(19)日本国特許庁(JP)　(12)公表特許公報(A)　(11)特許出願公表番号
特表2013-507334
(P2013-507334A)
(43)公表日　平成25年3月4日(2013.3.4)

(51)Int.Cl.		F I		テーマコード（参考）
C07D 401/04	(2006.01)	C07D 401/04	CSP	4C050
C07D 231/16	(2006.01)	C07D 231/16		4C063
C07D 405/06	(2006.01)	C07D 405/06		4C065
C07D 405/14	(2006.01)	C07D 405/14		4C071
C07D 403/04	(2006.01)	C07D 403/04		4H011

審査請求 未請求　予備審査請求 未請求　（全 283 頁）　最終頁に続く

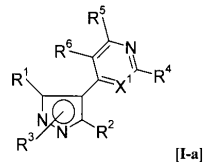
(21)出願番号　特願2012-532558 (P2012-532558)
(86)(22)出願日　平成22年10月4日 (2010.10.4)
(85)翻訳文提出日　平成24年5月22日 (2012.5.22)
(86)国際出願番号　PCT/EP2010/064742
(87)国際公開番号　WO2011/042389
(87)国際公開日　平成23年4月14日 (2011.4.14)
(31)優先権主張番号　09172677.8
(32)優先日　平成21年10月9日 (2009.10.9)
(33)優先権主張国　欧州特許庁 (EP)
(31)優先権主張番号　61/250,149
(32)優先日　平成21年10月9日 (2009.10.9)
(33)優先権主張国　米国 (US)

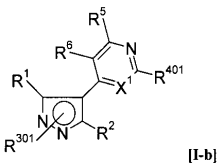
(71)出願人　507203353
バイエル・クロップサイエンス・アーゲー
ＢＡＹＥＲ　ＣＲＯＰＳＣＩＥＮＣＥ　ＡＧ
ドイツ国、４０７８９・モンハイム、アルフレート－ノベル－シユトラーセ・５０
(74)代理人　100146318
弁理士　岩瀬　吉和
(74)代理人　100114188
弁理士　小野　誠
(74)代理人　100119253
弁理士　金山　賢教
(74)代理人　100124855
弁理士　坪倉　道明

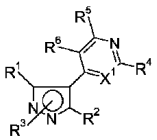
最終頁に続く

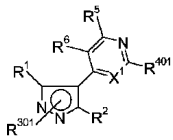
(54)【発明の名称】フェニルピリ（ミ）ジニラゾール類

(57)【要約】
式［Ｉ－ａ］および［Ｉ－ｂ］


[I-a]

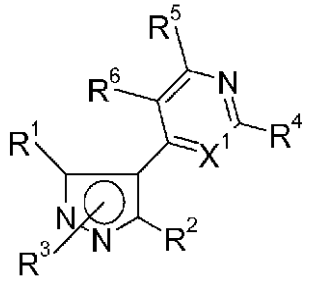

[I-b]


[I-a]


[I-b]

［式中、記号は明細書中で述べた意味を有する］のフェニルピリ（ミ）ジニラゾール類、ならびにその農薬的に活性な塩、ならびに植物および材料の保護における望まない微生物の防除のための、ならびに植物および植物の部分におけるマイコトキシンの低下のためのその使用、ならびに式［Ｉ－ａ］および［Ｉ－ｂ］の化合物の製造方法。

【特許請求の範囲】
【請求項１】
式［Ｉ－ａ］：
【化１】



[I-a]

［式中、記号は以下の意味を有する：
X^1はＣ－ＨまたはＮを表し、
R^1はフェニル、ナフタレニル、キノリン－５－イル、キノリン－８－イル、イソキノリン－５－イル、イソキノリン－８－イル、１－ベンゾチオフェン－４－イル、１－ベンゾチオフェン－７－イル、１－ベンゾ－フラン－４－イル、１－ベンゾフラン－７－イル、１，３－ベンゾジオキソール－４－イルまたは１，３－ベンゾジオキソール－５－イルを表し、各々、１または複数の、同一または異なったR^7で置換されていてもよく、
R^2はシアノ、ニトロ、ハロゲン、C_1－C_6アルキル、C_1－C_6アルコキシ、C_1－C_6ハロアルキル、C_3－C_6シクロアルキル、C_3－C_6ハロシクロアルキル、C_1－C_6ハロアルコキシ、C_1－C_6アルキルチオ、C_2－C_9ヘテロシクリルまたは水素を表し、
R^3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_3－C_6シクロアルキル、C_3－C_6シクロアルキル－C_1－C_6アルキル、C_3－C_6シクロアルキルオキシ、C_1－C_6アルコキシ、C_1－C_6アルコキシ－C_1－C_6アルキル、アシルオキシ－C_1－C_6アルキル、ヘテロアリール－C_1－C_6アルキル、アリール－C_1－C_6アルキル、C_1－C_6アルキルチオ－C_1－C_6アルキル、C_1－C_4アルキル－Ｃ（Ｏ）－C_1－C_6アルキル、C_3－C_6シクロアルキル－Ｃ（Ｏ）－C_1－C_4アルキル、C_2－C_9ヘテロシクイル－Ｃ（Ｏ）－C_1－C_4アルキル、C_1－C_4アルキル－Ｃ（Ｏ）Ｏ－C_1－C_6アルキル、C_1－C_4アルキル－Ｃ（Ｏ）Ｏ－C_3－C_6シクロアルキル、C_1－C_4アルキル－Ｃ（Ｏ）Ｏヘテロシクリル、ヘテロシクリル－C_1－C_6アルキル、ヘテロシクリル、オキソヘテロシクリルまたはヘテロアリールを表し、各々、１または複数の、同一または異なったハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、C_1－C_6アルキル、C_1－C_6アルコキシ、ハロアルコキシ、フェニルまたはフェノキシで置換されていてもよく、
R^4は水素、ハロゲン、シアノ、－Ｃ（Ｏ）ＯR^{12}、－ＳR^{12}、－Ｎ$R^{12}R^{13}$、－Ｃ（Ｏ）Ｎ$R^{12}R^{13}$または－Ｎ$R^{12}R^{14}$、－Ｎ＝Ｃ＝ＮR^{22}、－Ｎ＝Ｃ（Ｈ）ＯR^{22}、－Ｎ＝Ｃ（ＯR^{22}）R^{23}、－Ｎ＝Ｃ（ＳR^{22}）R^{23}、－Ｃ（＝ＮR^{22}）Ｎ$R^{22}R^{23}$、－ＳＯ（＝ＮR^{22}）R^{23}または－SO_2R^{20}を表し、
あるいは、各々、１または複数の、同一または異なったR^{11}で置換されていてもよい、C_1－C_6アルキル、C_3－C_8シクロアルキル、C_2－C_6アルケニル、C_6－C_{14}アリール、C_2－C_9ヘテロシクリルまたはC_2－C_9ヘテロアリールを表し、
R^5およびR^6は、相互に独立して、水素、フッ素、塩素、臭素、シアノ、ニトロ、－ＯＨまたは－ＳＨを表し、
あるいは各々、１または複数の、同一または異なったR^{11}で置換されていてもよい、C_1－C_6アルキル、C_3－C_6シクロアルキル、C_2－C_6アルケニル、C_2－C_6アルキニル、C_6－C_{14}アリール、－Ｏ－（C_1－C_4アルキル）、－Ｏ－（C_6－C_{14}アリール）、－Ｓ－（C_1－C_4アルキル）、－Ｓ（Ｏ）－（C_1－C_6アルキル）または－Ｃ（Ｏ）－（C_1－C_6アルキル）を表し、

あるいは、それらが結合している炭素原子と一緒になって、１または複数の、同一または異なったハロゲン、酸素、シアノまたはC_1－C_4アルキルで置換されていてもよい３から８の環原子を持つ環を形成し、ここで、該環は酸素、硫黄または－NR^{19}の範囲からの１から４のヘテロ原子を含有することができ、

R^7は、相互に独立して、以下の基：フッ素、塩素、臭素、シアノ、ニトロ、－ＯＨまたは－ＳＨの１以上を表し、

あるいは、各々、１または複数の、同一または異なったフッ素、塩素、臭素、－ＯＨ、シアノ、C_1－C_6アルキルまたは－Ｏ－（C_1－C_4アルキル）で置換されていてもよい、C_1－C_6アルキル、C_3－C_6シクロアルキル、C_2－C_6アルケニル、C_2－C_6アルキニル、トリ（C_1－C_4アルキル）シリル、C_6－C_{14}アリール、－Ｏ－（C_1－C_4アルキル）、－Ｏ－（C_6－C_{14}アリール）、－Ｓ－（C_1－C_4アルキル）、－Ｓ（Ｏ）－（C_1－C_6アルキル）、または－Ｓ（Ｏ）$_2$－（C_1－C_6アルキル）を表し、

R^{11}は－ＯＨ、フッ素、塩素、臭素、シアノ、－ＮＨ－Ｃ（Ｏ）R^{20}、－$NR^{20}R^{21}$、－Ｃ（Ｏ）R^{20}、－Ｃ（Ｏ）OR^{20}、－Ｃ（Ｏ）$NR^{20}R^{21}$または－SO_2R^{20}を表し、

あるいは、各々、１または複数の、同一または異なったフッ素、塩素、臭素、－ＯＨ、カルボニル、シアノ、C_1－C_6アルキルまたは－Ｏ－（C_1－C_4アルキル）で置換されていてもよい、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_{11}ヘテロアルキル、C_3－C_8シクロアルキル、－Ｏ－（C_1－C_4アルキル）、－Ｓ－（C_1－C_4アルキル）、－Ｏ－（C_3－C_8シクロアルキル）、－Ｓ－（C_3－C_8シクロアルキル）、C_6－C_{14}アリール、－Ｏ－（C_6－C_{14}アリール）、－Ｓ－（C_6－C_{14}アリール）、C_2－C_9ヘテロシクリルまたはC_2－C_9ヘテロアリールを表し、

R^{12}およびR^{13}は、相互に独立して、以下の基：Ｈ、－Ｃ（Ｓ）R^{15}、－Ｃ（Ｏ）R^{15}、－SO_2R^{15}、－Ｃ（Ｏ）OR^{15}、－OR^{15}または－Ｃ（Ｏ）$NR^{15}R^{16}$の１以上を表し、

あるいは、各々、１または複数の、同一または異なったフッ素、塩素、臭素、－ＯＨ、シアノ、C_1－C_6アルキル、－Ｏ－Ｃ（Ｏ）R^{11}、－Ｏ－Ｐ（Ｏ）（OR^{11}）$_2$、－Ｏ－Ｂ（OR^{11}）$_2$または－Ｏ－（C_1－C_4アルキル）で置換されていてもよい、C_1－C_6アルキル、C_3－C_6シクロアルキル、C_2－C_6アルケニル、C_2－C_6アルキニル、C_3－C_8シクロアルキル、C_6－C_{14}アリール、C_2－C_9ヘテロシクリルまたはC_2－C_9ヘテロアリールを表し、

R^{14}は－CH_2－$NR^{22}R^{23}$、ピペリジン－１－イルメチルまたはモルホリン－４－イルメチルを表し、

あるいは各々、１または複数の、同一または異なったフッ素、塩素、臭素、－ＯＨまたはシアノで置換されていてもよい、C_1－C_6アルキルまたは－Ｏ－（C_1－C_4アルキル）を表し、

R^{15}およびR^{16}は、相互に独立して、水素または－ＯＨを表し、

あるいは各々、１または複数の、同一または異なったR^{11}で置換されていてもよい、C_1－C_6アルキル、C_3－C_6シクロアルキル、C_2－C_6アルケニル、C_2－C_6アルキニル、C_3－C_8シクロアルキル、C_6－C_{14}アリール、C_2－C_9ヘテロシクリルまたはC_2－C_9ヘテロアリールを表し、

あるいはそれらが結合している窒素原子と一緒になって、さらに、当該窒素に隣接しないＮまたはＯの範囲からのヘテロ原子を含有することができる３または７員の環を形成し、

R^{17}およびR^{18}は、相互に独立して、以下の基：Ｈ、－Ｃ（Ｏ）OR^{11}の１以上を表し、

あるいは各々、１または複数の、同一または異なったフッ素、塩素、臭素、－ＯＨ、シアノ、C_1－C_6アルキル、および－Ｏ－（C_1－C_4アルキル）で置換されていてもよ

い、C_1－C_6アルキル、C_3－C_6シクロアルキル、C_2－C_6アルケニル、C_2－C_6アルキニル、C_3－C_8シクロアルキル、C_6－C_{14}アリール、C_2－C_9ヘテロシクリルまたはC_2－C_9ヘテロアリールを表し、

R^{19}はH、C_1－C_6アルキル、C_3－C_6シクロアルキル、C_2－C_6アルケニル、C_2－C_6アルキニル、－C（S）R^{15}、－C（O）R^{15}、－SO_2R^{15}または－C（O）OR^{15}を表し、

R^{20}およびR^{21}は、相互に、独立して、C_1－C_6アルキル、C_3－C_6シクロアルキル、C_2－C_6アルケニルまたはC_2－C_6アルキニルを表し、各々、1または複数の、同一または異なったフッ素、塩素、臭素、－OHまたはシアノで置換されていてもよく、あるいは水素を表し、ならびに

R^{22}およびR^{23}は、相互に独立して、C_1－C_6アルキル、C_3－C_6シクロアルキル、C_2－C_6アルケニル、C_2－C_6アルキニルまたは水素を表す］

の化合物、およびその農薬的に活性な塩、

但し、以下の化合物は除かれる：

ａ）

X^1がNを表し、

R^1が置換されていてもよいフェニルを表し、

R^3がブチルまたはプロピン－２－イルを表し、

R^4が－NHR_{12}を表し、および

R^{12}が置換されていてもよいフェニルを表す化合物、ならびに

ｂ）

X^1がNを表し、

R^2、R^4、R^5、R^6がHを表し、および

R^1が４－クロロフェニルを表す場合、R^3がメチル、エチル、アリル、２－メトキシエチルもしくはベンジルを表し、または

R^1がフェニル、４－メトキシフェニルもしくは４－フルオロフェニルを表す場合、R^3がメチルを表す化合物。

【請求項２】

記号が以下の意味を有する、請求項１記載の式［Ｉ－ａ］の化合物およびその農薬的に活性な塩。

R^1は、1または複数の、同一または異なったR^7で置換されていてもよいフェニルを表し、

R^2はメチル、エチル、イソプロピル、シクロプロピルまたは水素を表し、

R^3はプロパン－２－イル、イソブチル、ブタン－２－イル、２－メチルプロピル、２，２－ジメチル－プロピル、３－メチルブタ－２－エン－１－イル、ブタ－２－エン－１－イル、ブタ－３－エン－２－イル、プロパジエニル、プロパ－２－イン－１－イル、ブタ－２－イン－１－イル、ブタ－３－イン－２－イル、２－メチルブタ－３－イン－２－イル、２－メチルブタ－３－イン－２－イル、シアノメチル、２－シアノエチル、１－シアノプロパン－２－イル、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、（２，２－ジクロロシクロプロピル）メチル、シクロプロピルメチル、１－シクロプロピルエチル、トリクロロメチル、トリフルオロメチル、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、２，２，２－トリクロロエチル、２－クロロエチル、２－ブロモエチル、２－フルオロプロピル、３－フルオロプロピル、２－クロロプロピル、３－クロロプロピル、１，３－ジフルオロプロパン－２－イル、２－フルオロベンジル、３－フルオロベンジル、４－フルオロベンジル、２，３－ジフルオロベンジル、２－クロロ－６－フルオロベンジル、１－（２－クロロフェニル）エチル、１－（３－クロロフェニル）エチル、１－（４－クロロフェニル）エチル、３－シアノベンジル、４－シアノベンジル、４－（ジフルオロメトキシ）ベンジル、２－シアノベンジル、２－（３－クロロフェニル）エチル、２－（２－クロロフェニル）エチル、１－ナフチルメチル、（ピリジン－３－イルメチル、２－クロロ－１，３－チアゾール－５－イ

ル）メチル、メトキシメチル、２－メトキシエチル、２－（メチルスルファニル）エチル、２－（トリフルオロメトキシ）エチル、１－メトキシプロパン－２－イル、２－［２－（２－メトキシエトキシ）エトキシ］エチル、２－（２－メトキシエトキシ）エチル、テトラヒドロフラン－２－イルメチル、（３－メチルオキセタン－３－イル）メチル、１Ｈ－イミダゾール－２－イルメチル、テトラヒドロフラン－３－イル、２－オキソテトラヒドロフラン－３－イル、２－ｔｅｒｔ－ブトキシ－２－オキソエチル、１－メトキシ－３－メチル－１－オキソブタン－２－イル、１－メトキシ－１－オキソプロパン－２－イルまたは３－エトキシ－３－オキソプロピル、プロパン－２－イルオキシ、メチル、エチル、ｎ－プロピル、２－エトキシエチルまたは２－シクロエチルを表し、

R^4は水素または、－$NR^{12}R^{13}$もしくは－NHR^{13}を表し、

R^5およびR^6は、相互に独立して、水素、フッ素またはシアノを表し、

あるいはそれらが結合している炭素原子と一緒になって、それらが一緒に、１または複数の、同一または異なったR^{11}で置換されていてもよい、－（ＣＨ＝ＣＨ－ＣＨ＝ＣＨ）－、－（ＣＨ＝ＣＨ－Ｎ（R^{19}）、－（ＣＨ＝ＣＨ－ＣＨ＝Ｎ）－、－（ＮＨ－ＣＨ＝Ｎ）－または－（CH_2－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（R^{19}）－を表す単一の環を形成し、

R^7は、相互に独立して、以下の基：フッ素、塩素、シアノまたはメチルの１以上を表し、

R^{11}は、－ＯＨ、フッ素、塩素、臭素、シアノ、－ＮＨ－Ｃ（Ｏ）R^{20}、－Ｃ（Ｏ）R^{20}、－Ｃ（Ｏ）ＯR^{20}、－Ｃ（Ｏ）Ｎ$R^{20}R^{21}$または－SO_2R^{20}を表し、

あるいは各々、１または複数の、同一または異なったフッ素、塩素、臭素、－ＯＨ、シアノ、C_1－C_6アルキルまたは－Ｏ－（C_1－C_4アルキル）で置換されていてもよい、C_1－C_6アルキル、C_3－C_8シクロアルキル、C_2－C_6アルケニル、C_2－C_6アルキニル、－Ｏ－（C_1－C_4アルキル）、－Ｓ－（C_1－C_4アルキル）、－Ｏ－（C_3－C_8シクロアルキル）または－Ｓ－（C_3－C_8シクロアルキル）を表し、

R^{12}は水素、－Ｃ（Ｓ）R^{15}、－Ｃ（Ｏ）R^{15}、－SO_2R^{15}、－Ｃ（Ｏ）ＯR^{15}、－ＯR^{15}または－Ｃ（Ｏ）Ｎ$R^{15}R^{16}$を表し、

R^{13}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_2－C_9ヘテロシクリル、またはC_2－C_9ヘテロアリールまたは水素を表し、

R^{15}は、各々、１または複数の、同一または異なったハロゲン、－ＯＨ、シアノまたはC_1－C_4アルキルで置換されていてもよい、C_1－C_6アルキル、C_3－C_6シクロアルキル、C_2－C_6アルケニル、C_2－C_6アルキニル、C_3－C_8シクロアルキル、C_2－C_9ヘテロシクリルまたはC_2－C_9ヘテロアリールを表し、

あるいは水素を表し

R^{16}は水素、メチル、エチルまたはプロピルを表し、

R^{19}はＨ、C_2－C_6アルキニル、－Ｃ（Ｏ）R^{15}、－SO_2R^{15}または－Ｃ（Ｏ）ＯR^{15}を表し、ならびに

R^{20}およびR^{21}は、相互に独立して、各々、１または複数の、同一または異なったフッ素、塩素、臭素、－ＯＨまたはシアノで置換されていてもよい、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、シクロプロピルまたはシクロブチルを表し、

あるいは水素を表す。

【請求項３】

記号が以下の意味を有する、請求項１から２の１以上記載の式［Ｉ－ａ］の化合物、およびその農薬的に活性な塩。

X^1はＣ－Ｈを表し、および

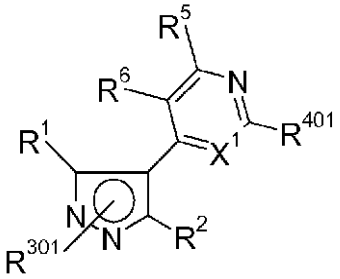
R^4は水素を表す。

【請求項４】

記号が以下の意味を有する、請求項１から２の１以上記載の式［Ｉ－ａ］の化合物、およびその農薬的に活性な塩。

X^1はＮを表し、

R^4は－NHR^{13}を表し、および
R^{13}は、各々、１または複数の、同一または異なったフッ素、塩素、臭素、－ＯＨまたはシアノで置換されていてもよい、C_1－C_6アルキル、C_3－C_6シクロアルキル、C_2－C_6アルケニル、C_2－C_6アルキニル、C_2－C_9ヘテロシクリルまたはC_2－C_9ヘテロアリールを表す。
【請求項５】
式［Ｉ－ｂ］：
【化２】



[I-b]

［式中、記号は以下の意味を有する：
X^1はＣ－ＨまたはＮを表し、
R^1は、各々、１または複数の、同一または異なったR^7で置換されていてもよい、フェニル、ナフタレニル、キノリン－５－イル、キノリン－８－イル、イソキノリン－５－イル、イソキノリン－８－イル、１－ベンゾチオフェン－４－イル、１－ベンゾチオフェン－７－イル、１－ベンゾ－フラン－４－イル、１－ベンゾフラン－７－イル、１，３－ベンゾジオキソール－４－イルまたは１，３－ベンゾジオキソール－５－イルを表し、
R^2はシアノ、ニトロ、ハロゲン、C_1－C_6アルキル、C_1－C_6アルコキシ、C_1－C_6ハロアルキル、C_1－C_6ハロアルコキシ、C_1－C_6アルキルチオ、C_3－C_6シクロアルキル、C_3－C_6ハロシクロアルキル、C_2－C_9ヘテロシクリルまたは水素を表し、
R^{301}は、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（R^9R^{10}）、－Ｃ（Ｏ）R^9、－Ｃ（Ｏ）ＯR^9または－Ｓ（Ｏ）$_2R^9$を表し、あるいは各々、１または複数の、同一または異なったR^8で置換されていてもよい、C_1－C_6アルキル、C_2－C_6アルケニル、C_3－C_6アレニル、C_2－C_6アルキニル、C_3－C_8シクロアルキル、C_1－C_6アルコキシ、C_2－C_9ヘテロシクリル、C_2－C_9オキソヘテロシクリルまたはヘテロアリールを表し、
R^{401}は－N$R^{12}R^{13}$、－Ｃ（Ｏ）N$R^{12}R^{13}$または－Ｎ（R^{12}）$_2$を表し、
R^5およびR^6は、相互に独立して、水素、フッ素、塩素、臭素、シアノ、ニトロ、－ＯＨまたは－ＳＨを表し、
あるいは各々、１または複数の、同一または異なったR^{11}で置換されていてもよい、C_1－C_6アルキル、C_3－C_6シクロアルキル、C_2－C_6アルケニル、C_2－C_6アルキニル、C_6－C_{14}アリール、－Ｏ－（C_1－C_4アルキル）、－Ｏ－（C_6－C_{14}アリール）、－Ｓ－（C_1－C_4アルキル）、－Ｓ（Ｏ）－（C_1－C_6アルキル）または－Ｃ（Ｏ）－（C_1－C_6アルキル）を表し、
あるいはそれらが結合している炭素原子と一緒になって、１または複数の、同一または異なったハロゲン、酸素、シアノまたはC_1－C_4アルキルで置換されていてもよい３から８の環原子を持つ環を形成し、ここで、該環は、酸素、硫黄または－Ｎ－R^{19}の範囲からの１から４のヘテロ原子を含有することができ、
R^7は、相互に独立して、以下の基：フッ素、塩素、臭素、シアノ、ニトロ、－ＯＨまたは－ＳＨの１以上を表し、
あるいは、１または複数の、同一または異なったフッ素、塩素、臭素、－ＯＨ、シアノ、C_1－C_6アルキルまたは－Ｏ－（C_1－C_4アルキル）で置換されていてもよい、C_1－C_6アルキル、C_3－C_6シクロアルキル、C_2－C_6アルケニル、C_2－C_6アル

キニル、トリ（C_1－C_4アルキル）シリル、C_6－C_{14}アリール、－Ｏ－（C_1－C_4アルキル）、－Ｏ－（C_6－C_{14}アリール）、－Ｓ－（C_1－C_4アルキル）、－Ｓ（Ｏ）－（C_1－C_6アルキル）または－Ｓ（Ｏ）$_2$－（C_1－C_6アルキル）を表し、

R^8は－ＯＨ、ハロゲン、NO_2、シアノ、－NR^9R^{10}、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（R^9R^{10}）、－Ｃ（Ｏ）R^9、－Ｃ（Ｏ）ＯR^9、－Ｏ－Ｃ（Ｏ）R^9または－（CH_2）$_n$Ｃ（Ｏ）R^9を表し、ここで、ｎ＝１および６の間の全数字であり、

あるいは各々、１または複数の、同一または異なったR^{11}で置換されていてもよい、C_1－C_6アルキル、C_2－C_8アルケニル、C_2－C_8アルキニル、C_3－C_8シクロアルキル、C_1－C_6ハロアルキル、C_6－C_{14}アリール、C_2－C_9ヘテロシクリル、C_2－C_9ヘテロアリール、－Ｏ－（C_1－C_4アルキル）、－Ｓ－（C_1－C_4アルキル）、－Ｏ－（C_3－C_8シクロアルキル）または－Ｓ－（C_3－C_8シクロアルキル）を表し、

R^9およびR^{10}は、相互に独立して、各々、１または複数の、同一または異なったR^{11}で置換されていてもよい、C_1－C_6アルキル、C_2－C_8アルケニル、C_2－C_8アルキニル、C_3－C_8シクロアルキル、C_6－C_{14}アリール、C_2－C_9ヘテロシクリルまたはC_2－C_9ヘテロアリールを表し、

あるいは水素を表し、

R^{11}は－ＯＨ、フッ素、塩素、臭素、シアノ、－ＮＨ－Ｃ（Ｏ）R^{20}、－$NR^{20}R^{21}$、－Ｃ（Ｏ）R^{20}、－Ｃ（Ｏ）ＯR^{20}、－Ｃ（Ｏ）$NR^{20}R^{21}$または－SO_2R^{20}を表し、

あるいは１または複数の、同一または異なったフッ素、塩素、臭素、－ＯＨ、カルボニル、シアノ、C_1－C_6アルキルまたは－Ｏ－（C_1－C_4アルキル）で置換されていてもよい、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_{11}ヘテロアルキル、C_3－C_8シクロアルキル、－Ｏ－（C_1－C_4アルキル）、－Ｓ－（C_1－C_4アルキル）、－Ｏ－（C_3－C_8シクロアルキル）、Ｓ－（C_3－C_8シクロアルキル）、C_6－C_{14}アリール、－Ｏ－（C_6－C_{14}アリール）、－Ｓ－（C_6－C_{14}アリール）、C_2－C_9ヘテロシクリルまたはC_2－C_9ヘテロアリールを表し、

R^{12}は－Ｃ（Ｓ）R^{15}、－Ｃ（Ｏ）R^{15}、－SO_2R^{15}、－Ｃ（Ｏ）ＯR^{15}、－ＯR^{15}または－Ｃ（Ｏ）$NR^{15}R^{16}$を表し、

R^{13}は、各々、１または複数の、同一または異なったフッ素、塩素、臭素、－ＯＨ、シアノ、C_1－C_6アルキル、－Ｏ－Ｃ（Ｏ）－C_1－C_4アルキル、－Ｏ－Ｐ（Ｏ）（Ｏ－C_1－C_4アルキル）$_2$、－Ｏ－Ｂ（Ｏ－C_1－C_4アルキル）$_2$または－Ｏ－（C_1－C_4アルキル）で置換されていてもよい、C_1－C_6アルキル、C_3－C_6シクロアルキル、C_2－C_6アルケニル、C_2－C_6アルキニル、C_3－C_8シクロアルキル、C_2－C_9ヘテロシクリルまたはC_2－C_9ヘテロアリールを表し、

あるいは水素を表し、

R^{15}およびR^{16}は、相互に独立して、水素または－ＯＨを表し

あるいは各々、１または複数の、同一または異なったR^{11}で置換されていてもよい、C_1－C_6アルキル、C_3－C_6シクロアルキル、C_2－C_6アルケニル、C_2－C_6アルキニル、C_3－C_8シクロアルキル、C_6－C_{14}アリール、C_2－C_9ヘテロシクリルまたはC_2－C_9ヘテロアリールを表し、

あるいはそれらが結合している窒素原子と一緒になって、当該窒素に隣接しないＮまたはＯの範囲からのさらなるヘテロ原子を含有することができる３から７員の環を形成し、

R^{19}はＨ、C_1－C_6アルキル、C_3－C_6シクロアルキル、C_2－C_6アルケニル、C_2－C_6アルキニル、－Ｃ（Ｓ）R^{15}、－Ｃ（Ｏ）R^{15}、－SO_2R^{15}または－Ｃ（Ｏ）ＯR^{15}を表し、ならびに

R^{20}およびR^{21}は、相互に独立して、各々、１または複数の、同一または異なったフッ素、塩素、臭素、－ＯＨまたはシアノで置換されていてもよい、C_1－C_6アルキル、C_3－C_6シクロアルキル、C_2－C_6アルケニルまたはC_2－C_6アルキニルを表し

、あるいは水素を表す］
の化合物、およびその農薬的に活性な塩、
但し、以下の化合物は除かれる：
ａ）
R^{301}が、置換されていてもよい［１，２，４［トリアゾロ［４，３－ｂ］ピリダジン－６－イル、７，８－ジヒドロ［１，２，４［トリアゾロ［４，３－ｂ］ピリダジン６－イル、６－オキソ－１，６－ジヒドロピリダジン－３－イル、６－オキソ－１，４，５，６－テトラヒドロピリダジン－３－イルまたは６－クロロピリダジン－３－イルを表し、および
R^5、R^6がＨを表す；
化合物、ならびに
ｂ）化合物４－｛１－［２－（ジメチルアミノ）エチル］－３－（４－フルオロフェニル）－１Ｈ－ピラゾール－４－イル｝－Ｎ，Ｎ－ジメチルピリジン－２－アミンおよび１－（４－｛４－［１－エチル－３－（４－ニトロフェニル）－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］－１Ｈ－ピロロ［２，３－ｂ］ピリジン－６－イル｝フェニル）－Ｎ，Ｎ－ジメチルメタンアミン。

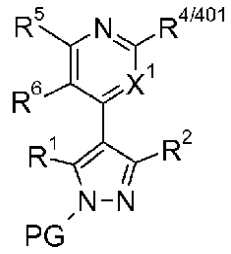
【請求項６】
記号が以下の意味を有する請求項５記載の式［Ｉ－ｂ］の化合物、およびその農薬的に活性な塩。
R^1は１または複数の、同一または異なったR^7で置換されていてもよいフェニルを表し
R^2はメチル、エチル、イソプロピル、シクロプロピルまたは水素を表し、
R^{301}は、各々、１または複数の、同一または異なったR^8で置換されていてもよい、C_1－C_6アルキル、C_2－C_6アルケニル、C_3－C_6アレニル、C_2－C_6アルキニル、C_3－C_8シクロアルキルまたはC_1－C_6アルコキシを表し、
R^{401}は－$NR^{12}R^{13}$を表し、
R^5およびR^6は、相互に独立して、水素、フッ素またはシアノを表し、
あるいはそれらが結合している炭素原子と一緒になって、それらが一緒に、１または複数の、同一または異なったR^{11}で置換されていてもよい、－（ＣＨ＝ＣＨ－ＣＨ＝ＣＨ）－、－（ＣＨ＝ＣＨ－Ｎ（R^{19}）－、－（ＣＨ＝ＣＨ－ＣＨ＝Ｎ）－または－（CH_2－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（R^{19}）－を表す単一の環を形成し
R^7はフッ素、塩素、シアノまたはメチルを表し、
R^8はフッ素、塩素またはシアノを表し、あるいは各々、１または複数の、同一または異なったR^{11}で置換されていてもよい、C_1－C_6アルキル、C_2－C_8アルケニル、C_2－C_8アルキニル、C_3－C_8シクロアルキル、C_6－C_{14}アリール、ヘテロシクリル、ヘテロアリール、－Ｏ－（C_1－C_4アルキル）、－Ｓ－（C_1－C_4アルキル）、－Ｏ－（C_3－C_8シクロアルキル）または－Ｓ－（C_3－C_8シクロアルキル）を表し、
R^{11}は以下の基：－ＯＨ、フッ素、塩素、臭素、シアノ、－ＮＨ－Ｃ（Ｏ）R^{20}、－Ｃ（Ｏ）R^{20}、－Ｃ（Ｏ）ＯR^{20}、－Ｃ（Ｏ）Ｎ$R^{20}R^{21}$または－SO_2R^{20}の１以上を表し、
あるいは各々、１または複数の、同一または異なったフッ素、塩素、臭素、－ＯＨ、シアノ、C_1－C_6アルキルまたは－Ｏ－（C_1－C_4アルキル）で置換されていてもよい、C_1－C_6アルキル、C_3－C_8シクロアルキル、C_2－C_6アルケニル、C_2－C_6アルキニル、－Ｏ－（C_1－C_6アルキル）、－Ｓ－（C_1－C_4アルキル）、－Ｏ－（C_3－C_8シクロアルキル）または－Ｓ（C_3－C_8シクロアルキル）を表し、
R^{12}は－Ｃ（Ｓ）R^{15}、－Ｃ（Ｏ）R^{15}、－SO_2R^{15}、－Ｃ（Ｏ）ＯR^{15}、－ＯR^{15}または－Ｃ（Ｏ）Ｎ$R^{15}R^{16}$を表し、
R^{13}はC_1－C_6アルキル、C_2－C_6アルケニル、C_2－C_6アルキニルまたは水素を表し、

R^{15}は、各々、１または複数の、同一または異なったハロゲン、－ＯＨ、シアノまたはC_1－C_4アルキルで置換されていてもよい、C_1－C_6アルキル、C_3－C_6シクロアルキル、C_2－C_6アルケニル、C_2－C_6アルキニル、C_3－C_8シクロアルキル、C_2－C_9ヘテロシクリルまたはC_2－C_9ヘテロアリールを表し、
あるいは水素を表し、
R^{16}は水素、メチル、エチルまたはプロピルを表し、
R^{19}はＨ、－C_2－C_6アルキニル、－Ｃ（Ｏ）R^{15}、－SO_2R^{15}または－Ｃ（Ｏ）OR^{15}を表し、ならびに
R^{20}およびR^{21}は、相互に独立して、各々、１または複数の、同一または異なったフッ素、塩、臭素、－ＯＨまたはシアノで置換されていてもよい、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、シクロ－プロピルまたはシクロブチルを表し、
あるいは水素を表す。

【請求項７】
記号が以下の意味を有する、請求項５から６の１以上記載の式［Ｉ－ｂ］の化合物、およびその農薬的に活性な塩。
X^1はＮを表し、
R^1はフェニル、３－メチルフェニル、２－フルオロフェニル、３－フルオロフェニル、４－フルオロフェニル、３－トリフルオロメチルフェニル、４－クロロフェニル、２，５－ジフルオロフェニル、２，４－ジフルオロフェニル、２，６－ジフルオロフェニル、３－メチル－４－フルオロフェニル、３－シアノ－４－フルオロフェニルまたは２，４，６－トリフルオロフェニルを表し、
R^{301}はメチル、エチル、１－プロピル、プロパン－２－イル、イソブチル、ブタン－２－イル、２－メチルプロピル、２，２－ジメチルプロピル、２－（モルホリン－４－イル）エチル、２－シアノエチル、シアノメチル、２－シアノ－２－メチルプロピル、３－メチルブタ－２－エン－１－イル、ブタ－２－エン－１－イル、ブタ－３－エン－２－イル、プロパジエニル、プロパ－２－エン－１－イル、プロパ－２－イン－１－イル、ブタ－２－イン－１－イル、ブタ－３－イン－２－イル、２－メチルブタ－３－イン－２－イル、２－メチルブタ－３－イン－２－イル、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、（２，２－ジクロロシクロプロピル）メチル、シクロプロピルメチル、１－シクロプロピルエチル、トリクロロメチル、トリフルオロメチル、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、２，２，２－トリクロロエチル、２－クロロエチル、２－ブロモエチル、２－フルオロプロピル、３－フルオロプロピル、２－クロロプロピル、３－クロロプロピル、１，３－ジフルオロプロパン－２－イル、１，１，１－トリフルオロプロパン－２－イル、１，１，１－トリフルオロ－２－メチルプロパン－２－イル、３，３，３－トリフルオロ－２－ヒドロキシプロピル、２－フルオロ－ベンジル、３－フルオロベンジル、４－フルオロベンジル、２，３－ジフルオロベンジル、２－クロロ－６－フルオロベンジル、１－（２－クロロフェニル）エチル、１－（３－クロロフェニル）エチル、１－（４－クロロ－フェニル）エチル、３－シアノベンジル、４－シアノベンジル、４－（ジフルオロメトキシ）ベンジル、２－シアノベンジル、２－（３－クロロフェニル）エチル、２－（２－クロロフェニル）エチル、１－ナフチルメチル、（ピリジン－３－イルメチル、２－クロロ－１，３－チアゾール－５－イル）メチル、メトキシメチル、２－メトキシエチル、２－メトキシプロピル、２－（メチルスルファニル）－エチル、２－（トリフルオロメトキシ）エチル、１－メトキシプロパン－２－イル、２－［２－（２－メトキシエトキシ）エトキシ］エチル、２－（２－メトキシエトキシ）エチル、１，３－ジメトキシプロパン－２－イル、２－（シクロプロピルオキシ）エチル、テトラヒドロフラン－２－イルメチル、（３－メチルオキセタン－３－イル）メチル、１Ｈ－イミダゾール－２－イルメチル、テトラヒドロフラン－３－イル、２－オキソテトラヒドロ－フラン－３－イル、２－ｔｅｒｔ－ブトキシ－２－オキソエチル、１－メトキシ－３－メチル－１－オキソブタン－２－イル、１－メトキシ－１－オキソプロパン－２－イルまたは３－エトキシ－３－オキソプロピル、１－シア

ノプロパン－２－イル、プロパン－２－イルオキシまたは２－エトキシエチルを表し、
　Ｒ^{401}は－ＮＨＲ^{12}を表し、
　Ｒ^{11}は以下の基：－ＯＨ、フッ素、塩素、シアノ、メチル、エチルまたはシクロプロピルの１以上を表し、
　Ｒ^{12}は－Ｃ（Ｓ）Ｒ^{15}、－ＳＯ$_2$Ｒ^{15}、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ^{15}または－Ｃ（Ｏ）Ｒ^{15}を表し、
　Ｒ^{15}は、各々、１または複数の、同一または異なったハロゲン、ＯＨ、シアノまたはＣ^1－Ｃ^{4}アルキルで置換されていてもよい、メチル、エチル、ｎ－プロピル、イソプロピル、ｓｅｃ－ブチル、イソブチル、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、２－メトキシエチル、（２－メトキシエトキシ）－メチル、シクロペンテニル、シクロヘキセニル、オキセタニル、テトラヒドロフラン－２－イル、エチニル、プロパ－１－イン－１－イル、プロパ－１－エン－１－イル、アミノメチル、アミノエチル、アミノ－プロピル、アミノブチル、アミノイソプロピル、アミノシクロプロピル、アミノシクロブチル、アミノシクロペンチル、ジメチルアミノ、エチル（メチル）アミノ、ピロリジニル、ジエチルアミノ、２－ピリジル、３－ピリジル、４－ピリジル、エトキシカルボニル、ベンジル、フェニル、２－チエニルまたは３－チエニルを表し、
　あるいは水素を表し、および
　Ｒ^{19}はＨ、アセチル、エトキシカルボニル、メトキシカルボニル、プロパ－２－イン－１－イルまたはブタ－２－イン－１－イルを表す。
【請求項８】
　記号が以下の意味を有する、請求項５から６の１以上記載の式［Ｉ－ｂ］の化合物、およびその農薬的に活性な塩。
　Ｘ^{1}はＣ－Ｈを表し、
　Ｒ^{1}は４－フルオロフェニル、３－クロロフェニル、２，６－ジフルオロフェニルまたは３－メチルフェニルを表し、
　Ｒ^{2}はシクロプロピル、メチル、Ｈまたはジフルオロメトキシを表し、および
　Ｒ^{401}はアセチルアミノ、ｎ－プロピオニルアミノ、イソブチリルアミノ、（シクロプロピルカルボニル）アミノ、（メトキシアセチル）アミノ、２－メトキシプロパノイル、（２－メチル－ブタノイル）アミノ、ブタ－２－エノイルアミノ、プロパ－２－イノイルアミノ、３－（ジメチルアミノ）－プロパ－２－エノイル］アミノ、３，３，３－トリフルオロプロパノイル）アミノ、３，３－ジフルオロ－プロパノイル）アミノ、（シクロプロピルアセチル）アミノ、ラクトイルアミノ、（シクロブチル－カルボニル）アミノ、（シクロペンチルアセチル）アミノ、２－メチルシクロプロピル）カルボニル］アミノ、（３－メチルブタノイル）アミノ、（フェニルアセチル）アミノ、ベンゾイルアミノ、（３－チエニルカルボニル）アミノ、（２－チエニルカルボニル）アミノ、（２－ヒドロキシ－２－メチル－プロパノイル）アミノ、［（２－メトキシエトキシ）アセチル］アミノまたは２，３－ジヒドロキシ－プロパノイル）アミノ
【請求項９】
　請求項１から８の１以上記載の、式［Ｉ－ａ］および／または［Ｉ－ｂ］のフェニルピリ（ミ）ジニラゾール類を真菌および／またはその生息地に適用することを特徴とする、植物病原性およびマイコトキシン生産真菌を防除する方法。
【請求項１０】
　一定含有量の請求項１から８の１以上記載の、式［Ｉ－ａ］および／または［Ｉ－ｂ］の少なくとも１つのフェニルピリ（ミ）ジニラゾールならびにシンナーおよび／または表面活性物質を含むことを特徴とする、植物病原性およびマイコトキシン生産真菌の防除のための剤。
【請求項１１】
　式［Ｘ］：

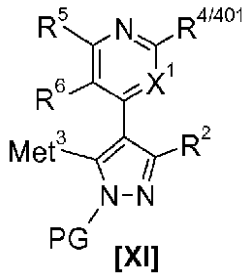
【化３】



[X]

［式中、ＰＧはテトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－２－イルを表し、および
Ｒ^{1}、Ｒ^{2}、Ｘ^{1}、Ｒ^{6}、Ｒ^{5}、Ｒ$^{4/401}$は請求項１から８における式［Ｉ－ａ］および［Ｉ－ｂ］について定義されたのと同一の残基の定義を表す］
の化合物、およびその農薬的に活性な塩。

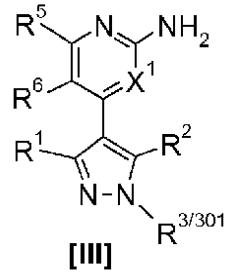
【請求項１２】
式［ＸＩ］：
【化４】



[XI]

［式中、Ｍｅｔ^{3}はトリブチルスタニル、４，４，５，５－テトラメチル－１，３，２－ジオキサボロラン－２－イルを表し、
ＰＧはテトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－２－イル、２－（トリメチルシリル）エトキシ］メチルを表し、および
Ｒ^{2}、Ｘ^{1}、Ｒ^{6}、Ｒ^{5}、Ｒ$^{4/401}$は請求項１から８において式［Ｉ－ａ］および［Ｉ－ｂ」について定義したのと同一の残基の定義を表す」
の化合物、およびその農薬的に活性な塩、但し、化合物１－（｛４－［１－（２，２－ジフルオロエチル）－３－（トリメチルスタニル）－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリミジン－２－イル｝アミノ）プロパン－２－オールは除かれる。

【請求項１３】
式［ＩＩＩ］：
【化５】



[III]

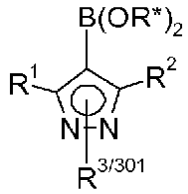
［式中、
Ｒ^{1}、Ｒ^{2}、Ｘ^{1}、Ｒ^{6}、Ｒ^{5}、Ｒ$^{3/301}$は請求項１から８において式［Ｉ－ａ］および［Ｉ－ｂ］について定義したのと同一の残基の定義を表す］
の化合物、その農薬的に活性な塩、但し、化合物４－［３－（４－フルオロフェニル）－５－メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－２－アミン、４－［３－（４－ク

ロロフェニル）－５－メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－２－アミン、４－［３－（４－メトキシフェニル）－５－メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－２－アミン、４－［３－（４－フルオロフェニル）－１Ｈ－ピラゾール－４－イル」ピリミジン－２－アミン；４－（５－メチル－３－フェニル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリミジン－２－アミンおよび［４－（２－アミノピリミジン－４－イル）－３－（３－クロロ－５－ヒドロキシ－フェニル）－１Ｈ－ピラゾール－１－イル］アセトニトリルは除かれる。

【請求項１４】

式［Ｖ］：

【化６】



[V]

［式中、

Ｂ（ＯＲ＊）$_2$は－Ｂ（ＯｉＰｒ）$_2$または－Ｂ（ＯＨ）$_2$を表し、および

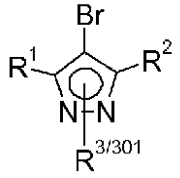
R^1、R^2、$R^{3/301}$は請求項１から８において式［Ｉ－ａ］および［Ｉ－ｂ］について定義したのと同一の残基の定義を表す］

の化合物、およびその農薬的に活性な塩、但し、化合物１－メチル－３－フェニル－４－（４，４，５，５－テトラメチル－１，３，２－ジオキサボロラン－２－イル）－１Ｈ－ピラゾール類は除かれる。

【請求項１５】

式［ＶＩ］：

【化７】



[VI]

［式中、

R^1、R^2、$R^{3/301}$は請求項１から８において式［Ｉ－ａ］および［Ｉ－ｂ］について定義したのと同一の残基の定義を表す］

の化合物、およびその農薬的に活性な塩、但し、$R^{3/301}$＝Ｈ、ＣＨ$_3$またはＣ（ＣＨ$_3$）$_3$である化合物は除かれる。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

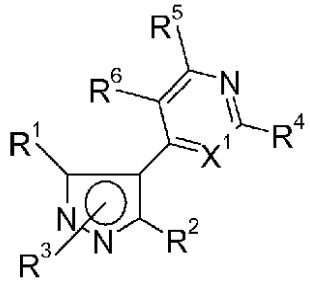
【０００１】

本発明は、新規なフェニルピリ（ミ）ジニラゾール類、その製造のためのいくつかの方法、ならびに植物および材料の保護における望ましくない微生物の防除のための、ならびに植物および植物の部分におけるマイコトキシンの低下のためのその使用に関する。本発明は、さらに、植物病原性真菌の防除のための、ならびに植物保護での植物および植物の部分におけるマイコトキシンの低下のための方法、ならびにフェニルピリ（ミ）ジニラゾール類を含有する殺虫剤に関する。

【背景技術】

【０００２】
ある種のアリールピラゾール類が殺菌性特性を保有することは既に知られている（例えば、国際公開第０３／０４９５４２号、同第０１／０３０１５４号およびＰｈａｒｍａｚｉｅ　１９９９，５４（２），１０６－１１）。記載された物質の有効性は良好であるが、多くの場合、望まれるべきことが残されている。
【０００３】
国際公開第９８／０５２９３７号において、ある種のヘテロアリール－置換ピラゾール類が記載されており、これは、炎症性サイトカインの生産の阻害のために、およびヒトｐ３８キナーゼ－媒介疾患の治療のために医学的に用いることができる。また、欧州特許出願公開第１５５３０９６号、国際公開第０４／０２９０４３号、同第９８／０５２９４０号、同第００／０３１０６３号、同第９５／０３１４５１号、同第０２／０５７２６５号および同第００／０３９１１６号には同様な化合物がやはり記載されている。しかしながら、真菌病原体に対する効果は記載されていない。
【０００４】
国際公開第０７／１０５０５８号において、ある種のヘテロアリール－置換ピラゾール類が記載されており、これはヒトＲａｆ酵素のモジュレーターまたは阻害剤として用いることができる。しかしながら、真菌病原体に対する効果は記載されていない。
【０００５】
現代の殺虫剤に対する生態学的および経済的要件は、例えば、活性スペクトル、毒性、選択性、投与量、残基形成および生産の容易性に関して着実に増加しており、加えて、例えば、抵抗性に関する問題が起こり得るので、少なくともいくつかの分野において、公知のものと比較して利点を有する新規な殺虫剤、特に、殺真菌剤を開発する一定の仕事がある。
【０００６】
驚くべきことに、今回、本発明のフェニルピリ（ミ）ジニラゾール類は、少なくともいくつかの点において該問題を解決し、殺虫剤として、特に、殺真菌剤として適当であることが判明した。
【先行技術文献】
【特許文献】
【０００７】
【特許文献１】国際公開第０３／０４９５４２号
【特許文献２】国際公開第０１／０３０１５４号
【特許文献３】国際公開第９８／０５２９３７号
【特許文献４】欧州特許出願公開第１５５３０９６号
【特許文献５】国際公開第０４／０２９０４３号
【特許文献６】国際公開第９８／０５２９４０号
【特許文献７】国際公開第００／０３１０６３号
【特許文献８】国際公開第９５／０３１４５１号
【特許文献９】国際公開第０２／０５７２６５号
【特許文献１０】国際公開第００／０３９１１６号
【特許文献１１】国際公開第０７／１０５０５８号
【非特許文献】
【０００８】
【非特許文献１】Ｐｈａｒｍａｚｉｅ　１９９９，５４（２），１０６－１１
【発明の概要】
【課題を解決するための手段】
【０００９】
本発明の主題は、式［Ｉ－ａ］：
【００１０】

【化１】



[I-a]

［式中、記号は以下の意味を有する：
X^1はＣ－ＨまたはＮを表し、
R^1はフェニル、ナフタレニル、キノリン－５－イル、キノリン－８－イル、イソキノリン－５－イル、イソキノリン－８－イル、１－ベンゾチオフェン－４－イル、１－ベンゾチオフェン－７－イル、１－ベンゾフラン－４－イル、１－ベンゾフラン－７－イル、１，３－ベンゾジオキソール－４－イルまたは１，３－ベンゾジオキソール－５－イルを表し、各々、１または複数の、同一または異なったR^7で置換されていてもよく、
R^2はシアノ、ニトロ、ハロゲン、$Ｃ_1$－$Ｃ_6$アルキル、$Ｃ_1$－$Ｃ_6$アルコキシ、$Ｃ_1$－$Ｃ_6$ハロアルキル、$Ｃ_1$－$Ｃ_6$ハロアルコキシ、$Ｃ_1$－$Ｃ_6$アルキルチオ、$Ｃ_3$－$Ｃ_6$シクロアルキル、$Ｃ_3$－$Ｃ_6$ハロシクロアルキル、$Ｃ_2$－$Ｃ_9$ヘテロシクリルまたは水素を表し、
R^3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、$Ｃ_3$－$Ｃ_6$シクロアルキル、$Ｃ_3$－$Ｃ_6$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－オキシ、$Ｃ_1$－$Ｃ_6$アルコキシ、$Ｃ_1$－$Ｃ_6$アルコキシ－$Ｃ_1$－$Ｃ_6$アルキル、アシルオキシ－$Ｃ_1$－$Ｃ_6$アルキル、ヘテロアリール－$Ｃ_1$－$Ｃ_6$アルキル（好ましくは、$Ｃ_2$－$Ｃ_9$ヘテロアリール－$Ｃ_1$－$Ｃ_6$アルキル）、アリール－$Ｃ_1$－$Ｃ_6$アルキル（好ましくは、$Ｃ_6$－$Ｃ_{14}$アリール－$Ｃ_1$－$Ｃ_6$アルキル）、$Ｃ_1$－$Ｃ_6$アルキルチオ－$Ｃ_1$－$Ｃ_6$アルキル、$Ｃ_3$－$Ｃ_6$シクロアルキル－Ｃ（Ｏ）－$Ｃ_1$－$Ｃ_4$アルキル、$Ｃ_2$－$Ｃ_9$ヘテロシクリル－Ｃ（Ｏ）－$Ｃ_1$－$Ｃ_4$アルキル、$Ｃ_1$－$Ｃ_4$アルキル－Ｃ（Ｏ）－$Ｃ_3$－$Ｃ_6$シクロアルキル、$Ｃ_1$－$Ｃ_4$アルキル－Ｃ（Ｏ）ヘテロシクリル（好ましくは、$Ｃ_1$－$Ｃ_4$アルキル－Ｃ（Ｏ）－$Ｃ_2$－$Ｃ_9$ヘテロシクリル）、$Ｃ_1$－$Ｃ_4$アルキル－Ｃ（Ｏ）Ｏ－$Ｃ_1$－$Ｃ_6$アルキル、アシルオキシ－$Ｃ_3$－$Ｃ_6$シクロアルキル、アシルオキシ－ヘテロシクリル、ヘテロシクリル－$Ｃ_1$－$Ｃ_6$アルキル（好ましくは、$Ｃ_2$－$Ｃ_9$ヘテロシクリル－$Ｃ_1$－$Ｃ_6$アルキル）、ヘテロシクリル（好ましくは、$Ｃ_2$－$Ｃ_9$ヘテロシクリル）、$Ｃ_2$－$Ｃ_9$オキソヘテロシクリルまたはヘテロアリール（好ましくは、$Ｃ_2$－$Ｃ_9$ヘテロアリール）を表し、各々、１または複数の、同一または異なったハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、$Ｃ_1$－$Ｃ_6$アルキル、$Ｃ_1$－$Ｃ_6$アルコキシ、ハロアルコキシ（好ましくは、$Ｃ_1$－$Ｃ_6$ハロアルコキシ）、フェニルまたはフェノキシで置換されていてもよく、
R^4は水素、ハロゲン、シアノ、－Ｃ（Ｏ）$ＯR^{12}$、－$ＳR^{12}$、－$ＮR^{12}R^{13}$、－Ｃ（Ｏ）$ＮR^{12}R^{13}$または－$ＮR^{12}R^{14}$、－Ｎ＝Ｃ＝$ＮR^{22}$、－Ｎ＝Ｃ（Ｈ）$ＯR^{22}$、－Ｎ＝Ｃ（$ＯR^{22}$）R^{23}、－Ｎ＝Ｃ（$ＳR^{22}$）R^{23}、－Ｃ（＝NR^{22}）$ＮR^{22}R^{23}$、－ＳＯ（＝NR^{22}）R^{23}または－$ＳＯ_2R^{20}$を表し、
あるいは、各々、１または複数の、同一または異なったR^{11}で置換されていてもよい、$Ｃ_1$－$Ｃ_6$アルキル、$Ｃ_3$－$Ｃ_8$シクロアルキル、$Ｃ_2$－$Ｃ_6$アルケニル、$Ｃ_6$－$Ｃ_{14}$アリール、$Ｃ_2$－$Ｃ_9$ヘテロシクリルまたは$Ｃ_2$－$Ｃ_9$ヘテロアリールを表し、
ここで、R^4は好ましくは水素または－$ＮＨR^{13}$を表し、ここで、R^{13}は$Ｃ_1$－$Ｃ_6$アルキル、$Ｃ_3$－$Ｃ_6$シクロアルキル、$Ｃ_2$－$Ｃ_6$アルケニル、$Ｃ_2$－$Ｃ_6$アルキニル、$Ｃ_3$－$Ｃ_8$シクロアルキル、$Ｃ_6$－$Ｃ_{14}$アリール、$Ｃ_2$－$Ｃ_9$ヘテロシクリルまたは$Ｃ_2$－$Ｃ_9$ヘテロアリールを表し、各々、１または複数の、同一または異なったフッ素、

塩素、臭素、－ＯＨ、シアノ、Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキル、－Ｏ－Ｃ（Ｏ）Ｒ^{11}、－Ｏ－Ｐ（Ｏ）（ＯＲ^{11}）$_2$、－Ｏ－Ｂ（ＯＲ^{11}）$_2$または－Ｏ－（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）で置換されていてもよく、

Ｒ^{5}およびＲ^{6}は、相互に独立して、水素、フッ素、塩素、臭素、シアノ、ニトロ、－ＯＨまたは－ＳＨを表し、

あるいは各々、１または複数の、同一または異なったＲ^{11}で置換されていてもよい、Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル、Ｃ$_2$－Ｃ$_6$アルケニル、Ｃ$_2$－Ｃ$_6$アルキニル、Ｃ$_6$－Ｃ$_{14}$アリール、－Ｏ－（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）、－Ｏ－（Ｃ$_6$－Ｃ$_{14}$アリール）、－Ｓ－（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）、－Ｓ（Ｏ）－（Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキル）または－Ｃ（Ｏ）－（Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキル）を表し、

あるいは、それらが結合している炭素原子と一緒になって、３、好ましくは５から８の環原子を持つ環（好ましくは、飽和、不飽和または部分的不飽和の単一の環）を形成し、ここで、該環は酸素、硫黄または－ＮＲ^{19}の範囲からの１から４のヘテロ原子を含有することができ、１または複数の、同一または異なったハロゲン、酸素、シアノまたはＣ$_1$－Ｃ$_4$アルキルで置換されていてもよく、

Ｒ^{7}は、相互に独立して、以下の基：フッ素、塩素、臭素、シアノ、ニトロ、－ＯＨまたは－ＳＨの１以上を表し、

あるいは、各々、１または複数の、同一または異なったフッ素、塩素、臭素、－ＯＨ、シアノ、Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキルまたは－Ｏ－（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）で置換されていてもよい、Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル、Ｃ$_2$－Ｃ$_6$アルケニル、Ｃ$_2$－Ｃ$_6$アルキニル、トリ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）シリル、Ｃ$_6$－Ｃ$_{14}$アリール、－Ｏ－（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）、－Ｏ－（Ｃ$_6$－Ｃ$_{14}$アリール）、－Ｓ－（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）、－Ｓ（Ｏ）－（Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキル）、または－Ｓ（Ｏ）$_2$－（Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキル）を表し、

Ｒ^{11}は－ＯＨ、フッ素、塩素、臭素、シアノ、－ＮＨ－Ｃ（Ｏ）Ｒ^{20}、－ＮＲ^{20}Ｒ^{21}、－Ｃ（Ｏ）Ｒ^{20}、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ^{20}、－Ｃ（Ｏ）ＮＲ^{20}Ｒ^{21}または－ＳＯ$_2$Ｒ^{20}を表し、

あるいは、各々、１または複数の、同一または異なったフッ素、塩素、臭素、－ＯＨ、カルボニル、シアノ、Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキルまたは－Ｏ－（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）で置換されていてもよい、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$_{11}$ヘテロアルキル、Ｃ$_3$－Ｃ$_8$シクロアルキル、－Ｏ－（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）、－Ｓ－（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）、－Ｏ－（Ｃ$_3$－Ｃ$_8$シクロアルキル）、－Ｓ－（Ｃ$_3$－Ｃ$_8$シクロアルキル）、Ｃ$_6$－Ｃ$_{14}$アリール、－Ｏ－（Ｃ$_6$－Ｃ$_{14}$アリール）、－Ｓ－（Ｃ$_6$－Ｃ$_{14}$アリール）、Ｃ$_2$－Ｃ$_9$ヘテロシクリルまたはＣ$_2$－Ｃ$_9$ヘテロアリールを表し、

Ｒ^{12}およびＲ^{13}は、相互に独立して、以下の基：Ｈ、－Ｃ（Ｓ）Ｒ^{15}、－Ｃ（Ｏ）Ｒ^{15}、－ＳＯ$_2$Ｒ^{15}、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ^{15}、－ＯＲ^{15}または－Ｃ（Ｏ）ＮＲ^{15}Ｒ^{16}の１以上を表し、

あるいは、各々、１または複数の、同一または異なったフッ素、塩素、臭素、－ＯＨ、シアノ、Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキル、－Ｏ－Ｃ（Ｏ）Ｒ^{11}、－Ｏ－Ｐ（Ｏ）（ＯＲ^{11}）$_2$、－Ｏ－Ｂ（ＯＲ^{11}）$_2$または－Ｏ－（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）で置換されていてもよい、Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル、Ｃ$_2$－Ｃ$_6$アルケニル、Ｃ$_2$－Ｃ$_6$アルキニル、Ｃ$_3$－Ｃ$_8$シクロアルキル、Ｃ$_6$－Ｃ$_{14}$アリール、Ｃ$_2$－Ｃ$_9$ヘテロシクリルまたはＣ$_2$－Ｃ$_9$ヘテロアリールを表し、

Ｒ^{14}は－ＣＨ$_2$－ＮＲ^{22}Ｒ^{23}、ピペリジン－１－イルメチルまたはモルホリン－４－イルメチルを表し、

あるいは各々、１または複数の、同一または異なったフッ素、塩素、臭素、－ＯＨまたはシアノで置換されていてもよい、Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキルまたは－Ｏ－（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）を表し、

Ｒ^{15}およびＲ^{16}は、相互に独立して、水素または－ＯＨを表し、

あるいは各々、１または複数の、同一または異なったＲ１１で置換されていてもよい、Ｃ１－Ｃ６アルキル、Ｃ３－Ｃ６シクロアルキル、Ｃ２－Ｃ６アルケニル、Ｃ２－Ｃ６アルキニル、Ｃ３－Ｃ８シクロアルキル、Ｃ６－Ｃ１４アリール、Ｃ２－Ｃ９ヘテロシクリルまたはＣ２－Ｃ９ヘテロアリールを表し、

あるいは（Ｒ１２および／またはＲ１３が－Ｃ（Ｏ）ＮＲ１５Ｒ１６を表す場合）それらが結合している窒素原子と一緒になって、さらに、当該窒素に（直接的に）隣接しないＮまたはＯの範囲からのヘテロ原子を含有することができる３から７員の環を形成し、

Ｒ１７およびＲ１８は、相互に独立して、以下の基：Ｈ、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ１１の１以上を表し、

あるいは各々、１または複数の、同一または異なったフッ素、塩素、臭素、－ＯＨ、シアノ、Ｃ１－Ｃ６アルキル、および－Ｏ－（Ｃ１－Ｃ４アルキル）で置換されていてもよい、Ｃ１－Ｃ６アルキル、Ｃ３－Ｃ６シクロアルキル、Ｃ２－Ｃ６アルケニル、Ｃ２－Ｃ６アルキニル、Ｃ３－Ｃ８シクロアルキル、Ｃ６－Ｃ１４アリール、Ｃ２－Ｃ９ヘテロシクリルまたはＣ２－Ｃ９ヘテロアリールを表し、

Ｒ１９はＨ、Ｃ１－Ｃ６アルキル、Ｃ３－Ｃ６シクロアルキル、Ｃ２－Ｃ６アルケニル、Ｃ２－Ｃ６アルキニル、－Ｃ（Ｓ）Ｒ１５、－Ｃ（Ｏ）Ｒ１５、－ＳＯ２Ｒ１５または－Ｃ（Ｏ）ＯＲ１５を表し、

Ｒ２０およびＲ２１は、相互に、独立して、Ｃ１－Ｃ６アルキル、Ｃ３－Ｃ６シクロアルキル、Ｃ２－Ｃ６アルケニルまたはＣ２－Ｃ６アルキニルを表し、各々、１または複数の、同一または異なったフッ素、塩素、臭素、－ＯＨまたはシアノで置換されていてもよく、あるいは水素を表し、ならびに

Ｒ２２およびＲ２３は、相互に独立して、Ｃ１－Ｃ６アルキル、Ｃ３－Ｃ６シクロアルキル、Ｃ２－Ｃ６アルケニル、Ｃ２－Ｃ６アルキニルまたは水素を表す］

の化合物、およびその農薬的に活性な塩である。

【００１１】

式［Ｉ－ａ］の記号が以下の意味：

Ｘ１がＮを表し、および

Ｒ１が置換されていてもよいフェニルを表し、

Ｒ３がブチルまたはプロピン－２－イルを表し、

Ｒ４がＮＨＲ１２を表し、および

Ｒ１２が置換されていてもよいＣ６－Ｃ１４アリールを表す化合物、ならびに

Ｘ１がＮを表し、

Ｒ２、Ｒ４、Ｒ５、Ｒ６がＨを表し、

Ｒ３が、Ｒ１が４－クロロフェニルを表す場合、メチル、エチル、アリル、２－メトキシエチルまたはベンジルを表し、あるいは

Ｒ３が、Ｒ１がフェニル、４－メトキシフェニルまたは４－フルオロフェニルを表す場合、メチルを表す化合物；

を有する組合せは、一般的に詳述した、または前記好ましい範囲において詳述した残基の定義または説明から除かれる。

【００１２】

最後に、本発明による式［Ｉ－ａ］のフェニルピリ（ミ）ジニラゾール類は非常に良好な殺微生物特性を保有し、植物および材料の保護における望まれない微生物の防除のために、ならびに植物および植物の部分におけるマイコトキシンの低下のために用いることができる。

【００１３】

本発明によるフェニルピリ（ミ）ジニラゾール類は、一般に、式［Ｉ－ａ］によって定義される。前記および後記で名称が挙げられる式の好ましい残基の定義は以下に述べる。これらの定義は、式［Ｉ－ａ］の最終生成物、および全ての中間体に等しく適用される。

【００１４】

本発明の式［Ｉ－ａ］の好ましい化合物は、記号の１以上が以下の意味：

X^1はＣ－ＨまたはＮを表し、
R^1は、フェニル、ナフタレニル、キノリン－５－イル、キノリン－８－イル、イソキノリン－５－イル、イソキノリン－８－イル、１，３－ベンゾジオキソール－４－イルまたは１，３－ベンゾジオキソール－５－イルを表し、各々、１または複数の、同一または異なったR^7で置換されていてもよく、
R^2は、シアノ、ニトロ、ハロゲン、C_1－C_6アルキル、C_1－C_6アルコキシ、C_1－C_6ハロアルキル、C_1－C_6ハロアルコキシ、C_1－C_6アルキルチオ、C_3－C_6シクロアルキル、C_3－C_6ハロシクロアルキル、C_2－C_9ヘテロシクリルまたは水素を表し、
R^3は、各々、１または複数の、同一または異なったハロゲン、シアノ、ヒドロキシまたはハロアルコキシで置換されていてもよい、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_3－C_6シクロアルキル－C_1－C_6アルキル、C_6－C_{14}アリール－C_1－C_6アルキル、C_1－C_6アルコキシ－C_1－C_6アルキル、C_1－C_6アルコキシ、C_2－C_9ヘテロシクリル－C_1－C_6アルキルおよびC_2－C_9ヘテロアリールを表し、あるいは
ピリジン－２－イルメチル、ピリジン－３－イルメチル、ピリジン－４－イルメチル、２－クロロ－１，３－チアゾール－５－イル）メチル、５－（トリフルオロメチル）－１，３，４－チアジアゾール－２－イル、２－（メチルスルファニル）－エチル、２－シクロヘキシル－２－オキソエチル、２－シクロペンチル－２－オキソエチル、１－アセチルピペリジン－４－イル、テトラ－ヒドロフラン－３－イル、２－オキソテトラヒドロフラン－３－イル、２－アセトキシエチル、２－ｔｅｒｔ－ブトキシ－２－オキソエチル、１－メトキシ－３－メチル－１－オキソブタン－２－イル、１－メトキシ－１－オキソプロパン－２－イル、２－［２－（２－メトキシエトキシ）エトキシ］エチル、２－（２－メトキシエトキシ）エチル、ビフェニル－４－イルメチル、ビフェニル－３－イルメチル、ビフェニル－２－イルメチル、３－フェノキシベンジル、４－フルオロ－３－フェノキシ－ベンジル、シクロペンチルオキシ、２－（１，５－ジメチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）－２－オキソエチルまたは３－エトキシ－３－オキソプロピルを表し、
R^4は水素、－$NR^{12}R^{13}$または－Ｃ（Ｏ）$NR^{12}R^{13}$を表し、
ここで、R^4は好ましくは水素またはNHR^{13}を表し、次いで、R^{13}は、各々、１または複数の、同一または異なったフッ素、塩素、臭素、－ＯＨまたはシアノで置換されていてもよい、C_1－C_6アルキル、C_3－C_6シクロアルキル、C_2－C_6アルケニル、C_2－C_6アルキニル、C_3－C_8シクロアルキル、C_2－C_9ヘテロシクリルまたはC_2－C_9ヘテロアリールを表し、
R^5およびR^6は、相互に独立して、水素、フッ素、塩素、臭素、シアノ、ニトロ、－ＯＨまたは－ＳＨを表し、
あるいは各々、１または複数の、同一または異なったR^{11}で置換されていてもよい、C_1－C_6アルキル、C_3－C_6シクロアルキル、C_2－C_6アルケニル、C_2－C_6アルキニル、－Ｏ－（C_1－C_4アルキル）、－Ｓ－（C_1－C_4アルキル）または－Ｓ（Ｏ）－（C_1－C_6アルキル）を表し、
あるいはそれらが結合している炭素原子と一緒になって、３から８の環原子を持つ飽和、不飽和または部分的不飽和の単一の環を形成し、ここで、該単一の環は酸素、硫黄または－Ｎ－R^{19}の範囲からのヘテロ原子を含有することができ、１または複数の、同一または異なったハロゲン、酸素、シアノまたはC_1－C_4アルキルで置換されていてもよく、
R^7は、相互に独立して、以下の基：フッ素、塩素、臭素、シアノ、ニトロ、メチル、エチル、イソプロピル、－CF_3、－CHF_2、－C_2F_5、－CCl_3、－OCH_3、－OC_2H_5、－Ｏ－ＣＨ（CH_3）$_2$、－OCF_3、－$OCHF_2$、－OC_2F_5、－SCH_3、－SO_2CH_3または－SCF_3の１以上を表し、
R^{11}は、－ＯＨ、フッ素、塩素、臭素、シアノ、－ＮＨ－Ｃ（Ｏ）R^{20}、－Ｃ（Ｏ）R^{20}、－Ｃ（Ｏ）OR^{20}、－Ｃ（Ｏ）$NR^{20}R^{21}$または－SO_2R^{20}を表し

、
あるいは各々、１または複数の、同一または異なったフッ素、塩素、臭素、－ＯＨ、シアノ、Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキルまたはＯ－（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）で置換されていてもよい、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$_{11}$ヘテロアルキル、Ｃ$_3$－Ｃ$_8$シクロアルキル、－Ｏ－（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）、－Ｓ－（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）、－Ｏ－（Ｃ$_3$－Ｃ$_8$シクロアルキル）、－Ｓ－（Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル）、Ｃ$_2$－Ｃ$_9$ヘテロシクリルまたはＣ$_2$－Ｃ$_9$ヘテロアリールを表し、
Ｒ^{12}およびＲ^{13}は、相互に独立して、以下の基：Ｈ、－Ｃ（Ｓ）Ｒ^{15}、－Ｃ（Ｏ）Ｒ^{15}、－ＳＯ$_2$Ｒ^{15}、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ^{15}、－ＯＲ^{15}または－Ｃ（Ｏ）ＮＲ^{15}Ｒ^{16}の１以上を表し、
あるいは各々、１または複数の、同一または異なったフッ素、塩素、臭素、－ＯＨまたはシアノで置換されていてもよい、Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル、Ｃ$_2$－Ｃ$_6$アルケニル、Ｃ$_2$－Ｃ$_6$アルキニル、Ｃ$_3$－Ｃ$_8$シクロアルキル、Ｃ$_2$－Ｃ$_9$ヘテロシクリルまたはＣ$_2$－Ｃ$_9$ヘテロアリールを表し、
Ｒ^{15}およびＲ^{16}は、相互に独立して、Ｈまたは－ＯＨを表し、
あるいは各々、１または複数の、同一または異なったＲ^{11}で置換されていてもよい、Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル、Ｃ$_2$－Ｃ$_6$アルケニル、Ｃ$_2$－Ｃ$_6$アルキニル、Ｃ$_3$－Ｃ$_8$シクロアルキル、Ｃ$_6$－Ｃ$_{14}$アリール、Ｃ$_2$－Ｃ$_9$ヘテロシクリルまたはＣ$_2$－Ｃ$_9$ヘテロアリールを表し、
あるいはＲ^{12}および／またはＲ^{13}が－Ｃ（Ｏ）ＮＲ^{15}Ｒ^{16}を表す場合、それらが結合している窒素原子と一緒になって、当該窒素に直接的に隣接しないＮまたはＯの範囲からのさらなるヘテロ原子を含有することができる３から７員の環を形成し、
Ｒ^{19}はＨ、Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル、Ｃ$_2$－Ｃ$_6$アルケニル、Ｃ$_2$－Ｃ$_6$アルキニル、－Ｃ（Ｓ）Ｒ^{15}、－Ｃ（Ｏ）Ｒ^{15}、－ＳＯ$_2$Ｒ^{15}または－Ｃ（Ｏ）ＯＲ^{15}を表し、
Ｒ^{20}およびＲ^{21}は、相互に独立して、Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル、Ｃ$_2$－Ｃ$_6$アルケニル、またはＣ$_2$－Ｃ$_6$アルキニルを表し、各々、１または複数の、同一または異なったフッ素、塩素、臭素、－ＯＨまたはシアノで置換されていてもよく、あるいは水素を表し、ならびに
Ｒ^{22}およびＲ^{23}は、相互に独立して、Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル、Ｃ$_2$－Ｃ$_6$アルケニル、Ｃ$_2$－Ｃ$_6$アルキニルまたは水素を表す；
の１つを有するもの、ならびにその農薬的に活性な塩である。

【００１５】

本発明の第一の実施態様において、記号の１以上が以下の意味：
Ｘ^{1}はＣ－Ｈを表し、
Ｒ^{1}は、各々、１または複数の、同一または異なったＲ^{7}で置換されていてもよい、フェニルまたはナフタレニルを表し、
Ｒ^{2}はハロゲン、Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキルまたは水素を表し、
Ｒ^{3}はプロパン－２－イル、イソブチル、ブタン－２－イル、２－メチルプロピル、２，２－ジメチルプロピル、３－メチルブタ－２－エン－１－イル、ブタ－２－エン－１－イル、ブタ－３－エン－２－イル、プロパジエニル、４－メチルペンタ－３－エン－２－イル、プロパ－２－イン－１－イル、ブタ－２－イン－１－イル、ブタ－３－イン－２－イル、２－メチルブタ－３－イン－２－イル、２－メチルブタ－３－イン－２－イル、シアノメチル、２－シアノエチル、１－シアノプロパン－２－イル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロペンチルオキシ、シクロヘキシル、（２，２－ジクロロシクロプロピル）－メチル、シクロプロピルメチル、１－シクロプロピルエチル、トリクロロメチル、トリフルオロメチル、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、２，２，２－トリクロロエチル、２－クロロエチル、２－ブロモエチル、２－フルオロプロピル、３－フルオロプロピル、２－クロロプロピル、３－クロロプロピル、１，１，１－トリフルオロプロパン－２－イル、１，１－ジフル

オロプロパン－２－イル、１，１，１－トリフルオロ－２－メチルプロパン－２－イル、１，３－ジフルオロプロパン－２－イル、３，３，３－トリフルオロ－２－ヒドロキシプロピル、ピリジン－２－イルメチル、ピリジン－３－イルメチル、ピリジン－４－イルメチル、２－クロロ－１，３－チアゾール－５－イルメチル、ベンジル、２－フルオロベンジル、３－フルオロベンジル、４－フルオロベンジル、１－（２－クロロフェニル）エチル、２，３－ジフルオロベンジル、２－クロロ－６－フルオロベンジル、１－（３－クロロフェニル）エチル、１－（４－クロロフェニル）エチル、２－シアノベンジル、３－シアノベンジル、４－シアノベンジル、４－（ジフルオロ－メトキシ）ベンジル、ビフェニル－３－イルメチル、ビフェニル－４－イルメチル、ビフェニル－２－イルメチル、３－フェノキシベンジル、４－フルオロ－３－フェノキシベンジル、２－（３－クロロフェニル）エチル、２－（２－クロロフェニル）エチル、１－ナフチルメチル、メトキシメチル、２－メトキシエチル、２－メトキシプロピル、２－（メチルスルファニル）エチル、２－（トリフルオロメトキシ）エチル、１－メトキシプロパン－２－イル、２－［２－（２－メトキシエトキシ）エトキシ］エチル、２－（２－メトキシエトキシ）エチル、１，３－ジメトキシプロパン－２－イル、２－（シクロプロピルオキシ）エチル、プロポキシ、（２－メチルプロパ－２－エン－１－イル）オキシ、（３－メチル－ブタノイル）オキシ、１－シアノエトキシ、２－クロロエトキシ、ブタ－２－イン－１－イルオキシ、シアノメトキシ、プロパ－２－イン－１－イルオキシ、２－シクロヘキシル－２－オキソエチル、２－シクロペンチル－２－オキソエチル、テトラヒドロ－フラン－２－イルメチル、（３－メチルオキセタン－３－イル）メチル、１Ｈ－イミダゾール－２－イルメチル、２－（１，５－ジメチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）－２－オキソエチル、１－アセチルピペリジン－４－イル、テトラヒドロフラン－３－イル、２－オキソテトラヒドロフラン－３－イル、５－（トリフルオロメチル）ピリジン－２－イル、５－（トリフルオロメチル）－１，３，４－チアジアゾール－２－イル、６－（トリフルオロメチル）ピリミジン－４－イル、２－ヒドロキシプロピル、２－ヒドロキシ－２－メチルプロピル、２，３－ジヒドロキシプロピル、２－アセトキシエチル、シアノ、２－ｔｅｒｔ－ブトキシ－２－オキソエチル、１－メトキシ－３－メチル－１－オキソブタン－２－イル、１－メトキシ－１－オキソプロパン－２－イルまたは３－エトキシ－３－オキソプロピル、プロパン－２－イルオキシ、メチル、エチル、２－エトキシエチル、または２－クロロエチルを表し、

R^4は水素、－Ｃ（Ｏ）ＮＲ^{12}Ｒ^{13}または－ＮＲ^{12}Ｒ^{13}を表し、

ここで、R^4は好ましくは水素を表し、

R^5およびR^6は、相互に独立して、水素、フッ素、塩素、臭素、シアノ、ニトロを表し、

あるいは各々、１または複数の、同一または異なったR^{11}で置換されていてもよい、C_1－C_6アルキル、C_3－C_6シクロアルキル、C_2－C_6アルケニル、C_2－C_6アルキニル、－Ｏ－（C_1－C_4アルキル）、－Ｓ－（C_1－C_4アルキル）または－Ｓ（Ｏ）－（C_1－C_6アルキル）を表し、

あるいはそれらが結合している炭素原子と一緒に、それらが一緒に、１または複数の、同一または異なったR^{11}で置換されていてもよい、－（ＣＨ＝ＣＨ－ＣＨ＝ＣＨ）－、－（ＣＨ＝ＣＨ－Ｎ（R^{19}）、－（ＣＨ＝ＣＨ－ＣＨ＝Ｎ）－、－（ＮＨ－ＣＨ＝Ｎ）－または－（CH_2－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（R^{19}）－を表す単一の環を形成し、

R^7は、相互に独立して、以下の基：フッ素、塩素、シアノ、ニトロ、メチル、エチル、イソプロピル、－CF_3、－CHF_2、－C_2F_5または－CCl_3の１以上を表し、

R^{11}は、－ＯＨ、フッ素、塩素、臭素、シアノ、－ＮＨＣ（Ｏ）R^{20}、－Ｃ（Ｏ）R^{20}、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ^{20}、－Ｃ（Ｏ）ＮＲ^{20}Ｒ^{21}または－SO_2R^{20}を表し、

あるいは各々、１または複数の、同一または異なったフッ素、塩素、臭素、－ＯＨ、シアノ、C_1－C_6アルキルまたは－Ｏ－（C_1－C_4アルキル）で置換されていてもよい、C_1－C_6アルキル、C_3－C_8シクロアルキル、C_2－C_6アルケニル、C_2－C_6アルキニル、－Ｏ－（C_1－C_4アルキル）、－Ｓ－（C_1－C_4アルキル）、－Ｏ－（

C_3－C_8シクロアルキル）または－Ｓ－（C_3－C_8シクロアルキル）を表し、
R^{12}およびR^{13}は、相互に独立して、以下の基：Ｈ、－Ｃ（Ｓ）R^{15}、－Ｃ（Ｏ）R^{15}、－SO_2R^{15}、－Ｃ（Ｏ）OR^{15}、－OR^{15}または－Ｃ（Ｏ）$NR^{15}R^{16}$の１以上を表し、
あるいは各々、１または複数の、同一または異なったフッ素、塩素、臭素、－ＯＨまたはシアノで置換されていてもよい、C_1－C_6アルキル、C_3－C_6シクロアルキル、C_2－C_6アルケニル、C_2－C_6アルキニル、C_2－C_9ヘテロシクリルまたはC_2－C_9ヘテロアリールを表し、
R^{15}およびR^{16}は、相互に独立して、各々、１または複数の、同一または異なったR^{11}で置換されていてもよい、C_1－C_6アルキル、C_3－C_6シクロアルキル、C_2－C_6アルケニル、C_2－C_6アルキニル、C_3－C_8シクロアルキル、C_2－C_9ヘテロシクリルまたはC_2－C_9ヘテロアリールを表し、
あるいは水素を表し、
あるいはそれらが結合している窒素原子と一緒になって、当該窒素に隣接しないＮまたはＯの範囲からのさらなるヘテロ原子を含有することができる３から７員の環を形成し、
R^{19}はＨ、C_2－C_6アルキニル、Ｃ（Ｏ）R^{15}、SO_2R^{15}またはＣ（Ｏ）OR^{15}を表し、ならびに
R^{20}およびR^{21}は、相互に独立して、各々、１または複数の、同一または異なったフッ素、塩素、臭素、－ＯＨまたはシアノで置換されていてもよい、C_1－C_6アルキル、C_3－C_6シクロアルキル、C_2－C_6アルケニルまたはC_2－C_6アルキニルを表し、
あるいは水素を表す；
の１つを有する式［Ｉ－ａ］の化合物、ならびにその農薬的に活性な塩が特に好ましい。

【００１６】

本発明のこの第一の実施態様において、記号の１以上が以下の意味：
X^1はＣ－Ｈを表し、
R^1は、１または複数の、同一または異なったR^7で置換されていてもよい、フェニルを表し、
R^2はメチル、エチル、イソプロピル、シクロプロピルまたは水素を表し、
R^3はプロパン－２－イル、イソブチル、ブタン－２－イル、２－メチルプロピル、２，２－ジメチルプロピル、３－メチルブタ－２－エン－１－イル、ブタ－２－エン－１－イル、ブタ－３－エン－２－イル、プロパジエニル、プロパ－２－イン－１－イル、ブタ－２－イン－１－イル、ブタ－３－イン－２－イル、２－メチルブタ－３－イン－２－イル、２－メチルブタ－３－イン－２－イル、シアノ－メチル、２－シアノエチル、１－シアノプロパン－２－イル、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、（２，２－ジクロロシクロプロピル）メチル、シクロプロピルメチル、１－シクロプロピルエチル、トリクロロメチル、トリフルオロメチル、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、２，２，２－トリクロロエチル、２－クロロエチル、２－ブロモエチル、２－フルオロプロピル、３－フルオロプロピル、２－クロロプロピル、３－クロロプロピル、１，３－ジフルオロプロパン－２－イル、２－フルオロベンジル、３－フルオロ－ベンジル、４－フルオロベンジル、２，３－ジフルオロベンジル、２－クロロ－６－フルオロベンジル、１－（２－クロロ－フェニル）エチル、１－（３－クロロフェニル）エチル、１－（４－クロロフェニル）エチル、３－シアノベンジル、４－シアノベンジル、４－（ジフルオロメトキシ）ベンジル、２－シアノベンジル、２－（３－クロロフェニル）エチル、２－（２－クロロフェニル）エチル、１－ナフチルメチル、（ピリジン－３－イルメチル、２－クロロ－１，３－チアジアゾール－５－イル）メチル、メトキシメチル、２－メトキシエチル、２－（メチルスルファニル）エチル、２－（トリフルオロメトキシ）エチル、１－メトキシプロパン－２－イル、２－［２－（２－メトキシエトキシ）エトキシ］－エチル、２－（２－メトキシエトキシ）エチル、テトラヒドロフラン－２－イルメチル、（３－メチルオキセタン－３－イル）メ

チル、１Ｈ－イミダゾール－２－イルメチル、テトラヒドロフラン－３－イル、２－オキソテトラヒドロフラン－３－イル、２－ｔｅｒｔ－ブトキシ－２－オキソエチル、１－メトキシ－３－メチル－１－オキソブタン－２－イル、１－メトキシ－１－オキソプロパン－２－イルまたは３－エトキシ－３－オキソプロピル、プロパン－２－イルオキシ、２－エトキシエチル、メチル、エチル、１－プロピルまたは２－クロロエチルを表し、好ましい修飾において、R^3は先に定義した通りであるが、メチルまたはエチルを含まず、

R^4は水素、－$NR^{12}R^{13}$または－NHR^{13}を表し、

ここで、R^4は好ましくは水素を表し、

R^5およびR^6は、相互に独立して、水素、フッ素またはシアノを表し、

あるいはそれらが結合している炭素原子と一緒になって、それらが一緒に、１または複数の、同一または異なったR^{11}で置換されていてもよい、－（ＣＨ＝ＣＨ－ＣＨ＝ＣＨ）－、－（ＣＨ＝ＣＨ－Ｎ（R^{19}）、－（ＣＨ＝ＣＨ－ＣＨ＝Ｎ）－、－（ＮＨ－ＣＨ＝Ｎ）－または－（CH_2－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（R^{19}）－を表す環を形成し、

R^7は、相互に独立して、以下の基：フッ素、塩素、シアノまたはメチルの１以上を表し、

R^{11}は－ＯＨ、フッ素、塩素、臭素、シアノ、－ＮＨ－Ｃ（Ｏ）R^{20}、－Ｃ（Ｏ）R^{20}、－Ｃ（Ｏ）OR^{20}、－Ｃ（Ｏ）$NR^{20}R^{21}$または－SO_2R^{20}を表し、

あるいは各々、１または複数の、同一または異なったフッ素、塩素、臭素、ＯＨ、シアノ、C_1－C_6アルキル、または－Ｏ－（C_1－C_4アルキル）で置換されていてもよい、C_1－C_6アルキル、C_3－C_8シクロアルキル、C_2－C_6アルケニル、C_2－C_6アルキニル、－Ｏ－（C_1－C_4アルキル）、－Ｓ－（C_1－C_4アルキル）、－Ｏ－（C_3－C_8シクロアルキル）または－Ｓ－（C_3－C_8シクロアルキル）を表し、

R^{12}は－Ｃ（Ｓ）R^{15}、－Ｃ（Ｏ）R^{15}、－SO_2R^{15}、－Ｃ（Ｏ）OR^{15}、－OR^{15}または－Ｃ（Ｏ）$NR^{15}R^{16}$を表し、

R^{13}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_2－C_9ヘテロシクリルまたはC_2－C_9ヘテロアリールまたは水素を表し、

R^{15}は、各々、１または複数の、同一または異なったハロゲン、－ＯＨ、シアノまたはC_1－C_4アルキルで置換されていてもよい、C_1－C_6アルキル、C_3－C_6シクロアルキル、C_2－C_6アルケニル、C_2－C_6アルキニル、C_3－C_8シクロアルキル、C_2－C_9ヘテロシクリルまたはC_2－C_9ヘテロアリールを表し、

あるいは水素を表し、

R^{16}は水素、メチル、エチルまたはプロピルを表し、

R^{19}はＨ、C_2－C_6アルキニル、－Ｃ（Ｏ）R^{15}、－SO_2R^{15}または－Ｃ（Ｏ）OR^{15}を表し、ならびに

R^{20}およびR^{21}は、相互に独立して、各々、１または複数の、同一または異なったフッ素、塩素、臭素、ＯＨまたはシアノで置換されていてもよい、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、シクロプロピルまたはシクロブチルを表し、

あるいは水素を表す；

の１つを有する式［Ｉ－ａ］の化合物、ならびにその農薬的に活性な塩がかなり特に好ましい。

【００１７】

本発明のこの第一の実施態様において、記号の１以上が以下の意味：

X^1はＣ－Ｈを表し、

R^1はフェニル、３－メチルフェニル、２－フルオロフェニル、３－フルオロフェニル、４－フルオロフェニル、３－トリフルオロメチルフェニル、４－クロロフェニル、２，５－ジフルオロフェニル、２，４－ジフルオロフェニル、２，６－ジフルオロフェニル、３－メチル－４－フルオロフェニル、３－シアノ－４－フルオロフェニルまたは２，４，６－トリフルオロフェニルを表し、

R^2はメチル、エチル、イソプロピル、シクロプロピル、または水素を表し、

R^3はプロパン－２－イル、イソブチル、ブタン－２－イル、２－メチルプロピル、２

，２－ジメチルプロピル、プロパ－２－イン－１－イル、ブタ－３－イン－２－イル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、（２，２－ジクロロシクロプロピル）メチル、シクロプロピルメチル、１－シクロプロピルエチル、トリフルオロメチル、トリクロロメチル、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、２，２，２－トリクロロ－エチル、２－クロロエチル、２－フルオロプロピル、３－フルオロプロピル、１，３－ジフルオロプロパン－２－イル、２－フルオロベンジル、２，３－ジフルオロベンジル、２－クロロ－６－フルオロベンジル、１－（２－クロロフェニル）エチル、１－（３－クロロフェニル）エチル、２－（トリフルオロメトキシ）エチル、または１－メトキシプロパン－２－イル、２，２－ジフルオロエチル、２－シアノエチル、シアノメチル、１－シアノプロパン－２－イル、１－プロピル、２－エトキシエチル、２－クロロエチルまたは２－メトキシエチルを表し、

R^4は水素を表し、

R^5およびR^6は、相互に独立して、水素、フッ素またはシアノを表し、

あるいはそれらが結合している炭素原子と一緒になって、それらが一緒になって、１または複数の、同一または異なったR^{11}で置換されていてもよい、－（ＣＨ＝ＣＨ－ＣＨ＝ＣＨ）－、－（ＣＨ＝ＣＨ－Ｎ（R^{19}）－、－（ＣＨ＝ＣＨ－ＣＨ＝Ｎ）－、－（ＮＨ－ＣＨ＝Ｎ）－または－（CH_2－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（R^{19}）－を表す環を形成し、

R^{11}は－ＯＨ、フッ素、塩素、シアノ、C_1－C_6アルキル、C_2－C_6アルケニルまたはC_2－C_6アルキニル、またはC_3－C_6シクロアルキルを表し、

あるいは水素を表し、ならびに

R^{19}はＨ、アセチル、エトキシカルボニル、メトキシカルボニル、プロパ－２－イン－１－イルまたはブタ－２－イン－１－イルを表す；

の１つを有する式［Ｉ－ａ］の化合物、ならびにその農薬的に活性な塩が特別に好ましい。

【００１８】

本発明のこの第一の実施態様において、記号の１以上が以下の意味：

X^1はＣ－Ｈを表し、

R^4はＨを表し、および

R^3はプロパン－２－イル、イソブチル、ブタン－２－イル、２－メチルプロピル、プロパ－２－イン－１－イル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、（２，２－ジクロロシクロプロピル）メチル、シクロプロピルエチル、１－シクロプロピルエチル、２，２，２－トリフルオロエチル、２－フルオロベンジル、２－（トリフルオロメトキシ）エチル、１－メトキシプロパン－２－イル、２，２－ジフルオロエチル、２－シアノエチル、シアノメチル、１－シアノ－プロパン－２－イル、１－プロピル、２－エトキシエチル、２－シクロエチルまたは２－メトキシエチルを表し、

ここで、他の置換基は前記意味の１以上を有する；

の１つを有する式［Ｉ－ａ］の化合物、ならびにその農薬的に活性な塩がさらに特別に好ましい。

【００１９】

さらに特別に好ましいのは、式［Ｉ－ａ］

［式中、

R^3はプロパン－２－イル、イソブチル、ブタン－２－イル、２－メチルプロピル、プロパ－２－イン－１－イル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、（２，２－ジクロロシクロプロピル）メチル、シクロプロピル－メチル、２，２，２－トリフルオロエチル、２－フルオロベンジル、２－（トリフルオロメトキシ）エチルまたは１－メトキシ－プロパン－２－イルを表し、

ここで、他の置換基は前記した意味の１以上を有する］

の本発明の第一の実施態様の化合物、およびその農薬的に活性な塩である。

【００２０】

本発明の第二の実施態様において、記号の１以上が以下の意味：

X^1はＮを表し、
R^1は、各々、１または複数の、同一または異なったR^7で置換されていてもよい、フェニルまたはナフタレニルを表し、
R^2はハロゲン、C_1－C_6アルキル、C_3－C_6シクロアルキル、または水素を表し、
R^3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_3－C_6シクロアルキル、C_3－C_6シクロアルキル－C_1－C_6アルキル、C_6－C_{14}アリール－C_1－C_6アルキル、C_1－C_6アルコキシ－C_1－C_6アルキル、C_1－C_6アルコキシ、C_2－C_9ヘテロシクリル－C_1－C_6アルキルおよびC_2－C_9ヘテロアリールを表し、各々、１または複数の、同一または異なったハロゲン、シアノ、ヒドロキシまたはハロアルコキシで置換されていてもよく、
R^4は水素、－Ｃ（Ｏ）$NR^{12}R^{13}$または－$NR^{12}R^{13}$を表し、
ここで、R^4は好ましくは－NHR^{13}を表し、およびR^{13}は、各々、１または複数の、同一または異なったフッ素、塩素、臭素、－ＯＨまたはシアノで置換されていてもよい、C_1－C_6アルキル、C_3－C_6シクロアルキル、C_2－C_6アルケニル、C_2－C_6アルキニル、C_2－C_9ヘテロシクリルまたはC_2－C_9ヘテロアリールを表し、
R^5およびR^6は、相互に独立して、水素、フッ素、塩素、臭素、シアノまたはニトロを表し、あるいは各々、１または複数の、同一または異なったR^{11}で置換されていてもよい、C_1－C_6アルキル、C_3－C_6シクロアルキル、C_2－C_6アルケニル、C_2－C_6アルキニル、－Ｏ－（C_1－C_4アルキル）、－Ｓ－（C_1－C_4アルキル）または－Ｓ（Ｏ）－（C_1－C_6アルキル）を表し、
あるいはそれらが結合している炭素原子と一緒になって、それらが一緒に、１または複数の、同一または異なったR^{11}で置換されていてもよい、－（ＣＨ＝ＣＨ－ＣＨ＝ＣＨ）－、－（ＣＨ＝ＣＨ－Ｎ（R^{19}）、－（ＣＨ＝ＣＨ－ＣＨ＝Ｎ）－、－（ＮＨ－ＣＨ＝Ｎ）－または－（CH_2－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（R^{19}）－を表す単一の環を形成し、
R^7は、相互に独立して、以下の基：フッ素、塩素、シアノ、ニトロ、メチル、エチル、イソプロピル、－CF_3、－CHF_2、－C_2F_5または－CCl_3の１以上を表し、
R^{11}は－ＯＨ、フッ素、塩素、臭素、シアノ、－ＮＨＣ（Ｏ）R^{20}、－Ｃ（Ｏ）R^{20}、－Ｃ（Ｏ）OR^{20}、－Ｃ（Ｏ）$NR^{20}R^{21}$または－SO_2R^{20}を表し、
あるいは各々、１または複数の、同一または異なったフッ素、塩素、臭素、－ＯＨ、シアノ、C_1－C_6アルキルまたは－Ｏ－（C_1－C_4アルキル）で置換されていてもよい、C_1－C_6アルキル、C_3－C_8シクロアルキル、C_2－C_6アルケニル、C_2－C_6アルキニル、－Ｏ－（C_1－C_4アルキル）、－Ｓ－（C_1－C_4アルキル）、－Ｏ－（C_3－C_8シクロアルキル）または－Ｓ－（C_3－C_8シクロアルキル）を表し、
R^{12}およびR^{13}は、相互に独立して、以下の基：Ｈ、－Ｃ（Ｓ）R^{15}、－Ｃ（Ｏ）R^{15}、－SO_2R^{15}、－Ｃ（Ｏ）OR^{15}、－OR^{15}または－Ｃ（Ｏ）$NR^{15}R^{16}$の１以上を表し、
あるいは各々、１または複数の、同一または異なったフッ素、塩素、臭素、－ＯＨまたはシアノで置換されていてもよい、C_1－C_6アルキル、C_3－C_6シクロアルキル、C_2－C_6アルケニル、C_2－C_6アルキニル、C_2－C_9ヘテロシクリルまたはC_2－C_9ヘテロアリールを表し、
R^{15}およびR^{16}は、相互に独立して、各々、１または複数の、同一または異なったR^{11}で置換されていてもよい、C_1－C_6アルキル、C_3－C_6シクロアルキル、C_2－C_6アルケニル、C_2－C_6アルキニル、C_3－C_8シクロアルキル、C_2－C_9ヘテロシクリルまたはC_2－C_9ヘテロアリールを表し、
あるいは水素を表し、
あるいはそれらが結合している窒素原子と一緒になって、当該窒素に隣接しないＮまたはＯの範囲からのさらなるヘテロ原子を含有することができる３から７員の環を形成し、
R^{19}はＨ、C_2－C_6アルキニル、－Ｃ（Ｏ）R^{15}、－SO_2R^{15}または－Ｃ（Ｏ）OR^{15}を表し、ならびに

R^{20}およびR^{21}は、相互に独立して、各々、１または複数の、同一または異なったフッ素、塩素、臭素、－ＯＨまたはシアノで置換されていてもよい、C_1－C_6アルキル、C_3－C_6シクロアルキル、C_2－C_6アルケニルまたはC_2－C_6アルキニルを表し、
あるいは水素を表す；
の１つを有する式［Ｉ－ａ］の化合物、ならびにその農薬的に活性な塩が特に好ましい。

【００２１】

本発明のこの第二の実施態様において、記号の１以上が以下の意味：
X^1はＮを表し、
R^1は、１または複数の、同一または異なったR^7で置換されていてもよいフェニルを表し、
R^2はメチル、エチル、イソプロピル、シクロプロピルまたは水素を表し、
R^3はメチル、エチル、１－プロピル、プロパン－２－イル、イソブチル、ブタン－２－イル、２－メチルプロピル、２，２－ジメチルプロピル、３－メチルブタ－２－エン－１－イル、ブタ－２－エン－１－イル、ブタ－３－エン－２－イル、プロパジエニル、プロパ－２－イン－１－イル、ブタ－２－イン－１－イル、ブタ－３－イン－２－イル、２－メチルブタ－３－イン－２－イル、２－メチルブタ－３－イン－２－イル、シアノメチル、２－シアノエチル、１－シアノプロパン－２－イル、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、（２，２－ジクロロシクロプロピル）メチル、シクロプロピルメチル、１－シクロプロピルエチル、トリクロロメチル、トリフルオロメチル、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、２，２，２－トリクロロエチル、２－クロロエチル、２－ブロモエチル、２－フルオロプロピル、３－フルオロプロピル、２－クロロプロピル、３－クロロプロピル、１，３－ジフルオロプロパン－２－イル、２－フルオロベンジル、３－フルオロベンジル、４－フルオロベンジル、２，３－ジフルオロベンジル、２－クロロ－６－フルオロベンジル、１－（２－クロロフェニル）エチル、１－（３－クロロフェニル）エチル、１－（４－クロロフェニル）エチル、３－シアノ－ベンジル、４－シアノベンジル、４－（ジフルオロメトキシ）ベンジル、２－シアノベンジル、２－（３－クロロ－フェニル）エチル、２－（２－クロロフェニル）エチル、１－ナフチルメチル、（ピリジン－３－イルメチル、２－クロロ－１，３－チアジアゾール－５－イル）メチル、メトキシメチル、２－メトキシエチル、２－（メチル－スルファニル）エチル、２－（トリフルオロメトキシ）エチル、１－メトキシプロパン－２－イル、２－［２－（２－メトキシエトキシ）エトキシ］エチル、２－（２－メトキシエトキシ）エチル、テトラヒドロフラン－２－イルメチル、（３－メチルオキセタン－３－イル）メチル、１Ｈ－イミダゾール－２－イルメチル、テトラヒドロフラン－３－イル、２－オキソ－テトラヒドロフラン－３－イル、２－ｔｅｒｔ－ブトキシ－２－オキソエチル、１－メトキシ－３－メチル－１－オキソブタン－２－イル、１－メトキシ－１－オキソプロパン－２－イルまたは３－エトキシ－３－オキソプロピル、プロパン－２－イルオキシ、２－エトキシ－エチル、または２－クロロエチルを表し、
R^4は水素、－$NR^{12}R^{13}$または－NHR^{13}を表し、
ここで、R^4は好ましくは－NHR^{13}を表し、およびR^{13}は、各々、１または複数の、同一または異なったフッ素、塩素、臭素、ＯＨまたはシアノで置換されていてもよい、C_1－C_6アルキル、C_3－C_6シクロアルキル、C_2－C_6アルケニル、C_2－C_6アルキニル、C_2－C_9ヘテロシクリルまたはC_2－C_9ヘテロアリールを表し、
R^5およびR^6は、相互に独立して、水素、フッ素またはシアノを表し、
あるいはそれらが結合している炭素原子と一緒になって、それらが一緒に、１または複数の、同一または異なったR^{11}で置換されていてもよい、－（ＣＨ＝ＣＨ－ＣＨ＝ＣＨ）－、－（ＣＨ＝ＣＨ－Ｎ（R^{19}）、－（ＣＨ＝ＣＨ－ＣＨ＝Ｎ）－、－（ＮＨ－ＣＨ＝Ｎ）－または－（CH_2－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（R^{19}）－を表す環を形成し、
R^7は、相互に独立して、以下の基：フッ素、塩素、シアノまたはメチルの１以上を表し、

R^{11}は－ＯＨ、フッ素、塩素、臭素、シアノ、－ＮＨ－Ｃ（Ｏ）R^{20}、－Ｃ（Ｏ）R^{20}、－Ｃ（Ｏ）ＯR^{20}、－Ｃ（Ｏ）Ｎ$R^{20}R^{21}$または－SO_2R^{20}を表し、
あるいは各々、１または複数の、同一または異なったフッ素、塩素、臭素、ＯＨ、シアノ、C_1－C_6アルキルまたは－Ｏ－（C_1－C_4アルキル）で置換されていてもよい、C_1－C_6アルキル、C_3－C_8シクロアルキル、C_2－C_6アルケニル、C_2－C_6アルキニル、－Ｏ－（C_1－C_4アルキル）、－Ｓ－（C_1－C_4アルキル）、－Ｏ－（C_3－C_8シクロアルキル）または－Ｓ－（C_3－C_8シクロアルキル）を表し、
R^{12}は－Ｃ（Ｓ）R^{15}、－Ｃ（Ｏ）R^{15}、－SO_2R^{15}、－Ｃ（Ｏ）ＯR^{15}、－ＯR^{15}または－Ｃ（Ｏ）Ｎ$R^{15}R^{16}$を表し、
R^{13}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_2－C_9ヘテロシクリルまたはC_2－C_9ヘテロアリールまたは水素を表し、
R^{15}は、１または複数の、同一または異なったハロゲン、ＯＨ、シアノまたはC_1－C_4アルキルで置換されていてもよい、C_1－C_6アルキル、C_3－C_6シクロアルキル、C_2－C_6アルケニル、C_2－C_6アルキニル、C_3－C_8シクロアルキル、C_2－C_9ヘテロシクリルまたはC_2－C_9ヘテロアリールを表し、
あるいは水素を表し、
R^{16}は水素、メチル、エチルまたはプロピルを表し、
R^{19}はＨ、C_2－C_6アルキニル、－Ｃ（Ｏ）R^{15}、－SO_2R^{15}または－Ｃ（Ｏ）ＯR^{15}を表し、ならびに
R^{20}およびR^{21}は、相互に独立して、各々、１または複数の、同一または異なったフッ素、塩素、臭素、－ＯＨまたはシアノで置換されていてもよい、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、シクロプロピルまたはシクロブチルを表し、
あるいは水素を表す；
の１つを有する式［Ｉ－ａ］の化合物、ならびにその農薬的に活性な塩がかなり特に好ましい。

【００２２】

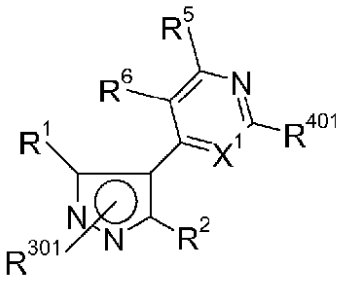
本発明のこの第二の実施態様において、記号の１以上が以下の意味：
X^1はＮを表し、
R^1はフェニル、４－フルオロフェニルを表し、
R^2はメチル、エチル、イソプロピル、シクロプロピル、または水素を表し、
R^3はメチル、エチル、１－プロピル、プロパン－２－イル、イソブチル、ブタン－２－イル、２－メチルプロピル、２，２－ジメチルプロピル、プロパ－２－イン－１－イル、ブタ－３－イン－２－イル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロ－ペンチル、（２，２－ジクロロシクロプロピル）メチル、シクロプロピルメチル、１－シクロプロピルエチル、トリフルオロメチル、トリクロロエチル、２－フルオロエチル、２、２－ジフルオロエチル、２，２，２－トリフルオロエチル、２，２，２－トリクロロエチル、２－クロロエチル、２－フルオロプロピル、３－フルオロプロピル、１、３－ジフルオロ－プロパン－２－イル、２－フルオロベンジル、２，３－ジフルオロベンジル、２－クロロ－６－フルオロベンジル、１－（２－クロロフェニル）エチル、１－（３－クロロフェニル）エチル、２－（トリフルオロメトキシ）エチル、または１－メトキシプロパン－２－イル、２，２－ジフルオロエチル、２－シアノエチル、シアノメチル、１－シアノ－プロパン－２－イル、１－プロピル、２－エトキシエチル、２－クロロエチルまたは２－メトキシエチルを表し、
R^4は水素、－ＮＨR^{12}、または、－ＮＨR^{13}、好ましくは、－ＮＨR^{13}を表し、
R^5およびR^6は、相互に独立して、水素、フッ素またはシアノを表し、
あるいはそれらが結合している炭素原子と一緒になって、それらが一緒に、１または複数の、同一または異なったR^{11}で置換されていてもよい、－（ＣＨ＝ＣＨ－ＣＨ＝ＣＨ）－、－（ＣＨ＝ＣＨ－Ｎ（R^{19}）－、－（ＣＨ＝ＣＨ－ＣＨ＝Ｎ）－または－（CH_2－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（R^{19}）－を表す環を形成し、

