

(19) 日本国特許庁 (JP)

(12) 特 許 公 報 (B2)

(11) 特許番号

特許第5186751号
(P5186751)

(45) 発行日 平成25年4月24日 (2013. 4. 24)

(24) 登録日 平成25年2月1日 (2013. 2. 1)

(51) Int. Cl.

F I

C O 7 D 401/04 (2006. 01)

C O 7 D 401/04 C S P

A O 1 N 43/56 (2006. 01)

A O 1 N 43/56 D

A O 1 P 7/04 (2006. 01)

A O 1 P 7/04

請求項の数 6 (全 450 頁)

(21) 出願番号 特願2006-275993 (P2006-275993)
(22) 出願日 平成18年10月10日 (2006. 10. 10)
(65) 公開番号 特開2007-182422 (P2007-182422A)
(43) 公開日 平成19年7月19日 (2007. 7. 19)
審査請求日 平成21年8月26日 (2009. 8. 26)
(31) 優先権主張番号 特願2005-299843 (P2005-299843)
(32) 優先日 平成17年10月14日 (2005. 10. 14)
(33) 優先権主張国 日本国 (JP)
(31) 優先権主張番号 特願2006-144829 (P2006-144829)
(32) 優先日 平成18年5月25日 (2006. 5. 25)
(33) 優先権主張国 日本国 (JP)

前置審査

(73) 特許権者 000002093
住友化学株式会社
東京都中央区新川二丁目2 7 番 1 号
(74) 代理人 100113000
弁理士 中山 亨
(74) 代理人 100151909
弁理士 坂元 徹
(72) 発明者 池上 宏
兵庫県宝塚市高司四丁目2 番 1 号 住友化
学株式会社内
(72) 発明者 ヤックマン マークス
兵庫県宝塚市高司四丁目2 番 1 号 住友化
学株式会社内

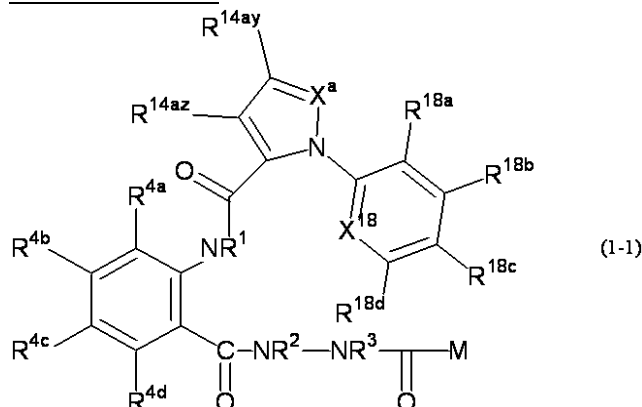
最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 ヒドラジド化合物およびその有害生物防除用途

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (1 - 1)



(1-1)

10

〔式中、

R¹ は、水素原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基を表し、

R² は、水素原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基を表し、

20

R³は、水素原子、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基、または、C 2 - C 6 アルコキシカルボニル基を表し、

R^{4a}は、水素原子、ハロゲン原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基を表し、

R^{4b}は、水素原子を表し、

R^{4c}は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基を表し、

R^{4d}は、水素原子を表し、

Mは、OR⁶を表し

(ここで、R⁶は、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基である。)

10

X^aは、窒素原子を表し、

R^{14ay}は、水素原子、ハロゲン原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基を表し、

R^{14az}は、水素原子を表し、

X¹⁸は、窒素原子を表し、

R^{18a}は、ハロゲン原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基を表し、

R^{18b}、R^{18c}およびR^{18d}は、水素原子を表す。]

で示されるヒドラジド化合物。

20

【請求項 2】

R¹が、水素原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 4 アルキル基、

R²が、水素原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 4 アルキル基、

R³が、水素原子、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 4 アルキル基、または、C 2 - C 4 アルコキシカルボニル基、

R^{4a}が、水素原子、ハロゲン原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 4 アルキル基、

R^{4c}が、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 4 アルキル基、

30

R⁶が、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 4 アルキル基、

R^{14ay}が、水素原子、ハロゲン原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 4 アルキル基、

R^{18a}が、ハロゲン原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 4 アルキル基

である請求項 1 に記載のヒドラジド化合物。

【請求項 3】

R¹が、水素原子、

R²が、水素原子、またはC 1 - C 4 アルキル基、

40

R³が、水素原子、またはC 1 - C 4 アルキル基

R^{4a}が、ハロゲン原子、またはC 1 - C 4 アルキル基、

R⁶が、C 1 - C 4 アルキル基、

R^{14ay}が、ハロゲン原子、またはハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 4 アルキル基、

R^{18a}が、ハロゲン原子、

である請求項 2 に記載のヒドラジド化合物。

【請求項 4】

請求項 1 ~ 3 いずれか1項に記載される化合物を有効成分として含有する農薬組成物。

【請求項 5】

50

有害生物を防除するための請求項 1 ~ 3 いずれか1項に記載される化合物を活性成分として含む農薬組成物。

【請求項 6】

請求項 1 ~ 3 いずれか1項に記載される化合物を有害生物に直接、または有害生物の生息場所に施用することを特徴とする有害生物の防除方法。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明はヒドラジド化合物およびその有害生物防除用途に関する。

【背景技術】

10

【0002】

従来、有害生物を防除するために多くの化合物が開発され、実用に供されている。また、ある種のアミド化合物が当該分野で知られている。

【0003】

【特許文献 1】WO 01 / 70671 号公報

【特許文献 2】WO 03 / 015518 号公報

【特許文献 3】WO 03 / 016284 号公報

【特許文献 4】WO 03 / 016300 号公報

【特許文献 5】WO 03 / 024222 号公報

【発明の開示】

20

【発明が解決しようとする課題】

【0004】

本発明は、有害生物に対して優れた防除効力を有する化合物を提供することを課題とする。

【課題を解決するための手段】

【0005】

本発明者等は、有害生物に対して優れた防除効力を有する化合物を見出すべく鋭意検討した結果、下記式 (1) で示されるヒドラジド化合物に優れた防除効力を有することを見出し、本発明に至った。

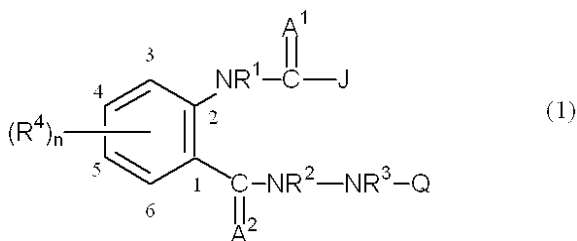
【0006】

30

即ち、本発明は、

「発明 1」

式 (1)



〔式中、

R¹は、水素原子、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキル基、C2 - C6シアノアルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC2 - C6アルコキシアルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC2 - C6アルケニル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC3 - C6アルキニル基、または、ベンゼン環部分が(1)ハロゲン原子、(2)シアノ基、(3)ニトロ基、(4)ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキル基および(5)ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルコキシ基からなる群より選ばれる1 ~ 5個の独立した置換基で置換されていてもよいC7 - C9フェニルアルキル基を表し、

R²およびR³は、各々、独立して、水素原子、ハロゲン原子で置換されていてもよいC

40

50

1 - C 6 アルキル基、C 1 - C 6 アシル基、C 2 - C 6 アルコキシカルボニル基、C 3 - C 7 N, N - ジアルキルカルバモイル基、または、

(1) ハロゲン原子、(2) シアノ基、(3) ニトロ基および(4) ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基からなる群より選ばれる 1 ~ 5 個の独立した置換基で置換されていてもよいフェニル基を表し、

R⁴ は、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルコキシ基、ハロゲン原子で置換されていてもよいフェニル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキルチオ基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキルスルフィニル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキルスルホニル基、または、

ベンゼン環上の隣接する炭素原子に結合する 2 つの R⁴ 基が末端で結合し、T 1 または T 2

T 1 : - C R^{4 1} = C R^{4 2} - C R^{4 3} = C R^{4 4} -

T 2 : - (C R^{4 5} R^{4 6})_h -

(ここで、R^{4 1}、R^{4 2}、R^{4 3} および R^{4 4} は、各々、独立して、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルコキシ基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキルチオ基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキルスルフィニル基、またはハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6

アルキルスルホニル基を表し、

R^{4 5} および R^{4 6} は、各々、独立して、水素原子、またはハロゲン原子で置換されて

いてもよいC 1 - C 6 アルキル基を表し、

h は 3 または 4 の整数を表す。) で示される基を表し、

Q は、Q 1 ~ Q 6

Q1 : —C(=A³¹)—R⁵

Q2 : —C(=A³²)—OR⁶

Q3 : —C(=A³³)—SR⁷

Q4 : —C(=A³⁴)—NR⁸R⁹

Q5 : —S(O)₂—R¹⁰

Q6 : —S(O)₂—NR¹¹R¹²

(ここで、A³¹、A³²、A³³ および A³⁴ は、酸素原子または硫黄原子を表し、

R⁵ は、水素原子、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 2 - C 6 アルケニル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 2 - C 6 アルキニル基、

(1) ハロゲン原子、(2) C 1 - C 6 アルコキシ基、(3) C 1 - C 6 アルキルチオ基、(4) C 1 - C 6 アルキルスルフィニル基、(5) C 1 - C 6 アルキルスルホニル基、(6) C 2 - C 6 ジアルキルアミノ基および(7) C 3 - C 6 シクロアルキル基からなる群より選ばれる 1 個または 2 個以上の独立した置換基で置換されていてもよいC 1 - C 6

アルキル基、

(1) ハロゲン原子および(2) C 1 - C 6 アルキル基からなる群より選ばれる 1 個または 2 個以上の独立した置換基で置換されていてもよいC 3 - C 6 シクロアルキル基、

(1) ハロゲン原子、(2) シアノ基、(3) ニトロ基、(4) ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基、(5) ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルコキシ基、(6) ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキルチオ基、(7) ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキルスルフィニル基、(8) ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキルスルホニル基、(9) ハロ

10

20

30

40

50

ゲン原子で置換されていてもよいC 2 - C 6 ジアルキルアミノ基および(1 0) ハロゲン原子で置換されていてもよいC 2 - C 6 アルコキシカルボニル基からなる群より選ばれる1 ~ 5 個の独立した置換基で置換されていてもよいフェニル基、

(1) ハロゲン原子、(2) シアノ基、(3) ニトロ基、(4) ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基および(5) ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルコキシ基からなる群より選ばれる1 ~ 9 個の独立した置換基で置換されていてもよいナフチル基、

(1) ハロゲン原子、(2) シアノ基、(3) ニトロ基、(4) ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基および(5) ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルコキシ基からなる群より選ばれる1 個または2 個以上の独立した置換基で置換されていてもよい5 - 6 員環ヘテロアリール基、

10

(1) ハロゲン原子および(2) C 1 - C 6 アルキル基からなる群より選ばれる1 個または2 個以上の独立した置換基で置換されていてもよい3 - 8 員非芳香ヘテロ環基、

ベンゼン環部分が(1) ハロゲン原子、(2) シアノ基、(3) ニトロ基、(4) ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基および(5) ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルコキシ基からなる群より選ばれる1 ~ 5 個の独立した置換基で置換されていてもよいC 7 - C 9 フェニルアルキル基、

または、

ベンゼン環部分が(1) ハロゲン原子、(2) シアノ基、(3) ニトロ基、(4) ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基および(5) ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルコキシ基からなる群より選ばれる1 ~ 5 個の独立した置換基で置換されていてもよいC 7 - C 9 フェノキシアルキル基を表し、

20

R⁶およびR⁷は、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 3 - C 6 アルコキシアルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 2 - C 6 アルケニル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 3 - C 6 アルキニル基、

(1) ハロゲン原子および(2) C 1 - C 6 アルキル基からなる群より選ばれる1 個または2 個以上の独立した置換基で置換されていてもよいC 3 - C 6 シクロアルキル基、

(1) ハロゲン原子、(2) シアノ基、(3) ニトロ基、(4) ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基、(5) ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルコキシ基、(6) ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキルチオ基、(7) ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキルスルフィニル基、(8) ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキルスルホニル基、(9) ハロゲン原子で置換されていてもよいC 2 - C 6 ジアルキルアミノ基および(1 0) ハロゲン原子で置換されていてもよいC 2 - C 6 アルコキシカルボニル基からなる群より選ばれる1 ~ 5 個の独立した置換基で置換されていてもよいフェニル基、

30

(1) ハロゲン原子、(2) シアノ基、(3) ニトロ基、(4) ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基および(5) ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルコキシ基からなる群より選ばれる1 ~ 5 個の独立した置換基で置換されていてもよい5 - 6 員環ヘテロアリール基、

40

または、

ベンゼン環部分が(1) ハロゲン原子、(2) シアノ基、(3) ニトロ基、(4) ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基および(5) ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルコキシ基からなる群より選ばれる1 ~ 5 個の独立した置換基で置換されていてもよいC 7 - C 9 フェニルアルキル基を表し、

R⁸およびR⁹は、各々、独立して、水素原子、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 2 - C 6 アルコキシアルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 2 - C 6 アルケニル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 3 - C 6 アルキニル基、

(1) ハロゲン原子および(2) C 1 - C 6 アルキル基からなる群より選ばれる1 個また

50

は2個以上の独立した置換基で置換されていてもよいC3 - C6シクロアルキル基、
 (1)ハロゲン原子、(2)シアノ基、(3)ニトロ基、(4)ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキル基、(5)ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルコキシ基、(6)ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキルチオ基、(7)ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキルスルフィニル基、(8)ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキルスルホニル基、(9)ハロゲン原子で置換されていてもよいC2 - C6ジアルキルアミノ基および(10)ハロゲン原子で置換されていてもよいC2 - C6アルコキシカルボニル基からなる群より選ばれる1 ~ 5個の独立した置換基で置換されていてもよいフェニル基、

(1)ハロゲン原子、(2)シアノ基、(3)ニトロ基、(4)ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキル基および(5)ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルコキシ基からなる群より選ばれる1 ~ 5個の独立した置換基で置換されていてもよい5 - 6員環ヘテロアリール基、

ベンゼン環部分が(1)ハロゲン原子、(2)シアノ基、(3)ニトロ基、(4)ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキル基および(5)ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルコキシ基からなる群より選ばれる1 ~ 5個の独立した置換基で置換されていてもよいC7 - C9フェニルアルキル基を表すか、

または、

R⁸およびR⁹が結合している窒素原子と一緒にあって、3 - 8員非芳香ヘテロ環基を形成し、該3 - 8員非芳香ヘテロ環基は環内に(1)酸素原子、(2)硫黄原子および(3) - NR^a - 基

(ここで、R^aは、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC2 - C6アルコキシカルボニル基、または(1)ハロゲン原子、(2)シアノ基、(3)ニトロ基、(4)ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキル基および(5)ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルコキシ基からなる群より選ばれる1 ~ 5個の独立した置換基で置換されていてもよいフェニル基を表す。)

からなる群より選ばれる1個または2個以上の独立した基を含有していてもよく、また、環内の炭素原子が(1)ハロゲン原子、(2)ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキル基および(3)ハロゲン原子で置換されていてもよいC2 - C6アルコキシカルボニル基からなる群より選ばれる1個または2個以上の独立した置換基で置換されていてもよく、

R¹⁰は、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキル基、

(1)ハロゲン原子および(2)ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキル基からなる群より選ばれる1個または2個以上の独立した置換基で置換されていてもよいC3 - C6シクロアルキル基、

または、

(1)ハロゲン原子、(2)シアノ基、(3)ニトロ基、(4)ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキル基および(5)ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルコキシ基からなる群より選ばれる1 ~ 5個の独立した置換基で置換されていてもよいフェニル基を表し、

R¹¹およびR¹²は、各々、独立して、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキル基、

(1)ハロゲン原子および(2)ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキル基からなる群より選ばれる1個または2個以上の独立した置換基で置換されていてもよいC3 - C6シクロアルキル基、

または、

(1)ハロゲン原子、(2)シアノ基、(3)ニトロ基、(4)ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキル基および(5)ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルコキシ基からなる群より選ばれる1 ~ 5個の独立した置換基で置換されてい

10

20

30

40

50

てもよいフェニル基を表すか、
または、

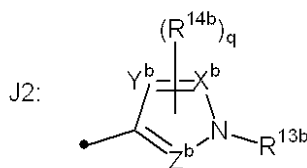
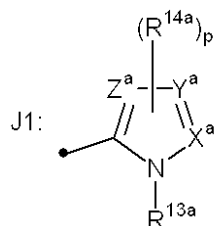
R^{11} および R^{12} が結合している窒素原子と一緒にあって、3 - 8員非芳香ヘテロ環基を形成し、該3 - 8員非芳香ヘテロ環基は環内に(1)酸素原子、(2)硫黄原子および(3) - NR^b - 基

(ここで、 R^b は、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC2 - C6アルコキシカルボニル基、または、(1)ハロゲン原子、(2)シアノ基、(3)ニトロ基、(4)ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキル基および(5)ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルコキシ基からなる群より選ばれる1 ~ 5個の独立した置換基で置換されていてもよいフェニル基を表す。)

10

からなる群より選ばれる1個または2個以上の独立した基を含有していてもよく、また、環内の炭素原子が、(1)ハロゲン原子、(2)ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキル基および(3)ハロゲン原子で置換されていてもよいC2 - C6アルコキシカルボニル基からなる群より選ばれる1個または2個以上の独立した置換基で置換されていてもよく、

Jは、J1またはJ2



20

(ここで、 X^a 、 Y^a 、 Z^a 、 X^b 、 Y^b および Z^b は、各々、独立して、CHまたは窒素原子を表し、

R^{13a} および R^{13b} は、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキル基、C2 - C6シアノアルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC2 - C6アルコキシアルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC2 - C6アルケニル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC2 - C6アルキニル基、

(1)ハロゲン原子および(2)C1 - C6アルキル基からなる群より選ばれる1個または2個以上の独立した置換基で置換されていてもよいC3 - C6シクロアルキル基、

30

(1)ハロゲン原子、(2)シアノ基、(3)ニトロ基、(4)ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキル基、(5)ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルコキシ基、(6)ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキルチオ基、(7)ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキルスルフィニル基および(8)ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキルスルホニル基からなる群より選ばれる1 ~ 5個の独立した置換基で置換されていてもよいフェニル基、

(1)ハロゲン原子、(2)シアノ基、(3)ニトロ基、(4)ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキル基および(5)ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルコキシ基からなる群より選ばれる1個または2個以上の独立した置換基で置換されていてもよい5 - 6員環ヘテロアリール基、

40

ベンゼン環部分が(1)ハロゲン原子、(2)シアノ基、(3)ニトロ基、(4)ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキル基および(5)ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルコキシ基からなる群より選ばれる1個または2個以上の独立した置換基で置換されていてもよいC7 ~ C9フェニルアルキル基、

または、

ピリジン環部分が(1)ハロゲン原子、(2)シアノ基、(3)ニトロ基、(4)ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキル基および(5)ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルコキシ基からなる群より選ばれる1個または2個以上の独立した置換基で置換されていてもよいC7 ~ C9ピリジニルアルキル基を表し、

50

R^{14a} および R^{14b} は、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルコキシ基、C 2 - C 6 シアノアルキルオキシ基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 3 - C 6 アルコシアルキルオキシ基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 3 - C 6 アルケニルオキシ基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 3 - C 6 アルキニルオキシ基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキルチオ基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキルスルフィニル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキルスルホニル基、

(1) ハロゲン原子、(2) シアノ基、(3) ニトロ基、(4) ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基および(5) ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルコキシ基からなる群より選ばれる 1 個 ~ 5 個の独立した置換基で置換されていてもよいフェニル基、

(1) ハロゲン原子、(2) シアノ基、(3) ニトロ基、(4) ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基および(5) ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルコキシ基からなる群より選ばれる 1 個または 2 個以上の独立した置換基で置換されていてもよい5 - 6 員環ヘテロアリール基、または、

(1) ハロゲン原子、(2) シアノ基、(3) ニトロ基、(4) ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基および(5) ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルコキシ基からなる群より選ばれる 1 個 ~ 5 個の独立した置換基で置換されていてもよいフェノキシ基を表し、

p は 0 ~ 3 の整数を表し、 q は 0 ~ 3 の整数を表す。

(但し、 p が 2 または 3 の整数である場合には、2 個以上の R^{14a} は互いに同一でも異なってもよく、 q が 2 または 3 の整数である場合には、2 個以上の R^{14b} は互いに同一でも異なってもよい。)) で示される基を表し、

A^1 および A^2 は、各々、独立して、酸素原子または硫黄原子を表す。)
で示されるヒドラジド化合物 (以下、本発明化合物と記す。) 。

【 0 0 0 7 】

「 発 明 2 」

n が 0 ~ 3 の整数である「 発 明 1 」記載の化合物。

【 0 0 0 8 】

「 発 明 3 」

R^4 が、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルコキシ基、ハロゲン原子で置換されていてもよいフェニル基、または、

ベンゼン環上の隣接する炭素原子に結合する 2 つの R^4 基が末端で結合し、T 1

T 1 : $-CR^{41} = CR^{42} - CR^{43} = CR^{44} -$

(ここで、 R^{41} 、 R^{42} 、 R^{43} および R^{44} が水素原子である。) で示される基である「 発 明 2 」に記載される化合物。

【 0 0 0 9 】

「 発 明 4 」

R^4 がフッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、シアノ基、メチル基、エチル基、トリフルオロメチル基、メトキシ基、フェニル基、または、
ベンゼン環上の隣接する 2 つの R^4 基が末端で結合し、T 1

T 1 : $-CR^{41} = CR^{42} - CR^{43} = CR^{44} -$

(ここで、 R^{41} 、 R^{42} 、 R^{43} および R^{44} が水素原子である。) で示される基である「 発 明 3 」に記載される化合物。

【 0 0 1 0 】

「 発 明 5 」

J が J 1、

Y^a がCH、

R^{13a} が、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基、
 (1) ハロゲン原子および (2) C 1 - C 6 アルキル基からなる群より選ばれる 1 個または 2 個以上の独立した置換基で置換されていてもよいC 3 - C 6 シクロアルキル基、
 (1) ハロゲン原子、(2) シアノ基、(3) ニトロ基、(4) ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基、(5) ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルコキシ基、(6) ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキルチオ基、(7) ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキルスルフィニル基および (8) ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキルスルホニル基からなる群より選ばれる 1 ~ 5 個の独立した置換基で置換されていてもよいフェニル基、
 または、

10

(1) ハロゲン原子、(2) シアノ基、(3) ニトロ基、(4) ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基および (5) ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルコキシ基からなる群より選ばれる 1 個または 2 個以上の独立した置換基で置換されていてもよい5 - 6 員環ヘテロアリール基、

R^{14a} が、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキルチオ基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキルスルフィニル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキルスルホニル基、または、

(1) ハロゲン原子、(2) シアノ基、(3) ニトロ基、(4) ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基および (5) ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルコキシ基からなる群より選ばれる 1 個 ~ 5 個の独立した置換基で置換されていてもよいフェニル基、

20

p が 0 ~ 2 の整数

である「発明 1」~「発明 4」のいずれか 1 つに記載される化合物。

【 0 0 1 1 】

「発明 6」

J が J 2、

Y^b がCH、

R^{13b} が、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基、

R^{14b} が、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基、または、

30

(1) ハロゲン原子、(2) シアノ基、(3) ニトロ基、(4) ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基および (5) ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルコキシ基からなる群より選ばれる 1 個 ~ 5 個の独立した置換基で置換されていてもよいフェニル基、

q が 1

である「発明 1」~「発明 4」のいずれか 1 つに記載される化合物。

【 0 0 1 2 】

「発明 7」

A^1 および A^2 が、酸素原子、

R^1 が、水素原子またはメチル基

40

である「発明 1」~「発明 6」のいずれか 1 つに記載される化合物。

【 0 0 1 3 】

「発明 8」

Q が Q 1、

A^{31} が、酸素原子、

R^5 が、水素原子、

(1) ハロゲン原子、(2) C 1 - C 6 アルコキシ基、(3) C 1 - C 6 アルキルチオ基、(4) C 1 - C 6 アルキルスルフィニル基、(5) C 1 - C 6 アルキルスルホニル基、(6) C 2 - C 6 ジアルキルアミノ基および (7) C 3 - C 6 シクロアルキル基からなる群より選ばれる 1 個または 2 個以上の独立した置換基で置換されていてもよいC 1 - C 6

50

アルキル基、

(1) ハロゲン原子および(2) C1 - C6 アルキル基からなる群より選ばれる1個または2個以上の独立した置換基で置換されていてもよいC3 - C6 シクロアルキル基、

(1) ハロゲン原子、(2) シアノ基、(3) ニトロ基、(4) ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6 アルキル基、(5) ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6 アルコキシ基、(6) ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6 アルキルチオ基、(7) ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6 アルキルスルフィニル基、(8) ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6 アルキルスルホニル基、(9) ハロゲン原子で置換されていてもよいC2 - C6 ジアルキルアミノ基および(10) ハロゲン原子で置換されていてもよいC2 - C6 アルコキシカルボニル基からなる群より選ばれる1 ~ 5 個の独立した置換基で置換されていてもよいフェニル基、

10

(1) ハロゲン原子、(2) シアノ基、(3) ニトロ基、(4) ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6 アルキル基および(5) ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6 アルコキシ基からなる群より選ばれる1個または2個以上の独立した置換基で置換されていてもよい5 - 6 員環ヘテロアリール基、または、

(1) ハロゲン原子および(2) C1 - C6 アルキル基からなる群より選ばれる1個または2個以上の独立した置換基で置換されていてもよい3 - 8 員非芳香ヘテロ環基、
である「発明1」~「発明7」のいずれか1つに記載される化合物。

【0014】

「発明9」

20

R⁵が、水素原子、メチル基、エチル基、tert - ブチル基、シクロプロピル基、フェニル基、3 - メチルフェニル基、4 - メトキシフェニル基、2 - ピリジニル基、または、モルホリノ基

である「発明8」に記載される化合物。

【0015】

「発明10」

QがQ2、

A³²が、酸素原子、

R⁶が、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6 アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC2 - C6 アルケニル基、または、

30

(1) ハロゲン原子、(2) シアノ基、(3) ニトロ基、(4) ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6 アルキル基、(5) ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6 アルコキシ基、(6) ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6 アルキルチオ基、(7) ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6 アルキルスルフィニル基、(8) ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6 アルキルスルホニル基、(9) ハロゲン原子で置換されていてもよいC2 - C6 ジアルキルアミノ基および(10) ハロゲン原子で置換されていてもよいC2 - C6 アルコキシカルボニル基からなる群より選ばれる1 ~ 5 個の独立した置換基で置換されていてもよいフェニル基

である「発明1」~「発明7」のいずれか1つに記載される化合物。

【0016】

40

「発明11」

R⁶が、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、sec - ブチル基、2 - プロペニル基、または、フェニル基

である「発明10」に記載される化合物。

【0017】

「発明12」

QがQ4、

A³⁴が、酸素原子、

R⁸およびR⁹が、各々、独立して、水素原子、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6 アルキル基、または、

50

(1) ハロゲン原子、(2) シアノ基、(3) ニトロ基、(4) ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、(5) ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルコキシ基、(6) ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキルチオ基、(7) ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキルスルフィニル基、(8) ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキルスルホニル基、(9) ハロゲン原子で置換されていてもよい C 2 - C 6 ジアルキルアミノ基および(10) ハロゲン原子で置換されていてもよい C 2 - C 6 アルコキシカルボニル基からなる群より選ばれる 1 ~ 5 個の独立した置換基で置換されていてもよいフェニル基である「発明 1」~「発明 7」のいずれか 1 つに記載される化合物。

【 0 0 1 8 】

10

「発明 1 3」

R⁸およびR⁹が、各々、独立して、水素原子、メチル基、エチル基、または、フェニル基

である「発明 1 2」に記載される化合物。

【 0 0 1 9 】

「発明 1 4」

R²が、水素原子またはメチル基、

R³が、水素原子、メチル基、イソプロピル基、または、メトキシカルボニル基

である「発明 1」~「発明 1 3」のいずれか 1 つに記載される化合物。

【 0 0 2 0 】

20

「発明 1 5」

R¹が、水素原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、

R²が、水素原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、

R³が、水素原子、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、または C 2 - C 6 アルコキシカルボニル基、

R⁴が、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルコキシ基、ハロゲン原子で置換されていてもよいフェニル基、または、

30

ベンゼン環上の隣接する炭素原子に結合する 2 つの R⁴ 基が末端で結合して、T 1

T 1 : - C R^{4 1} = C R^{4 2} - C R^{4 3} = C R^{4 4} -

(ここで、R^{4 1}、R^{4 2}、R^{4 3} および R^{4 4} が、水素原子である。) で示される基、
n が 0 ~ 3 の整数、

Q が Q 1 ~ Q 6

Q1 : —C(=A³¹)—R⁵

Q2 : —C(=A³²)—OR⁶

Q3 : —C(=A³³)—SR⁷

Q4 : —C(=A³⁴)—NR⁸R⁹

40

Q5 : —S(O)₂—R¹⁰

Q6 : —S(O)₂—NR¹¹R¹²

(ここで、A³¹、A³² および A³³ が酸素原子、A³⁴ が酸素原子または硫黄原子、
R⁵ が、水素原子、

(1) ハロゲン原子、(2) C 1 - C 6 アルコキシ基、(3) C 1 - C 6 アルキルチオ基、
(4) C 1 - C 6 アルキルスルフィニル基、(5) C 1 - C 6 アルキルスルホニル基、
(6) C 2 - C 6 ジアルキルアミノ基および(7) C 3 - C 6 シクロアルキル基からなる
群より選ばれる 1 個または 2 個以上の独立した置換基で置換されていてもよい C 1 - C 6
アルキル基、

50

(1) ハロゲン原子および(2) C1 - C6 アルキル基からなる群より選ばれる1個または2個以上の独立した置換基で置換されていてもよいC3 - C6 シクロアルキル基、

(1) ハロゲン原子、(2) シアノ基、(3) ニトロ基、(4) ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6 アルキル基、(5) ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6 アルコキシ基、(6) ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6 アルキルチオ基、(7) ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6 アルキルスルフィニル基、(8) ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6 アルキルスルホニル基、(9) ハロゲン原子で置換されていてもよいC2 - C6 ジアルキルアミノ基および(10) ハロゲン原子で置換されていてもよいC2 - C6 アルコキシカルボニル基からなる群より選ばれる1 ~ 5 個の独立した基で置換されていてもよいフェニル基、

10

(1) ハロゲン原子、(2) シアノ基、(3) ニトロ基、(4) ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6 アルキル基および(5) ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6 アルコキシ基からなる群より選ばれる1個または2個以上の独立した置換基で置換されていてもよい5 - 6 員環ヘテロアリール基、または、

(1) ハロゲン原子および(2) C1 - C6 アルキル基からなる群より選ばれる1個または2個以上の独立した置換基で置換されていてもよい3 - 8 員非芳香ヘテロ環基、

R⁶が、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6 アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC2 - C6 アルケニル基、または、

(1) ハロゲン原子、(2) シアノ基、(3) ニトロ基、(4) ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6 アルキル基、(5) ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6 アルコキシ基、(6) ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6 アルキルチオ基、(7) ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6 アルキルスルフィニル基、(8) ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6 アルキルスルホニル基、(9) ハロゲン原子で置換されていてもよいC2 - C6 ジアルキルアミノ基および(10) ハロゲン原子で置換されていてもよいC2 - C6 アルコキシカルボニル基からなる群より選ばれる1 ~ 5 個の独立した置換基で置換されていてもよいフェニル基、

20

R⁷が、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6 アルキル基、

R⁸およびR⁹が、各々、独立して、水素原子、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6 アルキル基、または、

(1) ハロゲン原子、(2) シアノ基、(3) ニトロ基、(4) ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6 アルキル基、(5) ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6 アルコキシ基、(6) ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6 アルキルチオ基、(7) ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6 アルキルスルフィニル基、(8) ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6 アルキルスルホニル基、(9) ハロゲン原子で置換されていてもよいC2 - C6 ジアルキルアミノ基および(10) ハロゲン原子で置換されていてもよいC2 - C6 アルコキシカルボニル基からなる群より選ばれる1 ~ 5 個の独立した置換基で置換されていてもよいフェニル基、

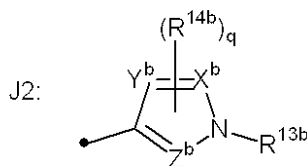
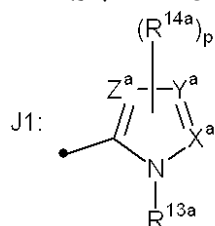
30

R¹⁰が、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6 アルキル基、

R¹¹およびR¹²が、各々、独立して、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6 アルキル基)で示される基、

40

Jが、J1またはJ2



(ここで、X^aがCHまたは窒素原子、Y^aがCH、Z^aがCHまたは窒素原子、X^bがCHまたは窒素原子、Y^bがCH、Z^bがCHまたは窒素原子、

R^{13a}が、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6 アルキル基、

50

(1) ハロゲン原子および(2) C1 - C6 アルキル基からなる群より選ばれる1個または2個以上の独立した置換基で置換されていてもよいC3 - C6 シクロアルキル基、

(1) ハロゲン原子、(2) シアノ基、(3) ニトロ基、(4) ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6 アルキル基、(5) ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6 アルコキシ基、(6) ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6 アルキルチオ基、(7) ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6 アルキルスルフィニル基および(8) ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6 アルキルスルホニル基からなる群より選ばれる1 ~ 5 個の独立した置換基で置換されていてもよいフェニル基、または、(1) ハロゲン原子、(2) シアノ基、(3) ニトロ基、(4) ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6 アルキル基および(5) ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6 アルコキシ基からなる群より選ばれる1個または2個以上の独立した置換基で置換されていてもよい5 - 6 員環ヘテロアリール基、

R^{13b} が、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6 アルキル基、

R^{14a} が、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6 アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6 アルキルチオ基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6 アルキルスルフィニル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6 アルキルスルホニル基、または、

(1) ハロゲン原子、(2) シアノ基、(3) ニトロ基、(4) ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6 アルキル基および(5) ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6 アルコキシ基からなる群より選ばれる1個 ~ 5 個の独立した置換基で置換されていてもよいフェニル基、

R^{14b} が、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6 アルキル基、または、

(1) ハロゲン原子、(2) シアノ基、(3) ニトロ基、(4) ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6 アルキル基および(5) ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6 アルコキシ基からなる群より選ばれる1個 ~ 5 個の独立した置換基で置換されていてもよいフェニル基、

p が0 ~ 2 の整数(但し、 p が2である場合には、2個の R^{14a} は、互いに同一でも異なってもよい。)、

q が1である。)で示される基、

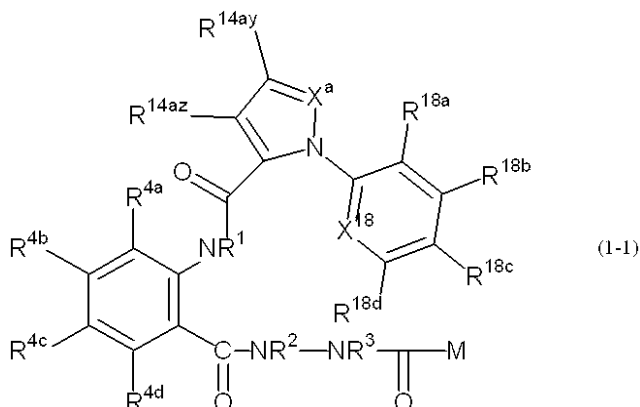
A^1 および A^2 が酸素原子

で示される「発明1」記載の化合物。

【0021】

「発明16」

式(1-1)



[式中、

R^1 が、水素原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6 アルキル基、

R^2 が、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6 アルキル基、

R^3 が、水素原子、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルキル基、または、 $C2 - C6$ アルコキシカルボニル基、

R^{4a} が、水素原子、ハロゲン原子、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルコキシ基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいフェニル基、

R^{4b} 、 R^{4c} および R^{4d} が、各々、独立して、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルキル基、または、

R^{4b} と R^{4c} とが末端で結合して、

$-CR^{41} = CR^{42} - CR^{43} = CR^{44} -$

(ここで、 R^{41} 、 R^{42} 、 R^{43} および R^{44} が水素原子である。) で示される基、

M が、 OR^6 、 SR^7 または NR^8R^9

(ここで、 R^6 および R^7 が、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C3 - C6$ アルコシアルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C2 - C6$ アルケニル基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C3 - C6$ アルキニル基、

R^8 および R^9 が、各々、独立して、水素原子、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C2 - C6$ アルケニル基、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C3 - C6$ アルキニル基、

または、 R^8 および R^9 と、結合している窒素原子とが一緒になって、ピロリジン - 1 - イル基、ピペリジノ基、ヘキサメチレンイミン - 1 - イル基、ヘプタメチレンイミン - 1 - イル基、モルホリノ基、チオモルホリン - 4 - イル基、または、4 - フェニルピペラジン - 1 - イル基を形成する。)、

X^a が、窒素原子または CR^{14ax}

(ここで、 R^{14ax} が、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルキルチオ基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルキルスルフィニル基である。)、

R^{14ay} が、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルキルチオ基、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルキルスルフィニル基、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルキルスルホニル基、または、フェニル基、

R^{14az} が、水素原子、

X^{18} が、窒素原子または CR^{18e}

(ここで、 R^{18e} が、水素原子またはハロゲン原子である。)、

R^{18a} 、 R^{18b} 、 R^{18c} および R^{18d} が、各々、独立して、水素原子またはハロゲン原子である。]

で示されるヒドラジド化合物。

【0022】

「発明17」

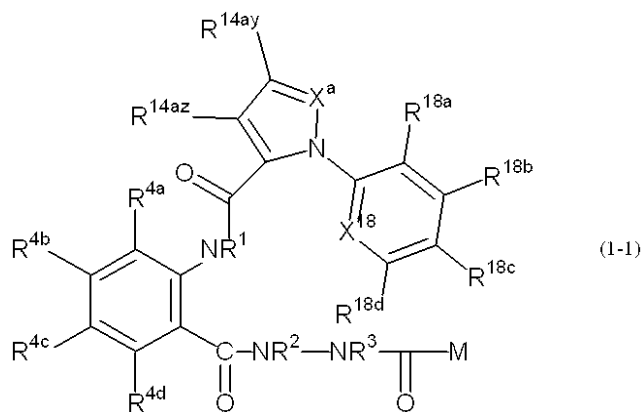
式(1-1)

10

20

30

40



10

【 0 0 2 3 】

〔 式中、

R^1 が、水素原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、

R^2 が、水素原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、

R^3 が、水素原子、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、または、C 2 - C 6 アルコキシカルボニル基、

R^{4a} が、水素原子、ハロゲン原子、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルコキシ基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいフェニル基、

20

R^{4b} 、 R^{4c} および R^{4d} が、各々、独立して、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、または、

R^{4b} と R^{4c} とが末端で結合し、

- C R^{41} = C R^{42} - C R^{43} = C R^{44} -

(ここで、 R^{41} 、 R^{42} 、 R^{43} および R^{44} が水素原子である。) で示される基、

M が、水素原子、

X^a が、窒素原子または C R^{14ax}

(ここで、 R^{14ax} が、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルコキシ基、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキルチオ基、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキルスルフィニル基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキルスルホニル基である。)、

30

R^{14ay} が、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキルチオ基、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキルスルフィニル基、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキルスルホニル基、または、フェニル基、

R^{14az} が、水素原子、

X^{18} が、窒素原子または C R^{18e}

40

(ここで、 R^{18e} が、水素原子またはハロゲン原子である。)、

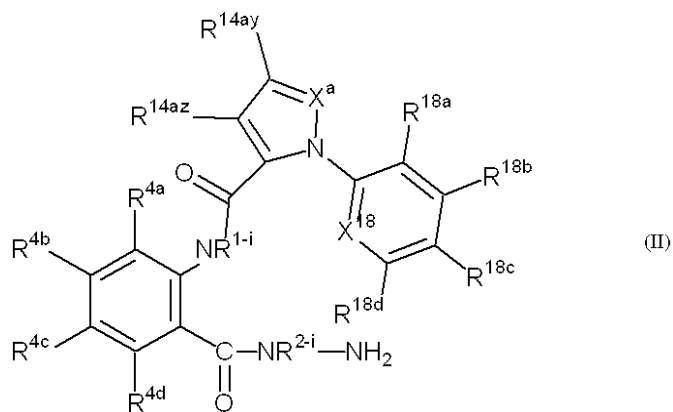
R^{18a} 、 R^{18b} 、 R^{18c} および R^{18d} が、各々、独立して、水素原子またはハロゲン原子である。]

で示されるヒドラジド化合物。

【 0 0 2 4 】

「 発 明 1 8 」

式 (I I)



10

〔式中、

R^{1-i} は、水素原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基を表し、

R^{2-i} は、水素原子またはメチル基を表し、

R^{4a} は、ハロゲン原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基を表し、

R^{4b} 、 R^{4c} および R^{4d} は、各々、独立して、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、

または、 R^{4b} と R^{4c} とが末端で結合して、

T 1 : $-CR^{41} = CR^{42} - CR^{43} = CR^{44} -$

(ここで、 R^{41} 、 R^{42} 、 R^{43} および R^{44} は、各々、独立して、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基である。) で示される基を表し、

X^a は、窒素原子または CR^{14ax}

(ここで、 R^{14ax} は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルコキシ基、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキルチオ基、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキルスルフィニル基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキルスルホニル基を表す。) を表し、

R^{14ay} および R^{14az} は、各々、独立して、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルコキシ基、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキルチオ基、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキルスルフィニル基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキルスルホニル基を表し、

X^{18} は、窒素原子または CR^{18e}

(ここで、 R^{18e} は、水素原子、ハロゲン原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基を表す。) を表し、

R^{18a} は、ハロゲン原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基を表し、

R^{18b} 、 R^{18c} 、および R^{18d} は、各々、独立して、水素原子、ハロゲン原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基を表す。]

で示されるヒドラジド化合物。

【0025】

「発明19」

R^{2-i} が、メチル基である「発明18」に記載される化合物。

【0026】

「発明20」

「発明1」～「発明17」のいずれか1つに記載される化合物を有効成分として含有す

50

る農薬組成物。

【0027】

「発明21」

「発明1」～「発明17」のいずれか1つに記載される化合物またはその塩の農薬としての使用。

【0028】

「発明22」

有害生物を防除するための「発明1」～「発明17」のいずれか1つに記載される化合物を活性成分として含む農薬組成物。

【0029】

「発明23」

有害生物を防除するための農薬の製造のための、「発明1」～「発明17」のいずれか1つに記載される化合物の使用。

【0030】

「発明24」

「発明1」～「発明17」のいずれか1つに記載される化合物を有害生物に直接、または有害生物の生息場所に施用することを特徴とする有害生物の防除方法。

を提供するものである。

【発明の効果】

【0031】

本発明化合物は有害生物に対して優れた防除効力を有することから、有害生物防除剤の有効成分として有用である。

【発明を実施するための最良の形態】

【0032】

本明細書において、 R^{14a} は、J1で示される基の環を構成するCHの水素原子が置き換わり得る基を示し、 R^{14b} は、J2で示される基の環を構成するCHの水素原子が置き換わり得る基を示す。

【0033】

本発明において、ハロゲン原子としては、例えば、フッ素原子、塩素原子、臭素原子およびヨウ素原子が挙げられる。

【0034】

R^1 、 R^2 および R^3 における、

【0035】

「ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキル基」としては、例えば、メチル基、エチル基、2,2,2-トリフルオロエチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、sec-ブチル基、tert-ブチル基、ペンチル基およびヘキシル基が挙げられる。

【0036】

R^1 における、

【0037】

「C2 - C6シアノアルキル基」としては、例えば、シアノメチル基および2-シアノエチル基が挙げられ、

【0038】

「ハロゲン原子で置換されていてもよいC2 - C6アルコキシアルキル基」としては、例えば、2-メトキシエチル基、2-エトキシエチル基および2-イソプロピルオキシエチル基が挙げられ、

【0039】

「ハロゲン原子で置換されていてもよいC2 - C6アルケニル基」としては、例えば、2-プロペニル基、3-クロロ-2-プロペニル基、2-クロロ-2-プロペニル基、3,3-ジクロロ-2-プロペニル基、2-ブテニル基、3-ブテニル基、2-メチル-2

10

20

30

40

50

- プロペニル基、3 - メチル - 2 - ブテニル基、2 - ペンテニル基および2 - ヘキセニル基が挙げられ、

【0040】

「ハロゲン原子で置換されていてもよいC3 - C6アルキニル基」としては、例えば、2 - プロピニル基、3 - クロロ - 2 - プロピニル基、3 - ブロモ - 2 - プロピニル基、2 - ブチニル基および3 - ブチニル基が挙げられ、

【0041】

「ベンゼン環部分が(1)ハロゲン原子、(2)シアノ基、(3)ニトロ基、(4)ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキル基および(5)ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルコキシ基からなる群より選ばれる1 ~ 5個の独立した基で置換されていてもよいC7 - C9フェニルアルキル基」としては、例えば、ベンジル基、1 - フェニルエチル基、2 - フェニルエチル基、2 - クロロベンジル基、3 - クロロベンジル基、4 - クロロベンジル基、2 - シアノベンジル基、3 - シアノベンジル基、4 - シアノベンジル基、2 - ニトロベンジル基、3 - ニトロベンジル基、4 - ニトロベンジル基、2 - メチルベンジル基、3 - メチルベンジル基、4 - メチルベンジル基、2 - (トリフルオロメチル)ベンジル基、3 - (トリフルオロメチル)ベンジル基、4 - (トリフルオロメチル)ベンジル基、2 - メトキシベンジル基、3 - メトキシベンジル基および4 - メトキシベンジル基が挙げられる。

【0042】

R²およびR³における、

【0043】

「C1 - C6アシル基」としては、例えば、ホルミル基、アセチル基、プロピオニル基、イソブチリル基およびトリメチルアセチル基が挙げられ、

【0044】

「C2 - C6アルコキシカルボニル基」としては、例えば、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、イソプロポキシカルボニル基およびtert - ブトキシカルボニル基が挙げられ、

【0045】

「C3 - C7N, N - ジアルキルカルバモイル基」としては、例えば、N, N - ジメチルカルバモイル基およびN, N - ジエチルカルバモイル基が挙げられ、

【0046】

「(1)ハロゲン原子、(2)シアノ基、(3)ニトロ基、(4)ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキル基および(5)ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキル基からなる群より選ばれる1 ~ 5個の独立した基で置換されていてもよいフェニル基」としては、例えば、フェニル基、2 - クロロフェニル基、3 - クロロフェニル基、4 - クロロフェニル基、2 - シアノフェニル基、3 - シアノフェニル基、4 - シアノフェニル基、2 - ニトロフェニル基、3 - ニトロフェニル基、4 - ニトロフェニル基、2 - メチルフェニル基、3 - メチルフェニル基、4 - メチルフェニル基、2 - (トリフルオロメチル)フェニル基、3 - (トリフルオロメチル)フェニル基および4 - (トリフルオロメチル)フェニル基が挙げられる。

【0047】

R⁴、R⁴¹、R⁴²、R⁴³およびR⁴⁴における、

【0048】

「ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキル基」としては、例えば、メチル基、トリフルオロメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、sec - ブチル基、tert - ブチル基、ペンチル基およびヘキシル基が挙げられる。

【0049】

R⁴、R⁴¹、R⁴²、R⁴³およびR⁴⁴における、

【0050】

10

20

30

40

50

「ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルコキシ基」としては、例えば、メトキシ基、トリフルオロメトキシ基、エトキシ基、2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ基、プロピルオキシ基、イソプロピルオキシ基、ブトキシ基、イソブチルオキシ基、sec - ブトキシ基、tert - ブトキシ基、ペンチルオキシ基およびヘキシルオキシ基が挙げられる。

【0051】

R^4 、 R^{41} 、 R^{42} 、 R^{43} および R^{44} における、

【0052】

「ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキルチオ基」としては、例えば、メチルチオ基、トリフルオロメチルチオ基およびエチルチオ基が挙げられる。

10

【0053】

R^4 、 R^{41} 、 R^{42} 、 R^{43} および R^{44} における、

【0054】

「ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキルスルフィニル基」としては、例えば、メチルスルフィニル基、トリフルオロメチルスルフィニル基およびエチルスルフィニル基が挙げられる。

【0055】

R^4 、 R^{41} 、 R^{42} 、 R^{43} および R^{44} における、

【0056】

「ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキルスルホニル基」としては、例えば、メチルスルホニル基、トリフルオロメチルスルホニル基およびエチルスルホニル基が挙げられる。

20

【0057】

R^4 における、

【0058】

「ハロゲン原子で置換されていてもよいフェニル基」としては、例えば、フェニル基、2 - クロロフェニル基、3 - クロロフェニル基および4 - クロロフェニル基が挙げられる。

【0059】

R^{45} および R^{46} における、

30

【0060】

「ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基」としては、例えば、メチル基、トリフルオロメチル基、エチル基が挙げられる。

【0061】

R^5 における、

【0062】

「ハロゲン原子で置換されていてもよいC 2 - C 6 アルケニル基」としては、例えば、ビニル基、1 - プロペニル基、2 - プロペニル基、1 - メチルビニル基、2 - クロロビニル基および2 - メチル - 1 - プロペニル基が挙げられ、

【0063】

「ハロゲン原子で置換されていてもよいC 2 - C 6 アルキニル基」としては、例えば、エチニル基が挙げられ、

40

【0064】

「(1) ハロゲン原子、(2) C 1 - C 6 アルコキシ基、(3) C 1 - C 6 アルキルチオ基、(4) C 1 - C 6 アルキルスルフィニル基、(5) C 1 - C 6 アルキルスルホニル基、(6) C 2 - C 6 ジアルキルアミノ基および(7) C 3 - C 6 シクロアルキル基からなる群より選ばれる1個または2個以上の独立した置換基で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基」としては、例えば、メチル基、トリフルオロメチル基、トリクロロメチル基、クロロメチル基、ジクロロメチル基、フルオロメチル基、ジフルオロメチル基、メトキシメチル基、エトキシメチル基、メチルチオメチル基、エチルチオメチル基、メチル

50

スルフィニルメチル基、メチルスルホニルメチル基、ジメチルアミノメチル基、シクロプロピルメチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、エチル基、ペンタフルオロエチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、*sec*-ブチル基、*tert*-ブチル基、ペンチル基およびヘキシル基が挙げられ、

【0065】

「(1)ハロゲン原子および(2)C1-C6アルキル基からなる群より選ばれる1個または2個以上の独立した置換基で置換されていてもよいC3-C6シクロアルキル基」としては、例えば、シクロプロピル基、2-メチルシクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基およびシクロヘキシル基が挙げられ、

【0066】

「(1)ハロゲン原子、(2)シアノ基、(3)ニトロ基、(4)ハロゲン原子で置換されていてもよいC1-C6アルキル基、(5)ハロゲン原子で置換されていてもよいC1-C6アルコキシ基、(6)ハロゲン原子で置換されていてもよいC1-C6アルキルチオ基、(7)ハロゲン原子で置換されていてもよいC1-C6アルキルスルフィニル基、(8)ハロゲン原子で置換されていてもよいC1-C6アルキルスルホニル基、(9)ハロゲン原子で置換されていてもよいC2-C6ジアルキルアミノ基および(10)ハロゲン原子で置換されていてもよいC2-C6アルコキシカルボニル基からなる群より選ばれる1~5個の独立した置換基で置換されていてもよいフェニル基」としては、例えば、フェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、4-フルオロフェニル基、4-ブromoフェニル基、4-ヨードフェニル基、2-シアノフェニル基、3-シアノフェニル基、4-シアノフェニル基、2-ニトロフェニル基、3-ニトロフェニル基、4-ニトロフェニル基、2-メチルフェニル基、3-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-(トリフルオロメチル)フェニル基、3-(トリフルオロメチル)フェニル基、4-(トリフルオロメチル)フェニル基、2-メトキシフェニル基、3-メトキシフェニル基、4-メトキシフェニル基、4-(トリフルオロメトキシ)フェニル基、4-(メチルチオ)フェニル基、4-(メチルスルフィニル)フェニル基、4-(メチルスルホニル)フェニル基および4-(メトキシカルボニル)フェニル基が挙げられ、

【0067】

「(1)ハロゲン原子、(2)シアノ基、(3)ニトロ基、(4)ハロゲン原子で置換されていてもよいC1-C6アルキル基および(5)ハロゲン原子で置換されていてもよいC1-C6アルコキシ基からなる群より選ばれる1~9個の独立した置換基で置換されていてもよいナフチル基」としては、例えば、1-ナフチル基および2-ナフチル基が挙げられ、

【0068】

「(1)ハロゲン原子、(2)シアノ基、(3)ニトロ基、(4)ハロゲン原子で置換されていてもよいC1-C6アルキル基および(5)ハロゲン原子で置換されていてもよいC1-C6アルコキシ基からなる群より選ばれる1個または2個以上の独立した置換基で置換されていてもよい5-6員環ヘテロアリール基」としては、例えば、1-メチル-2-ピロリル基、2-フリル基、3-フリル基、5-ブromo-2-フリル基、5-ニトロ-2-フリル基、2-メチル-3-フリル基、2,5-ジメチル-3-フリル基、2,4-ジメチル-3-フリル基、2-チエニル基、3-チエニル基、5-メチル-2-チエニル基、3-メチル-2-チエニル基、1-メチル-3-トリフルオロメチル-5-ピラゾリル基、5-クロロ-1,3-ジメチル-4-ピラゾリル基、2-ピリジニル基、3-ピリジニル基、4-ピリジニル基、2-メチル-3-ピリジニル基、6-メチル-3-ピリジニル基、2-クロロ-3-ピリジニル基、6-クロロ-3-ピリジニル基およびピラジニル基が挙げられ、

【0069】

「(1)ハロゲン原子および(2)C1-C6アルキル基からなる群より選ばれる1個または2個以上の独立した置換基で置換されていてもよいC3-C8員非芳香ヘテロ環基

10

20

30

40

50

」としては、例えば、テトラヒドロ - 2 - フリル基、テトラヒドロ - 3 - フリル基、モルホリノ基が挙げられ、

【 0 0 7 0 】

「ベンゼン環部分が、(1) ハロゲン原子、(2) シアノ基、(3) ニトロ基、(4) ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基および (5) ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルコキシ基からなる群より選ばれる 1 ~ 5 個の独立した置換基で置換されていてもよい C 7 - C 9 フェニルアルキル基」としては、例えば、ベンジル基、1 - フェニルエチル基、2 - フェニルエチル基、2 - クロロベンジル基、3 - クロロベンジル基、4 - クロロベンジル基、2 - シアノベンジル基、3 - シアノベンジル基、4 - シアノベンジル基、2 - ニトロベンジル基、3 - ニトロベンジル基、4 - ニトロベンジル基、2 - メチルベンジル基、3 - メチルベンジル基、4 - メチルベンジル基、2 - (トリフルオロメチル)ベンジル基、3 - (トリフルオロメチル)ベンジル基、4 - (トリフルオロメチル)ベンジル基、2 - メトキシベンジル基、3 - メトキシベンジル基および 4 - メトキシベンジル基が挙げられ、

【 0 0 7 1 】

「ベンゼン環部分が、(1) ハロゲン原子、(2) シアノ基、(3) ニトロ基、(4) ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基および (5) ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルコキシ基からなる群より選ばれる 1 ~ 5 個の独立した置換基で置換されていてもよい C 7 - C 9 フェノキシアルキル基」としては、例えば、フェノキシメチル基、2 - フェノキシエチル基および 1 - フェノキシエチル基が挙げられる。

【 0 0 7 2 】

R⁶および R⁷における、

【 0 0 7 3 】

「ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基」としては、例えば、メチル基、エチル基、2, 2, 2 - トリフルオロエチル基、2, 2, 2 - トリクロロエチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、sec - ブチル基、tert - ブチル基、ペンチル基およびヘキシル基が挙げられ、

【 0 0 7 4 】

「ハロゲン原子で置換されていてもよい C 3 - C 6 アルコキシアルキル基」としては、例えば、2 - メトキシエチル基、2 - エトキシエチル基および 2 - イソプロピルオキシエチル基が挙げられ、

【 0 0 7 5 】

「ハロゲン原子で置換されていてもよい C 2 - C 6 アルケニル基」としては、例えば、1 - プロペニル基、2 - プロペニル基、3 - クロロ - 2 - プロペニル基、2 - クロロ - 2 - プロペニル基、3, 3 - ジクロロ - 2 - プロペニル基、2 - ブテニル基、3 - ブテニル基、2 - メチル - 2 - プロペニル基、3 - メチル - 2 - ブテニル基、2 - ペンテニル基および 2 - ヘキセニル基が挙げられ、

【 0 0 7 6 】

「ハロゲン原子で置換されていてもよい C 3 - C 6 アルキニル基」としては、例えば、2 - プロピニル基、3 - クロロ - 2 - プロピニル基、3 - ブロモ - 2 - プロピニル基、2 - ブチニル基および 3 - ブチニル基が挙げられ、

【 0 0 7 7 】

「(1) ハロゲン原子および (2) C 1 - C 6 アルキル基からなる群より選ばれる 1 個または 2 個以上の独立した置換基で置換されていてもよい C 3 - C 6 シクロアルキル基」としては、例えば、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基およびシクロヘキシル基が挙げられ、

【 0 0 7 8 】

「(1) ハロゲン原子、(2) シアノ基、(3) ニトロ基、(4) ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、(5) ハロゲン原子で置換されていてもよい C

10

20

30

40

50

1 - C 6 アルコキシ基、(6) ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキルチオ基、(7) ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキルスルフィニル基、(8) ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキルスルホニル基、(9) ハロゲン原子で置換されていてもよい C 2 - C 6 ジアルキルアミノ基および(10) ハロゲン原子で置換されていてもよい C 2 - C 6 アルコキシカルボニル基からなる群より選ばれる 1 ~ 5 個の独立した置換基で置換されていてもよいフェニル基」としては、例えば、フェニル基、2 - クロロフェニル基、3 - クロロフェニル基、4 - クロロフェニル基、4 - フルオロフェニル基、4 - ブロモフェニル基、4 - ヨードフェニル基、2 - シアノフェニル基、3 - シアノフェニル基、4 - シアノフェニル基、2 - ニトロフェニル基、3 - ニトロフェニル基、4 - ニトロフェニル基、2 - メチルフェニル基、3 - メチルフェニル基、4 - メチルフェニル基、2 - (トリフルオロメチル)フェニル基、3 - (トリフルオロメチル)フェニル基、4 - (トリフルオロメチル)フェニル基、2 - メトキシフェニル基、3 - メトキシフェニル基、4 - メトキシフェニル基、4 - (トリフルオロメトキシ)フェニル基、4 - (メチルチオ)フェニル基、4 - (メチルスルフィニル)フェニル基、4 - (メチルスルホニル)フェニル基および 4 - (メトキシカルボニル)フェニル基が挙げられ、

【 0 0 7 9 】

「(1) ハロゲン原子、(2) シアノ基、(3) ニトロ基、(4) ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基および(5) ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルコキシ基からなる群より選ばれる 1 ~ 5 個の独立した置換基で置換されていてもよい 5 - 6 員環ヘテロアリール基」としては、例えば、2 - ピリジニル基が挙げられ、

【 0 0 8 0 】

「ベンゼン環部分が、(1) ハロゲン原子、(2) シアノ基、(3) ニトロ基、(4) ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基および(5) ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルコキシ基からなる群より選ばれる 1 ~ 5 個の独立した置換基で置換されていてもよい C 7 - C 9 フェニルアルキル基」としては、例えば、ベンジル基、1 - フェニルエチル基、2 - フェニルエチル基、2 - クロロベンジル基、3 - クロロベンジル基、4 - クロロベンジル基、2 - シアノベンジル基、3 - シアノベンジル基、4 - シアノベンジル基、2 - ニトロベンジル基、3 - ニトロベンジル基、4 - ニトロベンジル基、2 - メチルベンジル基、3 - メチルベンジル基、4 - メチルベンジル基、2 - (トリフルオロメチル)ベンジル基、3 - (トリフルオロメチル)ベンジル基、4 - (トリフルオロメチル)ベンジル基、2 - メトキシベンジル基、3 - メトキシベンジル基および 4 - メトキシベンジル基が挙げられる。

【 0 0 8 1 】

R⁸および R⁹における、

【 0 0 8 2 】

「ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基」としては、例えば、メチル基、エチル基、2, 2, 2 - トリフルオロエチル基、2, 2, 2 - トリクロロエチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、sec - ブチル基、tert - ブチル基、ペンチル基およびヘキシル基が挙げられ、

【 0 0 8 3 】

「ハロゲン原子で置換されていてもよい C 2 - C 6 アルコキシアルキル基」としては、例えば、2 - メトキシエチル基、2 - エトキシエチル基および 2 - イソプロピルオキシエチル基が挙げられ、

【 0 0 8 4 】

「ハロゲン原子で置換されていてもよい C 2 - C 6 アルケニル基」としては、例えば、2 - プロペニル基、3 - クロロ - 2 - プロペニル基、2 - クロロ - 2 - プロペニル基、3, 3 - ジクロロ - 2 - プロペニル基、2 - ブテニル基、3 - ブテニル基、2 - メチル - 2 - プロペニル基、3 - メチル - 2 - ブテニル基、2 - ペンテニル基および 2 - ヘキセニル

10

20

30

40

50

基が挙げられ、

【0085】

「ハロゲン原子で置換されていてもよいC3 - C6アルキニル基」としては、例えば、2 - プロピニル基、3 - クロロ - 2 - プロピニル基、3 - ブロモ - 2 - プロピニル基、2 - ブチニル基および3 - ブチニル基が挙げられ、

【0086】

「(1)ハロゲン原子および(2)C1 - C6アルキル基からなる群より選ばれる1個または2個以上の独立した置換基で置換されていてもよいC3 - C6シクロアルキル基」としては、例えば、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基およびシクロヘキシル基が挙げられ、

【0087】

「(1)ハロゲン原子、(2)シアノ基、(3)ニトロ基、(4)ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキル基、(5)ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルコキシ基、(6)ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキルチオ基、(7)ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキルスルフィニル基、(8)ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキルスルホニル基、(9)ハロゲン原子で置換されていてもよいC2 - C6ジアルキルアミノ基および(10)ハロゲン原子で置換されていてもよいC2 - C6アルコキシカルボニル基からなる群より選ばれる1 ~ 5個の独立した置換基で置換されていてもよいフェニル基」としては、例えば、フェニル基、2 - クロロフェニル基、3 - クロロフェニル基、4 - クロロフェニル基、4 - フルオロフェニル基、4 - ブロモフェニル基、4 - ヨードフェニル基、2 - シアノフェニル基、3 - シアノフェニル基、4 - シアノフェニル基、2 - ニトロフェニル基、3 - ニトロフェニル基、4 - ニトロフェニル基、2 - メチルフェニル基、3 - メチルフェニル基、4 - メチルフェニル基、2 - (トリフルオロメチル)フェニル基、3 - (トリフルオロメチル)フェニル基、4 - (トリフルオロメチル)フェニル基、2 - メトキシフェニル基、3 - メトキシフェニル基、4 - メトキシフェニル基、4 - (トリフルオロメトキシ)フェニル基、4 - (メチルチオ)フェニル基、4 - (メチルスルフィニル)フェニル基、4 - (メチルスルホニル)フェニル基および4 - (メトキシカルボニル)フェニル基が挙げられ、

【0088】

「(1)ハロゲン原子、(2)シアノ基、(3)ニトロ基、(4)ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキル基および(5)ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルコキシ基からなる群より選ばれる1 ~ 5個の独立した置換基で置換されていてもよい5 - 6員環ヘテロアリール基」としては、例えば、3 - ピリジニル基が挙げられ、

【0089】

「ベンゼン環部分が、(1)ハロゲン原子、(2)シアノ基、(3)ニトロ基、(4)ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキル基および(5)ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルコキシ基からなる群より選ばれる1 ~ 5個の独立した置換基で置換されていてもよいC7 - C9フェニルアルキル基」としては、例えば、ベンジル基、1 - フェニルエチル基、2 - フェニルエチル基、2 - クロロベンジル基、3 - クロロベンジル基、4 - クロロベンジル基、2 - シアノベンジル基、3 - シアノベンジル基、4 - シアノベンジル基、2 - ニトロベンジル基、3 - ニトロベンジル基、4 - ニトロベンジル基、2 - メチルベンジル基、3 - メチルベンジル基、4 - メチルベンジル基、2 - (トリフルオロメチル)ベンジル基、3 - (トリフルオロメチル)ベンジル基、4 - (トリフルオロメチル)ベンジル基、2 - メトキシベンジル基、3 - メトキシベンジル基および4 - メトキシベンジル基が挙げられ、

【0090】

「R⁸およびR⁹が結合している窒素原子と一緒にあって、3 - 8員非芳香ヘテロ環基を形成する場合の該3 - 8員環の非芳香ヘテロ環基」としては、例えば、ピロリジン - 1 -

10

20

30

40

50

イル基、ピペリジノ基、3, 5 - ジメチルピペリジノ基、ヘキサメチレンイミン - 1 - イル基、ヘプタメチレンイミン - 1 - イル基、モルホリノ基、2, 6 - ジメチルモルホリノ基、チオモルホリン - 4 - イル基、4 - メチルピペラジン - 1 - イル基、4 - (エトキシカルボニル) ピペラジン - 1 - イル基および4 - フェニルピペラジン - 1 - イル基が挙げられる。

【0091】

R¹⁰における、

【0092】

「ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基」としては、例えば、メチル基、トリフルオロメチル基、トリクロロメチル基、エチル基、2 - クロロエチル基、2, 2, 2 - トリフルオロエチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、sec - ブチル基、tert - ブチル基、ペンチル基およびヘキシル基が挙げられ、

10

【0093】

「(1) ハロゲン原子および(2) ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基からなる群より選ばれる1個または2個以上の独立した置換基で置換されていてもよいC 3 - C 6 シクロアルキル基」としては、例えば、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基およびシクロヘキシル基が挙げられ、

【0094】

「(1) ハロゲン原子、(2) シアノ基、(3) ニトロ基、(4) ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基および(5) ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルコキシ基からなる群より選ばれる1 ~ 5 個の独立した置換基で置換されていてもよいフェニル基」としては、例えば、フェニル基、4 - クロロフェニル基、4 - ニトロフェニル基および4 - メチルフェニル基が挙げられる。

20

【0095】

R¹¹およびR¹²における、

【0096】

「ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基」としては、例えば、メチル基、エチル基、2, 2, 2 - トリフルオロエチル基、2, 2, 2 - トリクロロエチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、sec - ブチル基、tert - ブチル基、ペンチル基およびヘキシル基が挙げられ、

30

【0097】

「(1) ハロゲン原子および(2) ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基からなる群より選ばれる1個または2個以上の独立した置換基で置換されていてもよいC 3 - C 6 シクロアルキル基」としては、例えば、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基およびシクロヘキシル基が挙げられ、

【0098】

「(1) ハロゲン原子、(2) シアノ基、(3) ニトロ基、(4) ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基および(5) ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルコキシ基からなる群より選ばれる1 ~ 5 個の独立した基で置換されていてもよいフェニル基」としては、例えば、フェニル基および4 - メチルフェニル基が挙げられ、

40

【0099】

「R¹¹およびR¹²が結合している窒素原子と一緒にあって、3 - 8 員非芳香ヘテロ環基を形成する場合の該3 - 8 員環の非芳香ヘテロ環基」としては、例えば、ピロリジン - 1 - イル基、ピペリジノ基、3, 5 - ジメチルピペリジノ基、モルホリノ基、2, 6 - ジメチルモルホリノ基、チオモルホリン - 4 - イル基および4 - メチルピペラジン - 1 - イル基、4 - (エトキシカルボニル) ピペラジン - 1 - イル基および4 - フェニルピペラジン - 1 - イル基が挙げられる。

【0100】

50

R^{13a}およびR^{13b}における、

【0101】

「ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキル基」としては、例えば、メチル基、フルオロメチル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、エチル基、2, 2, 2 - トリフルオロエチル基、1, 1, 2, 2 - テトラフルオロエチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、sec - ブチル基、tert - ブチル基、ペンチル基およびヘキシル基が挙げられ、

【0102】

「C2 - C6シアノアルキル基」としては、例えば、シアノメチル基および2 - シアノエチル基が挙げられ、

【0103】

「ハロゲン原子で置換されていてもよいC2 - C6アルコキシアルキル基」としては、例えば、メトキシメチル基、エトキシメチル基、2 - メトキシエチル基、2 - エトキシエチル基および2 - イソプロピルオキシエチル基が挙げられ、

【0104】

「ハロゲン原子で置換されていてもよいC2 - C6アルケニル基」としては、例えば、2 - プロペニル基、3 - クロロ - 2 - プロペニル基、2 - クロロ - 2 - プロペニル基、3, 3 - ジクロロ - 2 - プロペニル基、2 - ブテニル基、3 - ブテニル基、2 - メチル - 2 - プロペニル基、3 - メチル - 2 - ブテニル基、2 - ペンテニル基および2 - ヘキセニル基が挙げられ、

【0105】

「ハロゲン原子で置換されていてもよいC2 - C6アルキニル基」としては、例えば、2 - プロピニル基、3 - クロロ - 2 - プロピニル基、3 - プロモ - 2 - プロピニル基、2 - ブチニル基および3 - ブチニル基が挙げられ、

【0106】

「(1) ハロゲン原子および(2) C1 - C6アルキル基からなる群より選ばれる1個または2個以上の独立した置換基で置換されていてもよいC3 - C6シクロアルキル基」としては、例えば、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基およびシクロヘキシル基が挙げられ、

【0107】

「(1) ハロゲン原子、(2) シアノ基、(3) ニトロ基、(4) ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキル基、(5) ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルコキシ基、(6) ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキルチオ基、(7) ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキルスルフィニル基および(8) ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキルスルホニル基からなる群より選ばれる1 ~ 5個の独立した置換基で置換されていてもよいフェニル基」としては、例えば、フェニル基、2 - フルオロフェニル基、3 - フルオロフェニル基、4 - フルオロフェニル基、2 - クロロフェニル基、3 - クロロフェニル基、4 - クロロフェニル基、2 - ブロモフェニル基、2 - ヨードフェニル基、2, 6 - ジフルオロフェニル基、2, 6 - ジクロロフェニル基、2 - クロロ - 6 - フルオロフェニル基、2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル基、2 - シアノフェニル基、3 - シアノフェニル基、4 - シアノフェニル基、2 - ニトロフェニル基、3 - ニトロフェニル基、4 - ニトロフェニル基、2 - メチルフェニル基、3 - メチルフェニル基、4 - メチルフェニル基、2 - エチルフェニル基、2 - イソプロピルフェニル基、2 - tert - ブチルフェニル基、2 - (トリフルオロメチル)フェニル基、3 - (トリフルオロメチル)フェニル基、4 - (トリフルオロメチル)フェニル基、2 - メトキシフェニル基、3 - メトキシフェニル基、4 - メトキシフェニル基、2 - エトキシフェニル基、2 - (トリフルオロメトキシ)フェニル基、2 - (メチルチオ)フェニル基、2 - (メチルスルフィニル)フェニル基および2 - (メチルスルホニル)フェニル基が挙げられ、

【0108】

10

20

30

40

50

「(1)ハロゲン原子、(2)シアノ基、(3)ニトロ基、(4)ハロゲン原子で置換されていてもよいC1-C6アルキル基および(5)ハロゲン原子で置換されていてもよいC1-C6アルコキシ基からなる群より選ばれる1個または2個以上の独立した置換基で置換されていてもよい5-6員環ヘテロアリール基」としては、例えば、2-ピリジニル基、3-フルオロ-2-ピリジニル基、3-クロロ-2-ピリジニル基、3-プロモ-2-ピリジニル基、3-ヨード-2-ピリジニル基、3-メチル-2-ピリジニル基、3-トリフルオロメチル-2-ピリジニル基、3-メトキシ-2-ピリジニル基、3-シアノ-2-ピリジニル基、3-ニトロ-2-ピリジニル基、3-ピリジニル基、2-クロロ-3-ピリジニル基、4-クロロ-3-ピリジニル基、4-ピリジニル基、3-クロロ-4-ピリジニル基、3,5-ジクロロ-4-ピリジニル基、2-ピリミジニル基、4-メチル-2-ピリミジニル基、4,6-ジメチル-2-ピリミジニル基、4-ピリミジニル基、5-クロロ-4-ピリミジニル基、ピラジニル基、3-メチル-2-ピラジニル基、2-チアゾリル基、1-メチル-5-ピラゾリル基、4-クロロ-1-メチル-5-ピラゾリル基、4-クロロ-1,3-ジメチル-5-ピラゾリル基および4-クロロ-5-メチル-3-イソキサゾリル基が挙げられ、

【0109】

「ベンゼン環部分が、(1)ハロゲン原子、(2)シアノ基、(3)ニトロ基、(4)ハロゲン原子で置換されていてもよいC1-C6アルキル基および(5)ハロゲン原子で置換されていてもよいC1-C6アルコキシ基からなる群より選ばれる1個または2個以上の独立した置換基で置換されていてもよいC7-C9フェニルアルキル基」としては、例えば、ベンジル基、1-フェニルエチル基、2-フェニルエチル基、2-クロロベンジル基、3-クロロベンジル基、4-クロロベンジル基、2-シアノベンジル基、3-シアノベンジル基、4-シアノベンジル基、2-ニトロベンジル基、3-ニトロベンジル基、4-ニトロベンジル基、2-メチルベンジル基、3-メチルベンジル基、4-メチルベンジル基、2-(トリフルオロメチル)ベンジル基、3-(トリフルオロメチル)ベンジル基、4-(トリフルオロメチル)ベンジル基、2-メトキシベンジル基、3-メトキシベンジル基および4-メトキシベンジル基が挙げられ、

【0110】

「ピリジン環部分が、(1)ハロゲン原子、(2)シアノ基、(3)ニトロ基、(4)ハロゲン原子で置換されていてもよいC1-C6アルキル基および(5)ハロゲン原子で置換されていてもよいC1-C6アルコキシ基からなる群より選ばれる1個または2個以上の独立した置換基で置換されていてもよいC7-C9ピリジニルアルキル基」としては、例えば、2-ピリジニルメチル基、3-ピリジニルメチル基、4-ピリジニルメチル基、3-クロロ-2-ピリジニルメチル基および2-クロロ-3-ピリジニルメチル基が挙げられる。

【0111】

R^{14a}およびR^{14b}における、

【0112】

「ハロゲン原子で置換されていてもよいC1-C6アルキル基」としては、例えば、メチル基、トリフルオロメチル基、トリクロロメチル基、クロロメチル基、ジクロロメチル基、フルオロメチル基、ジフルオロメチル基、エチル基、ペンタフルオロエチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、sec-ブチル基、tert-ブチル基、ペンチル基およびヘキシル基が挙げられ、

【0113】

「ハロゲン原子で置換されていてもよいC1-C6アルコキシ基」としては、例えば、メトキシ基、エトキシ基、2,2,2-トリフルオロエトキシ基、プロポキシ基、イソプロポキシ基、ブトキシ基、イソブチルオキシ基、sec-ブトキシ基およびtert-ブトキシ基が挙げられ、

【0114】

「C2-C6シアノアルキルオキシ基」としては、例えば、シアノメトキシ基および2

10

20

30

40

50

- シアノエトキシ基が挙げられ、

【0115】

「ハロゲン原子で置換されていてもよいC3 - C6アルコキシアルキルオキシ基」としては、例えば、2 - (メトキシ)エトキシ基が挙げられ、

【0116】

「ハロゲン原子で置換されていてもよいC3 - C6アルケニルオキシ基」としては、例えば、2 - プロペニルオキシ基および2 - メチル - 2 - プロペニルオキシ基が挙げられ、

【0117】

「ハロゲン原子で置換されていてもよいC3 - C6アルキニルオキシ基」としては、例えば、2 - プロピニルオキシ基および2 - ブチニルオキシ基が挙げられ、

10

【0118】

「ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキルチオ基」としては、例えば、メチルチオ基、トリフルオロメチルチオ基、エチルチオ基、プロピルチオ基、イソプロピルチオ基、ブチルチオ基、イソブチルチオ基、sec - ブチルチオ基、tert - ブチルチオ基、ペンチルチオ基およびヘキシルチオ基が挙げられ、

【0119】

「ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキルスルフィニル基」としては、例えば、メチルスルフィニル基、トリフルオロメチルスルフィニル基、エチルスルフィニル基、プロピルスルフィニル基、イソプロピルスルフィニル基、ブチルスルフィニル基、イソブチルスルフィニル基、sec - ブチルスルフィニル基、tert - ブチルスルフィニル基、ペンチルスルフィニル基およびヘキシルスルフィニル基が挙げられ、

20

【0120】

「ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキルスルホニル基」としては、例えば、メチルスルホニル基、トリフルオロメチルスルホニル基、エチルスルホニル基、プロピルスルホニル基、イソプロピルスルホニル基、ブチルスルホニル基、イソブチルスルホニル基、sec - ブチルスルホニル基、tert - ブチルスルホニル基、ペンチルスルホニル基およびヘキシルスルホニル基が挙げられ、

【0121】

「(1)ハロゲン原子、(2)シアノ基、(3)ニトロ基、(4)ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキル基および(5)ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルコキシ基からなる群より選ばれる1 ~ 5個の独立した置換基で置換されていてもよいフェニル基」としては、例えば、フェニル基、2 - クロロフェニル基、3 - クロロフェニル基、4 - クロロフェニル基、4 - フルオロフェニル基、4 - ブロモフェニル基、4 - ヨードフェニル基、2 - シアノフェニル基、3 - シアノフェニル基、4 - シアノフェニル基、2 - ニトロフェニル基、3 - ニトロフェニル基、4 - ニトロフェニル基、2 - メチルフェニル基、3 - メチルフェニル基、4 - メチルフェニル基、2 - (トリフルオロメチル)フェニル基、3 - (トリフルオロメチル)フェニル基、4 - (トリフルオロメチル)フェニル基、2 - メトキシフェニル基、3 - メトキシフェニル基、4 - メトキシフェニル基および4 - (トリフルオロメトキシ)フェニル基が挙げられ、

30

【0122】

「(1)ハロゲン原子、(2)シアノ基、(3)ニトロ基、(4)ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキル基および(5)ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルコキシ基からなる群より選ばれる1個または2個以上の独立した置換基で置換されていてもよい5 - 6員環ヘテロアリール基」としては、例えば、2 - フリル基、3 - フリル基、2 - ピリジニル基、3 - ピリジニル基、4 - ピリジニル基およびピラジニル基が挙げられ、

40

【0123】

「(1)ハロゲン原子、(2)シアノ基、(3)ニトロ基、(4)ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキル基および(5)ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルコキシ基からなる群より選ばれる1 ~ 5個の独立した置換基で置換され

50

ていてもよいフェノキシ基」としては、例えば、フェノキシ基、2 - クロロフェノキシ基、3 - クロロフェノキシ基、4 - クロロフェノキシ基、2 - シアノフェノキシ基、3 - シアノフェノキシ基、4 - シアノフェノキシ基、2 - ニトロフェノキシ基、3 - ニトロフェノキシ基、4 - ニトロフェノキシ基、2 - メチルフェノキシ基、3 - メチルフェノキシ基、4 - メチルフェノキシ基、2 - (トリフルオロメチル)フェノキシ基、3 - (トリフルオロメチル)フェノキシ基、4 - (トリフルオロメチル)フェノキシ基、2 - メトキシフェノキシ基、3 - メトキシフェノキシ基、4 - メトキシフェノキシ基および4 - (トリフルオロメトキシ)フェノキシ基が挙げられる。

