), 2.04-1.84 (m, 2H), 1.07 (t, J = 7.2 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 364.9 [M+1].
492	(エチルイミノ)(2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル)(ペンタン-3-イル)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.49 (s, 1H), 9.26 (s, 1H), 8.75 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.54 (dt, J = 9.9, 2.3 Hz, 1H), 8.33 (s, 1H), 7.92 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.60 (dd, J = 9.2, 1.6 Hz, 1H), 3.06-3.00 (m, 1H), 2.89 (dt, J = 19.4, 7.2 Hz, 1H), 2.77 (dt, J = 19.4, 7.2 Hz, 1H), 1.98-1.90 (m, 1H), 1.79-1.68 (m, 2H), 1.54-1.46 (m, 1H), 1.07 (dd, J = 14.1, 6.7 Hz, 3H), 0.96 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 0.84 (t, J = 7.6 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 375 [M+1].
567	シクロブチル(エチルイミノ)(2-(ピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.45 (dd, J = 7.0, 0.9 Hz, 1H), 9.33 (q, J = 2.4 Hz, 1H), 8.70 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.52-8.48 (m, 1H), 8.33 (q, J = 0.8 Hz, 1H), 7.91 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.69-7.65 (m, 1H), 7.57 (dd, J = 9.2, 1.5 Hz, 1H), 4.13-4.05 (m, 1H), 2.94-2.85 (m, 1H), 2.84-2.74 (m, 1H), 2.23-2.15 (m, 2H), 1.91-1.75 (m, 3H), 1.07-1.03 (m, 4H); ESI MS (m/z): 340.95 [M+1].
568	(シクロヘキシルメチル)(エチルイミノ)(2-(ピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.44 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 9.33 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.70 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.50 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 8.37 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 7.92 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.69-7.62 (m, 2H), 3.17 (dd, J = 6.0, 1.7 Hz, 2H), 2.85 (dd, J = 12.2, 7.3 Hz, 1H), 2.72 (dd, J = 12.2, 7.0 Hz, 1H), 1.84 (d, J = 3.1 Hz, 2H), 1.56 (d, J = 43.4 Hz, 4H), 1.09-1.02 (m, 8H); ESI MS (m/z): 383.05 [M+1].
585	(エチルイミノ)(ペンタン-3-イル)(2-(ピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.44 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 9.32 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.70 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.49 (dq, J = 8.3, 1.3 Hz, 1H), 8.32 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 7.92 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.68 (dd, J = 8.3, 4.9 Hz, 1H), 7.59 (dd, J = 9.2, 1.6 Hz, 1H), 3.05-2.99 (m, 1H), 2.93-2.85 (m, 1H), 2.81-2.73 (m, 1H), 1.94 (qd, J = 7.3, 4.6 Hz, 1H), 1.79-1.66 (m, 2H), 1.55-1.44 (m, 1H), 1.10-1.02 (m, 3H), 0.96 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 0.84 (t, J = 7.6 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 357.05 [M+1].
586	シクロペンチル(エチルイミノ)(2-(ピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.44 (s, 1H), 9.33 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 8.70 (d, J = 4.0 Hz, 1H), 8.50 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 8.34 (s, 1H), 7.92 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.68 (dd, J = 8.3, 4.9 Hz, 1H), 7.61 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 3.77 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 2.91-2.84 (m, 1H), 2.76 (dt, J = 19.4, 7.1 Hz, 1H), 2.11 (dd, J = 13.4, 7.6 Hz, 1H), 1.94 (d, J = 5.5 Hz, 1H), 1.73 (dd, J = 12.2, 7.0 Hz, 1H), 1.54 (dd, J = 15.3, 6.7 Hz, 4H), 1.48 (t, J = 6.6 Hz, 1H), 1.04 (t, J = 7.2 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 354.95 [M+1].
587	シクロヘプチル(エチルイミノ)(2-(ピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.44 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 9.32 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.70 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.49 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 8.31 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 7.91 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.70-7.66 (m, 1H), 7.58 (dd, J = 9.0, 1.7 Hz, 1H), 3.28-3.23 (m, 1H), 2.94-2.85 (m, 1H), 2.82-2.74 (m, 1H), 2.30-2.23 (m, 1H), 1.97-1.91 (m, 1H), 1.68-1.59 (m, 3H), 1.54-1.31 (m, 7H), 1.05 (q, J = 7.2 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 382.95 [M+1].
588	(2-シクロヘキシルエチル)(エチルイミノ)(2-(ピリジン-3-イル)-2H-イン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.45 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 9.33 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.70 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.50 (dq, J = 8.3, 1.3 Hz, 1H), 8.35 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 7.92 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.68 (dd, J = 8.3, 4.9 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 3.28-3.23 (m,