R^{11}は－ＯＨ、フッ素、塩素、シアノ、C_1－C_6アルキル、C_2－C_6アルケニルまたはC_2－C_6アルキニル、またはC_3－C_6シクロアルキルを表し、
R^{12}は－Ｃ（Ｓ）R^{15}、－SO_2R^{15}、－Ｃ（Ｏ）OR^{15}または－Ｃ（Ｏ）R^{15}を表し、
R^{13}はアリル、ベンジル、シクロブチル、シクロペンタ－３－エン－１－イル、シクロペンチル、シクロプロピル、（１－シクロプロピルエチル）、（１－シクロプロピルエチル）、（シクロプロピルメチル）、（シクロプロピル－メチル）、（ジシクロプロピルメチル）、（２，２－ジフルオロエチル）、（２，２－ジメトキシエチル）、［２－（ジメチルアミノ）－２－オキソエチル］、［（２，２－ジメチルシクロプロピル）メチル］、（２－エトキシ－エチル）、エチル、（３－フルオロベンジル）、（４－フルオロベンジル）、（２－フルオロベンジル）、［１－（２－フルオロ－フェニル）エチル］、（２－ヒドロキシ－２－メチルプロピル）、（２－ヒドロキシエチル）、（２－ヒドロキシプロピル）、（２－ヒドロキシプロピル）、イソプロピル、（２－メトキシエチル）、（１－メトキシプロパン－２－イル）、（１－メトキシプロパン－２－イル）、メチル、［２－（モルホリン－４－イル）エチル］、オキセタン－３－イル、（１－フェニル－エチル）、プロパ－２－イン－１－イル、プロピル、［１－（ピリジン－２－イル）エチル］、（ピリミジン－２－イルメチル）、ｓｅｃ－ブチル、テトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－３－イル、テトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－４－イルまたはテトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－４－イルを表し、
R^{15}はメチル、エチル、ｎ－プロピル、イソプロピル、ｓｅｃ－ブチル、イソブチル、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、２－メトキシエチル、（２－メトキシエトキシ）メチル、シクロペンテニル、シクロヘキセニル、オキセタニル、テトラヒドロフラン－２－イル、エチニル、プロパ－１－イン－１－イル、プロパ－１－エン－１－イル、アミノメチル、アミノエチル、アミノプロピル、アミノブチル、アミノイソプロピル、アミノシクロプロピル、アミノシクロブチル、アミノシクロペンチル、ジメチルアミノ、エチル－（メチル）アミノ、ピロリジニル、ジエチルアミノ、２－ピリジル、３－ピリジル、４－ピリジル、エトキシカルボニル、ベンジルまたはフェニルを表し、各々、１または複数の、同一または異なったハロゲン、－ＯＨ、シアノまたはC_1－C_4アルキルで置換されていてもよく、
あるいは水素を表し、ならびに
R^{19}はＨ、アセチル、エトキシカルボニル、メトキシカルボニル、プロパ－２－イン－１－イルまたはブタ－２－イン－１－イルを表す；
の１つを有する式［Ｉ－ａ］の化合物、ならびにその農薬的に活性な塩が特別に好ましい。

【００２３】
さらに特別に好ましいのは式［Ｉ－ａ］
［式中、
R^4は－NHR^{13}またはＨを表し、
ここで、他の置換基は前記意味の１以上を有する］
の本発明の第２の実施態様の化合物、およびその農薬的に活性な塩である。

【００２４】
前記本発明の第１および第２の実施態様の式［Ｉ－ａ］のかなり特に好ましい化合物は、記号の１以上が以下の意味：
R^1は、かなり特別に好ましくは、４－フルオロフェニル、３－クロロフェニル、２，６－ジフルオロ－フェニル、または３－メチルフェニル、特に、４－フルオロフェニルを表し、
R^2は、かなり特別に好ましくは、シクロプロピル、エチル、メチルまたは水素、特に、水素を表し
R^5およびR^6は、かなり特別に好ましくは、共に水素を表す；
の１つを有するものである。

【００２５】
一般的に詳説した、または前記好ましい範囲において詳説した残基の定義または説明は、しかしながら、相互に、すなわち、関連する範囲および好ましい範囲の間で組み合わせることもできる。それらは、対応して、最終生成物に、ならびに前駆体および中間体に適用される。加えて、いくつかの個々の定義は適用されないであろう。
【００２６】
全ての残基が、各々、前記した好ましい意味を有する式［Ｉ－ａ］の化合物が好ましい。
【００２７】
全ての残基が、各々、前記した特に好ましい意味を有する式［Ｉ－ａ］の化合物が特に好ましい。
【００２８】
全ての残基が、各々、前記したかなり特に好ましい意味を有する式［Ｉ－ａ］の化合物が、かなり特に好ましい。
【００２９】
全ての残基が、各々、前記した特別に好ましい意味を有する式［Ｉ－ａ］の化合物が、特別に好ましい。
【００３０】
加えて、式［Ｉ－ｂ］：
【００３１】
【化２】



[I-b]

［式中、記号は以下の意味を有する：
X^1はＣ－ＨまたはＮを表し、
R^1は、各々、１または複数の、同一または異なったR^7で置換されていてもよい、フェニルナフタレニル、キノリン－５－イル、キノリン－８－イル、イソキノリン－５－イル、イソキノリン－８－イル、１－ベンゾチオフェン－４－イル、１－ベンゾチオフェン－７－イル、１－ベンゾフラン－４－イル、１－ベンゾフラン－７－イル、１，３－ベンゾジオキソール－４－イルまたは１，３－ベンゾジオキソール－５－イルを表し、
R^2はシアノ、ニトロ、ハロゲン、C_1－C_6アルキル、C_1－C_6アルコキシ、C_1－C_6ハロアルキル、C_1－C_6ハロアルコキシ、C_1－C_6アルキルチオ、C_3－C_6シクロアルキル、C_3－C_6ハロシクロアルキル、C_2－C_9ヘテロシクリルまたは水素を表し、
R^{301}は－Ｃ（Ｏ）Ｎ（R^9R^{10}）、－Ｃ（Ｏ）R^9、－Ｃ（Ｏ）ＯR^9、－Ｓ（Ｏ）$_2R^9$を表し、あるいは各々、１または複数の、同一または異なったR^8で置換されていてもよい、C_1－C_6アルキル、C_2－C_6アルケニル、C_3－C_6アレニル、C_2－C_6アルキニル、C_3－C_8シクロアルキル、C_1－C_6アルコキシ、C_2－C_9ヘテロシクリル、C_2－C_9オキソヘテロシクリル、またはヘテロアリール（好ましくは、C_2－C_9ヘテロアリール）を表し、
R^{401}は－Ｎ$R^{12}R^{13}$、－Ｃ（Ｏ）Ｎ$R^{12}R^{13}$または－Ｎ（R^{12}）$_2$を表し、
R^5およびR^6は、相互に独立して、水素、フッ素、塩素、臭素、シアノ、ニトロ、－

ＯＨまたは－ＳＨを表し、
あるいは各々、１または複数の、同一または異なったR^{11}で置換されていてもよい、C_1－C_6アルキル、C_3－C_6シクロアルキル、C_2－C_6アルケニル、C_2－C_6アルキニル、C_6－C_{14}アリール、－Ｏ－（C_1－C_4アルキル）、－Ｏ－（C_6－C_{14}アリール）、－Ｓ－（C_1－C_4アルキル）、－Ｓ（Ｏ）－（C_1－C_6アルキル）または－Ｃ（Ｏ）－（C_1－C_6アルキル）を表し、
あるいはそれらが結合している炭素原子と一緒になって、３、好ましくは５から８の環原子を持つ環（好ましくは、飽和、不飽和または部分的不飽和の単一の環）を形成し、ここで、該環は酸素、硫黄または－Ｎ－R^{19}の範囲からの１から４のヘテロ原子を含有することができ、１または複数の、同一または異なったハロゲン、酸素、シアノまたはC_1－C_4アルキルで置換されていてもよく、
R^7は、相互に独立して、以下の基：フッ素、塩素、臭素、シアノ、ニトロ、－ＯＨまたは－ＳＨの１以上を表し、
あるいは、１または複数の、同一または異なったフッ素、塩素、臭素、ＯＨ、シアノ、C_1－C_6アルキルまたは－Ｏ－（C_1－C_4アルキル）で置換されていてもよい、C_1－C_6アルキル、C_3－C_6シクロアルキル、C_2－C_6アルケニル、C_2－C_6アルキニル、トリ（C_1－C_4アルキル）－シリル、C_6－C_{14}アリール、－Ｏ－（C_1－C_4アルキル）、－Ｏ－（C_6－C_{14}アリール）、－Ｓ－（C_1－C_4アルキル）－Ｓ（Ｏ）－（C_1－C_6アルキル）または－Ｓ（Ｏ）$_2$－（C_1－C_6アルキル）を表し、
R^8は－ＯＨ、ハロゲン（好ましくは、フッ素、塩素または臭素）、－NO_2、シアノ、－NR^9R^{10}、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（R^9R^{10}）、－Ｃ（Ｏ）R^9、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ^9、－Ｏ－Ｃ（Ｏ）R^9または－（CH_2）$_n$Ｃ（Ｏ）R^9を表し、ここで、ｎ＝１および６の間の全数字であり、
あるいは各々、１または複数の、同一または異なったR^{11}で置換されていてもよい、C_1－C_6アルキル、C_2－C_8アルケニル、C_2－C_8アルキニル、C_3－C_8シクロアルキル、C_1－C_6ハロアルキル、C_6－C_{14}アリール、C_2－C_9ヘテロシクリル、C_2－C_9ヘテロアリール、－Ｏ－（C_1－C_4アルキル）、－Ｓ－（C_1－C_4アルキル）－Ｏ－（C_3－C_8シクロアルキル）または－Ｓ－（C_3－C_8シクロアルキル）を表し、
R^9およびR^{10}は、相互に独立して、各々、１または複数の、同一または異なったR^{11}で置換されていてもよい、C_1－C_6アルキル、C_2－C_8アルケニル、C_2－C_8アルキニル、C_3－C_8シクロアルキル、C_6－C_{14}アリール、C_2－C_9ヘテロシクリルまたはC_2－C_9ヘテロアリールを表し、
あるいは水素を表し、
R^{11}は－ＯＨ、フッ素、塩素、臭素、シアノ、－ＮＨ－Ｃ（Ｏ）R^{20}、－$NR^{20}R^{21}$、－Ｃ（Ｏ）R^{20}、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ^{20}、－Ｃ（Ｏ）$NR^{20}R^{21}$または－SO_2R^{20}を表し、
あるいは、１または複数の、同一または異なったフッ素、塩素、臭素、ＯＨ、カルボニル、シアノ、C_1－C_6アルキル、または－Ｏ－（C_1－C_4アルキル）で置換されていてもよい、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_{11}ヘテロアルキル、C_3－C_8シクロアルキル、－Ｏ－（C_1－C_4アルキル）、－Ｓ－（C_1－C_4アルキル）、－Ｏ－（C_3－C_8シクロアルキル）、－Ｓ－（C_3－C_8シクロアルキル）、C_6－C_{14}アリール、－Ｏ－（C_6－C_{14}アリール）、－Ｓ－（C_6－C_{14}アリール）、C_2－C_9ヘテロシクリルまたはC_2－C_9ヘテロアリールを表し、
R^{12}は－Ｃ（Ｓ）R^{15}、－Ｃ（Ｏ）R^{15}、－SO_2R^{15}、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ^{15}、－ＯＲ^{15}または－Ｃ（Ｏ）$NR^{15}R^{16}$を表し、
R^{13}は、各々、１または複数の、同一または異なったフッ素、塩素、臭素、－ＯＨ、シアノ、C_1－C_6アルキル、－Ｏ－Ｃ（Ｏ）－C_1－C_4アルキル、－Ｏ－Ｐ（Ｏ）（Ｏ－C_1－C_4アルキル）$_2$、－Ｏ－Ｂ（Ｏ－C_1－C_4アルキル）$_2$－または－Ｏ（Ｃ

$_1$－C$_4$アルキル）で置換されていてもよい、C$_1$－C$_6$アルキル、C$_3$－C$_6$シクロアルキル、C$_2$－C$_6$アルケニル、C$_2$－C$_6$アルキニル、C$_3$－C$_8$シクロアルキル、C$_2$－C$_9$ヘテロシクリルまたはC$_2$－C$_9$ヘテロアリールを表し、

あるいは水素を表し、

R^{15}およびR^{16}は、相互に独立して、水素または－OHを表し、

あるいは、各々、1または複数の、同一または異なったR^{11}で置換されていてもよい、C$_1$－C$_6$アルキル、C$_3$－C$_6$シクロアルキル、C$_2$－C$_6$アルケニル、C$_2$－C$_6$アルキニル、C$_3$－C$_8$シクロアルキル、C$_6$－C$_{14}$アリール、C$_2$－C$_9$ヘテロシクリル、またはC$_2$－C$_9$ヘテロアリールを表し、

あるいは（R^{12}が－C（O）NR^{15}R^{16}を表す場合）それらが結合している窒素原子と一緒になって、当該窒素に直接的に隣接しないNまたはOの範囲からのさらなるヘテロ原子を含有することができる3から7員の環を形成し、

R^{19}はH、C$_1$－C$_6$アルキル、C$_3$－C$_6$シクロアルキル、C$_2$－C$_6$アルケニル、C$_2$－C$_6$アルキニル、－C（S）R^{15}、－C（O）R^{15}、－SO$_2$R^{15}または－C（O）OR^{15}を表し、ならびに

R^{20}およびR^{21}は、相互に独立して、各々、1または複数の、同一または異なったフッ素、塩素、臭素、－OHまたはシアノで置換されていてもよい、C$_1$－C$_6$アルキル、C$_3$－C$_6$シクロアルキル、C$_2$－C$_6$アルケニル、C$_2$－C$_6$アルキニルまたは水素を表す］

の新規なフェニルピリ（ミ）ジニラゾール類ならびにその農薬的に活性な塩が見出された。

【００３２】

式［Ｉ－ｂ］の記号が以下の意味：

ａ）R^{301}が、置換されていてもよい［１、２、４［トリアゾロ［４，３－ｂ］ピリダジン－６－イル、７，８－ジヒドロ－［１，２，４［トリアゾロ［４，３－ｂ］ピリダジン－６－イル、６－オキソ－１，６－ジヒドロピリダジン－３－イル、６－オキソ－１，４，５，６－テトラヒドロピリダジン－３－イルまたは６－クロロピリダジン－３－イルを表し、および

R^5、R^{6}がHを表す化合物、ならびに

ｂ）化合物：４－｛１－［２－（ジメチルアミノ）エチル］－３－（４－フルオロフェニル）－１Ｈ－ピラゾール－４－イル｝－Ｎ，Ｎ－ジメチル－ピリジン－２－アミンおよび１－（４－｛４－［１－エチル－３－（４－ニトロフェニル）－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］－１－Ｈ－ピロロ［２，３－ｂ］ピリジン－６－イル｝フェニル）－Ｎ，Ｎ－ジメチルメタンアミン

を有する組合せは、一般に詳説した、または前記好ましい範囲で詳説した残基の定義または説明から除外される。

【００３３】

最後に、式［Ｉ－ｂ］の本発明によるフェニルピリ（ミ）ジニラゾール類は非常に良好な殺微生物特性を保有し、材料の保護のために、および植物および植物の部分におけるマイコトキシンの低下のために用いることができるのが判明した。

【００３４】

本発明によるフェニルピリ（ミ）ジニラゾール類は、一般に式［Ｉ－ｂ］によって定義される。前記および後記で名称が挙げられる式についての好ましい残基の定義は以下で述べる。これらの定義は式［Ｉ－ｂ］の最終生成物および全ての中間体に同等に適用される

記号の１以上が以下の意味：

X^{1}はC－HまたはNを表し、

R^{1}は、各々、1または複数の、同一または異なったR^{7}で置換されていてもよい、フェニル、ナフタレニル、キノリン－５－イル、キノリン－８－イル、イソキノリン－５－イル、イソキノリン－８－イル、１，３－ベンゾジオキソール－４－イルまたは１，３－ベンゾジオキソール－５－イルを表し、

R^2はシアノ、ハロゲン、C_1－C_6アルキル、C_1－C_6アルコキシ、C_1－C_6ハロアルキル、C_1－C_6ハロアルコキシ、C_1－C_6アルキルチオ、C_3－C_6シクロアルキル、C_3－C_6ハロシクロアルキル、C_2－C_9ヘテロシクリル、または水素を表し、

R^{301}は－C（O）R^9、－C（O）OR^9または－S（O）$_2R^9$を表し、

あるいは１または複数の、同一または異なったR^8で置換されていてもよい、C_1－C_6アルキル、C_2－C_6アルケニル、C_3－C_6アレニル、C_2－C_6アルキニル、C_3－C_8シクロアルキル，C_1－C_6アルコキシ、C_2－C_9ヘテロシクリル、C_2－C_9オキソヘテロシクリル、またはヘテロアリールを表し、

R^{401}は－N$R^{12}R^{13}$または－C（O）N$R^{12}R^{13}$を表し、

R^5およびR^6は、相互に独立して、水素、フッ素、塩素、臭素、シアノ、ニトロ、－OHまたは－SHを表し、

あるいは各々、１または複数の、同一または異なったR^{11}で置換されていてもよい、C_1－C_6アルキル、C_3－C_6シクロアルキル、C_2－C_6アルケニル、C_2－C_6アルキニル、－O－（C_1－C_4アルキル）、－S－（C_1－C_4アルキル）または－S（O）－（C_1－C_6アルキル）を表し、

あるいはそれらが結合している炭素原子と一緒になって、３、好ましくは、５から８の環原子を持つ環（好ましくは、飽和、不飽和または部分的不飽和の単一の環）を形成し、ここで、該環は酸素、硫黄または－NR^{19}の範囲からの１から４のヘテロ原子を含有することができ、１または複数の、同一または異なったハロゲン、酸素、シアノまたはC_1－C_4アルキルで置換されていてもよく、

R^7は以下の基：フッ素、塩素、臭素、シアノ、ニトロ、メチル、エチル、イソプロピル、－CF_3、－CHF_2、－C_2F_5、－CCl_3、－OMe、－OEt、－O－iPR、－OCF_3、－$OCHF_2$、－OC_2F_5、－SMeまたは－SCF_3の１以上を表し、

R^8は－OH、フッ素、塩素、シアノ、－NR^9R^{10}、－C（O）N（R^9R^{10}），－C（O）R^9、－C（O）OR^9、－O－C（O）R^9、－（CH_2）$_n$C（O）R^9を表し、ここで、ｎ＝１および６の間の全数字であり、あるいは、各々、１または複数の、同一または異なったR^{11}で置換されていてもよい、C_1－C_6アルキル、C_2－C_8アルケニル、C_2－C_8アルキニル、C_3－C_8シクロアルキル、C_1－C_6ハロアルキル、C_6－C_{14}アリール、C_2－C_9ヘテロシクリル、C_2－C_9ヘテロアリール、－O－（C_1－C_4アルキル），－S（C_1－C_4アルキル）、－O－（C_3－C_8シクロアルキル）または－S－（C_3－C_8シクロアルキル）を表し、

R^9およびR^{10}は、相互に独立して、各々、１または複数の、同一または異なったR^{11}で置換されていてもよい、C_1－C_6アルキル、C_2－C_8アルケニル、C_2－C_8アルキニル、C_3－C_8シクロアルキル、C_2－C_9ヘテロシクリル、またはC_2－C_9ヘテロアリールを表し、

あるいは水素を表し、

R^{11}は以下の基：－OH、フッ素、塩素、臭素、シアノ、－NH－C（O）R^{20}、－C（O）R^{20}、－C（O）OR^{20}、－C（O）N$R^{20}R^{21}$または－SO_2R^{20}の１以上を表し、

あるいは、各々、１または複数の、同一または異なったフッ素、塩素、臭素、－OH、シアノ、C_1－C_6アルキルまたは－O－（C_1－C_4アルキル）で置換されていてもよい、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_{11}ヘテロアルキル、C_3－C_8シクロアルキル、－O－（C_1－C_4アルキル）、－S－（C_1－C_4アルキル）、－O－（C_3－C_8シクロアルキル）、－S－（C_3－C_8シクロアルキル）、C_2－C_9ヘテロシクリルまたはC_2－C_9ヘテロアリールを表し、

R^{12}は、－C（S）R^{15}、－C（O）R^{15}、－SO_2R^{15}、－C（O）OR^{15}、－OR^{15}または－C（O）N$R^{15}R^{16}$を表し、

R^{13}は、各々、１または複数の、同一または異なったフッ素、塩素、臭素、－OHま

たはシアノで置換されていてもよい、C_1－C_6アルキル、C_3－C_6シクロアルキル、C_2－C_6アルケニル、C_2－C_6アルキニル、C_3－C_8シクロアルキル、C_2－C_9ヘテロシクリルまたはC_2－C_9ヘテロアリールを表し、あるいは水素を表し、

R^{15}およびR^{16}は、相互に独立して、水素または－ＯＨを表し、

あるいは各々、１または複数の、同一または異なったR^{11}で置換されていてもよい、C_1－C_6アルキル、C_3－C_6シクロアルキル、C_2－C_6アルケニル、C_2－C_6アルキニル、C_3－C_8シクロアルキル、C_6－C_{14}アリール、C_2－C_9ヘテロシクリルまたはC_2－C_9ヘテロアリールを表し、

あるいはそれらが結合している窒素原子と一緒になって、当該窒素に（直接的に）隣接しないＮまたはＯの範囲からのさらなるヘテロ原子を含有することができる３から７員の環を形成し、

R^{19}は、Ｈ、C_1－C_6アルキル、C_3－C_6シクロアルキル、C_2－C_6アルケニル、C_2－C_6アルキニル、－Ｃ（Ｓ）R^{15}、－Ｃ（Ｏ）R^{15}、－SO_2R^{15}または－Ｃ（Ｏ）OR^{15}を表し、ならびに

R^{20}およびR^{21}は、相互に独立して、各々、１または複数の、同一または異なったフッ素、塩素、臭素、－ＯＨまたはシアノで置換されていてもよい、C_1－C_6アルキル、C_3－C_6シクロアルキル、C_2－C_6アルケニルまたはC_2－C_6アルキニルを表し、あるいは水素を表す；

の１つを有する式［Ｉ－ｂ］の化合物、ならびにその農薬的に活性な塩が好ましい。

【００３５】

記号の１以上が以下の意味：

X^1はＣ－ＨまたはＮを表し、

R^1は、各々、１または複数の、同一または異なったR^7で置換されていてもよい、フェニルまたはナフタレニルを表し、

R^2はハロゲン、C_1－C_6アルキル、C_3－C_6シクロアルキル、または水素を表し、

R^{301}は、各々、１または複数の、同一または異なったR^8で置換されていてもよい、C_1－C_6アルキル、C_2－C_6アルケニル、C_3－C_6アレニル、C_2－C_6アルキニル、C_3－C_8シクロアルキル、C_1－C_6アルコキシ、C_2－C_9ヘテロシクリル、C_2－C_9オキソヘテロシクリルまたはアリールを表し、

R^{401}は－$NR^{12}R^{13}$を表し、

R_5およびR^6は、相互に独立して、水素、フッ素、塩素、臭素、シアノ、ニトロを表し、

あるいは各々、１または複数の、同一または異なったR^{11}で置換されていてもよい、C_1－C_6アルキル、C_3－C_6シクロアルキル、C_2－C_6アルケニル、C_2－C_6アルキニル、－Ｏ－（C_1－C_4アルキル）、Ｓ－（C_1－C_4アルキル）または－Ｓ（Ｏ）－（C_1－C_6アルキル）を表し、

あるいはそれらが結合している炭素原子と一緒になって５から８の環原子を持つ環を形成し、ここで、該環は、１または複数の、同一または異なったハロゲン、酸素、シアノまたはC_1－C_4アルキルで置換されていてもよい、酸素、硫黄または－Ｎ－R^{19}の範囲からの１から４のさらなるヘテロ原子を含有することができ、

R^7はフッ素、塩素、シアノ、ニトロ、メチル、エチル、イソプロピル、－CF_3、－CHF_2、C_2F_5またはCCl_3を表し、

R^8は、－ＯＨ、フッ素、塩素、シアノ、－Ｃ（Ｏ）R^9、－Ｃ（Ｏ）OR^9、－Ｏ－Ｃ（Ｏ）R^9、－$(CH_2)_n$Ｃ（Ｏ）R^9を表し、ここで、ｎ＝１および６の間の全数字であり、あるいは各々、１または複数の、同一または異なったR^{11}で置換されていてもよい、C_1－C_6アルキル、C_2－C_8アルケニル、C_2－C_8アルキニル、C_3－C_8シクロアルキル、C_1－C_6ハロアルキル、C_2－C_9ヘテロシクリル、C_2－C_9ヘテロアリール、－Ｏ－（C_1－C_4アルキル）、－Ｓ－（C_1－C_4アルキル）、－Ｏ－（C_3－C_8シクロアルキル）、－Ｓ－（C_3－C_8シクロアルキル）を表し、

R^9およびR^{10}は、相互に独立して、各々、１または複数の、同一または異なったR^{11}で置換されていてもよい、C_1－C_6アルキル、C_2－C_8アルケニル、C_2－C_8アルキニル、またはC_3－C_8シクロアルキルを表し、
あるいは水素を表し、
R^{11}は－ＯＨ、フッ素、塩素、臭素、シアノ、－ＮＨ－Ｃ（Ｏ）R^{20}、－Ｃ（Ｏ）R^{20}、－Ｃ（Ｏ）ＯR^{20}、－Ｃ（Ｏ）Ｎ$R^{20}R^{21}$または－SO_2R^{20}を表し、
あるいは１または複数の、同一または異なったフッ素、塩素、臭素、－ＯＨ、シアノ、C_1－C_6アルキルまたは－Ｏ－（C_1－C_4アルキル）で置換されていてもよい、C_1－C_6アルキル、C_3－C_8シクロアルキル、C_2－C_6アルケニル、C_2－C_6アルキニル、－Ｏ－（C_1－C_4アルキル）、－Ｓ－（C_1－C_4アルキル）、－Ｏ－（C_3－C_8シクロアルキル）、または－Ｓ－（C_3－C_8シクロアルキル）を表し、
R^{12}は－Ｃ（Ｓ）R^{15}、－Ｃ（Ｏ）R^{15}、－SO_2R^{15}、－Ｃ（Ｏ）ＯR^{15}または－Ｃ（Ｏ）Ｎ$R^{15}R^{16}$を表し、
R^{13}は、各々、１または複数の、同一または異なったフッ素または塩素で置換されていてもよい、C_1－C_6アルキル、C_3－C_6シクロアルキル、C_2－C_6アルケニル、C_2－C_6アルキニル、C_3－C_8シクロアルキル、C_2－C_9ヘテロシクリルまたはC_2－C_9ヘテロアリールを表し、
あるいは水素を表し、
R^{15}およびR^{16}は、相互に独立して、各々、１または複数の、同一または異なったR^{11}で置換されていてもよい、C_1－C_6アルキル、C_3－C_6シクロアルキル、C_2－C_6アルケニル、C_2－C_6アルキニル、C_3－C_8シクロアルキル、C_6－C_{14}アリール、C_2－C_9ヘテロシクリルまたはC_2－C_9ヘテロアリールを表し、
あるいは水素を表し、
あるいはそれらが結合している窒素原子と一緒になって、当該窒素に（直接的に）隣接していないＮまたはＯの範囲からのさらなるヘテロ原子を含有することができる３から７員の環を形成し、
R^{19}はＨ、C_2－C_6アルキニル、－Ｃ（Ｏ）R^{15}、－SO_2R^{15}または－Ｃ（Ｏ）ＯR^{15}を表し、ならびに
R^{20}およびR^{21}は、相互に独立して、各々、１または複数の、同一または異なったフッ素、塩素、臭素、－ＯＨまたはシアノで置換されていてもよい、C_1－C_6アルキル、C_3－C_6シクロアルキル、C_2－C_6アルケニルまたはC_2－C_6アルキニルを表し、
あるいは水素を表す；
の１つを有する式［Ｉ－ｂ］の化合物、およびその農薬的に活性な塩が特に好ましい。

【００３６】

記号の１以上が以下の意味：
X^1はＣ－ＨまたはＮを表し、
R^1は、１または複数の、同一または異なったR^7で置換されていてもよいフェニルを表し、
R^2はメチル、エチル、イソプロピル、シクロプロピル、または水素を表し、
R^{301}は、各々、１または複数の、同一または異なったR^8で置換されていてもよい、C_1－C_6アルキル、C_2－C_6アルケニル、C_3－C_6アレニル、C_2－C_6アルキニル、C_3－C_8シクロアルキルまたはC_1－C_6アルコキシを表し、
R^{401}は－Ｎ$R^{12}R^{13}$を表し、
R^5およびR^6は、相互に独立して、水素、フッ素またはシアノを表し、
あるいはそれらが結合している炭素原子と一緒になって、それらが一緒になって、１または複数の、同一または異なったR^{11}で置換されていてもよい、－（ＣＨ＝ＣＨ－ＣＨ＝ＣＨ）－、－（ＣＨ＝ＣＨ－Ｎ（R^{19}）－、－（ＣＨ＝ＣＨ－ＣＨ＝Ｎ）－または－（CH_2－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（R^{19}）－を表す環を形成し、
R^7はフッ素、塩素、シアノまたはメチルを表し、

R^8はフッ素、塩素またはシアノを表し、あるいは各々、１または複数の、同一または異なったR^{11}で置換されていてもよい、C_1－C_6アルキル、C_2－C_8アルケニル、C_2－C_8アルキニル、C_3－C_8シクロアルキル、C_6－C_{14}アリール、ヘテロシクリル、ヘテロアリール、－Ｏ－（C_1－C_4アルキル）、－Ｓ－（C_1－C_4アルキル）、－Ｏ－（C_3－C_8シクロアルキル）または－Ｓ－（C_3－C_8シクロアルキル）を表し、

R^{11}は以下の基：－ＯＨ、フッ素、塩素、臭素、シアノ、－ＮＨ－Ｃ（Ｏ）R^{20}、－Ｃ（Ｏ）R^{20}、－Ｃ（Ｏ）ＯR^{20}、－Ｃ（Ｏ）Ｎ$R^{20}R^{21}$または－SO_2R^{20}の１以上を表し、

あるいは各々、１または複数の、同一または異なったフッ素、塩素、臭素、ＯＨ、シアノ、C_1－C_6アルキルまたはＯ－（C_1－C_4アルキル）で置換されていてもよい、C_1－C_6アルキル、C_3－C_8シクロアルキル、C_2－C_6アルケニル、C_2－C_6アルキニル、－Ｏ－（C_1－C_4アルキル）、－Ｓ－（C_1－C_4アルキル）、－Ｏ－（C_3－C_8シクロアルキル）またはＳ－（C_3－C_8シクロアルキル）を表し、

R^{12}は－Ｃ（Ｓ）R^{15}、－Ｃ（Ｏ）R^{15}、－SO_2R^{15}、－Ｃ（Ｏ）ＯR^{15}、－ＯR^{15}または－Ｃ（Ｏ）Ｎ$R^{15}R^{16}$を表し、

R^{13}はC_1－C_6アルキル、C_2－C_6アルケニル、C_2－C_6アルキニルまたは水素を表し、

R^{15}は各々、１または複数の、同一または異なったハロゲン、－ＯＨ、シアノまたはC_1－C_4アルキルで置換されていてもよい、C_1－C_6アルキル、C_3－C_6シクロアルキル、C_2－C_6アルケニル、C_2－C_6アルキニル、C_3－C_8シクロアルキル、C_6－C_{14}アリール、C_2－C_9ヘテロシクリルまたはC_2－C_9ヘテロアリールを表し、

あるいは水素を表し、

R^{16}は水素、メチル、エチルまたはプロピルを表し、

R^{19}はＨ、C_2－C_6アルキニル、－Ｃ（Ｏ）R^{15}、－SO_2R^{15}または－Ｃ（Ｏ）ＯR^{15}を表し、ならびに

R^{20}およびR^{21}は、相互に独立して、１または複数の、同一または異なったフッ素、塩素、臭素、－ＯＨまたはシアノで置換されていてもよい、各々、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、シクロプロピル、またはシクロブチルを表し、

あるいは水素を表す；

の１つを有する式［Ｉ－ｂ］の化合物、ならびにその農薬的に活性な塩がかなり特に好ましい。

【００３７】

本発明のさらなる実施態様において、特に、記号の１以上が以下の意味：

X^1はＮを表し、

R^1はフェニル、３－メチルフェニル、２－フルオロフェニル、３－フルオロフェニル、４－フルオロフェニル、３－トリフルオロメチルフェニル、４－クロロフェニル、２，５－ジフルオロフェニル、２，４－ジフルオロフェニル、２，６－ジフルオロフェニル、３－メチル－４－フルオロフェニル、３－シアノ－４－フルオロフェニルまたは２，４，６－トリ－フルオロフェニルを表し、

R^2はメチル、エチル、イソプロピル、シクロプロピル、または水素を表し、

R^{301}は、メチル、エチル、１－プロピル、プロパン－２－イル、イソブチル、ブタン－２－イル、２－メチルプロピル、２，２－ジメチルプロピル、２－（モルホリン－４－イル）エチル、２－シアノエチル、シアノメチル、２－シアノ－２－メチルプロピル、３－メチルブタ－２－エン－１－イル、ブタ－２－エン－１－イル、ブタ－３－エン－２－イル、プロパジエニル、プロパ－２－エン－１－イル、プロパ－２－イン－１－イル、ブタ－２－イン－１－イル、ブタ－３－イン－２－イル、２－メチルブタ－３－イン－２－イル、２－メチルブタ－３－イン－２－イル、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、（２，２－ジクロロシクロプロピル）メチル、シクロプロピ

ルメチル、１－シクロプロピルエチル、トリクロロメチル、トリフルオロメチル、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、２，２，２－トリクロロ－エチル、２－クロロエチル、２－ブロモエチル、２－フルオロプロピル、３－フルオロプロピル、２－クロロプロピル、３－クロロプロピル、１，３－ジフルオロプロパン－２－イル、１，１，１－トリフルオロプロパン－２－イル、１，１，１－トリフルオロ－２－メチルプロパン－２－イル、３，３，３－トリフルオロ－２－ヒドロキシプロピル、２－フルオロベンジル、３－フルオロベンジル、４－フルオロベンジル、２，３－ジフルオロベンジル、２－クロロ－６－フルオロベンジル、１－（２－クロロフェニル）エチル、１－（３－クロロフェニル）エチル、１－（４－クロロフェニル）エチル、３－シアノベンジル、４－シアノベンジル、４－（ジフルオロメトキシ）ベンジル、２－シアノベンジル、２－（３－クロロフェニル）エチル、２－（２－クロロフェニル）エチル、１－ナフチルメチル、（ピリジン－３－イルメチル，２－クロロ－１，３－チアゾール－５－イル）－メチル、メトキシメチル、２－メトキシエチル、２－メトキシプロピル、２－（メチルスルファニル）－エチル、２－（トリフルオロメトキシ）エチル、１－メトキシプロパン－２－イル、２－［２－（２－メトキシエトキシ）－エトキシ］エチル、２－（２－メトキシエトキシ）エチル、１，３－ジメトキシプロパン－２－イル、２－（シクロプロピル－オキシ）エチル、テトラヒドロフラン－２－イルメチル、（３－メチルオキセタン－３－イル）メチル、１Ｈ－イミダゾール－２－イルメチル、テトラヒドロフラン－３－イル、２－オキソテトラヒドロフラン－３－イル、２－ｔｅｒｔ－ブトキシ－２－オキソエチル、１－メトキシ－３－メチル－１－オキソブタン－２－イル、１－メトキシ－１－オキソプロパン－２－イルまたは３－エトキシ－３－オキソプロピル、１－シアノプロパン－２－イル、１－プロピル、プロパン－２－イルオキシまたは２－エトキシエチルを表し、

R^{401}は－ＮＨR^{12}を表し、

R^{5}およびR^{6}は、相互に独立して、水素、フッ素またはシアノを表し、

あるいはそれらが結合している炭素原子と一緒になって、それらが一緒に、１または複数の、同一または異なったR^{11}で置換されていてもよい、－（ＣＨ＝ＣＨ－ＣＨ＝ＣＨ）－、－（ＣＨ＝ＣＨ－Ｎ（R^{19}）－、－（ＣＨ＝ＣＨ－ＣＨ＝Ｎ）－または－（CH_2－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（R^{19}）－を表す環を形成し、

R^{11}は以下の基：－ＯＨ、フッ素、塩素、シアノ、メチル、エチルまたはシクロプロピルの１以上を表し、

R^{12}は－Ｃ（Ｓ）R^{15}、－SO_2R^{15}、－Ｃ（Ｏ）ＯR^{15}または－Ｃ（Ｏ）R^{15}を表し、

R^{15}は、各々、１または複数の、同一または異なったハロゲン、－ＯＨ、シアノまたはC_1－C_4アルキルで置換されていてもよい、メチル、エチル、ｎ－プロピル、イソプロピル、ｓｅｃ－ブチル、イソブチル、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、２－メトキシエチル、（２－メトキシエトキシ）メチル、シクロペンテニル、シクロヘキセニル、オキセタニル、テトラヒドロフラン－２－イル、エチニル、プロパ－１－イン－１－イル、プロパ－１－エン－１－イル、アミノメチル、アミノエチル、アミノプロピル、アミノブチル、アミノイソプロピル、アミノシクロプロピル、アミノシクロブチル、アミノシクロペンチル、ジメチルアミノ、エチル－（メチル）アミノ、ピロリジニル、ジエチルアミノ、２－ピリジル、３－ピリジル、４－ピリジル、エトキシ－カルボニル、ベンジル、フェニル、２－チエニルまたは３－チエニルを表し、

あるいは水素を表し、ならびに

R^{19}はＨ、アセチル、エトキシカルボニル、メトキシカルボニル、プロパ－２－イン－１－イルまたはブタ－２－イン－１－イルを表す；

の１つを有する式［Ｉ－ｂ］の化合物、ならびにその農薬的に活性な塩もまた好ましい。

【００３８】

本発明のさらなる実施態様において、特に、記号の１以上が以下の意味：

X^{1}はＣ－Ｈを表し、

R^1は４－フルオロフェニル、３－クロロフェニル、２，６－ジフルオロフェニルまたは３－メチルフェニルを表し、
R^2はシクロプロピル、メチル、Ｈまたはジフルオロメトキシを表し、および
R^{401}はアセチルアミノ、ｎ－プロピオニルアミノ、イソブチリルアミノ、（シクロプロピルカルボニル）－アミノ、（メトキシアセチル）アミノ、２－メトキシプロパノイル、（２－メチルブタノイル）アミノ、ブタ－２－エノイルアミノ、プロパ－２－イノイルアミノ、３－（ジメチルアミノ）プロパ－２－エノイル］アミノ、３，３，３－トリフルオロプロパノイル）アミノ、３，３－ジフルオロプロパノイル）アミノ、（シクロプロピルアセチル）アミノ、ラクトイルアミノ、（シクロブチルカルボニル）アミノ、（シクロペンチルアセチル）アミノ、２－メチルシクロプロピル）カルボニル］アミノ、（３－メチルブタノイル）アミノ、（フェニルアセチル）アミノ、ベンゾイル－アミノ、（３－チエニルカルボニル）アミノ、（２－チエニルカルボニル）アミノ、（２－ヒドロキシ－２－メチル－プロパノイル）アミノ、［（２－メトキシエトキシ）アセチル］アミノまたは２，３－ジヒドロキシプロパノイル）－アミノを表し、
ここで、他の置換基は前記意味の１以上を有する；
の１つを有する式［Ｉ－ｂ］の化合物、およびその農薬的に活性な塩が好ましい。

【００３９】

さらに、記号の１以上が以下の意味：
X^1はＣ－Ｈを表し、
R^1は４－フルオロフェニル、３－クロロフェニル、２，６－ジフルオロフェニルまたは３－メチルフェニルを表し、
R^2はシクロプロピル、メチル、Ｈまたはジフルオロメトキシを表し、
R^{301}はメチル、エチル、１－プロピル、プロパン－２－イル、イソブチル、ブタン－２－イル、２－メチルプロピル、２，２－ジメチルプロピル、２－（モルホリン－４－イル）エチル、２－シアノエチル、シアノメチル、２－シアノ－２－メチルプロピル、３－メチルブタ－２－エン－１－イル、ブタ－２－エン－１－イル、ブタ－３－エン－２－イル、プロパジエニル、プロパ－２－エン－１－イル、プロパ－２－イン－１－イル、ブタ－２－イン－１－イル、ブタ－３－イン－２－イル、２－メチルブタ－３－イン－２－イル、２－メチルブタ－３－イン－２－イル、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、（２，２－ジクロロシクロプロピル）メチル、シクロプロピルメチル、１－シクロプロピルエチル、トリクロロメチル、トリフルオロメチル、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、２，２，２－トリクロロ－エチル、２－クロロエチル、２－ブロモエチル、２－フルオロプロピル、３－フルオロプロピル、２－クロロプロピル、３－クロロプロピル、１，３－ジフルオロプロパン－２－イル、１，１，１－トリフルオロプロパン－２－イル、１，１，１－トリフルオロ－２－メチルプロパン－２－イル、３，３，３－トリフルオロ－２－ヒドロキシプロピル、２－フルオロベンジル、３－フルオロベンジル、４－フルオロベンジル、２，３－ジフルオロベンジル、２－クロロ－６－フルオロベンジル、１－（２－クロロフェニル）エチル、１－（３－クロロフェニル）エチル、１－（４－クロロフェニル）エチル、３－シアノベンジル、４－シアノベンジル、４－（ジフルオロメトキシ）ベンジル、２－シアノベンジル、２－（３－クロロフェニル）エチル、２－（２－クロロフェニル）エチル、１－ナフチルメチル、（ピリジン－３－イルメチル、２－クロロ－１、３－チアゾール－５－イル）－メチル、メトキシメチル、２－メトキシエチル、２－メトキシプロピル、２－（メチルスルファニル）－エチル、２－（トリフルオロメトキシ）エチル、１－メトキシプロパン－２－イル、２－［２－（２－メトキシエトキシ）－エトキシ］エチル、２－（２－メトキシエトキシ）エチル、１，３－ジメトキシプロパン－２－イル、２－（シクロプロピル－オキシ）エチル、テトラヒドロフラン－２－イルメチル、（３－メチルオキセタン－３－イル）メチル、１Ｈ－イミダゾール－２－イルメチル、テトラヒドロフラン－３－イル、２－オキソテトラヒドロフラン－３－イル、２－ｔｅｒｔ－ブトキシ－２－オキソエチル、１－メトキシ－３－メチル－１－オキソブタン－２－イル、１－メト

キシ－１－オキソプロパン－２－イル、３－エトキシ－３－オキソプロピル、１－シアノプロパン－２－イル、プロパン－２－イルオキシ、２－エトキシエチル、３－メトキシプロピル、２－（トリフルオロメトキシ）エチルまたは１，３－ジオキソラン－２－イルメチルを表し、および
　R^{401}は－NHR^{12}を表し、
　ここで、他の置換基は前記意味の１以上を有する；
の１つを有する式［Ｉ－ｂ］の化合物、ならびにその農薬的に活性な塩が特別に好ましい。

【００４０】
　X^1がＣ－Ｈを表し、
　ここで、他の置換基は前記意味の１以上を有する；
　式［Ｉ－ｂ］の化合物、およびその農薬的に活性な塩がさらに特別に好ましい。

【００４１】
　R^1がR^1の一般的な残基の定義または式［Ｉ－ａ］の化合物における好ましい範囲で詳説し定義と同一の意味を有し、
　ここで、他の置換基は前記意味の１以上を有する；
　式［Ｉ－ｂ］の化合物、およびその農薬的に活性な塩がさらに特別に好ましい。

【００４２】
　R^2がR^2の一般的な残基の定義または式［Ｉ－ａ］の化合物における好ましい範囲で詳説した定義と同一の意味を有し、
　ここで、他の置換基は前記意味の１以上を有する；
　式［Ｉ－ｂ］の化合物、およびその農薬的に活性な塩がさらに特別に好ましい。

【００４３】
　R^{301}がメチル、エチル、１－プロピル、プロパン－２－イル、イソブチル、ブタン－２－イル、２－メチルプロピル、プロパ－２－イン－１－イル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、（２，２－ジクロロシクロプロピル）－メチル、２－シアノエチル、２－クロロエチル、シクロプロピルメチル、２，２－ジフルオロエチル、２，２，２－トリフルオロエチル、２－フルオロベンジル、２－（トリフルオロメトキシ）エチル、１－メトキシプロパン－２－イル、１－シクロプロピルエチル、１－シアノプロパン－２－イル、プロパン－２－イルオキシ、２－エトキシエチル、３－メトキシ－プロピル、２－（トリフルオロメトキシ）エチルまたは１，３－ジオキソラン－２－イルメチルを表し、
　ここで、他の置換基は前記意味の１以上を有する；
　式［Ｉ－ｂ］の化合物、およびその農薬的に活性な塩がさらに特別に好ましい。

【００４４】
　R^{401}が－$NH-COR^{15}$を表し、
　ここで、他の置換基は前記意味の１以上を有する；
　式［Ｉ－ｂ］の化合物、およびその農薬的に活性な塩がさらに特別に好ましい。

【００４５】
　R^{15}がC_1-C_6アルキルまたはC_3-C_6シクロアルキルを表し、
　ここで、他の置換基は前記意味の１以上を有する；
　式［Ｉ－ｂ］の化合物、およびその農薬的に活性な塩がさらに特別に好ましい。

【００４６】
　R^1がR^1の一般的な残基の定義または式［Ｉ－ａ］の化合物における好ましい範囲で詳説した定義と同一の意味を有し、
　R^2がR^2の一般的な残基の定義またはまたは式［Ｉ－ａ］の化合物における好ましい範囲で詳説した定義と同一の意味を有し、
　R^5およびR^6がR^5およびR^6の一般的な残基の定義または式［Ｉ－ａ］の化合物における好ましい範囲で詳説した定義と同一の意味を有し、
　R^7がR^7の一般的な残基の定義または式［Ｉ－ａ］の化合物における好ましい範囲で

詳説した定義と同一の意味を有し、
R^{19}がR^{19}の一般的な残基の定義または式［Ｉ－ａ］の化合物における好ましい範囲で詳説した定義と同一の意味を有し、
R^{20}およびR^{21}がR^{20}およびR^{21}の一般的な残基の定義または式［Ｉ－ａ］の化合物における好ましい範囲で詳説した定義と同一の意味を有し、
ここで、他の置換基は前記意味の１以上を有する；
式［Ｉ－ｂ］の化合物、ならびにその農薬的に活性な塩がさらに特別に好ましい。
【００４７】
前記残基の定義はいずれの手法で相互に組み合わせることもできる。加えて、いくつかの個々の定義は適用されないであろう。
【００４８】
しかしながら、一般的に詳説した、または前記好ましい範囲において詳説した残基の定義または説明もまた、すなわち、関連する範囲および好ましい範囲の間で相互に組み合わせることもできる。それらは、対応して、最終の生成物に、ならびに前駆体および中間体に適用される。加えて、いくつかの個々の定義は適用されないであろう。
【００４９】
全ての残基が、各々、前記好ましい意味を有する式［Ｉ－ｂ］の化合物が好ましい。
【００５０】
全ての残基が、各々、前記特に好ましい意味を有する式［Ｉ－ｂ］の化合物が特に好ましい。
【００５１】
全ての残基が、各々、前記かなり特に好ましい意味を有する式［Ｉ－ｂ］の化合物がかなり特に好ましい。
【００５２】
全ての残基が、各々、前記特別に好ましい意味を有する式［Ｉ－ｂ］の化合物が特別に好ましい。
【００５３】
式［Ｉ－ａ］および［Ｉ－ｂ］の本発明による化合物は、いくつかの場合において、異なる可能な異性体形態、特に、例えば、ＥおよびＺ、スレオおよびエリスロ、ならびに光学異性体、時々は互変異性体の混合物として存在することができる。ＥおよびＺ異性体、また、スレオおよびエリスロ、ならびに光学異性体の双方、これらの異性体のいずれかの混合物、ならびに可能な互変異性体形態が特許請求される。
【００５４】
置換されていてもよい基は一回または複数回置換でき、ここで、多数の置換基の場合には、置換基は同一または異なることができる。
【００５５】
前記定義の置換基の性質に応じて、式（Ｉ）の化合物は酸性または塩基性特性を呈し、無機または有機酸とで、塩基とで、または金属イオンとで塩を形成することができ、およびいくつかの場合には、内部塩またはアダクトを形成することができる。もし式（Ｉ）の化合物がアミノ、アルキルアミノ、または塩基性特性を誘導する他の基を担うならば、これらの化合物は酸との塩に変換させることができ、あるいは合成を通じて直接的に塩として生じさせることができる。もし式（Ｉ）の化合物がヒドロキシ、カルボキシ、または酸性特性を誘導する他の基を担うならば、これらの化合物は塩基との塩に変換させることができる。適当な塩基は、例えば、アルカリおよびアルカリ土類金属の水酸化物、炭酸塩および水素炭酸塩、特に、ナトリウム、カリウム、マグネシウムおよびカルシウム、また、アンモニア、C_1－C_4アルキル基を持つ第一級、第二級および第三級アミン、C_1－C_4アルカノールからのモノ－、ジ－およびトリアルカノールアミン、コリンおよびクロロコリンの水酸化物、炭酸塩および水素炭酸塩である。
【００５６】
無機酸の例はフッ化水素、塩化水素、臭化水素、およびヨウ化水素、硫酸、リン酸およ

び硝酸のようなハロゲン化水素酸、ならびにＮａＨＳＯ$_4$およびＫＨＳＯ$_4$のような酸性塩である。有機酸としては、例えば、ギ酸、炭酸、および酢酸、トリフルオロ酢酸、トリクロロ酢酸およびプロピオン酸のようなアルカン酸、ならびにまた、グリコール酸、チオシアン酸、乳酸、コハク酸、クエン酸、安息香酸、桂皮酸、シュウ酸、飽和または単一にもしくは二重に不飽和のＣ$_6$－Ｃ$_{20}$脂肪酸、飽和または単一にもしくは二重に不飽和のＣ$_6$－Ｃ$_{20}$アルキレンジカルボン酸、アルキル硫酸モノエステル、アルキルスルホン酸（１から２０の炭素原子を持つ直鎖または分岐鎖のアルキル残基を持つスルホン酸）、アリールスルホン酸またはアリールジスルホン酸（１または２のスルホン酸基を担うフェニルおよびナフチルのような芳香族残基）、アルキルホスホン酸（１から２０の炭素原子を持つ直鎖または分岐鎖のアルキル残基を備えたホスホン酸）、アリールホスホン酸またはアリールジホスホン酸（１または２のホスホン酸残基を担うフェニルおよびナフチルのような芳香族残基）、ここで、該アルキルまたはアリール残基はさらなる置換基を担うことができ、例えば、ｐ－トルエンスルホン酸、サリチル酸、ｐ－アミノサリチル酸、２－フェノキシ安息香酸、２－アセトキシ安息香酸等。

【００５７】

可能な金属イオンは、特に、第二主族の元素、特に、カルシウムおよびマグネシウム、第三および第四主族、特に、アルミニウム、スズおよび鉛、ならびに第一から第八遷移族、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イオンである。第四周期の元素の金属イオンが特に好ましい。ここで、該金属はそれらが利用可能な種々の原子価で存在することができる。

【００５８】

かく得ることができる塩もまた、殺菌およびマイコトキシン－低下特性を呈する。

【００５９】

前記式で述べた記号の定義において、一般的には、代表的には、以下の置換基を表す集合的な用語を用いた：

アルキル：１から８の炭素原子を持つ飽和した、直鎖または分岐鎖の炭化水素残基、例えば、（限定されるものではないが）メチル、エチル、プロピル、１－メチルエチル、ブチル、１－メチル－プロピル、２－メチルプロピル、１，１－ジメチルエチル、ペンチル、１－メチルブチル、２－メチルブチル、３－メチルブチル、２，２－ジ－メチルプロピル、１－エチルプロピル、ヘキシル、１，１－ジメチルプロピル、１，２－ジメチルプロピル、１－メチルペンチル、２－メチルペンチル、３－メチルペンチル、４－メチルペンチル、１，１－ジメチルブチル、１，２－ジメチルブチル、１，３－ジメチルブチル、２，２－ジメチルブチル、２，３－ジメチルブチル、３，３－ジメチルブチル、１－エチルブチル、２－エチルブチル、１，１，２－トリメチルプロピル、１，２，２－トリメチルプロピル、１－エチル－１－メチルプロピルおよび１－エチル－２－メチルプロピルのようなＣ$_1$－Ｃ$_6$アルキル。好ましくは、アルキルは、１から６、好ましくは１から４の炭素原子を持つ飽和した、直鎖または分岐鎖の炭化水素残基を表す。

【００６０】

ハロアルキル：（前記したような）１から８（好ましくは、１から６、なおより好ましくは、１から４）の炭素原子を持つ直鎖または分岐鎖のアルキル基、ここで、これらの基において、水素原子は部分的にまたは全部が前記したようなハロゲン原子で置き換えることができる、例えば、（限定されるものではないが）クロロメチル、ブロモメチル、ジクロロメチル、トリクロロメチル、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロフルオロメチル、ジクロロフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、１－クロロエチル、１－ブロモエチル、１－フルオロエチル、２－フルオロエチル、２，２－ジフルオロエチル、２，２，２－トリフルオロエチル、２－クロロ－２－フルオロエチル、２－クロロ－２－ジフルオロエチル、２，２－ジクロロ－２－フルオロエチル、２，２，２－トリクロロエチル、ペンタフルオロエチルおよび１，１，１－トリフルオロ－プロパ－２－イルのようなＣ$_1$－Ｃ$_3$ハロアルキル；

シクロアルキル：３から８（好ましくは３から６）の炭素環員を持つ単環の、飽和した

炭化水素基、例えば、（限定されるものではないが）シクロプロピル、シクロペンチルおよびシクロヘキシル；

ハロシクロアルキル：（前記したような）３から８（好ましくは、３から６）の炭素環員を持つ単環の、飽和した炭化水素基、ここで、これらの基において、水素原子は部分的にまたは全部が前記したようなハロゲン原子で置き換えることができる、例えば、（限定されるものではないが）２－フルオロシクロプロピル、２，２－ジフルオロシクロプロピル、３，３－ジフルオロシクロブチル、２－フルオロシクロペンチルおよび３－フルオロシクロペンチル；

ヘテロシクリル：酸素、窒素または硫黄の群からの１から４のヘテロ原子を含有する、３から１５員の、好ましくは、３から９員の、飽和または部分的に不飽和の複素環：炭素環員とは別に、１から３の窒素原子ならびに／または１つの酸素もしくは硫黄原子、もしくは１もしくは２の酸素および／もしくは硫黄原子を含有する単環、二環または三環の複素環；もし該環がいくつかの酸素原子を含有するならば、これらは直接的に隣接して位置しない；例えば、（限定されるものではないが）以下のようなもの、オキシラニル、アジリジニル、２－テトラヒドロフラニル、３－テトラヒドロフラニル、２－テトラヒドロチエニル、３－テトラヒドロチエニル、２－ピロリジニル、３－ピロリジニル、３－イソオキサゾリジニル、４－イソオキサゾリジニル、５－イソオキサゾリジニル、３－イソチアゾリジニル、４－イソチアゾリジニル、５－イソチアゾリジニル、３－ピラゾリジニル、４－ピラゾリジニル、５－ピラゾリジニル、２－オキサゾリジニル、４－オキサゾリジニル、５－オキサゾリジニル、２－チアゾリジニル、４－チアゾリジニル、５－チアゾリジニル、２－イミダゾリジニル、４－イミダゾリジニル、１，２，４－オキサジアゾリジン－３－イル、１，２，４－オキサジアゾリジン－５－イル、１，２，４－チアジアゾリジン－３－イル、１，２，４－チアジアゾリジン－５－イル、１，２，４－トリアゾリジン－３－イル、１，３，４－オキサジアゾリジン－２－イル、１，３，４－チアジアゾリジン－２－イル、１，３，４－トリアゾリジン－２－イル、２，３－ジヒドロフラ－２－イル、２，３－ジヒドロフラ－３－イル、２，４－ジヒドロフラ－２－イル、２，４－ジヒドロフラ－３－イル、２，３－ジヒドロチエン－２－イル、２，３－ジヒドロチエン－３－イル、２，４－ジヒドロチエン－２－イル、２，４－ジヒドロチエン－３－イル、２－ピロリン－２－イル、２－ピロリン－３－イル、３－ピロリン－２－イル、３－ピロリン－３－イル、２－イソオキサゾリン－３－イル、３－イソオキサゾリン－３－イル、４－イソオキサゾリン－３－イル、２－イソオキサゾリン－４－イル、３－イソオキサゾリン－４－イル、４－イソオキサゾリン－４－イル、２－イソオキサゾリン－５－イル、３－イソオキサゾリン－５－イル、４－イソオキサゾリン－５－イル、２－イソチアゾリン－３－イル、３－イソチアゾリン－３－イル、４－イソチアゾリン－３－イル、２－イソチアゾリン－４－イル、３－イソチアゾリン－４－イル、４－イソチアゾリン－４－イル、２－イソチアゾリン－５－イル、３－イソチアゾリン－５－イル、４－イソチアゾリン－５－イル、２，３－ジヒドロピラゾール－１－イル、２，３－ジヒドロピラゾール－２－イル、２，３－ジヒドロピラゾール－３－イル、２，３－ジヒドロピラゾール－４－イル、２，３－ジヒドロピラゾール－５－イル、３，４－ジヒドロピラゾール－１－イル、３，４－ジヒドロピラゾール－３－イル、３，４－ジヒドロピラゾール－４－イル、３，４－ジヒドロピラゾール－５－イル、４，５－ジヒドロピラゾール－１－イル、４，５－ジヒドロピラゾール－３－イル、４，５－ジヒドロピラゾール－４－イル、４，５－ジヒドロピラゾール－５－イル、２，３－ジヒドロオキサゾール－２－イル、２，３－ジヒドロオキサゾール－３－イル、２，３－ジヒドロオキサゾール－４－イル、２，３－ジヒドロオキサゾール－５－イル、３，４－ジヒドロオキサゾール－２－イル、３，４－ジヒドロオキサゾール－３－イル、３，４－ジヒドロオキサゾール－４－イル、３，４－ジヒドロオキサゾール－５－イル、３，４－ジヒドロオキサゾール－２－イル、３，４－ジヒドロオキサゾール－３－イル、３，４－ジヒドロオキサゾール－４－イル、２－ピペリジネイル、３－ピペリジネイル、４－ピペリジネイル、１，３－ジオキサン－５－イル、２－テトラヒドロピラニル、４－テトラヒドロピラニル、２－テトラヒドロチエニル、３－ヘキ

サヒドロピリダジニル、４－ヘキサヒドロピリダジニル、２－ヘキサヒドロピリミジニル、４－ヘキサヒドロピリミジニル、５－ヘキサヒドロピリミジニル、２－ピペラジニル、１，３，５－ヘキサヒドロトリアジン－２－イルおよび１，２，４－ヘキサヒドロトリアジン－３－イル；

オキソヘテロシクリル：（前記したような）３から１５員、好ましくは、３から９員の、飽和または部分的不飽和の複素環、ここで、これらの基において、１以上のCH_2基の水素原子は１以上のカルボニル基によって置き換えることができる、例えば、（限定されるものではないが）２－オキソオキセタン－３－イル、５－オキソテトラヒドロフラン－３－イル、２－オキソテトラヒドロフラン－３－イル、２，５－ジオキソテトラヒドロフラン－３－イル、５－オキソ－２，５－ジヒドロフラン－３－イル、２－オキソ－２，５－ジヒドロフラン－３－イル、５－オキソピロリジン－３－イル、２－オキソピロリジン－３－イル、５－オキソピロリジン－２－イル）、３－オキソピロリジン－２－イルおよび４－オキソ－３，４－ジヒドロ－２Ｈ－ピラン－５－イル；

アルケニル：２から８（好ましくは、２から６）の炭素原子、およびいずれかの位置における二重結合を持つ不飽和の、直鎖または分岐鎖の炭化水素残基、例えば、（限定されるものではないが）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、３－メチル－１－ペンテニル、４－メチル－１－ペンテニル、１－メチル－２－ペンテニル、２－メチル－２－ペンテニル、３－メチル－２－ペンテニル、４－メチル－２－ペンテニル、１－メチル－３－ペンテニル、２－メチル－３－ペンテニル、３－メチル－３－ペンテニル、４－メチル－３－ペンテニル、１－メチル－４－ペンテニル、２－メチル－４－ペンテニル、３－メチル－４－ペンテニル、４－メチル－４－ペンテニル、１，１－ジメチル－２－ブテニル、１，１－ジメチル－３－ブテニル、１，２－ジメチル－１－ブテニル、１，２－ジメチル－２－ブテニル、１，２－ジメチル－３－ブテニル、１，３－ジメチル－１－ブテニル、１，３－ジメチル－２－ブテニル、１，３－ジメチル－３－ブテニル、２，２－ジメチル－３－ブテニル、２，３－ジメチル－１－ブテニル、２，３－ジメチル－２－ブテニル、２，３－ジメチル－３－ブテニル、３，３－ジメチル－１－ブテニル、３，３－ジメチル－２－ブテニル、１－エチル－１－ブテニル、１－エチル－２－ブテニル、１－エチル－３－ブテニル、２－エチル－１－ブテニル、２－エチル－２－ブテニル、２－エチル－３－ブテニル、１，１，２－トリメチル－２－プロペニル、１－エチル－１－メチル－２－プロペニル、１－エチル－２－メチル－１－プロペニルおよび１－エチル－２－メチル－２－プロペニルのようなＣ２－Ｃ６アルケニル；

アルキニル：２から８（好ましくは、２から６）の炭素原子およびいずれかの位置における三重結合を持つ直鎖または分岐鎖の炭化水素の基、例えば、（限定されるものではないが）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－プロピニルのようなＣ$_2$－Ｃ$_6$アルキニル；

アリール：４から１４員の、完全に不飽和の炭素環系、例えば、（限定されるものではないが）フェニル、１－ナフチル、２－ナフチル、２－アントリルおよび１－アントリル；

ヘテロアリール：酸素、窒素または硫黄の群からの１から４のヘテロ原子を含有する、５または６員の、完全に不飽和の単環系、もし該環がいくつかの酸素原子を含有すれば、これらは直接的に隣接して位置しない；

アルコキシ：直鎖または分岐鎖のアルコキシ残基、好ましくはＣ$_1$－Ｃ$_6$アルコキシ残基、特に好ましくは、Ｃ$_1$－Ｃ$_3$アルコキシ残基、例えば、（限定されるものではないが）メトキシ、エトキシ、ｎ－プロポキシ、１－メチルエトキシ、ｎ－ブトキシ、１－メチルプロポキシ、２－メチルプロポキシまたは１，１－ジメチルエトキシ、特に、メトキシまたはエトキシ；

アルキルチオ：は、直鎖または分岐鎖のアルキルチオ、例えば、（限定されるものではないが）メチルチオ、エチルチオ、ｎ－およびｉ－プロピルチオ、ｎ－、ｉ－、ｓｅｃ－およびｔｅｒｔ－ブチルチオ、ｎ－ペンチルチオ、ならびに１－、２－および３－メチル－ブチルチオのようなそれらの異性体を表す。該アルキルチオ基は１から３のハロゲン原子（好ましくは、塩素および／またはフッ素）で置換することができ、例えば、（限定されるものではないが）ジ－およびトリフルオロメチルチオならびにジフルオロクロロメチルチオである。

【００６１】

ハロアルコキシ：は、１以上の水素原子がフッ素、塩素または臭素によって置き換えられた、直鎖または分岐鎖のアルコキシ残基、例えば、（限定されるものではないが）－ＯＣＦ$_3$または－ＯＣＨＦ$_2$を表す。フッ素または塩素での１倍から３倍置換が好ましい。

【００６２】

アシルオキシ：は、酸素原子を介して結合した、直鎖、分岐鎖、環状の、飽和または不飽和のアシルオキシ残基、例えば、（限定されるものではないが）アセチルオキシ、プロピオニルオキシおよびイソブチリルオキシを表す。

【００６３】

ヘテロアルキル：２から１０（好ましくは、２から８）の炭素原子、および少なくとも１つのヘテロ原子を持つ、飽和または不飽和の、直鎖または分岐鎖の炭化水素残基、ここで、２つのヘテロ原子は直接的に隣接してはならない。

【００６４】

自然の法則に反する、従って、当業者がその専門家の知識に基づいて排除した組合せは含まれない。例えば、３以上の隣接するＯ原子を持つ環構造は除外される。

【発明を実施するための形態】

【００６５】

製法および中間体の説明

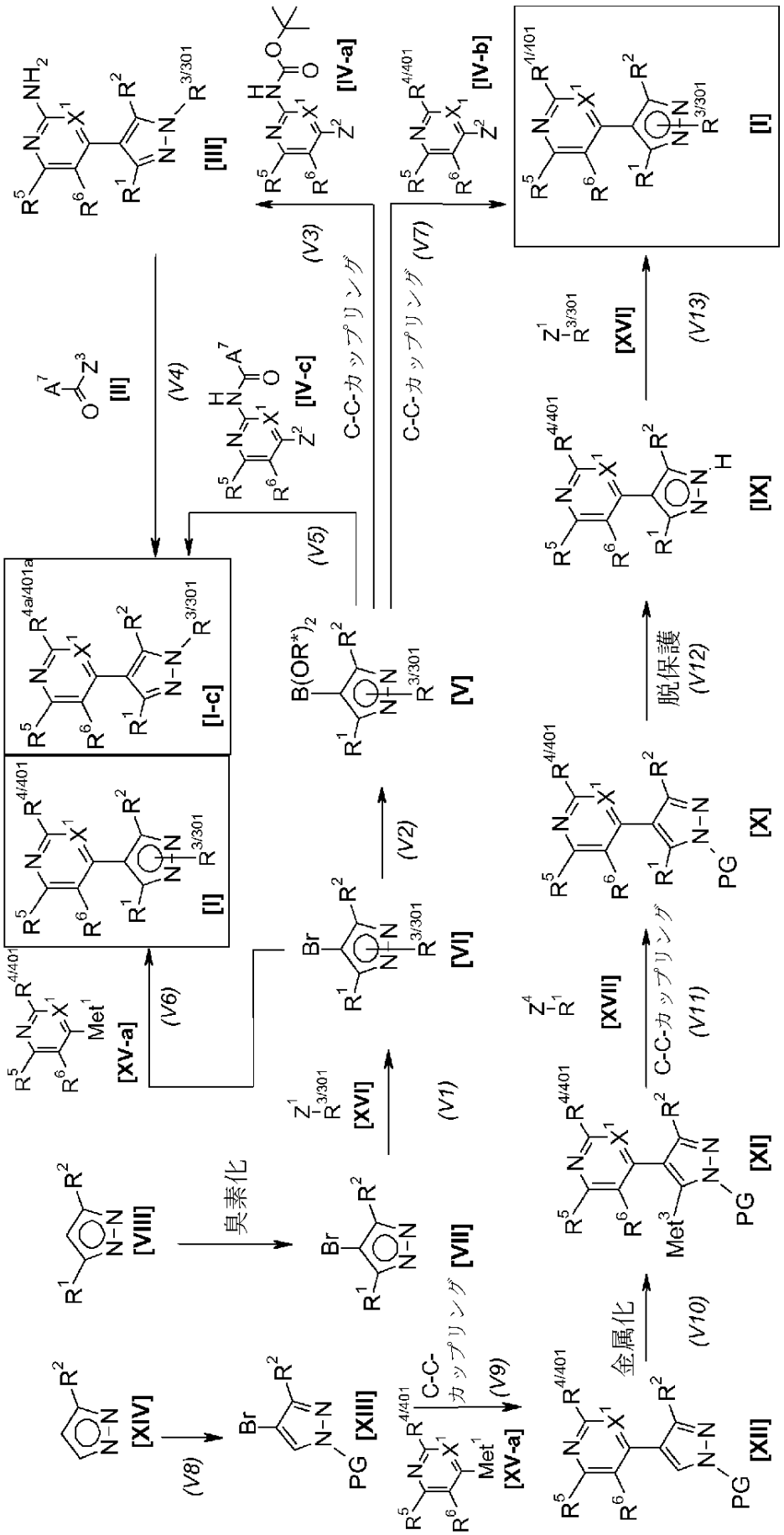
式［Ｉ－ａ］および［Ｉ－ｂ］の本発明によるフェニルピリ（ミ）ジニラゾール類は、種々の方法で製造することができる。製法に記載の目的では、式［Ｉ－ａ］および［Ｉ－ｂ］の化合物は式［Ｉ］下で一緒にする。というのは、本発明による製法は双方の式に適用することができるからである。以下に、可能な製法をまず模式的に示す。そうでないことが述べられるのでなければ、述べた残基は先に述べた意味を有する。

【００６６】

式［Ｉ］の本発明によるフェニルピリ（ミ）ジニラゾール類は、以下のスキームに従って製法Ａによって製造することができる。

スキーム１
【００６７】

【化３】



Ｍｅｔ^{1}＝例えば、－Ｓｎ（Ｂｕ）$_{3}$、－Ｂ（ＯＲ＊）$_{2}$

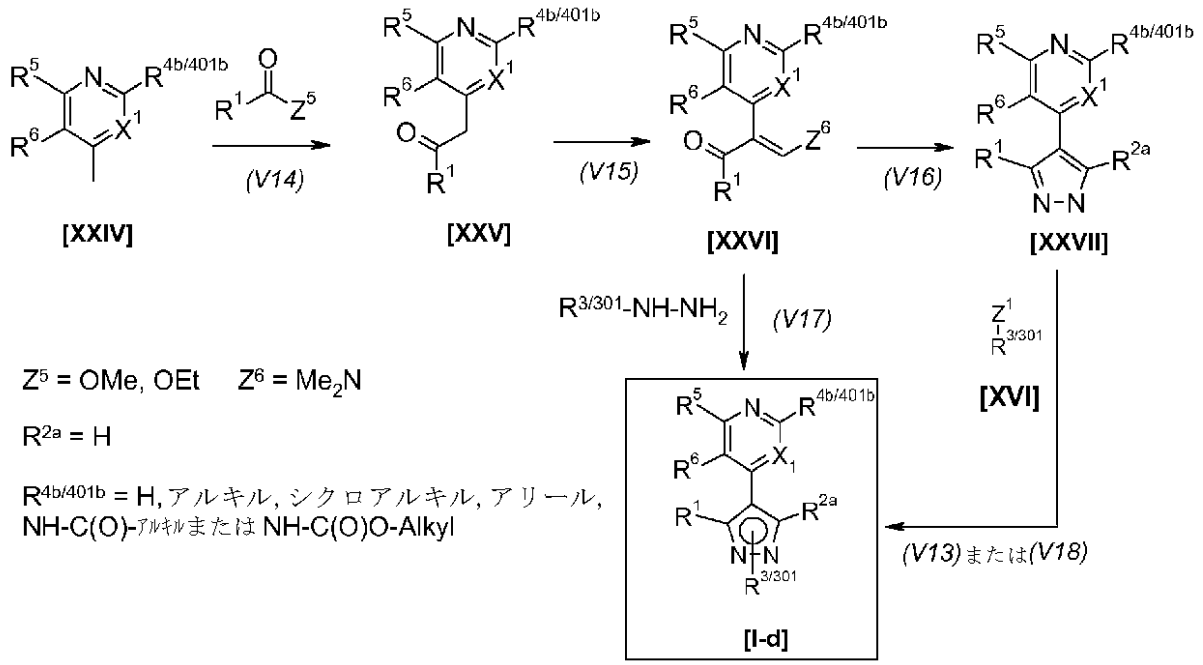
Ｍｅｔ^{3}＝例えば、－Ｓｎ（Ｂｕ）$_{3}$、４，４，５，５－テトラメチル－１，３，２－ジオキサボロラン－２－イル
Ｂ（ＯＲ＊）$_{2}$＝例えば、－Ｂ（ＯｉＰｒ）$_{2}$、－Ｂ（ＯＨ）$_{2}$
Ｚ^{1}＝例えば、Ｃｌ、Ｂｒ、Ｉ、－ＯＴｏｓ、－ＯＭｓ、－ＯＨ
Ｚ^{2}＝例えば、Ｃｌ、Ｂｒ
Ｚ^{3}＝例えば、Ｃｌ、－ＯＨ
Ｚ^{4}＝例えば、Ｉ、Ｃｌ、Ｂｒ、－ＯＭｓ、－ＯＴｏｓ
Ａ^{7}＝Ｒ^{15}、－ＯＲ^{15}
Ｒ$^{4a/401a}$＝例えば、－ＮＨ－Ｃ（Ｓ）Ｒ^{15}、－ＮＨ－Ｃ（Ｏ）Ｒ^{15}、－ＮＨ－Ｃ（Ｏ）ＯＲ^{15}、－ＮＨ－Ｃ（Ｏ）ＮＲ^{15}Ｒ^{16}
Ｒ$^{4b/401b}$＝例えば、水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、－ＮＨ－Ｃ（Ｏ）－アルキルまたは－ＮＨ－Ｃ（Ｏ）Ｏ－アルキル
ＰＧ＝例えば、テトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－２－イル、２－（トリメチルシリル）エトキシ］メチル

加えて、式［Ｉ－ｄ］の本発明によるフェニルピリ（ミ）ジニラゾール類は製法Ｂ（スキーム２）によって製造することもできる。

スキーム２

【００６８】

【化４】

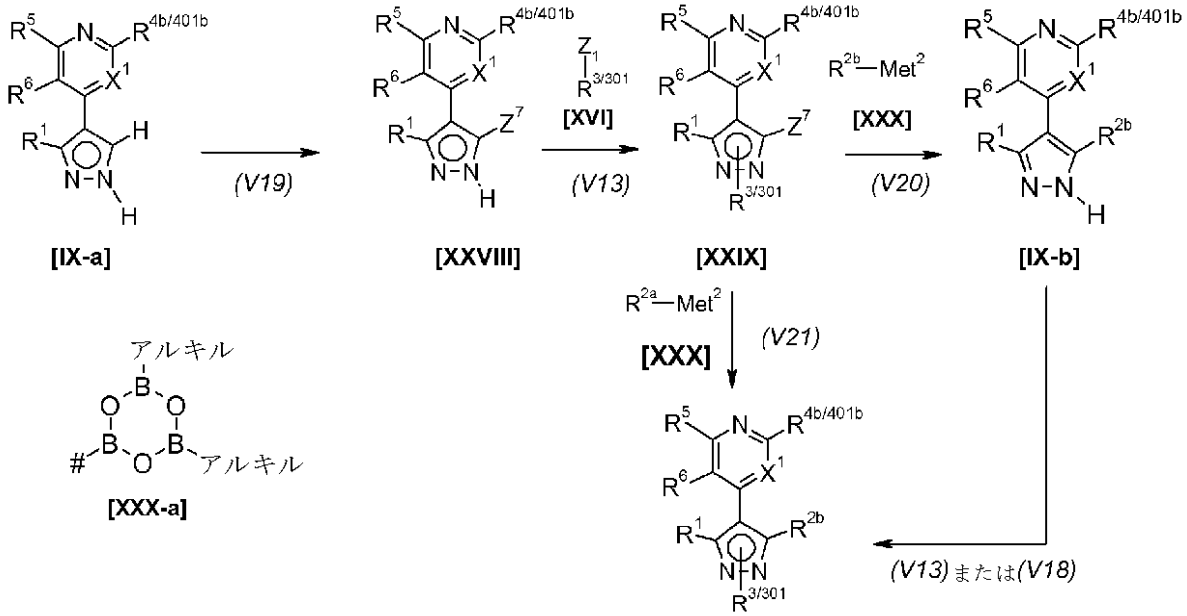


別法として、式［Ｉ－ｅ］の本発明によるアリールピラゾール類および式［ＩＸ－ｂ］の中間体は製法Ｃ（スキーム３）によって製造することもできる。

スキーム３

【００６９】

【化５】



Z^7 = Cl, Br　Met^2 = $B(OAlkyl)_2$, **[XXX-a]**

R^{2b} = アルキル, シクロアルキルまたはアリール

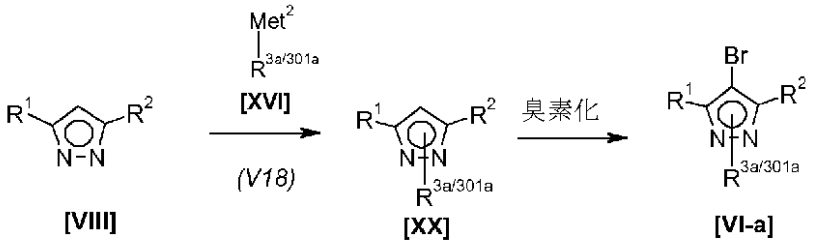
$R^{4b/401b}$ = アルキル, シクロアルキル, アリール, NH-C(O)-アルキルまたはNH-C(O)O-Alkyl

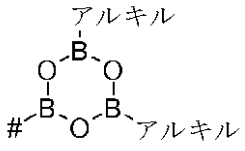
別法として、式［ＶＩ－ａ］の中間体は製法Ｄ（スキーム４）によって製造することもできる。

スキーム４

【００７０】

【化６】





Met^2 = $B(OAlkyl)_2$, **[XXX-a]**

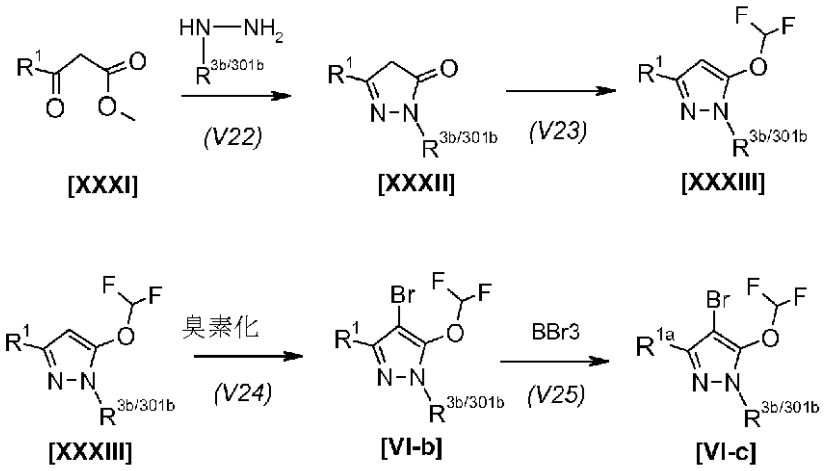
$R^{3a/301a}$ = シクロプロピル

別法として、式［ＶＩ－ｂ］の中間体および式［ＶＩ－ｃ］の中間体は製法Ｅ（スキーム５）によって製造することもできる。

スキーム５

【００７１】

【化７】



$R^{3b/301b}$ = アルキル, シクロアルキル

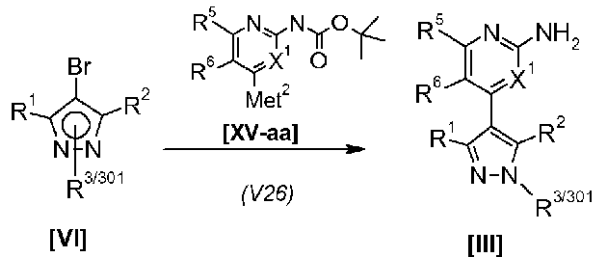
[VI-b] R1 = (4-フルオロフェニル、4-フルオロ-2-メトキシフェニル)
[VI-c] R1 = (4-フルオロ-2-ヒドロキシフェニル)

別法として、式［ＩＩＩ］の中間体は製法Ｆ（スキーム６）によって製造することもできる。

スキーム６

【００７２】

【化８】



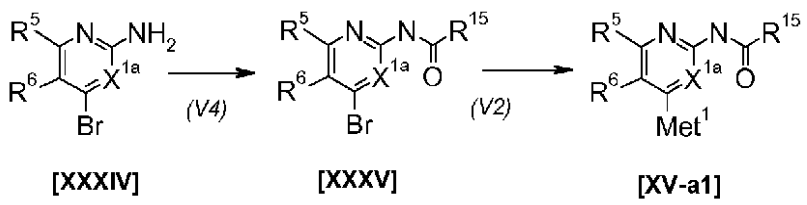
$Met^2 = B(OAlkyl)_2$

タイプ［ＸＶ－ａ］の中間体は製法Ｇ（スキーム７）によって製造することができる。

スキーム７

【００７３】

【化９】

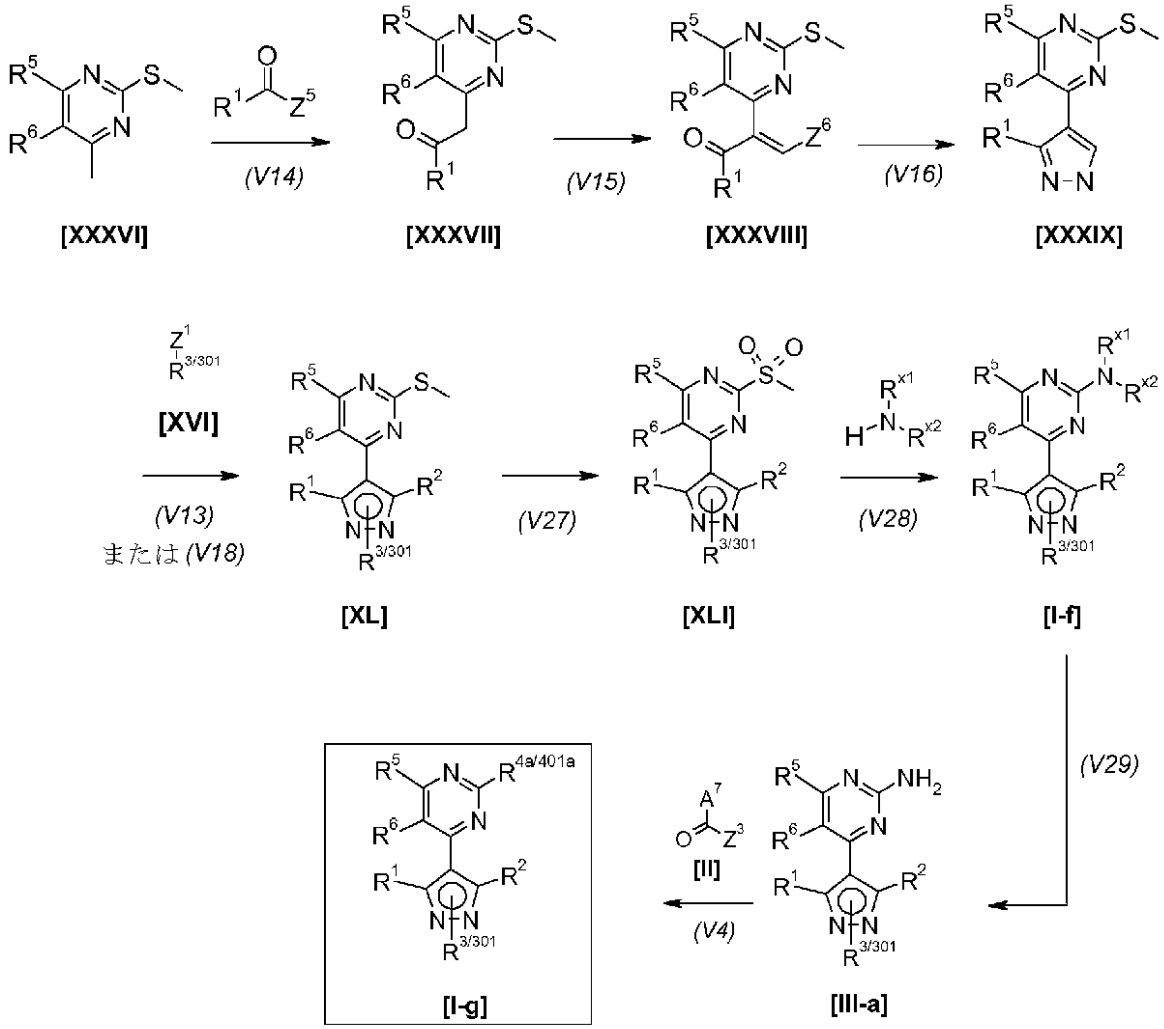


Met^1 = #-B(O)(O)

$X^{1a} = CH$

加えて、式［Ｉ－ｆ］および［Ｉ－ｇ］の本発明によるフェニルピリ（ミ）ジニラゾール類は製法Ｈ（スキーム８）によって製造することもできる。

スキーム８
【００７４】
【化１０】

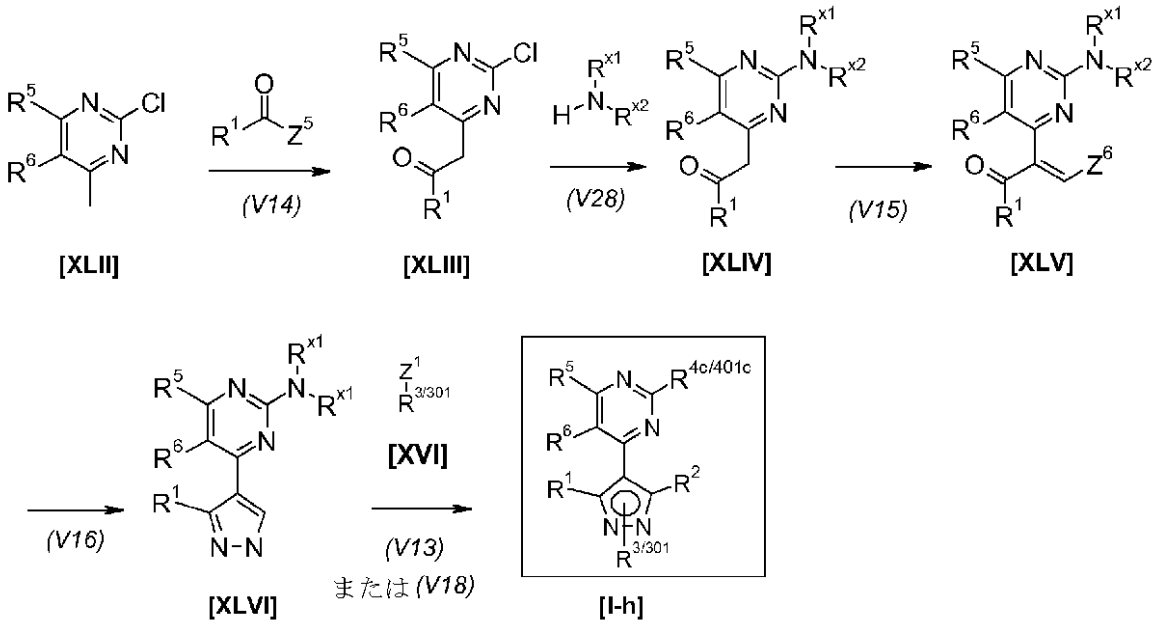


Ｚ^{1}＝例えば、Ｃｌ、Ｂｒ、Ｉ、－ＯＴｏｓ、Ｏｍｓ、－ＯＨ
Ｚ^{3}＝例えば、Ｃｌ
Ｚ^{5}＝－ＯＭｅ、－ＯＥｔ
Ｚ^{6}＝Ｍｅ$_{2}$Ｎ
Ｒ$^{4a/401a}$＝例えば、－ＮＨ－Ｃ（Ｓ）Ｒ^{15}、－ＮＨ－Ｃ（Ｏ）Ｒ^{15}、－ＮＨ－Ｃ（Ｏ）ＯＲ^{15}、－ＮＨ－Ｃ（Ｏ）ＮＲ^{15}Ｒ^{16}
Ｒ^{x1}＝例えば、水素、アルキル、シクロアルキル、ベンジル
Ｒ^{x2}＝例えば、アルキル、シクロアルキル、ベンジル
Ａ^{7}＝－Ｒ^{15}、－ＯＲ^{15}

加えて、式［Ｉ－ｈ］の本発明によるフェニルピリ（ミ）ジニラゾール類は、製法Ｉ（スキーム９）によって製造することができる。

スキーム９
【００７５】

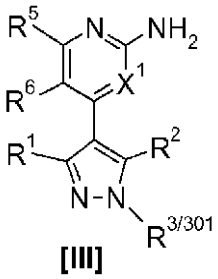
【化１１】



Ｚ^{1}＝例えば、Ｃｌ、Ｂｒ、Ｉ、－ＯＴｏｓ、Ｏｍｓ、－ＯＨ
Ｚ^{5}＝－ＯＭｅ、－ＯＥｔ
Ｚ^{6}＝Ｍｅ$_{2}$Ｎ
Ｒ$^{4c/401c}$＝例えば、－ＮＲ^{12a}Ｒ^{13a}、－ＮＨＲ^{13a}、－ＮＨＲ^{14a}
Ｒ^{x1}＝例えば、水素、アルキル、シクロアルキル、ベンジル、ヘテロシクリル
Ｒ^{x2}＝例えば、アルキル、シクロアルキル、ベンジル、ヘテロシクリル
式［ＩＩＩ］：

【００７６】

【化１２】



［式中、記号Ｒ^{1}、Ｒ^{2}、Ｒ$^{3/301}$、Ｒ^{5}、Ｒ^{6}およびＸ^{1}は前記した一般的な、好ましい、特に好ましい、かなり特に好ましい、最も好ましい、または特別に好ましい意味を有する］
の化合物、およびその塩は新規である。

【００７７】

例えば、以下の表にリストされたタイプ［ＩＩＩ］の化合物は新規である：

【００７８】

【表１】

No.	名称	R^1	R^2	$R^{3/301}$	LogP (pH 2.3)[1]	$[M+H]^+$ ピーク[2]
[III-1]	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-イソプロピル 1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-アミン	4-フルオロフェニル	H	イソプロピル	1.22	297.13
[III-2]	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(2-メトキシエチル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-アミン	4-フルオロフェニル	H	2-メトキシエチル	0.98	313.15
[III-3]	4-[1-エチル-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-アミン	4-フルオロフェニル	H	エチル	0.97	283.20
[III-4]	4-[1-(2,2-ジフルオロエチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-アミン	4-フルオロフェニル	H	2,2-ジフルオロエチル	1.03	319.48
[III-5]	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-アミン	4-フルオロフェニル	H	メチル	0.71	269.2

ここで、
X^1 は＝Ｃ－Ｈを表し、および
R^5、R^6 はＨを表す。

【００７９】

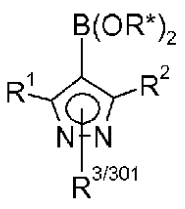
化合物４－［３－（４－フルオロフェニル）－５－メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－２－アミン、４－［３－（４－クロロ－フェニル）－５－メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－２－アミン、４－［３－（４－メトキシフェニル）－５－メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－２－アミン、４－［３－（４－フルオロフェニル）－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリミジン－２－アミン、４－（５－メチル－３－フェニル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリミジン－２－アミンおよび［４－（２－アミノピリミジン－４－イル）－３－（３－クロロ－５－ヒドロキシフェニル）－１Ｈ－ピラゾール－１－イル］アセトニトリルは除外される。

【００８０】

式［Ｖ］：

【００８１】

【化１３】



[V]

$B(OR^*)_2$= z.B. $B(OiPr)_2$, $B(OH)_2$

［式中、記号R^2、$R^{3/301}$は前記した一般的、好ましい、特に好ましい、かなり特

に好ましいまたは特別に好ましい意味を有し、および
Ｒ[1]は前記した好ましい、特に好ましい、かなり特に好ましい、最も好ましいまたは特別に好ましい意味を有する］
の化合物、およびその塩も新規である。
【００８２】
例えば、以下の表にリストされたタイプ［Ｖ］の化合物は新規である：
【００８３】

【表２】

No.	名称	R^1	R^2	$R^{3/301}$	LogP (pH 2.3)[1]	$[M+H]^+$ ピーク[2]
[V-1]	3-(4-フルオロフェニル)-1-イソプロピル-4-(4,4,5,5-テトラメチル-1,3,2-ジオキサボロラン-2-イル)-1H-ピラゾール	4-フルオロフェニル	H	イソプロピル	4.46	331.2
[V-2]	3-(4-フルオロフェニル)-1-(2-メトキシエチル)-4-(4,4,5,5-テトラメチル-1,3,2-ジオキサボロラン-2-イル)-1H-ピラゾール	4-フルオロフェニル	H	2-メトキシエチル	3.58	347.2
[V-3]	3-(4-フルオロフェニル)-1-イソブチル-4-(4,4,5,5-テトラメチル-1,3,2-ジオキサボロラン-2-イル)-1H-ピラゾール	4-フルオロフェニル	H	イソブチル	4.89	345.2
[V-4]	1-(2,2-ジフルオロエチル)-3-(4-フルオロフェニル)-4-(4,4,5,5-テトラメチル-1,3,2-ジオキサボロラン-2-イル)-1H-ピラゾール	4-フルオロフェニル	H	2,2-ジフルオロエチル	3.84	353.2
[V-5]	3-(4-フルオロフェニル)-1-イソプロポキシ-4-(4,4,5,5-テトラメチル-1,3,2-ジオキサボロラン-2-イル)-1H-ピラゾール	4-フルオロフェニル	H	イソプロポキシ	4.81	347.2
[V-6]	1-(シクロペンチルオキシ)-3-(4-フルオロフェニル)-4-(4,4,5,5-テトラメチル-1,3,2-ジオキサボロラン-2-イル)-1H-ピラゾール	4-フルオロフェニル	H	シクロペンチルオキシ	5.51	373.2
[V-7]	1-シクロプロピル-3-(4-フルオロフェニル)-4-(4,4,5,5-テトラメチル-1,3,2-ジオキサボロラン-2-イル)-1H-ピラゾール	4-フルオロフェニル	H	シクロプロピル	3.47	329.2
[V-8]	1-(シクロプロピルメチル)-3-(4-フルオロフェニル)-4-(4,4,5,5-テトラメチル-1,3,2-ジオキサボロラン-2-イ	4-フルオロフェニル	H	シクロプロピルメチル	4.42	343.2

No.	名称	R^1	R^2	$R^{3/301}$	LogP (pH 2.3)[1]	$[M+H]^+$ ピーク[2]
	ル)-1H-ピラゾール					
[V-9]	3-(4-フルオロフェニル)-1-メチル-4-(4,4,5,5-テトラメチル-1,3,2-ジオキサボロラン-2-イル)-1H-ピラゾール	4-フルオロフェニル	H	メチル	3.47	303.2
[V-10]	1-(2-クロロエチル)-3-(4-フルオロフェニル)-4-(4,4,5,5-テトラメチル-1,3,2-ジオキサボロラン-2-イル)-1H-ピラゾール	4-フルオロフェニル	H	2-クロロエチル	4.06	351.1

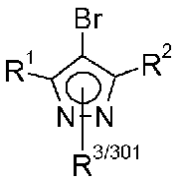
化合物１－メチル－３－フェニル－４－（４，４，５，５－テトラメチル－１，３，２－ジオキサボロラン－２－イル）－１Ｈ－ピラゾールは除外される。

【００８４】

式［ＶＩ］：

【００８５】

【化１４】



[VI]

［式中、R^1は前記した特に好ましい、かなり特に好ましい、最も好ましい、または特別に好ましい意味を有し、および

R^2および$R^{3/301}$は前記した好ましい、特に好ましい、かなり特に好ましい、最も好ましい、または特別に好ましい意味を有する］

の化合物、およびその塩は新規である。

【００８６】

例えば、以下の表にリストされたタイプ［ＶＩ］の化合物は新規である：

【００８７】

【表３】

No.	名称	R^1	R^2	$R^{3/301}$	LogP (pH 2.3)[1]	$[M+H]^+$ ピーク[2]
[VI-2]	4-ブロモ-1-エチル-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール	4-フルオロフェニル	H	C2H5	3.32	269.0
[VI-4]	4-ブロモ-3-(4-フルオロフェニル)-1-イソブチル-1H-ピラゾール	4-フルオロフェニル	H	イソブチル	4.34	297.0
[VI-6]	4-ブロモ-3-(4-フルオロフェニル)-1-(2-メトキシエチル)-1H-ピラゾール	4-フルオロフェニル	H	2-メトキシエチル	3.08	299.0
[VI-9]	4-ブロモ-3-(4-フルオロフェニル)-1-[1-(2-フルオロフェニル)エチル]-1H-ピラゾール	4-フルオロフェニル	H	1-(2-フルオロフェニル)エチル	4.77	363.0
[VI-10]	4-ブロモ-1-[(2,2-ジクロロシクロプロピル)メチル]-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール	4-フルオロフェニル	H	(2,2-ジクロロシクロプロピル)-メチル	4.43	364.9
[VI-11]	5-(4-ブロモ-1-イソブチル-1H-ピラゾール-3-イル)-2-フルオロベンゾニトリル	3-シアノ-4-フルオロフェニル	H	イソブチル	4.15	324.1
[VI-12]	3-{[4-ブロモ-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-1-イル]メチル}ベンゾニトリル	4-フルオロフェニル	H	3-シアノベンジル	3.93	358.0
[VI-13]	4-ブロモ-1-(2-フルオロベンジル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール	4-フルオロフェニル	H	2-フルオロベンジル	4.39	349.0
[VI-14]	4-ブロモ-3-(4-フルオロフェニル)-1-プロピル-1H-ピラゾール	4-フルオロフェニル	H	1-プロピル	3.89	283.0
[VI-15]	4-ブロモ-3-(4-フルオロフェニル)-1-[2-(メチルスルファニル)-エチル]-1H-ピラゾール	4-フルオロフェニル	H	2-(メチルスルファニル)エチル	3.63	315.0

No.	名称	R^1	R^2	$R^{3/301}$	LogP (pH 2.3)[1]	$[M+H]^+$ ピーク[2]
[VI-16]	メチル-2-[4-ブロモ-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-1-イル]-3-メチルブタノエート	4-フルオロフェニル	H	1-メトキシ-3-メチル-1-オキソブタン-2-イル	4.27	357.1
[VI-17]	4-ブロモ-1-(1,3-ジオキソラン-2-イルメチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール	4-フルオロフェニル	H	1,3-ジオキソラン-2-イルメチル	3.01	329.0
[VI-18]	4-ブロモー1-(シクロプロピルメチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール	4-フルオロフェニル	H	シクロプロピルメチル	3.90	297.0
[VI-19]	4-ブロモ-1-sec-ブチル-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール	4-フルオロフェニル	H	sec-ブチル	4.39	299.0
[VI-20]	4-ブロモ-1-(2-エトキシエチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール	4-フルオロフェニル	H	2-エトキシエチル	3.51	313.0
[VI-21]	3-[4-ブロモ-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-1-イル]ブタノニトリル	4-フルオロフェニル	H	1-シアノプロパン-2-イル	3.08	310.1
[VI-22]	4-ブロモ-1-(1-シクロプロピルエチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール	4-フルオロフェニル	H	1-シクロプロピルエチル	4.43	309.0
[VI-23]	3-[4-ブロモ-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-1-イル]プロパノニトリル	4-フルオロフェニル	H	2-シアノエチル	2.69	296.0
[VI-24]	4-ブロモ-3-(4-フルオロフェニル)-1-イソプロピル-5-(トリフルオロメチ	4-フルオロフェニル	CF_3	イソプロピル	5.51	353.1

	ル)-1H-ピラゾール					
[VI-25]	4-ブロモ-3-(4-フルオロフェニル)-1-イソプロポキシ-1H-ピラゾール	4-フルオロフェニル	H	イソプロポキシ	4.11	301.1
[VI-26]	4-ブロモ-1-シクロプロピル-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール	4-フルオロフェニル	H	シクロプロピル	3.59	281.0
[VI-27]	tert-ブチル―4-[4-ブロモ-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-1-イル]ピペリジン-1-カルボキシレート	4-フルオロフェニル	H	1-(tert-ブトキシカルボニル)-ピペリジン-4-イル	4.77	368 [M+-C4H9]+
[VI-b-1]	4-ブロモ-5-(ジフルオロメトキシ)-3-(4-フルオロフェニル)-1-メチル―1H-ピラゾール	4-フルオロフェニル	CHF_2	メチル	3.52	321.1
[VI-b-2]	4-ブロモ-5-(ジフルオロメトキシ)-3-(4-フルオロフェニル)-1-イソプロピル-1H-ピラゾール	4-フルオロフェニル	CHF_2	イソプロピル	4.61	351.0
[VI-b-3]	4-ブロモ-5-(ジフルオロメトキシ)-3-(4-フルオロフェニル)-1-イソブチル-1H-ピラゾール	4-フルオロフェニル	CHF_2	イソブチル	4.91	365.0
[VI-c-1]	2-[4-ブロモ-5-(ジフルオロメトキシ)-1-メチル-1H-ピラゾール-3-イル]-5-フルオロフェノール	4-フルオロフェニル	CHF_2	メチル	3.48	336.9

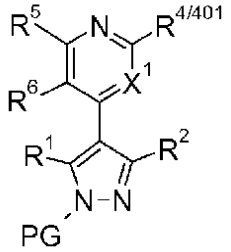
$R^{3/301}$＝Ｈ、CH_3またはＣ（CH_3）$_3$である化合物は排除される。

【００８８】

式［Ｘ］：

【００８９】

【化１５】



[X]

10

［式中、Ｒ２、Ｒ４／４０１、Ｒ５、Ｒ６およびＸ１は前記した一般的な、好ましい、特に好ましい、かなり特に好ましい、最も好ましいまたは特別に好ましい意味を有する］の化合物は新規である。

【００９０】

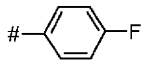
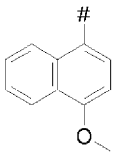
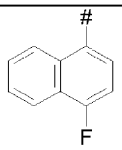
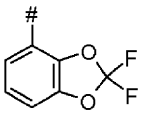
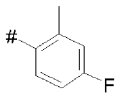
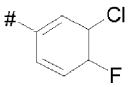
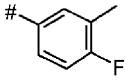
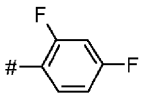
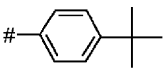
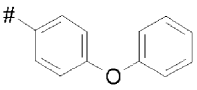
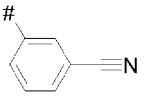
例えば、Ｒ２、Ｒ４／４０１、Ｒ５、Ｒ６がＨを表し、

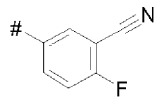
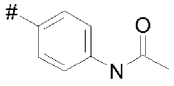
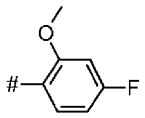
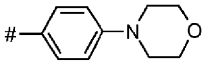
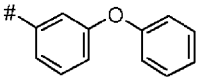
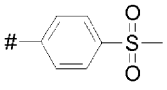
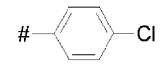
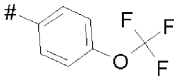
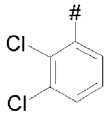
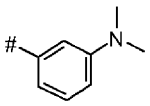
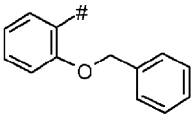
Ｘ１が＝Ｃ－Ｈを表し、および

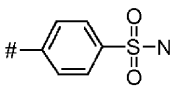
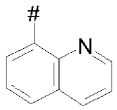
ＰＧがテトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－２－イルを表す化合物は新規である。

【００９１】

【表４】

No.	名称	R^1	LogP (pH 2.3)[1]	$[M+H]^+$ ピーク[2]
[X-1]	4-[5-(4-フルオロフェニル)-1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン		1.23	324.18
[X-2]	4-[5-(4-メトキシ-1-ナフチル)-1-(テトラヒドロー2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン		1.61	386.04
[X-3]	4-[5-(4-フルオロ-1-ナフチル)-1-(テトラヒドロー2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン		1.72	374.01
[X-4]	4-[5-(2,2-ジフルオロ-1,3-ベンゾジオキソール-4-イル)-1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン		1.64	386.10
[X-5]	4-[5-(4-フルオロ-2-メチルフェニル)-1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリド		1.40	338.05
[X-6]	4-[5-(3-クロロ-4-フルオロフェニル)-1-(テトラヒドロー2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン		1.57	357.95
[X-7]	4-[5-(4-フルオロ-3-メチルフェニル)-1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリド		1.47	338.05
[X-8]	4-[5-(2,4-ジフルオロフェニル)-1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン		1.35	342.04
[X-9]	4-[5-(4-tert-ブチルフェニル)-1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン		2.02	362.17
[X-10]	4-[5-(4-フェノキシフェニル)-1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン		1.88	398.13
[X-11]	3-[4-(ピリジン-4-イル)-1-(テトラヒドロー2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-5-イル]ベンゾニトリル		1.23	331.06