【0124】

J1で示される基としては、例えば、1 - フェニルピラゾール - 5 - イル基、1 - (2 - クロロフェニル)ピラゾール - 5 - イル基、1 - (2 - ピリジニル)ピラゾール - 5 - イル基、1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル)ピラゾール - 5 - イル基、3 - フルオロ - 1 - フェニルピラゾール - 5 - イル基、1 - (2 - クロロフェニル) - 3 - フルオロピラゾール - 5 - イル基、3 - フルオロ - 1 - (2 - ピリジニル)ピラゾール - 5 - イル基、3 - フルオロ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル)ピラゾール - 5 - イル基、3 - クロロ - 1 - フェニルピラゾール - 5 - イル基、3 - クロロ - 1 - (2 - クロロフェニル)ピラゾール - 5 - イル基、3 - クロロ - 1 - (2 - ピリジニル)ピラゾール - 5 - イル基、3 - クロロ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル)ピラゾール - 5 - イル基、3 - プロモ - 1 - フェニルピラゾール - 5 - イル基、3 - プロモ - 1 - (2 - クロロフェニル)ピラゾール - 5 - イル基、3 - プロモ - 1 - (2 - ピリジニル)ピラゾール - 5 - イル基、3 - プロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル)ピラゾール - 5 - イル基、3 - ヨード - 1 - フェニルピラゾール - 5 - イル基、3 - ヨード - 1 - (2 - クロロフェニル)ピラゾール - 5 - イル基、3 - ヨード - 1 - (2 - ピリジニル)ピラゾール - 5 - イル基、3 - ヨード - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル)ピラゾール - 5 - イル基、3 - メチル - 1 - フェニルピラゾール - 5 - イル基、1 - (2 - クロロフェニル) - 3 - メチルピラゾール - 5 - イル基、3 - メチル - 1 - (2 - ピリジニル)ピラゾール - 5 - イル基、1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - メチルピラゾール - 5 - イル基、1 - フェニル - 3 - (トリフルオロメチル)ピラゾール - 5 - イル基、1 - (2 - クロロフェニル) - 3 - (トリフルオロメチル)ピラゾール - 5 - イル基、1 - (2 - ピリジニル) - 3 - (トリフルオロメチル)ピラゾール - 5 - イル基、1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - (トリフルオロメチル)ピラゾール - 5 - イル基、

【0125】

3 - クロロ - 1 - メチルピラゾール - 5 - イル基、3 - クロロ - 1 - エチルピラゾール - 5 - イル基、3 - クロロ - 1 - イソプロピルピラゾール - 5 - イル基、1 - tert - ブチル - 3 - クロロピラゾール - 5 - イル基、3 - クロロ - 1 - (3 - フルオロ - 2 - ピリジニル)ピラゾール - 5 - イル基、1 - (3 - プロモ - 2 - ピリジニル) - 3 - クロロピラゾール - 5 - イル基、3 - クロロ - 1 - (3 - ヨード - 2 - ピリジニル)ピラゾール - 5 - イル基、3 - クロロ - 1 - (3 - メチル - 2 - ピリジニル)ピラゾール - 5 - イル基、3 - クロロ - 1 - (3 - トリフルオロメチル - 2 - ピリジニル)ピラゾール - 5 - イル基、3 - クロロ - 1 - (3 - メトキシ - 2 - ピリジニル)ピラゾール - 5 - イル基、3 - クロロ - 1 - (3 - シアノ - 2 - ピリジニル)ピラゾール - 5 - イル基、3 - クロロ - 1 - (3 - ニトロ - 2 - ピリジニル)ピラゾール - 5 - イル基、

【0126】

3 - プロモ - 1 - メチルピラゾール - 5 - イル基、3 - プロモ - 1 - エチルピラゾール - 5 - イル基、3 - プロモ - 1 - イソプロピルピラゾール - 5 - イル基、3 - プロモ - 1 - tert - ブチルピラゾール - 5 - イル基、3 - プロモ - 1 - (3 - フルオロ - 2 - ピリジニル)ピラゾール - 5 - イル基、3 - プロモ - 1 - (3 - プロモ - 2 - ピリジニル)ピラゾール - 5 - イル基、3 - プロモ - 1 - (3 - ヨード - 2 - ピリジニル)ピラゾール - 5 - イル基、3 - プロモ - 1 - (3 - メチル - 2 - ピリジニル)ピラゾール - 5 - イル基、3 - プロモ - 1 - (3 - トリフルオロメチル - 2 - ピリジニル)ピラゾール - 5 - イ

10

20

30

40

50

ル基、3 - プロモ - 1 - (3 - メトキシ - 2 - ピリジニル) ピラゾール - 5 - イル基、3 - プロモ - 1 - (3 - シアノ - 2 - ピリジニル) ピラゾール - 5 - イル基、3 - プロモ - 1 - (3 - ニトロ - 2 - ピリジニル) ピラゾール - 5 - イル基、

【0127】

1 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) ピラゾール - 5 - イル基、1 - エチル - 3 - (トリフルオロメチル) ピラゾール - 5 - イル基、1 - イソプロピル - 3 - (トリフルオロメチル) ピラゾール - 5 - イル基、1 - tert - ブチル - 3 - (トリフルオロメチル) ピラゾール - 5 - イル基、1 - (3 - フルオロ - 2 - ピリジニル) - 3 - (トリフルオロメチル) ピラゾール - 5 - イル基、1 - (3 - プロモ - 2 - ピリジニル) - 3 - (トリフルオロメチル) ピラゾール - 5 - イル基、1 - (3 - ヨード - 2 - ピリジニル) - 3 - (トリフルオロメチル) ピラゾール - 5 - イル基、1 - (3 - メチル - 2 - ピリジニル) - 3 - (トリフルオロメチル) ピラゾール - 5 - イル基、1 - (3 - トリフルオロメチル - 2 - ピリジニル) - 3 - (トリフルオロメチル) ピラゾール - 5 - イル基、1 - (3 - メトキシ - 2 - ピリジニル) - 3 - (トリフルオロメチル) ピラゾール - 5 - イル基、1 - (3 - シアノ - 2 - ピリジニル) - 3 - (トリフルオロメチル) ピラゾール - 5 - イル基、1 - (3 - ニトロ - 2 - ピリジニル) - 3 - (トリフルオロメチル) ピラゾール - 5 - イル基、

【0128】

1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - エチルピラゾール - 5 - イル基、1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - イソプロピルピラゾール - 5 - イル基、3 - tert - ブチル - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) ピラゾール - 5 - イル基、1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - (メチルチオ) ピラゾール - 5 - イル基、1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - (エチルチオ) ピラゾール - 5 - イル基、1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - (イソプロピルチオ) ピラゾール - 5 - イル基、3 - tert - ブチルチオ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) ピラゾール - 5 - イル基、1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - (メチルスルフィニル) ピラゾール - 5 - イル基、1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - (エチルスルフィニル) ピラゾール - 5 - イル基、1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - (イソプロピルスルフィニル) ピラゾール - 5 - イル基、3 - tert - ブチルスルフィニル - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) ピラゾール - 5 - イル基、1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - (メチルスルホニル) ピラゾール - 5 - イル基、1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - (エチルスルホニル) ピラゾール - 5 - イル基、1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - (イソプロピルスルホニル) ピラゾール - 5 - イル基、3 - tert - ブチルスルホニル - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) ピラゾール - 5 - イル基、1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - (2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ) ピラゾール - 5 - イル基、1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - シアノピラゾール - 5 - イル基、

【0129】

1 - (2 - クロロフェニル) ピロール - 2 - イル基、1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) ピロール - 2 - イル基、4 - クロロ - 1 - (2 - クロロフェニル) ピロール - 2 - イル基、4 - クロロ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) ピロール - 2 - イル基、5 - クロロ - 1 - (2 - クロロフェニル) ピロール - 2 - イル基、5 - クロロ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) ピロール - 2 - イル基、1 - (2 - クロロフェニル) - 4, 5 - ジクロロピロール - 2 - イル基、1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 4, 5 - ジクロロピロール - 2 - イル基、4 - プロモ - 1 - (2 - クロロフェニル) ピロール - 2 - イル基、4 - プロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) ピロール - 2 - イル基、5 - プロモ - 1 - (2 - クロロフェニル) ピロール - 2 - イル基、5 - プロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) ピロール - 2 - イル基、1 - (2 - クロロフェニル) - 4, 5 - ジプロモピロール - 2 - イル基、1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 4, 5 - ジプロモピロール - 2 - イル基、1 - (2 - クロロフェニル) - 4 - ヨードピロール - 2 - イル基、1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 4 - ヨードピロール - 2 - イル基、1 - (2 - クロ

10

20

30

40

50

ロフェニル) - 5 - ヨードピロール - 2 - イル基、1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 5 - ヨードピロール - 2 - イル基、1 - (2 - クロロフェニル) - 4, 5 - ジヨードピロール - 2 - イル基、1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 4, 5 - ジヨードピロール - 2 - イル基、1 - (2 - クロロフェニル) - 4 - (トリフルオロメチル)ピロール - 2 - イル基、1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 4 - (トリフルオロメチル)ピロール - 2 - イル基、1 - (2 - クロロフェニル) - 5 - (トリフルオロメチル)ピロール - 2 - イル基、1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 5 - (トリフルオロメチル)ピロール - 2 - イル基、

【0130】

1 - (2 - クロロフェニル)イミダゾール - 2 - イル基、1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル)イミダゾール - 2 - イル基、4 - クロロ - 1 - (2 - クロロフェニル)イミダゾール - 2 - イル基、4 - クロロ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル)イミダゾール - 2 - イル基、4 - ブロモ - 1 - (2 - クロロフェニル)イミダゾール - 2 - イル基、4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル)イミダゾール - 2 - イル基、1 - (2 - クロロフェニル) - 4 - (トリフルオロメチル)イミダゾール - 2 - イル基、1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 4 - (トリフルオロメチル)イミダゾール - 2 - イル基、

1 - (2 - クロロフェニル) - 1, 2, 4 - トリアゾール - 5 - イル基、1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1, 2, 4 - トリアゾール - 5 - イル基、3 - クロロ - 1 - (2 - クロロフェニル) - 1, 2, 4 - トリアゾール - 5 - イル基、3 - クロロ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1, 2, 4 - トリアゾール - 5 - イル基、3 - ブロモ - 1 - (2 - クロロフェニル) - 1, 2, 4 - トリアゾール - 5 - イル基、3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1, 2, 4 - トリアゾール - 5 - イル基、1 - (2 - クロロフェニル) - 3 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - トリアゾール - 5 - イル基および 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - トリアゾール - 5 - イル基が挙げられる。

【0131】

J 2 で示される基としては、例えば、1 - メチル - 3 - フェニルピラゾール - 4 - イル基、3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - メチルピラゾール - 4 - イル基、1 - メチル - 3 - (2 - ピリジニル)ピラゾール - 4 - イル基、3 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 - メチルピラゾール - 4 - イル基、1 - メチル - 5 - フェニルピラゾール - 4 - イル基、5 - (2 - クロロフェニル) - 1 - メチルピラゾール - 4 - イル基、1 - メチル - 5 - (2 - ピリジニル)ピラゾール - 4 - イル基、5 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 - メチルピラゾール - 4 - イル基、3 - フェニル - 1 - (2, 2, 2 - トリフルオロエチル)ピラゾール - 4 - イル基、3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (2, 2, 2 - トリフルオロエチル)ピラゾール - 4 - イル基、3 - (2 - ピリジニル) - 1 - (2, 2, 2 - トリフルオロエチル)ピラゾール - 4 - イル基、3 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 - (2, 2, 2 - トリフルオロエチル)ピラゾール - 4 - イル基、5 - フェニル - 1 - (2, 2, 2 - トリフルオロエチル)ピラゾール - 4 - イル基、5 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (2, 2, 2 - トリフルオロエチル)ピラゾール - 4 - イル基、5 - (2 - ピリジニル) - 1 - (2, 2, 2 - トリフルオロエチル)ピラゾール - 4 - イル基、5 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 - (2, 2, 2 - トリフルオロエチル)ピラゾール - 4 - イル基、1 - (ジフルオロメチル) - 3 - フェニルピラゾール - 4 - イル基、3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (ジフルオロメチル)ピラゾール - 4 - イル基、1 - (ジフルオロメチル) - 3 - (2 - ピリジニル)ピラゾール - 4 - イル基、3 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 - (ジフルオロメチル)ピラゾール - 4 - イル基、1 - (ジフルオロメチル) - 5 - フェニルピラゾール - 4 - イル基、5 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (ジフルオロメチル)ピラゾール - 4 - イル基、1 - (ジフルオロメチル) - 5 - (2 - ピリジニル)ピラゾール - 4 - イル基、5 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 - (ジフルオロメチル)ピラゾール - 4 - イル基、3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - エチルピラゾール - 4 - イル基、3 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 - エチルピラゾール -

10

20

30

40

50

4 - イル基、5 - (2 - クロロフェニル) - 1 - エチルピラゾール - 4 - イル基、5 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 - エチルピラゾール - 4 - イル基、3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - イソプロピルピラゾール - 4 - イル基、3 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 - イソプロピルピラゾール - 4 - イル基、5 - (2 - クロロフェニル) - 1 - イソプロピルピラゾール - 4 - イル基、5 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 - イソプロピルピラゾール - 4 - イル基、3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - tert - ブチルピラゾール - 4 - イル基、3 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 - tert - ブチルピラゾール - 4 - イル基、5 - (2 - クロロフェニル) - 1 - tert - ブチルピラゾール - 4 - イル基および 5 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 - tert - ブチルピラゾール - 4 - イル基が挙げられる。

10

【 0 1 3 2 】

式 (1) で示される化合物としては、例えば、以下のものが挙げられる。

【 0 1 3 3 】

式 (1) において、

R¹ は、水素原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、

R² は、水素原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、

R³ は、水素原子、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、または C 2 - C 6 アルコキシカルボニル基、

20

R⁴ は、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルコキシ基、ハロゲン原子で置換されていてもよいフェニル基、または、

ベンゼン環上の隣接する炭素原子に結合する 2 つの R⁴ 基が末端で結合して、T 1

T 1 : - C R^{4 1} = C R^{4 2} - C R^{4 3} = C R^{4 4} -

(ここで、R^{4 1}、R^{4 2}、R^{4 3} および R^{4 4} は、水素原子を表す。) で示される基、
n は 0 ~ 3 の整数、

Q は Q 1 ~ Q 6

Q1 : —C(=A³¹)—R⁵

Q2 : —C(=A³²)—OR⁶

30

Q3 : —C(=A³³)—SR⁷

Q4 : —C(=A³⁴)—NR⁸R⁹

Q5 : —S(O)₂—R¹⁰

Q6 : —S(O)₂—NR¹¹R¹²

(ここで、A³¹、A³² および A³³ は酸素原子、A³⁴ は酸素原子または硫黄原子、

R⁵ は、水素原子、

(1) ハロゲン原子、(2) C 1 - C 6 アルコキシ基、(3) C 1 - C 6 アルキルチオ基、(4) C 1 - C 6 アルキルスルフィニル基、(5) C 1 - C 6 アルキルスルホニル基、(6) C 2 - C 6 ジアルキルアミノ基および (7) C 3 - C 6 シクロアルキル基からなる群より選ばれる 1 個または 2 個以上の独立した置換基で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、

40

(1) ハロゲン原子および (2) C 1 - C 6 アルキル基からなる群より選ばれる 1 個または 2 個以上の独立した置換基で置換されていてもよい C 3 - C 6 シクロアルキル基、

(1) ハロゲン原子、(2) シアノ基、(3) ニトロ基、(4) ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、(5) ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルコキシ基、(6) ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキルチオ基、(7) ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキルスルフィニル基、(8) ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキルスルホニル基、(9) ハロ

50

ゲン原子で置換されていてもよい C 2 - C 6 ジアルキルアミノ基および (1 0) ハロゲン原子で置換されていてもよい C 2 - C 6 アルコキシカルボニル基からなる群より選ばれる 1 ~ 5 個の独立した基で置換されていてもよいフェニル基、

(1) ハロゲン原子、(2) シアノ基、(3) ニトロ基、(4) ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基および (5) ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルコキシ基からなる群より選ばれる 1 個または 2 個以上の独立した置換基で置換されていてもよい 5 - 6 員環ヘテロアリール基、または、

(1) ハロゲン原子および (2) C 1 - C 6 アルキル基からなる群より選ばれる 1 個または 2 個以上の独立した置換基で置換されていてもよい 3 - 8 員非芳香ヘテロ環基、

R⁶は、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 2 - C 6 アルケニル基、または、

(1) ハロゲン原子、(2) シアノ基、(3) ニトロ基、(4) ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、(5) ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルコキシ基、(6) ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキルチオ基、(7) ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキルスルフィニル基、(8) ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキルスルホニル基、(9) ハロゲン原子で置換されていてもよい C 2 - C 6 ジアルキルアミノ基および (1 0) ハロゲン原子で置換されていてもよい C 2 - C 6 アルコキシカルボニル基からなる群より選ばれる 1 ~ 5 個の独立した置換基で置換されていてもよいフェニル基、

R⁷は、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、

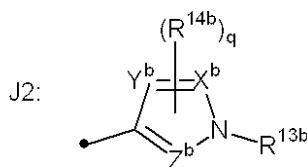
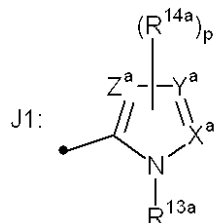
R⁸および R⁹は、各々、独立して、水素原子、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、または、

(1) ハロゲン原子、(2) シアノ基、(3) ニトロ基、(4) ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、(5) ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルコキシ基、(6) ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキルチオ基、(7) ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキルスルフィニル基、(8) ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキルスルホニル基、(9) ハロゲン原子で置換されていてもよい C 2 - C 6 ジアルキルアミノ基および (1 0) ハロゲン原子で置換されていてもよい C 2 - C 6 アルコキシカルボニル基からなる群より選ばれる 1 ~ 5 個の独立した置換基で置換されていてもよいフェニル基、

R¹⁰は、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、

R¹¹および R¹²は、各々、独立して、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基) で示される基、

J は、J 1 または J 2



(ここで、X^aは C H または窒素原子、Y^aは C H、Z^aは C H または窒素原子、X^bは C H または窒素原子、Y^bは C H、Z^bは C H または窒素原子、

R^{13a}は、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、

(1) ハロゲン原子および (2) C 1 - C 6 アルキル基からなる群より選ばれる 1 個または 2 個以上の独立した置換基で置換されていてもよい C 3 - C 6 シクロアルキル基、

(1) ハロゲン原子、(2) シアノ基、(3) ニトロ基、(4) ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、(5) ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルコキシ基、(6) ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキルチオ基、(7) ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキルスルフィニル基および (8) ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキルスルホニル基からなる

群より選ばれる 1 ~ 5 個の独立した置換基で置換されていてもよいフェニル基、または、
 (1) ハロゲン原子、(2) シアノ基、(3) ニトロ基、(4) ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基および (5) ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルコキシ基からなる群より選ばれる 1 個または 2 個以上の独立した置換基で置換されていてもよい 5 - 6 員環ヘテロアリール基、

R^{13b} は、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、

R^{14a} は、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキルチオ基、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキルスルフィニル基、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキルスルホニル基、または、

(1) ハロゲン原子、(2) シアノ基、(3) ニトロ基、(4) ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基および (5) ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルコキシ基からなる群より選ばれる 1 個 ~ 5 個の独立した置換基で置換されていてもよいフェニル基、

R^{14b} は、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、または、
 (1) ハロゲン原子、(2) シアノ基、(3) ニトロ基、(4) ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基および (5) ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルコキシ基からなる群より選ばれる 1 個 ~ 5 個の独立した置換基で置換されていてもよいフェニル基、

p は 0 ~ 2 の整数

(但し、p が 2 である場合には、2 個の R^{14a} は、互いに同一でも異なってもよい。)、

q は 1 である。) で示される基、

A^1 および A^2 は、酸素原子

で示される化合物。

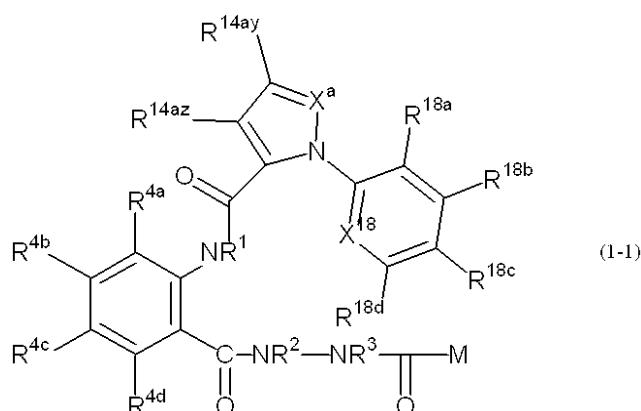
【 0 1 3 4 】

本発明化合物の態様としては、例えば、以下の「態様 1 ~ 3 2」のものが挙げられる。

【 0 1 3 5 】

「態様 1」

式 (1 - 1) において、



R^1 は、水素原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、

R^2 は、水素原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、

R^3 は、水素原子、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、または、C 2 - C 6 アルコキシカルボニル基、

R^{4a} は、水素原子、ハロゲン原子、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルコキシ基、または、ハ

ロゲン原子で置換されていてもよいフェニル基、

R^{4b} 、 R^{4c} および R^{4d} は、各々、独立して、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルキル基、

あるいは、 R^{4b} と R^{4c} とが末端で結合し、



(ここで、 R^{41} 、 R^{42} 、 R^{43} および R^{44} は水素原子である。) で示される基、

M は、 R^5 、 OR^6 、 SR^7 、または NR^8R^9

(ここで、 R^5 は、水素原子、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルキル基、 $C3 - C6$ シクロアルキル基、

(1) ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルキル基および (2) ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルコキシ基からなる群より選ばれる 1 個の置換基で置換されていてもよいフェニル基、5 - 6 員環ヘテロアリアル基、または、3 - 8 員非芳香ヘテロ環基、

R^6 は、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C2 - C6$ アルケニル基、または、フェニル基、

R^7 は、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルキル基、

R^8 および R^9 は、各々、独立して、水素原子、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルキル基、または、フェニル基、

あるいは、 R^8 および R^9 は、結合している窒素原子と一緒にあって、モルホリノ基を形成する。)、

X^a は、窒素原子、

R^{14a} は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルキルチオ基、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルキルスルフィニル基、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルキルスルホニル基、または、フェニル基、

R^{14az} は、水素原子、

X^{18} は、窒素原子または CR^{18e}

(ここで、 R^{18e} は、水素原子またはハロゲン原子である。)、

R^{18a} 、 R^{18b} 、 R^{18c} および R^{18d} は、各々、独立して、水素原子またはハロゲン原子である化合物。

【0136】

「態様 2」

(1-1) において、

R^1 は、水素原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルキル基、

R^2 は、水素原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルキル基、

R^3 は、水素原子、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルキル基、または、 $C2 - C6$ アルコキシカルボニル基、

R^{4a} は、水素原子、ハロゲン原子、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルコキシ基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいフェニル基、

R^{4b} 、 R^{4c} および R^{4d} は、各々、独立して、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルキル基、

あるいは、 R^{4b} と R^{4c} とが末端で結合し、



(ここで、 R^{41} 、 R^{42} 、 R^{43} および R^{44} は水素原子である。) で示される基、

M は、 R^5 、 OR^6 、 SR^7 、または NR^8R^9

(ここで、 R^5 は、水素原子、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルキル

10

20

30

40

50

基、C 3 - C 6 シクロアルキル基、

(1) ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基および (2) ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルコキシ基からなる群より選ばれる 1 個の置換基で置換されていてもよいフェニル基、5 - 6 員環ヘテロアリール基、または、3 - 8 員非芳香ヘテロ環基、

R⁶ は、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 2 - C 6 アルケニル基、または、フェニル基、

R⁷ は、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、

R⁸ および R⁹ は、各々、独立して、水素原子、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、または、フェニル基、
あるいは、R⁸ および R⁹ は、結合している窒素原子と一緒にあって、モルホリノ基を形成する。)、

X^a は、C R^{1 4 a x}

(ここで、R^{1 4 a x} は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキルチオ基、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキルスルフィニル基、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキルスルホニル基、または、フェニル基である。)、

R^{1 4 a y} は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキルチオ基、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキルスルフィニル基、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキルスルホニル基、または、フェニル基、

R^{1 4 a z} は、水素原子、

X^{1 8} は、窒素原子または C R^{1 8 e}

(ここで、R^{1 8 e} は、水素原子またはハロゲン原子である。)、

R^{1 8 a}、R^{1 8 b}、R^{1 8 c} および R^{1 8 d} は、各々、独立して、水素原子またはハロゲン原子である化合物。

【 0 1 3 7 】

「態様 3」

式 (1 - 1) において、

R¹ は、水素原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、

R² は、水素原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、

R³ は、水素原子、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、または C 2 - C 6 アルコキシカルボニル基、

R^{4 a} は、ハロゲン原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、

R^{4 b} は、水素原子、

R^{4 c} は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、

R^{4 d} は、水素原子、ハロゲン原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、

M は、O R⁶

(ここで、R⁶ は、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基である。)、

X^a は、窒素原子、

R^{1 4 a y} は、水素原子、ハロゲン原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、

R^{14a} は、水素原子、
 X^{18} は、窒素原子、
 R^{18a} は、ハロゲン原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、
 R^{18b} 、 R^{18c} および R^{18d} は、水素原子
 である化合物。

【0138】

「態様 4」

式 (1-1) において、

R^1 は、水素原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、 10

R^2 は、水素原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、

R^3 は、水素原子、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、または、C 2 - C 6 アルコキシカルボニル基、

R^{4a} は、ハロゲン原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、

R^{4b} は、水素原子、

R^{4c} は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、 20

R^{4d} は、水素原子、ハロゲン原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、

M は、 OR^6

(ここで、 R^6 は、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基である。)、

X^a は、 CR^{14ax}

(ここで、 R^{14ax} は、水素原子、ハロゲン原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基である。)、

R^{14ay} は、各々、独立して、水素原子、ハロゲン原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、 30

R^{14az} は、水素原子、

X^{18} は、窒素原子、

X^{18a} は、ハロゲン原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、

R^{18b} 、 R^{18c} および R^{18d} は、水素原子
 である化合物。

【0139】

「態様 5」

式 (1-1) において、

R^1 は、水素原子またはメチル基、 40

R^2 は、水素原子またはメチル基、

R^3 は、水素原子、メチル基、またはメトキシカルボニル基、

R^{4a} は、水素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、メチル基、エチル基、トリフルオロメチル基、メトキシ基、またはフェニル基、

R^{4c} は、水素原子、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、メチル基、またはシアノ基、

R^{4b} および R^{4d} は、水素原子、塩素原子、またはメチル基、

M は、 OR^6

(ここで、 R^6 は、メチル基である。)、

X^a は、窒素原子、 50

R^{14ay} は、水素原子、塩素原子、臭素原子、シアノ基、メチル基、イソプロピル基、トリフルオロメチル基、メチルチオ基、メチルスルフィニル基、メチルスルホニル基、またはフェニル基、

R^{14az} は、水素原子または臭素原子、

X^{18} は、窒素原子、

R^{18a} は、塩素原子、

R^{18b} 、 R^{18c} および R^{18d} は、水素原子

である化合物。

【0140】

「態様6」

10

式(1-1)において、

R^1 は、水素原子またはメチル基、

R^2 は、水素原子またはメチル基、

R^3 は、水素原子、メチル基、またはメトキシカルボニル基、

R^{4a} は、水素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、メチル基、エチル基、トリフルオロメチル基、メトキシ基、またはフェニル基、

R^{4c} は、水素原子、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、メチル基、またはシアノ基、

R^{4b} および R^{4d} は、水素原子、塩素原子、またはメチル基、

Mは、 OR^6

20

(ここで、 R^6 は、メチル基である。)、

X^a は、 CR^{14ax}

(ここで、 R^{14ax} は、水素原子またはハロゲン原子である。)、

R^{14ay} は、水素原子、塩素原子、臭素原子、シアノ基、メチル基、イソプロピル基、トリフルオロメチル基、メチルチオ基、メチルスルフィニル基、メチルスルホニル基、またはフェニル基、

R^{14az} は、水素原子または臭素原子、

X^{18} は、窒素原子、

R^{18a} は、塩素原子、

R^{18b} 、 R^{18c} および R^{18d} は、水素原子

30

である化合物。

【0141】

「態様7」

式(1-1)において、

R^1 は、水素原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキル基、

R^2 は、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキル基、

R^3 は、水素原子、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキル基、または、C2 - C6アルコキシカルボニル基、

R^{4a} は、水素原子、ハロゲン原子、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルコキシ基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいフェニル基、

40

R^{4b} 、 R^{4c} および R^{4d} は、各々、独立して、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキル基、または、

R^{4b} と R^{4c} とが末端で結合し、

$-CR^{41} = CR^{42} - CR^{43} = CR^{44} -$

(ここで、 R^{41} 、 R^{42} 、 R^{43} および R^{44} は、水素原子である。)で示される基、

Mは、 OR^6 、 SR^7 または NR^8R^9

(ここで、 R^6 および R^7 は、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC3 - C6アルコキシアルキル基、ハロゲン原

50

子で置換されていてもよいC 2 - C 6 アルケニル基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 3 - C 6 アルキニル基、

R⁸ および R⁹ は、各々、独立して、水素原子、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 2 - C 6 アルケニル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 3 - C 6 アルキニル基、

または、R⁸ および R⁹ は、結合している窒素原子と一緒にあって、ピロリジン - 1 - イル基、ピペリジノ基、ヘキサメチレンイミン - 1 - イル基、ヘプタメチレンイミン - 1 - イル基、モルホリノ基、チオモルホリン - 4 - イル基、または、4 - フェニルピペラジン - 1 - イル基を形成する。)、

X^a は、窒素原子またはC R^{1 4 a x}

10

(ここで、R^{1 4 a x} は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキルチオ基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキルスルフィニル基である。)、

R^{1 4 a y} は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキルチオ基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキルスルフィニル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキルスルホニル基、または、フェニル基、

R^{1 4 a z} は、水素原子、

20

X^{1 8} は、窒素原子またはC R^{1 8 e}

(ここで、R^{1 8 e} は、水素原子またはハロゲン原子である。)、

R^{1 8 a}、R^{1 8 b}、R^{1 8 c} および R^{1 8 d} は、各々、独立して、水素原子またはハロゲン原子である化合物。

【0142】

「態様8」

式(1-1)において、

R¹ は、水素原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基、

30

R² は、水素原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基、

R³ は、水素原子、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基、または、C 2 - C 6 アルコキシカルボニル基、

R^{4 a} は、水素原子、ハロゲン原子、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルコキシ基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいフェニル基、

R^{4 b}、R^{4 c} および R^{4 d} は、各々、独立して、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基、または、

R^{4 b} と R^{4 c} とが末端で結合し、

40

- C R^{4 1} = C R^{4 2} - C R^{4 3} = C R^{4 4} -

(ここで、R^{4 1}、R^{4 2}、R^{4 3} および R^{4 4} は、水素原子である。)で示される基、

Mは、水素原子、

X^a は、窒素原子またはC R^{1 4 a x}

(ここで、R^{1 4 a x} は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルコキシ基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキルチオ基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキルスルフィニル基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキルスルホニル基である。)、

R^{1 4 a y} は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン原子で置換されていても

50

よいC 1 - C 6 アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキルチオ基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキルスルフィニル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキルスルホニル基、または、フェニル基、

$R^{14a z}$ は、水素原子、

X^{18} は、窒素原子またはC R^{18e}

(ここで、 R^{18e} は、水素原子またはハロゲン原子である。)、

R^{18a} 、 R^{18b} 、 R^{18c} および R^{18d} は、各々、独立して、水素原子またはハロゲン原子である化合物。

【0143】

「態様9」

式(1-1)において、

R^1 は、水素原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基、

R^2 は、水素原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基、

R^3 は、水素原子、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基、または、C 2 - C 6 アルコキシカルボニル基、

R^{4a} は、ハロゲン原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基、

R^{4b} 、 R^{4c} および R^{4d} は、各々、独立して、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基、

若しくは、 R^{4b} と R^{4c} とが末端で結合し、

- C R^{41} = C R^{42} - C R^{43} = C R^{44} -

(ここで、 R^{41} 、 R^{42} 、 R^{43} および R^{44} は、各々、独立して、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基である。)で示される基、

Mは、 R^5 、O R^6 、S R^7 またはN $R^8 R^9$

(ここで、 R^5 は、水素原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基、

R^6 および R^7 は、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 3 - C 6 アルコシアルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 2 - C 6 アルケニル基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 3 - C 6 アルキニル基、

R^8 および R^9 は、各々、独立して、水素原子、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 2 - C 6 アルケニル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 3 - C 6 アルキニル基、

若しくは、 R^8 および R^9 は、結合している窒素原子と一緒にあって、ピロリジン - 1 - イル基、ピペリジノ基、ヘキサメチレンイミン - 1 - イル基、ヘプタメチレンイミン - 1 - イル基、モルホリノ基、または、チオモルホリン - 4 - イル基を形成する。)、

X^a は、窒素原子またはC R^{14ax}

(ここで、 R^{14ax} は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルコキシ基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキルチオ基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキルスルフィニル基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキルスルホニル基である。)、

R^{14ay} および R^{14az} は、各々、独立して、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルコキシ基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキルチオ基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキルスルフィニル

10

20

30

40

50

基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキルスルホニル基、

X^{18} は、窒素原子または CR^{18e}

(ここで、 R^{18e} は、水素原子、ハロゲン原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基である。)、

R^{18a} 、 R^{18b} 、 R^{18c} および R^{18d} は、各々、独立して、水素原子、ハロゲン原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基である化合物。

【0144】

「態様 10」

式 (1-1) において、

R^1 は、水素原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、

R^2 は、水素原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、

R^3 は、水素原子、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、または、C 2 - C 6 アルコキシカルボニル基、

R^{4a} は、ハロゲン原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、

R^{4b} 、 R^{4c} および R^{4d} は、各々、独立して、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、

若しくは、 R^{4b} と R^{4c} とが末端で結合し、

$-CR^{41} = CR^{42} - CR^{43} = CR^{44} -$

(ここで、 R^{41} 、 R^{42} 、 R^{43} および R^{44} は、各々、独立して、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基である。) で示される基、

M は、 R^5 、 OR^6 、 SR^7 または NR^8R^9 、

(ここで、 R^5 は、水素原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、

R^6 および R^7 は、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 3 - C 6 アルコキシアルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 2 - C 6 アルケニル基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 3 - C 6 アルキニル基、

R^8 および R^9 は、各々、独立して、水素原子、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 2 - C 6 アルケニル基、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 3 - C 6 アルキニル基、

若しくは、 R^8 および R^9 は、結合している窒素原子と一緒にあって、ピロリジン - 1 - イル基、ペリリジノ基、ヘキサメチレンイミン - 1 - イル基、ヘプタメチレンイミン - 1 - イル基、モルホリノ基またはチオモルホリン - 4 - イル基を形成する。)、

X^a は、窒素原子、

R^{14ay} および R^{14az} は、各々、独立して、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルコキシ基、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキルチオ基、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキルスルフィニル基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキルスルホニル基、

X^{18} は、窒素原子、または CR^{18e}

(ここで、 R^{18e} は、水素原子、ハロゲン原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基である。)、

R^{18a} 、 R^{18b} 、 R^{18c} および R^{18d} は、各々、独立して、水素原子、ハロゲン原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基である化合物。

10

20

30

40

50

【 0 1 4 5 】

「 態 様 1 1 」

上記式 (1 - 1) において、

R^1 は、水素原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C 1 - C 6$ アルキル基、

R^2 は、水素原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C 1 - C 6$ アルキル基、

R^3 は、水素原子、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C 1 - C 6$ アルキル基、または、 $C 2 - C 6$ アルコキシカルボニル基、

R^{4a} は、ハロゲン原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C 1 - C 6$ アルキル基、

R^{4b} 、 R^{4c} および R^{4d} は、各々、独立して、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C 1 - C 6$ アルキル基、

若しくは、 R^{4b} と R^{4c} とが末端で結合し、



(ここで、 R^{41} 、 R^{42} 、 R^{43} および R^{44} は、各々、独立して、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C 1 - C 6$ アルキル基である。) で示される基、

M は、 R^5 、 OR^6 、 SR^7 または NR^8R^9

(ここで、 R^5 は、水素原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C 1 - C 6$ アルキル基、

R^6 および R^7 は、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C 1 - C 6$ アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C 3 - C 6$ アルコシアルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C 2 - C 6$ アルケニル基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C 3 - C 6$ アルキニル基、

R^8 および R^9 は、各々、独立して、水素原子、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C 1 - C 6$ アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C 2 - C 6$ アルケニル基、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C 3 - C 6$ アルキニル基、

若しくは、 R^8 および R^9 は、結合している窒素原子と一緒にあって、ピロリジン - 1 - イル基、ピペリジノ基、ヘキサメチレンイミン - 1 - イル基、ヘプタメチレンイミン - 1 - イル基、モルホリノ基、または、チオモルホリン - 4 - イル基を形成する。)、

X^a は、 CR^{14ax}

(ここで、 R^{14ax} は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C 1 - C 6$ アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C 1 - C 6$ アルコキシ基、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C 1 - C 6$ アルキルチオ基、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C 1 - C 6$ アルキルスルフィニル基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C 1 - C 6$ アルキルスルホニル基である。)、

R^{14ay} および R^{14az} は、各々、独立して、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C 1 - C 6$ アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C 1 - C 6$ アルコキシ基、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C 1 - C 6$ アルキルチオ基、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C 1 - C 6$ アルキルスルフィニル基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C 1 - C 6$ アルキルスルホニル基、

X^{18} は、窒素原子、または CR^{18e}

(ここで、 R^{18e} は、水素原子、ハロゲン原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C 1 - C 6$ アルキル基である。)、

R^{18a} 、 R^{18b} 、 R^{18c} および R^{18d} は、各々、独立して、水素原子、ハロゲン原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C 1 - C 6$ アルキル基である化合物。

【 0 1 4 6 】

「 態 様 1 2 」

10

20

30

40

50

上記式(1-1)において、

R^1 は、水素原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキル基、

R^2 は、水素原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキル基、

R^3 は、水素原子、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキル基、または、C2 - C6アルコキシカルボニル基、

R^{4a} は、ハロゲン原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキル基、

R^{4b} 、 R^{4c} および R^{4d} は、各々、独立して、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキル基、

若しくは、 R^{4b} と R^{4c} とが末端で結合し、

$-CR^{41} = CR^{42} - CR^{43} = CR^{44} -$

(ここで、 R^{41} 、 R^{42} 、 R^{43} および R^{44} は、各々、独立して、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキル基である。)で示される基、

Mは、 R^5 、 OR^6 、 SR^7 または NR^8R^9

(ここで、 R^5 は、水素原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキル基、

R^6 および R^7 は、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC3 - C6アルコキシアルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC2 - C6アルケニル基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC3 - C6アルキニル基、

R^8 および R^9 は、各々、独立して、水素原子、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC2 - C6アルケニル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC3 - C6アルキニル基、

若しくは、 R^8 および R^9 は、結合している窒素原子と一緒にあって、ピロリジン-1-イル基、ペペリジノ基、ヘキサメチレンイミン-1-イル基、ヘプタメチレンイミン-1-イル基、モルホリノ基またはチオモルホリン-4-イル基を形成する。)、

X^a は、 CR^{14ax}

(ここで、 R^{14ax} は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルコキシ基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキルチオ基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキルスルフィニル基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキルスルホニル基である。)、

R^{14ay} および R^{14az} は、各々、独立して、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルコキシ基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキルチオ基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキルスルフィニル基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキルスルホニル基、

X^{18} は、窒素原子、または CR^{18e}

(ここで、 R^{18e} は、ハロゲン原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキル基である。)、

R^{18a} 、 R^{18b} 、 R^{18c} および R^{18d} は、各々、独立して、水素原子、ハロゲン原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキル基である化合物。

【0147】

「態様13」

上記式(1-1)において、

R^1 は、水素原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキル

基、

R^2 は、水素原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルキル基、

R^3 は、水素原子、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルキル基、または、 $C2 - C6$ アルコキシカルボニル基、

R^{4a} は、水素原子、ハロゲン原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルキル基、

R^{4b} は、水素原子、

R^{4c} は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルキル基、

R^{4d} は、水素原子、

M は、 OR^6

(ここで、 R^6 は、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルキル基である。)

X^a は、窒素原子、

R^{14ay} は、水素原子、ハロゲン原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルキル基、

R^{14az} は、水素原子、

X^{18} は、窒素原子、

R^{18a} は、ハロゲン原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルキル基、

R^{18b} 、 R^{18c} および R^{18d} は、水素原子である化合物。

【0148】

「態様14」

上記式(1-1)において、

R^1 は、水素原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルキル基、

R^2 は、水素原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルキル基、

R^3 は、水素原子、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルキル基、または、 $C2 - C6$ アルコキシカルボニル基、

R^{4a} は、水素原子、ハロゲン原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルキル基、

R^{4b} は、水素原子、

R^{4c} は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルキル基、

R^{4d} は、水素原子、

M は、 OR^6

(ここで、 R^6 は、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルキル基である。)

X^a は、 CR^{14ax}

(ここで、 R^{14ax} は、水素原子、ハロゲン原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルキル基である。)、

R^{14ay} は、水素原子、ハロゲン原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルキル基、

R^{14az} は、水素原子、

X^{18} は、窒素原子、

R^{18a} は、ハロゲン原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルキル基、

R^{18b} 、 R^{18c} および R^{18d} は、水素原子である化合物。

【0149】

「態様15」

上記式(1-1)において、

R^1 は、水素原子、またはメチル基

R^2 は、水素原子、またはメチル基

R^3 は、水素原子、メチル基、またはメトキシカルボニル基

R^{4a} は、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、またはメチル基

R^{4c} は、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、メチル基、またはシアノ基、

R^{4b} および R^{4d} は、水素原子、

Mは、 OR^6

(ここで、 R^6 は、メチル基である。)、

X^a は、窒素原子、

R^{14ay} は、塩素原子、臭素原子、またはトリフルオロメチル基、

R^{14az} は、水素原子、

X^{18} は、窒素原子、

R^{18a} は、塩素原子、または臭素原子、

R^{18b} 、 R^{18c} および R^{18d} は、水素原子

である化合物。

【0150】

「態様16」

上記式(1-1)において、

R^1 は、水素原子、またはメチル基

R^2 は、水素原子、またはメチル基

R^3 は、水素原子、メチル基、またはメトキシカルボニル基

R^{4a} は、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、またはメチル基

R^{4c} は、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、メチル基、またはシアノ基、

R^{4b} および R^{4d} は、水素原子、

Mは、 OR^6

(ここで、 R^6 は、メチル基である。)、

X^a は、 CR^{14ax}

(ここで、 R^{14ax} は、水素原子、塩素原子、または臭素原子である。)、

R^{14ay} は、塩素原子、臭素原子、またはトリフルオロメチル基、

R^{14az} は、水素原子、

X^{18} は、窒素原子、

R^{18a} は、塩素原子、または臭素原子、

R^{18b} 、 R^{18c} および R^{18d} は、水素原子

である化合物。

【0151】

「態様17」

上記式(1-1)において、

R^1 は、水素原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキル基、

R^2 は、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキル基、

R^3 は、水素原子、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキル基、または、C2 - C6アルコキシカルボニル基、

R^{4a} は、ハロゲン原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキル基、

R^{4b} 、 R^{4c} および R^{4d} は、各々、独立して、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基

10

20

30

40

50

、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基、

若しくは、 R^{4b} と R^{4c} とが末端で結合し、



(ここで、 R^{41} 、 R^{42} 、 R^{43} および R^{44} は、各々、独立して、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基である。)で示される基、

Mは、 OR^6 、 SR^7 または NR^8R^9

(ここで、 R^6 および R^7 は、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 3 - C 6 アルコキシアルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 2 - C 6 アルケニル基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 3 - C 6 アルキニル基、

R^8 および R^9 は、各々、独立して、水素原子、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 2 - C 6 アルケニル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 3 - C 6 アルキニル基、

あるいは、 R^8 および R^9 は、結合している窒素原子と一緒にあって、ピロリジン - 1 - イル基、ペリリジノ基、ヘキサメチレンイミン - 1 - イル基、ヘプタメチレンイミン - 1 - イル基、モルホリノ基またはチオモルホリン - 4 - イル基を形成する。)、

X^a は、窒素原子または CR^{14ax}

(ここで、 R^{14ax} は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルコキシ基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキルチオ基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキルスルフィニル基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキルスルホニル基である。)、

R^{14ay} および R^{14az} は、各々、独立して、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルコキシ基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキルチオ基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキルスルフィニル基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキルスルホニル基、

X^{18} は、窒素原子、または CR^{18e}

(ここで、 R^{18e} は、水素原子、ハロゲン原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基である。)、

R^{18a} 、 R^{18b} 、 R^{18c} および R^{18d} は、各々、独立して、水素原子、ハロゲン原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基である化合物。

【0152】

「態様18」

上記式(1-1)において、

R^1 は、水素原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基、

R^2 は、水素原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基、

R^3 は、水素原子、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基、または、C 2 - C 6 アルコキシカルボニル基、

R^{4a} は、ハロゲン原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基、

R^{4b} 、 R^{4c} および R^{4d} は、各々、独立して、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基、

若しくは、 R^{4b} と R^{4c} とが末端で結合し、



(ここで、 R^{41} 、 R^{42} 、 R^{43} および R^{44} は、各々、独立して、水素原子、ハロゲ

ン原子、シアノ基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基である。)で示される基、

Mは、水素原子、

X^{14a} は、窒素原子または CR^{14ax}

(ここで、 R^{14ax} は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルコキシ基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキルチオ基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキルスルフィニル基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキルスルホニル基である。)、

R^{14ay} および R^{14az} は、各々、独立して、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルコキシ基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキルチオ基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキルスルフィニル基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキルスルホニル基、

X^{18} は、窒素原子、または CR^{18e}

(ここで、 R^{18e} は、水素原子、ハロゲン原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基である。)、

R^{18a} 、 R^{18b} 、 R^{18c} および R^{18d} は、各々、独立して、水素原子、ハロゲン原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基である化合物。

【0153】

「態様19」

式(1-1)において、

R^1 は、水素原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基、

R^2 は、水素原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基、

R^3 は、水素原子、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基、または、C 2 - C 6 アルコキシカルボニル基、

R^{4a} は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基、

R^{4b} および R^{4c} は、 R^{4b} と R^{4c} とが末端で結合し、

$-CR^{41} = CR^{42} - CR^{43} = CR^{44} -$

(ここで、 R^{41} 、 R^{42} 、 R^{43} および R^{44} は、各々、独立して、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基である。)で示される基、

R^{4d} は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基、

Mは、 R^5 、 OR^6 、 SR^7 、または NR^8R^9

(ここで、 R^5 は、水素原子、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基、または、C 3 - C 6 シクロアルキル基、

R^6 および R^7 は、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 3 - C 6 アルコキシアルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 2 - C 6 アルケニル基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 3 - C 6 アルキニル基、

R^8 および R^9 は、各々、独立して、水素原子、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 2 - C 6 アルケニル基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 3 - C 6 アルキニル基、

若しくは、 R^8 および R^9 が、結合している窒素原子と一緒に、ピロリジン-1-イル基、ピペリジノ基、ヘキサメチレンイミン-1-イル基、ヘプタメチレンイミン-1

10

20

30

40

50

- イル基、モルホリノ基、チオモルホリン - 4 - イル基、または、4 - メチルピペラジン - 1 - イル基を形成する。)、

X^a は、窒素原子、または CR^{14ax}

R^{14ax} 、 R^{14ay} および R^{14az} は、各々、独立して、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルコキシ基、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルキルチオ基、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルキルスルフィニル基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルキルスルホニル基、

X^{18} は、窒素原子、または CR^{18e}

R^{18a} 、 R^{18b} 、 R^{18c} 、 R^{18d} および R^{18e} は、各々、独立して、水素原子、ハロゲン原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルキル基である化合物。

【0154】

「態様20」

式(1-1)において、

R^1 は、水素原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルキル基、

R^2 は、水素原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルキル基、

R^3 は、水素原子、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルキル基、または、 $C2 - C6$ アルコキシカルボニル基、

R^{4a} は、水素原子、またはハロゲン原子、

R^{4b} および R^{4c} は、 R^{4b} と R^{4c} とが末端で結合し、

$-CR^{41} = CR^{42} - CR^{43} = CR^{44} -$

(ここで、 R^{41} 、 R^{42} 、 R^{43} および R^{44} は、各々、独立して、水素原子、またはハロゲン原子である。)で示される基、

R^{4d} は、水素原子、

M は、 R^5 、 OR^6 、 SR^7 または NR^8R^9

(ここで、 R^5 は、水素原子、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルキル基、または、 $C3 - C6$ シクロアルキル基、

R^6 および R^7 は、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C3 - C6$ アルコキシアルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C2 - C6$ アルケニル基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C3 - C6$ アルキニル基、

R^8 および R^9 は、各々、独立して、水素原子、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C2 - C6$ アルケニル基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C3 - C6$ アルキニル基、

若しくは、 R^8 および R^9 が、結合している窒素原子と一緒にあって、ピロリジン - 1 - イル基、ピペリジノ基、ヘキサメチレンイミン - 1 - イル基、ヘプタメチレンイミン - 1 - イル基、モルホリノ基、チオモルホリン - 4 - イル基、または、4 - メチルピペラジン - 1 - イル基を形成する。)、

X^a は、窒素原子または CR^{14ax}

R^{14ax} 、 R^{14ay} および R^{14az} は、各々、独立して、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルコキシ基、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルキルチオ基、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルキルスルフィニル基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルキルスルホニル基、

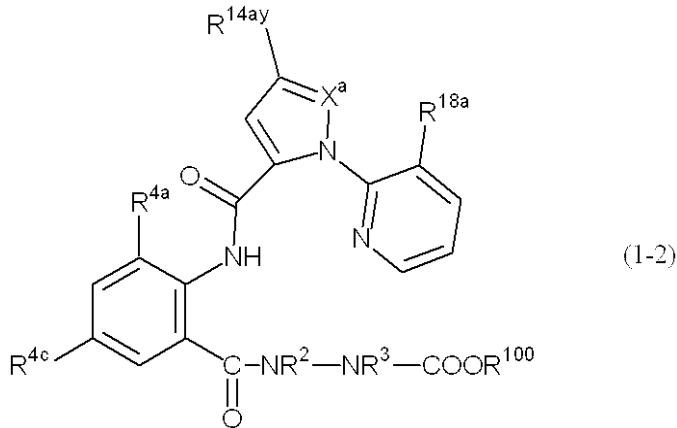
X^{18} は、窒素原子、または CR^{18e}

R^{18a} 、 R^{18b} 、 R^{18c} 、 R^{18d} および R^{18e} は、各々、独立して、水素原子、ハロゲン原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基である化合物。

【 0 1 5 5 】

「態様 2 1」

式 (1 - 2)



10

(式中、

R^2 は、水素原子、または C 1 - C 6 アルキル基、

R^3 は、水素原子、またはメチル基、

R^{4a} は、ハロゲン原子、またはメチル基、

R^{4c} は、ハロゲン原子、

R^{14ay} は、ハロゲン原子、またはトリフルオロメチル基、

X^a は、窒素原子、または C H、

R^{18a} は、ハロゲン原子、

R^{100} は、C 1 - C 6 アルキル基である。)

で示される化合物。

【 0 1 5 6 】

「態様 2 2」

式 (1 - 2) において、

R^2 は、C 1 - C 6 アルキル基、

R^3 は、水素原子、またはメチル基、

R^{4a} は、ハロゲン原子、またはメチル基、

R^{4c} は、ハロゲン原子、

R^{14ay} は、ハロゲン原子、またはトリフルオロメチル基、

X^a は、窒素原子、または C H

R^{18a} は、ハロゲン原子

である化合物。

【 0 1 5 7 】

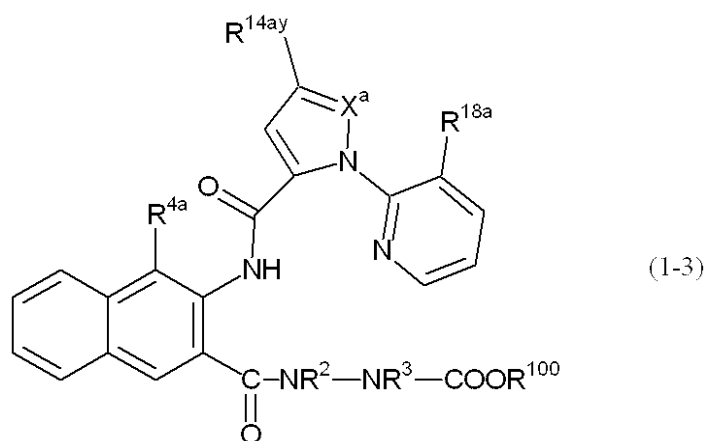
「態様 2 3」

式 (1 - 3)

20

30

40



10

(式中、

R^2 は、水素原子、または C 1 - C 6 アルキル基、

R^3 は、水素原子、またはメチル基、

R^{4a} は、ハロゲン原子、またはメチル基、

R^{14ay} は、ハロゲン原子、またはトリフルオロメチル基、

X^a は、窒素原子、または C H、

R^{18a} は、ハロゲン原子、

R^{100} は、C 1 - C 6 アルキル基である。)

20

で示される化合物。

【 0 1 5 8 】

「 態 様 2 4 」

式 (1 - 1) において、

R^1 は、水素原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、

R^2 は、水素原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、

R^3 は、水素原子、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、または、C 2 - C 6 アルコキシカルボニル基、

30

R^{4a} は、ハロゲン原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、

R^{4b} は、水素原子、

R^{4c} は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、

R^{4d} は、水素原子、

M は、O R^6

(ここで、 R^6 は、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 3 - C 6 アルコキシアルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 2 - C 6 アルケニル基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 3 - C 6 アルキニル基である。)、

40

X^a は、窒素原子または C R^{14ax}

(ここで、 R^{14ax} は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルコキシ基、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキルチオ基、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキルスルフィニル基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキルスルホニル基である。)、

R^{14ay} は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルコキシ基、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキルチオ基、ハロゲン原子で置

50

換されていてもよい C 1 - C 6 アルキルスルフィニル基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキルスルホニル基、

R^{1 4 a z} は、水素原子、

X^{1 8} は、窒素原子、

R^{1 8 a} は、ハロゲン原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、

R^{1 8 b}、R^{1 8 c} および R^{1 8 d} は、水素原子である化合物。

【 0 1 5 9 】

「態様 2 5」

10

式 (1 - 1) において、

R¹ は、水素原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、

R² は、水素原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、

R³ は、水素原子、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、または、C 2 - C 6 アルコキシカルボニル基、

R^{4 a} は、ハロゲン原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、

R^{4 b} は、水素原子、

20

R^{4 c} は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、

R^{4 d} は、水素原子、

M は、O R⁶

(ここで、R⁶ は、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 3 - C 6 アルコキシアルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 2 - C 6 アルケニル基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 3 - C 6 アルキニル基である。)、

X^a は、窒素原子、

R^{1 4 a y} は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルコキシ基、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキルチオ基、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキルスルフィニル基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキルスルホニル基、

30

R^{1 4 a z} は、水素原子、

X^{1 8} は、窒素原子、

R^{1 8 a} は、ハロゲン原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、

R^{1 8 b}、R^{1 8 c} および R^{1 8 d} は、水素原子である化合物。

40

【 0 1 6 0 】

「態様 2 6」

式 (1 - 1) において、

R¹ は、水素原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、

R² は、水素原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、

R³ は、水素原子、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基、または、C 2 - C 6 アルコキシカルボニル基、

R^{4 a} は、ハロゲン原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1 - C 6 ア

50

ルキル基、

R^{4b} は、水素原子、

R^{4c} は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルキル基、

R^{4d} は、水素原子、

M は、 OR^6

(ここで、 R^6 は、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C3 - C6$ アルコキシアルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C2 - C6$ アルケニル基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C3 - C6$ アルキニル基である。)、

X^a は、 CR^{14ax}

(ここで、 R^{14ax} は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルコキシ基、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルキルチオ基、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルキルスルフィニル基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルキルスルホニル基である。)、

R^{14ay} は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルコキシ基、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルキルチオ基、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルキルスルフィニル基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルキルスルホニル基、

R^{14az} は、水素原子、

X^{18} は、窒素原子、

R^{18a} は、ハロゲン原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルキル基、

R^{18b} 、 R^{18c} および R^{18d} は、水素原子である化合物。

【0161】

「態様27」

式(1-1)において、

R^1 は、水素原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルキル基、

R^2 は、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルキル基、

R^3 は、水素原子、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルキル基、または、 $C2 - C6$ アルコキシカルボニル基、

R^{4a} は、ハロゲン原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルキル基、

R^{4b} は、水素原子、

R^{4c} は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルキル基、

R^{4d} は、水素原子、

M は、 OR^6

(ここで、 R^6 は、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C3 - C6$ アルコキシアルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C2 - C6$ アルケニル基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C3 - C6$ アルキニル基である。)、

X^a は、窒素原子または CR^{14ax}

(ここで、 R^{14ax} は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルコキシ基、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1 - C6$ アルキルチオ基、ハロゲン

10

20

30

40

50

原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキルスルフィニル基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキルスルホニル基である。)、

R^{1 4 a y}は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルコキシ基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキルチオ基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキルスルフィニル基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキルスルホニル基、

R^{1 4 a z}は、水素原子、

X^{1 8}は、窒素原子、

R^{1 8 a}は、ハロゲン原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基、

R^{1 8 b}、R^{1 8 c}およびR^{1 8 d}は、水素原子である化合物。

【0162】

「態様28」

式(1-1)において、

R¹は、水素原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基、

R²は、水素原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基、

R³は、水素原子、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基、または、C 2 - C 6 アルコキシカルボニル基、

R^{4 a}は、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基、

R^{4 b}およびR^{4 c}は、R^{4 b}とR^{4 c}とが末端で結合し、
- C R^{4 1} = C R^{4 2} - C R^{4 3} = C R^{4 4} -

(ここで、R^{4 1}、R^{4 2}、R^{4 3}およびR^{4 4}は、各々、独立して、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基である。)で示される基、

R^{4 d}は、水素原子、

Mは、O R⁶

(ここで、R⁶は、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 3 - C 6 アルコキシアルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 2 - C 6 アルケニル基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 3 - C 6 アルキニル基である。)、

X^aは、窒素原子またはC R^{1 4 a x}

(ここで、R^{1 4 a x}は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルコキシ基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキルチオ基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキルスルフィニル基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキルスルホニル基である。)、

R^{1 4 a y}は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルコキシ基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキルチオ基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキルスルフィニル基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキルスルホニル基、

R^{1 4 a z}は、水素原子、

X^{1 8}は、窒素原子、

R^{1 8 a}は、ハロゲン原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基、

R^{18b} 、 R^{18c} および R^{18d} は、水素原子である化合物。

【0163】

「態様29」

式(1-2)において

R^2 は、水素原子、または C1 - C6 アルキル基、

R^3 は、水素原子、または C1 - C6 アルキル基、

R^{4a} は、ハロゲン原子、またはメチル基、

R^{4c} は、ハロゲン原子、

R^{14ay} は、ハロゲン原子、またはトリフルオロメチル基、

X^a は、窒素原子または CR^{14ax}

10

(ここで、 R^{14ax} は、水素原子、またはハロゲン原子である。)、

R^{18a} は、ハロゲン原子、

R^{100} は、C1 - C6 アルキル基

である化合物。

【0164】

「態様30」

式(1-2)において、

R^2 は、C1 - C6 アルキル基、

R^3 は、水素原子、または C1 - C6 アルキル基、

R^{4a} は、ハロゲン原子、またはメチル基、

R^{4c} は、ハロゲン原子、

R^{14ay} は、ハロゲン原子、またはトリフルオロメチル基、

X^a は、窒素原子または CR^{14ax}

20

(ここで、 R^{14ax} は、水素原子、またはハロゲン原子である。)、

R^{18a} は、ハロゲン原子、

R^{100} は、C1 - C6 アルキル基

である化合物。

【0165】

「態様31」

式(1-2)において、

R^2 は、C1 - C6 アルキル基、

R^3 は、C1 - C6 アルキル基、

R^{4a} は、ハロゲン原子、またはメチル基、

R^{4c} は、ハロゲン原子、

R^{14ay} は、ハロゲン原子、またはトリフルオロメチル基、

X^a は、窒素原子または CR^{14ax}

(ここで、 R^{14ax} は、水素原子、またはハロゲン原子である。)、

R^{18a} は、ハロゲン原子、

R^{100} は、C1 - C6 アルキル基

30

40

である化合物。

【0166】

「態様32」

式(1-3)において、

R^2 は、水素原子、または C1 - C6 アルキル基、

R^3 は、水素原子、または C1 - C6 アルキル基、

R^{4a} は、ハロゲン原子、またはメチル基、

R^{14ay} は、ハロゲン原子、またはトリフルオロメチル基、

X^a は、窒素原子または CR^{14ax}

(ここで、 R^{14ax} は、水素原子、またはハロゲン原子である。)、

50

R^{18a} は、ハロゲン原子、
 R^{100} は、C1 - C6アルキル基
 である化合物。

【0167】

次に、本発明化合物の製造法を示す。

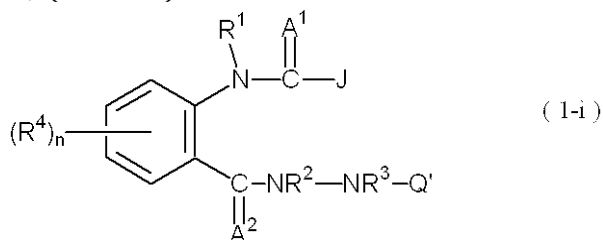
【0168】

本発明化合物は、例えば、以下の（製造法A - 1）～（製造法C - 1）により製造することができる。

【0169】

（製造法A - 1）

本発明化合物のうち、
 式（1 - i）：

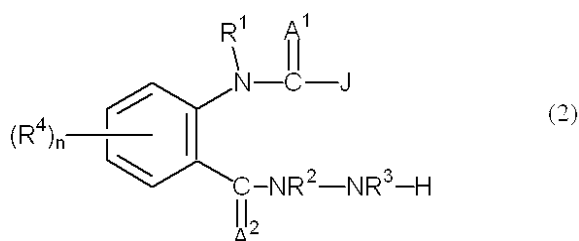


〔式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 A^1 、 A^2 、Jおよびnは、前記と同じ意味を表し、

Q' は、前記Q1～Q6からなる群より選ばれるいずれか（但し、 Q' がQ4であり、 R^8 および R^9 が水素原子である場合を除く。）を表す。〕

で示される化合物（以下、化合物（1 - i）と記す。）は、

式（2）：



〔式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 A^1 、 A^2 、Jおよびnは、前記と同じ意味を表す。〕

で示される化合物（以下、化合物（2）と記す。）と、

式（3）：



〔式中、 Q' は前記と同じ意味を表し、

L^1 は、ハロゲン原子または $Q'-O-$ 基（但し、 Q' がQ4であり、 R^8 および R^9 が水素原子である場合を除く。）を表す。〕

で示される化合物（以下、化合物（3）と記す。）とを反応させることにより製造することができる。

【0170】

該反応は、溶媒の存在下または非存在下で行われる。反応に用いられる溶媒としては、例えば1, 4 - ジオキサン、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、メチル tert - ブチルエーテル等のエーテル、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1, 2 - ジクロロエタン、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素、トルエン、ベンゼン、キシレン等の炭化水素、アセトニトリル等のニトリル、N, N - ジメチルホルムアミド、N - メチルピロリドン、1, 3 - ジメチル - 2 - イミダゾリジノン、ジメチルスルホキシド等の非プロトン性極性溶媒およびこれらの混合物が挙げられる。

【0171】

該反応に用いられる化合物（3）の量は、化合物（2）1モルに対して、通常1～2モ

10

20

30

40

50

ルの割合である。

【 0 1 7 2 】

該反応は、必要に応じて、塩基の存在下で行われる。塩基の存在下で行われる場合に用いられる塩基としては、例えば、ピリジン、ピコリン、2, 6 - ルチジン、1, 8 - ジアザピシクロ〔5, 4, 0〕7 - ウンデセン (DBU)、1, 5 - ジアザピシクロ〔4, 3, 0〕5 - ノネン (DBN) 等の含窒素複素環化合物、トリエチルアミン、N, N - ジイソプロピルエチルアミン等の第3級アミン、炭酸カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が挙げられる。塩基の存在下で行われる場合に用いられる塩基の量は、化合物 (2) 1 モルに対して、通常 1 ~ 2 モルの割合であるが、ピリジン等の反応条件下で液体である塩基を用いる場合は、該塩基を溶媒量用いることもできる。

10

【 0 1 7 3 】

該反応の反応温度は、通常、0 ~ 100 の範囲であり、反応時間は、通常、0.1 ~ 24 時間の範囲である。

【 0 1 7 4 】

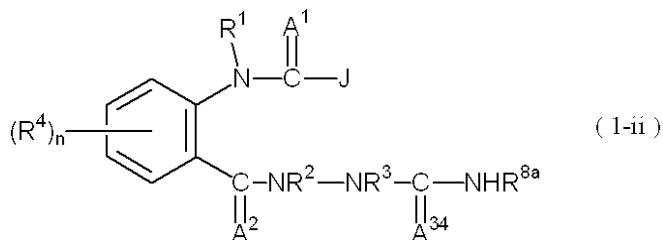
反応終了後は、反応混合物を水に注加した後、有機溶媒抽出する、または、析出した沈殿の濾取することにより化合物 (1 - i) を単離することができる。単離された化合物 (1 - i) は、再結晶、クロマトグラフィ - 等により更に精製することもできる。

【 0 1 7 5 】

(製造法 A - 2)

本発明化合物のうち、
式 (1 - ii) :

20



〔式中、R¹、R²、R³、R⁴、A¹、A²、A³⁴、J および n は、前記と同じ意味を表し、

R^{8a} はハロゲン原子で置換されていてもよい C1 - C6 アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよい C2 - C6 アルコキシアルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよい C2 - C6 アルケニル基、ハロゲン原子で置換されていてもよい C3 - C6 アルキニル基、

30

(1) ハロゲン原子および (2) C1 - C6 アルキル基からなる群より選ばれる1個以上の独立した置換基で置換されていてもよい C3 - C6 シクロアルキル基、

(1) ハロゲン原子、(2) シアノ基、(3) ニトロ基、(4) ハロゲン原子で置換されていてもよい C1 - C6 アルキル基、(5) ハロゲン原子で置換されていてもよい C1 - C6 アルコキシ基、(6) ハロゲン原子で置換されていてもよい C1 - C6 アルキルチオ基、(7) ハロゲン原子で置換されていてもよい C1 - C6 アルキルスルフィニル基、(8) ハロゲン原子で置換されていてもよい C1 - C6 アルキルスルホニル基、(9) ハロゲン原子で置換されていてもよい C2 - C6 ジアルキルアミノ基および (10) ハロゲン原子で置換されていてもよい C2 - C6 アルコキシカルボニル基からなる群より選ばれる 1 ~ 5 個の独立した置換基で置換されていてもよいフェニル基、

40

(1) ハロゲン原子、(2) シアノ基、(3) ニトロ基、(4) ハロゲン原子で置換されていてもよい C1 - C6 アルキル基および (5) ハロゲン原子で置換されていてもよい C1 - C6 アルコキシ基からなる群より選ばれる 1 ~ 5 個の独立した置換基で置換されていてもよい 5 - 6 員環ヘテロアリール基、

または、

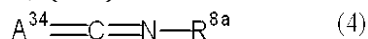
ベンゼン環部分が、(1) ハロゲン原子、(2) シアノ基、(3) ニトロ基、(4) ハロゲン原子で置換されていてもよい C1 - C6 アルキル基および (5) ハロゲン原子で置換

50

されていてもよい C 1 - C 6 アルコキシ基からなる群より選ばれる 1 ~ 5 個の独立した置換基で置換されていてもよい C 7 - C 9 フェニルアルキル基を表す。]

で示される化合物(以下、化合物(1 - ii)と記す。)は、化合物(2)と、

式(4)：



[式中、 A^{34} および R^{8a} は、前記と同じ意味を表す。]

で示される化合物(以下、化合物(4)と記す。)とを反応させることにより製造することができる。

【0176】

該反応は、溶媒の存在下または非存在下で行われる。反応に用いられる溶媒としては、例えば 1, 4 - ジオキサン、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、メチル tert - ブチルエーテル等のエーテル、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1, 2 - ジクロロエタン、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素、トルエン、ベンゼン、キシレン等の炭化水素、アセトニトリル等のニトリル、N, N - ジメチルホルムアミド、N - メチルピロリドン、1, 3 - ジメチル - 2 - イミダゾリジノン、ジメチルスルホキシド等の非プロトン性極性溶媒およびこれらの混合物が挙げられる。

【0177】

該反応に用いられる化合物(4)の量は、化合物(2)1モルに対して、通常 1 ~ 2 モルの割合である。

【0178】

該反応の反応温度は、通常、0 ~ 100 の範囲であり、反応時間は、通常、0.1 ~ 24 時間の範囲である。

【0179】

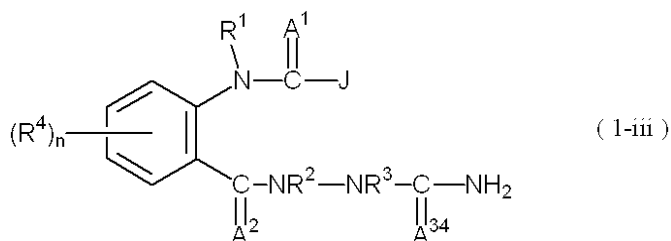
反応終了後は、反応混合物を水に注加した後、有機溶媒抽出する、または、析出した沈殿を濾取することにより化合物(1 - ii)を単離することができる。単離された化合物(1 - ii)は、再結晶、クロマトグラフィ - 等により更に精製することもできる。

【0180】

(製造法 A - 3)

本発明化合物のうち、

式(1 - iii)：



[式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 A^1 、 A^2 、 A^{34} 、Jおよびnは、前記と同じ意味を表す。

]

で示される化合物(以下、化合物(1 - iii)と記す。)は、化合物(2)と、シアン酸塩またはチオシアン酸塩とを反応させることにより製造することができる。

【0181】

該反応は、溶媒の存在下で行われる。反応に用いられる溶媒としては、例えば、酢酸等の有機酸および塩酸等の鉱酸の酸、並びにこれらの酸と水、クロロホルム等との混合物が挙げられる。

【0182】

該反応に用いられるシアン酸塩またはチオシアン酸塩の量は、化合物(2)1モルに対して、通常 1 ~ 2 モルの割合である。

【0183】

該反応の反応温度は、通常、0 ~ 100 の範囲であり、反応時間は、通常、0.1 ~

10

20

30

40

50

24時間の範囲である。

【0184】

シアン酸塩またはチオシアン酸塩としては、例えば、シアン酸カリウム、シアン酸ナトリウム、シアン酸アンモニウム、チオシアン酸カリウム、チオシアン酸ナトリウムおよびチオシアン酸アンモニウムが挙げられる。

【0185】

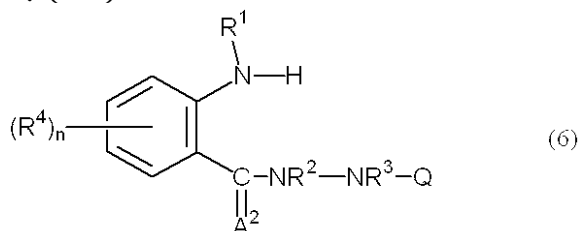
反応終了後は、反応混合物を水に注加した後、有機溶媒抽出する、または、析出した沈殿を濾取することにより化合物(1-iii)を単離することができる。単離された化合物(1-iii)は、再結晶、クロマトグラフィ - 等により更に精製することもできる。

【0186】

(製造法B-1)

本発明化合物は、

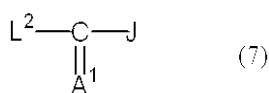
式(6)：



〔式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 A^2 、 Q および n は、前記と同じ意味を表す。〕

で示される化合物(以下、化合物(6)と記す。)と、

式(7)：



〔式中、 A^1 および J は、前記と同じ意味を表し、 L^2 は、ハロゲン原子を表す。〕

で示される化合物(以下、化合物(7)と記す。)とを反応させることにより製造することができる。

【0187】

該反応は、溶媒の存在下または非存在下で行われる。反応に用いられる溶媒としては、例えば、1,4-ジオキサン、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、メチル tert-ブチルエーテル等のエーテル、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1,2-ジクロロエタン、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素、トルエン、ベンゼン、キシレン等の炭化水素、アセトニトリル等のニトリル、N,N-ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン、1,3-ジメチル-2-イミダゾリジノン、ジメチルスルホキシド等の非プロトン性極性溶媒およびこれらの混合物が挙げられる。

【0188】

該反応に用いられる化合物(7)の量は、化合物(6)1モルに対して、通常、1~2モルの割合である。

【0189】

該反応は、必要に応じて、塩基の存在下で行われる。塩基の存在下で行われる場合に用いられる塩基としては、例えば、ピリジン、ピコリン、2,6-ルチジン、1,8-ジアザビシクロ[5,4,0]7-ウンデセン(DBU)、1,5-ジアザビシクロ[4,3,0]5-ノネン(DBN)等の含窒素複素環化合物、トリエチルアミン、N,N-ジイソプロピルエチルアミン等の第3級アミン、炭酸カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が挙げられる。塩基の存在下で行われる場合に用いられる塩基の量は、化合物(6)1モルに対して、通常、1~2モルの割合であるが、ピリジン等の反応条件下で液体である塩基を用いる場合は、該塩基を溶媒量用いることもできる。

【0190】

該反応の反応温度は、通常、0～100 の範囲であり、反応時間は、通常、0.1～24時間の範囲である。

【0191】

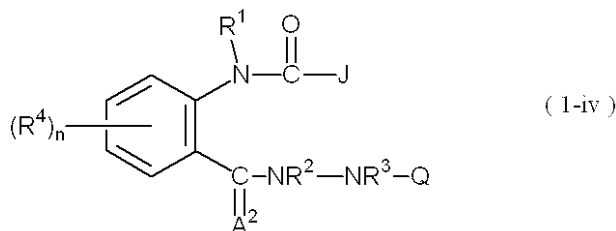
反応終了後は、反応混合物を水に注加した後、有機溶媒抽出する、または、析出した沈殿の濾取することにより本発明化合物を単離することができる。単離された本発明化合物は、再結晶、クロマトグラフィ - 等により更に精製することもできる。

【0192】

(製造法B-2)

本発明化合物のうち、

式(1-iv)：

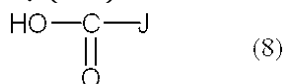


10

〔式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 A^2 、 J 、 Q および n は、前記と同じ意味を表す。〕

で示される化合物(以下、化合物(1-iv)と記す。)は、化合物(6)と、

式(8)：



20

〔式中、 J は、前記と同じ意味を表す。〕

で示される化合物(以下、化合物(8)と記す。)とを脱水剤の存在下で反応させることにより製造することができる。

【0193】

該反応は、溶媒の存在下または非存在下で行われる。反応に用いられる溶媒としては、例えば、1,4-ジオキサン、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、メチル tert-ブチルエーテル等のエーテル、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1,2-ジクロロエタン、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素、トルエン、ベンゼン、キシレン等の炭化水素、アセトニトリル等のニトリル、N,N-ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン、1,3-ジメチル-2-イミダゾリジノン、ジメチルスルホキシド等の非プロトン性極性溶媒およびこれらの混合物が挙げられる。

30

【0194】

該反応に用いられる化合物(8)の量は、化合物(6)1モルに対して、通常、1～2モルの割合である。

【0195】

該反応に用いられる脱水剤としては、例えば、ジシクロヘキシルカルボジイミド(DCC)、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩(WSC)等のカルボジイミドが挙げられる。用いられる脱水剤の量は、化合物(6)1モルに対して、通常、1～2モルの割合である。

40

【0196】

該反応の反応温度は通常0～100 の範囲であり、反応時間は通常0.1～24時間の範囲である。

【0197】

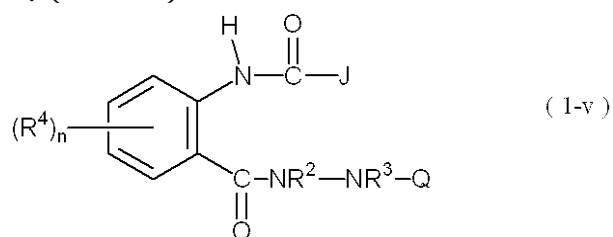
反応終了後は、反応混合物を水に注加した後、有機溶媒抽出する、または、析出した沈殿の濾取することにより、化合物(1-iv)を単離することができる。単離された化合物(1-iv)は、再結晶、クロマトグラフィ - 等により更に精製することもできる。

【0198】

50

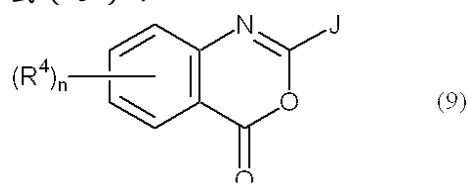
(製造法 C - 1)

本発明化合物のうち、
式 (1 - v) :

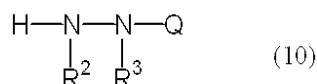


10

[式中、 R^2 、 R^3 、 R^4 、J、Qおよびnは、前記と同じ意味を表す。]
で示される化合物(以下、化合物(1 - v)と記す。)は、
式(9) :



[式中、 R^4 、Jおよびnは、前記と同じ意味を表す。]
で示される化合物(以下、化合物(9)と記す。)と、
式(10) :



20

[式中、 R^2 、 R^3 およびQは、前記と同じ意味を表す。]
で示される化合物(以下、化合物(10)と記す。)
とを反応させることにより製造することができる。

【0199】

該反応は、溶媒の存在下または非存在下で行われる。反応に用いられる溶媒としては、
例えば 1, 4 - ジオキサン、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、メチル tert - ブ
チルエーテル等のエーテル、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1, 2 - ジク
ロロエタン、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素、トルエン、ベンゼン、キシレン等
の炭化水素、アセトニトリル等のニトリル、N, N - ジメチルホルムアミド、N - メチル
ピロリドン、1, 3 - ジメチル - 2 - イミダゾリジノン、ジメチルスルホキシド等の非ブ
ロトン性極性溶媒およびこれらの混合物が挙げられる。

30

【0200】

該反応に用いられる化合物(10)の量は、化合物(9)1モルに対して、通常、1 ~
20モルの割合である。

【0201】

該反応の反応温度は、通常、0 ~ 100 の範囲であり、反応時間は、通常、0.1 ~
48時間の範囲である。

40

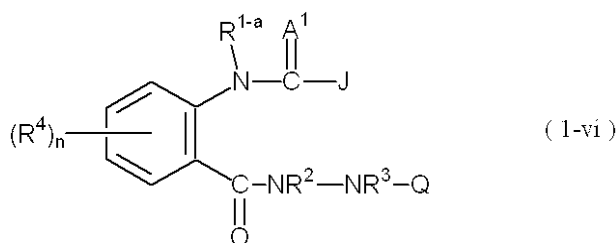
【0202】

反応終了後は、反応混合物を水に注加した後、有機溶媒抽出する、または、析出した沈
殿の濾取することにより化合物(1 - v)を単離することができる。単離された化合物(
1 - v)は、再結晶、クロマトグラフィ - 等により更に精製することもできる。

【0203】

(製造法 C - 2)

本発明化合物のうち、
式(1 - vi) :



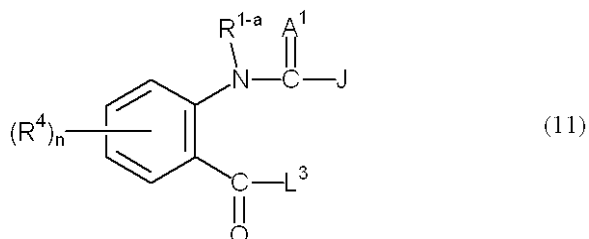
〔式中、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 A^1 、 J 、 Q および n は、前記と同じ意味を表し、

R^{1-a} は、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキル基、C2 - C6シアノアルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC2 - C6アルコキシアルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC2 - C6アルケニル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC3 - C6アルキニル基、または、

ベンゼン環部分が、(1)ハロゲン原子、(2)シアノ基、(3)ニトロ基、(4)ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキル基および(5)ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルコキシ基からなる群より選ばれる1 ~ 5個の独立した置換基で置換されていてもよいC7 - C9フェニルアルキル基を表す。〕

で示される化合物(以下、化合物(1 - vi)と記す。)は、

式(11)：



〔式中、 R^{1-a} 、 R^4 、 A^1 、 J および n は、前記と同じ意味を表し、

L^3 はハロゲン原子を表す。〕

で示される化合物(以下、化合物(11)と記す。)と、化合物(10)とを反応させることにより製造することができる。

【0204】

該反応は、溶媒の存在下または非存在下で行われる。反応に用いられる溶媒としては、例えば、1,4-ジオキサン、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、メチル tert-ブチルエーテル等のエーテル、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1,2-ジクロロエタン、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素、トルエン、ベンゼン、キシレン等の炭化水素、アセトニトリル等のニトリル、N,N-ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン、1,3-ジメチル-2-イミダゾリジノン、ジメチルスルホキシド等の非プロトン性極性溶媒およびこれらの混合物が挙げられる。