10

20

30

40

【表 1 3 - 4】

	ダゾール-5-イル)- λ ⁶ -スルファノン	2H), 2.91-2.84 (m, 1H), 2.81-2.74 (m, 1H), 1.59-1.47 (m, 6H), 1.36-1.30 (m, 1H), 1.24-1.20 (m, 1H), 1.11-1.01 (m, 6H), 0.77 (t, J = 10.5 Hz, 2H); ESI MS (m/z): 397 [M+1].
589	(エチルイミノ)(イ ソブチル)(2-(ピリ ジン-3-イル)-2H- インダゾール-5-イ ル)-λ ⁶ -スルファノ ン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.45 (s, 1H), 9.33 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 8.70 (d, J = 3.7 Hz, 1H), 8.51-8.49 (m, 1H), 8.37 (s, 1H), 7.93 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.68 (dd, J = 8.3, 4.9 Hz, 1H), 7.63 (dd, J = 9.2, 1.5 Hz, 1H), 3.23-3.12 (m, 2H), 2.89-2.82 (m, 1H), 2.78-2.71 (m, 1H), 2.11-2.05 (m, 1H), 1.04 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.98 (d, J = 6.7 Hz, 3H), 0.87 (d, J = 6.7 Hz, 3H) ESI MS (m/z): 343 [M+1].
595	シクロヘキシル(エ チルイミノ)(2-(ピ リジン-3-イル)- 2H-インダゾール- 5-イル)-λ ⁶ -スルフ アノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.48 (s, 1H), 9.33 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.71 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.51 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 8.44 (s, 1H), 7.97 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.69 (dd, J = 8.2, 4.8 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 9.3, 1.2 Hz, 1H), 3.62-3.58 (m, 1H), 2.00 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 1.35-1.11 (m, 6H), 0.83 (dt, J = 36.4, 7.2 Hz, 3H) ESI MS (m/z): 369 [M+1].
597	(エチルイミノ)(2- (ピリジン-3-イ ル)-2H-インダゾー ル-5-イル)((テト ラヒドロフラン-2- イル)メチル)-λ ⁶ - スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.45 (dd, J = 6.1, 0.9 Hz, 1H), 9.33 (d, J = 2.8 Hz, 1H), 8.71-8.69 (m, 1H), 8.52-8.48 (m, 1H), 8.38-8.35 (m, 1H), 7.90 (q, J = 4.6 Hz, 1H), 7.69-7.62 (m, 2H), 4.14 (td, J = 6.2, 2.5 Hz, 1H), 3.54-3.40 (m, 5H), 2.93-2.73 (m, 2H), 1.77-1.68 (m, 2H), 1.63-1.48 (m, 1H), 1.09-1.03 (m, 3H) ESI MS (m/z): 370.95 [M+1].
603	4-(N-エチル-2-(ピ リジン-3-イル)- 2H-インダゾール- 5-スルホニイミド イル)ブタンニトリ ル	¹ H-NMR (400 MHz, MeOD) δ 9.32 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 9.25 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.69 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.55-8.52 (m, 2H), 7.97-7.95 (m, 1H), 7.72-7.68 (m, 2H), 3.46-3.42 (m, 2H), 3.08-3.00 (m, 1H), 2.97-2.89 (m, 1H), 2.62 (t, J = 7.2 Hz, 2H), 2.13-1.95 (m, 2H), 1.19 (t, J = 7.2 Hz, 3H) ESI MS (m/z): 353.9 [M+1].
604	(エチルイミノ)(イ ソブチル)(2-(ピ リジン-3-イル)- 2H-インダゾール- 5-イル)-λ ⁶ -スルフ アノン	¹ H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 9.22 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.74-8.73 (m, 1H), 8.69 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.50 (s, 1H), 8.30 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.95-7.90 (m, 1H), 7.71 (dd, J = 9.3, 1.7 Hz, 1H), 7.56-7.52 (m, 1H), 3.49-3.27 (m, 2H), 3.13-3.05 (m, 1H), 2.99-2.90 (m, 1H), 1.78-1.68 (m, 1H), 1.67-1.57 (m, 1H), 1.50-1.41 (m, 1H), 1.25-1.21 (m, 3H), 0.86 (dd, J = 8.7, 6.5 Hz, 6H); ESI MS (m/z): 357.05 [M+1].
612	(エチルイミノ)(2- (ピリジン-3-イ ル)-2H-インダゾー ル-5-イル)(3,3,3- トリフルオロプロ ピル)-λ ⁶ -スルフ アノン	¹ H-NMR (400 MHz, METHANOL-D ₄) δ 9.31 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.24 (s, 1H), 8.68 (dd, J = 4.6, 1.2 Hz, 1H), 8.54-8.51 (m, 2H), 7.96 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.73-7.67 (m, 2H), 3.59-3.48 (m, 2H), 3.07-2.92 (m, 2H), 2.76-2.48 (m, 2H), 1.19 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 382.9 [M+1].
615	(エチルイミノ)(ペ ンタン-2-イル)(2- (ピリジン-3-イ ル)-2H-インダゾー ル-5-イル)-λ ⁶ -ス ルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 9.22 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.73 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.65 (t, J = 1.2 Hz, 1H), 8.39 (s, 1H), 8.32-8.29 (m, 1H), 7.90 (dd, J = 9.2, 1.2 Hz, 1H), 7.66 (dt, J = 9.2, 1.4 Hz, 1H), 7.54 (dd, J = 8.3, 4.9 Hz, 1H), 3.19-3.05 (m, 2H), 3.00-2.91 (m, 1H), 2.24-1.83 (m, 1H), 1.43-1.36 (m, 3H), 1.28-1.18 (m, 6H), 0.95-0.83 (m, 3H) ESI MS (m/z): 357.15 [M+1].
617	(エチルイミノ)(ブ ロピル)(2-(ピリジ ン-3-イル)-2H-イ	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.46 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 9.33 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.70 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.50 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 8.35 (q, J = 0.8 Hz, 1H), 7.94-7.91 (m, 1H), 7.68 (ddd, J = 8.4, 4.7, 0.7 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 9.3, 1.7 Hz, 1H), 3.27-3.18 (m,