No.	名称	R^1	LogP (pH 2.3)[1]	$[M+H]^+$ ピーク[2]
[X-12]	2-フルオロ-5-[4-(ピリジン-4-イル)-1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-5-イル]ベンゾニトリル		1.45	349.01
[X-13]	N-{4-[4-(ピリジン-4-イル)-1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-5-イル]フェニル}アセトアミド		0.97	363.11
[X-14]	4-[5-(4-フルオロ-2-メトキシフェニル)-1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン		1.26	354.05
[X-15]	4-{4-[4-(ピリジン-4-イル)-1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-5-イル]フェニル}モルホリン		1.26	391.14
[X-16]	4-[5-(3-フェノキシフェニル)-1-(テトラヒドロー2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン		1.88	398.13
[X-17]	4-{5-[4-(メチルスルホニル)フェニル]-1-(テトラヒドロー2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル}ピリジン		0.96	384.02
[X-18]	4-[5-(4-クロロフェニル)-1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン		1.52	340.15
[X-19]	4-{1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-5-[4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]-1H-ピラゾール-4-イル}ピリジン		1.78	390.07
[X-20]	4-[5-(2,3-ジクロロフェニル)-1-(テトラヒドロー2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン		1.66	374.07
[X-21]	N,N-ジメチル-3-[4-(ピリジン-4-イル)-1-(テトラヒドロー2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-5-イル]アニリン		1.33	349.20
[X-22]	4-{5-[2-(ベンジルオキシ)フェニル]-1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル}ピリジン		1.64	412.17

No.	名称	R^1	LogP (pH 2.3)[1]	$[M+H]^+$ ピーク[2]
[X-23]	4-[4-(ピリジン-4-イル)-1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-5-イル]ベンゼンスルフォンアミド		0.92	385.03
[X-24]	8-[4-(ピリジン-4-イル)-1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-5-イル]キノリン		1.09	357.13

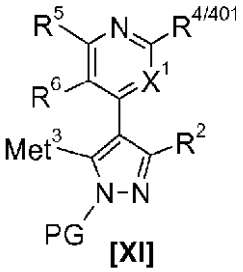
[1] logP 値の決定において、以下に記載する方法を用いた。

[2] 述べられた質量は最高の強度での$[M+H]^+$イオンの同位体パターンのピークであり;もし$[M-H]^-$イオンが検出されれば、質量値は a2 でマークする。

式［ＸＩ］：

【００９２】

【化１６】



[XI]

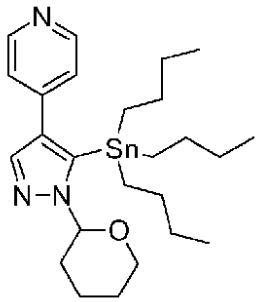
［式中、記号R^2、$R^{4/401}$、R^5、R^6およびX^1は前記した一般的な、好ましい、特に好ましい、かなり特に好ましい、最も好ましいまたは特別に好ましい意味を有し、ＰＧは、例えば、テトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－２－イルまたは２－（トリメチルシリル）エトキシ］メチルのような保護基を表し、Met^3は、例えば、トリブチルスタニルまたは４，４，５，５－テトラメチル－１，３，２－ジオキサボロラン－２－イルのような置換された金属原子を表す］
の化合物、およびその塩は新規である。

【００９３】

例えば、［ＸＩ－１］：

【００９４】

【化１７】



[XI-I]

化合物１－（｛４－［１－（２，２－ジフルオロエチル）－３－（トリメチルスタニル）－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリミジン－２－イル｝アミノ）プロパン－２－オールは除外される。

【００９５】
製法Ａによる一般式［Ｉ］を持つ化合物の製造は以下のように行うことができる：
一般式［ＸＩＶ］を持つ化合物を臭素化し、次いで、保護基を与えて、式［ＸＩＩＩ］を持つ化合物を得る。この化合物をＣ－Ｃカップリング反応において式［ＸＶ－ａ］の基質と反応させることができ、それにより、式［ＸＩＩ］を持つ化合物が形成される。この化合物は、強塩基の反応、またはホウ素またはスズ化合物との引き続いての反応によって、式［ＸＩ］の化合物に変換することができる。この化合物は、一般式［ＸＶＩＩ］の基質とのＣ－Ｃカップリング反応において式［Ｘ］の化合物に変換される。次に、この化合物を脱保護し、それにより、一般式［ＩＸ］の化合物が得られる。さて、式［ＩＸ］のピラゾールをタイプ［ＸＶＩ］の基質と反応させ、それにより、式［Ｉ］の本発明によるアリールピラゾール類が得られる（スキーム１）。

【００９６】
別法として、もう１つの製法経路を選択することもできる。一般式［ＶＩＩＩ］を持つ化合物を臭素化し、式［ＶＩＩ］の化合物が得られる。これを、タイプ［ＸＶＩ］の基質との反応によって、タイプ［ＶＩ］の化合物に変換し、それにより、ピラゾール位置異性体の混合物を形成することができる。これらは、通常のプロセス、例えば、クロマトグラフィープロセスによって個々の位置異性体に分離することができる。一般式［ＶＩ］の化合物を、Ｃ－Ｃカップリングにおいて、式［ＸＶ－ａ］の基質と反応させることができ、それにより、式［Ｉ］の化合物が得られる（スキーム１）。

【００９７】
別法として、一般式［ＶＩ］のピラゾール化合物を、ボロン酸エステルとの反応により、タイプ［Ｖ］の化合物に変換することができる。これらは、Ｃ－Ｃカップリング反応において、式［ＩＶ－ｃ］の基質との反応によって、式［Ｉ－ｃ］の化合物に変換することができる（スキーム１）。

【００９８】
別法として、タイプ［Ｖ］の化合物は、Ｃ－Ｃカップリング反応において、式［ＩＶ－ａ］の基質との反応によって、式［ＩＩＩ］の化合物に変換することができる。これらの化合物は、同様に、式［ＩＩ］の基質との反応によって、タイプ［Ｉ－ｃ］の化合物に変換される。

【００９９】
さらに、タイプ［Ｖ］の化合物は、Ｃ－Ｃカップリング反応において、式［ＩＶ－ｂ］の基質との反応によって、式［Ｉ］の本発明によるアリールピラゾール類に変換することができる（スキーム１）。

【０１００】
$R^{4b/401b}$が水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、－ＮＨ－Ｃ（Ｏ）－アルキルまたは－ＮＨ－Ｃ（Ｏ）Ｏ－アルキルを表す、一般式［Ｉ－ｄ］を持つ化合物の製造は、製法Ｂによって以下のように行うことができる：
一般式［ＸＸＩＶ］の化合物が、商業的に入手可能であるか、あるいは公知の文献方法によって調製することができる。

【０１０１】
一般式［ＸＸＩＶ］の化合物を、エステル、ニトリル、ジアルキルアミド、または一般式R^{1}－ＣＯＺ^{5}のＮ，Ｏ－ジアルキルアミドと反応させ、それにより、一般式［ＸＸＶ］の化合物が得られる。これらの化合物［ＸＸＶ］は、ＤＭＦジアルキルアセタールとの反応によって、一般式［ＸＸＶＩ］の化合物に変換される。次いで、一般式［ＸＸＶＩ］の化合物から、ヒドラジンまたはヒドラジン水和物との反応によって式［ＸＸＶＩＩ］の化合物が得られる。さて、得られた式［ＸＸＶＩＩ］のピラゾールをタイプ［ＸＶＩ］の基質と反応させ、それにより、式［Ｉ－ｄ］の本発明によるアリールピラゾール類が得られる。

【０１０２】
$R^{3/301}$＝シクロプロピルである場合、式［ＸＸＶＩＩ］の基質とシクロプロピル

ボロン酸とのＣ－Ｃカップリング反応によって、式［Ｉ－ｄ］の化合物を得ることもできる。

【０１０３】

一般式［Ｉ－ｄ］の化合物は、ヒドラジン誘導体と式［ＸＸＶＩ］の基質との直接的反応によって得ることもできる。

【０１０４】

一般式［Ｉ－ｅ］を持つ化合物の製造は、製法Ｃによって以下のように行うことができる：

一般式［ＩＸ－ａ］の化合物は商業的に入手可能であるか、あるいは製法Ａによって調製することができる。式［ＩＸ－ａ］の化合物は、ハロゲン化反応によって、式［ＸＸＶＩＩＩ］の化合物に変換される。さて、得られた式［ＸＸＶＩＩＩ］のピラゾールは、タイプ［ＸＶＩ］の基質と反応させ、それにより、式［ＸＸＩＸ］の化合物が得られる。これらの化合物は、式［ＸＸＸ］のボロン酸誘導体とのＣ－Ｃカップリング反応、および（例えば、ｐ－メトキシベンジル残基の場合には）$R^{3/301}$残基の除去による引き続いての脱保護反応によって、式［ＩＸ－ｂ］の中間体に変換される。これらは、製法ＡおよびＢに記載された方法によってピラゾールの窒素原子に機能性化することができ、それにより、式［Ｉ－ｅ］の本発明によるピラゾール類が得られる。

【０１０５】

別法として、式［ＸＸＩＸ］の中間体は、式［ＸＸＸ］のボロン酸誘導体とのＣ－Ｃカップリング反応によって、式［Ｉ－ｅ］の本発明によるピラゾールに直接的に変換することもできる。

【０１０６】

一般式［ＶＩ－ａ］を持つ中間体の製造は製法Ｄによって以下のように行うことができる：

一般式［ＶＩＩＩ］のピラゾール化合物は、ボロン酸エステルとの反応によって、タイプ［ＸＸ］の化合物に変換することができる。これらの化合物は、臭素化によって、一般式［ＶＩ－ａ］の中間体に変換される。

【０１０７】

一般式［ＶＩ－ｂ］および［ＶＩ－ｃ］を持つ中間体の製造は、製法Ｅによって以下のように行うことができる：

公知の文献方法（国際公開第１９９６／０１５１１５号、米国特許第５９２８９９９号）に従い、ヒドラジンとの反応によって、対応するβ－ケトエステル［ＸＸＸＩ］から出発してピラゾリノン［ＸＸＸＩＩ］が製造される。これらのピラゾロンは、公知の文献方法（Ｏｒｇ．Ｌｅｔｔ．２００６，８，１７，３８０５－３８０８）に従って、ジフルオロメチル化によってタイプ［ＸＸＸＩＩＩ］の化合物に変換される。次に、式［ＸＸＸＩＩＩ］の化合物は、ハロゲン化反応によって式［ＶＩ－ｂ］の化合物に変換される。R^1が４－フルオロ－２－メトキシフェニルを表すタイプ［ＶＩ－ｂ］の化合物は、BBr_3との反応によって、R^{1a}が４－フルオロ－２－ヒドロキシフェニルを表すタイプ［ＶＩ－ｅ］の化合物に変換することができる。

【０１０８】

別法として、一般式［［ＩＩＩ］を持つ中間体の製造は、製法Ｆによって以下のように行うこともできる：

Ｃ－Ｃカップリング反応において、タイプ［ＶＩ］の中間体を、Met^2がボロン酸エステルを表す一般式［ＸＶ－ａａ］の基質と反応させる。該反応の間に、アミノ保護基の除去によって遊離アミンが形成され、それにより、一般式［ＩＩＩ］の中間体が得られる。

【０１０９】

一般式［ＸＶ－ａ］を持つ中間体の製造は、製法Ｇによって以下のように行うことができる：

一般式［ＸＸＸＩＶ］の化合物は、アシル化反応によって、式［ＸＸＸＶ］の化合物に

変換される。次に、これらの化合物は、カップリング反応において、式［ＸＶ－ａ１］のボロン酸エステルに変換される。

【０１１０】

一般式［Ｉ－ｆ］および［Ｉ－ｇ］を持つ化合物の製造は、製法Ｈによって以下のように行うことができる：

一般式［ＸＸＸＶＩ］の化合物は、公知の文献方法（Ｊ．Ｍｅｄ．Ｃｈｅｍ．１９９９，４２，１２，２１８０－２１９０）に従って、カルボン酸エステル、ニトリル、ジアルキルアミド、または一般式$Ｒ^{1}$－$ＣＯＺ^{5}$のＮ，Ｏ－ジアルキルアミドと反応させ、それにより、一般式［ＸＸＸＶＩＩ］の化合物が得られる。ここで、一般式$Ｒ^{1}$－$ＣＯＺ^{5}$の化合物は、例えば、ＮＨまたはＯＨ基のような、酸性プロトンを持つ基を含有してはならない。これらの化合物［ＸＸＸＶＩＩ］は、ＤＭＦジアルキルアセタールとの反応によって、一般式［ＸＸＸＶＩＩＩ］の化合物に変換される。一般式［ＸＸＸＶＩＩＩ］の化合物から、次いで、ヒドラジンまたはヒドラジン水和物との反応によって、式［ＸＸＩＸ］の化合物が得られる。さて、得られた式［ＸＸＩＸ］のピラゾールをタイプ［ＸＶＩ］の基質と反応させ、それにより、一般式［ＸＬ］の化合物が得られる。これらは、酸化剤、例えば、ｍ－クロロ化安息香酸との反応によって、式［ＸＬＩ］の化合物に変換される。式［Ｉ－ｆ］の本発明によるアリールピラゾール類は、第一級または第二級アミンの存在下で、置換反応によって式［ＸＬＩ］の化合物から得られる。必要であれば、これらの化合物は、（例えば、水素化反応によるベンジルアミンの場合には）アミン置換基の除去によって一般式［ＩＩＩ－ａ］の化合物に変換することができる。これらの化合物［ＩＩＩ－ａ］は、式［ＩＩ］の基質との反応によって、式［Ｉ－ｇ］の本発明によるアリールピラゾール類に変換される。

【０１１１】

一般式［Ｉ－ｈ］を持つ化合物の製造は、製法Ｉによって以下のように行うことができる：

一般式［ＸＬＩＩ］の化合物は、公知文献方法（Ｔｅｔｒａｈｅｄｒｏｎ　Ｌｅｔｔ．２００９，５０，２１，２５５２－２５５４）に従って、一般式$Ｒ^{1}$－$ＣＯＺ^{5}$のカルボン酸エステルと反応させ、それにより、一般式［ＸＬＩＩＩ］の化合物が得られる。ここで、一般式$Ｒ^{1}$－$ＣＯＺ^{5}$の化合物は、例えば、ＮＨまたはＯＨ基のような酸性プロトンを持つ基を含有してはならない。式［ＸＬＩＶ］の化合物は、第一級または第二級アミンの存在下で、置換反応によって一般式［ＸＬＩＩＩ］の化合物から得られる。これらの化合物［ＸＬＩＶ］は、ＤＭＦジアルキルアセタールとの反応によって一般式［ＸＬＶ］の化合物に変換される。次いで、ヒドラジンまたはヒドラジン水和物との反応によって、式［ＸＬＶＩ］の化合物が一般式［ＸＬＶ］の化合物から得られる。さて、得られた式［ＸＬＶＩ］のピラゾールをタイプ［ＸＶＩ］の基質と反応させ、それにより、一般式［Ｉ－ｈ］の本発明による化合物が得られる。

工程（Ｖ１）

式［ＶＩ］の化合物の合成についての１つの可能性がスキーム１に示される。

【０１１２】

$Ｒ^{3／301}$が水素を表さない式［ＶＩ］の化合物は、もし必要であれば、溶媒および酸スカベンジャー／塩基の存在下で、タイプ［ＶＩＩ］の化合物と一般式［ＸＶＩ］（式中、$Ｚ^{1}$は、例えば、Ｃｌ、Ｂｒ、Ｉ、－ＯＴｏｓ、－ＯＭｓ等のような脱離基を表す）の基質との反応によって、文献に記載された手法（Ｂｉｏｏｒｇ．Ｍｅｄ．Ｃｈｅｍ．Ｌｅｔｔ．２０００，１０，１３５１－１３５６またはＪ．Ａｍ．Ｃｈｅｍ．Ｓｏｃ．２００７，１２９，２６，８０６４－８０６５）と同様に合成することができる。

【０１１３】

さらに、$Ｒ^{3／301}$が水素を表さない式［ＶＩ］の化合物は、ホスファン（例えば、トリフェニルホスファン）およびアゾジカルボキシレート（例えば、ジエチルアゾジカルボキシレート）および溶媒（例えば、ＴＨＦ）の存在下で、例えば、タイプ［ＶＩＩ］の化合物と一般式［ＸＶＩ］（式中、$Ｚ^{1}$はＯＨを表す）の基質との反応によって、文献

に記載された手法（Ｍｉｔｓｕｎｏｂｕ，Ｏ．Ｓｙｎｔｈｅｓｉｓ　１９８１，１－２８）と同様に合成することができる。

【０１１４】

式［ＶＩＩ］の臭素－置換ピラゾール類は商業的に入手可能であるか、あるいは文献方法によって製造することができる。適当なブロモピラゾール類の製造のための１つの方法は、例えば、酢酸中でのＮ－ブロモスクシンイミドとの反応による、（例えば、欧州特許出願公開第１３８２６０３号に記載された）対応するピラゾール類［ＶＩＩＩ］の臭素化である。

【０１１５】

例えば、３－（４－フルオロフェニル）－１Ｈ－ピラゾール、３－（４－クロロ－フェニル）－１Ｈ－ピラゾールまたは３－（３－クロロフェニル）－１Ｈ－ピラゾールのようなタイプ［ＶＩＩＩ］の化合物は商業的に入手可能であるか、あるいは例えば、ジメチルホルムアミドジメチルアセタールおよびヒドラジンとの反応によって、市販のアセトフェノンから、公知の文献方法（Ｔｅｔｒａｈｅｄｒｏｎ，２００３，５９，５５５－５６０）によって製造することができる。

【０１１６】

反応に必要な式［ＸＶＩ］の化合物は商業的に入手可能であるか、あるいは文献方法（Ｒ．Ｃ．Ｌａｒｏｃｋ，Ｃｏｍｐｒｅｈｅｎｓｉｖｅ　Ｏｒｇａｎｉｃ　Ｔｒａｎｓｆｏｒｍａｔｉｏｎｓ，２ｎｄ　Ｅｄｉｔｉｏｎ，１９９９，Ｗｉｌｅｙ－ＶＣＨ，ｐ．６９０ｆｆ．およびｐ．１９２９ｆｆ．およびそこに引用された文献）によって製造することができる。

【０１１７】

式［ＸＶＩ］（式中、アルキル化反応の場合における$R^{3/301}$は、例えば、置換されたまたは置換されていないアルキルまたはシクロアルキル残基を表す）の適当な化合物の製造のための１つの方法は、例えば、アルコールと塩化メタンスルホニルおよびトリエチルアミンとの反応（Ｏｒｇ．Ｌｅｔｔ．２００８，１０，４４２５－４４２８）、または、（例えば、Ｔｅｔｒａｈｅｄｒｏｎ　２００８，６４，７２４７－７２５１に記載された）トリフェニルホスフィンおよびCCl_4とのアッペル（Ａｐｐｅｌ）反応による。

【０１１８】

式［ＸＶＩ］（式中、アシル化反応の場合における$R^{3/301}$においては、カルボニル基はZ^1に直接的に結合している）の適当な化合物の製造は、公知の文献方法（例えば、Ｊｅｒｒｙ　Ｍａｒｃｈ，Ａｄｖａｎｃｅｄ　Ｏｒｇａｎｉｃ　Ｃｈｅｍｉｓｔｒｙ，４ｔｈ　Ｅｄｉｔｉｏｎ，Ｊｏｈｎ　Ｗｉｌｅｙ　＆　Ｓｏｎｓ，ｐ．４３７ｆｆ．およびそこに引用された文献）によって行われる。

【０１１９】

一般式［ＸＶＩ］の基質の化学的構造から、適当な溶媒および適当な塩基の選択におけるある種の好ましい組合せを見出すことができる。

【０１２０】

式［ＸＶＩ］（式中、アルキル化反応の場合における$R^{3/301}$は、例えば、置換されたまたは置換されていないアルキルまたはシクロアルキル残基を表す）の基質でのアルキル化反応の場合には、例えば、環状および非環状エーテル（例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン）、芳香族炭化水素（例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン）、ハロゲン化炭化水素（例えば、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素）、ハロゲン化芳香族炭化水素（例えば、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン）、ニトリル（例えば、アセトニトリル）、カルボン酸エステル（例えば、酢酸エチル）、アミド（例えば、Ｎ，Ｎ－ジメチルホルムアミド、Ｎ，Ｎ－ジメチルアセトアミド）、ジメチルスルホキシドまたは１，３－ジメチル－２－イミダゾリノンのような、反応条件下で不活性な全ての通常の溶媒を用いることができるか、あるいは反応はこれらの溶媒の２以上の混合物中で行うことができる。好ましい溶媒はジメチルホルムアミドおよびアセトニトリルである。

【０１２１】
式［ＸＶＩ］（式中、アルキル化反応の場合におけるＲ$^{３／３０１}$は、例えば、置換されたまたは置換されていないアルキルまたはシクロアルキル残基を表す）の基質でのアルキル化反応の場合において、この反応で用いることができる塩基は、例えば、リチウムヘキサメチルジシラジド（ＬｉＨＭＤＳ）、炭酸カルシウム、炭酸セシウムおよび水素化ナトリウムである。好ましい塩基は水素化ナトリウムである。原則的には、少なくとも１当量の塩基が用いられる。
【０１２２】
式［ＸＶＩ］（式中、Ｒ$^{３／３０１}$において、カルボニル基が直接的にＺ^{１}に結合している）の基質でのアシル化反応の場合には、例えば、環状および非環状エーテル（例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン）、芳香族炭化水素（例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン）、ハロゲン化炭化水素（例えば、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素）、ハロゲン化芳香族炭化水素（例えば、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン）、ニトリル（例えば、アセトニトリル）および芳香族複素環アミン（ピリジン）のような、反応条件下で不活性な全ての通常の溶媒を用いることができるか、あるいは該反応はこれらの溶媒の２以上の混合物中で行うことができる。好ましい溶媒はテトラヒドロフランおよびジクロロメタンである。
【０１２３】
式［ＸＶＩ］（式中、Ｒ$^{３／３０１}$において、カルボニル基は直接的にＺ^{１}に結合している）の基質でのアシル化反応の場合には、例えば、一般式［ＶＩＩ］の出発物質に対して１当量の酸スカベンジャー／塩基（例えば、ピリジン、ジイソプロピルエチルアミン、トリエチルアミンまたは商業的に入手可能なポリマー酸スカベンジャー）を用いることができる。もし出発物質が塩であれば、少なくとも２当量の酸スカベンジャーが必要である。もしピリジンを溶媒として用いるならば、記載された文献と同様に、いくつかの場合には、さらなる塩基の添加は省略することができる（欧州特許出願公開第１０００００６２号）。
【０１２４】
該反応は、通常、０℃から１００℃、好ましくは、２０℃から３０℃の温度で行われるが、それは反応混合物の還流温度で行うこともできる。反応時間は反応の規模および反応温度に応じて変化するが、一般には、数分および４８時間の間にある。
【０１２５】
反応の完了の後、化合物［ＶＩ］は、通常の分離技術のうちの１つによって反応混合物から分離される。用いる式［ＸＶＩ］の基質の性質および反応条件に依存して、Ｒ$^{３／３０１}$が水素を表さない式［ＶＩ］の化合物は、純粋な位置異性体として、または２つの可能な位置異性体の混合物として（ここで、基Ｒ$^{３／３０１}$はピラゾールのＮ原子上の双方の位置を占めることができる）得ることができる。位置異性体の混合物が得られる場合には、これらは（例えば、結晶化またはクロマトグラフィー方法のような）物理的方法によって精製することができるか、あるいは、先立っての精製なくして次の工程で用いてもよい。
工程（Ｖ２）
式［Ｖ］の化合物の合成のための１つの可能性がスキーム１に示されている。
【０１２６】
式［Ｖ］の化合物は、例えば、塩基および適当な溶媒の存在下で、例えば、二塩化１，１’－ビス（ジフェニルホスフィノ）フェロセン－パラジウム（ＩＩ）のような触媒の存在下での、ブロモピラゾール［ＶＩ］と、例えば、ビスピナコラトジホウ素（４，４，４’，４’，５，５，５’，５’－オクタメチル－２，２’－ビ－１，３，２－ジオキサボロラン）のようなボロン酸エステルとの反応を介して、記載された方法によって製造することができる（米国特許第０，０１８，１５６号、国際公開第０７／０２４８４３号または欧州特許出願公開第１３８２６０３号）。
【０１２７】

溶媒としては、例えば、スルホキシド（例えば、ジメチルスルホキシド）、環状エーテル（例えば、ジオキサン）およびアミド（例えば、Ｎ，Ｎ－ジメチルホルムアミド）のような反応条件下で不活性な全ての通常の溶媒を用いることができ、該反応はこれらの溶媒の２以上の混合物中で行うことができる。好ましい溶媒はジメチルスルホキシドおよびジオキサンである。

【０１２８】

該反応は、通常、８０℃から１２０℃の温度で行われ、好ましい反応温度は約８５℃から９０℃である。反応時間は、反応の規模および反応温度に依存して変化するが、一般には、１時間および１６時間の間にある。

【０１２９】

同様に、文献に記載された他の合成方法を、式［Ｖ］の化合物の製造で用いることができる。例えば、式［Ｖ］の化合物は、ブロモピラゾール［ＶＩ］と、例えば、ｎ－ブチルリチウムのような塩基での金属化、および例えば、ホウ酸トリメチルのようなボロン酸エステルとの反応、および得られたピラゾール－ボロン酸とピナコールとの引き続いての反応によって製造することができる（例えば、Ｊ．ｈｅｔ．Ｃｈｅｍ．２００４，４１，９３１－９４０または欧州特許出願公開第１３８２６０３号および国際公開第２００７／１６３９２号参照）。

工程（Ｖ３）

式［ＩＩＩ］の化合物の合成のための１つの可能性がスキーム１に示されている。

【０１３０】

式［ＩＩＩ］の化合物は、例えば、公知の文献手法（Ｔｏｐ．Ｃｕｒｒ．Ｃｈｅｍ．２００２，２１９，１１；Ｏｒｇａｎｏｍｅｔ．Ｃｈｅｍ．１９９９，２８，１４７およびそこに引用された文献）によって、適当な温度での、触媒、塩基および適当な溶媒の存在下でのピラゾールボロン酸［Ｖ］と式［ＩＶ－ａ］（式中、Z^2は、例えば、ＣｌまたはＢｒのような脱離基を表す）の複素環とのカップリングによって製造することができる。

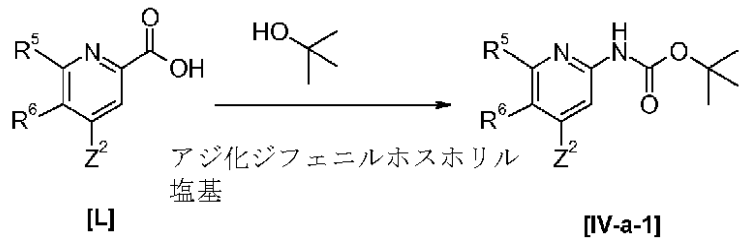
【０１３１】

式［ＩＶ－ａ］（式中、X^1はＣ－Ｈを表す）の化合物は商業的に入手可能であるか、あるいは文献方法（スキーム１０）によって製造することができる。適当なＮ－Ｂｏｃ－ハロ複素環［ＩＶ－ａ－１］の製造のための１つの方法は適当な酸（例えば、４－ブロモ－ピコリン酸）［Ｌ］とアジ化ジフェニルホスホリルおよびｔｅｒｔ－ブタノールとの反応である（Ａｕｓｔ．Ｊ．Ｃｈｅｍ．１９８２，３５，２０２５－２０３４，Ｊ．Ｍｅｄ．Ｃｈｅｍ．１９９２，３５，１５，２７６１－２７６８または米国特許第５，１１２，８３７号）。

スキーム１０

【０１３２】

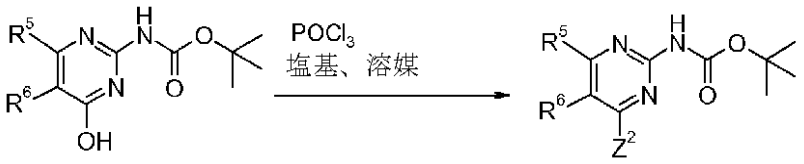
【化１８】



[L] [IV-a-1]

カルボン酸［Ｌ］は公知であるか、あるいは文献に記載された手法（例えば、欧州特許出願公開第１６５０１９４号参照）によって商業的に入手可能な前駆体から、例えば、ジメチルホルムアミド中での塩化チオニルとの反応によって商業的に入手可能なピリジン－２－カルボン酸から製造することができる。別法として、一般式［Ｌ］の化合物は、公知の文献手法（Ａｕｓｔ．Ｊ．Ｃｈｅｍ．１９８２，３５，２０２５－２０３４）によって、商業的に入手可能な４－ハロ－２－メチル－ピリジン誘導体の酸化によって製造することもできる。

【０１３３】
式［ＩＶ－ａ］（式中、X^1はＮを表す）の化合物は商業的に入手可能であるか、あるいは文献方法（スキーム１１）によって製造することができる。適当なＮ－Ｂｏｃ－ハロ複素環［ＩＶ－ａ－２］の製造のための１つの方法は、オキシ塩化リンでのヒドロキシ化合物（例えば、（４－ヒドロキシ－ピリミジン－２－イル）カルバメート）の塩素化である（Ｃｈｅｍ．Ｐｈａｒｍ．Ｂｕｌｌ．２００３，５１，８，９７５－９７７）。
スキーム１１
【０１３４】
【化１９】



[LI] [IV-a-2]

ヒドロキシ化合物［ＬＩ］は公知であるか、あるいは文献に記載された手法によって商業的に入手可能な前駆体から製造することができる（Ｃｈｅｍ．Ｐｈａｒｍ．Ｂｕｌｌ．２００３，５１，８，９７５－９７７）。
【０１３５】
式［ＩＩＩ］の化合物の合成用の溶媒としては、例えば、アルコール（例えば、メタノール、エタノール、１－プロパノール、２－プロパノール、エチレングリコール、１－ブタノール、２－ブタノール、ｔｅｒｔ－ブタノール）、環状および非環状エーテル（ジエチルエーテル、ジメトキシメタン、ジエチレングリコールジメチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジイソプロピルエーテル、ｔｅｒｔ－ブチルメチルエーテル）、芳香族炭化水素（例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン）、炭化水素（例えば、ヘキサン、イソ－ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン）、ケトン（例えば、アセトン、エチルメチルケトン、イソ－ブチルメチルケトン）、ニトリル（例えば、アセトニトリル、プロピオニトリル、ブチロニトリル）およびアミド（例えば、ジメチル－ホルムアミド、ジメチルアセトアミド、Ｎ－メチルピロリドン）および水のような、反応条件下で不活性な全ての通常の溶媒を用いることができるか、あるいは該反応はこれらの溶媒の２以上の混合物中で行うことができる。好ましい溶媒はジオキサンである。
【０１３６】
本発明による製法で好ましく用いられる塩基はアルカリおよびアルカリ土類金属水酸化物、アルカリおよびアルカリ土類金属炭酸塩、アルカリ金属水素炭酸塩、アルカリおよびアルカリ土類金属酢酸塩、アルカリおよびアルカリ土類金属アルコラート、ならびに第一級、第二級および第三級アミンである。好ましい塩基は、例えば、炭酸セシウム、炭酸ナトリウムおよび炭酸カリウムのようなアルカリ金属炭酸塩である。
【０１３７】
本発明による製法においては、塩基は、好ましくは、芳香族ボロン酸に基づいて１００から１０００モル％の割合で用いられる。好ましい割合は６００から８００モル％である。
【０１３８】
触媒としては、例えば、パラジウム金属、パラジウム化合物および／またはニッケル化合物を用いることができる。また、触媒は、活性炭または酸化アルミニウムのような固体担持体に適用することもできる。テトラキス（トリフェニルホスフィン）－パラジウム、二塩化ビス（トリフェニルホスフィン）パラジウム、二塩化ビス（ジフェニルホスフィノ）フェロセンパラジウム、パラジウムケトネート、（例えば、パラジウムビスアセチルアセトネートのような）パラジウムアセチルアセトネート、（例えば、二塩化ビス（ベンゾニトリル）パラジウム、二塩化ビス（アセトニトリル）－パラジウムのような）ニトリルパラジウムハロゲン化物、ハロゲン化パラジウム（$PdCl_2$、Na_2PdCl_4、Ｎａ

$_2$ＰｄＣｌ$_6$）、ハロゲン化アリルパラジウム、（例えば、酢酸パラジウム－ＩＩのような）パラジウムビスカルボキシレートおよびテトラクロロパラディックアシッドのような、パラジウムが酸化状態（０）または（ＩＩ）で存在するパラジウム触媒が好ましい。特に好ましい触媒はテトラキス（トリフェニルホスフィン）－パラジウム、二塩化ビス（トリフェニルホスフィン）－パラジウムおよび二塩化ビス（ジフェニルホスフィノ）フェロセンパラジウムである。例えば、塩化パラジウム（ＩＩ）および酢酸ナトリウムからの酢酸パラジウム（ＩＩ）のようなパラジウム化合物を系内で生じさせることもできる。

【０１３９】

脱離基Ｚ^{2}を担うヘテロ芳香族［ＩＶ－ａ］に基づく触媒の量は好ましくは０．００１から０．５モル％、特に好ましくは０．０１から０．２モル％である。

【０１４０】

該触媒はリン含有リガンドを含有することができるか、あるいはリン含有リガンドを反応混合物に別に加えることができる。好ましくは、リン含有リガンドとして適当なのはトリ－ｎ－アルキルホスファン、トリアリールホスファン、ジアルキルアリールホスファン、アルキルジアリールホスファンならびに／またはトリピリジルホスファンおよびトリフリルホスファンのようなヘテロアリールホスファンであり、ここで、該リン上の３つの置換基は同一または異なるものとすることができ、ここで、１以上の置換基はいくつかのホスファンのリン基を連結させることができ、ここで、この連結の１つの部分は金属原子でもあり得る。特に好ましいのは、トリフェニルホスファン、トリ－ｔｅｒｔ－ブチルホスファンおよびトリシクロヘキシルホスファンのようなホスファンである。

【０１４１】

脱離基Ｚ^{2}を担うヘテロ芳香族［ＩＶ－ａ］に基づくリン含有リガンドの全濃度は好ましくは１モル％まで、特に好ましくは０．０１から０．５モル％である。

【０１４２】

本発明による製法を行うためには、便宜には、遊離体、溶媒、塩基、触媒および、もし適当であれば、リガンドを徹底的に混合し、好ましくは０℃から２００℃の温度、特に好ましくは１００から１７０℃で反応させる。反応時間は、反応の規模および反応温度に依存して変化するが、一般には、数分および４８時間の間にある。ワンポット反応以外では、該反応は、種々の反応体が反応の間に制御された方法で計量されるように実行することもでき、異なる計量変数が可能である。

【０１４３】

有機ホウ素化合物［Ｖ］に対するヘテロ芳香族［ＩＶ－ａ］のモル反応体比率は好ましくは０．９から１．５である。

【０１４４】

本発明による製法は、一般には、常圧下で行われる。しかしながら、増大したまたは低下した圧力の下で操作するのも可能である。反応は、一般には、例えば、アルゴンまたは窒素のようなブランケットガスを使用して行われる。反応の完了の後に、固体として生じる触媒を濾過によって除去し、粗生成物を溶媒または複数溶媒から分離し、次いで、当業者に知られており、かつ特定の生成物に対して適切な方法によって、例えば、再結晶、蒸留、昇華、ゾーンメルティング、メルト結晶化またはクロマトグラフィーによって精製する。

工程（Ｖ４）

式［Ｉ－ｃ］の化合物の合成のための１つの可能性がスキーム１に示されている。

【０１４５】

一般式［Ｉ－ｃ］を持つ化合物は、必要であれば、酸スカベンジャー／塩基の存在下で、対応する一般式［ＩＩＩ］を持つ化合物と（Ｚ^3、例えば、＝Ｃｌ、Ｂｒ、Ｆまたは－ＯＨを持つ）一般式［ＩＩ］の基質とのカップリング反応によって、文献に記載された手法（例えば、国際公開第０４／０５２８８０号および、例えば、Ｔ．Ｗ．Ｇｒｅｅｎｅ，Ｐ．Ｇ．Ｍ．Ｗｕｔｓ，Ｐｒｏｔｅｃｔｉｖｅ Ｇｒｏｕｐｓ ｉｎ Ｏｒｇａｎｉｃ Ｓｙｎｔｈｅｓｉｓ，１９９９，Ｊｏｈｎ Ｗｉｌｅｙ ＆ Ｓｏｎｓ，Ｉｎｃ．参照）

と同様に合成することができ、ここで、前記スキームにおける残基R^1、R^2、R^3／R^{301}、R^{4a}／R^{401a}、R^5、R^6およびX^1の定義は前記した定義に対応する。

【０１４６】

酸ハロゲン化物［ＩＩ］（Z^3＝Ｃｌ）または対応するカルボン酸［ＩＩ］（Z^3＝ＯＨ）は商業的に入手可能であるか、あるいは文献に記載された製法によって調製可能である。加えて、Z^3＝Ｃｌを持つ一般式［ＩＩ］を持つ基質は、公知の文献製法（Ｒ．Ｃ．Ｌａｒｏｃｋ，Ｃｏｍｐｒｅｈｅｎｓｉｖｅ Ｏｒｇａｎｉｃ Ｔｒａｎｓｆｏｒｍａｔｉｏｎｓ，２ｎｄ Ｅｄｉｔｉｏｎ，１９９９，Ｗｉｌｅｙ－ＶＣＨ，ｐａｇｅ １９２９ｆｆ．およびそこに引用された文献）を用いる塩素化によって、対応する酸（Z^3＝ＯＨ）から調製することができる。

【０１４７】

溶媒としては、例えば、環状および非環状エーテル（例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン）、芳香族炭化水素（例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン）、ハロゲン化炭化水素（例えば、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素）、ハロゲン化芳香族炭化水素（例えば、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン）およびニトリル（例えば、アセトニトリル）のような、反応条件下で不活性な全ての通常の溶媒を用いることができるか、あるいは該反応はこれらの溶媒の２以上の混合物中で行うことができる。好ましい溶媒はテトラヒドロフランおよびジクロロメタンである。

【０１４８】

一般式［ＩＩＩ］の出発物質に対して少なくとも１当量の酸スカベンジャー／塩基（例えば、ヒュニッヒ（Ｈｕｎｉｇ）塩基、トリエチルアミンまたは商業的に入手可能なポリマー酸スカベンジャー）を用いる。もし出発物質が塩であれば、少なくとも２当量の酸スカベンジャーが必要である。

【０１４９】

該反応は、通常、０℃から１００℃の温度、好ましくは、２０℃から３０℃で行われるが、それは反応混合物の還流温度で行うこともできる。反応時間は反応の規模および反応温度に依存して変化するが、一般には、数分および４８時間の間にある。

【０１５０】

式［Ｉ－ｃ］の化合物の製造のための本発明による製法（Ｖ４）を行うためには、一般に、式［ＩＩ］のカルボン酸ハロゲン化物のモル当たり、０．２から２モル、好ましくは０．５から０．９モルの式［ＩＩＩ］のアミノ誘導体を用いる。仕上げ処理は、真空下での揮発性成分の蒸発、および粗製物質のアンモニア性メタノール溶液（７モラー）での処理によって行われる。

【０１５１】

反応の完了の後に、通常の分離技術のうちの１つによって、化合物［Ｉ－ｃ］を反応混合物から分離する。必要であれば、化合物は再結晶、蒸留またはクロマトグラフィーによって精製する。

【０１５２】

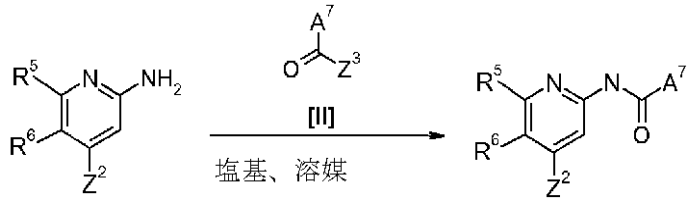
別法として、式［Ｉ－ｃ］の化合物は、文献に記載された手法（例えば、Ｔｅｔｒａｈｅｄｒｏｎ ２００５，６１，１０８２７－１０８５２およびそこに引用された文献）と同様に、カップリング試薬の存在下で、式［ＩＩＩ］の対応する化合物と、Z^3＝－ＯＨを持つ式［ＩＩ］の基質とから合成することもできる。

【０１５３】

適当なカップリング試薬は、例えば、ペプチドカップリング試薬（例えば、４－ジメチルアミノ－ピリジンと混合されたＮ－（３－ジメチル－アミノプロピル）－Ｎ’－エチル－カルボジイミド、１－ヒドロキシ－ベンゾトリアゾールと混合されたＮ－（３－ジメチルアミノ－プロピル）－Ｎ’－エチル－カルボジイミド、ブロモ－トリピロリジノ－ホスホニウムヘキサフルオロホスフェート、Ｏ－（７－アザベンゾトリアゾール－１－イル）－Ｎ，Ｎ，Ｎ’，Ｎ’－テトラメチルウロニウムヘキサフルオロホスフェート等）である。

【０１５４】
必要であれば、例えば、トリエチルアミンまたはヒュニッヒ塩基のような塩基を反応で用いることができる。
【０１５５】
溶媒としては、例えば、アルコール（例えば、メタノール、エタノール、プロパノール）、環状および非環状エーテル（例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン）、芳香族炭化水素（例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン）、ハロゲン化炭化水素（例えば、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素）、ハロゲン化芳香族炭化水素（例えば、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン）、ニトリル（例えば、アセトニトリル）およびアミド（例えば、Ｎ，Ｎ－ジメチルホルムアミド、Ｎ，Ｎ－ジメチルアセトアミド）のような、反応条件下で不活性な全ての通常の溶媒を用いることができるか、あるいは該反応はこれらの溶媒の２以上の混合物中で行うことができる。好ましい溶媒はジクロロメタンである。
【０１５６】
該反応は、通常、０℃から１００℃の温度、好ましくは、０℃から３０℃で行われるが、それは反応混合物の還流温度で行うこともできる。反応時間は反応の規模および反応温度に応じて変化するが、一般には、数分および４８時間の間にある。
【０１５７】
反応の完了の後、通常の分離技術のうちの１つによって、化合物［Ｉ－ｃ］は反応混合物から分離される。必要であれば、化合物は再結晶、蒸留またはクロマトグラフィーによって精製される。
【０１５８】
R^{4a}／４０１ａが－ＮＲ^{12}Ｒ$^{12'}$（対称にまたは非対称にビスアシル化されたアミノピリジン）を表す一般式［Ｉ－ｃ］の化合物は、式［ＩＩ］（Z^{3}＝例えば、Ｃｌ、Ｆ）の酸ハロゲン化物との反応によって、R^{4a}／４０１ａが－ＮＨＲ^{12}（モノアシル化アミノピリジン）を表す一般式［Ｉ－ｃ］の化合物から前記した方法によって直接的に製造することができる。
工程（Ｖ５）
式［Ｉ－ｃ］の化合物の合成のためのさらなる可能性がスキーム１に示される。
【０１５９】
式［Ｉ－ｃ］の化合物は、公知の文献手法（Ｔｏｐ．Ｃｕｒｒ．Ｃｈｅｍ．２００２，２１９，１１；Ｏｒｇａｎｏｍｅｔ．Ｃｈｅｍ．１９９９，２８，１４７およびそこに引用された文献）によって、適当な温度での、触媒、塩基および適当な溶媒の存在下での、ピラゾールボロン酸［Ｖ］と式［ＩＶ－ｃ］（式中、Z^{2}は、例えば、ＣｌまたはＢｒのような脱離基である）の複素環とのカップリングによって製造することができる。
【０１６０】
式［ＩＶ－ｃ］（式中、X^{1}はＣ－Ｈを表す）の化合物は商業的に入手可能であるか、あるいは文献方法によって製造することができる（スキーム１２）。適当なハロ複素環［ＩＶ－ｃ－１］の製造のための１つの方法は、塩基および溶媒の存在下での式［ＸＸ］のアミノ複素環と酸塩化物との反応である（Ｓｙｎｔｈ．Ｃｏｍｍｕｎ．１９９７，２７，５，８６１－８７０）。溶媒、塩基および温度の選択は、用いる基質［ＸＸ］に依存して変化させることができ、式［Ｉ－ｃ］の化合物の製造のための式［ＩＩＩ］のアミノ複素環と式［ＩＩ］の基質との反応用の工程（Ｖ４）下で記載した可能な変形を含む。
スキーム１２
【０１６１】

【化２０】



[XX] [IV-c-1]

アミノ複素環［ＸＸ］（式中、X^1はＣ－Ｈを表す）は公知であるか、文献に記載された手法（Ａｕｓｔ．Ｊ．Ｃｈｅｍ．１９８２，３５，１０，２０２５－２０３４およびそこに含まれる文献）によって、式［ＩＶ－ａ］の化合物からのＮ－ＢＯＣ保護基の除去により製造することができる。

【０１６２】

アミノ複素環［ＸＸ］（式中、X^1はＮを表す）は公知であるか、あるいは文献に記載された手法（例えば、Ｊ．Ｍｅｄ．Ｃｈｅｍ．２００６，４９，１４，４４０９－４４２４後）によって、ヒドロキシ化合物（Z^2＝－ＯＨ）のハロゲン化により製造することができる。

【０１６３】

溶媒、塩基、温度、触媒および添加されたリガンドの選択は、必要であれば、用いる基質［ＩＶ－ｃ］に応じて変化させることができ、式［Ｖ］の化合物のＣ－Ｃカップリングのための工程（Ｖ３）下で記載された可能な変形を含む。

【０１６４】

反応の完了の後に、固体として生じる触媒を濾過によって除去し、粗生成物を溶媒または複数溶媒から分離し、次いで、当業者に知られており、かつ特定の生成物に適切な方法によって、例えば、再結晶、蒸留、昇華、ゾーンメルティング、メルト結晶化またはクロマトグラフィーによって精製する。

工程（Ｖ６）

式［Ｉ］の化合物の合成のためのさらなる可能性がスキーム１に示されている。

【０１６５】

式［Ｉ］の化合物は、公知の文献手法（Ｔｏｐ．Ｃｕｒｒ．Ｃｈｅｍ．２００２，２１９，１１；Ｏｒｇａｎｏｍｅｔ．Ｃｈｅｍ．１９９９，２８，１４７およびそこに引用された文献、２００５，７，２１，４７５３－４７５６）による、適当な温度での、触媒、塩基、必要であれば、リガンドおよび適当な溶媒の存在下での、ハロピラゾール［ＶＩ］の、式［ＸＶ－ａ］（式中、Met^1は、例えば、Ｂ（ＯｉＰｒ）$_3$、Ｂ（ＯＨ）$_2$のようなボレートエステルまたはボロン酸を表す）の金属化複素環とのカップリングによって製造することができる（スキーム１３）。

【０１６６】

式［Ｉ］の化合物は、例えば、公知の文献手法（Ｓｙｎｔｈｅｓｉｓ　１９９２，８０３－８１５参照）によって、適当な温度にて、触媒、もし必要であれば、無機または有機ハライド塩、もし必要であれば、リガンドおよび適当な溶媒の存在下で、ハロピラゾール［ＶＩ］と、式［ＸＶ－ａ］の金属化複素環とのカップリングによって製造することもできる。

【０１６７】

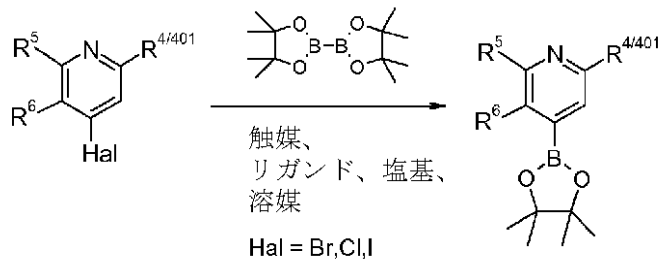
式［ＸＶ－ａ１］（式中、X^1はＣ－Ｈを表す）の化合物は商業的に入手可能であるか、あるいは文献手法によって製造することができる。適当なハロ複素環［ＸＶ－ａ１］の製造のための１つの方法は、文献に記載された方法（Ｂｉｏｏｒｇ．Ｍｅｄ．Ｃｈｅｍ．Ｌｅｔｔ．２００６，１６，５，１２７７－１２８１および国際公開第０４／０１４９１３号）（スキーム１３）による、（例えば、Ｐｄ（ＯＡｃ）$_2$またはＰｄＣｌ$_2$（ｄｐｐｆ）のような）触媒、もし必要であれば、（例えば、塩化１，３－ビス（２，６－ジイソプロピルフェニル）－４，５－ジヒドロイミダゾリウムのような）リガンド、（例えば、

酢酸カリウムまたは酢酸ナトリウムのような）塩基および（例えば、テトラヒドロフランまたはジメチルスルホキシドのような）溶媒の存在下での、式［ＸＸＩ］のハロ複素環とビスピナコラトジホウ素との反応である。

スキーム１３

【０１６８】

【化２１】



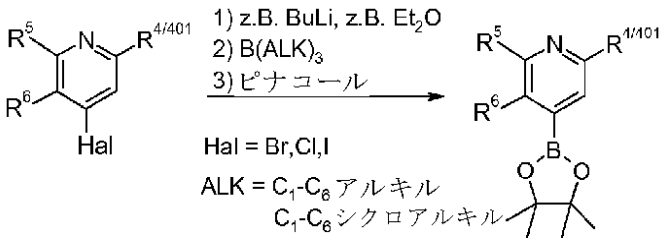
[XXI] [XV-a1]

別法として、式［ＸＶ－ａ１］（式中、Ｘ^{1}はＣ－Ｈを表す）の化合物は他の公知の文献方法によって調製することもできる。適当な複素環［ＸＶ－ａ１］の製造のための１つの方法は、公知の文献方法（Ｓｙｎｔｈｅｓｉｓ　２００４，４，４６９－４８３およびそこに記載された文献）（スキーム１４）による、（例えば、ジエチルエーテルまたはテトラヒドロフランのような）溶媒中でのハロピリジン［ＸＸＩ］の（例えば、ｎ－ブチルリチウムのような）塩基での金属化、および（例えば、Ｂ（ｉ－ＰｒＯ）$_{3}$またはＢ（ＯＭｅ）$_{3}$のような）ボロン酸エステルおよびピナコールとの引き続いての反応である。

スキーム１４

【０１６９】

【化２２】



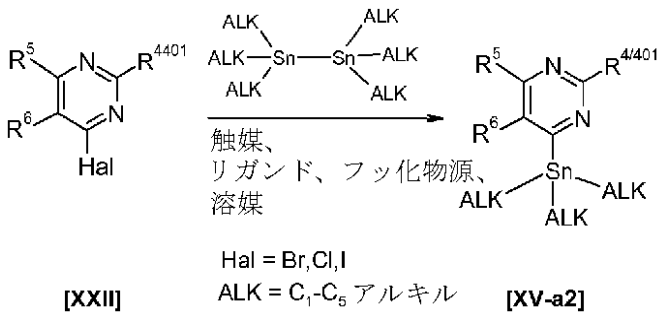
[XXI] [XV-a1]

式［ＸＶ－ａ２］（式中、Ｘ^{1}はＮを表す）の化合物は商業的に入手可能であるか、あるいは文献手法によって製造することができる。適当なハロ複素環［ＸＶ－ａ２］の製造のための１つの方法は、文献に記載された方法（国際公開第０３／０９５４５５号または同第０７／１０４５３８号）（スキーム１５）による、（例えば、酢酸ビス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（ＩＩ）のような）触媒、もし必要であれば、（例えば、フッ化テトラブチルアンモニウムのような）フッ化物イオン源および（例えば、テトラヒドロフランまたはジエチルエーテルのような）溶媒の存在下での、式［ＸＸＩＩ］のハロ複素環と（例えば、１，１，１，２，２，２－ヘキサブチルジスズのような）ヘキサアルキルジスズ化合物との反応である。

スキーム１５

【０１７０】

【化２３】



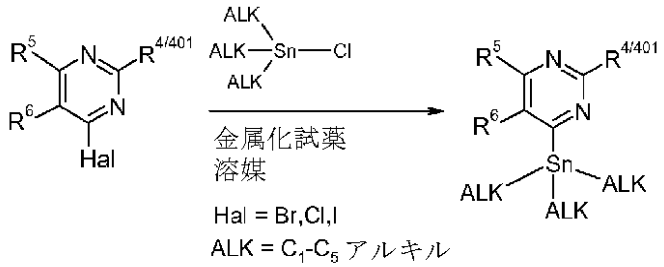
[XXII] [XV-a2]

別法として、式［ＸＶ－ａ２］（式中、X^1はＮを表す）の化合物は、他の公知の文献方法によって調製することもできる。適当なハロ複素環［ＸＶ－ａ２］の製造のための１つの方法は、公知の文献方法（国際公開第０８／００８７４７号またはＴｅｔｒａｈｅｄｒｏｎ　１９９４，２７５－２８４およびそこに記載された文献のような）（スキーム１６）による、（例えば、ジエチルエーテルまたはテトラヒドロフランのような）溶媒中での、金属化試薬（例えば、ｎ－ブチルリチウムのようなアルキルリチウム化合物または、例えば、塩化イソプロピルマグネシウムのようなグリニャール試薬）を用いるハロピリジン［ＸＸＩＩ］の金属化、および（例えば、Bu_3SnClのような）トリアルキルスズハロゲン化合物との引き続いての反応である。

スキーム１６

【０１７１】

【化２４】



[XXII] [XV-a2]

式［ＸＸＩ］および［ＸＸＩＩ］の化合物は商業的に入手可能であるか、あるいは例えば、公知の文献方法（例えば、Ｊ．Ｏｒｇ．Ｃｈｅｍ．２００４，６９，５４３－５４８）によって、対応するアミン（$R^{4/401}$＝－NH_2の場合）のアシル化によって調製することができる。タイプ［ＸＸＩ］および［ＸＸＩＩ］の化合物の調製のためのもう１つの方法は、化合物［ＸＸ］および［ＩＶ－ｂ］の合成について述べたハロゲン化方法と同様な、対応するヒドロキシ複素環のハロゲン化よりなる。

【０１７２】

ハロピラゾール［ＶＩ］の式［ＸＶ－ａ］（式中、Ｍｅｔは、例えば、Ｂ（ＯｉＰｒ）$_3$またはＢ（ＯＨ）$_2$のようなボレートエステルまたはボロン酸を表す）の金属化複素環とのカップリングにおいて、溶媒、塩基、温度、触媒および添加されるリガンドの選択は、もし必要であれば、用いるボレートエステル基質に依存して変化させることができ、式［Ｖ］の化合物と式［ＩＶ－ａ］の基質とのＣ－Ｃカップリングについて工程（Ｖ３）下で記載した可能な変形を含む。

【０１７３】

ハロピラゾール［ＶＩ］の式［ＸＶ－ａ］（式中、Ｍｅｔは、例えば、Ｓｎ（Ｂｕ）$_3$のようなアルキルスズ担持基を表す）の金属化複素環とのカップリングにおいて、触媒、必要であれば、無機または有機ハライド塩、もし必要であれば、リガンドおよび適当な溶媒の適当な温度における選択は、用いるアルキルスズ基質に応じて変化させることができる。

【０１７４】
式［ＸＶ－ａ］の化合物の反応のための溶媒としては、例えば、環状および非環状エーテル（ジエチルエーテル、ジメトキシメタン、ジエチレングリコールジメチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジイソプロピルエーテル、ｔｅｒｔ－ブチルメチルエーテル）、芳香族炭化水素（例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン）、アミド（例えば、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、Ｎ－メチルピロリドン）およびスルホキシド（例えば、ジメチルスルホキシド）のような、反応条件下で不活性な全ての通常の溶媒を用いることができるか、あるいは該反応はこれらの溶媒の２以上の混合物中で行うことができる。好ましい溶媒はジメチルホルムアミドである。
【０１７５】
本発明による製法で好ましく用いられる式［ＸＶ－ａ］の化合物の反応のためのハロゲン化物塩は、例えば、ハロゲン化銅（例えば、ＣｕＢｒまたはＣｕＩ）、ハロゲン化セシウム（ＣｓＦ）およびハロゲン化テトラアルキルアンモニウム（ＴＢＡＦ）である。
【０１７６】
ハロゲン化物塩は、好ましくは、有機スズ化合物に基づいて１から４００モル％の割合で本発明による製法で用いられる。しかしながら、ハロゲン化物塩の混合物を１から４００モル％の割合で用いることもできる。１から２００モル％の割合でのヨウ化銅およびフッ化セシウムの混合物の添加が特に好ましい。
【０１７７】
式［ＸＶ－ａ］の化合物の反応のための触媒として、式［Ｖ］および［ＩＶ－ａ］の化合物の反応による、式［ＩＩＩ］の化合物の製造について前記したのと同一の触媒を用いることができる。
【０１７８】
脱離基Met^1を担うヘテロ芳香族［ＸＶ－ａ］に基づく触媒の量は、好ましくは０．００１から０．５モル％、特に好ましくは０．０１から０．２モル％である。
【０１７９】
該触媒はリン含有またはヒ素含有リガンドを含有することができるか、あるいはリン含有またはヒ素含有リガンドを反応混合物に別に加えることができる。リン含有リガンドとしては、リン上の３つの置換基が同一または異なるものとすることができ、キラルまたはアキラルとすることができ、および１以上の置換基はいくつかのホスファンのリン基を連結させることができ、この連結の１つの部分は金属原子とすることもできる、好ましくは、トリ－ｎ－アルキルホスファン、トリアリールホスファン、ジアルキルアリール－ホスファン、アルキルジアリールホスファンならびに／またはトリピリジルホスファンおよびトリフリルホスファンのようなヘテロアリールホスファンが適当である。特に好ましいのは、トリフェニルホスファン、トリ－ｔｅｒｔ－ブチルホスファンおよびトリシクロヘキシル－ホスファンのようなホスファンである。ヒ素含有リガンドとしては、例えば、ヒ素上の３つの置換基が同一または異なるものとすることができる、トリ－ｎ－アルキルアルサンおよびトリアリールアルサンが適当である。
【０１８０】
脱離基Met^1を担うヘテロ芳香族［ＸＶ－ａ］に基づくリガンドの合計濃度は、好ましくは、１モル％までであり、特に好ましくは０．０１から０．５モル％である。
【０１８１】
本発明による製法を行うためには、有利には、遊離体、溶媒、塩基、ハロゲン化物塩、触媒および、必要であれば、リガンドを徹底的に混合し、好ましくは、０℃から２００℃の温度で、特に好ましくは６０から１５０℃で反応させる。反応時間は反応の規模および反応温度に依存して変化するが、一般には、数分および４８時間の間にある。ワンポット反応以外では、反応は、種々の反応体が反応の間に制御された様式で計量されるように実行することもでき、それにより、異なる計量変数が可能である。
【０１８２】
本発明による製法は、一般に、常圧下で行われる。しかしながら、増加したまたは低下

した圧力下で操作するのも可能である。反応は、一般に、例えば、アルゴンまたは窒素のようなブランケットガスを用いて行われる。

【０１８３】

有機スズ化合物［ＸＶ－ａ２］に対するハロピラゾール［ＶＩ］のモラー反応体比率は好ましくは０．９から２である。

【０１８４】

反応の完了の後に、固体として生じる触媒を濾過によって除去し、粗生成物を溶媒または複数溶媒から分離し、次いで、当業者に公知であって、特定の生成物に適した方法によって、例えば、再結晶、蒸留、昇華、ゾーンメルティング、メルト結晶化またはクロマトグラフィーによって精製する。

工程（Ｖ７）

式［Ｉ］の化合物の合成のためのさらなる可能性がスキーム１に示される。

【０１８５】

式［Ｉ］の化合物は、例えば、公知の文献手法（Ｔｏｐ．Ｃｕｒｒ．Ｃｈｅｍ．２００２，２１９，１１；ｂ－Ａ．Ｓｕｚｕｋｉ，Ｏｒｇａｎｏｍｅｔ．Ｃｈｅｍ．１９９９，２８，１４７およびそこに引用された文献）によって、適当な温度にて、触媒、塩基および適当な溶媒の存在下で、ピラゾールボロン酸［Ｖ］の式［ＩＶ－ｂ］（式中、Z^2は、例えば、ＣｌまたはＢｒのような脱離基を表す）の複素環とのカップリングによって製造することができる。

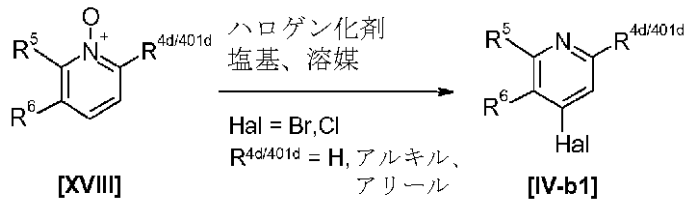
【０１８６】

式［ＩＶ－ｂ１］（式中、X^1はＣ－Ｈを表す）の化合物は商業的に入手可能であるか、あるいは文献手法（スキーム１７）によって製造することができる。適当なハロ複素環［ＩＶ－ｂ１］の製造のための１つの方法は、ピリジンＮ－オキサイドとハロゲン化剤（例えば、PCl_3、$POCl_3$、$SOCl_2$または塩化メタンスルホニル）との反応である（Ｂｉｏｏｒｇ．Ｍｅｄ．Ｃｈｅｍ．Ｌｅｔｔ．２００７，１７，７，１９３４－１９３７参照）。

スキーム１７

【０１８７】

【化２５】



ピリジンＮ－オキサイド［ＸＶＩＩＩ］は公知であるか、あるいは文献に記載された手法（ＡＲＫＩＶＯＣ　２００１（ｉ）２４２－２６８およびそこに含まれる文献）によって、（例えば、H_2O_2、H_2O_2＋メチルトリオキソレニウム、ｍ－クロロ過安息香酸、ジメチル－ジオキシランまたはH_2O_2＋マンガンテトラキス（２，６－ジクロロフェニル）ポルフィリンでの）対応するピリジンの酸化によって製造することができる。

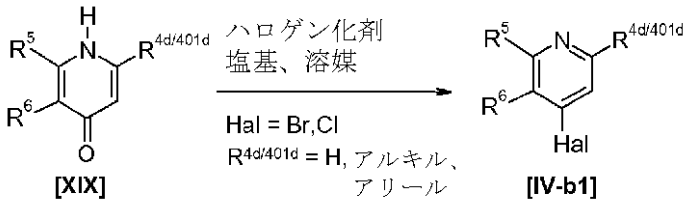
【０１８８】

適当なハロ複素環［ＩＶ－ｂ１］の製造のためのさらなる方法は、公知の文献手法（Ｐｏｌ．Ｊ．Ｃｈｅｍ．１９８１，５５，４，９２５－９２９）（スキーム１８）による、４－ヒドロキシピリジン化合物［ＸＩＸ］とハロゲン化剤（例えば、PCl_3、$POCl_3$）との反応である。

スキーム１８

【０１８９】

【化２６】



ヒドロキシピリジン［ＸＩＸ］は公知である。

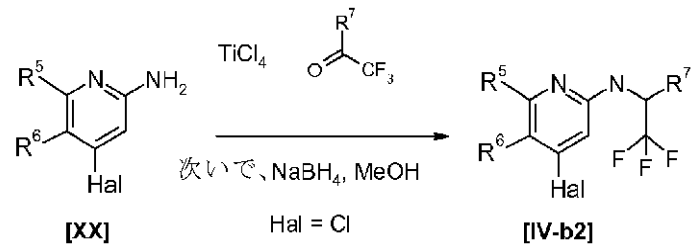
【０１９０】

式［ＩＶ－ｂ２］（式中、Ｘ^{1}はＣ－Ｈを表す）の化合物は、文献手法（スキーム１９）によって製造することができる。適当なハロ複素環［ＩＶ－ｂ２］の製造のための１つの方法は、塩化チタン－ＩＶ、塩基および溶媒の存在下での式［ＸＸ］のアミノ複素環とトリフルオロメチルケトンとの反応である。（Ｊ．Ａｍ．Ｃｈｅｍ．Ｓｏｃ．１９９６，１１８，７１３４－７１３８）。この反応の間に生じるイミンを、文献手法（Ｔｅｔｒａｈｅｄｒｏｎ　２００９，６５，９８０７－９８１３）による還元によってアミン［ＩＶ－ｂ２］に変換することができる。

スキーム１９

【０１９１】

【化２７】



アミノ複素環［ＸＸ］（式中、Ｘ^{1}はＣ－Ｈを表す）は公知である（米国特許出願公開第第２００６／１８９６１７号）。

【０１９２】

溶媒、塩基、温度、触媒および添加されるリガンドの選択は、必要であれば、用いる基質［ＩＶ－ｂ］に依存して変化させることができ、式［Ｖ］の化合物のＣ－Ｃカップリングについて工程（Ｖ３）下で記載された可能な変形を含む。

【０１９３】

反応の完了の後に、固体として生じる触媒を濾過によって除去し、粗生成物を溶媒または複数溶媒から分離し、次いで、当業者に公知であって、特定の生成物に適した方法によって、例えば、再結晶、蒸留、昇華、ゾーンメルティング、メルト結晶化またはクロマトグラフィーによって精製する。

工程Ｖ８

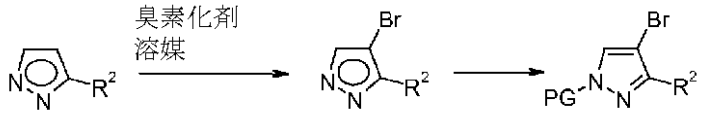
式［ＸＩＩＩ］の化合物の合成のための１つの可能性がスキーム１に示される。

【０１９４】

一般式［ＸＩＩＩ］を持つ化合物は公知（Ｒ^{2}＝Ｈ）であるか、あるいは文献に記載された手法（例えば、Ａｃｔａ　Ｃｈｅｍ．Ｓｃａｎｄ．，Ｓｅｒｉｅｓ　Ｂ：Ｏｒｇａｎｉｃ　Ｃｈｅｍｉｓｔｒｙ　ａｎｄ　Ｂｉｏｃｈｅｍｉｓｔｒｙ　１９８２，３６，２，１０１－１０８および欧州特許出願公開第１３８２６０３号参照）と同様に合成することができる。化合物［ＸＩＩＩ］の製造のための１つの可能性は、ピラゾール［ＸＩＶ］の適当な溶媒中でのハロゲン化剤での、ピラゾール［ＸＸＩＶ］へのハロゲン化、続いての、得られたハロピラゾールの適当な保護基ＰＧ（例えば、３、４－ジヒドロ－２Ｈ－ピラン）での、式［ＸＩＩＩ］への化合物への変換である（スキーム２０）

スキーム２０

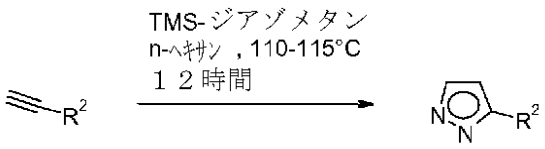
【０１９５】
【化２８】



[XIV] [XXIV] [XIII]

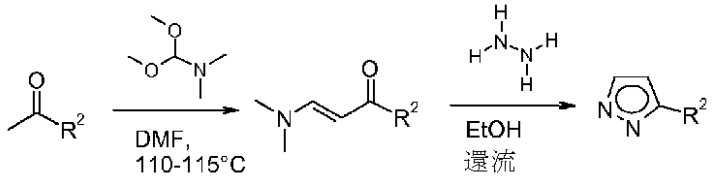
式［ＸＩＶ］（Ｒ^{2}＝Ｈ、ＣＨ$_{3}$）のピラゾールは商業的に入手可能であるか、または文献に記載された製法によって調製可能である。適当なピラゾール［ＸＩＶ］の製造のための方法は、例えば、記載された方法（米国特許第０，０６３，７４４号）による、アルキンとＴＭＳ－ジアゾメタンとの反応（スキーム２１）またはメチルケトンとジメチルホルムアミドジメチルアセタールおよびヒドラジンとの反応（スキーム２２）である。

スキーム２１
【０１９６】
【化２９】



[XXI] [XIV]

スキーム２２
【０１９７】
【化３０】



[XXII] [XXIII] [XIV]

ハロゲン化剤としては、例えば、Ｎ－ブロモスクシンイミドおよび臭素を用いることができる。

【０１９８】

ハロゲン化反応のための溶媒としては、例えば、アミド（例えば、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、Ｎ－メチルピロリドン）、ハロゲン化炭化水素（例えば、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素）、および酢酸のような、反応条件下で不活性な全ての通常の溶媒を用いることができるか、あるいは該反応はこれらの溶媒の２以上の混合物中で行うことができる。溶媒の選択は、用いるハロゲン化試薬に応じて変化させることができる。好ましい溶媒は酢酸およびジメチルホルムアミドである。

【０１９９】

ハロゲン化反応は、通常、０℃から１００℃の温度、好ましくは、２０℃から３０℃で行われる。反応時間は、反応の規模および反応温度に依存して変化するが、一般には、数分間および４８時間の間にある。

【０２００】

ハロゲン化反応の完了の後に、粗生成物を通常の分離技術のうちの１つによって反応混合物から分離する。必要であれば、化合物を再結晶、蒸留またはクロマトグラフィーによって精製するか、あるいは、先に精製することなくさらなる変換のために直接的に用いてもよい。

【０２０１】

得られたブロモピラゾール［ＸＸＩＶ］は、触媒量のルイス酸（例えば、ｐ－トルエンスルホン酸）の存在下で、３，４－ジヒドロ－２Ｈ－ピラン中で加熱することによって水素原子上で保護される。得られた生成物は、位置異性体として生じ得る。必要であれば、化合物は蒸留またはクロマトグラフィーによって精製されるか、あるいは、先に精製することなく直接的にさらなる変換のために用いてもよい。

工程Ｖ９

式［ＸＩＩ］の化合物の合成のための１つの可能性がスキーム１に示される。

【０２０２】

式［ＸＩＩ］の化合物は、例えば、公知の文献手法（Ｔｏｐ．Ｃｕｒｒ．Ｃｈｅｍ．２００２，２１９，１１；Ｏｒｇａｎｏｍｅｔ．Ｃｈｅｍ．１９９９，２８，１４７およびそこに引用された文献、Ｏｒｇ．Ｌｅｔｔ．２００５，７，２１，４７５３－４７５６）によって、適当な温度にて、触媒、塩基、必要ならば、リガンドおよび適当な溶媒の存在下で、ハロピラゾール［ＸＩＩＩ］の式［ＸＶ－ａ］（式中、Ｍｅｔは、例えば、Ｂ（ＯｉＰｒ）$_3$またはＢ（ＯＨ）$_2$のようなボレートエスまたはボロン酸を表す）の金属化複素環とのカップリングによって製造することができる。

【０２０３】

さらに、式［ＸＩＩ］の化合物は、例えば、公知の文献手法（Ｓｙｎｔｈｅｓｉｓ １９９２，８０３－８１５参照）によって、適当な温度にて、触媒、必要であれば、無機または有機ハロゲン化物塩、必要であれば、リガンドおよび適当な溶媒の存在下で、ハロピラゾール［ＸＩＩＩ］の式［ＸＶ－ａ］の金属化複素環とのカップリングによって製造することができる。

【０２０４】

タイプ［ＸＶ－ａ］の化合物の製造は、ハロピラゾール［ＶＩ］の同様な反応について工程（Ｖ６）下で記載されている

溶媒、塩基または添加されるハロゲン化物塩、必要であれば、温度、触媒および添加されるリガンドの選択は、必要であれば、用いる基質［ＸＶ－ａ］に依存して変化させることができ、式［ＶＩ］の化合物のＣ－Ｃカップリングについて工程（Ｖ６）下で記載された可能な変形を含む。ここで、Ｍｅｔ^{1}が（例えば、Ｓｎ（Ｂｕ）$_3$のような）アルキルスズ担持基を表す式［ＸＶ－ａ］の化合物の反応において、塩基の添加は通常省略され、この代わりに、工程（Ｖ６）下で記載されているように、ハロゲン化物塩が加えられる。

工程Ｖ１０

式［ＸＩ］の化合物の合成のための１つの可能性がスキーム１に示されている。

【０２０５】

式［ＸＩ］の化合物の製造のための１つの方法は、（例えば、ジエチルエーテル、またはテトラヒドロフランのような）溶媒中での（例えば、ｎ－ブチルリチウムのような）塩基での保護されたピラゾール［ＸＩＩ］の金属化、および公知の文献方法（Ｔｅｔｒａｈｅｄｒｏｎ Ｌｅｔｔｅｒｓ ２００６，４７；２７；２００６；４６６５－４６６９およびそこに記載された文献参照）による（例えば、Ｂ（ｉ－ＰｒＯ）$_3$またはＢ（ＯＭｅ）$_3$のような）ボロン酸エステルおよびピナコールとの、あるいは公知の文献方法（国際公開第０６／１０８５９１号）と同様に（例えば、Ｂｕ$_3$ＳｎＣｌのような）トリアルキルスズハロゲン化合物との引き続いての反応である。

【０２０６】

溶媒としては、例えば、環状および非環状エーテル（例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン）のような、反応条件下で不活性な全ての通常の溶媒を用いることができるか、あるいは該反応はこれらの溶媒の２以上の混合物中で行うことができる。好ましい溶媒はテトラヒドロフランである。

【０２０７】

反応は、通常、－８０℃から０℃の温度、好ましくは、－７８℃から－２０℃で行われる。反応の間に、（例えば、金属化工程の後における）反応温度の変化は、第二の反応パートナー（例えば、ハロゲン化アルキルスズまたはボレートエステル）との反応を確実と

するために有益であるかまたは、必要であり得る。反応時間は、反応の規模および反応温度に依存して変化するが、一般には、数分間および４８時間の間にある。

【０２０８】

仕上げ処理は、通常、プロトン源（例えば、飽和塩化アンモニウム水溶液）の添加および引き続いての相分離によって行われる。次に、化合物［ＸＩ］は通常の分離技術のうちの１つによって反応混合物から分離される。

【０２０９】

しかしながら、別法として、反応混合物は水性仕上げ処理なくして濃縮することもでき、粗生成物［ＸＩ］は反応混合物から直接的に蒸留することができる。

【０２１０】

必要であれば、そのようにして得られた化合物は、再結晶、蒸留またはクロマトグラフィーによって精製される。

工程Ｖ１１

式［Ｘ］の化合物の合成のための１つの可能性がスキーム１に示されている。

【０２１１】

式［Ｘ］の化合物は、例えば、公知の文献手法（Ｔｏｐ．Ｃｕｒｒ．Ｃｈｅｍ．２００２，２１９，１１；Ｏｒｇａｎｏｍｅｔ．Ｃｈｅｍ．１９９９，２８，１４７およびそこに引用された文献、Ｏｒｇ．Ｌｅｔｔ．２００５，７，２１，４７５３－４７５６）によって、適当な温度にて、触媒、塩基、必要であれば、リガンドおよび適当な溶媒の存在下で、式［ＸＩ］（式中、Ｍｅｔは、例えば、Ｂ（ＯｉＰｒ）$_3$またはＢ（ＯＨ）$_2$のようなボレートエステルまたはボロン酸を表す）のピラゾールの式［ＸＶＩＩ］（式中、$Ｚ^4$は、例えば、Ｃｌ、Ｂｒ、Ｉメシレートまたはトリフレートのような脱離基を表す）の化合物とのカップリングによって製造することができる。

【０２１２】

さらに、式［Ｘ］の化合物は、例えば、公知の文献手法（Ｓｙｎｔｈｅｓｉｓ　１９９２，８０３－８１５参照）によって、適当な温度にて触媒、必要であれば、無機または有機ハロゲン化物塩、必要であれば、リガンドおよび適当な溶媒の存在下で式［ＸＩ］（式中、$Ｍｅｔ^3$は、例えば、－Ｓｎ（Ｂｕ）$_3$のようなアルキルスズ担持基を表す）のピラゾールの、式［ＸＶＩＩ］（式中、$Ｚ^4$は、例えば、Ｃｌ、Ｂｒ、Ｉ、メシレートまたはトリフレートのような脱離基を表す）の化合物とのカップリングによって製造することができる。

【０２１３】

例えば、４－ブロモ－１－フルオロベンゼンのような式［ＸＶＩＩ］の化合物は、公知であって、商業的に入手可能である。

【０２１４】

ピラゾール［ＸＩ］と式［ＸＶＩＩ］の化合物とのカップリングにおいて、溶媒、塩基、温度、触媒および添加されるリガンドの選択は、必要であれば、用いるピラゾール［ＸＩ］に依存して変化させることができ、（Ｖ６）下で記載された可能な変形を含む。

【０２１５】

ピラゾール［ＸＩ］と式［ＸＶＩＩ］の化合物とのカップリングにおいて、触媒、必要であれば、無機または有機ハロゲン化物塩、必要であれば、リガンドおよび適当な溶媒の適当な温度での選択は、用いるピラゾール［ＸＩ］に依存して変化させることができ、工程（Ｖ３）下で記載された可能な変形を含む。

【０２１６】

本発明による製法は、一般に、常圧下で行われる。しかしながら、増加したまたは低下した圧力下で操作することも可能である。

【０２１７】

反応は、一般に、例えばアルゴンまたは窒素のようなブランケットガスを用いて行われる。

【０２１８】

式［ＸＶＩＩ］の化合物に対するピラゾール［ＸＩ］のモラー反応体比率は好ましくは０．９から２である。

【０２１９】

反応の完了の後に、固体として生じる触媒を濾過によって除去し、粗生成物を溶媒または複数溶媒から分離し、次いで、当業者に公知であって、かつ特定の生成物に適した方法によって、例えば、再結晶、蒸留、昇華、ゾーンメルティング、メルト結晶化またはクロマトグラフィーによって精製する。

工程（Ｖ１２）

式［ＩＸ］の化合物の合成のための１つの可能性がスキーム１に示されている。

【０２２０】

式［Ｘ］の化合物は、文献（「Ｐｒｏｔｅｃｔｉｖｅ Ｇｒｏｕｐｓ ｉｎ Ｏｒｇａｎｉｃ Ｓｙｎｔｈｅｓｉｓ」；Ｔｈｉｒｄ Ｅｄｉｔｉｏｎ；Ｔｈｅｏｄｏｒａ Ｗ．Ｇｒｅｅｎｅ、Ｐｅｔｅｒ Ｇ．Ｍ．Ｗｕｔｓ；１９９９，Ｗｉｌｅｙ－ＶＣＨ，ｐ．４９４－６５３およびそこに引用された文献）に記載されている保護基の除去のための適当な方法によって、式［ＩＸ］の化合物に変換される。

【０２２１】

２－（トリメチルシリル－エトキシ）メチルおよびテトラヒドロピラン－２－イル保護基は、例えば、公知の文献手法（国際公開第０３／０９９８２２号およびＪ．Ｏｒｇ．Ｃｈｅｍ．２００８、７３，４３０９－４３１２およびそこに含まれる文献）によって、（例えば、メタノール性ＨＣｌまたはトリフルオロ酢酸を含む）酸性媒体中で除去することができる。ベンジル性保護基は、公知の文献手法（欧州特許公開第１２２８０６７号）によって、触媒（例えば、活性炭上のパラジウムまたは活性炭上の水酸化パラジウム）の存在下で、水素源（例えば、水素、ギ酸アンモニウム、ギ酸またはシクロヘキセン）で水素化分解により除去することができる。

【０２２２】

溶媒としては、例えば、アルコール（例えば、メタノール、エタノール、プロパノール）、環状および非環状エーテル（例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン）、芳香族炭化水素（例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン）、ハロゲン化炭化水素（例えば、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素）、ハロゲン化芳香族炭化水素（例えば、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン）、ニトリル（例えば、アセトニトリル）、カルボキシレートエステル（例えば、酢酸エチル）、アミド（例えば、Ｎ，Ｎ－ジメチルホルムアミド、Ｎ，Ｎ－ジメチルアセトアミド）、ジメチルスルホキシド、１，３－ジメチル－２－イミダゾリノン、水および酢酸のような、反応条件下で不活性な全ての通常の溶媒を用いることができるか、あるいは該反応はこれらの溶媒の２以上の混合物中で行うことができる。

【０２２３】

反応は、通常、０℃から１５０℃の温度、好ましくは、室温で行われるが、それは、反応混合物の還流温度で行うこともできる。反応時間は、反応の規模および反応温度に依存して変化するが、一般には、半時間および７２時間の間にある。

【０２２４】

反応の完了の後に、化合物［ＩＸ］は、通常の分離技術のうちの１つによって反応混合物から分離される。必要であれば、化合物は再結晶、蒸留またはクロマトグラフィーによって精製され、あるいはもし望むならば、先の精製なくして次の工程で用いることもできる。さらに、一般式［ＩＸ］の化合物を塩として、例えば、塩酸またはトリフルオロ酢酸の塩として単離することが可能である。

工程（Ｖ１３）

式［Ｉ］の化合物の合成のための１つのさらなる可能性がスキーム１に示される。

【０２２５】

式［ＩＸ］の化合物は、式［ＩＸ］の化合物においては、反応性酸性Ｈ原子との官能性がＲ$^{４／４０１}$に含まれていてはならない、工程（Ｖ１）に記載された方法と同様に（ス

キーム１）式［Ｉ］の化合物に変換することができる。
【０２２６】
溶媒、塩基および温度の選択は用いる基質［ＩＸ］に依存して変化させることができ、工程（Ｖ１）下で記載された可能な変形を含む。
【０２２７】
反応の完了の後に、化合物［Ｉ］は通常の分離技術のうちの１つによって反応混合物から分離される。用いる式［ＸＶＩ］の基質の性質および反応条件に依存して、$Ｒ^{3}$が水素を表さない式［Ｉ］の化合物は、純粋な位置異性体として、または双方の可能な位置異性体（ここで、基$Ｒ^{3}$／３０１はピラゾールのＮ原子の上の双方の位置を占めることができる）の混合物として得ることができる。位置異性体の混合物が得られる場合には、これらは（例えば、結晶化またはクロマトグラフィー方法のような）物理的方法によって精製することができる。
【０２２８】
スキーム２に記載されたピラゾール［Ｉ－ｄ］の合成、およびスキーム３に記載されたピラゾール［Ｉ－ｅ］および［ＸＸＩＸ］の合成は、同様に行うことができ、そこでは、式［ＩＸ－ｂ］、［ＸＸＶＩＩ］および［ＸＸＶＩＩＩ］の化合物においては、反応性酸性Ｈ原子との官能性が$Ｒ^{4}$に含まれてはならない。
工程（Ｖ１４）
式［ＸＸＶ］の化合物の合成のための１つの可能性がスキーム２に示されている。
【０２２９】
公知の文献方法（Ｊ．Ｍｅｄ．Ｃｈｅｍ．２００７，５０，２７３２－２７３６、国際公開第０５／０４０１５５号、同第０１／７４８１１号、米国特許第６，３４２，６０８号）によって、強い塩基の存在下で、カルボン酸エステル、ニトリル、ジアルキルアミドまたは－Ｎ，Ｏ－ジアルキルアミドを式［ＸＸＩＶ］のアルキルピリジンまたはアルキルピリミジンと反応させる。
【０２３０】
本発明による製法で好ましく用いられる塩基は、（例えば、ＫＯｔＢｕまたはＮａＯｔＢｕのような）アルカリ金属アルコキシド、（例えば、ＬＤＡまたはＬｉＨＭＤＳのような）リチウムアミド、または（例えば、ＫＨまたはＮａＨのような）金属水素化物である。
【０２３１】
溶媒としては、例えば、環状および非環状エーテル（例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタン）、アミド（例えば、Ｎ，Ｎ－ジメチルホルムアミド、Ｎ，Ｎ－ジメチルアセトアミド）、ジメチルスルホキシドまたはＨＭＰＴのような、反応条件下で不活性な全ての通常の溶媒を用いることができるか、あるいは該反応はこれらの溶媒の２以上の混合物中で行うことができる。Ｎ，Ｎ－ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシドまたはＨＭＰＴのような極性溶媒の使用が好ましい。
【０２３２】
反応は、通常、－７８℃から溶媒の沸点までの温度にて、好ましくは、－２０℃から４０度の範囲で行われる。反応時間は反応の規模および反応温度に依存して変化するが、一般には、半時間および７２時間の間にある。
【０２３３】
反応の完了の後に、化合物［ＸＸＶ］は、通常の分離技術のうちの１つによって反応混合物から分離される。必要であれば、化合物は再結晶、蒸留またはクロマトグラフィーによって精製され、あるいは望まれるならば、先の精製なくして次の工程で用いることもできる。
【０２３４】
式［ＸＸＩＶ］のアルキルピリジンまたはアルキルピリミジンは商業的に入手可能であるか、あるいは公知の文献方法（例えば、国際公開第０４／０５８７７６号または同第０４／０３５５４５号）によって製造することができる。

【０２３５】
スキーム８に記載された式［ＸＸＸＶＩＩ］の化合物の合成、およびスキーム９に記載された式［ＸＬＩＩＩ］の化合物の合成は同様に行うことができ、そこでは式［ＸＸＸＶＩ］および［ＸＬＩＩ］の化合物においては、反応性酸性Ｈ原子との官能性は$Ｒ^{5}$および$Ｒ^{6}$に含まれてはならない。
工程（Ｖ１５）
式［ＸＸＶＩ］の化合物の合成のための１つの可能性がスキーム２に示されている。
【０２３６】
一般式［ＸＸＶＩ］の化合物は、式［ＸＸＶ］の化合物とＤＭＦジアルキルアセタールとの反応によって、公知の文献方法（Ｊ．Ｍｅｄ．Ｃｈｅｍ．２００７，５０，２７３２－２７３６および国際公開第０５／０４０１５５号、$Ｒ^{4ｂ}$／$Ｒ^{401ｂ}$＝ＮＨＣ（Ｏ）Ｏアルキルでは、例えば、欧州特許出願公開第１５５３０９６号）によって得られる。該反応は、溶媒の存在下で行うことができ、適当な溶媒は、（例えば、エタノールのような）アルコール、（例えば、酢酸エチルのような）エステル、（例えば、テトラヒドロフランのような）環状エーテルまたはアミド（例えば、Ｎ，Ｎ－ジメチルホルムアミド、またはＮ－メチルピロリドン）である。反応は塩基（例えば、トリエチルアミン）の存在下で行うことができる。
【０２３７】
反応は、通常、－７８℃から溶媒の沸点までの温度で行われる。
【０２３８】
スキーム８に記載された式［ＸＸＸＶＩＩＩ］の化合物の合成、およびスキーム９に記載された式［ＸＬＶ］の化合物の合成は同様に行うことができる。
工程（Ｖ１６）
式［ＸＸＶＩＩ］の化合物の合成のための１つの可能性がスキーム２に示されている。
【０２３９】
一般式［ＸＸＶＩＩ］の化合物は、公知の文献方法（例えば、欧州特許出願公開第１５５３０９６号、同第１１８８７５４号）によって、一般式［ＸＸＶＩ］の化合物とヒドラジンまたはヒドラジン水和物との反応によって得られる。ここで、スキーム２において名称が挙げられる基$Ｚ^{6}$は、例えば、$ＮＭｅ_{2}$のような脱離基を表す。
【０２４０】
該反応は、例えば、トリエチルアミンのような塩基の存在下で行うことができる。
【０２４１】
溶媒として、例えば、環状および非環状エーテル（例えば、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタン）またはアルコール（例えば、エタノール、メタノール）のような、反応条件下で不活性な全ての通常の溶媒を用いることができるか、あるいは、該反応はこれらの溶媒の２以上の混合物中で行うことができる。例えば、エタノールのような極性溶媒の使用が好ましい。
【０２４２】
反応は、通常、０℃から溶媒の沸点までの温度にて、好ましくは、２５℃の領域で行われる。反応時間は反応の規模および反応温度に依存して変化するが、一般には、半時間および７２時間の間にある。反応は上昇させた温度にてマイクロ波装置（例えば、ＣＥＭエクスプローラー）で行うことができ、それにより、必要な反応時間は短縮することができる。
【０２４３】
スキーム８に記載された式［ＸＸＸＩＸ］の化合物の合成、およびスキーム９に記載された式［ＸＬＶＩ］の化合物の合成は同様に行うことができる。
工程（Ｖ１７）
式［Ｉ－ｄ］の化合物の合成のための１つの可能性がスキーム２に示されている。
【０２４４】
一般式［Ｉ－ｄ］の化合物は、公知の文献方法（例えば、米国特許第６，３３５，３３

６号）によって、一般式［ＸＸＶＩ］の化合物の、式$R^{3/301}$－ＮＨ－NH_2のアルキルヒドラジンとの反応によって得られる。ここで、スキーム２で名称が挙げられる基Z^6は、例えば、NMe_2のような脱離基を表す。

【０２４５】

該反応は、例えば、トリエチルアミンのような塩基の存在下で行うことができる。

【０２４６】

溶媒としては、例えば、環状および非環状エーテル（例えば、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタン）またはアルコール（例えば、エタノール、メタノール）のような、反応条件下で不活性な全ての通常の溶媒を用いることができるか、あるいは該反応はこれらの溶媒の２以上の混合物中で行うことができる。例えば、エタノールのような極性溶媒の使用が好ましい。

【０２４７】

反応は、通常、０℃から溶媒の沸点までの温度で、好ましくは、２５℃の領域で行われる。反応時間は反応の規模および反応温度に依存して変化するが、一般に、半時間および７２時間の間にある。反応は、上昇させた温度にてマイクロ波装置（例えば、ＣＥＭエクスプローラー）で行うことができ、それにより、必要な反応時間は短縮することができる。

工程Ｖ１８

$R^{3/301}$がシクロプロピルを表す式［Ｉ－ｄ］の化合物の合成のための１つの可能性は、公知の文献手法（Ｊ．Ｏｒｇ．Ｃｈｅｍ．２００８，７３，６４４１－６４４４または国際公開第０８／０８８６９２号）による、式［ＸＸＶＩＩ］のピラゾールとシクロプロピルボロン酸との反応である。

【０２４８】

該反応は（例えば、トリエチルアミン、ピリジン、炭酸ナトリウム、リン酸カリウムまたは炭酸セシウムのような）塩基および（例えば、Ｃｕ（ＯＡｃ）$_2$またはＣｕＣｌ$_2$のような）Ｃｕ（ＩＩ）塩の存在下で行われる。

【０２４９】

加えて、反応は、（例えば、ピリジンまたは２，２－ピリジン、Ｎ，Ｎ，Ｎ‘，Ｎ’－テトラメチルエチレンジアミンまたは１，１０－フェナントリジンのような）適当なリガンドの添加で起こり得る。

【０２５０】

溶媒としては、例えば、環状および非環状エーテル（例えば、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタン）、ハロゲンアルカン（例えば、ジクロロエタン）または芳香族炭化水素（例えば、ベンゼン、トルエン）のような、反応条件下で不活性な全ての通常の溶媒を用いることができるか、あるいは該反応はこれらの溶媒の２以上の混合物中で行うことができる。例えば、ジクロロエタンのようなハロアルカンの使用が好ましい。

【０２５１】

反応は、通常、５０℃から溶媒の沸点までの温度にて、好ましくは、７０℃の領域で行われる。反応時間は、反応の規模および反応温度に依存して変化するが、一般には、半時間および７２時間の間にある。反応は、上昇させた温度にてマイクロ波装置（例えば、ＣＥＭエクスプローラー）で行うことができ、それにより、必要な反応時間を短縮することができる。

【０２５２】

スキーム２に記載されたピラゾール［Ｉ－ｄ］の合成と同様に、スキーム３に記載されたピラゾール［Ｉ－ｅ］の合成、スキーム４に記載されたピラゾール［ＸＸ］の合成をこの製法で行うことができる。

工程（Ｖ１９）

式［ＸＸＶＩＩＩ］の化合物の合成のための１つの可能性がスキーム３に示されている。

【０２５３】

一般式［ＸＸＶＩＩＩ］の化合物は、公知の文献手法（例えば、Ｂｉｏｏｒｇ．Ｍｅｄ．Ｃｈｅｍ．Ｌｅｔｔ．２００８，１８，５０９－５１２）によって、式［ＸＸＶＩＩ］のピラゾールのハロゲン化によって得られる。

【０２５４】

ハロゲン化剤としては、例えば、Ｎ－ブロモスクシンイミドおよび臭素を用いることができる。

【０２５５】

ハロゲン化反応のための溶媒としては、例えば、アミド（例えば、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、Ｎ－メチルピロリドン）、ハロゲン化炭化水素（例えば、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素）、および酢酸のような、反応条件下で不活性な全ての通常の溶媒を用いることができるか、あるいは該反応はこれらの溶媒の２以上の混合物中で行うことができる。溶媒の選択は用いるハロゲン化試薬に依存して変化させることができる。好ましい溶媒は酢酸およびジメチルホルムアミドである。

【０２５６】

ハロゲン化反応は、通常、０℃から１００℃の温度にて、好ましくは、２０℃から８０℃で行われる。反応時間は反応の規模および反応温度に依存して変化するが、一般に、数分および４８時間の間にある。

【０２５７】

ハロゲン化反応の完了の後に、粗生成物は、通常の分離技術のうちの１つによって反応混合物から分離される。必要であれば、化合物は再結晶、蒸留またはクロマトグラフィーによって精製されるか、あるいは、先の精製なくしてさらなる反応で用いてもよい。

工程（Ｖ２０）

式［ＩＸ－ｂ］の化合物の合成のための１つの可能性がスキーム３に示される。

【０２５８】

R^{2a}がアルキルまたはシクロアルキルを表す式［ＩＸ－ｂ］の化合物は、公知の文献手法（米国特許第０，０１８，１３２号）によって、式［ＸＸＩＸ］のピラゾールとボロン酸またはホウ酸エステル（例えば、トリメチルボロキシンまたはシクロプロピルボロン酸エステル）とのＣ－Ｃカップリングによって製造することができる。

【０２５９】

該反応は、（例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸ナトリウムまたは炭酸セシウムのような）塩基および（例えばジクロロ［１．１’－フェロセニルビス（ジフェニルホスファン）］－パラジウム（ＩＩ）＊CH_2Cl_2のような）パラジウム触媒の存在下で行われる。

【０２６０】

溶媒としては、例えば、環状および非環状エーテル（例えば、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタン）のような反応条件下で不活性な全ての通常の溶媒を用いることができるか、あるいは該反応はこれらの溶媒の２以上の混合物中で行うことができる。

【０２６１】

反応は、通常、５０℃から溶媒の沸点までの温度にて、好ましくは、９０℃の範囲で行われる。反応時間は、反応の規模および反応温度に依存して変化するが、一般には、半時間および７２時間の間にある。反応は、上昇させた温度にてマイクロ波装置（例えば、ＣＥＭエクスプローラー）で行うことができ、それにより、必要な反応時間は短縮することができる。

【０２６２】

式［ＸＸＩＸ］のピラゾールと化合物［ＸＸＸ］（式中、Met^2は、例えば、$B(OiPr)_3$または$B(OH)_2$のようなボレートエステルまたはボロン酸を表す）とのＣ－Ｃカップリングにおいて、適当な温度における触媒、塩基、リガンドおよび適当な溶媒の選択は用いるピラゾール［ＸＸＩＸ］に依存して変化させることができ、同様に、工程（Ｖ３）下で記載された可能な変形を含む。

【０２６３】
仕上げ処理では、反応混合物を水で処理し、酢酸エチルで抽出する。有機相を分離し、真空化で溶媒を除去する。
【０２６４】
得られた粗生成物を公知の文献方法（例えば、「Ｐｒｏｔｅｃｔｉｖｅ Ｇｒｏｕｐｓ ｉｎ Ｏｒｇａｎｉｃ Ｓｙｎｔｈｅｓｉｓ」；Ｔｈｉｒｄ Ｅｄｉｔｉｏｎ；Ｔｈｅｏｄｏｒａ Ｗ．Ｇｒｅｅｎｅ，Ｐｅｔｅｒ Ｇ．Ｍ．Ｗｕｔｓ；１９９９，Ｗｉｌｅｙ－ＶＣＨ，ｐ．６３９－６４０、およびそこに引用された文献）によってトリフルオロ酢酸と反応させて、（例えば、R^3＝ｐ－メトキシベンジルの場合には）ピラゾール上に位置する基R^3を除去し、それにより、式［ＩＸ－ｂ］の化合物が得られる。
【０２６５】
反応の完了の後に、化合物［ＩＸ－ｂ］は、通常の分離技術のうちの１つによって反応混合物から分離される。必要であれば、化合物は再結晶、蒸留またはクロマトグラフィーによって精製される。
工程（Ｖ２１）
式［Ｉ－ｅ］の化合物の合成のための１つの可能性がスキーム３に示される。
【０２６６】
R^{2a}がアルキルまたはシクロアルキルを表す式［Ｉ－ｅ］の化合物は、公知の文献手法（米国特許第０，０１８，１３２号）によって、式［ＸＸＩＸ］のピラゾールとボロン酸またはボロン酸エステル（例えば、トリメチルボロキシンまたはシクロプロピルボロン酸エステル）とのＣ－Ｃカップリングによって製造することができる。
【０２６７】
カップリングのための条件は、脱保護反応による基$R^{3/301}$の除去を行わない前記製法（Ｖ２０）下で述べた条件に対応する。
【０２６８】
反応の完了の後に、化合物［Ｉ－ｅ］は、通常の分離技術のうちの１つによって反応混合物から分離される。必要であれば、化合物は再結晶、蒸留またはクロマトグラフィーによって精製される。
工程（Ｖ２２）
式［ＸＸＸＩＩ］の化合物の合成のための１つの可能性がスキーム４に示されている。
【０２６９】
一般式［ＸＸＸＩＩ］の化合物は、公知の文献方法（例えば、米国特許第５７４４４２６号）によって、一般式［ＸＸＸＩ］の化合物と式$R^{3/301}$－ＮＨ－NH_2のアルキルヒドラジンとの反応によって得られる。
【０２７０】
該反応は、例えば、酢酸のような酸の存在下で行うことができる。
【０２７１】
溶媒としては、例えば、環状および非環状エーテル（例えば、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタン）、アルコール（例えば、エタノール、メタノール）またはエステル（例えば、アセテートエステル）のような反応条件下で不活性な全ての通常の溶媒を用いることができるか、あるいは該反応はこれらの溶媒の２以上の混合物中で行うことができる。例えば、エタノールのような極性溶媒の使用が好ましい。
【０２７２】
反応は、通常、０℃から溶媒の沸点までの温度にて、好ましくは、還流下で行われる。反応時間は、反応の規模および反応温度に依存して変化するが、一般に、半時間および７２時間の間にある。反応は、上昇させた温度にてマイクロ波装置（例えば、ＣＥＭエクスプローラー）で行うことができ、それにより、必要な反応時間は短縮することができる。
工程（Ｖ２３）
式［ＸＸＸＩＩＩ］の化合物の合成のための１つの可能性がスキーム４に示される。
【０２７３】

一般式［ＸＸＸＩＩＩ］の化合物は、公知の文献方法（例えば、米国特許第５８６１３５９号、Ｏｒｇ．Ｌｅｔｔ．２００６，８，１７，３８０５－３８０８）によって、一般式［ＸＸＸＩＩ］の化合物と、（例えば、クロロジフルオロ－メタンまたはクロロジフルオロ酢酸ナトリウムのような）ハロジフルオロメタン化合物との反応によって得られる。

【０２７４】

反応は、例えば、炭酸カリウムのような塩基の存在下で行われる。

【０２７５】

溶媒としては、例えば、アミド（例えば、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、Ｎ－メチルピロリドン）、環状および非環状エーテル（例えば、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタン）またはニトリル（例えば、アセトニトリル）のような、反応条件下で不活性な全ての通常の溶媒を用いることができる。

【０２７６】

反応は、通常、２５℃から溶媒の沸点までの温度で行われる。反応時間は、反応の規模および反応温度に依存して変化するが、一般には、半時間および７２時間の間にある。

工程（Ｖ２４）

式［ＶＩ－ａｂ］の化合物の合成のための１つの可能性がスキーム４に示されている。

【０２７７】

一般式［ＶＩ－ｂ］の化合物は、公知の文献手法（例えば、米国特許第６４８２７７４号）によって、式［ＸＸＸＩＩＩ］のピラゾールのハロゲン化によって得られる。

【０２７８】

ハロゲン化剤としては、例えば、Ｎ－ブロモスクシンイミドまたは臭素を用いることができる。

【０２７９】

ハロゲン化反応のための溶媒としては、例えば、アミド（例えば、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、Ｎ－メチルピロリドン）、ハロゲン化炭化水素（例えば、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素）または酢酸のような、反応条件下で不活性な全ての通常の溶媒を用いることができるか、あるいは該反応はこれらの溶媒の２以上の混合物中で行うことができる。溶媒の選択は、用いるハロゲン化試薬に依存して変化させることができる。好ましい溶媒はジクロロメタンおよびテトラクロロメタンである。

【０２８０】

ハロゲン化反応は、通常、０℃から１００℃の温度、好ましくは、２０℃から８０℃で行われる。反応時間は、反応の規模および反応温度に依存して変化するが、一般には、数分間および４８時間の間にある。

【０２８１】

ハロゲン化反応の完了の後に、粗生成物は、通常の分離技術のうちの１つによって反応混合物から分離される。必要であれば、化合物は再結晶、蒸留またはクロマトグラフィーによって精製され、あるいは、先の精製なくしてさらなる反応で用いることもできる。

工程（Ｖ２５）

式［ＶＩ－ｃ］の化合物の合成のための１つの可能性がスキーム４に示されている。

【０２８２】

一般式［ＶＩ－ｃ］の化合物は、公知の文献手法（例えば、国際公開第２００７／１０５０５８号）によって、R^2が４－フルオロ－２－メトキシフェニルを表す式［ＶＩ－ｂ］のピラゾールのエーテル開裂によって得られる。

【０２８３】

反応は、ルイス酸、例えば、三臭化ホウ素、および反応条件下で不活性な溶媒（例えば、ジクロロメタン）の存在下で行われる。反応は、通常、－２０℃から＋２０℃の温度にて、好ましくは、－５℃から０℃で行われる。

工程（Ｖ２６）

式［ＩＩＩ］の化合物の合成のための１つの可能性がスキーム６に示されている。

【０２８４】

式［ＩＩＩ］の化合物は、例えば、公知の文献手法（Ｔｏｐ．Ｃｕｒｒ．Ｃｈｅｍ．２００２，２１９，１１；Ｏｒｇａｎｏｍｅｔ．Ｃｈｅｍ．１９９９，２８，１４７およびそこに引用された文献、Ｏｒｇ．Ｌｅｔｔ．２００５，７，２１，４７５３－４７５６）によって、適当な温度にて、触媒、塩基、必要であれば、リガンドおよび適当な溶媒の存在下で、ハロピラゾール［ＶＩ］と、式［ＸＶ－ａ］（式中、Ｍｅｔは、例えば、Ｂ（ＯｉＰｒ）$_3$またはＢ（ＯＨ）$_2$のようなボレートエステルまたはボロン酸を表す）の金属化複素環とのカップリングによって製造することができる。

【０２８５】

タイプ［ＶＩ］の化合物の製造は工程（Ｖ６）の下で記載されている。

【０２８６】

溶媒、添加された塩基、温度、触媒および添加されたリガンドの選択は、必要であれば、用いる基質［ＶＩ］に依存して変化させることができ、式［ＶＩ］の化合物のＣ－Ｃカップリングについて工程（Ｖ６）下で記載された可能な変形を含む。

工程（Ｖ２７）

式［ＸＬＩ］の化合物の合成のための１つの可能性がスキーム８に示されている。

【０２８７】

一般式［ＸＬＩ］の化合物は、公知の文献手法（例えば、国際公開第２００９／１６４６０号または同第２００７／２４８４３号）によって、式［ＸＬ］のチオアルキルピリミジンの酸化によって得られる。

【０２８８】

酸化剤としては、例えば、ｍ－クロロ過安息香酸（ｍ－ＣＰＢＡ）またはオキソン（Ｏｘｏｎｅ）（ペルオキソ一硫酸カリウム）を用いることができる。

【０２８９】

酸化反応のための溶媒としては、例えば、ハロゲン化炭化水素（例えば、ジクロロメタン）、エーテル（例えば、テトラヒドロフラン）、アルコール（例えば、メタノール）または水のような、反応条件下で不活性な全ての通常の溶媒を用いることができるか、あるいは該反応は、これらの溶媒の２以上の混合物中で行うことができる。溶媒の選択は、用いる酸化試薬に応じて変化させることができる。好ましい溶媒はジクロロメタン（ｍ－ＣＰＢＡ）および水／ＴＨＦ混合物（オキソン）である。

【０２９０】

酸化反応は、通常、０℃から２０℃の温度で行われる。反応時間は、反応の規模および反応温度に依存して変化するが、一般には、数時間および４８時間の間にある。

【０２９１】

酸化反応の完了の後に、粗生成物を通常の分離技術のうちの１つによって反応混合物から分離する。必要であれば、化合物を再結晶、蒸留またはクロマトグラフィーによって精製し、あるいは、先の精製なくしてさらなる反応で用いてもよい。

工程（Ｖ２８）

式［Ｉ－ｆ］の化合物の合成のための１つの可能性がスキーム８に示されている。

【０２９２】

一般式［Ｉ－ｆ］の化合物は、公知の文献方法（例えば、国際公開第２００７／１０５０５８号または米国特許第６４２３７１３号）によって、一般式［ＸＬＩ］の化合物と第一級または第二級アミンとの反応によって得られる。

【０２９３】

該反応は必要であれば、例えば、フッ化セシウムのような塩の存在下で行われる。

【０２９４】

溶媒としては、例えば、アミド（例えば、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、Ｎ－メチルピロリドン）、環状および非環状エーテル（例えば、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタン）、ニトリル（例えば、アセトニトリル）、スルホキシド（例えば、ジメチルスルホキシド）または、アルコール（例えば、エタノール、ｎ－ブタノール）のような、反応条件下で不活性な全ての通常の溶媒を用いることができる。別