【0205】

該反応に用いられる化合物(10)の量は、化合物(11)1モルに対して、通常、1 ~ 2モルの割合である。

【0206】

該反応は、必要に応じて塩基の存在下で行われる。塩基の存在下で行われる場合に用いられる塩基としては、例えば、ピリジン、ピコリン、2,6-ルチジン、1,8-ジアザビシクロ〔5,4,0〕7-ウンデセン(DBU)、1,5-ジアザビシクロ〔4,3,0〕5-ノネン(DBN)等の含窒素複素環化合物、トリエチルアミン、N,N-ジイソプロピルエチルアミン等の第3級アミン、炭酸カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が挙げられる。塩基の存在下で行われる場合に用いられる塩基の量は、化合物(6)1モルに対して、通常、1 ~ 2モルの割合であるが、ピリジン等の反応条件下で液体である塩基を用いる場合は、該塩基を溶媒量用いることもできる。

【0207】

該反応の反応温度は、通常、0～100 の範囲であり、反応時間は、通常、0.1～24時間の範囲である。

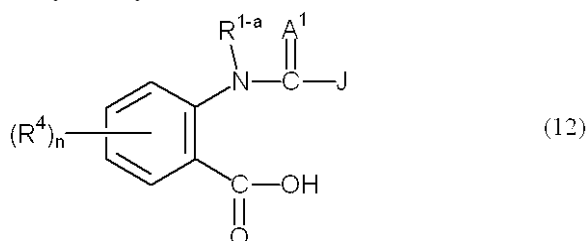
【0208】

反応終了後は、反応混合物を水に注加した後、有機溶媒抽出する、または、析出した沈殿の濾取することにより、化合物(1-vi)を単離することができる。単離された化合物(1-vi)は、再結晶、クロマトグラフィ - 等により更に精製することもできる。

【0209】

(製造法C-3)

化合物(1-vi)は、
式(12)：



10

〔式中、 R^4 、 R^{1-a} 、 A^1 、 J および n は、前記と同じ意味を表す。〕

で示される化合物(以下、化合物(12)と記す。)と、化合物(10)とを脱水剤と存在下反応させることにより製造することもできる。

20

【0210】

該反応は、溶媒の存在下または非存在下で行われる。反応に用いられる溶媒としては、例えば、1,4-ジオキサン、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、メチル tert-ブチルエーテル等のエーテル、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1,2-ジクロロエタン、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素、トルエン、ベンゼン、キシレン等の炭化水素、アセトニトリル等のニトリル、N,N-ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン、1,3-ジメチル-2-イミダゾリジノン、ジメチルスルホキシド等の非プロトン性極性溶媒およびこれらの混合物が挙げられる。

【0211】

該反応に用いられる化合物(10)の量は、化合物(12)1モルに対して、通常1～2モルの割合である。

30

【0212】

該反応に用いられる脱水剤としては、例えば、ジシクロヘキシルカルボジイミド(DCC)、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩(WSC)等のカルボジイミドが挙げられる。用いられる脱水剤の量は、化合物(12)1モルに対して、通常、1～2モルの割合である。

【0213】

該反応の反応温度は、通常、0～100 の範囲であり、反応時間は、通常、0.1～24時間の範囲である。

【0214】

40

反応終了後は、反応混合物を水に注加した後、有機溶媒抽出する、または、析出した沈殿の濾取することにより化合物(1-vi)を単離することができる。単離された化合物(1-vi)は、再結晶、クロマトグラフィ - 等により更に精製することもできる。

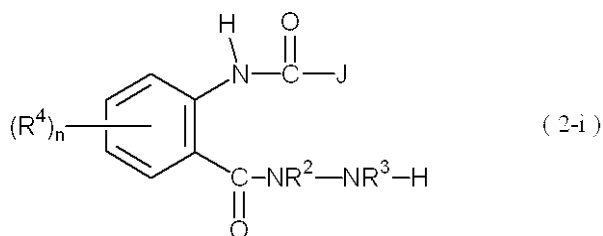
【0215】

次に、本発明化合物の製造中間体の製造法について説明する。

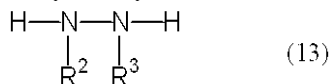
【0216】

(参考製造法1)

化合物(2)のうち、
式(2-i)：



〔式中、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 J および n は、前記と同じ意味を表す。〕
 で示される化合物（以下、化合物（2-i）と記す。）は、化合物（9）と、
 式（13）：



〔式中、 R^2 および R^3 は、前記と同じ意味を表す。〕
 で示される化合物（以下、化合物（13）と記す。）とを反応させることにより製造することができる。

【0217】

該反応は、溶媒の存在下または非存在下で行われる。反応に用いられる溶媒としては、例えば、1, 4 - ジオキサン、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、メチル tert - ブチルエーテル等のエーテル、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1, 2 - ジクロロエタン、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素、トルエン、ベンゼン、キシレン等の炭化水素、アセトニトリル等のニトリル、N, N - ジメチルホルムアミド、N - メチルピロリドン、1, 3 - ジメチル - 2 - イミダゾリジノン、ジメチルスルホキシド等の非プロトン性極性溶媒、メタノール、エタノール、2 - プロパノール等のアルコールおよびこれらの混合物が挙げられる。

【0218】

該反応に用いられる化合物（13）の量は、化合物（9）1モルに対して、通常、1 ~ 5モルの割合である。

【0219】

該反応の反応温度は、通常、- 50 ~ 100 の範囲であり、反応時間は、通常、0 . 1 ~ 24時間の範囲である。

【0220】

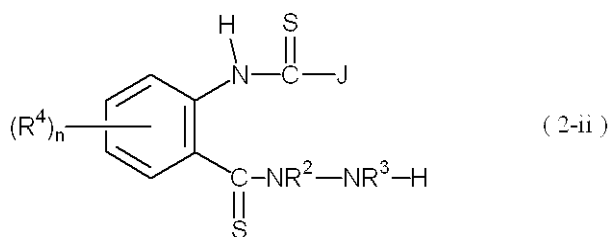
反応終了後は、反応混合物を水に注加した後、有機溶媒抽出する、または、析出した沈殿の濾取することにより化合物（2-i）を単離することができる。単離された化合物（2-i）は、再結晶、クロマトグラフィ - 等により更に精製することもできる。

【0221】

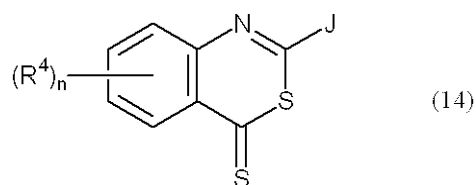
（参考製造法2）

化合物（2）のうち、

式（2-ii）：



〔式中、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 J および n は、前記と同じ意味を表す。〕
 で示される化合物（以下、化合物（2-ii）と記す。）は、
 式（14）：



〔式中、 R^4 、 J および n は、前記と同じ意味を表す。〕
 で示される化合物（以下、化合物（14）と記す。）と、化合物（13）とを反応させる
 ことにより製造することができる。

【0222】

該反応は、溶媒の存在下または非存在下で行われる。反応に用いられる溶媒としては、
 例えば、1,4-ジオキサン、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、メチル tert-
 ブチルエーテル等のエーテル、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1,2-ジ
 クロロエタン、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素、トルエン、ベンゼン、キシレン
 等の炭化水素、アセトニトリル等のニトリル、N,N-ジメチルホルムアミド、N-メチ
 ルピロリドン、1,3-ジメチル-2-イミダゾリジノン、ジメチルスルホキシド等の非
 プロトン性極性溶媒、メタノール、エタノール、2-プロパノール等のアルコールおよび
 これらの混合物が挙げられる。

【0223】

該反応に用いられる化合物（13）の量は、化合物（14）1モルに対して、通常、1
 ~ 5モルの割合である。

【0224】

該反応の反応温度は、通常、-50 ~ 100 の範囲であり、反応時間は、通常、0 .
 1 ~ 24時間の範囲である。

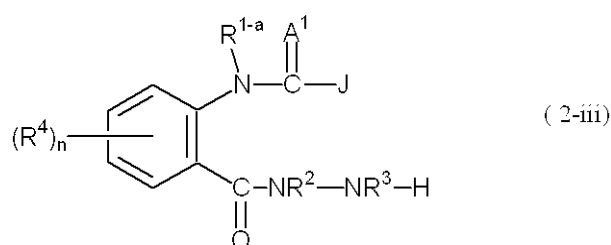
【0225】

反応終了後は、反応混合物を水に注加した後、有機溶媒抽出する、または、析出した沈
 殿の濾取することにより化合物（2-ii）を単離することができる。単離された化合物
 （2-ii）は、再結晶、クロマトグラフィ - 等により更に精製することもできる。

【0226】

（参考製造法3）

化合物（2）のうち、
 式（2-iii）：



〔式中、 R^{1-a} 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 A^1 、 J および n は、前記と同じ意味を表す。〕
 で示される化合物（以下、化合物（2-iii）と記す。）は、化合物（11）と、化合物
 （13）とを反応させることにより製造することができる。

【0227】

該反応は、溶媒の存在下または非存在下で行われる。反応に用いられる溶媒としては、
 例えば、1,4-ジオキサン、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、メチル tert-
 ブチルエーテル等のエーテル、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1,2-ジ
 クロロエタン、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素、トルエン、ベンゼン、キシレン
 等の炭化水素、アセトニトリル等のニトリル、N,N-ジメチルホルムアミド、N-メチ
 ルピロリドン、1,3-ジメチル-2-イミダゾリジノン、ジメチルスルホキシド等の非
 プロトン性極性溶媒およびこれらの混合物が挙げられる。

【0228】

該反応に用いられる化合物(13)の量は、化合物(11)1モルに対して、通常、2～10モルの割合である。

【0229】

該反応の反応温度は、通常、-50～100 の範囲であり、反応時間は、通常、0.1～24時間の範囲である。

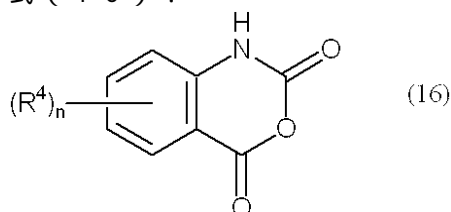
【0230】

反応終了後は、反応混合物を水に注加した後、有機溶媒抽出する、または、析出した沈殿の濾取することにより化合物(2-iii)を単離することができる。単離された化合物(2-iii)は、再結晶、クロマトグラフィ - 等により更に精製することもできる。

【0231】

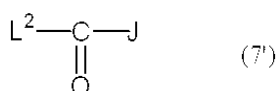
(参考製造法4)

化合物(9)は、
式(16)：



〔式中、 R^4 および n は前記と同じ意味を表す。〕

で示される化合物(以下、化合物(16)と記す。)と、
式(7')：



〔式中、 J および L^2 は前記と同じ意味を表す。〕

で示される化合物(以下、化合物(7')と記す。)とを反応させることにより製造することができる。

【0232】

該反応は、塩基の存在下、溶媒の存在下または非存在下で行われる。反応に用いられる溶媒としては、例えば、1,4-ジオキサン、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、メチル tert-ブチルエーテル等のエーテル、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1,2-ジクロロエタン、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素、トルエン、ベンゼン、キシレン等の炭化水素、アセトニトリル等のニトリル、N,N-ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン、1,3-ジメチル-2-イミダゾリジノン、ジメチルスルホキシド等の非プロトン性極性溶媒およびこれらの混合物が挙げられる。

【0233】

該反応に用いられる化合物(7')の量は、化合物(16)に対して、通常、0.5～2モルの割合である。

【0234】

該反応に用いられる塩基としては、例えば、ピリジン、ピコリン、2,6-ルチジン、1,8-ジアザビシクロ[5,4,0]7-ウンデセン(DBU)、1,5-ジアザビシクロ[4,3,0]5-ノネン(DBN)等の含窒素複素環化合物、トリエチルアミン、N,N-ジイソプロピルエチルアミン等の第3級アミン、炭酸カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が挙げられる。塩基の存在下で行われる場合に用いられる塩基の量は、化合物(16)1モルに対して、通常、1～2モルの割合であるが、ピリジン等の反応条件下で液体である塩基を用いる場合は、該塩基を溶媒量用いることもできる。

【0235】

該反応の反応温度は、通常、50～150 の範囲であり、反応時間は、通常、1～24時間の範囲である。

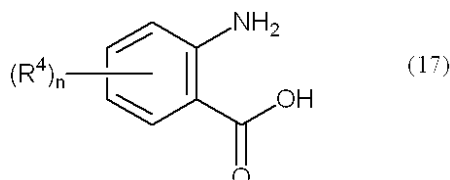
【 0 2 3 6 】

反応終了後は、反応混合物を水に注加した後、有機溶媒抽出する、または、析出した沈殿の濾取することにより化合物(9)を単離することができる。単離された化合物(9)は、再結晶、クロマトグラフィ - 等により更に精製することもできる。

【 0 2 3 7 】

(参考製造法5)

化合物(9)は、
式(17)：



10

〔式中、 R^4 および n は、前記と同じ意味を表す。〕

で示される化合物(以下、化合物(17)と記す。)と、化合物(7')とを反応させることにより製造することができる。

【 0 2 3 8 】

該反応は、溶媒の存在下または非存在下で行われる。反応に用いられる溶媒としては、例えば、1,4-ジオキサン、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、メチル tert-ブチルエーテル等のエーテル、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1,2-ジクロロエタン、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素、トルエン、ベンゼン、キシレン等の炭化水素、アセトニトリル等のニトリル、N,N-ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン、1,3-ジメチル-2-イミダゾリジノン、ジメチルスルホキシド等の非プロトン性極性溶媒およびこれらの混合物が挙げられる。

20

【 0 2 3 9 】

該製造法は、以下の(工程5-1)および(工程5-2)とからなる。

【 0 2 4 0 】

(工程5-1)

該工程は塩基の存在下、化合物(17)と化合物(7')とを反応させることにより行われる。

30

【 0 2 4 1 】

該工程で用いられる化合物(7')の量は、化合物(17)1モルに対して、通常、1~2モルの割合である。該工程に用いられる塩基としては、例えば、ピリジン、ピコリン、2,6-ルチジン、1,8-ジアザビシクロ[5,4,0]7-ウンデセン(DBU)、1,5-ジアザビシクロ[4,3,0]5-ノネン(DBN)等の含窒素複素環化合物、トリエチルアミン、N,N-ジイソプロピルエチルアミン等の第3級アミン、炭酸カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が挙げられる。用いられる塩基の量は、化合物(17)1モルに対して、通常、1~2モルの割合である。

【 0 2 4 2 】

該工程の反応温度は、通常、0~50 の範囲であり、反応時間は、通常、0.1~2 4時間の範囲である。

40

【 0 2 4 3 】

該工程の終了後は、通常、反応混合物は、そのまま、次の(工程5-2)に用いられる。

【 0 2 4 4 】

(工程5-2)

該工程は塩基の存在下、前記(工程5-1)における反応混合物と、スルホン酸ハロゲン化物とを反応させることにより行われる。

【 0 2 4 5 】

該工程に用いられるスルホン酸ハロゲン化物としては、例えば、メタンスルホン酸塩化

50

物、p - トルエンスルホン酸塩化物、トリフルオロメタンスルホン酸塩化物が挙げられる。該工程に用いられるスルホン酸ハロゲン化物の量は、(工程 5 - 1) で用いられる化合物 (17) 1 モルに対して、通常 1 ~ 2 モルの割合である。

【0246】

該工程に用いられる塩基としては、(工程 5 - 1) に記載の塩基と同じものが挙げられ、通常は、(工程 5 - 1) で用いられる塩基と同一の塩基が挙げられる。用いられる塩基の量は、(工程 5 - 1) で用いられる化合物 (17) 1 モルに対して、通常、2 ~ 4 モルの割合である。

【0247】

該工程の反応温度は、通常、0 ~ 50 の範囲であり、反応時間は、通常、0.1 ~ 2 4 時間の範囲である。 10

【0248】

該工程の終了後は、反応混合物を水に注加した後、通常の有機溶媒抽出等によって化合物 (9) を単離することができる。単離された化合物 (9) は、再結晶、クロマトグラフィ - 等により更に精製することもできる。

【0249】

(参考製造法 6)

化合物 (14) は、化合物 (9) とチオカルボニル化剤とを反応させることにより製造することができる。

【0250】

20

該反応は、溶媒の存在下または非存在下で行われる。反応に用いられる溶媒としては、例えば、1, 4 - ジオキサン、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、メチル tert - ブチルエーテル、ジグライム等のエーテル、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1, 2 - ジクロロエタン、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素、トルエン、ベンゼン、キシレン等の炭化水素、アセトニトリル等のニトリル、ピリジン、ピコリン、ルチジン等のピリジンおよびこれらの混合物が挙げられる。

【0251】

該反応に用いられるチオカルボニル化剤としては、五硫化ニリン、ローソン試薬 (2, 4 - ビス - (4 - メトキシフェニル) - 1, 3 - ジチア - 2, 4 - ジホスフェタン 2, 4 - ジスルフィド) 等が挙げられる。 30

【0252】

該反応に用いられるチオカルボニル化剤の量は、化合物 (9) 1 モルに対して、通常、1 ~ 3 モルの割合である。

【0253】

該反応の反応温度は、通常、0 ~ 200 の範囲であり、反応時間は、通常、1 ~ 2 4 時間の範囲である。

【0254】

反応終了後は、反応混合物中に析出した沈殿を濾取する、または、反応混合物を有機溶媒抽出等により化合物 (14) を単離することができる。単離された化合物 (14) は、再結晶、クロマトグラフィー等によりさらに精製することもできる。 40

【0255】

(参考製造法 7)

化合物 (11) は、化合物 (12) をハロゲン化剤とさせることにより製造することができる。

【0256】

該反応は、溶媒の存在下または非存在下で行われる。反応に用いられる溶媒としては、例えば、1, 4 - ジオキサン、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、メチル tert - ブチルエーテル等のエーテル、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1, 2 - ジクロロエタン、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素、トルエン、ベンゼン、キシレン等の炭化水素、アセトニトリル等のニトリル、N, N - ジメチルホルムアミド、N - メチ 50

ルピロリドン、1,3-ジメチル-2-イミダゾリジノン、ジメチルスルホキシド等の非プロトン性極性溶媒およびこれらの混合物が挙げられる。

【0257】

該反応に用いられるハロゲン化剤としては、例えば、塩化チオニル、臭化チオニル、オキシ塩化リン、オキシ臭化リン、五塩化リン、オキサリルクロライド、ホスゲンが挙げられる。

【0258】

該反応に用いられるハロゲン化剤の量は、化合物(12)1モルに対して、通常、1~2モルの割合であるが、場合によっては、ハロゲン化剤を溶媒量用いることもできる。

【0259】

該反応の反応温度は、通常、0~150の範囲であり、反応時間は、通常、0.1~24時間の範囲である。

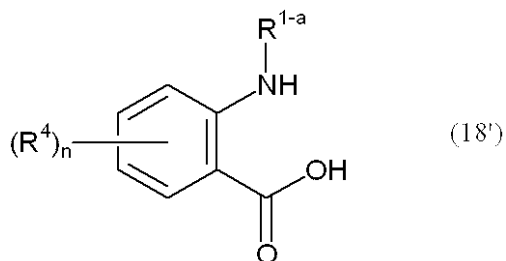
【0260】

反応終了後は、反応混合物中に析出した沈殿を濾取する、または、反応混合物を濃縮することにより、化合物(11)を単離することができる。単離された化合物(11)は、通常、このまま、次工程に用いるが、必要に応じて、再結晶等により更に精製することもできる。

【0261】

(参考製造例8)

化合物(12)は、
式(18'):



[式中、 R^{1-a} 、 R^4 および n は、前記と同じ意味を表す。]

で示される化合物(以下、化合物(18')と記す。)と、化合物(7)とを反応させることにより製造することができる。

【0262】

該反応は、溶媒の存在下または非存在下で行われる。反応に用いられる溶媒としては、例えば、1,4-ジオキサン、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、メチル tert-ブチルエーテル等のエーテル、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1,2-ジクロロエタン、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素、トルエン、ベンゼン、キシレン等の炭化水素、アセトニトリル等のニトリル、N,N-ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン、1,3-ジメチル-2-イミダゾリジノン、ジメチルスルホキシド等の非プロトン性極性溶媒およびこれらの混合物が挙げられる。

【0263】

該反応で用いられる化合物(7)の量は、化合物(18')1モルに対して、通常、1~2モルの割合である。

【0264】

該反応は、塩基の存在下で行われる。用いられる塩基としては、例えば、ピリジン、ピコリン、2,6-ルチジン、1,8-ジアザビシクロ[5,4,0]7-ウンデセン(DBU)、1,5-ジアザビシクロ[4,3,0]5-ノネン(DBN)等の含窒素複素環化合物、トリエチルアミン、N,N-ジイソプロピルエチルアミン等の第3級アミン、炭酸カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が挙げられる。用いられる塩基の量は、化合物(18')1モルに対して、通常1~2モルの割合である。

【0265】

該工程の反応温度は、通常、0～50 の範囲であり、反応時間は、通常、0.1～24時間の範囲である。

【0266】

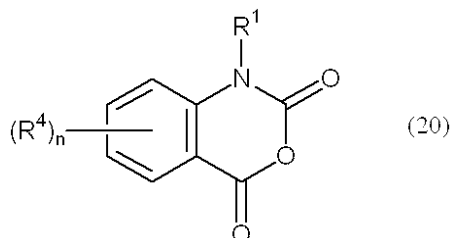
該工程の終了後は、反応混合物を水に注加した後、通常の有機溶媒抽出する、または、析出沈殿を濾取することにより化合物(12)を単離することができる。単離された化合物(12)は、再結晶、クロマトグラフィー等により更に精製することもできる。

【0267】

(参考製造法9)

化合物(6)は、

式(20)：



〔式中、R¹、R⁴およびnは、前記と同じ意味を表す。〕

で示される化合物(以下、化合物(20)と記す。)と、化合物(10)とを反応させることにより製造することができる。

【0268】

該反応は、溶媒の存在下または非存在下で行われる。反応に用いられる溶媒としては、例えば、1,4-ジオキサン、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、メチル tert-ブチルエーテル等のエーテル、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1,2-ジクロロエタン、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素、トルエン、ベンゼン、キシレン等の炭化水素、アセトニトリル等のニトリル、N,N-ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン、1,3-ジメチル-2-イミダゾリジノン、ジメチルスルホキシド等の非プロトン性極性溶媒、メタノール、エタノール、イソプロピルアルコール等のアルコールおよびこれらの混合物が挙げられる。

【0269】

該反応に用いられる化合物(10)の量は、化合物(20)1モルに対して、通常、1～2モルの割合である。

【0270】

該反応の反応温度は、通常、-20～150 の範囲であり、反応時間は、通常、0.1～24時間の範囲である。

【0271】

反応終了後は、反応混合物を水に注加した後、有機溶媒抽出する、または、析出した沈殿の濾取することにより化合物(20)を単離することができる。単離された化合物(20)は、再結晶、クロマトグラフィー等により更に精製することもできる。

【0272】

化合物(3)、(4)および(13)は、公知の化合物であるか、または、既知の方法(例えば、Organic Functional Group Preparations, 2nd edition, Vol.1, chapter 12, p.359-376 (Stanley R. Sandler, Wolf Karo.)、または、Organic Functional Group Preparations, 2nd edition, Vol.1, chapter 14, p.434-465 (Stanley R. Sandler, Wolf Karo.)参照。)に準じて、公知の化合物より製造することができる。

【0273】

上記の(製造法A-1)～(製造法C-1)および参考製造法1～9によって得られた化合物は、粉碎、粉末化、再結晶、カラムクロマトグラフィー、高速液体カラムクロマトグラフィー(HPLC)、中圧分取HPLC、脱塩樹脂カラムクロマトグラフィー、再沈澱等の常法によって単離、精製できる。

【 0 2 7 4 】

本発明化合物は、互変異性体、不斉炭素原子および二重結合に基づく光学異性体、幾何異性体などの立体異性体を1種以上包含することもある。かかる異性体およびそれらの混合物もすべて本発明の範囲に包含されるものである。

【 0 2 7 5 】

本発明化合物には、溶媒和物（例えば、水和物等）の形態をとるものがあるが、これらの形態のものも本発明の範囲に包含されるものである。

【 0 2 7 6 】

本発明化合物には、結晶形態および/または非結晶形態の形態をとるものがあるが、これらの形態のものも本発明の範囲に包含されるものである。

10

【 0 2 7 7 】

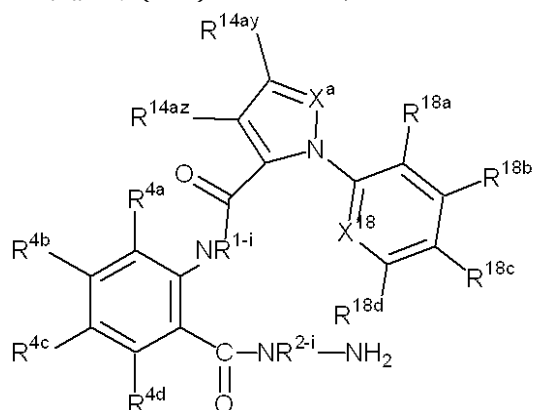
本発明には、プロドラッグの形態をとるものがあるが、これらの形態のものも本発明の範囲に包含されるものである。

【 0 2 7 8 】

化合物（2）の態様としては、例えば、以下のものが挙げられる。

【 0 2 7 9 】

下記式（II）において、



(II)

20

〔式中、

R^{1-i} は、水素原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキル基を表し、

30

R^{2-i} は、水素原子、またはメチル基を表し、

R^{4a} は、ハロゲン原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキル基を表し、

R^{4b} 、 R^{4c} および R^{4d} は、各々、独立して、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキル基を表すか、

または、 R^{4b} と R^{4c} とが末端で結合し、

T1: $-CR^{41} = CR^{42} - CR^{43} = CR^{44} -$

（ここで、 R^{41} 、 R^{42} 、 R^{43} および R^{44} は、各々、独立して、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキル基を表す。）で示される基を表し、

40

X^a は、窒素原子または CR^{14ay}

（ここで、 R^{14ay} は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルコキシ基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキルチオ基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキルスルフィニル基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキルスルホニル基を表す。）を表し、

R^{14ay} および R^{14az} は、各々、独立して、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルコキシ基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6

50

アルキルチオ基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキルスルフィニル基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキルスルホニル基を表し、

X^{18} は、窒素原子または CR^{18e}

(ここで、 R^{18e} は、水素原子、ハロゲン原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基を表す。)を表し、

R^{18a} は、ハロゲン原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基を表し、

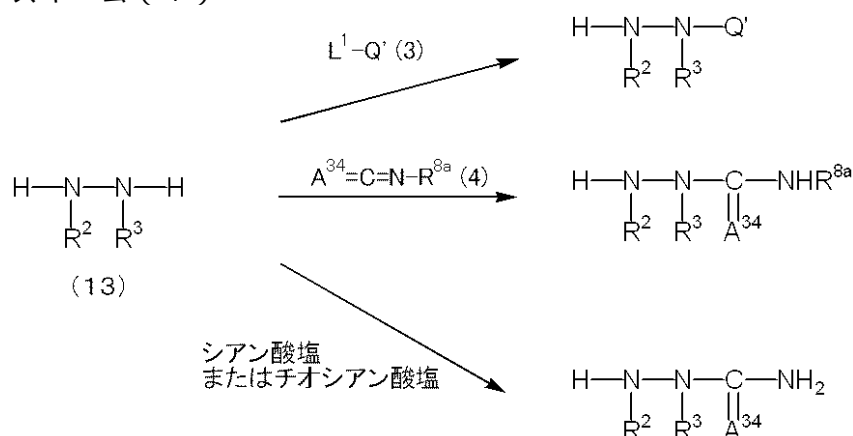
R^{18b} 、 R^{18c} 、および R^{18d} は、各々、独立して、水素原子、ハロゲン原子、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC 1 - C 6 アルキル基を表す。) 10
で示されるヒドラジド化合物。

【0280】

化合物(10)は、例えば、下記のスキーム(1)に従って製造することができる。

【0281】

スキーム(1)



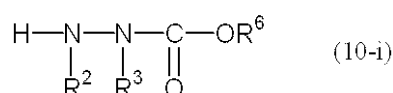
20

[スキーム中、 A^{34} 、 L^1 、 Q' 、 R^2 、 R^3 および R^{8a} は、前記と同じ意味を表す。]

【0282】

化合物(10)のうち、

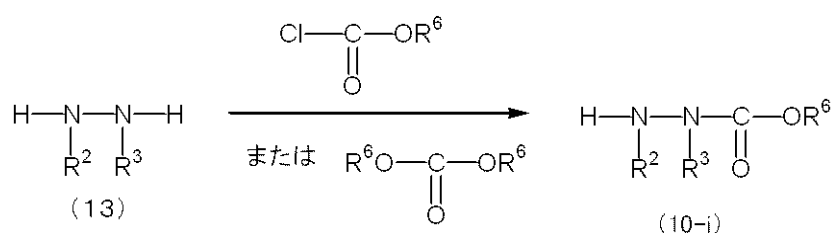
式(10-i)：



[式中、 R^2 、 R^3 および R^6 は、前記と同じ意味を表す。]で示される化合物は、例えば、下記のスキーム(2)に従って製造することができる。

【0283】

スキーム(2)



40

[スキーム中、 R^2 、 R^3 および R^6 は、前記と同じ意味を表す。]

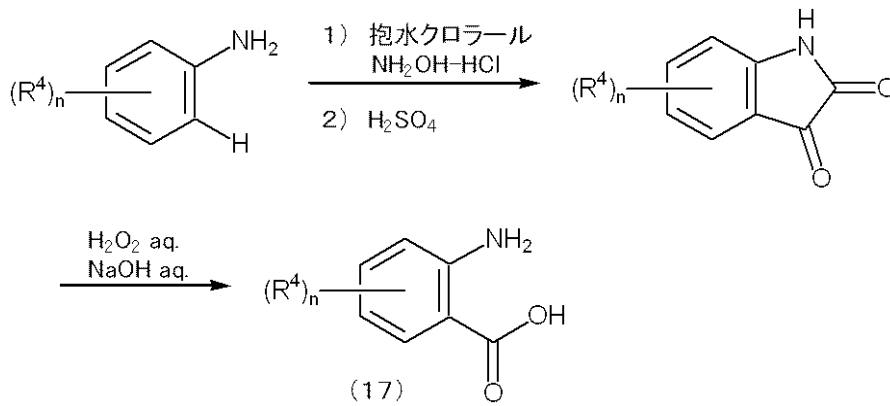
【0284】

化合物(17)は、例えば、下記のスキーム(3)に従って製造することができる。

【0285】

スキーム(3)

50



10

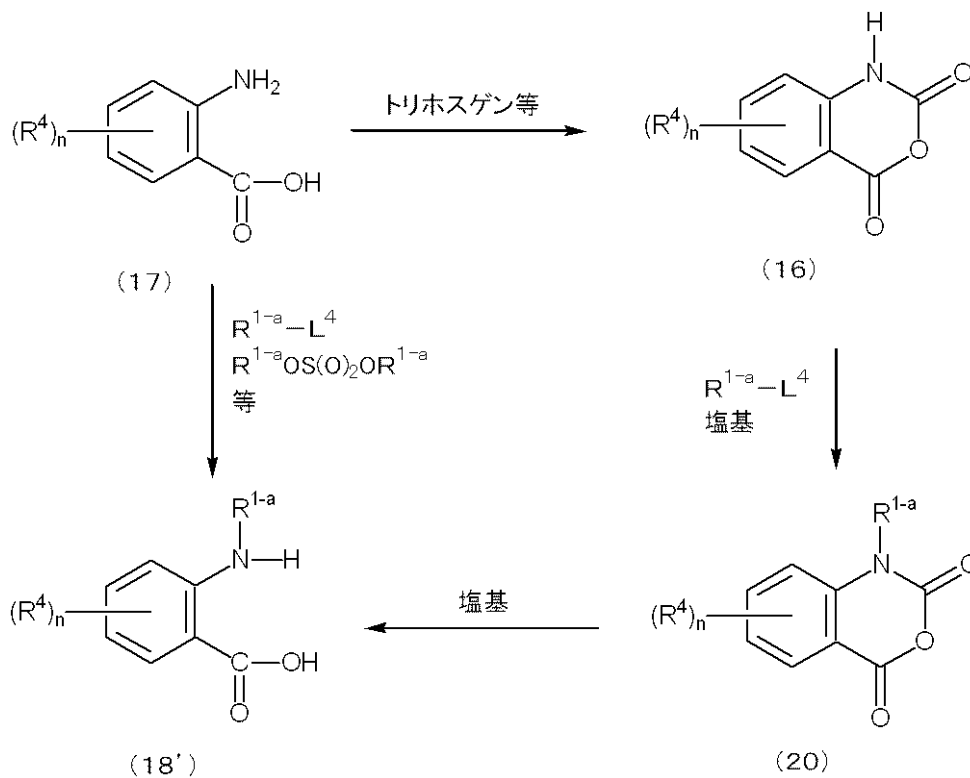
〔スキーム中、 R^4 および n は、前記と同じ意味を表す。〕

【0286】

化合物(16)、(18')および(20)は、例えば、下記のスキーム(4)に従って製造することができる。

【0287】

スキーム(4)



20

30

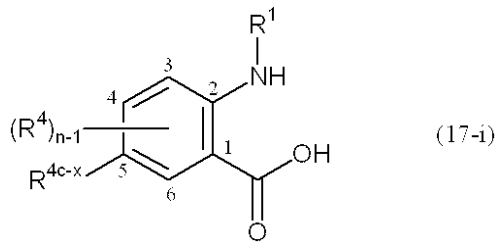
〔スキーム中、 R^{1-a} 、 R^4 および n は、前記と同じ意味を表し、

L^4 は、脱離基(例えば、ハロゲン原子、メタンスルホンイルオキシ基、 p -トルエンスルホンイルオキシ基等)を表す。〕

【0288】

化合物(17)および(18)のうち、
式(17-i)

40



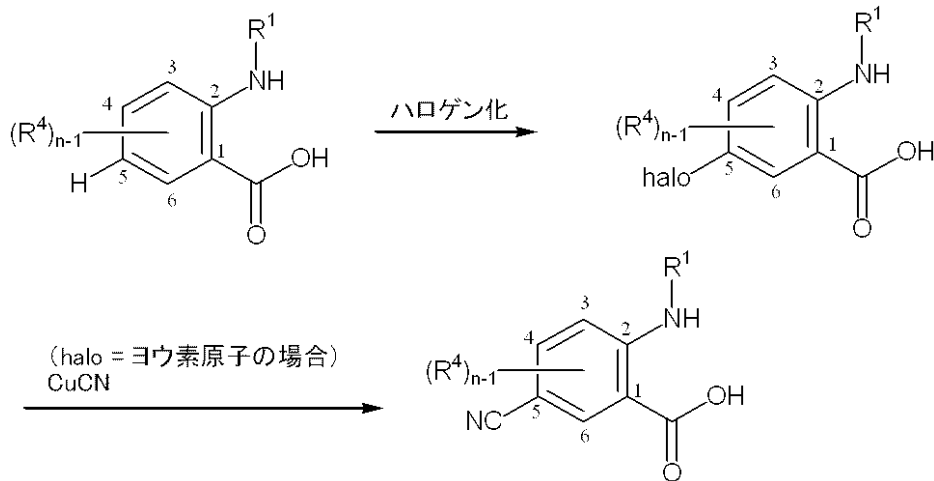
〔式中、 R^1 および R^4 は、前記と同じ意味を表し、

R^{4c-x} は、ハロゲン原子またはシアノ基を表し、

$n-1$ は、 $0 \sim 3$ の整数を表す。〕で示される化合物は、例えば、下記のスキーム (5) に従って製造することができる。

【0289】

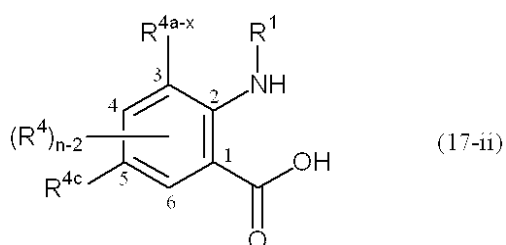
スキーム (5)



〔スキーム中、 R^1 、 R^4 および $n-1$ は、前記と同じ意味を表し、halo は、ハロゲン原子を表す。〕

【0290】

化合物 (17) および (18) のうち、
式 (17-ii) :



〔式中、 R^1 および R^4 は、前記と同じ意味を表し、

R^{4a-x} は、ハロゲン原子を表し、

R^{4c} は、 R^4 と同じ意味を表し、

$n-2$ は、 $0 \sim 2$ の整数を表す。〕で示される化合物は、例えば、下記のスキーム (6) に従って製造することができる。

【0291】

スキーム (6)

10

20

30

40



(17-ii)

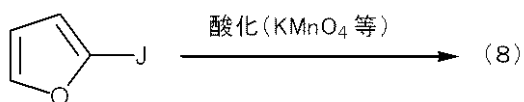
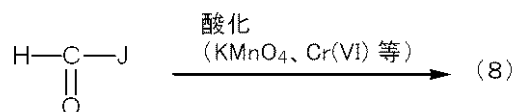
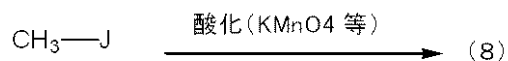
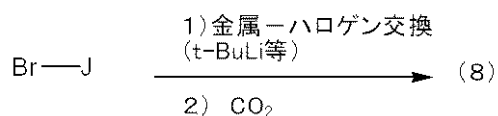
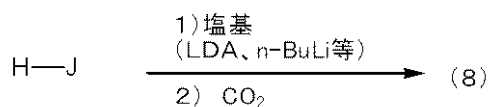
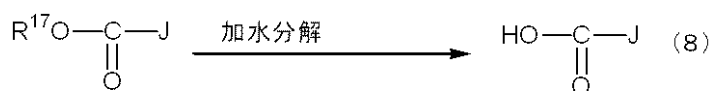
〔スキーム中、 R^1 、 R^4 、 R^{4a-x} 、 R^{4c} および $n-2$ は、前記と同じ意味を表す。〕

【0292】

化合物(8)は、例えば、下記のスキーム(7)に示す方法に従って製造することができる。

【0293】

スキーム(7)



〔スキーム中、J は、前記と同じ意味を表し、

R^{17} は、メチル基またはエチル基を表し、

LDA は、リチウムジイソプロアミドを表し、

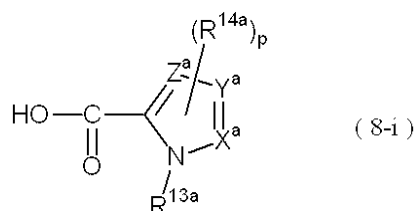
n-BuLi は、ノルマルブチルリチウムを表し、

t-BuLi は、ターシャリーブチルリチウムを表す。〕

【0294】

化合物(8)のうち、

式(8-i)：



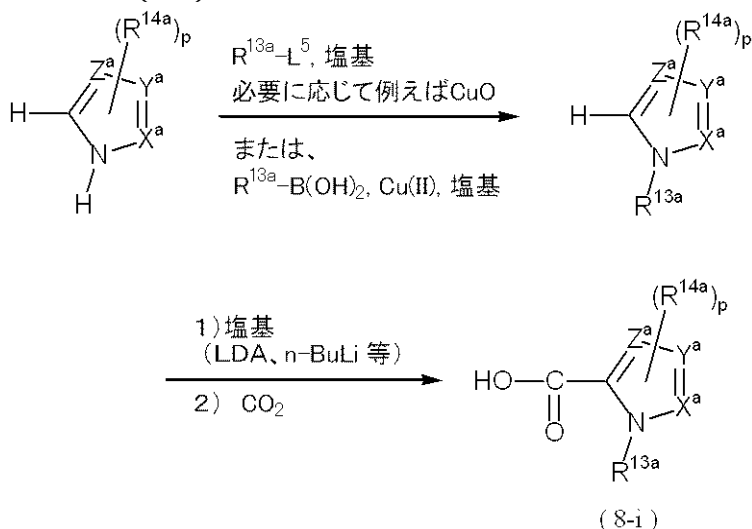
(8-i)

〔式中、 R^{13a} 、 R^{14a} 、 X^a 、 Y^a 、 Z^a および p は、前記と同じ意味を表す。〕

で示される化合物は、例えば、下記のスキーム（８）に示す方法に従って製造することができる。

【 0 2 9 5 】

スキーム（８）



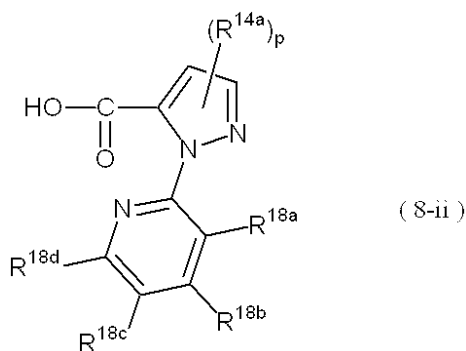
〔スキーム中、 R^{13a} 、 R^{14a} 、 X^a 、 Y^a 、 Z^a 、 p 、 LDA および $n-BuLi$ は、前記と同じ意味を表し、

L^5 は、脱離基（例えば、ハロゲン原子、メタンスルホニルオキシ基、 p -トルエンスルホニルオキシ基、メチルスルホニル基等）を表す。〕

【 0 2 9 6 】

化合物（８）のうち、

式（８-i i）：



〔式中、 R^{14a} および p は、前記と同じ意味を表し、

R^{18a} 、 R^{18b} 、 R^{18c} および R^{18d} は、各々、独立して、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1-C6$ アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1-C6$ アルコキシ基、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1-C6$ アルキルチオ基、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1-C6$ アルキルスルフィニル基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C1-C6$ アルキルスルホニル基を表す。〕で示される化合物は、例えば、下記のスキーム（９）に示す方法に従って製造することができる。

【 0 2 9 7 】

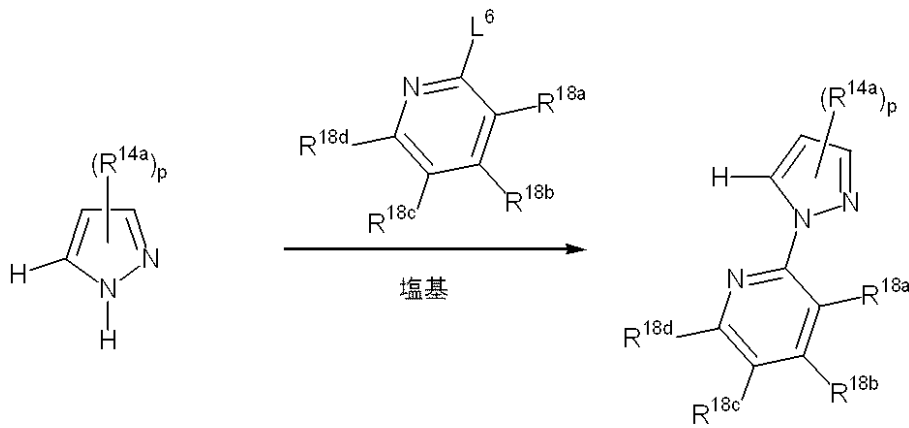
スキーム（９）

10

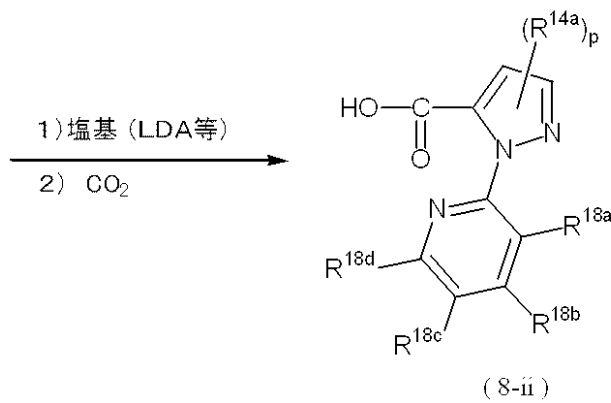
20

30

40



10

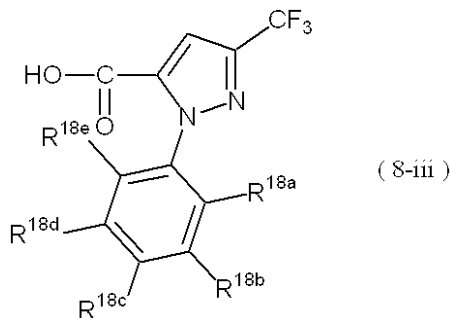


20

〔スキーム中、 R^{14a} 、 R^{18a} 、 R^{18b} 、 R^{18c} 、 R^{18d} 、LDAおよびpは、前記と同じ意味を表し、 L^6 は脱離基（例えば、ハロゲン原子、メチルスルホニル基等）を表す。〕

【0298】

化合物(8)のうち、
式(8-iii)：



30

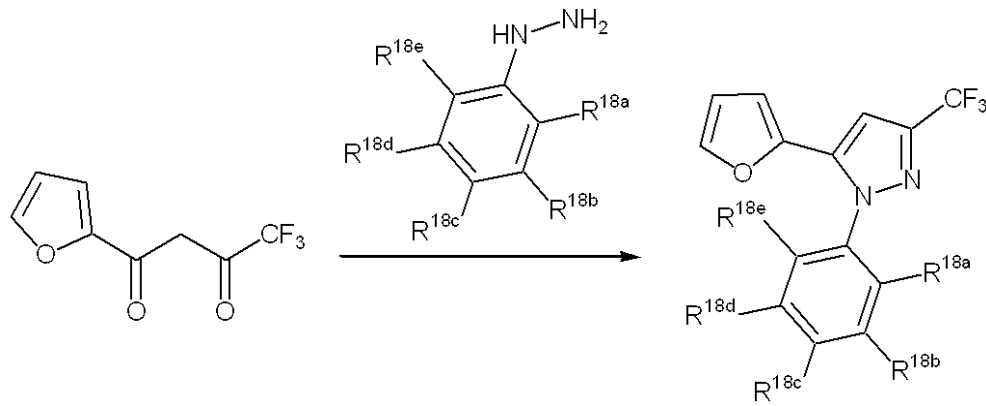
〔式中、 R^{18a} 、 R^{18b} 、 R^{18c} 、 R^{18d} および R^{18e} は、各々、独立して、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルコキシ基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキルチオ基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキルスルフィニル基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキルスルホニル基を表す。〕

40

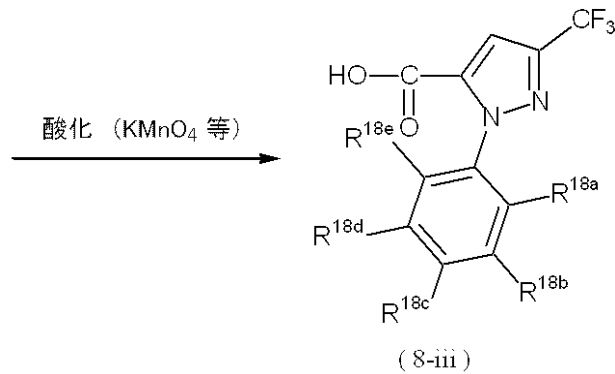
で示される化合物は、例えば、下記のスキーム(10)に示す方法に従って製造することができる。

【0299】

スキーム(10)



10

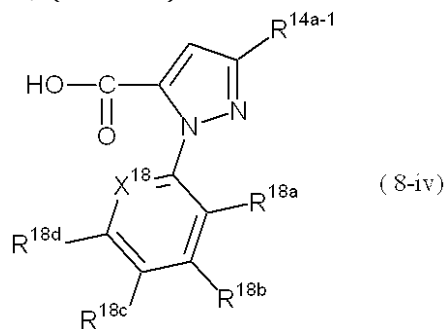


20

〔スキーム中、 R^{18a} 、 R^{18b} 、 R^{18c} 、 R^{18d} および R^{18e} は、前記と同じ意味を表す。〕

【0300】

化合物(8)のうち、
式(8-iv)：



30

〔式中、 X^{18} は、 $-N=$ 、または、 $-CR^{18e}=$ を表し、

R^{18a} 、 R^{18b} 、 R^{18c} 、 R^{18d} および R^{18e} は、前記と同じ意味を表し、

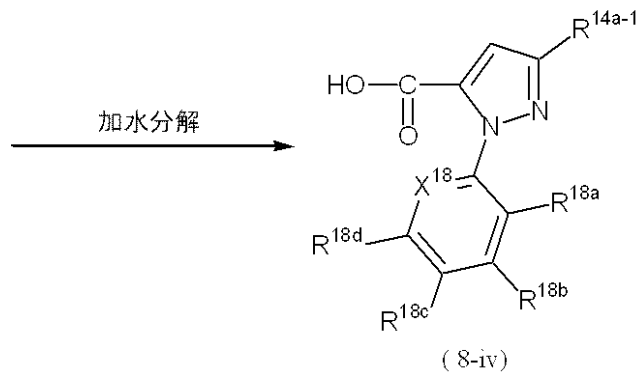
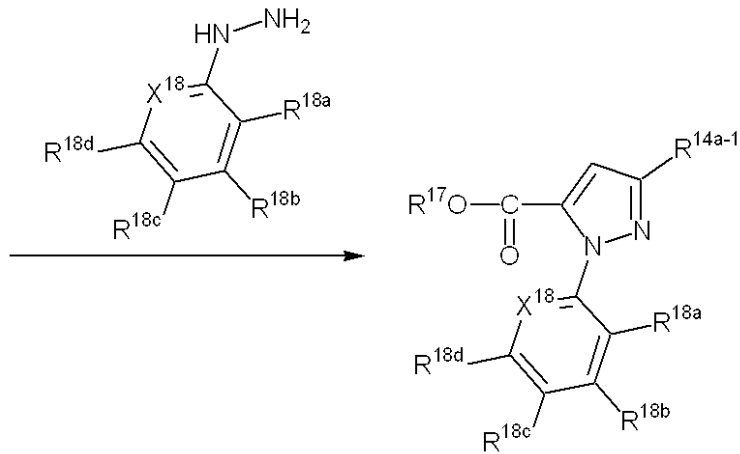
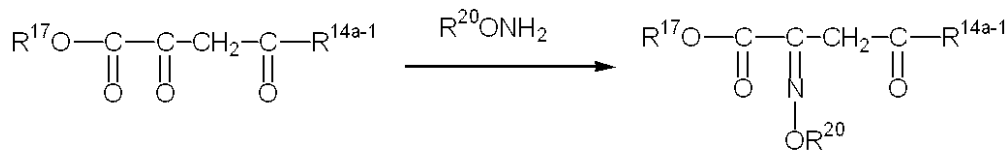
R^{14a-1} は、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1-C6アルキル基を表す。〕

で示される化合物は、例えば、下記のスキーム(11)に示す方法に従って製造することができる。

【0301】

スキーム(11)

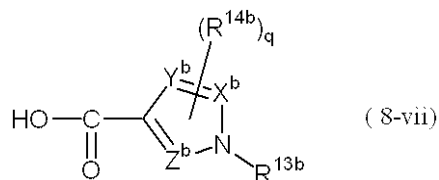
40



〔スキーム中、 R^{14a-1} 、 R^{17} 、 R^{18a} 、 R^{18b} 、 R^{18c} 、 R^{18d} および X^{18} は、前記と同じ意味を表し、 R^{20} は、メチル基またはエチル基を表す。〕

【0302】

化合物(8)のうち、
式(8-vii)：



〔式中、 R^{13b} 、 R^{14b} 、 X^b 、 Y^b 、 Z^b および q は、前記と同じ意味を表す。〕
で示される化合物は、例えば、下記のスキーム(12)に示す方法に従って製造することができる。

【0303】

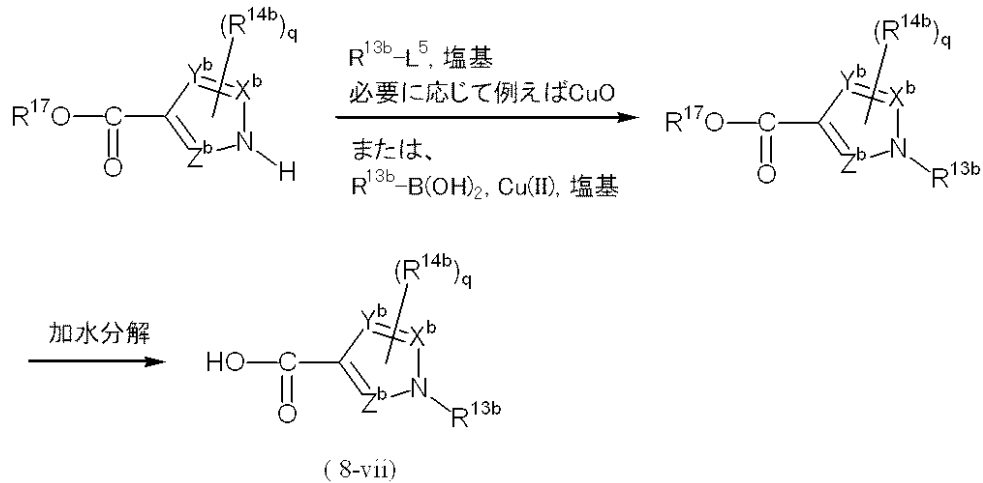
スキーム(12)

10

20

30

40

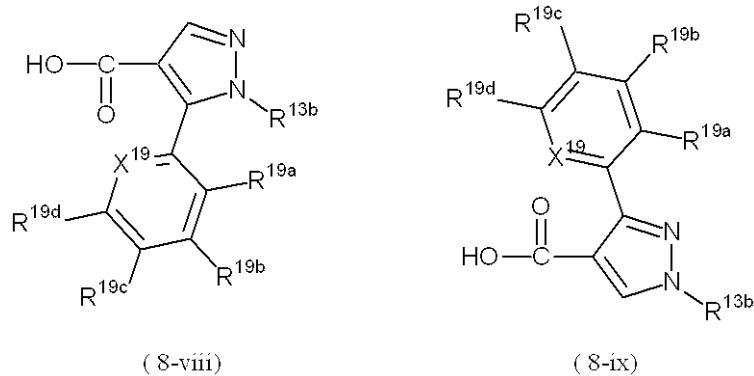


10

〔スキーム中、 R^{13b} 、 R^{14b} 、 R^{17} 、 X^b 、 Y^b 、 Z^b 、 L^5 および q は、前記と同じ意味を表す。〕

【0304】

化合物(8)のうち、
式(8-viii)および式(8-ix)：



20

〔式中、 R^{13b} は、前記と同じ意味を表し、

X^{19} は、 $-N=$ 、または、 $-C R^{19e}=$ を表し、

R^{19a} 、 R^{19b} 、 R^{19c} 、 R^{19d} および R^{19e} は、各々、独立して、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルコキシ基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキルチオ基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキルスルフィニル基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1 - C6アルキルスルホニル基を表す。〕

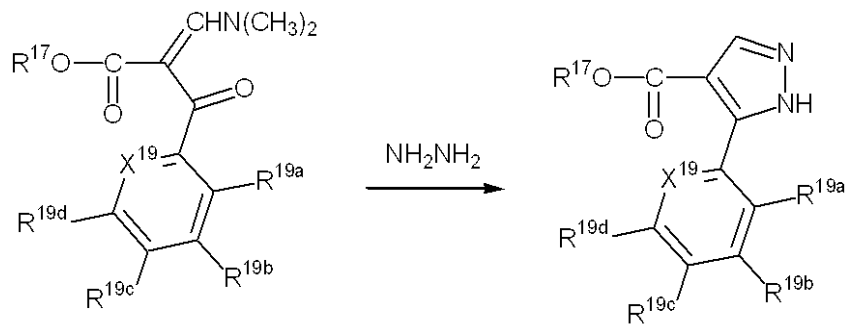
で示される化合物は、例えば、下記のスキーム(13)に示す方法に従って製造することができる。

【0305】

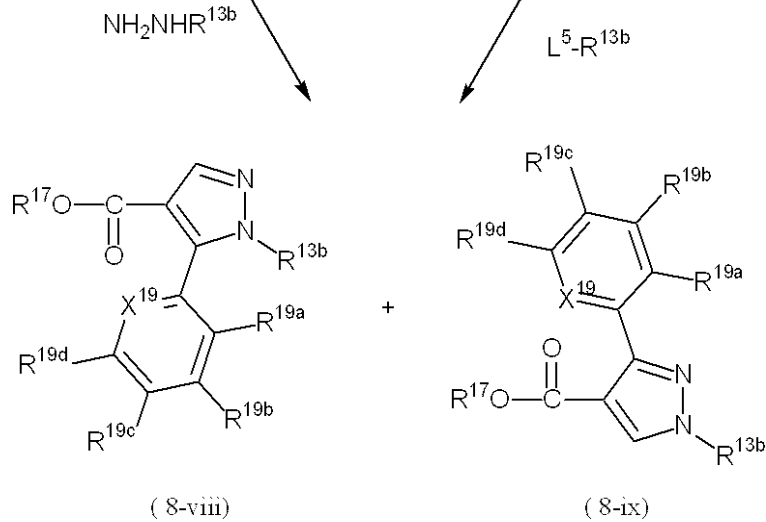
スキーム(13)

30

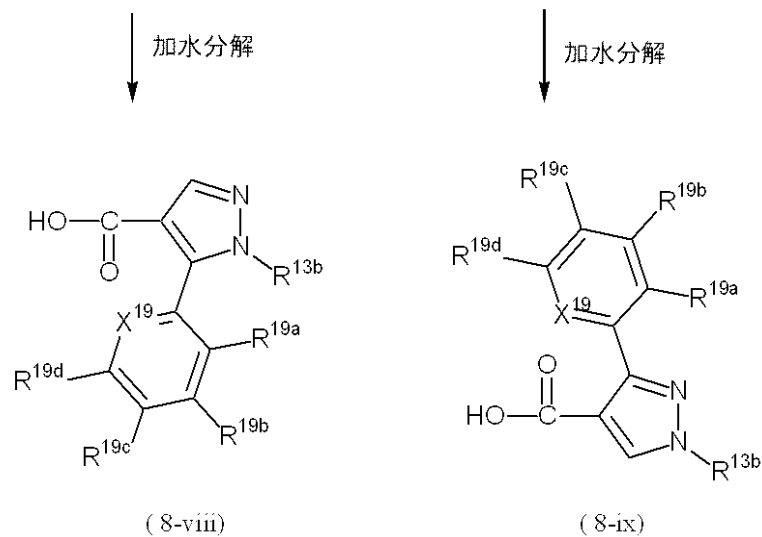
40



10



20



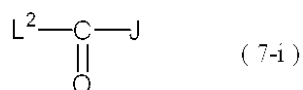
30

〔スキーム中、 R^{13b} 、 R^{17} 、 R^{19a} 、 R^{19b} 、 R^{19c} 、 R^{19d} 、 L^5 および X^{19} は、前記と同じ意味を表す。〕

40

【 0 3 0 6 】

化合物 (7) のうち、
式 (7 - i) :



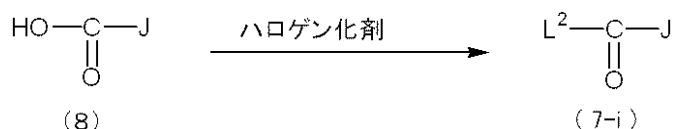
〔式中、 L^2 および J は、前記と同じ意味を表す。〕

で示される化合物は、例えば、下記のスキーム (1 4) に示す方法に従って製造することができる。

50

【 0 3 0 7 】

スキーム (1 4)

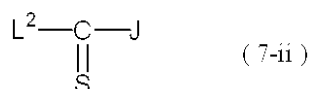


[スキーム中、 L^2 および J は、前記と同じ意味を表す。]

【 0 3 0 8 】

化合物 (7) のうち、

式 (7 - i i) :

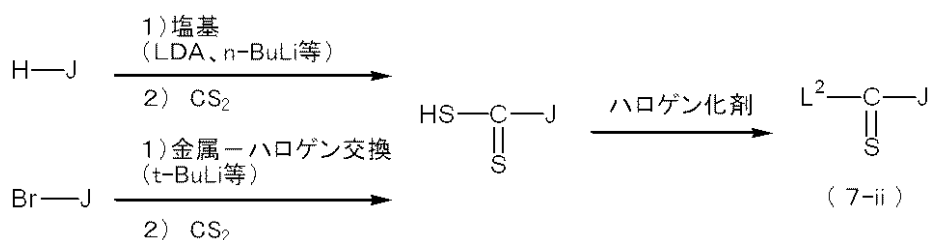


[式中、 L^2 および J は、前記と同じ意味を表す。]

で示される化合物は、例えば、下記のスキーム (1 5) に示す方法に従って製造することができる。

【 0 3 0 9 】

スキーム (1 5)



[スキーム中、 L^2 および J は、前記と同じ意味を表し、

LDA は、リチウムジイソプロアミドを表し、

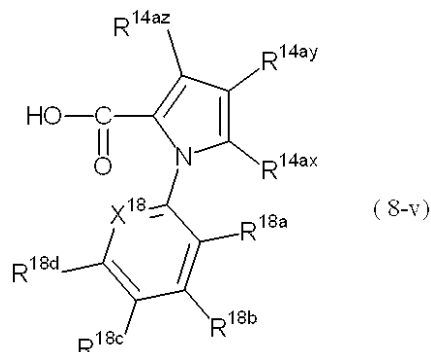
$n\text{-BuLi}$ は、ノルマルブチルリチウムを表し、

$t\text{-BuLi}$ は、ターシャリーブチルリチウムを表す。]

【 0 3 1 0 】

化合物 (8) のうち、

式 (8 - v) :



[式中、 $\text{R}^{18\text{a}}$ 、 $\text{R}^{18\text{b}}$ 、 $\text{R}^{18\text{c}}$ 、 $\text{R}^{18\text{d}}$ および X^{18} は、前記と同じ意味を表し、

$\text{R}^{14\text{ax}}$ 、 $\text{R}^{14\text{ay}}$ および $\text{R}^{14\text{az}}$ は、各々、独立して、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン原子で置換されていてもよい $\text{C}1 - \text{C}6$ アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよい $\text{C}1 - \text{C}6$ アルコキシ基、ハロゲン原子で置換されていてもよい $\text{C}1 - \text{C}6$ アルキルチオ基、ハロゲン原子で置換されていてもよい $\text{C}1 - \text{C}6$ アルキルスルフィニル基、または、ハロゲン原子で置換されていてもよい $\text{C}1 - \text{C}6$ アルキルスルホニル基を表す。]

で示される化合物は、例えば、下記のスキーム (1 6) に示す方法に従って製造すること

10

20

30

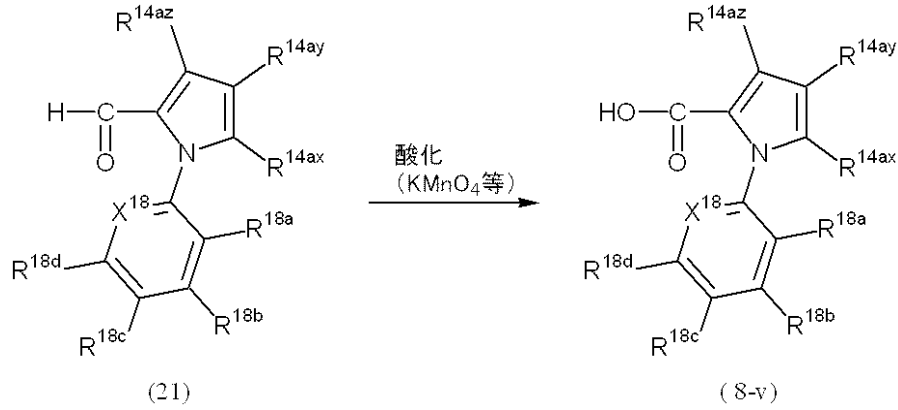
40

50

ができる。

【 0 3 1 1 】

スキーム (1 6)



10

〔スキーム中、 R^{18a} 、 R^{18b} 、 R^{18c} 、 R^{18d} 、 X^{18} 、 R^{14ax} 、 R^{14ay} および R^{14az} は、前記と同じ意味を表す。〕

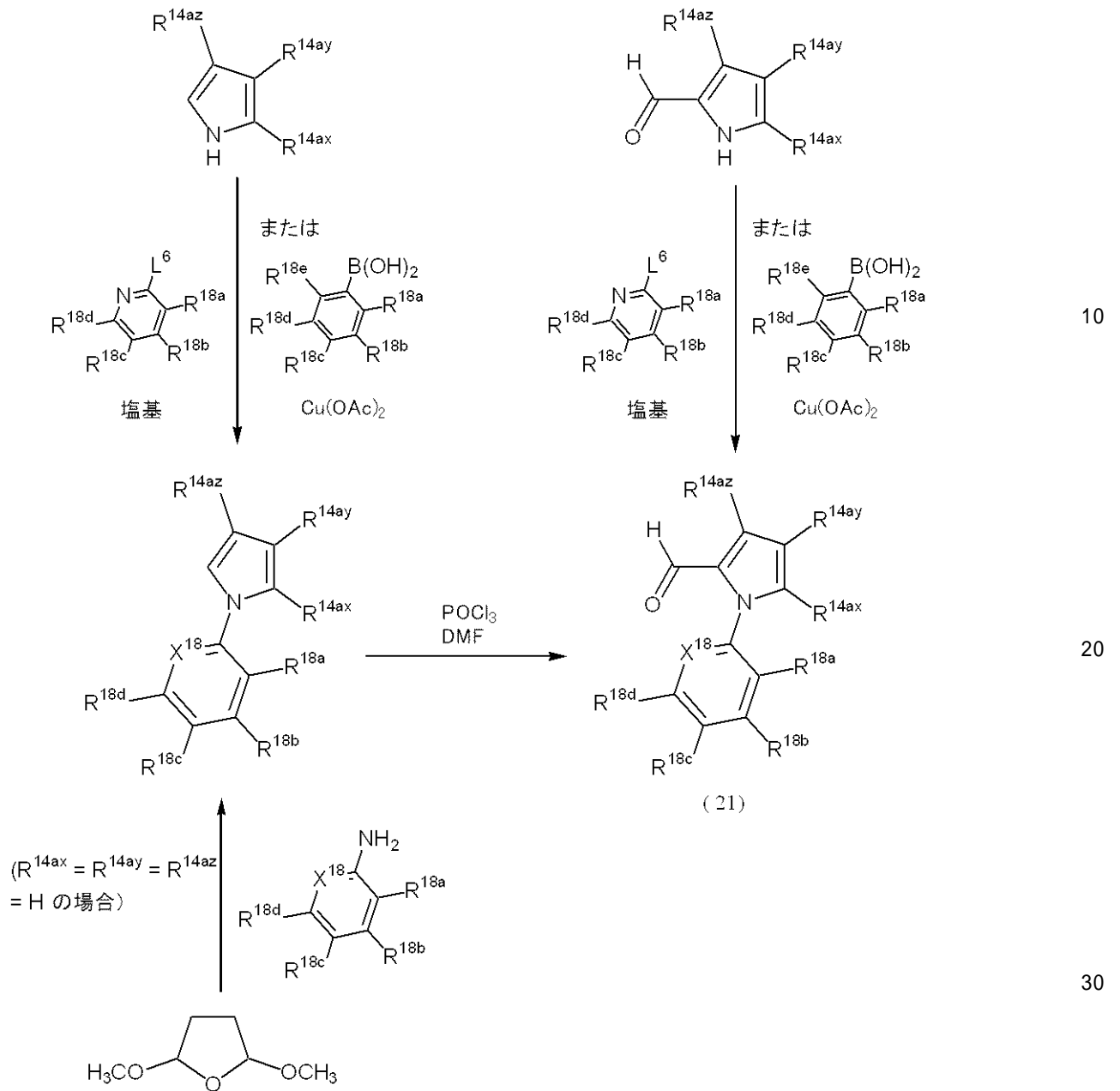
【 0 3 1 2 】

スキーム (1 6) における化合物 (2 1) は、例えば、下記のスキーム (1 7) に示す方法に従って製造することができる。

【 0 3 1 3 】

スキーム (1 7)

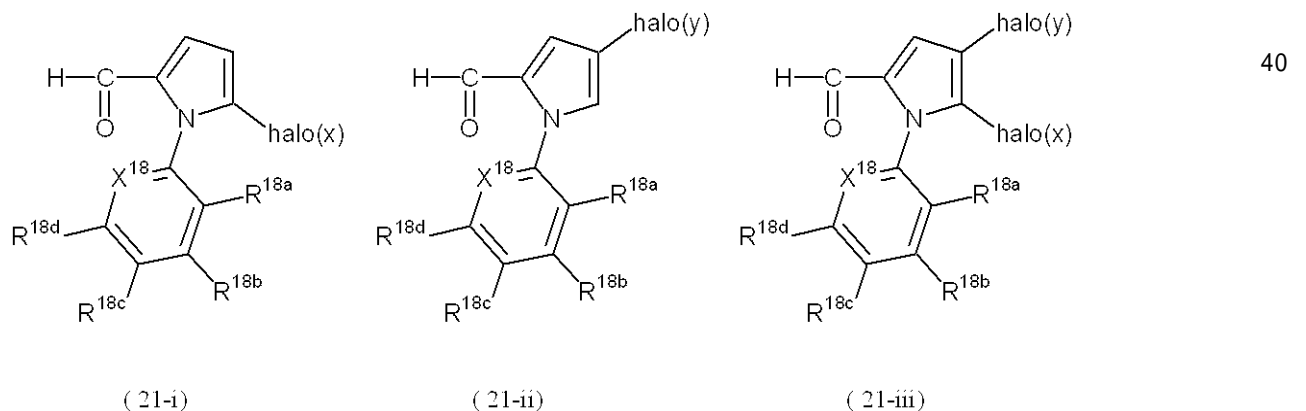
20



〔スキーム中、R^{18a}、R^{18b}、R^{18c}、R^{18d}、R^{18e}、X¹⁸、R^{14ax}、R^{14ay}、R^{14az}およびL⁶は、前記と同じ意味を表す。〕

【0314】

スキーム(16)における化合物(21)のうち、
式(21-i)、式(21-ii)および式(21-iii)：



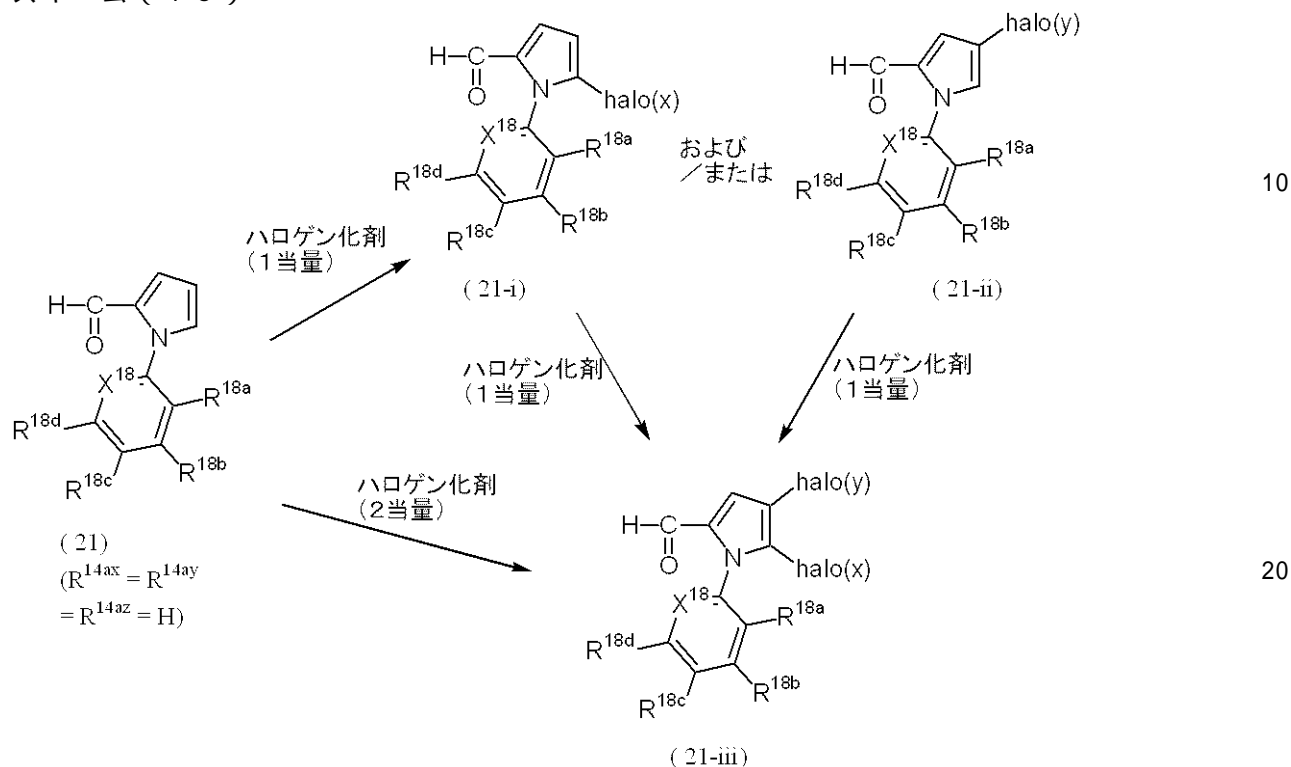
〔式中、R^{18a}、R^{18b}、R^{18c}、R^{18d}およびX¹⁸は、前記と同じ意味を表し、

halo(x)およびhalo(y)は、各々、独立して、ハロゲン原子を表す。]

で示される化合物は、例えば、下記のスキーム(18)に示す方法に従って製造することができる。

【0315】

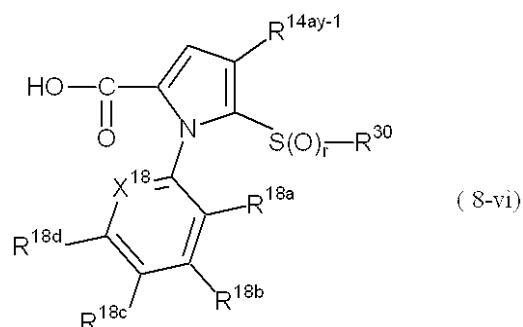
スキーム(18)



〔スキーム中、 R^{18a} 、 R^{18b} 、 R^{18c} 、 R^{18d} 、 X^{18} 、halo(x)およびhalo(y)は、前記と同じ意味を表す。〕

【0316】

化合物(8)のうち、
式(8-vi)：



〔式中、 R^{18a} 、 R^{18b} 、 R^{18c} 、 R^{18d} および X^{18} は、前記と同じ意味を表し、

R^{14ay-1} は、水素原子またはハロゲン原子を表し、

R^{30} は、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1-C6アルキル基を表し、

r は、0~2の整数を表す。〕

で示される化合物は、例えば、下記のスキーム(19)に示す方法に従って製造することができる。

【0317】

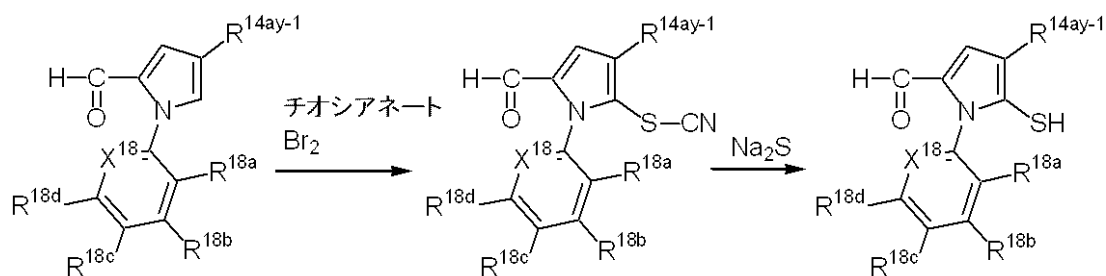
スキーム(19)

10

20

30

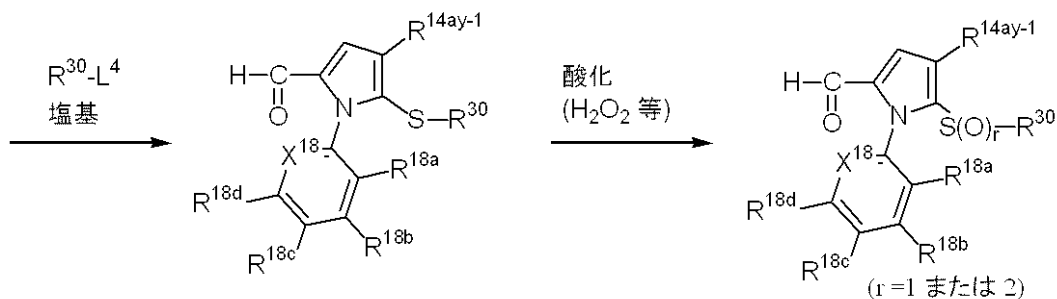
40



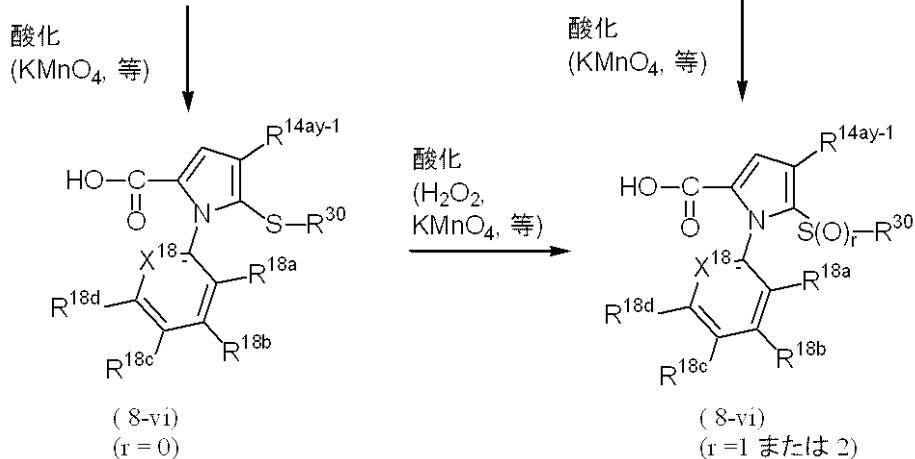
(21)

 $(R^{14ax} = R^{14az} = H,$ $R^{14ay} = H \text{ または } halo)$

10



20



30

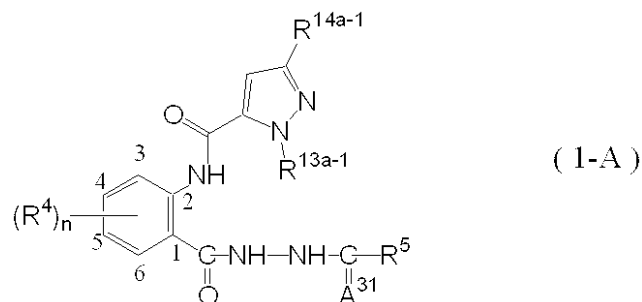
〔スキーム中、 R^{18a} 、 R^{18b} 、 R^{18c} 、 R^{18d} 、 X^{18} 、 R^{14ay-1} 、 R^{30} 、 r および L^4 は、前記と同じ意味を表す。〕

【0318】

以下に本発明化合物の具体例を示す。

【0319】

式(1-A)で示される化合物。



40

式中の R^5 、 A^{31} 、 $(R^4)_n$ 、 R^{13a-1} および R^{14a-1} は、〔表1〕～〔表7〕に記載の組合せを表す。

【0320】

【表 1】

R ⁵	A ³¹	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
H	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
H	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
H	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
H	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
H	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
H	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
H	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
H	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
H	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
H	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
H	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
H	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
H	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
H	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
H	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
H	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃

10

20

30

【 0 3 2 1 】

【表 2】

R ⁵	A ³¹	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH(CH ₃) ₂	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH(CH ₃) ₂	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH(CH ₃) ₂	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH(CH ₃) ₂	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH(CH ₃) ₂	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH(CH ₃) ₂	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH(CH ₃) ₂	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH(CH ₃) ₂	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH(CH ₃) ₂	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH(CH ₃) ₂	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH(CH ₃) ₂	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH(CH ₃) ₂	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH(CH ₃) ₂	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH(CH ₃) ₂	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH(CH ₃) ₂	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH(CH ₃) ₂	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃

10

20

30

【 0 3 2 2 】

【表 3】

R^5	A^{31}	$(R^4)_n$	R^{13a-1}	R^{14a-1}
$C(CH_3)_3$	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
$C(CH_3)_3$	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
$C(CH_3)_3$	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
$C(CH_3)_3$	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
$C(CH_3)_3$	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
$C(CH_3)_3$	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
$C(CH_3)_3$	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
$C(CH_3)_3$	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
$C(CH_3)_3$	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
$C(CH_3)_3$	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
$C(CH_3)_3$	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
$C(CH_3)_3$	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
$C(CH_3)_3$	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
$C(CH_3)_3$	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
$C(CH_3)_3$	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
$C(CH_3)_3$	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CF ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CF ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CF ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CF ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CF ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CF ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CF ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CF ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CF ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CF ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CF ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CF ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CF ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CF ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CF ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CF ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃

10

20

30

【 0 3 2 3 】

【表 4】

R ⁵	A ³¹	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₂ OCH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₂ OCH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₂ OCH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₂ OCH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₂ OCH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₂ OCH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₂ OCH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₂ OCH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₂ OCH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₂ OCH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₂ OCH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₂ OCH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₂ OCH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₂ OCH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₂ OCH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₂ OCH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₂ SCH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₂ SCH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₂ SCH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₂ SCH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₂ SCH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₂ SCH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₂ SCH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₂ SCH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₂ SCH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₂ SCH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₂ SCH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₂ SCH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₂ SCH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₂ SCH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₂ SCH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₂ SCH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃

10

20

30

【 0 3 2 4 】

【表 5】

R ⁵	A ³¹	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₂ N(CH ₃) ₂	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₂ N(CH ₃) ₂	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₂ N(CH ₃) ₂	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₂ N(CH ₃) ₂	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₂ N(CH ₃) ₂	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₂ N(CH ₃) ₂	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₂ N(CH ₃) ₂	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₂ N(CH ₃) ₂	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₂ N(CH ₃) ₂	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₂ N(CH ₃) ₂	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₂ N(CH ₃) ₂	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₂ N(CH ₃) ₂	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₂ N(CH ₃) ₂	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₂ N(CH ₃) ₂	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₂ N(CH ₃) ₂	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₂ N(CH ₃) ₂	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
シクロプロピル	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
シクロプロピル	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
シクロプロピル	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
シクロプロピル	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
シクロプロピル	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
シクロプロピル	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
シクロプロピル	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
シクロプロピル	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
シクロプロピル	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
シクロプロピル	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
シクロプロピル	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
シクロプロピル	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
シクロプロピル	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
シクロプロピル	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
シクロプロピル	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
シクロプロピル	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃

10

20

30

【 0 3 2 5 】

【表 6】

R ⁵	A ³¹	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
シクロブチル	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
シクロブチル	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
シクロブチル	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
シクロブチル	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
シクロブチル	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
シクロブチル	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
シクロブチル	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
シクロブチル	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
シクロブチル	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
シクロブチル	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
シクロブチル	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
シクロブチル	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
シクロブチル	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
シクロブチル	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
シクロブチル	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
シクロブチル	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
シクロペンチル	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
シクロペンチル	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
シクロペンチル	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
シクロペンチル	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
シクロペンチル	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
シクロペンチル	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
シクロペンチル	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
シクロペンチル	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
シクロペンチル	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
シクロペンチル	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
シクロペンチル	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
シクロペンチル	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
シクロペンチル	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
シクロペンチル	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
シクロペンチル	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
シクロペンチル	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃

10

20

30

【 0 3 2 6 】

【表 7】

R ⁵	A ³¹	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
シクロヘキシル	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
シクロヘキシル	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
シクロヘキシル	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
シクロヘキシル	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
シクロヘキシル	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
シクロヘキシル	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
シクロヘキシル	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
シクロヘキシル	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
シクロヘキシル	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
シクロヘキシル	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
シクロヘキシル	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
シクロヘキシル	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
シクロヘキシル	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
シクロヘキシル	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
シクロヘキシル	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
シクロヘキシル	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
フェニル	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
フェニル	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
フェニル	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
フェニル	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
フェニル	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
フェニル	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
フェニル	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
フェニル	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
フェニル	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
フェニル	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
フェニル	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
フェニル	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
フェニル	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
フェニル	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
フェニル	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
フェニル	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃

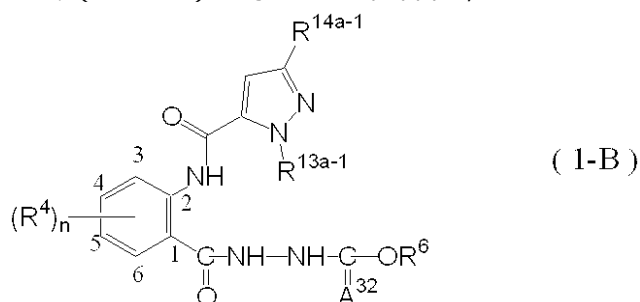
10

20

30

【0327】

式(1-B)で示される化合物；



40

式中のR⁶、A³²、(R⁴)_n、R^{13a-1}およびR^{14a-1}は、〔表8〕～〔表31〕に記載の組合せを表す。

【0328】

50

【表 8】

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₃	0	3-CH ₃	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-I	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CH ₃	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-Cl, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-Cl, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-Cl, 5-I	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-Cl, 5-CH ₃	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-Cl, 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-Br, 5-I	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-Br, 5-CH ₃	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-Br, 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-I	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-I, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-I, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-I, 5-I	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-I, 5-CH ₃	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-I, 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H

10

20

【 0 3 2 9 】

30

【表 9】

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₃	0	3-CH ₃	3-クロロ-2-ピリジニル	F
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	F
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	F
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-I	3-クロロ-2-ピリジニル	F
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CH ₃	3-クロロ-2-ピリジニル	F
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	F
CH ₃	0	3-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	F
CH ₃	0	3-Cl, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	F
CH ₃	0	3-Cl, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	F
CH ₃	0	3-Cl, 5-I	3-クロロ-2-ピリジニル	F
CH ₃	0	3-Cl, 5-CH ₃	3-クロロ-2-ピリジニル	F
CH ₃	0	3-Cl, 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	F
CH ₃	0	3-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	F
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	F
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	F
CH ₃	0	3-Br, 5-I	3-クロロ-2-ピリジニル	F
CH ₃	0	3-Br, 5-CH ₃	3-クロロ-2-ピリジニル	F
CH ₃	0	3-Br, 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	F
CH ₃	0	3-I	3-クロロ-2-ピリジニル	F
CH ₃	0	3-I, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	F
CH ₃	0	3-I, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	F
CH ₃	0	3-I, 5-I	3-クロロ-2-ピリジニル	F
CH ₃	0	3-I, 5-CH ₃	3-クロロ-2-ピリジニル	F
CH ₃	0	3-I, 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	F

10

20

【 0 3 3 0 】

30

【表 10】

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₃	0	3-CH ₃	3-クロロ-2-ピリジニル	C1
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	C1
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	C1
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-I	3-クロロ-2-ピリジニル	C1
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CH ₃	3-クロロ-2-ピリジニル	C1
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	C1
CH ₃	0	3-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	C1
CH ₃	0	3-Cl, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	C1
CH ₃	0	3-Cl, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	C1
CH ₃	0	3-Cl, 5-I	3-クロロ-2-ピリジニル	C1
CH ₃	0	3-Cl, 5-CH ₃	3-クロロ-2-ピリジニル	C1
CH ₃	0	3-Cl, 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	C1
CH ₃	0	3-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	C1
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	C1
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	C1
CH ₃	0	3-Br, 5-I	3-クロロ-2-ピリジニル	C1
CH ₃	0	3-Br, 5-CH ₃	3-クロロ-2-ピリジニル	C1
CH ₃	0	3-Br, 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	C1
CH ₃	0	3-I	3-クロロ-2-ピリジニル	C1
CH ₃	0	3-I, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	C1
CH ₃	0	3-I, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	C1
CH ₃	0	3-I, 5-I	3-クロロ-2-ピリジニル	C1
CH ₃	0	3-I, 5-CH ₃	3-クロロ-2-ピリジニル	C1
CH ₃	0	3-I, 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	C1

10

20

【0331】

30

【表 1 1】

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₃	0	3-CH ₂ CH ₃	3-クロロ-2-ピリジニル	C1
CH ₃	0	3-CH(CH ₃) ₂	3-クロロ-2-ピリジニル	C1
CH ₃	0	3-C(CH ₃) ₃	3-クロロ-2-ピリジニル	C1
CH ₃	0	3-CF ₃	3-クロロ-2-ピリジニル	C1
CH ₃	0	3-OCH ₃	3-クロロ-2-ピリジニル	C1
CH ₃	0	3-フェニル	3-クロロ-2-ピリジニル	C1
CH ₃	0	3-CH ₂ CH ₃ , 5-C1	3-クロロ-2-ピリジニル	C1
CH ₃	0	3-CH(CH ₃) ₂ , 5-C1	3-クロロ-2-ピリジニル	C1
CH ₃	0	3-C(CH ₃) ₃ , 5-C1	3-クロロ-2-ピリジニル	C1
CH ₃	0	3-CF ₃ , 5-C1	3-クロロ-2-ピリジニル	C1
CH ₃	0	3-OCH ₃ , 5-C1	3-クロロ-2-ピリジニル	C1
CH ₃	0	3-フェニル, 5-C1	3-クロロ-2-ピリジニル	C1
CH ₃	0	3-CH ₃ , 4-C1	3-クロロ-2-ピリジニル	C1
CH ₃	0	3-C1, 4-C1	3-クロロ-2-ピリジニル	C1
CH ₃	0	3-CH ₃ , 6-C1	3-クロロ-2-ピリジニル	C1
CH ₃	0	3-C1, 6-C1	3-クロロ-2-ピリジニル	C1
CH ₃	0	3-CH ₃ , 4-C1, 5-C1	3-クロロ-2-ピリジニル	C1
CH ₃	0	3-C1, 4-C1, 5-C1	3-クロロ-2-ピリジニル	C1
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-C1, 6-C1	3-クロロ-2-ピリジニル	C1
CH ₃	0	3-C1, 5-C1, 6-C1	3-クロロ-2-ピリジニル	C1
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-F	3-クロロ-2-ピリジニル	C1
CH ₃	0	3-C1, 5-F	3-クロロ-2-ピリジニル	C1
CH ₃	0	3-Br, 5-F	3-クロロ-2-ピリジニル	C1
CH ₃	0	3-I, 5-F	3-クロロ-2-ピリジニル	C1
CH ₃	0	3-Me, 4, 5-CH=CH-CH=CH-	3-クロロ-2-ピリジニル	C1
CH ₃	0	3-C1, 4, 5-CH=CH-CH=CH-	3-クロロ-2-ピリジニル	C1
CH ₃	0	3-Br, 4, 5-CH=CH-CH=CH-	3-クロロ-2-ピリジニル	C1
CH ₃	0	3-I, 4, 5-CH=CH-CH=CH-	3-クロロ-2-ピリジニル	C1

10

20

30

【 0 3 3 2 】

【表 1 2】

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₃	0	3-CH ₃	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-I	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CH ₃	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-Cl, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-Cl, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-Cl, 5-I	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-Cl, 5-CH ₃	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-Cl, 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-Br, 5-I	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-Br, 5-CH ₃	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-Br, 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-I	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-I, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-I, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-I, 5-I	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-I, 5-CH ₃	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-I, 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Br

10

20

【 0 3 3 3 】

30

【表 1 3】

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₃	0	3-CH ₂ CH ₃	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-CH(CH ₃) ₂	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-C(CH ₃) ₃	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-CF ₃	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-OCH ₃	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-フェニル	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-CH ₂ CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-CH(CH ₃) ₂ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-C(CH ₃) ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-CF ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-OCH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-フェニル, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-CH ₃ , 4-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-Cl, 4-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-CH ₃ , 6-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-Cl, 6-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-CH ₃ , 4-Cl, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-Cl, 4-Cl, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl, 6-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-Cl, 5-Cl, 6-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-F	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-Cl, 5-F	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-Br, 5-F	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-I, 5-F	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-Me, 4, 5-CH=CH-CH=CH-	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-Cl, 4, 5-CH=CH-CH=CH-	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-Br, 4, 5-CH=CH-CH=CH-	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-I, 4, 5-CH=CH-CH=CH-	3-クロロ-2-ピリジニル	Br

10

20

30

【 0 3 3 4 】

【表 1 4】

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₃	0	3-CH ₃	3-クロロ-2-ピリジニル	I
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	I
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	I
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-I	3-クロロ-2-ピリジニル	I
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CH ₃	3-クロロ-2-ピリジニル	I
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	I
CH ₃	0	3-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	I
CH ₃	0	3-Cl, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	I
CH ₃	0	3-Cl, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	I
CH ₃	0	3-Cl, 5-I	3-クロロ-2-ピリジニル	I
CH ₃	0	3-Cl, 5-CH ₃	3-クロロ-2-ピリジニル	I
CH ₃	0	3-Cl, 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	I
CH ₃	0	3-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	I
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	I
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	I
CH ₃	0	3-Br, 5-I	3-クロロ-2-ピリジニル	I
CH ₃	0	3-Br, 5-CH ₃	3-クロロ-2-ピリジニル	I
CH ₃	0	3-Br, 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	I
CH ₃	0	3-I	3-クロロ-2-ピリジニル	I
CH ₃	0	3-I, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	I
CH ₃	0	3-I, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	I
CH ₃	0	3-I, 5-I	3-クロロ-2-ピリジニル	I
CH ₃	0	3-I, 5-CH ₃	3-クロロ-2-ピリジニル	I
CH ₃	0	3-I, 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	I

10

20

【 0 3 3 5 】

30

【表 15】

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₃	0	3-CH ₃	3-クロロ-2-ピリジニル	CH ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CH ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CH ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-I	3-クロロ-2-ピリジニル	CH ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CH ₃	3-クロロ-2-ピリジニル	CH ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CH ₃
CH ₃	0	3-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CH ₃
CH ₃	0	3-Cl, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CH ₃
CH ₃	0	3-Cl, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CH ₃
CH ₃	0	3-Cl, 5-I	3-クロロ-2-ピリジニル	CH ₃
CH ₃	0	3-Cl, 5-CH ₃	3-クロロ-2-ピリジニル	CH ₃
CH ₃	0	3-Cl, 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CH ₃
CH ₃	0	3-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CH ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CH ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CH ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-I	3-クロロ-2-ピリジニル	CH ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-CH ₃	3-クロロ-2-ピリジニル	CH ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CH ₃
CH ₃	0	3-I	3-クロロ-2-ピリジニル	CH ₃
CH ₃	0	3-I, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CH ₃
CH ₃	0	3-I, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CH ₃
CH ₃	0	3-I, 5-I	3-クロロ-2-ピリジニル	CH ₃
CH ₃	0	3-I, 5-CH ₃	3-クロロ-2-ピリジニル	CH ₃
CH ₃	0	3-I, 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CH ₃

10

20

【0336】

30

【表 16】

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₃	0	3-CH ₃	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-I	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CH ₃	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-Cl, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-Cl, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-Cl, 5-I	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-Cl, 5-CH ₃	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-Cl, 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-I	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-CH ₃	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-I	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-I, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-I, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-I, 5-I	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-I, 5-CH ₃	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-I, 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃

10

20

【0337】

30

【表 17】

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₃	0	3-CH ₂ CH ₃	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-CH(CH ₃) ₂	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-C(CH ₃) ₃	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-CF ₃	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-OCH ₃	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-フェニル	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-CH ₂ CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-CH(CH ₃) ₂ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-C(CH ₃) ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-CF ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-OCH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-フェニル, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 4-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-Cl, 4-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 6-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-Cl, 6-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 4-Cl, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-Cl, 4-Cl, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl, 6-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-Cl, 5-Cl, 6-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-F	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-Cl, 5-F	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-F	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-I, 5-F	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-Me, 4, 5-CH=CH-CH=CH-	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-Cl, 4, 5-CH=CH-CH=CH-	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-Br, 4, 5-CH=CH-CH=CH-	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-I, 4, 5-CH=CH-CH=CH-	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃

10

20

30

【0338】

【表 18】

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₃	0	3-CH ₃	3-クロロ-2-ピリジニル	SCH ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	SCH ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	SCH ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-I	3-クロロ-2-ピリジニル	SCH ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CH ₃	3-クロロ-2-ピリジニル	SCH ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	SCH ₃
CH ₃	0	3-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	SCH ₃
CH ₃	0	3-Cl, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	SCH ₃
CH ₃	0	3-Cl, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	SCH ₃
CH ₃	0	3-Cl, 5-I	3-クロロ-2-ピリジニル	SCH ₃
CH ₃	0	3-Cl, 5-CH ₃	3-クロロ-2-ピリジニル	SCH ₃
CH ₃	0	3-Cl, 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	SCH ₃
CH ₃	0	3-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	SCH ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	SCH ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	SCH ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-I	3-クロロ-2-ピリジニル	SCH ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-CH ₃	3-クロロ-2-ピリジニル	SCH ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	SCH ₃
CH ₃	0	3-I	3-クロロ-2-ピリジニル	SCH ₃
CH ₃	0	3-I, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	SCH ₃
CH ₃	0	3-I, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	SCH ₃
CH ₃	0	3-I, 5-I	3-クロロ-2-ピリジニル	SCH ₃
CH ₃	0	3-I, 5-CH ₃	3-クロロ-2-ピリジニル	SCH ₃
CH ₃	0	3-I, 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	SCH ₃

10

20

【0339】

30

【表 19】

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₃	0	3-CH ₃	3-クロロ-2-ピリジニル	S(=O)CH ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	S(=O)CH ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	S(=O)CH ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-I	3-クロロ-2-ピリジニル	S(=O)CH ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CH ₃	3-クロロ-2-ピリジニル	S(=O)CH ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	S(=O)CH ₃
CH ₃	0	3-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	S(=O)CH ₃
CH ₃	0	3-Cl, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	S(=O)CH ₃
CH ₃	0	3-Cl, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	S(=O)CH ₃
CH ₃	0	3-Cl, 5-I	3-クロロ-2-ピリジニル	S(=O)CH ₃
CH ₃	0	3-Cl, 5-CH ₃	3-クロロ-2-ピリジニル	S(=O)CH ₃
CH ₃	0	3-Cl, 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	S(=O)CH ₃
CH ₃	0	3-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	S(=O)CH ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	S(=O)CH ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	S(=O)CH ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-I	3-クロロ-2-ピリジニル	S(=O)CH ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-CH ₃	3-クロロ-2-ピリジニル	S(=O)CH ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	S(=O)CH ₃
CH ₃	0	3-I	3-クロロ-2-ピリジニル	S(=O)CH ₃
CH ₃	0	3-I, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	S(=O)CH ₃
CH ₃	0	3-I, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	S(=O)CH ₃
CH ₃	0	3-I, 5-I	3-クロロ-2-ピリジニル	S(=O)CH ₃
CH ₃	0	3-I, 5-CH ₃	3-クロロ-2-ピリジニル	S(=O)CH ₃
CH ₃	0	3-I, 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	S(=O)CH ₃

10

20

【0340】

30

【表 20】

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₃	0	3-CH ₃	3-クロロ-2-ピリジニル	S(=O) ₂ CH ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	S(=O) ₂ CH ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	S(=O) ₂ CH ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-I	3-クロロ-2-ピリジニル	S(=O) ₂ CH ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CH ₃	3-クロロ-2-ピリジニル	S(=O) ₂ CH ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	S(=O) ₂ CH ₃
CH ₃	0	3-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	S(=O) ₂ CH ₃
CH ₃	0	3-Cl, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	S(=O) ₂ CH ₃
CH ₃	0	3-Cl, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	S(=O) ₂ CH ₃
CH ₃	0	3-Cl, 5-I	3-クロロ-2-ピリジニル	S(=O) ₂ CH ₃
CH ₃	0	3-Cl, 5-CH ₃	3-クロロ-2-ピリジニル	S(=O) ₂ CH ₃
CH ₃	0	3-Cl, 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	S(=O) ₂ CH ₃
CH ₃	0	3-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	S(=O) ₂ CH ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	S(=O) ₂ CH ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	S(=O) ₂ CH ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-I	3-クロロ-2-ピリジニル	S(=O) ₂ CH ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-CH ₃	3-クロロ-2-ピリジニル	S(=O) ₂ CH ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	S(=O) ₂ CH ₃
CH ₃	0	3-I	3-クロロ-2-ピリジニル	S(=O) ₂ CH ₃
CH ₃	0	3-I, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	S(=O) ₂ CH ₃
CH ₃	0	3-I, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	S(=O) ₂ CH ₃
CH ₃	0	3-I, 5-I	3-クロロ-2-ピリジニル	S(=O) ₂ CH ₃
CH ₃	0	3-I, 5-CH ₃	3-クロロ-2-ピリジニル	S(=O) ₂ CH ₃
CH ₃	0	3-I, 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	S(=O) ₂ CH ₃

10

20

【0341】

30

【表 2 1】

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	SCH ₂ CH ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	SCH ₂ CH ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	SCH ₂ CH ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	SCH ₂ CH ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	SCH(CH ₃) ₂
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	SCH(CH ₃) ₂
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	SCH(CH ₃) ₂
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	SCH(CH ₃) ₂
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	OCH ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	OCH ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	OCH ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	OCH ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	OCH ₂ CF ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	OCH ₂ CF ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	OCH ₂ CF ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	OCH ₂ CF ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CH ₂ CH ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CH ₂ CH ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CH ₂ CH ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CH ₂ CH ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CH(CH ₃) ₂
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CH(CH ₃) ₂
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CH(CH ₃) ₂
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CH(CH ₃) ₂
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	C(CH ₃) ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	C(CH ₃) ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	C(CH ₃) ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	C(CH ₃) ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CN
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CN
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CN
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CN

10

20

30

【 0 3 4 2 】

【表 2 2】

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-フルオロ-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-フルオロ-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-フルオロ-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-フルオロ-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-フルオロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-フルオロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-フルオロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-フルオロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-フルオロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-フルオロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-フルオロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-フルオロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-フルオロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-フルオロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-フルオロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-フルオロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-ブromo-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-ブromo-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-ブromo-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-ブromo-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-ブromo-2-ピリジニル	Cl
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-ブromo-2-ピリジニル	Cl
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-ブromo-2-ピリジニル	Cl
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-ブromo-2-ピリジニル	Cl
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-ブromo-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-ブromo-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-ブromo-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-ブromo-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-ブromo-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-ブromo-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-ブromo-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-ブromo-2-ピリジニル	CF ₃

10

20

30

【 0 3 4 3 】

【表 2 3】

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-メチル-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-メチル-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-メチル-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-メチル-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-メチル-2-ピリジニル	Cl
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-メチル-2-ピリジニル	Cl
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-メチル-2-ピリジニル	Cl
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-メチル-2-ピリジニル	Cl
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-メチル-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-メチル-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-メチル-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-メチル-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-メチル-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-メチル-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-メチル-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-メチル-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-トリフルオロメチル-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-トリフルオロメチル-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-トリフルオロメチル-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-トリフルオロメチル-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-トリフルオロメチル-2-ピリジニル	Cl
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-トリフルオロメチル-2-ピリジニル	Cl
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-トリフルオロメチル-2-ピリジニル	Cl
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-トリフルオロメチル-2-ピリジニル	Cl
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-トリフルオロメチル-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-トリフルオロメチル-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-トリフルオロメチル-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-トリフルオロメチル-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-トリフルオロメチル-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-トリフルオロメチル-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-トリフルオロメチル-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-トリフルオロメチル-2-ピリジニル	CF ₃

10

20

30

【 0 3 4 4 】

【表 2 4】

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-シアノ-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-シアノ-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-シアノ-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-シアノ-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-シアノ-2-ピリジニル	Cl
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-シアノ-2-ピリジニル	Cl
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-シアノ-2-ピリジニル	Cl
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-シアノ-2-ピリジニル	Cl
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-シアノ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-シアノ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-シアノ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-シアノ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-シアノ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-シアノ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-シアノ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-シアノ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-ニトロ-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-ニトロ-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-ニトロ-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-ニトロ-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-ニトロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-ニトロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-ニトロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-ニトロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-ニトロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-ニトロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-ニトロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-ニトロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-ニトロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-ニトロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-ニトロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-ニトロ-2-ピリジニル	CF ₃

10

20

30

【 0 3 4 5 】

【表 2 5】

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	2-クロロフェニル	H
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	2-クロロフェニル	H
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	2-クロロフェニル	H
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	2-クロロフェニル	H
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	2-クロロフェニル	Cl
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	2-クロロフェニル	Cl
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	2-クロロフェニル	Cl
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	2-クロロフェニル	Cl
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	2-クロロフェニル	Br
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	2-クロロフェニル	Br
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	2-クロロフェニル	Br
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	2-クロロフェニル	Br
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	2-クロロフェニル	CF ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	2-クロロフェニル	CF ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	2-クロロフェニル	CF ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	2-クロロフェニル	CF ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	2,6-ジクロロフェニル	H
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	2,6-ジクロロフェニル	H
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	2,6-ジクロロフェニル	H
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	2,6-ジクロロフェニル	H
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	2,6-ジクロロフェニル	Cl
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	2,6-ジクロロフェニル	Cl
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	2,6-ジクロロフェニル	Cl
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	2,6-ジクロロフェニル	Cl
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	2,6-ジクロロフェニル	Br
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	2,6-ジクロロフェニル	Br
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	2,6-ジクロロフェニル	Br
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	2,6-ジクロロフェニル	Br
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	2,6-ジクロロフェニル	CF ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	2,6-ジクロロフェニル	CF ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	2,6-ジクロロフェニル	CF ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	2,6-ジクロロフェニル	CF ₃

10

20

30

【 0 3 4 6 】

【表 2 6】

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃

10

20

【 0 3 4 7 】

【表 27】

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₂ CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₂ CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₂ CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₂ CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₂ CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₂ CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₂ CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₂ CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₂ CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₂ CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₂ CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₂ CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₂ CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH(CH ₃) ₂	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH(CH ₃) ₂	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH(CH ₃) ₂	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH(CH ₃) ₂	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH(CH ₃) ₂	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH(CH ₃) ₂	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH(CH ₃) ₂	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH(CH ₃) ₂	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH(CH ₃) ₂	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH(CH ₃) ₂	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH(CH ₃) ₂	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH(CH ₃) ₂	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH(CH ₃) ₂	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH(CH ₃) ₂	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH(CH ₃) ₂	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH(CH ₃) ₂	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃

10

20

30

【0348】

【表 28】

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
C(CH ₃) ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
C(CH ₃) ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
C(CH ₃) ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
C(CH ₃) ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
C(CH ₃) ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
C(CH ₃) ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
C(CH ₃) ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
C(CH ₃) ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
C(CH ₃) ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
C(CH ₃) ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
C(CH ₃) ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
C(CH ₃) ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
C(CH ₃) ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
C(CH ₃) ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
C(CH ₃) ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
C(CH ₃) ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₂ CH=CH ₂	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₂ CH=CH ₂	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₂ CH=CH ₂	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₂ CH=CH ₂	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₂ CH=CH ₂	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₂ CH=CH ₂	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₂ CH=CH ₂	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₂ CH=CH ₂	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₂ CH=CH ₂	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₂ CH=CH ₂	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₂ CH=CH ₂	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₂ CH=CH ₂	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₂ CH=CH ₂	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₂ CH=CH ₂	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₂ CH=CH ₂	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₂ CH=CH ₂	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃

10

20

30

【0349】

【表 29】

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₂ CCH	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₂ CCH	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₂ CCH	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₂ CCH	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₂ CCH	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₂ CCH	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₂ CCH	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₂ CCH	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₂ CCH	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₂ CCH	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₂ CCH	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₂ CCH	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₂ CCH	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₂ CCH	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₂ CCH	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₂ CCH	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
フェニル	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
フェニル	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
フェニル	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
フェニル	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
フェニル	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
フェニル	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
フェニル	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
フェニル	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
フェニル	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
フェニル	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
フェニル	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
フェニル	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
フェニル	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
フェニル	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
フェニル	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
フェニル	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃

10

20

30

【0350】

【表 3 0】

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₃	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₃	S	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₃	S	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₃	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₃	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₃	S	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₃	S	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₃	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₃	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	S	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	S	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	S	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	S	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₂ CH ₃	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₂ CH ₃	S	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₂ CH ₃	S	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₂ CH ₃	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₂ CH ₃	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₂ CH ₃	S	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₂ CH ₃	S	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₂ CH ₃	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₂ CH ₃	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₂ CH ₃	S	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₂ CH ₃	S	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₂ CH ₃	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₂ CH ₃	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₂ CH ₃	S	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₂ CH ₃	S	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₂ CH ₃	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃

10

20

30

【 0 3 5 1 】

【表 3 1】

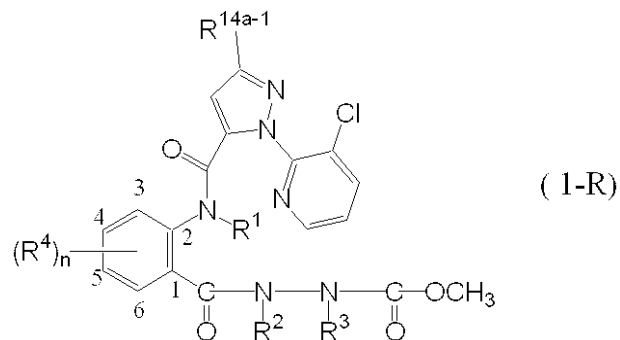
R^6	A^{32}	$(R^4)_n$	R^{13a-1}	R^{14a-1}
フェニル	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
フェニル	S	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
フェニル	S	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
フェニル	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
フェニル	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
フェニル	S	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
フェニル	S	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
フェニル	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
フェニル	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
フェニル	S	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
フェニル	S	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
フェニル	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
フェニル	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
フェニル	S	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
フェニル	S	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
フェニル	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃

10

20

【 0 3 5 2 】

式 (1 - R) で示される化合物 ;



30

式中の R^1 、 R^2 、 R^3 、 $(R^4)_n$ および R^{14a-1} は、〔表 3 2〕～〔表 4 6〕に記載の組合せを表す。

【 0 3 5 3 】

【表 3 2】

R ¹	R ²	R ³	(R ⁴) _n	R ^{14a-1}
H	CH ₃	H	3-CH ₃ , 5-Cl	H
H	CH ₃	H	3-Br, 5-Cl	H
H	CH ₃	H	3-Br, 5-Br	H
H	CH ₃	H	3-CH ₃ , 5-CN	H
H	CH ₃	H	3-CH ₃ , 5-Cl	Cl
H	CH ₃	H	3-Br, 5-Cl	Cl
H	CH ₃	H	3-Br, 5-Br	Cl
H	CH ₃	H	3-CH ₃ , 5-CN	Cl
H	CH ₃	H	3-CH ₃ , 5-Cl	Br
H	CH ₃	H	3-Br, 5-Cl	Br
H	CH ₃	H	3-Br, 5-Br	Br
H	CH ₃	H	3-CH ₃ , 5-CN	Br
H	CH ₃	H	3-CH ₃ , 5-Cl	CF ₃
H	CH ₃	H	3-Br, 5-Cl	CF ₃
H	CH ₃	H	3-Br, 5-Br	CF ₃
H	CH ₃	H	3-CH ₃ , 5-CN	CF ₃
H	H	CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	H
H	H	CH ₃	3-Br, 5-Cl	H
H	H	CH ₃	3-Br, 5-Br	H
H	H	CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	H
H	H	CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	Cl
H	H	CH ₃	3-Br, 5-Cl	Cl
H	H	CH ₃	3-Br, 5-Br	Cl
H	H	CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	Cl
H	H	CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	Br
H	H	CH ₃	3-Br, 5-Cl	Br
H	H	CH ₃	3-Br, 5-Br	Br
H	H	CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	Br
H	H	CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	CF ₃
H	H	CH ₃	3-Br, 5-Cl	CF ₃
H	H	CH ₃	3-Br, 5-Br	CF ₃
H	H	CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	CF ₃

10

20

30

【 0 3 5 4 】

【表 3 3】

R ¹	R ²	R ³	(R ⁴) _n	R ^{14a-1}
H	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	H
H	CH ₃	CH ₃	3-Br, 5-Cl	H
H	CH ₃	CH ₃	3-Br, 5-Br	H
H	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	H
H	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	Cl
H	CH ₃	CH ₃	3-Br, 5-Cl	Cl
H	CH ₃	CH ₃	3-Br, 5-Br	Cl
H	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	Cl
H	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	Br
H	CH ₃	CH ₃	3-Br, 5-Cl	Br
H	CH ₃	CH ₃	3-Br, 5-Br	Br
H	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	Br
H	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	CF ₃
H	CH ₃	CH ₃	3-Br, 5-Cl	CF ₃
H	CH ₃	CH ₃	3-Br, 5-Br	CF ₃
H	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	CF ₃
H	H	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	H
H	H	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Cl	H
H	H	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Br	H
H	H	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	H
H	H	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	Cl
H	H	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Cl	Cl
H	H	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Br	Cl
H	H	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	Cl
H	H	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	Br
H	H	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Cl	Br
H	H	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Br	Br
H	H	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	Br
H	H	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	CF ₃
H	H	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Cl	CF ₃
H	H	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Br	CF ₃
H	H	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	CF ₃

10

20

30

【 0 3 5 5 】

【表 3 4】

R^1	R^2	R^3	$(R^4)_n$	R^{14a-1}
H	H	$CH(CH_3)_2$	3- CH_3 , 5-Cl	H
H	H	$CH(CH_3)_2$	3-Br, 5-Cl	H
H	H	$CH(CH_3)_2$	3-Br, 5-Br	H
H	H	$CH(CH_3)_2$	3- CH_3 , 5-CN	H
H	H	$CH(CH_3)_2$	3- CH_3 , 5-Cl	Cl
H	H	$CH(CH_3)_2$	3-Br, 5-Cl	Cl
H	H	$CH(CH_3)_2$	3-Br, 5-Br	Cl
H	H	$CH(CH_3)_2$	3- CH_3 , 5-CN	Cl
H	H	$CH(CH_3)_2$	3- CH_3 , 5-Cl	Br
H	H	$CH(CH_3)_2$	3-Br, 5-Cl	Br
H	H	$CH(CH_3)_2$	3-Br, 5-Br	Br
H	H	$CH(CH_3)_2$	3- CH_3 , 5-CN	Br
H	H	$CH(CH_3)_2$	3- CH_3 , 5-Cl	CF_3
H	H	$CH(CH_3)_2$	3-Br, 5-Cl	CF_3
H	H	$CH(CH_3)_2$	3-Br, 5-Br	CF_3
H	H	$CH(CH_3)_2$	3- CH_3 , 5-CN	CF_3
H	H	$C(CH_3)_3$	3- CH_3 , 5-Cl	H
H	H	$C(CH_3)_3$	3-Br, 5-Cl	H
H	H	$C(CH_3)_3$	3-Br, 5-Br	H
H	H	$C(CH_3)_3$	3- CH_3 , 5-CN	H
H	H	$C(CH_3)_3$	3- CH_3 , 5-Cl	Cl
H	H	$C(CH_3)_3$	3-Br, 5-Cl	Cl
H	H	$C(CH_3)_3$	3-Br, 5-Br	Cl
H	H	$C(CH_3)_3$	3- CH_3 , 5-CN	Cl
H	H	$C(CH_3)_3$	3- CH_3 , 5-Cl	Br
H	H	$C(CH_3)_3$	3-Br, 5-Cl	Br
H	H	$C(CH_3)_3$	3-Br, 5-Br	Br
H	H	$C(CH_3)_3$	3- CH_3 , 5-CN	Br
H	H	$C(CH_3)_3$	3- CH_3 , 5-Cl	CF_3
H	H	$C(CH_3)_3$	3-Br, 5-Cl	CF_3
H	H	$C(CH_3)_3$	3-Br, 5-Br	CF_3
H	H	$C(CH_3)_3$	3- CH_3 , 5-CN	CF_3

10

20

30

【 0 3 5 6 】

【表 3 5】

R ¹	R ²	R ³	(R ⁴) _n	R ^{14a-1}
H	H	C(=O)OCH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	H
H	H	C(=O)OCH ₃	3-Br, 5-Cl	H
H	H	C(=O)OCH ₃	3-Br, 5-Br	H
H	H	C(=O)OCH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	H
H	H	C(=O)OCH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	Cl
H	H	C(=O)OCH ₃	3-Br, 5-Cl	Cl
H	H	C(=O)OCH ₃	3-Br, 5-Br	Cl
H	H	C(=O)OCH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	Cl
H	H	C(=O)OCH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	Br
H	H	C(=O)OCH ₃	3-Br, 5-Cl	Br
H	H	C(=O)OCH ₃	3-Br, 5-Br	Br
H	H	C(=O)OCH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	Br
H	H	C(=O)OCH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	CF ₃
H	H	C(=O)OCH ₃	3-Br, 5-Cl	CF ₃
H	H	C(=O)OCH ₃	3-Br, 5-Br	CF ₃
H	H	C(=O)OCH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	CF ₃
H	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-Cl	H
H	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Cl	H
H	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Br	H
H	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-CN	H
H	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-Cl	Cl
H	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Cl	Cl
H	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Br	Cl
H	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-CN	Cl
H	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-Cl	Br
H	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Cl	Br
H	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Br	Br
H	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-CN	Br
H	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-Cl	CF ₃
H	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Cl	CF ₃
H	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Br	CF ₃
H	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-CN	CF ₃

10

20

30

【 0 3 5 7 】

【表 3 6】

R ¹	R ²	R ³	(R ⁴) _n	R ^{14a-1}
CH ₃	CH ₃	H	3-CH ₃ , 5-Cl	H
CH ₃	CH ₃	H	3-Br, 5-Cl	H
CH ₃	CH ₃	H	3-Br, 5-Br	H
CH ₃	CH ₃	H	3-CH ₃ , 5-CN	H
CH ₃	CH ₃	H	3-CH ₃ , 5-Cl	Cl
CH ₃	CH ₃	H	3-Br, 5-Cl	Cl
CH ₃	CH ₃	H	3-Br, 5-Br	Cl
CH ₃	CH ₃	H	3-CH ₃ , 5-CN	Cl
CH ₃	CH ₃	H	3-CH ₃ , 5-Cl	Br
CH ₃	CH ₃	H	3-Br, 5-Cl	Br
CH ₃	CH ₃	H	3-Br, 5-Br	Br
CH ₃	CH ₃	H	3-CH ₃ , 5-CN	Br
CH ₃	CH ₃	H	3-CH ₃ , 5-Cl	CF ₃
CH ₃	CH ₃	H	3-Br, 5-Cl	CF ₃
CH ₃	CH ₃	H	3-Br, 5-Br	CF ₃
CH ₃	CH ₃	H	3-CH ₃ , 5-CN	CF ₃
CH ₃	H	CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	H
CH ₃	H	CH ₃	3-Br, 5-Cl	H
CH ₃	H	CH ₃	3-Br, 5-Br	H
CH ₃	H	CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	H
CH ₃	H	CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	Cl
CH ₃	H	CH ₃	3-Br, 5-Cl	Cl
CH ₃	H	CH ₃	3-Br, 5-Br	Cl
CH ₃	H	CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	Cl
CH ₃	H	CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	Br
CH ₃	H	CH ₃	3-Br, 5-Cl	Br
CH ₃	H	CH ₃	3-Br, 5-Br	Br
CH ₃	H	CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	Br
CH ₃	H	CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	CF ₃
CH ₃	H	CH ₃	3-Br, 5-Cl	CF ₃
CH ₃	H	CH ₃	3-Br, 5-Br	CF ₃
CH ₃	H	CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	CF ₃

10

20

30

【 0 3 5 8 】

【表 3 7】

R ¹	R ²	R ³	(R ⁴) _n	R ^{14a-1}
CH ₃	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	H
CH ₃	CH ₃	CH ₃	3-Br, 5-Cl	H
CH ₃	CH ₃	CH ₃	3-Br, 5-Br	H
CH ₃	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	H
CH ₃	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	Cl
CH ₃	CH ₃	CH ₃	3-Br, 5-Cl	Cl
CH ₃	CH ₃	CH ₃	3-Br, 5-Br	Cl
CH ₃	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	Cl
CH ₃	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	Br
CH ₃	CH ₃	CH ₃	3-Br, 5-Cl	Br
CH ₃	CH ₃	CH ₃	3-Br, 5-Br	Br
CH ₃	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	Br
CH ₃	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	CF ₃
CH ₃	CH ₃	CH ₃	3-Br, 5-Cl	CF ₃
CH ₃	CH ₃	CH ₃	3-Br, 5-Br	CF ₃
CH ₃	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	CF ₃
CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	H
CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Cl	H
CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Br	H
CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	H
CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	Cl
CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Cl	Cl
CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Br	Cl
CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	Cl
CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	Br
CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Cl	Br
CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Br	Br
CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	Br
CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	CF ₃
CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Cl	CF ₃
CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Br	CF ₃
CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	CF ₃

10

20

30

【 0 3 5 9 】

【表 3 8】

R ¹	R ²	R ³	(R ⁴) _n	R ^{14a-1}
CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-Cl	H
CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Cl	H
CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Br	H
CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-CN	H
CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-Cl	Cl
CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Cl	Cl
CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Br	Cl
CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-CN	Cl
CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-Cl	Br
CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Cl	Br
CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Br	Br
CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-CN	Br
CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-Cl	CF ₃
CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Cl	CF ₃
CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Br	CF ₃
CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-CN	CF ₃
CH ₃	H	C(CH ₃) ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	H
CH ₃	H	C(CH ₃) ₃	3-Br, 5-Cl	H
CH ₃	H	C(CH ₃) ₃	3-Br, 5-Br	H
CH ₃	H	C(CH ₃) ₃	3-CH ₃ , 5-CN	H
CH ₃	H	C(CH ₃) ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	Cl
CH ₃	H	C(CH ₃) ₃	3-Br, 5-Cl	Cl
CH ₃	H	C(CH ₃) ₃	3-Br, 5-Br	Cl
CH ₃	H	C(CH ₃) ₃	3-CH ₃ , 5-CN	Cl
CH ₃	H	C(CH ₃) ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	Br
CH ₃	H	C(CH ₃) ₃	3-Br, 5-Cl	Br
CH ₃	H	C(CH ₃) ₃	3-Br, 5-Br	Br
CH ₃	H	C(CH ₃) ₃	3-CH ₃ , 5-CN	Br
CH ₃	H	C(CH ₃) ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	CF ₃
CH ₃	H	C(CH ₃) ₃	3-Br, 5-Cl	CF ₃
CH ₃	H	C(CH ₃) ₃	3-Br, 5-Br	CF ₃
CH ₃	H	C(CH ₃) ₃	3-CH ₃ , 5-CN	CF ₃

10

20

30

【 0 3 6 0 】

【表 3 9】

R ¹	R ²	R ³	(R ⁴) _n	R ^{14a-1}
CH ₃	H	C(=O)OCH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	H
CH ₃	H	C(=O)OCH ₃	3-Br, 5-Cl	H
CH ₃	H	C(=O)OCH ₃	3-Br, 5-Br	H
CH ₃	H	C(=O)OCH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	H
CH ₃	H	C(=O)OCH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	Cl
CH ₃	H	C(=O)OCH ₃	3-Br, 5-Cl	Cl
CH ₃	H	C(=O)OCH ₃	3-Br, 5-Br	Cl
CH ₃	H	C(=O)OCH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	Cl
CH ₃	H	C(=O)OCH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	Br
CH ₃	H	C(=O)OCH ₃	3-Br, 5-Cl	Br
CH ₃	H	C(=O)OCH ₃	3-Br, 5-Br	Br
CH ₃	H	C(=O)OCH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	Br
CH ₃	H	C(=O)OCH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	CF ₃
CH ₃	H	C(=O)OCH ₃	3-Br, 5-Cl	CF ₃
CH ₃	H	C(=O)OCH ₃	3-Br, 5-Br	CF ₃
CH ₃	H	C(=O)OCH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	CF ₃
CH ₃	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-Cl	H
CH ₃	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Cl	H
CH ₃	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Br	H
CH ₃	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-CN	H
CH ₃	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-Cl	Cl
CH ₃	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Cl	Cl
CH ₃	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Br	Cl
CH ₃	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-CN	Cl
CH ₃	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-Cl	Br
CH ₃	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Cl	Br
CH ₃	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Br	Br
CH ₃	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-CN	Br
CH ₃	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-Cl	CF ₃
CH ₃	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Cl	CF ₃
CH ₃	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Br	CF ₃
CH ₃	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-CN	CF ₃

10

20

30

【 0 3 6 1 】

【表 40】

R^1	R^2	R^3	$(R^4)_n$	R^{14a-1}
H	CH_3	H	3-Cl, 5-Cl	H
H	CH_3	H	3-Cl, 5-Cl	Cl
H	CH_3	H	3-Cl, 5-Cl	Br
H	CH_3	H	3-Cl, 5-Cl	CF_3
H	H	CH_3	3-Cl, 5-Cl	H
H	H	CH_3	3-Cl, 5-Cl	Cl
H	H	CH_3	3-Cl, 5-Cl	Br
H	H	CH_3	3-Cl, 5-Cl	CF_3
H	CH_3	CH_3	3-Cl, 5-Cl	H
H	CH_3	CH_3	3-Cl, 5-Cl	Cl
H	CH_3	CH_3	3-Cl, 5-Cl	Br
H	CH_3	CH_3	3-Cl, 5-Cl	CF_3
H	H	CH_2CH_3	3-Cl, 5-Cl	H
H	H	CH_2CH_3	3-Cl, 5-Cl	Cl
H	H	CH_2CH_3	3-Cl, 5-Cl	Br
H	H	CH_2CH_3	3-Cl, 5-Cl	CF_3
H	H	$CH(CH_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	H
H	H	$CH(CH_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	Cl
H	H	$CH(CH_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	Br
H	H	$CH(CH_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	CF_3
H	H	$C(CH_3)_3$	3-Cl, 5-Cl	H
H	H	$C(CH_3)_3$	3-Cl, 5-Cl	Cl
H	H	$C(CH_3)_3$	3-Cl, 5-Cl	Br
H	H	$C(CH_3)_3$	3-Cl, 5-Cl	CF_3
H	H	$C(=O)OCH_3$	3-Cl, 5-Cl	H
H	H	$C(=O)OCH_3$	3-Cl, 5-Cl	Cl
H	H	$C(=O)OCH_3$	3-Cl, 5-Cl	Br
H	H	$C(=O)OCH_3$	3-Cl, 5-Cl	CF_3
H	H	$C(=O)N(CH_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	H
H	H	$C(=O)N(CH_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	Cl
H	H	$C(=O)N(CH_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	Br
H	H	$C(=O)N(CH_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	CF_3

【0362】

10

20

30

【表 4 1】

R ¹	R ²	R ³	(R ⁴) _n	R ^{14a-1}
CH ₃	CH ₃	H	3-Cl, 5-Cl	H
CH ₃	CH ₃	H	3-Cl, 5-Cl	Cl
CH ₃	CH ₃	H	3-Cl, 5-Cl	Br
CH ₃	CH ₃	H	3-Cl, 5-Cl	CF ₃
CH ₃	H	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	H
CH ₃	H	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	Cl
CH ₃	H	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	Br
CH ₃	H	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	CF ₃
CH ₃	CH ₃	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	H
CH ₃	CH ₃	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	Cl
CH ₃	CH ₃	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	Br
CH ₃	CH ₃	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	CF ₃
CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	3-Cl, 5-Cl	H
CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	3-Cl, 5-Cl	Cl
CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	3-Cl, 5-Cl	Br
CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	3-Cl, 5-Cl	CF ₃
CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H
CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Cl
CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Br
CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	CF ₃
CH ₃	H	C(CH ₃) ₃	3-Cl, 5-Cl	H
CH ₃	H	C(CH ₃) ₃	3-Cl, 5-Cl	Cl
CH ₃	H	C(CH ₃) ₃	3-Cl, 5-Cl	Br
CH ₃	H	C(CH ₃) ₃	3-Cl, 5-Cl	CF ₃
CH ₃	H	C(=O)OCH ₃	3-Cl, 5-Cl	H
CH ₃	H	C(=O)OCH ₃	3-Cl, 5-Cl	Cl
CH ₃	H	C(=O)OCH ₃	3-Cl, 5-Cl	Br
CH ₃	H	C(=O)OCH ₃	3-Cl, 5-Cl	CF ₃
CH ₃	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H
CH ₃	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Cl
CH ₃	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Br
CH ₃	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	CF ₃

10

20

30

【 0 3 6 3 】

【表 4 2】

R ¹	R ²	R ³	(R ⁴) _n	R ^{14a-1}
H	CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	H
H	CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Cl	H
H	CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Br	H
H	CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	H
H	CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-Cl, 5-Cl	H
H	CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	Cl
H	CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Cl	Cl
H	CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Br	Cl
H	CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	Cl
H	CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-Cl, 5-Cl	Cl
H	CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	Br
H	CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Cl	Br
H	CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Br	Br
H	CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	Br
H	CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-Cl, 5-Cl	Br
H	CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	CF ₃
H	CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Cl	CF ₃
H	CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Br	CF ₃
H	CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	CF ₃
H	CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-Cl, 5-Cl	CF ₃

【 0 3 6 4 】

【表 4 3】

R ¹	R ²	R ³	(R ⁴) _n	R ^{14a-1}
H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-Cl	H
H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Cl	H
H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Br	H
H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-CN	H
H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H
H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-Cl	Cl
H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Cl	Cl
H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Br	Cl
H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-CN	Cl
H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Cl
H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-Cl	Br
H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Cl	Br
H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Br	Br
H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-CN	Br
H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Br
H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-Cl	CF ₃
H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Cl	CF ₃
H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Br	CF ₃
H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-CN	CF ₃

【 0 3 6 5 】

【表 4 4】

R ¹	R ²	R ³	(R ⁴) _n	R ^{14a-1}
H	CH ₂ CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	H
H	CH ₂ CH ₃	CH ₃	3-Br, 5-Cl	H
H	CH ₂ CH ₃	CH ₃	3-Br, 5-Br	H
H	CH ₂ CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	H
H	CH ₂ CH ₃	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	H
H	CH ₂ CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	Cl
H	CH ₂ CH ₃	CH ₃	3-Br, 5-Cl	Cl
H	CH ₂ CH ₃	CH ₃	3-Br, 5-Br	Cl
H	CH ₂ CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	Cl
H	CH ₂ CH ₃	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	Cl
H	CH ₂ CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	Br
H	CH ₂ CH ₃	CH ₃	3-Br, 5-Cl	Br
H	CH ₂ CH ₃	CH ₃	3-Br, 5-Br	Br
H	CH ₂ CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	Br
H	CH ₂ CH ₃	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	Br
H	CH ₂ CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	CF ₃
H	CH ₂ CH ₃	CH ₃	3-Br, 5-Cl	CF ₃
H	CH ₂ CH ₃	CH ₃	3-Br, 5-Br	CF ₃
H	CH ₂ CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	CF ₃
H	CH ₂ CH ₃	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	CF ₃

10

20

【0 3 6 6】

【表 4 5】

R ¹	R ²	R ³	(R ⁴) _n	R ^{14a-1}
H	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	H
H	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	3-Br, 5-Cl	H
H	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	3-Br, 5-Br	H
H	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	H
H	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	H
H	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	Cl
H	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	3-Br, 5-Cl	Cl
H	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	3-Br, 5-Br	Cl
H	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	Cl
H	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	Cl
H	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	Br
H	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	3-Br, 5-Cl	Br
H	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	3-Br, 5-Br	Br
H	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	Br
H	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	Br
H	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	CF ₃
H	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	3-Br, 5-Cl	CF ₃
H	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	3-Br, 5-Br	CF ₃
H	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	CF ₃
H	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	CF ₃

30

40

【0 3 6 7】

50

【表 4 6】

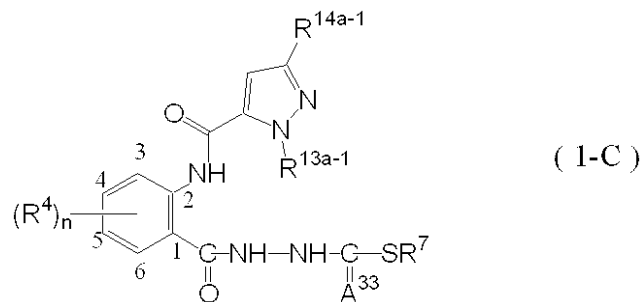
R ¹	R ²	R ³	(R ⁴) _n	R ^{14a-1}
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	H
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Cl	H
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Br	H
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	H
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-Cl, 5-Cl	H
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	Cl
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Cl	Cl
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Br	Cl
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	Cl
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-Cl, 5-Cl	Cl
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	Br
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Cl	Br
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Br	Br
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	Br
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-Cl, 5-Cl	Br
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	CF ₃
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Cl	CF ₃
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Br	CF ₃
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	CF ₃
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-Cl, 5-Cl	CF ₃

10

20

【0368】

式(1-C)で示される化合物；



30

式中の R^7 、 A^{33} 、 $(R^4)_n$ 、 R^{13a-1} および R^{14a-1} は、〔表 4 7〕および〔表 4 8〕に記載の組合せを表す。

【0369】

【表 4 7】

R ⁷	A ³³	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃

10

20

30

【 0 3 7 0 】

【表 4 8】

R ⁷	A ³³	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
フェニル	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
フェニル	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
フェニル	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
フェニル	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
フェニル	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
フェニル	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
フェニル	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
フェニル	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
フェニル	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
フェニル	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
フェニル	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
フェニル	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
フェニル	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
フェニル	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
フェニル	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
フェニル	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
フェニル	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
フェニル	S	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
フェニル	S	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
フェニル	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
フェニル	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
フェニル	S	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
フェニル	S	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
フェニル	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
フェニル	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
フェニル	S	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
フェニル	S	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
フェニル	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
フェニル	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
フェニル	S	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
フェニル	S	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
フェニル	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃

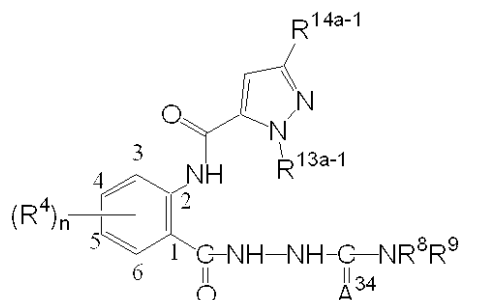
10

20

30

【0371】

式(1-D)で示される化合物；



(1-D)

40

式中の NR⁸R⁹、A³⁴、(R⁴)_n、R^{13a-1} および R^{14a-1} は、〔表 4 9〕～〔表 6 4〕に記載の組合せを表す。

【0372】

50

【表 4 9】

NR ⁸ R ⁹	A ³⁴	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
NH ₂	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
NH ₂	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
NH ₂	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
NH ₂	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
NH ₂	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
NH ₂	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
NH ₂	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
NH ₂	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
NH ₂	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
NH ₂	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
NH ₂	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
NH ₂	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
NH ₂	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
NH ₂	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
NH ₂	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
NH ₂	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
NHCH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
NHCH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
NHCH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
NHCH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
NHCH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
NHCH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
NHCH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
NHCH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
NHCH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
NHCH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
NHCH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
NHCH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
NHCH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
NHCH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
NHCH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
NHCH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃

10

20

30

【 0 3 7 3 】

【表 5 0】

NR^8R^9	A^{34}	$(\text{R}^4)_n$	R^{13a-1}	R^{14a-1}
NHCH_2CH_3	0	3- CH_3 , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
NHCH_2CH_3	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
NHCH_2CH_3	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
NHCH_2CH_3	0	3- CH_3 , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
NHCH_2CH_3	0	3- CH_3 , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
NHCH_2CH_3	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
NHCH_2CH_3	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
NHCH_2CH_3	0	3- CH_3 , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
NHCH_2CH_3	0	3- CH_3 , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
NHCH_2CH_3	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
NHCH_2CH_3	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
NHCH_2CH_3	0	3- CH_3 , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
NHCH_2CH_3	0	3- CH_3 , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF_3
NHCH_2CH_3	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF_3
NHCH_2CH_3	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CF_3
NHCH_2CH_3	0	3- CH_3 , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CF_3
$\text{NHCH}(\text{CH}_3)_2$	0	3- CH_3 , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
$\text{NHCH}(\text{CH}_3)_2$	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
$\text{NHCH}(\text{CH}_3)_2$	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
$\text{NHCH}(\text{CH}_3)_2$	0	3- CH_3 , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
$\text{NHCH}(\text{CH}_3)_2$	0	3- CH_3 , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
$\text{NHCH}(\text{CH}_3)_2$	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
$\text{NHCH}(\text{CH}_3)_2$	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
$\text{NHCH}(\text{CH}_3)_2$	0	3- CH_3 , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
$\text{NHCH}(\text{CH}_3)_2$	0	3- CH_3 , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
$\text{NHCH}(\text{CH}_3)_2$	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
$\text{NHCH}(\text{CH}_3)_2$	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
$\text{NHCH}(\text{CH}_3)_2$	0	3- CH_3 , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
$\text{NHCH}(\text{CH}_3)_2$	0	3- CH_3 , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF_3
$\text{NHCH}(\text{CH}_3)_2$	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF_3
$\text{NHCH}(\text{CH}_3)_2$	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CF_3
$\text{NHCH}(\text{CH}_3)_2$	0	3- CH_3 , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CF_3

10

20

30

【 0 3 7 4 】

【表 5 1】

NR^8R^9	A^{34}	$(\text{R}^4)_n$	R^{13a-1}	R^{14a-1}
$\text{NHC}(\text{CH}_3)_3$	0	3- CH_3 , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
$\text{NHC}(\text{CH}_3)_3$	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
$\text{NHC}(\text{CH}_3)_3$	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
$\text{NHC}(\text{CH}_3)_3$	0	3- CH_3 , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
$\text{NHC}(\text{CH}_3)_3$	0	3- CH_3 , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
$\text{NHC}(\text{CH}_3)_3$	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
$\text{NHC}(\text{CH}_3)_3$	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
$\text{NHC}(\text{CH}_3)_3$	0	3- CH_3 , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
$\text{NHC}(\text{CH}_3)_3$	0	3- CH_3 , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
$\text{NHC}(\text{CH}_3)_3$	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
$\text{NHC}(\text{CH}_3)_3$	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
$\text{NHC}(\text{CH}_3)_3$	0	3- CH_3 , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
$\text{NHC}(\text{CH}_3)_3$	0	3- CH_3 , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF_3
$\text{NHC}(\text{CH}_3)_3$	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF_3
$\text{NHC}(\text{CH}_3)_3$	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CF_3
$\text{NHC}(\text{CH}_3)_3$	0	3- CH_3 , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CF_3
$\text{N}(\text{CH}_3)_2$	0	3- CH_3 , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
$\text{N}(\text{CH}_3)_2$	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
$\text{N}(\text{CH}_3)_2$	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
$\text{N}(\text{CH}_3)_2$	0	3- CH_3 , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
$\text{N}(\text{CH}_3)_2$	0	3- CH_3 , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
$\text{N}(\text{CH}_3)_2$	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
$\text{N}(\text{CH}_3)_2$	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
$\text{N}(\text{CH}_3)_2$	0	3- CH_3 , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
$\text{N}(\text{CH}_3)_2$	0	3- CH_3 , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
$\text{N}(\text{CH}_3)_2$	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
$\text{N}(\text{CH}_3)_2$	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
$\text{N}(\text{CH}_3)_2$	0	3- CH_3 , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
$\text{N}(\text{CH}_3)_2$	0	3- CH_3 , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF_3
$\text{N}(\text{CH}_3)_2$	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF_3
$\text{N}(\text{CH}_3)_2$	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CF_3
$\text{N}(\text{CH}_3)_2$	0	3- CH_3 , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CF_3

10

20

30

【 0 3 7 5 】

【表 5 2】

NR^8R^9	A^{34}	$(\text{R}^4)_n$	R^{13a-1}	R^{14a-1}
$\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}_3)_2$	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
$\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}_3)_2$	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
$\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}_3)_2$	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
$\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}_3)_2$	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
$\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}_3)_2$	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
$\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}_3)_2$	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
$\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}_3)_2$	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
$\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}_3)_2$	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
$\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}_3)_2$	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
$\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}_3)_2$	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
$\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}_3)_2$	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
$\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}_3)_2$	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
$\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}_3)_2$	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
$\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}_3)_2$	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
$\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}_3)_2$	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
$\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}_3)_2$	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
$\text{N}\{\text{CH}(\text{CH}_3)_2\}_2$	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
$\text{N}\{\text{CH}(\text{CH}_3)_2\}_2$	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
$\text{N}\{\text{CH}(\text{CH}_3)_2\}_2$	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
$\text{N}\{\text{CH}(\text{CH}_3)_2\}_2$	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
$\text{N}\{\text{CH}(\text{CH}_3)_2\}_2$	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
$\text{N}\{\text{CH}(\text{CH}_3)_2\}_2$	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
$\text{N}\{\text{CH}(\text{CH}_3)_2\}_2$	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
$\text{N}\{\text{CH}(\text{CH}_3)_2\}_2$	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
$\text{N}\{\text{CH}(\text{CH}_3)_2\}_2$	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
$\text{N}\{\text{CH}(\text{CH}_3)_2\}_2$	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
$\text{N}\{\text{CH}(\text{CH}_3)_2\}_2$	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
$\text{N}\{\text{CH}(\text{CH}_3)_2\}_2$	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
$\text{N}\{\text{CH}(\text{CH}_3)_2\}_2$	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
$\text{N}\{\text{CH}(\text{CH}_3)_2\}_2$	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
$\text{N}\{\text{CH}(\text{CH}_3)_2\}_2$	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
$\text{N}\{\text{CH}(\text{CH}_3)_2\}_2$	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃

10

20

30

【 0 3 7 6 】

【表 5 3】

NR ⁸ R ⁹	A ³⁴	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
シクロプロピルアミノ	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
シクロプロピルアミノ	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
シクロプロピルアミノ	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
シクロプロピルアミノ	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
シクロプロピルアミノ	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
シクロプロピルアミノ	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
シクロプロピルアミノ	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
シクロプロピルアミノ	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
シクロプロピルアミノ	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
シクロプロピルアミノ	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
シクロプロピルアミノ	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
シクロプロピルアミノ	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
シクロプロピルアミノ	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
シクロプロピルアミノ	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
シクロプロピルアミノ	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
シクロプロピルアミノ	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
シクロブチルアミノ	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
シクロブチルアミノ	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
シクロブチルアミノ	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
シクロブチルアミノ	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
シクロブチルアミノ	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
シクロブチルアミノ	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
シクロブチルアミノ	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
シクロブチルアミノ	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
シクロブチルアミノ	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
シクロブチルアミノ	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
シクロブチルアミノ	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
シクロブチルアミノ	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
シクロブチルアミノ	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
シクロブチルアミノ	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
シクロブチルアミノ	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
シクロブチルアミノ	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃

10

20

30

【 0 3 7 7 】

【表 5 4】

NR ⁸ R ⁹	A ³⁴	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
シクロペンチルアミノ	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
シクロペンチルアミノ	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
シクロペンチルアミノ	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
シクロペンチルアミノ	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
シクロペンチルアミノ	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
シクロペンチルアミノ	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
シクロペンチルアミノ	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
シクロペンチルアミノ	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
シクロペンチルアミノ	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
シクロペンチルアミノ	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
シクロペンチルアミノ	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
シクロペンチルアミノ	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
シクロペンチルアミノ	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
シクロペンチルアミノ	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
シクロペンチルアミノ	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
シクロペンチルアミノ	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
シクロヘキシルアミノ	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
シクロヘキシルアミノ	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
シクロヘキシルアミノ	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
シクロヘキシルアミノ	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
シクロヘキシルアミノ	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
シクロヘキシルアミノ	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
シクロヘキシルアミノ	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
シクロヘキシルアミノ	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
シクロヘキシルアミノ	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
シクロヘキシルアミノ	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
シクロヘキシルアミノ	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
シクロヘキシルアミノ	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
シクロヘキシルアミノ	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
シクロヘキシルアミノ	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
シクロヘキシルアミノ	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
シクロヘキシルアミノ	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃

10

20

30

【 0 3 7 8 】

【表 5 5】

NR ⁸ R ⁹	A ³⁴	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
アニリノ	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
アニリノ	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
アニリノ	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
アニリノ	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
アニリノ	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
アニリノ	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
アニリノ	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
アニリノ	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
アニリノ	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
アニリノ	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
アニリノ	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
アニリノ	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
アニリノ	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
アニリノ	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
アニリノ	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
アニリノ	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
ピロリジン-1-イル	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
ピロリジン-1-イル	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
ピロリジン-1-イル	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
ピロリジン-1-イル	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
ピロリジン-1-イル	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
ピロリジン-1-イル	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
ピロリジン-1-イル	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
ピロリジン-1-イル	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
ピロリジン-1-イル	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
ピロリジン-1-イル	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
ピロリジン-1-イル	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
ピロリジン-1-イル	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
ピロリジン-1-イル	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
ピロリジン-1-イル	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
ピロリジン-1-イル	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
ピロリジン-1-イル	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃

10

20

30

【 0 3 7 9 】

【表 5 6】

NR ⁸ R ⁹	A ³⁴	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
ピペリジン-1-イル	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
ピペリジン-1-イル	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
ピペリジン-1-イル	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
ピペリジン-1-イル	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
ピペリジン-1-イル	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
ピペリジン-1-イル	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
ピペリジン-1-イル	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
ピペリジン-1-イル	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
ピペリジン-1-イル	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
ピペリジン-1-イル	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
ピペリジン-1-イル	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
ピペリジン-1-イル	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
ピペリジン-1-イル	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
ピペリジン-1-イル	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
ピペリジン-1-イル	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
ピペリジン-1-イル	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
モルホリン-4-イル	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
モルホリン-4-イル	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
モルホリン-4-イル	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
モルホリン-4-イル	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
モルホリン-4-イル	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
モルホリン-4-イル	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
モルホリン-4-イル	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
モルホリン-4-イル	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
モルホリン-4-イル	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
モルホリン-4-イル	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
モルホリン-4-イル	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
モルホリン-4-イル	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
モルホリン-4-イル	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
モルホリン-4-イル	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
モルホリン-4-イル	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
モルホリン-4-イル	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃

10

20

30

【 0 3 8 0 】

【表 57】

NR ⁸ R ⁹	A ³⁴	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
チオモルホリン-4-イル	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
チオモルホリン-4-イル	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
チオモルホリン-4-イル	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
チオモルホリン-4-イル	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
チオモルホリン-4-イル	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
チオモルホリン-4-イル	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
チオモルホリン-4-イル	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
チオモルホリン-4-イル	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
チオモルホリン-4-イル	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
チオモルホリン-4-イル	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
チオモルホリン-4-イル	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
チオモルホリン-4-イル	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
チオモルホリン-4-イル	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
チオモルホリン-4-イル	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
チオモルホリン-4-イル	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
チオモルホリン-4-イル	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
1-メチルピペラジン-4-イル	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
1-メチルピペラジン-4-イル	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
1-メチルピペラジン-4-イル	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
1-メチルピペラジン-4-イル	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
1-メチルピペラジン-4-イル	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
1-メチルピペラジン-4-イル	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
1-メチルピペラジン-4-イル	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
1-メチルピペラジン-4-イル	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
1-メチルピペラジン-4-イル	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
1-メチルピペラジン-4-イル	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
1-メチルピペラジン-4-イル	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
1-メチルピペラジン-4-イル	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
1-メチルピペラジン-4-イル	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
1-メチルピペラジン-4-イル	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
1-メチルピペラジン-4-イル	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
1-メチルピペラジン-4-イル	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃

10

20

30

【0381】

【表 5 8】

NR^8R^9	A^{34}	$(\text{R}^4)_n$	R^{13a-1}	R^{14a-1}
NH_2	S	3- CH_3 , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
NH_2	S	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
NH_2	S	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
NH_2	S	3- CH_3 , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
NH_2	S	3- CH_3 , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
NH_2	S	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
NH_2	S	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
NH_2	S	3- CH_3 , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
NH_2	S	3- CH_3 , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
NH_2	S	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
NH_2	S	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
NH_2	S	3- CH_3 , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
NH_2	S	3- CH_3 , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF_3
NH_2	S	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF_3
NH_2	S	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CF_3
NH_2	S	3- CH_3 , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CF_3
NHCH_3	S	3- CH_3 , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
NHCH_3	S	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
NHCH_3	S	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
NHCH_3	S	3- CH_3 , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
NHCH_3	S	3- CH_3 , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
NHCH_3	S	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
NHCH_3	S	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
NHCH_3	S	3- CH_3 , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
NHCH_3	S	3- CH_3 , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
NHCH_3	S	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
NHCH_3	S	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
NHCH_3	S	3- CH_3 , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
NHCH_3	S	3- CH_3 , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF_3
NHCH_3	S	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF_3
NHCH_3	S	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CF_3
NHCH_3	S	3- CH_3 , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CF_3

10

20

30

【 0 3 8 2 】

【表 59】

NR^8R^9	A^{34}	$(\text{R}^4)_n$	R^{13a-1}	R^{14a-1}
NHCH_2CH_3	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
NHCH_2CH_3	S	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
NHCH_2CH_3	S	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
NHCH_2CH_3	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
NHCH_2CH_3	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
NHCH_2CH_3	S	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
NHCH_2CH_3	S	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
NHCH_2CH_3	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
NHCH_2CH_3	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
NHCH_2CH_3	S	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
NHCH_2CH_3	S	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
NHCH_2CH_3	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
NHCH_2CH_3	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
NHCH_2CH_3	S	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
NHCH_2CH_3	S	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
NHCH_2CH_3	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
$\text{NHCH}(\text{CH}_3)_2$	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
$\text{NHCH}(\text{CH}_3)_2$	S	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
$\text{NHCH}(\text{CH}_3)_2$	S	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
$\text{NHCH}(\text{CH}_3)_2$	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
$\text{NHCH}(\text{CH}_3)_2$	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
$\text{NHCH}(\text{CH}_3)_2$	S	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
$\text{NHCH}(\text{CH}_3)_2$	S	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
$\text{NHCH}(\text{CH}_3)_2$	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
$\text{NHCH}(\text{CH}_3)_2$	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
$\text{NHCH}(\text{CH}_3)_2$	S	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
$\text{NHCH}(\text{CH}_3)_2$	S	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
$\text{NHCH}(\text{CH}_3)_2$	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
$\text{NHCH}(\text{CH}_3)_2$	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
$\text{NHCH}(\text{CH}_3)_2$	S	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
$\text{NHCH}(\text{CH}_3)_2$	S	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
$\text{NHCH}(\text{CH}_3)_2$	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃

10

20

30

【0383】

【表 6 0】

NR^8R^9	A^{34}	$(\text{R}^4)_n$	R^{13a-1}	R^{14a-1}
$\text{NHC}(\text{CH}_3)_3$	S	3- CH_3 , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
$\text{NHC}(\text{CH}_3)_3$	S	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
$\text{NHC}(\text{CH}_3)_3$	S	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
$\text{NHC}(\text{CH}_3)_3$	S	3- CH_3 , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
$\text{NHC}(\text{CH}_3)_3$	S	3- CH_3 , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
$\text{NHC}(\text{CH}_3)_3$	S	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
$\text{NHC}(\text{CH}_3)_3$	S	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
$\text{NHC}(\text{CH}_3)_3$	S	3- CH_3 , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
$\text{NHC}(\text{CH}_3)_3$	S	3- CH_3 , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
$\text{NHC}(\text{CH}_3)_3$	S	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
$\text{NHC}(\text{CH}_3)_3$	S	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
$\text{NHC}(\text{CH}_3)_3$	S	3- CH_3 , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
$\text{NHC}(\text{CH}_3)_3$	S	3- CH_3 , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF_3
$\text{NHC}(\text{CH}_3)_3$	S	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF_3
$\text{NHC}(\text{CH}_3)_3$	S	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CF_3
$\text{NHC}(\text{CH}_3)_3$	S	3- CH_3 , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CF_3
$\text{N}(\text{CH}_3)_2$	S	3- CH_3 , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
$\text{N}(\text{CH}_3)_2$	S	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
$\text{N}(\text{CH}_3)_2$	S	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
$\text{N}(\text{CH}_3)_2$	S	3- CH_3 , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
$\text{N}(\text{CH}_3)_2$	S	3- CH_3 , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
$\text{N}(\text{CH}_3)_2$	S	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
$\text{N}(\text{CH}_3)_2$	S	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
$\text{N}(\text{CH}_3)_2$	S	3- CH_3 , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
$\text{N}(\text{CH}_3)_2$	S	3- CH_3 , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
$\text{N}(\text{CH}_3)_2$	S	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
$\text{N}(\text{CH}_3)_2$	S	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
$\text{N}(\text{CH}_3)_2$	S	3- CH_3 , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
$\text{N}(\text{CH}_3)_2$	S	3- CH_3 , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF_3
$\text{N}(\text{CH}_3)_2$	S	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF_3
$\text{N}(\text{CH}_3)_2$	S	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CF_3
$\text{N}(\text{CH}_3)_2$	S	3- CH_3 , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CF_3

10

20

30

【 0 3 8 4 】

【表 6 1】

NR ⁸ R ⁹	A ³⁴	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
N(CH ₂ CH ₃) ₂	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
N(CH ₂ CH ₃) ₂	S	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
N(CH ₂ CH ₃) ₂	S	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
N(CH ₂ CH ₃) ₂	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
N(CH ₂ CH ₃) ₂	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
N(CH ₂ CH ₃) ₂	S	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
N(CH ₂ CH ₃) ₂	S	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
N(CH ₂ CH ₃) ₂	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
N(CH ₂ CH ₃) ₂	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
N(CH ₂ CH ₃) ₂	S	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
N(CH ₂ CH ₃) ₂	S	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
N(CH ₂ CH ₃) ₂	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
N(CH ₂ CH ₃) ₂	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
N(CH ₂ CH ₃) ₂	S	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
N(CH ₂ CH ₃) ₂	S	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
N(CH ₂ CH ₃) ₂	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
シクロプロピルアミノ	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
シクロプロピルアミノ	S	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
シクロプロピルアミノ	S	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
シクロプロピルアミノ	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
シクロプロピルアミノ	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
シクロプロピルアミノ	S	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
シクロプロピルアミノ	S	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
シクロプロピルアミノ	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
シクロプロピルアミノ	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
シクロプロピルアミノ	S	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
シクロプロピルアミノ	S	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
シクロプロピルアミノ	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
シクロプロピルアミノ	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
シクロプロピルアミノ	S	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
シクロプロピルアミノ	S	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
シクロプロピルアミノ	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃

10

20

30

【 0 3 8 5 】

【表 6 2】

NR ⁸ R ⁹	A ³⁴	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
シクロブチルアミノ	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
シクロブチルアミノ	S	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
シクロブチルアミノ	S	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
シクロブチルアミノ	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
シクロブチルアミノ	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
シクロブチルアミノ	S	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
シクロブチルアミノ	S	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
シクロブチルアミノ	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
シクロブチルアミノ	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
シクロブチルアミノ	S	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
シクロブチルアミノ	S	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
シクロブチルアミノ	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
シクロブチルアミノ	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
シクロブチルアミノ	S	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
シクロブチルアミノ	S	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
シクロブチルアミノ	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
シクロペンチルアミノ	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
シクロペンチルアミノ	S	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
シクロペンチルアミノ	S	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
シクロペンチルアミノ	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
シクロペンチルアミノ	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
シクロペンチルアミノ	S	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
シクロペンチルアミノ	S	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
シクロペンチルアミノ	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
シクロペンチルアミノ	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
シクロペンチルアミノ	S	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
シクロペンチルアミノ	S	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
シクロペンチルアミノ	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
シクロペンチルアミノ	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
シクロペンチルアミノ	S	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
シクロペンチルアミノ	S	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
シクロペンチルアミノ	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃

10

20

30

【 0 3 8 6 】

【表 6 3】

NR ⁸ R ⁹	A ³⁴	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
シクロヘキシルアミノ	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
シクロヘキシルアミノ	S	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
シクロヘキシルアミノ	S	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
シクロヘキシルアミノ	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
シクロヘキシルアミノ	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
シクロヘキシルアミノ	S	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
シクロヘキシルアミノ	S	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
シクロヘキシルアミノ	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
シクロヘキシルアミノ	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
シクロヘキシルアミノ	S	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
シクロヘキシルアミノ	S	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
シクロヘキシルアミノ	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
シクロヘキシルアミノ	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
シクロヘキシルアミノ	S	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
シクロヘキシルアミノ	S	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
シクロヘキシルアミノ	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
アニリノ	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
アニリノ	S	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
アニリノ	S	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
アニリノ	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
アニリノ	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
アニリノ	S	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
アニリノ	S	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
アニリノ	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
アニリノ	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
アニリノ	S	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
アニリノ	S	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
アニリノ	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
アニリノ	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
アニリノ	S	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
アニリノ	S	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
アニリノ	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃

10

20

30

【 0 3 8 7 】

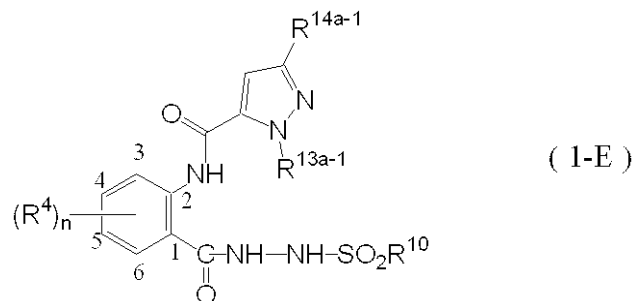
【表 6 4】

NR ⁸ R ⁹	A ³⁴	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
モルホリン-4-イル	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
モルホリン-4-イル	S	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
モルホリン-4-イル	S	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
モルホリン-4-イル	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
モルホリン-4-イル	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
モルホリン-4-イル	S	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
モルホリン-4-イル	S	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
モルホリン-4-イル	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
モルホリン-4-イル	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
モルホリン-4-イル	S	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
モルホリン-4-イル	S	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
モルホリン-4-イル	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
モルホリン-4-イル	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
モルホリン-4-イル	S	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
モルホリン-4-イル	S	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
モルホリン-4-イル	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃

10

【 0 3 8 8 】

式 (1 - E) で示される化合物 ;



式中の R¹⁰、(R⁴)_n、R^{13a-1} および R^{14a-1} は、〔表 6 5〕～〔表 6 7〕に記載の組合せを表す。

【 0 3 8 9 】

20

30

【表 6 5】

R ¹⁰	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₃	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₃	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₃	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₃	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃

10

20

30

【 0 3 9 0 】

【表 6 6】

R ¹⁰	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CF ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CF ₃	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CF ₃	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CF ₃	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CF ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CF ₃	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CF ₃	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CF ₃	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CF ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CF ₃	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CF ₃	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CF ₃	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CF ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CF ₃	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CF ₃	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CF ₃	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
フェニル	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
フェニル	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
フェニル	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
フェニル	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
フェニル	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
フェニル	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
フェニル	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
フェニル	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
フェニル	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
フェニル	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
フェニル	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
フェニル	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
フェニル	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
フェニル	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
フェニル	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
フェニル	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃

10

20

30

【0391】

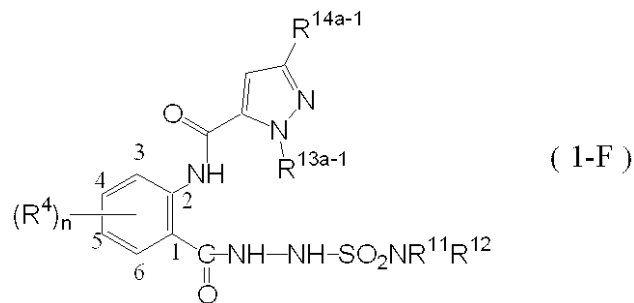
【表 6 7】

R^{10}	$(R^4)_n$	R^{13a-1}	R^{14a-1}
4-メチルフェニル	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
4-メチルフェニル	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
4-メチルフェニル	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
4-メチルフェニル	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
4-メチルフェニル	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
4-メチルフェニル	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
4-メチルフェニル	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
4-メチルフェニル	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
4-メチルフェニル	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
4-メチルフェニル	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
4-メチルフェニル	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
4-メチルフェニル	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
4-メチルフェニル	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
4-メチルフェニル	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
4-メチルフェニル	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
4-メチルフェニル	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃

10

【0392】

式(1-F)で示される化合物；



(1-F)