10

20

30

40

【表 13-5】

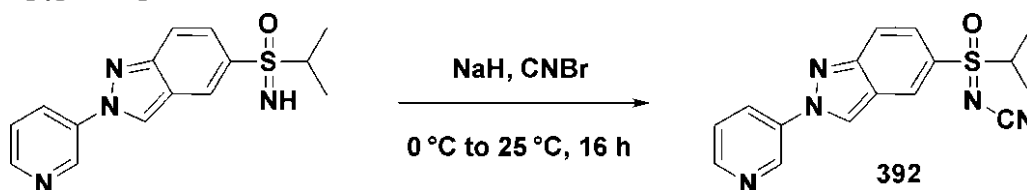
	ンダゾール-5-イル)- λ^6 -スルファノン	2H), 2.93-2.84 (m, 1H), 2.81-2.73 (m, 1H), 1.66-1.45 (m, 2H), 1.06 (t, J = 7.1 Hz, 3H), 0.87 (t, J = 7.5 Hz, 3H) ESI MS (m/z): 329.05 [M+1].
618	(エチルイミノ)(ネオペンチル)(2-(ピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル)- λ^6 -スルファノン	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9.59 (s, 1H), 9.36 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.79 (s, 1H), 8.74 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.53 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 8.14 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.82 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 7.71 (dd, J = 8.1, 4.4 Hz, 1H), 4.13 (d, J = 30.6 Hz, 2H), 3.10-2.94 (m, 2H), 1.11 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 1.03 (d, J = 14.9 Hz, 9H); ESI MS (m/z): 357.05 [M+1].

10

【0259】

例 14 N-(イソプロピル(オキソ)(2-(ピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル)- λ^6 -スルファネリデン)シアナミド 392 の合成

【化 45】



20

N, N-ジメチルホルムアミド (5 mL) 中のイミノ(イソプロピル)(2-(ピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル)- λ^6 -スルファノン (300 mg、0.999ミリモル) の攪拌溶液に、水素化ナトリウム (59.9 mg、1.498ミリモル) を窒素雰囲気下、25°C で仕込み、さらに5~10分間攪拌した。その後、反応混合物を0°C に冷却し、この温度で攪拌しながら臭化シアン (159 mg、1.498ミリモル) を加えた。添加終了後、反応混合物を25°C で加温し、この温度で12時間攪拌した。反応終了後、混合物を氷冷水に注ぎ、水層を酢酸エチル (3 X 25 mL) で抽出した。有機層を分離し、食塩水 (2 X 25 mL) で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過し、減圧濃縮して粗油を得た。粗物質をフラッシュクロマトグラフィーで精製し、所望のN-(イソプロピル(オキソ)(2-(ピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル)- λ^6 -スルファネリデン)シアナミド 392 (130 mg、0.400ミリモル、収率40.0%) を得た。

30

【0260】

表 14: 本開示の代表的な化合物を、例 14 に記載の適切な出発物質および方法に従って調製した。

【表 14】

化合物番号	化合物名	分析データ
392	N-(イソプロピル(オキソ)(2-(ピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-イル)- λ^6 -スルファネリデン)シアナミド	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9.59 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 9.35 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.74 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.66 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 8.53 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 8.10 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.75-7.69 (m, 2H), 1.37 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 1.23 (d, J = 6.6 Hz, 4H); ESI MS (m/z): 325.5 [M+1].