法として、反応は、溶媒なくして、例えば、過剰のアミンを用いて行うことができる。
【０２９５】
反応は、通常、５０℃から溶媒の沸点までの温度で行われる。反応時間は、反応の規模および反応温度に依存して変化するが、一般に、半時間および７２時間の間にある。反応は、上昇させた温度にてマイクロ波装置（例えば、ＣＥＭエクスプローラー）で行うことができ、それにより、必要な反応時間を短縮することができる。
【０２９６】
スキーム８に記載されたピラゾール［Ｉ－ｆ］の合成と同様に、スキーム９に記載されたタイプ［ＸＬＩＩＩ］の化合物からのピラゾール［ＸＬＩＶ］の合成をこの製法で行うことができる。
工程（Ｖ２９）
式［ＩＩＩ－ａ］の化合物の合成のための１つの可能性がスキーム８に示されている。
【０２９７】
一般式［ＩＩＩ－ａ］の化合物は、公知の文献方法（例えば、Ｊ．Ｍｅｄ．Ｃｈｅｍ，１９９９，４２，１２，２１８０－２１９０またはＢｉｏｏｒｇ．Ｍｅｄ．Ｃｈｅｍ．Ｌｅｔｔ．２００８，１８，１４，４００６－４０１０）によって、一般式［Ｉ－ｆ］（式中、R^{x1}はＨを表し、およびR^{x2}はベンジル、４－メトキシベンジルまたは３，４－ジメトキシベンジルを表す）の化合物の脱アルキル化によって得られる。
【０２９８】
反応は、通常、強酸、例えば、硫酸、塩酸またはトリフルオロ酢酸の存在下で行われる。
【０２９９】
反応は、通常、０℃から１２０℃までの温度で行われる。反応時間は、反応の規模および反応温度に依存して変化するが、一般には、半時間および７２時間の間にある。反応は上昇させた温度でマイクロ波装置（例えば、ＣＥＭエクスプローラー）で行うことができ、それにより、必要な反応時間を短縮することができる。
【０３００】
本発明のさらなる主題は、望まない微生物の防除のための、ならびに植物および植物の部分におけるマイコトキシンの低下のため、本発明によるフェニルピリ（ミ）ジニラゾール類またはそれらの混合物の非医薬的使用に関する。
【０３０１】
本発明のさらなる主題は、本発明による少なくとも１つのフェニルピリ（ミ）ジニラゾールを含む望まない微生物の防除のための、ならびに植物および植物の部分におけるマイコトキシンの低下のための剤に関する。
【０３０２】
加えて、本発明は、本発明によるフェニルピリ（ミ）ジニラゾールを微生物に、および／またはそれらの生息場所に適用することを特徴とする、望まない微生物の防除のためのならびに植物および植物の部分におけるマイコトキシンの低下のための方法に関する。
【０３０３】
本発明による物質は強い殺微生物作用を呈し、植物の保護において、および材料の保護において、真菌および細菌のような望まない微生物の防除に用いることができる。
【０３０４】
式（Ｉａ）および（Ｉｂ）の本発明によるフェニルピリ（ミ）ジニラゾール類は非常に良好な殺菌特性を保有し、例えば、ネコブカビ類（Ｐｌａｓｍｏｄｉｏｐｈｏｒｏｍｙｃｅｔｅｓ）、卵菌類（Ｏｏｍｙｃｅｔｅｓ）、ツボカビ類（Ｃｈｙｔｒｉｄｉｏｍｙｃｅｔｅｓ）、接合菌類（Ｚｙｇｏｍｙｃｅｔｅｓ）、子嚢菌類（Ａｓｃｏｍｙｃｅｔｅｓ）、担子菌類（Ｂａｓｉｄｉｏｍｙｃｅｔｅｓ）および不完全菌類（Ｄｅｕｔｅｒｏｍｙｃｅｔｅｓ）の防除のために、植物保護において用いることができる。
【０３０５】
殺菌剤は、例えば、シュードモナス科（Ｐｓｅｕｄｏｍｏｎａｄａｃｅａｅ）、リゾビ

ウム科（Ｒｈｉｚｏｂｉａｃｅａｅ）、腸内細菌科（Ｅｎｔｅｒｏｂａｃｔｅｒｉａｃｅａｅ）、コリネバクテリウム科（Ｃｏｒｙｎｅｂａｃｔｅｒｉａｃｅａｅ）およびストレプトミセス科（Ｓｔｒｅｐｔｏｍｙｃｅｔａｃｅａｅ）の防除のために植物保護で用いることができる。

【０３０６】

本発明による殺真菌剤は、植物病原性真菌の防除のために治癒的にまたは保護的に用いることができる。従って、本発明は、種子、植物もしくは植物の部分、果実、または植物が成長する土壌に適用される、本発明による活性な物質または剤の使用を通じて植物病原性真菌の防除のための治癒的および保護的方法にも関する。

【０３０７】

植物保護における植物病原性真菌の防除のための本発明による剤は、有効であるが非植物毒性量の本発明による活性な物質を含む。「有効であるが非植物毒性量」は、植物の真菌病を適切に防除し、または完全に殺してしまうのに十分であって、同時に、それに植物毒性のいずれの有意な兆候ももたらさない本発明による剤の量を意味する。この適用投与量は、一般に、かなりの範囲にわたって変化し得る。それはいくつかの因子、例えば、防除すべき真菌、植物、気候条件、および本発明による剤の成分に依存する。

【０３０８】

本発明によると、全ての植物および植物の部分を処理することができる。ここで、植物は、望まれるおよび望まれない野生型植物または作物植物（天然に生じる作物植物を含む）のような全ての植物および植物の集団を意味すると理解される。作物植物は、慣用的な育種および最適化方法によって、またはトランスジェニック植物を含めた、および植物育種者の権利によって保護され得る、または保護され得ない植物の品種を含めた、バイオテクノロジーおよび遺伝子工学方法、またはこれらの方法の組合せによって得ることができる植物であり得る。植物の部分は、苗条、葉、花および根のような植物の全ての地上および地下の部分ならびに器官を意味すると理解されるべきであり、ここで、例えば、葉、針状葉、葉柄、茎、花、果実体、果実および種子ならびに根、塊茎および地下茎が挙げられる。草木植物は収穫された材料、ならびに栄養性および生殖性材料、例えば、切穂、塊茎、地下茎、葡匐茎および種子も含む。

【０３０９】

本発明に従って処理できる植物として、以下のものが挙げられる：Ｒｏｓａｃｅａｅ ｓｐ.（例えば、リンゴおよびナシのような多肉果、のみならず杏、さくらんぼ、アーモンドおよび桃のような核果、ならびにイチゴのようなベリー果実）、Ｒｉｂｅｓｉｏｉｄａｅ ｓｐ.、Ｊｕｇｌａｎｄａｃｅａｅ ｓｐ.、Ｂｅｔｕｌａｃｅａｅ ｓｐ.、Ａｎａｃａｒｄｉａｃｅａｅ ｓｐ.、Ｆａｇａｃｅａｅ ｓｐ.、ｍｏｒａｃｅａｅ ｓｐ.、Ｏｌｅａｃｅａｅ ｓｐ.、Ａｃｔｉｎｉｄａｃｅａｅ ｓｐ.、Ｌａｕｒａｃｅａｅ ｓｐ.、Ｍｕｓａｃｅａｅ ｓｐ.（例えば、バナナ樹木およびプランテーション）、Ｒｕｂｉａｃｅａｅ ｓｐ.（例えば、コーヒー）、Ｔｈｅａｃｅａｅ ｓｐ.、Ｓｔｅｒｃｕｌｉｃｅａｅ ｓｐ.、Ｒｕｔａｃｅａｅ ｓｐ.（例えば、レモン、オレンジおよびグレープフルーツ）；Ｓｏｌａｎａｃｅａｅ ｓｐ.（例えば、トマト）、Ｌｉｌｉａｃｅａｅ ｓｐ.、Ａｓｔｅｒａｃｅａｅ ｓｐ.（例えば、レタス）、Ｕｍｂｅｌｌｉｆｅｒａｅ ｓｐ.、Ｃｒｕｃｉｆｅｒａｅ ｓｐ.、Ｃｈｅｎｏｐｏｄｉａｃｅａｅ ｓｐ.、Ｃｕｃｕｒｂｉｔａｃｅａｅ ｓｐ.（例えばキュウリ）、Ａｌｌｉａｃｅａｅ ｓｐ.（例えば、ニラ、玉ねぎ）、Ｐａｐｉｌｉｏｎａｃｅａｅ ｓｐ.（例えば、エンドウ豆）のような、綿、亜麻、つる植物、果実および野菜；Ｇｒａｍｉｎｅａｅ ｓｐ.（例えば、トウモロコシ、芝生、小麦、ライ麦、コメ、大麦、オウト麦、キビおよびライコムギのような穀類）、Ａｓｔｅｒａｃｅａｅ ｓｐ.（例えば、ひまわり）、Ｂｒａｓｓｉｃａｃｅａｅ ｓｐ.（例えば、ホワイトキャベツ、レッドキャベツ、ブロッコリー、カリフラワー、芽キャベツ、青梗菜、カブキャベツ、ダイコンおよびセイヨウアブラナ、からし、セイヨウワサビおよびクレソン）、Ｆｂａｃａｅ ｓｐ.（例えば、豆類、落花生）、Ｐａｐｉｌｉｏｎａｃｅａｅ ｓｐ.（例えば、大豆）、Ｓｏｌａｎａ

ｃｅａｅ ｓｐ．（例えば、ジャガイモ）、Ｃｈｅｎｏｐｏｄｉａｃｅａｅ ｓｐ．（例えば、てんさい、飼料ビート、マンゴールド、テーブルビート）のような主用途植物；庭および森林中の有用な植物および観葉植物；ならびにこれらの植物の各々の遺伝子工学的に修飾した種。好ましくは、穀物植物を本発明に従って処理する。

【０３１０】

例えば、限定されるものではないが、本発明に従って処理することができる真菌病のいくつかの病原体を挙げることができる；

例えばＢｌｕｍｅｒｉａ ｇｒａｍｉｎｉｓのようなＢｌｕｍｅｒｉａ種；例えば、Ｐｏｄｏｓｐｈａｅｒａ ｌｅｕｃｏｔｒｉｃｈａのようなＰｏｄｏｓｐｈａｅｒａ種；例えば、Ｓｐｈａｅｒｏｔｈｅｃａ ｆｕｌｉｇｉｎｅａのようなＳｐｈａｅｒｏｔｈｅｃａ種；例えば、Ｕｎｃｉｎｕｌａ ｎｅｃａｔｏｒのようなＵｎｃｉｎｕｌａ種のような真のうどんこ病の病原体によって引き起こされる病気；

例えば、Ｇｙｍｎｏｓｐｏｒａｎｇｉｕｍ ｓａｂｉｎａｅのようなＧｙｍｎｏｓｐｏｒａｎｇｉｕｍ種；例えば、Ｈｅｍｉｌｅｉａ ｖａｓｔａｔｒｉｘのようなＨｅｍｉｌｅｉａ種；例えば、Ｐｈａｋｏｐｓｏｒａ ｐａｃｈｙｒｈｉｚｉおよびＰｈａｋｏｐｓｏｒａ ｍｅｉｂｏｍｉａｅのようなＰｈａｋｏｐｓｏｒａ種；例えば、Ｐｕｃｃｉｎｉａ ｒｅｃｏｎｄｉｔａまたはＰｕｃｃｉｎｉａ ｔｒｉｔｉｃｉｎａのようなＰｕｃｃｉｎｉａ種；例えば、Ｕｒｏｍｙｃｅｓ ａｐｐｅｎｄｉｃｕｌａｔｕｓのようなＵｒｏｍｙｃｅｓ種のようなさび病の病原体によって引き起こされる病気；

例えば、Ｂｒｅｍｉａ ｌａｃｔｕｃａｅのようなＢｒｅｍｉａ種；例えば、Ｐｅｒｏｎｏｓｐｏｒａ ｐｉｓｉまたはＰ．ｂｒａｓｓｉｃａｅのようなＰｅｒｏｎｏｓｐｏｒａ種；例えば、Ｐｈｙｔｏｐｈｔｈｏｒａ ｉｎｆｅｓｔａｎｓのようなＰｈｙｔｏｐｈｔｈｏｒａ種；例えば、Ｐｌａｓｍｏｐａｒａ ｖｉｔｉｃｏｌａのようなＰｌａｓｍｏｐａｒａ種；例えば、Ｐｓｅｕｄｏｐｅｒｏｎｏｓｐｏｒａ ｈｕｍｕｌｉまたはＰｓｅｕｄｏｐｅｒｏｎｏｓｐｏｒａ ｃｕｂｅｎｓｉｓのようなＰｓｅｕｄｏｐｅｒｏｎｏｓｐｏｒａ種；例えば、Ｐｙｔｈｉｕｍ ｕｌｔｉｍｕｍのようなＰｙｔｈｉｕｍ種のような卵菌類群の病原体によって引き起こされる病気；

例えば、Ａｌｔｅｒｎａｒｉａ ｓｏｌａｎｉのようなＡｌｔｅｒｎａｒｉａ種；例えば、Ｃｅｒｃｏｓｐｏｒａ ｂｅｔｉｃｏｌａのようなＣｅｒｃｏｓｐｏｒａ種；例えば、Ｃｌａｄｉｏｓｐｏｒｉｕｍ ｃｕｃｕｍｅｒｉｎｕｍのようなＣｌａｄｉｏｓｐｏｒｉｕｍ種；例えば、Ｃｏｃｈｌｉｏｂｏｌｕｓ ｓａｔｉｖｕｓ（分生子形態：Ｄｒｅｃｈｓｌｅｒａ，Ｓｙｎ：Ｈｅｌｍｉｎｔｈｏｓｐｏｒｉｕｍ）のようなＣｏｃｈｌｉｏｂｏｌｕｓ種；例えば、Ｃｏｌｌｅｔｏｔｒｉｃｈｕｍ ｌｉｎｄｅｍｕｔｈａｎｉｕｍのようなＣｏｌｌｅｔｏｔｒｉｃｈｕｍ種；例えば、Ｃｙｃｌｏｃｏｎｉｕｍ ｏｌａｇｉｎｕｍのようなＣｙｃｌｏｃｏｎｉｕｍ種；例えば、Ｄｉａｐｏｒｔｈｅ ｃｉｔｒｉのようなＤｉａｐｏｒｔｈｅ種；例えば、Ｅｌｓｉｎｏｅ ｆａｗｃｅｔｔｉｉのようなＥｌｓｉｎｏｅ種；例えば、Ｇｌｏｅｏｓｐｏｒｉｕｍ ｌａｅｔｉｃｏｌｏｒのようなＧｌｏｅｏｓｐｏｒｉｕｍ種；例えば、Ｇｌｏｍｅｒｅｌｌａ ｃｉｎｇｕｌａｔａのようなＧｌｏｍｅｒｅｌｌａ種；例えば、Ｇｕｉｇｎａｒｄｉａ ｂｉｄｗｅｌｌｉのようなＧｕｉｇｎａｒｄｉａ種；例えば、Ｌｅｐｔｏｓｐｈａｅｒｉａ ｍａｃｕｌａｎｓのようなＬｅｐｔｏｓｐｈａｅｒｉａ種；例えば、Ｍａｇｎａｐｏｒｔｈｅ ｇｒｉｓｅａのようなＭａｇｎａｐｏｒｔｈｅ種；例えば、Ｍｉｃｒｏｄｏｃｈｉｕｍ ｎｉｖａｌｅのようなＭｉｃｒｏｄｏｃｈｉｕｍ種；例えば、Ｍｙｃｏｓｐｈａｅｒｅｌｌａ ｇｒａｍｉｎｉｃｏｌａおよびＭ．ｆｉｊｉｅｎｓｉｓのようなＭｙｃｏｓｐｈａｅｒｅｌｌａ種；例えば、Ｐｈａｅｏｓｐｈａｅｒｉａ ｎｏｄｏｒｕｍのようなＰｈａｅｏｓｐｈａｅｒｉａ種；例えば、Ｐｙｒｅｎｏｐｈｏｒａ ｔｅｒｅｓのようなＰｙｒｅｎｏｐｈｏｒａ種；例えば、Ｒａｍｕｌａｒｉａ ｃｏｌｌｏｃｙｇｎｉのようなＲａｍｕｌａｒｉａ種；例えば、Ｒｈｙｎｃｈｏｓｐｏｒｉｕｍ ｓｅｃａｌｉｓのようなＲｈｙｎｃｈｏｓｐｏｒｉｕｍ種；例えば、Ｓｅｐｔｏｒｉａ ａｐｉｉのようなＳｅｐｔｏｒｉａ種；例えば、Ｔｙｐｈｕｌａ ｉｎｃａｒｎａｔａのようなＴｙｐｈｕｌａ種；例えば、Ｖｅｎ

ｔｕｒｉａ ｉｎａｅｑｕａｌｉｓのようなＶｅｎｔｕｒｉａ種によって引き起こされる斑点病および葉枯病；

例えば、Ｃｏｒｔｉｃｉｕｍ ｇｒａｍｉｎｅａｒｕｍのようなＣｏｒｔｉｃｉｕｍ種；例えば、Ｆｕｓａｒｉｕｍ ｏｘｙｓｐｏｒｕｍのようなＦｕｓａｒｉｕｍ種；例えば、Ｇａｅｕｍａｎｎｏｍｙｃｅｓ ｇｒａｍｉｎｉｓのようなＧａｅｕｍａｎｎｏｍｙｃｅｓ種；例えば、Ｒｈｉｚｏｃｔｏｎｉａ ｓｏｌａｎｉのようなＲｈｉｚｏｃｔｏｎｉａ種；例えば、Ｔａｐｅｓｉａ ａｃｕｆｏｒｍｉｓのようなＴａｐｅｓｉａ種；例えば、Ｔｈｉｅｌａｖｉｏｐｓｉｓ ｂａｓｉｃｏｌａのようなＴｈｉｅｌａｖｉｏｐｓｉｓ種によって引き起こされる根および茎病；

例えば、Ａｌｔｅｒｎａｒｉａ ｓｐｐ．のようなＡｌｔｅｒｎａｒｉａ種；例えば、Ａｓｐｅｒｇｉｌｌｕｓ ｆｌａｖｕｓのようなＡｓｐｅｒｇｉｌｌｕｓ種；例えば、Ｃｌａｄｏｓｐｏｒｉｕｍ ｃｌａｄｏｓｐｏｒｉｏｉｄｅｓのようなＣｌａｄｏｓｐｏｒｉｕｍ種；例えば、Ｃｌａｖｉｃｅｐｓ ｐｕｒｐｕｒｅａのようなＣｌａｖｉｃｅｐｓ種；例えば、Ｆｕｓａｒｉｕｍ ｃｕｌｍｏｒｕｍのようなＦｕｓａｒｉｕｍ種；例えば、Ｇｉｂｂｅｒｅｌｌａ ｚｅａｅのようなＧｉｂｂｅｒｅｌｌａ種；例えば、Ｍｏｎｏｇｒａｐｈｅｌｌａ ｎｉｖａｌｉｓのようなＭｏｎｏｇｒａｐｈｅｌｌａ種；例えば、Ｓｅｐｔｏｒｉａ ｎｏｄｏｒｕｍのようなＳｅｐｔｏｒｉａ種によって引き起こされる、（トウモロコシの穂軸を含めた）実および穂の病気；

例えば、Ｓｐｈａｃｅｌｏｔｈｅｃａ ｒｅｉｌｉａｎａのようなＳｐｈａｃｅｌｏｔｈｅｃａ種；例えば、Ｔｉｌｌｅｔｉａ ｃａｒｉｅｓ，Ｔ．ｃｏｎｔｒｏｖｅｒｓａのようなＴｉｌｌｅｔｉａ種；例えば、Ｕｒｏｃｙｓｔｉｓ ｏｃｃｕｌｔａのようなＵｒｏｃｙｓｔｉｓ種；例えば、Ｕｓｔｉｌａｇｏ ｎｕｄａ，Ｕ．ｎｕｄａ ｔｒｉｔｉｃｉのようなＵｓｔｉｌａｇｏ種のような黒穂真菌類によって引き起こされる病気；

例えば、Ａｓｐｅｒｇｉｌｌｕｓ ｆｌａｖｕｓのようなＡｓｐｅｒｇｉｌｌｕｓ種；例えば、Ｂｏｔｒｙｔｉｓ ｃｉｎｅｒｅａのようなＢｏｔｒｙｔｉｓ種；例えば、Ｐｅｎｉｃｉｌｌｉｕｍ ｅｘｐａｎｓｕｍおよびＰ．ｐｕｒｐｕｒｏｇｅｎｕｍのようなＰｅｎｉｃｉｌｌｉｕｍ種；例えば、Ｓｃｌｅｒｏｔｉｎｉａ ｓｃｌｅｒｏｔｉｏｒｕｍのようなＳｃｌｅｒｏｔｉｎｉａ種によって引き起こされる果実腐敗；

例えば、Ｖｅｒｔｉｃｉｌｉｕｍ ａｌｂｏａｔｒｕｍのようなＶｅｒｔｉｃｉｌｉｕｍ種；

例えば、Ｆｕｓａｒｉｕｍ ｃｕｌｍｏｒｕｍのようなＦｕｓａｒｉｕｍ種；例えば、Ｐｈｙｔｏｐｈｔｈｏｒａ ｃａｃｔｏｒｕｍのようなＰｈｙｔｏｐｈｔｈｏｒａ種；例えば、Ｐｙｔｈｉｕｍ ｕｌｔｉｍｕｍのようなＰｙｔｈｉｕｍ種；例えば、Ｒｈｉｚｏｃｔｏｎｉａ ｓｏｌａｎｉのようなＲｈｉｚｏｃｔｏｎｉａ種；例えば、Ｓｃｌｅｒｏｔｉｕｍ ｒｏｌｆｓｉｉのようなＳｃｌｅｒｏｔｉｕｍ種によって引き起こされる種子および土壌伝幡性腐敗病ならびに胴枯れ病および実生病；

例えば、Ｎｅｃｔｒｉａ ｇａｌｌｉｇｅｎａのようなＮｅｃｔｒｉａ種によって引き起こされる癌腫病、瘤およびてぐす症；

例えば、Ｍｏｎｉｌｉｎｉａ ｌａｘａのようなＭｏｎｉｌｉｎｉａ種によって引き起こされる胴枯れ病；

例えば、Ｔａｐｈｒｉｎａ ｄｅｆｏｒｍａｎｓのようなＴａｐｈｒｉｎａ種によって引き起こされる葉、花および果実の変形；

例えば、Ｐｈａｅｍｏｎｉｅｌｌａ ｃｌａｍｙｄｏｓｐｏｒａおよびＰｈａｅｏａｃｒｅｍｏｎｉｕｍ ａｌｅｏｐｈｉｌｕｍおよびＦｏｍｉｔｉｐｏｒｉａ ｍｅｄｉｔｅｒｒａｎｅａのようなＥｓｃａ種によって引き起こされる木質植物の変性病；

例えば、Ｂｏｔｒｙｔｉｓ ｃｉｎｅｒｅａのようなＢｏｔｒｙｔｉｓ種によって引き起こされる花および種子病；

例えば、Ｒｈｉｚｏｃｔｏｎｉａ ｓｏｌａｎｉのようなＲｈｉｚｏｃｔｏｎｉａ種；例えば、Ｈｅｌｍｉｎｔｈｏｓｐｏｒｉｕｍ ｓｏｌａｎｉのような Ｈｅｌｍｉｎｔｈｏｓｐｏｒｉｕｍ種によって引き起こされる植物塊茎の病気；

例えば、Ｘａｎｔｈｏｍｏｎａｓ ｃａｍｐｅｓｔｒｉｓ ｐｖ．ｏｒｙｚａｅのようなＸａｎｔｈｏｍｏｎａｓ種；例えば、Ｐｓｅｕｄｏｍｏｎａｓ ｓｙｒｉｎｇａｅ ｐｖ．ｌａｃｈｒｙｍａｎｓのようなＰｓｅｕｄｏｍｏｎａｓ種；例えば、Ｅｒｗｉｎｉａ ａｍｙｌｏｖｏｒａのようなＥｒｗｉｎｉａ種のような細菌病原体によって引き起こされる病気；

好ましくは、大豆の以下の病気を防除することができる：

例えば、アルテルナリア斑点病（Ａｌｔｅｒｎａｒｉａ ｓｐｅｃ．ａｔｒａｎｓ ｔｅｎｕｉｓｓｉｍａ）、炭疽病（Ｃｏｌｌｅｔｏｔｒｉｃｈｕｍ ｇｌｏｅｏｓｐｏｒｏｉｄｅｓ ｄｅｍａｔｉｕｍ ｖａｒ．ｔｒｕｎｃａｔｕｍ）、褐斑病（Ｓｅｐｔｏｒｉａ ｇｌｙｃｉｎｅｓ）、Ｃｅｒｃｏｓｐｏｒａ斑点病および葉枯病（Ｃｅｒｃｏｓｐｏｒａ ｋｉｋｕｃｈｉｉ）、Ｃｈｏａｎｅｐｈｏｒａ葉枯病（Ｃｈｏａｎｅｐｈｏｒａ ｉｎｆｕｎｄｉｂｕｌｉｆｅｒａ ｔｒｉｓｐｏｒａ（Ｓｙｎ．））、Ｄａｃｔｕｌｉｏｐｈｏｒａ斑点病（Ｄａｃｔｕｌｉｏｐｈｏｒａ ｇｌｙｃｉｎｅｓ）、べと病（Ｐｅｒｏｎｏｓｐｏｒａ ｍａｎｓｈｕｒｉｃａ）、Ｄｒｅｃｈｓｌｅｒａ胴枯れ病（Ｄｒｅｃｈｓｌｅｒａ ｇｌｙｃｉｎｉ）、フロッグアイ斑点病（Ｃｅｒｃｏｓｐｏｒａ ｓｏｊｉｎａ）、Ｌｅｐｔｏｓｐｈａｅｒｕｌｉｎａ斑点病ｔ（Ｌｅｐｔｏｓｐｈａｅｒｕｌｉｎａ ｔｒｉｆｏｌｉｉ）、Ｐｈｙｌｌｏｓｔｉｃａ斑点病（Ｐｈｙｌｌｏｓｔｉｃｔａ ｓｏｊａｅｃｏｌａ）、鞘および茎枯れ病（Ｐｈｏｍｏｐｓｉｓ ｓｏｊａｅ）、べと病（Ｍｉｃｒｏｓｐｈａｅｒａ ｄｉｆｆｕｓａ）、Ｐｙｒｅｎｏｃｈａｅｔａ斑点病（Ｐｙｒｅｎｏｃｈａｅｔａ ｇｌｙｃｉｎｅｓ）、Ｒｈｉｚｏｃｔｏｎｉａ空中、茎葉枯病およびクモの巣病（Ｒｈｉｚｏｃｔｏｎｉａ ｓｏｌａｎｉ）、さび病（Ｐｈａｋｏｐｓｏｒａ ｐａｃｈｙｒｈｉｚｉ、Ｐｈａｋｏｐｓｏｒａ ｍｅｉｂｏｍｉａｅ）、赤かび病（Ｓｐｈａｃｅｌｏｍａ ｇｌｙｃｉｎｅｓ）、Ｓｔｅｍｐｈｙｌｉｕｍ葉枯れ病（Ｓｔｅｍｐｈｙｌｉｕｍ ｂｏｔｒｙｏｓｕｍ）、輪紋病（Ｃｏｒｙｎｅｓｐｏｒａ ｃａｓｓｉｉｃｏｌａ）によって引き起こされる葉、茎、苗条および種子の真菌病。

【０３１１】

例えば、黒根腐敗病（Ｃａｌｏｎｅｃｔｒｉａ ｃｒｏｔａｌａｒｉａｅ）、炭腐病（Ｍａｃｒｏｐｈｏｍｉｎａ ｐｈａｓｅｏｌｉｎａ）、Ｆｕｓａｒｉｕｍ胴枯れ病または立ち枯れ病、根腐敗病、ならびに鞘およびカラー（ｃｏｌｌａｒ）腐敗病（Ｆｕｓａｒｉｕｍ ｏｘｙｓｐｏｒｕｍ，Ｆｕｓａｒｉｕｍ ｏｒｔｈｏｃｅｒａｓ，Ｆｕｓａｒｉｕｍ ｓｅｍｉｔｅｃｔｕｍ，Ｆｕｓａｒｉｕｍ ｅｑｕｉｓｅｔｉ）、Ｍｙｃｏｌｅｐｔｏｄｉｓｃｕｓ根腐敗病（Ｍｙｃｏｌｅｐｔｏｄｉｓｃｕｓ ｔｅｒｒｅｓｔｒｉｓ）、Ｎｅｏｃｏｓｍｏｓｐｏｒａ（Ｎｅｏｃｏｓｍｏｐｓｐｏｒａ ｖａｓｉｎｆｅｃｔａ）、鞘および茎枯れ病（Ｄｉａｐｏｒｔｈｅ ｐｈａｓｅｏｌｏｒｕｍ）、茎癌腫病（Ｄｉａｐｏｒｔｈｅ ｐｈａｓｅｏｌｏｒｕｍ ｖａｒ．ｃａｕｌｉｖｏｒａ）、Ｐｈｙｔｏｐｈｔｈｏｒａ腐敗病（Ｐｈｙｔｏｐｈｔｈｏｒａ ｍｅｇａｓｐｅｒｍａ）、落ち葉病（Ｐｈｉａｌｏｐｈｏｒａ ｇｒｅｇａｔａ）、Ｐｙｔｈｉｕｍ腐敗病（Ｐｙｔｈｉｕｍ ａｐｈａｎｉｄｅｒｍａｔｕｍ、Ｐｙｔｈｉｕｍ ｉｒｒｅｇｕｌａｒｅ、Ｐｙｔｈｉｕｍ ｄｅｂａｒｙａｎｕｍ、Ｐｙｔｈｉｕｍ ｍｙｒｉｏｔｙｌｕｍ、Ｐｙｔｈｉｕｍ ｕｌｔｉｍｕｍ）、Ｒｈｉｚｏｃｔｏｎｉａ根腐敗病、幹枯損および苗立ち枯れ病（Ｒｈｉｚｏｃｔｏｎｉａ ｓｏｌａｎｉ）、Ｓｃｌｅｒｏｔｉｎｉａ茎枯損（Ｓｃｌｅｒｏｔｉｎｉａ ｓｃｌｅｒｏｔｉｏｒｕｍ）、Ｓｃｌｅｒｏｔｉｎｉａ白絹病（Ｓｃｌｅｒｏｔｉｎｉａ ｒｏｌｆｓｉｉ）およびＴｈｉｅｌａｖｉｏｐｓｉｓ根腐敗病（Ｔｈｉｅｌａｖｉｏｐｓｉｓ ｂａｓｉｃｏｌａ）によって引き起こされる根および茎基部の真菌病。

【０３１２】

本発明の場合においては、望まれない微生物は植物病原性真菌および細菌を意味すると理解される。かくして、本発明による物質は、該病原体害虫からの感染に対する処理後ある期間以内に植物を保護するのに用いることができる。その保護が行われる期間は、一般に、活性な物質での植物の処理後１から１０日、好ましくは１から７日の範囲である。

【０３１３】
植物病の防除で必要な濃度での活性な物質の良好な植物許容性は、地上植物部分、植物および種子材料ならびに土壌の処置を可能とする。
【０３１４】
同時に、本発明による活性な物質は、例えば、Ｅｒｙｓｉｐｈｅ種に対する、Ｐｕｃｃｉｎｉａに対する、およびＦｕｓａｒｉａ種に対する穀物病、例えば、ＰｙｒｉｃｕｌａｒｉａおよびＲｈｉｚｏｃｔｏｎｉａに対するような米病、ならびに例えば、Ｂｏｔｒｙｔｉｓ－、Ｖｅｎｔｕｒｉａ－、Ｓｐｈａｅｒｏｔｈｅｃａ－およびＰｏｄｏｓｐｈａｅｒａ種に対するような、ブドウ栽培、果実成長および野菜栽培における病気の防除のために、特に良好な結果を伴って用いることができる。
【０３１５】
本発明による活性な物質は、収穫の収率を増大させるのにも適している。さらに、それらは低毒性のものであって、良好な植物許容性を呈する。
【０３１６】
本発明による化合物は、除草剤、毒性緩和剤、成長調節剤、または植物特性の改良のための剤として、あるいは殺微生物剤として、例えば、殺真菌剤、抗真菌剤、殺菌剤、（ウイロイドに対する剤を含めた）殺ウイルス剤として、あるいはＭＬＯ（マイコプラズマ様生物）およびＲＬＯ（リケッチア様生物）に対する剤として、ある濃度または適用投与量で用いてもよい。それらは、殺虫剤として用いてもよい。それらは、さらなる活性な物質の合成のための中間体または前駆体生成物として用いてもよい。
【０３１７】
本発明による活性な物質は、植物の成長に影響させるために、および動物害虫の防除のために、除草剤としてある濃度および適用投与量で用いてもよい。それらは、さらなる活性な物質の合成のための中間体または前駆体として用いてもよい。
【０３１８】
良好な植物許容性、低い哺乳動物毒性および良好な環境許容性を持つ本発明による活性な物質は、植物および植物器官の保護に、収穫の収率を増大させるのに、ならびに収穫された材料の品質を改良するのに適している。それらは、好ましくは、殺虫剤として用いることができる。それらは、通常、感受性および抵抗性種に対して、ならびに全てのまたはいくつかの発生段階に対して活性である。
【０３１９】
本発明による活性な物質または剤での植物および植物の部分の処理は、直接的に、あるいは通常の処理方法によって、例えば、ディッピング、散液、噴霧、灌漑、気化、散粉、ミスティング、飛散、発泡、コーティング、延展、どぶづけ、液滴灌漑および、また、生殖系材料、特に、種子については、乾燥ドレッシング、湿潤ドレッシング、スラリードレッシング、外皮形成（ｉｎｃｒｕｓｔａｔｉｏｎ）、単層または多層コーティングなどによって、植物および植物の部分の環境、生息地または貯蔵空間に作用させることによって行われる。また、超低用量プロセスによって活性な物質を適用し、または活性な物質の調製物もしくは活性な物質それ自体を土壌に噴出させるのも可能である。
【０３２０】
適用される活性な物質の量はかなりの範囲にわたって変化し得る。それは、本質的には、望まれる効果の性質に依存する。一般に、適用投与量は土壌領域ヘクタール当たり活性な物質の１ｇおよび１０ｋｇの間の、好ましくは、ｈａ当たり５ｇおよび５ｋｇの間にある。
【０３２１】
本発明による活性な物質の穀物植物許容性の有利な効果は、ある濃度比率で特に顕著である。しかしながら、活性な物質の組合せにおける活性な物質の重量比率は比較的大きな範囲にわたって変化し得る。一般に、（ｂ’）下で前記にて名称が挙げられた穀物植物許容性改良化合物（解毒剤／毒性緩和剤）のうちの１つの０．００１から１０００重量部、好ましくは、０．０１から１００重量部、特に好ましくは、０．０５から２０重量部が、

式（Ｉ）の活性な物質の１重量部について用いられる。
【０３２２】
本発明による活性な物質は、一般に、仕上げられた処方物の形態で用いられる。しかしながら、活性な物質の組合せに含有される活性な物質は適用に際して単一の処方物に混合することもでき、すなわち、タンク混合物の形態で適用することもできる。
【０３２３】
加えて、本発明による処理を通じて、収穫された材料、およびそれから生産された食品および飼料におけるマイコトキシン含有量は低下させることができる。ここで、以下のマイコトキシンが、特に限定されるものではないが名称が挙げられる。例えば、以下の真菌：とりわけ、Ｆｕｓａｒｉｕｍ ａｃｕｍｉｎａｔｕｍ、Ｆ．ａｖｅｎａｃｅｕｍ、Ｆ．ｃｒｏｏｋｗｅｌｌｅｎｓｅ、Ｆ．ｃｕｌｍｏｒｕｍ、Ｆ．ｇｒａｍｉｎｅａｒｕｍ（Ｇｉｂｂｅｒｅｌｌａ ｚｅａｅ）、Ｆ．ｅｑｕｉｓｅｔｉ、Ｆ．ｆｕｊｉｋｏｒｏｉ、Ｆ．ｍｕｓａｒｕｍ、Ｆ．ｏｘｙｓｐｏｒｕｍ、Ｆ．ｐｒｏｌｉｆｅｒａｔｕｍ、Ｆ．ｐｏａｅ、Ｆ．ｐｓｅｕｄｏｇｒａｍｉｎｅａｒｕｍ、Ｆ．ｓａｍｂｕｃｉｎｕｍ、Ｆ．ｓｃｉｒｐｉ、Ｆ．ｓｅｍｉｔｅｃｔｕｍ、Ｆ．ｓｏｌａｎｉ、Ｆ．ｓｐｏｒｏｔｒｉｃｈｏｉｄｅｓ、Ｆ．ｌａｎｇｓｅｔｈｉａｅ、Ｆ．ｓｕｂｇｌｕｔｉｎａｎｓ、Ｆ．ｔｒｉｃｉｎｃｔｕｍ、Ｆ．ｖｅｒｔｉｃｉｌｌｉｏｉｄｅｓによって、および、また、とりわけ、Ａｓｐｅｒｇｉｌｌｕｓ ｓｐｐ．、Ｐｅｎｉｃｉｌｌｉｕｍ ｓｐｐ．、Ｃｌａｖｉｃｅｐｓ ｐｕｒｐｕｒｅａまたはＳｔａｃｈｙｂｏｔｒｙｓ ｓｐｐ．によって引き起こされ得るデオキシミバレノール（ＤＯＮ）、ニバレノール、１５－Ａｃ－ＤＯＮ、３－Ａｃ－ＤＯＮ、Ｔ２－およびＨＴ２－トキシン、フモニシン、ゼアラレノン、モニリフォルミン、フサリン、ジアセトキシシルペノール（ＤＡＳ）、ボベリシン、エンニアチン、フサロプロリフェリン、フサレノール、エクラトキシン、パツリン、エルゴアルカロイドならびにアフラトキシン。
【０３２４】
さらに、本発明による活性な物質または剤は、例えば、真菌のような望まない微生物による感染および破壊に対する産業材料の保護のための材料保護で用いることができる。
【０３２５】
本発明においては、産業材料は、産業で用いるために調製された生きていない材料を意味すると理解されるべきである。例えば、微生物の腐敗または破壊に対する本発明による活性物質によって保護されることが意図される技術材料は接着剤、にかわ、紙および厚紙、テキスタイル、皮、木材、コーティング材料およびプラスチック製品、冷却潤滑剤、ならびに微生物によって感染または分解され得る他の材料であり得る。保護されるべき材料、生産植物の部分との関係では、例えば、微生物の増殖によって損なわれ得る冷却水ループを挙げることができる。本発明との関係では、好ましくは、接着剤、にかわ、紙および厚紙、テキスタイル、皮、木材、コーティング材料、冷却潤滑剤および熱移動流体、特に好ましくは、木材を産業材料として挙げることができる。本発明による活性な物質または剤は、腐敗、崩壊、変色、脱色またはカビ発生のような有害効果を妨げることができる。
【０３２６】
望まない真菌の防除のための本発明による方法は、いわゆる貯蔵商品の保護で用いることもできる。ここで、「貯蔵商品」は、自然から採取され、かつ長期間の保護が望まれる、天然の物質または植物もしくは動物起源、またはそれからの加工製品を意味すると理解される。例えば、葉柄、葉、塊茎、種子、果実、または穀類のような植物または植物の部分のような植物起源の貯蔵商品は、新たに収穫された状態で、あるいは（予備）乾燥、加湿、粉砕、ミリング、プレスまたは焙焼による加工後に保護することができる。貯蔵商品は、加工されていないか否かにかかわらず、全木材のような木材、電源ラインマストおよびボックスも含み、あるいは家具のような仕上げられた製品の形態である。動物起源の貯蔵商品は、例えば、毛皮、皮、フリースおよび毛状物である。本発明による活性な物質は腐敗、崩壊、変色、脱色またはカビ発生のような有害効果を妨げる。
【０３２７】

産業材料において分解または改変を引き起こし得る微生物としては、例えば、細菌、真菌、酵母、藻、ヘドロ生物の名称を挙げることができる。好ましくは、本発明による活性物質は真菌、特に、黴真菌、木質変色および木質破壊真菌（Ｂａｓｉｄｉｏｍｙｃｅｔｅｓ）に対しておよびヘドロ生物および藻に対して作用する。例えば、以下の属の微生物の名称を挙げることができる：Ａｌｔｅｒｎａｒｉａ ｔｅｎｕｉｓのようなＡｌｔｅｒｎａｒｉａ；Ａｓｐｅｒｇｉｌｌｕｓ ｎｉｇｅｒのようなＡｓｐｅｒｇｉｌｌｕｓ；Ｃｈａｅｔｏｍｉｕｍ ｇｌｏｂｏｓｕｍのようなＣｈａｅｔｏｍｉｕｍ；Ｃｏｎｉｏｐｈｏｒａ ｐｕｅｔａｎａのようなＣｏｎｉｏｐｈｏｒａ；Ｌｅｎｔｉｎｕｓ ｔｉｇｒｉｎｕｓのようなＬｅｎｔｉｎｕｓ；Ｐｅｎｉｃｉｌｌｉｕｍ ｇｌａｕｃｕｍのようなＰｅｎｉｃｉｌｌｉｕｍ；ｐｏｌｙｐｏｒｕｓ ｖｅｒｓｉｃｏｌｏｒのようなｐｏｌｙｐｏｒｕｓ；Ａｕｒｅｏｂａｓｉｄｉｕｍ ｐｕｌｌｕｌａｎｓのようなＡｕｒｅｏｂａｓｉｄｉｕｍ；Ｓｃｌｅｒｏｐｈｏｍａ ｐｉｔｙｏｐｈｉｌａのようなＳｃｌｅｒｏｐｈｏｍａ；Ｔｒｉｃｈｏｄｅｒｍａ ｖｉｒｉｄｅのようなＴｒｉｃｈｏｄｅｒｍａ；Ｅｓｃｈｅｒｉｃｈｉａ ｃｏｌｉのようなＥｓｃｈｅｒｉｃｈｉａ；Ｐｓｅｕｄｏｍｏｎａｓ ａｅｒｕｇｉｎｏｓａのようなＰｓｅｕｄｏｍｏｎａｓ；Ｓｔａｐｈｙｌｏｃｏｃｃｕｓ ａｕｒｅｕｓのようなＳｔａｐｈｙｌｏｃｏｃｃｕｓ。

【０３２８】

本発明は、本発明によるチエニルアミノピリジンの少なくとも１つを含む望まない微生物の防除のための剤に関する。これらは、好ましくは、農業的に使用できる添加剤、溶媒、担体物質、表面活性物質またはシンナーを含有する殺真菌剤である。

【０３２９】

本発明によると、担体物質は、活性な物質を良好な適用性のために、とりわけ、植物または植物の部分もしくは種子への適用のために混合または組み合わせる天然または合成、有機または無機物質を意味する。固体または液体であり得る担体物質は、一般に、不活性であって、農業で使用できるものとすべきである。

【０３３０】

可能な担体物質は：アンモニウム塩、およびカオリン、アルミナ、タルク、チョーク、石英、アタパルジャイト、モンモリロナイトまたは珪藻土のような天然鉱物粉末、ならびに高分散シリカ、酸化アルミニウムおよびシリケートのような合成鉱物粉末であり、顆粒のための可能な担体物質は、例えば：カルサイト、大理石、軽石、海泡石、ドロマイトのような破砕され分別された天然鉱物、無機および有機粉末からの合成顆粒、ならびに紙、鋸屑、ヤシ殻、トウモロコシ穂軸およびタバコ茎のような有機材料からの顆粒であり；可能な乳化剤または発泡剤は、例えば：ポリオキシエチレン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレン脂肪酸エーテル、例えば、アルキルアリールポリグリコールエーテル、アルキルスルホネート、アルキルスルフェート、アリールスルホネートおよび蛋白質加水分解物のような非イオン性およびアニオン性乳化剤であり；可能な分散剤は、例えば、アルコールＰＯＥおよび／またはＰＯＰエーテル、酸および／またはＰＯＰ－ＰＯＥエステル、アルキル－アリールおよび／またはＰＯＰ　ＰＯＥエーテル、脂肪および／またはＰＯＰ　ＰＯＥアダクト、ＰＯＥおよび／またはＰＯＰポリオール誘導体、ＰＯＥおよび／またはＰＯＰソルビタンまたは糖アダクト、アルキルまたはアリールスルフェート、スルホネートおよびホスフェート、または対応するＰＯエーテルアダクトのクラスからの非イオン性および／またはイオン性物質である。また、例えば、ビニル性モノマーから、アクリル酸から、ＥＯおよび／またはＰＯ単独、または例えば（ポリ－）アルコールまたは（ポリ－）アミンと組み合わせたＥＯおよび／またはＰＯから出発した、適当なオリゴマーまたはポリマー。さらに、リグニンおよびそのスルホン酸誘導体、単純なおよび修飾されたセルロース、芳香族および／または脂肪族スルホン酸ならびにホルムアルデヒドとのそのアダクトを用いることができる。

【０３３１】

活性な物質は、溶液、エマルジョン、湿潤性粉末、水および油系懸濁液、粉末、ダスティング剤、ペースト、可溶性粉末、可溶性顆粒、展延のための顆粒、懸濁エマルジョン濃

縮物、活性物質を含浸させた天然物質、活性物質含浸合成物質、肥料ならびにポリマー物質中への超微細カプセル化のような通常の処方物に変換することができる。

【０３３２】

活性な物質は、それ自体、直ぐに使える溶液、エマルジョン、水または油系懸濁液、粉末、湿潤性粉末、ペースト、可溶性粉末、ダスティング剤、可溶性顆粒、展延のための顆粒、懸濁エマルジョン濃縮物、活性な物質含浸天然物質、活性物質含浸合成物質、肥料およびポリマー物質中の超微細カプセル化のような、その処方物、またはそれから調製された使用形態で適用することができる。該適用は、通常の方法で、例えば、どぶづけ、散液、噴霧、飛散、ダスティング、発泡、コーティングなどによって行われる。また、活性な物質を超低容量のプロセスによって適用し、または活性な物質の調製物もしくは活性な物質それ自体を土壌へ噴出させることも可能である。植物の種子を処理することもできる。

【０３３３】

該処方物はそれ自体公知の方法で、例えば、活性な物質を少なくとも１つの通常のシンナー、溶媒または希釈剤、乳化剤、分散および／または結合または固定剤、湿潤剤、撥水剤、必要であれば、乾燥材、ＵＶ安定化剤、および、必要であれば、染料および顔料、脱泡剤、保存剤、二次増粘剤、にかわ、ジベレリンおよび他の加工添加剤と混合することによって調製することができる。

【０３３４】

本発明による剤は、既に用いる用意ができた、かつ適当な装置で植物または種子に適用することができる処方物のみならず、使用前に水で希釈しなければならない商業的濃縮物を含む。

【０３３５】

本発明による活性な物質は、それ自体で、あるいはその（通常の商業的）処方物にて、および、殺虫剤、誘引剤、滅菌剤、殺菌剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺真菌剤、成長調節剤、除草剤、肥料、毒性緩和剤または情報化学物質と混合されたこれらの処方物から調製された使用形態で存在させることができる。

【０３３６】

添加剤としては、ある種の技術的特性および／または特殊な生物学的特性さえのような、剤それ自体および／またはそれから誘導された調製物（例えば、湿潤性粉末、シードドレッシング）に特定の特性を付与するのに適した物質を用いることができる。シンナー、溶媒および担体物質は、典型的な可能な添加剤である。

【０３３７】

水、例えば、（パラフィン、アルキルベンゼン、アルキルナフタレン、クロロベンゼンのような）芳香族および非芳香族炭化水素、（置換されたエーテル化および／またはエステル化されていてもよい）アルコールおよびポリオール、（アセトン、シクロヘキサノンのような）ケトン、エステル（また、油脂）および（ポリ－）エーテル、単純な置換されたアミン、アミド、（Ｎ－アルキルピロリドンのような）ラクタムおよびラクトン、スルホンおよび（ジメチルスルホキシドのような）スルホキシドのクラスからの極性および非極性有機化学的液体は、例えば、シンナーとして適当である。

【０３３８】

液化ガスシンナーまたは担体物質とは、常温で常圧下でガス状である液体、例えば、ハロ炭化水素およびブタン、プロパン、窒素および二酸化炭素のようなアエロゾル・プロペラント・ガスを意味する。

【０３３９】

処方物において、カルボキシメチルセルロースのような接着剤、天然および合成粉末、アラビアガム、ポリビニルアルコール、ポリ酢酸ビニルのような顆粒状またはラテックスポリマーならびにセファリンおよびレシチンのような天然リン脂質、ならびに合成リン脂質を用いることができる。他の添加剤は鉱物および植物油であり得る。

【０３４０】

水のシンナーとしての使用の場合には、例えば、有機溶媒を補助的な溶媒として用いる

こともできる。本質的には、可能な液体溶媒は：キシレン、トルエンまたはアルキルナフタレンのような芳香族、クロロベンゼン、クロロエチレンまたは塩化メチレンのような塩素化芳香族または塩素化脂肪族炭化水素、シクロヘキサンまたはパラフィンのような脂肪族炭化水素、例えば、石油分画物、ブタノールまたはグリコールおよびそのエーテルおよびエステルのようなアルコール、アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトンまたはシクロヘキサノンのようなケトン、ジメチルホルムアミドおよびジメチルスルホキシドのような強く極性の溶媒ならびに水である。

【０３４１】

本発明による剤は、加えて、例えば、表面活性物質のような他の成分を含有することができる。可能な表面活性物質は、イオン性または非イオン性特性を持つ、乳化および／もしくは発泡剤、分散剤もしくは湿潤剤、またはこれらの表面活性物質の混合物である。これらの例はポリアクリル酸の塩、リグノスルホン酸の塩、フェノールスルホン酸またはナフタレンスルホン酸の塩、エチレンオキサイドと、脂肪アルコールとの、または脂肪酸との、または脂肪アミンとの重縮合物、置換されたフェノール（好ましくは、アルキルフェノールまたはアリールフェノール）、スルホコハク酸エステルの塩、タウリン誘導体（好ましくは、タウリン酸アルキル）、ポリエトキシル化アルコールまたはフェノールのホスフェートエステル、ポリオールの脂肪酸エステル、ならびにスルフェート、スルホネートおよびホスフェートを含有する化合物の誘導体、例えば、アルキルアリールポリグリコールエーテル、アルキルスルホネート、アルキルスルフェート、アリールスルホネート、蛋白質加水分解物、リグニンスルファイト廃棄液ならびにメチルセルロースである。表面活性物質の存在は、活性な物質の１つおよび／または不活性な担体物質の１つが水に可溶性でない場合、ならびに適用が水中で行われる場合に必要である。表面活性物質の割合は、本発明による剤の５および４０重量パーセントの間にある。

【０３４２】

無機顔料、例えば、酸化鉄、酸化チタン、プルシャンブルー、ならびにアリザリン、アゾおよび金属フタロシアニン染料のような有機染料のような着色剤、ならびに鉄、マンガン、ホウ素、銅、コバルト、モリブデンおよび亜鉛の塩のような微量栄養素を用いることができる。

【０３４３】

さらなる添加剤は、香料、鉱物または修飾されていてもよい植物油、ワックス、ならびに鉄、マンガン、ホウ素、銅、コバルト、モリブデンおよび亜鉛の塩のような（微量栄養素を含めた）栄養素であり得る。

【０３４４】

冷安定化剤、保存剤、抗酸化剤、光保護材または他の化学的および／もしくは物理的安定性を改良する剤のような安定化剤を含有させることもできる。

【０３４５】

他のさらなる成分、例えば、保護コロイド、バインダー、接着剤、増粘剤、チクソトロピー物質、浸透促進剤、安定化剤、隔離剤および複合化剤を含有させてもよい。一般に、活性な物質は、処方目的で通常用いられるいずれかの固体または液体添加剤と合わせることができる。

【０３４６】

処方は、一般に、０．０５および９９ｗｔ％の間、０．０１および９８ｗｔ％の間、好ましくは、０．１および９５ｗｔ％の間、特に好ましくは、０．５および９０％の間の活性な物質、かなり特に好ましくは、１０および７０重量パーセントの間を含有する。

【０３４７】

前記した処方物は、望まない微生物の防除のために本発明による方法で用いることができ、ここで、本発明によるチエニルアミノピリミジンは微生物および／またはその生息地に適用される。

【０３４８】

本発明による活性な物質は、それ自体、あるいはかくして、例えば、活性スペクトルを

広げ、または抵抗性の発生を回避するために、公知の殺真菌剤、殺菌剤、殺ダニ剤、殺線虫剤または殺虫剤と混合したその処方物にて用いることもできる。

【０３４９】

可能な混合パートナーは、例えば、公知の殺真菌剤、殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、または殺菌剤である（また、Ｐｅｓｔｉｃｉｄｅ　Ｍａｎｕａｌ，第１３版参照）。

【０３５０】

除草剤のような他の公知の活性な物質との、または肥料および成長調節剤、毒性緩和剤または情報化学物質との混合物も可能である。

【０３５１】

適用は、使用形態に適した方法で行われる。

【０３５２】

植物病原性有害真菌の防除を、土壌および地上植物部分の殺害虫剤での処理によってまず最初に行う。環境、ならびに人々および動物の健康に対する殺害虫剤の可能な効果についての関心のため、適用される活性な物質の量を低下させる努力がなされる。

【０３５３】

活性な物質は、それ自体、その処方物の形態で、または直ぐに使用できる溶液、懸濁液、湿潤可能粉末液、ペースト、可溶性粉末、ダスティング剤および顆粒のようなそれから調製された使用形態で適用することができる。適用は、通常の方法で、例えば、どぶづけ、散液、噴霧、飛散、ダスティング、発泡、コーティングなどによって行われる。また、超低容量プロセスによって活性物質調製物もしくは活性物質それ自体を適用し、または活性物質調製物もしくは活性物質それ自体を土壌に噴出させるのも可能である。植物の種子を処理することもできる。

【０３５４】

適用の態様に従って、殺真菌剤としての本発明による活性な物質を用いるにおいて、適用投与量はかなりの範囲内で変化させることができる。本発明による活性物質の適用投与量は：

植物の部分、例えば、葉の処理においては：０．１から１０，０００ｇ／ｈａ、好ましくは１０から１，０００ｇ／ｈａ、特に好ましくは５０から３００ｇ／ｈａ（どぶづけまたはドリッピングによる適用では、適用投与量は、特に、岩綿またはパーライトのような不活性な基材を用いる場合には低下させることさえできる）；

種子処理においては：１００ｋｇ種子当たり２から２００ｇ、好ましくは１００ｋｇ種子当たり３から１５０ｇ、特に好ましくは１００ｋｇ種子当たり２．５から２５ｇ、かなり特に好ましくは１００ｋｇ種子当たり２．５から１２．５ｇ；

土壌処理においては：０．１から１０，０００ｇ／ｈａ、好ましくは１から５，０００ｇ／ｈａである。

【０３５５】

これらの適用投与量は、例としてのみかつ非限定的に本発明の意味で述べられている。

【０３５６】

同時に、本発明による化合物は、物体、特に、海水または塩気がある水と接触する、船体、ふるい、ネット、ビルディング、ワーブおよび信号設置に対する成長からの保護で用いることができる。

【０３５７】

さらに、本発明による化合物は単独で、または防汚剤としての他の活性な物質と組み合わせて用いることができる。

【０３５８】

本発明による処理方法は、遺伝子的に修飾された生物（ＧＭＯ）、例えば、植物または種子の処理で用いることができる。遺伝子的に修飾された植物（またはトランスジェニック植物）は異種遺伝子がゲノムに安定に組み込まれている植物である。用語「異種遺伝子」は、本質的には、植物の外側で調製され、または組み立てられ、導入に際して、細胞の核ゲノム、葉緑体ゲノムまたはヒポコンドリアゲノムに導入され、それにより、（例えば

、アンチセンス技術、共抑制技術またはＲＮＡｉ技術［ＲＮＡ干渉］によって）形質転換された植物に新しいまたは改良された農学的または他の特性を付与し、それは注目する蛋白質もしくはポリペプチドを発現し、またはそれは植物に存在するもう１つの遺伝子、もしくは植物に存在する他の遺伝子をダウンレギュレートし、もしくはスイッチオフする遺伝子を意味する。ゲノムに存在する異種遺伝子は導入遺伝子とも記載される。植物ゲノムにおけるその特異的存在によって規定される導入遺伝子は、形質転換またはトランスジェニック事象として記載される。

【０３５９】

植物種または植物品種、その位置および成長条件（土壌、気候、生育期、栄養）に依存して、本発明による処理は超相加的（「相乗的」）効果に導くこともできる。かくして、例えば、予測されると厳密に言われる効果を超える以下の効果：減少した適用投与量ならびに／または拡大された活性スペクトルならびに／または本発明によって用いることができる活性物質のおよび組成物の増大した有効性、良好な植物の成長、高温または低温忍耐する増大した許容性、干ばつまたは水もしくは土壌の塩含有量に対する増大した許容性、増加した開花、収穫のより大きな容易性、加速された成熟、より高い収率、より大きな果実、より大きな植物の高さ、葉のより強い緑色、より早い開花、収穫された産物のより高い品質および／またはより高い栄養価、果実中のより高い糖濃度、ならびに収穫された産物の良好な貯蔵性および／または加工性が可能である。

【０３６０】

本発明の場合、望まない植物病原性真菌および／または微生物および／またはウイルスは、植物病原性、真菌、細菌、およびウイルスを意味すると理解される。従って、本発明による物質は、該処理後のある期間内の該病原体による感染に対する植物の保護で用いることができる。保護作用が達成される期間は、活性物質での植物の処理後１から１０日、好ましくは１から７日にわたる。

【０３６１】

本発明に従って、好ましくは処理される植物および植物品種は、（これが育種および／またはバイオテクノロジーによって達成されるか否かにかかわらず）これらの植物に、特に有利な有用な特徴を付与する遺伝物質を有する全ての植物を含む。

【０３６２】

同様に、好ましくは、本発明に従って処理される植物および植物品種は、１以上の生物的ストレス因子に対して抵抗性であり、すなわち、これらの植物は線虫、昆虫、ダニ、植物病原性真菌、細菌、ウイルスおよび／またはウイロイドのような動物および微生物害虫に対して改良された防御を有する。

【０３６３】

本発明に従ってやはり処理することができる植物および植物品種は、１以上の非生物的ストレス因子に対して抵抗性の植物である。非生物的ストレス因子は、例えば、乾燥状態、冷および熱条件、浸透圧、湿地状態、増大した土壌塩含有量、鉱物に対する増大した暴露、オゾン状態、強い光状態、窒素性栄養素の限定された利用性、リン栄養素の限定された利用性または影の回避を含むことができる。

【０３６４】

本発明によりやはり処理することができる植物および植物品種は、増大した収率の特性によって特徴付けられる植物である。これらの植物では、増大した収率は、例えば、水利用効率、水保持効率、改良された窒素利用、増大した炭素同化、改良された植物合成、強められた生命力および加速された成熟のような、改良された植物生理学、改良された植物成長および改良された植物発生によるものであり得る。さらに、該収率は、早い開花、ハイブリッド種子の生産のための開花の制御、実生活力、植物のサイズ、節間数および空間、根成長、種子サイズ、果実のサイズ、鞘サイズ、鞘または穂の数、種子質量、強められた種子充填、減少した種子損失、減少した鞘破裂および倒伏抵抗性を含めた、改良された植物アーキテクチャーによって（ストレスおよび非ストレス条件下で）影響され得る。さらなる収率特徴は、炭水化物含有量、蛋白質含有量、油含有量および油組成のような種子

組成、栄養価、抗栄養素化合物の低下、改良された加工性および改良された貯蔵性を含む。

【０３６５】

本発明により処理することができる植物は、既にヘテロシスまたはハイブリッド効果の特性を発現し、一般に、より高い収率、より大きな活力、良好な健康、および生物的および非生物的ストレス因子に対する良好な抵抗性をもたらすハイブリッド植物である。そのような植物は、典型的には、近親交配の花粉不稔親系（雌交配パートナー）をもう１つの近親交配花粉稔性親系（雄交配パートナー）と交配することによって作られる。ハイブリッド種子は、典型的には、花粉不稔植物から収穫され、育種者に販売される。花粉不稔植物は、時々（例えば、トウモロコシについて）、雄穂除去（すなわち、雄生殖器官または雄花の機械的な除去）によって生産することができ；しかしながら、花粉不稔性は、植物ゲノム中の遺伝的決定因子によるのがより通常である。この場合、特に、望まれる産物が種子である場合、それはハイブリッド植物から収穫するのが望まれるので、通常、花粉稔性が、花粉不稔性の原因である遺伝決定因子を含有するハイブリッド植物において十分に回復されるのを確実とするのが有益である。これは、雄交配パートナーが、花粉不稔性の原因である遺伝決定因子を含有するハイブリッド植物において花粉稔性を回復することができる対応する稔性回復遺伝子を保有するのを確実とすることによって達成することができる。花粉不稔性についての遺伝的決定因子は細胞質に位置させることができる。細胞質花粉不稔性（ＣＭＳ）の例は、例えば、アブラナ（Ｂｒａｓｓｉｃａ）種について記載されている。しかしながら、花粉不稔性についての遺伝的決定因子は、細胞核ゲノムに位置させることもできる。花粉不稔性植物は、遺伝子工学のような植物バイオテクノロジー方法で得ることもできる。花粉不稔性植物の創成のための特に好都合な手段は国際公開第８９／１０３９６号に記載されており、そこでは、例えば、バルナーゼのようなリボヌクレアーゼが雄蕊中のタペート細胞で選択的に発現される。稔性は、タペート細胞中のバルスターのようなリボヌクレアーゼ阻害剤の発現によって回復することができる。

【０３６６】

本発明に従って処理することができる（遺伝子工学のような植物バイオテクノロジー方法によって得られる）植物または植物品種は、除草剤耐性植物、すなわち、１以上の特定の除草剤に対して耐性とされた植物である。そのような植物は遺伝的形質転換によって、またはそのような除草剤耐性を付与する突然変異を含有する植物の選択によって得ることができる。

【０３６７】

除草剤耐性植物は、例えば、グリフォセート耐性植物、すなわち、除草剤グリフォセートまたはその塩に対して耐性とされた植物である。かくして、例えば、グリフォセート耐性植物は、該植物の酵素５－エノール－ピリビルシキミ酸３－ホスフェートシンターゼ（ＥＰＳＰＳ）をコードする遺伝子での形質転換によって得ることができる。そのようなＥＰＳＰＳ遺伝子の例は、細菌Ｓａｌｍｏｎｅｌｌａ ｔｙｐｈｉｍｕｒｉｕｍのＡｒｏＡ遺伝子（突然変異体ＣＴ７）、細菌Ａｇｒｏｂａｃｔｅｒｉｕｍ ｓｐ．のＣＰ４遺伝子、およびペチュニアからのＥＰＳＰＳ、トマトからのＥＰＳＰＳ、またはオヒシバ属からのＥＰＳＰＳをコードする遺伝子である。それは突然変異したＥＰＳＰＳでもあり得る。グリフォセート耐性植物は、グリフォセートオキシドレダクターゼ酵素をコードする遺伝子を発現させることによって得ることもできる。グリフォセート耐性植物は、グリフォセートアセチルトランスフェラーゼ酵素をコードする遺伝子を発現させることによって得ることができる。グリフォセート耐性植物は、前記した遺伝子の天然に生じる突然変異を持つ植物を選択することによって得ることができる。

【０３６８】

他の除草剤抵抗性植物は、例えば、ビアラフォス、ホスフィノトリシンまたはグルフォシネートのような酵素グルタミンシンターゼを阻害する除草剤に対して耐性とされている植物である。そのような植物は、該除草剤を解毒する酵素を発現させることによって得ることができるか、あるいは阻害に対して抵抗性である酵素グルタミンシンターゼの突然変

異体である。そのような効果的な解毒酵素は、例えば、（例えば、Ｓｔｒｅｐｔｏｍｙｃｅｓ種からのＢＡＲまたはＰＡＴ蛋白質のような）ホスフィノトリシンアセチルトランスフェラーゼをコードする酵素である。外因性ホスフィノトリシンアセチルトランスフェラーゼを発現する植物は記載されている。

【０３６９】

また、さらなる除草剤耐性植物は、酵素ヒドロキシフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼ（ＨＰＰＤ）を阻害する除草剤に対して耐性とされている植物である。ヒドロキシフェニル－ピルビン酸ジオキシゲナーゼは、パラ－ヒドロキシフェニルピルベート（ＨＰＰ）がホモゲンチセートに変換される反応を触媒する酵素である。ＨＰＰＤ阻害剤に対して耐性である植物を、天然に生じる抵抗性ＨＰＰＤをコードする遺伝子、または突然変異したＨＰＰＤ酵素をコードする遺伝子で形質転換することができる。ＨＰＰＤ阻害剤に対する耐性は、植物を、ＨＰＰＤ阻害剤による天然ＨＰＰＤ酵素の阻害にかかわらずホモゲンチセートの形成を可能とするある種の酵素をコードする遺伝子で形質転換することによって達成することもできる。ＨＰＰＤ阻害剤に対する植物の耐性は、植物を、ＨＰＰＤ耐性酵素をコードする遺伝子に加えて、プレフェン酸デヒドロゲナーゼ酵素をコードする遺伝子で形質転換することによって改良することもできる。

【０３７０】

他の除草剤抵抗性植物は、アセト乳酸シンターゼ（ＡＬＳ）阻害剤に対して耐性とされている植物である。公知のＡＬＳ阻害剤は、例えば、スルホニル尿素、イミダゾリノン、トリアゾロピリミジン、ピリミジニルオキシ（チオ）ベンゾエートおよび／またはスルホニルアミノカルボニルトリアゾリノン除草剤を含む。（アセトヒドロキシ酸シンターゼ、ＡＨＡＳとしても知られた）酵素ＡＬＳにおける種々の突然変異は、異なる除草剤または除草剤の群に対して耐性を付与することは知られている。スルホニル尿素耐性植物およびイミダゾリノン耐性植物の生産は、国際公開国際公開第９６／０３３２７０号に記載されている。他のスルホニル尿素およびイミダゾリノン耐性植物もまた、例えば、国際公開第０７／０２４７８２号に記載されている。

【０３７１】

イミダゾリノンに対して耐性であるおよび／またはスルホニル尿素耐性である他の植物は、誘導された突然変異誘発、除草剤の存在下での細胞培養の選択によって、または突然変異育種によって得ることができる。

【０３７２】

本発明によってやはり処理することができる（遺伝子工学のような植物バイオテクノロジー方法によって得られた）植物または植物品種は昆虫抵抗性トランスジェニック植物、すなわち、ある種の標的昆虫による感染に対して抵抗性とされている植物である。そのような植物は遺伝的形質転換によって、あるいはそのような昆虫抵抗性を付与する突然変異を含有する植物の選択によって得ることができる。

【０３７３】

本発明の関係では、用語「昆虫抵抗性トランスジェニック植物」は、以下のものをコードするコーディング配列を含有する少なくとも１つの導入遺伝子を含有するいずれの植物も含む：

１）記載され、ｈｔｔｐ：／／ｗｗｗ．ｌｉｆｅｓｃｉ．ｓｕｓｓｅｘ．ａｃ．ｕｋ／Ｈｏｍｅ／Ｎｅｉｌ＿Ｃｒｉｃｋｍｏｒｅ／Ｂｔ／においてオンライン編集された殺虫性結晶性蛋白質、その殺虫性部分、例えば、Ｃｒｙ蛋白質クラスＣｒｙ１Ａｂ、Ｃｒｙ１Ａｃ、Ｃｒｙ１Ｆ、Ｃｒｙ２Ａｂ、Ｃｒｙ３ＡｅもしくはＣｒｙ３Ｂｂの蛋白質またはその殺虫性部分のようなＢａｃｉｌｌｕｓ　ｔｈｕｒｉｎｇｉｅｎｓｉｓからの殺虫性結晶性蛋白質またはその殺虫性部分；または

２）結晶性蛋白質Ｃｙ３４およびＣｙ３５よりなる、バイナリートキシンのような、Ｂａｃｉｌｌｕｓ　ｔｈｕｒｉｎｇｉｅｎｓｉｓ以外の第二の結晶性蛋白質またはその部分の存在下で、殺虫作用を有するＢａｃｉｌｌｕｓ　ｔｈｕｒｉｎｇｉｅｎｓｉｓからの結晶性蛋白質またはその部分；または

３）例えば、前記１）からの蛋白質のハイブリッド、前記２）からの蛋白質のハイブリッド、例えば、トウモロコシ事象ＭＯＮ９８０３４（国際公開第０７／０２７７７７号）によって生産される蛋白質Ｃｒｙ１Ａ．１０５のような、Ｂａｃｉｌｌｕｓ　ｔｈｕｒｉｎｇｉｅｎｓｉｓからの２つの異なる殺虫性結晶性蛋白質の部分を含む殺虫性ハイブリッド蛋白質；または

４）トウモロコシ事象ＭＯＮ８６３またはＭＯＮ８８０１７における蛋白質Ｃｒｙ３Ｂｂ１、またはトウモロコシ事象ＭＩＲ６０４における蛋白質Ｃｒｙ３Ａのような、前記ポイント１）から３）のうちの１つによる蛋白質、ここで、標的昆虫種に対するより高い殺虫活性を達成するために、および／または関連標的昆虫種のスペクトルを広くするために、および／またはクローニングもしくは形質転換の間にクローニングＤＮＡで誘導された変化のため、いくつかの、特に１から１０のアミノ酸がもう１つのアミノ酸によって置き換えられている；

５）ｈｔｔｐ：／／ｗｗｗ．ｌｉｆｅｓｃｉ．ｓｕｓｓｅｘ．ａｃ．ｕｋ／Ｈｏｍｅ／Ｎｅｉｌ＿Ｃｒｉｃｋｍｏｒｅ／Ｂｔ／ｖｉｐ．ｈｔｍｌ下でリストされた、植物性に作用する昆虫毒性蛋白質（植物性殺虫性蛋白質、ＶＩＰ）、例えば、蛋白質クラスＶＩＰ３Ａａの蛋白質のようなＢａｃｉｌｌｕｓ　ｔｈｕｒｉｎｇｉｅｎｓｉｓまたはＢａｃｉｌｌｕｓ　ｃｅｒｅｕｓからの殺虫性の分泌された蛋白質またはその殺虫性部分；または

６）蛋白質ＶＩＰ１ＡおよびＶＩＰ２Ａよりなるバイナリートキシンのような、Ｂａｃｉｌｌｕｓ　ｔｈｕｒｉｎｇｉｅｎｓｉｓまたはＢａｃｉｌｌｕｓ　ｃｅｒｅｕｓからの第二の分泌された蛋白質の存在下で、殺虫作用を有するＢａｃｉｌｌｕｓ　ｔｈｕｒｉｎｇｉｅｎｓｉｓまたはＢ．ｃｅｒｅｕｓからの分泌された蛋白質；または

７）１）からの蛋白質のハイブリッドまたは、前記２）からの蛋白質のハイブリッドのような、Ｂａｃｉｌｌｕｓ　ｔｈｕｒｉｎｇｉｅｎｓｉｓまたはＢａｃｉｌｌｕｓ　ｃｅｒｅｕｓからの種々の分泌された蛋白質の部分を含む殺虫性ハイブリッド蛋白質；または

８）綿事象ＣＯＴ１０２における蛋白質ＶＩＰ３Ａａのような、前記ポイント１）から３）のうちの１つによる蛋白質、ここで、標的昆虫種に対するより高い殺虫活性を達成するために、および／または関連標的昆虫種のスペクトルを広くするために、および／またはクローニングもしくは形質転換の間にコーディングＤＮＡで誘導された変化のため（ここで、殺虫性蛋白質についてのコーディングは保持されている）、いくつか、特に１から１０のアミノ酸はもう１つのアミノ酸によって置き換えられている。

【０３７４】

当然、本発明の関係での昆虫抵抗性トランスジェニック植物は、前記したクラス１から８のうちの１つからの蛋白質をコードする遺伝子の組合せを含有するいずれかの植物をやはり含む。１つの実施態様において、昆虫抵抗性植物は、同一標的昆虫種に対して殺虫性であるが、昆虫における異なる受容体結合部位への結合のように、異なる作用態様を有する種々の蛋白質を導入することによって、関連標的昆虫種のスペクトルを広げるために、または植物に対する昆虫の抵抗性の発生を遅らせるために、前記１から８のうちの１つによる蛋白質をコードする１を超える導入遺伝子を含有する。

【０３７５】

本発明に従ってやはり処理することができる（遺伝子工学のような植物バイオテクノロジー方法によって得られた）植物または植物品種は、非生物的ストレス因子に対して耐性である。そのような植物は、遺伝的形質転換によって、またはそのようなストレス抵抗性を付与する突然変異を含有する植物の選択によって得ることができる。ストレス耐性を持つ特に有用な植物は以下のものを含む：

ａ．植物細胞または植物においてポリ（ＡＤＰリボース）ポリメラーゼ（ＰＡＲＰ）についての遺伝子の発現および／または活性を低下させることができる導入遺伝子を含有する植物。

【０３７６】

ｂ．ＰＡＲＧをコードする植物または植物細胞の遺伝子の発現および／または活性を低下させることができるストレス耐性促進導入遺伝子を含有する植物；

ｃ．ニコチンアミダーゼ、ニコチン酸ホスホリボシルトランスフェラーゼ、ニコチン酸モノヌクレオチドアデニルトランスフェラーゼ、ニコチンアミドアデニンジヌクレオチドシンテターゼまたはニコチンアミドホスホリボシルトランスフェラーゼを含めた、植物におけるニコチンアミドアデニンジヌクレオチドサルベージ生合成の酵素をコードするストレス耐性促進導入遺伝子を含有する植物。

【０３７７】

本発明に従ってやはり処理することができる（遺伝子工学のような植物バイオテクノロジー方法によって得られた）植物または植物品種は、例えば以下のような、収穫された産物の修飾された量、質および／もしくは貯蔵性、ならびに／または収穫された産物のある種の成分の修飾された特性を呈する：

１）この修飾された澱粉がある種の適用でより良好に適するように、野生型細胞または植物で合成された澱粉と比較して、その化学的および物理的特性、特に、アミロース含有量またはアミロース／アミロペクチン比率、分岐の程度、平均鎖長さ、側鎖の分布、粘度挙動、ゲル強度、澱粉粒サイズおよび／または澱粉形態に関して修飾された、修飾された澱粉を合成するトランスジェニック植物。

【０３７８】

２）非澱粉炭水化物ポリマー、またはその特性が遺伝子修飾を持たない野生型植物と比較して修飾された非澱粉炭水化物ポリマーを合成するトランスジェニック植物。その例は、特に、イヌリンおよびレバンタイプのポリフルクトースを生産する植物、アルファ－１，４－グルカンを生産する植物、アルファ－１，６－分岐アルファ－１，４－グルカンを生産する植物、ならびにアルテルナンを生産する植物である。

【０３７９】

３）ヒアルロナンを生産するトランスジェニック植物。

【０３８０】

本発明に従ってやはり処理することができる（遺伝子工学のような植物バイオテクノロジー方法によって得られた）植物または植物品種は、修飾された繊維特性を持つ綿植物のような植物である。そのような植物は、遺伝的形質転換によって、またはそのような修飾された繊維特性を付与する突然変異を含有する植物の選択によって得ることができ；これらは以下を含む：

ａ）修飾された形態またはセルロースシンターゼ遺伝子を含有する綿植物のような植物；

ｂ）ｒｓｗ２またはｒｓｗ３相同核酸の修飾された形態を含有する綿植物のような植物；

ｃ）サッカロースホスフェートシンターゼの増大した発現を持つ綿植物のような植物；

ｄ）サッカロースシンターゼの増大した発現を持つ綿植物のような植物；

ｅ）原形質連絡の浸透性制御のタイミングが、例えば、繊維選択的β－１，３－グルカナーゼのダウンレギュレーションによって、繊維細胞に基づいて修飾された綿植物のような植物；

ｆ）例えば、ｎｏｄＣも含めたＮ－アセチルグルコサミントランスフェラーゼ遺伝子、およびキチンシンターゼ遺伝子の発現によって、修飾された反応性を持つ繊維を持つ綿植物のような植物。

【０３８１】

本発明に従ってやはり処理することができる（遺伝子工学のような植物バイオテクノロジー方法によって得られた）植物または植物品種は、修飾された油組成特性を持つアブラナまたは関連アブラナ属（Ｂｒａｓｓｉｃａ）植物のような植物である。そのような植物は遺伝的形質転換によって、またはそのような修飾された油特性を付与する突然変異を含有する植物の選択によって得ることができ；それらは以下のものを含む：

ａ）高いオレイン酸含有量を持つ油を生産するアブラナ植物のような植物；

ｂ）低いリノレン酸含有量を持つ油を生産するアブラナ植物のような植物；

ｃ）低い飽和脂肪酸含有量を持つ油を生産するアブラナ植物のような植物。

【０３８２】
本発明に従って処理することができる特に有用なトランスジェニック植物は１以上のトキシンをコードする１以上の遺伝子を持つ植物であり、以下の商品名下で販売されているトランスジェニック植物である：ＹＩＥＬＤ ＧＡＲＤ（登録商標）（例えば、トウモロコシ、綿、大豆）、ＫｎｏｃｋＯｕｔ（登録商標）（例えば、トウモロコシ）、ＢｉｔｅＧａｒｄ（登録商標）（例えば、トウモロコシ）、ＢＴ－Ｘｔｒａ（登録商標）（例えば、トウモロコシ）、ＳｔａｒＬｉｎｋ（登録商標）（例えば、トウモロコシ）、Ｂｏｌｌｇａｒｄ（登録商標）（綿）、Ｎｕｃｏｔｎ（登録商標）（綿）、Ｎｕｃｏｔｎ３３Ｂ（登録商標）（綿）、ＮａｔｕｒｅＧａｒｄ（登録商標）（例えば、トウモロコシ）、Ｐｒｏｔｅｃｔａ（登録商標）およびＮｅｗＬｅａｆ（登録商標）（ジャガイモ）。言及すべき除草剤耐性植物は、例えば、以下の商品名下で販売されているトウモロコシ品種、綿品種および大豆品種である：Ｒｏｕｎｄｕｐ Ｒｅａｄｙ（登録商標）（グリフォセート耐性、例えば、トウモロコシ、綿、大豆）、Ｌｉｂｅｒｔｙ Ｌｉｎｋ（登録商標）（ホスフィノトルシン耐性、例えば、アブラナ）、ＩＭＩ（登録商標）（イミダゾリノン耐性）およびＳＣＳ（登録商標）（スルホニル尿素耐性）、例えば、トウモロコシ。言及すべき除草剤抵抗性植物（除草剤耐性について伝統的に育種された植物）は名称Ｃｌｅａｒｆｉｅｌｄ（登録商標）（例えば、トウモロコシ）下で販売されている品種を含む。

【０３８３】
本発明に従って処理することができる特に有用なトランスジェニック植物は、形質転換事象、または形質転換事象の組合せを含有し、例えば、種々の国内または地方の当局のデータベースにリストされた植物である（例えば、ｈｔｔｐ：／／ｇｍｏｉｎｆｏ．ｊｒｃ．ｉｔ／ｇｍｐ＿ｂｒｏｗｓｅ．ａｓｐｘおよびｈｔｔｐ：／／ｗｗｗ．ａｇｂｉｏｓ．ｃｏｍ／ｄｂａｓｅ．ｐｈｐ参照）。

【０３８４】
リストされた植物は、一般式（Ｉ）のｄｅｎ化合物で本発明に従って特に有利に処理することができる。活性な物質または混合物について先に述べた選択範囲はこれらの植物の処理にやはり適用される。本テキストに具体的にリストされた化合物または混合物での植物の処理は特に強調することができる。

【０３８５】
本発明による活性な物質または剤を用いて、処理後のある期間内に当該害虫による感染に対して植物を保護することもできる。保護が付与される期間は、一般に、活性な物質での処理後１から２８日、好ましくは１から１４日、特に好ましくは１から１０日、かなり特に好ましくは１から７日、または種子処理後２００日までにわたる。

【実施例】

【０３８６】
式［Ｉ］および［Ｉ－ｃ］の本発明による活性な物質の製造および使用は、以下の実施例に従う。しかしながら、本発明はこれらの実施に制限されない。

【０３８７】
式［ＶＩＩ］の出発材料の製造：
４－ブロモ－３－（４－フルオロフェニル）－１Ｈ－ピラゾール［ＶＩＩ－１］
１４．９ｇ（９２ミリモル）の３－（４－フルオロフェニル）－１Ｈ－ピラゾール（欧州特許出願公開第１３８２６０３号に記載された合成）を４５ｍＬの酢酸に溶解させる。これに、３５℃にて、９ＭＬの酢酸中の５．７ｍＬ臭素（１１０ミリモル）の溶液を加える。沈殿が形成され、それに、さらに、１３０ｍＬの酢酸を加える。この後、反応混合物を室温にてさらに４時間攪拌する。次に、全ての揮発性成分を高真空下で除去する。残渣を１モラーの炭酸ナトリウム溶液に溶解させ、酢酸エチルで数回抽出する。次に、有機相を乾燥し（Na_2SO_4）、濃縮する。２１．８ｇの４－ブロモ－３－（４－フルオロフェニル）－１Ｈ－ピラゾール（収率９８％）が無色固体として得られる。該生成物をさらに精製することなくさらに反応させる。
ｌｏｇＰ（ｐＨ２．７）：２．２９

ＭＳ（ＥＳＩ）：２４１．０（［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$）
１Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ｄ$_{6}$－ＤＭＳＯ）：δ＝１３．３（ｓ，１Ｈ，ｂｒ）、７．８２（ｍ，３Ｈ）、７．３０（ｍ，２Ｈ）ｐｐｍ

式［ＶＩ］の出発材料の製造：

４－ブロモ－３－（４－フルオロフェニル）－１－イソプロピル－１Ｈ－ピラゾールおよび４－ブロモ－５－（４－フルオロ－フェニル）－１－イソプロピル－１Ｈ－ピラゾールの混合物［ＶＩ－１］

３．６ｇ（１４．９ミリモル）の４－ブロモ－３－（４－フルオロ）－１Ｈ－ピラゾールを６ｍＬのＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミドに溶解させる。油中の６０％懸濁液としての０．４３ｇの水素化ナトリウム（１７．９ミリモル）をこれに加え、混合物を２５℃にて２０分間攪拌する。次に、３．８ｇのヨウ化イソプロピル（２２．４ミリモル）を加え、反応混合物を２５℃にて一晩攪拌する。仕上げ処理のために、（濃）酢酸をゆっくりと加え（０．２ｅｑ）、次いで、全ての揮発性成分を高真空下で除去する。残渣を水に溶解させ、酢酸エチルで数回抽出する。次に、有機相を乾燥し（Ｎａ$_{2}$ＳＯ$_{4}$）、濃縮する。精製は、溶離剤シクロヘキサン（Ａ）／酢酸エチル（Ｂ）（０％Ｂから４０％Ｂ）でのシリカゲルクロマトグラフィーによって行う。３．５４ｇの４－ブロモ－３－（４－フルオロフェニル）－１－イソプロピル－１Ｈ－ピラゾールおよび（従たる）４－ブロモ－５－（４－フルオロフェニル）－１－イソプロピル－１Ｈ－ピラゾールの（８４：１６）で混合物が無色固体として得られる。該生成物をさらに精製することなくさらに反応させる。
ｌｏｇＰ（ｐＨ２．７）：３．９６および３．６８^{minor}
ＭＳ（ＥＳＩ）：２８５．０（［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$）
１Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ｄ６－ＤＭＳＯ）：δ＝８．０４（ｓ，１Ｈ）、７．８５（ｄｄ，２Ｈ）、７．６４（ｓ，１Ｈ^{minor}）、７．４３（ｄｄ，２Ｈ^{minor}）、７．３６（ｔ，２Ｈ^{minor}）、７．２５（ｔ，２Ｈ）、４．５１（ｍ，１Ｈ）、４．３６（ｍ，１Ｈ^{minor}）、１．４５（ｄ，６Ｈ）、１．３３（ｄ，６Ｈ^{minor}）ｐｐｍ

４－ブロモ－１－エチル－３－（４－フルオロフェニル）－１Ｈ－ピラゾール［ＶＩ－２］

４－ブロモ－１－エチル－５－（４－フルオロフェニル）－１Ｈ－ピラゾール［ＶＩ－３］

３．０ｇ（１２．３ミリモル）の４－ブロモ－３－（４－フルオロフェニル）－１Ｈ－ピラゾールを６ｍＬのＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミドに溶解させる。油中の６０％懸濁液としての０．５９ｇの水素化ナトリウム（１４．７ミリモル）をこれに加え、混合物を２５℃にて２０分間攪拌する。次に、２．９ｇのヨードエタン（１８．４ミリモル）を加え、反応混合物を２５℃にて一晩攪拌する。仕上げ処理のために、（濃）酢酸をゆっくりと加え（０．２ｅｑ）、次いで、高真空化で全ての揮発性成分を除去する。残渣を水に溶解させ、酢酸エチルで数回抽出する。次に、有機相を乾燥し（Ｎａ$_{2}$ＳＯ$_{4}$）、濃縮する。精製は、溶離剤シクロヘキサン（Ａ）／酢酸エチル（Ｂ）（０％Ｂから４０％Ｂ）でのシリカゲルクロマトグラフィーによって行う。２．５２ｇのピラゾール異性体の（７５：２５）混合物が無色固体として得られる。混合物は分取用ＨＰＬＣ（Ｋｒｏｍａｓｉｌ　１００　Ｃ１８　１６μｍ　２５０＊１００ｍｍ、６０／４０メタノール／Ｈ$_{2}$Ｏイソクラティック、流速８００ｍｌ／分）によって分離し、１．５８ｇ（４８％収率）の４－ブロモ－１－エチル－３－（４－フルオロフェニル）－１Ｈ－ピラゾールおよび０．４１ｇ（１２％収率）の４－ブロモ－１－エチル－５－（４－フルオロフェニル）－１Ｈ－ピラゾールが得られる。

主たる異性体：４－ブロモ－１－エチル－３－（４－フルオロフェニル）－１Ｈ－ピラゾール［ＶＩ－２］
ｌｏｇＰ（ｐＨ２．７）：３．３７
ＭＳ（ＥＳＩ）：２６９．０（［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$）
^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ｄ$_{6}$－ＤＭＳＯ）：δ＝８．０２（ｓ，１Ｈ）、７．８５

（ｄｄ，２Ｈ）、７．２５（ｔ，２Ｈ）、４．１６（ｑ，２Ｈ）、１．４１（ｔ，３Ｈ）ｐｐｍ

従たる異性体：４－ブロモ－１－エチル－５－（４－フルオロフェニル）－１Ｈ－ピラゾール［ＶＩ－３］

ｌｏｇＰ（ｐＨ２．７）：３．１５

ＭＳ（ＥＳＩ）：２６９．０（［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$）

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ｄ$_{6}$－ＤＭＳＯ）：δ＝７．６２（ｓ，１Ｈ）、７．４８（ｄｄ，２Ｈ）、７．３６（ｔ，２Ｈ）、４．０２（ｑ，２Ｈ）、１．２４（ｔ，３Ｈ）ｐｐｍ

４－ブロモ－３－（４－フルオロフェニル）－１－イソブチル－１Ｈ－ピラゾール［ＶＩ－４］

４－ブロモ－５－（４－フルオロフェニル）－１－イソブチル－１Ｈ－ピラゾール［ＶＩ－５］

３．６２ｇ（１４．９ミリモル）の４－ブロモ－３－（４－フルオロフェニル）－１Ｈ－ピラゾールを６ｍＬのＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミドに溶解させる。油中の６０％懸濁液としての０．４３ｇの水素化ナトリウム（１７．９ミリモル）をこれに加え、混合物を２５℃にて２０分間攪拌する。次に、４．１ｇの１－ヨード－２－メチルプロパン（２２．４ミリモル）をこれに加え、反応混合物を２５℃にて一晩攪拌する。仕上げ処理のために、（濃）酢酸をゆっくりと加え（０．２ｅｑ）、次いで、高真空下で全ての揮発性成分を除去する。残渣を水に溶解させ、酢酸エチルで数回抽出する。次に、有機相を乾燥し（Na_2SO_4）、濃縮する。精製は、溶離剤シクロヘキサン（Ａ）／酢酸エチル（ｂ）（０％Ｂから４０％Ｂ）でのシリカゲルクロマトグラフィーによって行う。３．７４ｇのピラゾール異性体の（７１：２９）混合物が無色固体として得られる。混合物は分取用ＨＰＬＣ（Ｋｒｏｍａｓｉｌ　１００　Ｃ１８　１６μｍ　２５０＊１００ｍｍ、７０／３０メタノール／H_2Oイソクラティック、流速８００ｍｌ／分）によって分離し、２．５１ｇ（５６％）の４－ブロモ－３－（４－フルオロフェニル）－１－イソブチル－１Ｈ－ピラゾールおよび０．５９ｇ（１３％収率）の４－ブロモ－５－（４－フルオロフェニル）－１－イソブチル－１Ｈ－ピラゾールが得られる。

【０３８８】

主たる異性体：４－ブロモ－３－（４－フルオロフェニル）－１－イソブチル－１Ｈ－ピラゾール［ＶＩ－４］

ｌｏｇＰ（ｐＨ２．７）：４．３４

ＭＳ（ＥＳＩ）：２９９．０（［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$）

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ｄ$_{6}$－ＤＭＳＯ）：δ＝７．９９（ｓ，１Ｈ）、７．８５（ｄｄ，２Ｈ）、７．２５（ｔ，２Ｈ）、３．９４（ｄ，２Ｈ）、２．１８（ｍ，１Ｈ）、０．８８（ｄ，６Ｈ）ｐｐｍ

従たる異性体：４－ブロモ－５－（４－フルオロフェニル）－１－イソブチル－１Ｈ－ピラゾール［ＶＩ－５］

ｌｏｇＰ（ｐＨ２．７）：４．０４

ＭＳ（ＥＳＩ）：２９９．０（［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$）

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ｄ$_{6}$－ＤＭＳＯ）：δ＝７．６４（ｓ，１Ｈ）、７．４８（ｄｄ，２Ｈ）、７．３６（ｔ，２Ｈ）、３．８４（ｄ，２Ｈ）、１．９８（ｍ，１Ｈ）、０．６９（ｄ，６Ｈ）ｐｐｍ

４－ブロモ－３－（４－フルオロフェニル）－１－（２－メトキシエチル）－１Ｈ－ピラゾール［ＶＩ－６］

４－ブロモ－５－（４－フルオロフェニル）－１－（２－メトキシエチル）－１Ｈ－ピラゾール［ＶＩ－７］

３．６２ｇ（１４．９ミリモル）の４－ブロモ－３－（４－フルオロフェニル）－１Ｈ－ピラゾールを６ｍＬのＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミドに溶解させる。油中の６０％懸濁液としての０．４３ｇの水素化ナトリウム（１７．９ミリモル）をこれに加え、混合物を

２５℃にて２０分間攪拌する。次に、３．１ｇの１－ブロモ－２－メトキシエタン（２２．４ミリモル）を加え、反応混合物を２５℃にて一晩攪拌する。仕上げ処理のために、（濃）酢酸をゆっくりと加え（０．２ｅｑ）、次いで、高真空下で全ての揮発性成分を除去する。残渣を水に溶解させ、酢酸エチルで数回抽出する。次に、有機相を乾燥し（Na_2SO_4）、濃縮する。精製は、溶離剤シクロヘキサン（Ａ）／酢酸エチル（Ｂ）（０％Ｂから４０％Ｂ）でのシリカゲルクロマトグラフィーによって行う。２．９１ｇのピラゾール異性体の（７６：２３）混合物が無色固体として得られる。混合物を分取用ＨＰＬＣ（Ｋｒｏｍａｓｉｌ　１００　Ｃ１８　１６μｍ　２５０＊１００ｍｍ、６２／３８メタノール／H_2Oイソクラティック、流速８００ｍｌ／分）によって分離し、２．９２ｇ（６１％収率）の４－ブロモ－３－（４－フルオロフェニル）－１－（２－メトキシエチル）－１Ｈ－ピラゾールおよび０．４３ｇ（９％収率）の４－ブロモ－５－（４－フルオロフェニル）－１－（２－メトキシエチル）－１Ｈ－ピラゾールが得られる。

【０３８９】

主たる異性体：４－ブロモ－３－（４－フルオロフェニル）－１－（２－メトキシエチル）－１Ｈ－ピラゾール［ＶＩ－６］

ｌｏｇＰ（ｐＨ　２．７）：３．０８

ＭＳ（ＥＳＩ）：２９９．０（$[M+H]^+$）^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，d_6－ＤＭＳＯ）：δ＝７．９８（ｓ，１Ｈ）、７．８５（ｄｄ，２Ｈ）、７．２３（ｔ，２Ｈ）、４．２９（ｔ，２Ｈ）、３．７３（ｔ，２Ｈ）、３．２６（ｓ，３Ｈ）ｐｐｍ

従たる異性体：４－ブロモ－５－（４－フルオロフェニル）－１－（２－メトキシエチル）－１Ｈ－ピラゾール［ＶＩ－７］

ｌｏｇＰ（ｐＨ　２．７）：２．９０

ＭＳ（ＥＳＩ）：２９９．０（$[M+H]^+$）

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，d_6－ＤＭＳＯ）：δ＝７．６５（ｓ，１Ｈ）、７．４８（ｄｄ，２Ｈ）、７．３６（ｔ，２Ｈ）、４．１３（ｔ，２Ｈ）、３．６３（ｔ，２Ｈ）、３．１０（ｓ，３Ｈ）ｐｐｍ

同一のプロセスによって以下のものを製造することができる。

【０３９０】

４－ブロモ－３－（４－フルオロフェニル）－１－メチル－１Ｈ－ピラゾール「ＶＩ－８」

ｌｏｇＰ（ｐＨ　２．７）：２．８６

ＭＳ（ＥＳＩ）：２５７．０（$[M+H]^+$）

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，CD_3CN）：δ＝７．８８－７，８４（ｍ，２Ｈ）、７．６５（ｓ，１Ｈ）、７．２１－７．１６（ｍ，２Ｈ）、３．８７（ｓ，３Ｈ）ｐｐｍ

４－ブロモ－３－（４－フルオロフェニル）－１－［１－（２－フルオロフェニル）エチル］－１Ｈ－ピラゾール［ＶＩ－９］

ｌｏｇＰ（ｐＨ　２．７）：３．６３

ＭＳ（ＥＳＩ）：４７７．０（$[M+H]^+$）

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ＣＤ３ＣＮ）：δ＝８．１５（ｓ，１Ｈ）、７．８８－７．７８（ｍ，２Ｈ）、７．３８－７．２８（ｍ，２Ｈ）、４．３７（ｄｄ，１Ｈ）、４，３１（ｄｄ，１Ｈ）、２．３３（ｍ，１Ｈ）、１．８７（ｄｄ，１Ｈ）、１．６５（ｔ，１Ｈ）ｐｐｍ

４－ブロモ－１－［（２，２－ジクロロシクロプロピル）メチル］－３－（４－フルオロフェニル）－１Ｈ－ピラゾール［ＶＩ－１０］

ｌｏｇＰ（ｐＨ　２．７）：４．４３

ＭＳ（ＥＳＩ）：３６４．９（$[M+H]^+$）

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，CD_3CN）：δ＝７．８８－７，８３（ｍ，２Ｈ）、７．８２（ｓ，１Ｈ）、７．３１－７．２９（ｍ，２Ｈ）、７．２７－７．１０（ｍ，４Ｈ）、５．８６（ｑ，１Ｈ）、１．８８（ｄ，３Ｈ）ｐｐｍ

５－（４－ブロモ－１－イソブチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）－２－フルオロベ

ンゾニトリル［ＶＩ－１１］
ｌｏｇＰ（ｐＨ　２．７）：４．１５
ＭＳ（ＥＳＩ）：３２４．１（［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$）
^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ｄ６－ＤＭＳＯ）：δ＝８．２３－８．２２（ｍ，１Ｈ）、８．２０－８．１７（ｍ，１Ｈ）、８．１６（ｓ，１Ｈ）、７．６５（ｔ，１Ｈ）、３．９７（ｄ，２Ｈ）、２．１５（ｑ，１Ｈ）ｐｐｍ
３－｛［４－ブロモ－３－（４－フルオロフェニル）－１Ｈ－ピラゾール－１－イル］メチル｝ベンゾニトリル［ＶＩ－１２］
ｌｏｇＰ（ｐＨ　２．７）：３．９３
ＭＳ（ＥＳＩ）：３５８．０（［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$）
^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ＣＤ$_{3}$ＣＮ）：δ＝７．８８－７，８１（ｍ，２Ｈ）、７．７８（ｓ，１Ｈ）、７．７０－７．６５（ｍ，２Ｈ）、７．６０－７．５１（ｍ，２Ｈ）、７．２２－７．１６（ｍ，２Ｈ）、５．３５（ｓ，２Ｈ）ｐｐｍ
４－ブロモ－１－（２－フルオロベンジル）－３－（４－フルオロフェニル）－１Ｈ－ピラゾール［ＶＩ－１３］
ｌｏｇＰ（ｐＨ　２．７）：４．３９
ＭＳ（ＥＳＩ）：３４９．０（［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$）
^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ｄ６－ＤＭＳＯ）：δ＝８．１８（ｓ，１Ｈ）、７．８３－７．４３（ｍ，２Ｈ）、７．４２－７．３３（ｍ，１Ｈ）、７．３１－７．１９（ｍ，５Ｈ）、５．４３（ｓ，２Ｈ）ｐｐｍ
４－ブロモ－３－（４－フルオロフェニル）－１－プロピル－１Ｈ－ピラゾール「ＶＩ－１４」
ｌｏｇＰ（ｐＨ　２．７）：３．８９
ＭＳ（ＥＳＩ）：２８３．０（［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$）
^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ＣＤ$_{3}$ＣＮ）：δ＝７．８９－７，８４（ｍ，２Ｈ）、７．６９（ｓ，１Ｈ）、７．２１－７．１５（ｍ，２Ｈ）、４．０８（ｔ，２Ｈ）、１．９０－１．８１（ｍ，２Ｈ）、０．８９（ｔ，３Ｈ）ｐｐｍ
４－ブロモ－３－（４－フルオロフェニル）－１－［２－（メチルスルファニル）エチル］－１Ｈ－ピラゾール［ＶＩ－１５］
ｌｏｇＰ（ｐＨ　２．７）：３．６３
ＭＳ（ＥＳＩ）：３１５．０（［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$）
^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ＣＤ$_{3}$ＣＮ）：δ＝７．８９－７，８４（ｍ，２Ｈ）、７．７５（ｓ，１Ｈ）、７．２２－７．１６（ｍ，２Ｈ）、４．３１（ｔ，２Ｈ）、２．９５（ｔ，２Ｈ）、２．０４（ｓ，３Ｈ）ｐｐｍ
２－［４－ブロモ－４－（４－フルオロフェニル）－１Ｈ－ピラゾール－１－イル］－３－メチルブタン酸メチル［ＶＩ－１６］
ｌｏｇＰ（ｐＨ　２．７）：４．２７
ＭＳ（ＥＳＩ）：３５７．０（［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$）
^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ＣＤ$_{3}$ＣＮ）：δ＝７．８８（ｓ，１Ｈ）、７．８７－７．８４（ｍ，２Ｈ）、７．２２－７．１７（ｍ，２Ｈ）、４．７０（ｄ，１Ｈ）、３．７３（ｓ，１Ｈ）、２．５３（ｍ，１Ｈ）、１．０１（ｄ，３Ｈ）、０．８６（ｄ，３．０３）ｐｐｍ
４－ブロモ－１－（１，３－ジオキソラン－２－イルメチル）－３－（４－フルオロフェニル）－１Ｈ－ピラゾール［ＶＩ－１７］
ｌｏｇＰ（ｐＨ　２．７）：３．０１
ＭＳ（ＥＳＩ）：３２９．０（［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$）
^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ＣＤ$_{3}$ＣＮ）：δ＝７．８９－７．８４（ｍ，２Ｈ）、７．７３（ｓ，１Ｈ）、７．２２－７．１６（ｍ，２Ｈ）、５．２０（ｔ，１Ｈ）、４．２６（ｄ，２Ｈ）、３．８７（ｍ，４Ｈ）ｐｐｍ
４－ブロモ－１－（シクロプロピルメチル）－３－（４－フルオロフェニル）－１Ｈ－

ピラゾール［ＶＩ－１８］
ｌｏｇＰ（ｐＨ　２．７）：３．９０
ＭＳ（ＥＳＩ）：２９７．０（［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$）
^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ＣＤ$_{3}$ＣＮ）：δ＝７．９０－７．８５（ｍ，２Ｈ）、７．７８（ｓ，１Ｈ）、７．２８－７．１６（ｍ，２Ｈ）、３．９８（ｄ，２Ｈ）、１．２７（ｍ，１Ｈ）、０．６２（ｍ，２Ｈ）、０．４０（ｍ，２Ｈ）ｐｐｍ
４－ブロモ－１－ｓｅｃ－ブチル－３－（４－フルオロフェニル）－１Ｈ－ピラゾール［ＶＩ－１９］
ｌｏｇＰ（ｐＨ　２．７）：４．３９
ＭＳ（ＥＳＩ）：２９９．０（［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$）
^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ＣＤ$_{3}$ＣＮ）：δ＝７．９０－７，８５（ｍ，２Ｈ）、７．７１（ｓ，１Ｈ）、７．２１－７．１５（ｍ，２Ｈ）、４．２（ｍ，１Ｈ）、１．９４－１．８６（ｍ，１Ｈ）、１．８４－１．７４（ｍ，１Ｈ）、１．４５（ｄ，３Ｈ）、０．７０（ｔ，３Ｈ）ｐｐｍ
４－ブロモ－１－（２－エトキシエチル）－３－（４－フルオロフェニル）－１Ｈ－ピラゾール［ＶＩ－２０］
ｌｏｇＰ（ｐＨ　２．７）：３．５１
ＭＳ（ＥＳＩ）：３１３．０（［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$）
^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ｄ６－ＤＭＳＯ）：δ＝８．０４（ｓ，１Ｈ）、７．８７－７．８２（ｍ，２Ｈ）、７．３２－７．２６（ｍ，２Ｈ）、４．２８（ｔ，２Ｈ）、３．７８（ｔ，２Ｈ）、３．４４（ｑ，２Ｈ）、１．０８（ｔ，３Ｈ）ｐｐｍ
３－［４－ブロモ－３－（４－フルオロフェニル）－１Ｈ－ピラゾール－１－イル］ブタノニトリル［ＶＩ－２１］
ｌｏｇＰ（ｐＨ　２．７）：３．０８
ＭＳ（ＥＳＩ）：３１０．１（［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$）
^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ＣＤ$_{3}$ＣＮ）：δ＝７．９１－７．８８（ｍ，２Ｈ）、７．８３（ｓ，１Ｈ）、７．２３－７．１９（ｍ，２Ｈ）、４．７２－４．６９（ｍ，１Ｈ）、３．０３－２．９５（ｍ，２Ｈ）、１．６０－１．５９（ｄ，３Ｈ）ｐｐｍ
４－［４－ブロモ－３－（４－フルオロフェニル）－１Ｈ－ピラゾール－１－イル］ピペリジン－１－カルボン酸ｔｅｒｔ－ブチル［ＶＩ－２７］
ｌｏｇＰ（ｐＨ　２．７）：４．７７
ＭＳ（ＥＳＩ）：３６８．０（［Ｍ－Ｃ$_{4}$Ｈ$_{9}$］$^{+}$）
^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ＣＤ$_{3}$ＣＮ）：δ＝７．８８－７．８６（ｍ，２Ｈ）、７．７５（ｓ，１Ｈ）、７．２０－７．１７（ｍ，２Ｈ）、４．３５－４．３０（ｍ，１Ｈ）、４．２０－４．１０（ｍ，２Ｈ）、３．００－２．８５（ｍ，２Ｈ，ｂｒ）、２．０８－２．０５（ｍ，２Ｈ）、１．８８－１．８３（ｍ，２Ｈ）、１．４４（ｓ，９Ｈ）ｐｐｍ
式［ＶＩ］の出発材料の製造のための他の方法：
４－ブロモ－１－（１－シクロプロピルエチル）－３－（４－フルオロフェニル）－１Ｈ－ピラゾール［ＶＩ－２２］
２１．７ｇ（０．０８２モル、３ｅｑ）のトリフェニルホスフィンを７０ｍＬのテトラヒドロフランに溶解させ、氷冷却によって０℃まで冷却する。アルゴン下で、トルエン中の２３．８ｇ（２ｅｑ、０．０５５モル）のアゾジカルボン酸ジエチル（ＤＥＡＤ）の２５ｍＬの溶液をゆっくりと加え、その間に、内部温度は２０℃を超えない。１０分間の攪拌後、２０ｍＬのテトロヒドロフランに溶解させた６．９ｇ（１ｅｑ、０．０２７モル）の４－ブロモ－３－（４－フルオロフェニル）－１Ｈ－ピラゾールおよび４．９ｇ（２ｅｑ、０．０５５モル）のシクロプロピルメチルカルビノールを０℃にてゆっくりと加える。反応混合物をＲＴにて一晩攪拌し、次いで、蒸発させ、カラムクロマトグラフィーによって精製する。１．９２ｇ（２２．７％）の４－ブロモ－１－（１－シクロ－プロピルエチル）－３－（４－フルオロフェニル）－１Ｈ－ピラゾールが得られる。

ｌｏｇＰ（ｐＨ　２．７）：４．４３
ＭＳ（ＥＳＩ）：３０９．０（［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$）
^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ＣＤ$_{3}$ＣＮ）：δ＝７．９１－７，８５（ｍ，２Ｈ）、７．８０（ｓ，１Ｈ）、７．２２－７．１６（ｍ，２Ｈ）、３．６４（ｍ，１Ｈ）、１．５７（ｄ，３Ｈ）、１．２５（ｍ，１Ｈ）０．６７（ｍ，１Ｈ）、０．５０（ｍ，１Ｈ）、０．４４（ｍ，２Ｈ）ｐｐｍ

３－［４－ブロモ－３－（４－フルオロフェニル）－１Ｈ－ピラゾール－１－イル］プロパノニトリル［ＶＩ－２３］

２５ｍＬのＤＭＦ中の２．５ｇの４－ブロモ－５－（４－フルオロフェニル）－１Ｈ－ピラゾール（１０．４ミリモル）の溶液に５．０７ｇのＣｓ$_{2}$ＣＯ$_{3}$（１５．６ミリモル）および３－ブロモプロパノニトリル（２．０８ｇ、１５．６ミリモル）を加え、反応混合物を７０℃にて一晩攪拌する。この後、混合物を室温まで冷却し、水に注ぎ、酢酸エチルで抽出する。有機相を乾燥し、蒸発させ、分取用ＨＰＬＣによって精製する。２．６０ｇ（８５％）の３－［４－ブロモ－３－（４－フルオロフェニル）－１Ｈ－ピラゾール－１－イル］プロパノニトリルが得られる。