30

式中の $NR^{11}R^{12}$ 、 $(R^4)_n$ 、 R^{13a-1} および R^{14a-1} は、〔表 6 8〕に記載の組合せを表す。

【0393】

【表 6 8】

$\text{NR}^{11}\text{R}^{12}$	$(\text{R}^4)_n$	R^{13a-1}	R^{14a-1}
$\text{N}(\text{CH}_3)_2$	3- CH_3 , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
$\text{N}(\text{CH}_3)_2$	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
$\text{N}(\text{CH}_3)_2$	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
$\text{N}(\text{CH}_3)_2$	3- CH_3 , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
$\text{N}(\text{CH}_3)_2$	3- CH_3 , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
$\text{N}(\text{CH}_3)_2$	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
$\text{N}(\text{CH}_3)_2$	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
$\text{N}(\text{CH}_3)_2$	3- CH_3 , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
$\text{N}(\text{CH}_3)_2$	3- CH_3 , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
$\text{N}(\text{CH}_3)_2$	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
$\text{N}(\text{CH}_3)_2$	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
$\text{N}(\text{CH}_3)_2$	3- CH_3 , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
$\text{N}(\text{CH}_3)_2$	3- CH_3 , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF_3
$\text{N}(\text{CH}_3)_2$	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF_3
$\text{N}(\text{CH}_3)_2$	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CF_3
$\text{N}(\text{CH}_3)_2$	3- CH_3 , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CF_3
アニリノ	3- CH_3 , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
アニリノ	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
アニリノ	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
アニリノ	3- CH_3 , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
アニリノ	3- CH_3 , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
アニリノ	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
アニリノ	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
アニリノ	3- CH_3 , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
アニリノ	3- CH_3 , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
アニリノ	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
アニリノ	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
アニリノ	3- CH_3 , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
アニリノ	3- CH_3 , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF_3
アニリノ	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF_3
アニリノ	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CF_3
アニリノ	3- CH_3 , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CF_3

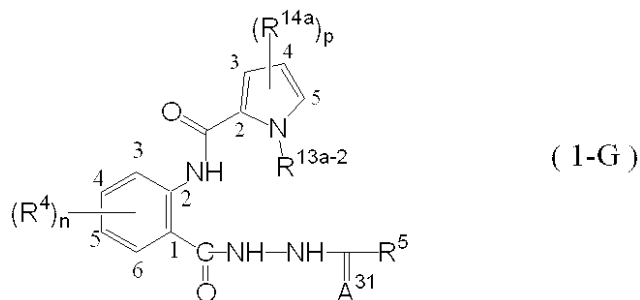
10

20

30

【0394】

式(1-G)で示される化合物；



40

式中の R^5 、 A^{31} 、 $(\text{R}^4)_n$ 、 R^{13a-2} および $(\text{R}^{14a})_p$ は、〔表 6 9〕に記載の組合せを表す。

【0395】

50

【表 69】

R^5	A^{31}	$(R^4)_n$	R^{13a-2}	$(R^{14a})_p$
H	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
H	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
H	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
H	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
H	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Cl
H	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Cl
H	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Cl
H	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Cl
H	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Br
H	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Br
H	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Br
H	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Br
H	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	4-CF ₃
H	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	4-CF ₃
H	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	4-CF ₃
H	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	4-CF ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Cl
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Cl
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Cl
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Cl
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Br
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Br
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Br
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Br
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	4-CF ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	4-CF ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	4-CF ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	4-CF ₃

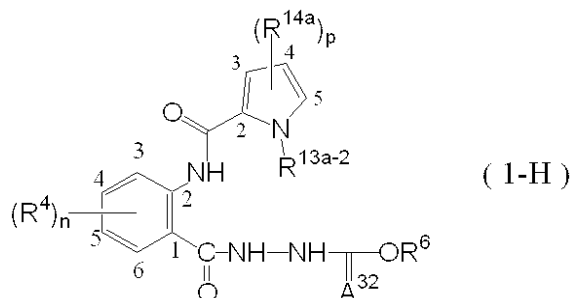
10

20

30

【0396】

式(1-H)で示される化合物；



40

式中の R^6 、 A^{32} 、 $(R^4)_n$ 、 R^{13a-2} および $(R^{14a})_p$ は、〔表 70〕～〔表 82〕に記載の組合せを表す。

【0397】

50

【表 70】

R^6	A^{32}	$(R^4)_n$	R^{13a-2}	$(R^{14a})_p$
CH_3	0	3- CH_3	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH_3	0	3- CH_3 , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH_3	0	3- CH_3 , 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH_3	0	3- CH_3 , 5-I	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH_3	0	3- CH_3 , 5- CH_3	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH_3	0	3- CH_3 , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH_3	0	3-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH_3	0	3-Cl, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH_3	0	3-Cl, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH_3	0	3-Cl, 5-I	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH_3	0	3-Cl, 5- CH_3	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH_3	0	3-Cl, 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH_3	0	3-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH_3	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH_3	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH_3	0	3-Br, 5-I	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH_3	0	3-Br, 5- CH_3	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH_3	0	3-Br, 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH_3	0	3-I	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH_3	0	3-I, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH_3	0	3-I, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH_3	0	3-I, 5-I	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH_3	0	3-I, 5- CH_3	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH_3	0	3-I, 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H

10

20

【0398】

30

【表 7 1】

R^6	A^{32}	$(R^4)_n$	R^{13a-2}	$(R^{14a})_p$
CH_3	0	3- CH_3	3-クロロ-2-ピリジニル	4-C1
CH_3	0	3- CH_3 , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	4-C1
CH_3	0	3- CH_3 , 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	4-C1
CH_3	0	3- CH_3 , 5-I	3-クロロ-2-ピリジニル	4-C1
CH_3	0	3- CH_3 , 5- CH_3	3-クロロ-2-ピリジニル	4-C1
CH_3	0	3- CH_3 , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	4-C1
CH_3	0	3-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	4-C1
CH_3	0	3-Cl, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	4-C1
CH_3	0	3-Cl, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	4-C1
CH_3	0	3-Cl, 5-I	3-クロロ-2-ピリジニル	4-C1
CH_3	0	3-Cl, 5- CH_3	3-クロロ-2-ピリジニル	4-C1
CH_3	0	3-Cl, 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	4-C1
CH_3	0	3-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	4-C1
CH_3	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	4-C1
CH_3	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	4-C1
CH_3	0	3-Br, 5-I	3-クロロ-2-ピリジニル	4-C1
CH_3	0	3-Br, 5- CH_3	3-クロロ-2-ピリジニル	4-C1
CH_3	0	3-Br, 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	4-C1
CH_3	0	3-I	3-クロロ-2-ピリジニル	4-C1
CH_3	0	3-I, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	4-C1
CH_3	0	3-I, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	4-C1
CH_3	0	3-I, 5-I	3-クロロ-2-ピリジニル	4-C1
CH_3	0	3-I, 5- CH_3	3-クロロ-2-ピリジニル	4-C1
CH_3	0	3-I, 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	4-C1

10

20

【 0 3 9 9 】

30

【表 7 2】

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-2}	(R ^{14a}) _p
CH ₃	0	3-CH ₂ CH ₃	3-クロロ-2-ピリジニル	4-C1
CH ₃	0	3-CH(CH ₃) ₂	3-クロロ-2-ピリジニル	4-C1
CH ₃	0	3-C(CH ₃) ₃	3-クロロ-2-ピリジニル	4-C1
CH ₃	0	3-CF ₃	3-クロロ-2-ピリジニル	4-C1
CH ₃	0	3-OCH ₃	3-クロロ-2-ピリジニル	4-C1
CH ₃	0	3-フェニル	3-クロロ-2-ピリジニル	4-C1
CH ₃	0	3-CH ₂ CH ₃ , 5-C1	3-クロロ-2-ピリジニル	4-C1
CH ₃	0	3-CH(CH ₃) ₂ , 5-C1	3-クロロ-2-ピリジニル	4-C1
CH ₃	0	3-C(CH ₃) ₃ , 5-C1	3-クロロ-2-ピリジニル	4-C1
CH ₃	0	3-CF ₃ , 5-C1	3-クロロ-2-ピリジニル	4-C1
CH ₃	0	3-OCH ₃ , 5-C1	3-クロロ-2-ピリジニル	4-C1
CH ₃	0	3-フェニル, 5-C1	3-クロロ-2-ピリジニル	4-C1
CH ₃	0	3-CH ₃ , 4-C1	3-クロロ-2-ピリジニル	4-C1
CH ₃	0	3-C1, 4-C1	3-クロロ-2-ピリジニル	4-C1
CH ₃	0	3-CH ₃ , 6-C1	3-クロロ-2-ピリジニル	4-C1
CH ₃	0	3-C1, 6-C1	3-クロロ-2-ピリジニル	4-C1
CH ₃	0	3-CH ₃ , 4-C1, 5-C1	3-クロロ-2-ピリジニル	4-C1
CH ₃	0	3-C1, 4-C1, 5-C1	3-クロロ-2-ピリジニル	4-C1
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-C1, 6-C1	3-クロロ-2-ピリジニル	4-C1
CH ₃	0	3-C1, 5-C1, 6-C1	3-クロロ-2-ピリジニル	4-C1
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-F	3-クロロ-2-ピリジニル	4-C1
CH ₃	0	3-C1, 5-F	3-クロロ-2-ピリジニル	4-C1
CH ₃	0	3-Br, 5-F	3-クロロ-2-ピリジニル	4-C1
CH ₃	0	3-I, 5-F	3-クロロ-2-ピリジニル	4-C1
CH ₃	0	3-Me, 4, 5-CH=CH-CH=CH-	3-クロロ-2-ピリジニル	4-C1
CH ₃	0	3-C1, 4, 5-CH=CH-CH=CH-	3-クロロ-2-ピリジニル	4-C1
CH ₃	0	3-Br, 4, 5-CH=CH-CH=CH-	3-クロロ-2-ピリジニル	4-C1
CH ₃	0	3-I, 4, 5-CH=CH-CH=CH-	3-クロロ-2-ピリジニル	4-C1

10

20

30

【 0 4 0 0 】

【表 7 3】

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-2}	(R ^{14a}) _p
CH ₃	0	3-CH ₃	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Br
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Br
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Br
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-I	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Br
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CH ₃	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Br
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Br
CH ₃	0	3-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Br
CH ₃	0	3-Cl, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Br
CH ₃	0	3-Cl, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Br
CH ₃	0	3-Cl, 5-I	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Br
CH ₃	0	3-Cl, 5-CH ₃	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Br
CH ₃	0	3-Cl, 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Br
CH ₃	0	3-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Br
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Br
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Br
CH ₃	0	3-Br, 5-I	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Br
CH ₃	0	3-Br, 5-CH ₃	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Br
CH ₃	0	3-Br, 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Br
CH ₃	0	3-I	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Br
CH ₃	0	3-I, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Br
CH ₃	0	3-I, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Br
CH ₃	0	3-I, 5-I	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Br
CH ₃	0	3-I, 5-CH ₃	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Br
CH ₃	0	3-I, 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Br

10

20

【 0 4 0 1 】

30

【表 7 4】

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-2}	(R ^{14a}) _p
CH ₃	0	3-CH ₂ CH ₃	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Br
CH ₃	0	3-CH(CH ₃) ₂	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Br
CH ₃	0	3-C(CH ₃) ₃	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Br
CH ₃	0	3-CF ₃	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Br
CH ₃	0	3-OCH ₃	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Br
CH ₃	0	3-フェニル	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Br
CH ₃	0	3-CH ₂ CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Br
CH ₃	0	3-CH(CH ₃) ₂ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Br
CH ₃	0	3-C(CH ₃) ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Br
CH ₃	0	3-CF ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Br
CH ₃	0	3-OCH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Br
CH ₃	0	3-フェニル, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Br
CH ₃	0	3-CH ₃ , 4-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Br
CH ₃	0	3-Cl, 4-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Br
CH ₃	0	3-CH ₃ , 6-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Br
CH ₃	0	3-Cl, 6-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Br
CH ₃	0	3-CH ₃ , 4-Cl, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Br
CH ₃	0	3-Cl, 4-Cl, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Br
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl, 6-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Br
CH ₃	0	3-Cl, 5-Cl, 6-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Br
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-F	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Br
CH ₃	0	3-Cl, 5-F	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Br
CH ₃	0	3-Br, 5-F	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Br
CH ₃	0	3-I, 5-F	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Br
CH ₃	0	3-Me, 4, 5-CH=CH-CH=CH-	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Br
CH ₃	0	3-Cl, 4, 5-CH=CH-CH=CH-	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Br
CH ₃	0	3-Br, 4, 5-CH=CH-CH=CH-	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Br
CH ₃	0	3-I, 4, 5-CH=CH-CH=CH-	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Br

10

20

30

【 0 4 0 2 】

【表 7 5】

R^6	A^{32}	$(R^4)_n$	R^{13a-2}	$(R^{14a})_p$
CH_3	0	3- CH_3	3-クロロ-2-ピリジニル	4- CF_3
CH_3	0	3- CH_3 , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	4- CF_3
CH_3	0	3- CH_3 , 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	4- CF_3
CH_3	0	3- CH_3 , 5-I	3-クロロ-2-ピリジニル	4- CF_3
CH_3	0	3- CH_3 , 5- CH_3	3-クロロ-2-ピリジニル	4- CF_3
CH_3	0	3- CH_3 , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	4- CF_3
CH_3	0	3-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	4- CF_3
CH_3	0	3-Cl, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	4- CF_3
CH_3	0	3-Cl, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	4- CF_3
CH_3	0	3-Cl, 5-I	3-クロロ-2-ピリジニル	4- CF_3
CH_3	0	3-Cl, 5- CH_3	3-クロロ-2-ピリジニル	4- CF_3
CH_3	0	3-Cl, 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	4- CF_3
CH_3	0	3-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	4- CF_3
CH_3	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	4- CF_3
CH_3	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	4- CF_3
CH_3	0	3-Br, 5-I	3-クロロ-2-ピリジニル	4- CF_3
CH_3	0	3-Br, 5- CH_3	3-クロロ-2-ピリジニル	4- CF_3
CH_3	0	3-Br, 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	4- CF_3
CH_3	0	3-I	3-クロロ-2-ピリジニル	4- CF_3
CH_3	0	3-I, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	4- CF_3
CH_3	0	3-I, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	4- CF_3
CH_3	0	3-I, 5-I	3-クロロ-2-ピリジニル	4- CF_3
CH_3	0	3-I, 5- CH_3	3-クロロ-2-ピリジニル	4- CF_3
CH_3	0	3-I, 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	4- CF_3

10

20

【 0 4 0 3 】

30

【表 7 6】

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-2}	(R ^{14a}) _p
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	4-F
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	4-F
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	4-F
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	4-F
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	4-I
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	4-I
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	4-I
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	4-I
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	4-CH ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	4-CH ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	4-CH ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	4-CH ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	5-Cl
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	5-Cl
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	5-Cl
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	5-Cl
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	5-Br
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	5-Br
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	5-Br
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	5-Br
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	5-CF ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	5-CF ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	5-CF ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	5-CF ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	4, 5-Cl ₂
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	4, 5-Cl ₂
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	4, 5-Cl ₂
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	4, 5-Cl ₂
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	4, 5-Br ₂
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	4, 5-Br ₂
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	4, 5-Br ₂
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	4, 5-Br ₂

10

20

30

【 0 4 0 4 】

【表 77】

R^6	A^{32}	$(R^4)_n$	R^{13a-2}	$(R^{14a})_p$
CH_3	0	3- CH_3 , 5-Cl	3-フルオロ-2-ピリジニル	H
CH_3	0	3-Br, 5-Cl	3-フルオロ-2-ピリジニル	H
CH_3	0	3-Br, 5-Br	3-フルオロ-2-ピリジニル	H
CH_3	0	3- CH_3 , 5-CN	3-フルオロ-2-ピリジニル	H
CH_3	0	3- CH_3 , 5-Cl	3-フルオロ-2-ピリジニル	4-Cl
CH_3	0	3-Br, 5-Cl	3-フルオロ-2-ピリジニル	4-Cl
CH_3	0	3-Br, 5-Br	3-フルオロ-2-ピリジニル	4-Cl
CH_3	0	3- CH_3 , 5-CN	3-フルオロ-2-ピリジニル	4-Cl
CH_3	0	3- CH_3 , 5-Cl	3-フルオロ-2-ピリジニル	4-Br
CH_3	0	3-Br, 5-Cl	3-フルオロ-2-ピリジニル	4-Br
CH_3	0	3-Br, 5-Br	3-フルオロ-2-ピリジニル	4-Br
CH_3	0	3- CH_3 , 5-CN	3-フルオロ-2-ピリジニル	4-Br
CH_3	0	3- CH_3 , 5-Cl	3-フルオロ-2-ピリジニル	4- CF_3
CH_3	0	3-Br, 5-Cl	3-フルオロ-2-ピリジニル	4- CF_3
CH_3	0	3-Br, 5-Br	3-フルオロ-2-ピリジニル	4- CF_3
CH_3	0	3- CH_3 , 5-CN	3-フルオロ-2-ピリジニル	4- CF_3
CH_3	0	3- CH_3 , 5-Cl	3-ブロモ-2-ピリジニル	H
CH_3	0	3-Br, 5-Cl	3-ブロモ-2-ピリジニル	H
CH_3	0	3-Br, 5-Br	3-ブロモ-2-ピリジニル	H
CH_3	0	3- CH_3 , 5-CN	3-ブロモ-2-ピリジニル	H
CH_3	0	3- CH_3 , 5-Cl	3-ブロモ-2-ピリジニル	4-Cl
CH_3	0	3-Br, 5-Cl	3-ブロモ-2-ピリジニル	4-Cl
CH_3	0	3-Br, 5-Br	3-ブロモ-2-ピリジニル	4-Cl
CH_3	0	3- CH_3 , 5-CN	3-ブロモ-2-ピリジニル	4-Cl
CH_3	0	3- CH_3 , 5-Cl	3-ブロモ-2-ピリジニル	4-Br
CH_3	0	3-Br, 5-Cl	3-ブロモ-2-ピリジニル	4-Br
CH_3	0	3-Br, 5-Br	3-ブロモ-2-ピリジニル	4-Br
CH_3	0	3- CH_3 , 5-CN	3-ブロモ-2-ピリジニル	4-Br
CH_3	0	3- CH_3 , 5-Cl	3-ブロモ-2-ピリジニル	4- CF_3
CH_3	0	3-Br, 5-Cl	3-ブロモ-2-ピリジニル	4- CF_3
CH_3	0	3-Br, 5-Br	3-ブロモ-2-ピリジニル	4- CF_3
CH_3	0	3- CH_3 , 5-CN	3-ブロモ-2-ピリジニル	4- CF_3

10

20

30

【 0 4 0 5 】

【表 78】

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-2}	(R ^{14a}) _p
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-メチル-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-メチル-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-メチル-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-メチル-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-メチル-2-ピリジニル	4-Cl
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-メチル-2-ピリジニル	4-Cl
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-メチル-2-ピリジニル	4-Cl
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-メチル-2-ピリジニル	4-Cl
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-メチル-2-ピリジニル	4-Br
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-メチル-2-ピリジニル	4-Br
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-メチル-2-ピリジニル	4-Br
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-メチル-2-ピリジニル	4-Br
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-メチル-2-ピリジニル	4-CF ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-メチル-2-ピリジニル	4-CF ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-メチル-2-ピリジニル	4-CF ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-メチル-2-ピリジニル	4-CF ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-トリフルオロメチル-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-トリフルオロメチル-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-トリフルオロメチル-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-トリフルオロメチル-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-トリフルオロメチル-2-ピリジニル	4-Cl
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-トリフルオロメチル-2-ピリジニル	4-Cl
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-トリフルオロメチル-2-ピリジニル	4-Cl
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-トリフルオロメチル-2-ピリジニル	4-Cl
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-トリフルオロメチル-2-ピリジニル	4-Br
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-トリフルオロメチル-2-ピリジニル	4-Br
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-トリフルオロメチル-2-ピリジニル	4-Br
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-トリフルオロメチル-2-ピリジニル	4-Br
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-トリフルオロメチル-2-ピリジニル	4-CF ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-トリフルオロメチル-2-ピリジニル	4-CF ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-トリフルオロメチル-2-ピリジニル	4-CF ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-トリフルオロメチル-2-ピリジニル	4-CF ₃

10

20

30

【 0 4 0 6 】

【表 79】

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-2}	(R ^{14a}) _p
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-シアノ-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-シアノ-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-シアノ-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-シアノ-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-シアノ-2-ピリジニル	4-Cl
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-シアノ-2-ピリジニル	4-Cl
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-シアノ-2-ピリジニル	4-Cl
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-シアノ-2-ピリジニル	4-Cl
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-シアノ-2-ピリジニル	4-Br
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-シアノ-2-ピリジニル	4-Br
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-シアノ-2-ピリジニル	4-Br
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-シアノ-2-ピリジニル	4-Br
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-シアノ-2-ピリジニル	4-CF ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-シアノ-2-ピリジニル	4-CF ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-シアノ-2-ピリジニル	4-CF ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-シアノ-2-ピリジニル	4-CF ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-ニトロ-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-ニトロ-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-ニトロ-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-ニトロ-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-ニトロ-2-ピリジニル	4-Cl
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-ニトロ-2-ピリジニル	4-Cl
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-ニトロ-2-ピリジニル	4-Cl
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-ニトロ-2-ピリジニル	4-Cl
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-ニトロ-2-ピリジニル	4-Br
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-ニトロ-2-ピリジニル	4-Br
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-ニトロ-2-ピリジニル	4-Br
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-ニトロ-2-ピリジニル	4-Br
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-ニトロ-2-ピリジニル	4-CF ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-ニトロ-2-ピリジニル	4-CF ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-ニトロ-2-ピリジニル	4-CF ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-ニトロ-2-ピリジニル	4-CF ₃

10

20

30

【0407】

【表 80】

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-2}	(R ^{14a}) _p
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	2-クロロフェニル	H
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	2-クロロフェニル	H
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	2-クロロフェニル	H
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	2-クロロフェニル	H
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	2-クロロフェニル	4-Cl
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	2-クロロフェニル	4-Cl
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	2-クロロフェニル	4-Cl
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	2-クロロフェニル	4-Cl
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	2-クロロフェニル	4-Br
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	2-クロロフェニル	4-Br
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	2-クロロフェニル	4-Br
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	2-クロロフェニル	4-Br
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	2-クロロフェニル	4-CF ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	2-クロロフェニル	4-CF ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	2-クロロフェニル	4-CF ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	2-クロロフェニル	4-CF ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	2,6-ジクロロフェニル	H
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	2,6-ジクロロフェニル	H
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	2,6-ジクロロフェニル	H
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	2,6-ジクロロフェニル	H
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	2,6-ジクロロフェニル	4-Cl
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	2,6-ジクロロフェニル	4-Cl
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	2,6-ジクロロフェニル	4-Cl
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	2,6-ジクロロフェニル	4-Cl
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	2,6-ジクロロフェニル	4-Br
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	2,6-ジクロロフェニル	4-Br
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	2,6-ジクロロフェニル	4-Br
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	2,6-ジクロロフェニル	4-Br
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	2,6-ジクロロフェニル	4-CF ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	2,6-ジクロロフェニル	4-CF ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	2,6-ジクロロフェニル	4-CF ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	2,6-ジクロロフェニル	4-CF ₃

10

20

30

【0408】

【表 8 1】

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-2}	(R ^{14a}) _p
CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Cl
CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Cl
CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Cl
CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Cl
CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Br
CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Br
CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Br
CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Br
CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	4-CF ₃
CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	4-CF ₃
CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	4-CF ₃
CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	4-CF ₃

10

【0409】

【表 8 2】

R ⁸	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-2}	(R ^{14a}) _p
CH ₃	0	3-Cl, 5-Cl	3-chloro-2-pyridinyl	4-F
CH ₃	0	3-Cl, 5-Cl	3-chloro-2-pyridinyl	4-I
CH ₃	0	3-Cl, 5-Cl	3-chloro-2-pyridinyl	4-CH ₃
CH ₃	0	3-Cl, 5-Cl	3-chloro-2-pyridinyl	5-Cl
CH ₃	0	3-Cl, 5-Cl	3-chloro-2-pyridinyl	5-Br
CH ₃	0	3-Cl, 5-Cl	3-chloro-2-pyridinyl	5-CF ₃
CH ₃	0	3-Cl, 5-Cl	3-chloro-2-pyridinyl	4, 5-Cl ₂
CH ₃	0	3-Cl, 5-Cl	3-chloro-2-pyridinyl	4, 5-Br ₂
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-chloro-2-pyridinyl	4-Cl, 5-Br
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-chloro-2-pyridinyl	4-Cl, 5-Br
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-chloro-2-pyridinyl	4-Cl, 5-Br
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-chloro-2-pyridinyl	4-Cl, 5-Br
CH ₃	0	3-Cl, 5-Cl	3-chloro-2-pyridinyl	4-Cl, 5-Br
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-chloro-2-pyridinyl	4-Br, 5-Cl
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-chloro-2-pyridinyl	4-Br, 5-Cl
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-chloro-2-pyridinyl	4-Br, 5-Cl
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-chloro-2-pyridinyl	4-Br, 5-Cl
CH ₃	0	3-Cl, 5-Cl	3-chloro-2-pyridinyl	4-Br, 5-Cl

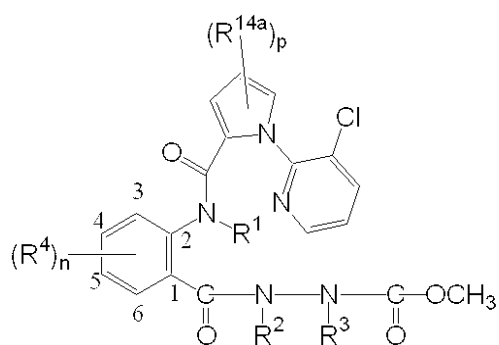
20

30

40

【0410】

式(1-S)で示される化合物；



(1-S)

式中の R¹、R²、R³、(R⁴)_nおよび(R^{14a})_pは、〔表83〕～〔表94〕に記載の組合せを表す。

【0411】

【表83】

R ¹	R ²	R ³	(R ⁴) _n	(R ^{14a}) _p
H	CH ₃	H	3-CH ₃ , 5-Cl	H
H	CH ₃	H	3-Br, 5-Cl	H
H	CH ₃	H	3-Br, 5-Br	H
H	CH ₃	H	3-CH ₃ , 5-CN	H
H	CH ₃	H	3-CH ₃ , 5-Cl	4-Cl
H	CH ₃	H	3-Br, 5-Cl	4-Cl
H	CH ₃	H	3-Br, 5-Br	4-Cl
H	CH ₃	H	3-CH ₃ , 5-CN	4-Cl
H	CH ₃	H	3-CH ₃ , 5-Cl	4-Br
H	CH ₃	H	3-Br, 5-Cl	4-Br
H	CH ₃	H	3-Br, 5-Br	4-Br
H	CH ₃	H	3-CH ₃ , 5-CN	4-Br
H	CH ₃	H	3-CH ₃ , 5-Cl	4-CF ₃
H	CH ₃	H	3-Br, 5-Cl	4-CF ₃
H	CH ₃	H	3-Br, 5-Br	4-CF ₃
H	CH ₃	H	3-CH ₃ , 5-CN	4-CF ₃
H	H	CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	H
H	H	CH ₃	3-Br, 5-Cl	H
H	H	CH ₃	3-Br, 5-Br	H
H	H	CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	H
H	H	CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	4-Cl
H	H	CH ₃	3-Br, 5-Cl	4-Cl
H	H	CH ₃	3-Br, 5-Br	4-Cl
H	H	CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	4-Cl
H	H	CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	4-Br
H	H	CH ₃	3-Br, 5-Cl	4-Br
H	H	CH ₃	3-Br, 5-Br	4-Br
H	H	CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	4-Br
H	H	CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	4-CF ₃
H	H	CH ₃	3-Br, 5-Cl	4-CF ₃
H	H	CH ₃	3-Br, 5-Br	4-CF ₃
H	H	CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	4-CF ₃

【0412】

10

20

30

40

50

【表 8 4】

R^1	R^2	R^3	$(R^4)_n$	$(R^{14a})_p$
H	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	H
H	CH ₃	CH ₃	3-Br, 5-Cl	H
H	CH ₃	CH ₃	3-Br, 5-Br	H
H	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	H
H	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	4-Cl
H	CH ₃	CH ₃	3-Br, 5-Cl	4-Cl
H	CH ₃	CH ₃	3-Br, 5-Br	4-Cl
H	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	4-Cl
H	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	4-Br
H	CH ₃	CH ₃	3-Br, 5-Cl	4-Br
H	CH ₃	CH ₃	3-Br, 5-Br	4-Br
H	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	4-Br
H	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	4-CF ₃
H	CH ₃	CH ₃	3-Br, 5-Cl	4-CF ₃
H	CH ₃	CH ₃	3-Br, 5-Br	4-CF ₃
H	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	4-CF ₃
H	H	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	H
H	H	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Cl	H
H	H	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Br	H
H	H	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	H
H	H	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	4-Cl
H	H	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Cl	4-Cl
H	H	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Br	4-Cl
H	H	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	4-Cl
H	H	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	4-Br
H	H	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Cl	4-Br
H	H	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Br	4-Br
H	H	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	4-Br
H	H	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	4-CF ₃
H	H	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Cl	4-CF ₃
H	H	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Br	4-CF ₃
H	H	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	4-CF ₃

10

20

30

【 0 4 1 3 】

【表 8 5】

R^1	R^2	R^3	$(R^4)_n$	$(R^{14a})_p$
H	H	$CH(CH_3)_2$	3- CH_3 , 5-Cl	H
H	H	$CH(CH_3)_2$	3-Br, 5-Cl	H
H	H	$CH(CH_3)_2$	3-Br, 5-Br	H
H	H	$CH(CH_3)_2$	3- CH_3 , 5-CN	H
H	H	$CH(CH_3)_2$	3- CH_3 , 5-Cl	4-Cl
H	H	$CH(CH_3)_2$	3-Br, 5-Cl	4-Cl
H	H	$CH(CH_3)_2$	3-Br, 5-Br	4-Cl
H	H	$CH(CH_3)_2$	3- CH_3 , 5-CN	4-Cl
H	H	$CH(CH_3)_2$	3- CH_3 , 5-Cl	4-Br
H	H	$CH(CH_3)_2$	3-Br, 5-Cl	4-Br
H	H	$CH(CH_3)_2$	3-Br, 5-Br	4-Br
H	H	$CH(CH_3)_2$	3- CH_3 , 5-CN	4-Br
H	H	$CH(CH_3)_2$	3- CH_3 , 5-Cl	4- CF_3
H	H	$CH(CH_3)_2$	3-Br, 5-Cl	4- CF_3
H	H	$CH(CH_3)_2$	3-Br, 5-Br	4- CF_3
H	H	$CH(CH_3)_2$	3- CH_3 , 5-CN	4- CF_3
H	H	$C(CH_3)_3$	3- CH_3 , 5-Cl	H
H	H	$C(CH_3)_3$	3-Br, 5-Cl	H
H	H	$C(CH_3)_3$	3-Br, 5-Br	H
H	H	$C(CH_3)_3$	3- CH_3 , 5-CN	H
H	H	$C(CH_3)_3$	3- CH_3 , 5-Cl	4-Cl
H	H	$C(CH_3)_3$	3-Br, 5-Cl	4-Cl
H	H	$C(CH_3)_3$	3-Br, 5-Br	4-Cl
H	H	$C(CH_3)_3$	3- CH_3 , 5-CN	4-Cl
H	H	$C(CH_3)_3$	3- CH_3 , 5-Cl	4-Br
H	H	$C(CH_3)_3$	3-Br, 5-Cl	4-Br
H	H	$C(CH_3)_3$	3-Br, 5-Br	4-Br
H	H	$C(CH_3)_3$	3- CH_3 , 5-CN	4-Br
H	H	$C(CH_3)_3$	3- CH_3 , 5-Cl	4- CF_3
H	H	$C(CH_3)_3$	3-Br, 5-Cl	4- CF_3
H	H	$C(CH_3)_3$	3-Br, 5-Br	4- CF_3
H	H	$C(CH_3)_3$	3- CH_3 , 5-CN	4- CF_3

10

20

30

【 0 4 1 4 】

【表 8 6】

R^1	R^2	R^3	$(R^4)_n$	$(R^{14a})_p$
H	H	$C(=O)OCH_3$	3- CH_3 , 5-Cl	H
H	H	$C(=O)OCH_3$	3-Br, 5-Cl	H
H	H	$C(=O)OCH_3$	3-Br, 5-Br	H
H	H	$C(=O)OCH_3$	3- CH_3 , 5-CN	H
H	H	$C(=O)OCH_3$	3- CH_3 , 5-Cl	4-Cl
H	H	$C(=O)OCH_3$	3-Br, 5-Cl	4-Cl
H	H	$C(=O)OCH_3$	3-Br, 5-Br	4-Cl
H	H	$C(=O)OCH_3$	3- CH_3 , 5-CN	4-Cl
H	H	$C(=O)OCH_3$	3- CH_3 , 5-Cl	4-Br
H	H	$C(=O)OCH_3$	3-Br, 5-Cl	4-Br
H	H	$C(=O)OCH_3$	3-Br, 5-Br	4-Br
H	H	$C(=O)OCH_3$	3- CH_3 , 5-CN	4-Br
H	H	$C(=O)OCH_3$	3- CH_3 , 5-Cl	4- CF_3
H	H	$C(=O)OCH_3$	3-Br, 5-Cl	4- CF_3
H	H	$C(=O)OCH_3$	3-Br, 5-Br	4- CF_3
H	H	$C(=O)OCH_3$	3- CH_3 , 5-CN	4- CF_3
H	H	$C(=O)N(CH_3)_2$	3- CH_3 , 5-Cl	H
H	H	$C(=O)N(CH_3)_2$	3-Br, 5-Cl	H
H	H	$C(=O)N(CH_3)_2$	3-Br, 5-Br	H
H	H	$C(=O)N(CH_3)_2$	3- CH_3 , 5-CN	H
H	H	$C(=O)N(CH_3)_2$	3- CH_3 , 5-Cl	4-Cl
H	H	$C(=O)N(CH_3)_2$	3-Br, 5-Cl	4-Cl
H	H	$C(=O)N(CH_3)_2$	3-Br, 5-Br	4-Cl
H	H	$C(=O)N(CH_3)_2$	3- CH_3 , 5-CN	4-Cl
H	H	$C(=O)N(CH_3)_2$	3- CH_3 , 5-Cl	4-Br
H	H	$C(=O)N(CH_3)_2$	3-Br, 5-Cl	4-Br
H	H	$C(=O)N(CH_3)_2$	3-Br, 5-Br	4-Br
H	H	$C(=O)N(CH_3)_2$	3- CH_3 , 5-CN	4-Br
H	H	$C(=O)N(CH_3)_2$	3- CH_3 , 5-Cl	4- CF_3
H	H	$C(=O)N(CH_3)_2$	3-Br, 5-Cl	4- CF_3
H	H	$C(=O)N(CH_3)_2$	3-Br, 5-Br	4- CF_3
H	H	$C(=O)N(CH_3)_2$	3- CH_3 , 5-CN	4- CF_3

10

20

30

【 0 4 1 5 】

【表 8 7】

R^1	R^2	R^3	$(R^4)_n$	$(R^{14a})_p$
CH_3	CH_3	H	3- CH_3 , 5-Cl	H
CH_3	CH_3	H	3-Br, 5-Cl	H
CH_3	CH_3	H	3-Br, 5-Br	H
CH_3	CH_3	H	3- CH_3 , 5-CN	H
CH_3	CH_3	H	3- CH_3 , 5-Cl	4-Cl
CH_3	CH_3	H	3-Br, 5-Cl	4-Cl
CH_3	CH_3	H	3-Br, 5-Br	4-Cl
CH_3	CH_3	H	3- CH_3 , 5-CN	4-Cl
CH_3	CH_3	H	3- CH_3 , 5-Cl	4-Br
CH_3	CH_3	H	3-Br, 5-Cl	4-Br
CH_3	CH_3	H	3-Br, 5-Br	4-Br
CH_3	CH_3	H	3- CH_3 , 5-CN	4-Br
CH_3	CH_3	H	3- CH_3 , 5-Cl	4- CF_3
CH_3	CH_3	H	3-Br, 5-Cl	4- CF_3
CH_3	CH_3	H	3-Br, 5-Br	4- CF_3
CH_3	CH_3	H	3- CH_3 , 5-CN	4- CF_3
CH_3	H	CH_3	3- CH_3 , 5-Cl	H
CH_3	H	CH_3	3-Br, 5-Cl	H
CH_3	H	CH_3	3-Br, 5-Br	H
CH_3	H	CH_3	3- CH_3 , 5-CN	H
CH_3	H	CH_3	3- CH_3 , 5-Cl	4-Cl
CH_3	H	CH_3	3-Br, 5-Cl	4-Cl
CH_3	H	CH_3	3-Br, 5-Br	4-Cl
CH_3	H	CH_3	3- CH_3 , 5-CN	4-Cl
CH_3	H	CH_3	3- CH_3 , 5-Cl	4-Br
CH_3	H	CH_3	3-Br, 5-Cl	4-Br
CH_3	H	CH_3	3-Br, 5-Br	4-Br
CH_3	H	CH_3	3- CH_3 , 5-CN	4-Br
CH_3	H	CH_3	3- CH_3 , 5-Cl	4- CF_3
CH_3	H	CH_3	3-Br, 5-Cl	4- CF_3
CH_3	H	CH_3	3-Br, 5-Br	4- CF_3
CH_3	H	CH_3	3- CH_3 , 5-CN	4- CF_3

10

20

30

【 0 4 1 6 】

【表 8 8】

R^1	R^2	R^3	$(R^4)_n$	$(R^{14a})_p$
CH_3	CH_3	CH_3	3- CH_3 , 5-Cl	H
CH_3	CH_3	CH_3	3-Br, 5-Cl	H
CH_3	CH_3	CH_3	3-Br, 5-Br	H
CH_3	CH_3	CH_3	3- CH_3 , 5-CN	H
CH_3	CH_3	CH_3	3- CH_3 , 5-Cl	4-Cl
CH_3	CH_3	CH_3	3-Br, 5-Cl	4-Cl
CH_3	CH_3	CH_3	3-Br, 5-Br	4-Cl
CH_3	CH_3	CH_3	3- CH_3 , 5-CN	4-Cl
CH_3	CH_3	CH_3	3- CH_3 , 5-Cl	4-Br
CH_3	CH_3	CH_3	3-Br, 5-Cl	4-Br
CH_3	CH_3	CH_3	3-Br, 5-Br	4-Br
CH_3	CH_3	CH_3	3- CH_3 , 5-CN	4-Br
CH_3	CH_3	CH_3	3- CH_3 , 5-Cl	4- CF_3
CH_3	CH_3	CH_3	3-Br, 5-Cl	4- CF_3
CH_3	CH_3	CH_3	3-Br, 5-Br	4- CF_3
CH_3	CH_3	CH_3	3- CH_3 , 5-CN	4- CF_3
CH_3	H	CH_2CH_3	3- CH_3 , 5-Cl	H
CH_3	H	CH_2CH_3	3-Br, 5-Cl	H
CH_3	H	CH_2CH_3	3-Br, 5-Br	H
CH_3	H	CH_2CH_3	3- CH_3 , 5-CN	H
CH_3	H	CH_2CH_3	3- CH_3 , 5-Cl	4-Cl
CH_3	H	CH_2CH_3	3-Br, 5-Cl	4-Cl
CH_3	H	CH_2CH_3	3-Br, 5-Br	4-Cl
CH_3	H	CH_2CH_3	3- CH_3 , 5-CN	4-Cl
CH_3	H	CH_2CH_3	3- CH_3 , 5-Cl	4-Br
CH_3	H	CH_2CH_3	3-Br, 5-Cl	4-Br
CH_3	H	CH_2CH_3	3-Br, 5-Br	4-Br
CH_3	H	CH_2CH_3	3- CH_3 , 5-CN	4-Br
CH_3	H	CH_2CH_3	3- CH_3 , 5-Cl	4- CF_3
CH_3	H	CH_2CH_3	3-Br, 5-Cl	4- CF_3
CH_3	H	CH_2CH_3	3-Br, 5-Br	4- CF_3
CH_3	H	CH_2CH_3	3- CH_3 , 5-CN	4- CF_3

10

20

30

【 0 4 1 7 】

【表 8 9】

R^1	R^2	R^3	$(R^4)_n$	$(R^{14a})_p$
CH_3	H	$CH(CH_3)_2$	3- CH_3 , 5-Cl	H
CH_3	H	$CH(CH_3)_2$	3-Br, 5-Cl	H
CH_3	H	$CH(CH_3)_2$	3-Br, 5-Br	H
CH_3	H	$CH(CH_3)_2$	3- CH_3 , 5-CN	H
CH_3	H	$CH(CH_3)_2$	3- CH_3 , 5-Cl	4-Cl
CH_3	H	$CH(CH_3)_2$	3-Br, 5-Cl	4-Cl
CH_3	H	$CH(CH_3)_2$	3-Br, 5-Br	4-Cl
CH_3	H	$CH(CH_3)_2$	3- CH_3 , 5-CN	4-Cl
CH_3	H	$CH(CH_3)_2$	3- CH_3 , 5-Cl	4-Br
CH_3	H	$CH(CH_3)_2$	3-Br, 5-Cl	4-Br
CH_3	H	$CH(CH_3)_2$	3-Br, 5-Br	4-Br
CH_3	H	$CH(CH_3)_2$	3- CH_3 , 5-CN	4-Br
CH_3	H	$CH(CH_3)_2$	3- CH_3 , 5-Cl	4- CF_3
CH_3	H	$CH(CH_3)_2$	3-Br, 5-Cl	4- CF_3
CH_3	H	$CH(CH_3)_2$	3-Br, 5-Br	4- CF_3
CH_3	H	$CH(CH_3)_2$	3- CH_3 , 5-CN	4- CF_3
CH_3	H	$C(CH_3)_3$	3- CH_3 , 5-Cl	H
CH_3	H	$C(CH_3)_3$	3-Br, 5-Cl	H
CH_3	H	$C(CH_3)_3$	3-Br, 5-Br	H
CH_3	H	$C(CH_3)_3$	3- CH_3 , 5-CN	H
CH_3	H	$C(CH_3)_3$	3- CH_3 , 5-Cl	4-Cl
CH_3	H	$C(CH_3)_3$	3-Br, 5-Cl	4-Cl
CH_3	H	$C(CH_3)_3$	3-Br, 5-Br	4-Cl
CH_3	H	$C(CH_3)_3$	3- CH_3 , 5-CN	4-Cl
CH_3	H	$C(CH_3)_3$	3- CH_3 , 5-Cl	4-Br
CH_3	H	$C(CH_3)_3$	3-Br, 5-Cl	4-Br
CH_3	H	$C(CH_3)_3$	3-Br, 5-Br	4-Br
CH_3	H	$C(CH_3)_3$	3- CH_3 , 5-CN	4-Br
CH_3	H	$C(CH_3)_3$	3- CH_3 , 5-Cl	4- CF_3
CH_3	H	$C(CH_3)_3$	3-Br, 5-Cl	4- CF_3
CH_3	H	$C(CH_3)_3$	3-Br, 5-Br	4- CF_3
CH_3	H	$C(CH_3)_3$	3- CH_3 , 5-CN	4- CF_3

10

20

30

【 0 4 1 8 】

【表 90】

R^1	R^2	R^3	$(R^4)_n$	$(R^{14a})_p$
CH_3	H	$C(=O)OCH_3$	3- CH_3 , 5-Cl	H
CH_3	H	$C(=O)OCH_3$	3-Br, 5-Cl	H
CH_3	H	$C(=O)OCH_3$	3-Br, 5-Br	H
CH_3	H	$C(=O)OCH_3$	3- CH_3 , 5-CN	H
CH_3	H	$C(=O)OCH_3$	3- CH_3 , 5-Cl	4-Cl
CH_3	H	$C(=O)OCH_3$	3-Br, 5-Cl	4-Cl
CH_3	H	$C(=O)OCH_3$	3-Br, 5-Br	4-Cl
CH_3	H	$C(=O)OCH_3$	3- CH_3 , 5-CN	4-Cl
CH_3	H	$C(=O)OCH_3$	3- CH_3 , 5-Cl	4-Br
CH_3	H	$C(=O)OCH_3$	3-Br, 5-Cl	4-Br
CH_3	H	$C(=O)OCH_3$	3-Br, 5-Br	4-Br
CH_3	H	$C(=O)OCH_3$	3- CH_3 , 5-CN	4-Br
CH_3	H	$C(=O)OCH_3$	3- CH_3 , 5-Cl	4- CF_3
CH_3	H	$C(=O)OCH_3$	3-Br, 5-Cl	4- CF_3
CH_3	H	$C(=O)OCH_3$	3-Br, 5-Br	4- CF_3
CH_3	H	$C(=O)OCH_3$	3- CH_3 , 5-CN	4- CF_3
CH_3	H	$C(=O)N(CH_3)_2$	3- CH_3 , 5-Cl	H
CH_3	H	$C(=O)N(CH_3)_2$	3-Br, 5-Cl	H
CH_3	H	$C(=O)N(CH_3)_2$	3-Br, 5-Br	H
CH_3	H	$C(=O)N(CH_3)_2$	3- CH_3 , 5-CN	H
CH_3	H	$C(=O)N(CH_3)_2$	3- CH_3 , 5-Cl	4-Cl
CH_3	H	$C(=O)N(CH_3)_2$	3-Br, 5-Cl	4-Cl
CH_3	H	$C(=O)N(CH_3)_2$	3-Br, 5-Br	4-Cl
CH_3	H	$C(=O)N(CH_3)_2$	3- CH_3 , 5-CN	4-Cl
CH_3	H	$C(=O)N(CH_3)_2$	3- CH_3 , 5-Cl	4-Br
CH_3	H	$C(=O)N(CH_3)_2$	3-Br, 5-Cl	4-Br
CH_3	H	$C(=O)N(CH_3)_2$	3-Br, 5-Br	4-Br
CH_3	H	$C(=O)N(CH_3)_2$	3- CH_3 , 5-CN	4-Br
CH_3	H	$C(=O)N(CH_3)_2$	3- CH_3 , 5-Cl	4- CF_3
CH_3	H	$C(=O)N(CH_3)_2$	3-Br, 5-Cl	4- CF_3
CH_3	H	$C(=O)N(CH_3)_2$	3-Br, 5-Br	4- CF_3
CH_3	H	$C(=O)N(CH_3)_2$	3- CH_3 , 5-CN	4- CF_3

10

20

30

【0419】

【表 9 1】

R ¹	R ²	R ³	(R ⁴) _n	(R ^{14a}) _p
H	CH ₃	H	3-Cl, 5-Cl	H
H	CH ₃	H	3-Cl, 5-Cl	4-Cl
H	CH ₃	H	3-Cl, 5-Cl	4-Br
H	CH ₃	H	3-Cl, 5-Cl	4-CF ₃
H	CH ₃	H	3-Cl, 5-Cl	4, 5-Cl ₂
H	CH ₃	H	3-Cl, 5-Cl	4, 5-Br ₂
H	CH ₃	H	3-CH ₃ , 5-Cl	4-Cl, 5-Br
H	CH ₃	H	3-Br, 5-Cl	4-Cl, 5-Br
H	CH ₃	H	3-Br, 5-Br	4-Cl, 5-Br
H	CH ₃	H	3-CH ₃ , 5-CN	4-Cl, 5-Br
H	CH ₃	H	3-Cl, 5-Cl	4-Cl, 5-Br
H	CH ₃	H	3-CH ₃ , 5-Cl	4-Br, 5-Cl
H	CH ₃	H	3-Br, 5-Cl	4-Br, 5-Cl
H	CH ₃	H	3-Br, 5-Br	4-Br, 5-Cl
H	CH ₃	H	3-CH ₃ , 5-CN	4-Br, 5-Cl
H	CH ₃	H	3-Cl, 5-Cl	4-Br, 5-Cl
H	H	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	H
H	H	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	4-Cl
H	H	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	4-Br
H	H	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	4-CF ₃
H	H	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	4, 5-Cl ₂
H	H	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	4, 5-Br ₂
H	H	CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	4-Cl, 5-Br
H	H	CH ₃	3-Br, 5-Cl	4-Cl, 5-Br
H	H	CH ₃	3-Br, 5-Br	4-Cl, 5-Br
H	H	CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	4-Cl, 5-Br
H	H	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	4-Cl, 5-Br
H	H	CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	4-Br, 5-Cl
H	H	CH ₃	3-Br, 5-Cl	4-Br, 5-Cl
H	H	CH ₃	3-Br, 5-Br	4-Br, 5-Cl
H	H	CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	4-Br, 5-Cl
H	H	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	4-Br, 5-Cl

10

20

30

【 0 4 2 0 】

【表 9 2】

R^1	R^2	R^3	$(R^4)_n$	$(R^{14a})_p$
H	CH_3	CH_3	3-Cl, 5-Cl	H
H	CH_3	CH_3	3-Cl, 5-Cl	4-Cl
H	CH_3	CH_3	3-Cl, 5-Cl	4-Br
H	CH_3	CH_3	3-Cl, 5-Cl	4- CF_3
H	CH_3	CH_3	3-Cl, 5-Cl	4, 5- Cl_2
H	CH_3	CH_3	3-Cl, 5-Cl	4, 5- Br_2
H	CH_3	CH_3	3- CH_3 , 5-Cl	4-Cl, 5-Br
H	CH_3	CH_3	3-Br, 5-Cl	4-Cl, 5-Br
H	CH_3	CH_3	3-Br, 5-Br	4-Cl, 5-Br
H	CH_3	CH_3	3- CH_3 , 5-CN	4-Cl, 5-Br
H	CH_3	CH_3	3-Cl, 5-Cl	4-Cl, 5-Br
H	CH_3	CH_3	3- CH_3 , 5-Cl	4-Br, 5-Cl
H	CH_3	CH_3	3-Br, 5-Cl	4-Br, 5-Cl
H	CH_3	CH_3	3-Br, 5-Br	4-Br, 5-Cl
H	CH_3	CH_3	3- CH_3 , 5-CN	4-Br, 5-Cl
H	CH_3	CH_3	3-Cl, 5-Cl	4-Br, 5-Cl
H	H	CH_2CH_3	3-Cl, 5-Cl	H
H	H	CH_2CH_3	3-Cl, 5-Cl	4-Cl
H	H	CH_2CH_3	3-Cl, 5-Cl	4-Br
H	H	CH_2CH_3	3-Cl, 5-Cl	4- CF_3
H	H	$CH(CH_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	H
H	H	$CH(CH_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	4-Cl
H	H	$CH(CH_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	4-Br
H	H	$CH(CH_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	4- CF_3
H	H	$C(CH_3)_3$	3-Cl, 5-Cl	H
H	H	$C(CH_3)_3$	3-Cl, 5-Cl	4-Cl
H	H	$C(CH_3)_3$	3-Cl, 5-Cl	4-Br
H	H	$C(CH_3)_3$	3-Cl, 5-Cl	4- CF_3

10

20

30

【 0 4 2 1 】

【表 9 3】

R^1	R^2	R^3	$(R^4)_n$	$(R^{14a})_p$
H	H	$C(=O)OCH_3$	3-Cl, 5-Cl	H
H	H	$C(=O)OCH_3$	3-Cl, 5-Cl	4-Cl
H	H	$C(=O)OCH_3$	3-Cl, 5-Cl	4-Br
H	H	$C(=O)OCH_3$	3-Cl, 5-Cl	4-CF ₃
H	H	$C(=O)N(CH_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	H
H	H	$C(=O)N(CH_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	4-Cl
H	H	$C(=O)N(CH_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	4-Br
H	H	$C(=O)N(CH_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	4-CF ₃
CH ₃	CH ₃	H	3-Cl, 5-Cl	H
CH ₃	CH ₃	H	3-Cl, 5-Cl	4-Cl
CH ₃	CH ₃	H	3-Cl, 5-Cl	4-Br
CH ₃	CH ₃	H	3-Cl, 5-Cl	4-CF ₃
CH ₃	H	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	H
CH ₃	H	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	4-Cl
CH ₃	H	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	4-Br
CH ₃	H	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	4-CF ₃
CH ₃	CH ₃	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	H
CH ₃	CH ₃	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	4-Cl
CH ₃	CH ₃	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	4-Br
CH ₃	CH ₃	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	4-CF ₃
CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	3-Cl, 5-Cl	H
CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	3-Cl, 5-Cl	4-Cl
CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	3-Cl, 5-Cl	4-Br
CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	3-Cl, 5-Cl	4-CF ₃
CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H
CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	4-Cl
CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	4-Br
CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	4-CF ₃
CH ₃	H	C(CH ₃) ₃	3-Cl, 5-Cl	H
CH ₃	H	C(CH ₃) ₃	3-Cl, 5-Cl	4-Cl
CH ₃	H	C(CH ₃) ₃	3-Cl, 5-Cl	4-Br
CH ₃	H	C(CH ₃) ₃	3-Cl, 5-Cl	4-CF ₃

10

20

30

【 0 4 2 2 】

【表 9 4】

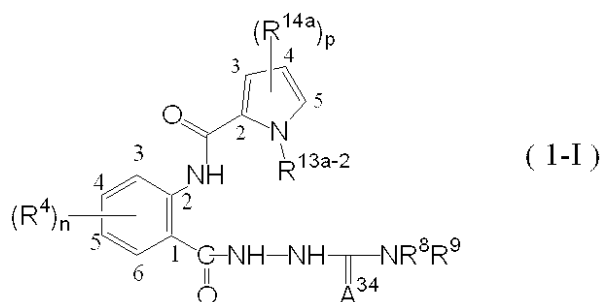
R^1	R^2	R^3	$(R^4)_n$	$(R^{14a})_p$
CH ₃	H	$C(=O)OCH_3$	3-Cl, 5-Cl	H
CH ₃	H	$C(=O)OCH_3$	3-Cl, 5-Cl	4-Cl
CH ₃	H	$C(=O)OCH_3$	3-Cl, 5-Cl	4-Br
CH ₃	H	$C(=O)OCH_3$	3-Cl, 5-Cl	4-CF ₃
CH ₃	H	$C(=O)N(CH_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	H
CH ₃	H	$C(=O)N(CH_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	4-Cl
CH ₃	H	$C(=O)N(CH_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	4-Br
CH ₃	H	$C(=O)N(CH_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	4-CF ₃

40

50

【 0 4 2 3 】

式 (1 - I) で示される化合物 ;



式中の NR^8R^9 、 A^{34} 、 $(\text{R}^4)_n$ 、 R^{13a-2} および $(\text{R}^{14a})_p$ は、〔表 9 5〕に記載の組合せを表す。

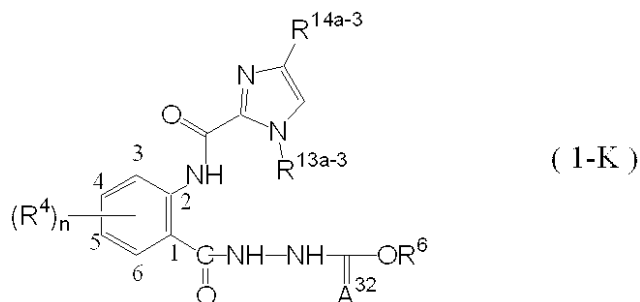
【 0 4 2 4 】

【表 9 5】

NR^8R^9	A^{34}	$(\text{R}^4)_n$	R^{13a-2}	$(\text{R}^{14a})_p$
$\text{N}(\text{CH}_3)_2$	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
$\text{N}(\text{CH}_3)_2$	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
$\text{N}(\text{CH}_3)_2$	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
$\text{N}(\text{CH}_3)_2$	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
$\text{N}(\text{CH}_3)_2$	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Cl
$\text{N}(\text{CH}_3)_2$	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Cl
$\text{N}(\text{CH}_3)_2$	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Cl
$\text{N}(\text{CH}_3)_2$	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Cl
$\text{N}(\text{CH}_3)_2$	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Br
$\text{N}(\text{CH}_3)_2$	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Br
$\text{N}(\text{CH}_3)_2$	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Br
$\text{N}(\text{CH}_3)_2$	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	4-Br
$\text{N}(\text{CH}_3)_2$	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	4-CF ₃
$\text{N}(\text{CH}_3)_2$	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	4-CF ₃
$\text{N}(\text{CH}_3)_2$	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	4-CF ₃
$\text{N}(\text{CH}_3)_2$	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	4-CF ₃

【 0 4 2 5 】

式 (1 - K) で示される化合物 ;



式中の R^6 、 A^{32} 、 $(\text{R}^4)_n$ 、 R^{13a-3} および R^{14a-3} は、〔表 9 6〕に記載の組合せを表す。

【 0 4 2 6 】

【表 9 6】

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-3}	R ^{14a-3}
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃

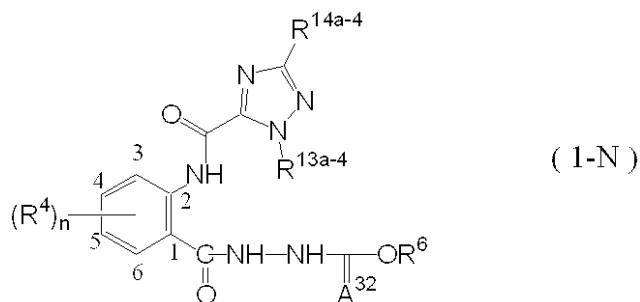
10

20

30

【0427】

式(1-N)で示される化合物；



40

式中の R⁶、A³²、(R⁴)_n、R^{13a-4} および R^{14a-4} は、【表 9 7】に記載の組合せを表す。

【0428】

50

【表 97】

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-4}	R ^{14a-4}
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H
CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Cl
CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	Br
CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃
CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	CF ₃

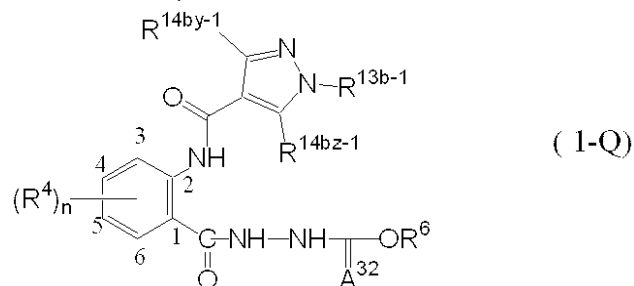
10

20

30

【0429】

式(1-Q)で示される化合物；



40

式中の R⁶、A³²、(R⁴)_n、R^{13b-1}、R^{14bz-1} および R^{14by-1} は、【表 98】～【表 101】に記載の組合せを表す。

【0430】

50

【表 9 8】

R ⁵	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{14bx-1}	R ^{14by-1}	R ^{13b-1}
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	2-クロロフェニル	H	CH ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	2-クロロフェニル	H	CH ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	2-クロロフェニル	H	CH ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	2-クロロフェニル	H	CH ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H	CH ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H	CH ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H	CH ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H	CH ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	H	2-クロロフェニル	CH ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	H	2-クロロフェニル	CH ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	H	2-クロロフェニル	CH ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	H	2-クロロフェニル	CH ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	H	3-クロロ-2-ピリジニル	CH ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	H	3-クロロ-2-ピリジニル	CH ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	H	3-クロロ-2-ピリジニル	CH ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	H	3-クロロ-2-ピリジニル	CH ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	2-クロロフェニル	H	C(CH ₃) ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	2-クロロフェニル	H	C(CH ₃) ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	2-クロロフェニル	H	C(CH ₃) ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	2-クロロフェニル	H	C(CH ₃) ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H	C(CH ₃) ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H	C(CH ₃) ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H	C(CH ₃) ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H	C(CH ₃) ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	H	2-クロロフェニル	C(CH ₃) ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	H	2-クロロフェニル	C(CH ₃) ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	H	2-クロロフェニル	C(CH ₃) ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	H	2-クロロフェニル	C(CH ₃) ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	H	3-クロロ-2-ピリジニル	C(CH ₃) ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	H	3-クロロ-2-ピリジニル	C(CH ₃) ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	H	3-クロロ-2-ピリジニル	C(CH ₃) ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	H	3-クロロ-2-ピリジニル	C(CH ₃) ₃

10

20

【 0 4 3 1 】

【表 9 9】

R ⁵	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{14bx-1}	R ^{14by-1}	R ^{13b-1}
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	2-クロロフェニル	H	CH ₂ CF ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	2-クロロフェニル	H	CH ₂ CF ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	2-クロロフェニル	H	CH ₂ CF ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	2-クロロフェニル	H	CH ₂ CF ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H	CH ₂ CF ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H	CH ₂ CF ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H	CH ₂ CF ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H	CH ₂ CF ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	H	2-クロロフェニル	CH ₂ CF ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	H	2-クロロフェニル	CH ₂ CF ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	H	2-クロロフェニル	CH ₂ CF ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	H	2-クロロフェニル	CH ₂ CF ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	H	3-クロロ-2-ピリジニル	CH ₂ CF ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	H	3-クロロ-2-ピリジニル	CH ₂ CF ₃
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	H	3-クロロ-2-ピリジニル	CH ₂ CF ₃
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	H	3-クロロ-2-ピリジニル	CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	2-クロロフェニル	H	CH ₃
CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	2-クロロフェニル	H	CH ₃
CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Br	2-クロロフェニル	H	CH ₃
CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	2-クロロフェニル	H	CH ₃
CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H	CH ₃
CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H	CH ₃
CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H	CH ₃
CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H	CH ₃
CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	H	2-クロロフェニル	CH ₃
CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	H	2-クロロフェニル	CH ₃
CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Br	H	2-クロロフェニル	CH ₃
CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	H	2-クロロフェニル	CH ₃
CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	H	3-クロロ-2-ピリジニル	CH ₃
CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	H	3-クロロ-2-ピリジニル	CH ₃
CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Br	H	3-クロロ-2-ピリジニル	CH ₃
CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	H	3-クロロ-2-ピリジニル	CH ₃

10

20

【 0 4 3 2 】

【表 1 0 0】

R ⁵	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{14bx-1}	R ^{14by-1}	R ^{13b-1}
CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	2-クロロフェニル	H	C(CH ₃) ₃
CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	2-クロロフェニル	H	C(CH ₃) ₃
CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Br	2-クロロフェニル	H	C(CH ₃) ₃
CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	2-クロロフェニル	H	C(CH ₃) ₃
CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H	C(CH ₃) ₃
CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H	C(CH ₃) ₃
CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H	C(CH ₃) ₃
CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H	C(CH ₃) ₃
CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	H	2-クロロフェニル	C(CH ₃) ₃
CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	H	2-クロロフェニル	C(CH ₃) ₃
CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Br	H	2-クロロフェニル	C(CH ₃) ₃
CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	H	2-クロロフェニル	C(CH ₃) ₃
CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	H	3-クロロ-2-ピリジニル	C(CH ₃) ₃
CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	H	3-クロロ-2-ピリジニル	C(CH ₃) ₃
CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Br	H	3-クロロ-2-ピリジニル	C(CH ₃) ₃
CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	H	3-クロロ-2-ピリジニル	C(CH ₃) ₃
CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	2-クロロフェニル	H	CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	2-クロロフェニル	H	CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Br	2-クロロフェニル	H	CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	2-クロロフェニル	H	CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H	CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H	CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H	CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H	CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	H	2-クロロフェニル	CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	H	2-クロロフェニル	CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Br	H	2-クロロフェニル	CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	H	2-クロロフェニル	CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	H	3-クロロ-2-ピリジニル	CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	H	3-クロロ-2-ピリジニル	CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₃	0	3-Br, 5-Br	H	3-クロロ-2-ピリジニル	CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	H	3-クロロ-2-ピリジニル	CH ₂ CF ₃

10

20

【 0 4 3 3】

【表 101】

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{14bz-1}	R ^{14bz-1}	R ^{13b-1}
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	2-クロロフェニル	H	CHF ₂
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	2-クロロフェニル	H	CHF ₂
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	2-クロロフェニル	H	CHF ₂
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	2-クロロフェニル	H	CHF ₂
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H	CHF ₂
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H	CHF ₂
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H	CHF ₂
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H	CHF ₂
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	H	2-クロロフェニル	CHF ₂
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	H	2-クロロフェニル	CHF ₂
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	H	2-クロロフェニル	CHF ₂
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	H	2-クロロフェニル	CHF ₂
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	H	3-クロロ-2-ピリジニル	CHF ₂
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	H	3-クロロ-2-ピリジニル	CHF ₂
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	H	3-クロロ-2-ピリジニル	CHF ₂
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	H	3-クロロ-2-ピリジニル	CHF ₂
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	2-クロロフェニル	H	CBrF ₂
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	2-クロロフェニル	H	CBrF ₂
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	2-クロロフェニル	H	CBrF ₂
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	2-クロロフェニル	H	CBrF ₂
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H	CBrF ₂
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	3-クロロ-2-ピリジニル	H	CBrF ₂
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	3-クロロ-2-ピリジニル	H	CBrF ₂
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-クロロ-2-ピリジニル	H	CBrF ₂
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	H	2-クロロフェニル	CBrF ₂
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	H	2-クロロフェニル	CBrF ₂
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	H	2-クロロフェニル	CBrF ₂
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	H	2-クロロフェニル	CBrF ₂
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-Cl	H	3-クロロ-2-ピリジニル	CBrF ₂
CH ₃	0	3-Br, 5-Cl	H	3-クロロ-2-ピリジニル	CBrF ₂
CH ₃	0	3-Br, 5-Br	H	3-クロロ-2-ピリジニル	CBrF ₂
CH ₃	0	3-CH ₃ , 5-CN	H	3-クロロ-2-ピリジニル	CBrF ₂

10

20

30

【0434】

本発明化合物が効力を有する有害生物としては、例えば、有害昆虫類や有害ダニ類などの有害節足動物、および線虫類の線形動物が挙げられ、具体的には、例えば、以下のものが挙げられる。

40

【0435】

半翅目害虫：ヒメトビウンカ (*Laodelphax striatellus*)、トビイロウンカ (*Nilaparvata lugens*)、セジロウンカ (*Sogatella furcifera*) 等のウンカ類、ツマグロヨコバイ (*Nephotettix cincticeps*)、タイワンツマグロヨコバイ (*Nephotettix virescens*)、チャノミドリヒメヨコバイ (*Empoasca onukii*) 等のヨコバイ類、ワタアブラムシ (*Aphis gossypii*)、モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*)、ダイコンアブラムシ (*Brevicoryne brassicae*)、ユキヤナギアブラムシ (*Aphis spiraeicola*)、チューリップヒゲナガアブラムシ (*Macrosiphum euphorbiae*)、ジャガイモヒゲナガアブラムシ (*Aulacorthum solani*)、ムギクビレアブラムシ (*Rhopalosiphum padi*)、ミカンクロアブラムシ (*Toxop*

50

tera citricidus)、モモコフキアブラムシ (*Hyalopterus pruni*) 等のアブラムシ類、アオクサカメムシ (*Nezara antennata*)、ホソヘリカメムシ (*Riptortus clavetus*)、クモヘリカメムシ (*Leptocoris chinensis*)、トゲシラホシカメムシ (*Eysarcoris parvus*)、クサギカメムシ (*Halyomorpha mista*) 等のカメムシ類、オンシツコナジラミ (*Trialetodes vaporariorum*)、タバココナジラミ (*Bemisia tabaci*)、シルバーリーフコナジラミ (*Bemisia argentifolii*)、ミカンコナジラミ (*Dialeurodes citri*)、ミカントゲコナジラミ (*Aleurocanthus spiniferus*) 等のコナジラミ類、アカマルカイガラムシ (*Aonidiella aurantii*)、サンホーゼカイガラムシ (*Comstockaspis perniciosus*)、シトラスノースケール (*Unaspis citri*)、ルビーロウムシ (*Ceroplastes rubens*)、イセリヤカイガラムシ (*Icerya purchasi*)、フジコナカイガラムシ (*Planococcus kraunhiae*)、クワコナカイガラムシ (*Pseudococcus longispinis*)、クワシロカイガラムシ (*Pseudaulacaspis pentagona*) 等のカイガラムシ類、グンバイムシ類、キジラミ類等。

【 0 4 3 6 】

鱗翅目害虫：ニカメイガ (*Chilo suppressalis*)、サンカメイガ (*Tryporyza incertulas*)、コブノメイガ (*Cnaphalocrocis medinalis*)、ワタノメイガ (*Notarcha derogata*)、ノシメダラメイガ (*Plodia interpunctella*)、アワノメイガ (*Ostrinia furnacalis*)、ハイマダラノメイガ (*Hellula undalis*)、シバツトガ (*Pediasia teterrellus*) 等のメイガ類、ハスモンヨトウ (*Spodoptera litura*)、シロイチモジヨトウ (*Spodoptera exigua*)、アワヨトウ (*Pseudaletia separata*)、ヨトウガ (*Mamestra brassicae*)、タマナヤガ (*Agrotis ipsilon*)、タマナギンウバ (*Plusia nigrisigna*)、トリコプルシア属、ヘリオティス属、ヘリコベルパ属等のヤガ類、モンシロチョウ (*Pieris rapae*) 等のシロチョウ類、アドキソフィエス属、ナシヒメシンクイ (*Grapholita molesta*)、マメシンクイガ (*Leguminivora glycinivorella*)、アズキサヤムシガ (*Matsumuraeses azukivora*)、リンゴコカクモンハマキ (*Adoxophyes orana fasciata*)、チャノコカクモンハマキ (*Adoxophyes* sp.)、チャハマキ (*Homona magnanima*)、ミダレカクモンハマキ (*Archips fuscocupreanus*) コドリリング (*Cydia pomonella*) 等のハマキガ類、チャノホソガ (*Caloptilia theivora*)、キンモンホソガ (*Phyllonorycter ringoneella*) のホソガ類、モモシンクイガ (*Carposina niponensis*) 等のシンクイガ類、リオネティア属等のハモグリガ類、リマントリア属、ユーブロクティス属等のドクガ類、コナガ (*Plutella xylostella*) 等のスガ類、ワタアカミムシ (*Pectinophora gossypiella*) ジャガイモガ (*Phthorimaea operculella*) 等のキバガ類、アメリカシロヒトリ (*Hyphantria cunea*) 等のヒトリガ類、イガ (*Tinea translucens*)、コイガ (*Tineola bisselliella*) 等のヒロズコガ類等。

【 0 4 3 7 】

アザミウマ目害虫：ミカンキイロアザミウマ (*Frankliniella occidentalis*)、ミナミキイロアザミウマ (*Thrips parvi*)、チャノキイロアザミウマ (*Scirtothrips dorsalis*)、ネギアザミウマ (*Thrips tabaci*)、ヒラズハナアザミウマ (*Frankliniella intonsa*) などのアザミウマ類

【 0 4 3 8 】

双翅目害虫：イエバエ (*Musca domestica*)、アカイエカ (*Culex popiens pallens*)、ウシアブ (*Tabanus trigonus*)、タマネギバエ (*Hylemya antiqua*)、タネバエ (*Hylemya platura*)、シナハマダラカ (*Anopheles sinensis*)、イネハモグリバエ (*Agromyza oryzae*)、イネヒメハモグリバエ (*Hydrellia griseola*)、イネキモグリバエ (*Chlorops oryzae*)、ウリミバエ (*Dacus cucurbitae*)、チチュウカイミバエ (*Ceratitis capitata*)、マメハモグリバエ (*Liriomyza trifolii*)、トマトハモグリバエ (*Liriomyza sativae*)、ナモグリバエ (*Chromatomyia horticola*) 等。

【 0 4 3 9 】

甲虫目害虫：ニジュウヤホシテントウ (*Epilachna vigintioctopunctata*)、ウリハムシ (*Aulacophora femoralis*)、キスジノミハムシ (*Phyllotreta striolata*)、イネドロオイムシ (*Oulema oryzae*)、イネゾウムシ (*Echinocnemus squameus*)、イネミズゾウム

10

20

30

40

50

シ (*Lissorhoptrus oryzophilus*)、ワタミゾウムシ (*Anthonomus grandis*)、アズキゾウムシ (*Callosobruchus chinensis*)、シバオサゾウムシ (*Sphenophorus venatus*)、マメコガネ (*Popillia japonica*)、ドウガネブイブイ (*Anomala cuprea*)、コーンルートワームの仲間 (*Diabrotica* spp.)、コロラドハムシ (*Leptinotarsa decemlineata*)、コメツキムシの仲間 (*Agriotes* spp.)、タバコシバンムシ (*Lasioderma serricorne*)、ヒメマルカツオブシムシ (*Anthrenus verbasci*)、コクヌストモドキ (*Tribolium castaneum*)、ヒラタキクイムシ (*Lyctus brunneus*)、ゴマダラカミキリ (*Anoplophora malasiaca*)、マツノキクイムシ (*Tomicus piniperda*) 等。

【 0 4 4 0 】

直翅目害虫：トノサマバッタ (*Locusta migratoria*)、ケラ (*Gryllotalpa africana*)、コバネイナゴ (*Oxya yezoensis*)、ハネナガイナゴ (*Oxya japonica*) 等。

10

【 0 4 4 1 】

膜翅目害虫：カブラハバチ (*Athalia rosae*)、ハキリアリ (*Acromyrmex* spp.)、ファイヤーアント (*Solenopsis* spp.) 等。

【 0 4 4 2 】

線虫類：イネシンガレセンチュウ (*Aphelenchoides besseyi*)、イチゴメセンチュウ (*Nothotylenchus acris*)、サツマイモネコブセンチュウ (*Meloidogyne incognita*)、キタネコブセンチュウ (*Meloidogyne hapla*)、ジャワネコブセンチュウ (*Meloidogyne javanica*)、ダイズシストセンチュウ (*Heterodera glycines*)、ジャガイモシストセンチュウ (*Globodera rostochiensis*)、ミナミネグサレセンチュウ (*Pratylenchus coffeae*)、ムギネグサレセンチュウ (*Pratylenchus neglectus*) 等。

20

【 0 4 4 3 】

ゴキブリ目害虫：チャバネゴキブリ (*Blattella germanica*)、クロゴキブリ (*Periplaneta fuliginosa*)、ワモンゴキブリ (*Periplaneta americana*)、トビイロゴキブリ (*Periplaneta brunnea*)、トウヨウゴキブリ (*Blatta orientalis*) 等。

【 0 4 4 4 】

ダニ目害虫：ナミハダニ (*Tetranychus urticae*)、カンザワハダニ (*Tetranychus kanzawai*)、ミカンハダニ (*Panonychus citri*)、リンゴハダニ (*Panonychus ulmi*)、オリゴニカス属等のハダニ類、ミカンサビダニ (*Aculops pelekassi*)、リュウキュウミカンサビダニ (*Phyllocoptruta citri*)、トマトサビダニ (*Aculops lycopersici*)、チャノサビダニ (*Calacarus carinatus*)、チャノナガサビダニ (*Acaphylla theavagrans*)、ニセナシサビダニ (*Eriophyes chibaensis*) 等のフシダニ類、チャノホコリダニ (*Polyphagotarsonemus latus*) 等のホコリダニ類、ミナミヒメハダニ (*Brevipalpus phoenicis*) 等のヒメハダニ類、ケナガハダニ類、フタトゲチマダニ (*Haemaphysalis longicornis*)、ヤマトチマダニ (*Haemaphysalis flava*)、タイワンカクマダニ (*Dermacentor taiwanicus*)、ヤマトマダニ (*Ixodes ovatus*)、シュルツマダニ (*Ixodes persulcatus*)、オウシマダニ (*Boophilus microplus*)、クリイロコイタマダニ (*Rhipicephalus sanguineus*) 等のマダニ類、ケナガコナダニ (*Tyrophagus putrescentiae*)、ハウレンソウケナガコナダニ (*Tyrophagus similis*) 等のコナダニ類、コナヒョウヒダニ (*Dermatophagoides farinae*)、ヤケヒョウヒダニ (*Dermatophagoides pteromyssus*) 等のヒョウヒダニ類、ホソツメダニ (*Cheyletus eruditus*)、クワガタツメダニ (*Cheyletus malaccensis*)、ミナミツメダニ (*Cheyletus moorei*) 等のツメダニ類、ワクモ類等。

30

40

【 0 4 4 5 】

本発明の有害生物防除剤は、本発明化合物そのものでもよいが、通常は、本発明化合物と固体担体、液体担体、ガス状担体等の不活性担体とを混合し、必要に応じて、界面活性剤、その他の製剤用補助剤を添加して、乳剤、油剤、粉剤、粒剤、水和剤、フロアブル剤、マイクロカプセル剤、エアゾール剤、燻煙剤、毒餌剤、樹脂製剤等に製剤化されている。これらの製剤は、本発明化合物を、通常、0.01～95重量%含有する。

【 0 4 4 6 】

製剤化の際に用いられる固体担体としては、例えば、粘土類 (カオリンクレー、珪藻土

50

、ベントナイト、フバサミクレ、酸性白土等）、合成含水酸化珪素、タルク、セラミック、その他の無機鉱物（セリサイト、石英、硫黄、活性炭、炭酸カルシウム、水和シリカ等）、化学肥料（硫安、燐安、硝安、尿素、塩安等）等の微粉末および粒状物等があげられる。

【0447】

液体担体としては、例えば、水、アルコール類（メタノール、エタノール、イソプロピルアルコール、ブタノール、ヘキサノール、ベンジルアルコール、エチレングリコール、プロピレングリコール、フェノキシエタノール等）、ケトン類（アセトン、メチルエチルケトン、シクロヘキサノン等）、芳香族炭化水素類（トルエン、キシレン、エチルベンゼン、ドデシルベンゼン、フェニルキシリルエタン、メチルナフタレン等）、脂肪族炭化水素類（ヘキサン、シクロヘキサン、灯油、軽油等）、エステル類（酢酸エチル、酢酸ブチル、ミリスチン酸イソプロピル、オレイン酸エチル、アジピン酸ジイソプロピル、アジピン酸ジイソブチル、プロピレングリコールモノメチルエーテルアセテート等）、ニトリル類（アセトニトリル、イソブチロニトリル等）、エーテル類（ジイソプロピルエーテル、1,4-ジオキサン、エチレングリコールジメチルエーテル、ジエチレングリコールジメチルエーテル、ジエチレングリコールモノメチルエーテル、プロピレングリコールモノメチルエーテル、ジプロピレングリコールモノメチルエーテル、3-メトキシ-3-メチル-1-ブタノール等）、酸アミド類（N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド等）、ハロゲン化炭化水素類（ジクロロメタン、トリクロロエタン、四塩化炭素等）、スルホキシド類（ジメチルスルホキシド等）、炭酸プロピレンおよび植物油（大豆油、綿実油等）が挙げられる。

【0448】

ガス状担体としては、例えば、フルオロカーボン、ブタンガス、LPG（液化石油ガス）、ジメチルエーテルおよび炭酸ガスがあげられる。

【0449】

界面活性剤としては、例えば、ポリオキシエチレンアルキルエーテル、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル、ポリエチレングリコール脂肪酸エステル、等の非イオン界面活性剤、およびアルキルスルホン酸塩、アルキルベンゼンスルホン酸塩、アルキル硫酸塩等の陰イオン界面活性剤が挙げられる。

【0450】

その他の製剤用補助剤としては、固着剤、分散剤、着色剤および安定剤等、具体的には例えば、カゼイン、ゼラチン、糖類（でんぷん、アラビアガム、セルロース誘導体、アルギン酸等）、リグニン誘導体、ベントナイト、合成水溶性高分子（ポリビニルアルコール、ポリビニルピロリドン、ポリアクリル酸類等）、PAP（酸性りん酸イソプロピル）、BHT（2,6-ジ-tert-ブチル-4-メチルフェノール）、BHA（2-tert-ブチル-4-メトキシフェノールと3-tert-ブチル-4-メトキシフェノールとの混合物）等が挙げられる。

【0451】

本発明の有害生物防除方法は、通常、本発明の有害生物防除剤を有害生物に直接または有害生物の生息場所（植物体、土壌、家屋内、動物体等）に施用することにより行われる。

【0452】

また、本発明の有害生物防除方法は、本発明化合物をそのまま用いることもできるが、通常は、本発明化合物を前記した本発明の有害生物防除剤の形態に製剤化して、例えば、有害生物または有害生物の生息場所に従来の有害生物防除剤と同様の方法で施用し、発生する上記の有害生物に接触或いは摂取させる方法が挙げられる。

本発明における有害生物の生息場所としては、水田、畑、果樹園、非農耕地、家屋等が挙げられる。

かかる施用方法としては、例えば、散布処理、土壌処理、種子処理および水耕液処理が挙げられる。

本発明における散布処理とは、具体的には、例えば、茎葉散布、樹幹散布等の植物体表面あるいは有害生物自体に、有効成分（本発明化合物）を処理することにより、有害生物に対する防除効力を発現する処理方法であり、