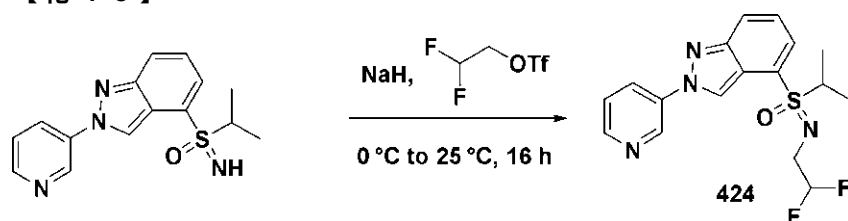
40

【0261】

例 15: ((2, 2-ジフルオロエチル)イミノ)(イソプロピル)(2-(ピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-4-イル)- λ^6 -スルファノン 424 の合成

50

【化 4 6】



イミノ（イソプロピル）（2-（ピリジン-3-イル）-2H-インダゾール-4-イル）-λ⁶-スルファノン（300mg、0.999ミリモル）のN，N-ジメチルホルムアミド（5mL）水素化ナトリウム（59.9mg、1.498ミリモル）中の攪拌溶液に、窒素雰囲気下、25 °Cで仕込み、さらに5～10分間攪拌を続けた。その後、反応混合物を0 °Cに冷却し、この温度で攪拌しながら2，2-ジフルオロエチルトリフルオロメタンスルホン酸（662μl、4.99ミリモル）を添加した。添加完了後、反応混合物を25 °Cで加温し、この温度で16時間攪拌した。反応終了後、反応混合物を氷冷水に注ぎ、水性層を酢酸エチル（3×25mL）で抽出した。有機層を分離し、食塩水（2×25mL）で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過し、減圧下で濃縮して粗油を得た。粗化合物をフラッシュクロマトグラフィーで精製し、所望の（（2，2-ジフルオロエチル）イミノ）（イソプロピル）（2-（ピリジン-3-イル）-2H-インダゾール-4-イル）-λ⁶-スルファノン424（70mg、0.192ミリモル、収率19.23%）を得た。

【0262】

表15：本開示の代表的化合物を、例15に記載の適切な出発物質および方法に従って調製した。

【表 1 5】

化合物番号	化合物名	分析データ
424	((2,2-ジフルオロエチル)イミノ)(イソプロピル)(2-(ピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-4-イル)-λ ⁶ -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.36 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.23 (d, J = 0.5 Hz, 1H), 8.70 (dd, J = 4.6, 1.2 Hz, 1H), 8.55 (dq, J = 8.3, 1.3 Hz, 1H), 8.13-8.08 (m, 1H), 7.69-7.63 (m, 2H), 7.58 (dd, J = 8.6, 7.1 Hz, 1H), 6.01 (tt, J = 56.3, 4.2 Hz, 1H), 3.73-3.66 (m, 1H), 3.25-3.00 (m, 2H), 1.36-1.28 (m, 3H), 1.07 (d, J = 6.6 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 364.95 [M+1].

*化合物名はChemdraw Professional 19.1を用いて作成した。

【0263】

式A-1、A-2またはA-3の化合物は、明細書に記載の一般式6-14に従って合成される。特に、式A-1（式中、A1、A2およびA3はCを表す）の化合物は、WO 2016 14435に記載の手順に従って合成され、式A-1（式中、A1、A2およびA3のうちの1つはNを表す）の化合物は、以下に記載の手順に従って合成される。