ｌｏｇＰ（ｐＨ２．７）：２．６９
ＭＳ（ＥＳＩ）：２９６．０（［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$）
^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ＣＤ$_{3}$ＣＮ）：δ＝７．９１－７，８６（ｍ，２Ｈ）、７．７９（ｓ，１Ｈ）、７．２３－７．１７（ｍ，２Ｈ）、４．３８（ｔ，２Ｈ）、３．７３（ｔ，２Ｈ）ｐｐｍ

４－ブロモ－３－（４－フルオロフェニル）－１－イソプロピル－５－（トリフルオロメチル）－１Ｈ－ピラゾール［ＶＩ２４］

５ｍＬのＤＭＦ中の１．４ｇ（４．５ミリモル）の４－ブロモ－３－（４－フルオロフェニル）－５－（トリフルオロメチル）－１Ｈ－ピラゾールの溶液に０．６３ｇ（４．５ミリモル）のＫ$_{2}$ＣＯ$_{3}$および０．６６ｇ（５．４ミリモル）の３－ブロモプロパノニトリルを加え、反応混合物を８０℃にて一晩攪拌する。この後、混合物を室温まで冷却し、水に注ぎ、ジエチルエーテルで抽出する。有機相を乾燥し、蒸発させ、シリカゲル上のクロマトグラフィー（溶離剤石油エーテル）によって精製する。０．５ｇ（３２％）の４－ブロモ－３－（４－フルオロフェニル）－１－イソブチル－５－（トリフルオロメチル）－１Ｈ－ピラゾールが得られる。

ｌｏｇＰ（ｐＨ　２．７）：５．５１
ＭＳ（ＥＳＩ）：３５３．１（［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$）
^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ＣＤ$_{3}$ＣＮ）：δ＝７．８４－７，８２（ｍ，２Ｈ）、７．２５－７．２２（ｍ，２Ｈ）、４．７８（ｑ，１Ｈ）、１．５１（ｄ，６Ｈ）ｐｐｍ

４－ブロモ－３－（４－フルオロフェニル）－１－イソプロポキシ－１Ｈ－ピラゾール［ＶＩ－２５］

ＤＭＦ中の１．２６ｇ（５２．７ミリモル）の水素化ナトリウムの懸濁液に、３０ｍＬのＤＭＦに溶解させた７．５ｇ（２９．３ミリモル）の４－ブロモ－３－（４－フルオロフェニル）－１Ｈ－ピラゾール－１－オールを０℃で加える。添加の後に、反応混合物を室温で２０分間攪拌する。次いで、混合物を０℃まで冷却し、４．１ｍＬ（４３．９ミリモル）の２－ブロモプロパンに加える。この後、反応混合物を室温にて１５時間攪拌し、次いで５００ｍＬの氷水に注ぎ、１５０ｍＬの酢酸エチルで３回抽出する。合わせた有機相を水で洗浄し、Ｎａ$_{2}$ＳＯ$_{4}$で乾燥し、真空下で蒸発させる。粗材料をシリカゲル上のカラムクロマトグラフィー（溶離剤２％酢酸エチル／石油エーテル）によって、次いで、分取用ＨＰＬＣによって精製する。１．２ｇの４－ブロモ－３－（４－フルオロフェニル）－１－イソプロポキシ－１Ｈ－ピラゾール（１３．７％）が得られる。

ｌｏｇＰ（ｐＨ　２．７）：４．１１
ＭＳ（ＥＳＩ）：３０１．１（［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$）
^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ｄ６－ＤＭＳＯ）：δ＝８．２３（ｓ，１Ｈ）、７．８４－７．８０（ｍ，２Ｈ）、７．３２－７．２８（ｍ，２Ｈ）、４．６８（ｑ，１Ｈ）、１

．２７（ｄ，６Ｈ）ｐｐｍ
４－ブロモ－１－シクロプロピル－３－（４－フルオロフェニル）－１Ｈ－ピラゾール［ＶＩ－２６］
２５０ｍＬのジクロロメタン中の４．８ｇ（２７．２ミリモル）のＮ－ブロモスクシンイミドの懸濁液に、５ｇ（２０．２ミリモル）の１－シクロプロピル－３－（４－フルオロフェニル）－１Ｈ－ピラゾールを０℃にて加える。添加の後に、反応混合物を室温にて１時間攪拌する。この後、反応混合物を水で処理し、ジクロロメタンで抽出する。合わせた有機相を水で洗浄し、Na_2SO_4上で乾燥し、真空下で蒸発させる。粗材料をシリカゲル上のカラムクロマトグラフィーによって精製する。５ｇの４－ブロモ－１－シクロピロピル－３－（４－フルオロフェニル）－１Ｈ－ピラゾール（７３％）が得られる。
ｌｏｇＰ（ｐＨ ２．７）：３．５９
ＭＳ（ＥＳＩ）：２８１．０（［Ｍ＋Ｈ］$^+$）
^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，CD_3CN）：δ＝７．８８－７．８４（ｍ，２Ｈ）、７．７５（ｓ，１Ｈ）、７．２０－７．１６（ｍ，２Ｈ）、３．６８－３．６５（ｍ，１Ｈ）、１．１２－１．０９（ｍ，２Ｈ）、１．０４－１．０１（ｍ，２Ｈ）ｐｐｍ
製法Ｖ２による式［Ｖ］の出発材料の製造：
３－（４－フルオロフェニル）－１－イソプロピル－４－（４，４，５，５－テトラメチル－１，３，２－ジオキソボロラン－２－イル）－１Ｈ－ピラゾール［Ｖ－１］
３．０ｇ（１０．５ミリモル）の４－ブロモ－３－（４－フルオロフェニル）－１－イソプロピル－１Ｈ－ピラゾールおよび５．３８ｇ（２１．１ミリモル）のビス（ピナコラト）－ジボランを３０ｍＬのジメチルスルホキシドに溶解させる。これに、３．１ｇの酢酸カリウム（３１．８ミリモル）および０．８６ｇ（１．０６ミリモル）の１，１’－ビス（ジフェニルホスフィノ）フェロセン］－ジクロロパラジウム（ＩＩ）＊CH_2Cl_2を加え、反応混合物をアルゴン流下で８５℃にて５時間加熱する。８０℃における２時間の新たな加熱後に、反応混合物を冷却し、高真空下でジメチルスルホキシドを除去する。残渣を水に溶解させ、酢酸エチルで数回抽出する。次に、有機相を乾燥し（Na_2SO_4）、濃縮する。精製は、溶離剤シクロヘキサン（Ａ）／シクロヘキサン中の２０％酢酸エチル（Ｂ）（０％Ｂから７０％Ｂ）でのシリカゲルクロマトグラフィーによって行う。３．８５ｇの３－（４－フルオロフェニル）－１－イソプロピル－４－（４，４，４，５－テトラメチル－１，３，２－ジオキサボロラン－２－イル）－１Ｈ－ピラゾールが無色固体として得られる（ＮＭＲによると４０％純度）。該化合物をさらに精製することなくさらに反応させる。
ｌｏｇＰ（ｐＨ ２．７）：４．５１
ＭＳ（ＥＳＩ）：３３１．２０（［Ｍ＋Ｈ］$^+$）
^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ｄ$_3$－CD_3CN）：δ＝７．９０（ｄｄ，２Ｈ）、７．７８（ｓ，１Ｈ）、７．１０（ｄｄ，１Ｈ）、４．５２（ｍ，１Ｈ）、１．４９（ｄ，６Ｈ）、１．２５（ｓ，１２Ｈ）ｐｐｍ
３－（４－フルオロフェニル）－１－（２－メトキシエチル）－４－（４，４，５，５－テトラメチル－１，３，２－ジオキサボロラン－２－イル）－１Ｈ－ピラゾール［Ｖ－２］
１．０ｇ（３．３．ミリモル）の４－ブロモ－３－（４－フルオロフェニル）－１－（２－メトキシエチル）－１Ｈ－ピラゾールおよび１．６９ｇ（２ｅｑ、６．７ミリモル）のビス－（ピナコラト）－ジボランを１５ｍＬのジメチルスルホキシドに溶解させる。これに、０．９８ｇの酢酸カリウム（１０ミリモル）および０．２７ｇ（０．３ミリモル）の１，１’－ビス（ジフェニルホスフィノ）－フェロセン］ジクロロパラジウム（ＩＩ）＊CH_2Cl_2を加え、反応混合物をアルゴン流下で８５℃にて７時間加熱する。この後、反応混合物を冷却し、高真空下でジメチルスルホキシドを除去する。残渣を水に溶解させ、酢酸エチルで数回抽出する。次に、有機相を乾燥し（Na_2SO_4）、濃縮する。精製は、溶離剤シクロヘキサン（Ａ）／シクロヘキサン中の２０％酢酸エチル（Ｂ）（０％Ｂから７０％Ｂ）でのシリカゲルクロマトグラフィーによって行う。０．３９ｇの３－（

４－フルオロフェニル）－１－（２－メトキシエチル）－４－（４，４，５，５－テトラメチル－１，３，２－ジオキサボロラン－２－イル）－１Ｈ－ピラゾールが無色固体として得られる（ＮＭＲによると６０％純度）。該化合物をさらに精製することなくさらに反応させる。

ｌｏｇＰ（ｐＨ　２．７）：３．５８

ＭＳ（ＥＳＩ）：３４７．２１（［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$）

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ｄ$_{3}$－ＣＤ$_{3}$ＣＮ）：δ＝７．８０（ｄｄ，２Ｈ）、７．５８（ｓ，１Ｈ）、７．１５（ｄｄ，１Ｈ）、４．３０（ｍ，２Ｈ）、３．７５（ｍ，２Ｈ）、３．３０（ｓ，３Ｈ）、１．２８（ｓ，１２Ｈ）ｐｐｍ

３－（４－フルオロフェニル）－１－イソブチル－４－（４，４，５，５－テトラメチル－１，３，２－ジオキサボロラン－２－イル）－１Ｈ－ピラゾール［Ｖ－３］

２．０ｇ（６．７ミリモル）の４－ブロモ－３－（４－フルオロフェニル）－１－イソブチル－１Ｈ－ピラゾールおよび３．４ｇ（１３．４ミリモル）のビス－（ピナコラト）－ジボランを３０ｍＬのジメチルスルホキシドに溶解させる。これに、１．９８ｇの酢酸カリウム（２０ミリモル）および０．５５ｇ（０．６７ミリモル）の１，１’－ビス（ジフェニルホスフィノ）－フェロセン］ジクロロパラジウム（ＩＩ）＊ＣＨ$_{2}$Ｃｌ$_{2}$を加え、反応混合物をアルゴン流下で８５℃にて７時間加熱する。この後、反応混合物を冷却し、高真空下でジメチルスルホキシドを除去する。残渣を水に溶解させ、酢酸エチルで数回抽出する。次に、有機相を乾燥し（Ｎａ$_{2}$ＳＯ$_{4}$）、濃縮する。精製は、溶離剤シクロヘキサン（Ａ）／シクロヘキサン中の２０％酢酸エチル（Ｂ）（０％Ｂから７０％Ｂ）でのシリカゲルクロマトグラフィーによって行う。１．１ｇの３－（４－フルオロフェニル）－１－イソブチル－４－（４，４，５，５－テトラメチル－１，３，２－ジオキサボロラン－２－イル）－１Ｈ－ピラゾールが無色固体として得られる（ＮＭＲによると２３％純度）。該化合物をさらに精製することなくさらに反応させる。

ｌｏｇＰ（ｐＨ　２．７）：４．７６

ＭＳ（ＥＳＩ）：３４５．１７（［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$）

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ｄ３－ＣＤ$_{3}$ＣＮ）：δ＝７．９０（ｄｄ，２Ｈ）、７．７２（ｓ，１Ｈ）、７．１０（ｄｄ，１Ｈ）、３．９５（ｄ，２Ｈ）、２．２０（ｍ，１Ｈ）、１．３０（ｓ，１２Ｈ）、０．９０（ｄ，６Ｈ）ｐｐｍ

前記した方法と同様に、タイプ［ＩＩＩ］の以下の化合物を調製することもできる：

１－（２，２－ジフルオロエチル）－３－（４－フルオロフェニル）－４－（４，４，５，５－テトラメチル－１，３，２－ジオキサボロラン－２－イル）－１Ｈ－ピラゾール［Ｖ－４］

ｌｏｇＰ（ｐＨ　２．７）：３．８４

ＭＳ（ＥＳＩ）：３５３．２（［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$）

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ｄ６－ＤＭＳＯ）：δ＝８．０６（ｓ，１Ｈ）、７．９０－７．８７（ｍ，２Ｈ）、７．２１（ｍ，２Ｈ）、６．４１（ｍ，１Ｈ）、４．６８（ｍ，２Ｈ）、１．２７（ｓ，１２Ｈ）ｐｐｍ

３－（４－フルオロフェニル）－１－イソプロポキシ－４－（４，４，５，５－テトラメチル－１，３，２－ジオキサボロラン－２－イル）－１Ｈ－ピラゾール［Ｖ－５］

ｌｏｇＰ（ｐＨ　２．７）：４．８１

ＭＳ（ＥＳＩ）：３４７．２（［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$）

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ＣＤ$_{3}$ＣＮ）：δ＝７．８９－７．８５（ｍ，２Ｈ）、７．６８（ｓ，１Ｈ）、７．１５－７．１０（ｍ，２Ｈ）、４．７１（ｍ，１Ｈ）、１．２９（ｍ，１８Ｈ）ｐｐｍ

１－（シクロペンチルオキシ）－３－（４－フルオロフェニル）－４－（４，４，５，５－テトラメチル－１，３，２－ジオキサボロラン－２－イル）－１Ｈ－ピラゾール［Ｖ－６］

ｌｏｇＰ（ｐＨ　２．７）：５．５１

ＭＳ（ＥＳＩ）：３７３．２（［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$）

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ＣＤ$_3$ＣＮ）：δ＝７．８９－７．８５（ｍ，２Ｈ）、７．６７（ｓ，１Ｈ）、７．１５－７．１０（ｍ，２Ｈ）、１．９５－１．９３（ｍ，７Ｈ）、１．８０－１．７９（ｍ，２Ｈ）ｐｐｍ

１－シクロプロピル－３－（４－フルオロフェニル）－４－（４，４，５，５－テトラメチル－１，３，２－ジオキサボロラン－２－イル）－１Ｈ－ピラゾール［Ｖ－７］

乾燥テトラヒドロフラン（４０ｍＬ）中の２ｇ（７．１１ミリモル）の４－ブロモ－１－シクロプロピル－３－（４－フルオロフェニル）－１Ｈ－ピラゾールおよび１．９８ｇ（１０．６７ミリモル）の２－イソプロポキシ－４，４，５，５－テトラメチル－１，３，２－ジオキサボロランの溶液に、アルゴン下で、ｎ－ヘキサン（１ｅｑ）中のｎ－ブチルリチウムの溶液を－７８℃にてゆっくりと加える。反応混合物を－７８℃にて５分間攪拌し、次いで、ＮＨ$_4$Ｃｌ水溶液で処理する。反応混合物の室温への加温後に、反応混合物を酢酸エチルで抽出する。合わせた有機抽出物を乾燥し、真空下で蒸発させる。得られた粗材料を、シリカゲル上のクロマトグラフィー（溶離剤ｎ－ヘキサン／ジクロロメタン２：１）によって精製する。９００ｍｇ（３９％）の１－シクロプロピル－３－（４－フルオロフェニル）－４－（４，４，４，５－テトラメチル－１，３，２－ジオキサボロラン－２－イル）－１Ｈ－ピラゾールが得られる。

ｌｏｇＰ（ｐＨ　２．７）：３．４７

ＭＳ（ＥＳＩ）：３２９．２（［Ｍ＋Ｈ］$^+$）

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ＣＤ$_3$ＣＮ）：δ＝７．８９－７．８６（ｍ，２Ｈ）、７．８１（ｓ，１Ｈ）、７．１３－７．０９（ｍ，２Ｈ）、３．６５（ｍ，１Ｈ）、１．２８（ｓ，１２Ｈ）、１．１０（ｍ，２Ｈ）、１．００（ｍ，２Ｈ）ｐｐｍ

前記した方法と同様に、タイプ［ＩＩＩ］の以下の化合物がピラゾールの金属化によって調製することもできる：

１－（シクロプロピルメチル）－３－（４－フルオロフェニル）－４－（４，４，５，５－テトラメチル－１，３，２－ジオキサボロラン－２－イル）－１Ｈ－ピラゾール［Ｖ－８］

ｌｏｇＰ（ｐＨ　２．７）：４．４２

ＭＳ（ＥＳＩ）：３４３．２（［Ｍ＋Ｈ］$^+$）

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ｄ６－ＤＭＳＯ）：δ＝８．０１（ｓ，１Ｈ）、７．９０－７．８７（ｍ，２Ｈ）、７．１９（ｍ，２Ｈ）、４．００（ｄ，２Ｈ）、０．３９－０．５５（ｍ，５Ｈ）ｐｐｍ

３－（４－フルオロフェニル）－１－メチル－４－（４，４，５，５－テトラメチル－１，３，２－ジオキサボロラン－２－イル）－１Ｈ－ピラゾール［Ｖ－９］

ｌｏｇＰ（ｐＨ　２．７）：３．４７

ＭＳ（ＥＳＩ）：３０３．２（［Ｍ＋Ｈ］$^+$）

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ｄ６－ＤＭＳＯ）：δ＝７．９５（ｓ，１Ｈ）、７．９０－７．８６（ｍ，２Ｈ）、７．１９（ｍ，２Ｈ）、３．８７（ｓ，３Ｈ）、１．２６（ｓ，１２Ｈ）ｐｐｍ

１－（２－クロロエチル）－３－（４－フルオロフェニル）－４－（４，４，５，５－テトラメチル－１，３，２－ジオキサボロラン－２－イル）－１Ｈ－ピラゾール［Ｖ－１０］

ｌｏｇＰ（ｐＨ　２．７）：４．０６

ＭＳ（ＥＳＩ）：３５１．１（［Ｍ＋Ｈ］$^+$）

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ｄ６－ＤＭＳＯ）：δ＝８．０６（ｓ，１Ｈ）、７．９１－７．８７（ｍ，２Ｈ）、７．２２－７．１８（ｍ，２Ｈ）、４．４９（ｔ，２Ｈ）、４．０３（ｔ，２Ｈ）、１．２７（ｓ，１２Ｈ）ｐｐｍ

式［ＩＶ－ｃ］の出発材料の製造：

４－［３－（４－フルオロフェニル）－１－イソプロピル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－２－アミン［ＩＶ－ｃ－１］

５００ｍｇ（２．９ミリモル）の４－ブロモピリジン－２－アミンおよび４５０μＬ（

３．２ミリモル）のトリエチルアミンを２５ｍＬのテトラヒドロフランに溶解させる。これに、３３８μＬの塩化２－メチルプロパノイル（２．９ミリモル）を加え、反応混合物を室温にて１６時間攪拌する。次に、高真空下で揮発性成分を除去し、粗材料をメタノール中の３ｍＬのＮＨ$_3$（７モラー）で処理する。混合物を室温にて１６時間攪拌し、次いで、蒸発させる。粗生成物をシリカゲルクロマトグラフィー（溶離剤シクロヘキサン／酢酸エチル）によって精製する。３８２ｍｇ（４７％収率）のＮ－（４－ブロモピリジン－２－イル）－２－メチルプロパンアミドが無色固体として得られる。

ｌｏｇＰ（ｐＨ　２．７）：２．０９

ＭＳ（ＥＳＩ）：２４４．９（［Ｍ＋Ｈ］$^+$）

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ｄ$_3$－ＣＤ$_3$ＣＮ）：δ＝８．７０（ｓ，１Ｈ，ｂｒ）、８．４０（ｄ，１Ｈ）、８．１２（ｄ，１Ｈ）、７．２５（ｄｄ，１Ｈ）、２．６５（ｍ，１Ｈ）、１．１５（ｄ，６Ｈ）ｐｐｍ

製法（Ｖ３）による式［ＩＩＩ］の出発材料の製造：

４－［３－（４－フルオロフェニル）－１－イソプロピル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－２－アミン［ＩＩＩ－１］

２００ｍｇ（０．６ミリモル）の３－（４－フルオロフェニル）－１－イソプロピル－４－（４，４，５，５－テトラメチル－１，３，２－ジオキサボロラン－２－イル）１Ｈ－ピラゾールおよび１６６ｍｇ（０．７２ミリモル）の（４－クロロピリジン－２－イル）カルバミン酸ｔｅｒｔ－ブチルを３ｍＬの１，４－ジオキサンに溶解させる。これに、４４．７ｍｇのビス（トリシクロヘキシルホスフィン）パラジウム（ＩＩ）二塩化物（０．０６ミリモル）および２ｍＬの炭酸ナトリウム溶液（２モラー）を加える。反応混合物をアルゴンで５分間フラッシュし、次いで、シールする。次いで、混合物をマイクロ波（ＣＥＭエクスプローラー）にて１５０℃で１２分間加熱する。冷却の後、不溶性成分を濾去し、塩残渣を１，４－ジオキサンで洗浄する。有機相を蒸発させ、粗生成物をシリカゲルグロマトグラフィー（溶離剤シクロヘキサン／酢酸エチル）によって精製する。４５．４ｍｇ（２５％収率）の４－［３－（４－フルオロフェニル）－１－イソプロピル－Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－２－アミンが無色固体として得られる。

【０３９１】

ｌｏｇＰ（ｐＨ　２．７）：１．２２

ＭＳ（ＥＳＩ）：２９７．１３（［Ｍ＋Ｈ］$^+$）

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ｄ$_3$－ＣＤ$_3$ＣＮ）：δ＝７．８０（ｍ，２Ｈ）、７．５０（ｄｄ，２Ｈ）、７．１０（ｄｄ，１Ｈ）、６．４７（ｄ，１Ｈ）、６．３９（ｓ，１Ｈ）、５．１０（ｓ，２Ｈ，ｂｒ）、４．５３（ｍ，１Ｈ）、１．２０（ｄ，６Ｈ）ｐｐｍ

製法（Ｖ２６）による式［ＩＩＩ］の出発材料の製造：

４－［３－（４－フルオロフェニル）－１－（２－メトキシエチル）－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－２－アミン［ＩＩＩ－２］

２５７ｍｇ（０．８６ミリモル）の４－ブロモ－３－（４－フルオロフェニル）－１－（２－メトキシエチル）－１Ｈ－ピラゾールおよび３０３ｍｇ（０．９４ミリモル）のｔｅｒｔ－ブチル－［４－（４，４，５，５－テトラメチル－１，３，２－ジオキサボロラン－２－イル）ピリジン－２－イル］カルバメートを４ｍＬの１，４－ジオキサンに溶解させる。これに、５０．８ｍｇのビス（トリシクロヘキシルホスフィン）－パラジウム（ＩＩ）二塩化物（０．０４ミリモル）および２ｍＬの炭酸ナトリウム溶液（Ｈ２Ｏ中２Ｍ）を加える。反応混合物をアルゴンで５分間フラッシュし、次いで、シールする。次に、混合物をマイクロ波（ＣＥＭエクスプローラー）にて１５０℃で１２分間加熱する。冷却の後、不溶性成分を濾去し、塩残渣を１，４－ジオキサンで洗浄する。有機相を蒸発させ、粗生成物をシリカゲルクロマトグラフィー（溶離剤ジクロロメタン／１０％メタノール－ジクロロメタン）によって精製する。２５５ｍｇ（８６％収率）の４－［３－（４－フルオロフェニル）－１－（２－メトキシエチル）－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－２－アミンが無色固体として得られる。

ｌｏｇＰ（ｐＨ　２．７）：０．９８
ＭＳ（ＥＳＩ）：３１３．１５（［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$）
^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ｄ３－ＣＤ$_{3}$ＣＮ）：δ＝７．８５（ｄ，１Ｈ）、７．７７（ｓ，１Ｈ）、７．４８－７．４６（ｍ，２Ｈ）、７．１２－７．０９（ｍ，２Ｈ）、６．４４（ｄｄ，１Ｈ）、６．３７（ｓ，１Ｈ）、４．７９（ｓ，２Ｈ，ｂｒ）、４．２９（ｔ，２Ｈ）、３．７７（ｔ，２Ｈ）、３．３１（ｓ，３Ｈ）ｐｐｍ

記載された方法と同様に、タイプ［ＩＩＩ］の以下の化合物を調製することもできる：

４－［１－エチル－３－（４－フルオロフェニル）－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－２－アミン［ＩＩＩ－３］
ｌｏｇＰ（ｐＨ　２．７）：０．９７
ＭＳ（ＥＳＩ）：２８３．３２（［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$）
^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ｄ３－ＣＤ$_{3}$ＣＮ）：δ＝７．８５（ｍ，１Ｈ）、７．７７（ｓ，１Ｈ）、７．４８－７．４６（ｍ，２Ｈ）、７．１２－７．０９（ｍ，２Ｈ）、６．４５（ｄｄ，１Ｈ）、６．３７（ｓ，１Ｈ）、４．８２（ｓ，２Ｈ，ｂｒ）、４．２０（ｑ，２Ｈ）、１．４９（ｔ，３Ｈ）ｐｐｍ

４－［１－（２，２－ジフルオロエチル）－３－（４－フルオロフェニル）－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－２－アミン［ＩＩＩ－４］
ｌｏｇＰ（ｐＨ　２．７）：１．０３
ＭＳ（ＥＳＩ）：３１９．４８（［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$）
^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ｄ３－ＣＤ$_{3}$ＣＮ）：δ＝７．８６（ｄ，１Ｈ）、７．８２（ｓ，１Ｈ）、７．４８－７．４６（ｍ，２Ｈ）、７．１２－７．０９（ｍ，２Ｈ）、６．４４（ｄｄ，１Ｈ）、６．３７（ｓ，１Ｈ）、６．２６（ｔｄ，１Ｈ）、４．８７（ｓ，１Ｈ）、ｂｒ）、４．５７（ｄｔ，２Ｈ）ｐｐｍ

４－［３－（４－フルオロフェニル）－１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－２－アミン［ＩＩＩ－５］
ｌｏｇＰ（ｐＨ　２．７）：０．７１
ＭＳ（ＥＳＩ）：２６９．２（［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$）
^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ｄ６－ＤＭＳＯ）：δ＝７．９５（ｓ，１Ｈ）、７．８１（ｍ，１Ｈ）、７．４５－７．４２（ｍ，２Ｈ）、７．２１－７．１８（ｍ，２Ｈ）、６．３１－６．２９（ｍ，２Ｈ）、５．８０（ｓ，２Ｈ，ｂｒ）、３．９０（ｓ，３Ｈ）ｐｐｍ

式［ＸＶ－ａ］の中間体の製造：

２－メトキシ－Ｎ－［４－（４，４，５，５－テトラメチル－１，３，２－ジオキサボロラン－２－イル）ピリジン－２－イル］アセトアミド［ＸＶ－ａ－１］

２．０ｇ（８．５ミリモル）のＮ－（４－ブロモピリジン－２－イル）－２－メトキシアセトアミドおよび２．４ｇ（９．３ミリモル）のビス－（ピナコラト）－ジボランを５０ｍＬの乾燥ジオキサンに溶解させる。これに、２．５０ｇの酢酸カリウム（２５．５ミリモル）および０．３１ｇ（０．３８ミリモル）の１，１’－ビス（ジフェニルホスフィノ）フェロセン］ジクロロ－パラジウム（ＩＩ）＊ＣＨ$_{2}$Ｃｌ$_{2}$を加え、反応混合物をアルゴン流下で８０℃にて３時間加熱する。この後、反応混合物を冷却し、水を加え、酢酸エチルで数回抽出する。次に、有機相を乾燥し（Ｎａ$_{2}$ＳＯ$_{4}$）、濃縮する。精製は、溶離剤ヘキサン／エーテル（３：１）でのシリカゲルクロマトグラフィーによって行う。１．３４ｇ（５３％収率）の２－メトキシ－Ｎ－［４－（４，４，５，５－テトラメチル－１，３，２－ジオキサボロラン－２－イル）ピリジン－２－イル］アセトアミドが無色固体として得られる。
ｌｏｇＰ（ｐＨ　２．７）：－０．１８
ＭＳ（ＥＳＩ）：２１１．１３（［Ｍ（－ｐｉｎａｃｏｌ）＋Ｈ］$^{+}$）
^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ｄ$_{3}$－ＣＤ$_{3}$ＣＮ）：δ＝８．７５（ｓ，１Ｈ，ｂｒ）、８．３８（ｓ，１Ｈ）、８．３３（ｄ，１Ｈ）、７．３３（ｍ，１Ｈ）、４．００（ｓ，２Ｈ）、３．４６（ｓ，３Ｈ）、１．３４（ｓ，１２Ｈ）ｐｐｍ

Ｎ－［４－（４，４，５，５－テトラメチル－１，３，２－ジオキサボロラン－２－イル）ピリジン－２－イル］プロパンアミド［ＸＶ－ａ－２］
１．８０ｇ（７．９ミリモル）のＮ－（４－ブロモピリジン－２－イル）プロパンアミドおよび２．１９ｇ（８．６ミリモル）のビス－（ピナコラト）－ジボランを５０ｍＬの乾燥ジオキサンに溶解させる。これに、２．３１ｇの酢酸カリウム（２３．６ミリモル）および０．３５ｇ（０．４３ミリモル）の１，１’－ビス（ジフェニルホスフィノ）フェロセン］ジクロロ－パラジウム（ＩＩ）＊CH_2Cl_2を加え、反応混合物をアルゴン流下で８０℃にて３時間加熱する。この後、反応混合物を冷却し、水を加え、酢酸エチルで数回抽出する。次に、有機相を乾燥し（Na_2SO_4）、濃縮する。精製を、溶離剤ヘキサン／エーテル（３：１）でのシリカゲルクロマトグラフィーによって行う。０．８７０ｇ（３６％収率）のＮ－［４－（４，４，５，５－テトラメチル－１，３，２－ジオキサボロラン－２－イル）ピリジン－２－イル］プロパンアミドが無色固体として得られる。
^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，d_3－CD_3CN）：δ＝８．５５（ｓ，１Ｈ，ｂｒ）、８．３７（ｓ，１Ｈ）、８．２８（ｄ，１Ｈ）、７．２７（ｍ，１Ｈ）、２．４３（ｑ，２Ｈ）、１．３４（ｓ，１２Ｈ）、１．１５（ｔ，３Ｈ）ｐｐｍ
２－フェニル－Ｎ－［４－（４，４，５，５－テトラメチル－１，３，２－ジオキサボロラン－２－イル）ピリジン－２－イル］アセトアミド［ＸＶ－ａ－３］
１．４０ｇ（４．８１ミリモル）のＮ－（４－ブロモピリジン－２－イル）－２－フェニルアセトアミドおよび１．３４ｇ（５．３ミリモル）のビス－（ピナコラト）－ジボランを５０ｍＬの乾燥ジオキサンに溶解させる。これに、１．４２ｇの酢酸カリウム（１４．３ミリモル）および０．１８ｇ（０．２２ミリモル）の１，１’－ビス（ジフェニルホスフィノ）フェロセン］ジクロロ－パラジウム（ＩＩ）＊CH_2Cl_2を加え、反応混合物をアルゴン流の下で８０℃にて３時間加熱する。この後、反応混合物を冷却し、水を加え、酢酸エチルで数回抽出する。次に、有機相を乾燥し（Na_2SO_4）、濃縮する。精製は、ヘキサン／エーテル（３：１）での生成物のトリチュレーションによって行う。０．８７ｇ（５４％収率）の２－フェニル－Ｎ－［４－（４，４，５，５－テトラメチル－１，３，２－ジオキサボロラン－２－イル）ピリジン－２－イル］アセトアミドが無色固体として得られる。
^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，d_3－CD_3CN）：δ＝８．６８（ｓ，１Ｈ，ｂｒ）、８．３３（ｓ，１Ｈ）、８．２８（ｄ，１Ｈ）、７．３６（ｍ，５Ｈ）、７．２７（ｍ，１Ｈ）、３．７２（ｓ，２Ｈ）、１．３２（ｓ，１２Ｈ）ｐｐｍ
タイプ［ＸＶ－ａ］の以下の中間体も同様に製造することができる：
２－メチル－Ｎ－［４－（４，４，５，５－テトラメチル－１，３，２－ジオキサボロラン－２－イル）ピリジン－２－イル］プロパンアミド［ＸＶ－ａ－４］
ｌｏｇＰ（ｐＨ　２．７）：０．０４
ＭＳ（ＥＳＩ）：２０９．１（［Ｍ－Ｃ６Ｈ１２］$^+$）
^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，CD_3CN）：δ＝８．３９（ｓ，１Ｈ）、８．２９（ｄ，１Ｈ）、７．２８（ｄ，１Ｈ）、１．９４（ｍ，１Ｈ）、１．３４（ｓ，１２Ｈ）、１．１７（ｄ，６Ｈ）ｐｐｍ
２－シクロプロピル－Ｎ－［４－（４，４，５，５－テトラメチル－１，３，２－ジオキサボロラン－２－イル）ピリジン－２－イル］アセトアミド［ＸＶ－ａ－５］
ｌｏｇＰ（ｐＨ２．７）：０．２７
ＭＳ（ＥＳＩ）：２２１．１（［Ｍ－Ｃ６Ｈ１２］$^+$）
^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，CD_3CN）：δ＝８．６０（ｓ，１Ｈ，ｂｒ）、８．３９（ｓ，１Ｈ）、８．２９（ｄ，１Ｈ）、７．２８（ｄ，１Ｈ）２．２９（ｄ，２Ｈ）、１．３４（ｓ，１２Ｈ）、１．１０（ｍ，１Ｈ）、０．５７（ｍ，２Ｈ）、０．２５（ｍ，２Ｈ）ｐｐｍ
［４－（４，４，５，５－テトラメチル－１，３，２－ジオキサボロラン－２－イル）ピリジン－２－イル］カルバミン酸エチル［ＸＶ－ａ－６］
ｌｏｇＰ（ｐＨ　２．７）：０．００

ＭＳ（ＥＳＩ）：２１１．１（［Ｍ－Ｃ６Ｈ１２］$^{+}$）
^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ＣＤ$_{3}$ＣＮ）：δ＝８．２８（ｍ，２Ｈ）、８．１８（ｓ，１Ｈ）、７．２４（ｄ，１Ｈ）、１．９４（ｍ，１Ｈ）、４．２１（ｑ，２Ｈ）、１．３４（ｓ，１２Ｈ）、１．２９（ｔ，３Ｈ）ｐｐｍ
Ｎ－［４－（４，４，５，５－テトラメチル－１，３，２－ジオキサボロラン－２－イル）ピリジン－２－イル］シクロプロパンカルボキサミド［ＸＶ－ａ－７］
ｌｏｇＰ（ｐＨ ２．７）：０．００
ＭＳ（ＥＳＩ）：２０７．１（［Ｍ－Ｃ６Ｈ１２］$^{+}$）
^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ＣＤ$_{3}$ＣＮ）：δ＝８．３６（ｓ，１Ｈ）、８．２９（ｄ，１Ｈ）、７．２７（ｄ，１Ｈ）、１．８０（ｍ，１Ｈ）、１．３３（ｓ，１２Ｈ）、０．９３（ｍ，３Ｈ）、０．８４（ｍ，２Ｈ）ｐｐｍ
式［ＸＩＩＩ］の中間体の製造：
４－ブロモ－１－（テトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－２－イル）－１Ｈ－ピラゾール［ＸＩＩＩ－１］
２３４．７ｇの臭素（７５．２６ｍｌ、１．４７３モル）を、４０℃まで予め加熱したＨ$_{2}$Ｏ（４００ｍｌ）中のピラゾール（１００ｇ、１．４７モル）の溶液に滴下する。反応溶液を加熱し、還流下で３０分間攪拌する（ＴＬＣ、ヘキサン：ＥｔＯＡｃ １：１、Ｒ$_{f}$＝０．６）。反応溶液（ｐＨ＝３）の室温への冷却の後、濃ＮａＯＨ（水溶液）を滴下し、ｐＨを８に調整する（白色沈殿の沈積）。得られた懸濁液を濾過し、残渣を氷冷Ｈ$_{2}$Ｏ（１５０ｍｌ）で洗浄し、次いで、真空下で乾燥する。１９５．４７ｇの中間体４－ブロモ－１Ｈ－ピラゾール（９１％収率、純度レベル９９％）が白色固体として得られ、これをさらに精製することなくさらに反応させる。
【０３９２】
４－ブロモ－１Ｈ－ピラゾール（１８１ｇ、１．２３モル）、３，４－ジヒドロ－２Ｈ－ピラン（１５５．５ｇ、１６８．６ｍｌ、１．８５モル）およびトリフルオロ酢酸（０．８４ｇ、０．５７ｍｌ、７．４０ミリモル）の懸濁液を加熱し、還流下で５時間攪拌する。次に、ＮａＨ（１．１８ｇ、０．０５モル）の添加後に得られた粗生成物を分別蒸留する。２５３ｇの４－ブロモ－１－（テトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－２－イル）－１Ｈ－ピラゾール（８９％）が無色液体として得られる（０．０２ｍｍＨｇの圧力においてＢ．Ｐｔ．８８－９０℃）。
【０３９３】
分光分析データは文献に記載されたデータに対応する（Ａｃｔａ Ｃｈｅｍ．Ｓｃａｎｄ．Ｓｅｒｉｅｓ Ｂ：Ｏｒｇａｎｉｃ Ｃｈｅｍｉｓｔｒｙ ａｎｄ Ｂｉｏｃｈｅｍｉｓｔｒｙ １９８２，３６，２，１０１－１０８）。
１Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ｄ$_{3}$－ＣＤ$_{3}$ＣＮ）：δ＝７．７８（ｓ，１Ｈ）、７．４７（ｓ，１Ｈ）、５．３３（ｄｄ，１Ｈ）、３．９５（ｍ，１Ｈ）、３．６５（ｍ，１Ｈ）、２．１０－２．００（ｍ，２Ｈ）、１．７０－１．５０（ｍ，４Ｈ）ｐｐｍ
式［ＸＩＩ］の中間体の製造：
４－［１－（テトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－２－イル）－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン［ＸＩＩ－１］
４．８８ｇのＰｄ（ＰＰｈ$_{3}$）$_{4}$（４．２２ミリモル、２．５モル％）を、ジオキサン（２０００ｍＬ）中の３９．０ｇの４－ブロモ－１－（テトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－２－イル）－１Ｈ－ピラゾール（０．１７モル）、６７５ｍＬの水性Ｎａ$_{2}$ＣＯ$_{3}$（Ｈ$_{2}$Ｏ中２．０モラー、１．３５モル）および２５．１ｇの４－ピリジンボロン酸（０．２１モル）の懸濁液に加える。反応混合物をブランケット雰囲気下で、かつ還流下で８０℃にて加熱し、４１時間攪拌する。次に、反応をＨ$_{2}$Ｏ（５０ｍＬ）で処理する。反応溶液を容量の１／４まで濃縮し、酢酸エチル（３×３００ｍＬ）で抽出する。合わせた有機相を飽和ＮａＣｌ溶液で洗浄し、次いで、ＭｇＳＯ$_{4}$で乾燥する。得られた相生成物をクーゲルロール蒸留（ｐ＝０．０２ｍｍＨｇにおいてＢ．Ｐｔ．１３０から１３５℃）によって精製する。２６．３７ｇが得られる（９７．３％の純度レベルまでを達成することができた

。２６．３７ｇの４－［１－（テトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－２－イル）－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン（６８％）が黄色の高度に粘性な油として得られた。
ｌｏｇＰ（ｐＨ　２．７）：０．３８
ＭＳ（ＥＳＩ）：２３０．１（［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$）
１Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ｄ$_{3}$－ＣＤ$_{3}$ＣＮ）：δ＝８．４９（ｄ，２Ｈ）、８．２０（ｓ，１Ｈ）、７．９４（ｓ，１Ｈ）、７．４８（ｄ，２Ｈ）、５．３９（ｄｄ，１Ｈ）、４．００（ｍ，１Ｈ）、３．６９（ｍ，１Ｈ）、２．１０－２．００（ｍ，２Ｈ）、１．７０－１．５０（ｍ，４Ｈ）ｐｐｍ
式［ＸＩ］の中間体の製造：
４－［１－（テトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－２－イル）－５－（トリブチルスタニル）－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン［ＸＩ－１］
１３．５ｍＬのｎ－ブチルリチウム（ｎ－ヘキサン中２．５モラー、３３．７５ミリモル）を、ブランケットガス雰囲気下で、かつ攪拌しつつ、－７０℃にて、乾燥ＴＨＦ（２００ｍＬ）中の７．０ｇの４－［１－（テトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－２－イル）－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン（３０．５ミリモル）の溶液に加える。添加の完了後に、混合物をこの温度でさらに１時間攪拌する。この後、９．５ｇの塩化トリ－Ｎ－ブチルスズ（２９．２ミリモル）を加える。次に、反応混合物を室温まで加温し、次いで、この温度でさらに１５分間攪拌する。全ての揮発性成分を真空下で蒸発させ、残渣を高真空下で（＜０．１ミリバール）蒸留する。１３０℃を超える沸点を持つ画分を単離し、さらに、クロマトグラフィー（ｎ－ヘキサン／ジエチルエーテル＝１：４溶離剤）によって精製する。７．５ｇの４－［１－（テトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－２－イル）－５－（トリブチルスタニル）－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン（４５％）が得られる。
ｌｏｇＰ（ｐＨ　２．７）：５．０９
ＭＳ（ＥＳＩ）：５２０．１（［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$）
^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ｄ$_{3}$－ＣＤ$_{3}$ＣＮ）：δ＝８．５０（ｄ，２Ｈ）、８．２０（ｓ，１Ｈ）、７．９４（ｓ，１Ｈ）、７．４８（ｄ，２Ｈ）、５．４０（ｄｄ，１Ｈ）、４．００（ｍ，１Ｈ）、３．６８（ｍ，１Ｈ）、２．１０－２．００（ｍ，２Ｈ）、１．７０－１．５０（ｍ，１０Ｈ）、１．４０－１．３０（ｍ，６Ｈ）、１．１０－１．００（ｍ，６Ｈ）、０．８９（ｔ，９Ｈ）ｐｐｍ
式［Ｘ］の中間体の製造：
４－［５－（４－フルオロフェニル）－１－（テトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－２－イル）－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン［Ｘ－１］
２５０ｍｇ（０．４８ミリモル）の４－［１－（テトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－２－イル）－５－（トリブチルスタニル）－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジンおよび１２６ｍｇ（０．７２ミリモル）の４－ブロモフルオロベンゼンを３ｍＬのジメチルホルムアミド中で攪拌する。これに、１４６ｍｇのフッ化セシウム（０．９６ミリモル）、８４ｍｇのテトラキス（トリフェニルホスフィン）－パラジウム（０）（０．０７ミリモル、１５モル％）および９ｍｇのヨウ化銅（Ｉ）（０．０５ミリモル、１０モル％）を加え、混合物をブランケットガスで５分間脱気する。この後、混合物をマイクロ波（ＣＥＭ　Ｄｉｓｃｏｖｅｒ）にて１５０℃で２０分間加熱する。次に、粗混合物をＣｅｌｉｔｅでのカートリッジを通して濾過し、揮発性成分を真空下で除去する。粗生成物をシリカゲル上のクロマトグラフィー（シクロヘキサン／酢酸エチル）によって精製し、４７．４ｍｇの４－［５－（４－フルオロフェニル）－１－（テトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－２－イル）－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン（３０％）および４１ｍｇの開裂生成物４－［３－（４－フルオロフェニル）－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン［ＩＸ－１］（３５％）が無色油として得られる。
【０３９４】
４－［５－（４－フルオロフェニル）－１－（テトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－２－イル）－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン［Ｘ－１］
ｌｏｇＰ（ｐＨ　２．７）：１．２３

ＭＳ（ＥＳＩ）：３２４．１８（［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$）
^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ｄ$_{3}$－ＣＤ$_{3}$ＣＮ）：δ＝８．３６（ｄｄ，２Ｈ）、７．９０（ｓ，１Ｈ）、７．４２（ｄｄ，２Ｈ）、７．２６（ｄｄ，２Ｈ）、７．０９（ｄｄ，２Ｈ）、５．０１（ｄｄ，１Ｈ）、３．９６（ｍ，１Ｈ）、２．４０（ｍ，１Ｈ）、１．８２（ｍ，１Ｈ）、１．７０－１．４５（ｍ，３Ｈ）、１．３５－１．２５（ｍ，１Ｈ）ｐｐｍ

式［ＩＸ］の中間体の製造：

４－［３－（４－フルオロフェニル）－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン［ＩＸ－１］

一般手法Ｖ１１で製造された中間体もまたさらに精製することなく脱保護反応で用いることもできる。

【０３９５】

前記手法（Ｖ１１）と同様に７５０ｍｇ（１．４５ミリモル）の４－［１－（テトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－２－イル）－５－（トリブチルスタニル）－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン、３８０ｍｇ（２．１７ミリモル）の４－ブロモフルオロ－ベンゼン、４４０ｍｇのフッ化セシウム（２．８９ミリモル）、２５０ｍｇのテトラキス（トリフェニルホスフィン）－パラジウム（０）（０．２８ミリモル、１５モル％）および２８ｍｇのヨウ化銅（Ｉ）（０．１５ミリモル、１０モル％）を反応させる。Ｃｅｌｉｔｅ上での濾過による不溶性成分の除去および真空下での揮発性成分の除去の後に９５０ｍｇの粗生成物が得られる。

【０３９６】

粗生成物を５ｍＬメタノールに溶解させ、ジオキサン中の５．８ｍＬのＨＣｌ（４モラー）で処理する。溶液を室温で１．５時間攪拌し、次いで、濃縮する。得られた固体をジエチルエーテルで数回トリチュレートし、３８７ｍｇの４－［３－（４－フルオロフェニル）－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン塩酸塩（７５％）が白色固体として得られる。これから、該塩酸塩を酢酸エチルに溶解させ、炭酸ナトリウムで洗浄することによって、遊離４－［３－（４－フルオロフェニル）－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジンが塩フリーなピラゾールの形態で得ることができる。

【０３９７】

４－［３－（４－フルオロフェニル）－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン塩酸塩［ＩＸ－１］
ｌｏｇＰ（ｐＨ　２．７）：０．６５
ＭＳ（ＥＳＩ）：２４０．１１（［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$）
^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ｄ$_{3}$－ＣＤ$_{3}$ＣＮ）：δ＝１１．３（ｓ，０．５Ｈ）、８．４４（ｄｄ，２Ｈ）、７．８９（ｓ，１Ｈ，ｂｒ）、７．４５（ｄｄ，２Ｈ）、７．４０（ｓ，０．５Ｈ，ｂｒ）、７．２３（ｄｄ，２Ｈ）、７．１５（ｍ，２Ｈ）ｐｐｍ

製法（Ｖ７）による式［Ｉ］の化合物の製造：

４－［３－（４－フルオロフェニル）－１－イソプロピル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］キノリン［Ｉ－１］

７９ｍｇ（０．２４ミリモル）の３－（４－フルオロフェニル）－１－イソプロピル－４－（４，４，５，５－テトラメチル－１，３，２－ジオキサボロラン－２－イル）－１Ｈ－ピラゾールおよび５９ｍｇ（０．３６ミリモル）の４－クロロキノリンを２．５ｍＬの１，４－ジオキサンに溶解させる。これに、１７．７ｍｇの１，１’－ビス（ジフェニルホスフィノ）フェロセン］ジクロロパラジウム（ＩＩ）＊ＣＨ$_{2}$Ｃｌ$_{2}$（０．０１ミリモル）および０．５ｍＬの炭酸ナトリウム溶液（２モラー）を加える。反応混合物をアルゴンで５分間フラッシュし、次いで、シールする。次に、混合物をマイクロ波（ＣＥＭエクスプローラー）にて１５０℃で１２分間加熱する。冷却後、不溶性成分をＣｅｌｉｔｅ上で濾去し、残渣を１，４－ジオキサンで洗浄する。有機相を蒸発させ、粗生成物を、分取用ＨＰＬＣ（ＸＴｅｒｒａ　１２５×１９ｍｍ、５μｍ、グラジエント：０から１．５分　８０％水、１５％メタノール、５％水性１０％ＮＨ$_{4}$ＨＣＯ$_{3}$溶液、１．５から１０

．０分の直線状グラジエント　０％水、９５％メタノール、５％水性１０％NH_4HCO_3溶液まで、１０．０から１５．０分　０％水、９５％メタノール、５％水性１０％NH_4HCO_3溶液）によって精製する。２５ｍｇ（２２％）の４－［３－（４－フルオロフェニル）－１－イソプロピル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］キノリンが無色固体として得られる。

ｌｏｇＰ（ｐＨ　２．７）：２．２３

ＭＳ（ＥＳＩ）：３３２．０７（［Ｍ＋Ｈ］$^+$）

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，d_6－ＤＭＳＯ）：δ＝８．８６（ｄ，１Ｈ）、８．１５（ｓ，１Ｈ）、８．０５（ｄ，１Ｈ）、７．７５－７．７０（ｍ，２Ｈ）、７．４８（ｍ，１Ｈ）、７．３５（ｄ，１Ｈ）、７．２８（ｄｄ，２Ｈ）、７．０３（ｔ，２Ｈ）、４．６５（ｍ，１Ｈ）、１．５６（ｄ，６Ｈ）ｐｐｍ

製法（Ｖ６）による式［Ｉ］の化合物の製造：

Ｎ－｛４－［３－（４－フルオロフェニル）－１－（２－メトキシエチル）－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－２－イル｝プロパンアミド［Ｉ－２］

５０ｍｇ（０．１８ミリモル）のＮ－［４－（４，４，５，５－テトラメチル－１，３，２－ジオキサボロラン－２－イル］ピリジン－２－イル］プロパンアミドおよび４２ｍｇ（０．１３ミリモル）の４－ブロモ－３－（４－フルオロフェニル）－１－（２－メトキシエチル）－１Ｈ－ピラゾールを２．５ｍＬの１，４－ジオキサンに溶解させる。これに、１１．３ｍｇの１，１’－ビス（ジフェニルホスフィノ）フェロセン］－ジクロロパラジウム（ＩＩ）＊CH_2Cl_2（０．０１ミリモル）および１ｍＬの炭酸セシウム溶液（２モラー）を加える。反応混合物をアルゴンで５分間フラッシュし、次いで、シールする。次に、混合物をマイクロ波（ＣＥＭエクスプローラー）にて９０℃で２５分間加熱する。冷却後、不溶性成分をＣｅｌｉｔｅ上で濾去し、残渣を１，４－ジオキサンで洗浄する。有機相を蒸発させ、粗生成物を分取用ＨＰＬＣ（Ｍａｃｈｅｒｅｙ　Ｎａｇｅｌ、Ｎｕｃｌｅｏｄｕｒ　Ｃ１８　１００－５ｅｃ、ＶＰ５０×２１ｍｍ、グラジエント：０から１．５分　９０％水、１０％メタノール、１．５から１０．０分　直線状グラジエント　５％水、９５％メタノールまで、１０．０から１５．０分　０％水、９５％メタノール、モディファイヤーＨ２Ｏ中の２０％ＨＣＯＯＨ、分離を通じて２．０ｍＬ／分にてモディファイヤーの添加）によって精製する。４６ｍｇ（６９％）のＮ－｛４－［３－（４－フルオロフェニル）－１－（２－メトキシエチル）－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－２－イル｝プロパンアミドが無色固体として得られる。

ｌｏｇＰ（ｐＨ　２．７）：１．６１

ＭＳ（ＥＳＩ）：３６９．２２（［Ｍ＋Ｈ］$^+$）

１Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，d_3－CD_3CN）：δ＝８．５４（ｓ，１Ｈ，ｂｒ）、８．１０（ｍ，２Ｈ）、７．８６（ｓ，１Ｈ）、７．４６（ｄｄ，２Ｈ）、７．０９（ｔ，２Ｈ）、６．８７（ｄｄ，１Ｈ）、４．３１（ｔ，２Ｈ）、３．７８（ｔ，２Ｈ）、３．３２（ｓ，３Ｈ）、２．３８（ｑ，２Ｈ）、１．１１（ｔ，２Ｈ）ｐｐｍ

製法（Ｖ１３）による式［Ｉ］の化合物の製造：

３－｛［３－（４－フルオロフェニル）－４－（ピリジン－４－イル）－１Ｈ－ピラゾール－１－イル］メチル｝ベンゾニトリル［Ｉ－３］

３－｛［５－（４－フルオロフェニル）－４－（ピリジン－４－イル）－１Ｈ－ピラゾール－１－イル］メチル｝ベンゾニトリル［Ｉ－４］

６０ｍｇ（０．２５ミリモル）の４－［３－（４－フルオロフェニル）－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジンを２ｍＬのジメチルホルムアミドに溶解させる。これに、鉱油中の６０％懸濁液としての１２．７ｍｇの水素化ナトリウム（０．３２モル）を加え、それを室温にて１０分間攪拌する。次に、７４ｍｇ（０．３８ミリモル）の３－（ブロモメチル）ベンゾニトリルを加え、反応混合物を室温で１時間攪拌する。仕上げ処理のために、約２μＬの酢酸（０．０３ミリモル）を加える。得られた懸濁液を濾過し、粗生成物を、分取用ＨＰＬＣ（ＸＴｅｒｒａ　１２５×１９ｍｍ、５μｍ、グラジエント：０から１．５分　８０％水、１５％メタノール、５％水性１０％NH_4HCO_3溶液、１．５から

１０．０分　直線状グラジエント、１５％水、８５％メタノール、５％水性１０％NH_4HCO_3溶液まで、１０．０から１５．０分　１５％水、８０％メタノール、５％水性１０％NH_4HCO_3溶液）によって精製する。２７ｍｇ（３０％）の主たる異性体３－｛［３－（４－フルオロフェニル）－４－（ピリジン－４－イル）－１Ｈ－ピラゾール－１－イル］メチル｝ベンゾニトリル［Ｉ－３］が、従たる位置異性体３－｛［５－（４－フルオロフェニル）－４－（ピリジン－４－イル）－１Ｈ－ピラゾール－１－イル］メチル｝ベンゾニトリル［Ｉ－４］無色固体との（比率５８：３７の）混合物として得られる。
ｌｏｇＰ（ｐＨ２．７）：１．５１　主たる異性体
ｌｏｇＰ（ｐＨ２．７）：１．３８　従たる異性体
ＭＳ（ＥＳＩ）：双方の異性体について３５５．２（［Ｍ＋Ｈ］$^+$）
^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，d_3－CD_3CN）：δ＝８．４７（ｄｄ）、８．３７（ｍ）、８．１６（ｓ）、７．８６（ｓ）、７．８１（ｄ）、７．７０（ｍ）、７．５０（ｔ）、７．４５－７．３０（ｍ）、７．２５－７．１０（ｍ）、７．１２（ｄｄ）、５．４７（ｓ，２Ｈ，CH_2　主たる異性体）、５．２７（ｓ，２Ｈ，CH_2　側鎖異性体）ｐｐｍ

前記実施例と同様に、かつ本発明による該製法の一般的記載に従って、以下の表１に名称を挙げた式［Ｉ］の化合物を得ることができる。これらは異性体混合物の形態で得ることができ、ここで、主たるおよび従たる異性体の比率は用いた基質に応じて異なり得る。

【０３９８】

製法（Ｖ４）による式［Ｉ－ｃ］の化合物の製造：

Ｎ－｛４－［３－（４－フルオロフェニル）－１－イソプロピル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－２－イル｝シクロプロパンカルボキサミド［Ｉ－ｃ－１］

２２ｍｇ（０．０７７ミリモル）の４－［３－（４－フルオロフェニル）－１－イソプロピル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－２－アミンおよび１２μＬ（０．０８４ミリモル）のトリエチルアミンを２ｍＬのテトラヒドロフランに溶解させる。これに、８．８ｍｇのシクロプロパンカルボン酸塩化物（０．０８４ミリモル）を加え、反応混合物を室温にて２日間攪拌する。次に、揮発性成分を真空下で除去し、粗材料をメタノール中の３ｍＬのNH_3（７モラー）で処理する。混合物を室温にて２時間攪拌し、次いで蒸発させる。粗生成物をシリカゲルクロマトグラフィー（溶離剤シクロヘキサン／酢酸エチル）によって精製する。１１．２ｍｇ（４０％）のＮ－｛４－［３－（４－フルオロフェニル）－１－イソプロピル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－２－イル｝シクロプロパンカルボキサミドが無色固体として得られる。
ｌｏｇＰ（ｐＨ　２．７）：２．０７
ＭＳ（ＥＳＩ）：３６５．１３（［Ｍ＋Ｈ］$^+$）
１Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，d_3－CD_3CN）：δ＝８．８２（ｓ，１Ｈ，ｂｒ）、８．１１（ｄ，１Ｈ）、８．０７（ｓ，１Ｈ）、７．８５（ｓ，１Ｈ）、７．４４（ｄｄ，２Ｈ）、７．０６（ｔ，２Ｈ）、６．８６（ｄｄ，１Ｈ）、４．５４（ｍ，１Ｈ）、１．７８（ｍ，１Ｈ）、１．５１（ｄ，６Ｈ）、０．９０－０．８０（ｍ，４Ｈ）ｐｐｍ

製法（Ｖ５）による式［Ｉ－ｃ］の化合物の製造：

４－［３－（４－フルオロフェニル）－１－イソプロピル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］キノリン［Ｉ－ｃ－２］

８０ｍｇ（０．１８ミリモル）の３－（４－フルオロフェニル）－１－イソブチル－４－（４，４，５，５－テトラメチル－１，３，２－ジオキサボロラン－２－イル）－１Ｈ－ピラゾールおよび６８ｍｇ（０．２７ミリモル）のＮ－（４－ブロモピリジン－２－イル）－２－メチルプロパンアミドを２．５ｍＬの１，４－ジオキサンに溶解させる。これに１５ｍｇの１，１’－ビス（ジフェニルホスフィノ）フェロセン］－ジクロロ－パラジウム（ＩＩ）＊CH_2Cl_2（０．０１ミリモル）および０．５ｍＬの炭酸ナトリウム溶液（２モラー）を加える。反応混合物をアルゴンで５分間フラッシュし、次いで、シールする。次に、混合物をマイクロ波（ＣＥＭエクスプローラー）にて８０℃で２５分間加熱する。冷却後、不溶性成分をＣｅｌｉｔｅ上で濾去し、残渣を１，４－ジオキサンで洗浄

する。有機相を蒸発させ、粗生成物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶離剤シクロヘキサン／酢酸エチル）によって精製する。２９ｍｇ（４０％収率）のＮ－｛４－［３－（４－フルオロフェニル）－１－イソブチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－２－イル｝－２－メチルプロパンアミドが無色固体として得られる。

ｌｏｇＰ（ｐＨ　２．７）：２．８９

ＭＳ（ＥＳＩ）：３８１．１９（［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$）

１Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，d_3－ＣＤ$_3$ＣＮ）：δ＝８．５９（ｓ，１Ｈ，ｂｒ）、８．１０（ｍ，２Ｈ）、７．８３（ｓ，１Ｈ）、７．４６（ｄｄ，２Ｈ）、７．０９（ｄｄ，２Ｈ）、６．８６（ｍ，１Ｈ）、３．９６（ｄ，２Ｈ）、２．６２（ｍ，１Ｈ）、２．２５（ｍ，１Ｈ）、１．１３（ｄ，６Ｈ）、０．９３（ｄ，６Ｈ）ｐｐｍ

製法（Ｖ１７）による式［Ｉ－ｄ］の化合物の製造：

４－［３－（２，６－ジフルオロフェニル）－１－イソプロピル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン｛Ｉ－ｄ－１｝および

４－［５－（２，６－ジフルオロフェニル）－１－イソプロピル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン［Ｉ－ｄ－２］

５ｍｌエタノール中の１－（２，６－ジフルオロフェニル）－３－（ジメチルアミノ）－２－（ピリジン－４－イル）プロパ－２－エン－１－オン（０．８６ミリモル）、イソプロピルヒドラジン（１．３ミリモル）およびトリエチルアミン（１．３ミリモル）の混合物をマイクロ波にて１２０℃で１５分間照射する。溶媒を真空下で蒸発させ、残渣をシリカゲル上のクロマトグラフィー（グラジエント　ヘプタン／ＥＡ２０：１から５：１）に付す。６９ｍｇの４－［３－（２，６－ジフルオロ－フェニル）－１－イソプロピル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン（２５％収率）および３４ｍｇ（１２％収率）の４－［５－（２，６－ジフルオロフェニル）－１－イソプロピル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジンが得られる。

【０３９９】

４－［３－（２，６－ジフルオロフェニル）－１－イソプロピル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン

ｌｏｇＰ（ｐＨ　２．７）：１．４０

ＭＳ（ＥＳＩ）：３００．２（［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$）

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，d_6－ＤＭＳＯ）：δ＝８．４３（ｄ，２Ｈ）、８．２１（ｓ，１Ｈ）、７．７８（ｍ，１Ｈ）、７．３０（ｔ，２Ｈ）、７．１０（ｄ，２Ｈ）、４．１９（ｍ，１Ｈ）、１．３８（ｄ，６Ｈ）ｐｐｍ

４－［５－（２，６－ジフルオロフェニル）－１－イソプロピル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン

ｌｏｇＰ（ｐＨ　２．７）：１．５４

ＭＳ（ＥＳＩ）：３００．３（［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$）

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，d_6－ＤＭＳＯ）：δ＝８．５３（ｓ，１Ｈ）、８．４２（ｄ，２Ｈ）、７．６０（ｍ，１Ｈ）、７．２４（ｔ，２Ｈ）、７．１５（ｄ，２Ｈ）、４．６０（ｍ，１Ｈ）、１．５１（ｄ，６Ｈ）ｐｐｍ

製法（Ｖ１８）による式［ＸＸ］の化合物の製造：

１－シクロプロピル－３－（４－フルオロフェニル）－１Ｈ－ピラゾール［ＸＸ－１］

乾燥ＴＨＦ中の１０ｇの３－（４－フルオロフェニル）－１Ｈ－ピラゾール（６２ミリモル）、１０．５９ｇのシクロプロピルボロン酸（１２３ミリモル）、４４ｍＬトリエチルアミン（３０８ミリモル）および４０ｍＬピリジン（４９３ミリモル）の混合物を還流下で１８時間加熱する。次に、反応混合物を冷却し、Ｃｅｌｉｔｅ上で濾過し濃縮する。残渣を酢酸エチル中に取り、Ｎａ２ＣＯ３溶液で洗浄し、乾燥し、真空下で蒸発させる。粗生成物をシリカゲル上のクロマトグラフィーに付し、５ｇ（４０％）の１－シクロプロピル－３－（４－フルオロフェニル）－１Ｈ－ピラゾールが得られる。

ＭＳ（ＥＳＩ）：２０３．０（［Ｍ＋Ｈ］＋）

１Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ＣＤＣｌ３）δ＝７．７６－７．７３（ｍ，２Ｈ）７．４

３５（ｄ，Ｊ＝２．０４Ｈｚ，１Ｈ）、７．０５（ｔ，Ｊ＝８．６Ｈｚ，２Ｈ）、６．４４（ｓ，１Ｈ）、３．６４－３．５８（ｍ，１Ｈ）、１．２４－１．１４（ｍ，２Ｈ）、１．０６－１．０１（ｍ，２Ｈ）ｐｐｍ

製法（Ｖ１６）による式［ＸＸＶＩＩ］の化合物の製造：

４－［３－（２，６－ジフルオロフェニル）－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン［ＸＸＶＩＩ－１］

５ｍｌのエタノール中の１－（２，６－ジフルオロフェニル）－３－（ジメチルアミノ）－２－（ピリジン－４－イル）プロパ－２－エン－１－オン（０．８６ミリモル）、ヒドラジン水和物（１．３ミリモル）およびトリエチルアミン（１．３ミリモル）の混合物をマイクロ波にて１２０℃で１５分間照射する。溶媒を真空下で蒸発させ、残渣をジクロロメタン（ＤＣＭ）中に取り、懸濁液を濾過する。固体を真空オーブン中で５０℃にて乾燥する。０．１８ｇ（７６％収率）の４－［３－（２，６－ジフルオロフェニル）－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジンが得られる。

ｌｏｇＰ（ｐＨ　２．７）：１．５４

ＭＳ（ＥＳＩ）：２５８．１（［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$）

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ｄ$_{6}$－ＤＭＳＯ）：δ＝１３．５９（ｂｓ，１Ｈ）、８．４６（ｍ，３Ｈ）、７．６０（ｍ，１Ｈ）、７．２９（ｍ，２Ｈ）、７．１８（ｍ，２Ｈ）ｐｐｍ

製法（Ｖ１５）による式［ＸＸＶＩ］の化合物の製造：

１－（２，６－ジフルオロフェニル）－３－（ジメチルアミノ）－２－（ピリジン－４－イル）プロパ－２－エン－１－オン［ＸＸＶＩ－１］

２０ｍｌのＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド（ＤＭＦ）中の４－（２，６－ジフルオロフェニル）－２－ピリド－４－イルエタノン（１７．７ミリモル）の懸濁液をＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミドジメチルアセタール（６０．３ミリモル）で処理し、還流下で３時間加熱する。室温まで冷却した後、溶媒を真空下で蒸発させ、残渣を酢酸エチル内に取り、水性相をＥＡで３回抽出する。合わせた抽出物を$MgSO_4$上で乾燥し、真空下で蒸発させる。残渣をシリガゲル上のクロマトグラフィー（グラジエント　ヘプタン／ＥＡ　２：１から０：１）に付す。３．１ｇ（５８％）の１－（２，６－ジフルオロフェニル）－３－（ジメチルアミノ）－２－（ピリジン－４－イル）プロパ－２－エン－１－オンが得られる。

ｌｏｇＰ（ｐＨ　２．７）：０．６０

ＭＳ（ＥＳＩ）：２８９．２（［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$）

製法（Ｖ１４）による式［ＸＸＶ］の化合物の製造：

１－（２，６－ジフルオロフェニル）－２－（ピリジン－４－イル）エタノン［ＸＸＶ－１］

５８ｍｌの無水テトラヒドロフラン（ＴＨＦ）中の４－メチルピリジン（２４．６ミリモル）および２，６－ジフルオロ安息香酸エチル（２７．１ミリモル）の溶液を０℃まで冷却し、２４．６ｍｌのリチウムビストリメチルシリルアミド（ＬｉＨＭＤＳ、ヘキサン中の１モラー溶液）で滴下処理する。５から１０℃での３時間後に、水を加え、混合物を酢酸エチル（酢酸のエチルエステル）で抽出する。有機相を飽和塩化ナトリウム溶液（飽和ＮａＣｌ）で洗浄し、硫酸マグネシウム（$MgSO_4$）上で乾燥し、真空下で蒸発させる。残渣をシリカゲル上のクロマトグラフィー（グラジエント　ヘプタン／ＥＡ　３：１から１：１）に付す。４．１ｇ（５４％収率）の４－（２，６－ジフルオロフェニル）－２－ピリド－４－イルエタノンが得られる。

ｌｏｇＰ（ｐＨ　２．７）：０．６２

ＭＳ（ＥＳＩ）：２３４．１（［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$）

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ｄ$_{6}$－ＤＭＳＯ）：δ＝８．５３（ｄ，２Ｈ）、７．６５（ｍ，１Ｈ）、７．２７（ｍ，４Ｈ）、４．３４（ｓ，２Ｈ）ｐｐｍ

製法（Ｖ１９）による式［ＸＸＶＩＩＩ］の化合物の製造：

４－［５－ブロモ－３－（４－フルオロフェニル）－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピ

リジン［ＸＸＶＩＩＩ－１］
２ｍＬのＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミドおよびＮ－ブロモスクシンイミド（０．５８ミリモル）中の４－［３－（４－フルオロフェニル）－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン（０．５８ミリモル）の溶液を８０℃にて２時間加熱する。室温まで冷却した後、これを水および酢酸エチルで処理する。有機相を水で洗浄し、$MgSO_4$上で乾燥し、濾過の後、真空下で蒸発させる。残渣をジイソプロピルエーテルに懸濁させ、濾過し、真空オーブン中で５０℃にて乾燥させる。０．１３ｇ（６４％収率）の４－［５－ブロモ－３－（４－フルオロフェニル）－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジンが得られる。
ｌｏｇＰ（ｐＨ　２．７）：０．９２
ＭＳ（ＥＳＩ）：３１８．０（$[M+H]^+$）
^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，d_6－ＤＭＳＯ）：δ＝１３．８８（ｂｓ，１Ｈ）、８．６０（ｄ，２Ｈ）、７．３８（ｍ，２Ｈ）、７．２９（ｍ，４Ｈ）ｐｐｍ
製法（Ｖ２０）による式［ＩＸ－ｂ］の化合物の製造：
４－［３－（４－フルオロフェニル）－５－メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン［ＩＸ－ｂ－１］
アルゴン下で、１０．５ｍｌのジメトキシエタンおよび３ｍｌの水中の４－［５－ブロモ－３－（４－フルオロフェニル）－１－（４－メトキシベンジル）－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジンおよび４－［３－ブロモ－５－（４－フルオロフェニル）－１－（４－メトキシベンジル）－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］－ピリジン（２つの位置異性体の混合物、１：１、０．６８ミリモル）の脱気した溶液を炭酸水素ナトリウム（$NaHCO_3$、２．１ミリモル）およびジクロロ［１．１’－フェロセニルビス（ジフェニルホスファン）］パラジウム（ＩＩ）ジクロロメタン（０．０３ミリモル）の溶液に加える。これに続いて、ＴＨＦ中のトリメチルボロキシン（１．３６ミリモル）の５０％溶液を加える。混合物を９０℃にて３時間加熱し、室温まで冷却し、水および酢酸エチルで処理する。水溶液を酢酸エチルで抽出し、有機相を飽和ＮａＣｌ水溶液で洗浄し、$MgSO_4$上で乾燥し、真空下で蒸発させる。
【０４００】
ピラゾール上のＮ－置換基の除去：残渣を３ｍｌのトリフルオロ酢酸（ＴＦＡ）中に取り、６５℃にて２時間攪拌する。水および酢酸エチルの添加後に、有機相を酢酸エチルで抽出し、飽和ＮａＣｌ水溶液で洗浄し、$MgSO_4$上で乾燥し、真空下で蒸発させる。
【０４０１】
残渣をシリカゲル上のクロマトグラフィー（グラジエント　ＤＣＭ／メタノール（ＭｅＯＨ）２０：１から１０：１）に付す。８８ｍｇ（４３％収率）の４－［３－（４－フルオロフェニル）－５－メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジンが得られる。
ｌｏｇＰ（ｐＨ　２．７）：０．６０
ＭＳ（ＥＳＩ）：２５４．１（$[M+H]^+$）
^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，d_6－ＤＭＳＯ）：δ＝１３．０３（ｓ，１Ｈ）、８．５２（ｄ，２Ｈ）、７．３５（ｍ，２Ｈ）、７．１６（ｍ，４Ｈ）、２．２９（ｓ，３Ｈ）ｐｐｍ
４－［３－（４－フルオロフェニル）－５－シクロプロピル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン［ＩＸ－ｂ－２］
アルゴン下で１０．５ｍｌのジメトキシエタンおよび３ｍｌの水中の４－［５－ブロモ－３－（４－フルオロフェニル）－１－（４－メトキシベンジル）－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジンおよび４－［３－ブロモ－５－（４－フルオロフェニル）－１－（４－メトキシベンジル）－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン（２つの位置異性体の混合物、１：１、０．６８ミリモル）の脱気した溶液を、炭酸水素ナトリウム（$NaHCO_3$、２．１ミリモル）、ジクロロ［１．１’－フェロセニル－ビス（ジフェニルホスファン）］パラジウム（ＩＩ）ジクロロメタン（０．０３ミリモル）およびシクロプロピルボロン酸（１．６３ミリモル）の溶液に加える。混合物を９０℃にて３時間、および６５℃にて１６時間加熱し、室温まで冷却し、水および酢酸エチルで処理する。水溶液を酢酸エ

チルで抽出し、有機相を飽和ＮａＣｌで洗浄し。$MgSO_4$で乾燥し、真空下で蒸発させる。

【０４０２】

ピラゾール上のＮ－置換基の除去：残渣を３ｍｌのトリフルオロ酢酸（ＴＦＡ）上に取り、６５℃にて２時間撹拌する。水およびＥＡの添加の後に、有機相を酢酸エチルで抽出し、飽和ＮａＣｌで洗浄し、$MgSO_4$で乾燥し、真空下で蒸発させる。

【０４０３】

残渣をシリカゲル上のクロマトグラフィー（グラジエント　ＤＣＭ／メタノール（ＭｅＯＨ）２０：１から１０：１）に付す。７５．８ｍｇ（３８％収率）の４－［３－（４－フルオロフェニル）－５－シクロプロピル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジンが得られた。

ｌｏｇＰ（ｐＨ　２．７）：０．９２０

ＭＳ（ＥＳＩ）：２８０（$[M+H]^+$）

製法（Ｖ２２）による式［ＸＸＸＩＩ］の化合物の製造：

５－（４－フルオロフェニル）－２－メチル－２，４－ジヒドロ－３Ｈ－ピラゾール－３１－オン［ＸＸＸＩＩ－１］

４５ｍＬの酢酸エチル中の８．００ｇの３－（４－フルオロフェニル）－３－オキソプロパン酸メチル（４０．８モル）の溶液に、２．４３ｇ（５３．０ミリモル）のメチルヒドラジンをゆっくり加える。次に、出発材料の完全な反応まで、反応混合物を還流下で加熱する。室温まで冷却した後、反応混合物をジエチルエーテルおよび水で処理する。形成された沈殿をポンプにて濾過し、石油エーテル／ジエチルエーテル混合物（６０ｍＬ、１：１）で洗浄し、乾燥する。５．３３ｇ（６８％）の５－（４－フルオロフェニル）－２－メチル－２，４－ジヒドロ－３Ｈ－ピラゾール－３オンが得られる。

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ＣＤＣｌ$_3$）：δ＝７．６９－７．６３（ｍ，２Ｈ）、７．１２（ｔ，２Ｈ）、３．５９（ｓ，２Ｈ）、３．４１（ｓ，３Ｈ）ｐｐｍ

製法（Ｖ２３）による式［ＸＸＸＩＩＩ］の化合物の製造：

５－（ジフルオロメトキシ）－３－（４－フルオロフェニル）－１－メチル－１Ｈ－ピラゾール［ＸＸＸＩＩＩ－１］

無水アセトニトリル（１００ｍＬ）中の４．４０ｇ（２２．９ミリモル）の５－（４－フルオロフェニル）－２－メチル－２，４－ジヒドロ－３Ｈ－ピラゾール－３－オンの溶液に、３．１６ｇ（２２．９ミリモル）のK_2CO_3および４．１９ｇ（２７．５ミリモル）のクロロジフルオロ酢酸ナトリウムを加え、混合物を還流下でN_2雰囲気中で５時間還流下で加熱する。反応混合物を冷却後に、ＮＨ４Ｃｌ水溶液（８５ｍＬ）を加え、有機相を酢酸エチル（３×５０ｍＬ）で抽出する。合わせた有機抽出物をＮａＣｌ溶液で洗浄し、乾燥し、真空下で蒸発させる。粗生成物をシリカゲル上のクロマトグラフィー（溶離剤石油エーテル／酢酸エチル８／２）によって精製する。１．２６ｇ（２３％）の５－（ジフルオロ－メトキシ）－３－（４－フルオロフェニル）－１－メチル－１Ｈ－ピラゾールが得られる。

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ＣＤＣｌ$_3$）：δ＝７．７４－７．６８（ｍ，２Ｈ）；７．０８（ｔ，２Ｈ）；６．５６（ｔ，２ＪＨＦ＝７２．２Ｈｚ，１Ｈ，ＣＨＦ２）；６．１４（ｓ，１Ｈ）；３．７８（ｓ，３Ｈ）ｐｐｍ

製法（Ｖ２４）による式［ＶＩ－ｂ］の化合物の製造：

４－ブロモ－５－（ジフルオロメトキシ）－３－（４－フルオロフェニル）－１－メチル－１Ｈ－ピラゾール［ＶＩ－ｂ－１］

０．９１４ｇ（５．７２ミリモル）の臭素を、ジクロロメタン（１４ｍＬ）中の１．１６ｇ（７．２８ミリモル）の５－（ジフルオロメトキシ）－３－（４－フルオロフェニル）－１－メチル－１Ｈ－ピラゾールの溶液に滴下する。反応混合物を室温にて２６時間撹拌する。次に、反応混合物を$Na_2S_2O_3$溶液（３×２０ｍＬ）およびＮａＨＣＯ３溶液（３×３０ｍＬ）で洗浄する。有機相を乾燥し、真空下で蒸発させる。１．３４ｇ（８０％）の４－ブロモ－５－（ジフルオロメトキシ）－３－（４－フルオロフェニル）－１

－メチル－１Ｈ－ピラゾールが得られる。
ｌｏｇＰ（ｐＨ　２．７）：３．５２
ＭＳ（ＥＳＩ）：３２１．１（［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$）
^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ｄ６－ＤＭＳＯ）：δ＝７．８６－７．８１（ｍ，２Ｈ）、７．５０－７．１５（ｍ，３Ｈ）、３．８０（ｓ，３Ｈ）ｐｐｍ
前記例と同様に式［ＶＩ－ｂ］の以下の化合物を得ることもできる：
４－ブロモ－５－（ジフルオロメトキシ）－３－（４－フルオロフェニル）－１－イソプロピル－１Ｈ－ピラゾール［ＶＩ－ｂ－２］
ｌｏｇＰ（ｐＨ　２．７）：４．６１
ＭＳ（ＥＳＩ）：３５１．０（［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$）
^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ｄ６－ＤＭＳＯ）：δ＝７．８７－７．８２（ｍ，２Ｈ）、７．５２－７．１６（ｍ，３Ｈ）、４．６４－４．５７（ｍ，１Ｈ）、１．４２（ｄ，６Ｈ）ｐｐｍ
４－ブロモ－５－（ジフルオロメトキシ）－３－（４－フルオロフェニル）－１－イソブチル－１Ｈ－ピラゾール［ＶＩ－ｂ－３］
ｌｏｇＰ（ｐＨ　２．７）：４．９１
ＭＳ（ＥＳＩ）：３６５．０（［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$）
^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ｄ６－ＤＭＳＯ）：δ＝７．８７－７．８３（ｍ，２Ｈ）、７．５１－７．１６（ｍ，３Ｈ）、３．９０（ｄ，２Ｈ）、２．２２－２．１５（ｍ，６Ｈ）ｐｐｍ
４－ブロモ－５－（ジフルオロメトキシ）－３－（４－フルオロ－２－メトキシフェニル）－１－メチル－１Ｈ－ピラゾール［ＶＩ－ｂ－４］
ｌｏｇＰ（ｐＨ　２．７）：３．１５
ＭＳ（ＥＳＩ）：３５３．０（［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$）
^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ｄ６－ＤＭＳＯ）：δ＝７．５０－７．１３（ｍ，３Ｈ）、７．０５－７．０２（ｍ，１Ｈ）、６．８６－６．８１（ｍ，１Ｈ）３．８０（ｓ，３Ｈ）、３．７８（ｓ，３Ｈ）ｐｐｍ
製法（Ｖ２５）による式［ＶＩ－ｃ］の化合物の製造：
２－［４－ブロモ－５－（ジフルオロメトキシ）－１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル］－５－フルオロフェノール［ＶＩ－ｃ－１］
５．８ｍＬのＢＢｒ$_{3}$（ジクロロメタン中の１Ｍ溶液、５．８ミリモル）を、０℃にて、ジクロロメタン（６８ｍＬ）中の３．０ｇ（８．６ミリモル）の４－ブロモ－５－（ジフルオロメトキシ）－３－（４－フルオロ－２－メトキシフェニル）－１－メチル－１Ｈ－ピラゾールの溶液に滴下する。反応混合物を室温までゆっくりと加温し、２３時間攪拌する。次に、１５０ｍＬのジエチルエーテルを加え、得られた混合物を飽和ＮａＨＣＯ$_{3}$溶液（１００ｍＬ）および酢酸エチル（２００ｍＬ）の間に分配する。得られた沈殿を１００ｍＬの水の添加によって溶解させ、相を分離する。水性相を酢酸エチル（３×２００ｍＬ）で抽出する。合わせた有機抽出物を水および飽和ＮａＣｌ溶液で洗浄し、乾燥する。真空下での溶媒の除去の後、得られた粗生成物をシリカゲル上のクロマトグラフィー（溶離剤石油エーテル／酢酸エチル９５／５）によって精製する。１．６ｇ（５５％）の２－［４－ブロモ－５－（ジフルオロメトキシ）－１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル］－５－フルオロフェノールが得られる。
ｌｏｇＰ（ｐＨ　２．７）：３．４８
ＭＳ（ＥＳＩ）：３３６．９（［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$）
１Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ｄ６－ＤＭＳＯ）：δ＝７．４９－７．１３（ｍ，２Ｈ）、６．７４－６．６８（ｍ，２Ｈ）、３．７８（ｓ，３Ｈ）ｐｐｍ
製法Ｖ１４による式［ＸＸＸＶＩＩ］の出発材料の製造：
１－（４－フルオロフェニル）－２－［２－（メチルスルファニル）ピリミジン－４－イル］エタノン［ＸＸＸＶＩＩ－１］
５０ｍＬの無水テトラヒドロフラン（ＴＨＦ）中の４－メチル－２－（メチルスルファ

ニル）ピリミジン（１ｅｑ、４１ミリモル）およびエチル－４－フルオロベンゾエート（１．１ｅｑ、４５ミリモル）の溶液を０℃まで冷却し、リチウムビストリメチルシリルアミド（２ｅｑ、８２ミリモル、ｎ－ヘキサン中のＬｉＨＭＤＳの１モラー溶液）で滴下処理する。５から１０℃での３時間後に、水を加え、混合物を酢酸エチル（酢酸エチルエステル）で抽出する。有機相を飽和塩化ナトリウム溶液（ＮａＣｌ）で洗浄し、硫酸マグネシウム（$MgSO_4$）上で乾燥し、真空下で蒸発させる。残渣を１００ｍＬのシクロヘキサンからの結晶化によって精製し、真空下で乾燥する。８．９ｇ（８３％収率）の１－（４－フルオロ－フェニル）－２－［２－（メチルスルファニル）ピリミジン－４－イル］エタノンが得られる。

【０４０４】

製法Ｖ１５による式［ＸＸＸＶＩＩＩ］の出発材料の製造：

３－（ジメチルアミノ）－１－（４－フルオロフェニル）－２－［２－（メチルスルファニル）ピリミジン－４－イル］プロパ－２－エン－１－オン［ＸＸＸＶＩＩＩ－１］

４０ｍＬのＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミドジメチルアセタール中の１－（４－フルオロフェニル）－２－［２－（メチルスルファニル）ピリミジン－４－イル］エタノン（１ｅｑ、３０ミリモル）の溶液を７５から８０℃にて１時間加熱する。室温まで冷却した後、溶媒を真空下で除去し、残渣をシリカゲル上のクロマトグラフィー（グラジエント　ヘプタン／酢酸エチル　１：１から２：８）によって精製する。９．３ｇ（９７％）の（２Ｚ）－３－（ジメチルアミノ）－１－（４－フルオロフェニル）－２－［２－（メチルスルファニル）ピリミジン－４－イル］プロパ－２－エン－１－オンが得られる。

【０４０５】

製法Ｖ１６による式［ＸＸＸＩＸ］の出発材料の製造：

４－［３－（４－フルオロフェニル）－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］－２－（メチルスルファニル）ピリミジン［ＸＸＸＩＸ－１］

１８６ｍＬエタノール中の３－（ジメチルアミノ）－１－（４－フルオロフェニル）－２－［２－（メチルスルファニル）ピリミジン－４－イル］プロパ－２－エン－１－オン（１ｅｑ、２９ミリモル）、ヒドラジン水和物（１．５ｅｑ、４４ミリモル）およびトリエチルアミン（１．５ｅｑ、４４ミリモル）の混合物を還流下で３時間加熱する。溶媒を真空下で蒸発させ、水を加え、混合物を酢酸エチルで抽出する。有機相を分離し、乾燥し（$MgSO_4$）、真空下で蒸発させる。７．９ｇ（９４％収率）の４－［３－（４－フルオロフェニル）－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］－２－（メチルスルファニル）ピリミジンが得られる。

ｌｏｇＰ（ｐＨ　２．７）：２．２８

ＭＳ（ＥＳＩ）：２８７．０（$[M+H]^+$）

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，d_6－ＤＭＳＯ）：δ＝１３．４８（ｂｓ，１Ｈ）、８．４４（ｄ，１Ｈ）、８．３８（ｂｓ，１Ｈ）、７．５６（ｍ，２Ｈ）、７．２７（ｔ，２Ｈ）、７．１２（ｄ，１Ｈ）、２．２１（ｓ，３Ｈ）ｐｐｍ

製法Ｖ１３による式［ＸＬ］の出発材料の製造：

４－［３－（４－フルオロフェニル）－１－イソプロピル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］－２－（メチルスルファニル）ピリミジン［ＸＬ－１］

Cs_2CO_3（２．５ｅｑ、７３．３ミリモル）および２－ヨードプロパン（１．５ｅｑ、４４ミリモル）を、７５ｍＬのＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド中の４－［３－（４－フルオロフェニル）－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］－２－（メチルスルファニル）ピリミジン（１ｅｑ、２９．３モル）の溶液に加え、反応混合物を室温にて一晩攪拌する。この後、混合物を水で処理し、酢酸エチルで抽出する。有機相を乾燥し、蒸発させ、シリカゲル上のクロマトグラフィー（グラジエント　ジクロロメタン／酢酸エチル　２０：１から５：１）によって精製する。６．５ｇ（６４％）の４－［３－（４－フルオロフェニル）－１－イソプロピル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］－２－（メチルスルファニル）－ピリミジンが得られる。

ｌｏｇＰ（ｐＨ　２．７）：３．６２

ＭＳ（ＥＳＩ）：３２９．０（［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$）
^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ＣＤＣｌ$_{3}$）：δ＝８．２８（ｄ，１Ｈ）、８．１０（ｓ，１Ｈ）、７．５２（ｍ，２Ｈ）、７．１１（ｔ，２Ｈ）、６．７３（ｄ，１Ｈ）、４．５７（ｍ，１Ｈ）、２．５０（ｓ，３Ｈ）、１．６０（ｄ，６Ｈ）ｐｐｍ

製法Ｖ２７による式［ＸＬＩ］の出発材料の製造：

４－［３－（４－フルオロフェニル）－１－イソプロピル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］－２－（メチルスルホニル）ピリミジン［ＸＬＩ－１］

５２０ｍＬのジクロロメタン中の４－［３－（４－フルオロフェニル）－１－イソプロピル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］－２－（メチルスルファニル）ピリミジン（１ｅｑ、１９．７ミリモル）およびｍ－クロロ過安息香酸（２ｅｑ、４０ミリモル、７０％）の溶液を室温にて一晩攪拌する。この後、反応混合物を水および亜硫酸ナトリウム（２．１ｅｑ、４１．５ミリモル）で処理し、相を分離する。有機相を２Ｍ　Ｋ$_{2}$ＣＯ$_{3}$水溶液で２回洗浄し、乾燥し、真空下で蒸発させる。６．３ｇ（８４％）の４－［３－（４－フルオロフェニル）－１－イソプロピル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］－２－（メチルスルホニル）ピリミジンが得られる。

ｌｏｇＰ（ｐＨ　２．７）：２．９０
ＭＳ（ＥＳＩ）：３７５．１（［Ｍ＋Ｈ］＋）
^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ｄ$_{6}$－ＤＭＳＯ）：δ＝８．８７（ｄ，１Ｈ）、８．７０（ｓ，１Ｈ）、７．６２（ｄ，１Ｈ）、７．６１（ｍ，２Ｈ）、７．２５（ｔ，２Ｈ）、４．０５（ｄ，２Ｈ）、３．１７（ｓ，３Ｈ）、２．２２（ｍ，１Ｈ）、０．９２（ｄ，６Ｈ）ｐｐｍ

製法Ｖ２８による式［Ｉ－ｆ］の化合物の製造：

Ｎ－ベンジル－４－［３－（４－フルオロフェニル）－１－イソプロピル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリミジン－２－アミン［Ｉ－ｆ－１］

４３ｍＬのベンジルアミン中の４－［３－（４－フルオロフェニル）－１－イソプロピル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］－２－（メチルスルホニル）ピリミジン（１ｅｑ、９．１５ミリモル）の混合物を室温で４時間攪拌する。次に、ベンジルアミンを真空下で除去し、粗生成物をシリカゲル上のクロマトグラフィー（グラジエント　ジクロロメタン／酢酸エチル　２０：１から５：１）によつて精製する。１．７７ｇ（４７％）のＮ－ベンジル－４－［３－（４－フルオロ－フェニル）－１－イソプロピル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリミジン－２－アミンが得られる。

ｌｏｇＰ（ｐＨ　２．７）：３．３１
ＭＳ（ＥＳＩ）：３８５．１（［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$）

製法Ｖ２９による式［ＩＩＩ－ａ］の出発材料の製造：

４－［３－（４－フルオロフェニル）－１－イソプロピル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリミジン－２－アミン［ＩＩＩ－ａ－１］

硫酸（１００ｅｑ、５２１ミリモル）中のＮ－ベンジル－４－［３－（４－フルオロフェニル）－１－イソプロピル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリミジン－２－アミン（１ｅｑ、５．２１ミリモル）の溶液を室温にて一晩攪拌する。次に、反応混合物をまず氷、次いで水で処理し、３０％ＮａＯＨでｐＨ＝９まで注意深く中和する。水性相をジクロロメタンで数回抽出する。合わせた有機相を乾燥し、真空下で蒸発させる。１．１ｇ（６７％）の４－［３－（４－フルオロフェニル）－１－イソプロピル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリミジン－２－アミンが得られる。

ｌｏｇＰ（ｐＨ　２．７）：１．５４
ＭＳ（ＥＳＩ）：２９８．２（［Ｍ＋Ｈ］＋）
^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ｄ$_{6}$－ＤＭＳＯ）：δ＝８．２３（ｓ，１Ｈ）、８．０８（ｄ，１Ｈ）、７．５５（ｍ，２Ｈ）、７．２３（ｔ，２Ｈ）、６．４７（ｓ，１Ｈ）６．７６（ｄ，１Ｈ）、６．３５（ｄ，１Ｈ）、４．５７（ｍ，１Ｈ）、１．４８（ｄ，６Ｈ）ｐｐｍ

製法Ｖ４による式［Ｉ－ｇ］の化合物の製造：

Ｎ－｛４－［３－（４－フルオロフェニル）－１－イソプロピル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリミジン－２－イル｝プロパンアミド［Ｉ－ｇ－１］

塩化プロピオニル（２ｅｑ、０．６７ミリモル）を、６ｍＬのテトラヒドロフラン中の４－［３－（４－フルオロフェニル）－１－イソプロピル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリミジン－２－アミン（４ｅｑ、１．３４ミリモル）およびトリエチルアミン（４ｅｑ、１．３４ミリモル）の溶液に加える。反応混合物を室温にて一晩攪拌する。次に、揮発性成分を真空下で除去し、粗材料をメタノール中の６ｍＬのＮＨ$_3$（７モラー）で処理する。混合物を室温にて２時間攪拌し、次いで蒸発させる。粗生成物を水で処理し、ジクロロメタンで２回抽出する。有機抽出物を乾燥し、真空下で蒸発させる。粗生成物をシリカゲル上のクロマトグラフィー（溶離剤ヘプタン／酢酸エチル）によって精製する。７０ｍｇ（５９％）のＮ－｛４－［３－（４－フルオロフェニル）－１－イソプロピル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］－ピリミジン－２－イル｝プロパンアミドが得られる。

ｌｏｇＰ（ｐＨ　２．７）：２．３５

ＭＳ（ＥＳＩ）：３５４．２（［Ｍ＋Ｈ］$^+$）

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ｄ$_6$－ＤＭＳＯ）：δ＝１０．２７（ｂｓ，１Ｈ）、８．４６（ｄ，１Ｈ）、８．３８（ｓ，１Ｈ）、７．６０（ｍ，２Ｈ）、７．２３（ｔ，２Ｈ）、６．９４（ｍ，１Ｈ）、４．６１（ｍ，１Ｈ）、２．４０（ｑ，２Ｈ）、１．５０（ｄ，６Ｈ）、０．９８（ｔ，３Ｈ）ｐｐｍ

製法Ｖ１４による式［ＸＬＩＩＩ］の出発材料の製造：

２－（２－クロロピリミジン－４－イル）－１－（４－フルオロフェニル）エタノン［ＸＬＩＩＩ－１］

１７ｍＬの無水テトラヒドロフラン（ＴＨＦ）中の２－クロロ－４－メチルピリミジン（１ｅｑ、１５．５ミリモル）および４－フルオロ安息香酸エチル（１．１ｅｑ、１７．１ミリモル）の溶液を０℃まで冷却し、リチウムビストリメチルシリルアミド（２ｅｑ、３１ミリモル、ｎ－ヘキサン中のＬｉＨＭＤＳの１モラー溶液）で滴下処理する。５から１０℃での３時間後に、水を加え、混合物をジクロロメタンで抽出する。有機相を飽和塩化ナトリウム溶液（ＮａＣｌ）で洗浄し、硫酸マグネシウム（ＭｇＳＯ$_4$）上で乾燥し、真空下で蒸発させる。３．８ｇ（８３％収率）の２－（２－クロロピリミジン－４－イル）－１－（４－フルオロフェニル）－エタノン（ケトおよびエノール形態の４／９混合物）が得られる。

ｌｏｇＰ（ｐＨ　２．７）：２．２７

ＭＳ（ＥＳＩ）：２５１．０（［Ｍ＋Ｈ］$^+$）

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ｄ$_6$－ＤＭＳＯ）：δ＝１３．５８（ｓ，１Ｈ，ｅｎｏｌ）、８．７５（ｄ，１Ｈ）、８．５７（ｂｓ，１Ｈ，ｅｎｏｌ）、８．１１（ｍ，２Ｈ）、７．９２（ｍ，２Ｈ，ｅｎｏｌ）、７．６０（ｄ，１Ｈ）、７．４１（ｍ，２Ｈ）、７．３４（ｍ，３Ｈ，ｅｎｏｌ）、６．５１（ｂｓ，１Ｈ，ｅｎｏｌ）、４．７０（ｓ，２Ｈ）ｐｐｍ

製法Ｖ２８による式［ＸＬＩＶ］の出発材料の製造：

Ｎ－ベンジル－４－［３－（４－フルオロフェニル）－１－イソプロピル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリミジン－２－アミン［ＸＬＩＶ－１］

２７ｍＬのイソプロピルアミン中の２－（２－クロロピリミジン－４－イル）－１－（４－フルオロフェニル）エタノン（１ｅｑ、１６ミリモル）の混合物をマイクロ波オーブン（ＣＥＭエクスプローラー）中で１１０℃にて１０分間加熱する。次に、アミンを真空下で除去し、粗生成物をジクロロメタン（２５ｍＬ）および１Ｍ　ＨＣｌ（７ｍＬ）で処理する。溶液を室温にて一晩攪拌し、次いで、１Ｍ　ＮａＯＨで中和する。相を分離し、水性相をジクロロメタンで２回抽出する。合わせた有機抽出物を乾燥し（ＭｇＳＯ$_4$）、真空下で蒸発させる。４．０ｇ（７７％）の１－（４－フルオロフェニル）－２－［２－（イソプロピルアミノ）ピリミジン－４－イル］エタノンが得られる。

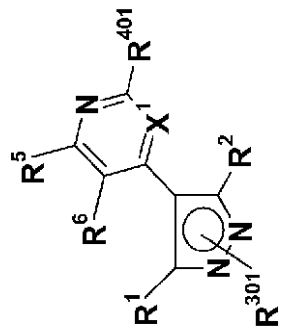
ｌｏｇＰ（ｐＨ　２．７）：２．０５

ＭＳ（ＥＳＩ）：２７４．２（［Ｍ＋Ｈ］$^+$）

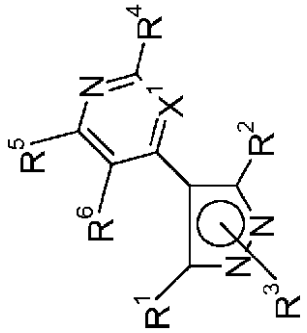
製法Ｖ１５による式［ＸＬＶ］の出発材料の製造：
３－（ジメチルアミノ）－１－（４－フルオロフェニル）－２－［２－（イソプロピルアミノ）ピリミジン－４－イル］プロパ－２－エン－１－オン［ＸＬＶ－１］
６．５ｍＬのＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミドおよび６．５ｍＬのＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミドジメチルアセタールの混合物中の１－（４－フルオロフェニル）－２－［２－（イソプロピルアミノ）ピリミジン－４－イル］エタノン（１ｅｑ、１４．６ミリモル）の溶液を１００℃にて２．５時間加熱する。室温まで冷却した後、溶媒を真空下で除去する。５．４ｇ（６５％）の３－（ジメチルアミノ）－１－（４－フルオロフェニル）－２－［２－（イソプロピルアミノ）ピリミジン－４－イル］プロパ－２－エン－１－オンが得られる。
ｌｏｇＰ（ｐＨ　２．７）：１．４５
ＭＳ（ＥＳＩ）：３２９．２（［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$）
製法Ｖ１６による式［ＸＬＶＩ］の出発材料の製造：
４－［３－（４－フルオロフェニル）－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］－Ｎ－イソプロピルピリミジン－２－アミン［ＸＬＶＩ－１］
１００ｍＬのエタノール中の３－（ジメチルアミノ）－１－（４－フルオロフェニル）－２－［２－（イソプロピルアミノ）ピリミジン－４－イル］プロパ－２－エン－１－オン（１ｅｑ、１６．４ミリモル）およびヒドラジン水和物（１．１ｅｑ、１８ミリモル）の混合物を室温にて１６時間攪拌する。溶媒を真空下で蒸発させ、残渣をシリカゲル上のクロマトグラフィー（グラジエント　ヘプタン／酢酸エチル　１：０から６：４）によって精製する。３．５ｇ（６５％収率）の４－［３－（４－フルオロフェニル）－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］－Ｎ－イソプロピルピリミジン－２－アミンが得られる。
ｌｏｇＰ（ｐＨ　２．７）：１．３７
ＭＳ（ＥＳＩ）：２９８．２（［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$）
^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ｄ$_{6}$－ＤＭＳＯ）：δ＝１３．２８（ｂｓ，１Ｈ）、８．１２（ｄ，１Ｈ）、７．５９（ｂｓ，２Ｈ）、７．２８（ｂｓ，２Ｈ）、６．７７（ｄ，１Ｈ）、６．５２（ｂｓ，１Ｈ）、３．８１（ｂｓ，１Ｈ）、１．０９（ｂｓ，６Ｈ）ｐｐｍ．
製法Ｖ１３による式［Ｉ－ｈ］の化合物の製造：
４－［３－（４－フルオロフェニル）－１－イソブチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］－Ｎ－イソプロピルピリミジン－２－アミン［Ｉ－ｈ－１］
Ｃｓ$_{2}$ＣＯ$_{3}$（１．１ｅｑ、０．９ミリモル）および２－ヨードプロパン（１．５ｅｑ、１．２３ミリモル）を、８ｍＬのＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド中の４－［３－（４－フルオロフェニル）－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］－Ｎ－イソプロピルピリミジン－２－アミン（１ｅｑ、０．８２ミリモル）の溶液に加え、反応混合物を室温にて一晩攪拌し、次いで、８０℃にて４時間加熱する。この後、溶媒を除去し、粗生成物を水で処理し、ジクロロメタンで３回抽出する。有機相を乾燥し、蒸発させ、シリカゲル上のクロマトグラフィー（グラジエント　ヘプタン／酢酸エチル　１：０から１：１）によって精製する。１２４ｍｇ（４０％）の４－［３－（４－フルオロフェニル）－１－イソブチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］－Ｎ－イソプロピルピリミジン－２－アミンが得られる。
ｌｏｇＰ（ｐＨ　２．７）：１．８１
ＭＳ（ＥＳＩ）：３１２．２（［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$）
^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ＣＤＣｌ$_{3}$）：δ＝８．０１（ｄ，１Ｈ）、７．８９（ｓ，１Ｈ）、７．４５（ｍ，２Ｈ）、７．０２（ｔ，２Ｈ）、６．３６（ｄ，１Ｈ）、４．９４（ｂｓ，２Ｈ）、３．８９（ｄ，２Ｈ）、２．２３（ｍ，１Ｈ）、０．９１（ｄ，６Ｈ）ｐｐｍ
以下の表ＩからＩＩＩ中で名称が挙げられた式［Ｉ－ａ］および［Ｉ－ｂ］の化合物もまた前記方法によって得られる。
【０４０６】

【化３１】

[I-b]



[I-a]



【０４０７】

【表５】

表1

Ex.	X1	R1	R2	R3/3a1	R4/4a1	R5	R6
1	CH	4-フルオロフェニル	H	2-メチルプロピル	H	H	H
2	CH	2,6-ジフルオロフェニル	H	2-メチルプロピル	H	H	H
3	CH	2,6-ジフルオロフェニル	H	ブタン-2-イル	H	H	H
4[a]	CH	4-フルオロフェニル	H	H	H	H	H
5	N	3-クロロフェニル	H	2-メチルプロピル	H	H	H
6	CH	2,6-ジフルオロフェニル	H	2,2-ジメチルプロピル	H	H	H
7	CH	2,6-ジフルオロフェニル	H	3-メチルブタ-2-エン-1-イル	H	H	H
8	CH	2,6-ジフルオロフェニル	H	シクロブチル	H	H	H
9	CH	4-フルオロフェニル	H	テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル	H	H	H
10	CH	2,6-ジフルオロフェニル	H	プロパン-2-イル	H	H	H
11	CH	2,6-ジフルオロフェニル	H	2,2-ジメチルプロピル	H	H	H
12	CH	2,6-ジフルオロフェニル	H	2,2,2-トリフルオロエチル	H	H	H
13	CH	2,6-ジフルオロフェニル	H	2—メチルプロピル	H	H	H
14	CH	2,6-ジフルオロフェニル	H	プロパン-2-イル	H	H	H
15	CH	2,6-ジフルオロフェニル	H	シクロブチル	H	H	H
16	CH	2,6-ジフルオロフェニル	H	シクロペンチル	H	H	H
17	CH	2,6-ジフルオロフェニル	H	シクロペンチル	H	H	H
18[a]	N	4-フルオロフェニル	H	H	CH_3	H	H
19	CH	4-フルオロフェニル	H	テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル	プロパノイルアミノ	H	H
20	CH	4-フルオロフェニル	H	テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル	H	-NHCH=CH-	

Ex.	X1	R1	R2	R3/R01	R4/R01	R5	R6
21	CH	4-フルオロフェニル	H	テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル	(2-メチルプロパノイル)-アミノ	H	H
22	CH	2,6-ジフルオロフェニル	H	3-メチルブタ-2-エン-1-イル	H	H	H
23	CH	4-フルオロフェニル	H	テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル	(メトキシアセチル)-アミノ	H	H
24	CH	4-フルオロフェニル	H	2-メチルプロピル	H	H	H
25	CH	4-フルオロフェニル	H	3-メチルブタ-2-エン-1-イル	H	H	H
26	CH	2,6-ジフルオロフェニル	H	テトラヒドロフラン-2-イルメチル	H	H	H
27	CH	2,6-ジフルオロフェニル	H	テトラヒドロフラン-2-イルメチル	H	H	H
28	CH	3-クロロフェニル	H	テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル	H	H	H
29	N	4-フルオロフェニル	H	テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル	CH_3	H	H
30	CH	4-フルオロフェニル	H	3-メチルブタ-2-エン-1-イル	H	H	H
31	CH	4-フルオロフェニル	H	テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル	CH_3	H	H
32	CH	3-クロロフェニル	H	テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル	H	-NHCH=CH-	
33	CH	2,2-ジフルオロ-1,3-ベンゾジオキソール-4-イル	H	テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル	H	H	H
34	N	3-クロロフェニル	H	3-メチルブタ-2-エン-1-イル	H	H	H
35	CH	4-フルオロフェニル	ブロモ	テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル	H	H	H
36	N	3-(トリフルオロメチル)-フェニル	H	テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル	モルホリン-4-イル	H	H
37	CH	4-フルオロ-2-メチル-フェニル	H	テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル	H	H	H

Ex.	X1	R1	R2	R3/601	R4/401	R5	R6
38	CH	2,6-ジフルオロフェニル	H	ブタン-2-イル	H	H	H
39	CH	4-フルオロフェニル	H	テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル	アミノ	H	H
40	CH	4-フルオロフェニル	H	プロパン-2-イル	(メトキシアセチル)-アミノ	H	H
41	CH	4-フルオロフェニル	H	テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル	(2,2-ジメチルプロパノイル)アミノ	H	H
42	CH	3-(トリフルオロメチル)-フェニル	H	テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル	H	H	H
43	CH	4-メトキシフェニル	H	テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル	H	H	H
44	CH	4-フルオロフェニル	H	プロパン-2-イル	H	(1Z,3Z)-ブタ-1,3-ジエン-1,4-ジイル	
45	CH	4-メトキシナフタレン-1-イル	H	テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル	H	H	H
46	CH	4-フルオロフェニル	H	プロパン-2-イル	アミノ	H	H
47	CH	4-フロオロフェニル	H	プロパン-2-イル	H	-(プロパ-2-イン-1-イル)N-CH=CH-	
48	CH	3-(トリフルオロメチル)-フェニル	H	テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル	(2,2-ジメチル-プロパノイル)アミノ	H	H
49	CH	4-フルオロフェニル	H	テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル	H	-(プロパ-2-イン-1-イル)N-CH=CH-	
50	CH	3-(トリフルオロメチル)-フェニル	H	テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル	H	-NHCH=CH-	
51	CH	3-クロロ-4-フルオロフェニル	H	テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル	H	H	H