土壌処理とは、例えば、有害生物による摂食等の被害から保護しようとする作物の植物体内部に根部等から浸透移行させるために、土壌あるいは灌水液等に有効成分を処理することにより、該作物を有害生物による被害から保護する処理方法であり、具体的には、例えば、植穴処理（植穴散布、植穴処理土壌混和）、株元処理（株元散布、株元土壌混和、株元灌注、育苗期後半株元処理）、植溝処理（植溝散布、植溝土壌混和）、作条処理（作条散布、作条土壌混和、生育期作条散布）、播種時作条処理（播種時作条散布、播種時作条土壌混和）、全面処理（全面土壌散布、全面土壌混和）、その他土壌散布処理（生育期粒剤葉面散布、樹冠下または主幹周辺散布、土壌表面散布、土壌表面混和、播穴散布、畦部地表面散布、株間散布）、その他灌注処理（土壌灌注、育苗期灌注、薬液注入処理、地際部灌注、薬液ドリッピングイリゲーション、ケミゲーション）、育苗箱処理（育苗箱散布、育苗箱灌注）、育苗トレイ処理（育苗トレイ散布、育苗トレイ灌注）、苗床処理（苗床散布、苗床灌注、水苗代苗床散布、苗浸漬）、床土混和处理（床土混和、播種前床土混和）、その他処理（培土混和、鋤き込み、表土混和、雨落ち部土壌混和、植位置処理、粒剤花房散布、ペースト肥料混和）が挙げられ、

10

種子処理とは、例えば、有害生物による摂食等の被害から保護しようとする作物の種子、種芋または球根等に直接あるいはその近傍に有効成分を処理することにより、有害生物に対する防除効力を発現する処理方法であり、具体的には、例えば、吹きつけ処理、塗沫処理、浸漬処理、含浸処理、塗布処理、フィルムコート処理、ペレットコート処理が挙げられ、

20

水耕液処理とは、例えば、有害生物による摂食等の被害から保護しようとする作物の植物体内部に根部等から浸透移行させるために水耕液等に有効成分を処理することにより、該作物を有害生物による被害から保護する処理方法であり、具体的には、例えば、水耕液混和、水耕液混入などが挙げられる。

【 0 4 5 3 】

本発明の有害生物防除剤を農業分野の有害生物防除に用いる場合、その施用量は 10000 m^2 あたりの本発明化合物量で、通常、 $1 \sim 10000\text{ g}$ である。本発明の有害生物防除剤が乳剤、水和剤、フロアブル剤等に製剤化されている場合は、通常、有効成分濃度が $0.01 \sim 10000\text{ ppm}$ となるように水で希釈して施用し、粒剤、粉剤等は、通常、そのまま施用する。

30

【 0 4 5 4 】

これらの製剤や製剤の水希釈液は、有害生物または有害生物から保護すべき作物等の植物に直接散布処理してもよく、また耕作地の土壌に生息する有害生物を防除するために、該土壌に処理してもよい。

【 0 4 5 5 】

また、シート状やひも状に加工した樹脂製剤を作物に巻き付ける、作物近傍に張り渡す、株元土壌に敷く等の方法により処理することもできる。

【 0 4 5 6 】

40

本発明の有害生物防除剤を家屋内に生息する有害生物（例えば、ハエ、蚊、ゴキブリ）の防除に用いる場合、その施用量は、面上に処理する場合は処理面積 1 m^2 あたりの本発明化合物量で、通常、 $0.01 \sim 1000\text{ mg}$ であり、空間に処理する場合は処理空間 1 m^3 あたりの本発明化合物量で、通常、 $0.01 \sim 500\text{ mg}$ である。本発明の有害生物防除剤が乳剤、水和剤、フロアブル剤等に製剤化されている場合は、通常有効成分濃度が $0.1 \sim 1000\text{ ppm}$ となるように水で希釈して施用し、油剤、エアゾール剤、燻煙剤、毒餌剤等はそのまま施用する。

【 0 4 5 7 】

本発明化合物は、畑、水田、芝生、果樹園等の農耕地又は非農耕地用の殺虫剤として使用することができる。本発明化合物は、下記に挙げられる「作物」等を栽培する農耕地等

50

において、該「作物」等に対して薬害を与えることなく、当該農耕地の害虫を防除することができる場合がある。

【0458】

「作物」：

農作物；トウモロコシ、イネ、コムギ、オオムギ、ライムギ、エンバク、ソルガム、ワタ、ダイズ、ピーナッツ、ソバ、テンサイ、ナタネ、ヒマワリ、サトウキビ、タバコ等、

野菜；ナス科野菜（ナス、トマト、ピーマン、トウガラシ、ジャガイモ等）、ウリ科野菜（キュウリ、カボチャ、ズッキーニ、スイカ、メロン等）、アブラナ科野菜（ダイコン、カブ、セイヨウワサビ、コールラビ、ハクサイ、キャベツ、カラシナ、ブロッコリー、カリフラワー等）、キク科野菜（ゴボウ、シュンギク、アーティチョーク、レタス等）、ユリ科野菜（ネギ、タマネギ、ニンニク、アスパラガス）、セリ科野菜（ニンジン、パセリ、セロリ、アメリカボウフウ等）、アカザ科野菜（ハウレンソウ、フダンソウ等）、シソ科野菜（シソ、ミント、バジル等）、イチゴ、サツマイモ、ヤマノイモ、サトイモ等、
花卉、

観葉植物、

果樹；仁果類（リンゴ、セイヨウナシ、ニホンナシ、カリン、マルメロ等）、核果類（モモ、スモモ、ネクタリン、ウメ、オウトウ、アンズ、プルーン等）、カンキツ類（ウンシュウミカン、オレンジ、レモン、ライム、グレープフルーツ等）、堅果類（クリ、クルミ、ハシバミ、アーモンド、ピスタチオ、カシューナッツ、マカダミアナッツ等）、液果類（ブルーベリー、クランベリー、ブラックベリー、ラズベリー等）、ブドウ、カキ、オリブ、ピワ、バナナ、コーヒー、ナツメヤシ、ココヤシ等、

果樹以外の樹；チャ、クワ、花木、街路樹（トネリコ、カバノキ、ハナミズキ、ユーカリ、イチヨウ、ライラック、カエデ、カシ、ポプラ、ハナズオウ、フウ、プラタナス、ケヤキ、クロベ、モミノキ、ツガ、ネズ、マツ、トウヒ、イチイ）等。

【0459】

上記「作物」とは、イソキサフルトール等のHPPD阻害剤、イマゼタピル、チフェンスルフロンメチル等のALS阻害剤、EPSP合成酵素阻害剤、グルタミン合成酵素阻害剤、プロモキシニル等の除草剤に対する耐性が、古典的な育種法、もしくは遺伝子組換え技術により付与された作物も含まれる。

古典的な育種法により耐性が付与された「作物」の例として、イマゼタピル等のイミダゾリノン系除草剤耐性のClearfield（登録商標）カノーラ、チフェンスルフロンメチル等のスルホニルウレア系ALS阻害型除草剤耐性のSTSダイズ等がある。

また、遺伝子組換え技術により耐性が与えられた「作物」の例として、グリホサートやグルホシネート耐性のトウモロコシ品種があり、RoundupReady（登録商標）およびLibertyLink（登録商標）等の商品名ですでに販売されている。

【0460】

上記「作物」とは、遺伝子組換え技術を用いて、例えば、バチルス属で知られている選択的毒素等を合成する事が可能となった作物も含まれる。

このような遺伝子組換え植物で発現される毒素として、バチルス・セレウスやバチルス・ポピリエ由来の殺虫性タンパク；バチルス・チューリングェンシス由来のCry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1またはCry9C等の - エンドトキシン、VIP1、VIP2、VIP3またはVIP3A等の殺虫タンパク；線虫由来の殺虫タンパク；さそり毒素、クモ毒素、ハチ毒素または昆虫特異的神経毒素等動物によって産生される毒素；糸条菌類毒素；植物レクチン；アグルチニン；トリプシン阻害剤、セリンプロテアーゼ阻害剤、パタチン、シスタチン、パパイン阻害剤等のプロテアーゼ阻害剤；リシン、トウモロコシ - RIP、アブリン、ルフィン、サポリン、ブリオジン等のリボゾーム不活性化タンパク（RIP）；3 - ヒドロキシステロイドオキシダーゼ、エクジステロイド - UDP - グルコシルトランスフェラーゼ、コレステロールオキシダーゼ等のステロイド代謝酵素；エクダイソン阻害剤；HMG-CoAリダクターゼ；ナトリウムチャンネル、カルシウムチャンネル阻害剤等のイオンチャンネル阻害剤；幼若ホルモンエステラーゼ；利尿ホルモン受容体；スチルベンシンターゼ

；ピベンジルシンターゼ；キチナーゼ；グルカナーゼ等が挙げられる。

また、このような遺伝子組換え作物で発現される毒素として、Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1またはCry9C等の - エンドトキシタンパク、VIP1、VIP2、VIP3またはVIP3A等の殺虫タンパクのハイブリッド毒素、一部を欠損した毒素、修飾された毒素も含まれる。

ハイブリッド毒素は、組換え技術を用いて、これらタンパクの異なるドメインの新しい組み合わせによって作り出される。

一部を欠損した毒素としては、アミノ酸配列の一部を欠損したCry1Abが知られている。

修飾された毒素は、天然型の毒素のアミノ酸の1つまたは複数が置換されている。

これら毒素の例およびこれら毒素を合成することができる組換え植物は、EP-A-0 374 753、WO 93/07278、WO 95/34656、EP-A-0 427 529、EP-A-451 878、WO 03/052073等に記載されている。

これらの組換え植物に含まれる毒素は、特に、甲虫目害虫、双翅目害虫、鱗翅目害虫への耐性を植物へ付与する。

【0461】

また、1つもしくは複数の殺虫性の害虫抵抗性遺伝子を含み、1つまたは複数の毒素を発現する遺伝子組換え植物は既に知られており、いくつかのものは市販されている。

これら遺伝子組換え植物の例として、YieldGard（登録商標）（Cry1Ab毒素を発現するトウモロコシ品種）、YieldGard Rootworm（登録商標）（Cry3Bb1毒素を発現するトウモロコシ品種）、YieldGard Plus（登録商標）（Cry1AbとCry3Bb1毒素を発現するトウモロコシ品種）、Herculex I（登録商標）（Cry1Fa2毒素とグルホシネートへの耐性を付与する為にホスフィノトリシン N - アサチルトランスフェラーゼ（PAT）を発現するトウモロコシ品種）、NuCOTN33B（登録商標）（Cry1Ac毒素を発現するワタ品種）、Bollgard I（登録商標）（Cry1Ac毒素を発現するワタ品種）、Bollgard II（登録商標）（Cry1AcとCry2Ab毒素とを発現するワタ品種）、VIPCOT（登録商標）（VIP毒素を発現するワタ品種）、NewLeaf（登録商標）（Cry3A毒素を発現するジャガイモ品種）、NatureGard（登録商標）Agrisure（登録商標）GT Advantage（GA21 グリホサート耐性形質）、Agrisure（登録商標）CB Advantage（Bt11コーンローラー（CB）形質）、Protecta（登録商標）等が挙げられる。

【0462】

上記「作物」とは、遺伝子組換え技術を用いて、選択的な作用を有する抗病原性物質を産生する能力を付与されたものも含まれる。

抗病原性物質の例として、PRタンパク等が知られている（PRPs、EP-A-0 392 225）。このような抗病原性物質とそれを産生する遺伝子組換え植物は、EP-A-0 392 225、WO 95/33 818、EP-A-0 353 191等に記載されている。

こうした遺伝子組換え植物で発現される抗病原性物質の例として、例えば、ナトリウムチャンネル阻害剤、カルシウムチャンネル阻害剤（ウイルスが産生するKP1、KP4、KP6毒素等が知られている。）等のイオンチャンネル阻害剤；スチルベンシンターゼ；ピベンジルシンターゼ；キチナーゼ；グルカナーゼ；PRタンパク；ペプチド抗生物質、ヘテロ環を有する抗生物質、植物病害抵抗性に関与するタンパク因子（植物病害抵抗性遺伝子と呼ばれ、WO 03/000906に記載されている。）等の微生物が産生する抗病原性物質等が挙げられる。

【0463】

本発明の有害生物防除剤には、例えば、他種の殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤、除草剤、植物ホルモン剤、植物成長調節物質等の有害生物防除剤等（異性体およびその塩を含む）あるいは、共力剤、薬害軽減剤、色素、肥料、土壌改良剤、動物用飼料等を含有していてもよい。

【0464】

また、本発明化合物と、例えば、他種の殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤または殺菌剤、植物ホルモン剤、植物成長調節物質、除草剤等の有害生物防除剤等（異性体およびその塩を含む）あるいは、共力剤、薬害軽減剤、色素、肥料、土壌改良剤、動物用飼料等とを配合

10

20

30

40

50

し、適宜混合製剤を作製して、散布処理、土壌処理および水耕液処理に使用することも可能である。

【 0 4 6 5 】

上記の他種の殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤、除草剤、植物ホルモン剤、植物成長調節剤等の有害生物防除剤等（異性体およびその塩を含む）、あるいは、共力剤、薬害軽減剤の有効成分としては、例えば、以下のものが挙げられる。

【 0 4 6 6 】

殺虫剤としては、例えば、

（ 1 ）有機リン系化合物

アセフェート（acephate）、りん化アルミニウム（Aluminium phosphide）、ブタチオホス（butathiofos）、キャドサホス（cadusafos）、クロロエトキシホス（chlorethoxyfos）、クロルフエンピンホス（chlorfenvinphos）、クロルピリホス（chlorpyrifos）、クロルピリホスメチル（chlorpyrifos-methyl）、シアノホス（cyanophos：CYAP）、ダイアジノン（diazinon）、D C I P（dichlorodiisopropyl ether）、ジクロフェンチオン（dichlofenthion：ECP）、ジクロロボス（dichlorvos：DDVP）、ジメトエート（dimethoate）、ジメチルピンホス（dimethylvinphos）、ジスルホトン（disulfoton）、EPN、エチオン（ethion）、エトプロホス（ethoprophos）、エトリムホス（etrimfos）、フェンチオン（fenthion：MPP）、フェントロチオン（fenitrothion：MEP）、ホスチアゼート（fosthiazate）、ホルモチオン（formothion）、りん化水素（Hydrogen phosphide）、イソフェンホス（isofenphos）、イソキサチオン（isoxathion）、馬拉チオン（malathion）、メスルフェンホス（mesulfenfos）、メチダチオン（methidathion：DMTP）、モノクロトホス（monocrotophos）、ナレド（naled：BRP）、オキシデプロホス（oxydeprofos：ESP）、パラチオン（parathion）、ホサロン（phosalone）、ホスメット（phosmet：PM P）、ピリミホスメチル（pirimiphos-methyl）、ピリダフェンチオン（pyridafenthion）、キナルホス（quinalphos）、フェントエート（phenthoate：PAP）、プロフェノホス（profenofos）、プロパホス（propaphos）、プロチオホス（prothiofos）、ピラクロホス（pyraclofos）、サリチオン（salithion）、スルプロホス（sulprofos）、テブピリムホス（tebupirimfos）、テムホス（temephos）、テトラクロルフエンピンホス（tetrachlorvinphos）、テルブホス（terbufos）、チオメトン（thiometon）、トリクロロホン（trichlorphon：DEP）、バミドチオン（vamidothion）等、

【 0 4 6 7 】

（ 2 ）カーバメート系化合物

アラニカルブ（alanycarb）、ベンダイオカルブ（bendiocarb）、ベンフラカルブ（benfuracarb）、BPMC、カルバリル（carbaryl）、カルボフラン（carbofuran）、カルボスルファン（carbosulfan）、クロエトカルブ（cloethocarb）、エチオフエンカルブ（ethiofencarb）、フェノブカルブ（fenobucarb）、フェノチオカルブ（fenothiocarb）、フェノキシカルブ（fenoxycarb）、フラチオカルブ（furathiocarb）、イソプロカルブ（isoproc carb：MIPC）、メトルカルブ（metolcarb）、メソミル（methomyl）、メチオカルブ（methiocarb）、NAC、オキサミル（oxamyl）、ピリミカーブ（pirimicarb）、プロボキスル（propoxur：PHC）、XMC、チオジカルブ（thiodicarb）、キシリルカルブ（xylylcarb）等、

【 0 4 6 8 】

（ 3 ）合成ピレスロイド系化合物

アクリナトリン（acrinathrin）、アレスリン（allethrin）、ベンフルスリン（benfluthrin）、ベータ - シフルトリン（beta-cyfluthrin）、ビフェントリン（bifenthrin）、シクロプロトリン（cycloprothrin）、シフルトリン（cyfluthrin）、シハロトリン（cyhalothrin）、シペルメトリン（cypermethrin）、デルタメトリン（deltamethrin）、エスフェンバレレート（esfenvalerate）、エトフェンプロックス（ethofenprox）、フェンプロパトリン（fenpropathrin）、フェンバレレート（fenvalerate）、フルシトリネート（flucythrinate）、フルフェンプロックス（flufenoprox）、フルメスリン（flumethrin）

)、フルバリネート (fluvalinate)、ハルフェンプロックス (halfenprox)、イミプロトリン (imiprothrin)、ペルメトリン (permethrin)、プラレトリン (prallethrin)、ピレトリン (pyrethrins)、レスメトリン (resmethrin)、シグマ - サイパーメスリン (sigma-cypermethrin)、シラフルオフェン (silaflluofen)、テフルトリン (tefluthrin)、トラロメトリン (tralomethrin)、トランスフルトリン (transfluthrin)、2, 3, 5, 6 - テトラフルオロ - 4 - (メトキシメチル) ベンジル (E Z) - (1 R S, 3 R S; 1 R S, 3 S R) - 2, 2 - ジメチル - 3 - プロプ - 1 - エニルシクロプロパンカルボキシレート、2, 3, 5, 6 - テトラフルオロ - 4 - メチルベンジル (E Z) - (1 R S, 3 R S; 1 R S, 3 S R) - 2, 2 - ジメチル - 3 - プロプ - 1 - エニルシクロプロパンカルボキシレート、2, 3, 5, 6 - テトラフルオロ - 4 - (メトキシメチル) ベンジル (1 R S, 3 R S; 1 R S, 3 S R) - 2, 2 - ジメチル - 3 - (2 - メチル - 1 - プロペニル) シクロプロパンカルボキシレート等、

10

【0469】

(4) ネライストキシン系化合物

カルタップ (cartap)、ベンスルタップ (bensultap)、チオシクラム (thiocyclam)、モノスルタップ (monosultap)、ビスルタップ (bisultap) 等、

【0470】

(5) ネオニコチノイド系化合物

イミダクロプリド (imidacloprid)、ニテンピラム (nitenpyram)、アセタミプリド (acetamiprid)、チアメトキサム (thiamethoxam)、チアクロプリド (thiacloprid)、ジノテフラン (dinotefuran)、クロチアニジン (clothianidin) 等、

20

【0471】

(6) ベンゾイル尿素系化合物

クロルフルアズロン (chlorfluazuron)、ビストリフルロン (bistrifluron)、ジアフェンチウロン (diafenthiuron)、ジフルベンズロン (diflubenzuron)、フルアズロン (fluazuron)、フルシクロクスロン (flucycloxuron)、フルフェノクスロン (flufenoxuron)、ヘキサフルムロン (hexaflumuron)、ルフエヌロン (lufenuron)、ノバルロン (nivaluron)、ノビフルムロン (noviflumuron)、テフルベンズロン (teflubenzuron)、トリフルムロン (triflumuron) 等、

【0472】

30

(7) フェニルピラゾール系化合物

アセトプロール (acetoprole)、エチプロール (ethiprole)、フィプロニル (fipronil)、バニリプロール (vaniliprole)、ピリプロール (pyriprole)、ピラフルプロール (pyrafluprole) 等、

【0473】

(8) Bt トキシン系殺虫剤

バチルス・チューリンゲンシス菌由来の生芽胞および産生結晶毒素、並びにそれらの混合物、

【0474】

(9) ヒドラジン系化合物

40

クロマフェノジド (chromafenozide)、ハロフェノジド (halofenozide)、メトキシフェノジド (methoxyfenozide)、テブフェノジド (tebufenozide) 等、

【0475】

(10) 有機塩素系化合物

アルドリン (aldrin)、ディルドリン (dieldrin)、ジエノクロル (dienochlor)、エンドスルファン (endosulfan)、メトキシクロル (methoxychlor) 等、

【0476】

(11) 天然系殺虫剤

マシン油 (machine oil)、硫酸ニコチン (nicotine-sulfate) 等、

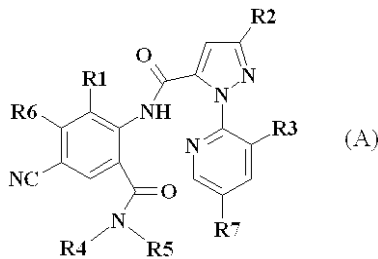
【0477】

50

(1 2) その他の殺虫剤

アベルメクチン (avermectin-B)、プロモプロピレート (bromopropylate)、ブプロフェジン (buprofezin)、クロルフェナピル (chlorphenapyr)、シロマジン (cyromazine)、D - D (1, 3-Dichloropropene)、エマメクチンベンゾエート (emamectin-benzoate)、フェナザキン (fenazaquin)、フルピラゾホス (flupyrzofos)、ハイドロブレン (hydroprene)、インドキサカルブ (indoxacarb)、メトキサジアゾン (metoxadiazon)、ミルベマイシン A (milbemycin-A)、ピメトロジン (pymetrozine)、ピリダリル (pyridalyl)、ピリプロキシフェン (pyriproxyfen)、スピノサッド (spinosad)、スルフラミド (sulfluramid)、トルフェンピラド (tolfenpyrad)、トリアゼメイト (triazamate)、フルベンジアミド (flubendiamide)、S I - 0 0 0 9、シフルメトフェン (cyflumetofen)、亜ひ酸 (Arsenic acid)、ベンクロチアズ (benclothiaz)、石灰窒素 (Calcium cyanamide)、石灰硫黄合剤 (Calcium polysulfide)、クロルデン (chlordane)、D D T、D S P、フルフェネリウム (flufenimer)、フロニックアミド (flonicamid)、フルリムフェン (flurimfen)、ホルメタネート (formetanate)、メタム・アンモニウム (metam-ammonium)、メタム・ナトリウム (metam-sodium)、臭化メチル (Methyl bromide)、ニディノテフラン (nidinotefuran)、オレイン酸カリウム (Potassium oleate)、プロトリフェンビュート (protrifenbute)、スピロメシフェン (spiromesifen)、硫黄 (Sulfur)、メタフルミゾン (metaflumizone)、スピロテトラマト (spirotetramat)、N N I - 0 1 0 1、S - 1 9 4 7、クロラントラニリプロール (chlorantraniliprole)、下記式 (A)

式 (A) :



「式中、

R1は、Me、Cl、BrまたはF、

R2は、F、Cl、Br、C1 - C4 ハロアルキル、またはC1 - C4 ハロアルコキシ、

R3は、F、ClまたはBr、

R4は、H、1個またはそれ以上のハロゲン原子；CN；SMe；S(O)Me；S(O)₂Me およびOMe で置換されていてもよいC1 - C4 アルキル、C3 - C4 アルケニル、C3 - C4 アルキニル、または、C3 - C5 シクロアルキル、

R5は、HまたはMe、

R6は、H、FまたはCl、

R7は、H、FまたはClを表す。」

で示される化合物等が挙げられる。

【 0 4 7 8 】

殺ダニ剤 (殺ダニ活性成分) としては、例えば、

アセキノシル (acequinocyl)、アミトラズ (amitraz)、ベンゾキシメート (benzoximate)、ビフェナゼート (bifenazate)、フェニソプロモレート (bromopropylate)、キノメチオネート (chinomethionate)、クロルベンジレート (chlorobenzilate)、C P C B S (chlorfenson)、クロフェンテジン (clofentezine)、ケルセン (ジコホル : dicofol)、エトキサゾール (etoxazole)、酸化フェンブタスズ (fenbutatin oxide)、フェノチオカルブ (fenothiocarb)、フェンピロキシメート (fenpyroximate)、フルアクリピリム (fluacrypyrim)、フルプロキシフェン (fluproxyfen)、ヘキシチアゾクス (hexythiazox)、プロパルギット (propargite : BPPS)、ポリナクチン複合体 (polynactins)、ピリダベン (pyridaben)、ピリミジフェン (Pyrimidifen)、テブフェンピラド (te

bufenpyrad)、テトラジホン(tetradifon)、スピロディクロフェン(spirodiclofen)、アミドフルメット(amidoflumet)、ピフェナゼート(Bifenazate)、シフルメトフェン(Cyflumetofen)等が挙げられ、

【0479】

殺線虫剤(殺線虫活性成分)としては、例えば、

D C I P、フォスチアゼート(fosthiazate)、塩酸レバミゾール(levamisol)、メチルイソチオシアネート(methyisothiocyanate)、酒石酸モランテル(morantel tartarate)等が挙げられる。

【0480】

殺菌剤としては、例えば、

アシベンゾラル-S-メチル(acibenzolar-S-methyl)、アンバム(amobam)、アムプロピルホス(ampropylfos)、アニラジン(anilazine)、アゾキシストロビン(azoxystrobin)、ベナラキシル(benalaxyl)、ベノダニル(benodanil)、ベノミル(benomyl)、ベンチアバリカルブ(benthiavalicarb)、ベンチアゾール(benthiazole)、ベソキサジン(bethoxazin)、ビテルタノール(bitertanol)、ブラストサイジン-S(blastidyn-S)、ボルドー液(Bordeaux mixture)、ボスカリド(boscalid)、ブロムコナゾール(bromuconazole)、ブチオベート(buthiobate)、次亜塩素酸カルシウム(Calcium hypochlorite)、石灰硫黄合剤(Calcium polysulfide)、キャプタン(captan)、カルベンダゾール(carbendazol)、カルボキシシン(carboxin)、カルプロパミド(carpropamid)、クロベンチアゾン(chlobenthiazole)、クロロネブ(chloroneb)、クロルピクリン(chloropicrin)、クロロタロニル(chlorothalonil: TPN)、クロルチオホス(chlorthiophos)、桂皮アルデヒド(Cinnamaldehyde)、クロジラコン(clozylacon)、C N A (2,6-Dichloro-4-nitroaniline)、水酸化第二銅(Copper hydroxide)、硫酸銅(Copper sulfate)、シアゾファミド(cyazofamid)、シフルフェンアミド(cyfluphenamid)、シモキサニル(cymoxanil)、シプロコナゾール(cyproconazole)、シプロジニル(cyprodinil)、シプロフラム(cyprofuram)、ダゾメット(dazomet)、デバカルブ(debacarb)、ジクロフルアニド(dichlofluanid)、D-D(1,3-Dichloropropene)、ジクロシメット(diclocymet)、ジクロメジン(diclomezine)、ジエトフェンカルブ(diethofencarb)、ジフェノコナゾール(difenoconazole)、ジフルメトリム(diflumetorim)、ジメフルアゾール(dimefluazole)、ジメチリモール(dimethirimol)、ジメトモルフ(dimethomorph)、ジニコナゾール・M(diniconazole-M)、ジノカップ(dinocap)、エジフェンホス(edifenphos)、エポキシコナゾール(epoxiconazole)、ジメチルジチオカルバミン酸ニッケル、エタコナゾール(etaconazole)、エタボキサム(ethaboxam)、エチリモル(ethirimol)、エトリジアゾール(etridiazole)、ファミキサドン(famoxadone)、フェナミドン(fenamidone)、フェナリモル(fenarimol)、フェンブコナゾール(fenbuconazole)、フェンダゾスラム(Fendazosulam)、フェンヘキサミド(fenhexamid)、フェノキサニル(fenoxanil)、フェンピクロニル(fenpiclonil)、フェンプロピジン(fenpropidin)、フェンプロピモルフ(fenpropimorph)、フェンチアゾン(fentiazon)、水酸化トリフェニルスズ(fentin hydroxide)、フェリムゾン(ferimzone)、フルアジナム(fluazinam)、フルジオキサニル(fludioxonil)、フルメトバー(flumetover)、フルモルフ(flumorph)、フルオリミド(fluoroimide)、フルオトリマゾール(fluotrimazole)、フルオキサストロビン(fluxastrobin)、フルキンコナゾール(fluquinconazole)、フルシラゾール(flusilazole)、フルスルファミド(flusulfamide)、フルトラニル(flutolanil)、フルトリアホル(flutriafol)、ホセチル(fosetyl-Al)、フサライド(fthalide)、フベリダゾール(fuberidazole)、フララキシル(furalaxyl)、フラメトピル(furametpyr)、フルカルバニル(furcarbanil)、フルコナゾール-シス(furconazole-cis)、ヘキサコナゾール(hexaconazole)、ヒメキサゾール(hymexazol)、I B P (IBP)、イマザリル(imazalil)、イミベンコナゾール(imibenconazole)、イミノクタジン・アルベシル酸塩(iminoctadine-albesilate)、イミノクタジン酢酸塩(iminoctadine-triacetate)、ヨードカルブ(iodocarb)、イブコナゾール(i

10

20

30

40

50

pconazole)、イプロジオン (iprodione)、イプロバリカルブ (iprovalicarb)、イソプロチオラン (isoprothiolane)、カスガマイシン (kasugamycin)、クレソキシム・メチル (kresoxim-methyl)、マンコゼブ (mancozeb)、マンネブ (maneb)、メパニピリム (mepanipirim)、メプロニル (mepronil)、メタラキシル (metalaxyl)、メタラキシル・M (metalaxyl-M)、メタム・ナトリウム (metam-sodium)、メタスルホカルブ (methasulfocarb)、臭化メチル (Methyl bromide)、メトコナゾール (metconazole)、メトフロキサム (methfuroxam)、メトミノストロビン (metominostrobin)、メトラフェノン (metrafenone)、メトスルホバックス (metsulfobax)、ミルディオマイシン (mildiomycin)、ミルネブ (milneb)、ミクロブタニル (myclobutanil)、ミクロゾリン (myclozolin)、ナーバム (nabam)、オリスastrobin (orysastrobin)、オフレース (ofurace)、オキサジキシル (oxadixyl)、オキシロニック酸 (oxolinic acid)、オキシポコナゾール (oxpoconazole)、オキシカルボキシ (oxycarboxin)、オキシテトラサイクリン (oxytetracycline)、ペフラゾエート (pefurazoate)、ペンコナゾール (penconazole)、ペンシクロン (pencycuron)、ピコキシストロビン (picoxystrobin)、ポリカーバメート (polycarbamate)、ポリオキシ (polyoxin)、炭酸水素カリウム (Potassium hydrogen carbonate)、プロベナゾール (probenazole)、プロクロラズ (prochloraz)、プロシミドン (procymidone)、プロパモカルブ塩酸塩 (propamocarb-hydrochloride)、プロピコナゾール (propiconazole)、プロピネブ (propineb)、プロキナジド (proquinazid)、プロチオカーブ (prothiocarb)、プロチオコナゾール (prothioconazole)、ピラカルボリド (pyracarbolid)、ピラクロストロビン (pyraclostrobin)、ピラゾホス (pyrazophos)、ピリブチカルブ (pyributicarb)、ピリフェノックス (pyrifenoxy)、ピリメタニル (pyrimethanil)、ピロキロン (pyroquilon)、キノキシフェン (quinoxifen)、キントゼン (quintozene: PCNB)、シルチオフアーム (silthiopham)、シメコナゾール (simeconazole)、シブコナゾール (sipconazole)、炭酸水素ナトリウム (Sodium bicarbonate)、次亜塩素酸ナトリウム (sodium hypochlorite)、スピロキサミン (spiroxamine)、SSF-129 ((E)-2-[2-(2,5-dimethylphenoxy)methyl]phenyl)-2-methoxyimino-N-methylacetamide)、ストレプトマイシン (streptomycin)、硫黄 (Sulfur)、テブコナゾール (tebuconazole)、テクロフタラム (tecloftalam)、テトラコナゾール (tetraconazole)、チアベンダゾール (thiabendazole)、チアジニル (thiadinil)、チウラム (thiram: TMTD)、チフルザミド (thifluzamide)、チオフアナートメチル (thiophanate-methyl)、トルクロホス・メチル (tolclofos-methyl)、TPN (TPN)、トリアジメホン (triadimefon)、トリアジメノール (triadimenol)、トリアゾキシド (triazoxide)、トリクラミド (triclamide)、トリシクラゾール (tricyclazole)、トリデモルフ (tridemorph)、トリフルミゾール (triflumizole)、トリフロキシストロビン (trifloxystrobin)、トリホリン (triforine)、トリチコナゾール (triticonazole)、バリダマイシン (validamycin)、ビンクロゾリン (vinclozolin)、ビニコナゾール (viniconazole)、ジネブ (zineb)、ジラム (ziram)、ゾキサミド (zoxamide) が挙げられ、

【0481】

除草剤、植物ホルモン剤、植物成長調節剤としては、例えば、

アブシジン酸 (Absciscic acid)、アセトクロール (aceto-chlor)、アシフルオルフェン (acifluorfen-sodium)、アラクロール (alachlor)、アロキシジム (aloxymidim)、アメトリン (ametryn)、アミカルバゾン (amicarbazone)、アミドスルフロ (amidosulfuron)、アミノエトキシビニルグリシン (aminoethoxyvinylglycine)、アミノピラリド (aminopyralid)、AC94, 377、アミプロホスメチル (amiprofos-methyl)、アンシミドール (ancymidol)、アシュラム (asulam)、アトラジン (atrazine)、アビグリシン (aviglycine)、アジスルフロ (azimsulfuron)、ベフルブタミド (beflubutamid)、ベンフルラリン (benfluralin)、ベンフレセート (benfuresate)、ベンスルフロ・メチル (bensulfuron-methyl)、ベンスリド (bensulide: SAP)、ベントゾン (bentazone)、ベンチオカーブ (benthiocarb)、ベンザミゾール (benzamidazole)、ベンズフェン

10

20

30

40

50

ディゾン (benzfendizone)、ベンゾピシクロン (benzobicyclon)、ベンゾフェナップ (benzofenap)、ベンジルアデニン (benzyl adenine)、ベンジルアミノプリン (benzylaminopurine)、ビアラホス (bialaphos)、ピフェノックス (bifenox)、ブラシノライド (Brassinolide)、プロマシル (bromacil)、プロモブチド (bromobutide)、ブタクロール (butachlor)、ブタフェナシル (butafenacil)、ブタミホス (butamifos)、ブチレート (butylate)、カフェンストロール (cafenstrole)、炭酸カルシウム (Calcium carbonate)、過酸化カルシウム (Calcium peroxide)、カルバリル (carbaryl)、クロメトキシニル (chlomethoxynil)、クロリダゾン (chloridazon)、クロリムロン・エチル (chlorimuron-ethyl)、クロルフタリム (chlorphthalim)、クロルプロファム (chlorpropham)、クロルスルフロン (chlorsulfuron)、クロルタル・ジメチル (chlorthal-dimethyl)、クロルチアミド (chlorthiamid: DCBN)、塩化コリン (choline chloride)、シニドンエチル (cinidon-ethyl)、シンメチリン (cinmethylin)、シノスルフロン (cinosulfuron)、クレトジム (clethodim)、クロメプロップ (clomeprop)、クロキシホナック (cloxyfonac-sodium)、クロルメコート (chlormequat chloride)、4 - C P A (4-chlorophenoxyacetic acid)、クロプロップ (cliprop)、クロフェンセット (clofence t)、クミルロン (cumyluron)、シアナジン (cyanazine)、シクラニリド (cyclanilide)、シクロスルファムロン (cyclosulfamron)、シハロホップ・ブチル (cyhalofop-butyl)、2, 4 - D 塩 (2, 4-Dichlorophenoxyacetic acid salts)、ジクロルプロップ (dichlorprop: 2, 4-DP)、ダイムロン (daimuron)、ダラポン (dalapon: DPA)、ジメテンアミド-P (dimethenamid-P)、ダミノジット (daminozide)、ダゾメット (dazomet)、デシルアルコール (n-Decyl alcohol)、ジカンバ (dicamba-sodium: MDBA)、ジクロベニル (dichlobenil: DBN)、ジフルフェニカン (diflufenican)、ジケグラック (dikegularac)、ジメピペレート (dimepiperate)、ジメタメトリン (dimethametryn)、ジメテナミド (dimethenamid)、ジクワット (diquat)、ジチオピル (dithiopyr)、ジウロン (diuron)、エンドタル (endothal)、エポコレオン (epocholeone)、エスプロカルブ (esprocarb)、エテホン (ethephon)、エチジムロン (ethidimuron)、エトキシスルフロン (ethoxysulfuron)、エチクロゼート (ethychlozate)、エトベンザニド (etobenzanid)、フェナリモル (fenarimol)、フェノキサプロップ・エチル (fenoxaprop-ethyl)、フェントラザミド (fentrazamide)、フラザスルフロン (flazasulfuron)、フロラスラム (florasulam)、フルアジホップ (fluazifop-butyl)、フルアゾレート (fluazolate)、フルカルバゾン (flucarbazone)、フルフェナセット (flufenacet)、フルフェンピル (flufenpyr)、フルメトラリン (flumetralin)、フルミオキサジン (flumioxazin)、フルプロパネート・ナトリウム (flupropanate-sodium)、フルピルスルフロン・メチル・ナトリウム (flupyrsulfuron-methyl-sodium)、フルルプリミドール (flurprimidol)、フルチアセット・メチル (fluthiacet-methyl)、フォラムスルフロン (foramsulfuron)、ホルクロルフェニユロン (forchlorfenuron)、ホメサフェン (formesafen)、ジベレリン (gibberellin)、グルホシネート (glufosinate)、グリホサート (glyphosate)、ハロスルフロン・メチル (halosulfuron-methyl)、ヘキサジノン (hexazinone)、イマザモックス (imazamox)、イマザピック (imazapic)、イマザビル (imazapyr)、イマザキン (imazaquin)、イマゾスルフロン (imazosulfuron)、イナベンフィド (inabenzifide)、インドール酢酸 (Indole acetic acid: IAA)、インドール酪酸 (Indole butyric acid)、ヨードスルフロン (iodosulfuron)、アイオキシニル (ioxynil-octanoate)、イソウロン (isouron)、イソオキサクロロトール (isoxachlortole)、イソオキサディフェン (isoxadifen)、カルブチレート (karbutilate)、ラクトフェン (lactofen)、レナシル (lenacil)、リニュロン (linuron)、L G C - 4 2 1 5 3 (LGC-42153)、マレイン酸ヒドラジド (Maleic hydrazide)、メコプロップ (mecoprop: MCPP)、M C P 塩 (2-Methyl-4-chlorophenoxyacetic acid salts)、M C P A ・チオエチル (MCPA-thioethyl)、M C P B (2-Methyl-4-chlorophenoxybutanoic acid ethyl ester)、メフェナセット (mefenacet)、メフルイジド (mefluidide)、メピコート (mepiquat)、メソスルフロン (mesosulfuron)、メソトリオン (mesotrione)、メチルダイムロン (methyl d

10

20

30

40

50

aimuron)、メタミホップ (metamifop)、メトラクロール (metolachlor)、メトリブジン (metribuzin)、メトスルフロン・メチル (metsulfuron-methyl)、モリネート (molinate)、ナフタリン酢酸 (naphthylacetic acid)、N A D (1-naphthaleneacetamide)、ナプロアニリド (naproanilide)、ナプロパミド (napropamide)、デシルアルコール (n-decyl alcohol)、ニコスルフロン (nicosulfuron)、フェニルフタルアミド酸 (n-phenylphthalamic acid)、オルベンカルブ (orbencarb)、オキサジアゾン (oxadiazon)、オキサジクロメホン (oxaziclomefone)、オキシシ硫酸塩 (oxine-sulfate)、パクロブトラゾール (paclobutrazol)、パラコート (paraquat)、ペラルゴン酸 (Pelargonic acid)、ペンディメタリン (pendimethalin)、ペノックスラム (penoxsulam)、ペントキサゾン (pentoxazone)、ペトキサミド (pethoxamide)、フェンメディファム (phenmedipham)、ピクロラム (picloram)、ピコリナフェン (picolinafen)、ピペロニルブトキシド (piperonyl butoxide)、ピペロホス (piperophos)、プレチラクロール (pretilachlor)、プリミスルフロン (primisulfuron-methyl)、プロカルバゾン (procarbazon)、プロジアミン (prodiamine)、プロフルアゾール (profluazol)、プロフォキシディム (profoxydim)、プロヘキサジオン・カルシウム (prohexadione-calcium)、プロハイドロジャスモン (prohydrojasmon)、プロメトリン (prometryn)、プロパニル (propanil)、プロボキシカルバゾン (propoxycarbazon)、プロピザミド (propyzamide)、ピラクロニル (pyraclonil)、ピラフルフェン・エチル (pyraflufen-ethyl)、ピラゾレート (pyrazolate)、ピラズスルフロン・エチル (pyrazosulfuron-ethyl)、ピラゾキシフェン (pyrazoxyfen)、ピリベンゾキシム (pyribenzoxim)、ピリブチカルブ (pyributicarb)、ピリダフォール (pyridafol)、ピリデート (pyridate)、ピリフタリド (pyriftalid)、ピリミノバック・メチル (pyriminobac-methyl)、ピリチオバック (pyrithiobac)、キンクロラック (quiclorac)、キノクラミン (quinoclamine)、キザロホップ・エチル (quizalofop-ethyl)、リムスルフロン (rimsulfuron)、セトキシジム (sethoxydim)、シデュロン (siduron)、シマジン (simazine)、シメトリン (simetryn)、塩素酸ナトリウム (Sodium chlorate)、スルホスルフロン (sulfosulfuron)、スエップ (sweep : MCC)、テブチウロン (tebuthiuron)、テブラロキシディム (tepraloxym)、ターバシル (terbacil)、テルブカルブ (terbucarb : MBPMC)、テニルクロール (thenylchlor)、チアザフルロン (thiazafurion)、チジアズロン (ティジアズロン)、チフェンスルフロン・メチル (thifensulfuron-methyl)、トリアジフラム (triaziflam)、トリブフォス (tribufos)、トリクロピル (triclopyr)、トリジファン (tridiphane)、トリフロキシスルフロン (trifloxysulfuron)、トリフルラリン (trifluralin)、トリネキサバック・エチル (trinexapac-ethyl)、トリトスルフロン (tritosulfuron)、ユニコナゾール・P (uniconazole-P)、バーナレート (vemolate : PPTC) が挙げられる。

【 0 4 8 2 】

共力剤としては、例えば、

ピペロニル ブトキサイド (piperonyl butoxide)、セサメックス (sesamex)、N - (2 - エチルヘキシル) - 8 , 9 , 1 0 - トリノルボルン - 5 - エン - 2 , 3 - ジカルボキシイミド (MGK 264)、W A R F - アンチレジスタント (WARF-antiresistant)、ジエチルマレエート (diethylmaleate) が挙げられる。

【 0 4 8 3 】

薬害軽減剤としては、例えば、

ベノキサノール (benoxacor)、クロキントセト - メキシル (cloquintocet-mexyl)、シオメトリニル (cyometrinil)、ダイムロン (daimuron)、ジクロルミド (dichlormid)、フェンクロラゾール - エチル (fenchlorazole-ethyl)、フェンクロリム (fencloirim)、フルラゾール (flurazole)、フルフェニム (fluxofenim)、フリラゾール (furilazole)、メフェンピル - ジエチル (mefenpyr-diethyl)、MG191、無水ナフタル酸 (naphthalic anhydride)、オキサベトリニル (oxabetrinil) が挙げられる。

【 0 4 8 4 】

以下、製造例、製剤例、試験例等により本発明をさらに詳しく説明するが、本発明はこ

これらの例に限定されるものではない。

【0485】

まず、本発明化合物の製造例を示す。

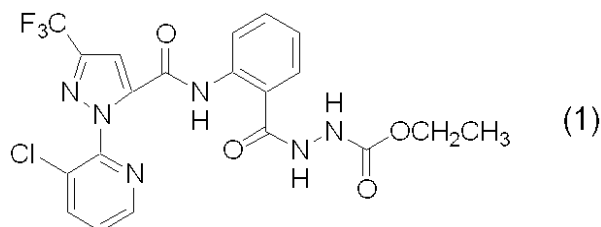
【0486】

製造例 1

N - (2 - アミノベンゾイル) - N ' - エトキシカルボニルヒドラジン 0 . 2 2 g 、 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボニルクロライド 0 . 3 1 g およびピリジン 1 0 m l を混合し、該混合物を室温で 2 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、析出した沈殿を濾取することにより、本発明化合物 (1) 0 . 1 3 g を得た。

10

本発明化合物 (1)



^1H - NMR (CDCl_3 , TMS) (ppm) : 1 . 3 5 (3 H , t , $J = 8 \text{ Hz}$) , 4 . 2 9 (2 H , q , $J = 8 \text{ Hz}$) , 6 . 8 5 (1 H , b r s) , 7 . 1 0 (1 H , t , $J = 8 \text{ Hz}$) , 7 . 2 4 (1 H , s) , 7 . 4 4 (1 H , t , $J = 8 \text{ Hz}$) , 7 . 4 7 (1 H , d d , $J = 8 \text{ Hz}$, 4 Hz) , 7 . 6 2 (1 H , d , $J = 8 \text{ Hz}$) , 7 . 9 3 (1 H , d , $J = 4 \text{ Hz}$) , 8 . 4 2 (1 H , b r s) , 8 . 4 6 (1 H , d , $J = 8 \text{ Hz}$) , 8 . 5 2 (1 H , d , $J = 8 \text{ Hz}$) , 1 1 . 8 6 (1 H , b r s)

20

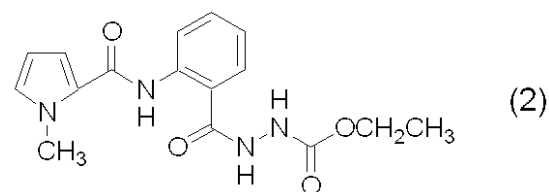
【0487】

製造例 2

1 - メチル - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸 0 . 1 3 g 、 塩化チオニル 0 . 1 5 g およびヘキサン 5 m l を混合し、該混合物を 2 時間加熱還流した。反応混合物を減圧下濃縮して、1 - メチル - 1 H - ピロール - 2 - カルボニルクロライド 0 . 1 4 g を得た。得られた 1 - メチル - 1 H - ピロール - 2 - カルボニルクロライド 0 . 1 4 g を、N - (2 - アミノベンゾイル) - N ' - エトキシカルボニルヒドラジン 0 . 2 2 g とピリジン 1 0 m l との混合物に加え、該混合物を室温で 2 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、析出した沈殿を濾取することにより、本発明化合物 (2) 0 . 1 1 g を得た。

30

本発明化合物 (2)



^1H - NMR ($\text{DMSO}-d_6$, TMS) (ppm) : 1 . 0 2 - 1 . 2 8 (3 H , m) , 3 . 9 1 (3 H , s) , 4 . 0 0 - 4 . 1 6 (2 H , m) , 6 . 1 3 (1 H , d , $J = 4 \text{ Hz}$) , 6 . 7 8 (1 H , d , $J = 4 \text{ Hz}$) , 7 . 0 6 (1 H , m) , 7 . 1 5 (1 H , t , $J = 8 \text{ Hz}$) , 7 . 5 6 (1 H , t , $J = 8 \text{ Hz}$) , 7 . 7 9 (1 H , d , $J = 8 \text{ Hz}$) , 8 . 5 7 (1 H , d , $J = 8 \text{ Hz}$) , 9 . 3 0 (1 H , b r s) , 1 0 . 5 7 (1 H , b r s) , 1 1 . 6 3 (1 H , b r s)

40

【0488】

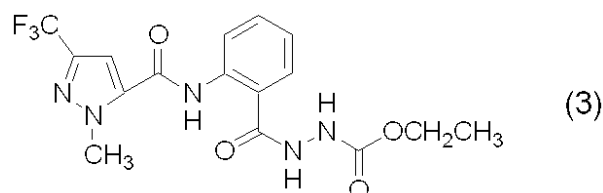
製造例 3

1 - メチル - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボン酸 0 . 1 9 g 、 塩化チオニル 0 . 1 5 g およびヘキサン 5 m l を混合し、該混合物を 2 時間加熱還流し

50

た。反応混合物を減圧下濃縮して、1 - メチル - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボニルクロライド 0.14 g を得た。得られた 1 - メチル - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボニルクロライド 0.14 g を、N - (2 - アミノベンゾイル) - N' - エトキシカルボニルヒドラジン 0.22 g とピリジン 10 ml との混合物に加え、該混合物を室温で 2 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、析出した沈殿を濾取することにより、本発明化合物 (3) 0.23 g を得た。

本発明化合物 (3)



10

^1H - NMR (DMSO - d_6 , TMS) (ppm): 1.20 (3H, t, $J = 8\text{ Hz}$), 4.10 (2H, q, $J = 8\text{ Hz}$), 4.19 (3H, s), 7.17 (1H, s), 7.28 (1H, t, $J = 8\text{ Hz}$), 7.60 (1H, t, $J = 8\text{ Hz}$), 7.79 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.37 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 9.02 (1H, brs), 10.41 (1H, brs), 11.50 (1H, brs)

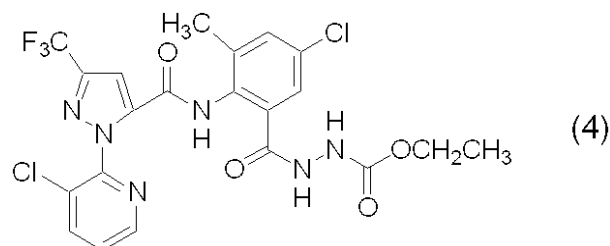
【0489】

製造例 4

20

N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド 0.22 g、クロロギ酸エチル 0.06 g およびピリジン 10 ml を混合し、該混合物を室温で 2 時間攪拌した。反応液に水を注加し、析出した沈殿を濾取することにより、本発明化合物 (4) 0.08 g を得た。

本発明化合物 (4)



30

^1H - NMR (DMSO - d_6 , TMS) (ppm): 0.96 - 1.26 (3H, m), 2.16 (3H, s), 3.90 - 4.12 (2H, m), 7.38 (1H, s), 7.55 (1H, s), 7.66 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 4 Hz), 7.71 (1H, s), 8.22 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.53 (1H, d, $J = 4\text{ Hz}$), 9.25 (1H, brs), 10.14 (1H, brs), 10.37 (1H, brs)

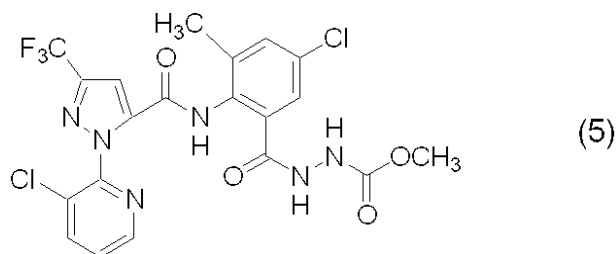
【0490】

製造例 5

40

N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド 0.22 g、クロロギ酸メチル 0.05 g およびピリジン 10 ml を混合し、該混合物を室温で 2 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、析出した沈殿を濾取することにより、本発明化合物 (5) 0.16 g を得た。

本発明化合物 (5)



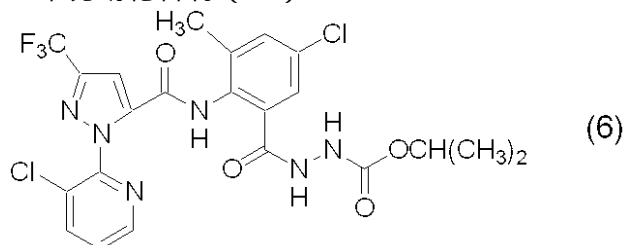
^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 2.16 (3H, s), 3.62 (3H, s), 7.39 (1H, s), 7.56 (1H, s), 7.67 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 4 Hz), 7.70 (1H, s), 8.22 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.54 (1H, d, $J = 4\text{ Hz}$), 9.31 (1H, br s), 10.17 (1H, br s), 10.38 (1H, br s)

【0491】

製造例 6

N-[4-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド 0.22 g、クロロギ酸 イソプロピル 0.05 g およびピリジン 10 ml を混合し、該混合物を室温で2時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、析出した沈殿を濾取することにより、本発明化合物(6) 0.21 g を得た。

本発明化合物(6)



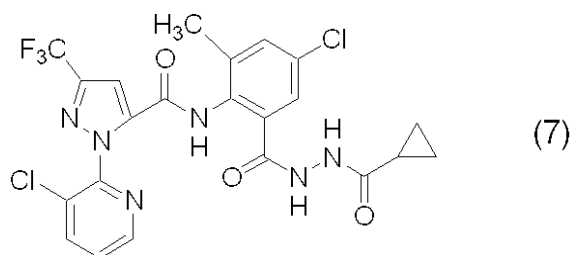
^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 0.97 - 1.31 (6H, m), 2.16 (3H, s), 4.68 - 4.89 (1H, m), 7.38 (1H, s), 7.55 (1H, s), 7.66 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 4 Hz), 7.71 (1H, s), 8.22 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.53 (1H, d, $J = 4\text{ Hz}$), 9.18 (1H, br s), 10.12 (1H, br s), 10.37 (1H, br s)

【0492】

製造例 7

N-[4-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド 0.22 g、シクロプロパンカルボニルクロリド 0.05 g およびピリジン 10 ml を混合し、該混合物を室温で2時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、析出した沈殿を濾取することにより、本発明化合物(7) 0.20 g を得た。

本発明化合物(7)



^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 0.57 - 0.82 (4H, m), 1.63 - 1.73 (1H, m), 2.16 (3H, s), 7.43 (1H, s), 7.54 (1H, s), 7.66 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 4 Hz), 7.74 (1H, s)

s), 8.22 (1H, d, J = 8 Hz), 8.53 (1H, d, J = 4 Hz), 10.19 (1H, brs), 10.40 (1H, brs)

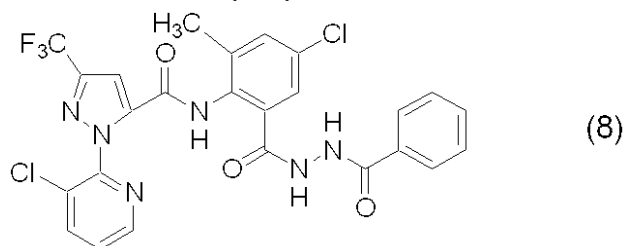
【0493】

製造例 8

N-[4-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド 0.22 g、ベンゾイルクロリド 0.07 g およびピリジン 10 ml を混合し、該混合物を室温で 2 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、析出した沈殿を濾取することにより、本発明化合物(8) 0.15 g を得た。

本発明化合物(8)

10



$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 2.18 (3H, s), 7.48 - 7.69 (5H, m), 7.77 (1H, s), 7.90 - 7.96 (3H, m), 8.22 (1H, d, J = 8 Hz), 8.55 (1H, d, J = 4 Hz), 10.36 (1H, brs), 10.42 (1H, brs), 10.60 (1H, brs)

20

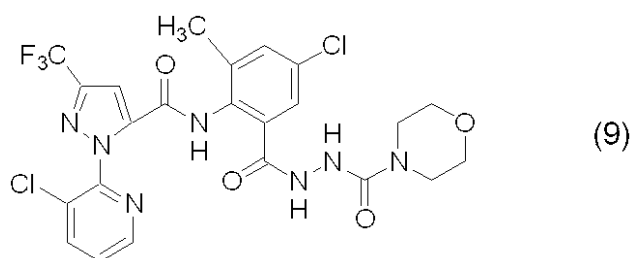
【0494】

製造例 9

N-[4-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド 0.22 g、4-モルホリンカルボニルクロライド 0.07 g およびピリジン 10 ml を混合し、該混合物を室温で 2 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、析出した沈殿を濾取することにより、本発明化合物(9) 0.12 g を得た。

本発明化合物(9)

30



$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 2.15 (3H, s), 3.22 - 3.42 (4H, m), 3.53 - 3.63 (4H, m), 7.44 (1H, s), 7.53 (1H, s), 7.66 (1H, dd, J = 8 Hz, 4 Hz), 7.77 (1H, s), 8.22 (1H, d, J = 8 Hz), 8.54 (1H, d, J = 4 Hz), 8.78 (1H, brs), 9.88 (1H, brs), 10.33 (1H, brs)

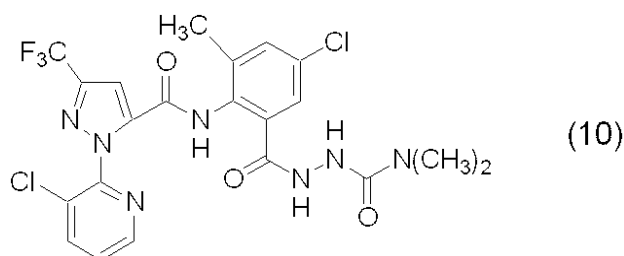
40

【0495】

製造例 10

N-[4-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド 0.22 g、N,N-ジメチルカルバモイルクロライド 0.06 g およびピリジン 10 ml を混合し、該混合物を室温で 2 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、析出した沈殿を濾取することにより、本発明化合物(10) 0.13 g を得た。

本発明化合物(10)



^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 2.14 (3H, s), 2.86 (6H, s), 7.42 (1H, s), 7.52 (1H, s), 7.67 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 4 Hz), 7.82 (1H, s), 8.22 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.48 - 8.58 (2H, m), 9.83 (1H, brs), 10.31 (1H, brs)

10

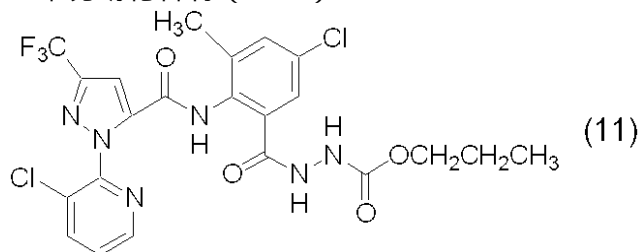
【0496】

製造例 11

N-[4-chloro-2-((3-chloro-2-pyridinyl)-3-(trifluoromethyl)-1H-pyrazol-5-yl)carbamoyl]-6-methylphenyl]-1-((3-chloro-2-pyridinyl)-3-(trifluoromethyl)-1H-pyrazol-5-yl)carbamoylhydrazide 0.22 g、クロロギ酸 n-プロピル 0.06 g およびピリジン 10 ml を混合し、該混合物を室温で 2 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、析出した沈殿を濾取することにより、本発明化合物 (11) 0.24 g を得た。

本発明化合物 (11)

20



^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 0.66 - 0.98 (3H, m), 1.37 - 1.66 (2H, m), 2.16 (3H, s), 3.83 - 4.08 (2H, m), 7.38 (1H, s), 7.55 (1H, s), 7.66 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 4 Hz), 7.71 (1H, s), 8.22 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.53 (1H, d, $J = 4\text{ Hz}$), 9.26 (1H, brs), 10.14 (1H, brs), 10.37 (1H, brs)

30

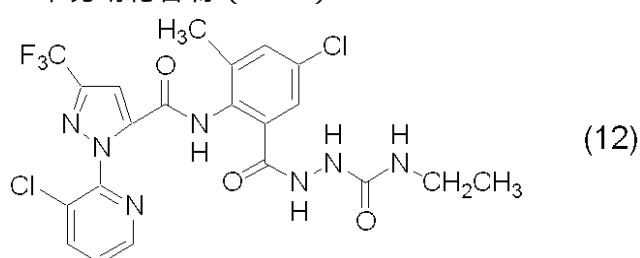
【0497】

製造例 12

N-[4-chloro-2-((3-chloro-2-pyridinyl)-3-(trifluoromethyl)-1H-pyrazol-5-yl)carbamoyl]-6-methylphenyl]-1-((3-chloro-2-pyridinyl)-3-(trifluoromethyl)-1H-pyrazol-5-yl)carbamoylhydrazide 0.22 g、エチルイソシアナート 0.05 g およびテトラヒドロフラン 10 ml を混合し、該混合物を室温で 2 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、析出した沈殿を濾取することにより、本発明化合物 (12) 0.16 g を得た。

40

本発明化合物 (12)



^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 1.12 (3H, t, $J = 6\text{ Hz}$), 2.18 (3H, s), 3.78 (2H, q, $J = 6\text{ Hz}$), 6.34 (1H, m)

50

, 7.48 (1H, s), 7.54 (1H, s), 7.65 - 7.69 (2H, m), 7.74 (1H, brs), 8.23 (1H, d, J = 8 Hz), 8.54 (1H, d, J = 4 Hz), 9.99 (1H, brs), 10.34 (1H, brs)

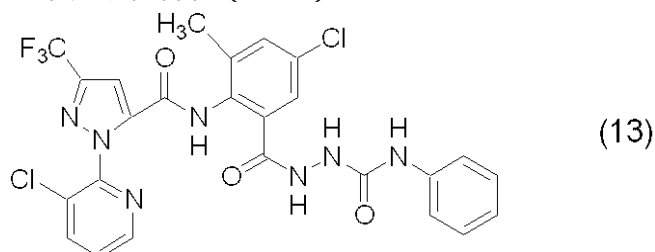
【0498】

製造例13

N-[4-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド 0.22g、フェニルイソシアナート 0.07g およびテトラヒドロフラン 10ml を混合し、該混合物を室温で2時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、析出した沈殿を濾取することにより、本発明化合物(13) 0.12g を得た。

10

本発明化合物(13)



¹H-NMR (DMSO-d₆, TMS) (ppm): 2.18 (3H, s), 6.93 - 7.00 (2H, m), 7.21 - 7.31 (2H, m), 7.40 - 7.47 (2H, m), 7.51 (1H, s), 7.54 - 7.58 (1H, m), 7.66 (1H, d, J = 8 Hz, 4 Hz), 7.71 (1H, s), 8.22 (1H, d, J = 8 Hz), 8.53 (1H, d, J = 4 Hz), 8.73 (1H, brs), 10.18 (1H, brs), 10.40 (1H, brs)

20

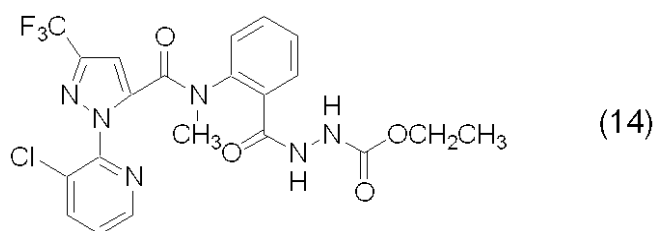
【0499】

製造例14

N-(2-メチルアミノベンゾイル)-N'-エトキシカルボニルヒドラジン 0.24g、1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-カルボニルクロライド 0.31g およびピリジン 10ml を混合し、該混合物を室温で2時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、析出した沈殿を濾取することにより、本発明化合物(14) 0.20g を得た。

30

本発明化合物(14)



¹H-NMR (DMSO-d₆, TMS) (ppm): 1.06 - 1.27 (3H, m), 3.18 (3H, s), 4.01 - 4.16 (2H, m), 6.34 (1H, s), 7.31 - 7.37 (1H, m), 7.53 - 7.61 (3H, m), 7.71 (1H, d, J = 8 Hz, 4 Hz), 8.31 (1H, d, J = 8 Hz), 8.62 (1H, d, J = 4 Hz), 9.33 (1H, brs), 10.44 (1H, brs)

40

【0500】

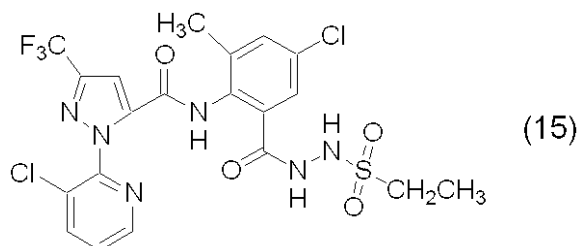
製造例15

N-[4-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド 0.22g、エタンスルホニルクロライド 0.05g およびピリジン 10ml を混合し、該混合物を室温で2時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、析出した沈殿を濾

50

取することにより、本発明化合物(15)0.14gを得た。

本発明化合物(15)



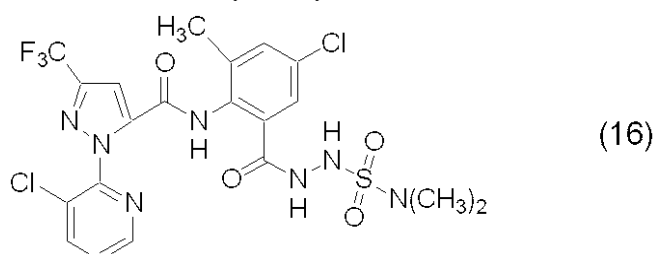
$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 1.20 (3H, t, $J = 8\text{ Hz}$), 2.18 (3H, s), 3.02 (2H, q, $J = 8\text{ Hz}$), 7.39 (1H, s), 7.57 (1H, s), 7.66 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 4 Hz), 7.68 (1H, s), 8.22 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.53 (1H, d, $J = 4\text{ Hz}$), 9.95 (1H, brs), 10.41 (1H, brs), 10.57 (1H, brs)

【0501】

製造例16

N-[4-chloro-2-((3-chloro-2-pyridinyl)-3-(trifluoromethyl)-1H-pyrazol-5-yl)carbamoyl]-6-methylphenyl]-1-((3-chloro-2-pyridinyl)-3-(trifluoromethyl)-1H-pyrazol-5-yl)carbamoylhydrazine 0.22g, N,N-dimethylsulfamoylchloride 0.05gおよびピリジン10mLを混合し、該混合物を室温で2時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、析出した沈殿を濾取することにより、本発明化合物(16)0.14gを得た。

本発明化合物(16)



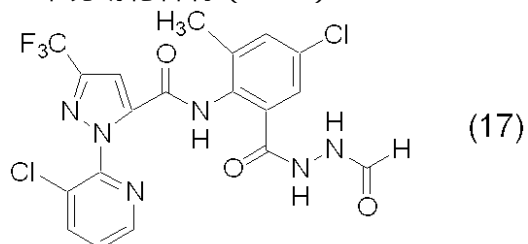
$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 2.16 (3H, s), 2.71 (6H, s), 7.28 (1H, s), 7.57 (1H, s), 7.66 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 4 Hz), 7.75 (1H, s), 8.22 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.53 (1H, d, $J = 4\text{ Hz}$), 9.31 (1H, brs), 10.42 (1H, brs), 10.51 (1H, brs)

【0502】

製造例17

N-[4-chloro-2-((3-chloro-2-pyridinyl)-3-(trifluoromethyl)-1H-pyrazol-5-yl)carbamoyl]-6-methylphenyl]-1-((3-chloro-2-pyridinyl)-3-(trifluoromethyl)-1H-pyrazol-5-yl)carbamoylhydrazine 0.22g, ギ酸10mLおよび無水酢酸5mLを氷冷下で混合し、該混合物を室温で2時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、析出した沈殿を濾取することにより、本発明化合物(17)0.02gを得た。

本発明化合物(17)



$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 2.16 (3H, s), 7.43

(1 H , s) , 7 . 5 6 (1 H , s) , 7 . 6 6 (1 H , d d , J = 8 H z , 4 H z) , 7 . 7 3 (1 H , s) , 8 . 0 5 (1 H , s) , 8 . 2 2 (1 H , d , J = 8 H z) , 8 . 5 3 (1 H , d , J = 4 H z) , 1 0 . 1 3 (1 H , b r s) , 1 0 . 3 9 (1 H , b r s) , 1 0 . 4 6 (1 H , b r s)

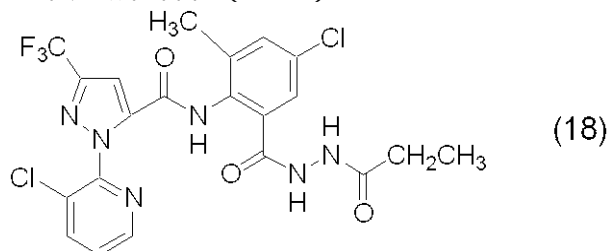
【 0 5 0 3 】

製造例 1 8

N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド 0 . 2 2 g 、 プロピオニルクロライド 0 . 0 5 g およびピリジン 1 0 m l を混合し、該混合物を室温で 2 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、析出した沈殿を濾取することにより、本発明化合物 (1 8) 0 . 1 5 g を得た。

10

本発明化合物 (1 8)



¹H - NMR (DMSO - d₆ , TMS) (ppm) : 1 . 0 4 (3 H , t , J = 8 H z) , 2 . 1 3 (5 H , m) , 7 . 4 4 (1 H , s) , 7 . 5 5 (1 H , s) , 7 . 6 6 (1 H , d d , J = 8 H z , 4 H z) , 7 . 7 4 (1 H , s) , 8 . 2 2 (1 H , d , J = 8 H z) , 8 . 5 4 (1 H , d , J = 4 H z) , 9 . 9 1 (1 H , b r s) , 1 0 . 1 6 (1 H , b r s) , 1 0 . 3 6 (1 H , b r s)

20

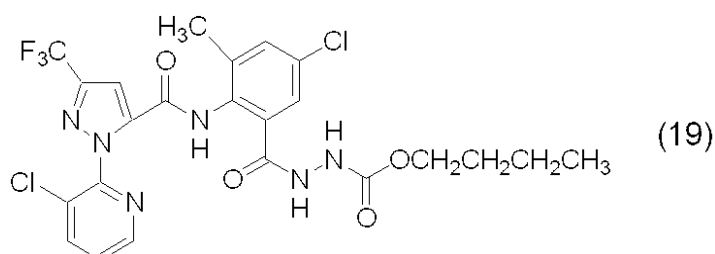
【 0 5 0 4 】

製造例 1 9

N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド 0 . 2 2 g 、 クロロギ酸 n - ブチル 0 . 0 5 g およびピリジン 1 0 m l を混合し、該混合物を室温で 2 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、析出した沈殿を濾取することにより、本発明化合物 (1 9) 0 . 1 9 g を得た。

30

本発明化合物 (1 9)



¹H - NMR (DMSO - d₆ , TMS) (ppm) : 0 . 7 9 - 0 . 9 4 (3 H , m) , 1 . 2 2 - 1 . 4 0 (2 H , m) , 1 . 4 6 - 1 . 6 2 (2 H , m) , 2 . 1 7 (3 H , s) , 3 . 9 2 - 4 . 1 3 (2 H , m) , 7 . 3 7 (1 H , s) , 7 . 5 6 (1 H , s) , 7 . 6 6 (1 H , d d , J = 8 H z , 4 H z) , 7 . 7 0 (1 H , s) , 8 . 2 2 (1 H , d , J = 8 H z) , 8 . 5 3 (1 H , d , J = 4 H z) , 9 . 2 5 (1 H , b r s) , 1 0 . 1 4 (1 H , b r s) , 1 0 . 3 7 (1 H , b r s)

40

【 0 5 0 5 】

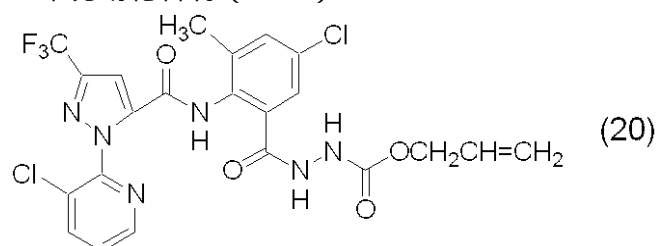
製造例 2 0

N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド 0 . 2 2 g 、 クロロギ酸アリル 0 . 0 5 g およびピリジン 1 0 m l を混合し、該

50

混合物を室温で2時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、析出した沈殿を濾取することにより、本発明化合物(20)0.23gを得た。

本発明化合物(20)



10

^1H -NMR(DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 2.16(3H, s), 4.43-4.60(2H, m), 5.21(1H, d, J = 6 Hz), 5.33(1H, d, J = 8 Hz), 5.86-6.00(1H, m), 7.39(1H, s), 7.56(1H, s), 7.66(1H, dd, J = 8 Hz, 4 Hz), 7.70(1H, s), 8.22(1H, d, J = 8 Hz), 8.54(1H, d, J = 4 Hz), 9.39(1H, brs), 10.18(1H, brs), 10.38(1H, brs)

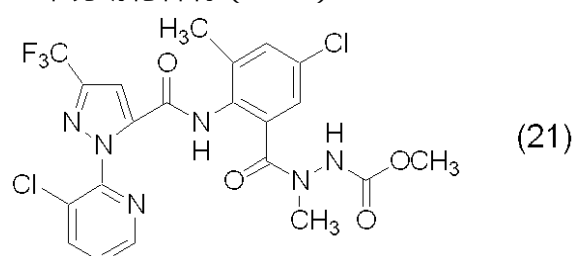
【0506】

製造例21

N-[4-クロロ-2-(N-メチルヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド0.22g、クロロギ酸メチル0.05gおよびピリジン10mlを混合し、該混合物を室温で2時間攪拌した。反応液に水を注加し、析出した沈殿を濾取し、本発明化合物(21)0.09gを得た。

20

本発明化合物(21)



30

^1H -NMR(DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 2.11(3H, s), 3.06(3H, s), 3.33(3H, s), 7.07(1H, s), 7.45(1H, s), 7.68(1H, s), 7.69(1H, dd, J = 8 Hz, 4 Hz), 8.24(1H, d, J = 8 Hz), 8.55(1H, d, J = 4 Hz), 9.11(0.6H, brs), 10.20(1H, brs), 10.54(0.4H, brs)

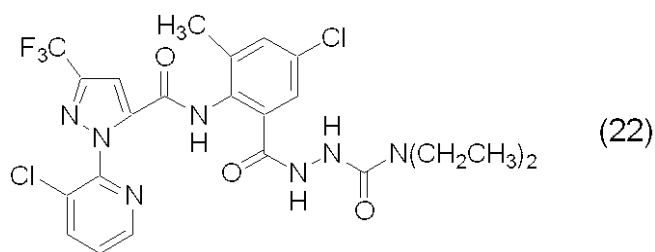
【0507】

製造例22

N-[4-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド0.22g、N,N-ジエチルカルバモイルクロライド0.05gおよびピリジン10mlを混合し、該混合物を室温で2時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、析出した沈殿を濾取することにより、本発明化合物(22)0.19gを得た。

40

本発明化合物(22)



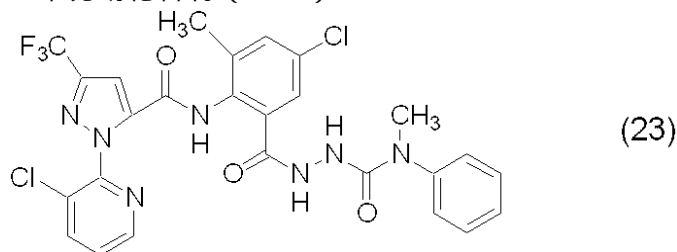
^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 1.06 (6H, t, $J = 6\text{ Hz}$), 2.14 (3H, s), 3.26 (4H, q, $J = 6\text{ Hz}$), 7.42 (1H, s), 7.52 (1H, s), 7.68 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 4 Hz), 7.82 (1H, s), 8.23 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.48 (1H, brs), 8.53 (1H, d, $J = 4\text{ Hz}$), 9.84 (1H, brs), 10.35 (1H, brs)

【0508】

製造例 23

N-[4-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド 0.22 g、N-メチル-N-フェニルカルバモイルクロライド 0.10 g およびピリジン 10 ml を混合し、該混合物を室温で2時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、析出した沈殿を濾取することにより、本発明化合物(23) 0.19 g を得た。

本発明化合物(23)



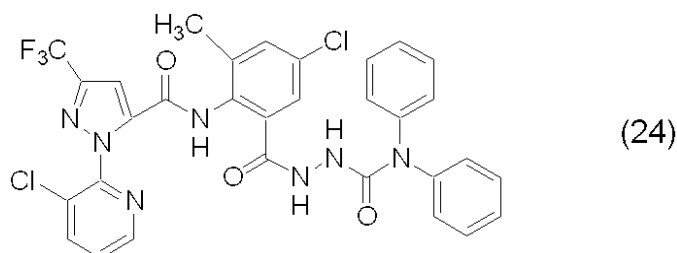
^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 2.15 (3H, s), 3.08 (3H, s), 7.10 - 7.45 (6H, m), 7.53 (1H, s), 7.66 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 4 Hz), 7.76 (1H, s), 8.14 (1H, brs), 8.20 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.50 (1H, d, $J = 4\text{ Hz}$), 9.97 (1H, brs), 10.32 (1H, brs)

【0509】

製造例 24

N-[4-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド 0.22 g、N,N-ジフェニルカルバモイルクロライド 0.15 g およびピリジン 10 ml を混合し、該混合物を室温で2時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、析出した沈殿を濾取することにより、本発明化合物(24) 0.24 g を得た。

本発明化合物(24)



^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 2.15 (3H, s), 6.77 (1H, t, $J = 8\text{ Hz}$), 6.81 (1H, t, $J = 8\text{ Hz}$), 7.05 - 7.39 (9H, m), 7.52 (1H, s), 7.64 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 4 Hz), 7

. 72 (1H, s), 8.13 (1H, brs), 8.19 (1H, d, J = 8 Hz), 8.47 (1H, d, J = 4 Hz), 10.08 (1H, brs), 10.34 (1H, brs)

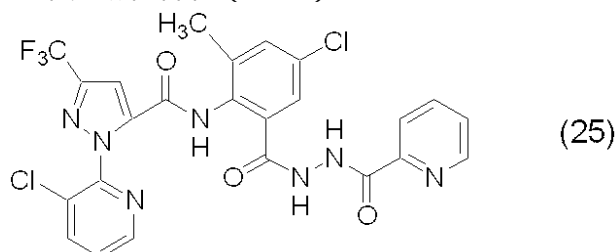
【0510】

製造例 25

N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド 0.22 g、ピコリノイルクロライド塩酸塩 0.07 g およびピリジン 10 ml を混合し、該混合物を室温で 2 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、析出した沈殿を濾取することにより、本発明化合物 (25) 0.16 g を得た。

10

本発明化合物 (25)



^1H - NMR (DMSO - d_6 , TMS) (ppm) : 2.18 (3H, s), 7.50 - 7.59 (2H, m), 7.63 - 7.71 (3H, m), 7.77 - 7.88 (1H, m), 8.05 (1H, s), 8.06 (1H, s), 8.23 (1H, d, J = 8 Hz), 8.54 (1H, d, J = 4 Hz), 8.70 (1H, d, J = 4 Hz), 10.35 - 10.70 (2H, m)

20

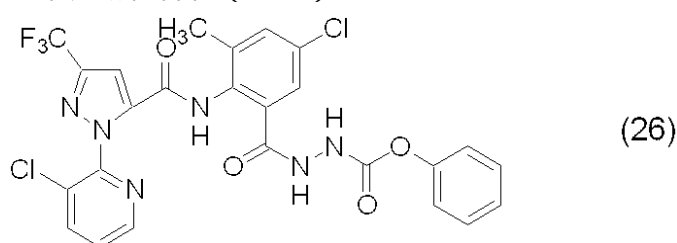
【0511】

製造例 26

N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド 0.22 g、クロロギ酸フェニル 0.07 g およびピリジン 10 ml を混合し、該混合物を室温で 2 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、析出した沈殿を濾取することにより、フェニル本発明化合物 (26) 0.16 g を得た。

30

本発明化合物 (26)



^1H - NMR (DMSO - d_6 , TMS) (ppm) : 2.17 (3H, s), 7.13 - 7.69 (9H, m), 8.22 (1H, d, J = 8 Hz), 8.53 (1H, d, J = 4 Hz), 9.95 (1H, brs), 10.43 (1H, brs), 10.45 (1H, brs)

40

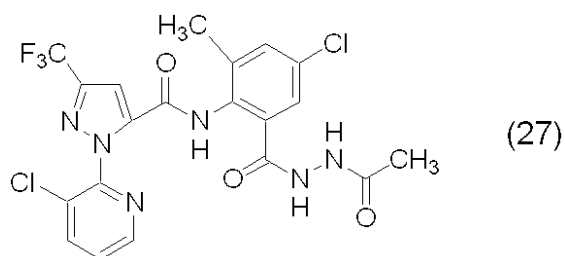
【0512】

製造例 27

N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド 0.22 g、アセチルクロライド 0.04 g およびピリジン 10 ml を混合し、該混合物を室温で 2 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、析出した沈殿を濾取することにより、本発明化合物 (27) 0.22 g を得た。

本発明化合物 (27)

50



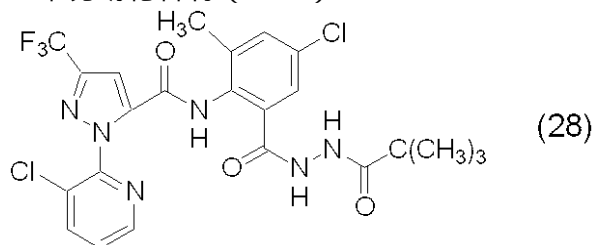
¹H - NMR (DMSO - d₆, TMS) (ppm): 1.89 (3H, s), 2.16 (3H, s), 7.44 (1H, s), 7.55 (1H, s), 7.66 (1H, dd, J = 8 Hz, 4 Hz), 7.73 (1H, s), 8.21 (1H, d, J = 8 Hz), 8.54 (1H, d, J = 4 Hz), 9.94 (1H, br s), 10.17 (1H, br s), 10.38 (1H, br s)