反応式：

例-16：

10

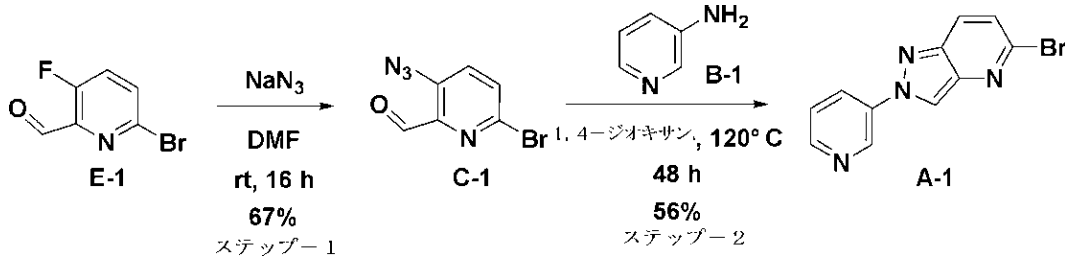
20

30

40

50

【化 4 7】



3-アジド-6-ブロモピコリンアルデヒド：

【化 4 8】

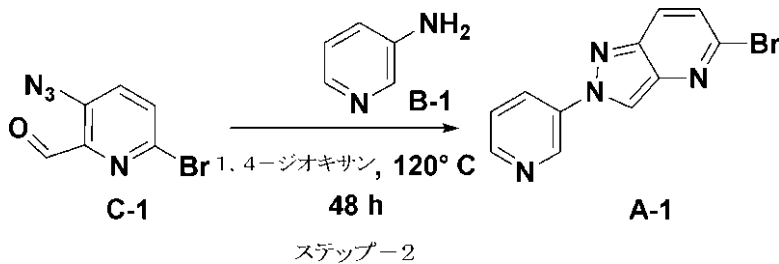


6-ブロモ-3-フルオロピコリンアルデヒド E- (8 g、39.2 ミリモル) の N, N-ジメチルホルムアミド溶液 (80 ml) にアジ化ナトリウム (3.06 g、47.1 ミリモル) を加え、25 °C で 16 時間攪拌した。反応終了後、水で希釈し、水層を酢酸エチルで抽出した。有機層を分離し、食塩水で洗浄した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、ろ過し、減圧濃縮して 3-アジド-6-ブロモピコリンアルデヒド C-1 (6 g、26.4 ミリモル、収率 67.4 %) を得た。TLC を純正スポットと比較した。

【0264】

5-ブロモ-2-(ピリジン-3-イル)-2H-ピラゾロ[4,3-b]ピリジン：

【化 4 9】



3-アジド-6-ブロモピコリンアルデヒド C-1 (6 g、26.4 ミリモル) の 1, 4-ジオキサン (60 ml) 中の攪拌溶液にピリジン-3-アミン B-1 (2.74 g、29.1 ミリモル) を加え、120 °C で 48 時間攪拌した。反応終了後、反応混合物を減圧濃縮し、水を加えて粗固体を得、これを濾過、捕集し、さらにフラッシュクロマトグラフィーで精製して目的の 5-ブロモ-2-(ピリジン-3-イル)-2H-ピラゾロ[4,3-b]ピリジン A-1 (4.1 g、14.90 ミリモル、収率 56.4 %) を得た。

【0265】

本明細書に記載されているように、式 (I) の化合物は、重要な農作物を襲う多数の昆虫に対して作用する殺虫活性を示す。本発明の化合物の活性を以下の試験で評価した：

生物学的例：

例 A : Bemisia tabaci

試験には葉浸漬法を用い、必要量の化合物を秤量し、溶媒溶液を入れたチューブに溶解した。チューブを適切に混合するために 2000 rpm の渦に乗せ、0.01 % Triton-X 溶液で試験濃度に希釈した。プリンジャールの葉を化合物溶液に 10 秒間浸漬した。20 分間陰干しした後、葉の背軸側を上にして、それぞれの容器のキャップに入れた 4

10

20

30

40

50

m l の固化 1 % 寒天溶液に置いた。新しく発生したコナジラミの成虫を、改良した吸引器を用いて既知数採取し、処理した葉を入れたキャップを入れた穴あき容器に放流した。容器は温度 25 ° C , 相対湿度 70 % の植物生長室に置いた。死んだ成虫、瀕死の成虫、生きている成虫の観察を放流 72 時間後に記録した。死亡率は死んだ成虫と瀕死の成虫を合わせて計算し、その結果を無処理対照のものと比較した。化合物 1

1 1	1 8	2 5	2 8	2 9	3 0	3 1	3 2
3 3	3 4	3 8	4 3	4 8	6 5	6 6	6 8
7 1	7 2	7 3	7 4	7 7	7 8	7 9	8 6
8 7	9 3	1 0	1	1 0	4	1 0	8
1 1	6	1 1	9	1 2	2	1 2	3
1 3	5	1 8	4	1 8	6	1 9	3
2 1	5	2 1	6	2 1	8	2 1	9
2 2	2	2 2	3	2 2	4	2 2	6
2 3	1	2 3	6	2 3	7	2 3	8
2 4	1	2 4	8	2 4	9	2 5	0
2 7	8	2 8	7	2 8	8	2 8	9
2 9	2	9	3	2 9	4	2 9	6
3 0	8	3 0	9	3 1	0	3 1	1
3 1	4	3 3	7	3 5	4	3 5	5
3 6	9	3 8	3	3 8	5	3 8	6
3 9	1	3 9	7	4 0	6	4 0	8
4 1	9	4 2	1	4 4	6	4 4	7
4 5	7	4 5	8	4 6	1	4 6	2
4 6	6	4 6	7	4 7	0	4 7	4
4 7	9	4 8	0	4 8	2	5 5	4