Ex.	X^1	R^1	R^2	$R^{3/3'01}$	$R^{4/4'01}$	R^5	R^6
52	N	4-フルオロフェニル	H	テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル	モルホリン-4-イル	H	H
53	CH	4-フルオロフェニル	H	プロパン-2-イル	メチルカルバモイル	H	H
54	CH	4-フルオロフェニル	H	テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル	H	(1Z,3Z)-ブタ-1,3-ジエン-1,4-ジイル	
55	CH	4-フルオロ-3-メチル-フェニル	H	テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル	H	H	H
56	CH	2,4-ジフルオロフェニル	H	テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル	H	H	H
57	CH	4-tert-ブチルフェニル	H	テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル	H	H	H
58	CH	4-フルオロフェニル	H	tert-ブチル		H	H
59	CH	4-フェノキシフェニル	H	テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル	H	H	H
60	CH	3-シアノフェニル	H	テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル	H	H	H
61	CH	3-シアノ-4-フルオロフェニル	H	テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル	H	H	H
62	N	4-メトキシフェニル	H	テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル	1H-ピラゾール-1-イル	H	H
63	N	4-フルオロフェニル	H	テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル	エチルアミノ	H	H
64	CH	4-フルオロ-2-メトキシ-フェニル	H	テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル	H	H	H
65	N	4-メトキシフェニル	H	テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル	H	-NHCH=CH-	
66	N	4-フルオロフェニル	H	テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル	H	-NHCH=CH-	
67	CH	3-フェノキシフェニル	H	テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル	H	H	H
68	CH	4-(メチルスルホニル)-フェニル	H	テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル	H	H	H
69	CH	4-メトキシフェニル	H	テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル	アミノ	H	H
70	CH	4-クロロフェニル	H	テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル	H	H	H

Ex.	X1	R1	R2	R3/R01	R4/R02	R5	R6
71	CH	4-(トリフルオロメトキシ)-フェニル	H	テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル	H	H	H
72	CH	4-フルオロフェニル	H	プロパン-2-イル	(2,2-ジメチル-プロパノイル)アミノ	H	H
73	CH	4-メトキシフェニル	H	テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル	CH_3	H	H
74	N	4-フルオロフェニル	H	テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル	メチルスルファニル	H	H
75	N	4-フルオロフェニル	H	テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル	1H-ピラゾール-1-イル	H	H
76	CH	2,3-ジクロロフェニル	H	テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル	H	H	H
77	N	4-メトキシフェニル	H	テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル	CH_3	H	H
78	N	4-メトキシフェニル	H	テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル	エチルアミノ	H	H
79	CH	4-フルオロフェニル	H	5-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-イル	H	H	H
80	CH	4-メトキシフェニル	H	テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル	H	-NHCH=CH-	
81	CH	4-フルオロフェニル	H	テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル	H	-N($COCH_3$)-CH=CH-	
82	CH	3-(トリフルオロメチル)-フェニル	H	テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル	(2,2-ジメチル-プロパノイル)アミノ	H	H
83	CH	3-クロロフェニル	H	テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル	メチルカルバモイル	H	H
84	CH	4-フルオロフェニル	H	プロパン-2-イル	(2-メチルプロパノイル)アミノ	H	H
85	CH	4-フルオロフェニル	H	プロパン-2-イル	プロパノイルアミノ	H	H
86	CH	4-フルオロフェニル	H	プロパン-2-イル	(シクロプロピル-カルバモイル)アミノ	H	H
87	CH	4-フルオロフェニル	H	2-メチルプロピル	(2-メチルプロパノイル)-アミノ	H	H

Ex.	X1	R1	R2	R3/R01	R4/R01	R5	R6
88	CH	4-フルオロフェニル	H	2-メトキシエチル	H	H	H
89	CH	4-フルオロフェニル	H	プロパン-2-イル	H	H	H
90	CH	4-フルオロフェニル	H	テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル	メチルカルバモイル	H	H
91	CH	4-フルオロフェニル	H	ブタン-2-イル	H	H	H
92	CH	4-フルオロフェニル	H	シクロペンチル	H	H	H
93	CH	4-フルオロフェニル	H	テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル	カルバモイル	H	H
94	CH	4-フルオロフェニル	H	テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル	フェニルカルバモイル	H	H
95	CH	3-クロロフェニル	H	テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル	カルバモイル	H	H
96	CH	3-クロロフェニル	H	テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル	フェニルカルバモイル	H	H
97	CH	4-フルオロフェニル	H	プロパン-2-イル	アミノ	H	H
98	CH	2-(ベンジルオキシ)フェニル	H	テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル	H	H	H
99	CH	キノリン-8-イル	H	テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル	H	H	H
100	CH	4-フルオロフェニル	H	ピリジン-3-イルメチル	H	H	H
101	CH	4-フルオロフェニル	H	1-(3-クロロフェニル)エチル	H	H	H
102	CH	4-フルオロフェニル	H	1-(2-クロロフェニル)エチル	H	H	H
103	CH	4-フルオロフェニル	H	2,2,2-トリフルオロエチル	H	H	H
104	CH	4-フルオロフェニル	H	2,3-ジフルオロベンジル	H	H	H
105	CH	4-フルオロフェニル	H	2-tert-ブトキシ-2-オキソエチル	H	H	H
106	CH	4-フルオロフェニル	H	1-メトキシ-3-メチル-1-オキソブタン-2-イル	H	H	H
107	CH	4-フルオロフェニル	H	1-メトキシ-1-オキソプロパン-2-イル	H	H	H
108	CH	4-フルオロフェニル	H	2-クロロ-6-フルオロベンジル	H	H	H

Ex	X1	R1	R2	R3/R3'	R4/R4'	R5	R6
109	CH	4-フルオロフェニル	H	4-(ジフルオロメトキシ)ベンジル	H	H	H
110	CH	4-フルオロフェニル	H	(2-クロロ-1,3-チアゾール-5-イル)-メチル	H	H	H
111	CH	4-フルオロフェニル	H	5-(トリフルオロメチル)-1,3,4-チアジアゾール-2-イル	H	H	H
112	CH	4-フルオロフェニル	H	6-(トリフルオロメチル)ピリミジン-4-イル	H	H	H
113	CH	4-フルオロフェニル	H	2-シクロヘキシル-2-オキソエチル	H	H	H
114	CH	4-フルオロフェニル	H	2-シクロペンチル-2-オキソエチル	H	H	H
115	CH	4-フルオロフェニル	H	ピリジン-2-イルメチル	H	H	H
116	CH	4-フルオロフェニル	H	(2,2-ジクロロシクロプロピル)-メチル	H	H	H
117	CH	4-フルオロフェニル	H	2-(メチルスルファニル)エチル	H	H	H
118	CH	4-フルオロフェニル	H	2-(3-クロロフェニル)エチル	H	H	H
119	CH	4-フルオロフェニル	H	2-(2-クロロフェニル)エチル	H	H	H
120	CH	4-フルオロフェニル	H	1-(4-クロロフェニル)エチル	H	H	H
121	CH	4-フルオロフェニル	H	ピリジン-4-イルメチル	H	H	H
122	CH	4-フルオロフェニル	H	2-(トリフルオロメトキシ)エチル	H	H	H
123	CH	4-フルオロフェニル	H	テトラヒドロフラン-2-イルメチル	H	H	H

Ex.	X1	R1	R2	R3/4/5	R4/4/5	R5	R6
124	CH	4-フルオロフェニル	H	2,3-ジヒドロキシプロピル	H	H	H
125	CH	4-フルオロフェニル	H	ビフェニル-3-イルメチル	H	H	H
126	CH	4-フルオロフェニル	H	シクロプロピルメチル	H	H	H
127	CH	4-フルオロフェニル	H	ベンジル	H	H	H
128	CH	4-フルオロフェニル	H	2-フルオロベンジル	H	H	H
129	CH	4-フルオロフェニル	H	3-フルオロベンジル	H	H	H
130	CH	4-フルオロフェニル	H	4-フルオロベンジル	H	H	H
131	CH	4-フルオロフェニル	H	ビフェニル-4-イルメチル	H	H	H
132	CH	4-フルオロフェニル	H	3-エトキシ-3-オキソプロピル	H	H	H
133	CH	4-フルオロフェニル	H	2-[2-(2-メトキシエトキシ)-エトキシ]エチル	H	H	H
134	CH	4-フルオロフェニル	H	2-(2-メトキシエトキシ)エチル	H	H	H
135	CH	4-フルオロフェニル	H	ビフェニル-2-イルメチル	H	H	H
136	CH	4-フルオロフェニル	H	2-シアノベンジル	H	H	H
137	CH	4-フルオロフェニル1	H	ナフタレン-1-イルメチル	H	H	H
138	CH	4-フルオロフェニル	H	3-フェノキシベンジル	H	H	H
139	CH	4-フルオロフェニル	H	4-フルオロ-3-フェノキシベンジル	H	H	H
140	CH	4-フルオロフェニル	H	3-シアノベンジル	H	H	H
141	CH	4-フルオロフェニル	H	4-シアノベンジル	H	H	H
142	CH	4-フルオロフェニル	H	2-オキソテトラヒドロフラン-3-イル	H	H	H
143	CH	4-フルオロフェニル	H	1H-イミダゾール-2-イルメチル	H	H	H

Ex.	X[1]	R[1]	R[2]	R[3/601]	R[4/401]	R[5]	R[6]
144	CH	4-フルオロフェニル	H	2-(1,5-ジメチル-1H-ピラゾール-3-イル)-2-オキソエチル	H	H	H
145	CH	4-フルオロフェニル	H	2-(アセチルオキシ)エチル	H	H	H
146	CH	4-フルオロフェニル	H	2-シアノエチル	H	H	H
147	CH	4-フルオロフェニル	H	2-メチルプロピル	H	-NHCOCH$_2$-	
148	CH	4-フルオロフェニル	H	2-メチルプロピル	H	-N(CH$_3$)COC(CH$_3$)$_2$-	
149	N	4-フルオロフェニル	H	2-メチルプロピル	プロパ-2-エン-1-イルアミノ	H	H
150	N	4-フルオロフェニル	H	2-メチルプロピル	プロパ-2-エン-1-イルアミノ	H	H
151[s]	CH	4-メトキシフェニル	H	H	H	H	H
152[s]	CH	3-(トリフルオロメチル)-フェニル	H	H	H	H	H
153	CH	4-フルオロフェニル	H	2-メトキシエチル	プロパノイルアミノ	H	H
154	CH	3-シアノ-4-フルオロフェニル	H	2-メチルプロピル	H	H	H
155	CH	4-フルオロフェニル	H	2-メチルプロピル	プロパノイルアミノ	H	H
156	CH	4-フルオロフェニル	H	プロパン-2-イル	(シクロプチルカルボニル)-アミノ	H	H
157	CH	4-フルオロフェニル	H	ブタン-2-イル	(2-メチルプロパノイル)-アミノ	H	H
158	CH	4-フルオロフェニル	H	2-メチルプロピル	(シクロプロピルアセチル)-アミノ	H	H

Ex.	X^1	R^1	R^2	$R^{3/3'01}$	$R^{4/4'01}$	R^5	R^6
159	CH	4-フルオロフェニル	H	ブタン-2-イル	(シクロプロピルアセチル)-アミノ	H	H
160	CH	4-フルオロフェニル	H	プロパン-2-イル	(3-メチルブタノイル)-アミノ	H	H
161	CH	4-フルオロフェニル	H	プロパン-2-イル	アセチルアミノ	H	H
162	CH	4-フルオロフェニル	H	ブタン-2-イル	(メトキシアセチル)-アミノ	H	H
163	CH	4-フルオロフェニル	H	2-メトキシエチル	(メトキシアセチル)-アミノ	H	H
164	CH	4-フルオロフェニル	H	ブタン-2-イル	プロパノイルアミノ	H	H
165	CH	4-フルオロフェニル	H	2-メチルプロピル	(シクロプロピル-カルボニル)アミノ	H	H
166	CH	4-フルオロフェニル	H	2-メチルプロピル	(メトキシアセチル)-アミノ	H	H
167	CH	4-フルオロフェニル	H	ブタン-2-イル	(シクロプロピル-カルボニル)アミノ	H	H
168	CH	4-フルオロフェニル	H	シクロヘキシル	H	H	H
169	CH	4-フルオロフェニル	H	2,2-ジフルオロエチル	H	H	H
170	CH	4-フルオロフェニル	H	2-エトキシ-2-オキソエチル	H	H	H
171	CH	4-フルオロフェニル	CH_3	プロパ-2-イン-1-イル	H	H	H
172	N	4-フルオロフェニル	H	H	プロパン-2-イルアミノ	H	H
173	N	4-フルオロフェニル	H	H	プロパ-2-イン-1-イルアミノ	H	H

10 20 30 40

Ex.	X[1]	R[1]	R[2]	R[3/3'01]	R[4/4'01]	R[5]	R[6]
174	N	4-フルオロフェニル	H	2-メチルプロピル	プロパン-2-イルアミノ	H	H
175	CH	4-フルオロフェニル	シアノ	H	H	H	H
176	CH	4-フルオロフェニル	H	1-(2-クロロ-1,3-チアゾール-5-イル)-エチル	H	H	H
177	CH	4-フルオロフェニル	H	1,3-ジフルオロプロパン-2-イル	H	H	H
178	CH	4-フルオロフェニル	H	3-メチル-2-オキソブチル	H	H	H
179	CH	4-フルオロフェニル	H	2-エトキシエチル	H	H	H
180	CH	4-フルオロフェニル	H	シアノメチル	H	H	H
181	CH	4-フルオロフェニル	H	プロパン-2-イル	[(プロパン-2-イルオキシ)-カルボニル]アミノ	H	H
182	N	4-フルオロフェニル	H	2-メチルプロピル	ベンジルアミノ	H	H
183	N	4-フルオロフェニル	H	2-メチルプロピル	プロパ-2-イン-1-イルアミノ	H	H
184	N	4-フルオロフェニル	H	2-メチルプロピル	アミノ	H	H
185	N	4-フルオロフェニル	H	2-メチルプロピル	(2-メチルプロパノイル)-(プロパン-2-イル)アミノ	H	H
186	N	4-フルオロフェニル	H	2-メチルプロピル	プロパン-2-イル(2,2,4-トリメチル-3-オキソ-ペンタノイル)アミノ	H	H
187	CH	4-フルオロフェニル	H	2-メチルプロピル	2-オキソピロリジン-1-イル	H	H

Ex.	X1	R1	R2	R3/R3'	R4/R4'	R5	R6
188	N	4-フルオロフェニル	H	2-メチルプロピル	ビス(2-メチル-プロパノイル)アミノ	H	H
189	N	4-フルオロフェニル	H	2-メチルプロピル	(2-メチル-プロパノイル)アミノ	H	H
190	CH	4-フルオロフェニル	H	エチル	(フェニルアセチル)アミノ	H	H
191	CH	4-フルオロフェニル	H	2-メチルプロピル	(フェニルアセチル)アミノ	H	H
192	CH	4-フルオロフェニル	H	プロパン-2-イル	[(2S)-2-ヒドロキシ-プロパノイル]アミノ	H	H
193	CH	4-フルオロフェニル	H	1-(tert-ブトキシカルボニル)-ピペリジン-4-イル	プロパノイルアミノ	H	H
194	CH	4-シアノ-2,5-ジフルオロフェニル	ジフルオロメトキシ	CH_3	プロパノイルアミノ	H	H
195	CH	4-クロロ-2-フルオロフェニル	メチルスルファニル	CH_3	プロパノイルアミノ	H	H
196	CH	4-フルオロ-2-ヒドロキシフェニル	ジフルオロメトキシ	CH_3	プロパノイルアミノ	H	H
197	CH	4-クロロ-2-フルオロフェニル	CF_3	CH_3	プロパノイルアミノ	H	H
198	CH	4-フルオロフェニル	H	エチル	プロパノイルアミノ	H	H
199	CH	4-シアノ-2,5-ジフルオロフェニル	ジフルフルオロメトキシ	CH_3	(メトキシアセチル)-アミノ	H	H

10 20 30 40

Ex.	X1	R1	R2	R3/R01	R4/R01	R5	R6
200	CH	4-クロロ-2-フルオロフェニル	メチルスルファニル	CH_3	(メトキシアセチル)-アミノ	H	H
201	CH	4-フルオロ-2-ヒドロキシフェニル	ジフルオロメトキシ	CH_3	(メトキシアセチル)-アミノ	H	H
202	CH	4-クロロ-2-フルオロフェニル	CF_3	CH_3	(メトキシアセチル)-アミノ	H	H
203	CH	4-フルオロフェニル	H	エチル	(メトキシアセチル)-アミノ	H	H
204	CH	4-フルオロフェニル	H	1-(tert-ブトキシカルボニル)-ピペリジン-4-イル	(メトキシアセチル)-アミノ	H	H
205	CH	4-フルオロフェニル	H	プロパン-2-イル	ベンジルアミノ	H	H
206	CH	4-フルオロフェニル	H	プロパン-2-イル	(チオフェン-2-イル-カルボニル)アミノ	H	H
207	CH	4-フルオロフェニル	H	プロパン-2-イル	(チオフェン-3-イル-カルボニル)アミノ	H	H
208	CH	4-フルオロフェニル	H	プロパン-2-イル	[(2-メトキシエトキシ)-アセチル]アミノ	H	H
209	CH	4-フルオロフェニル	H	プロパン-2-イル	(2-ヒドロキシ-2-メチル-プロパノイル)アミノ	H	H
210	CH	4-フルオロフェニル	H	プロパン-2-イル	(2,3-ジヒドロキシ-プロパノイル)アミノ	H	H
211	CH	4-フルオロフェニル	H	プロパン-2-イル	(エチルカルバモイル)-アミノ	H	H

Ex.	X1	R1	R2	R3/601	R4/401	R5	R6
212	CH	4-フルオロフェニル	H	2-メトキシエチル	(フェニルアセチル)アミノ	H	H
213	CH	4-フルオロフェニル	H	2-フルオロベンジル	プロパノイルアミノ	H	H
214	CH	4-フルオロフェニル	H	シクロプロピルメチル	プロパノイルアミノ	H	H
215	CH	4-フルオロフェニル	H	2,2-ジフルオロエチル	プロパノイルアミノ	H	H
216	CH	4-フルオロフェニル	H	2,2-ジフルオロエチル	(メトキシアセチル)-アミノ	H	H
217	CH	4-フルオロフェニル	H	2,2-ジフルオロエチル	(シクロプロピル-カルボニル)アミノ	H	H
218	CH	4-フルオロフェニル	H	2,2-ジフルオロエチル	(2-メチルプロパノイル)-アミノ	H	H
219	CH	4-フルオロフェニル	H	2-クロロエチル	プロパノイルアミノ	H	H
220	CH	4-フルオロフェニル	H	2-クロロエチル	(メトキシアセチル)-アミノ	H	H
221	CH	4-フルオロフェニル	H	2-クロロエチル	(シクロプロピル-カルボニル)アミノ	H	H
222	CH	4-フルオロフェニル	H	2-クロロエチル	(2-メチルプロパノイル)-アミノ	H	H
223	CH	4-フルオロフェニル	H	シクロプロピルメチル	(メトキシアセチル)-アミノ	H	H
224	CH	4-フルオロフェニル	H	シクロプロピルメチル	(シクロプロピル-カルボニル)アミノ	H	H
225	CH	4-フルオロフェニル	H	シクロプロピルメチル	(2-メチルプロパノイル)-アミノ	H	H

Ex	X1	R1	R2	R3/R01	R4/R01	R5	R6
226	CH	4-フルオロフェニル	H	プロパン-2-イルオキシ	プロパノイルアミノ	H	H
227	CH	4-フルオロフェニル	H	プロパン-2-イルオキシ	H	H	H
228	CH	4-フルオロフェニル	H	2-メチルプロピル	H	H	4-フルオロ-フェニル
229	CH	4-フルオロフェニル	H	2-メチルプロピル	H	H	3-フルオロ-フェニル
230	CH	3-シアノ-4-フルオロフェニル	H	2-メチルプロピル	プロパノイルアミノ	H	H
231	CH	4-フルオロフェニル	H	2,2-ジフルオロエチル	(エチルカルバモイル)-アミノ	H	H
232	CH	4-フルオロフェニル	H	1-(2-フルオロフェニル)エチル	(2-メチルプロパノイル)-アミノ	H	H
233	CH	4-フルオロフェニル	H	プロパン-2-イル	(ジメチルカルバモイル)アミノ	H	H
234	CH	4-フルオロフェニル	H	2,2-ジフルオロエチル	(プロパン-2-イルスルホニル)アミノ	H	H
235	CH	4-フルオロフェニル	H	2,2-ジフルオロエチル	(チオフェン-3-イル-カルボニル)アミノ	H	H
236	CH	4-フルオロフェニル	H	2,2-ジフルオロエチル	(チオフェン-2-イル-カルボニル)アミノ	H	H
237	CH	4-フルオロフェニル	H	2,2-ジフルオロエチル	(フェニルカルボニル)-アミノ	H	H
238	CH	4-フルオロフェニル	H	2,2-ジフルオロエチル	(3-メチルブタノイル)-アミノ	H	H

Ex.	X1	R1	R2	R3/R3'	R4/R4'	R5	R6
239	CH	4-フルオロフェニル	H	2,2-ジフルオロエチル	(2-メチルプタノイル)-アミノ	H	H
240	CH	4-フルオロフェニル	H	2,2-ジフルオロエチル	(シクロプチルカルボニル)-アミノ	H	H
241	CH	4-フルオロフェニル	H	2,2-ジフルオロエチル	(エトキシカルボニル)-アミノ	H	H
242	CH	4-フルオロフェニル	H	2,2-ジフルオロエチル	アセチルアミノ	H	H
243	CH	4-フルオロフェニル	H	2,2-ジフルオロエチル	(2-ヒドロキシ-2-メチル-プロパノイル)アミノ	H	H
244	CH	4-フルオロフェニル	H	1-(2-フルオロフェニル)エチル	(メトキシアセチル)-アミノ	H	H
245	CH	4-フルオロフェニル	H	(2,2-ジクロロシクロプロピル)-メチル	(メトキシアセチル)-アミノ	H	H
246	CH	3-シアノ-4-フルオロフェニル	H	2-メチルプロピル	(メトキシアセチル)-アミノ	H	H
247	CH	4-フルオロフェニル	H	2-フルオロベンジル	(メトキシアセチル)-アミノ	H	H
248	CH	4-フルオロフェニル	H	1-(2-フルオロフェニル)エチル	プロパノイルアミノ	H	H
249	CH	4-フルオロフェニル	H	(2,2-ジクロロシクロプロピル)-メチル	プロパノイルアミノ	H	H
250	CH	4-フルオロフェニル	H	1-(2-フルオロフェニル)エチル	(シクロプロピルアセチル)-アミノ	H	H

Ex.	X^1	R^1	R^2	$R^{3/3'01}$	$R^{4/4'01}$	R^5	R^6
251	CH	4-フルオロフェニル	H	(2,2-ジクロロシクロプロピル)-メチル	(シクロプロピルアセチル)-アミノ	H	H
252	CH	3-シアノ-4-フルオロフェニル	H	2-メチルプロピル	(シクロプロピルアセチル)-アミノ	H	H
253	CH	4-フルオロフェニル	H	2-フルオロベンジル	(シクロプロピルアセチル)-アミノ	H	H
254	CH	4-フルオロフェニル	H	(2,2-ジクロロシクロプロピル)-メチル	(2-メチルプロパノイル)-アミノ	H	H
255	CH	3-シアノ-4-フルオロフェニル	H	2-メチルプロピル	(2-メチルプロパノイル)-アミノ	H	H
256	CH	4-フルオロフェニル	H	2-フルオロベンジル	(2-メチルプロパノイル)-アミノ	H	H
257	CH	4-フルオロ-2-ヒドロキシフェニル	ジフルオロメトキシ	CH_3	(2-メチルプロパノイル)-アミノ	H	H
258	CH	4-フルオロ-2-ヒドロキシフェニル	ジフルオロエトキシ	CH_3	(シクロプロピル-カルボニル)アミノ	H	H
259	CH	4-フルオロフェニル	H	1-(2-フルオロフェニル)エチル	(シクロプロピル-カルボニル)アミノ	H	H
260	CH	4-フルオロフェニル	H	(2,2-ジクロロシクロプロピル)-メチル	(シクロプロピル-カルボニル)アミノ	H	H
261	CH	3-シアノ-4-フルオロフェニル	H	2-メチルプロピル	(シクロプロピル-カルボニル)アミノ	H	H
262	CH	4-フルオロフェニル	H	2-フルオロベンジル	(シクロプロピル-カルボニル)アミノ	H	H

Ex.	X1	R1	R2	R3/R01	R4/R01	R5	R6
263	CH	4-フルオロフェニル	H	1-(2-フルオロフェニル)エチル	(エトキシカルボニル)-アミノ	H	H
264	CH	4-フルオロフェニル	H	(2,2-ジクロロシクロプロピル)-メチル	(エトキシカルボニル)-アミノ	H	H
265	CH	3-シアノ-4-フルオロフェニル	H	2-メチルプロピル	(エトキシカルボニル)-アミノ	H	H
266	CH	4-フルオロフェニル	H	2-フルオロベンジル	(エトキシカルボニル)-アミノ	H	H
267	CH	4-フルオロフェニル	H	2-メチルプロピル	(エトキシカルボニル)-アミノ	H	H
268	CH	4-フルオロフェニル	H	ブタン-2-イル	(エトキシカルボニル)-アミノ	H	H
269	CH	4-フルオロフェニル	H	シクロペンチルオキシ	(シクロプロピル-カルボニル)アミノ	H	H
270	CH	4-フルオロフェニル	H	シクロペンチルオキシ	(2-メチルプロパノイル)-アミノ	H	H
271	CH	4-フルオロフェニル	H	プロパン-2-イルオキシ	(シクロプロピル-カルボニル)アミノ	H	H
272	CH	4-フルオロフェニル	H	プロパン-2-イルオキシ	(2-メチルプロパノイル)-アミノ	H	H
273	N	4-フルオロフェニル	H	2-メチルプロピル	(シクロプロピルメチル)-アミノ	H	H
274	CH	4-フルオロフェニル	H	1-メトキシ-3-メチル-1-オキソブタン-2-イル	プロパノイルアミノ	H	H

Ex.	X[1]	R[1]	R[2]	R[3/4/01]	R[4/4/01]	R[5]	R[6]
275	CH	4-フルオロフェニル	H	1,3-ジオキソラン-2-イルメチル	H	H	H
276	CH	4-フルオロフェニル	H	1,3-ジオキソラン-2-イルメチル	(2-メチルプロパノイル)-アミノ	H	H
277	CH	4-フルオロフェニル	H	1-メトキシ-3-メチル-1-オキソブタン-2-イル	(2-メチルプロパノイル)-アミノ	H	H
278	CH	4-フルオロフェニル	H	1,3-ジオキソラン-2-イルメチル	プロパノイルアミノ	H	H
279	N	4-フルオロフェニル	H	2-メチルプロピル	オキセタン-3-イルアミノ	H	H
280	CH	4-フルオロフェニル	H	プロパン-2-イル	H	-NHCH=N-	
281	N	4-フルオロフェニル	H	2-メチルプロピル	シクロプロピルアミノ	H	H
282	N	4-フルオロフェニル	H	プロパン-2-イル	H	-NHCH=N-	
283	CH	4-フルオロフェニル	H	プロパン-2-イル	4-メチル-1H-イミダゾール-1-イル	H	H
284	N	4-フルオロフェニル	H	2-メチルプロピル	tert-ブチルアミノ	H	H
285	N	4-フルオロフェニル	H	2-メチルプロピル	(1-メトキシプロパン-2-イル)アミノ	H	H
286	N	4-フルオロフェニル	H	2-メチルプロピル	ブタン-2-イルアミノ	H	H
287	N	4-フルオロフェニル	H	2-メチルプロピル	メチルスルホニル	H	H
288	N	4-フルオロフェニル	H	2-メチルプロピル	H	-C(CH$_3$)=CHS-	
289	N	4-フルオロフェニル	H	シクロプロピルメチル	H	-C(CH$_3$)=CHS-	
290	CH	4-フルオロフェニル	H	エチル	(2-メチルプロパノイル)-アミノ	H	H
291	CH	4-フルオロフェニル	H	エチル	(シクロプロピルアセチル)-アミノ	H	H

Ex.	X1	R1	R2	R3/R3a	R4/R4a	R5	R6
292	CH	4-フルオロフェニル	H	プロピル	プロパノイルアミノ	H	H
293	CH	4-フルオロフェニル	H	プロピル	(メトキシアセチル)-アミノ	H	H
294	CH	4-フルオロフェニル	H	プロピル	(2-メチルプロパノイル)-アミノ	H	H
295	CH	4-フルオロフェニル	H	プロピル	(シクロプロピルアセチル)-アミノ	H	H
296	CH	4-フルオロフェニル	H	CH_3	プロパノイルアミノ	H	H
297	CH	4-フルオロフェニル	H	CH_3	(メトキシアセチル)-アミノ	H	H
298	CH	4-フルオロフェニル	H	CH_3	(2-メチルプロパノイル)-アミノ	H	H
299	CH	4-フルオロフェニル	H	CH_3	(シクロプロピルアセチル)-アミノ	H	H
300	CH	4-フルオロフェニル	H	2-(メチルスルファニル)エチル	プロパノイルアミノ	H	H
301	CH	4-フルオロフェニル	H	1-シクロプロピルエチル	プロパノイルアミノ	H	H
302	CH	4-フルオロフェニル	H	3-シアノベンジル	プロパノイルアミノ	H	H
303	CH	4-フルオロフェニル	H	2-シアノエチル	プロパノイルアミノ	H	H
304	CH	4-フルオロフェニル	CF_3	プロパン-2-イル	プロパノイルアミノ	H	H
305	CH	4-フルオロフェニル	H	1-シクロプロピルエチル	H	H	H
306	CH	4-フルオロフェニル	H	2-(メチルスルファニル)エチル	(2-メチルプロパノイル)-アミノ	H	H
307	CH	4-フルオロフェニル	H	1-シクロプロピルエチル	(2-メチルプロパノイル)-アミノ	H	H

Ex.	X1	R1	R2	R3/R01	R4/R01	R5	R6
308	CH	4-フルオロフェニル	H	3-シアノベンジル	(2-メチルプロパノイル)-アミノ	H	H
309	CH	4-フルオロフェニル	H	2-シアノエチル	(2-メチルプロパノイル)-アミノ	H	H
310	N	4-フルオロフェニル	H	プロパン-2-イル	H	-NHCH=CH-	
311	N	4-フルオロフェニル	H	プロパン-2-イル	H	-NHCH$_2$CH$_2$CH$_2$-	
312	CH	4-フルオロフェニル	H	1-シアノプロパン-2-イル	プロパノイルアミノ	H	H
313	CH	4-フルオロフェニル	H	1-シアノプロパン-2-イル	(メトキシアセチル)-アミノ	H	H
314	CH	4-フルオロフェニル	H	1-シアノプロパン-2-イル	(2-メチルプロパノイル)-アミノ	H	H
315	CH	4-フルオロフェニル	H	1-シアノプロパン-2-イル	(シクロプロピルアセチル)-アミノ	H	H
316	CH	4-フルオロフェニル	ジフルオロメトキシ	CH_3	プロパノイルアミノ	H	H
317	CH	4-フルオロフェニル	H	シクロプロピルメチル	(1,1,1-トリフルオロ-プロパン-2-イル)アミノ	H	H
318	CH	4-フルオロフェニル	H	プロパン-2-イル	(1,1,1-トリフルオロ-プロパン-2-イル)アミノ	H	H
319	CH	4-フルオロフェニル	H	CH_3	(1,1,1-トリフルオロ-プロパン-2-イル)アミノ	H	H
320	CH	4-フルオロフェニル	H	シクロプロピル	プロパノイルアミノ	H	H

Ex.	X1	R1	R2	R3/001	R4/001	R5	R6
321	CH	4-フルオロフェニル	H	シクロプロピル	(メトキシアセチル)-アミノ	H	H
322	CH	4-フルオロフェニル	H	シクロプロピル	(2-メチルプロパノイル)-アミノ	H	H
323	CH	4-フルオロフェニル	H	シクロプロピル	(シクロプロピルアセチル)-アミノ	H	H
324	CH	4-フルオロフェニル	H	プロパン-2-イル	[2,2,2-トリフルオロ-1-(4-フルオロフェニル)エチル]-アミノ	H	H
325	CH	4-フルオロフェニル	H	プロパン-2-イル	(2,2,2-トリフルオロ-1-フェニルエチル)アミノ	H	H
326	CH	4-フルオロフェニル	H	2-エトキシエチル	プロパノイルアミノ	H	H
327	CH	4-フルオロフェニル	H	2-エトキシエチル	(メトキシアセチル)-アミノ	H	H
328	CH	4-フルオロフェニル	H	2-エトキシエチル	(2-メチルプロパノイル)-アミノ	H	H
329	CH	4-フルオロフェニル	H	2-エトキシエチル	(シクロプロパノイルアセチル)-アミノ	H	H
330	CH	4-フルオロフェニル	H	エチル	(6-メトキシ-6-オキソ-ヘキサノイル)アミノ	H	H
331	CH	4-フルオロフェニル	H	エチル	(5-メトキシ-5-オキソ-ペンタノイル)アミノ	H	H

Ex.	X1	R1	R2	R3/R01	R4/R01	R5	R6
332	CH	4-フルオロフェニル	H	エチル	(5-エトキシ-3-エチル-5-オキソペンタノイル)アミノ	H	H
333	CH	4-フルオロフェニル	H	エチル	{[3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル]カルボニル}アミノ	H	H
334	CH	4-フルオロフェニル	H	エチル	{[2-(ジフルオロメチル)-チオフェン-3-イル]-カルボニル}アミノ	H	H
335	CH	4-フルオロフェニル	H	エチル	[(4-メチル-1,2,3-チアジアゾール-5-イル)-カルボニル]アミノ	H	H
336	CH	4-フルオロフェニル	H	エチル	[3-(4-クロロフェニル)-プロパノイル]アミノ	H	H
337	CH	4-フルオロフェニル	H	エチル	{[(1R,2R)-2-フェニル-シクロプロピル]-カルボニル}アミノ	H	H
338	CH	4-フルオロフェニル	H	エチル	(シクロペンチルアセチル)-アミノ	H	H
339	CH	4-フルオロフェニル	H	エチル	(3-メチルブタノイル)-アミノ	H	H
340	CH	4-フルオロフェニル	H	エチル	(2-メチルブタノイル)-アミノ	H	H

Ex	X1	R1	R2	R3/R01	R4/R01	R5	R6
341	CH	4-フルオロフェニル	H	エチル	[(2-メチルシクロ-プロピル)カルボニル]-アミノ	H	H
342	CH	4-フルオロフェニル	H	エチル	アセチルアミノ	H	H
343	CH	4-フルオロフェニル	H	CH_3	(3-フェニルプロパノイル)-アミノ	H	H
344	CH	4-フルオロフェニル	H	CH_3	(4-フルオロベンゾイル)-アミノ	H	H
345	CH	4-フルオロフェニル	H	CH_3	[(2-メトキシエトキシ)-アセチル]アミノ	H	H
346	CH	4-フルオロフェニル	H	CH_3	(フェニルカルボニル)-アミノ	H	H
347	CH	4-フルオロフェニル	H	CH_3	(3-メチルブタノイル)-アミノ	H	H
348	CH	4-フルオロフェニル	H	CH_3	(2-メチルブタノイル)-アミノ	H	H
349	CH	4-フルオロフェニル	H	CH_3	(シクロプチルカルボニル)-アミノ	H	H
350	CH	4-フルオロフェニル	H	CH_3	アセチルアミノ	H	H
351	CH	4-フルオロフェニル	H	エチル	[アミノ(オキソ)アセチル]-アミノ	H	H
352	CH	4-フルオロフェニル	H	エチル	[(2S)-2-ヒドロキシ-プロパノイル]アミノ	H	H

Ex.	X^1	R^1	R^2	$R^{3/3'01}$	$R^{4/4'01}$	R^5	R^6
353	CH	4-フルオロフェニル	H	CH_3	[(2S)-2-ヒドロキシ-プロパノイル]アミノ	H	H
354	N	4-フルオロフェニル	H	プロパン-2-イル	(メトキシアセチル)-アミノ	H	H
355	N	4-フルオロフェニル	H	プロパン-2-イル	(2-メチルプロパノイル)-アミノ	H	H
356	N	4-フルオロフェニル	H	プロパン-2-イル	(シクロプロピル-カルボニル)アミノ	H	H
357	N	4-フルオロフェニル	H	2-メチルプロピル	アセチルアミノ	H	H
358	N	4-フルオロフェニル	H	2-メトキシエチル	プロパン-2-イルアミノ	H	H
359	N	4-フルオロフェニル	H	2-クロロエチル	プロパン-2-イルアミノ	H	H
360	N	4-フルオロフェニル	H	ブタン-2-イル	プロパン-2-イルアミノ	H	H
361	N	4-フルオロフェニル	H	CH_3	プロパン-2-イルアミノ	H	H
362	N	4-フルオロフェニル	H	2-シアノエチル	プロパン-2-イルアミノ	H	H
363	N	4-フルオロフェニル	H	プロパ-2-イン-1-イル	プロパン-2-イルアミノ	H	H
364	N	4-フルオロフェニル	H	2,2-ジフルオロエチル	プロパン-2-イルアミノ	H	H
365	N	4-フルオロフェニル	H	2-メチルプロピル	プロパノイルアミノ	H	H

【０４０８】

Ex.	X[1]	R[1]	R[2]	R[3/3'01]	R[4/4'01]	R[5]	R[6]
366	N	4-フルオロフェニル	H	プロパン-2-イル	アミノ	H	H
367	CH	4-フルオロフェニル	CH_3	2,2-ジフルオロエチル	H	H	H
368	CH	4-フルオロフェニル	CH_3	2-メチルプロピル	H	H	H
369	N	4-フルオロフェニル	H	プロパン-2-イル	ベンジルアミノ	H	H
370	N	4-フルオロフェニル	H	エチル	プロパン-2-イルアミノ	H	H
371	N	4-フルオロフェニル	H	プロパン-2-イル	プロパン-2-イルアミノ	H	H
372	N	4-フルオロフェニル	H	2-メチルプロピル	(1-シクロプロピルエチル)-アミノ	H	H

[s]以下の例は以下の塩の形態で存在する:実施例 4:塩酸塩;実施例 18:三塩酸塩;実施例 151:塩酸塩;実施例 152:塩酸塩

表 2 タイプ[I-a]および[I-b]の化合物の NMR データ

No.	名称	NMR	異性体比率[1]
1	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 8.47 (d, 2H), 8.22 (s, 1H), 7.43 (m, 2H), 7.22 (m, 4H), 3.99 (d, 2H), 2.20 (m, 1H), 0.92 (d, 6H) ppm	-
2	4-[5-(2,6-ジフルオロフェニル)-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 8.47 (s, 1H), 8.42 (d, 2H), 7.59 (m, 1H), 7.24 (m, 2H), 7.13 (m, 2H), 4.03 (d, 2H), 2.19 (m, 1H), 0.91 (d, 6H) ppm	-
3	4-[1-(ブタン-2-イル)-3-(2,6-ジフルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 8.53 (s, 1H), 8.42 (d, 2H), 7.59 (m, 1H), 7.25 (m, 2H), 7.14 (d, 2H), 4.36 (m, 1H), 1.84 (m, 2H), 1.50 (d, 3H), 0.79 (d, 3H) ppm	-
5	4-[3-(3-クロロフェニル)-1-イソブチル-1H-ピラゾール-4-イル]ピリミジン	1H-NMR (400 MHz, $CDCl_3$): δ = 9.12 (s, 1H), 8.48 (s, 1H), 8.08 (s, 1H), 7.58 (s, 1H), 7.36 (m, 3H), 7.10 (d, 1H), 3.99 (d, 2H), 2.32 (m, 1H), 0.99 (d, 6H) ppm	-
6	4-[5-(2,6-ジフルオロフェニル)-1-(2,2-ジメチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 8.43 (s, 1H), 8.42 (d, 2H), 7.58 (m, 1H), 7.23 (m, 2H), 7.13 (d, 2H), 4.02 (s, 2H), 0.96 (s, 9H) ppm	-
7	4-[3-(2,6-ジフルオロフェニル)-1-(3-メチルブタ-2-エン-1-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 8.42 (d, 2H), 8.17 (s, 1H), 7.75 (m, 1H), 7.38 (m, 2H), 7.13 (m, 2H), 5.14 (m, 1H), 4.59 (d, 2H), 1.59 (s, 3H), 1.36 (s, 3H) ppm	-
8	4-[1-シクロブチル-3-(2,6-ジフルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 8.42 (d, 2H), 8.24 (s, 1H), 7.76 (m, 1H), 7.38 (m, 2H), 7.13 (d, 2H), 4.50 (m, 1H), 2.58 (m, 2H), 2.23 (m, 2H), 1.75 (m, 2H) ppm	-
9	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1H-NMR (400 MHz, d3-CD3CN): δ = 8.45 (dd, 2H), 8.02 (s, 1H), 7.44 (dd, 2H), 7.20 (dd, 2H), 7.10 (t, 2H), 5.44 (dd, 1H), 4.05-4.00 (m, 1H), 3.75-3.70 (m, 1H), 2.20-2.10 (m, 1H), 2.05-1.95 (m, 2H), 1.70-1.50 (m, 3H) ppm	-

No.	名称	NMR	異性体比率[1]
10	4-[5-(2,6-ジフルオロフェニル)-1-(プロパン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 8.53 (s, 1H), 8.42 (d, 2H), 7.59 (m, 1H), 7.24 (m, 2H), 7.15 (m, 2H), 4.60 (m, 1H), 1.51 (d, 6H) ppm	-
11	4-[3-(2,6-ジフルオロフェニル)-1-(2,2-ジメチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 8.42 (d, 2H), 8.20 (s, 1H), 7.74 (m, 1H), 7.38 (m, 2H), 7.12 (d, 2H), 3.33 (s, 2H), 0.79 (s, 9H) ppm	-
13	4-[3-(2,6-ジフルオロフェニル)-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 8.42 (d, 2H), 8.21 (s, 1H), 7.77 (m, 1H), 7.39 (m, 2H), 7.13 (d, 2H), 3.75 (d, 2H), 2.05 (m, 1H), 0.73 (d, 6H) ppm	-
15	4-[1-シクロブチル-5-(2,6-ジフルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 8.59 (s, 1H), 8.42 (d, 2H), 7.60 (m, 1H), 7.24 (m, 2H), 7.14 (d, 2H), 4.94 (m, 1H), 2.60-2.45 (m, 4H), 1.83 (m, 2H) ppm	-
16	4-[1-シクロペンチル-3-(2,6-ジフルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 8.42 (d, 2H), 8.20 (s, 1H), 7.76 (m, 1H), 7.39 (m, 2H), 7.11 (d, 2H), 4.37 (m, 1H), 1.95 (m, 4H), 1.84 (m, 2H), 1.58 (m, 2H) ppm	-
19	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}プロパンアミド	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 10.38 (s, 1H), 8.29 (s, 1H), 8.18 (d, 1H), 8.07 (s, 1H), 7.44 (dd, 2H), 7.20 (t, 2H), 6.85 (dd, 1H), 5.49 (dd, 1H), 3.96 (m, 1H), 3.68 (m, 1H), 2.35 (q, 2H), 2.18 (m, 2H), 2.00-1.90 (m, 2H), 1.70 (m, 1H), 1.58 (m, 1H), 1.03 (t, 3H) ppm	-
20	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 9.70 (s, 1H, br), 8.16 (d, 1H), 8.02 (s, 1H), 7.42 (dd, 2H), 7.25 (m, 1H), 6.99 (t, 2H), 6.89 (d, 1H), 6.15 (d, 1H), 5.46 (dd, 1H), 4.04 (m, 1H), 3.76 (m, 1H), 2.25-2.15 (m, 1H), 2.10-2.00 (m, 2H), 1.80-1.60 (m, 3H) ppm	-
33	4-[5-(2,2-ジフルオロ-1,3-ベンゾジオキソール-4-イル)-1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.39 (m, 2H), 7.97 (s, 1H), 7.70-7.60 (m, 1H), 7.53-7.50 (m, 1H), 7.35-7.30 (m, 2H), 7.12 (m, 2H), 5.10 (m, 1H), 3.90 (m, 1H), 3.40 (m, 1H), 2.50-2.40 (m, 1H), 2.00 (m, 1H), 1.90 (m, 1H), 1.60-1.40 (m, 3H) ppm	-
38	4-[1-(ブタン-2-イル)-5-(2,6-ジフルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 8.42 (d, 2H), 8,23 (s, 1H), 7,77 (m, 1H), 7,41 (t, 2H), 7,13 (d, 2H), 3,85 (m, 1H), 1.89 (m, 1H), 1,68 (m, 1H), 1,38 (d, 3H), 0.59 (t, 3H) ppm	

No.	名称	NMR	異性体比率[1]
39	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-アミン	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD_3CN): δ = 7.91 (s, 1H), 7.87 (d, 1H), 7.47 (dd, 2H), 7.10 (t, 2H), 6.45 (dd, 1H), 6.37 (s, 1H), 5.42 (dd, 1H), 4.79 (s, 2H, br), 4.05-4.00 (m, 1H), 3.75-3.65 (m, 1H), 2.20-2.10 (m, 1H), 2.05-1.95 (m, 2H), 1.70-1.50 (m, 3H) ppm	-
40	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(プロパン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メトキシアセトアミド	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 9.90 (s, 1H), 8.22 (s, 1H), 8.19 (d, 1H), 8.02 (s, 1H), 7.44 (dd, 2H), 7.20 (t, 2H), 6.93 (d, 1H), 4.58 (m, 1H), 4.02 (s, 3H), 3.30 (m, 2H), 1.50 (d, 6H) ppm	-
43	4-[3-(4-メトキシフェニル)-1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD_3CN): δ = 8.44 (dd, 2H), 8.00 (s, 1H), 7.34 (d, 2H), 7.20 (dd, 2H), 6.92 (d, 2H), 5.43 (dd, 1H), 4.04 (m, 1H), 3.80 (s, 3H), 3.60 (m, 1H), 2.15 (m, 1H), 2.05-2.00 (m, 2H), 1.70-1.50 (m, 3H) ppm	-
44	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(プロパン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]キノリン	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 8.86 (d, 1H), 8.15 (s, 1H), 8.05 (d, 1H), 7.75-7.70 (m, 2H), 7.48 (m, 1H), 7.35 (d, 1H), 7.28 (dd, 2H), 7.03 (t, 2H), 4.65 (m, 1H), 1.56 (d, 6H) ppm	-
46	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(プロパン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-アミン	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD_3CN): δ = 7.80 (m, 2H), 7.50 (dd, 2H), 7.10 (dd, 1H), 6.47 (d, 1H), 6.39 (s, 1H), 5.10 (s, 2H, br), 4.53 (m, 1H), 1.20 (d, 6H) ppm	-
47	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(プロパン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]-1-(プロパ-2-イン-1-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD_3CN): δ = 8.18 (d, 1H), 8.05 (d, 1H, 異性体), 7.96 (s, 1H, 異性体), 7.93 (s, 1H), 7.43 (m, 3H), 7.38 (dd, 2H, 異性体), 7.19 (t, 2H, 異性体), 7.01 (t, 2H), 6.89 (d, 1H), 6.64 (d, 1H, 異性体), 6.48 (d, 1H, 異性体), 6.29 (d, 1H), 5.08 (d, 1H), 5.04 (d, 1H, 異性体), 4.60 (m, 1H), 4.48 (m, 1H, 異性体), 2.63 (t, 1H), 2.60 (t, 1H, 異性体), 1.56 (d, 6H), 1.42 (d, 6H, 異性体) ppm	80:20
53	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(プロパン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]-N-メチルピリジン-2-カルボキサミド	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 8.74 (d, 1H), 8.50 (d, 1H), 8.41 (s, 1H), 7.90 (s, 1H), 7.45-7.40 (dd, 2H), 7.37 (d, 1H), 7.25-7.20 (t, 2H), 4.57 (m, 1H), 2.79 (d, 3H), 1.51 (d, 6H) ppm	-

No.	名称	NMR	異性体比率[1]
70	4-[5-(4-クロロフェニル)-1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD_3CN): δ = 8.37 (m, 2H), 7.90 (s, 1H), 7.53 (d, 2H), 7.37 (d, 2H), 7.09 (m, 2H), 5.02 (dd, 1H), 3.96 (m, 1H), 3.46 (m, 1H), 2.50-2.35 (m, 1H), 2.00 (m, 1H), 1.80 (m, 1H), 1.60-1.40 (m, 3H) ppm	-
76	4-[5-(2,3-ジクロロフェニル)-1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD_3CN): δ = 8.37 (m, 2H), 8.01 (s, 1H), 7.75 (m, 1H), 7.50-7.45 (m, 1H), 7.43-7.38 (m, 1H), 7.05 (m, 2H), 5.08 (dd, 1H), 4.90 (dd, 1H, 異性体), 3.90-3.80 (m, 1H), 3.40-3.30 (m, 1H), 2.50-2.40 (m, 1H), 2.00 (m, 1H), 1.80 (m, 1H), 1.60-1.40 (m, 3H) ppm	40:60
81	1-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-1-イル}エタノン	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD_3CN): δ = 8.29 (d, 1H), 8.03 (s, 1H), 7.85 (d, 1H), 7.40-7.35 (dd, 2H), 7.09 (d, 1H), 7.02 (t, 2H), 6.34 (d, 1H), 5.49 (dd, 1H), 4.05-4.00 (m, 1H), 3.75-3.70 (m, 1H), 3.00 (s, 3H), 2.30-2.00 (m, 3H), 1.80-1.60 (m, 3H) ppm	-
84	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(プロパン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メチルプロパンアミド	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 10.36 (s, 1H), 8.18 (s, 1H), 8.16 (d, 1H), 8.10 (s, 1H), 7.44 (dd, 2H), 7.19 (t, 2H), 6.80 (dd, 1H), 4.57 (m, 1H), 2.73 (m, 1H), 1.50 (d, 6H), 1.06 (d, 6H) ppm	-
85	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(プロパン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}プロパンアミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD_3CN): δ = 8.55 (s, 1H, br), 8.10 (m, 2H), 7.88 (s, 1H), 7.46 (dd, 2H), 7.09 (t, 2H), 6.87 (dd, 1H), 4.55 (m, 1H), 2.38 (q, 2H), 1.51 (d, 6H), 1.10 (t, 2H) ppm	-
86	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(プロパン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}シクロプロパンカルボキサミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD_3CN): δ = 8.82 (s, 1H, br), 8.11 (d, 1H), 8.07 (s, 1H), 7.85 (s, 1H), 7.44 (dd, 2H), 7.06 (t, 2H), 6.86 (dd, 1H), 4.54 (m, 1H), 1.78 (m, 1H), 1.51 (d, 6H), 0.90-0.80 (m, 4H) ppm	-
87	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メチルプロパンアミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD_3CN): δ = 8.59 (s, 1H, br), 8.12 (m, 2H), 7.83 (s, 1H), 7.45 (dd, 2H), 7.09 (t, 2H), 6.86 (dd, 1H), 3.96 (d, 2H), 2.62 (m, 1H), 2.21 (m, 1H), 1.14 (d, 6H), 0.93 (d, 6H) ppm	-

No.	名称	NMR	異性体比率[1]
88	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(2-メトキシエチル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 8.45 (d, 2H), 8.37 (d, 2H, 異性体), 8.20 (s, 1H), 8.08 (s, 1H, 異性体), 7.48-7.38 (m, 2H), 7.25-7.20 (m, 4H), 7.08 (d, 2H, 異性体), 4.33 (t, 2H), 4.06 (t, 2H, 異性体), 3.77 (t, 2H), 3.65 (t, 2H, 異性体), 3.27 (s, 3H), 3.11 (s, 3H, 異性体) ppm	70:30
92	4-[1-シクロペンチル-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 8.45 (d, 2H), 8.36 (d, 2H, 異性体), 8.28 (s, 1H), 8.07 (s, 1H, 異性体), 7.48-7.38 (m, 2H), 7.25-7.20 (m, 4H), 7.07 (d, 2H, 異性体), 4.75 (m, 1H), 4.38 (m, 1H, 異性体), 2.15-2.10 (m, 2H), 2.05-2.00 (m, 2H), 2.00-1.90 (m, 2H, 異性体), 1.80 (m, 2H), 1.70-1.65 (m, 2H), 1.55 (m, 2H, 異性体) ppm	85:15
92	4-[1-シクロペンチル-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 8.45 (d, 2H), 8.36 (d, 2H, 異性体), 8.28 (s, 1H), 8.07 (s, 1H, 異性体), 7.48-7.38 (m, 2H), 7.25-7.20 (m, 4H), 7.07 (d, 2H, 異性体), 4.75 (m, 1H), 4.38 (m, 1H, 異性体), 2.15-2.10 (m, 2H), 2.05-2.00 (m, 2H), 2.00-1.90 (m, 2H, 異性体), 1.80 (m, 2H), 1.70-1.65 (m, 2H), 1.55 (m, 2H, 異性体) ppm	80:20
100	3-{[3-(4-フルオロフェニル)-4-(ピリジン-4-イル)-1H-ピラゾール-1-イル]メチル}ピリジン	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 8.63 (s, 1H), 8.54 (d, 1H), 8.47 (d, 2H), 8.38 (s, 1H), 7.78 (d, 1H), 7.40 (m, 3H), 7.25-7.20 (m, 4H), 5.46 (s, 2H) ppm	-
101	4-{1-[1-(3-クロロフェニル)エチル]-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル}ピリジン	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 8.47 (d, 2H), 8.38 (d, 2H, 異性体), 7.50-7.10 (m, 11H), 7.11 (m, 2H, 異性体), 5.72 (m, 1H), 5.30 (m, 1H, 異性体), 1.88 (d, 3H), 1.79 (d, 3H, 異性体) ppm	80:20
102	4-{1-[1-(2-クロロフェニル)エチル]-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル}ピリジン	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 8.46 (m, 3H), 8.37 (d, 2H, 異性体), 7.50 (d, 1H), 7.40-7.20 (m, 10H), 7.11 (d, 2H, 異性体), 6.03 (q, 2H), 5.65 (q, 2H, 異性体), 1.88 (d, 3H), 1.79 (d, 3H, 異性体) ppm	91:9
103	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(2,2,2-トリフルオロエチル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 8.50 (d, 2H), 8.40 (d, 2H, 異性体), 8.33 (s, 1H), 8.23 (s, 1H, 異性体), 7.48-7.38 (m, 2H), 7.25-7.20 (m, 4H), 7.11 (d, 2H, 異性体), 5.25 (q, 2H), 4.89 (q, 2H, 異性体) ppm	91:9

No.	名称	NMR	異性体比率[1]
104	4-[1-(2,3-ジフルオロベンジル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 8.47 (d, 2H), 8.38 (d, 2H, 異性体), 8.35 (s, 1H), 8.14 (s, 1H, 異性体), 7.45-7.30 (m, 4H), 7.25-7.20 (m, 5H), 7.11 (d, 2H, 異性体), 5.52 (s, 2H), 5.29 (s, 1H, 異性体) ppm	75:25
105	[3-(4-フルオロフェニル)-4-(ピリジン-4-イル)-1H-ピラゾール-1-イル]酢酸 tert-ブチル	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 8.48 (d, 2H), 8.39 (d, 2H, 異性体), 8.21 (s, 1H), 8.10 (s, 1H, 異性体), 7.40 (m, 2H), 7.25-7.20 (m, 4H), 7.12 (d, 2H, 異性体), 5.04 (s, 2H), 4.79 (s, 2H, 異性体), 1.45 (s, 9H), 1.30 (s, 9H, 異性体) ppm	78:22
106	2-[3-(4-フルオロフェニル)-4-(ピリジン-4-イル)-1H-ピラゾール-1-イル]-3-メチルブタン酸メチル	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 8.48 (d, 2H), 8.37 (d, 2H, 異性体), 8.36 (s, 1H), 8.17 (s, 1H, 異性体), 7.43 (m, 2H), 7.25-7.20 (m, 4H), 7.09 (d, 2H, 異性体), 4.89 (d, 1H), 4.30 (d, 1H, 異性体), 3.72 (s, 3H), 3.64 (s, 3H, 異性体), 1.00 (d, 3H), 0.87 (d, 3H), 0.71 (d, 3H, 異性体) ppm	93:7
107	2-[3-(4-フルオロフェニル)-4-(ピリジン-4-イル)-1H-ピラゾール-1-イル]プロパン酸メチル	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 8.48 (d, 2H), 8.36 (s, 1H), 7.43 (dd, 2H), 7.25-7.20 (m, 4H), 5.36 (q, 1H), 3.70 (s, 3H), 1.75 (d, 3H) ppm	-
108	4-[1-(2-クロロ-6-フルオロベンジル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 8.46 (d, 2H), 8.37 (d, 2H, 異性体), 8.29 (s, 1H), 8.00 (s, 1H, 異性体), 7.55-7.45 (m, 1H), 7.40-7.30 (m, 3H), 7.25-7.20 (m, 4H), 7.09 (d, 2H, 異性体), 5.53 (s, 2H), 5.26 (s, 1H, 異性体) ppm	87:13
109	4-{1-[4-(ジフルオロメトキシ)ベンジル]-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル}ピリジン	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 8.46 (d, 2H), 8.38 (d, 2H, 異性体), 8.35 (s, 1H), 8.14 (s, 1H, 異性体), 7.45-7.35 (m, 4H), 7.25-7.20 (m, 6H), 7.15 (m, 1H), 7.05 (d, 2H, 異性体), 5.39 (s, 2H), 5.18 (s, 1H, 異性体) ppm	74:26
110	4-{1-[(2-クロロ-1,3-チアゾール-5-イル)メチル]-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル}ピリジン	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 8.47 (d, 2H), 8.32 (s, 1H), 7.78 (s, 1H), 7.45-7.40 (dd, 2H), 7.25-7.20 (m, 4H), 5.66 (s, 2H) ppm	-

No.	名称	NMR	異性体比率[1]
111	4-{3-(4-フルオロフェニル)-1-[5-(トリフルオロメチル)-1,3,4-チアジアゾール-2-イル]-1H-ピラゾール-4-イル}ピリジン	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 9.32 (s, 1H), 8.58 (d, 2H), 7.53 (dd, 2H), 7.37 (d, 2H), 7.34 (t, 2H) ppm	-
112	4-[3-(4-フルオロフェニル)-4-(ピリジン-4-イル)-1H-ピラゾール-1-イル]-6-(トリフルオロメチル)ピリミジン	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 9.39 (s, 1H), 9.26 (s, 1H), 8.57 (d, 2H), 8.35 (s, 1H), 7.59 (dd, 2H), 7.38 (d, 2H), 7.33 (t, 2H) ppm	-
113	1-シクロヘキシル-2-[3-(4-フルオロフェニル)-4-(ピリジン-4-イル)-1H-ピラゾール-1-イル]エタノン	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 8.47 (d, 2H), 8.38 (d, 2H, 異性体), 8.12 (s, 1H), 8.09 (s, 1H, 異性体), 7.43-7.35 (m, 2H), 7.25-7.20 (m, 4H), 7.11 (d, 2H, 異性体), 5.32 (s, 2H), 5.09 (s, 1H, 異性体), 2.60 (m, 1H), 1.90 (m, 2H), 1.70 (m, 2H), 1.65-1.60 (m, 2H), 1.30-1.10 (m, 4H) ppm	80:20
114	1-シクロペンチル-2-[3-(4-フルオロフェニル)-4-(ピリジン-4-イル)-1H-ピラゾール-1-イル]エタノン	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 8.47 (d, 2H), 8.38 (d, 2H, 異性体), 8.15 (s, 1H), 8.10 (s, 1H, 異性体), 7.43-7.35 (m, 2H), 7.25-7.20 (m, 4H), 7.11 (d, 2H, 異性体), 5.30 (s, 2H), 5.08 (s, 1H, 異性体), 3.05 (m, 1H), 2.90 (m, 1H, 異性体), 1.90-1.20 (m, 8H) ppm	75:25
115	2-{[3-(4-フルオロフェニル)-4-(ピリジン-4-イル)-1H-ピラゾール-1-イル]メチル}ピリジン	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 8.56 (d, 1H), 8.47 (d, 2H), 8.22 (s, 1H), 7.88 (t, 1H), 7.58 (d, 2H), 7.52 (d, 1H), 7.46 (dd, 2H), 7.38 (m, 1H), 7.25-7.20 (m, 2H), 5.63 (s, 2H) ppm	-
115	2-{[3-(4-フルオロフェニル)-4-(ピリジン-4-イル)-1H-ピラゾール-1-イル]メチル}ピリジン	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 8.57 (d, 1H), 8.47 (d, 2H), 8.38 (m, 1H), 7.88 (m, 1H), 7.72 (m, 1H, 異性体), 7.45-7.40 (m, 3H), 7.30 (m, 1H), 7.25 (m, 1H), 7.20 (m, 2H), 7.11 (d, 2H, 異性体), 5.51 (s, 2H), 5.27 (s, 1H, 異性体) ppm	75:25
116	4-{1-[(2,2-ジクロロシクロプロピル)メチル]-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル}ピリジン	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 8.48 (d, 2H), 8.39 (d, 2H, 異性体), 8.30 (s, 1H), 8.15 (s, 1H, 異性体), 7.50 (m, 2H, 異性体), 7.48-7.40 (m, 2H), 7.25-7.20 (m, 4H), 7.11 (d, 2H, 異性体), 4.44 (dd, 1H), 4.34 (dd, 1H), 4.13 (m, 2H, 異性体), 2.38 (m, 1H), 2.21 (m, 1H, 異性体), 1.89 (dd, 1H), 1.77 (dd, 1H, 異性体), 1.70 (dd, 1H), 1.37 (dd, 1H, 異性体) ppm	75:25

No.	名称	NMR	異性体比率[1]
117	4-{3-(4-フルオロフェニル)-1-[2-(メチルスルファニル)エチル]-1H-ピラゾール-4-イル}ピリジン	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 8.46 (d, 2H), 8.38 (d, 2H, 異性体), 8.28 (s, 1H), 8.10 (s, 1H, 異性体), 7.48-7.38 (m, 2H), 7.25-7.20 (m, 4H), 7.08 (d, 2H, 異性体), 4.37 (t, 2H), 4.10 (t, 2H, 異性体), 2.98 (t, 2H), 2.82 (t, 2H, 異性体), 2.07 (s, 3H), 1.81 (s, 3H, 異性体) ppm	80:20
120	4-{1-[1-(4-クロロフェニル)エチル]-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル}ピリジン	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 8.46 (d, 2H), 8.42 (s, 1H), 8.37 (d, 2H, 異性体), 8.17 (s, 1H, 異性体), 7.45-7.35 (m, 6H), 7.25-7.20 (m, 4H), 7.08 (m, 2H, 異性体), 5.70 (q, 1H), 5.30 (q, 1H, 異性体), 1.86 (d, 3H), 1.78 (d, 3H, 異性体) ppm	80:20
121	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(ピリジン-4-イルメチル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 8.62 (d, 2H), 8.59 (d, 2H), 8.32 (s, 1H), 7.67 (d, 2H), 7.50 (m, 2H), 7.30 (d, 2H), 7.27 (t, 2H), 5.59 (s, 2H) ppm	-
122	4-{3-(4-フルオロフェニル)-1-[2-(トリフルオロメトキシ)エチル]-1H-ピラゾール-4-イル}ピリジン	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 8.48 (d, 2H), 8.38 (d, 2H, 異性体), 8.29 (s, 1H), 8.16 (s, 1H, 異性体), 7.43 (m, 2H), 7.25-7.20 (m, 4H), 7.10 (d, 2H, 異性体), 4.51 (m, 4H), 4.40 (t, 2H, 異性体), 4.24 (t, 2H, 異性体) ppm	88:12
122	4-{3-(4-フルオロフェニル)-1-[2-(トリフルオロメトキシ)エチル]-1H-ピラゾール-4-イル}ピリジン	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 8.48 (d, 2H), 8.38 (d, 2H, 異性体), 8.29 (s, 1H), 8.16 (s, 1H, 異性体), 7.43 (m, 2H), 7.25-7.20 (m, 4H), 7.10 (d, 2H, 異性体), 4.51 (m, 4H), 4.40 (t, 2H, 異性体), 4.24 (t, 2H, 異性体) ppm	66:33
123	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(テトラヒドロフラン-2-イルメチル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 8.45 (d, 2H), 8.37 (d, 2H, 異性体), 8.18 (s, 1H), 8.07 (s, 1H, 異性体), 7.40 (m, 2H), 7.25-7.20 (m, 4H), 7.08 (d, 2H, 異性体), 4.25 (m, 2H), 4.20 (m, 1H), 3.99 (dd, 1H, 異性体), 3.89 (dd, 1H, 異性体), 3.79 (m, 1H), 3.66 (m, 1H), 3.55 (m, 1H, 異性体), 2.00 (m, 1H), 1.83 (m, 2H), 1.56 (m, 1H) ppm	89:11
124	3-[3-(4-フルオロフェニル)-4-(ピリジン-4-イル)-1H-ピラゾール-1-イル]プロパン-1,2-ジオール	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 8.65 (d, 2H), 8.51 (s, 1H), 8.47 (s, 1H), 7.78 (d, 2H), 7.53 (m, 2H), 7.30 (t, 2H), 5.70 (s, 1H, br), 5.15 (s, 1H, br), 4.57 (dd, 1H), 4.28 (dd, 1H), 3.80 (m, 1H), 3.48 (m, 2H) ppm	-

No.	名称	NMR	異性体比率[1]
128	4-[1-(2-フルオロベンジル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 8.47 (d, 2H), 8.38 (d, 2H, 異性体), 8.32 (s, 1H), 8.13 (s, 1H, 異性体), 7.40-7.30 (m, 5H), 7.25-7.20 (m, 5H), 7.12 (m, 2H, 異性体), 5.47 (s, 2H), 5.24 (s, 2H, 異性体) ppm	80:20
134	4-{3-(4-フルオロフェニル)-1-[2-(2-メトキシエトキシ)エチル]-1H-ピラゾール-4-イル}ピリジン	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD_3CN): δ = 8.44 (d, 2H), 7.91 (s, 1H), 7.45 (m, 2H), 7.18 (d, 2H), 7.12 (t, 2H), 4.31 (t, 2H), 3.86 (t, 2H), 3.57 (t, 2H), 3.46 (t, 2H), 3.26 (s, 3H) ppm	-
140	3-{[3-(4-フルオロフェニル)-4-(ピリジン-4-イル)-1H-ピラゾール-1-イル]メチル}ベンゾニトリル	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD_3CN): δ = 8.47 (dd), 8.37 (m), 8.16 (s), 7.86 (s), 7.81 (d), 7.70 (m), 7.50 (t), 7.45-7.30 (m), 7.25-7.10 (m), 7.12 (dd), 5.47 (s, 2H), 5.27 (s, 2H, 異性体) ppm	60:40
141	4-{[3-(4-フルオロフェニル)-4-(ピリジン-4-イル)-1H-ピラゾール-1-イル]メチル}ベンゾニトリル	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 8.48 (d, 2H), 8.39 (d, 2H, 異性体), 8.37 (s, 1H), 8.17 (s, 1H, 異性体), 7.84 (d, 2H), 7.74 (d, 2H, 異性体), 7.50 (d, 2H), 7.40 (m, 2H), 7.33 (m, 1H), 7.25-7.20 (m, 2H), 7.08 (m, 2H, 異性体), 5.52 (s, 2H), 5.30 (s, 2H, 異性体) ppm	70:30
142	3-[3-(4-フルオロフェニル)-4-(ピリジン-4-イル)-1H-ピラゾール-1-イル]ジヒドロフラン-2(3H)-オン	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD_3CN): δ = 8.46 (m, 2H), 8.03 (s, 1H), 7.46 (dd, 2H), 7.24 (dd, 2H), 7.10 (t, 2H), 5.33 (t, 1H), 4.60 (m, 1H), 4.40 (m, 1H), 2.90-2.80 (m, 2H) ppm	-
143	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(1H-イミダゾール-2-イルメチル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD_3CN): δ = 8.43 (d, 2H), 7.94 (s, 1H), 7.44 (dd, 2H), 7.17 (d, 2H), 7.10 (t, 2H), 6.99 (s, 2H), 5.40 (s, 2H), 2.90 (s, 1H, br) ppm	-
144	1-(1,5-ジメチル-1H-ピラゾール-3-イル)-2-[3-(4-フルオロフェニル)-4-(ピリジン-4-イル)-1H-ピラゾール-1-イル]エタノン	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD_3CN): δ = 8.45 (d, 2H), 8.35 (d, 2H, 異性体), 7.94 (s, 1H, 異性体), 7.91 (s, 1H), 7.44 (dd, 2H), 7.36 (dd, 2H, 異性体), 7.20 (m, 2H), 7.10 (m, 2H), 6.57 (s, 1H), 6.47 (s, 1H, 異性体), 5.62 (s, 2H), 5.40 (s, 2H, 異性体), 3.85 (s, 3H), 3.77 (s, 3H, 異性体), 2.31 (s, 3H), 2.26 (s, 3H, 異性体) ppm	62:38

No.	名称	NMR	異性体比率[1]
144	1-(1,5-ジメチル-1H-ピラゾール-3-イル)-2-[3-(4-フルオロフェニル)-4-(ピリジン-4-イル)-1H-ピラゾール-1-イル]エタノン	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD_3CN): δ = 8.45 (d, 2H), 7.91 (s, 1H), 7.44 (dd, 2H), 7.20 (d, 2H), 7.10 (t, 2H), 6.57 (s, 1H), 5.62 (s, 2H), 3.85 (s, 3H), 2.31 (s, 3H) ppm	-
145	酢酸2-[3-(4-フルオロフェニル)-4-(ピリジン-4-イル)-1H-ピラゾール-1-イル]エチル	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD_3CN): δ = 8.50 (m, 2H, br), 7.89 (s, 1H), 7.45 (dd, 2H), 7.28 (m, 2H, br), 7.10 (t, 2H), 4.46 (m, 2H), 4.39 (m, 2H), 4.28 (t, 2H, 異性体), 3.90 (t, 2H), 2.00 (s, 3H), 1.90 (s, 3H, 異性体) ppm	91:9
146	3-[3-(4-フルオロフェニル)-4-(ピリジン-4-イル)-1H-ピラゾール-1-イル]プロパノニトリル	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD_3CN): δ = 8.50 (m, 2H, br), 7.94 (s, 1H), 7.46 (dd, 2H), 7.28 (m, 2H, br), 7.14 (t, 2H), 4.45 (t, 2H), 3.02 (t, 2H) ppm	-
147	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-イソブチル-1H-ピラゾール-4-イル]-1,3-ジヒドロ-2H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-2-オン	^{1}H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 11.02 (s, 1H), 8.21 (s, 1H), 7.91 (d, 1H), 7.42 (m, 2H), 7.21 (m, 2H), 6.60 (d, 1H), 4.00 (d, 2H), 3.42 (s, 2H), 2.20 (m, 1H), 0.92 (d, 6H) ppm	-
148	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-イソブチル-1H-ピラゾール-4-イル]-1,3,3-トリメチル-1,3-ジヒドロ-2H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-2-オン	^{1}H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 8.06 (d, 1H), 7.30 (m, 3H), 6.85 (t, 2H), 6.67 (d, 1H), 3.92 (d, 2H), 3.27 (s, 3H), 2.26 (m, 1H), 1.13 (s, 6H), 0.92(d, 6H) ppm	-
149	4-[5-(4-フルオロフェニル)-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]-N-(プロパ-2-エン-1-イル)ピリミジン-2-アミン	1H-NMR (400 MHz, $CDCl_3$): δ = 8,11 (s, 1H), 8,03 (d, 1H), 7,32 (m, 2H), 7,19 (t, 2H), 6,18 (bs, 1H), 5,87 (m, 1H), 5,20 (d, 1H), 5,09 (d, 1H), 5,02 (m, 1H), 3,85 (bs, 2H), 3,74 (d, 2H), 2,18 (m, 1H), 0,79 (d, 6H) ppm	-
150	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]-N-(プロパ-2-エン-1-イル)ピリミジン-2-アミン	1H-NMR (400 MHz, $CDCl_3$): δ = 8,10 (d, 1H), 7,93 (s, 1H), 7,54 (m, 2H), 7,07 (t, 2H), 6,39 (d, 1H), 5,95 (m, 1H), 5,26 (d, 1H), 5,12 (d, 2H), 4,04 (bs 1H), 3,96 (d, 2H), 2,30 (m, 1H), 0,98 (d, 6H) ppm	-

No.	名称	NMR	異性体比率[1]
153	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(2-メトキシエチル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}プロパンアミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD_3CN): δ = 8.54 (s, 1H, br), 8.10 (m, 2H), 7.86 (s, 1H), 7.46 (dd, 2H), 7.09 (t, 2H), 6.87 (dd, 1H), 4.31 (t, 2H), 3.78 (t, 2H), 3.32 (s, 3H), 2.38 (q, 2H), 1.11 (t, 2H) ppm	-
154	2-フルオロ-5-[1-(2-メチルプロピル)-4-(ピリジン-4-イル)-1H-ピラゾール-3-イル]ベンゾニトリル	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.47-8.46 (m, 2H), 7.86 (s, 1H), 7.81-7.79 (m, 1H), 7.73-7.71 (m, 1H), 7.33-7.30 (m, 1H), 7.19-7.18 (m, 2H), 3.99 (d, 2H), 2.23 (m, 1H), 0.94 (d, 6H) ppm	-
155	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}プロパンアミド	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 10.40 (s, 1H), 8.16 (d, 1H), 8.14 (s, 1H), 8.08 (s, 1H), 7.42-7.40 (m, 2H), 7.20-7.18 (m, 2H), 6.82 (dd, 1H), 3.98 (d, 2H), 2.38 (q, 2H), 2.20 (m, 1H), 1.05 (t, 3H), 0.92 (d, 6H) ppm	-
156	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(プロパン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}シクロブタンカルボキサミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.35 (s, 1H, br), 8.12 (s, 1H), 8.10 (m, 1H), 7.88 (s, 1H), 7.48-7.45 (m, 2H), 7.12-7.08 (m, 2H), 6.86 (dd, 1H), 4.55 (m, 1H), 3.25 (m, 1H), 2.03-2.15 (m, 6H), 1.53 (d, 6H) ppm	-
157	N-{4-[1-(ブタン-2-イル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]-ピリジン-2-イル}-2-メチルプロパンアミド	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 10.39 (s, 1H), 8.19 (s, 1H), 8.15 (m, 1H), 8.11 (s, 1H), 7.44-7.42 (m, 2H), 7.20-7.18 (m, 2H), 6.82-6.81 (dd, 1H), 4.35 (m, 1H), 2.74 (m, 1H), 1.90-1.80 (m, 1H), 1.48 (d, 2H), 1.06 (d, 6H), 0.80 (t, 3H) ppm	-
158	2-シクロプロピル-N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}アセトアミド	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 10.32 (s, 1H), 8.16-8.14 (m, 2H), 8.09 (s, 1H), 7.44-7.42 (m, 2H), 7.20-7.18 (m, 2H), 6.83-6.82 (dd, 1H), 3.99 (d, 2H), 2.24 (d, 2H), 2.20 (m, 1H), 1.05 (m, 1H), 0.91 (d, 6H), 0.45 (m, 2H), 0.16 (m, 2H) ppm	-
159	N-{4-[1-(ブタン-2-イル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-シクロプロピルアセトアミド	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 10.31 (s, 1H), 8.19 (s, 1H), 8.16 (d, 1H), 8.09 (s, 1H), 7.44-7.42 (dd, 2H), 7.20-7.18 (m, 2H), 6.84-6.83 (dd, 1H), 4.33 (m, 1H), 2.23 (d, 2H), 1.90 (m, 1H), 1.80 (m, 1H), 1.48 (d, 3H), 1.05 (m, 1H), 0.80 (t, 3H), 0.45 (m, 2H), 0.17 (m, 2H) ppm	-

No.	名称	NMR	異性体比率[1]
160	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(プロパン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-3-メチルブタンアミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.50 (s, 1H, br), 8.10 (m, 2H), 7.89 (s, 1H), 7.47-7.45 (m, 2H), 7.09-7.08 (m, 2H), 6.88 (dd, 1H), 4.55 (m, 1H), 2.21 (d, 2H), 2.10 (m, 1H), 1.53 (d, 6H), 0.95 (d, 6H) ppm	-
161	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(プロパン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}アセトアミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.59 (s, 1H, br), 8.11 (m, 1H), 8.05 (s, 1H), 7.88 (s, 1H), 7.47-7.45 (m, 2H), 7.11-7.08 (m, 2H), 6.88 (dd, 1H), 4.55 (m, 1H), 2.08 (s, 3H), 1.52 (d, 6H) ppm	-
162	N-{4-[1-(ブタン-2-イル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メトキシアセトアミド	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 9.93 (s, 1H), 8.23 (s, 1H), 8.20 (d, 1H), 8.03 (s, 1H), 7.44-7.40 (m, 2H), 7.22-7.19 (m, 2H), 6.94 (d, 1H), 4.35 (m, 1H), 4.03 (s, 2H), 1.90 (m, 1H), 1.80 (m, 1H), 1.49 (d, 3H), 1.04 (t, 3H), 0.80 (t, 3H) ppm	-
163	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(2-メトキシエチル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メトキシアセトアミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.70 (s, 1H, br), 8.15 (d, 1H), 8.08 (s, 1H), 7.88 (s, 1H), 7.47-7.45 (m, 2H), 7.12-7.10 (m, 2H), 6.95 (dd, 1H), 4.32 (t, 2H), 3.96 (s, 2H), 3.78 (t, 2H), 3.45 (s, 3H), 3.32 (s, 3H) ppm	-
164	N-{4-[1-(ブタン-2-イル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}プロパンアミド	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 10.39 (s, 1H), 8.19 (s, 1H), 8.17 (d, 1H), 8.09 (s, 1H), 7.44-7.42 (m, 2H), 7.22-7.19 (m, 2H), 6.84-6.83 (dd, 1H), 4.34 (m, 1H), 2.38 (q, 2H), 1.90 (m, 1H), 1.80 (m, 1H), 1.49 (d, 3H), 1.04 (t, 3H), 0.80 (t, 3H) ppm	-
165	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}シクロプロパンカルボキサミド	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 10.76 (s, 1H), 8.17 (d, 1H), 8.13 (s, 1H), 8.08 (s, 1H), 7.44-7.42 (m, 2H), 7.22-7.19 (m, 2H), 6.83-6.81 (dd, 1H), 3.99 (d, 2H), 2.20 (m, 1H), 1.98 (m, 1H), 0.91 (m, 6H), 0.78 (m, 4H) ppm	-
166	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メトキシアセトアミド	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 9.94 (s, 1H), 8.21-8.19 (m, 1H), 8.04 (s, 1H), 7.45-7.43 (m, 2H), 7.22 (m, 2H), 6.83-6.81 (dd, 1H), 4.03 (s, 2H), 3.99 (d, 2H), 2.20 (m, 1H), 0.91 (m, 6H) ppm	-
167	N-{4-[1-(ブタン-2-イル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}シクロプロパンカルボキサミド	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 10.76 (s, 1H), 8.17 (m, 2H), 8.07 (s, 1H), 7.44-7.42 (dd, 2H), 7.24-7.20 (m, 2H), 6.83-6.82 (dd, 1H), 4.35 (m, 1H), 2.00 (m, 1H), 1.90 (m, 1H), 1.80 (m, 1H), 1.40 (d, 3H), 0.80 (m, 7H) ppm	-

No.	名称	NMR	異性体比率[1]
169	4-[1-(2,2-ジフルオロエチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.46 (dd, 1H), 7.93 (s, 1H), 7.46-7.44 (m, 2H), 7.19 (m, 1H), 7.14-7.10 (m, 2H), 6.27 (tt, 2J(H,F)= 55Hz, 1H), 4.59 (dt, 3J(H,F)= 15Hz, 2H) ppm	-
170	[3-(4-フルオロフェニル)-4-(ピリジン-4-イル)-1H-ピラゾール-1-イル]酢酸エチル	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.45 (d, 2H), 7.91 (s, 1H), 7.45 (m, 2H), 7.21 (d, 2H), 7.14-7.08 (m, 2H), 4.99 (s, 2H), 4.21 (q, 2H), 1.28 (t, 3H) ppm	-
171	4-[3-(4-フルオロフェニル)-5-メチル-1-(プロパ-2-イン-1-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 8.56 (d, 2H), 8.46 (d, 2H, 異性体), 7.58 (t, 2H), 7.32 (m, 2H), 7.17 (m, 2H), 5.77 (d, 2H), 5.50 (d, 2H, 異性体), 2.34 (s, 3H), 2.30 (s, 1H) ppm	62/19
172	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]-N-(プロパン-2-イル)ピリミジン-2-アミン	^{1}H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 13.28 (bs, 1H), 8.12 (d, 1H), 7.59(bs, 2H), 7.28 (bs, 2H), 6.77 (d, 1H), 6.52 (bs, 1H), 3.81 (bs, 1H), 1.09 (bs, 6H) ppm.	-
173	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]-N-(プロパ-2-イン-1-イル)ピリミジン-2-アミン	1H-NMR (400 MHz, $CDCl_3$): δ = 8.15 (s, 1H), 8.06 (d, 1H), 7.46 (m, 2H), 7.09 (t, 2H), 6.49 (d, 1H), 4.05 (bs, 2H), 2.15 (s, 1H) ppm	-
174	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]-N-(プロパン-2-イル)ピリミジン-2-アミン	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 8.11 (s, 1H), 8.00 (d, 1H), 7.43 (m, 2H), 7.33 (t, 2H), 6.65 (d, 1H), 6.40 (bs, 1H), 3.70 (d, 2H), 2.02 (m, 1H), 0.98 (bs, 6H), 0.72 (d, 6H) ppm	-
175	3-(4-フルオロフェニル)-4-(ピリジン-4-イル)-1H-ピラゾール-5-カルボニトリル	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 8.62 (d, 2H), 7.46 (m, 2H), 7.631 (m, 4H) ppm	-
176	4-{1-[1-(2-クロロ-1,3-チアゾール-5-イル)エチル]-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル}ピリジン	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.45 (m, 2H), 7.98 (s, 1H), 7.57 (s, 1H), 7.48-7.43 (m, 2H), 7.18 (m, 2H), 7.14-7.08 (m, 2H), 5.88 (q, 1H), 2.15 (m, 3H) ppm	-

No.	名称	NMR	異性体比率[1]
178	1-[3-(4-フルオロフェニル)-4-(ピリジン-4-イル)-1H-ピラゾール-1-イル]-3-メチルブタン-2-オン	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.45 (m, 2H), 8.10 (s, 1H), 7.45 (m, 2H), 7.25 (m, 2H), 7.15 (m, 2H), 1.75 (d, 6H) ppm	-
179	4-[1-(2-エトキシエチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.45 (d, 2H), 7.89 (s, 1H), 7.45 (m, 2H), 7.18 (d, 2H), 7.14-7.08 (m, 2H), 4.30 (t, 2H), 3.82 (t, 2H), 3.49 (q, 2H), 1.12 (t, 3H) ppm	-
180	[3-(4-フルオロフェニル)-4-(ピリジン-4-イル)-1H-ピラゾール-1-イル]アセトニトリル	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.46 (dd, 2H), 7.96 (s, 1H), 7.47-7.44 (m, 2H), 7.20 (d, 2H), 7.14-7.11 (m, 2H), 5.23 (s, 2H) ppm	-
181	プロパン-2-イル{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(プロパン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}カルバメート	1H-NMR (400 MHz, d7-DMF): δ = 8.16 (d, 1H), 8.02 (m, 2H), 7.93 (s, 1H), 7.57-7.53 (m, 2H), 7.25-7.21 (m, 2H), 6.92 (dd, 1H), 4.90 (m, 1H), 4.67 (m, 1H), 3.20 (m, 6H), 1.57 (d, 6H) ppm	-
182	N-ベンジル-4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリミジン-2-アミン	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 8.30 (bs, 1H), 8.12 (d, 1H), 7.56 (m, 3H), 7.25 (t, 7H), 6.49 (bs, 1H), 4.37 (bs, 2H), 4.01 (d, 2H), 2.18 (m, 1H), 0.89 (d, 6H) ppm	-
184	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリミジン-2-アミン	1H-NMR (400 MHz, $CDCl_3$): δ = 8.01 (d, 1H), 7.89 (s, 1H), 7.45 (m, 2H), 7.02 (t, 2H), 6.36 (d, 1H), 4.94 (bs, 2H), 3.89 (d, 2H), 2.23 (m, 1H), 0.91 (d, 6H) ppm	-
185	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリミジン-2-イル}-2-メチル-N-(プロパン-2-イル)プロパンアミド	1H-NMR (400 MHz, $CDCl_3$): δ = 8.37 (d, 2H), 7.98 (s, 1H), 7.44 (m, 2H), 7.07 (d, 2H), 6.87 (d, 1H), 4.85 (m, 1H), 3.92 (d, 2H), 2.48 (m, 1H), 2.24 (m, 1H), 1.18 (d, 6H), 1.03 (d, 6H), 0.92 (d, 6H) ppm	-
186	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリミジン-2-イル}-2,2,4-トリメチル-3-オキソ-N-(プロパン-2-イル)ペンタンアミド	1H-NMR (400 MHz, $CDCl_3$): δ = 8.09 (bs, 1H), 7.93 (s, 1H), 7.41 (m, 2H), 7.05 (t, 2H), 6.8 (d, 1H), 4.85 (m, 1H), 3.92 (d, 2H), 3.05 (m, 1H), 2.25 (m, 1H), 1.23 (d, 6H), 1.1 (d, 6H), 1.04 (s, 6H), 0.93 (d, 6H) ppm	-

No.	名称	NMR	異性体比率[1]
187	1-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}ピロリジン-2-オン	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 8.26 (d, 2H), 8.16 (s, 1H), 7.43 (m, 2H), 7.20 (t, 2H), 6.93 (m, 1H), 3.98 (m, 4H), 2.54 (m, 2H), 2,20 (m, 1H), 2.02 (m, 2H), 0.91 (d, 6H) ppm	-
188	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリミジン-2-イル}-2-メチル-N-(2-メチルプロパノイル)プロパンアミド	1H-NMR (400 MHz, $CDCl_3$): δ = 8.44 (d, 1H), 7.98 (s, 1H), 7.44 (m, 2H), 7.06 (m, 2H), 6.95 (d, 1H), 3.90 (d, 2H), 2.87 (m, 2H), 2.23 (m, 1H), 1.14 (d, 12H), 0.91 (d, 6H) ppm	-
189	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリミジン-2-イル}-2-メチルプロパンアミド	1H-NMR (400 MHz, $CDCl_3$): δ = 8.25 (d, 2H), 8.05 (s, 1H), 8.00 (s, 1H), 7.42 (m, 2H), 7.04 (d, 2H), 6.98 (d, 1H), 3.90 (d, 2H), 2.9 (m, 1H), 2.24 (m, 1H), 1.2 (d, 6H), 0.91 (d, 6H) ppm	-
191	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-フェニルアセトアミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.61 (s, 1H, br), 8.10 (d, 1H), 8.09 (s, 1H), 7.82 (s, 1H), 7.45-7.43 (m, 2H), 7.35-7.28 (m, 5H), 7.09-7.06 (m, 2H), 6.88 (d, 1H), 3.96 (d, 2H), 3.69 (s, 2H), 2.20 (m, 1H), 0.93 (d, 6H) ppm	-
192	(2S)-N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(プロパン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-ヒドロキシプロパンアミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.98 (s, 1H, br), 8.15-8.10 (m, 2H), 7.90 (s, 1H), 7.48-7.45 (m, 2H), 7.11-7.08 (m, 2H), 6.92 (dd, 1H), 4.56 (m, 1H), 4.22 (m, 1H), 4.05 (s, 1H), 1.53 (d, 6H) ppm	-
193	4-{3-(4-フルオロフェニル)-4-[2-(プロパノイルアミノ)ピリジン-4-イル]-1H-ピラゾール-1-イル}ピペリジン-1-カルボン酸 tert-ブチル	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.50 (s, 1H, br), 8.10 (m, 2H), 7.89 (s, 1H), 7.47-7.45 (m, 2H), 7.11-7.08 (m, 2H), 6.92 (dd, 1H), 4.38 (m, 1H), 4.18 (m, 2H), 2.90 (m, 2H), 2.37 (q, 2H), 2.10 (m, 2H), 1.90 (m, 2H), 1.45 (s, 9H), 1.10 (t, 3H) ppm	-
195	N-{4-[3-(4-クロロ-2-フルオロフェニル)-1-メチル-5-(メチルスルファニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}プロパンアミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.53 (s, 1H, br), 8.15-8.13 (m, 3H), 7.42-7.40 (m, 2H), 7.25 (d, 1H), 7.15 (d, 1H), 6.85 (dd, 1H), 4.05 (s, 3H), 2.38 (q, 2H), 2.30 (s, 3H), 1.10 (t, 3H) ppm	-

No.	名称	NMR	異性体比率[1]
196	N-{4-[5-(ジフルオロメトキシ)-3-(4-フルオロ-2-ヒドロキシフェニル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}プロパンアミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 10.2 (s, 1H), 8.63 (s, 1H, br), 8.26 (d, 1H), 8.13 (s, 1H), 7.03 (dd, 1H), 6.95 (m, 1H), 6.70 (m, 1H), 6.55 (t, 1H), 6.45 (m, 1H), 3.82 (s, 3H), 2.41 (q, 2H), 1.12 (t, 3H) ppm	-
197	N-{4-[3-(4-クロロ-2-フルオロフェニル)-1-メチル-5-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}プロパンアミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.55 (s, 1H, br), 8.17 (d, 1H), 8.01 (s, 1H), 7.36 (dd, 1H), 7.21 (d, 1H), 7.18 (d, 1H), 6.82 (dd, 1H), 4.10 (s, 3H), 2.37 (q, 2H), 1.09 (t, 3H) ppm	-
198	N-{4-[1-エチル-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}プロパンアミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.50 (s, 1H, br), 8.10 (m, 2H), 7.86 (s, 1H), 7.47-7.45 (m, 2H), 7.11-7.08 (m, 2H), 6.86 (dd, 1H), 4.21 (q, 2H), 2.38 (q, 2H), 1.49 (t, 3H), 1.10 (t, 3H) ppm	-
199	N-{4-[3-(4-シアノ-2,5-ジフルオロフェニル)-5-(ジフルオロメトキシ)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メトキシアセトアミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.70 (s, 1H, br), 8.20 (d, 1H), 7.99 (s, 1H), 7.50-7.45 (m, 2H), 6.94 (dd, 1H), 6.65 (t, 2J(H,F), 1H), 3.96 (s, 2H), 3.86 (s, 3H), 3.44 (s, 3H) ppm	-
200	N-{4-[3-(4-クロロ-2-フルオロフェニル)-1-メチル-5-(メチルスルファニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メトキシアセトアミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.73 (s, 1H, br), 8.18-8.15 (m, 2H), 7.40 (m, 1H), 7.25 (d, 1H), 7.15 (d, 1H), 6.90 (m, 1H), 4.03 (s, 3H), 3.97 (s, 2H), 3.45 (s, 3H), 2.30 (s, 3H) ppm	-
201	N-{4-[5-(ジフルオロメトキシ)-3-(4-フルオロ-2-ヒドロキシフェニル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メトキシアセトアミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.80 (s, 1H, br), 8.30 (d, 1H), 8.12 (s, 1H), 7.03-7.00 (m, 2H), 6.70 (m, 1H), 6.58 (t, 2J(H,F), 1H), 6.48 (m, 1H), 3.99 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.46 (s, 3H) ppm	-

No.	名称	NMR	異性体比率[1]
202	N-{4-[3-(4-クロロ-2-フルオロフェニル)-1-メチル-5-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メトキシアセトアミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.78 (s, 1H, br), 8.21 (d, 1H), 8.01 (s, 1H), 7.36 (dd, 1H), 7.21 (d, 1H), 7.16 (d, 1H), 6.89 (dd, 1H), 4.10 (s, 3H), 3.96 (s, 2H), 3.45 (s, 3H) ppm	-
203	N-{4-[1-エチル-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メトキシアセトアミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.70 (s, 1H, br), 8.14 (d, 1H), 8.08 (s, 1H), 7.88 (s, 1H), 7.47-7.45 (m, 2H), 7.12-7.10 (m, 2H), 6.94 (dd, 1H), 4.21 (q, 2H), 3.96 (s, 2H), 3.45 (s, 3H), 1.50 (t, 3H) ppm	-
204	4-[3-(4-フルオロフェニル)-4-{2-[(メトキシアセチル)アミノ]ピリジン-4-イル}-1H-ピラゾール-1-イル]ピペリジン-1-カルボン酸 tert-ブチル	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.70 (s, 1H, br), 8.12 (d, 1H), 8.07(s, 1H), 7.92 (s, 1H), 7.45-7.41 (m, 2H), 7.08 (m, 2H), 6.95 (d, 1H), 4.38 (m, 1H), 4.15 (m, 2H), 3.96 (s, 2H), 3.45 (s, 3H), 2.1 (m, 2H), 1.90 (m, 2H), 1.45 (s, 9H) ppm	-
205	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(プロパン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}ベンズアミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.95 (s, 1H, br), 8.26 (s, 1H), 8.18 (d, 1H), 7.93 (m, 3H), 7.60 (m, 1H), 7.51-7.49 (m, 4H), 7.13-7.10 (m, 1H), 6.96-6.95 (dd, 1H), 4.57 (m, 1H), 1.54 (d, 6H) ppm	-
206	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(プロパン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}チオフェン-2-カルボキサミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.93 (s, 1H, br), 8.18 (m, 2H), 7.93 (s, 1H), 7.84 (m, 1H), 7.70 (dd, 1H), 7.50-7.48 (m, 2H), 7.18-7.16 (dd, 1H), 7.12-7.10 (m, 2H), 6.95 (dd, 1H), 4.56 (m, 1H), 1.54 (d, 6H) ppm	-
207	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(プロパン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}チオフェン-3-カルボキサミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.80 (s, 1H, br), 8.21 (s, 1H), 8.18 (m, 1H), 7.93 (s, 1H), 7.56 (m, 1H), 7.50-7.48 (m, 3H), 7.12-7.09 (m, 2H), 6.94 (dd, 1H), 4.55 (m, 1H), 1.53 (d, 6H) ppm	-
208	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(プロパン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-(2-メトキシエトキシ)アセトアミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 9.18 (s, 1H, br), 8.16 (d, 1H), 8.11 (s, 1H), 7.90 (s, 1H), 7.48-7.46 (m, 2H), 7.11-7.08 (m, 2H), 6.94 (dd, 1H), 4.55 (m, 1H), 4.04 (s, 2H), 3.71 (t, 2H), 3.56 (t, 2H), 3.38 (s, 3H), 1.53 (d, 6H) ppm	-

No.	名称	NMR	異性体比率[1]
209	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(プロパン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-ヒドロキシ-2-メチルプロパンアミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 9.12 (s, 1H, br), 8.13 (m, 2H), 7.90 (s, 1H), 7.48-7.46 (m, 2H), 7.11-7.09 (m, 2H), 6.91 (dd, 1H), 4.55 (m, 1H), 3.90 (s, 1H, br), 1.53 (d, 6H), 1.40 (s, 6H) ppm	-
210	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(プロパン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2,3-ジヒドロキシプロパンアミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 9.01 (s, 1H, br), 8.14 (m, 2H), 7.91 (s, 1H), 7.48-7.46 (m, 2H), 7.11-7.09 (m, 2H), 6.93 (dd, 1H), 4.56 (m, 1H), 4.15 (m, 1H), 4.10 (s, 1H, br), 3.74 (m, 2H), 3.10 (s, 1H, br), 1.53 (d, 6H) ppm	-
211	1-エチル-3-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(プロパン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}尿素	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.82 (s, 1H, br), 8.05 (d, 1H), 7.86 (s, 1H), 7.49-7.45 (m, 2H), 7.13-7.10 (m, 2H), 6.81 (s, 1H), 6.78 (m, 1H), 4.56 (m, 1H), 3.25 (q, 2H), 1.52 (d, 6H), 1.15 (t, 3H) ppm	-
212	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(2-メトキシエチル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-フェニルアセトアミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.60 (s, 1H, br), 8.10 (d, 1H), 8.09 (s, 1H), 7.84 (s, 1H), 7.45 (dd, 2H), 7.38-7.30 (m, 5H), 7.10 (t, 2H), 6.88 (d, 1H), 4.29 (t, 2H), 3.77 (t, 2H), 3.69 (s, 2H), 3.30 (s, 3H) ppm	-
213	N-{4-[1-(2-フルオロベンジル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}プロパンアミド	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 10.41 (s, 1H), 8.27 (s, 1H), 8.18 (d, 1H), 8.09 (s, 1H), 7.43-7.37 (m, 4H), 7.30-7.18 (m, 4H), 6.83 (dd, 1H), 5.48 (s, 2H), 2.38 (q, 2H), 1.05 (t, 3H) ppm	-
214	N-{4-[1-(シクロプロピルメチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}プロパンアミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.57 (s, 1H, br), 8.10 (m, 2H), 7.93 (s, 1H), 7.48-7.45 (m, 2H), 7.12-7.09 (m, 2H), 6.87 (dd, 1H), 4.03 (d, 2H), 2.38 (q, 2H), 1.36 (m, 1H), 1.11 (t, 3H), 0.62 (m, 2H), 0.44 (m, 2H) ppm	-
215	N-{4-[1-(2,2-ジフルオロエチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}プロパンアミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.60 (s, 1H, br), 8.12-8.10 (m, 2H), 7.93 (s, 1H), 7.48-7.45 (m, 2H), 7.13-7.10 (m, 2H), 6.86 (dd, 1H), 6.28 (tt, 2J(F,H)=54 Hz, 1H), 4.59 (dt, 3J(F,H)=14Hz, 2H), 2.39 (q, 2H), 1.11 (t, 3H) ppm	-

No.	名称	NMR	異性体比率[1]
216	N-{4-[1-(2,2-ジフルオロエチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メトキシアセトアミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.76 (s, 1H, br), 8.17 (d, 2H), 8.09 (s, 1H), 7.96 (s, 1H), 7.48-7.46 (m, 2H), 7.13-7.10 (m, 2H), 6.95 (dd, 1H), 6.28 (tt, 2J(F,H)=54 Hz, 1H), 4.59 (dt, 3J(F,H)=14Hz, 2H), 3.97 (s, 2H), 3.45 (s, 3H) ppm	-
217	N-{4-[1-(2,2-ジフルオロエチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}シクロプロパンカルボキサミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.91 (s, 1H, br), 8.13 (dd, 2H), 8.09 (s, 1H), 7.91 (s, 1H), 7.47-7.44 (m, 2H), 7.11-7.08 (m, 2H), 6.85 (dd, 1H), 6.27 (tt, 2J(F,H)=59 Hz, 1H), 4.59 (dt, 3J(F,H)=14Hz, 2H), 1.77 (m, 1H), 0.90-0.80 (m, 4H) ppm	-
218	N-{4-[1-(2,2-ジフルオロエチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メチルプロパンアミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.58 (s, 1H, br), 8.12 (m, 2H), 7.93 (s, 1H), 7.47-7.45 (m, 2H), 7.12-7.09 (m, 2H), 6.86 (dd, 1H), 6.27 (tt, 2J(F,H)=55 Hz, 1H), 4.58 (dt, 3J(F,H)=14Hz, 2H), 2.62 (m, 1H), 1.14 (d, 6H) ppm	-
219	N-{4-[1-(2-クロロエチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}プロパンアミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.58 (s, 1H, br), 8.11 (m, 2H), 7.93 (s, 1H), 7.49-7.45 (m, 2H), 7.15-7.08 (m, 2H), 6.86 (dd, 1H), 4.48 (t, 2H), 4.02 (t, 2H), 2.38 (q, 2H), 1.11 (t, 3H) ppm	-
220	N-{4-[1-(2-クロロエチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メトキシアセトアミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.74 (s, 1H, br), 8.16 (dd, 1H), 8.09 (s, 1H), 7.95 (s, 1H), 7.49-7.46 (m, 2H), 7.12-7.09 (m, 2H), 6.95 (dd, 1H), 4.49 (t, 2H), 4.02 (t, 2H), 3.96 (s, 2H), 3.45 (s, 3H) ppm	-
221	N-{4-[1-(2-クロロエチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}シクロプロパンカルボキサミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.90 (s, 1H, br), 8.12 (d, 1H), 8.09 (s, 1H), 7.90 (s, 1H), 7.47-7.45 (m, 2H), 7.12-7.08 (m, 2H), 6.86 (dd, 1H), 4.48 (t, 2H), 4.01 (t, 2H), 1.77 (m, 1H), 0.88-0.81 (m, 4H) ppm	-
222	N-{4-[1-(2-クロロエチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メチルプロパンアミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.58 (s, 1H, br), 8.13-8.11 (m, 2H), 7.93 (s, 1H), 7.48-7.46 (m, 2H), 7.12-7.09 (m, 2H), 6.86 (dd, 1H), 4.49 (t, 2H), 4.02 (t, 2H), 2.62 (m, 1H), 1.14 (d, 6H) ppm	-

No.	名称	NMR	異性体比率[1]
223	N-{4-[1-(シクロプロピルメチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メトキシアセトアミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.73 (s, 1H, br), 8.15 (d, 1H), 8.09 (s, 1H), 7.95 (s, 1H), 7.48-7.46 (m, 2H), 7.12-7.09 (m, 2H), 6.96 (dd, 1H), 4.03 (d, 2H), 3.97 (s, 2H), 3.45 (s, 3H), 1.36 (m, 1H), 0.63 (m, 2H), 0.43 (m, 2H) ppm	-
224	N-{4-[1-(シクロプロピルメチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}シクロプロパンカルボキサミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.92 (s, 1H, br), 8.11 (d, 1H), 8.10 (s, 1H), 7.91 (s, 1H), 7.47-7.45 (m, 2H), 7.11-7.08 (m, 2H), 6.86 (dd, 1H), 4.02 (d, 2H), 1.78 (m, 1H), 1.34 (m, 1H), 0.85-0.80 (m, 4H), 0.62 (m, 2H), 0.43 (m, 2H) ppm	-
225	N-{4-[1-(シクロプロピルメチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メチルプロパンアミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.60 (s, 1H, br), 8.12 (s, 1H), 8.10 (d, 1H), 7.93 (s, 1H), 7.48-7.45 (m, 2H), 7.11-7.08 (m, 2H), 6.86 (dd, 1H), 4.03 (d, 2H), 2.63 (m, 1H), 1.38 (m, 1H), 1.14 (d, 6H), 0.62 (m, 2H), 0.43 (m, 2H) ppm	-
226	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(プロパン-2-イルオキシ)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}プロパンアミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.54 (s, 1H, br), 8.13 (d, 1H), 8.09 (s, 1H), 7.80 (s, 1H), 7.47-7.44 (m, 2H), 7.11-7.08 (m, 2H), 6.89 (dd, 1H), 4.74 (m, 1H), 2.38 (q, 2H), 1.33 (d, 6H), 1.10 (t, 3H) ppm	-
227	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(プロパン-2-イルオキシ)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.45 (dd, 2H), 7.82 (s, 1H), 7.45-7.43 (m, 2H), 7.20-7.19 (dd, 2H), 7.13-7.10 (m, 2H), 4.77 (m, 1H), 1.33 (d, 6H) ppm	-
228	3-(4-フルオロフェニル)-4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 8.51 (d, 1H), 8.45 (s, 1H), 7.45 (s, 1H), 7.29 (d, 1H), 7.04-7.03 (dd, 2H), 6.94-6.91 (dd, 2H), 6.90-6.80 (m, 4H), 3.89 (d, 2H), 2.20 (m, 1H), 0.87 (d, 6H) ppm	-
229	3-(3-フルオロフェニル)-4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 8.54-8.53 (d, 1H), 8.46 (s, 1H), 7.46 (s, 1H), 7.32 (d, 1H), 7.13 (m, 1H), 7.05 (m, 2H), 6.90-6.86 (m, 2H), 6.75 (m, 1H), 6.65 (m, 1H), 3.89 (d, 2H), 2.20 (m, 1H), 0.87 (d, 6H) ppm	-