【0513】

製造例 28

N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド 0.22 g、トリメチルアセチルクロライド 0.06 g およびピリジン 10 ml を混合し、該混合物を室温で 2 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、析出した沈殿を濾取することにより、本発明化合物 (28) 0.25 g を得た。

本発明化合物 (28)

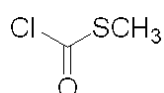


¹H - NMR (DMSO - d₆, TMS) (ppm): 1.17 (9H, s), 2.15 (3H, s), 7.46 (1H, s), 7.54 (1H, s), 7.66 (1H, dd, J = 8 Hz, 4 Hz), 7.76 (1H, s), 8.23 (1H, d, J = 8 Hz), 8.54 (1H, d, J = 4 Hz), 9.66 (1H, br s), 10.01 (1H, br s), 10.32 (1H, br s)

【0514】

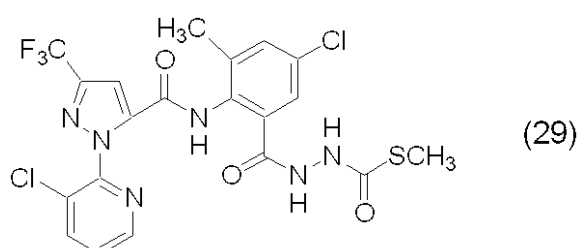
製造例 29

N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド 0.22 g、メチル クロロチオールホルメート



0.05 g およびピリジン 10 ml を混合し、室温で 2 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、析出した沈殿を濾取することにより、本発明化合物 (29) 0.10 g を得た。

本発明化合物 (29)



10

20

30

40

50

^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 2.03 - 2.34 (6H, m), 7.40 (1H, s), 7.58 (1H, s), 7.66 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 4 Hz), 7.71 (1H, s), 8.22 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.53 (1H, d, $J = 4\text{ Hz}$), 9.84 (1H, brs), 10.41 (1H, brs), 10.56 (1H, brs)

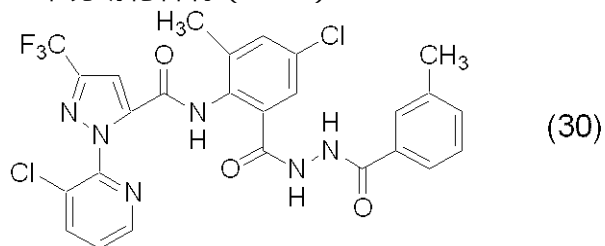
【0515】

製造例 30

N-[4-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド 0.22 g、3-メチルベンゾイルクロリド 0.09 g およびピリジン 10 ml を混合し、該混合物を室温で2時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、析出した沈殿を濾取することにより、本発明化合物(30) 0.19 gを得た。

10

本発明化合物(30)



20

^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 2.18 (3H, s), 2.30 (3H, s), 7.40 (1H, s), 7.55 (1H, s), 7.58 (1H, s), 7.65 - 7.73 (4H, m), 7.77 (1H, s), 8.23 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.54 (1H, d, $J = 4\text{ Hz}$), 10.35 (1H, brs), 10.41 (1H, brs), 10.54 (1H, brs)

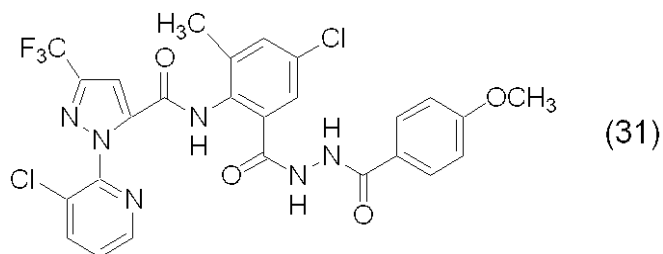
【0516】

製造例 31

N-[4-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド 0.22 g、4-メトキシベンゾイルクロリド 0.09 g およびピリジン 10 ml を混合し、該混合物を室温で2時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、析出した沈殿を濾取することにより、本発明化合物(31) 0.09 gを得た。

30

本発明化合物(31)



40

^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 2.18 (3H, s), 3.83 (3H, s), 7.04 (2H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 7.55 (1H, s), 7.58 (1H, s), 7.69 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 4 Hz), 7.77 (1H, s), 7.90 (2H, d, 8 Hz), 8.23 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.54 (1H, d, $J = 4\text{ Hz}$), 10.28 (1H, brs), 10.41 (1H, brs), 10.45 (1H, brs)

【0517】

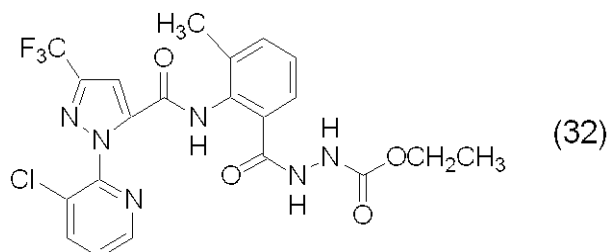
製造例 32

1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-N-[2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メ

50

チルフェニル] - 3 - トリフルオロメチル - 1H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド 0.18 g、クロロギ酸エチル 0.06 ml およびピリジン 1 ml を混合し、該混合物を室温で 2 時間攪拌した。反応混合物に水およびトルエンを順次加え減圧下濃縮した。得られた残渣をメチル tert - ブチルエーテルおよび水と混合してから分液し、得られた有機層を飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、本発明化合物 (32) 0.14 g を得た。

本発明化合物 (32)



10

^1H - NMR (CDCl₃, TMS) (ppm): 1.26 (3H, br m), 2.21 (3H, s), 4.18 (2H, br q, J = 7 Hz), 6.88 (1H, br s), 7.17 (1H, t, J = 8 Hz), 7.28 - 7.39 (4H, m), 7.86 (1H, d, J = 8 Hz), 8.05 (1H, br s), 8.43 (1H, d, J = 4 Hz), 9.73 (1H, br s)

20

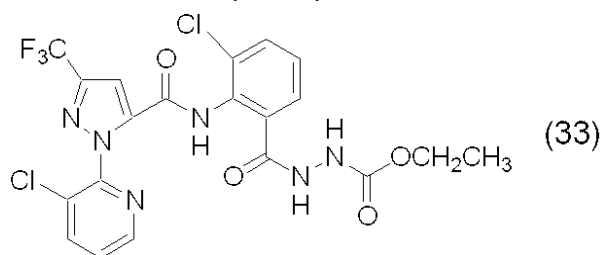
【0518】

製造例 33

N - [2 - クロロ - 6 - (ヒドラジノカルボニル)フェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド 0.21 g、クロロギ酸エチル 0.06 ml およびピリジン 5 ml を混合し、該混合物を室温で 2 時間攪拌した。反応混合物に水を注加した後、メチル tert - ブチルエーテルで 3 回抽出した。有機層を合わせて、2 mol/L - 塩酸、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液および飽和食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、本発明化合物 (33) 0.16 g を得た。

30

本発明化合物 (33)



^1H - NMR (CDCl₃, TMS) (ppm): 1.28 (3H, t, J = 7 Hz), 4.21 (2H, q, J = 7 Hz), 6.76 (1H, br s), 7.23 - 7.30 (2H, m), 7.42 (1H, dd, J = 8 Hz, 4 Hz), 7.50 (1H, d, J = 8 Hz), 7.55 (1H, d, J = 8 Hz), 7.85 (1H, br s), 7.90 (1H, dd, J = 8 Hz, 1 Hz), 8.47 (1H, dd, J = 4 Hz, 1 Hz), 9.16 (1H, br s)

40

【0519】

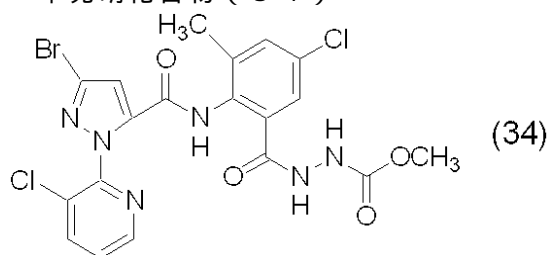
製造例 34

3 - プロモ - N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド 0.30 g、クロロギ酸メチル 0.20 ml、トリエチルアミン 0.09 ml、アセトニトリル 20 ml および N, N - ジメチルホルムアミド 10 ml を混合し、該混合物を室温で 3

50

時間攪拌した。反応混合物に水を注加した後、メチル *tert*-ブチルエーテルで3回抽出した。有機層を合わせて、飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、本発明化合物(34)0.13gを得た。

本発明化合物(34)



10

¹H-NMR (DMSO-d₆) (ppm): 2.14 (3H, s), 3.61 (3H, brs), 7.33 (1H, s), 7.37 (1H, brs), 7.53 (1H, brs), 7.60 (1H, dd, J = 8 Hz, 4 Hz), 8.16 (1H, dd, J = 8 Hz, 1 Hz), 8.49 (1H, dd, J = 4 Hz, 1 Hz), 9.29 (1H, brs), 10.15 (1H, brs), 10.22 (1H, brs)

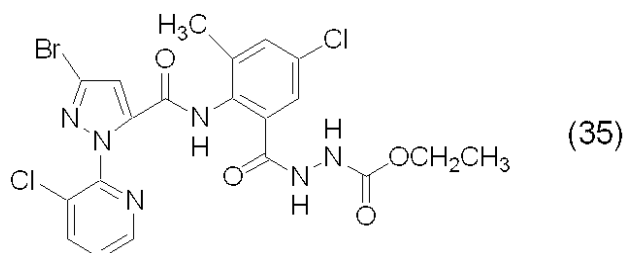
【0520】

製造例35

3-ブromo-N-[4-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド 0.30g、クロロギ酸エチル 0.09ml およびピリジン 3ml を混合し、該混合物を室温で3時間攪拌した後、減圧下濃縮した。得られた残渣に水およびトルエンを加えて濾過し、得られた濾物をメチル *tert*-ブチルエーテルおよび水と混合してから分液した。有機層を飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、本発明化合物(35)0.23gを得た。

20

本発明化合物(35)



30

¹H-NMR (DMSO-d₆) (ppm): 1.18 (3H, brm), 2.14 (3H, s), 4.06 (2H, brm), 7.34 (1H, s), 7.37 (1H, brs), 7.53 (1H, s), 7.60 (1H, dd, J = 8 Hz, 4 Hz), 8.16 (1H, dd, J = 8 Hz, 1 Hz), 8.49 (1H, dd, J = 4 Hz, 1 Hz), 9.24 (1H, brs), 10.12 (1H, brs), 10.21 (1H, brs)

40

【0521】

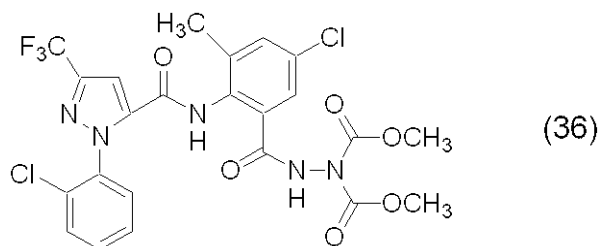
製造例36および37

N-[4-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(2-クロロフェニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド 0.30g をアセトニトリル 10ml に溶解し、クロロギ酸メチル 0.10ml およびトリエチルアミン 0.09ml を加え、該混合物を室温で1時間攪拌した後、該混合物にクロロギ酸メチル 0.10ml を加え、さらに3時間攪拌した。反応混合物に水を注加した後、メチル *tert*-ブチルエーテルで3回抽出した。有機層を合わせて、飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、本発明化合物(36)0.16g および本発明化

50

合物 (3 7) 0 . 1 6 g を得た。

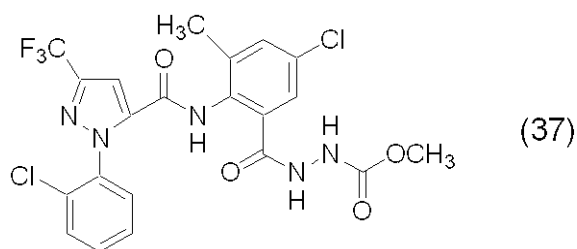
本發明化合物 (3 6)



10

¹H - NMR (CDCl₃, TMS) (ppm): 2.15 (3H, s), 3.76 (6H, s), 7.23 - 7.27 (3H, m), 7.30 - 7.40 (2H, m), 7.43 - 7.47 (2H, m), 8.84 (1H, brs), 9.29 (1H, brs)

本發明化合物 (3 7)



20

¹H - NMR (DMSO - d₆) (ppm) : 2.22 (3H, s), 3.68 (3H, brs), 7.44 (1H, brs), 7.53 - 7.72 (6H, m), 9.35 (1H, brs), 10.23 (1H, brs), 10.32 (1H, brs)

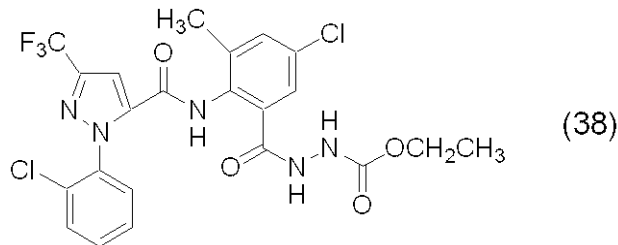
【 0 5 2 2 】

製造例 38

N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (2 - クロロフェニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド 0 . 3 0 g 、 ピリジン 2 m l およびクロロギ酸エチル 0 . 0 9 m l を混合し、該混合物を室温で 1 時間攪拌した後、減圧下濃縮した。得られた残渣に水およびトルエンを加えて濾過した。濾物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、本発明化合物 (3 8) 0 . 2 2 g を得た。

30

本發明化合物 (3 8)



40

¹H - NMR (DMSO - d₆) (ppm) : 1.19 (3H, br m), 2.15 (3H, s), 4.05 (2H, br m), 7.37 (1H, s), 7.49 - 7.66 (6H, m), 9.22 (1H, br s), 10.14 (1H, br s), 10.25 (1H, br s)

【 0 5 2 3 】

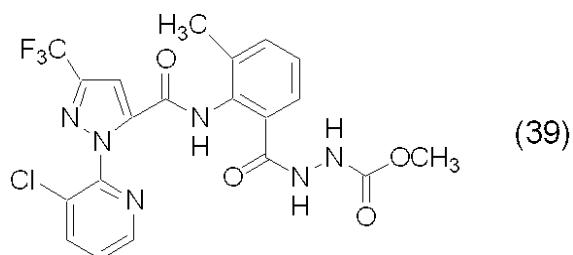
製造例 39

1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - N - [2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド 0 .

50

18 g、クロロギ酸メチル 0.05 ml およびピリジン 1 ml を混合し、該混合物を室温で 2 時間攪拌した。反応混合物に水を注加した後、トルエンを加えて減圧下濃縮した。得られた残渣をメチル tert - ブチルエーテルおよび水と混合してから分液し、有機層を飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、本発明化合物 (39) 0.13 g を得た。

本発明化合物 (39)



10

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) (ppm): 2.22 (3H, s), 3.75 (3H, brs), 6.86 (1H, brs), 7.19 (1H, t, $J = 8\text{ Hz}$), 7.27 (1H, s), 7.34 - 7.40 (3H, m), 7.87 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 1.5 Hz), 7.97 (1H, brs), 8.44 (1H, dd, $J = 4\text{ Hz}$, 1 Hz), 9.68 (1H, brs)

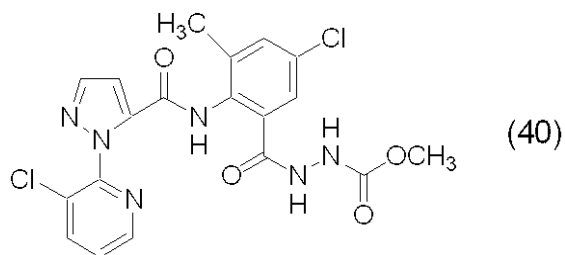
【0524】

20

製造例 40

N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド 0.30 g、クロロギ酸メチル 0.09 ml およびピリジン 3 ml を混合し、該混合物を室温で 1.5 時間攪拌した。反応混合物に水およびトルエンを順次加えて減圧下濃縮した。得られた残渣を酢酸エチルおよび水と混合してから分液し、有機層を飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、本発明化合物 (40) 0.20 g を得た。

本発明化合物 (40)



30

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$) (ppm): 2.17 (3H, s), 3.62 (3H, brs), 7.25 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.40 (1H, brs), 7.52 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.56 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 4 Hz), 7.86 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 8.11 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 1 Hz), 8.48 (1H, dd, $J = 4\text{ Hz}$, 1 Hz), 9.31 (1H, brs), 10.11 (1H, brs), 10.13 (1H, brs)

40

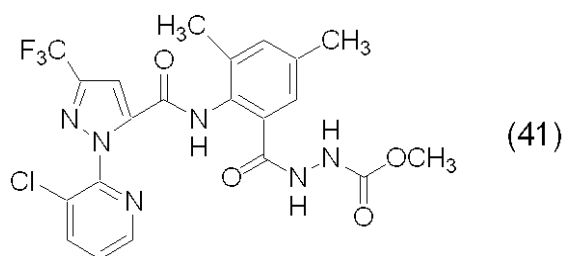
【0525】

製造例 41

N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1H - ピラゾール - 5 - カルボキサミドの代わりに、N - [4, 6 - ジメチル - 2 - (ヒドラジノカルボニル) フェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1H - ピラゾール - 5 - カルボキサミドを用い、製造例 5 と同様の方法で本発明化合物 (41) を得た。

本発明化合物 (41)

50



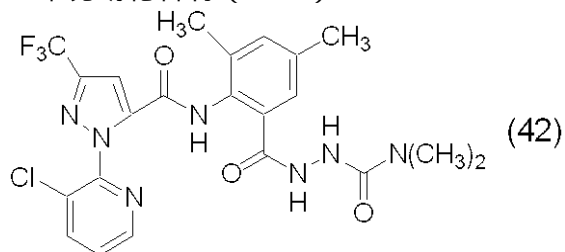
^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 2.11 (3H, s), 2.29 (3H, s), 3.55 - 3.68 (3H, m), 7.19 - 7.25 (2H, m), 7.66 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 4 Hz), 7.71 (1H, s), 8.22 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.53 (1H, d, $J = 4\text{ Hz}$), 9.23 (1H, brs), 9.98 (1H, brs), 10.22 (1H, brs)

【0526】

製造例 42

N-[4-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-カルボキサミドの代わりに、N-[4,6-ジメチル-2-(ヒドラジノカルボニル)フェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-カルボキサミドを用い、製造例10と同様の方法で本発明化合物(42)を得た。

本発明化合物(42)



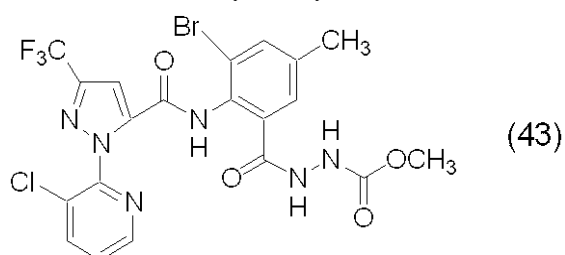
^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 2.13 (3H, s), 2.31 (3H, s), 2.86 (6H, s), 7.14 - 7.27 (2H, m), 7.65 - 7.70 (1H, m), 7.82 (1H, s), 8.23 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.48 (1H, brs), 8.53 (1H, d, $J = 4\text{ Hz}$), 9.65 (1H, brs), 10.16 (1H, brs)

【0527】

製造例 43

N-[4-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-カルボキサミドの代わりに、N-[6-ブロモ-2-(ヒドラジノカルボニル)-4-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-カルボキサミドを用い、製造例5と同様の方法で本発明化合物(43)を得た。

本発明化合物(43)



^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 2.35 (3H, s), 3.53 - 3.65 (3H, m), 7.35 (1H, s), 7.65 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$,

10

20

30

40

50

4 H z) , 7 . 6 8 - 7 . 7 0 (1 H , m) , 7 . 7 6 (1 H , s) , 8 . 2 0 (1 H , d , J = 8 H z) , 8 . 5 3 (1 H , d , J = 4 H z) , 9 . 2 7 (1 H , b r s) , 1 0 . 0 4 (1 H , b r s) , 1 0 . 4 7 (1 H , b r s)

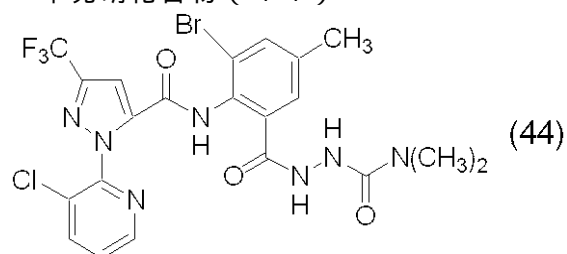
【 0 5 2 8 】

製造例 4 4

N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミドの代わりに、N - [6 - ブロモ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 4 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミドを用い、製造例 1 0 と同様の方法で本発明化合物 (4 4) を得た。

10

本発明化合物 (4 4)



¹ H - NMR (DMSO - d₆ , TMS) (ppm) : 2 . 3 4 (3 H , s) , 2 . 8 4 (6 H , s) , 7 . 4 0 (1 H , s) , 7 . 6 2 - 7 . 7 0 (2 H , m) , 7 . 8 3 (1 H , s) , 8 . 2 0 (1 H , d , J = 8 H z) , 8 . 4 8 (1 H , b r s) , 8 . 5 1 - 8 . 5 6 (1 H , m) , 9 . 6 9 (1 H , b r s) , 1 0 . 4 2 (1 H , b r s)

20

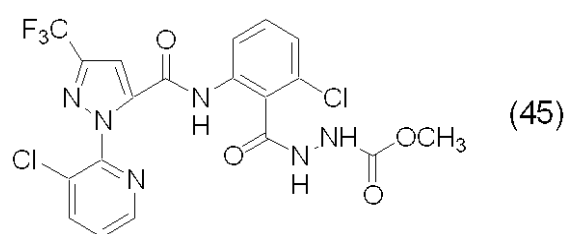
【 0 5 2 9 】

製造例 4 5

N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミドの代わりに、N - [3 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) フェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミドを用い、製造例 5 と同様の方法で本発明化合物 (4 5) を得た。

30

本発明化合物 (4 5)



¹ H - NMR (DMSO - d₆ , TMS) (ppm) : 3 . 6 7 - 3 . 7 4 (3 H , m) , 7 . 3 7 - 7 . 4 7 (2 H , m) , 7 . 6 9 - 7 . 7 4 (1 H , m) , 7 . 8 2 - 7 . 8 8 (2 H , m) , 8 . 2 5 - 8 . 3 3 (1 H , m) , 8 . 5 7 (1 H , d , J = 4 H z) , 9 . 7 1 (1 H , b r s) , 9 . 8 3 (1 H , b r s) , 1 0 . 5 6 (1 H , b r s)

40

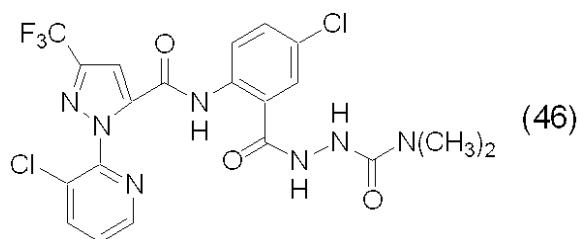
【 0 5 3 0 】

製造例 4 6

N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミドの代わりに、N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) フェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミドを用い、製造例 1 0 と同様の方法で本発明化合物 (4 6) を得た。

50

本発明化合物 (46)



^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 2.90 (6H, s), 7.57 (1H, d, J = 8 Hz), 7.68 - 7.70 (1H, m), 7.73 (1H, dd, 8 Hz, 4 Hz), 7.81 (1H, s), 8.18 (1H, d, J = 8 Hz), 8.29 (1H, d, J = 8 Hz), 8.57 (1H, d, J = 4 Hz), 8.83 (1H, brs), 10.36 (1H, brs), 11.27 (1H, brs)

10

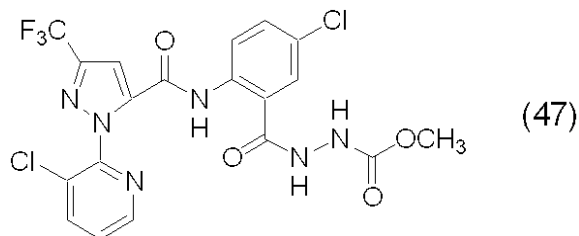
【0531】

製造例 47

N-[4-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-カルボキサミドの代わりに、N-[4-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)フェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-カルボキサミドを用い、製造例 5 と同様の方法で本発明化合物 (47) を得た。

20

本発明化合物 (47)



^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 3.64 - 3.71 (3H, m), 7.59 (1H, s), 7.63 (1H, d, J = 8 Hz), 7.72 (1H, dd, J = 8 Hz, 4 Hz), 7.86 (1H, s), 8.12 (1H, d, J = 8 Hz), 8.29 (1H, d, J = 8 Hz), 8.58 (1H, d, J = 4 Hz), 9.51 (1H, brs), 10.75 (1H, brs), 11.68 (1H, brs)

30

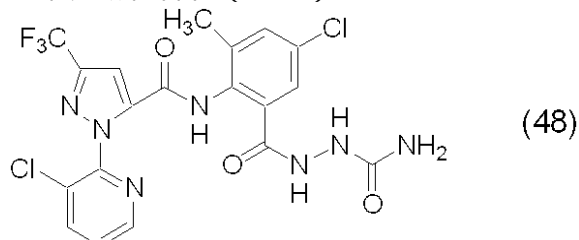
【0532】

製造例 48

N-[4-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド 0.22 g、シアン酸ナトリウム 0.04 g、酢酸 0.5 mL およびクロロホルム 5 mL を混合し、該混合物を氷冷下 4 時間攪拌した。反応混合物を減圧下濃縮し、得られた残渣を水およびクロロホルムで順次洗浄することにより、本発明化合物 (48) 0.080 g を得た。

40

本発明化合物 (48)



^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 2.16 (3H, s), 5.97

50

(2 H , b r s) , 7 . 5 2 - 7 . 5 4 (2 H , m) , 7 . 6 7 (1 H , d d , J = 8 H z , 4 H z) , 7 . 7 0 (1 H , s) , 7 . 7 6 (1 H , b r s) , 8 . 2 2 (1 H , d , J = 8 H z) , 8 . 5 4 (1 H , d , J = 4 H z) , 1 0 . 0 1 (1 H , b r s) , 1 0 . 3 9 (1 H , b r s)

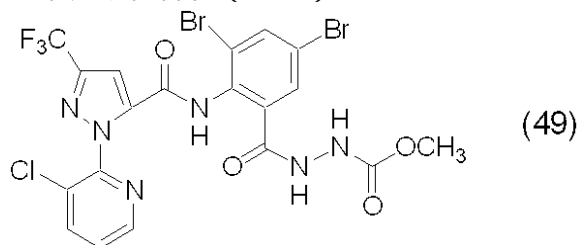
【 0 5 3 3 】

製造例 4 9

N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミドの代わりに、N - [4 , 6 - ジブromo - 2 - (ヒドラジノカルボニル) フェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミドを用い、製造例 5 と同様の方法で本発明化合物 (4 9) を得た。

10

本発明化合物 (4 9)



^1H - NMR (DMSO - d_6 , TMS) (p p m) : 3 . 4 0 - 3 . 7 0 (3 H , m) , 7 . 6 3 - 7 . 6 9 (2 H , m) , 7 . 7 6 (1 H , s) , 8 . 1 6 (1 H , s) , 8 . 2 1 (1 H , d , J = 8 H z) , 8 . 5 4 (1 H , d , J = 4 H z) , 9 . 3 5 (1 H , b r s) , 1 0 . 2 3 (1 H , b r s) , 1 0 . 6 3 (1 H , b r s)

20

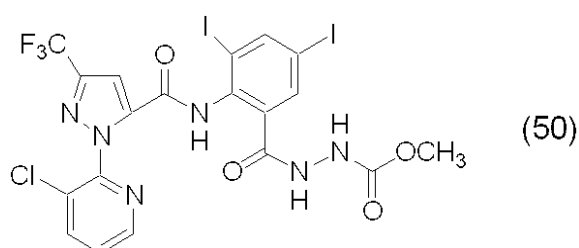
【 0 5 3 4 】

製造例 5 0

N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミドの代わりに、N - [4 , 6 - ジヨード - 2 - (ヒドラジノカルボニル) フェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミドを用い、製造例 5 と同様の方法で本発明化合物 (5 0) を得た。

30

本発明化合物 (5 0)



^1H - NMR (DMSO - d_6 , TMS) (p p m) : 3 . 5 5 - 3 . 6 5 (3 H , m) , 7 . 6 5 (1 H , d d , J = 8 H z , 4 H z) , 7 . 7 5 - 7 . 8 2 (2 H , m) , 8 . 2 0 (1 H , d , J = 8 H z) , 8 . 3 9 (1 H , s) , 8 . 5 3 (1 H , d , J = 4 H z) , 9 . 3 1 (1 H , b r s) , 1 0 . 1 4 (1 H , b r s) , 1 0 . 5 9 (1 H , b r s)

40

【 0 5 3 5 】

製造例 5 1

N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド 0 . 2 2 g 、メチルイソチオシアナート 0 . 0 5 g およびテトラヒドロフラン 1 0 m l を混合し、該混合物を室温で 2 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、析出した沈殿を濾取することにより、本発明化合物 (5 1) 0 . 2 0 g を得た。

50

CN(C)C(=S)NNC(=O)c1cc(Cl)cc(C)c1NC(=O)c2cc(F)(F)Fnn2-c3cccnc3Cl (51)

10

製造例 5 2

20

COC(=O)NNC(=O)c1ccc(NC(=O)c2cc(C(F)(F)F)n(C3=CC=CC=C3Cl)n2)c(Cl)c1 (52)

30

製造例 5 3

40

COC(=O)NNC(=O)c1ccc(NC(=O)c2c(C(F)(F)F)nn2-c3cccnc3Cl)cc1C (53)

50

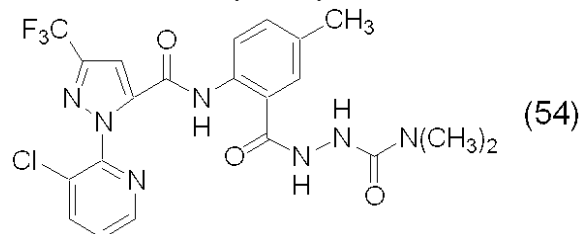
- 3.72 (3H, m), 7.37 (1H, d, J = 8 Hz), 7.55 (1H, s), 7.65 (1H, s), 7.73 (1H, dd, J = 8 Hz, 4 Hz), 8.02 (1H, d, J = 8 Hz), 8.29 (1H, d, J = 8 Hz), 8.57 (1H, d, J = 4 Hz), 9.43 (1H, brs), 10.64 (1H, brs), 11.72 (1H, brs)

【0538】

製造例 5 4

N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミドの代わりに、N - [2 - (ヒドラジノカルボニル) - 4 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミドを用い、製造例 10 と同様の方法で本発明化合物 (5 4) を得た。

本発明化合物 (5 4)



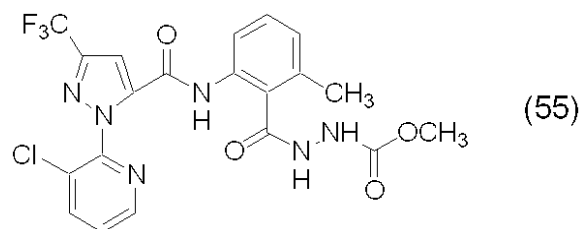
^1H - NMR (DMSO - d_6 , TMS) (ppm) : 2.31 (3 H, s), 2.91 (6 H, s), 7.29 - 7.34 (1 H, m), 7.48 - 7.51 (1 H, m), 7.70 - 7.79 (2 H, m), 8.04 - 8.09 (1 H, m), 8.26 - 8.33 (1 H, m), 8.55 - 8.60 (1 H, m), 8.75 (1 H, brs), 10.24 (1 H, brs), 11.30 (1 H, brs)

【0539】

製造例 5 5

N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミドの代わりに、N - [2 - (ヒドラジノカルボニル) - 3 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミドを用い、製造例 5 と同様の方法で本発明化合物 (5 5) を得た。

本発明化合物 (5 5)



^1H - NMR (DMSO - d_6 , TMS) (ppm) : 2.32 (3 H, s), 3.62 - 3.75 (3 H, m), 7.12 (1 H, d, J = 8 Hz), 7.31 (1 H, t, J = 8 Hz), 7.61 (1 H, d, J = 8 Hz), 7.68 - 7.73 (1 H, m), 7.80 (1 H, s), 8.27 (1 H, d, J = 8 Hz), 8.56 (1 H, d, J = 4 Hz), 9.59 (1 H, brs), 9.66 (1 H, brs), 10.30 (1 H, brs)

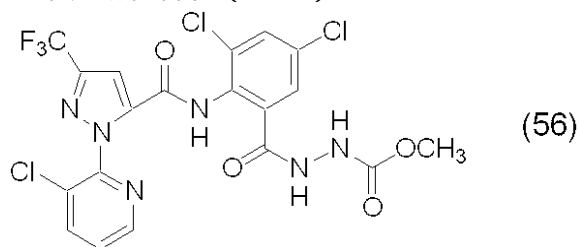
【0540】

製造例 5 6

N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボ

キサミドの代わりに、N - [4 , 6 - ジクロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) フェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミドを用い、製造例 5 と同様の方法で本発明化合物 (5 6) を得た。

本発明化合物 (5 6)



10

^1H - NMR (DMSO - d_6 , TMS) (ppm) : 3 . 4 5 - 3 . 6 6 (3 H , m) , 7 . 5 1 (1 H , s) , 7 . 6 6 (1 H , dd , J = 8 Hz , 4 Hz) , 7 . 7 6 (1 H , s) , 7 . 9 4 (1 H , s) , 8 . 2 1 (1 H , d , J = 8 Hz) , 8 . 5 3 (1 H , d , J = 4 Hz) , 9 . 3 7 (1 H , brs) , 10 . 2 7 (1 H , brs) , 10 . 6 4 (1 H , brs)

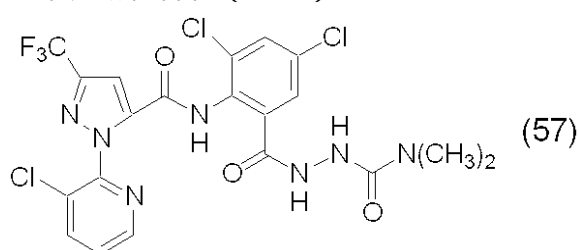
【 0 5 4 1 】

製造例 5 7

N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミドの代わりに、N - [4 , 6 - ジクロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) フェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミドを用い、製造例 1 0 と同様の方法で本発明化合物 (5 7) を得た。

20

本発明化合物 (5 7)



30

^1H - NMR (DMSO - d_6 , TMS) (ppm) : 2 . 8 5 (6 H , s) , 7 . 5 8 (1 H , s) , 7 . 6 4 - 7 . 7 0 (1 H , m) , 7 . 8 5 (1 H , s) , 7 . 9 0 (1 H , s) , 8 . 2 2 (1 H , d , J = 8 Hz) , 8 . 5 4 (1 H , d , J = 4 Hz) , 8 . 5 8 (1 H , brs) , 9 . 9 1 (1 H , brs) , 10 . 5 9 (1 H , brs)

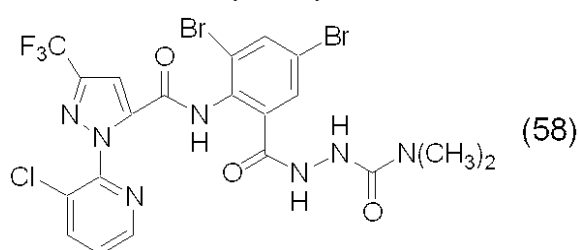
【 0 5 4 2 】

製造例 5 8

N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミドの代わりに、N - [4 , 6 - ジブromo - 2 - (ヒドラジノカルボニル) フェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミドを用い、製造例 1 0 と同様の方法で本発明化合物 (5 8) を得た。

40

本発明化合物 (5 8)



50

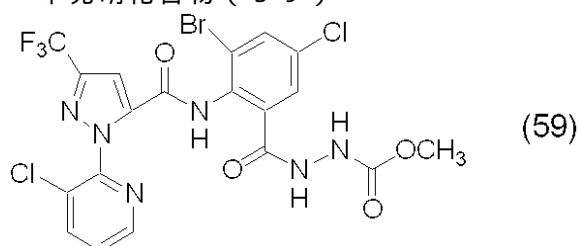
^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 2.84 (6H, s), 7.67 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 4 Hz), 7.74 (1H, s), 7.83 (1H, s), 8.13 (1H, s), 8.21 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.52 - 8.57 (2H, m), 9.88 (1H, brs), 10.60 (1H, brs)

【0543】

製造例 59

N-[4-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-カルボキサミドの代わりに、N-[6-ブromo-4-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)フェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-カルボキサミドを用い、製造例5と同様の方法で本発明化合物(59)を得た。

本発明化合物(59)



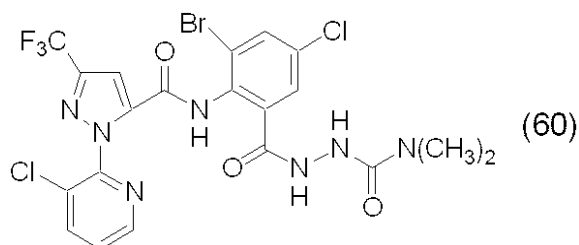
^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 3.55 - 3.65 (3H, m), 7.54 (1H, s), 7.66 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 4 Hz), 7.76 (1H, s), 8.06 (1H, s), 8.21 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.53 (1H, d, $J = 4\text{ Hz}$), 9.36 (1H, brs), 10.23 (1H, brs), 10.64 (1H, brs)

【0544】

製造例 60

N-[4-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-カルボキサミドの代わりに、N-[6-ブromo-4-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)フェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-カルボキサミドを用い、製造例10と同様の方法で本発明化合物(60)を得た。

本発明化合物(60)



^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 2.84 (6H, s), 7.62 (1H, s), 7.67 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 4 Hz), 7.83 (1H, s), 8.02 (1H, s), 8.21 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.52 - 8.57 (2H, m), 9.87 (1H, brs), 10.60 (1H, brs)

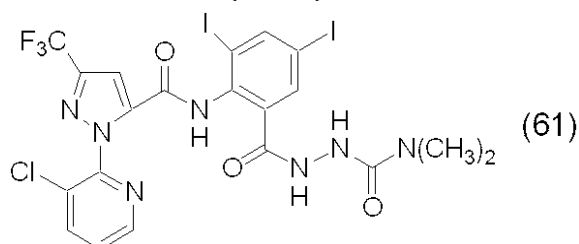
【0545】

製造例 61

N-[4-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-カルボキサミドの代わりに、N-[4,6-ジヨード-2-(ヒドラジノカルボニル)フェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-カルボキサミドを用い、製造例5と同様の方法で本発明化合物(61)を得た。

]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-カルボキサミドを用い、製造例10と同様の方法で本発明化合物(61)を得た。

本発明化合物(61)



10

^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 2.83 (6H, s), 7.66 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 4 Hz), 7.82 (1H, s), 7.88 (1H, s), 8.21 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.37 (1H, s), 8.48 (1H, brs), 8.53 (1H, d, $J = 4\text{ Hz}$), 9.78 (1H, brs), 10.55 (1H, brs)

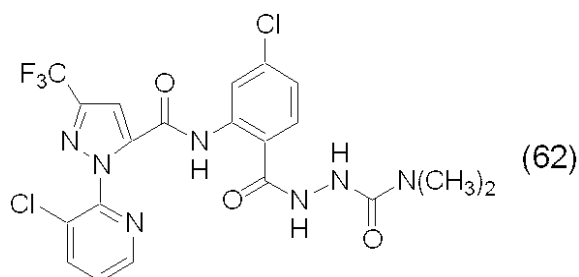
【0546】

製造例62

N-[4-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-カルボキサミドの代わりに、N-[5-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)フェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-カルボキサミドを用い、製造例10と同様の方法で本発明化合物(62)を得た。

20

本発明化合物(62)



30

^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 2.91 (6H, s), 7.33-7.48 (1H, m), 7.67-7.81 (3H, m), 8.24-8.35 (2H, m), 8.56-8.63 (1H, m), 8.80 (1H, brs), 10.38 (1H, brs), 11.57 (1H, brs)

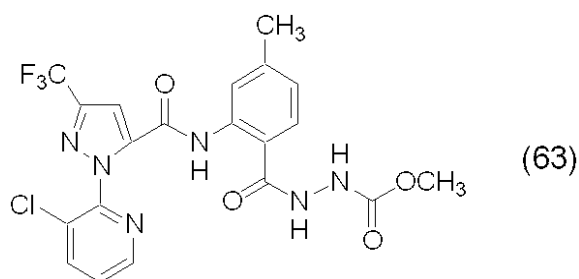
【0547】

製造例63

N-[4-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-カルボキサミドの代わりに、N-[2-(ヒドラジノカルボニル)-5-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-カルボキサミドを用い、製造例5と同様の方法で本発明化合物(63)を得た。

40

本発明化合物(63)



^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 2.32 (3H, s), 3.60 - 3.69 (3H, m), 7.09 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 7.54 (1H, s), 7.71 - 7.79 (2H, m), 8.06 (1H, s), 8.30 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.58 (1H, d, $J = 4\text{ Hz}$), 9.41 (1H, brs), 10.64 (1H, brs), 12.19 (1H, brs)

10

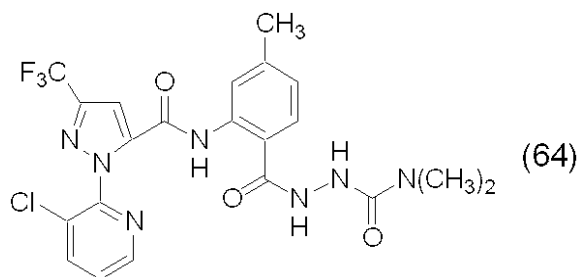
【0548】

製造例 6 4

N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミドの代わりに、N - [2 - (ヒドラジノカルボニル) - 5 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミドを用い、製造例 10 と同様の方法で本発明化合物 (6 4) を得た。

20

本発明化合物 (6 4)



^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 2.31 (3H, s), 2.90 (6H, s), 7.07 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 7.64 - 7.68 (2H, m), 7.74 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 4 Hz), 8.07 (1H, s), 8.31 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.58 (1H, d, $J = 4\text{ Hz}$), 8.67 (1H, brs), 10.28 (1H, brs), 11.82 (1H, brs)

30

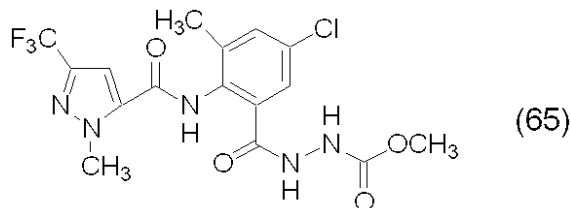
【0549】

製造例 6 5

N - (2 - アミノベンゾイル) - N' - エトキシカルボニルヒドラジンの代わりに、N - (2 - アミノ - 5 - クロロ - 3 - メチルベンゾイル) - N' - メトキシカルボニルヒドラジンを、製造例 3 と同様の方法で本発明化合物 (6 5) を得た。

本発明化合物 (6 5)

40



^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 2.25 (3H, s), 3.59 (3H, s), 4.13 (3H, s), 7.40 (1H, s), 7.44 (1H, s), 7.59 (1H, s), 9.26 (1H, brs), 10.11 (1H, brs), 10.17 (1H, brs)

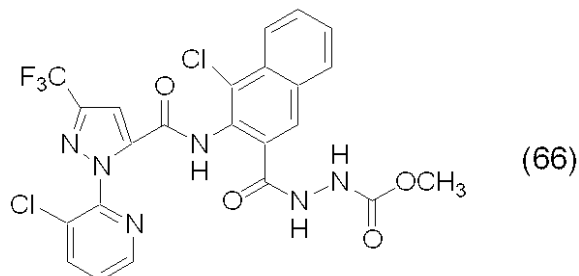
50

【 0 5 5 0 】

製造例 6 6

N - [1 - クロロ - 3 - (ヒドラジノカルボニル) - 2 - ナフチル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド 0 . 2 8 g、クロロギ酸メチル 0 . 0 6 g およびピリジン 1 0 m l を混合し、該混合物を室温で 2 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、析出した沈殿を濾取することにより、本発明化合物 (6 6) 0 . 0 8 g を得た。

本発明化合物 (6 6)



10

^1H - NMR (DMSO - d_6 , TMS) (ppm) : 3 . 6 0 - 3 . 6 8 (3 H , m) , 7 . 3 5 - 7 . 4 3 (1 H , m) , 7 . 6 0 - 7 . 8 5 (3 H , m) , 8 . 1 2 - 8 . 2 8 (3 H , m) , 8 . 5 2 - 8 . 6 0 (2 H , m) , 9 . 3 5 (1 H , b r s) , 1 0 . 3 2 (1 H , b r s) , 1 0 . 7 6 (1 H , b r s)

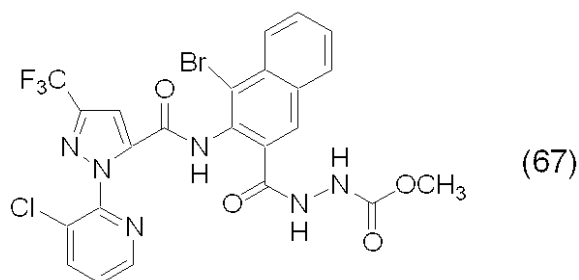
20

【 0 5 5 1 】

製造例 6 7

N - [1 - クロロ - 3 - (ヒドラジノカルボニル) - 2 - ナフチル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミドの代わりに、N - [1 - ブロモ - 3 - (ヒドラジノカルボニル) - 2 - ナフチル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミドを用い、製造例 6 6 と同様の方法で本発明化合物 (6 7) を得た。

本発明化合物 (6 7)



30

^1H - NMR (DMSO - d_6 , TMS) (ppm) : 3 . 5 8 - 3 . 6 9 (3 H , m) , 7 . 3 4 - 7 . 4 4 (1 H , m) , 7 . 6 0 - 7 . 8 5 (3 H , m) , 8 . 1 0 - 8 . 2 8 (3 H , m) , 8 . 5 0 - 8 . 6 2 (2 H , m) , 9 . 3 3 (1 H , b r s) , 1 0 . 2 8 (1 H , b r s) , 1 0 . 7 8 (1 H , b r s)

40

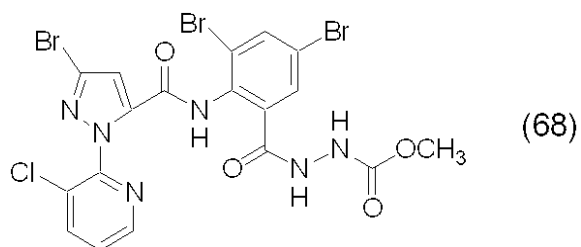
【 0 5 5 2 】

製造例 6 8

2 - [3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 6 , 8 - ジブロモ - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン 0 . 3 0 g、メチルカーバゼート 0 . 4 5 g および N , N - ジメチルホルムアミド 1 0 m l を混合し、該混合物を室温で 1 0 時間攪拌した。反応混合物に水 3 0 m l を注加した後、酢酸エチルで 3 回抽出した。有機層を合わせて、飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、本発明化合物 (6 8) 0 . 1 4 g を得た。

本発明化合物 (6 8)

50



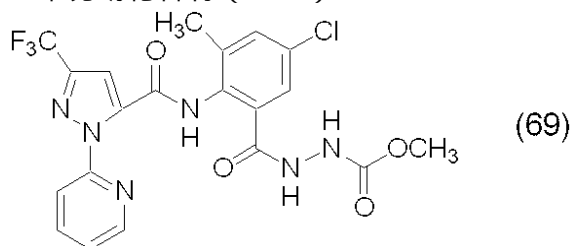
^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 3.44 - 3.66 (3H, m), 7.45 (1H, s), 7.60 (1H, dd, J = 8 Hz, 4 Hz), 7.65 (1H, s), 8.14 - 8.18 (2H, m), 8.50 (1H, d, J = 4 Hz), 9.36 (1H, brs), 10.26 (1H, brs), 10.55 (1H, brs)

【0553】

製造例 69

N-[4-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-カルボキサミドの代わりに、N-[4-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(2-ピリジニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-カルボキサミドを用い、製造例5と同様の方法で本発明化合物(69)を得た。

本発明化合物(69)



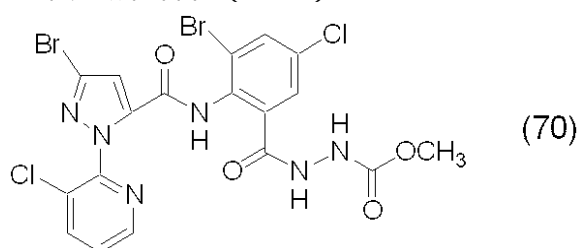
^1H -NMR (DMSO- d_6) (ppm): 2.33 (3H, s), 3.63 (3H, s), 7.36 (2H, s), 7.52 (1H, dd, J = 8 Hz, 4 Hz), 7.58 (1H, s), 7.81 (1H, d, J = 8 Hz), 8.06 (1H, t, J = 8 Hz), 8.46 (1H, d, J = 4 Hz), 9.33 (1H, brs), 10.19 (1H, brs), 10.34 (1H, brs)

【0554】

製造例 70

2-[3-ブロモ-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-イル]-8-ブロモ-6-クロロ-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オン 0.30g、メチルカーバゼート 0.45g および N,N-ジメチルホルムアミド 10ml を混合し、該混合物を室温で 10 時間攪拌した。反応混合物に水 30ml を注加した後、酢酸エチルで 3 回抽出した。有機層を合わせて、飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、本発明化合物(70) 0.13g を得た。

本発明化合物(70)



^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 3.48 - 3.62 (3H, m), 7.41 (1H, s), 7.53 - 7.62 (2H, m), 8.05 (1H, s), 8

10

20

30

40

50

. 16 (1H, d, J = 8 Hz), 8.50 (1H, d, J = 4 Hz), 9.36 (1H, brs), 10.21 (1H, brs), 10.48 (1H, brs)

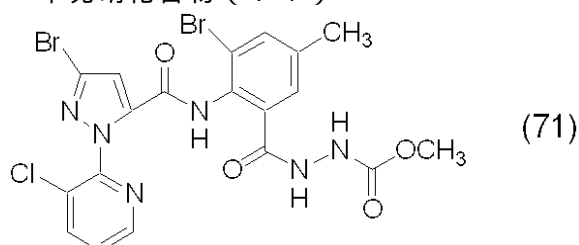
【0555】

製造例 71

2-[3-ブロモ-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-イル]-8-ブロモ-6-メチル-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オン 0.30 g、メチルカーバゼート 0.45 g および N,N-ジメチルホルムアミド 10 ml を混合し、該混合物を室温で 10 時間攪拌した。反応混合物に水 30 ml を注加した後、酢酸エチルで 3 回抽出した。有機層を合わせて、飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し

10

本発明化合物 (71)



¹H-NMR (DMSO-d₆, TMS) (ppm): 2.34 (3H, s), 3.56 - 3.64 (3H, m), 7.32 - 7.44 (2H, m), 7.59 (1H, dd, J = 8 Hz, 4 Hz), 7.66 - 7.71 (1H, m), 8.15 (1H, d, J = 8 Hz), 8.49 (1H, d, J = 4 Hz), 9.27 (1H, brs), 10.01 (1H, brs), 10.31 (1H, brs)

20

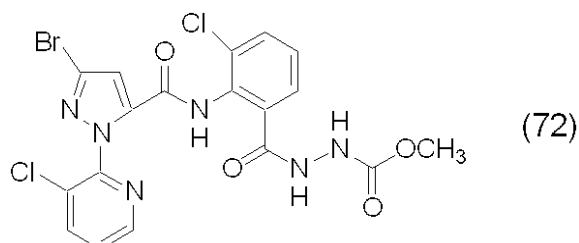
【0556】

製造例 72

2-[3-ブロモ-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-イル]-8-クロロ-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オン 0.21 g、メチルカーバゼート 0.9 g および N,N-ジメチルホルムアミド 10 ml を混合し、該混合物を室温で 10 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を水洗後、硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付して、本発明化合物 (72) 0.10 g を得た。

30

本発明化合物 (72)



¹H-NMR (DMSO-d₆, TMS) (ppm): 3.44 - 3.65 (3H, m), 7.40 - 7.54 (3H, m), 7.59 (1H, dd, J = 8 Hz, 4 Hz), 7.68 (1H, d, J = 8 Hz), 8.15 (1H, d, J = 8 Hz), 8.49 (1H, d, J = 4 Hz), 9.29 (1H, brs), 10.11 (1H, brs), 10.39 (1H, brs)

40

【0557】

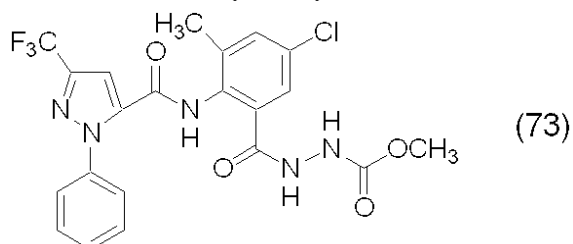
製造例 73

N-[4-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-カルボキサミドの代わりに、N-[4-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェ

50

エニル] - 1 - フェニル - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミドを用い、製造例 5 と同様の方法で本発明化合物 (7 3) を得た。

本発明化合物 (7 3)



10

^1H - NMR (DMSO - d_6) (ppm) : 2 . 1 8 (3 H , s) , 3 . 6 1 (3 H , s) , 7 . 3 7 (1 H , s) , 7 . 4 9 - 7 . 5 5 (7 H , m) , 9 . 3 1 (1 H , br s) , 1 0 . 2 2 (1 H , br s) , 1 0 . 3 0 (1 H , br s)

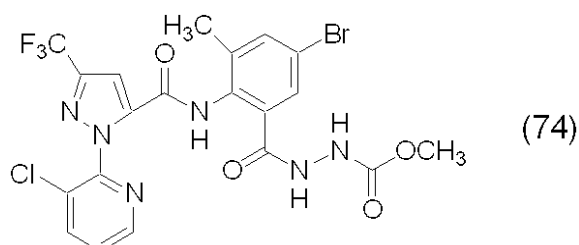
【 0 5 5 8 】

製造例 7 4

2 - [3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - クロロ - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンの代わりに、6 - ブロモ - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを用い、製造例 7 2 と同様の方法で本発明化合物 (7 4) を得た。

20

本発明化合物 (7 4)



^1H - NMR (DMSO - d_6 , TMS) (ppm) : 2 . 1 5 (3 H , s) , 3 . 5 6 - 3 . 6 5 (3 H , m) , 7 . 4 7 - 7 . 5 5 (1 H , m) , 7 . 6 2 - 7 . 7 5 (3 H , m) , 8 . 2 2 (1 H , d , $J = 8 \text{ Hz}$) , 8 . 5 3 (1 H , d , $J = 4 \text{ Hz}$) , 9 . 3 1 (1 H , br s) , 1 0 . 1 7 (1 H , br s) , 1 0 . 3 8 (1 H , br s)

30

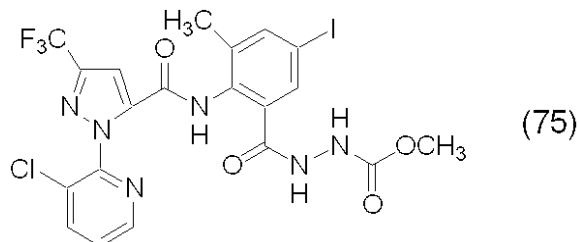
【 0 5 5 9 】

製造例 7 5

2 - [3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - クロロ - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンの代わりに、2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 6 - ヨード - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを用い、製造例 7 2 と同様の方法で本発明化合物 (7 5) を得た。

本発明化合物 (7 5)

40



^1H - NMR (DMSO - d_6 , TMS) (ppm) : 2 . 1 2 (3 H , s) , 3 . 5 5 - 3 . 6 6 (3 H , m) , 7 . 6 3 - 7 . 7 2 (3 H , m) , 7 . 8 3 (1 H , s) , 8 . 2 2 (1 H , d , $J = 8 \text{ Hz}$) , 8 . 5 3 (1 H , d , $J = 4 \text{ Hz}$) , 9 . 2 8 (1 H

50

, b r s) , 10 . 14 (1 H , b r s) , 10 . 35 (1 H , b r s)

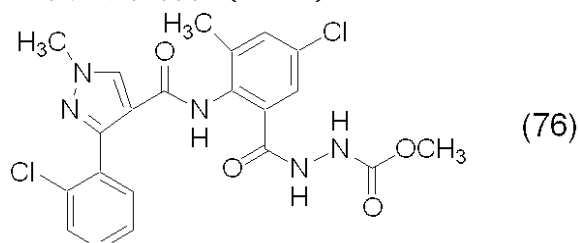
【 0560 】

製造例 76

N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド 0 . 18 g、クロロギ酸メチル 45 m g、ピリジン 68 m g およびアセトニトリル 5 m l を氷冷下混合し、該混合物を室温で 0 . 5 時間攪拌した。反応混合物に水を注加した後、酢酸エチルで抽出した。有機層を水洗後、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、本発明化合物 (76) 0 . 12 g を得た。

10

本発明化合物 (76)



^1H - NMR (DMSO - d_6) (p p m) : 2 . 13 (3 H , s) , 3 . 37 - 3 . 67 (6 H , m) , 7 . 37 (1 H , b r s) , 7 . 42 - 7 . 52 (4 H , m) , 7 . 60 (1 H , d , J = 8 \text{ Hz}) , 8 . 13 (1 H , s) , 9 . 28 - 9 . 37 (2 H , m) , 10 . 13 (1 H , b r s)

20

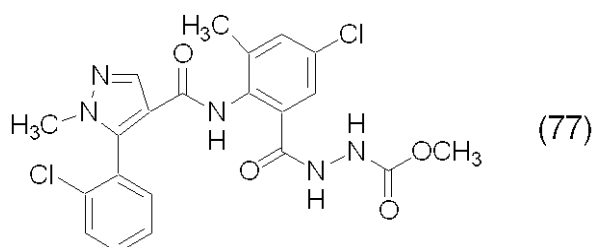
【 0561 】

製造例 77

N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミドの代わりに、N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 5 - (2 - クロロフェニル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミドを用い、製造例 76 と同様の方法で本発明化合物 (77) を得た。

本発明化合物 (77)

30



^1H - NMR (DMSO - d_6) (p p m) : 2 . 17 (3 H , s) , 3 . 46 - 3 . 62 (3 H , m) , 3 . 94 (3 H , s) , 7 . 32 - 7 . 41 (4 H , m) , 7 . 44 - 7 . 46 (1 H , m) , 7 . 50 (1 H , s) , 8 . 36 (1 H , s) , 9 . 30 - 9 . 34 (2 H , m) , 10 . 17 (1 H , b r s)

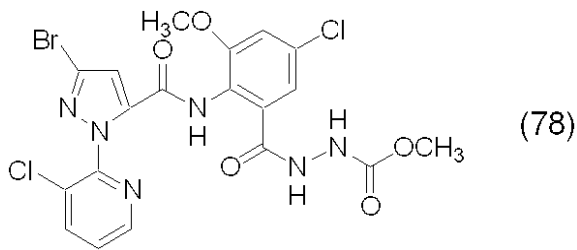
40

【 0562 】

製造例 78

2 - [3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - クロロ - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンの代わりに、2 - [3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 6 - クロロ - 8 - メトキシ - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを用い、製造例 72 と同様の方法で本発明化合物 (78) を得た。

本発明化合物 (78)



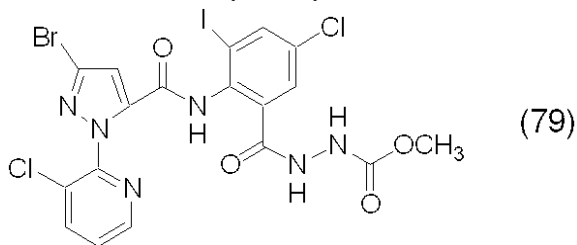
^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 3.56 - 3.64 (3H, m), 3.77 - 3.80 (3H, m), 7.12 (1H, brs), 7.32 (1H, brs), 7.38 (1H, brs), 7.59 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 4 Hz), 8.15 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.49 (1H, d, $J = 4\text{ Hz}$), 9.28 (1H, brs), 9.95 (1H, brs), 10.07 (1H, brs)

【0563】

製造例 79

2-[3-ブromo-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-イル]-8-クロロ-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オンの代わりに、2-[3-ブromo-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-イル]-6-クロロ-8-ヨード-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オンを用い、製造例 72 と同様の方法で本発明化合物 (79) を得た。

本発明化合物 (79)



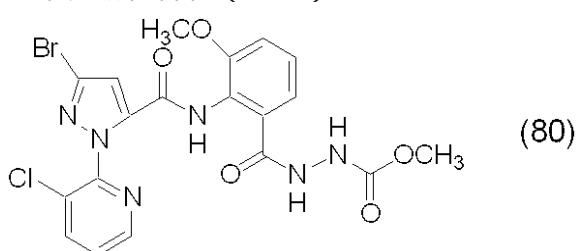
^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 3.56 - 3.64 (3H, m), 7.43 (1H, s), 7.53 (1H, s), 7.60 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 4 Hz), 8.12 - 8.19 (2H, m), 8.50 (1H, d, $J = 4\text{ Hz}$), 9.34 (1H, brs), 10.16 (1H, brs), 10.47 (1H, brs)

【0564】

製造例 80

2-[3-ブromo-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-イル]-8-クロロ-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オンの代わりに、2-[3-ブromo-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-イル]-8-メトキシ-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オンを用い、製造例 72 と同様の方法で本発明化合物 (80) を得た。

本発明化合物 (80)



^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 3.52 - 3.64 (3H, m), 3.74 (3H, s), 7.07 - 7.14 (1H, m), 7.21 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 7.31 - 7.42 (2H, m), 7.59 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 4 Hz), 8.15 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.49 (1H, d, $J = 4\text{ Hz}$), 9.2

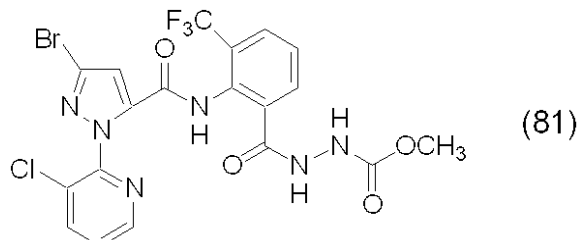
1 (1H, brs), 9.87 (1H, brs), 9.92 (1H, brs)

【0565】

製造例 8 1

2 - [3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - クロロ - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンの代わりに、2 - [3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - トリフルオロメチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを用い、製造例 7 2 と同様の方法で本発明化合物 (81) を得た。

本発明化合物 (81)



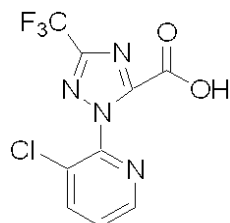
¹H - NMR (DMSO - d₆, TMS) (ppm): 3.46 - 3.69 (3H, m), 7.41 (1H, s), 7.59 (1H, dd, J = 8 Hz, 4 Hz), 7.68 (1H, t, J = 8 Hz), 7.77 - 7.87 (1H, m), 7.90 - 7.97 (1H, m), 8.14 (1H, d, J = 8 Hz), 8.48 (1H, d, J = 4 Hz), 9.32 (1H, brs), 10.14 (1H, brs), 10.48 (1H, brs)

【0566】

製造例 8 2

3 - クロロ - 2 - (3 - トリフルオロメチル - 1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) ピリジン 0.25 g とテトラヒドロフラン 5 ml との混合物に、-78 で 2.0 M リチウムジイソプロピルアミドのヘプタン/テトラヒドロフラン/エチルベンゼン溶液 0.50 ml を滴下し、-78 で 15 分間攪拌した。該混合物に内温が -60 以下に保たれる程度の速さで二酸化炭素を導入し、該混合物が黄色になってからさらに -78 で 10 分間攪拌した。反応混合物を室温まで昇温してから濃縮した。2 N 水酸化ナトリウム水溶液を加えて水層の pH が 10 - 12 となるように調整してから分液し、有機層を 0.5 N 水酸化ナトリウム水溶液で抽出した。水層を合わせてクロロホルムで洗浄後、水層の pH が 3 付近になるまで 2 N 塩酸を注加し、酢酸エチルで 3 回抽出した。有機層を合わせて飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮することにより、粗 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1H - 1, 2, 4 - トリアゾール 5 - カルボン酸 0.13 g を得た。

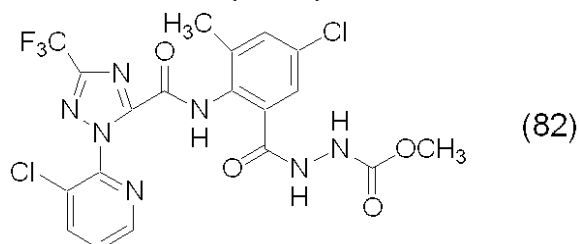
1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 5 - カルボン酸



得られた粗 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 5 - カルボン酸 0.13 g と塩化チオニル 0.10 ml との混合物を、アセトニトリル 10 ml 中で 2 時間加熱還流した。室温まで放冷した反応混合物を減圧下濃縮し、得られた残渣をアセトニトリル 10 ml に溶解し、N - (2 - アミノ - 5 - クロロ - 3 - メチルベンゾイル) - N' - メトキシカルボニルヒドラジン 0.11 g とジイソプロピルエチルアミン 0.10 ml を加え、室温で 16 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで 2 回抽出した。有機層を合わせて飽和食塩水で洗浄し、無

水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、本発明化合物(82) 12 mgを得た。

本発明化合物(82)



(82)

10

^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 2.31 (3H, s), 3.64 (3H, s), 7.40 (1H, s), 7.60 (1H, s), 7.90 (1H, brs), 8.77 (1H, d, $J = 7\text{ Hz}$), 9.33 (1H, brs), 9.50 (1H, brs), 10.27 (1H, brs), 10.44 (1H, brs)

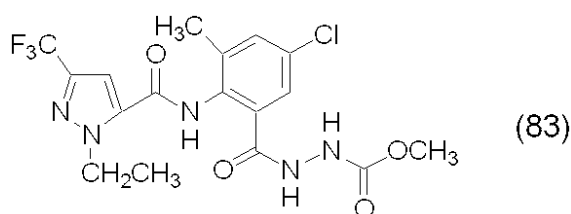
【0567】

製造例83

N-[4-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-カルボキサミドの代わりに、N-[4-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-エチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-カルボキサミドを用い、製造例5と同様の方法で本発明化合物(83)を得た。

20

本発明化合物(83)



(83)

^1H -NMR (DMSO- d_6) (ppm): 1.37 (3H, t, $J = 7\text{ Hz}$), 2.26 (3H, s), 3.60 (3H, s), 4.55 (2H, q, $J = 7\text{ Hz}$), 7.41 (2H, s), 7.58 (1H, s), 9.26 (1H, brs), 10.12 (1H, brs), 10.18 (1H, brs)

30

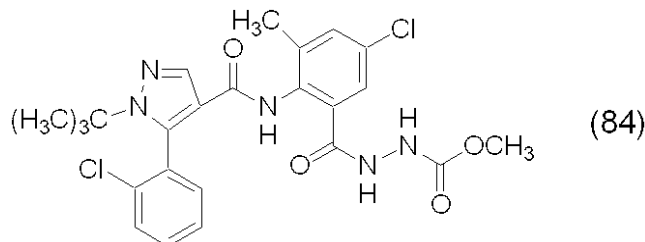
【0568】

製造例84

N-[4-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-3-(2-クロロフェニル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミドの代わりに、1-tert-ブチル-N-[4-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-5-(2-クロロフェニル)-1H-ピラゾール-4-カルボキサミドを用い、製造例76と同様の方法で本発明化合物(84)を得た。

本発明化合物(84)

40



(84)

^1H -NMR (DMSO- d_6) (ppm): 1.39 (9H, s), 2.05 (3H, s), 3.47-3.62 (3H, m), 7.36-7.53 (6H, m), 8.10 (1H, s), 9.19-9.26 (2H, m), 10.12 (1H, brs)

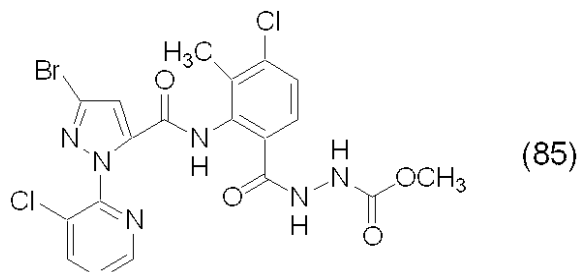
50

【 0 5 6 9 】

製造例 8 5

2 - [3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - クロロ - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンの代わりに、2 - [3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 7 - クロロ - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを用い、製造例 7 2 と同様の方法で本発明化合物 (8 5) を得た。

本発明化合物 (8 5)



10

^1H - NMR (DMSO - d_6 , TMS) (ppm) : 2 . 1 7 (3 H , s) , 3 . 6 0 - 3 . 6 5 (3 H , m) , 7 . 3 5 - 7 . 4 3 (2 H , m) , 7 . 5 4 (1 H , d , J = 8 Hz) , 7 . 6 1 (1 H , dd , J = 8 Hz , 4 Hz) , 8 . 1 7 (1 H , d , J = 8 Hz) , 8 . 5 0 (1 H , d , J = 4 Hz) , 9 . 2 8 (1 H , brs) , 1 0 . 1 4 (1 H , brs) , 1 0 . 4 1 (1 H , brs)

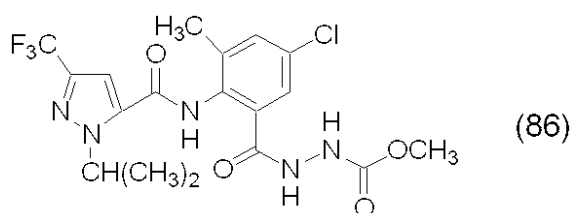
20

【 0 5 7 0 】

製造例 8 6

N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミドの代わりに、N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - イソプロピル - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミドを用い、製造例 5 と同様の方法で本発明化合物 (8 6) を得た。

本発明化合物 (8 6)



30

^1H - NMR (DMSO - d_6) (ppm) : 1 . 4 3 (6 H , d , J = 6 Hz) , 2 . 2 6 (3 H , s) , 3 . 6 0 (3 H , s) , 5 . 4 1 - 5 . 4 5 (1 H , m) , 7 . 3 5 (1 H , s) , 7 . 4 0 (1 H , s) , 7 . 5 9 (1 H , s) , 9 . 2 6 (1 H , brs) , 1 0 . 1 0 (1 H , brs) , 1 0 . 1 7 (1 H , brs)

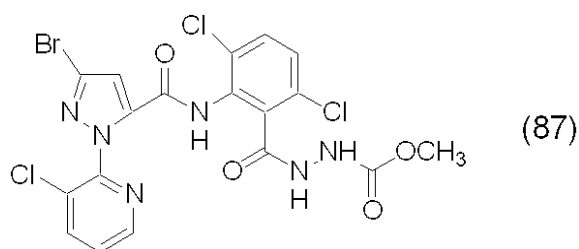
【 0 5 7 1 】

製造例 8 7

2 - [3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - クロロ - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンの代わりに、2 - [3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 5 , 8 - ジクロロ - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを用い製造例 7 2 と同様の方法で本発明化合物 (8 7) を得た。

本発明化合物 (8 7)

40



^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 3.50 - 3.68 (3H, m), 7.47 (1H, s), 7.52 - 7.65 (3H, m), 8.17 (1H, d, J = 8 Hz), 8.49 (1H, d, J = 4 Hz), 9.43 (1H, brs), 10.17 (1H, brs), 10.47 (1H, brs)

10

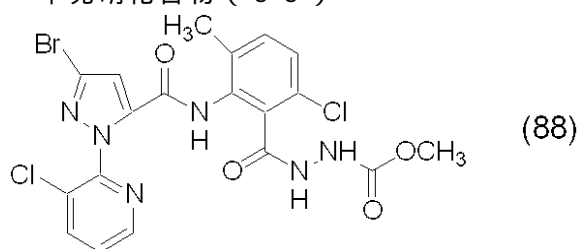
【0572】

製造例 88

2-[3-ブロモ-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-イル]-8-クロロ-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オンの代わりに、2-[3-ブロモ-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-イル]-5-クロロ-8-メチル-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オンを用い、製造例72と同様の方法で本発明化合物(88)を得た。

本発明化合物(88)

20



^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 2.09 (3H, s), 3.51 - 3.68 (3H, m), 7.31 - 7.45 (3H, m), 7.61 (1H, dd, J = 8 Hz, 4 Hz), 8.19 (1H, d, J = 8 Hz), 8.49 (1H, d, J = 4 Hz), 9.43 (1H, brs), 10.04 (1H, brs), 10.13 (1H, brs)

30

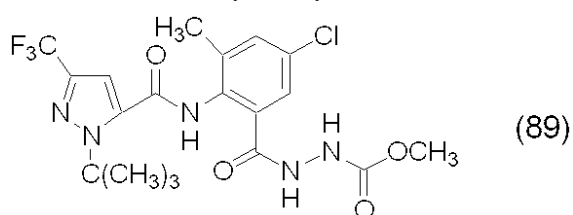
【0573】

製造例 89

N-[4-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-カルボキサミドの代わりに、N-[4-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-tert-ブチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-カルボキサミドを用い、製造例5と同様の方法で本発明化合物(89)を得た。

本発明化合物(89)

40



^1H -NMR (DMSO- d_6) (ppm): 1.67 (9H, s), 2.28 (3H, s), 3.64 (3H, s), 7.11 (1H, s), 7.42 (1H, s), 7.55 (1H, s), 9.29 (1H, brs), 10.18 (1H, brs), 10.23 (1H, brs)

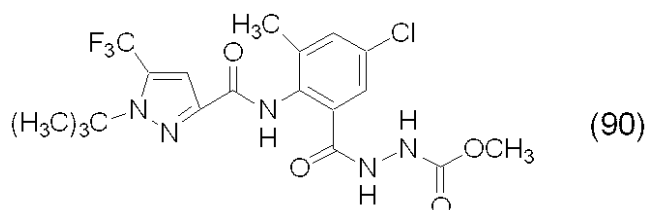
【0574】

50

製造例 90

N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミドの代わりに、N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - tert - ブチル - 5 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボキサミドを用い、製造例 5 と同様の方法で本発明化合物 (90) を得た。

本発明化合物 (90)



10

^1H - NMR (DMSO - d_6) (ppm) : 1 . 6 9 (9 H , s) , 2 . 2 6 (3 H , s) , 3 . 5 7 (3 H , s) , 7 . 4 3 (1 H , s) , 7 . 6 2 (1 H , d , J = 2 H z) , 7 . 8 2 (1 H , d , J = 2 H z) , 9 . 3 0 (1 H , b r s) , 1 0 . 2 3 (1 H , b r s) , 1 0 . 5 6 (1 H , b r s)

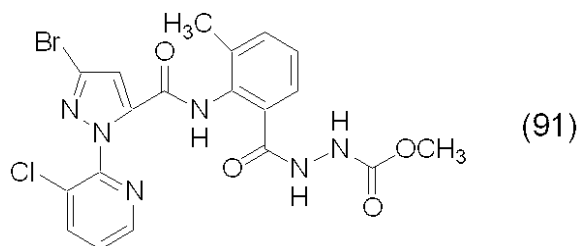
【 0 5 7 5 】

製造例 91

2 - [3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - クロロ - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンの代わりに、2 - [3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを用い、製造例 72 と同様の方法で本発明化合物 (91) を得た。

20

本発明化合物 (91)



30

^1H - NMR (DMSO - d_6 , TMS) (ppm) : 2 . 1 5 (3 H , s) , 3 . 5 5 - 3 . 6 7 (3 H , m) , 7 . 2 5 - 7 . 4 5 (3 H , m) , 7 . 6 1 (1 H , d d , J = 8 H z , 4 H z) , 7 . 9 4 - 7 . 9 7 (1 H , m) , 8 . 1 7 (1 H , d , J = 8 H z) , 8 . 4 8 - 8 . 5 3 (1 H , m) , 9 . 2 5 (1 H , b r s) , 1 0 . 0 4 (1 H , b r s) , 1 0 . 2 0 (1 H , b r s)

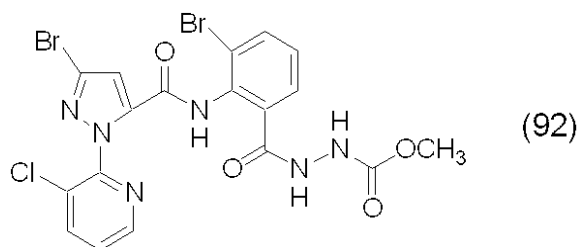
【 0 5 7 6 】

製造例 92

2 - [3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - クロロ - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンの代わりに、8 - ブロモ - 2 - [3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを用い、製造例 72 と同様の方法で本発明化合物 (92) を得た。

40

本発明化合物 (92)



^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 3.45 - 3.67 (3H, m), 7.34 - 7.44 (2H, m), 7.53 (1H, s), 7.60 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 4 Hz), 7.84 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.15 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.50 (1H, d, $J = 4\text{ Hz}$), 9.29 (1H, brs), 10.08 (1H, brs), 10.42 (1H, brs)

10

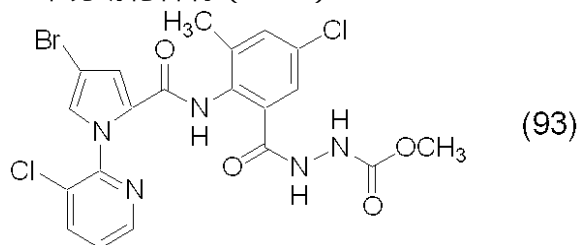
【0577】

製造例93

4-ブロモ-N-[4-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-カルボキサミド 0.20 g、クロロギ酸メチル 0.05 g およびピリジン 0.07 mL をN,N-ジメチルホルムアミド中で混合し、該混合物を室温で8時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、析出した沈殿を濾取することにより、本発明化合物(93) 0.16 gを得た。

本発明化合物(93)

20



^1H -NMR (DMSO- d_6) (ppm): 2.16 (3H, s), 3.63 (3H, s), 7.23 (1H, s), 7.41 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.48 - 7.51 (3H, m), 8.05 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 2 Hz), 8.43 (1H, dd, $J = 5\text{ Hz}$, 2 Hz), 9.31 (1H, brs), 9.75 (1H, brs), 10.12 (1H, brs)

30

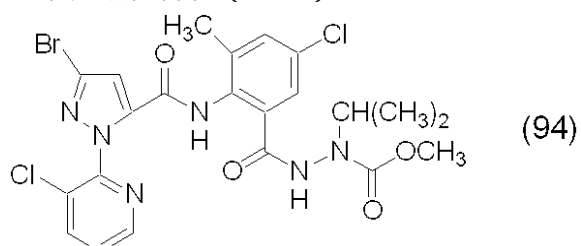
【0578】

製造例94

3-ブロモ-N-[4-クロロ-2-(N'-イソプロピルヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド 0.26 g、クロロギ酸メチル 0.06 mL およびピリジン 2 mL を混合し、該混合物を室温で1.5時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、メチル t-ブチルエーテルで3回抽出した。有機層を併せ、1N塩酸、飽和重曹水および飽和食塩水で順次洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、本発明化合物(94) 0.18 gを得た。

40

本発明化合物(94)



^1H -NMR (DMSO- d_6 , 80) (ppm): 1.03 (6H, d, $J = 7\text{ Hz}$)

50

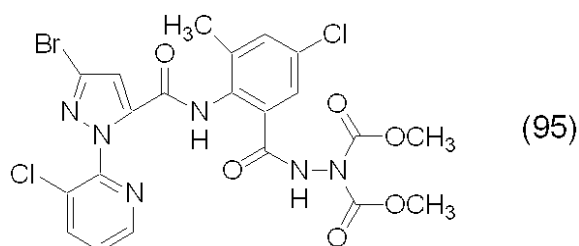
z), 2.18 (3H, s), 3.53 (3H, s), 4.24 (1H, hept., J = 7 Hz), 7.29 (1H, s), 7.37 (1H, d, J = 2 Hz), 7.49 (1H, d, J = 2 Hz), 7.57 (1H, dd, J = 8 Hz, 4 Hz), 8.10 (1H, dd, J = 8 Hz, 1 Hz), 8.45 (1H, dd, J = 4 Hz, 1 Hz), 9.92 (1H, s), 9.98 (1H, s)

【0579】

製造例 95

本発明化合物(34) 4.11g、トリエチルアミン 1.45ml およびテトラヒドロフラン 80ml の混合物に、氷冷下、クロロギ酸メチル 0.69ml を滴下した。得られた混合物を室温で 1 時間攪拌した後、反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで 3 回抽出した。有機層を合わせて、飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウム乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、本発明化合物(95) 2.66g を得た。

本発明化合物(95)



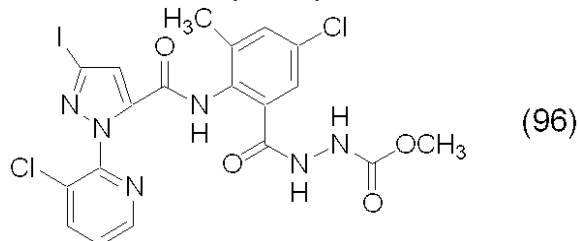
¹H-NMR (CDCl₃, TMS) (ppm): 2.22 (3H, s), 3.82 (6H, s), 6.99 (1H, s), 7.347.37 (2H, m), 7.41 (1H, d, J = 2 Hz), 7.88 (1H, dd, J = 8 Hz, 1 Hz), 8.37 (1H, dd, J = 4 Hz, 1 Hz), 8.43 (1H, s), 9.21 (1H, s)

【0580】

製造例 96

N-[4-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-ヨード-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド 0.11g、クロロギ酸メチル 0.095ml およびピリジン 2ml を混合し、該混合物を室温で 2.75 時間攪拌した。反応混合物に水とトルエンとを注加し、減圧下濃縮した。残渣を水と酢酸エチルとで分液し、有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、本発明化合物(96) 0.11g を得た。

本発明化合物(96)



¹H-NMR (DMSO-d₆) (ppm): 2.15 (3H, s), 3.63 (3H, brs), 7.40 (2H, brs), 7.54 (1H, s), 7.59 (1H, dd, J = 8 Hz, 4 Hz), 8.15 (1H, d, J = 8 Hz), 8.49 (1H, d, J = 4 Hz), 9.31 (1H, brs), 10.16 (2H, brs)

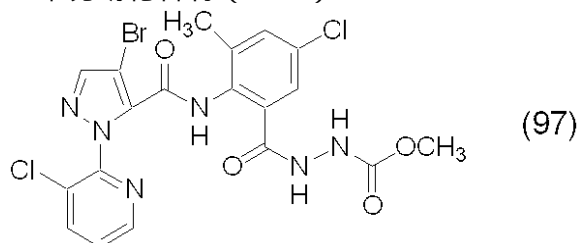
【0581】

製造例 97

4-ブromo-N-[4-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド 0.