および 580 は 300 ppm で 70 % 以上の死亡率を示した。

【0266】

例 B : Myzus persicae

試験にはリーフディップ法を用い、必要量の化合物を秤量し、溶媒溶液を入れたチューブに溶解した。チューブを適切に混合するために 2000 rpm の渦に乗せ、0.01 % Triton-X 溶液で所望の試験濃度に希釈した。トウガラシの葉を化合物溶液に 10 秒間浸し、20 分間陰干しした後、葉の背軸側を上にして、固化した 1 % 寒天溶液 4 ml を入れたバイオアッセイトレイの単一セルに入れた。シャーレに採取した既知数のヤナギ幼虫を、処理した葉とともに細胞内に放出し、通気性を高めるために有孔蓋で覆った。トレイは温度 25 ° C , 相対湿度 70 % の植物生長室に保存した。放出 72 時間後に死亡、瀕死、生存幼虫の観察を記録した。死亡率は、死亡幼虫と瀕死幼虫を組み合わせて算出し、未処理対照と比較した。化合物 1

2 9	3 2	4 1	6 4	7 0	7 1	7 3	8 8
8 9	9 0	9 2	9 9	1 0	2	1 1	0
9	1 2	3	1 2	4	1 3	6	1 3
1 4	6	1 4	7	1 4	8	1 5	6
1 9	3	2 1	6	2 1	7	2 1	8
2 3	7	2 3	8	2 3	9	2 4	0
2 5	0	2 5	4	2 5	5	2 5	6
2 9	0	2 9	1	3 0	6	3 1	2
3 5	4	3 8	3	3 8	6	3 8	7
3 9	0	3 9	7	4 0	6	4 1	9
4 5	7	4 5	8	4 6	0	4 6	1
4 8	0	4 8	2	4 8	3	4 8	4
4 8	7	4 8	8	4 9	0	4 9	1

5 5 8 5 6 0 5 6 4 5 6 7 5 6 9 と 5 8 1 は 3 0 0 p
pm で 7 0 % 以上の死亡率を示した。

【0 2 6 7】

例 C : *N i l a p a r v a t a l u g e n s*

試験には苗浸漬法を用いた。必要量の化合物を秤量し、溶媒溶液を入れた試験管に溶解した。試験管に 2 0 0 0 r p m の渦流をかけて適切に混合した後、0 . 0 1 % T r i t o n - X 溶液で試験濃度に希釈した。水田苗を化合物溶液に 1 0 秒間浸漬し、2 0 分間陰干した後、苗をガラス試験管に入れ、根を水中に保った。*N i l a p a r v a t a l u g e n s* の三齢幼虫 1 5 匹を各試験管に放出し、試験管を温度 2 5 ° C 、相対湿度 7 5 % の植物生長室に保存した。死亡、瀕死および生存幼虫の観察は、放流後 7 2 時間で記録した。死亡率は、死亡および瀕死の幼虫を組み合わせで計算し、その結果を未処理対照のもの

10

化合物 1	2 3	4	5 7	8	9
1 1	1 2	1 3	1 4 1 6	1 9	2 0
2 3	2 6	2 7 2 8	2 9	3 0	3 2 3 3
3 8	4 1 4 2	5 1	6 4	7 1 7 2	7 3
7 8 8 6	8 7	9 2	9 3	1 0 4	1 0 5 1
1 1	1 1 2	1 1 3	1 1 4	1 1 5	1 2 5
1 2 6	1 2 7	1 3 7	1 4 6	1 4 7	1 4 8
1 5 2	1 5 3	1 5 5	1 8 1	1 9 3	1 9 4
2 0 2	2 0 6	2 3 6	2 3 8	2 4 0	3 3 1
3 3 7	3 4 3	3 4 7	3 5 4	3 5 5	3 5 6
3 5 7	3 5 8	3 5 9	3 6 0	3 6 7	3 8 5
3 8 6	3 8 7	3 8 8	3 8 9	3 9 1	3 9 2
3 9 4	3 9 6	3 9 7	4 0 2	4 0 6	4 1 7
4 1 9	4 4 6	4 4 7	4 5 0	4 5 4	4 5 7
4 6 1	4 6 2	4 6 4	4 7 0	4 7 1	4 7 4