No.	名称	NMR	異性体比率[1]
230	N-{4-[3-(3-シアノ-4-フルオロフェニル)-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}プロパンアミド	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 10.41 (s, 1H), 8.24 (s, 1H), 8.20 (m, 1H), 8.06 (s, 1H), 7.92 (m, 1H), 7.78 (m, 1H), 7.56 (t, 1H), 6.92 (m, 1H), 4.02 (d, 2H), 2.39 (q, 2H), 2.20 (m, 1H), 1.05 (t, 3H), 0.92 (d, 6H) ppm	-
231	1-{4-[1-(2,2-ジフルオロエチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-3-エチル尿素	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.80 (s, 1H, br), 8.06 (m, 1H), 7.88 (s, 1H), 7.53-7.45 (m, 3H), 7.14-7.10 (m, 2H), 6.84 (s, 1H), 6.77 (m, 1H), 6.27 (tt, 2J(F,H)=55 Hz, 1H), 4.59 (dt, 3J(F,H)=14Hz, 2H), 3.27 (q, 2H), 1.14 (t, 3H) ppm	-
232	N-(4-{3-(4-フルオロフェニル)-1-[1-(2-フルオロフェニル)エチル]-1H-ピラゾール-4-イル}ピリジン-2-イル)-2-メチルプロパンアミド	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 10.40 (s, 1H), 8.34 (s, 1H), 8.17 (d, 1H), 8.10 (s, 1H), 7.45-7.35 (m, 4H), 7.25-7.18 (m, 4H), 6.82 (dd, 1H), 5.96 (q, 1H), 2.72 (m, 1H), 1.06 (d, 6H) ppm	-
233	3-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(プロパン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-1,1-ジメチル尿素	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.05 (m, 1H), 7.90 (m, 1H), 7.85 (s, 1H), 7.48-7.46 (m, 2H), 7.36 (s, 1H, br), 7.11-7.09 (m, 2H), 6.77 (dd, 1H), 4.55 (m, 1H), 2.95 (s, 6H), 1.53 (d, 6H) ppm	-
234	N-{4-[1-(2,2-ジフルオロエチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}プロパン-2-スルホンアミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.01 (s, 1H), 7.90 (d, 1H), 7.85 (m, 1H), 7.50-7.45 (m, 3H), 7.13-7.05 (m, 2H), 6.35 (m, 1H), 6.27 (tt, 1H), 4.60 (m, 2H), 3.05 (m, 1H), 1.34 (d, 6H) ppm	-
235	N-{4-[1-(2,2-ジフルオロエチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}チオフェン-3-カルボキサミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.91 (s, 1H, br), 8.23-8.17 (m, 3H), 7.97 (s, 1H), 7.57 (m, 1H), 7.49-7.48 (m, 2H), 7.13-7.11 (m, 2H), 6.94 (dd, 1H), 6.28 (tt, 2J(F,H)=55 Hz, 1H), 4.60 (dt, 3J(F,H)=14Hz, 2H) ppm	-
236	N-{4-[1-(2,2-ジフルオロエチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}チオフェン-2-カルボキサミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 9.04 (s, 1H, br), 8.24 (d, 1H), 8.20 (s, 1H), 7.87 (dd, 1H), 7.74 (d, 1H), 7.53-7.51 (m, 2H), 7.21-7.20 (dd, 1H), 7.17-7.14 (m, 2H), 6.98 (dd, 1H), 6.31 (tt, 2J(F,H)=55 Hz, 1H), 4.63 (dt, 3J(F,H)=14Hz, 2H) ppm	-

No.	名称	NMR	異性体比率[1]
237	N-{4-[1-(2,2-ジフルオロエチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}ベンズアミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 9.08 (s, 1H, br), 8.30 (m, 1H), 8.24 (m, 1H), 8.01 (s, 1H), 7.97 (d, 2H), 7.64 (m, 1H), 7.56-7.50 (m, 4H), 7.17-7.14 (m, 2H), 6.98 (dd, 1H), 6.32 (tt, 2J(F,H)=55 Hz, 1H), 4.64 (dt, 3J(F,H)=14Hz, 2H) ppm	-
238	N-{4-[1-(2,2-ジフルオロエチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-3-メチルブタンアミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.57 (s, 1H, br), 8.13-8.10 (m, 2H), 7.93 (s, 1H), 7.47-7.45 (m, 2H), 7.12-7.09 (m, 2H), 6.88 (dd, 1H), 6.27 (tt, 2J(F,H)=55 Hz, 1H), 4.58 (dt, 3J(F,H)=14Hz, 2H), 2.22 (m, 2H), 2.10 (m, 1H), 0.95 (d, 6H) ppm	-
239	N-{4-[1-(2,2-ジフルオロエチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メチルブタンアミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.57 (s, 1H, br), 8.13-8.10 (m, 2H), 7.93 (s, 1H), 7.47-7.45 (m, 2H), 7.12-7.09 (m, 2H), 6.86 (dd, 1H), 6.27 (tt, 2J(F,H)=55 Hz, 1H), 4.59 (dt, 3J(F,H)=14Hz, 2H), 2.42 (m, 1H), 1.65 (m, 1H), 1.45 (m, 1H), 1.12 (d, 3H), 0.89 (t, 3H) ppm	-
240	N-{4-[1-(2,2-ジフルオロエチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}シクロブタンカルボキサミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.44 (s, 1H, br), 8.16-8.14 (m, 2H), 7.96 (s, 1H), 7.51-7.49 (m, 2H), 7.16-7.13 (m, 2H), 6.89 (dd, 1H), 6.31 (tt, 2J(F,H)=55 Hz, 1H), 4.62 (dt, 3J(F,H)=14Hz, 2H), 2.30-2.20 (m, 6H), 1.85 (m, 1H) ppm	-
241	{4-[1-(2,2-ジフルオロエチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}カルバミン酸エチル	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.16 (s, 1H, br), 8.12 (d, 1H), 7.92 (s, 1H), 7.85 (d, 1H), 7.48-7.46 (m, 2H), 7.12-7.10 (m, 2H), 6.86 (dd, 1H), 6.27 (tt, 2J(F,H)=55 Hz, 1H), 4.59 (dt, 3J(F,H)=14Hz, 2H), 4.14 (q, 2H), 1.24 (t, 3H) ppm	-
242	N-{4-[1-(2,2-ジフルオロエチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}アセトアミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.63 (s, 1H, br), 8.13 (dd, 1H), 8.06 (s, 1H), 7.92 (s, 1H), 7.48-7.46 (m, 2H), 7.13-7.09 (m, 2H), 6.88 (dd, 1H), 6.27 (tt, 2J(F,H)=55 Hz, 1H), 4.59 (dt, 3J(F,H)=14Hz, 2H), 2.10 (s, 3H) ppm	-
243	N-{4-[1-(2,2-ジフルオロエチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-ヒドロキシ-2-メチルプロパンアミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 9.20 (s, 1H, br), 8.12 (m, 2H), 7.97 (s, 1H), 7.51-7.49 (m, 2H), 7.15-7.13 (m, 2H), 6.94 (dd, 1H), 6.30 (tt, 2J(F,H)=55 Hz, 1H), 4.62 (dt, 2H), 1.43 (s, 6H) ppm	-

No.	名称	NMR	異性体比率[1]
244	N-(4-{3-(4-フルオロフェニル)-1-[1-(2-フルオロフェニル)エチル]-1H-ピラゾール-4-イル}ピリジン-2-イル)-2-メトキシアセトアミド	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 9.95 (s, 1H), 8.38 (s, 1H), 8.20 (dd, 1H), 8.07 (s, 1H), 7.43-7.36 (m, 4H), 7.25-7.15 (m, 4H), 6.96 (dd, 1H), 4.03 (s, 2H), 3.40 (s, 3H), 1.90 (d, 3H) ppm	-
245	N-(4-{1-[(2,2-ジクロロシクロプロピル)メチル]-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル}ピリジン-2-イル)-2-メトキシアセトアミド	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 9.96 (s, 1H), 8.26 (s, 1H), 8.22 (d, 1H), 8.06 (s, 1H), 7.47 (m, 2H), 7.23 (m, 2H), 6.91 (dd, 1H), 4.45 (dd, 1H), 4.34 (dd, 1H), 4.03 (s, 2H), 3.40 (s, 3H), 2.40 (m, 1H), 1.90 (dd, 1H), 1.70 (dd, 1H) ppm	-
246	N-{4-[3-(3-シアノ-4-フルオロフェニル)-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メトキシアセトアミド	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 9.97 (s, 1H), 8.27 (s, 1H), 8.24 (d, 1H), 7.98 (s, 1H), 7.92 (dd, 1H), 7.78 (m, 1H), 7.55 (t, 1H), 6.99 (d, 1H), 4.03 (m, 4H), 3.40 (s, 3H), 2.20 (m, 1H), 0.91 (d, 6H) ppm	-
247	N-{4-[1-(2-フルオロベンジル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メトキシアセトアミド	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 9.96 (s, 1H), 8.30 (s, 1H), 8.21 (d, 1H), 8.04 (s, 1H), 7.45-7.38 (m, 4H), 7.30-7.18 (m, 4H), 6.92 (dd, 1H), 5.49 (s, 2H), 4.03 (s, 2H), 3.4 (s, 3H) ppm	-
248	N-(4-{3-(4-フルオロフェニル)-1-[1-(2-フルオロフェニル)エチル]-1H-ピラゾール-4-イル}ピリジン-2-イル)プロパンアミド	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 10.40 (s, 1H), 8.34 (s, 1H), 8.18 (d, 1H), 8.08 (s, 1H), 7.42-7.35 (m, 4H), 7.25-7.18 (m, 4H), 6.86 (dd, 1H), 5.96 (q, 1H), 2.38 (q, 2H), 1.90 (d, 3H), 1.05 (t, 3H) ppm	-
249	N-(4-{1-[(2,2-ジクロロシクロプロピル)メチル]-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル}ピリジン-2-イル)プロパンアミド	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 10.42 (s, 1H), 8.24 (s, 1H), 8.18 (d, 1H), 8.11 (s, 1H), 7.47 (m, 2H), 7.23 (m, 2H), 6.84 (dd, 1H), 4.45 (dd, 1H), 4.33 (dd, 1H), 2.40-2.35 (m, 3H), 1.90 (dd, 1H), 1.70 (dd, 1H), 1.04 (q, 3H) ppm	-
250	2-シクロプロピル-N-(4-{3-(4-フルオロフェニル)-1-[1-(2-フルオロフェニル)エチル]-1H-ピラゾール-4-イル}ピリジン-2-イル)アセトアミド	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 10.33 (s, 1H), 8.33 (s, 1H), 8.16 (d, 1H), 8.09 (s), 7.42-7.35 (m, 4H), 7.25-7.15 (m, 4H), 6.84 (dd, 1H), 5.95 (q, 1H), 2.23 (d, 2H), 1.90 (d, 3H), 1.00 (m, 1H), 0.45 (m, 2H), 0.16 (m, 2H) ppm	-

No.	名称	NMR	異性体比率[1]
251	2-シクロプロピル-N-(4-{1-[(2,2-ジクロロシクロプロピル)メチル]-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル}ピリジン-2-イル)アセトアミド	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 10.35 (s, 1H), 8.24 (s, 1H), 8.18 (dd, 1H), 8.11 (s, 1H), 7.45 (m, 2H), 7.22 (m, 2H), 6.83 (dd, 1H), 4.45 (dd, 1H), 4.33 (dd, 1H), 2.40 (m, 1H), 2.23 (d, 2H), 1.90 (dd, 1H), 1.70 (dd, 1H), 1.00 (m, 1H), 0.45 (d, 2H), 0.17 (d, 2H) ppm	-
252	N-{4-[3-(3-シアノ-4-フルオロフェニル)-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-シクロプロピルアセトアミド	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 10.34 (s, 1H), 8.24 (s, 1H), 8.20 (d, 1H), 8.06 (s, 1H), 7.90 (dd, 1H), 7.78 (m, 1H), 7.56 (t, 1H), 6.92 (dd, 1H), 4.00 (d, 2H), 2.23 (d, 2H), 2.20 (m, 1H), 1.05 (m, 1H), 0.91 (d, 6H), 0.45 (d, 2H), 0.16 (d, 2H) ppm	-
253	2-シクロプロピル-N-{4-[1-(2-フルオロベンジル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}アセトアミド	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 10.33 (s, 1H), 8.27 (s, 1H), 8.16 (dd, 1H), 8.09 (s, 1H), 7.42-7.35 (m, 4H), 7.25-7.15 (m, 4H), 6.82-6.80 (dd, 1H), 5.47 (s, 2H), 2.24 (d, 2H), 1.00 (m, 1H), 0.44 (m, 2H), 0.18 (m, 2H) ppm	-
254	N-(4-{1-[(2,2-ジクロロシクロプロピル)メチル]-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル}ピリジン-2-イル)-2-メチルプロパンアミド	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 10.41 (s, 1H), 8.24 (s, 1H), 8.18 (d, 1H), 8.13 (s, 1H), 7.45 (dd, 2H), 7.22 (m, 2H), 6.81 (dd, 1H), 4.45 (dd, 1H), 4.35 (dd, 1H), 2.75 (m, 1H), 2.43 (m, 1H), 1.89 (dd, 1H), 1.70 (dd, 1H), 1.05 (d, 6H) ppm	-
255	N-{4-[3-(3-シアノ-4-フルオロフェニル)-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メチルプロパンアミド	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 10.41 (s, 1H), 8.25 (s, 1H), 8.20 (d, 1H), 8.09 (s, 1H), 7.90 (dd, 1H), 7.78 (m, 1H), 7.55 (t, 1H), 6.90 (dd, 1H), 4.00 (d, 2H), 2.72 (m, 1H), 2.20 (m, 1H), 1.05 (d, 6H), 0.91 (d, 6H) ppm	-
256	N-{4-[1-(2-フルオロベンジル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メチルプロパンアミド	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 10.40 (s, 1H), 8.27 (s, 1H), 8.16 (dd, 1H), 8.11 (s, 1H), 7.45-7.35 (m, 3H), 7.25-7.15 (m, 5H), 6.80-6.79 (dd, 1H), 5.47 (s, 2H), 2.61 (m, 1H), 1.05 (d, 6H) ppm	-

No.	名称	NMR	異性体比率[1]
258	N-{4-[5-(ジフルオロメトキシ)-3-(4-フルオロ-2-ヒドロキシフェニル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}シクロプロパンカルボキサミド	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 10.69 (s, 1H), 9.92 (s, 1H), 8.15 (d, 1H), 8.03 (s, 1H), 7.20 (m, 1H), 7.13 (t, 2J(H,F)=71 Hz, 1H), 6.73 (dd, 1H), 6.67-6.64 (m, 1H), 6.58-6.55 (dd, 1H), 3.79 (s, 3H), 1.95 (m, 1H), 0.76 (m, 4H) ppm	-
259	N-(4-{3-(4-フルオロフェニル)-1-[1-(2-フルオロフェニル)エチル]-1H-ピラゾール-4-イル}ピリジン-2-イル)シクロプロパンカルボキサミド	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 10.76 (s, 1H), 8.32 (s, 1H), 8.18 (d, 1H), 8.07 (s), 7.44-7.42 (m, 4H), 7.25-7.15 (m, 4H), 6.83 (dd, 1H), 5.95 (q, 1H), 2.00 (m, 2H), 1.80 (d, 3H), 0.80 (m, 4H) ppm	-
260	N-(4-{1-[(2,2-ジクロロシクロ-プロピル)メチル]-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル}ピリジン-2-イル)シクロプロパンカルボキサミド	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 10.78 (s, 1H), 8.22 (s, 1H), 8.19 (d, 1H), 8.09 (s, 1H), 7.44 (dd, 2H), 7.23 (m, 2H), 6.82 (dd, 1H), 4.45 (dd, 1H), 4.34 (dd, 1H), 2.40 (m, 1H), 1.98 (m, 1H), 1.70 (dd, 1H), 0.78 (m, 4H) ppm	-
261	N-{4-[3-(3-シアノ-4-フルオロフェニル)-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}シクロプロパン-カルボキサミド	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 10.78 (s, 1H), 8.23 (s, 1H), 8.21 (d, 1H), 8.05 (s, 1H), 7.90 (dd, 1H), 7.77 (m, 1H), 7.55 (t, 1H), 6.90 (dd, 1H), 4.00 (d, 2H), 2.20 (m, 1H), 1.98 (m, 1H), 0.90 (d, 6H), 0.78 (m, 4H) ppm	-
262	N-{4-[1-(2-フルオロベンジル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}シクロプロパンカルボキサミド	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 10.78 (s, 1H), 8.25 (s, 1H), 8.17 (d, 1H), 8.08 (s, 1H), 7.45-7.30 (m, 3H), 7.30-7.15 (m, 5H), 6.81 (m, 1H), 5.47 (s, 2H), 1.98 (m, 1H), 0.78 (m, 4H) ppm	-
263	(4-{3-(4-フルオロフェニル)-1-[1-(2-フルオロフェニル)エチル]-1H-ピラゾール-4-イル}ピリジン-2-イル)カルバミン酸エチル	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 10.05 (s, 1H), 8.35 (s, 1H), 8.15 (d, 1H), 7.77 (s, 1H), 7.45-7.35 (m, 3H), 7.25-7.15 (m, 5H), 6.83 (dd, 1H), 5.94 (q, 1H), 1.90 (d, 3H), 1.22 (t, 3H) ppm	-

No.	名称	NMR	異性体比率[1]
264	(4-{1-[(2,2-ジクロロシクロプロピル)メチル]-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル}ピリジン-2-イル)カルバミン酸エチル	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 10.07 (s, 1H), 8.24 (s, 1H), 8.15 (d, 1H), 7.78 (s, 1H), 7.47-7.45 (dd, 2H), 7.22 (dd, 2H), 6.83 (dd, 1H), 4.47-4.44 (dd, 1H), 4.35-4.32 (dd, 1H), 4.09 (q, 2H), 2.40 (m, 1H), 1.90 (dd, 1H), 1.70 (dd, 1H), 1.22 (t, 3H) ppm	-
265	{4-[3-(3-シアノ-4-フルオロフェニル)-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}カルバミン酸エチル	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 10.08 (s, 1H), 8.25 (s, 1H), 8.16 (m, 1H), 7.92 (m, 1H), 7.78-7.70 (m, 2H), 7.56-7.53 (m, 2H), 7.40 (m, 1H), 6.90 (dd, 1H), 4.09 (q, 2H), 4.00 (d, 2H), 2.20 (m, 1H), 1.22 (m, 6H), 0.80 (d, 3H) ppm	-
266	{4-[1-(2-フルオロベンジル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}カルバミン酸エチル	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 10.06 (s, 1H), 8.27 (s, 1H), 8.14-8.13 (d, 1H), 7.78 (d, 1H), 7.44-7.42 (m, 4H), 7.35 (m, 1H), 7.25-7.15 (m, 4H), 5.47 (s, 2H), 4.10 (q, 2H), 1.22 (t, 3H) ppm	-
267	{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}カルバミン酸エチル	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 10.05 (s, 1H), 8.19 (s, 1H), 8.13 (d, 1H), 7.78 (d, 1H), 7.44-7.42 (m, 2H), 7.22-7.19 (dd, 2H), 6.83-6.82 (dd, 1H), 4.10 (q, 2H), 3.99 (d, 2H), 2.18 (m, 1H), 1.22 (m, 6H), 0.80 (d, 3H) ppm	-
268	{4-[1-(ブタン-2-イル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}カルバミン酸エチル	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 10.04 (s, 1H), 8.19 (s, 1H), 8.13 (d, 1H), 7.77 (s, 1H), 7.45-7.42 (m, 2H), 7.22 (dd, 2H), 6.84-6.83 (dd, 1H), 4.35 (m, 1H), 4.09 (q, 2H), 1.90 (m, 1H), 1.80 (m, 1H), 1.22 (m, 6H), 0.80 (t, 3H) ppm	-
269	N-{4-[1-(シクロペンチルオキシ)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}シクロプロパン-カルボキサミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.86 (s, 1H, br), 8.14 (d, 1H), 8.07 (s, 1H), 7.80 (s, 1H), 7.47-7.43 (m, 2H), 7.10-7.06 (m, 2H), 6.88 (dd, 1H), 5.09 (m, 1H), 1.85-1.78 (m, 5H), 1.70-1.63 (m, 2H), 0.85-0.75 (m, 4H) ppm	-
270	N-{4-[1-(シクロペンチルオキシ)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メチルプロパンアミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.53 (s, 1H, br), 8.13-8.11 (m, 2H), 7.81 (s, 1H), 7.47-7.44 (m, 2H), 7.11-7.08 (m, 2H), 6.87 (dd, 1H), 5.11 (m, 1H), 2.63 (m, 1H), 1.85-1.78 (m, 4H), 1.70-1.63 (m, 2H), 1.13 (d, 6H) ppm	-

40 30 20 10

No.	名称	NMR	異性体比率[1]
271	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(プロパン-2-イルオキシ)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}シクロプロパンカルボキサミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.87 (s, 1H, br), 8.13-8.12 (d, 1H), 8.07 (s, 1H), 7.78 (s, 1H), 7.46-7.44 (m, 2H), 7.10-7.08 (m, 2H), 6.87 (dd, 1H), 4.75 (m, 1H), 1.76 (m, 1H), 1.32 (d, 6H), 0.87-0.81 (m, 4H) ppm	-
272	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(プロパン-2-イルオキシ)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メチルプロパンアミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.53 (s, 1H, br), 8.13-8.11 (m, 2H), 7.80 (s, 1H), 7.47-7.44 (m, 2H), 7.10-7.08 (m, 2H), 6.87 (dd, 1H), 4.75 (m, 1H), 2.60 (m, 1H), 1.32 (d, 6H), 1.13 (d, 6H) ppm	-
273	N-(シクロプロピルメチル)-4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリミジン-2-アミン	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 8.30 (bs, 1H), 8.11 (d, 1H), 7.56 (m, 2H), 7.21 (t, 2H), 7.00 (m, 1H), 6.47 (bs, 1H), 3.99 (d, 2H), 2.94 (bs, 2H), 2.18 (m, 1H), 0.90 (d, 6H), 0.35 (m, 2H), 0.10 (m, 2H) ppm	-
274	2-{3-(4-フルオロフェニル)-4-[2-(プロピオニルアミノ)ピリジン-4-イル]-1H-ピラゾール-1-イル}-3-メチルブタン酸メチル	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 10.41 (s, 1H), 8.27 (s, 1H), 8.18 (dd, 1H), 8.09 (s, 1H), 7.44-7.41 (m, 2H), 7.22-7.20 (m, 2H), 6.85 (dd, 1H), 4.92 (d, 1H), 3.72 (s, 3H), 2.60 (m, 1H), 2.37 (q, 2H), 1.03 (t, 3H), 1.00 (d, 3H), 0.86 (d, 3H) ppm	-
275	4-[1-(1,3-ジオキソラン-2-イルメチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 8.47 (dd, 2H), 8.19 (s, 1H), 7.44-7.42 (m, 2H), 7.25-7.15 (m, 4H), 5.27 (t, 1H), 4.32 (d, 2H), 3.95-3.85 (m, 4H) ppm	-
276	N-{4-[1-(1,3-ジオキソラン-2-イルメチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メチルプロパンアミド	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 10.41 (s, 1H), 8.16 (dd, 1H), 8.12 (s, 2H), 7.44-7.42 (m, 2H), 7.22-7.19 (m, 2H), 6.78 (dd, 1H), 5.27 (t, 1H), 4.32 (d, 2H), 3.95-3.80 (m, 4H), 2.72 (m, 1H), 1.06 (d, 6H) ppm	-
277	2-{3-(4-フルオロフェニル)-4-[2-(イソブチリルアミノ)ピリジン-4-イル]-1H-ピラゾール-1-イル}-3-メチルブタン酸メチル	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 10.42 (s, 1H), 8.27 (s, 1H), 8.18 (dd, 1H), 8.12 (s, 1H), 7.44-7.41 (m, 2H), 7.22-7.20 (m, 2H), 6.83 (dd, 1H), 4.92 (d, 1H), 3.72 (s, 3H), 2.73 (m, 1H), 2.62 (m, 1H), 1.06 (d, 6H), 1.00 (d, 3H), 0.86 (d, 3H) ppm	-

No.	名称	NMR	異性体比率[1]
278	N-{4-[1-(1,3-ジオキソラン-2-イルメチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}プロパンアミド	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 10.41 (s, 1H), 8.16 (dd, 1H), 8.11-8.09 (m, 2H), 7.44-7.42 (m, 2H), 7.22-7.19 (m, 2H), 6.81 (dd, 1H), 5.27 (t, 1H), 4.32 (d, 2H), 3.95-3.80 (m, 4H), 2.37 (q, 2H), 1.04 (t, 3H) ppm	-
279	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]-N-(オキセタン-3-イル)ピリミジン-2-アミン	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 8.31 (bs, 1H), 8.16 (d, 1H), 7.73 (d, 1H), 7.54 (m, 2H), 7.27 (t, 2H), 6.52 (bs, 1H), 4.54 (bs, 2H), 4.43 (bs, 2H), 3.99 (d, 2H), 3.75 (bs, 1H), 2.18 (m, 1H), 0.90 (d, 6H) ppm	-
280	7-[3-(4-フルオロフェニル)-1-イソプロピル-1H-ピラゾール-4-イル]-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン	1H-NMR (400 MHz, $CDCl_3$): δ = 12.35 (bs, 1H), 8.78 (s, 1H), 8.69 (s, 1H), 8.12 (s, 1H), 7.65 (m, 2H), 7.00 (t, 2H), 4.58 (m, 1H), 1.57 (d, 6H) ppm	-
281	N-シクロプロピル-4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリミジン-2-アミン	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 8.26 (bs, 1H), 8.14 (d, 1H), 7.63 (m, 2H), 7.21 (t, 2H), 6.48 (d, 1H), 4.0 (d, 2H), 2.62 (m, 1H), 2.018 (m, 1H), 0.9 (d, 6H), 0.55 (m, 2H), 0.43 (m, 2H) ppm	-
282	6-[3-(4-フルオロフェニル)-1-イソプロピル-1H-ピラゾール-4-イル]-9H-プリン	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 11.00 (s, 1H), 8.85 (s, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.21 (s, 1H), 7.74-7.73 (m, 2H), 7.12-7.09 (m, 2H), 4.65 (m, 1H), 1.57 (d, 6H) ppm	-
283	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-イソプロピル-1H-ピラゾール-4-イル]-2-(4-メチル-1H-イミダゾール-1-イル)ピリジン	1H-NMR (250 MHz, $CDCl_3$): δ = 8.24 (d, 1H), 8.04 (s, 1H), 7.65 (s, 1H), 7.41 (m, 2H), 7.12 (d, 1H), 7.06-6.98 (m, 4H), 4.52 (m, 1H), 2.20 (s, 3H), 1.54 (d, 6H) ppm	-
284	N-tert-ブチル-4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリミジン-2-アミン	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 8.18 (s, 1H), 8.10 (d, 1H), 7.5 (m, 2H), 7.22 (t, 2H), 6.45 (s, 1H), 6.33 (d, 1H), 4.0 (d, 2H), 2.17 (m, 1H), 1.3 (bs, 9H), 0.9 (d, 6H) ppm	-
285	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]-N-(1-メトキシプロパン-2-イル)ピリミジン-2-アミン	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 8.04 (bs, 1H), 7.88 (d, 1H), 7.31 (m, 2H), 6.97 (t, 2H), 6.48 (d, 1H), 6.19 (bs, 1H), 3.76 (m, 3H), 3.10 (s, 3H), 2.96 (bs, 2H), 1.94 (m, 1H), 0.80 (bs, 3H), 0.66 (d, 6H) ppm	-

No.	名称	NMR	異性体比率[1]
286	N-(ブタン-2-イル)-4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリミジン-2-アミン	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 8.25 (bs, 1H), 8.10 (d, 1H), 7.55 (m, 2H), 7.20 (t, 2H), 6.72 (d, 1H), 3.99 (d, 2H), 2.18 (m, 1H), 1.00 (bs, 2H), 0.9 (d, 6H), 0.78 (bs, 2H) ppm	-
287	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]-2-(メチルスルホニル)ピリミジン	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 8.87 (d, 1H), 8.70 (s, 1H), 7.62 (d, 1H), 7.61 (m, 2H), 7.25 (t, 2H), 4.05 (d, 2H), 3.17 (s, 3H), 2.22 (m, 1H), 0.92 (d, 6H) ppm	-
288	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-イソブチル-1H-ピラゾール-4-イル]-7-メチルチエノ[3,2-d]ピリミジン	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 9.02 (s, 1H), 8.17 (s, 1H), 7.77 (s, 1H), 7.52-7.50 (m, 2H), 7.05-7.02 (m, 2H), 4.06 (d, 2H), 2.46 (s, 3H), 2.27 (m, 1H), 0.96 (d, 6H) ppm	-
289	4-[1-(シクロプロピルメチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]-7-メチルチエノ[3,2-d]ピリミジン	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 9.02 (s, 1H), 8.26 (s, 1H), 7.77 (m, 1H), 7.53-7.50 (m, 2H), 7.06-7.02 (m, 2H), 4.10 (d, 2H), 2.46 (d, 3H), 1.42-1.37 (m, 1H), 0.66-0.64 (m, 2H), 0.48-0.43 (m, 2H) ppm	-
290	N-{4-[1-エチル-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メチルプロパンアミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.61 (s, 1H, br), 8.11-8.09 (m, 2H), 7.87 (s, 1H), 7.47-7.45 (m, 2H), 7.11-7.09 (m, 2H), 6.86 (dd, 1H), 4.20 (q, 2H), 2.62 (m, 1H), 1.50 (t, 3H), 1.14 (d, 6H) ppm	-
291	2-シクロプロピル-N-{4-[1-エチル-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}アセトアミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.60 (s, 1H, br), 8.11 (m, 2H), 7.88 (s, 1H), 7.47-7.45 (m, 2H), 7.11-7.08 (m, 2H), 6.88 (dd, 1H), 4.21 (q, 2H), 2.26 (d, 2H), 1.50 (t, 3H), 1.05 (m, 1H), 0.54 (m, 2H), 0.21 (m, 2H) ppm	-
292	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-プロピル-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}プロパンアミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.61 (s, 1H, br), 8.10 (m, 2H), 7.86 (s, 1H), 7.47-7.45 (m, 2H), 7.11-7.08 (m, 2H), 6.87 (dd, 1H), 4.12 (t, 2H), 2.37 (q, 2H), 1.90 (m, 2H), 1.11 (t, 3H), 0.93 (t, 3H) ppm	-
293	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-プロピル-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メトキシアトアタミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.72 (s, 1H, br), 8.14 (dd, 1H), 8.08 (s, 1H), 7.88 (s, 1H), 7.47-7.45 (m, 2H), 7.11-7.09 (m, 2H), 6.93 (dd, 1H), 4.13 (t, 2H), 3.96 (s, 3H), 3.45 (s, 3H), 0.93 (t, 3H) ppm	-

No.	名称	NMR	異性体比率[1]
294	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-プロピル-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メチルプロパンアミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.60 (s, 1H, br), 8.12-8.10 (m, 2H), 7.86 (s, 1H), 7.47-7.45 (m, 2H), 7.11-7.08 (m, 2H), 6.86 (dd, 1H), 4.12 (t, 2H), 2.62 (m, 1H), 1.90 (m, 2H), 1.14 (d, 6H), 0.93 (t, 3H) ppm	-
295	2-シクロプロピル-N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-プロピル-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}アセトアミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.60 (s, 1H, br), 8.11 (m, 2H), 7.87 (s, 1H), 7.47-7.45 (m, 2H), 7.11-7.08 (m, 2H), 6.87 (dd, 1H), 4.13 (t, 2H), 2.26 (d, 2H), 1.05 (m, 1H), 0.93 (t, 3H), 0.54 (m, 2H), 0.21 (m, 2H) ppm	-
296	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}プロパンアミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.61 (s, 1H, br), 8.10 (m, 2H), 7.82 (s, 1H), 7.47-7.45 (m, 2H), 7.11-7.08 (m, 2H), 6.85 (dd, 1H), 3.91 (s, 3H), 2.37 (q, 2H), 1.11 (t, 3H) ppm	-
297	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メトキシアセトアミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.72 (s, 1H, br), 8.14 (dd, 1H), 8.08 (s, 1H), 7.84 (s, 1H), 7.47-7.45 (m, 2H), 7.11-7.09 (m, 2H), 6.93 (dd, 1H), 3.96 (s, 2H), 3.91 (s, 3H), 3.45 (s, 3H) ppm	-
298	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メチルプロパンアミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.60 (s, 1H, br), 8.10 (m, 2H), 7.82 (s, 1H), 7.47-7.45 (m, 2H), 7.11-7.09 (m, 2H), 6.95 (dd, 1H), 3.91 (s, 3H), 2.62 (m, 1H), 1.14 (d, 6H) ppm	-
299	2-シクロプロピル-N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}アセトアミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.60 (s, 1H, br), 8.11 (m, 2H), 7.83 (s, 1H), 7.47-7.45 (m, 2H), 7.11-7.08 (m, 2H), 6.86 (dd, 1H), 3.91 (s, 3H), 2.33 (d, 2H), 1.05 (m, 1H), 0.54 (m, 2H), 0.21 (m, 2H) ppm	-
300	N-(4-{3-(4-フルオロフェニル)-1-[2-(メチルスルファニル)エチル]-1H-ピラゾール-4-イル}ピリジン-2-イル)プロパンアミド	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 10.40 (s, 1H), 8.21 (s, 1H), 8.16 (dd, 1H), 8.10 (s, 1H), 7.44-7.42 (m, 2H), 7.22-7.19 (m, 2H), 6.81-6.80 (dd, 1H), 4.37 (t, 2H), 2.98 (t, 2H), 2.36 (q, 2H), 2.07 (s, 3H), 1.03 (t, 3H) ppm	-

No.	名称	NMR	異性体比率[1]
301	N-{4-[1-(1-シクロプロピルエチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}プロパンアミド	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 10.39 (s, 1H), 8.21 (s, 1H), 8.16 (dd, 1H), 8.09 (s, 1H), 7.45-7.43 (m, 2H), 7.21-7.18 (m, 2H), 6.84-6.83 (dd, 1H), 3.71 (m, 1H), 2.36 (q, 2H), 1.58 (d, 3H), 1.32 (m, 1H), 1.03 (t, 3H), 0.63 (m, 1H), 0.50 (m, 1H), 0.42-0.38 (m, 2H) ppm	-
302	N-{4-[1-(3-シアノベンジル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}プロパンアミド	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 10.40 (s, 1H), 8.35 (s, 1H), 8.17 (dd, 1H), 8.10 (s, 1H), 7.88 (d, 1H), 7.80 (m, 1H), 7.70 (d, 1H), 7.62-7.58 (m, 1H), 7.43-7.41 (m, 2H), 7.21-7.19 (m, 2H), 6.83-6.82 (dd, 1H), 5.48 (s, 2H), 2.36 (q, 2H), 1.03 (t, 3H) ppm	-
303	N-{4-[1-(2-シアノエチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}プロパンアミド	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 10.42 (s, 1H), 8.25 (s, 1H), 8.18 (dd, 1H), 8.11 (s, 1H), 7.46-7.43 (m, 2H), 7.25-7.21 (m, 2H), 6.82-6.81 (dd, 1H), 4.48 (t, 2H), 3.13 (t, 2H), 2.38 (q, 2H), 1.04 (t, 3H) ppm	-
304	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-イソプロピル-5-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}プロパンアミド	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 10.58 (s, 1H), 8.32 (dd, 1H), 8.03 (s, 1H), 7.33-7.30 (m, 2H), 7.18-7.15 (m, 2H), 7.00 (dd, 1H), 4.75 (m, 1H), 2.38 (q, 2H), 1.56 (d, 6H), 1.02 (t, 3H) ppm	-
305	4-[1-(1-シクロプロピルエチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 8.46 (dd, 2H), 8.31 (s, 1H), 7.45-7.43 (m, 2H), 7.24-7.21 (m, 4H), 3.71 (m, 1H), 1.57 (d, 3H), 1.32 (m, 1H), 0.63 (m, 1H), 0.50 (m, 1H), 0.42-0.38 (m, 2H) ppm	-
306	N-(4-{3-(4-フルオロフェニル)-1-[2-(メチルスルファニル)エチル]-1H-ピラゾール-4-イル}ピリジン-2-イル)-2-メチルプロパンアミド	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 10.41 (s, 1H), 8.22 (s, 1H), 8.16 (dd, 1H), 8.13 (s, 1H), 7.44-7.42 (m, 2H), 7.22-7.19 (m, 2H), 6.78 (dd, 1H), 4.37 (t, 2H), 2.98 (t, 2H), 2.73 (m, 1H), 2.07 (s, 3H), 1.06 (d, 6H) ppm	-
307	N-{4-[1-(1-シクロプロピルエチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メチルプロパンアミド	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 10.40 (s, 1H), 8.22 (s, 1H), 8.16 (dd, 1H), 8.12 (s, 1H), 7.45-7.42 (m, 2H), 7.21-7.18 (m, 2H), 6.81 (dd, 1H), 3.71 (m, 1H), 2.73 (m, 1H), 1.58 (d, 3H), 1.32 (m, 1H), 1.05 (d, 6H), 0.63 (m, 1H), 0.50 (m, 1H), 0.42-0.38 (m, 2H) ppm	-

No.	名称	NMR	異性体比率[1]
308	N-{4-[1-(3-シアノベンジル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メチルプロパンアミド	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 10.41 (s, 1H), 8.36 (s, 1H), 8.17 (dd, 1H), 8.13 (s, 1H), 7.88 (s, 1H), 7.82 (m, 1H), 7.69 (m, 1H), 7.62-7.58 (m, 1H), 7.43-7.41 (m, 2H), 7.21-7.18 (m, 2H), 6.81-6.79 (dd, 1H), 5.48 (s, 2H), 2.73 (m, 1H), 1.06 (d, 6H) ppm	-
309	N-{4-[1-(2-シアノエチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メチルプロパンアミド	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 10.42 (s, 1H), 8.26 (s, 1H), 8.18 (dd, 1H), 8.14 (s, 1H), 7.46-7.44 (m, 2H), 7.24-7.21 (m, 2H), 6.79 (dd, 1H), 4.48 (t, 2H), 3.17 (t, 2H), 2.73 (m, 1H), 1.07 (d, 6H) ppm	-
310	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-イソプロピル-1H-ピラゾール-4-イル]-7H-ピロロ[2,3-d]ピリミジン	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 9.90 (s, 1H), 8.63 (s, 1H), 8.11 (s, 1H), 7.55-7.53 (m, 2H), 7.28 (dd, 1H), 7.05-7.02 (m, 2H), 6.27 (dd, 1H), 4.62 (m, 1H), 1.57 (d, 6H) ppm	-
311	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-イソプロピル-1H-ピラゾール-4-イル]-5,6,7,8-テトラヒドロピリド[2,3-d]ピリミジン	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.15 (s, 1H), 7.69 (s, 1H), 7.47-7.44 (m, 2H), 7.05-7.02 (m, 2H), 5.89 (s, 1H), 4.55 (m, 1H), 3.28 (m, 1H), 2.35 (m, 2H), 1.67 (m, 2H), 1.52 (d, 6H) ppm	-
312	N-{4-[1-(1-シアノプロパン-2-イル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}プロパンアミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.54 (s, 1H, br), 8.12-8.10 (m, 2H), 7.50-7.47 (m, 2H), 7.13-7.10 (m, 2H), 7.13-7.7.10 (m, 1H), 6.87 (dd, 1H), 4.77-4.74 (m, 1H), 3.08-2.98 (m, 2H), 2.39 (q, 2H), 1.64 (d, 3H),1.10 (t, 3H) ppm	-
313	N-{4-[1-(1-シアノプロパン-2-イル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メトキシアセトアミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.71 (s, 1H, br), 8.17-8.10 (m, 1H), 7.99 (s, 1H), 7.50-7.48 (m, 2H), 7.13-7.7.10 (m, 1H), 6.96 (dd, 1H), 4.78-4.75 (m, 1H), 3.08-2.99 (m, 2H), (m, 1H), 2.27 (d, 2H),1.64 (d, 3H), 1.14 (d, 2H) ppm	-
314	N-{4-[1-(1-シアノプロパン-2-イル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メチルプロパンアミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.56 (s, 1H, br), 8.15-8.11 (m, 2H), 7.96 (s, 1H), 7.50-7.47 (m, 2H), 7.13-7.10 (m, 1H), 6.86 (dd, 1H), 4.76 (m, 2H), 3.08-2.99 (m, 2H), 2.65-2.60 (m, 1H), 2.27 (d, 2H),1.64 (d, 3H), 1.19 (d, 1H), 0.56 (m, 6H) ppm	-

No.	名称	NMR	異性体比率[1]
315	N-{4-[1-(1-シアノプロパン-2-イル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-シクロプロピルアセトアミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.56 (s, 1H, br), 8.15-8.13 (m, 1H), 7.98 (s, 1H), 7.51-7.48 (m, 2H), 7.14-7.11 (m, 2H), 6.90 (dd, 1H), 5.29 (m, 1H), 4.78-4.75 (m, 1H), 3.09-3.00 (m, 2H), 2.27 (d, 2H),1.65 (d, 3H), 1.12-1.05 (m, 1H), 0.56 (m, 2H), 0.22 (m, 2H) ppm	-
316	N-{4-[5-(ジフルオロメトキシ)-3-(4-フルオロフェニル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}プロパンアミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.58(s, 1H, br), 8.09 (s, 1H), 7.42-7.40 (m, 2H), 7.08-7.05 (m, 2H), 6.89 (dd, 1H), 3.82 (s, 3H), 2.50 (s, 1H), 2.39 (q, 2H), 1.11 (t, 2H) ppm	-
317	4-[1-(シクロプロピルメチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]-N-(1,1,1-トリフルオロプロパン-2-イル)ピリジン-2-アミン	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 7.92 (d, 1H), 7.86 (s, 1H), 7.49-7.44 (m, 2H), 7.10(m, 2H), 6.53 (dd, 1H), 6.42(m, 1H), 5.29 (m, 1H), 4.54 (d, 1H, br), 4.95-4.88 (m, 1H), 4.01 (d, 2H),1.36-1.29 (m, 4H), 0.63 (m, 2H), 0.42 (m, 2H) ppm	-
318	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-イソプロピル-1H-ピラゾール-4-イル]-N-(1,1,1-トリフルオロプロパン-2-イル)ピリジン-2-アミン	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 7.92 (d, 1H), 7.48-7.46 (m, 1H), 7.13-7.10 (m, 2H), 6.52 (dd, 2H), 6.50 (dd, 1H), 6.41 (m, 1H), 5.28(d, 1H, br), 4.90 (m, 1H), 4.54 (m, 1H), 1.50 (d, 6H), 1.31 (d, 3H) ppm	-
319	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル]-N-(1,1,1-トリフルオロプロパン-2-イル)ピリジン-2-アミン	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 7.92 (d, 1H), 7.74 (s, 1H), 7.47-7.44 (m, 2H), 7.12-7.10 (m, 2H), 6.50 (dd, 1H), 6.40 (m, 1H), 5.30 (d, 1H, br), 4.91 (m, 1H), 3.89 (s, 3H), 1.30 (d, 2H) ppm	-
320	N-{4-[1-シクロプロピル-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}プロパンアミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.52 (s, 1H, br), 8.11 (d, 1H), 8.08 (s, 1H), 7.90 (s, 1H), 7.46-7.44 (m, 2H), 7.11-7.08 (m, 2H), 6.86 (dd, 1H), 3.71 (m, 1H), 2.37 (q, 2H), 1.16-1.15 (m, 2H), 1.10 (t, 3H), 1.04-1.02 (m, 2H) ppm	-
321	N-{4-[1-シクロプロピル-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メトキシアセトアミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.70 (s, 1H, br), 8.15 (d, 1H), 8.07 (s, 1H), 7.92 (m, 2H), 7.47-7.44 (m, 2H), 7.12-7.08 (m, 2H), 6.94 (dd, 1H), 3.72(m, 1H), 3.45 (s, 3H), 1.17-1.14 (m, 2H), 1.05-1.02 (m, 2H) ppm	-

No.	名称	NMR	異性体比率[1]
322	N-{4-[1-シクロプロピル-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メチルプロパンアミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.51 (s, 1H, br), 8.11 (d, 2H), 7.90 (s, 1H), 7.46-7.44 (m, 2H), 7.10-7.07 (m, 2H), 6.85 (dd, 1H), 3.71 (m, 1H), 2.61(m, 1H), 1.17-1.13 (m, 8H), 1.05-1.02 (m, 2H) ppm	-
323	2-シクロプロピル-N-{4-[1-シクロプロピル-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}アセトアミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.53 (s, 1H, br), 8.12-8.10 (m, 2H), 7.90 (s, 1H), 7.47-7.44 (m, 2H), 7.11-7.07 (m, 2H), 6.88 (dd, 1H), 3.71 (m, 1H), 2.50(d, 2H), 1.17-1.14 (m, 2H), 1.11-1.60 (m, 3H) 0.55 (m, 2H), 0.22 (m, 2H) ppm	-
324	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-イソプロピル-1H-ピラゾール-4-イル]-N-[2,2,2-トリフルオロ-1-(4-フルオロフェニル)エチル]ピリジン-2-アミン	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 7.90(d, 1H), 7.82 (s, 1H), 7.53-7.50 (m, 2H), 7.46-7.44 (m, 2H), 7.17-7.09 (m, 4H), 6.56-6.53 (m, 2H), 6.09-6.04 (m, 1H), 4.53(q, 1H), 1.51 (d, 6H) ppm	-
325	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-イソプロピル-1H-ピラゾール-4-イル]-N-(2,2,2-トリフルオロ-1-フェニルエチル)ピリジン-2-アミン	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 7.91(d, 1H), 7.82 (s, 1H), 7.50-7.38 (m, 7H), 7.12-7.09 (m, 2H), 6.54 (d, 2H), 6.09-6.01 (m, 2H), 4.53 (m, 1H), 1.51(d, 6H), ppm	-
326	N-{4-[1-(2-エトキシエチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}プロパンアミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.52 (s, 1H, br), 8.11 (m, 2H), 7.87 (m, 1H), 7.90 (s, 1H), 7.48-7.43 (m, 2H), 7.12-7.08 (m, 2H), 6.74 (dd, 1H), 4.30 (t, 2H), 3.83 (t, 2H), 3.83 (t, 2H), 3.47 (q, 2H), 2.37 (q, 2H), 1.14-1.04 (t, 6H) ppm	-
327	N-{4-[1-(2-エトキシエチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メトキシアセトアミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.70 (s, 1H, br), 8.15 (d, 1H), 8.09 (s, 1H), 7.90 (s, 1H), 7.48-7.46 (m, 2H), 7.12-7.09 (m, 2H), 6.94 (dd, 1H), 4.31 (t, 2H), 3.96 (s, 2H), 3.83 (t, 2H), 3.49 (q, 2H), 3.45 (s, 3H), 1.12 (t, 3H) ppm	-
328	N-{4-[1-(2-エトキシエチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メチルプロパンアミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.51 (s, 1H, br), 8.11 (m, 2H), 7.88 (s, 1H), 7.48-7.45 (m, 2H), 7.11-7.09 (m, 2H), 6.86 (dd, 1H), 4.30 (t, 2H), 3.83 (t, 2H), 3.49 (q, 2H), 1.14-1.10 (m, 10H) ppm	-

No.	名称	NMR	異性体比率[1]
329	2-シクロプロピル-N-{4-[1-(2-エトキシエチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}アセトアミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.54 (s, 1H, br), 8.11 (m, 2H), 7.88 (s, 1H), 7.48-7.41 (m, 2H), 7.12-7.09 (m, 2H), 6.77 (dd, 1H), 4.30 (t, 2H), 4.07 (2H, 異性体), 3.83 (t, 2H), 3.73 (2H, 異性体), 3.49 (q, 2H), 3.32 (2H, 異性体), 2.41 (d, 2H), 2.22 (2H, 異性体), 1.13 (t, 3H), 1.07 (m, 1H), 0.54 (m, 2H), 0.21 (m, 2H) ppm	-
330	6-({4-[1-エチル-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}アミノ)-6-オキソヘキサン酸メチル	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.18-8.16 (m, 2H), 8.08 (s, 1H), 7.44-7.42 (m, 2H), 7.21-7.18 (m, 2H), 6.77 (dd, 1H), 4.21 (q, 2H), 3.58 (s, 1H), 2.39-2.31 (m, 4H), 1.56-1.52 (m, 4H), 1.45 (t, 3H) ppm	-
331	5-({4-[1-エチル-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}アミノ)-5-オキソペンタン酸メチル	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.18-8.16 (m, 2H), 8.07 (s, 1H), 7.44-7.42 (m, 2H), 7.21-7.18 (m, 2H), 6.83 (dd, 1H), 4.21 (q, 2H), 3.59 (s, 1H), 2.41-2.39 (m, 2H), 2.33 (t, 2H), 1.82-1.77 (t, 3H) ppm	-
332	3-エチル-5-({4-[1-エチル-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}アミノ)-5-オキソペンタン酸エチル	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.18-8.16 (m, 2H), 8.07 (s, 1H), 7.44-7.41 (m, 2H), 7.20-7.17 (m, 2H), 6.84 (dd, 1H), 4.21 (q, 2H), 4.03 (q, 2H), 2.33-2.19(m, 4H), 1.45 (t, 3H), 1.34-1.29 (m, 2H), 1.16 (t, 3H), 0.84 (t, 3H) ppm	-
333	3-(ジフルオロメチル)-N-{4-[1-エチル-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.67 (s, 1H, br), 8.23 (m, 2H), 8.14 (m, 1H), 7.46-7.43 (m, 2H), 7.23-7.20 (m, 2H), 6.89-6.88 (dd, 1H), 4.22 (q, 2H), 3.64(s, 3H), 1.46 (t, 3H) ppm	-
334	2-(ジフルオロメチル)-N-{4-[1-エチル-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}チオフェン-3-カルボキサミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.28 (d, 1H), 8.24 (s, 1H), 8.22 (m, 1H), 8.13 (m, 1H), 7.55-7.54 (m, 1H), 7.47-7.44 (m, 2H), 7.24-7.21 (m, 2H), 6.94(dd, 1H), 4.24 (q, 2H), 1.46 (t, 3H) ppm	-
335	N-{4-[1-エチル-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-4-メチル-1,2,3-チアジゾール-5-カルボキサミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.27 (m, 2H), 8.08 (s, 1H), 7.47-7.44 (m, 2H), 7.24-7.21 (m, 2H), 7.00 (dd, 1H), 4.22 (q, 2H), 2.78 (s, 3H), 1.46 (t, 3H) ppm	-

No.	名称	NMR	異性体比率[1]
336	3-(4-クロロフェニル)-N-{4-[1-エチル-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}プロパンアミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.17 (m, 2H), 8.06 (s, 1H, br), 7.44-7.41 (m, 2H), 7.43-7.32 (m, 2H), 7.26 (m, 2H), 7.22-7.19 (m, 2H), 6.85 (dd, 1H), 4.21 (q, 2H), 2.87 (t, 2H), 2.64 (t, 2H), 1.45 (t, 3H) ppm	-
337	(1R,2R)-N-{4-[1-エチル-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-フェニルシクロプロパンカルボキサミド	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 8.18-8.15 (m, 2H), 8.10 (s, 1H), 7.44-7.41 (m, 2H), 7.32-7.28 (m, 2H), 7.23-7.15 (m, 5H), 6.82-6.81 (dd, 1H), 4.23-4.19 (q, 2H), 2.35 (m, 1H), 1.43 (t, 3H), 1.43 (m, 1H), 1.35 (m, 1H) ppm	-
338	2-シクロペンチル-N-{4-[1-エチル-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}アセトアミド	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 8.18 (s, 1H), 8.16-8.15 (m, 1H), 8.07 (s, 1H), 7.43-7.41 (m, 2H), 7.21-7.18 (m, 2H), 6.83-6.82 (dd, 1H), 4.22-4.18 (m, 2H), 2.32 (d, 2H), 2.18 (m, 1H), 1.70 (m, 1H), 1.60 (m, 1H), 1.50 (m, 1H), 1.43 (t, 3H), 1.15 (m, 1H) ppm	-
339	N-{4-[1-エチル-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-3-メチルブタンアミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.18-8.16 (m, 2H), 8.08 (s, 1H, br), 7.44-7.41 (m, 2H), 7.21-7.18 (m, 2H), 6.84 (dd, 1H), 4.21 (m, 2H), 2.23 (d, 2H), 2.05-2.00 (m, 1H), 1.45 (t, 3H), 0.90 (d, 6H) ppm	-
340	N-{4-[1-エチル-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メチルブタンアミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.19-8.16 (m, 2H), 8.12 (s, 1H, br), 7.44-7.41 (m, 2H), 7.22-7.18 (m, 2H), 6.82 (dd, 1H), 4.21 (m, 1H), 1.45 (t, 3H), 1.38-1.34 (m, 1H), 1.21 (m, 1H), 1.04 (d, 3H), 0.83 (t, 3H) ppm	-
341	N-{4-[1-エチル-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メチルシクロプロパンカルボキサミド	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 10.67 (m, 1H), 8.17-8.14 (m, 2H), 8.05 (s, 1H), 7.43-7.40 (m, 2H), 7.21-7.17 (m, 2H), 6.82-6.79 (dd, 1H), 4.22-4.18 (m, 2H), 1.72 (m, 1H), 1.45 (m, 2H), 1.20 (m, 1H), 1.07 (d, 3H), 0.90 (m, 1H), 0.60 (m, 1H) ppm	-
342	N-{4-[1-エチル-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}アセトアミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.17 (m, 2H), 8.03(s, 1H, br), 7.44-7.41 (m, 2H), 7.22-7.18 (m, 2H), 6.86 (dd, 1H), 4.21 (m, 1H), 4.21 (q, 2H), 2.05 (s, 3H), 1.45 (t, 3H) ppm	-

No.	名称	NMR	異性体比率[1]
343	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-3-フェニルプロパンアミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.16 (d, 1H), 8.13(s, 1H), 8.07 (s, 1H, br), 7.44-7.41 (m, 2H), 7.29-7.26 (m, 2H), 7.23-7.17 (m, 5H), 6.82 (dd, 1H), 3.92 (s, 3H), 2.86 (t, 2H), 2.67 (t, 2H) ppm	-
344	4-フルオロ-N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}ベンズアミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.27 (d, 1H), 8.19(s, 1H), 8.16 (s, 1H), 8.09-8.06 (m, 2H), 7.47-7.45 (m, 2H), 7.35-7.32 (m, 2H), 7.24-7.21 (m, 2H), 6.92 (dd, 1H), 3.94 (s, 3H) ppm	-
345	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-(2-メトキシエトキシ)アセトアミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.20 (d, 1H), 8.19(s, 1H), 8.15 (s, 1H), 8.05 (s, 1H, br), 7.44-7.41 (m, 2H), 7.22-7.20 (m, 2H), 6.90 (dd, 1H), 4.10 (s, 2H), 3.91 (s, 3H), 3.66-3.64 (m, 2H), 3.51-3.50 (m, 2H), 3.29 (s, 3H) ppm	-
346	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}ベンズアミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.24 (m, 1H), 8.18(s, 2H), 8.00 (m, 2H), 7.60-7.58 (m, 1H), 7.52-7.45 (m, 4H), 7.23-7.21 (m, 2H), 6.92 (dd, 1H), 3.94 (s, 3H) ppm	-
347	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-3-メチルブタンアミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.17 (m, 1H), 8.14 (s, 1H), 8.07 (s, 1H, br), 7.43-7.41 (m, 2H), 7.21-7.18 (m, 2H), 6.83 (dd, 1H), 3.92 (s, 3H), 2.23 (d, 2H), 2.05-2.00 (m, 1H) ppm	-
348	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メチルブタンアミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.16 (m, 1H), 8.14 (s, 1H), 8.11 (s, 1H), 7.44-7.41 (m, 2H), 7.21-7.18 (m, 2H), 6.80 (dd, 1H), 3.92 (s, 3H), 1.59-1.55 (m, 1H), 1.38-1.35 (m, 1H), 1.23 (s, 1H, br), 1.04(d, 3H), 0.84 (t, 3H) ppm	-
349	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}シクロブタンカルボキサミド	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 10.27 (s, 1H), 8.15-8.11 (m, 3H), 7.43-7.41 (m, 2H), 7.22-7.19 (m, 2H), 6.80-6.78 (dd, 1H), 3.92 (s, 3H), 2.15 (m, 2H), 2.05 (m, 2H), 1.90 (m, 1H), 1.23 (m, 2H) ppm	-
350	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}アセトアミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.12 (d, 1H), 8.12 (s, 1H), 8.03 (s, 1H,br), 7.43-7.41 (m, 2H), 7.21-7.18 (m, 2H), 6.84 (dd, 1H), 3.92 (s, 3H), 2.05 (s, 3H) ppm	-

No.	名称	NMR	異性体比率[1]
351	N-{4-[1-エチル-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}エタンジアミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.42 (s, 1H, br), 8.28 (d, 1H), 8.24 (s, 1H), 8.12 (s, 1H, br), 7.99 (s, 1H, br), 7.47-7.43 (m, 2H), 7.23-7.20 (m, 2H), 7.05-7.04 (m, 1H), 4.22(q, 2H), 1.46 (t, 3H) ppm	-
352	(2S)-N-{4-[1-エチル-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-ヒドロキシプロパンアミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 9.56 (s, 1H), 8.21 (s, 1H), 8.19 (d, 1H), 8.07 (s, 1H, br), 7.45-7.42 (m, 2H), 7.22-7.19 (m, 2H), 6.90 (dd, 1H), 5.90 (d, 1H), 4.23-4.16(m, 3H), 1.45 (t, 3H), 1.28 (d, 3H) ppm	-
353	(2S)-N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-ヒドロキシプロパンアミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 9.56 (s, 1H), 8.20 (d, 1H), 8.16 (s, 1H), 8.07 (s, 1H, br), 7.44-7.41 (m, 2H), 7.22-7.19 (m, 2H), 6.90 (dd, 1H), 4.18 (m, 1H), 3.92 (s, 1H), 1.45 (t, 3H), 1.28 (d, 3H) ppm	-
354	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(プロパン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリミジン-2-イル}-2-メトキシアセトアミド	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 10.15 (bs, 1H), 8.49 (d, 1H), 8.44 (s, 1H), 7.60 (m, 2H), 7.24 (t, 1H), 6.99 (d, 1H), 4.61 (m, 1H), 4.07 (s, 2H), 3.33 (s, 3H), 1.51 (d, 6H) ppm	-
355	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(プロパン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリミジン-2-イル}-2-メチルプロパンアミド	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 10.33 (bs, 1H), 8.47 (d, 1H), 8.37 (s, 1H), 7.66 (m, 2H), 7.23 (t, 1H), 6.92 (d, 1H), 4.62 (m, 1H), 2.84 (m, 1H), 1.50 (d, 6H), 1.05 (d, 6H) ppm	-
356	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(プロパン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリミジン-2-イル}シクロプロパンカルボキサミド	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 10.63 (s, 1H), 8.47 (d, 1H), 8.36 (s, 1H), 7.66 (m, 2H), 7.22 (t, 2H), 6.94 (d, 1H), 4.61 (m, 1H), 2.16 (m, 1H), 1.5 (d, 6H), 0.8 (m, 2H), 0.74 (m, 2H) ppm	-
357	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリミジン-2-イル}アセトアミド	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.25 (d, 2H), 7.96 (s, 1H), 7.43 (m, 2H), 7.05 (t, 2H), 6.69 (d, 1H), 3.92 (d, 2H), 2.39 (s, 3H), 2.24 (m, 1H), 0.92 (d, 6H), ppm	-

No.	名称	NMR	異性体比率[1]
358	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(2-メトキシエチル)-1H-ピラゾール-4-イル]-N-(プロパン-2-イル)ピリミジン-2-アミン	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 8.26 (bs, 1H), 8.11 (d, 1H), 7.56 (m, 2H), 7.22 (t, 2H), 6.78 (d, 1H), 6.41 (bs, 1H), 4.34 (t, 2H), 4.01 (t, 2H, 異性体), 3.76 (t, 2H), 3.65 (t, 2H, 異性体), 3.28 (s, 3H), 3.12 (s, 3H, 異性体), 1.06 (bs, 6H), 0.96 (bs, 6H, 異性体) ppm	76/23
359	4-[1-(2-クロロエチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]-N-(プロパン-2-イル)ピリミジン-2-アミン	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 8.36 (bs, 1H), 8.12 (d, 1H), 7.56 (m, 2H), 7.23 (t, 2H), 6.80 (d, 1H), 6.40 (bs, 1H), 4.54 (t, 2H), 4.20 (t, 2H, 異性体), 4.08 (t, 2H), 3.97 (t, 2H, 異性体), 1.06 (bs, 6H), 0.95 (bs, 6H, 異性体) ppm	70/30
360	4-[1-(ブタン-2-イル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]-N-(プロパン-2-イル)ピリミジン-2-アミン	1H-NMR (400 MHz, $CDCl_3$): δ = 7.99 (d, 1H), 7.89 (s, 1H), 7.46 (m, 2H), 7.01 (t, 2H), 6.26 (d, 1H), 4.87 (bd, 1H), 4.19 (m, 1H), 4.03 (m, 1H), 1.79(m, 2H), 1.49 (d, 3H), 1.15 (d, 6H), 0.83 (t, 3H) ppm	-
361	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル]-N-(プロパン-2-イル)ピリミジン-2-アミン	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 8.25 (bs, 1H), 7.55 (m, 2H), 7.21 (t, 2H), 6.76 (d, 1H), 6.38 (bs, 1H), 3.23 (s, 3H), 1,06 (bs, 6H) ppm	-
362	3-{3-(4-フルオロフェニル)-4-[2-(プロパン-2-イルアミノ)ピリミジン-4-イル]-1H-ピラゾール-1-イル}プロパノニトリル	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 8.38 (bs, 1H), 8.13 (d, 1H), 7.56 (m, 2H), 7.24 (t, 2H), 6.82 (d, 1H), 6.39 (bs, 1H), 4.48 (t, 2H), 3.75 (bs, 1H), 3.16 (t, 2H), 1.07 (bs, 6H) ppm	-
363	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(プロパ-2-イン-1-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]-N-(プロパン-2-イル)ピリミジン-2-アミン	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 8.34 (bs, 1H), 8.12 (d, 1H), 7.55 (m, 2H), 7.23 (t, 2H), 6.83 (d, 1H), 6.38 (bs, 1H), 5.14 (s, 2H), 3.59 (m, 1H), 1.07 (bs, 6H) ppm	-
364	4-[1-(2,2-ジフルオロエチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]-N-(プロパン-2-イル)ピリミジン-2-アミン	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 8.34 (bs, 1H), 8.12 (d, 1H), 7.55 (m, 2H), 7.24 (t, 2H), 6.84 (d, 1H), 6.46 (tt, 1H), 6.40 (bs, 1H), 4.73 (td, 2H), 3.85 (bs, 1H), 1.07 (bs, 6H) ppm	-

No.	名称	NMR	異性体比率[1]
365	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリミジン-2-イル}プロパンアミド	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 10.30 (s, 1H), 8.45 (d, 1H), 8.34 (s, 1H), 7.62 (m, 2H), 7.24 (t, 2H), 6.91 (d, 1H), 4.03 (d, 2H), 2.41 (q, 2H), 2.28 (m, 1H), 0.99 (t, 3H), 0.91 (d, 6H) ppm	-
366	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(プロパン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリミジン-2-アミン	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 8.23 (s, 1H), 8.08 (d, 1H), 7.55 (m, 2H), 7.23 (t, 2H), 6.47 (s, 1H)6.76 (d, 1H), 6.35 (d, 1H), 4.57 (m, 1H), 1.48 (d, 6H) ppm	-
367	4-[1-(2,2-ジフルオロエチル)-3-(4-フルオロフェニル)-5-メチル-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 8.55 (d, 2H), 8.44 (d, 2H, 異性体), 7.35 (m, 4H), 7.17 (m, 2H), 7.07 (dd, 2H, 異性体), 6.47 (tt, 1H), 4.72 (td, 2H), 4.38 (td, 2H, 異性体), 2.31 (s, 3H) ppm	66/23
368	4-[3-(4-フルオロフェニル)-5-メチル-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 8.53 (d, 2H), 8.41 (d, 2H, 異性体), 7.33 (m, 4H), 7.15 (m, 4H), 7.03 (d, 2H, 異性体), 3.96 (d, 2H), 3.74 (d, 2H, 異性体), 2.28 (m, 4H), 0.94 (d, 6H), 0.72 (d, 6H,異性体) ppm	64/28
369	N-ベンジル-4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(プロパン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリミジン-2-アミン	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 8.47 (bs, 1H), 8.18 (bs, 1H), 7.57 (m, H), 7.22 (m, 8H), 6.72 (bs, 1H), 4.58 (m, 1H), 4.32 (bs, 2H), 1.47 (d, 6H) ppm	-
370	4-[1-エチル-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]-N-(プロパン-2-イル)ピリミジン-2-アミン	1H-NMR (400 MHz, d_6-DMSO): δ = 8.29 (bs, 1H), 8.10 (d, 1H), 7.56 (m, 2H), 7.21 (t, 2H), 6.76 (d, 1H), 6.41 (bs, 1H), 4.21 (q, 2H), 3.90 (q, 2H, 異性体), 3.68 (bs, 1H), 1.44 (t, 3H), 1.24 (t, 3H, 異性体), 1.06 (bs, 6H), 0.95 (bs, 6H, 異性体) ppm	-
371	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(プロパン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]-N-(プロパン-2-イル)ピリミジン-2-アミン	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.06 (d, 1H), 7.97 (s, 1H), 7.54 (m, 2H), 7.08 (t, 2H), 6.33 (d, 1H), 4.95 (d, 1H), 4.55 (m, 1H), 4.11 (m, 1H), 1.58 (d, 6H), 1.22 (d, 6H), ppm	-
372	N-(1-シクロプロピルエチル)-4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリミジン-2-アミン	1H-NMR (400 MHz, d_3-CD3CN): δ = 8.08 (d, 1H), 7.95 (s, 1H), 7.54 (m, 2H), 7.11 (t, 2H), 6.36 (d, 1H), 5.25 (bs, 1H), 3.98 (d, 2H), 3.45 (m, 1H), 2.33 (m, 1H), 127 (d, 3H),1.02 (d, 6H), 0.92 (m, 1H), 0.5 (m, 2H), 0.37 (m, 1H), 0.26 (m, 1H) ppm	-

[1] 異性体比率はいくつかの場合に得られた種々のピラゾール異性体の混合物に基づく(主たる異性体は 1-置換された 3-アリール-1H-ピラゾールであり、従たる異性体は対応する 1-置換された 5-アリール-1H-ピラゾールである)。もし異性体比率が与えられなければ、主たる異性体のみが存在する。

表 3-タイプ[I-a]および[I-b]の製造された化合物についての質量分析/logP データ

No.	名称	$LogP_A$ [1]	$[M+H]_A^+$ [2]	$LogP_B$ [3]	$[M+H]_B^+$ [2]	Isomer ratio[4]	Method [5]
1	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1.63	296	-	-	-	C
2	4-[5-(2,6-ジフルオロフェニル)-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1.86	314	-	-	-	C
3	4-[1-(ブタン-2-イル)-3-(2,6-ジフルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1.82	314	-	-	-	C
5	4-[3-(3-クロロフェニル)-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリミジン	3.27	313	-	-	-	C
6	4-[5-(2,6-ジフルオロフェニル)-1-(2,2-ジメチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1.79	328	-	-	-	C
7	4-[3-(2,6-ジフルオロフェニル)-1-(3-メチルブタ-2-エン-1-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1.69	326	-	-	-	C
8	4-[1-シクロブチル-3-(2,6-ジフルオロフェニル-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1.56	312	-	-	-	C
9	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1.29	324	-	-	-	B
10	4-[5-(2,6-ジフルオロフェニル)-1-(プロパン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1.54	300	-	-	-	C
11	4-[3-(2,6-ジフルオロフェニル)-1-(2,2-ジメチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1.84	328	-	-	-	C
12	4-[3-(2,6-ジフルオロフェニル)-1-(2,2,2-トリフルオロエチル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1.39	340	-	-	-	C

No.	名称	LogP$_A$ [1]	[M+H]$_A^+$ [2]	LogP$_B$ [3]	[M+H]$_B^+$ [2]	Isomer ratio[4]	Method [5]
13	4-[3-(2,6-ジフルオロフェニル)-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1.62	314	-	-	-	C
14	4-[3-(2,6-ジフルオロフェニル-1-(プロパン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1.4	300	-	-	-	C
15	4-[1-シクロブチル-5-(2,6-ジフルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1.49	312	-	-	-	C
16	4-[1-シクロペンチル-3-(2,6-ジフルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1.79	326	-	-	-	C
17	4-[1-シクロペンチル-5-(2,6-ジフルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1.74	326	-	-	-	C
19	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}プロパンアミド	2.32	395	-	-	-	A
20	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン	2.08	363	-	-	-	B
21	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メチルプロパンアミド	2.76	409	-	-	-	B
22	4-[5-(2,6-ジフルオロフェニル)-1-(3-メチルブタ-2-エン-1-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1.72	326	-	-	-	C
23	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メトキシアセトアミド	2.64	411	-	-	-	B

No.	名称	$LogP_A$ [1]	$[M+H]_A^+$ [2]	$LogP_B$ [3]	$[M+H]_B^+$ [2]	Isomer ratio[4]	Method [5]
24	4-[5-(4-フルオロフェニル)-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1.59	296	-	-	-	C
25	4-[5-(4-フルオロフェニル)-1-(3-メチルブタ-2-エン-1-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	2.68	308	-	-	-	C
26	4-[3-(2,6-ジフルオロフェニル)-1-(テトラヒドロフラン-2-イルメチル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1.16	342	-	-	-	C
27	4-[5-(2,6-ジフルオロフェニル)-1-(テトラヒドロフラン-2-イルメチル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1.21	342	-	-	-	C
28	4-[3-(3-クロロフェニル)-1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1.55	340	-	-	-	B
29	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]-2-メチルピリミジン	2.53	339	-	-	-	B
30	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(3-メチルブタ-2-エン-1-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	2.11	308	-	-	-	C
31	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]-2-メチルピリジン	1.38	338	-	-	-	B
32	4-[3-(3-クロロフェニル)-1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン	2.46	379	-	-	-	B
33	4-[5-(2,2-ジフルオロ-1,3-ベンゾジオキソール-4-	1.64	386	-	-	-	B

No.	名称	LogP$_A$ [1]	[M+H]$_A^+$ [2]	LogP$_B$ [3]	[M+H]$_B^+$ [2]	Isomer ratio[4]	Method [5]
	イル)-1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン						
34	4-[3-(3-クロロフェニル)-1-(3-メチルブタ-2-エン-1-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリミジン	3.5	325	-	-	-	C
36	4-(6-{1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-3-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]-1H-ピラゾール-4-イル}ピリミジン-4-イル)モルホリン	2.1	460	-	-	-	B
37	4-[5-(4-フルオロ-2-メチルフェニル)-1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1.40	338	-	-	-	B
38	4-[1-(ブタン-2-イル)-5-(2,6-ジフルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1.9	314	-	-	-	C
39	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-アミン	1.38	339	-	-	-	B
40	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(プロパン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メトキシアセトアミド	2.59	369	-	-	-	A
41	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2,2-ジメチルプロパンアミド	3.19	423	-	-	-	B
42	4-{1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-3-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]-1H-ピラゾール-4-イル}ピリジン	1.84	374	-	-	-	B

No.	名称	$LogP_A$ [1]	$[M+H]_A^+$ [2]	$LogP_B$ [3]	$[M+H]_B^+$ [2]	Isomer ratio[4]	Method [5]
43	4-[3-(4-メトキシフェニル)-1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1.24	336	-	-	-	B
44	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(プロパン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]キノリン	2.24	332	-	-	-	B
45	4-[5-(4-メトキシナフタレン-1-イル)-1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1.69	386	-	-	-	B
46	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(プロパン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-アミン	1.18	297	-	-	-	A
47	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(プロパン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]-1-(プロパ-2-イン-1-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン	3.63	359	-	-	80:20	B
48	2,2-ジメチル-N-(4-{1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-3-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]-1H-ピラゾール-4-イル}ピリジン-2-イル)プロパンアミド	4.1	473	-	-	-	B
49	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]-1-(プロパ-2-イン-1-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン	3.47	401	-	-	-	B
50	4-{1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-3-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]-1H-ピラゾール-4-イル}-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン	2.93	413	-	-	-	B
51	4-[5-(3-クロロ-4-フルオロフェニル)-1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1.57	359	-	-	-	B

No.	名称	$LogP_A$ [1]	$[M+H]_A^+$ [2]	$LogP_B$ [3]	$[M+H]_B^+$ [2]	Isomer ratio[4]	Method [5]
52	4-{6-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリミジン-4-イル}モルホリン	1.49	410	-	-	-	B
53	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(プロパン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]-N-メチルピリジン-2-カルボキサミド	2.74	339	-	-	-	A
54	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]キノリン	2.46	374	-	-	-	B
55	4-[5-(4-フルオロ-3-メチルフェニル)-1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1.47	338	-	-	-	B
56	4-[5-(2,4-ジフルオロフェニル)-1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1.35	342	-	-	-	B
57	4-[5-(4-tert-ブチルフェニル)-1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	2.02	362	-	-	-	B
58	4-[1-tert-ブチル-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	2.62	296	-	-	-	C
59	4-[5-(4-フェノキシフェニル)-1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1.88	398	-	-	-	B
60	3-[4-(ピリジン-4-イル)-1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-5-イル]ベンゾニトリル	1.23	331	-	-	-	B
61	2-フルオロ-5-[4-(ピリジン-4-イル)-1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-5-イル]ベン	1.45	349	-	-	-	B

No.	名称	$LogP_A$ [1]	$[M+H]_A^+$ [2]	$LogP_B$ [3]	$[M+H]_B^+$ [2]	Isomer ratio[4]	Method [5]
	ゾニトリル						
62	4-[3-(4-メトキシフェニル)-1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]-6-(1H-ピラゾール-1-イル)ピリミジン	3.32	403	-	-	-	B
63	N-エチル-6-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリミジン-4-アミン	1.42	368	-	-	-	B
64	4-[5-(4-フルオロ-2-メトキシフェニル)-1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1.26	354	-	-	-	B
65	4-[3-(4-メトキシフェニル)-1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]-7H-ピロロ[2,3-d]ピリミジン	1.54	376	-	-	-	B
66	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]-7H-ピロロ[2,3-d]ピリミジン	1.69	364	-	-	-	B
67	4-[5-(3-フェノキシフェニル)-1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1.88	398	-	-	-	B
68	4-{5-[4-(メチルスルホニル)フェニル]-1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル}ピリジン	0.96	384	-	-	-	B
69	4-[3-(4-メトキシフェニル)-1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-アミン	1.31	351	-	-	-	B

No.	名称	LogP$_A$ [1]	[M+H]$_A^+$ [2]	LogP$_B$ [3]	[M+H]$_B^+$ [2]	Isomer ratio[4]	Method [5]
70	4-[5-(4-クロロフェニル)-1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1.52	340	-	-	-	B
71	4-{1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-5-[4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]-1H-ピラゾール-4-イル}ピリジン	1.78	390	-	-	-	B
72	N-{4-[5-(4-フルオロフェニル)-1-(プロパン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2,2-ジメチルプロパンアミド	2.99	381	-	-	-	B
73	4-[3-(4-メトキシフェニル)-1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]-2-メチルピリジン	1.33	350	-	-	-	B
74	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]-2-(メチルスルファニル)ピリミジン	3.58	371	-	-	-	B
75	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]-6-(1H-ピラゾール-1-イル)ピリミジン	3.58	391	-	-	-	B
76	4-[5-(2,3-ジクロロフェニル)-1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1.66	374	1.60	374	40:60	B
77	4-[3-(4-メトキシフェニル)-1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]-2-メチルピリミジン	2.27	351	-	-	-	B
78	N-エチル-6-[3-(4-メトキシフェニル)-1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピ	1.28	380	-	-	-	B

No.	名称	$LogP_A$ [1]	$[M+H]_A^+$ [2]	$LogP_B$ [3]	$[M+H]_B^+$ [2]	Isomer ratio[4]	Method [5]
	リミジン-4-アミン						
79	2-[3-(4-フルオロフェニル)-4-(ピリジン-4-イル)-1H-ピラゾール-1-イル]-5-(トリフルオロメチル)ピリジン	2.64	385	-	-	-	B
80	4-[3-(4-メトキシフェニル)-1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン	1.87	375	-	-	-	B
81	1-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-1-イル}エタノン	3.85	405	-	-	-	B
82	2,2-ジメチル-N-(4-{1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-5-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]-1H-ピラゾール-4-イル}ピリジン-2-イル)プロパンアミド	3.84	473	-	-	-	B
83	4-[3-(3-クロロフェニル)-1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]-N-メチルピリジン-2-カルボキサミド	3.15	397	-	-	-	B
84	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(プロパン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メチルプロパンアミド	2.50	367	-	-	-	A
85	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(プロパン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}プロパンアミド	2.15	353	-	-	-	A
86	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(プロパン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}シク	2.07	365	-	-	-	B

No.	名称	$LogP_A$ [1]	$[M+H]_A^+$ [2]	$LogP_B$ [3]	$[M+H]_B^+$ [2]	Isomer ratio[4]	Method [5]
	ロプロパンカルボキサミド						
87	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メチルプロパンアミド	2.89	381	-	-	-	B
88	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(2-メトキシエチル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1.11	298	1.05	298	70:30	A
89	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(プロパン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1.16	282	-	-	-	B
90	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]-N-メチルピリジン-2-カルボキサミド	2.72	381	-	-	-	B
91	4-[1-(ブタン-2-イル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1.5	296	-	-	-	A
92	4-[1-シクロペンチル-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1.65	308	1.65	308	85:15	A
92	4-[1-シクロペンチル-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1.65	308	1.65	308	80:20	A
93	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-カルボキサミド	2.46	367	-	-	-	B
94	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]-N-フェニルピリジン-2-カルボキサミド	4.34	443	-	-	-	B
95	4-[3-(3-クロロフェニル)-1-(テトラヒドロ-2H-ピラ	2.93	383	-	-	-	B

No.	名称	$LogP_A$ [1]	$[M+H]_A^+$ [2]	$LogP_B$ [3]	$[M+H]_B^+$ [2]	Isomer ratio[4]	Method [5]
	ン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-カルボキサミド						
96	4-[3-(3-クロロフェニル)-1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]-N-フェニルピリジン-2-カルボキサミド	4.89	459	-	-	-	B
97	4-[5-(4-フルオロフェニル)-1-(プロパン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-アミン	1.25	297	-	-	-	B
98	4-{5-[2-(ベンジルオキシ)フェニル]-1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル}ピリジン	1.64	412	-	-	-	B
99	8-[4-(ピリジン-4-イル)-1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-5-イル]キノリン	1.09	357	-	-	-	B
100	3-{[3-(4-フルオロフェニル)-4-(ピリジン-4-イル)-1H-ピラゾール-1-イル]メチル}ピリジン	0.78	331	-	-	-	B
101	4-{1-[1-(3-クロロフェニル)エチル]-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル}ピリジン	2.17	378	2.1	378	80:20	A
102	4-{1-[1-(2-クロロフェニル)エチル]-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル}ピリジン	2.16	378	2.13	378	91:9	A
103	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(2,2,2-トリフルオロエチル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1.41	322	1.33	322	91:9	A
104	4-[1-(2,3-ジフルオロベンジル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1.80	366	1.7	366	75:25	A
105	[3-(4-フルオロフェニル)-4-(ピリジン-4-イル)-1H-ピラゾール-1-イル]酢酸 tert-ブチル	1.67	354	1.59	354	78:22	A

No.	名称	$LogP_A$ [1]	$[M+H]_A^+$ [2]	$LogP_B$ [3]	$[M+H]_B^+$ [2]	Isomer ratio[4]	Method [5]
106	メチル-2-[3-(4-フルオロフェニル)-4-(ピリジン-4-イル)-1H-ピラゾール-1-イル]-3-メチルブタノエート	1.67	354	1.6	354	93:7	A
107	メチル-2-[3-(4-フルオロフェニル)-4-(ピリジン-4-イル)-1H-ピラゾール-1-イル]プロパノエート	1.20	326	-	-	-	A
108	4-[1-(2-クロロ-6-フルオロベンジル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1.90	382	1.82	382	87:13	A
109	4-{1-[4-(ジフルオロメトキシ)ベンジル]-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル}ピリジン	1.88	396	1.79	396	74:26	A
110	4-{1-[(2-クロロ-1,3-チアゾール-5-イル)メチル]-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル}ピリジン	1.54	371	-	-	-	A
111	4-{3-(4-フルオロフェニル)-1-[5-(トリフルオロメチル)-1,3,4-チアジアゾール-2-イル]-1H-ピラゾール-4-イル}ピリジン	2.90	392	-	-	-	A
112	4-[3-(4-フルオロフェニル)-4-(ピリジン-4-イル)-1H-ピラゾール-1-イル]-6-(トリフルオロメチル)ピリミジン	2.73	386	-	-	-	A
113	1-シクロヘキシル-2-[3-(4-フルオロフェニル)-4-(ピリジン-4-イル)-1H-ピラゾール-1-イル]エタノン	1.86	364	1.76	364	80:20	A
114	1-シクロペンチル-2-[3-(4-フルオロフェニル)-4-(ピリジン-4-イル)-1H-ピラゾール-1-イル]エタノン	1.63	350	1.54	350	75:25	A

No.	名称	LogP$_A$ [1]	[M+H]$_A^+$ [2]	LogP$_B$ [3]	[M+H]$_B^+$ [2]	Isomer ratio[4]	Method [5]
115	2-{[3-(4-フルオロフェニル)-4-(ピリジン-4-イル)-1H-ピラゾール-1-イル]メチル}ピリジン	0.99	331	-	-	-	A
115	2-{[3-(4-フルオロフェニル)-4-(ピリジン-4-イル)-1H-ピラゾール-1-イル]メチル}ピリジン	1.08	331	0.97	331	75:25	A
116	4-{1-[(2,2-ジクロロシクロプロピル)メチル]-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル}ピリジン	1.76	362	1.68	362	75:25	A
117	4-{3-(4-フルオロフェニル)-1-[2-(メチル-スルファニル)エチル]-1H-ピラゾール-4-イル}ピリジン	1.29	314	1.25	314	80:20	A
118	4-{1-[2-(3-クロロフェニル)エチル]-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル}ピリジン	2.04	378	1.9	378	70:30	A
119	4-{1-[2-(2-クロロフェニル)エチル]-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル}ピリジン	2.04	378	1.9	378	72:28	A
120	4-{1-[1-(4-クロロフェニル)エチル]-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル}ピリジン	2.18	378	2.12	378	80:20	A
121	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(ピリジン-4-イルメチル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	0.25	331	-	-	-	B
122	4-{3-(4-フルオロフェニル)-1-[2-(トリフルオロ-メトキシ)エチル]-1H-ピラゾール-4-イル}ピリジン	1.66	352	1.59	352	88:12	A
122	4-{3-(4-フルオロフェニル)-1-[2-(トリフルオロ-メトキシ)エチル]-1H-ピラゾール-4-イル}ピリジン	1.66	352	1.59	352	66:33	A
123	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(テトラヒドロフラン-2-イルメチル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1.19	324	1.16	324	89:11	A
124	3-[3-(4-フルオロフェニル)-4-(ピリジン-4-イ	0.17	314	-	-	-	A

No.	名称	$LogP_A$ [1]	$[M+H]_A^+$ [2]	$LogP_B$ [3]	$[M+H]_B^+$ [2]	Isomer ratio[4]	Method [5]
	ル)-1H-ピラゾール-1-イル]プロパン-1,2-ジオール						
125	4-[1-(ビフェニル-3-イルメチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	2.38	406	2.25	406	91:9	A
126	4-[1-(シクロプロピルメチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1.33	294	-	-	-	A
127	4-[1-ベンジル-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1.63	330	1.57	330	77:23	A
128	4-[1-(2-フルオロベンジル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1.84	348	1.76	348	80:20	A
129	4-[1-(3-フルオロベンジル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1.71	348	1.61	348	75:25	A
130	4-[1-(4-フルオロベンジル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1.69	348	1.61	348	75:25	A
131	4-[1-(ビフェニル-4-イルメチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	2.39	406	2.3	406	95:5	A
132	エチル-3-[3-(4-フルオロフェニル)-4-(ピリジン-4-イル)-1H-ピラゾール-1-イル]プロパノエート	1.29	340	-	-	-	A
133	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-{2-[2-(2-メトキシエトキシ)エトキシ]エチル}-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1.11	386	1.06	386	70:30	A
134	4-{3-(4-フルオロフェニル)-1-[2-(2-メトキシエトキシ)エチル]-1H-ピラゾール-4-イル}ピリジン	1.04	342	-	-	-	A
134	4-{3-(4-フルオロフェニル)-1-[2-(2-メトキシエトキシ)エチル]-1H-ピラゾール-4-イル}ピリジン	1.11	342	-	-	-	A

No.	名称	$LogP_A$ [1]	$[M+H]_A^+$ [2]	$LogP_B$ [3]	$[M+H]_B^+$ [2]	Isomer ratio[4]	Method [5]
135	4-[1-(ビフェニル-2-イルメチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	2.34	406	-	-	-	B
136	2-{[3-(4-フルオロフェニル)-4-(ピリジン-4-イル)-1H-ピラゾール-1-イル]メチル}ベンゾニトリル	1.49	355	-	-	-	A
137	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(ナフタレン-1-イルメチル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	2.12	380	1.99	380	84:16	A
138	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(3-フェノキシベンジル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	2.36	422	-	-	-	A
139	4-[1-(4-フルオロ-3-フェノキシベンジル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	2.40	440	-	-	-	A
140	3-{[3-(4-フルオロフェニル)-4-(ピリジン-4-イル)-1H-ピラゾール-1-イル]メチル}ベンゾニトリル	1.50	355	-	-	-	A
140	3-{[3-(4-フルオロフェニル)-4-(ピリジン-4-イル)-1H-ピラゾール-1-イル]メチル}ベンゾニトリル	1.51	355	1.38	355	60:40	A
141	4-{[3-(4-フルオロフェニル)-4-(ピリジン-4-イル)-1H-ピラゾール-1-イル]メチル}ベンゾニトリル	1.48	355	-	-	-	A
141	4-{[3-(4-フルオロフェニル)-4-(ピリジン-4-イル)-1H-ピラゾール-1-イル]メチル}ベンゾニトリル	1.50	355	1.38	355	70:30	A
142	3-[3-(4-フルオロフェニル)-4-(ピリジン-4-イル)-1H-ピラゾール-1-イル]ジヒドロフラン-2(3H)-オン	0.95	324	-	-	-	A
143	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(1H-イミダゾール-2-イルメチル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	0.41	320	-	-	-	B
144	1-(1,5-ジメチル-1H-ピラゾール-3-イル)-2-[3-(4-フ	1.31	376	1.18	376	62:38	A

No.	名称	LogP$_A$ [1]	[M+H]$_A^+$ [2]	LogP$_B$ [3]	[M+H]$_B^+$ [2]	Isomer ratio[4]	Method [5]
	ルオロフェニル)-4-(ピリジン-4-イル)-1H-ピラゾール-1-イル]エタノン						
144	1-(1,5-ジメチル-1H-ピラゾール-3-イル)-2-[3-(4-フルオロフェニル)-4-(ピリジン-4-イル)-1H-ピラゾール-1-イル]エタノン	1.30	376	-	-	-	A
145	酢酸 2-[3-(4-フルオロフェニル)-4-(ピリジン-4-イル)-1H-ピラゾール-1-イル]エチル	1.05	326	0.97	326	91:9	A
146	3-[3-(4-フルオロフェニル)-4-(ピリジン-4-イル)-1H-ピラゾール-1-イル]プロパノニトリル	0.81	293	-	-	-	A
147	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]-1,3-ジヒドロ-2H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-2-オン	2.6	351	-	-	-	C
148	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]-1,3,3-トリメチル-1,3-ジヒドロ-2H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-2-オン	3.68	393	-	-	-	C
149	4-[5-(4-フルオロフェニル)-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]-N-(プロパ-2-エン-1-イル)ピリミジン-2-アミン	2.37	352	-	-	-	C
150	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]-N-(プロパ-2-エン-1-イル)ピリミジン-2-アミン	2.46	352	-	-	-	C
153	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(2-メトキシエチル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}プロパンアミド	1.61	369	-	-	-	B

No.	名称	$LogP_A$ [1]	$[M+H]_A^+$ [2]	$LogP_B$ [3]	$[M+H]_B^+$ [2]	Isomer ratio[4]	Method [5]
154	2-フルオロ-5-[1-(2-メチルプロピル)-4-(ピリジン-4-イル)-1H-ピラゾール-3-イル]ベンゾニトリル	1.65	321	-	-	-	A
155	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}プロパンアミド	2.51	367	-	-	-	A
156	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(プロパン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}シクロブタンカルボキサミド	2.57	379	-	-	-	A
157	N-{4-[1-(ブタン-2-イル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メチルプロパンアミド	2.82	381	-	-	-	B
158	2-シクロプロピル-N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}アセトアミド	3.03	393	-	-	-	B
159	N-{4-[1-(ブタン-2-イル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-シクロプロピルアセトアミド	3	393	-	-	-	B
160	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(プロパン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-3-メチルブタンアミド	2.82	381	-	-	-	A
161	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(プロパン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}アセトアミド	1.85	339	-	-	-	A
162	N-{4-[1-(ブタン-2-イル)-3-(4-フルオロフェニ	2.95	383	-	-	-	B

No.	名称	$LogP_A$ [1]	$[M+H]_A^+$ [2]	$LogP_B$ [3]	$[M+H]_B^+$ [2]	Isomer ratio[4]	Method [5]
	ル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メトキシアセトアミド						
163	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(2-メトキシエチル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メトキシアセトアミド	2.05	385	-	-	-	A
164	N-{4-[1-(ブタン-2-イル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}プロパンアミド	2.46	367	-	-	-	B
165	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}シクロプロパンカルボキサミド	2.6	379	-	-	-	B
166	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メトキシアセトアミド	2.96	383	-	-	-	B
167	N-{4-[1-(ブタン-2-イル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}シクロプロパンカルボキサミド	2.56	379	-	-	-	B
168	4-[1-シクロヘキシル-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1.91	322	1.82	322	69:31	A
169	4-[1-(2,2-ジフルオロエチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1	304	-	-	-	A
170	[3-(4-フルオロフェニル)-4-(ピリジン-4-イル)-1H-ピラゾール-1-イル]酢酸エチル	1.31	326	-	-	-	B
171	4-[3-(4-フルオロフェニル)-5-メチル-1-(プロパ-2-	2.51	292	2.33	292	62:19	C

No.	名称	$LogP_A$ [1]	$[M+H]_A^+$ [2]	$LogP_B$ [3]	$[M+H]_B^+$ [2]	Isomer ratio[4]	Method [5]
	イン-1-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン						
172	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]-N-(プロパン-2-イル)ピリミジン-2-アミン	1.37	298	-	-	-	A
173	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]-N-(プロパ-2-イン-1-イル)ピリミジン-2-アミン	1.44	294	-	-	-	A
174	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]-N-(プロパン-2-イル)ピリミジン-2-アミン	2.39	354	-	-	-	C
175	3-(4-フルオロフェニル)-4-(ピリジン-4-イル)-1H-ピラゾール-5-カルボニトリル	1.08	265	-	-	-	A
176	4-{1-[1-(2-クロロ-1,3-チアゾール-5-イル)エチル]-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル}ピリジン	1.82	385	-	-	-	B
177	4-[1-(1,3-ジフルオロプロパン-2-イル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1.16	318	-	-	-	B
178	1-[3-(4-フルオロフェニル)-4-(ピリジン-4-イル)-1H-ピラゾール-1-イル]-3-メチルブタン-2-オン	1.37	324	-	-	-	A
179	4-[1-(2-エトキシエチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1.25	312	-	-	-	B
180	[3-(4-フルオロフェニル)-4-(ピリジン-4-イル)-1H-ピラゾール-1-イル]アセトニトリル	0.89	279	-	-	-	A
181	{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(プロパン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}カル	2.99	383	-	-	-	A

10 20 30 40

No.	名称	LogP$_A$ [1]	[M+H]$_A^+$ [2]	LogP$_B$ [3]	[M+H]$_B^+$ [2]	Isomer ratio[4]	Method [5]
	バミン酸プロパン-2-イル						
182	N-ベンジル-4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリミジン-2-アミン	3.15	402	-	-	-	C
183	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]-N-(プロパ-2-イン-1-イル)ピリミジン-2-アミン	2.76	350	-	-	-	C
184	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリミジン-2-アミン	1.81	312	-	-	-	C
185	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリミジン-2-イル}-2-メチル-N-(プロパン-2-イル)プロパンアミド	4.25	424	-	-	-	C
186	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリミジン-2-イル}-2,2,4-トリメチル-3-オキソ-N-(プロパン-2-イル)ペンタンアミド	3.02	494	-	-	-	A
187	1-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}ピロリジン-2-オン	3.19	379	-	-	-	C
188	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリミジン-2-イル}-2-メチル-N-(2-メチルプロパノイル)プロパンアミド	4.74	452	-	-	-	C
189	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリミジン-2-イル}-2-	2.92	382	-	-	-	C

No.	名称	$LogP_A$ [1]	$[M+H]_A^+$ [2]	$LogP_B$ [3]	$[M+H]_B^+$ [2]	Isomer ratio[4]	Method [5]
	メチルプロパンアミド						
190	N-{4-[1-エチル-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-フェニルアセトアミド	2.72	401	-	-	-	B
191	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-フェニルアセトアミド	3.54	429	-	-	-	A
192	(2S)-N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(プロパン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-ヒドロキシプロパンアミド	2.14	369	-	-	-	B
193	4-{3-(4-フルオロフェニル)-4-[2-(プロパノイルアミノ)ピリジン-4-イル]-1H-ピラゾール-1-イル}ピペリジン-1-カルボン酸 tert-ブチル	3.03	494	-	-	-	B
194	N-{4-[3-(4-シアノ-2,5-ジフルオロフェニル)-5-(ジフルオロメトキシ)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}プロパンアミド		0	-	-	-	B
195	N-{4-[3-(4-クロロ-2-フルオロフェニル)-1-メチル-5-(メチルスルファニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}プロパンアミド	2.70	405	-	-	-	A
196	N-{4-[5-(ジフルオロメトキシ)-3-(4-フルオロ-2-ヒドロキシフェニル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}プロパンアミド	2.12	407	-	-	-	A
197	N-{4-[3-(4-クロロ-2-フルオロフェニル)-1-メチル-5-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-4-イル]	3.32	427	-	-	-	A

No.	名称	LogP$_A$ [1]	[M+H]$_A^+$ [2]	LogP$_B$ [3]	[M+H]$_B^+$ [2]	Isomer ratio[4]	Method [5]
	ピリジン-2-イル}プロパンアミド						
198	N-{4-[1-エチル-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}プロパンアミド	1.82	339	-	-	-	B
199	N-{4-[3-(4-シアノ-2,5-ジフルオロフェニル)-5-(ジフルオロメトキシ)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メトキシアセトアミド	2.59	450	-	-	-	B
200	N-{4-[3-(4-クロロ-2-フルオロフェニル)-1-メチル-5-(メチルスルファニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メトキシアセトアミド	3.00	421	-	-	-	B
201	N-{4-[5-(ジフルオロメトキシ)-3-(4-フルオロ-2-ヒドロキシフェニル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メトキシアセトアミド	2.38	423	-	-	-	B
202	N-{4-[3-(4-クロロ-2-フルオロフェニル)-1-メチル-5-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メトキシアセトアミド	3.45	443	-	-	-	B
203	N-{4-[1-エチル-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メトキシアセトアミド	2.20	355	-	-	-	A
204	4-[3-(4-フルオロフェニル)-4-{2-[(メトキシアセチル)アミノ]ピリジン-4-イル}-1H-ピラゾール-1-イル]ピペリジン-1-カルボン酸 tert-ブチル	3.51	510	-	-	-	A
205	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(プロパン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}ベンズアミド	3.20	401	-	-	-	A

No.	名称	LogP$_A$ [1]	[M+H]$_A^+$ [2]	LogP$_B$ [3]	[M+H]$_B^+$ [2]	Isomer ratio[4]	Method [5]
206	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(プロパン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}チオフェン-2-カルボキサミド	3.14	407	-	-	-	A
207	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(プロパン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}チオフェン-3-カルボキサミド	2.96	407	-	-	-	A
208	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(プロパン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-(2-メトキシエトキシ)アセトアミド	2.62	413	-	-	-	A
209	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(プロパン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-ヒドロキシ-2-メチルプロパンアミド	2.42	383	-	-	-	A
210	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(プロパン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2,3-ジヒドロキシプロパンアミド	1.76	385	-	-	-	A
211	1-エチル-3-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(プロパン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}尿素	2.02	368	-	-	-	A
212	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(2-メトキシエチル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-フェニルアセトアミド	*2.6*	431	-	-	-	A
213	N-{4-[1-(2-フルオロベンジル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}プロパンアミド	2.69	419	-	-	-	B

No.	名称	$LogP_A$ [1]	$[M+H]_A^+$ [2]	$LogP_B$ [3]	$[M+H]_B^+$ [2]	Isomer ratio[4]	Method [5]
214	N-{4-[1-(シクロプロピルメチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}プロパンアミド	2.20	366	-	-	-	B
215	N-{4-[1-(2,2-ジフルオロエチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}プロパンアミド	1.99	375	-	-	-	B
216	N-{4-[1-(2,2-ジフルオロエチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メトキシアセトアミド	2.27	391	-	-	-	B
217	N-{4-[1-(2,2-ジフルオロエチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}シクロプロパンカルボキサミド	2.07	388	-	-	-	B
218	N-{4-[1-(2,2-ジフルオロエチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メチルプロパンアミド	2.29	389	-	-	-	B
219	N-{4-[1-(2-クロロエチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}プロパンアミド	2.01	373	-	-	-	B
220	N-{4-[1-(2-クロロエチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メトキシアセトアミド	2.36	389	-	-	-	B
221	N-{4-[1-(2-クロロエチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}シクロプロパンカルボキサミド	2.10	385	-	-	-	B

No.	名称	LogP$_A$ [1]	[M+H]$_A^+$ [2]	LogP$_B$ [3]	[M+H]$_B^+$ [2]	Isomer ratio[4]	Method [5]
222	N-{4-[1-(2-クロロエチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メチルプロパンアミド	2.33	387	-	-	-	B
223	N-{4-[1-(シクロプロピルメチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メトキシアセトアミド	2.61	382	-	-	-	B
224	N-{4-[1-(シクロプロピルメチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}シクロプロパンカルボキサミド	2.29	377	-	-	-	B
225	N-{4-[1-(シクロプロピルメチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メチルプロパンアミド	2.54	380	-	-	-	B
226	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(プロパン-2-イルオキシ)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}プロパンアミド	2.58	369	-	-	-	A
227	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(プロパン-2-イルオキシ)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1.58	298	-	-	-	A
228	3-(4-フルオロフェニル)-4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	2.96	390	-	-	-	B
229	3-(3-フルオロフェニル)-4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	3.13	390	-	-	-	B
230	N-{4-[3-(3-シアノ-4-フルオロフェニル)-1-(2-メチ	2.67	392	-	-	-	B

No.	名称	LogP$_A$ [1]	[M+H]$_A^+$ [2]	LogP$_B$ [3]	[M+H]$_B^+$ [2]	Isomer ratio[4]	Method [5]
	ルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}プロパンアミド						
231	1-{4-[1-(2,2-ジフルオロメチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-3-エチル尿素	1.91	390	-	-	-	A
232	N-(4-{3-(4-フルオロフェニル)-1-[1-(2-フルオロフェニル)エチル]-1H-ピラゾール-4-イル}ピリジン-2-イル)-2-メチルプロパンアミド	3.41	447	-	-	-	B
233	3-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(プロパン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-1,1-ジメチル尿素	1.60	368	-	-	-	A
234	N-{4-[1-(2,2-ジフルオロエチル-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}プロパン-2-スルホンアミド	3.96	425	-	-	-	B
235	N-{4-[1-(2,2-ジフルオロエチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}チオフェン-3-カルボキサミド	2.69	429	-	-	-	B
236	N-{4-[1-(2,2-ジフルオロエチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}チオフェン-2-カルボキサミド	2.82	429	-	-	-	B
237	N-{4-[1-(2,2-ジフルオロエチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}ベンズアミド	2.90	423	-	-	-	B
238	N-{4-[1-(2,2-ジフルオロエチル)-3-(4-フルオロフ	2.63	403	-	-	-	B

No.	名称	LogP$_A$ [1]	[M+H]$_A^+$ [2]	LogP$_B$ [3]	[M+H]$_B^+$ [2]	Isomer ratio[4]	Method [5]
	エニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-3-メチルブタンアミド						
239	N-{4-[1-(2,2-ジフルオロエチル)-3-(4-フルオロフェニル-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メチルブタンアミド	2.62	403	-	-	-	B
240	N-{4-[1-(2,2-ジフルオロエチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}シクロブタンカルボキサミド	2.42	401	-	-	-	B
241	{4-[1-(2,2-ジフルオロエチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}カルバミン酸エチル	2.45	391	-	-	-	B
242	N-{4-[1-(2,2-ジフルオロエチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}アセトアミド	1.74	361	-	-	-	B
243	N-{4-[1-(2,2-ジフルオロエチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-ヒドロキシ-2-メチルブタンアミド	2.18	405	-	-	-	B
244	N-(4-{3-(4-フルオロフェニル)-1-[1-(2-フルオロフェニル)エチル]-1H-ピラゾール-4-イル}ピリジン-2-イル)-2-メトキシアセトアミド	3.50	449	-	-	-	B
245	N-(4-{1-[(2,2-ジクロロシクロプロピル)メチル]-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル}ピリジン-2-イル)-2-メトキシアセトアミド	3.22	449	-	-	-	B
246	N-{4-[3-(3-シアノ-4-フルオロフェニル)-1-(2-メチ	2.98	408	-	-	-	B

No.	名称	LogP$_A$ [1]	[M+H]$_A^+$ [2]	LogP$_B$ [3]	[M+H]$_B^+$ [2]	Isomer ratio[4]	Method [5]
	ルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メトキシアセトアミド						
247	N-{4-[1-(2-フルオロベンジル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メトキシアセトアミド	3.09	435	-	-	-	B
248	N-(4-{3-(4-フルオロフェニル)-1-[1-(2-フルオロフェニル)エチル]-1H-ピラゾール-4-イル}ピリジン-2-イル)プロパンアミド	3.03	433	-	-	-	B
249	N-(4-{1-[(2,2-ジクロロシクロプロピル)メチル]-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル}ピリジン-2-イル)プロパンアミド	2.80	433	-	-	-	B
250	2-シクロプロピル-N-(4-{3-(4-フルオロフェニル)-1-[1-(2-フルオロフェニル)エチル]-1H-ピラゾール-4-イル}ピリジン-2-イル)アセトアミド	3.54	459	-	-	-	B
251	2-シクロプロピル-N-(4-{1-[(2,2-ジクロロシクロプロピル)メチル]-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル}ピリジン-2-イル)アセトアミド	3.30	459	-	-	-	B
252	N-{4-[3-(3-シアノ-4-フルオロフェニル)-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール 4-イル]ピリジン-2-イル}-2-シクロプロピルアセトアミド	3.14	418	-	-	-	B
253	2-シクロプロピル-N-{4-[1-(2-フルオロベンジル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}アセトアミド	3.17	445	-	-	-	B
254	N-(4-{1-[(2,2-ジクロロシクロプロピル)メチ	3.17	447	-	-	-	B

No.	名称	$LogP_A$ [1]	$[M+H]_A^+$ [2]	$LogP_B$ [3]	$[M+H]_B^+$ [2]	Isomer ratio[4]	Method [5]
	ル]-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル}ピリジン-2-イル)-2-メチルプロパンアミド						
255	N-{4-[3-(3-シアノ-4-フルオロフェニル)-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メチルプロパンアミド	3.03	406	-	-	-	B
256	N-{4-[1-(2-フルオロベンジル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メチルプロパンアミド	3.03	433	-	-	-	B
257	N-{4-[5-(ジフルオロメトキシ)-3-(4-フルオロ-2-ヒドロキシフェニル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メチルプロパンアミド	2.44	421	-	-	-	B
258	N-{4-[5-(ジフルオロメトキシ)-3-(4-フルオロ-2-ヒドロキシフェニル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}シクロプロパンカルボキサミド	2.22	419	-	-	-	B
259	N-(4-{3-(4-フルオロフェニル)-1-[1-(2-フルオロフェニル)エチル]-1H-ピラゾール-4-イル}ピリジン-2-イル)シクロプロパンカルボキサミド	*3.13*	445	-	-	-	B
260	N-(4-{1-[(2,2-ジクロロシクロプロピル)メチル]-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル}ピリジン-2-イル)シクロプロパンカルボキサミド	*2.67*	445	-	-	-	B
261	N-{4-[3-(3-シアノ-4-フルオロフェニル)-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イ	*2.77*	404	-	-	-	B

No.	名称	$LogP_A$ [1]	$[M+H]_A^+$ [2]	$LogP_B$ [3]	$[M+H]_B^+$ [2]	Isomer ratio[4]	Method [5]
	ル}シクロプロパンカルボキサミド						
262	N-{4-[1-(2-フルオロベンジル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}シクロプロパンカルボキサミド	*2.77*	431	-	-	-	B
263	(4-{3-(4-フルオロフェニル)-1-[1-(2-フルオロフェニル)エチル]-1H-ピラゾール-4-イル}ピリジン-2-イル)カルバミン酸エチル	*3.65*	449	-	-	-	B
264	(4-{1-[(2,2-ジクロロシクロプロピル)メチル]-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル}ピリジン-2-イル)カルバミン酸エチル	*3.37*	451	-	-	-	B
265	{4-[3-(3-シアノ-4-フルオロフェニル)-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}カルバミン酸エチル	*3.19*	408	-	-	-	B
266	{4-[1-(2-フルオロベンジル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}カルバミン酸エチル	*3.24*	435	-	-	-	B
267	{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}カルバミン酸エチル	3.11	383	-	-	-	B
268	{4-[1-(ブタン-2-イル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}カルバミン酸エチル	3.08	383	-	-	-	B
269	N-{4-[1-(シクロペンチルオキシ)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}	3.35	407	-	-	-	A

No.	名称	LogP$_A$ [1]	[M+H]$_A^+$ [2]	LogP$_B$ [3]	[M+H]$_B^+$ [2]	Isomer ratio[4]	Method [5]
	シクロプロパンカルボキサミド						
270	N-{4-[1-(シクロペンチルオキシ)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メチルプロパンアミド	3.65	409	-	-	-	A
271	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(プロパン-2-イルオキシ)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}シクロプロパンカルボキサミド	2.73	381	-	-	-	A
272	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-プロパン-2-イルオキシ)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メチルプロパンアミド	3.01	383	-	-	-	A
273	N-(シクロプロピルメチル)-4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリミジン-2-アミン	2.55	366	-	-	-	C
274	メチル-2-{3-(4-フルオロフェニル)-4-[2-(プロピオニルアミノ)ピリジン-4-イル]-1H-ピラゾール-1-イル}-3-メチルブタノエート	2.67	425	-	-	-	A
275	4-[1-(1,3-ジオキソラン-2-イルメチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1.02	326	-	-	-	A
276	N-{4-[1-(1,3-ジオキソラン-2-イルメチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メチルプロパンアミド	1.99	411	-	-	-	A
277	メチル-2-{3-(4-フルオロフェニル)-4-[2-(イソブチリルアミノ)ピリジン-4-イル]-1H-ピラゾール-1-イル}-3-メチルブタノエート	3.05	439	-	-	-	A

No.	名称	$LogP_A$ [1]	$[M+H]_A^+$ [2]	$LogP_B$ [3]	$[M+H]_B^+$ [2]	Isomer ratio[4]	Method [5]
278	N-{4-[1-(1,3-ジオキソラン-2-イルメチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}プロパンアミド	1.59	397	-	-	-	B
279	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]-N-(オキセタン-3-イル)ピリミジン-2-アミン	2.35	368	-	-	-	C
280	7-[3-(4-フルオロフェニル)-1-イソプロピル-1H-ピラゾール-4-イル]-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリミジン	1.82	322	-	-	-	C
281	N-シクロプロピル-4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリミジン-2-アミン	2.41	352	-	-	-	C
282	6-[3-(4-フルオロフェニル)-1-イソプロピル-1H-ピラゾール-4-イル]-9H-プリン	1.79	323	-	-	-	B
283	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-イソプロピル-1H-ピラゾール-4-イル]-2-(4-メチル-1H-イミダゾール-1-イル)ピリジン	2.05	362	-	-	-	C
284	N-tert-ブチル-4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリミジン-2-アミン	2.94	368	-	-	-	C
285	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]-N-(1-メトキシプロパン-2-イル)ピリミジン-2-アミン	2.39	384	-	-	-	C
286	N-(ブタン-2-イル)-4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]	2.68	368	-	-	-	C

No.	名称	LogP$_A$ [1]	[M+H]$_A^+$ [2]	LogP$_B$ [3]	[M+H]$_B^+$ [2]	Isomer ratio[4]	Method [5]
	ピリミジン-2-アミン						
287	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]-2-(メチルスルホニル)ピリミジン	2.90	375	-	-	-	C
288	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-イソブチル-1H-ピラゾール-4-イル]-7-メチルチエノ[3,2-d]ピリミジン	3.85	367	-	-	-	B
289	4-[1-(シクロプロピルメチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]-7-メチルチエノ[3,2-d]ピリミジン	3.45	365	-	-	-	B
290	N-{4-[1-エチル-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メチルプロパンアミド	2.14	353	-	-	-	B
291	2-シクロプロピル-N-{4-[1-エチル-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}アセトアミド	2.29	365	-	-	-	B
292	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-プロピル-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}プロパンアミド	2.15	353	-	-	-	B
293	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-プロピル-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メトキシアセトアミド	2.58	369	-	-	-	B
294	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-プロピル-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メチルプロパンアミド	2.49	367	-	-	-	B
295	2-シクロプロピル-N-{4-[3-(4-フルオロフェニ	2.66	379	-	-	-	B

No.	名称	LogP$_A$ [1]	[M+H]$_A^+$ [2]	LogP$_B$ [3]	[M+H]$_B^+$ [2]	Isomer ratio[4]	Method [5]
	ル)-1-プロピル-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}アセトアミド						
296	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}プロパンアミド	1.56	325	-	-	-	B
297	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メトキシアセトアミド	1.89	341	-	-	-	B
298	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メチルプロパンアミド	1.83	339	-	-	-	B
299	2-シクロプロピル-N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}アセトアミド	1.98	351	-	-	-	B
300	N-(4-{3-(4-フルオロフェニル)-1-[2-(メチルスルファニル)エチル]-1H-ピラゾール-4-イル}ピリジン-2-イル)プロパンアミド	2.12	385	-	-	-	B
301	N-{4-[1-(1-シクロプロピルエチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}プロパンアミド	2.54	379	-	-	-	B
302	N-{4-[1-(3-シアノベンジル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}プロパンアミド	2.38	426	-	-	-	B
303	N-{4-[1-(2-シアノエチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}プロ	1.63	364	-	-	-	B

No.	名称	$LogP_A$ [1]	$[M+H]_A^+$ [2]	$LogP_B$ [3]	$[M+H]_B^+$ [2]	Isomer ratio[4]	Method [5]
	パンアミド						
304	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-イソプロピル-5-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}プロパンアミド	4.07	421	-	-	-	B
305	4-[1-(1-シクロプロピルエチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン	1.59	308	-	-	-	B
306	N-(4-{3-(4-フルオロフェニル)-1-[2-(メチルスルファニル)エチル]-1H-ピラゾール-4-イル}ピリジン-2-イル)-2-メチルプロパンアミド	2.44	399	-	-	-	B
307	N-{4-[1-(1-シクロプロピルエチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メチルプロパンアミド	2.90	393	-	-	-	B
308	N-{4-[1-(3-シアノベンジル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メチルプロパンアミド	2.69	440	-	-	-	B
309	N-{4-[1-(2-シアノエチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メチルプロパンアミド	1.91	378	-	-	-	B
310	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-イソプロピル-1H-ピラゾール-4-イル]-7H-ピロロ[2,3-d]ピリミジン	1.61	322	-	-	-	B
311	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-イソプロピル-1H-ピラゾール-4-イル]-5,6,7,8-テトラヒドロピリド[2,3-d]ピリミジン	1.29	338	-	-	-	B
312	N-{4-[1-(1-シアノプロパン-2-イル)-3-(4-フルオロ	1.87	378	-	-	-	B

No.	名称	$LogP_A$ [1]	$[M+H]_A^+$ [2]	$LogP_B$ [3]	$[M+H]_B^+$ [2]	Isomer ratio[4]	Method [5]
	フェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}プロパンアミド						
313	N-{4-[1-(1-シアノプロパン-2-イル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メトキシアセトアミド	2.17	394	-	-	-	B
314	N-{4-[1-(1-シアノプロパン-2-イル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2 -メチルプロパンアミド	1.29	392	-	-	-	B
315	N-{4-[1-(1-シアノプロパン-2-イル)-3-(4-fフルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-シクロピロピルアセトアミド	2.28	404	-	-	-	B
316	N-{4-[5-(ジフルオロメトキシ)-3-(4-フルオロフェニル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}プロパンアミド	2.33	391	-	-	-	B
317	4-[1-(シクロプロピルメチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]-N-(1,1,1-トリフルオロプロパン-2-イル)ピリジン-2-アミン	2.33	405	-	-	-	B
318	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-イソプロピル-1H-ピラゾール-4-イル]-N-(1,1,1-トリフルオロプロパン-2-イル)ピリジン-2-アミン	2.26	393	-	-	-	B
319	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル]-N-(1,1,1-トリフルオロプロパン-2-イル)ピリジン-2-アミン	1.73	365	-	-	-	B

No.	名称	$LogP_A$ [1]	$[M+H]_A^+$ [2]	$LogP_B$ [3]	$[M+H]_B^+$ [2]	Isomer ratio[4]	Method [5]
320	N-{4-[1-シクロプロピル-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}プロパンアミド	1.97	351	-	-	-	B
321	N-{4-[1-シクロプロピル-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メトキシアセトアミド	2.37	367	-	-	-	B
322	N-{4-[1-シクロプロピル-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メチルプロパンアミド	2.32	365	-	-	-	B
323	2-シクロプロピル-N-{4-[1-シクロプロピル-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}アセトアミド	2.48	377	-	-	-	B
324	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-イソプロピル-1H-ピラゾール-4-イル]-N-[2,2,2-トリフルオロ-1-(4-フルオロフェニル)エチル]ピリジン-2-アミン	3.88	473	-	-	-	B
325	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-イソプロピル-1H-ピラゾール-4-イル]-N-(2,2,2-トリフルオロ-1-フェニルエチル)ピリジン-2-アミン	3.66	455	-	-	-	B
326	N-{4-[1-(2-エトキシエチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}プロパンアミド	2.01	383	-	-	-	B
327	N-{4-[1-(2-エトキシエチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メトキシアセトアミド	2.38	399	-	-	-	B

No.	名称	$LogP_A$ [1]	$[M+H]_A^+$ [2]	$LogP_B$ [3]	$[M+H]_B^+$ [2]	Isomer ratio[4]	Method [5]
328	N-{4-[1-(2-エトキシエチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メチルプロパンアミド	2.32	397	-	-	-	B
329	2-シクロプロピル-N-{4-[1-(2-エトキシエチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}アセトアミド	2.48	409	-	-	-	B
330	メチル-6-({4-[1-エチル-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}アミノ)-6-オキソヘキサノエート	2.16	425	-	-	-	A
331	メチル-5-({4-[1-エチル-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}アミノ)-5-オキソペンタノエート	2.02	411	-	-	-	A
332	エチル-3-エチル-5-({4-[1-エチル-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}アミノ)-5-オキソペンタノエート	2.90	453	-	-	-	A
333	3-(ジフルオロメチル)-N-{4-[1-エチル-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド	2.47	441	-	-	-	A
334	2-(ジフルオロメチル)-N-{4-[1-エチル-3-(4-フルオロフェニル-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}チオフェン-3-カルボキサミド	3.27	443	-	-	-	A
335	N-{4-[1-エチル-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-4-メチル-1,2,3-チアジアゾール-5-カルボキサミド	2.72	409	-	-	-	A

No.	名称	LogP$_A$ [1]	[M+H]$_A^+$ [2]	LogP$_B$ [3]	[M+H]$_B^+$ [2]	Isomer ratio[4]	Method [5]
336	3-(4-クロロフェニル)-N-{4-[1-エチル-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}プロパンアミド	3.32	449	-	-	-	A
337	(1R,2R)-N-{4-[1-エチル-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-フェニルシクロプロパンカルボキサミド	3.06	427	-	-	-	A
338	2-シクロペンチル-N-{4-[1-エチル-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}アセトアミド	3.87	393	-	-	-	A
339	N-{4-[1-エチル-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-3-メチルブタンアミド	3.47	367	-	-	-	A
340	N-{4-[1-エチル-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メチルブタンアミド	2.42	367	-	-	-	A
341	N-{4-[1-エチル-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メチルシクロプロパンカルボキサミド	2.16	365	-	-	-	A
342	N-{4-[1-エチル-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}アセトアミド	1.57	325	-	-	-	A
343	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-3-フェニルプロパンアミド	2.54	401	-	-	-	A
344	4-フルオロ-N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-メチ	2.61	391	-	-	-	A

No.	名称	LogP$_A$ [1]	[M+H]$_A^+$ [2]	LogP$_B$ [3]	[M+H]$_B^+$ [2]	Isomer ratio[4]	Method [5]
	ル-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}ベンズアミド						
345	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-(2-メトキシエチル)アセトアミド	1.96	385	-	-	-	A
346	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}ベンズアミド	2.42	373	-	-	-	A
347	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-3-メチルブタンアミド	2.12	353	-	-	-	A
348	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-メチルブタンアミド	2.14	353	-	-	-	A
349	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}シクロブタンカルボキサミド	1.93	351	-	-	-	A
350	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}アセトアミド	1.32	311	-	-	-	A
351	N-{4-[1-エチル 3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}エタンジアミド	1.99	354	-	-	-	A
352	(2S)-N-{4-[1-エチル-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-ヒドロキシプロパンアミド	1.83	354	-	-	-	A
353	(2S)-N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-メチル-1H-	1.57	341	-	-	-	A

No.	名称	$LogP_A$ [1]	$[M+H]_A^+$ [2]	$LogP_B$ [3]	$[M+H]_B^+$ [2]	Isomer ratio[4]	Method [5]
	ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル}-2-ヒドロキシプロパンアミド						
354	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(プロパン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリミジン-2-イル}-2-メトキシアセトアミド	2.37	370	-	-	-	C
355	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(プロパン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリミジン-2-イル}-2-メチルプロパンアミド	2.55	368	-	-	-	C
356	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(プロパン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリミジン-2-イル}シクロプロパンカルボキサミド	2.49	366	-	-	-	C
357	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリミジン-2-イル}アセトアミド	2.44	354	-	-	-	C
358	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(2-メトキシエチル)-1H-ピラゾール-4-イル]-N-(プロパン-2-イル)ピリミジン-2-アミン	1.79	356	1.76	356	76:23	C
359	4-[1-(2-クロロエチル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]-N-(プロパン-2-イル)ピリミジン-2-アミン	2.05	360	2.01	360	70:30	C
360	4-[1-(ブタン-2-イル)-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]-N-(プロパン-2-イル)ピリミジン-2-アミン	2.41	354	-	-	-	C

No.	名称	$LogP_A$ [1]	$[M+H]_A^+$ [2]	$LogP_B$ [3]	$[M+H]_B^+$ [2]	Isomer ratio[4]	Method [5]
361	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル]-N-(プロパン-2-イル)ピリミジン-2-アミン	1.65	312	-	-	-	C
362	3-{3-(4-フルオロフェニル)-4-[2-(プロパン-2-イルアミノ)ピリミジン-4-イル]-1H-ピラゾール-1-イル}プロパノニトリル	1.74	351	-	-	-	C
363	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(プロパ-2-イン-1-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]-N-(プロパン-2-イル)ピリミジン-2-アミン	1.99	336	-	-	-	C
364	4-[1-(2,2-ジフルオロエチル 3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]-N-(プロパン-2-イル)ピリミジン-2-アミン	2.05	362	-	-	-	C
365	N-{4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリミジン-2-イル}プロパンアミド	2.70	368	-	-	-	C
366	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(プロパン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリミジン-2-アミン	1.54	298	-	-	-	C
367	4-[1-(2,2-ジフルオロエチル)-3-(4-フルオロフェニル)-5-メチル-1H-ピラゾール 4-イル]ピリジン	1.49	318	1.43	318	66:23	C
368	4-[3-(4-フルオロフェニル)-5-メチル-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール 4-イル]ピリジン	2.07	310	1.98	310	64:28	C
369	N-ベンジル-4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(プロパン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリミジン 2-アミン	3.31	388	-	-	-	C

No.	名称	$LogP_A$ [1]	$[M+H]_A^+$ [2]	$LogP_B$ [3]	$[M+H]_B^+$ [2]	Isomer ratio[4]	Method [5]
370	4-[1-エチル-3-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-4-イル]-N-(プロパン-2-イル)ピリミジン-2-アミン	1.91	326	-	-	-	C
371	4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(プロパン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]-N-(プロパン-2-イル)ピリミジン-2-アミン	2.92	340	-	-	-	C
372	N-(1-シクロプロピルエチル)-4-[3-(4-フルオロフェニル)-1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリミジン-2-アミン	2.73	380	-	-	-	C

[1] 述べられたlogP値は述べられた純粋な化合物についての、あるいはもし混合物が存在するならば、主たる異性体(1-置換された3-アリール-1H-ピラゾール)についての値である。

[2] 述べられた質量は最高の強度を持つ[M+H]+イオンの同位体パターンのピークであり;もし[M-H]-イオンが検出されたならば、質量値は6でマークされる。

[3] 述べられたlogP値は、(ピラゾール置換に基づいて)異性体混合物に存在する従たる異性体(1-置換された5-アリール-1H-ピラゾール)についての値である。

[4] 異性体比率はいくつかの場合に得られた種々のピラゾールの混合物に基づく(主たる異性体は1-置換された3-アリール-1H-ピラゾールであり、従たる異性体は対応する1-置換された5-アリール-1H-ピラゾールである)。もし異性体比率が述べられていなければ、主たる異性体のみが存在する。異性体比率は方法A、BまたはCで測定されたLC-MSスペクトルの(波長210nmにおける)UVクロマトグラムにおける領域に基づく。

[5] logP値の決定においては、以下に記載する方法を用いた。

[6] 述べられた質量は、最高の強度を持つ[M-H]-イオンの同位体パターンのピークである。

方法A　logP値の決定および質量の検出についての注意書き：述べられたlogP

の値は、逆相カラム（Ｃ１８）でのＨＰＬＣ（高速液体クロマトグラフィー）によってＥＥＣ－Ｄｉｒｅｃｔｉｖｅ ７９／８３１ Ａｎｍｅｘ Ｖ．Ａ８に従って決定された。Ａｇｉｌｅｎｔ １１００ＬＣシステム；５０＊４．６ Ｚｏｒｂａｘ Ｅｃｌｉｐｓｅ Ｐｌｕｓ Ｃ１８ １．８ミクロン；溶離剤Ａ：アセトニトリル（０．１％ギ酸）；溶離剤Ｂ：水（０．０９％ギ酸）；４．２５分における１０％アセトニトリルから９５％アセトニトリルまでの直線グラジエント、次いで、さらに１．２５分の間の９５％アセトニトリル；オーブン温度５５℃；流速：２．０ｍＬ／分。質量の検出はＡｇｉｌｅｎｄ ＭＳＤシステムで行った。

【０４１０】

方法Ｂ ｌｏｇＰ値の決定および質量の検出についての注意書き：述べられたＬｏｇＰ値は逆相カラム（Ｃ１８）でのＨＰＬＣ（高速液体クロマトグラフィー）によってＥＥＣ－Ｄｉｒｅｃｔｉｖｅ ７９／８３１ Ａｎｎｅｘ Ｖ．Ａ８に従って決定した。ＨＰ１１００；５０＊４．６ Ｚｏｒｂａｘ Ｅｃｌｉｐｓｅ Ｐｌｕｓ Ｃ１８ １．８ミクロン；溶離剤Ａ：アセトニトリル（０．１％ギ酸）；溶離剤Ｂ：水（０．０８％ギ酸）；１．７０分における５％アセトニトリルから９５％アセトニトリルへの直線グラジエント、次いで、さらに１．００分の間の９５％アセトニトリル；オーブン温度５５℃；流速：２．０ｍＬ／分。質量の検出は、ＷａｔｅｒｓからのＭｉｃｒｏｎａｓｓ ＺＱ２０００質量検出器で行った。

【０４１１】

方法Ｃ ｌｏｇＰ値の決定および質量の検出についての注意書き：述べられたｌｏｇＰの値は、逆相カラム（Ｃ１８）でのＵＰＬＣ（超高速液体クロマトグラフィー）によってＥＥＣ－Ｄｉｒｅｃｔｉｖｅ ７９／８３１ Ａｎｎｅｘ Ｖ．Ａ８に従って決定した。ＨＰ１１００；５０＊２．１ Ｚｏｒｂａｘ Ｅｃｌｉｐｓｅ Ｐｌｕｓ Ｃ１８ １．８ミクロン；溶離剤Ａ：アセトニトリル（０．０９％ギ酸）；溶離剤Ｂ：水（０．１％ギ酸）；３．２５分における１０％Ａから９５％Ａまでの直線グラジエント；オーブン温度４０℃；流速：０．８ｍＬ／分。質量の検出は、ＷａｔｅｒｓからのＬＣＴ ＰｒｅｍｉｅｒまたはＳＱＤ質量検出器で行った。

【０４１２】

キャリブレーションは、そのｌｏｇＰ値が知られている、（３から１６の炭素原子を持つ）非分岐アルカン－２－オンで行った（２つの連続的アルカノンの間の直線内挿による保持時間に基づくｌｏｇＰ値の決定）。

【０４１３】

ラムダ－最大値は、クロマトグラフィー信号の最大における２００ｎｍから４００ｎｍのＵＶスペクトルに基づいて決定した。

使用実施例

実施例Ａ：Ｐｅｒｏｎｏｓｐｏｒａ ｐａｒａｓｉｔｉｃａについてのイン・ビボテスト（ホワイトキャベツについてのべと病）：

活性な物質の水性懸濁液を、アセトン／Ｔｗｅｅｎ（分散剤）／ジメチルスルホキシド（ＤＭＳＯ）の混合物のホモゲナイゼーションおよび所望の濃度までの水への引き続いての希釈によって調製した。キャベツ植物（品種：Ｅｍｉｎｅｎｃｅ）を１８から２０℃にて泥炭－ポゾラン土基板（５０／５０）上の栽培皿中に種を撒き、植え付け、双葉段階で、前記した水性懸濁液を噴霧する。対照として、植物に、活性物質を含まない水溶液を噴霧する。２４時間後に、Ｐｅｒｏｎｏｓｐｏｒａ ｐａｒａｉｓｔｉｃａ胞子（ｍｌ当たり５０，０００胞子）の水性懸濁液を噴霧することによつて植物を接種する。胞子は感染した植物から由来する。接種したキャベツ植物を、湿潤雰囲気中約２０℃にて５日間インキュベートする。５日後、それらを対照植物と比較してスコアを取る。５００ｐｐｍの投与量におけるこれらの条件下で、良好な（７０％活性レベル）または完全な阻害が以下の化合物について観察された：

【０４１４】

【表８】

実施例化合物番号	% 活性レベル	実施例化合物番号	% 活性レベル	実施例化合物番号	% 活性レベル
1	100	44	78	122	93
2	85	46	94	123	83
3	97	81	89	126	89
6	70	84	100	127	78
10	85	85	100	129	78
15	75	86	100	133	89
19	100	88	83	134	94
21	100	91	89	136	94
22	97	102	70	137	72
23	100	103	100	140	78
28	97	106	100	141	89
32	79	113	73	150	100
33	93	116	97	171	91
40	98	117	93		
41	72	120	85		

実施例Ｂ：Ｂｏｔｒｙｔｉｓ　ｃｉｎｅｒｅａについてのイン・ビボテスト（キュウリについての灰色黴）：

活性な物質の水性懸濁液は、アセトン／Ｔｗｅｅｎ／ジメチルスルホキシドの混合物のホモゲナイゼーションおよび所望の濃度までの水での引き続いての希釈によって調製した。キュウリ植物（品種：Ｖｅｒｔ　ｐｅｔｉｔ　ｄｅ　Ｐａｒｉｓ）を、１８から２０℃にて泥炭－ポゾラン土基板（５０／５０）上の栽培皿に種を撒き、双葉段階Ｚ１１において、前記した水性懸濁液を噴霧した。対照として、植物に、活性物質を含まない水溶液を噴霧する。２４時間後に、Ｂｏｔｒｙｔｉｓ　ｃｉｎｅｒｅａ胞子（ｍｌ当たり１５０，０００胞子）の水性懸濁液の葉の表面への滴下適用によって植物を接種する。胞子は、以下の栄養溶液に懸濁させた１５日齢の培養に由来する：

－２０ｇ／ｌゼラチン
－５０ｇ／ｌのＤ－フルクトース
－２ｇ／ｌのNH_4NO_3
－１ｇ／ｌのKH_2PO_4

接種されたキュウリ植物を、１５から１１℃（昼／夜）および８０％雰囲気湿度の気候チャンバー中で５から７日間維持する。５から７日後、それを対照植物と比較してスコア取りする。５００ｐｐｍの投与量におけるこれらの条件下で、良好な（７０％活性レベル）または完全な阻害が以下の化合物について観察された：

【０４１５】

【表９】

実施例化合物番号	%活性レベル	実施例化合物番号	%活性レベル
1	100	40	100
2	74	44	71
8	94	84	100
10	73	85	100
13	100	86	100
14	100	171	71
17	83		

実施例Ｃ：Ａｌｔｅｒｎａｒｉａ　ｂｒａｓｓｉｃａｅについてのイン・ビボテスト（大根についての斑点病）：

アセトン／Ｔｗｅｅｎ／ジメチルスルホキシドの混合物のホモゲナイゼーション、および所望の濃度までの水での引き続いての希釈によって、活性な物質の水性懸濁液を調製した。大根植物（品種：Ｐｅｒｎｏｔ）を、１８から２０℃において泥炭－ポゾラン土基板（５０／５０）上の栽培皿に撒き、双葉段階において、前記した水性懸濁液を噴霧する。対照として、植物に、活性物質を含まない水溶液を噴霧する。２４時間後、Ａｌｔｅｒｎａｒｉａ　ｂｒａｓｓｉｃａｅ胞子（ｍｌ当たり４０，０００胞子）の水性懸濁液を噴霧することによって、植物を接種する。胞子は１２から１３日齢培養に由来する。接種された大根植物を、湿潤雰囲気中で、約１８℃にて６から７日間インキュベートする。６から７日後、それを対照植物と比較してスコア取りする。５００ｐｐｍの投与量でのこれらの条件下で、良好な（７０％活性レベル）または完全な阻害が以下の化合物について観察された：

【０４１６】

【表１０】

実施例化合物番号	%活性レベル
1	94
2	77
3	88
10	85
84	75
86	75

実施例Ｄ：Ｓｐｈａｅｒｏｔｈｅｃａ　ｆｕｌｉｇｉｎｅａ　についてのイン・ビボテスト（キュウリについてのうどんこ病）：

アセトン／Ｔｗｅｅｎ／ジメチルスルホキシドの混合物のホモゲナイゼーション、および所望の濃度までの水での引き続いての希釈によって、活性な物質の水性懸濁液を調製した。キュウリ植物（品種：Ｖｅｒｔ　ｐｅｔｉｔ　ｄｅ　Ｐａｒｉｓ）を、２０／２３℃にて、泥炭－ポゾラン土基板（５０／５０）上の栽培皿に撒き、双葉段階Ｚ１０において、前記した水性懸濁液を噴霧する。対照として、植物に、活性な物質を含まない水溶液を噴霧する。２４時間後に、Ｓｐｈａｅｒｏｔｈｅｃａ　ｆｕｌｉｇｉｎｅａ胞子（ｍｌ当たり１００，０００胞子）の水性懸濁液を噴霧することによって、植物を接種する。胞子は、腐った植物に由来する。接種されたキュウリ植物を、６０／７０％の相対雰囲気湿度において、約２０／２５℃でインキュベートする。１２時間後に、それを対照植物と比較してスコア取りする。５００ｐｐｍの投与量におけるこれらの条件下で、良好な（７０％活性レベル）または完全な阻害が以下の化合物で観察された：

【０４１７】
【表１１】

実施例化合物番号	%活性レベル	実施例化合物番号	%活性レベル	実施例化合物番号	%活性レベル
1	100	41	98	114	79
2	93	44	98	116	89
3	93	46	81	117	93
6	95	53	98	122	99
9	75	81	77	123	86
10	80	84	100	126	85
11	93	85	100	127	85
12	95	86	100	129	92
13	90	88	86	132	82
14	80	91	88	133	95
15	87	92	93	133	91
17	80	102	71	134	85
22	71	103	100	136	91
24	88	105	82	138	77
26	80	106	100	141	77
27	73	107	91	150	96
33	71	108	82	171	100
37	78	110	79		
40	100	113	82		

実施例Ｅ：Ｐｙｒｅｎｏｐｈｏｒａ　ｔｅｒｅｓについてのイン・ビボテスト（大麦網斑病）：

アセトン／Ｔｗｅｅｎ／ジメチルスルホキシドの混合物のホモゲナイゼーション、および所望の濃度までの水での引き続いての希釈によって、活性な物質の水性懸濁液を調製した。大麦植物（品種：Ｐｌａｉｓａｎｔ）を、１２℃にて、泥炭－ポゾラン土基板（５０／５０）上の栽培皿に撒き、第一葉段階（１０ｃｍサイズ）において、前記した水性懸濁液を噴霧する。対照として、植物に、活性物質を含まない水溶液を噴霧する。２４時間後に、Ｐｙｒｅｎｏｐｈｏｒａ　ｔｅｒｅｓ胞子（ｍｌ当たり１２，０００胞子）の水性懸濁液を噴霧することによって、植物を接種する。胞子は１２日齢培養に由来する。接種された大麦植物を、まず、約２０℃および１００％相対雰囲気湿度において２４時間、次いで、８０％相対雰囲気湿度において１２日間インキュベートする。１２日後に、それを対照植物と比較してスコア取りする。５００ｐｐｍの投与量におけるこれらの条件下で、良好な（７０％活性レベル）または完全な阻害が以下の化合物について観察された：

【０４１８】

【表１２】

実施例化合物番号	%活性レベル	実施例化合物番号	%活性レベル
1	96	85	75
7	73	86	81
19	83	136	71
21	73	140	71
24	92	150	86

実施例Ｆ：Ｐｕｃｃｉｎｉａ　ｒｅｃｏｎｄｉｔａについてのイン・ビボテスト（小麦褐さび病）：

アセトン／Ｔｗｅｅｎ／ジメチルスルホキシドの混合物のホモゲナイゼーション、および所望の濃度までの水での引き続いての希釈によって、活性な物質の水性懸濁液を調製した。小麦植物（品種：Ｓｃｉｐｉｏｎ）を、１２℃にて、泥炭－ポゾラン土基板（５０／５０）上の栽培皿に撒き、第一葉段階（１０ｃｍサイズ）において、前記した水性懸濁液を噴霧する。対照として、植物に、活性な物質を含まない水溶液を噴霧する。２４時間後に、Ｐｕｃｃｉｎｉａ　ｒｅｃｏｎｄｉｔａ胞子（ｍｌ当たり１００，０００胞子）の水性懸濁液を噴霧することによって、植物を接種する。胞子は１０日齢の感染した小麦作物に由来し、２．５ｍｌ／ｌのＴｗｅｅｎを含む水に懸濁させる。接種した小麦植物を、まず、２０℃および１００％相対雰囲気湿度において２４時間、次いで、２０℃および７０％相対雰囲気湿度において１０日間インキュベートする。１０日後、それを対照植物と比較してスコア取りする。５００ｐｐｍの投与量におけるこれらの条件下で、良好な（７０％活性レベル）または完全な阻害が以下の化合物で観察された：

【０４１９】

【表１３】

実施例化合物番号	%活性レベル	実施例化合物番号	%活性レベル	実施例化合物番号	%活性レベル
1	89	84	78	126	75
40	86	91	94	171	94
44	71	93	83		

実施例Ｇ：Ｍｙｃｏｓｐｈａｅｒｅｌｌａ　ｇｒａｍｉｎｉｃｏｌａについてのイン・ビボテスト（小麦葉枯病）：

アセトン／Ｔｗｅｅｎ／ジメチルスルホキシドの混合物のホモゲナイゼーション、および所望の濃度までの水での引き続いての希釈によって、活性な物質の水性懸濁液を調製した。小麦植物（品種：Ｓｃｉｐｉｏｎ）を、１２℃にて、泥炭－ポゾラン土基板（５０／５０）上の栽培皿に撒き、第一葉段階（１０ｃｍサイズ）において、前記した水性懸濁液を噴霧する。対照として、植物に、活性な物質を含まない水溶液を噴霧する。２４時間後に、Ｍｙｃｏｓｐｈａｅｒｅｌｌａ　ｇｒａｍｉｎｉｃｏｌａ胞子（ｍｌ当たり５００，０００胞子）の水性懸濁液を噴霧することによって、植物を接種する。胞子は７日齢培養に由来する。接種された小麦植物を、まず、１８℃および１００％相対雰囲気湿度において７２時間、次いで、９０％相対雰囲気湿度にて２１から２８日間インキュベートする。２１から２８日後、それを対照植物と比較してスコア取りする。５００ｐｐｍの投与量におけるこれらの条件下で、良好な（７０％活性レベル）または完全な阻害が以下の化合物で観察された：

【０４２０】

【表１４】

実施例化合物番号	%活性レベル	実施例化合物番号	%活性レベル	実施例化合物番号	%活性レベル
2	98	16	97	81	97
3	95	17	88	84	98
6	85	26	88	86	94
8	92	27	97	92	75
10	95	40	81	103	75
12	77	44	81	122	88
13	95	47	77	132	86
14	88	53	91	171	93
15	97	72	83		

実施例Ｈ：Ｐｙｒｉｃｕｌａｒｉａ　ｇｒｉｓｅａについてのイン・ビボテスト（米についてのイネイモチ病）：

アセトン／Ｔｗｅｅｎ／ジメチルスルホキシドの混合物のホモゲナイゼーション、および所望の濃度までの水での引き続いての希釈によって、活性な物質の水性懸濁液を調製した。米植物（品種：Ｋｏｓｈｉｈｉｋａｒｉ）を、２５℃にて、泥炭－ポゾラン土基板（５０／５０）上の栽培皿に撒き、第二葉段階（１３から１５ｃｍサイズ）において、前記した水性懸濁液を噴霧する。対照として、植物に、活性な物質を含まない水性アセトン／Ｔｗｅｅｎ／ＤＭＳＯ溶液を噴霧する。２４時間後に、Ｐｙｒｉｃｕｌａｒｉａ　ｇｒｉｓｅａ胞子（ｍｌ当たり３０，０００胞子）の水性懸濁液を噴霧することによって、植物をインキュベートする。胞子は１７日齢培養に由来し、２．５ｇ／ｌのゼラチンを含有する水に懸濁させる。接種された米植物を、まず、約２５℃および１００％相対雰囲気湿度において３日間、次いで、日中の間は２５℃および８０％相対雰囲気湿度、夜には２０％相対雰囲気湿度にて３日間インキュベートする。６日後に、それを対照植物と比較してスコア取りする。５００ｐｐｍの投与量におけるこれらの条件下で、良好な（７０％活性レベル）または完全な阻害が以下の化合物について観察された：

【０４２１】

【表１５】

実施例化合物番号	%活性レベル
1	82
91	75
148	71

実施例Ｉ：Ｆｕｓａｒｉｕｍ　ｐｒｏｌｉｆｅｒａｔｕｍによるフモニシンＦＢ１の生産

ＤＭＳＯ（０．５％）を含むフモニシン誘導液体培地（リットル当たり０．５ｇ麦芽抽出物、１ｇ酵母抽出物、１ｇのバクトペクトン、２０ｇのフルクトース、１ｇのKH_2PO_4、０．３ｇの$MgSO_4 x 7H_2O$、０．３ｇのＫＣｌ、０．０５ｇの$ZnSO_4 x 7H_2O$および０．０１ｇの$CuSO_4 x 5H_2O$）中にて、マイクロタイタープレートにて化合物をテストした。２０００胞子／ｍｌの最終濃度にて、Ｆｕｓａｒｉｕｍ　ｐｒｏｌｉｆｅｒａｔｕｍの濃縮された胞子懸濁液で接種を行った。

【０４２２】

プレートを高い雰囲気湿度にて２０℃で５日間インキュベートした。

【０４２３】

開始時および５日後に、成長阻害の計算のために、ＯＤ６２０（複数回測定：ウェル当たり３×３測定）でＯＤ測定を行った。

【０４２４】

５日後に、液体培地の試料を取り、５０％アセトニトリルに１：１０００希釈した。希釈された試料のＦＢ１濃度をＨＰＬＣ－ＭＳ／ＭＳによって分析し、測定された値を、活性な物質を含まない対照と比較してのフモニシンＦＢ１生産の阻害の計算のために用いた。

【０４２５】

ＨＰＬＣ－ＭＳ／ＭＳは以下のパラメータで行った。

イオン化タイプ：ＥＳＩ陽性

イオン噴霧電圧：５５００Ｖ

噴霧ガス温度：５００℃

クラスタ分離電位：１１４Ｖ

衝突エネルギー：５１ｅＶ

衝突ガス：N_2

ＮＭＲ追跡：７２２．３＞３５２．３；滞留時間１００ミリ秒

ＨＰＬＣカラム：Ｗａｔｅｒｓ　Ａｔｌａｎｔｉｓ　Ｔ３（シールされた、３官能性Ｃ１８結合）

粒子サイズ：３μｍ

カラム寸法：５０×２ｍｍ

温度：４０℃

溶媒Ａ：水＋０．１％ＨＣＯＯＨ（ｖ／ｖ）

溶媒Ｂ：アセトニトリル＋０．１％ＨＣＯＯＨ（ｖ／ｖ）

流速：４００μＬ／分

注入容量：５μＬ

グラジエント：

【０４２６】

【表１６】

時間 [分]	A%	B%
0	90	10
2	5	95
4	5	95
4.1	90	10
9	90	10

フモニシンＦＢ１生産の阻害の実施例

以下にリストした実施例は、５０μＭの濃度においてフモニシンＦＢ１生産の＞８０％阻害を示した。該実施例におけるＦｕｓａｒｉｕｍ　ｐｒｏｌｉｆｅｒａｔｕｍの成長の阻害は、５０μＭにおいて０から９９％まで変化した。

【０４２７】

【表１７】

実施例化合物番号	50μMにおけるFB1生産の%阻害	50μMにおける真菌成長の%阻害
19	100	68
20	100	65
21	100	55
23	100	73
29	82	34
33	99	99
40	100	98
41	100	56
44	100	33
47	98	0
50	89	8
53	96	0
54	100	47
58	89	42
59	95	0
60	100	92
66	85	40
70	92	0
84	100	88
85	100	95
86	100	96
87	100	83
146	100	41
153	100	48
155	100	97
156	100	93
163	100	72
164	100	97
165	100	90
166	100	98
189	90	0
191	96	1
193	85	0
195	100	17
196	100	25

実施例化合物番号	50μMにおけるFB1生産の%阻害	50μMにおける真菌成長の%阻害
198	100	99
200	99	1
203	100	99
213	100	56
214	100	96
215	100	94
216	100	97
217	100	97
218	100	79
219	100	97
220	100	99
221	100	99
222	100	96
223	100	96
224	100	99
225	100	93
5	100	79
9	96	40

実施例Ｊ：Ｆｕｓａｒｉｕｍ　ｇｒａｍｉｎｅａｒｕｍによる ＤＯＮ／アセチル－ＤＯＮの生産

ＤＯＮ誘導液体培地（リットル当たり１ｇの（NH_4）$_2HPO_4$、０．２ｇの$MgSO_4x7H_2O$、３ｇのKH_2PO_4、１０ｇのグリセリン、５ｇのＮａＣｌおよび４０ｇのサッカロース）およびＤＭＳＯ（０．５％）中でマイクロタイタープレートにて化合物をテストした。２０００胞子／ｍｌの最終濃度にて、Ｆｕｓａｒｉｕｍ　ｇｒａｍｉｎｅａｒｕｍの濃縮された胞子懸濁液で接種を行った。

【０４２８】

プレートを、高い雰囲気湿度にて、２８℃で７日間インキュベートした。

【０４２９】

開始時および３日後に、成長阻害の計算のために、ＯＤ６２０（複数回の測定：ウェル当たり３×３測定）でＯＤ測定を行った。

【０４３０】

７日後に、１容量の８４／１６アセトニトリル／水混合物を加え、次いで、液体培地の試料を各ウェルから取り、１０％アセトニトリルに１：１００希釈した。試料のＤＯＮおよびアセチル－ＤＯＮ含有量をＨＰＬＣ－ＭＳ／ＭＳによって分析し、測定した値を、活性な物質を含まない対照と比較してのＤＯＮ／ＡｃＤＯＮの阻害の計算のために用いた。

【０４３１】

ＨＰＬＣ－ＭＳ／ＭＳ測定は以下のパラメータで行った：

イオン化タイプ：ＥＳＩ陰性

イオン噴霧電圧：－４５００Ｖ

噴霧ガス温度：５００℃

クラスタ分離電位：－４０Ｖ

衝突エネルギー：－２２ｅＶ

衝突ガス：N_2

ＮＭＲスプール（Ｓｐｕｒ）：３５５．０＞２６４．９；

ＨＰＬＣカラム：Ｗａｔｅｒｓ　Ａｔｌａｎｔｉｓ　Ｔ３（シールされた、３官能性Ｃ１８結合）
粒子サイズ：３μｍ
カラム寸法：５０×２ｍｍ
温度：４０℃
溶媒Ａ：水／２．５ｍＭのＮＨ$_4$ＯＡｃ＋０．０５％ＣＨ$_3$ＣＯＯＨ（ｖ／ｖ）
溶媒Ｂ：メタノール／２．５ｍＭのＮＨ$_4$ＯＡｃ＋０．０５％ＣＨ$_3$ＣＯＯＨ（ｖ／ｖ）
流速：４００μＬ／分
注入容量：１１μＬ
グラジエント：

【０４３２】
【表１８】

時間 [分]	A%	B%
0	100	0
0.75	100	0
1.5	5	95
4	5	95
5	100	0
10	100	0

ＤＯＮ阻害の実施例
以下にリストする実施例は、５０μＭにおいて、ＤＯＮ／ＡｃＤＯＮ生産の≧８０％阻害を示した。述べた実施例におけるＦｕｓａｒｉｕｍ　ｇｒａｍｉｎｅａｒｕｍの成長の阻害は、５０μＭにおいて、０から１００％まで変化した。
【０４３３】

【表１９】

実施例化合物番号	50μM における DON/AcDON 生産の%阻害	50μM における真菌成長の%阻害
5	100	97
20	87	21
37	80	13
40	100	100
54	85	31
84	99	92
85	99	100
86	98	94
87	100	97
142	89	0
146	100	97
150	99	97
153	100	56
154	93	0
155	100	97
156	81	99
157	100	100
159	99	102
160	100	100
161	100	104
162	99	99
163	100	100
164	99	100
165	100	64
166	100	84
167	99	100
169	100	101
183	99	65
195	80	0
198	100	100
203	100	100
206	99	75
207	100	75
208	100	101
210	100	85

実施例化合物番号	50μM における DON/AcDON 生産の%阻害	50μM における真菌成長の%阻害
211	99	16
213	100	0
214	93	100
219	100	97
220	99	100
221	100	100
222	82	99
223	97	99
224	92	100
225	89	92
226	100	85
227	100	100
229	97	0
230	97	0
232	80	0
233	100	100
245	99	95
246	99	88
247	99	96
252	99	0
254	99	16
255	96	0
257	94	0
258	98	79
260	99	5
261	99	39
262	99	35
264	99	17
265	98	9
267	97	59
268	90	32
271	99	71
272	99	33
326	100	107
327	100	105
328	100	101

実施例化合物番号	50μM における DON/AcDON 生産の%阻害	50μM における真菌成長の%阻害
329	100	104

実施例Ｋ：Ａｓｐｅｒｇｉｌｌｕｓ　ｐａｒａｓｉｔｉｃｕｓによるアフラトキシンの生産

２０ｍＭのカバゾール（Ｃａｖａｓｏｌ）（ヒドロキシプロピル－ベーターシクロデキストリン）および１％ＤＭＳＯで処理したアフラトキシン誘導液体培地（リットル当たり２０ｇのサッカロース、４ｇの酵母抽出物、１ｇのKH_2PO_4および０．５ｇの$MgSO_4x7H_2O$）中で、マイクロタイタープレート（平坦かつ透明なベースを備えた黒色９６－ウェルプレート）にて、化合物をテストした。１０００胞子／ｍｌの最終濃度にて、Ａｓｐｅｒｇｉｌｌｕｓ　ｐａｒａｓｉｔｉｃｕｓの濃縮された胞子懸濁液で接種を行った。

【０４３４】

プレートを、高い雰囲気湿度にて、２０℃で７日間インキュベートした。

【０４３５】

７日後に、成長阻害の計算のために、ＯＤ６２０（複数回測定：ウェル当たり４×４測定）にてＯＤ測定を行った。同時に、プレートのベースを通じて、活性な物質を含まない対照と比較してのアフラトキシン生産の阻害の計算のために、蛍光測定Em_{360nm}およびEx_{426nm}（複数回測定：ウェル当たり３×３測定）を行った。

アフラトキシン生産の阻害の実施例

以下にリストした実施例は、５０μＭにおいて、アフラトキシン生産の＞８０％阻害を示した。これらの実施例において、５０μＭでのＡｓｐｅｒｇｉｌｌｕｓ　ｐａｒａｓｉｔｉｃｕｓの成長阻害もまた＞８０％であった。

【０４３６】

【表２０】

実施例化合物番号	50μMにおけるアフラトキシン生産の%阻害	50μMにおける真菌成長の%阻害
40	99	88
84	100	98
85	100	98
86	100	97
87	100	97
146	100	99
155	100	100
203	100	100

実施例Ｌ：Ｓｐｈａｅｒｏｔｈｅｃａ　ｆｕｌｉｇｉｎｅａについてのイン・ビボテスト（キュウリについてのうどんこ病／保護）：

溶媒：４９重量部のＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド

乳化剤：１重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテル

適当な活性な物質調製物の調製のために、１重量部の活性物資を述べた量の溶媒および乳化剤と混合し、濃縮物を水で所望の濃度まで希釈する。

【０４３７】

保護活性についてテストするために、若いキュウリ植物に、述べた適用投与量の活性な物質の調製物を噴霧する。処理から１日後に、Ｓｐｈａｅｒｏｔｈｅｃａ　ｆｕｌｉｇｉｎｅａの胞子懸濁液で植物を接種する。次に、植物を、７０％相対雰囲気湿度および２３℃の温度の温室に入れる。

【０４３８】

接種から７日後に、評価を行う。ここで、０％は対照のそれに対応する活性レベルを意味し、他方、１００％の活性レベルは、感染は観察されないことを意味する。

【０４３９】

このテストにおいて、５００ｐｐｍの活性な物質の濃度における以下の式の本発明による化合物は、７０％以上の活性レベルを呈する。

【０４４０】

【表２１】

Sphaerotheca テスト(キュウリ)/保護

実施例化合物番号	%活性レベル	実施例化合物番号	%活性レベル	実施例化合物番号	%活性レベル
5	70	217	100	299	84
9	90	218	100	298	100
31	70	219	100	297	90
29	70	220	97	296	84
15	95	221	100	295	94
11	73	222	100	294	98
85	100	223	91	293	94
86	100	224	99	292	95
84	100	225	100	291	95
89	88	165	86	290	100
136	73	226	95	371	94
91	100	228	75	369	88
126	95	229	94	368	94
150	93	232	93	367	84
122	95	233	95	366	94
92	94	236	86	307	100
116	93	237	88	306	94
104	70	238	100	301	95
103	100	239	95	300	90
146	95	240	96	309	100
87	100	242	97	303	95
171	100	243	95	312	100
174	100	245	88	313	98
169	89	162	99	314	100
178	75	249	92	315	95
179	74	250	84	316	75
156	94	251	96	320	94
181	85	253	92	320	89
183	94	158	97	320	95
184	95	159	97	322	95
192	85	254	92	323	86
198	99	256	92	326	94
155	95	157	100	328	100
203	95	258	80	329	94

実施例化合物番号	%活性レベル	実施例化合物番号	%活性レベル	実施例化合物番号	%活性レベル
166	97	260	95	331	94
163	93	167	100	335	74
161	100	267	98	337	88
160	100	268	100	338	91
205	100	271	79	339	95
206	94	272	94	340	95
207	100	286	89	341	100
208	100	285	89	342	94
209	100	284	91	346	95
210	100	283	78	347	95
211	93	281	94	348	95
212	96	280	93	349	95
213	74	279	100	350	94
164	100	278	89	351	80
214	100	277	94	352	73
215	100	276	99		
216	89	274	94		

実施例Ｍ：Ａｌｔｅｒｎａｒｉａ　ｓｏｌａｎｉについてのイン・ビボテスト（葉枯病／トマト／保護）：
溶媒：４９重量部のＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド
乳化剤：１重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテル
適当な活性物質の調製物の調製のために、１重量部の活性な物質を述べた量の溶媒および乳化剤と混合し、濃縮物を水で所望の濃度まで希釈する。

【０４４１】

保護活性をテストするために、若いトマト植物に、述べた適用投与量の活性な物質の調製物を噴霧する。処理から１日後に、Ａｌｔｅｒｎａｒｉａ　ｓｏｌａｎｉの胞子懸濁液で植物を接種し、次いで、１００％相対湿度および２２℃にて２４時間放置する。次に、植物を９６％相対雰囲気湿度および２０℃の温度にて放置する。

【０４４２】

接種から７日後に、評価を行う。ここで、０％は対照のそれに対応する活性レベルを意味し、他方、１００％の活性レベルは、感染が観察されないことを意味する。

【０４４３】

このテストにおいて、５００ｐｐｍの活性な物質の濃度での以下の式の本発明による化合物は、７０％以上の活性レベルを呈する。

実施例

【０４４４】

【表２２】

Alternaria テスト(トマト)/保護

実施例化合物番号	%活性レベル	実施例化合物番号	%活性レベル	実施例化合物番号	%活性レベル
30	90	164	95	298	80
25	90	214	95	297	100
5	90	215	94	296	100
9	89	216	95	295	100
81	95	218	95	294	100
29	78	220	95	293	100
2	100	222	90	292	100
15	95	223	90	291	100
11	80	224	70	290	100
72	95	225	95	371	95
85	100	165	95	370	95
84	95	226	95	369	90
89	89	227	95	310	95
136	95	228	70	368	95
135	78	229	95	367	95
134	100	231	95	366	80
91	95	232	95	365	80
126	95	233	90	307	100
150	95	235	94	306	95
122	95	236	94	305	100
92	90	237	100	302	95
116	95	238	94	301	95
113	89	239	100	300	80
108	80	240	88	309	100
106	95	241	94	364	95
104	90	242	88	363	90
103	90	243	100	303	100
102	95	244	94	362	80
146	100	245	94	361	70
144	94	247	94	312	100
142	94	162	94	313	95
170	78	248	94	314	100
87	95	249	94	315	95
153	90	250	94	316	100

実施例化合物番号	%活性レベル	実施例化合物番号	%活性レベル	実施例化合物番号	%活性レベル
171	95	251	94	317	70
173	94	253	94	318	80
174	100	158	94	319	90
176	100	159	94	320	95
178	94	254	94	321	70
179	100	256	94	322	95
156	94	157	94	323	95
181	94	257	94	326	95
183	100	258	95	327	95
184	95	259	90	328	95
189	95	260	90	329	95
192	100	262	95	332	90
193	93	267	95	337	95
195	80	268	80	338	80
196	100	269	89	339	95
198	93	271	89	340	95
155	100	272	94	341	95
200	93	273	90	342	95
203	93	286	90	347	95
166	95	285	95	348	95
163	93	284	100	349	80
161	95	283	95	350	95
160	95	282	70	351	95
205	95	281	95	352	95
206	90	280	95	353	80
207	90	279	70	164	95
208	80	278	95	214	95
209	95	277	100	215	94
210	80	276	95	216	95
211	70	275	90	218	95
212	95	274	95	220	95
213	90	299	100	298	80
297	100	296	100	295	100
294	100	293	100		

実施例Ｎ：Ｐｌａｓｍｏｐａｒａ　ｖｉｔｉｃｏｌａについてのイン・ビボテスト（うどんこ病、つる植物／保護）：
溶媒：２４．５重量部のアセトン
　　２４．５重量部のジメチルアセトアミド
乳化剤：１重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテル
適当な活性な物質の調製物の調製のために、１重量部の活性な物質を述べた量の溶媒および乳化剤と混合し、濃縮物を水で所望の濃度まで希釈する。

【０４４５】
保護活性をテストするために、若い植物に、述べた適用投与量の活性な物質の調製物を噴霧する。噴霧コーティングの乾燥の後に、Ｐｌａｓｍｏｐａｒａ ｖｉｔｉｃｏｌａの水性胞子懸濁液で植物を接種し、次いで、約２０℃および１００％相対雰囲気湿度にて、インキュベーションキャビン中に１日間放置する。次に、植物を、約２１℃および約９０％雰囲気湿度の温室に４日間入れる。次いで、植物を湿潤化し、１日間インキュベーションキャビンに入れる。
【０４４６】
接種から６日後に、評価を行う。ここで、０％は、対照のそれに対応する活性レベルを意味し、他方、１００％の活性レベルは、感染が観察されないことを意味する。
【０４４７】
このテストでは、１００ｐｐｍの活性な物質の濃度における本発明による以下の化合物は、７０％以上の活性レベルを呈する。
【０４４８】
【表２３】

実施例化合物番号	%活性レベル	実施例化合物番号	%活性レベル	実施例化合物番号	%活性レベル
1	100	169	96	219	95
40	72	183	86	225	90
85	94	192	94	236	76
86	84	198	92	237	84
84	98	161	95	238	88
89	73	160	79	239	88
126	81	207	71	240	90
92	73	212	83	260	70
174	70	214	88		

実施例Ｏ：Ｖｅｎｔｕｒｉａ ｉｎａｅｑｕａｌｉｓについてのイン・ビボテスト（リンゴ腐敗病／保護）：
溶媒：２４．５重量部のアセトン
２４．５重量部のジメチルアミノアセトアミド
乳化剤：１重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテル
適当な活性な物質の調製物の調製のために、１重量部の活性な物質を述べた量の溶媒および乳化剤と混合し、濃縮物を水で所望の濃度まで希釈する。
【０４４９】
保護活性をテストするために、若い植物に、述べた適用投与量の活性な物質の調製物を噴霧する。噴霧コーティングの乾燥の後に、リンゴ腐敗病の病原体のＶｅｎｔｕｒｉａ ｉｎａｅｑｕａｌｉｓの水性分生子懸濁液で植物を接種し、インキュベーションキャビン中で、約２０℃および１００％相対雰囲気湿度で１日間放置する。
【０４５０】
次いで、植物を、約２１℃および約９０％の相対雰囲気湿度の温室に入れる。
【０４５１】
接種から１０日後に、評価を行う。ここで、０％は、対照のそれに対応する活性レベルを意味し、他方、１００％の活性レベルは、感染が観察されないことを意味する。
【０４５２】
このテストにおいて、１００ｐｐｍの活性な物質の濃度における本発明による以下の化合物は、７０％以上の活性レベルを呈する。
【０４５３】

【表２４】

実施例化合物番号	%活性レベル	実施例化合物番号	%活性レベル	実施例化合物番号	%活性レベル
1	99	160	94	236	94
40	97	205	91	237	95
85	88	206	83	238	98
86	96	207	86	239	98
84	100	208	78	240	96
89	100	209	89	242	89
126	98	210	78	243	98
92	93	211	92	162	96
87	95	212	85	249	96
174	100	164	97	251	84
169	99	214	88	159	97
179	100	215	96	254	73
180	96	217	98	157	94
156	91	218	95	260	94
183	73	219	96	167	89
184	92	220	96	268	98
189	84	221	91	271	81
192	95	222	95	272	89
198	96	224	71		
161	95	225	96		

実施例Ｐ：Ｂｏｔｒｙｔｉｓ　ｃｉｎｅｒｅａについてのイン・ビボテスト（豆類についての灰色黴／保護）：

溶媒：２４．５重量部のアセトン
　　２４．５重量部のアセトン
乳化剤：１重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテル

適当な活性な物質の調製物の調製のために、１重量部の活性な物質を述べた量の溶媒および乳化剤と混合し、濃縮物を水で所望の濃度まで希釈する。

【０４５４】

保護活性をテストするために、述べた適用投与量の活性な物質の調製物を若い植物に噴霧する。噴霧コーティングの乾燥の後に、それらの上で成長するＢｏｔｒｙｔｉｓ　ｃｉｎｅｒｅａを含む２つの小さなピースの寒天を各葉の上に重ねる。接種された植物を、約２０℃および１００％の相対雰囲気湿度の暗くしたチャンバー中にセットする。

【０４５５】

接種から２日後に、葉上の感染斑点のサイズを評価する。ここで、０％は、対照のそれに対応する活性レベルを意味し、他方、１００％の活性レベルは、感染が観察されないことを意味する。

【０４５６】

このテストでは、２５０ｐｐｍの活性な物質の濃度における本発明による以下の化合物は、７０％以上の活性レベルを呈する。

【０４５７】

【表２５】

実施例化合物番号	%活性レベル	実施例化合物番号	%活性レベル	実施例化合物番号	%活性レベル
1	99	155	99	224	99
40	100	161	100	225	96
85	100	160	100	225	93
86	100	205	100	236	100
84	99	206	100	237	100
89	100	207	100	238	93
126	100	208	100	240	99
92	100	209	100	242	99
87	100	210	98	243	75
171	84	211	100	162	100
174	80	212	98	249	100
169	100	213	91	251	95
179	100	214	100	159	98
180	93	215	98	157	78
156	98	217	95	260	100
183	93	218	98	167	100
184	100	219	100	268	100
189	93	220	100	271	93
192	100	221	100	272	100
198	99	222	85		

実施例Ｑ：Ｌｅｐｔｏｓｐｈａｅｒｉａ　ｎｏｄｏｒｕｍについてのイン・ビボテスト（小麦での苞穎斑点／保護）：
溶媒：４９重量部のＮ，Ｎ－ジメチルアセトアミド
乳化剤：１重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテル
適当な活性な物質の調製物の調製のために、１重量部の活性な物質を述べた量の溶媒および乳化剤と混合し、濃縮物を水で所望の濃度まで希釈する。

【０４５８】
保護活性をテストするために、若い植物に、述べた適用投与量の活性な物質の調製物を噴霧する。

【０４５９】
噴霧コーティングの乾燥の後に、Ｌｅｐｔｏｓｐｈａｅｒｉａ　ｎｏｄｏｒｕｍの胞子懸濁液と共に胞子を植物に噴霧する。植物を、インキュベーションキャビン中で、２０℃および１００％相対雰囲気湿度で４８時間放置する。

【０４６０】
植物を、約２２℃の温度および約８０％の相対雰囲気湿度の温室にセットする。

【０４６１】
インキュベーションから８日後に、評価を行う。ここで、０％は、対照のそれに対応する活性レベルを意味し、他方、１００％の活性レベルは、感染が観察されないことを意味する。

【０４６２】
このテストにおいて、１０００ｐｐｍの活性な物質の濃度における本発明による以下の化合物は、７０％以上の活性レベルを呈する。

【０４６３】
【表２６】

実施例化合物番号	%活性レベル	実施例化合物番号	%活性レベル	実施例化合物番号	%活性レベル
1	100	174	93	164	93
85	100	169	100	214	71
86	100	184	88	215	71
84	100	192	86	218	93
89	83	198	100	225	86
87	88	212	71	167	92

実施例Ｒ：Ｓｅｐｔｏｒｉａ　ｔｒｉｔｉｃｉについてのイン・ビボテスト（小麦における葉枯病（黒色斑点）／保護）：
溶媒：４９重量部のＮ，Ｎ－ジメチルアセトアミド
乳化剤：１重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテル
適当な活性な物質の調製物の調製のために、１重量部の活性な物質を述べた量の溶媒および乳化剤と混合し、濃縮物を水で所望の濃度まで希釈する。
【０４６４】
保護活性をテストするために、若い植物に、述べた適用投与量の活性な物質の調製物を噴霧する。噴霧コーティングの乾燥の後に、Ｓｅｐｔｏｒｉａ　ｔｒｉｔｉｃｉの胞子懸濁液を植物に噴霧する。植物を、インキュベーションキャビン中で、２０℃および１００％相対雰囲気湿度で４８時間放置する。この後、植物を、１５℃および１００％相対雰囲気湿度の透明フード下にさらに６０時間置く。
【０４６５】
植物を、約１５℃の温度および８０％の相対雰囲気湿度の温室にセットする。
【０４６６】
接種から２１日後に、評価を行う。ここで、０％は、対照のそれに対応する活性レベルを意味し、他方、１００％の活性レベルは、感染が観察されないことを意味する。
【０４６７】
このテストにおいては、１０００ｐｐｍの活性な物質の濃度における本発明による以下の化合物は、７０％以上の活性レベルを呈する。
【０４６８】
【表２７】

実施例化合物番号	%活性レベル	実施例化合物番号	%活性レベル	実施例化合物番号	%活性レベル
1	100	169	100	215	94
85	100	184	100	218	100
86	100	192	100	224	100
84	100	198	100	225	100
89	100	212	71	240	75
87	100	164	100	159	100
174	90	214	100	157	100

実施例Ｓ：Ｒｈｙｎｃｈｏｓｐｏｒｉｕｍ　ｓｅｃａｌｉｓについてのイン・ビボテスト（大麦における葉焼け／保護）：
溶媒：４９重量部のＮ，Ｎ－ジメチルアセトアミド

乳化剤：１重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテル
適当な活性な物質の調製物の調製のために、１重量部の活性な物質を述べた量の溶媒および乳化剤と混合し、濃縮物を水で所望の濃度まで希釈する。
【０４６９】
保護活性をテストするために、若い植物に、述べた適用投与量の活性な物質の調製物を噴霧する。
【０４７０】
噴霧コーティングの乾燥の後に、Ｒｈｙｎｃｈｏｓｐｏｒｉｕｍ ｓｅｃａｌｉｓの胞子懸濁液と共に胞子を植物に噴霧する。植物を、インキュベーションキャビン中で、２０℃および１００％相対雰囲気湿度で４８時間放置する。
【０４７１】
約２０℃の温度、および約８０％の相対雰囲気湿度の温室に植物をセットする。
【０４７２】
接種から１４日後に、評価を行う。ここで、０％は、対照のそれと対応する活性レベルを意味し、他方、１００％の活性レベルは、感染が観察されないことを意味する。
【０４７３】
このテストにおいては、１０００ｐｐｍの活性な物質の濃度における本発明による以下の化合物は、７０％以上の活性レベルを呈する。
【０４７４】
【表２８】

実施例化合物番号	%活性レベル	実施例化合物番号	%活性レベル	実施例化合物番号	%活性レベル
86	86	184	71	214	100
84	90	192	71	215	90
87	88	198	90	218	100
169	100	164	100	225	90

実施例Ｔａ：Ｆｕｓａｒｉｕｍ ｎｉｖａｌｅ（ｖａｒ．ｍａｊｕｓ）についてのイン・ビボテスト（小麦における胴枯れ病／白色－穂／保護）：
溶媒：４９重量部のＮ，Ｎ－ジメチルアセトアミド
乳化剤：１重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテル
適当な活性な物質の調製物の調製のために、１重量部の活性物質を述べた量の溶媒および乳化剤と混合し、濃縮物を水で所望の濃度まで希釈する。
【０４７５】
保護活性をテストするために、述べた適用投与量の活性な物質の調製物を若い植物に噴霧する。
【０４７６】
噴霧コーティングの乾燥の後に、Ｆｕｓａｒｉｕｍ ｎｉｖａｌｅ（ｖａｒ．ｍａｊｕｓ）の胞子懸濁液と共に胞子を植物に噴霧する。
【０４７７】
植物を、１０℃および１００％相対雰囲気湿度の透明なインキュベーションフード下の温室チャンバーに植物を入れる。
【０４７８】
接種から５日後に、評価を行う。ここで、０％は、対照のそれに対応する活性レベルを意味し、他方、１００％の活性レベルは、感染が観察されないことを意味する。
【０４７９】
このテストにおいては、１０００ｐｐｍの活性な物質の濃度における本発明による以下の化合物は、７０％以上の活性レベルを呈する。
【０４８０】

【表２９】

実施例化合物番号	%活性レベル	実施例化合物番号	%活性レベル	実施例化合物番号	%活性レベル
1	92	192	100	225	100
85	100	198	100	238	75
86	100	212	75	240	75
84	100	164	100	159	75
89	92	214	100	157	88
87	92	215	100	167	100
169	71	218	92		
184	100	224	100		

実施例Ｔｂ：Ｆｕｓａｒｉｕｍ　ｇｒａｍｉｎｅａｒｕｍについてのイン・ビボテスト（大麦における胴枯れ病／白色－穂／保護）：
溶媒：４９重量部のＮ，Ｎ－ジメチルアセトアミド
乳化剤：１重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテル
適当な活性な物質の調製物の調製のために、１重量部の活性物質を述べた量の溶媒および乳化剤と混合し、濃縮物を水で所望の濃度まで希釈する。

【０４８１】
保護活性をテストするために、述べた適用投与量の活性な物質の調製物を若い植物に噴霧する。

【０４８２】
噴霧コーティングの乾燥の後に、Ｆｕｓａｒｉｕｍ　ｇｒａｍｉｎｅａｒｕｍの胞子懸濁液とともに胞子を植物に噴霧する。

【０４８３】
植物を、２２℃および１００％相対雰囲気湿度の透明なインキュベーションフード下の温室チャンバーに植物を入れる。

【０４８４】
接種から５日後に、評価を行う。ここで、０％は、対照のそれに対応する活性レベルを意味し、他方、１００％の活性レベルは、感染が観察されないことを意味する。

【０４８５】
このテストにおいては、１０００ｐｐｍの活性な物質の濃度における本発明による以下の化合物は、７０％以上の活性レベルを呈する。

【０４８６】
【表３０】

実施例化合物番号	%活性レベル	実施例化合物番号	%活性レベル	実施例化合物番号	%活性レベル
1	100	218	100	87	100
85	100	224	100	169	100
86	100	225	100	184	100
84	100	238	92	192	100
89	100	251	83	198	100
164	100	159	100	155	88
214	100	157	100		
215	100	167	100		

実施例Ｕ：Ｐｙｔｈｉｕｍ　ｕｌｔｉｍｕｍについてのイン・ビボテスト（綿における根腐れ病／立枯病／種子処理）：
テストは温室条件下で行った。
【０４８７】
本発明による活性な化合物、または本発明による活性な化合物の組合せで処理した綿種子を、６＊６ｃｍサイズの容器中の、蒸気処理した野原の土および砂の混合物（１：１）に撒いた。テスト化合物をＮ－メチル－２－ピロリドンに溶解させ、水で所望の濃度まで希釈した。植物を１０℃にて生育させた。
【０４８８】
パーライトをＰｙｔｈｉｕｍ　ｕｌｔｉｍｕｍからの菌糸体で接種した。１ｍＬの感染したパーライトを処理した綿種子の間に分布させた。種子をクレイ顆粒の被覆層で被覆し、２０℃および８０％相対雰囲気湿度において温室中で７日間インキュベートした。
【０４８９】
評価は、出芽をカウントすることによって行った。ここで、０％は、未処理対照のそれに対応する活性レベルを意味し、他方、１００％の活性レベルは、全ての種子が発芽したことを意味する。
【０４９０】
このテストにおいて、以下の化合物が、本発明による活性化合物の５０ｇ／ｄｔの用量において７０％以上の有効性を示した。
【０４９１】
【表３１】

実施例化合物番号	%活性レベル
198	88

実施例Ｖ：Ｐｙｒｉｃｕｌａｒｉａ　ｏｒｙｚａｅについてのイン・ビボテスト（イネイモチ病／保護）：
溶媒：２８．５重量部のアセトン
乳化剤：１．５重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテル
適当な活性な物質の調製物の調製のために、１重量部の活性な物質を述べた量の溶媒および乳化剤と混合し、濃縮物を水で所望の濃度まで希釈する。
【０４９２】
保護活性をテストするために、若い米植物に、述べた適用投与量の活性な物質の調製物を噴霧する。処理から１日後に、Ｐｙｒｉｃｕｌａｒｉａ　ｏｒｙｚａｅの水性胞子懸濁液で植物を接種する。次に、１００％相対雰囲気湿度および２５℃の温室に植物をセットする。
【０４９３】
接種から５日後に、評価を行う。ここで、０％は、対照のそれに対応する活性レベルを意味し、他方、１００％の活性レベルは、感染が観察されないことを意味する。
【０４９４】
このテストにおいて、２５０ｐｐｍの活性な物質の濃度における本発明による以下の化合物は、８０％以上の活性レベルを呈する。
【０４９５】

【表３２】

実施例番号	%活性レベル
1	80
4	80
30	80
40	95
84	85
85	80
86	93
102	93
104	80
108	85
113	90
116	80
122	85
136	80
198	85
217	85
221	92

実施例Ｗ：Ｒｈｉｚｏｃｔｏｎｉａ　ｓｏｌａｎｉについてのイン・ビボテスト（米における紋枯病／保護）：
溶媒：２８．５重量部のアセトン
乳化剤：１．５重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテル
適当な活性な物質の調製物の調製のために、１重量部の活性な物質を述べた量の溶媒および乳化剤と混合し、濃縮物を水で所望の濃度まで希釈する。

【０４９６】
保護活性をテストするために、述べた適用投与量の活性な物質の調製物を若い米植物に噴霧する。処理から１日後に、植物を、Ｒｈｉｚｏｃｔｏｎｉａ　ｓｏｌａｎｉの菌糸で接種する。次に、１００％相対雰囲気湿度および２５℃の温室に植物をセットする。

【０４９７】
接種から４日後に、評価を行う。ここで、０％は、対照のそれに対応する活性なレベルを意味し、他方、１００％の活性レベルは、感染が観察されないことを意味する。

【０４９８】
このテストにおいて、２５０ｐｐｍの活性な物質の濃度における本発明による以下の化合物は、８０％以上の活性レベルを呈する。

【０４９９】

【表３３】

実施例番号	%活性レベル
1	100
4	100
30	95
84	100
85	97
86	100
89	92
101	95
102	98
104	95
108	92
113	93
116	97
120	93
122	97
136	97
169	100
174	93
176	97
198	88
217	100
221	100

実施例Ｘ：Ｃｏｃｈｌｉｏｂｏｌｕｓ　ｍｉｙａｂｅａｎｕｓについてのイン・ビボテスト（褐斑病、米／保護）：
溶媒：２８．５重量部のアセトン
乳化剤：１．５重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテル
適当な活性な物質の調製物の調製のために、１重量部の活性な物質を述べた量の溶媒および乳化剤と混合し、濃縮物を水で所望の濃度まで希釈する。

【０５００】

保護活性をテストするために、述べた適用投与量の活性な物質の調製物を若い米植物に噴霧する。処理から１日後に、Ｃｏｃｈｌｉｏｂｏｌｕｓ　ｍｉｙａｂｅａｎｕｓの水性胞子懸濁液で植物を接種する。次に、植物を、１００％相対雰囲気湿度および２５℃の温室にセットする。

【０５０１】

接種から４日後に、評価を行う。ここで、０％は、対照のそれに対応する活性レベルを意味し、他方、１００％の活性レベルは、感染が観察されないことを意味する。

【０５０２】

このテストにおいて、２５０ｐｐｍの活性な物質の濃度における本発明による以下の化合物は、８０％以上の活性レベルを呈した。

【０５０３】

【表３４】

実施例番号	% 活性レベル
1	85
40	85
84	93
85	90
86	80
89	85
104	80
108	80
116	94
122	90
198	90
217	85
221	80

実施例Ｙ：Ｇｉｂｂｅｒｅｌｌａ　ｚｅａｅについてのイン・ビボテスト（米における胴枯れ病／保護）：

溶媒：２８．５重量部のアセトン

乳化剤：１．５重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテル

適当な活性な物質の調製物の調製のために、１重量部の活性な物質を述べた量の溶媒および乳化剤と混合し、濃縮物を水で所望の濃度まで希釈する。

【０５０４】

保護活性をテストするために、述べた適用投与量における活性な物質の調製物を若い米植物に噴霧する。処理から１日後に、Ｇｉｂｂｅｒｅｌｌａ　ｚｅａｅの水性胞子懸濁液で植物を接種する。次に、植物を、１００％相対雰囲気湿度および２５℃の温室にセットする。

【０５０５】

接種から５日後に、評価を行う。ここで、０％は、対照のそれに対応する活性レベルを意味し、他方、１００％の活性レベルは、感染が観察されないことを意味する。

【０５０６】

このテストにおいて、２５０ｐｐｍの活性な物質の濃度における本発明による以下の化合物は、８０％以上の活性レベルを呈する。

【０５０７】

【表３５】

実施例番号	% 活性レベル
198	80

実施例Ｚ：Ｐｈａｋｏｐｓｏｒａ　ｐａｃｈｙｒｈｉｚｉについてのイン・ビボテスト（大豆さび病／保護）：

溶媒：２８．５重量部のアセトン

乳化剤：１．５重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテル

適当な活性な物質の調製物の調製のために、１重量部の活性な物質を述べた量の溶媒および乳化剤と混合し、濃縮物を水で所望の濃度まで希釈する。

【０５０８】

保護活性をテストするために、述べた適用投与量の活性な物質の調製物を若い米植物に噴霧する。処理から１日後、Ｐｈａｋｏｐｓｏｒａ　ｐａｃｈｙｒｈｉｚｉの水性胞子懸濁液で植物を接種する。次に、植物を、８０％相対雰囲気湿度および２０℃の温室にセッ

トする。

【０５０９】

接種から１１日後、評価を行う。ここで、０％は、対照のそれに対応する活性レベルを意味し、他方、１００％の活性レベルは、感染が観察されないことを意味する。

【０５１０】

このテストにおいて、２５０ｐｐｍの活性な物質な濃度における本発明による以下の化合物は、８０％以上の活性レベルを呈した。

【０５１１】

【表３６】

実施例番号	% 活性レベル
1	91
84	98

【国際調査報告】

VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS

61200380009

PCT

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

(Artikel 18 sowie Regeln 43 und 44 PCT)

Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts BCS093088-WO	**WEITERES VORGEHEN**	siehe Formblatt PCT/ISA/220 sowie, soweit zutreffend, nachstehender Punkt 5
Internationales Aktenzeichen PCT/EP2010/064742	Internationales Anmeldedatum *(Tag/Monat/Jahr)* 04/10/2010	(Frühestes) Prioritätsdatum *(Tag/Monat/Jahr)* 09/10/2009
Anmelder BAYER CROPSCIENCE AG		

Dieser internationale Recherchenbericht wurde von der Internationalen Recherchenbehörde erstellt und wird dem Anmelder gemäß Artikel 18 übermittelt. Eine Kopie wird dem Internationalen Büro übermittelt.

Dieser internationale Recherchenbericht umfaßt insgesamt 14 Blätter.

[X] Darüber hinaus liegt ihm jeweils eine Kopie der in diesem Bericht genannten Unterlagen zum Stand der Technik bei.

1. **Grundlage des Berichts**
   a. Hinsichtlich der **Sprache** beruht die internationale Recherche auf
      [X] der internationalen Anmeldung in der Sprache, in der sie eingereicht wurde
      [ ] einer Übersetzung der internationalen Anmeldung in die folgende Sprache _____, bei der es sich um die Sprache der Übersetzung handelt, die für die Zwecke der internationalen Recherche eingereicht worden ist (Regeln 12.3 a) und 23.1 b)).

   b. [ ] Dieser internationale Recherchenbericht wurde erstellt unter Berücksichtigung der **Berichtigung eines offensichtlichen Fehlers**, die nach Regel 91 von dieser Behörde genehmigt wurde bzw. dieser Behörde mitgeteilt wurde (Regel 43.6*bis*. (a)).

   c. [ ] Hinsichtlich der in der internationalen Anmeldung offenbarten **Nucleotid- und/oder Aminosäuresequenz** siehe Feld Nr. I.

2. [ ] **Bestimmte Ansprüche haben sich als nicht recherchierbar erwiesen** (siehe Feld Nr. II).

3. [X] **Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung** (siehe Feld Nr. III).

4. Hinsichtlich der **Bezeichnung der Erfindung**
   [ ] wird der vom Anmelder eingereichte Wortlaut genehmigt.
   [X] wurde der Wortlaut von der Behörde wie folgt festgesetzt:

   PHENYLPYRI(MI)DINYLPYRAZOLE UND IHRE VERWENDUNG ALS FUNGIZIDE

5. Hinsichtlich der **Zusammenfassung**
   [X] wird der vom Anmelder eingereichte Wortlaut genehmigt.
   [ ] wurde der Wortlaut nach Regel 38.2 in der in Feld Nr. IV angegebenen Fassung von der Behörde festgesetzt. Der Anmelder kann dieser Behörde innerhalb eines Monats nach dem Datum der Absendung dieses internationalen Recherchenberichts eine Stellungnahme vorlegen.

6. Hinsichtlich der **Zeichnungen**
   a. ist folgende Abbildung der **Zeichnungen** mit der Zusammenfassung zu veröffentlichen: Abb. Nr. _____
      [ ] wie vom Anmelder vorgeschlagen
      [ ] wie von der Behörde ausgewählt, weil der Anmelder selbst keine Abbildung vorgeschlagen hat.
      [ ] wie von der Behörde ausgewählt, weil diese Abbildung die Erfindung besser kennzeichnet.
   b. [ ] wird keine der Abbildungen mit der Zusammenfassung veröffentlicht.

14. 8. 2012

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2010/064742

Feld Nr. II Bemerkungen zu den Ansprüchen, die sich als nicht recherchierbar erwiesen haben (Fortsetzung von Punkt 2 auf Blatt 1)

Gemäß Artikel 17(2)a) wurde aus folgenden Gründen für bestimmte Ansprüche kein internationaler Recherchenbericht erstellt:

1. ☐ Ansprüche Nr.
weil sie sich auf Gegenstände beziehen, zu deren Recherche diese Behörde nicht verpflichtet ist, nämlich

2. ☐ Ansprüche Nr.
weil sie sich auf Teile der internationalen Anmeldung beziehen, die den vorgeschriebenen Anforderungen so wenig entsprechen, dass eine sinnvolle internationale Recherche nicht durchgeführt werden kann, nämlich

3. ☐ Ansprüche Nr.
weil es sich dabei um abhängige Ansprüche handelt, die nicht entsprechend Satz 2 und 3 der Regel 6.4 a) abgefasst sind.

Feld Nr. III Bemerkungen bei mangelnder Einheitlichkeit der Erfindung (Fortsetzung von Punkt 3 auf Blatt 1)

Diese Internationale Recherchenbehörde hat festgestellt, dass diese internationale Anmeldung mehrere Erfindungen enthält:

siehe Zusatzblatt

1. ☐ Da der Anmelder alle erforderlichen zusätzlichen Recherchengebühren rechtzeitig entrichtet hat, erstreckt sich dieser internationale Recherchenbericht auf alle recherchierbaren Ansprüche.

2. ☐ Da für alle recherchierbaren Ansprüche die Recherche ohne einen Arbeitsaufwand durchgeführt werden konnte, der zusätzliche Recherchengebühr gerechtfertigt hätte, hat die Behörde nicht zur Zahlung solcher Gebühren aufgefordert.

3. ☒ Da der Anmelder nur einige der erforderlichen zusätzlichen Recherchengebühren rechtzeitig entrichtet hat, erstreckt sich dieser internationale Recherchenbericht nur auf die Ansprüche, für die Gebühren entrichtet worden sind, nämlich auf die Ansprüche Nr.
1-15(teilweise)

4. ☐ Der Anmelder hat die erforderlichen zusätzlichen Recherchengebühren nicht rechtzeitig entrichtet. Dieser internationale Recherchenbericht beschränkt sich daher auf die in den Ansprüchen zuerst erwähnte Erfindung; diese ist in folgenden Ansprüchen erfasst:

Bemerkungen hinsichtlich eines Widerspruchs

☐ Der Anmelder hat die zusätzlichen Recherchengebühren unter Widerspruch entrichtet und die gegebenenfalls erforderliche Widerspruchsgebühr gezahlt.

☐ Die zusätzlichen Recherchengebühren wurden vom Anmelder unter Widerspruch gezahlt, jedoch wurde die entsprechende Widerspruchsgebühr nicht innerhalb der in der Aufforderung angegebenen Frist entrichtet.

☒ Die Zahlung der zusätzlichen Recherchengebühren erfolgte ohne Widerspruch.

3

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2010/064742

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES
INV. C07D401/04 C07D401/14 C07D403/04 C07D403/14 C07D471/04
C07D487/04 A01N43/56
ADD.
Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPC) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPC

B. RECHERCHIERTE GEBIETE
Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)
C07D A01N

Recherchierte, aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)
EPO-Internal, BEILSTEIN Data, BIOSIS, CHEM ABS Data, WPI Data

C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	WO 03/049542 A1 (SYNGENTA PARTICIPATIONS AG [CH]; MUELLER URS [CH]; EBERLE MARTIN [CH];) 19. Juni 2003 (2003-06-19) in der Anmeldung erwähnt Verbindungen der Tabellen 8 und 11 Ansprüche; Beispiele -----	1-15
X	WO 01/30154 A2 (BASF AG [DE]; RHEINHEIMER JOACHIM [DE]; EICKEN KARL [DE]; ROSE INGO [D) 3. Mai 2001 (2001-05-03) Tabelle 1, diverse Verbindungen, z.B. Verbindung 15, 16, 26-28, 30, 31, etc.Ansprüche; Beispiele -----	1-15
	-/--	

[X] Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen [X] Siehe Anhang Patentfamilie

* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :
"A" Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist
"E" frühere Anmeldung oder Patent, die bzw. das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist
"L" Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)
"O" Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht
"P" Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist
"T" Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist
"X" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden
"Y" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist
"&" Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche	Absendedatum des internationalen Recherchenberichts
31. Mai 2012	12/06/2012

Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde	Bevollmächtigter Bediensteter
Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Fax: (+31-70) 340-3016	Stroeter, Thomas

4

Formblatt PCT/ISA/210 (Blatt 2) (April 2005)

4

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2010/064742

C. (Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	EL-EMARY T I ET AL: "SYNTHESIS AND BIOLOGICAL SCREENING OF NEW 1,3-DIPHENYLPYRAZOLES WITH DIFFERENT HETEROCYCLIC MOIETIES AT POSITION-4", DIE PHARMAZIE, GOVI VERLAG PHARMAZEUTISCHER VERLAG GMBH, ESCHBORN, DE, Bd. 54, Nr. 2, 1. Januar 1999 (1999-01-01) , Seiten 106-111, XP001180007, ISSN: 0031-7144 Schema 5 Tabelle 1; Verbindungen 18a, 19	1-15
X	US 6 525 059 B1 (ANANTANARAYAN ASHOK [US] ET AL) 25. Februar 2003 (2003-02-25) Beispiele A-179, A-191 bis A-198, A-203 bis A-207, A-210 bis A-212, A-215, A-229, A-231-235 und viele weitere z.B. A-318 oder solche Verbindungen ab Spalte 307 mit einem nicht-H-Substituenten am N-1-Atom	1-10
X	US 2006/154931 A1 (VERHOEST PATRICK R [US] ET AL) 13. Juli 2006 (2006-07-13) Beispiel 61, Preparation 61	1-10
X	US 6 028 072 A (LEE LEN F [US] ET AL) 22. Februar 2000 (2000-02-22) Diverse Verbindungen aus Anspruch 4, z.B. 1,5-Dimethyl-4-(4-pyridyl)-3-[4-(methylsulfonyl)phenyl]-1H-pyrazole; 5-(hydroxymethyl)-1-methyl-4-(4-pyridyl)-3-[4-(methylsulfonyl)phenyl]-1H-pyrazole; 1-(3-hydroxypropyl)-3-[4-(methylsulfonyl)-phenyl]-4-(4-pyridyl)-5-(trifluoro methyl)-1H-pyrazole etc.	1-10
X	US 2004/147525 A1 (KIMURA TOMIO [JP] ET AL) 29. Juli 2004 (2004-07-29) Verbindungen 1-919, 970, 1022, 1162, 1172, 1182, ... (aus Tabelle 1), Verbindungen 2-1, 52, 103, ... (aus Tabelle 2), Verbindung 5-64 (aus Tabelle 5), Verbindung 6-32 (aus Tabelle 6), Verbindungen 7-52, 510, 518 (aus Tabelle 7) und viele weitere Verbindungen aus diesen und nachfolgenden Tabellen.Ansprüche	1-10,13

-/--

4

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2010/064742

C. (Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	WO 2004/005282 A1 (NOVARTIS AG [CH]; NOVARTIS PHARMA GMBH [AT]; FURET PASCAL [FR]; IMBACH) 15. Januar 2004 (2004-01-15) diverse Beispielverbindungen, siehe z.B. Schema 6 auf Seite 59 und nachfolgendeAnsprüche	1-10
X	WO 2007/024843 A2 (SMITHKLINE BEECHAM CORP [US]; ADAMS JERRY LEROY [US]; FAITG THOMAS H [) 1. März 2007 (2007-03-01) Intermediate 32(a)-(l) auf Seite 65-69	1-10
X	JP 2007 217322 A (UBE INDUSTRIES) 30. August 2007 (2007-08-30) diverse Verbindungen aus den Tabellen; Seite 20 - Seite 51	1-10,13
X	EP 1 553 096 A1 (UBE INDUSTRIES [JP]) 13. Juli 2005 (2005-07-13) diverse Verbindungen aus den Tabellen; Seite 26 - Seite 123	1-10,13
X	WO 2007/105058 A2 (PFIZER PROD INC [US]; BENNETT MICHAEL JOHN [US]; CHO-SCHULTZ SUJIN [US) 20. September 2007 (2007-09-20) Ansprüche; Beispiele 2-6, 8-10, 23, 24, 127, etc.	1-10,13
X	WO 03/015781 A1 (SANKYO CO [JP]; FUJIWARA TOSHIHIKO [JP]; USHIYAMA SHIGERU [JP]; KIMURA) 27. Februar 2003 (2003-02-27) Diverse Verbindungen aus den Tabellen zu Formeln I-8, I-9, I-13, I-14, I-15, I-16 und I-17.	1-10
X	TANG J ET AL: "Knowledge-based design of 7-azaindoles as selective B-Raf inhibitors", BIOORGANIC & MEDICINAL CHEMISTRY LETTERS, PERGAMON, ELSEVIER SCIENCE, GB, Bd. 18, Nr. 16, 15. August 2008 (2008-08-15), Seiten 4610-4614, XP023613432, ISSN: 0960-894X, DOI: 10.1016/J.BMCL.2008.07.019 [gefunden am 2008-07-10] Verbindungen 5d, 5e	1-10

-/--

Formblatt PCT/ISA/210 (Fortsetzung von Blatt 2) (April 2005)

6

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2010/064742

C. (Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	VERHOEST P R ET AL: "Discovery of a novel class of phosphodiesterase 10A inhibitors and identification of clinical candidate 2-[4-(1-methyl-4-pyridin-4-yl-1H pyrazol-3- yl)-phenoxymethyl]-quinoline (PF-2545920) for the treatment of schizophrenia", JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY, AMERICAN CHEMICAL SOCIETY, US, Bd. 52, Nr. 16, 27. August 2009 (2009-08-27), Seiten 5188-5196, XP002567796, ISSN: 0022-2623, DOI: 10.1021/JM900521K [gefunden am 2009-07-24] Verbindung 24	1-10
X	SLISKOVIC D R ET AL: "Inhibitors of Cholesterol Biosynthesis. 6. trans-6-[2-(2-N-hetroaryl 3,5-disubstituted-pyrazol-4-yl)ethyl/ethenyl]tetrahydro-4-hydroxy-2 H-pyran-2-ones", JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY, AMERICAN CHEMICAL SOCIETY, US, Bd. 35, Nr. 11, 1. Mai 1992 (1992-05-01), Seiten 2095-2103, XP008122636, ISSN: 0022-2623, DOI: 10.1021/JM00089A022 Verbindungen 5a-5e	15
X	EP 0 252 476 A2 (WARNER LAMBERT CO [US]) 13. Januar 1988 (1988-01-13) Formel (II) Anspruch 1; Beispiel 1C	15
X	US 2005/261354 A1 (GRIFFIN JOHN [US] ET AL) 24. November 2005 (2005-11-24) Verbindungen 14, 39	15
X	US 3 040 047 A (KENZO SIRAKAWA) 19. Juni 1962 (1962-06-19) Beispiel 34	15
X	WO 2009/086041 A1 (DU PONT [US]; STEVENSON THOMAS MARTIN [US]; MARSHALL ERIC ALLEN [US];) 9. Juli 2009 (2009-07-09) Tabellen ID, IE, IF ab Seite 52 worin R1 = Me, R2 = H, Rwa = Me und Rwb = Br	15
X	US 4 957 971 A (PICARD JOSEPH A [US] ET AL) 18. September 1990 (1990-09-18) Beispiele 1C, 4B, 5B	15
X	DE 60 2004 000260 T2 (ARENA PHARM INC [US]) 24. August 2006 (2006-08-24) Zwischenverbindung aus Bsp. 1.81	15

-/--

4

Formblatt PCT/ISA/210 (Fortsetzung von Blatt 2) (April 2005)

7

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2010/064742

C. (Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	US 2007/149561 A1 (DHANAK DASHYANT [US] ET AL) 28. Juni 2007 (2007-06-28) Intermediate 3, 41, 43, 46 und 150 -----	15
X	WO 2007/090141 A2 (SMITHKLINE BEECHAM CORP [US]; TANG JUN [US]; NAKANO MASATO [JP]; HAMAJ) 9. August 2007 (2007-08-09) Intermediat 1; Seite 27 -----	15
X	US 7 074 801 B1 (YOSHIDA ICHIRO [JP] ET AL) 11. Juli 2006 (2006-07-11) Produktionsbeispiele 15, 17-20, 25, 27-29, 32, 33, 171, 172, 176-180, 197, 207, 211 und 215 -----	14,15

4

Formblatt PCT/ISA/210 (Fortsetzung von Blatt 2) (April 2005)

8.

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2010/064742

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO 03049542 A1	19-06-2003	AT 338461 T	15-09-2006
		AU 2002351124 A1	23-06-2003
		BR 0213140 A	19-10-2004
		CA 2460122 A1	19-06-2003
		EP 1455579 A1	15-09-2004
		US 2005080101 A1	14-04-2005
		WO 03049542 A1	19-06-2003
WO 0130154 A2	03-05-2001	AU 7922100 A	08-05-2001
		WO 0130154 A2	03-05-2001
US 6525059 B1	25-02-2003	AR 035836 A1	21-07-2004
		AT 278685 T	15-10-2004
		AT 373649 T	15-10-2007
		AU 774262 B2	24-06-2004
		AU 2145400 A	13-06-2000
		BG 105620 A	31-01-2002
		BR 9915420 A	22-01-2002
		CA 2351725 A1	02-06-2000
		CN 1342157 A	27-03-2002
		CZ 20011714 A3	12-12-2001
		DE 69920966 D1	11-11-2004
		DE 69920966 T2	09-03-2006
		DE 69937163 T2	21-05-2008
		DK 1500657 T3	02-01-2008
		EE 200100268 A	16-12-2002
		EP 1144403 A1	17-10-2001
		ES 2229809 T3	16-04-2005
		ES 2289411 T3	01-02-2008
		GE P20053421 B	25-01-2005
		HK 1040705 A1	04-03-2005
		HR 20010363 A2	28-02-2005
		HU 0200130 A2	29-06-2002
		ID 29993 A	25-10-2001
		IS 5938 A	09-05-2001
		JP 2002530397 A	17-09-2002
		NO 20012456 A	19-07-2001
		NZ 512344 A	28-11-2003
		OA 11914 A	11-04-2006
		PL 353853 A1	01-12-2003
		PT 1144403 E	31-01-2005
		PT 1500657 E	05-12-2007
		SK 6862001 A3	04-06-2002
		TR 200102001 T2	21-12-2001
		US 6514977 B1	04-02-2003
		US 6525059 B1	25-02-2003
		WO 0031063 A1	02-06-2000
		ZA 200103882 A	14-10-2002
US 2006154931 A1	13-07-2006	AP 2362 A	29-02-2012
		AR 052863 A1	11-04-2007
		AT 472543 T	15-07-2010
		AU 2005323794 A1	13-07-2006
		BR PI0518508 A2	25-11-2008
		CA 2592986 A1	13-07-2006
		CN 101098866 A	02-01-2008
		CR 9180 A	04-07-2007
		CU 20070156 A7	16-03-2009

9

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2010/064742

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument		Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie		Datum der Veröffentlichung
			DK	1841757 T3	13-09-2010
			EA	200701252 A1	28-12-2007
			EP	1841757 A2	10-10-2007
			ES	2346674 T3	19-10-2010
			HN	2006000668 A	17-09-2010
			HR	20100461 T1	30-11-2010
			JP	4302762 B2	29-07-2009
			JP	2008526825 A	24-07-2008
			KR	20070091005 A	06-09-2007
			MA	29140 B1	02-01-2008
			MY	142052 A	30-08-2010
			NL	1030863 A1	10-07-2006
			NL	1030863 C2	28-12-2006
			NZ	555737 A	29-01-2010
			PE	08732006 A1	04-09-2006
			PT	1841757 E	31-08-2010
			RS	51385 B	28-02-2011
			SI	1841757 T1	30-09-2010
			SV	2008002365 A	08-02-2008
			TW	I312682 B	01-08-2009
			US	2006154931 A1	13-07-2006
			US	2008214607 A1	04-09-2008
			UY	29324 A1	31-08-2006
			WO	2006072828 A2	13-07-2006
			ZA	200705427 A	25-09-2008
US 6028072	A	22-02-2000	AT	210648 T	15-12-2001
			AU	3126795 A	22-02-1996
			CA	2195123 A1	08-02-1996
			DE	69524600 D1	24-01-2002
			DE	69524600 T2	18-07-2002
			DK	772597 T3	08-04-2002
			EP	0772597 A1	14-05-1997
			ES	2169760 T3	16-07-2002
			JP	3490716 B2	26-01-2004
			JP	H10503201 A	24-03-1998
			PT	772597 E	31-05-2002
			US	5486534 A	23-01-1996
			US	5580985 A	03-12-1996
			US	5756530 A	26-05-1998
			US	6028072 A	22-02-2000
			WO	9603385 A1	08-02-1996
US 2004147525	A1	29-07-2004	AT	377598 T	15-11-2007
			DE	60223339 T2	28-08-2008
			EP	1361225 A1	12-11-2003
			ES	2296910 T3	01-05-2008
			US	2004147525 A1	29-07-2004
			WO	02057265 A1	25-07-2002
WO 2004005282	A1	15-01-2004	AT	468332 T	15-06-2010
			AU	2003249993 A1	23-01-2004
			BR	0312573 A	26-04-2005
			CA	2491635 A1	15-01-2004
			CN	1668610 A	14-09-2005
			EP	1521749 A1	13-04-2005
			ES	2346427 T3	15-10-2010
			JP	4478016 B2	09-06-2010

10

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2010/064742

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
		JP 2006501183 A	12-01-2006
		PT 1521749 E	18-08-2010
		US 2006106027 A1	18-05-2006
		WO 2004005282 A1	15-01-2004
WO 2007024843 A2	01-03-2007	AR 058029 A1	23-01-2008
		EP 1917258 A2	07-05-2008
		JP 2009506040 A	12-02-2009
		PE 03592007 A1	05-04-2007
		TW 200800211 A	01-01-2008
		US 2008242667 A1	02-10-2008
		WO 2007024843 A2	01-03-2007
JP 2007217322 A	30-08-2007	KEINE	
EP 1553096 A1	13-07-2005	AU 2003266617 A1	19-04-2004
		CA 2500225 A1	08-04-2004
		CN 1684953 A	19-10-2005
		EP 1553096 A1	13-07-2005
		KR 20050071518 A	07-07-2005
		US 2006063934 A1	23-03-2006
		WO 2004029043 A1	08-04-2004
WO 2007105058 A2	20-09-2007	CA 2643066 A1	20-09-2007
		EP 2024353 A2	18-02-2009
		JP 2009530261 A	27-08-2009
		WO 2007105058 A2	20-09-2007
WO 03015781 A1	27-02-2003	KEINE	
EP 0252476 A2	13-01-1988	CA 1286671 C	23-07-1991
		DE 3788982 D1	17-03-1994
		DE 3788982 T2	19-05-1994
		EP 0252476 A2	13-01-1988
		ES 2061451 T3	16-12-1994
		JP 2086475 C	02-09-1996
		JP 7116182 B	13-12-1995
		JP 63088179 A	19-04-1988
		US 4808621 A	28-02-1989
US 2005261354 A1	24-11-2005	KEINE	
US 3040047 A	19-06-1962	KEINE	
WO 2009086041 A1	09-07-2009	AR 070680 A1	28-04-2010
		AU 2008343031 A1	09-07-2009
		CA 2707520 A1	09-07-2009
		CN 101945856 A	12-01-2011
		CO 6280580 A2	20-05-2011
		EP 2225211 A1	08-09-2010
		JP 2011507893 A	10-03-2011
		KR 20100099735 A	13-09-2010
		NZ 585728 A	25-11-2011
		RU 2010130559 A	27-01-2012
		US 2010267561 A1	21-10-2010
		UY 31553 A1	03-08-2009
		WO 2009086041 A1	09-07-2009

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2010/064742

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
US 4957971 A	18-09-1990	KEINE	
DE 602004000260 T2	24-08-2006	AR 045069 A1	12-10-2005
		AT 313532 T	15-01-2006
		AU 2004261582 A1	10-02-2005
		BR PI0412263 A	19-09-2006
		CA 2533369 A1	10-02-2005
		CN 101871931 A	27-10-2010
		CN 101875961 A	03-11-2010
		DE 602004000260 T2	24-08-2006
		DK 1558582 T3	08-05-2006
		EC SP066269 A	28-07-2006
		EP 1558582 A1	03-08-2005
		ES 2258760 T3	01-09-2006
		HK 1072943 A1	10-03-2006
		HR 20060100 T3	31-03-2007
		IS 8241 A	19-01-2006
		JP 4198733 B2	17-12-2008
		JP 2006528195 A	14-12-2006
		JP 2007039461 A	15-02-2007
		JP 2008143908 A	26-06-2008
		KR 20060041260 A	11-05-2006
		MA 28066 A1	01-08-2006
		MX PA06000795 A	23-08-2006
		MY 141862 A	16-07-2010
		NZ 544331 A	26-03-2010
		PT 1558582 E	31-05-2006
		RS 20060035 A	07-08-2008
		US 2005080124 A1	14-04-2005
		US 2007072857 A1	29-03-2007
		US 2007078134 A1	05-04-2007
		WO 2005012254 A1	10-02-2005
US 2007149561 A1	28-06-2007	AR 058614 A1	13-02-2008
		AU 2006330587 A1	05-07-2007
		BR PI0620341 A2	08-11-2011
		CA 2634787 A1	05-07-2007
		CN 101389324 A	18-03-2009
		EA 200870117 A1	30-12-2008
		EP 1962830 A2	03-09-2008
		JP 2009521492 A	04-06-2009
		KR 20080083680 A	18-09-2008
		MA 30069 B1	01-12-2008
		TW 200800990 A	01-01-2008
		US 2007149561 A1	28-06-2007
		US 2008004308 A1	03-01-2008
		US 2008306120 A1	11-12-2008
		WO 2007076348 A2	05-07-2007
WO 2007090141 A2	09-08-2007	EP 1981887 A2	22-10-2008
		JP 2009525350 A	09-07-2009
		US 2009018156 A1	15-01-2009
		WO 2007090141 A2	09-08-2007
US 7074801 B1	11-07-2006	AT 402164 T	15-08-2008
		EP 1382603 A1	21-01-2004
		EP 2048142 A2	15-04-2009
		ES 2310202 T3	01-01-2009

12

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2010/064742

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
		JP 4310109 B2	05-08-2009
		US 7074801 B1	11-07-2006
		WO 02088107 A1	07-11-2002

Internationales Aktenzeichen PCT/ EP2010/ 064742

WEITERE ANGABEN PCT/ISA/ 210

Die internationale Recherchenbehörde hat festgestellt, dass diese internationale Anmeldung mehrere (Gruppen von) Erfindungen enthält, nämlich:

1. Ansprüche: 1-15(teilweise)

Verbindungen der Formel [I-a], [I-b], [III], [V], [VI], [X] und [XI] worin R1= Phenyl und R2 = CN bedeutet, sowie Produkte, Verfahren und Verwendungen die sich darauf beziehen.

---

2. Ansprüche: 1-15(teilweise)

Verbindungen der Formel [I-a], [I-b], [III], [V], [VI], [X] und [XI] worin R1= Phenyl und R2 = NO2 bedeutet, sowie Produkte, Verfahren und Verwendungen die sich darauf beziehen.

---

3. Ansprüche: 1-15(teilweise)

Verbindungen der Formel [I-a], [I-b], [III], [V], [VI], [X] und [XI] worin R1= Phenyl und R2 = Halogen bedeutet, sowie Produkte, Verfahren und Verwendungen die sich darauf beziehen.

---

4. Ansprüche: 1-15(teilweise)

Verbindungen der Formel [I-a], [I-b], [III], [V], [VI], [X] und [XI] worin R1= Phenyl und R2 = Alkyl, Halogenalkyl bedeutet, sowie Produkte, Verfahren und Verwendungen die sich darauf beziehen.

---

5. Ansprüche: 1-15(teilweise)

Verbindungen der Formel [I-a], [I-b], [III], [V], [VI], [X] und [XI] worin R1= Phenyl und R2 = Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio bedeutet, sowie Produkte, Verfahren und Verwendungen die sich darauf beziehen.

---

6. Ansprüche: 1-15(teilweise)

Verbindungen der Formel [I-a], [I-b], [III], [V], [VI], [X] und [XI] worin R1= Phenyl und R2 = Cycloalkyl, Halogencycloalkyl, Heterocyclyl bedeutet, sowie Produkte, Verfahren und Verwendungen die sich darauf beziehen.

---

7. Ansprüche: 1-15(teilweise)

Verbindungen der Formel [I-a], [I-b], [III], [V], [VI], [X]

(4)

Internationales Aktenzeichen PCT/ EP2010/ 064742

WEITERE ANGABEN PCT/ISA/ 210

und [XI] worin R1= Phenyl und R2 = H bedeutet, sowie Produkte, Verfahren und Verwendungen die sich darauf beziehen.

---

8. Ansprüche: 1-15(teilweise)

Verbindungen der Formel [I-a], [I-b], [III], [V], [VI], [X] und [XI] worin R1= Naphthalenyl, (Iso)chinolinyl, Benzothiophenyl/furanyl/dioxolyl bedeutet, sowie Produkte, Verfahren und Verwendungen die sich darauf beziehen.

フロントページの続き

(51)Int.Cl.		FI		テーマコード（参考）
Ｃ０７Ｄ 417/14	*(2006.01)*	Ｃ０７Ｄ 417/14		
Ｃ０７Ｄ 409/14	*(2006.01)*	Ｃ０７Ｄ 409/14		
Ｃ０７Ｄ 471/04	*(2006.01)*	Ｃ０７Ｄ 471/04	１０５Ｚ	
Ｃ０７Ｄ 473/00	*(2006.01)*	Ｃ０７Ｄ 471/04	１０７Ｚ	
Ｃ０７Ｄ 495/04	*(2006.01)*	Ｃ０７Ｄ 473/00		
Ｃ０７Ｄ 487/04	*(2006.01)*	Ｃ０７Ｄ 495/04	１０５Ｚ	
Ａ０１Ｎ 43/56	*(2006.01)*	Ｃ０７Ｄ 487/04	１４０	
Ａ０１Ｐ 3/00	*(2006.01)*	Ｃ０７Ｄ 471/04	１１７Ｚ	
		Ａ０１Ｎ 43/56	Ａ	
		Ａ０１Ｎ 43/56	Ｃ	
		Ａ０１Ｎ 43/56	Ｂ	
		Ａ０１Ｐ 3/00		

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

(74)代理人 100129713
弁理士 重森 一輝
(74)代理人 100137213
弁理士 安藤 健司
(74)代理人 230105223
弁護士 城山 康文
(72)発明者 スダウ，アレキサンダー
ドイツ国、４２７９９・ライヒリンゲン、ブルハー・ヴエーク・５アー
(72)発明者 エスーサイド，マーゼン
フランス国、６９２７０・クゾン・オ・モンドール、ルート・ドウ・ティグノ、２２
(72)発明者 ブラウン，クリストフ・アンドレアス
ドイツ国、４０６２７・ドウツセルドルフ、ランゲンビーラー・ヴエーク・１３
(72)発明者 マイズナー，ルース
ドイツ国、５１３７５・レバークーゼン、クルマンヴエーク・３５
(72)発明者 サーバン，カトリーヌ
フランス国、６９００９・リヨン、リュ・コムニユ
(72)発明者 ベンテイン，ヨーガン
ドイツ国、４２７９９・ライヒリンゲン、アムゼルシュトラーセ・７
(72)発明者 ダーメン，ペーター
ドイツ国、４１４７０・ノイス、アルテブリユツケルーシユトラーセ・６１
(72)発明者 ポーツ，ダニエラ
ドイツ国、５２３９１・フェットヴアイス、タールシユトラーセ・１１
(72)発明者 ヴアーヘンドルフーノイマン，ウルリケ
ドイツ国、５６５６６・ノイヴイート、オーベラー・マーケンヴエーク・８５
(72)発明者 デボルド，フィリップ
フランス国、エフー６９００６・リヨン、リユー・ドウ・ドクトウール・ムイセ

(72)発明者　バンナビ，サミル
フランス国、エフ－６９３００・カリユイル、ビス・デ・ラ・ガレ・ド・キユイール
(72)発明者　キヤサリン，クリストフ
フランス国、エフ－６９４６０・ル・ペレオン、ラ・プテイツト・グランジエ
(72)発明者　レブストツク，アン－ソフイー
フランス国、エフ－６９００４・リヨン、アブニユ・ド・バーミンガム
(72)発明者　グロスジヤン－クールノワイエ，マリー－クレール
フランス国、エフ－６９２５０・キユリ・オ・モンドール、ルート・ダルビニー
(72)発明者　波多野　広幸
〒３２９－０４３４栃木県下野市祇園３－２－１８
(72)発明者　ノブロツク，トーマス
フランス国、エフ－６９３８０・シヤテイヨン、ドム・デ・ヴイーニユ
(72)発明者　リノルフイ，フイリツプ
フランス国、エフ－６９３８０・シヤテイヨン・ダゼルグ、リユ・デイ・ラ・コルテイエール，レジデンス・ル・コトー

Ｆターム(参考) 4C050 AA01 BB04 CC08 EE03 FF10 GG01 HH04
4C063 AA01 AA03 AA05 BB01 BB02 BB03 BB09 CC22 CC25 CC29
CC62 CC67 CC72 CC75 CC78 CC81 CC92 DD10 DD12 DD22
DD29 EE03
4C065 AA01 AA04 BB04 BB06 BB11 DD02 DD03 EE02 HH10 JJ01
KK09 LL04 PP07 PP09
4C071 AA01 BB01 CC02 CC21 EE13 FF05 GG01 GG10 JJ05 LL01
4H011 AA01 BA01 BB09 BC03 BC05 BC06 DA16 DC05 DD03