および 4 7 5 は、3 0 0 p p m で 7 0 % 以上の死亡率を記録した。

20

【0 2 6 8】

特定の好ましい実施形態を参照して本発明を説明したが、他の実施形態は、明細書を検討することにより当業者に明らかになるであろう。

30

40

50

【国際調査報告】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/IN2023/050445

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER		
INV.	C07D401/04 A01N43/56 A01N43/90 A01P7/04 C07D401/14 C07D471/04	
ADD. According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC		
B. FIELDS SEARCHED		
Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) C07D A01N A01P		
Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched		
Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used) EPO-Internal, WPI Data		
C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	WO 2016/087421 A1 (BAYER CROPSCIENCE AG [DE]) 9 June 2016 (2016-06-09) cited in the application table 1 starting at page 183, especially derivatives with R2 = CO-NH-SO2-N (e.g. compounds 2, 5, 17, 28, 36, 39, 42) -----	1-22
A	WO 2016/087363 A1 (BAYER CROPSCIENCE AG [DE]) 9 June 2016 (2016-06-09) pages 113-114: especially derivatives with R2 = CO-NH-SO2-N (compounds 8, 10, 18); pages 113-114; compounds 8, 10, 18 -----	1-22
A	WO 2015/038503 A1 (DU PONT [US]) 19 March 2015 (2015-03-19) claim 1 page 160 - page 166; tables A-D page 162; compound 48 -----	1-22
☐ Further documents are listed in the continuation of Box C. ☒ See patent family annex.		
* Special categories of cited documents : "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance "E" earlier application or patent but published on or after the international filing date "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified) "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed "T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention "X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone "Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art "&" document member of the same patent family		
Date of the actual completion of the international search 16 June 2023		Date of mailing of the international search report 26/06/2023
Name and mailing address of the ISA/ European Patent Office, P.B. 5618 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Fax: (+31-70) 340-3016		Authorized officer Panday, Narendra

Form PCT/ISA/210 (second sheet) (April 2005)

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No

PCT/IN2023/050445

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 2016087421 A1	09-06-2016	BR 112017011667 A2	27-02-2018
		CN 107207466 A	26-09-2017
		EP 3227274 A1	11-10-2017
		ES 2747794 T3	11-03-2020
		JP 6826977 B2	10-02-2021
		JP 2017537915 A	21-12-2017
		US 2017327487 A1	16-11-2017
		WO 2016087421 A1	09-06-2016
WO 2016087363 A1	09-06-2016	BR 112017011416 A2	27-02-2018
		CN 107406443 A	28-11-2017
		EP 3227289 A1	11-10-2017
		JP 2017537912 A	21-12-2017
		US 2017325458 A1	16-11-2017
		WO 2016087363 A1	09-06-2016
WO 2015038503 A1	19-03-2015	AR 097633 A1	06-04-2016
		AR 118312 A2	29-09-2021
		AU 2014318984 A1	24-03-2016
		BR 112016005389 A2	01-08-2017
		CA 2923814 A1	19-03-2015
		CL 2016000581 A1	23-06-2017
		CR 20160127 A	03-08-2016
		CR 20210453 A	15-11-2021
		EA 201690584 A1	29-07-2016
		EP 3044220 A1	20-07-2016
		EP 3424919 A1	09-01-2019
		EP 3567036 A1	13-11-2019
		EP 4105209 A2	21-12-2022
		ES 2707398 T3	03-04-2019
		ES 2922575 T3	16-09-2022
		ES 2923498 T3	28-09-2022
		HU E042520 T2	29-07-2019
		HU E058831 T2	28-09-2022
		IL 269139 A	28-11-2019
		JP 6513682 B2	15-05-2019
		JP 2016530310 A	29-09-2016
		KR 20160054002 A	13-05-2016
		KR 20210151998 A	14-12-2021
		KR 20230016249 A	01-02-2023
		MD 20160038 A2	31-08-2016
		MD 20210063 A2	28-02-2022
		MD 20210064 A2	28-02-2022
		MY 177920 A	26-09-2020
		NI 201600036 A	02-05-2017
		NZ 717749 A	27-08-2021
		NZ 757027 A	27-08-2021
		PE 20160676 A1	26-07-2016
		PH 12016500494 A1	16-05-2016
		PL 3044220 T3	30-04-2019
		PL 3567036 T3	08-08-2022
		PT 3044220 T	11-02-2019
		PT 3567036 T	08-07-2022
		SG 10201801587X A	28-03-2018
		SG 11201601786P A	28-04-2016
		SI 3044220 T1	29-03-2019
		SI 3567036 T1	28-10-2022
		TR 201901556 T4	21-02-2019

Form PCT/ISA/210 (patent family annex) (April 2005)

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No

PCT/IN2023/050445

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
		TW 201601631 A	16-01-2016
		UA 123657 C2	12-05-2021
		US 2017174707 A1	22-06-2017
		US 2018009827 A1	11-01-2018
		US 2019055265 A1	21-02-2019
		US 2021017192 A1	21-01-2021
		US 2023159561 A1	25-05-2023
		UY 35737 A	30-04-2015
		WO 2015038503 A1	19-03-2015
		ZA 201601782 B	25-07-2018

フロントページの続き

(51)国際特許分類

F I

テーマコード (参考)

A 6 1 K	31/506 (2006.01)	A 6 1 K	31/506	
C 0 7 D	403/04 (2006.01)	C 0 7 D	403/04	
A 6 1 K	31/437 (2006.01)	A 6 1 K	31/437	
C 0 7 D	401/14 (2006.01)	C 0 7 D	401/14	
A 6 1 P	33/14 (2006.01)	A 6 1 P	33/14	
C 0 7 D	471/04 (2006.01)	C 0 7 D	471/04	1 0 6
A 6 1 K	45/00 (2006.01)	A 6 1 K	45/00	
A 6 1 P	43/00 (2006.01)	A 6 1 P	43/00	1 2 1

,MC,ME,MK,MT,NL,NO,PL,PT,RO,RS,SE,SI,SK,SM,TR),OA(BF,BJ,CF,CG,CI,CM,GA,GN,GQ,GW,KM,ML,MR,NE,SN,TD,TG),AE,AG,AL,AM,AO,AT,AU,AZ,BA,BB,BG,BH,BN,BR,BW,BY,BZ,CA,CH,CL,CN,C O,CR,CU,CV,CZ,DE,DJ,DK,DM,DO,DZ,EC,EE,EG,ES,FI,GB,GD,GE,GH,GM,GT,HN,HR,HU,ID,IL,IN,IQ,I R,IS,IT,JM,JO,JP,KE,KG,KH,KN,KP,KR,KW,KZ,LA,LC,LK,LR,LS,LU,LY,MA,MD,MG,MK,MN,MU,MW ,MX,MY,MZ,NA,NG,NI,NO,NZ,OM,PA,PE,PG,PH,PL,PT,QA,RO,RS,RU,RW,SA,SC,SC,SD,SE,SG,SK,SL ,ST,SV,SY,TH,TJ,TM,TN,TR,TT,TZ,UA,UG,US,UZ,VC,VN,WS,ZA,ZM,ZW

(特許庁注：以下のものは登録商標)

1. T R I T O N

ウェスト ベンガル, アンドゥルーモウリ, モヒアリー ロイ パラ

(72)発明者 モタポトゥラ シヴァ ナゲンドラ クマール

インド共和国 3 1 3 0 0 2 ウダイプール, ヒラン マグリ, セクター-4 エクステンション, マンサ ケーダ, ハヌマーン ナガル, ラメスワラム アpartment, ビー-1 1 2

(72)発明者 グルジャール バグワン ラール

インド共和国 3 1 3 0 0 2 ウダイプール, バドバデシュワール マハデヴ ロード, ゴヴェルダン ヴィラズ デワリ

(72)発明者 ジェイン プリテッシュ ラメッシュ

インド共和国 4 2 4 0 0 2 マハラシュトラ, ドゥーレ, ニヤハロード, パティルワダ, ロハール レーン, 1 0 1 4

(72)発明者 サクセーナ ロヒト

インド共和国 2 2 6 0 2 4 ラクナウ, ウッタル プラデーシュ, ヴィカス ナガル, セクター-4, 4 / 7 3 1

(72)発明者 パチョレ サチン ハリラル

インド共和国 4 3 1 1 1 2 ディストリクト-アウランガバード, タヒール-シロッド, ポスト-アンバイ, アット-パングリ

(72)発明者 サラゲール ラヴィクマール スリヤナラヤナ

インド共和国 5 6 0 0 9 8 バンガロール, カルナータカ, ラージラジェシュワリ ナガル, ビー-イーエムエル レイアウト, ファースト フェーズ, フィフス ステージ, サード メイン, デッカン アーケード-セカンド, フィフス フロア, ナンバー 5 0 3

(72)発明者 クラウゼナー アレクサンダー ジー. エム.

ドイツ連邦共和国 5 0 2 5 9 プルハイム, シフゲスウェグ 1 8

F ターム (参考) 4C084 AA19 NA14 ZB37 ZC75

4C086 AA01 AA02 AA03 AA04 BC37 CB05 GA07 GA08 MA01 MA04
NA14 ZB37 ZC75

4H011 AC01 BB09