2.7 g、クロロギ酸メチル 0.13 mL およびピリジン 3 mL を混合し、該混合物を室温で 1.75 時間攪拌した。反応混合物に水とトルエンとを注加した後、減圧下濃縮した。残渣を水と酢酸エチルとで分液し、有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、本発明化合物 (97) 0.24 g を得た。

本発明化合物 (97)



10

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6 , δ) (ppm): 2.14 (3H, s), 3.59 (3H, brs), 7.43 (1H, s), 7.48 (1H, s), 7.57 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 4 Hz), 8.03 (1H, s), 8.12 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.47 (1H, d, $J = 4\text{ Hz}$), 8.94 (1H, brs), 9.81 (1H, brs), 10.11 (1H, brs)

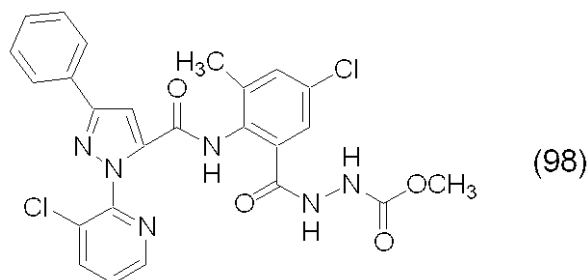
【0582】

製造例 98

20

N-[4-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-フェニル-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド 0.30 g、クロロギ酸メチル 0.15 mL およびピリジン 3 mL を混合し、該混合物を室温で 1.75 時間攪拌した。反応混合物に水とトルエンとを注加した後、減圧下濃縮した。残渣を水と酢酸エチルとで分液し、有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、本発明化合物 (98) 0.30 g を得た。

本発明化合物 (98)



30

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) (ppm): 2.19 (3H, s), 3.62 (3H, brs), 7.42 - 7.52 (4H, m), 7.55 (1H, brs), 7.60 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 4 Hz), 7.70 (1H, brs), 7.88 (2H, d, $J = 7\text{ Hz}$), 8.17 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 1 Hz), 8.32 (1H, dd, $J = 4\text{ Hz}$, 1 Hz), 9.34 (1H, brs), 10.19 (2H, brs)

40

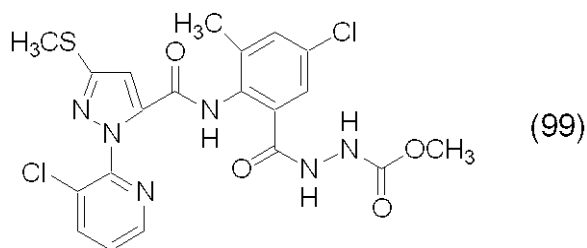
【0583】

製造例 99

N-[4-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-メチルチオ-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド 0.27 g、クロロギ酸メチル 0.14 mL およびピリジン 3 mL を混合し、該混合物を室温で 2 時間攪拌した。反応混合物に水とトルエンとを注加した後、減圧下濃縮した。残渣を水と酢酸エチルとで分液し、有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、本発明化合物 (99) 0.14 g を得た。

50

本発明化合物 (9 9)



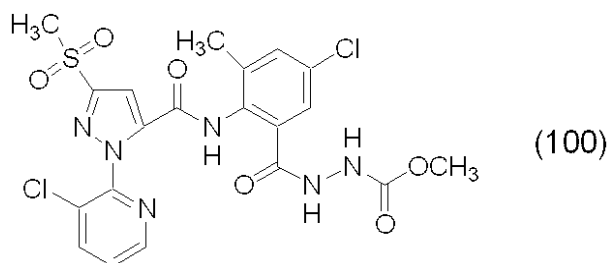
¹H - NMR (DMSO - d₆) (ppm) : 2 . 1 6 (3 H , s) , 2 . 5 4 (3 H , s) 3 . 6 2 (3 H , b r s) , 7 . 2 0 (1 H , s) , 7 . 3 8 (1 H , b r s) , 7 . 5 4 7 . 5 8 (2 H , m) , 8 . 1 3 (1 H , d d , J = 8 H z , 1 H z) , 8 . 4 8 (1 H , d d , J = 4 H z , 1 . 5 H z) , 9 . 3 2 (1 H , b r s) , 1 0 . 1 1 (1 H , s) , 1 0 . 1 4 (1 H , s)

【 0 5 8 4 】

製造例 1 0 0

6 - クロロ - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - メチルスルホニル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン 0 . 2 0 g、メチルカーバゼート 0 . 4 0 g および N , N - ジメチルホルムアミド 8 m l を混合し、該混合物を室温で 2 2 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、メチル t - ブチルエーテルで 3 回抽出した。有機層を併せ、水、飽和食塩水で順次洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付して、本発明化合物 (1 0 0) 0 . 1 3 g を得た。

本発明化合物 (1 0 0)



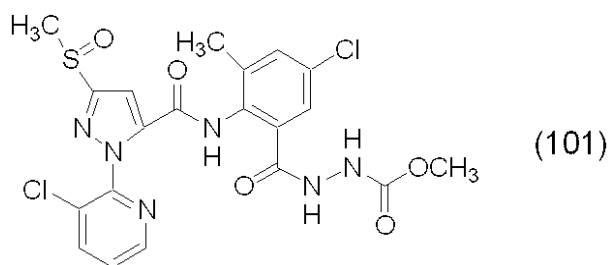
¹H - NMR (DMSO - d₆) (ppm) : 2 . 1 6 (3 H , s) , 3 . 3 9 (3 H , s) , 3 . 6 2 (3 H , b r s) , 7 . 3 9 (1 H , b r s) , 7 . 5 6 (1 H , s) , 7 . 6 7 (1 H , d d , J = 8 H z , 4 H z) , 7 . 7 8 (1 H , s) , 8 . 2 3 (1 H , d d , J = 8 H z , 1 H z) , 8 . 5 4 (1 H , d d , J = 4 H z , 1 H z) , 9 . 3 1 (1 H , b r s) , 1 0 . 1 6 (1 H , b r s) , 1 0 . 4 1 (1 H , b r s)

【 0 5 8 5 】

製造例 1 0 1

6 - クロロ - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - メチルスルフィニル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン 0 . 1 0 g、メチルカーバゼート 0 . 2 1 g および N , N - ジメチルホルムアミド 4 m l を混合し、該混合物を室温で 2 0 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、メチル t - ブチルエーテルで 3 回抽出した。有機層を併せ、水、飽和食塩水で順次洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付して、本発明化合物 (1 0 1) 0 . 0 9 2 g を得た。

本発明化合物 (1 0 1)



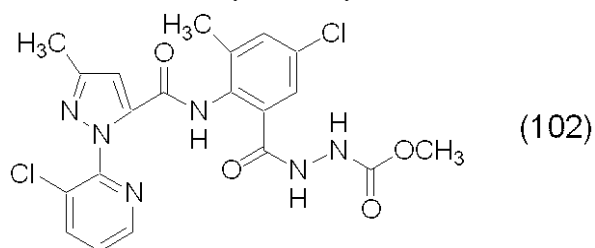
$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) (ppm): 2.16 (3H, s), 2.99 (3H, s), 3.62 (3H, brs), 7.39 (1H, brs), 7.55 (1H, s), 7.64 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 4 Hz), 7.74 (1H, s), 8.20 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 1.5 Hz), 8.52 (1H, dd, $J = 4\text{ Hz}$, 1 Hz), 9.32 (1H, brs), 10.15 (1H, brs), 10.35 (1H, brs)

【0586】

製造例102

6-クロロ-2-[1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-メチル-1H-ピラゾール-5-イル]-8-メチル-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オン 0.12g、メチルカーバゼート 0.27g および N,N-ジメチルホルムアミド 4ml を混合し、該混合物を室温で 24 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、メチル t-ブチルエーテルで 3 回抽出した。有機層を合わせ、水、飽和食塩水で順次洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付して、

本発明化合物(102) 0.10g を得た。



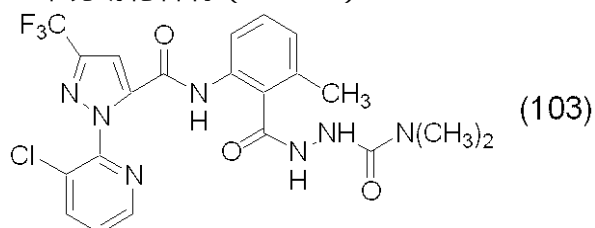
$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) (ppm): 2.15 (3H, s), 2.31 (3H, s), 3.62 (3H, brs), 7.02 (1H, s), 7.40 (1H, brs), 7.52-7.55 (2H, m), 8.11 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 1 Hz), 8.46 (1H, dd, $J = 4\text{ Hz}$, 1 Hz), 9.31 (1H, brs), 10.03 (1H, brs), 10.14 (1H, brs)

【0587】

製造例103

N-[4-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-カルボキサミドの代わりに、N-[2-(ヒドラジノカルボニル)-3-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-カルボキサミドを用い、製造例10と同様の方法で本発明化合物(103)を得た。

本発明化合物(103)



$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) (ppm): 2.29 (3H, s), 2.93 (6H, s), 3.62 (3H, brs), 7.02 (1H, s), 7.40 (1H, brs), 7.52-7.55 (2H, m), 8.11 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 1 Hz), 8.46 (1H, dd, $J = 4\text{ Hz}$, 1 Hz), 9.31 (1H, brs), 10.03 (1H, brs), 10.14 (1H, brs)

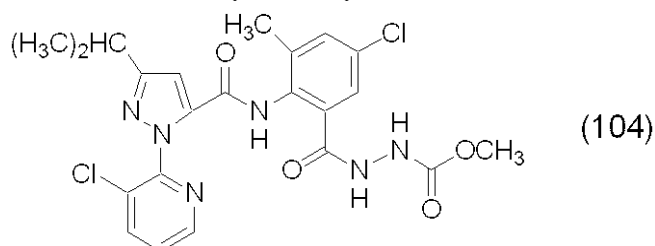
s), 7.07 (1H, d, J = 8 Hz), 7.27 (1H, t, J = 8 Hz), 7.71 (1H, dd, J = 8 Hz, 4 Hz), 7.86 (1H, d, J = 8 Hz), 8.11 (1H, s), 8.28 (1H, d, J = 8 Hz), 8.56 (1H, d, J = 4 Hz), 8.99 (1H, brs), 10.10 (1H, brs), 10.19 (1H, brs)

【0588】

製造例104

6-クロロ-2-[1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-イソプロピル-1H-ピラゾール-5-イル]-8-メチル-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オン 0.20g、メチルカーバゼート 0.43g および N,N-ジメチルホルムアミド 5ml を混合し、該混合物を室温で20時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、メチル t-ブチルエーテルで3回抽出した。有機層を合わせ、水、飽和食塩水で順次洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付して、本発明化合物(104) 0.22g を得た。

本発明化合物(104)



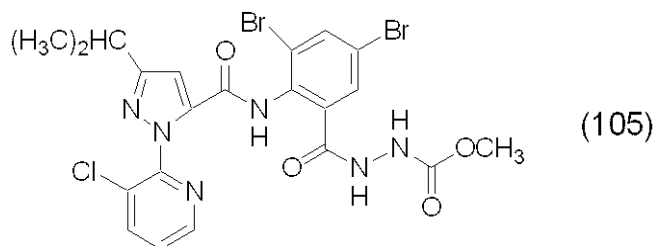
¹H-NMR (DMSO-d₆) (ppm): 1.35 (6H, d, J = 7 Hz), 2.22 (3H, s), 3.08 (1H, hept., J = 7 Hz), 3.68 (3H, brs), 7.17 (1H, s), 7.45 (1H, brs), 7.587.62 (2H, m), 8.17 (1H, dd, J = 8 Hz, 1 Hz), 8.52 (1H, dd, J = 4 Hz, 1 Hz), 9.39 (1H, brs), 10.09 (1H, brs), 10.20 (1H, brs)

【0589】

製造例105

2-[1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-イソプロピル-1H-ピラゾール-5-イル]-6,8-ジブromo-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オン 0.20g、メチルカーバゼート 0.34g および N,N-ジメチルホルムアミド 4ml を混合し、該混合物を室温で17時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、メチル t-ブチルエーテルで3回抽出した。有機層を合わせ、水、飽和食塩水で順次洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付して、本発明化合物(105) 0.16g を得た。

本発明化合物(105)



¹H-NMR (DMSO-d₆) (ppm): 1.27 (6H, d, J = 7 Hz), 3.01 (1H, hept., J = 7 Hz), 3.60 (3H, brs), 7.16 (1H, s), 7.53 (1H, dd, J = 8 Hz, 4 Hz), 7.64 (1H, brs), 8.07 (1H, dd, J = 8 Hz, 1 Hz), 8.11 (1H, brs), 8.45 (1H, dd, J = 4 Hz, 1 Hz), 9.35 (1H, brs), 10.16 (1H, br

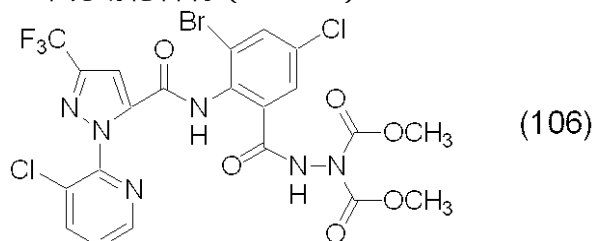
s), 10.22 (1H, brs)

【0590】

製造例106

本発明化合物(34)の代わりに、本発明化合物(59)を用い、製造例95と同様の方法で本発明化合物(106)を得た。

本発明化合物(106)



10

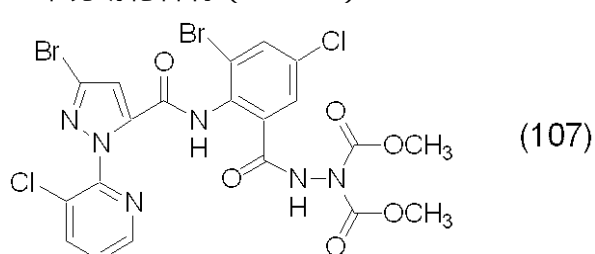
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) (ppm): 3.73 (6H, s), 7.38 - 7.45 (3H, m), 7.64 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.89 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.37 (1H, d, $J = 4\text{ Hz}$), 8.67 (1H, brs), 9.21 (1H, brs)

【0591】

製造例107

本発明化合物(34)の代わりに、本発明化合物(70)を用い、製造例95と同様の方法で本発明化合物(107)を得た。

本発明化合物(107)



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) (ppm): 3.77 (6H, s), 7.09 (1H, s), 7.36 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 4 Hz), 7.51 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.69 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.88 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 1 Hz), 8.35 (1H, dd, $J = 4\text{ Hz}$, 1 Hz), 8.63 (1H, brs), 8.95 (1H, brs)

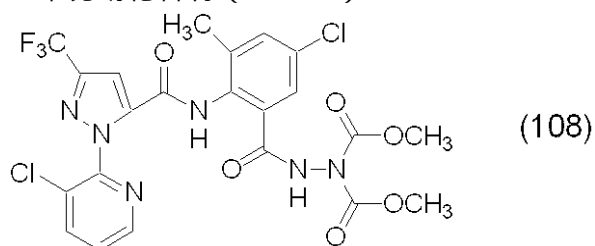
30

【0592】

製造例108

本発明化合物(34)の代わりに、本発明化合物(5)を用い、製造例95と同様の方法で本発明化合物(108)を得た。

本発明化合物(108)



40

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) (ppm): 2.23 (3H, s), 3.81 (6H, s), 7.24 (1H, s), 7.36 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.397.42 (2H, m), 7.91 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 1 Hz), 8.28 (1H, s), 8.40 (1H, dd, $J = 4\text{ Hz}$, 1 Hz), 9.27 (1H, s).

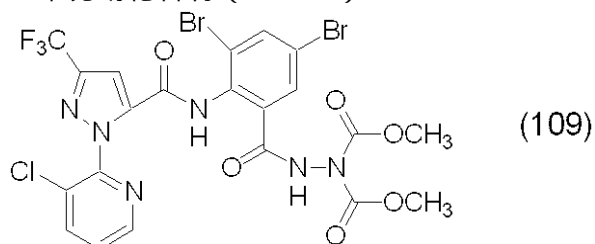
50

【 0 5 9 3 】

製造例 1 0 9

本発明化合物 (3 4) の代わりに、本発明化合物 (4 9) を用い、製造例 9 5 と同様の方法で本発明化合物 (1 0 9) を得た。

本発明化合物 (1 0 9)



10

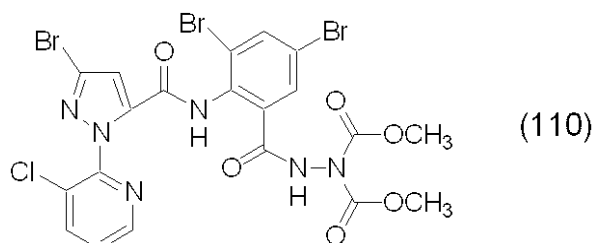
^1H -NMR (CDCl₃, TMS) (ppm): 3.75 (6H, s), 7.377.43 (2H, m), 7.63 (1H, d, J = 2 Hz), 7.84 (1H, d, J = 2 Hz), 7.90 (1H, dd, J = 8 Hz, 1 Hz), 8.38 (1H, dd, J = 4 Hz, J = 1 Hz), 8.57 (1H, brs), 9.17 (1H, brs).

【 0 5 9 4 】

製造例 1 1 0

本発明化合物 (3 4) の代わりに、本発明化合物 (6 8) を用い、製造例 9 5 と同様の方法で本発明化合物 (1 1 0) を得た。

本発明化合物 (1 1 0)



20

^1H -NMR (CDCl₃, TMS) (ppm): 3.78 (6H, s), 7.08 (1H, s), 7.37 (1H, dd, J = 8 Hz, 4 Hz), 7.67 (1H, d, J = 2 Hz), 7.87 - 7.90 (2H, m), 8.35 (1H, dd, J = 4 Hz, 1 Hz), 8.54 (1H, brs), 8.88 (1H, brs).

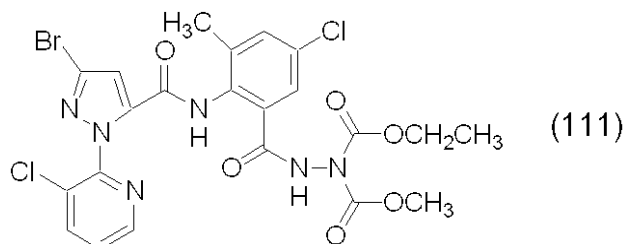
30

【 0 5 9 5 】

製造例 1 1 1

クロロギ酸メチルの代わりに、クロロギ酸エチルを用い製造例 9 5 と同様の方法で本発明化合物 (1 1 1) を得た。

本発明化合物 (1 1 1)



40

^1H -NMR (CDCl₃, TMS) (ppm): 1.30 (3H, t, J = 7 Hz), 2.24 (3H, s), 3.82 (3H, s), 4.30 (2H, q, J = 7 Hz), 6.97 (1H, s), 7.34 - 7.38 (2H, m), 7.45 (1H, s), 7.88 (1H, dd, J = 8 Hz, 2 Hz), 8.27 (1H, s), 8.38 (1H, dd, J = 5 Hz, 2 Hz), 9.21 (1H, s).

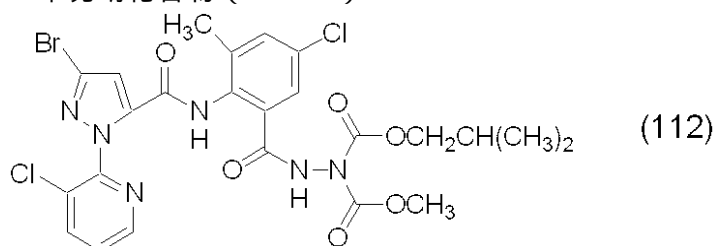
【 0 5 9 6 】

50

製造例 112

クロロギ酸メチルの代わりに、クロロギ酸イソブチルを用い製造例 95 と同様の方法で本発明化合物 (112) を得た。

本発明化合物 (112)



10

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) (ppm): 0.94 (6H, d, $J = 7\text{ Hz}$), 1.98 (1H, hept, $J = 7\text{ Hz}$), 2.24 (3H, s), 3.82 (3H, s), 4.04 (2H, d, $J = 7\text{ Hz}$), 6.96 (1H, s), 7.347.37 (2H, m), 7.45 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.88 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 2 Hz), 8.29 (1H, s), 8.38 (1H, dd, $J = 5\text{ Hz}$, 2 Hz), 9.23 (1H, s).

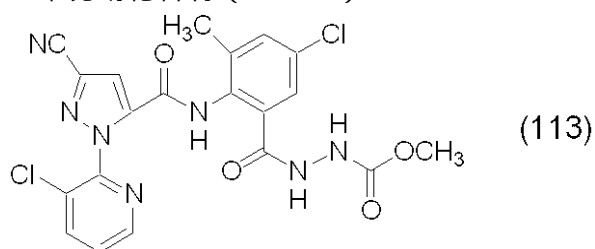
【0597】

製造例 113

6-クロロ-2-[1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-シアノ-1H-ピラゾール-5-イル]-8-メチル-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オン 0.10 g、メチルカーバゼート 0.23 g および N,N-ジメチルホルムアミド 4 mL を混合し、該混合物を室温で 18 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、メチル tert-ブチルエーテルで 3 回抽出した。有機層を合わせ、水、飽和食塩水で順次洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付して、本発明化合物 (113) 0.090 g を得た。

20

本発明化合物 (113)



30

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$) (ppm): 2.14 (3H, s), 3.61 (3H, brs), 7.38 (1H, brs), 7.54 (1H, s), 7.67 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 5 Hz), 7.81 (1H, s), 8.22 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.53 (1H, d, $J = 5\text{ Hz}$), 9.29 (1H, brs), 10.16 (1H, brs), 10.44 (1H, brs).

【0598】

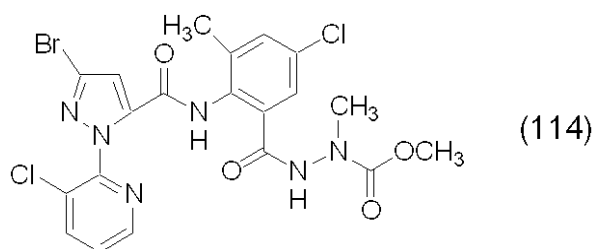
40

製造例 114

2-[3-ブロモ-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-イル]-6-クロロ-8-メチル-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オン 0.30 g、N-メチル-N-メトキシカルボニルヒドラジン 0.69 g、および N,N-ジメチルホルムアミド 15 mL を混合し、該混合物を 60 で 9 時間および 80 で 22 時間攪拌した。反応混合物に水を注加した後、メチル tert-ブチルエーテルで 3 回抽出した。有機層を合わせて、水および飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、本発明化合物 (114) 0.036 g を得た。

本発明化合物 (114)

50



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) (ppm): 2.20 (3H, s), 3.21 (3H, s), 3.74 (3H, brs), 7.05 (1H, s), 7.267.38 (3H, m), 7.86 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 2 Hz), 8.03 (1H, s), 8.42 (1H, dd, $J = 5\text{ Hz}$, 2 Hz), 9.47 (1H, s).

10

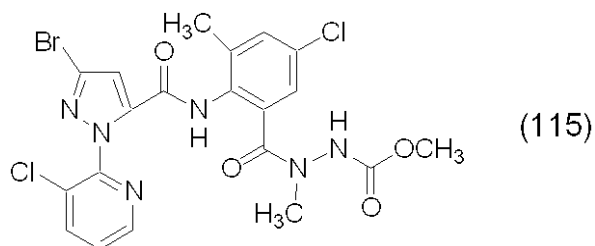
【0599】

製造例 115

3-プロモ-N-[4-クロロ-2-(N-メチルヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド 0.60 g、クロロギ酸メチル 0.41 mL およびピリジン 6 mL を混合し、該混合物を室温で 3 時間攪拌した。反応混合物に水を注加した後、減圧下濃縮した。残渣を水および酢酸エチルで分液し、有機層を飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、本発明化合物 (115) 0.46 g を得た。

20

本発明化合物 (115)



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) (ppm): 2.04 (3H, s), 3.22 (3H, s), 3.57 (2.6H, s), 3.80 (0.4H, s), 7.01 (1H, s), 7.04 (1H, s), 7.28 (1H, s), 7.40 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 5 Hz), 7.61 (1H, brs), 7.87 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 2 Hz), 8.46 (1H, dd, $J = 5\text{ Hz}$, 2 Hz), 9.80 (1H, brs).

30

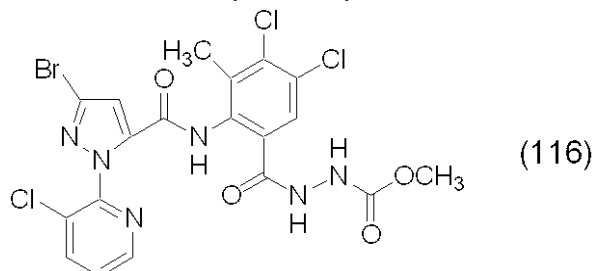
【0600】

製造例 116

2-[3-プロモ-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-イル]-8-クロロ-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オンの代わりに 2-[3-プロモ-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-イル]-6,7-ジクロロ-8-メチル-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オンを用い製造例 72 と同様の方法で本発明化合物 (116) を得た。

40

本発明化合物 (116)



$^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$, TMS) (ppm): 2.25 (3H, s), 3.4

50

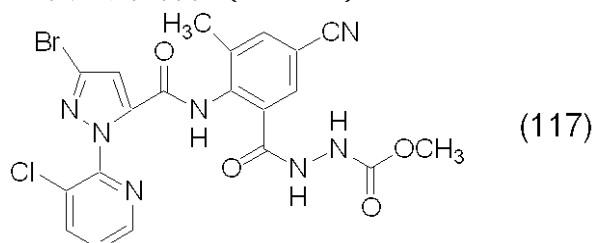
5 - 3.68 (3H, m), 7.36 (1H, s), 7.57 - 7.65 (2H, m), 8.18 (1H, d, J = 8 Hz), 8.50 (1H, d, J = 4 Hz), 9.36 (1H, brs), 10.24 (1H, brs), 10.49 (1H, brs).

【0601】

製造例 117

2 - [3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - クロロ - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンの代わりに 2 - [3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - メチル - 6 - シアノ - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを用い製造例 72 と同様の方法で本発明化合物 (117) を得た。

本発明化合物 (117)



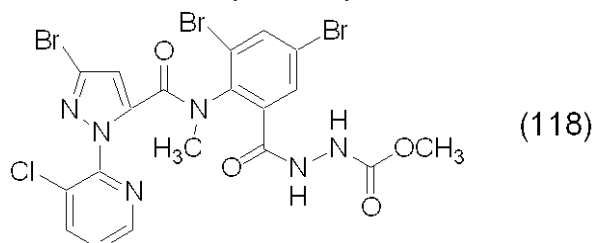
¹H - NMR (DMSO - d₆, TMS) (ppm): 2.20 (3H, s), 3.45 - 3.68 (3H, m), 7.38 (1H, s), 7.61 (1H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 7.77 (1H, s), 7.96 (1H, s), 8.17 (1H, d, J = 8 Hz), 8.50 (1H, d, J = 5 Hz), 9.36 (1H, brs), 10.27 (1H, brs), 10.49 (1H, brs).

【0602】

製造例 118

3, 5 - ジブロモ - 2 - {N - [3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピラゾール - 5 - カルボニル] - N - メチルアミノ}安息香酸 0.59 g、塩化チオニル 2 mL および N, N - ジメチルホルムアミド 1 滴を混合し、該混合物を 80 で 1 時間攪拌した。反応混合物を減圧下濃縮した後、ヘキサン 10 mL を加えさらに減圧下濃縮した。得られた残渣と、テトラヒドロフラン 10 mL、メチルカーバゼート 0.10 g およびピリジン 1 mL とを混合し、室温で 3 時間攪拌した。反応混合物を水 30 mL に注加し、酢酸エチルで 3 回抽出した。有機層を合わせ、水、飽和食塩水で順次洗浄後、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付して、本発明化合物 (118) 0.23 g を得た。

本発明化合物 (118)



¹H - NMR (DMSO - d₆, TMS) (ppm): 3.05 (1.9H, s), 3.38 (1.1H, s), 3.52 - 3.73 (3H, m), 5.68 (0.7H, brs), 7.11 (0.3H, brs), 7.57 - 7.81 (2H, m), 8.16 - 8.32 (2H, m), 8.49 - 8.55 (1H, m), 9.42 (1H, brs), 10.54 (1H, brs).

【0603】

製造例 119

3 - ブロモ - N - [4 - クロロ - 2 - (N, N' - ジメチルヒドラジノカルボニル) -

10

20

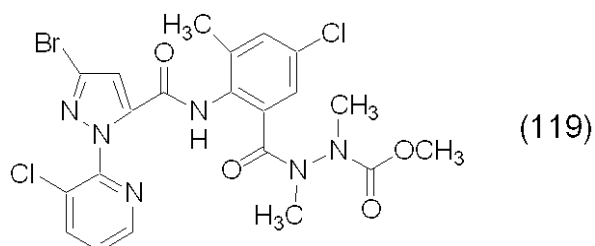
30

40

50

6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド 0 . 3 0 g 、クロロギ酸メチル 0 . 0 7 m l およびピリジン 5 m l を混合し、該混合物を室温で 1 時間攪拌した。反応混合物に水を注加した後、酢酸エチルで 3 回抽出した。有機層を合わせ、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣を酢酸エチルとヘキサンの混合溶媒で洗浄し、本発明化合物 (1 1 9) 0 . 0 9 g を得た。

本発明化合物 (1 1 9)



10

^1H - NMR (DMSO - d_6 , TMS) (ppm) : 2 . 1 0 - 2 . 2 4 (3 H , m) , 2 . 6 1 - 2 . 8 7 (3 H , m) , 2 . 9 0 - 3 . 1 8 (3 H , m) , 3 . 4 5 - 3 . 7 4 (3 H , m) , 7 . 1 2 - 7 . 3 0 (1 H , m) , 7 . 3 3 - 7 . 4 4 (1 H , m) , 7 . 4 4 - 7 . 5 8 (1 H , m) , 7 . 5 8 - 7 . 6 6 (1 H , m) , 8 . 2 0 (1 H , d , $J = 8 \text{ Hz}$) , 8 . 4 7 - 8 . 5 4 (1 H , m) , 1 0 . 1 0 - 1 0 . 5 0 (1 H , m) .

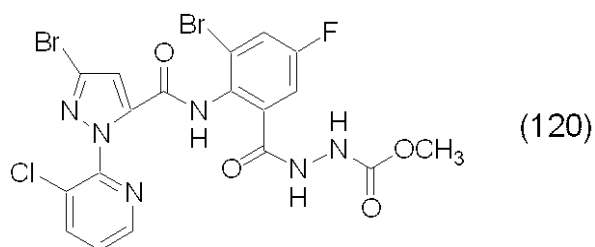
20

【 0 6 0 4 】

製造例 1 2 0

2 - [3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - クロロ - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンの代わりに 2 - [3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - ブロモ - 6 - フルオロ - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを用い製造例 7 2 と同様の方法で本発明化合物 (1 2 0) を得た。

本発明化合物 (1 2 0)



30

^1H - NMR (DMSO - d_6 , TMS) (ppm) : 3 . 4 2 - 3 . 6 9 (3 H , m) , 7 . 3 4 (1 H , d , $J = 8 \text{ Hz}$) , 7 . 4 1 (1 H , s) , 7 . 6 0 (1 H , dd , $J = 8 \text{ Hz}$, 5 Hz) , 7 . 8 9 (1 H , d , $J = 8 \text{ Hz}$) , 8 . 1 6 (1 H , d , $J = 8 \text{ Hz}$) , 8 . 5 0 (1 H , d , $J = 5 \text{ Hz}$) , 9 . 3 6 (1 H , brs) , 1 0 . 1 8 (1 H , brs) , 1 0 . 4 2 (1 H , brs) .

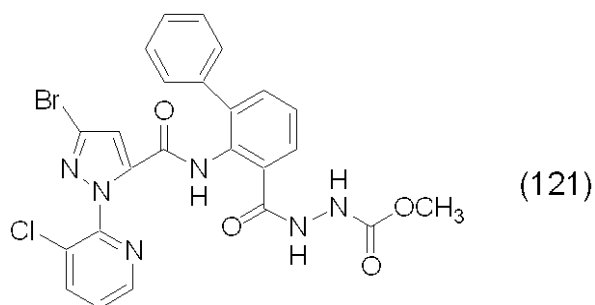
40

【 0 6 0 5 】

製造例 1 2 1

2 - [3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - クロロ - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンの代わりに 2 - [3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - フェニル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを用い製造例 7 2 と同様の方法で本発明化合物 (1 2 1) を得た。

本発明化合物 (1 2 1)



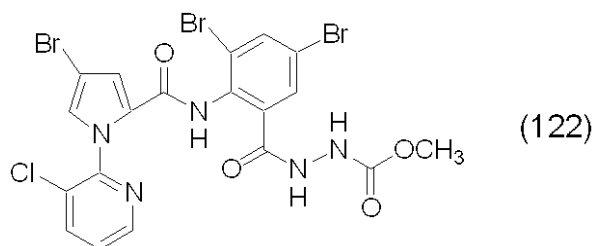
$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 3.49 - 3.68 (3H, m), 7.24 - 7.67 (10H, m), 8.08 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.43 (1H, d, $J = 4\text{ Hz}$), 9.29 (1H, brs), 10.08 (1H, brs), 10.19 (1H, brs).

【0606】

製造例 122

6,8-ジブロモ-2-[4-ブロモ-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-イル]-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オン 0.17 g、メチルカーバゼート 0.27 g および N,N-ジメチルホルムアミド 20 ml を混合し、該混合物を室温で2日間攪拌した。反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を水洗後、硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮して、本発明化合物(122) 0.15 g を得た。

本発明化合物(122)



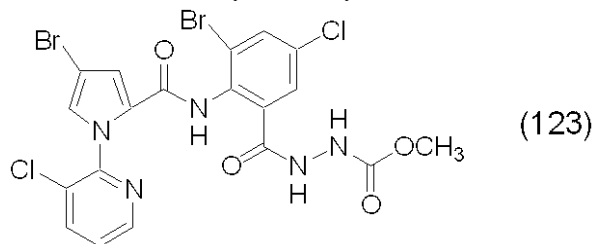
$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) (ppm): 3.67 (3H, s), 7.36 (1H, s), 7.46 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.54 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}, 5\text{ Hz}$), 7.70 (1H, s), 8.09 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.13 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 8.48 (1H, d, $J = 5\text{ Hz}$), 9.40 (1H, brs), 9.97 (1H, brs), 10.18 (1H, brs)

【0607】

製造例 123

6,8-ジブロモ-2-[4-ブロモ-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-イル]-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オンの代わりに8-ブロモ-2-[4-ブロモ-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-イル]-6-クロロ-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オンを用い製造例122と同様の方法で本発明化合物(123)を得た。

本発明化合物(123)



$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) (ppm): 3.62 (3H, s), 7.30 (1H, s), 7.39 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.48 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}, 5\text{ Hz}$)

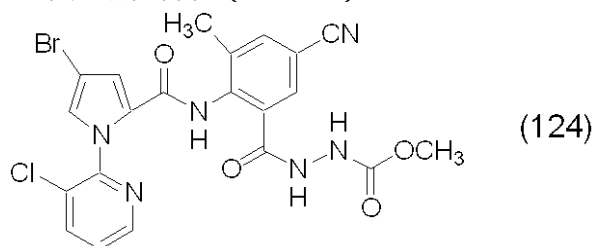
), 7.52 (1H, s), 7.96 (1H, d, J = 2 Hz), 8.03 (1H, dd, J = 8 Hz, 2 Hz), 8.42 (1H, dd, J = 5 Hz, 2 Hz), 9.35 (1H, brs), 9.92 (1H, brs), 10.11 (1H, brs)

【0608】

製造例 124

6, 8 - ジブromo - 2 - [4 - ブromo - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - イル] - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンの代わりに 2 - [4 - ブromo - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - イル] - 6 - シアノ - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを用い製造例 122 と同様の方法で本発明化合物 (124) を得た。

本発明化合物 (124)



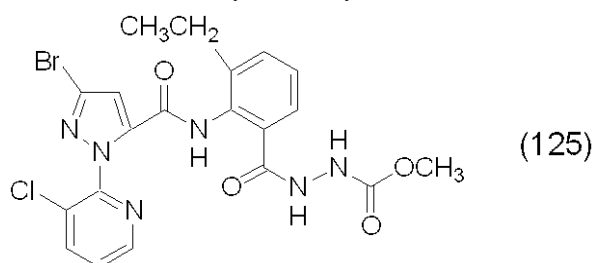
¹H - NMR (DMSO - d₆) (ppm) : 2.21 (3H, s), 3.64 (3H, s), 7.25 (1H, d, J = 2 Hz), 7.41 (1H, d, J = 2 Hz), 7.49 (1H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 7.77 (1H, s), 7.88 (1H, s), 8.04 (1H, dd, J = 8 Hz, 2 Hz), 8.43 (1H, dd, J = 5 Hz, 2 Hz), 9.36 (1H, brs), 10.05 (1H, brs), 10.27 (1H, brs)

【0609】

製造例 125

2 - [3 - ブromo - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - クロロ - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンの代わりに 2 - [3 - ブromo - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - エチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを用い製造例 72 と同様の方法で本発明化合物 (125) を得た。

本発明化合物 (125)



¹H - NMR (DMSO - d₆, TMS) (ppm) : 1.06 - 1.13 (3H, m), 2.45 - 2.60 (2H, m), 3.55 - 3.70 (3H, m), 7.25 - 7.47 (4H, m), 7.57 - 7.63 (1H, m), 8.14 - 8.19 (1H, m), 8.46 - 8.53 (1H, m), 9.24 (1H, brs), 9.98 (1H, brs), 10.16 (1H, brs) .

【0610】

製造例 126

N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1H - ピラゾール - 5 - カルボキサミドの代わりに N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - シクロヘキシル - 3 - トリフルオロメチル - 1H - ピラゾール - 5 - カルボ

10

20

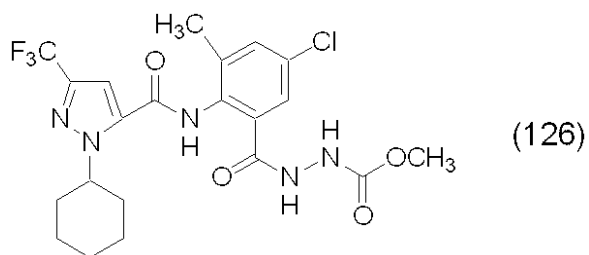
30

40

50

キサミドを用い製造例 5 と同様の方法で本発明化合物 (1 2 6) を得た。

本発明化合物 (1 2 6)



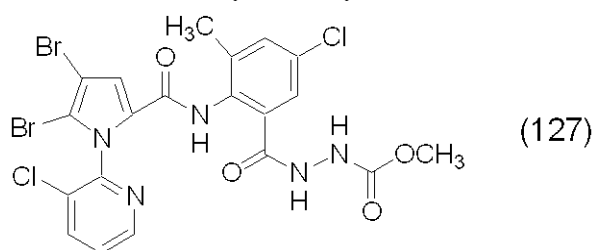
^1H - NMR (DMSO - d_6) (p p m) : 1 . 2 0 - 1 . 4 1 (3 H , m) , 1 . 6 7 - 1 . 8 0 (5 H , m) , 1 . 9 8 - 2 . 0 0 (2 H , m) , 2 . 2 5 (3 H , s) , 3 . 5 6 (3 H , s) , 5 . 0 0 - 5 . 0 8 (1 H , m) , 7 . 3 3 (1 H , s) , 7 . 4 0 (1 H , d , J = 2 H z) , 7 . 5 5 (1 H , d , J = 2 H z) , 9 . 0 2 (1 H , b r s) , 9 . 9 4 (1 H , b r s) , 1 0 . 0 4 (1 H , b r s)

【 0 6 1 1 】

製造例 1 2 7

4 - ブロモ - N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボキサミドの代わりに 4 , 5 - ジブロモ - N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボキサミドを用い製造例 9 3 と同様の方法で本発明化合物 (1 2 7) を得た。

本発明化合物 (1 2 7)



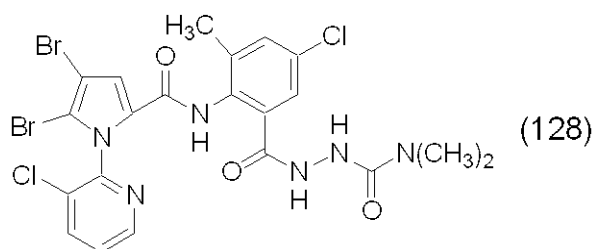
^1H - NMR (DMSO - d_6) (p p m) : 2 . 0 9 (3 H , s) , 3 . 6 3 (3 H , s) , 7 . 3 6 (1 H , s) , 7 . 4 2 (1 H , s) , 7 . 4 9 (1 H , s) , 7 . 5 7 (1 H , d d , J = 8 H z , 5 H z) , 8 . 1 4 (1 H , d , J = 8 H z) , 8 . 5 0 (1 H , d , J = 5 H z) , 9 . 2 9 (1 H , b r s) , 9 . 7 9 (1 H , b r s) , 1 0 . 1 2 (1 H , b r s)

【 0 6 1 2 】

製造例 1 2 8

4 , 5 - ジブロモ - N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボキサミド 0 . 2 0 g 、 N , N - ジメチルカルバモイルクロライド 0 . 0 4 g およびピリジン 0 . 0 8 m L を N , N - ジメチルホルムアミド中で混合し、該混合物を室温で 1 4 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を水洗後、硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付して、本発明化合物 (1 2 8) 0 . 1 6 g を得た。

本発明化合物 (1 2 8)



¹H - NMR (DMSO - d₆) (ppm) : 2.08 (3H, s), 2.88 (6H, s), 7.40 (1H, d, J = 2 Hz), 7.44 (1H, d, J = 2 Hz), 7.52 (1H, s), 7.58 (1H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 8.14 (1H, dd, J = 8 Hz, 1 Hz), 8.50 (1H, dd, J = 5 Hz, 1 Hz), 8.56 (1H, brs), 9.75 (1H, brs), 9.81 (1H, brs)

10

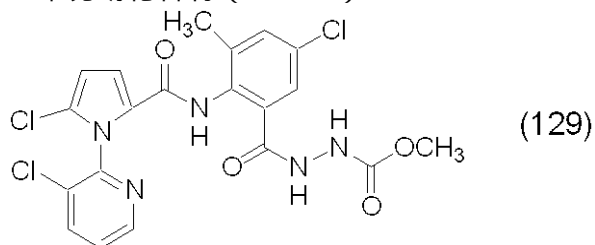
【0613】

製造例 129

6, 8 - ジブロモ - 2 - [4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - イル] - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンの代わりに、2 - [5 - クロロ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - イル] - 6 - クロロ - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを用い、製造例 122 と同様の方法で本発明化合物 (129) を得た。

本発明化合物 (129)

20



¹H - NMR (DMSO - d₆, TMS) (ppm) : 2.11 (3H, s), 3.63 (3H, s), 6.48 (1H, d, J = 4 Hz), 7.24 (1H, d, J = 4 Hz), 7.48 (1H, s), 7.55 (1H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 7.95 (1H, s), 8.12 (1H, dd, J = 8 Hz, 2 Hz), 8.49 (1H, dd, J = 5 Hz, 2 Hz), 9.31 (1H, brs), 9.74 (1H, brs), 10.13 (1H, brs)

30

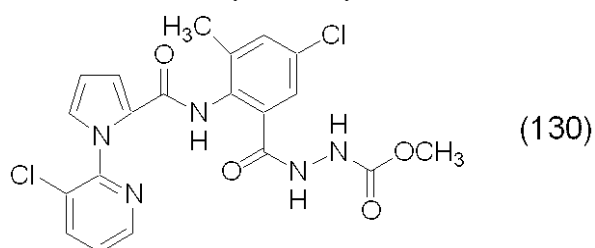
【0614】

製造例 130

4 - ブロモ - N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボキサミドの代わりに、N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボキサミドを用い、製造例 93 と同様の方法で本発明化合物 (130) を得た。

40

本発明化合物 (130)



¹H - NMR (DMSO - d₆, TMS) (ppm) : 2.16 (3H, s), 3.61 (3H, s), 6.37 (1H, d, J = 3 Hz), 7.12 - 7.18 (2H, m),

50

7.40 (1H, s), 7.45 - 7.50 (2H, m), 8.03 (1H, d, J = 8 Hz), 8.42 (1H, d, J = 5 Hz), 9.33 (1H, brs), 9.71 (1H, brs), 10.14 (1H, brs)

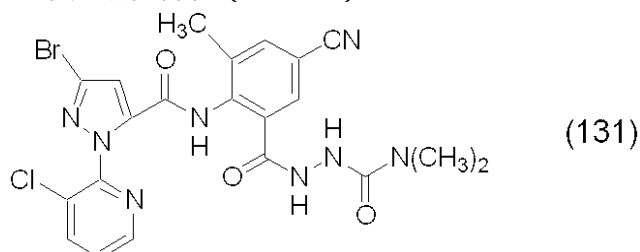
【0615】

製造例 131

N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミドの代わりに、3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - N - [4 - シアノ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミドを用い、製造例 10 と同様の方法で本発明化合物 (131) を得た。

10

本発明化合物 (131)



¹H - NMR (DMSO - d₆, TMS) (ppm) : 2.18 (3 H, s), 2.88 (6 H, s), 7.49 (1 H, s), 7.62 (1 H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 7.82 (1 H, s), 7.93 (1 H, s), 8.19 (1 H, dd, J = 8 Hz, 1 Hz), 8.50 (1 H, dd, J = 5 Hz, 1 Hz), 8.63 (1 H, brs), 9.93 (1 H, brs), 10.42 (1 H, brs)

20

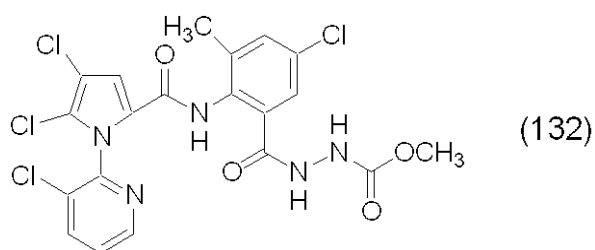
【0616】

製造例 132

4 - ブロモ - N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボキサミドの代わりに、4, 5 - ジクロロ - N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボキサミドを用い、製造例 93 と同様の方法で本発明化合物 (132) を得た。

30

本発明化合物 (132)



¹H - NMR (DMSO - d₆, TMS) (ppm) : 2.10 (3 H, s), 3.63 (3 H, s), 7.39 (2 H, s), 7.49 (1 H, s), 7.59 (1 H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 8.15 (1 H, dd, J = 8 Hz, 1 Hz), 8.51 (1 H, dd, J = 5 Hz, 1 Hz), 9.30 (1 H, brs), 9.82 (1 H, brs), 10.12 (1 H, brs)

40

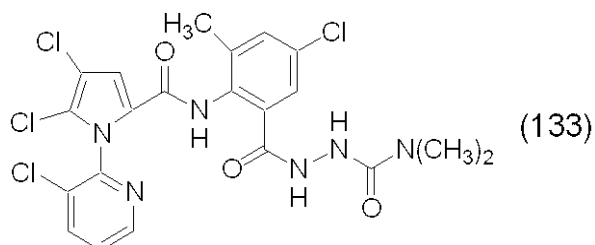
【0617】

製造例 133

4, 5 - ジブロモ - N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボキサミドの代わりに、4, 5 - ジクロロ - N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボキサミドを用い、製造例 128 と同様の方法で本発明化合物 (133) を得た。

50

本発明化合物 (1 3 3)



^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 2.10 (3H, s), 2.53 (6H, s), 7.37-7.39 (2H, m), 7.51 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.59 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 5 Hz), 8.17 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 2 Hz), 8.52 (1H, dd, $J = 5\text{ Hz}$, 2 Hz), 9.31 (1H, brs), 9.82 (1H, brs), 10.13 (1H, brs)

10

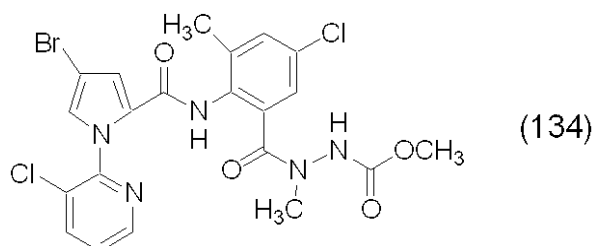
【 0 6 1 8 】

製造例 1 3 4

4-プロモ-N-[4-クロロ-2-(N-メチルヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-カルボキサミド 0.50 g、クロロギ酸メチル 0.11 g、ピリジン 0.18 ml および N,N-ジメチルホルムアミド 5 ml を混合し、該混合物を室温で 3 時間攪拌した。反応混合物を水に注加し、酢酸エチルで 3 回抽出した。有機層を合わせ、水および飽和食塩水で順次洗浄後、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付して、本発明化合物 (1 3 4) 0.09 g を得た。

20

本発明化合物 (1 3 4)



^1H -NMR (CDCl $_3$, TMS) (ppm): 2.05-2.12 (3H, m), 3.21 (3H, s), 3.54-3.76 (3H, m), 7.02 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.06 (2H, s), 7.29 (1H, brs), 7.33 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 5 Hz), 7.80-7.86 (2H, m), 8.40 (1H, dd, $J = 5\text{ Hz}$, 2 Hz), 8.99 (1H, brs)

30

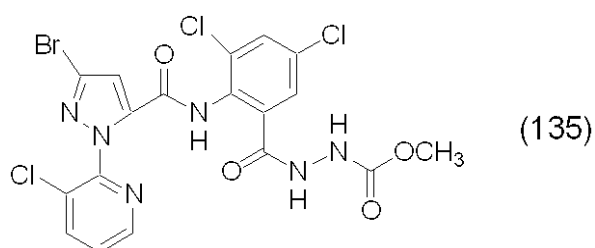
【 0 6 1 9 】

製造例 1 3 5

2-[3-プロモ-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-イル]-8-クロロ-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オンの代わりに、2-[3-プロモ-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-イル]-6,8-ジクロロ-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オンを用い、製造例 7 2 と同様の方法で本発明化合物 (1 3 5) を得た。

40

本発明化合物 (1 3 5)



50

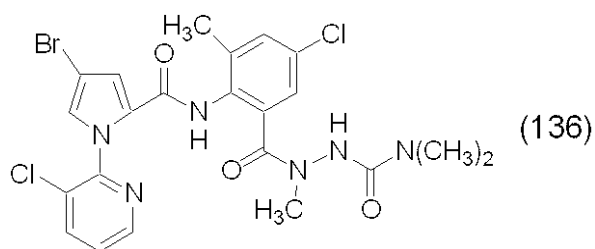
^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 3.47 - 3.62 (3H, m), 7.40 (1H, s), 7.51 (1H, s), 7.60 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 5 Hz), 7.93 (1H, s), 8.16 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 1 Hz), 8.50 (1H, dd, $J = 5\text{ Hz}$, 1 Hz), 9.37 (1H, brs), 10.24 (1H, brs), 10.48 (1H, brs)

【0620】

製造例 136

4-ブロモ-N-[4-クロロ-2-(N-メチルヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-カルボキサミド 0.25 g、N,N-ジメチルカルバモイルクロライド 0.06 g、ピリジン 0.09 mL および N,N-ジメチルホルムアミド 5 mL を混合し、該混合物を 70 で 8 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、析出した沈殿を濾取した。得られた固体をアセトニトリルで洗浄することにより、本発明化合物 (136) 0.10 g を得た。

本発明化合物 (136)



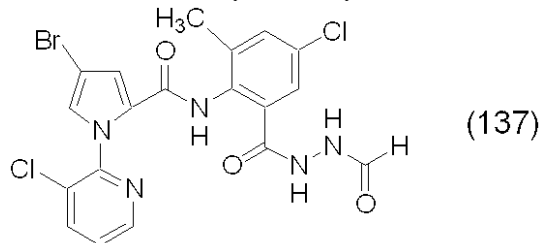
^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 2.11 (3H, s), 2.65 - 2.85 (6H, m), 3.19 - 3.29 (3H, m), 7.07 (1H, s), 7.14 (1H, s), 7.28 (1H, s), 7.40 (1H, s), 7.50 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 5 Hz), 7.60 (1H, brs), 8.06 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.43 (1H, d, $J = 5\text{ Hz}$), 9.86 (1H, brs)

【0621】

製造例 137

4-ブロモ-N-[4-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-カルボキサミド 0.50 g、ギ酸 4 mL および無水酢酸 2 mL を氷冷下混合し、該混合物を室温で 2 時間攪拌した。反応混合物を水に注加し、酢酸エチルで 3 回抽出した。有機層を合わせ、水および飽和食塩水で順次洗浄後、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮した。残渣をアセトニトリルで洗浄することにより、本発明化合物 (137) 0.20 g を得た。

本発明化合物 (137)



^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 2.15 (3H, s), 7.23 (1H, s), 7.42 - 7.44 (2H, m), 7.48 - 7.52 (2H, m), 8.05 (1H, d, $J = 7\text{ Hz}$), 8.43 (1H, d, $J = 3\text{ Hz}$), 8.98 (1H, s), 9.76 (1H, s), 9.96 (1H, brs), 10.12 (1H, brs)

【0622】

製造例 138

3-ブロモ-N-[4-クロロ-2-(N-メチルヒドラジノカルボニル)-6-メチ

10

20

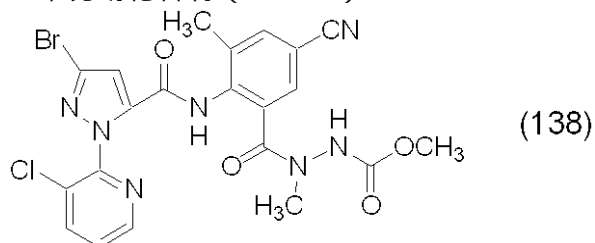
30

40

50

ルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミドの代わりに、3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - N - [4 - シアノ - 2 - (N - メチルヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミドを用い、製造例 1 1 5 と同様の方法で本発明化合物 (1 3 8) を得た。

本発明化合物 (1 3 8)



10

^1H - NMR (DMSO - d_6 , TMS) (ppm): 2.21 (3H, s), 3.08 (3H, s), 3.45 - 3.70 (3H, m), 7.30 - 7.43 (1H, m), 7.44 - 7.61 (1H, m), 7.63 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}, 5\text{ Hz}$), 7.82 - 7.94 (1H, m), 8.21 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}, 1\text{ Hz}$), 8.51 (1H, dd, $J = 5\text{ Hz}, 1\text{ Hz}$), 9.21 (1H, brs), 10.24 (1H, brs)

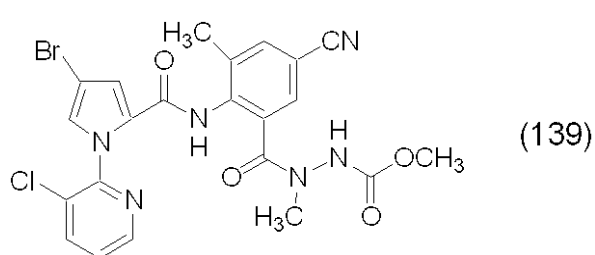
【0 6 2 3】

20

製造例 1 3 9

4 - ブロモ - N - [4 - クロロ - 2 - (N - メチルヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボキサミドの代わりに、4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - N - [4 - シアノ - 2 - (N - メチルヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 H - ピロール - 2 - カルボキサミドを用い、製造例 1 3 4 と同様の方法で本発明化合物 (1 3 9) を得た。

本発明化合物 (1 3 9)



30

^1H - NMR (DMSO - d_6 , TMS) (ppm): 2.21 (3H, s), 3.08 (3H, s), 3.47 - 3.70 (3H, m), 7.18 - 7.30 (1H, m), 7.41 - 7.50 (1H, m), 7.51 - 7.56 (2H, m), 7.80 - 7.90 (1H, m), 8.12 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}, 1\text{ Hz}$), 8.45 (1H, dd, $J = 5\text{ Hz}, 1\text{ Hz}$), 9.10 (1H, brs), 9.73 (1H, brs)

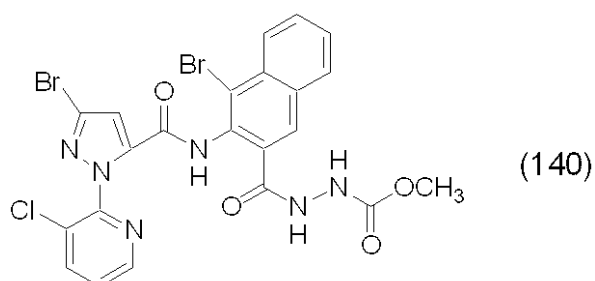
40

【0 6 2 4】

製造例 1 4 0

N - [1 - クロロ - 3 - (ヒドラジノカルボニル) - 2 - ナフチル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミドの代わりに、3 - ブロモ - N - [1 - ブロモ - 3 - (ヒドラジノカルボニル) - 2 - ナフチル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミドを用い、製造例 6 6 と同様の方法で本発明化合物 (1 4 0) を得た。

本発明化合物 (1 4 0)



^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 3.42 - 3.71 (3H, m), 7.48 (1H, s), 7.58 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 5 Hz), 7.72 (1H, t, $J = 7\text{ Hz}$), 7.81 (1H, t, $J = 7\text{ Hz}$), 8.10 - 8.21 (3H, m), 8.24 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.50 (1H, d, $J = 5\text{ Hz}$), 9.34 (1H, brs), 10.26 (1H, brs), 10.64 (1H, brs)

10

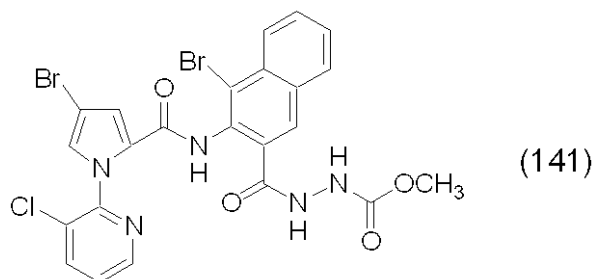
【0625】

製造例 141

N-[1-クロロ-3-(ヒドラジノカルボニル)-2-ナフチル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-カルボキサミドの代わりに、4-ブromo-N-[1-ブromo-3-(ヒドラジノカルボニル)-2-ナフチル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-カルボキサミドを用い、製造例 66 と同様の方法で本発明化合物 (141) を得た。

20

本発明化合物 (141)



^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 3.43 - 3.70 (3H, m), 7.37 (1H, s), 7.42 - 7.52 (2H, m), 7.70 (1H, t, $J = 7\text{ Hz}$), 7.79 (1H, t, $J = 7\text{ Hz}$), 8.03 (1H, d, $J = 7\text{ Hz}$), 8.06 - 8.20 (2H, m), 8.23 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.43 (1H, d, $J = 4\text{ Hz}$), 9.34 (1H, brs), 10.09 (1H, brs), 10.19 (1H, brs)

30

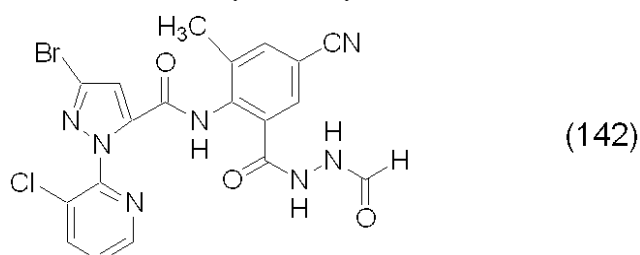
【0626】

製造例 142

N-[4-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-カルボキサミドの代わりに、3-ブromo-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-N-[4-シアノ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1H-ピラゾール-5-カルボキサミドを用い、製造例 17 と同様の方法で本発明化合物 (142) を得た。

40

本発明化合物 (142)



50

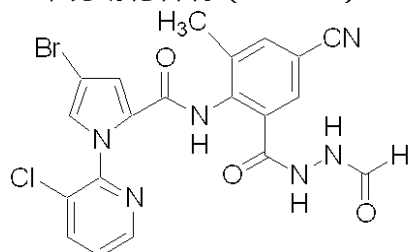
^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 2.16 - 2.34 (3H, m), 7.35 - 7.45 (1H, m), 7.57 - 7.66 (1H, m), 7.76 - 7.88 (1H, m), 7.93 - 8.02 (1H, m), 8.03 - 8.12 (1H, m), 8.17 (1H, d, $J = 7\text{ Hz}$), 8.50 (1H, brs), 9.55 - 10.03 (1H, m), 10.17 - 10.58 (2H, m)

【0627】

製造例 143

N-[4-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-カルボキサミドの代わりに、4-ブromo-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-N-[4-シアノ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1H-ピロール-2-カルボキサミドを用い、製造例 17 と同様の方法で本発明化合物 (143) を得た。

本発明化合物 (143)



(143)

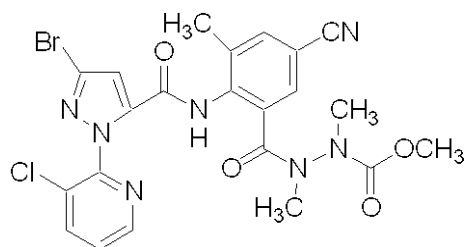
^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 2.17 - 2.30 (3H, m), 7.24 - 7.36 (1H, m), 7.45 - 7.55 (2H, m), 7.74 - 7.82 (1H, m), 7.88 - 7.95 (1H, m), 8.03 - 8.09 (2H, m), 8.44 (1H, d, $J = 5\text{ Hz}$), 10.02 (1H, brs), 10.21 (1H, brs), 10.46 (1H, brs)

【0628】

製造例 144

3-ブromo-N-[4-クロロ-2-(N,N'-ジメチルヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミドの代わりに、3-ブromo-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-N-[4-シアノ-2-(N,N'-ジメチルヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1H-ピラゾール-5-カルボキサミドを用い、製造例 119 と同様の方法で本発明化合物 (144) を得た。

本発明化合物 (144)



(144)

^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 2.14 - 2.29 (3H, m), 2.64 - 2.87 (3H, m), 2.87 - 3.15 (3H, m), 3.42 - 3.73 (3H, m), 7.30 - 7.45 (1H, m), 7.54 - 7.81 (2H, m), 7.83 - 8.01 (1H, m), 8.15 - 8.24 (1H, m), 8.50 (1H, brs), 10.20 - 10.68 (1H, m)

【0629】

製造例 145

3-ブromo-N-[1-ブromo-3-(ヒドラジノカルボニル)-2-ナフチル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド 0.25 g

10

20

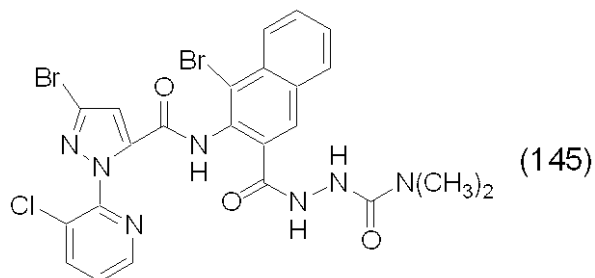
30

40

50

、N,N-ジメチルカルバモイルクロライド 0.22 g、アセトニトリル 4 ml およびピリジン 1 ml を混合し、該混合物を室温で 2 時間攪拌し、室温で 1 晩放置した。反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで 3 回抽出した。有機層を合わせて、水および飽和食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮し、本発明化合物 (145) 0.20 g を得た。

本発明化合物 (145)



10

¹H-NMR (DMSO-d₆, TMS) (ppm): 2.88 (6H, s), 7.54 (1H, s), 7.59 (1H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 7.72 (1H, t, J = 7 Hz), 7.79 (1H, t, J = 7 Hz), 8.09 (1H, d, J = 7 Hz), 8.15 (1H, dd, J = 8 Hz, 1 Hz), 8.19 - 8.26 (2H, m), 8.50 (1H, dd, J = 5, 1 Hz), 8.54 (1H, brs), 9.90 (1H, brs), 10.57 (1H, brs)

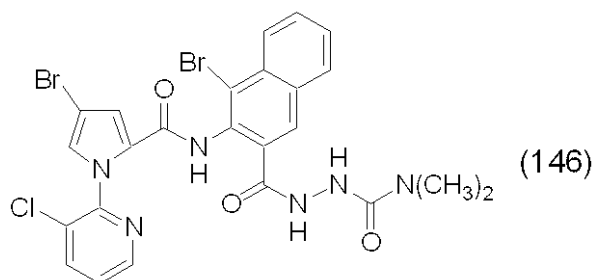
20

【0630】

製造例 146

3-ブromo-N-[1-ブromo-3-(ヒドラジノカルボニル)-2-ナフチル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミドの代わりに、4-ブromo-N-[1-ブromo-3-(ヒドラジノカルボニル)-2-ナフチル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-カルボキサミドを用い、製造例 145 と同様の方法で本発明化合物 (146) を得た。

本発明化合物 (146)



30

¹H-NMR (DMSO-d₆, TMS) (ppm): 2.88 (6H, s), 7.37 - 7.44 (1H, m), 7.44 - 7.51 (2H, m), 7.69 (1H, t, J = 7 Hz), 7.77 (1H, t, J = 7 Hz), 8.01 - 8.10 (2H, m), 8.19 - 8.25 (2H, m), 8.43 (1H, dd, J = 5 Hz, 1 Hz), 8.55 (1H, brs), 9.84 (1H, brs), 10.05 (1H, brs)

40

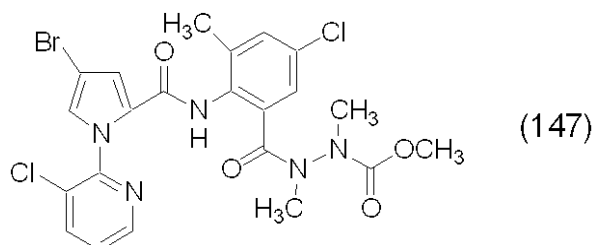
【0631】

製造例 147

4-ブromo-N-[4-クロロ-2-(N,N'-ジメチルヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-カルボキサミド 0.26 g、クロロギ酸メチル 0.05 g、ピリジン 0.09 ml および N,N-ジメチルホルムアミド 5 ml を混合し、該混合物を室温で 3 時間攪拌した。反応混合物を水に注加し、酢酸エチルで 3 回抽出した。有機層を合わせ、水および飽和食塩水で順次洗浄後、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付して、本発明化合物 (147) 0.20 g を得た。

50

本発明化合物 (1 4 7)



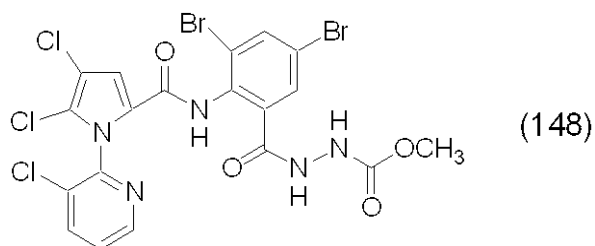
^1H -NMR (CDCl₃, TMS) (ppm): 2.18 (3H, s), 2.88 - 2.98 (3H, m), 3.13 - 3.22 (3H, m), 3.63 - 3.82 (3H, m), 7.01 - 7.12 (3H, m), 7.20 (1H, s), 7.30 (1H, d, J = 5 Hz), 7.79 - 7.80 (1H, m), 8.37 - 8.38 (1H, m), 8.45 - 8.58 (1H, br m)

【 0 6 3 2 】

製造例 1 4 8

4 - ブロモ - N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボキサミドの代わりに N - [4 , 6 - ジブロモ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) フェニル] - 4 , 5 - ジクロロ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボキサミドを用い製造例 9 3 と同様の方法で本発明化合物 (1 4 8) を得た。

本発明化合物 (1 4 8)



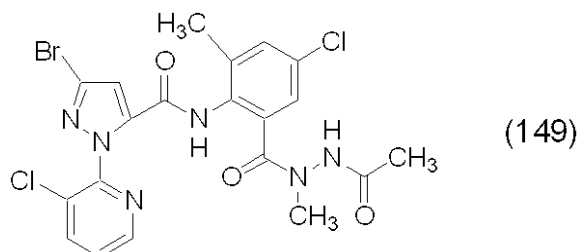
^1H -NMR (DMSO-d₆, TMS) (ppm): 3.62 (3H, s), 7.45 (1H, s), 7.58 (1H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 7.63 (1H, s), 8.10 (1H, s), 8.15 (1H, dd, J = 8 Hz, 2 Hz), 8.51 (1H, dd, J = 5 Hz, 2 Hz), 9.34 (1H, br s), 10.00 (1H, br s), 10.15 (1H, br s)

【 0 6 3 3 】

製造例 1 4 9

3 - ブロモ - N - [4 - クロロ - 2 - (N - メチルヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド 0.50 g、アセチルクロライド 0.09 g、ピリジン 0.09 g およびテトラヒドロフラン 10 ml を混合し、該混合物を室温で 2 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を水洗後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をメチル tert - ブチルエーテルおよびヘキサンで洗浄し、本発明化合物 (1 4 9) 0.48 g を得た。

本発明化合物 (1 4 9)



10

20

30

40

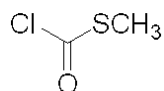
50

^1H -NMR (CDCl_3 , TMS) (ppm): 1.56 (3H, s), 2.01 (3H, s), 3.24 (3H, s), 6.97 (2H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.39 - 7.42 (2H, m), 7.88 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 1 Hz), 8.39 (1H, s), 8.47 (1H, dd, $J = 5\text{ Hz}$, 1 Hz), 10.12 (1H, brs)

【0634】

製造例 150

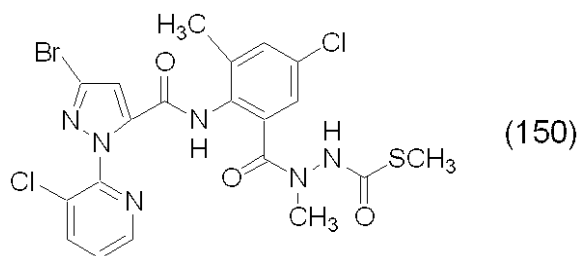
3-ブロモ-N-[4-クロロ-2-(N-メチルヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド 0.50 g、メチルクロロチオールホルメート(Methyl chlorothiol formate)



10

0.12 g、ピリジン 0.09 g およびテトラヒドロフラン 10 ml を混合し、室温で 2 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を水洗後、無水硫酸マグネシウムで乾燥、減圧下濃縮した。得られた残渣をメチル tert-ブチルエーテルおよびヘキサンで洗浄し、本発明化合物(150) 0.50 g を得た。

本発明化合物(150)



20

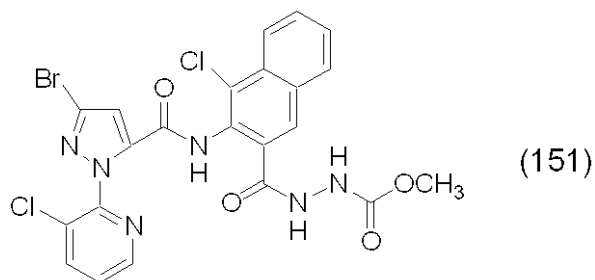
^1H -NMR (CDCl_3 , TMS) (ppm): 2.06 (3H, brs), 2.25 (3H, brs), 3.20 (3H, brs), 6.99 - 7.29 (3H, m), 7.41 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 5 Hz), 7.88 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 1 Hz), 8.01 - 8.23 (1H, brm), 8.46 (1H, d, $J = 5\text{ Hz}$), 9.49 - 9.79 (1H, brm)

【0635】

製造例 151

2-[3-ブロモ-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-イル]-10-クロロ-4H-ナフト[2,3-d][1,3]オキサジン-4-オン 0.49 g、メチルカーバゼート 0.90 g および N,N-ジメチルホルムアミド 5 ml を混合し、該混合物を室温で 2 時間攪拌した。反応混合物に水を注加した後、酢酸エチルで 3 回抽出した。有機層を合わせて、水および飽和食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮し、本発明化合物(151) 0.31 g を得た。

本発明化合物(151)



40

^1H -NMR ($\text{DMSO}-d_6$, TMS) (ppm): 3.59 - 3.68 (3H, m), 7.47 (1H, s), 7.56 - 7.62 (1H, m), 7.74 (1H, d, $J = 7\text{ Hz}$), 7.80 (1H, d, $J = 7\text{ Hz}$), 8.12 - 8.18 (3H, m), 8.25 (1H, d, $J = 7\text{ Hz}$), 8.50 (1H, d, $J = 5\text{ Hz}$), 9.35 (1H

50

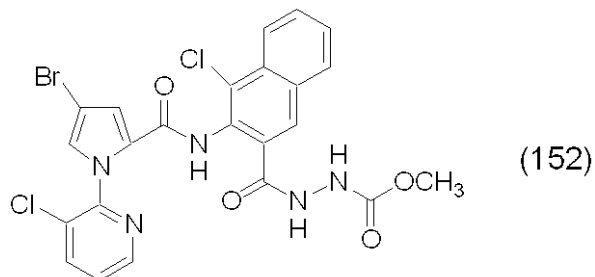
, b r s), 10.30 (1H, b r s), 10.60 (1H, b r s)

【0636】

製造例152

2-[3-ブromo-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-イル]-10-クロロ-4H-ナフト[2,3-d][1,3]オキサジン-4-オンの代わりに、2-[4-ブromo-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-イル]-10-クロロ-4H-ナフト[2,3-d][1,3]オキサジン-4-オンを用い、製造例151と同様の方法で本発明化合物(152)を得た。

本発明化合物(152)



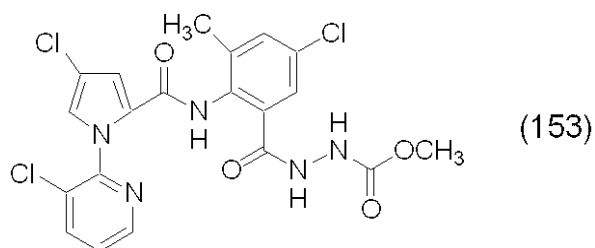
¹H-NMR(DMSO-d₆, TMS) (ppm): 3.55-3.70(3H, m), 7.35(1H, s), 7.43-7.51(2H, m), 7.71(1H, t, J=8Hz), 7.79(1H, t, J=8Hz), 8.04(1H, d, J=8Hz), 8.12(2H, d, J=8Hz), 8.23(1H, d, J=8Hz), 8.43(1H, d, J=5Hz), 9.35(1H, b r s), 10.06(1H, b r s), 10.24(1H, b r s)

【0637】

製造例153

4-ブromo-N-[4-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-カルボキサミドの代わりに、4-クロロ-N-[4-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-カルボキサミドを用い、製造例93と同様の方法で本発明化合物(153)を得た。

本発明化合物(153)



¹H-NMR(DMSO-d₆, TMS) (ppm): 2.17(3H, s), 3.63(3H, s), 7.18(1H, d, J=2Hz), 7.35(1H, d, J=2Hz), 7.39(1H, s), 7.47(1H, s), 7.49(1H, dd, J=8Hz, 5Hz), 8.03(1H, dd, J=8Hz, 2Hz), 8.42(1H, dd, J=5Hz, 2Hz), 9.31(1H, b r s), 9.76(1H, b r s), 10.12(1H, b r s)

【0638】

製造例154

3-ブromo-N-[4,6-ジクロロ-2-(N-メチルヒドラジノカルボニル)フェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド 0.52g、クロロギ酸メチル 0.10g、ピリジン 0.09gおよびテトラヒドロフラン 7mlを混合し、該混合物を室温で1時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、酢酸エ

10

20

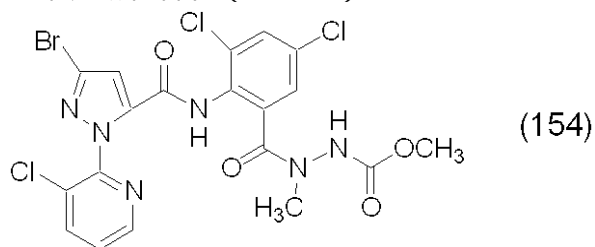
30

40

50

チルで抽出した。有機層を水洗後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をメチル *tert*-ブチルエーテルおよびヘキサンで洗浄し、本発明化合物 (154) 0.49 g を得た。

本発明化合物 (154)



10

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) (ppm): 3.12 - 3.18 (3H, br m), 3.60 - 3.84 (3H, br m), 7.21 - 7.22 (2H, m), 7.34 (1H, br s), 7.41 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 5 Hz), 7.51 (1H, br s), 7.88 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 1 Hz), 8.48 (1H, dd, $J = 5\text{ Hz}$, 1 Hz), 9.85 (1H, br s)

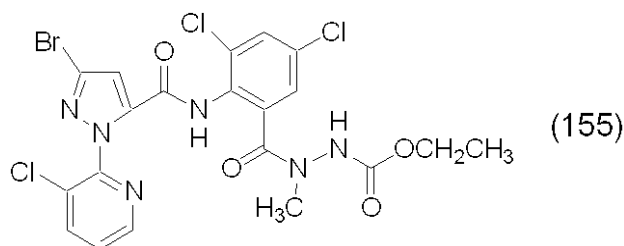
【0639】

製造例 155

クロロギ酸メチルの代わりに、クロロギ酸エチルを用い、製造例 154 と同様の方法で本発明化合物 (155) を得た。

20

本発明化合物 (155)



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) (ppm): 1.11 - 1.39 (3H, m), 3.12 - 3.18 (3H, br m), 4.06 - 4.25 (2H, br m), 7.08 - 7.22 (2H, m), 7.34 (1H, br s), 7.41 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 5 Hz), 7.43 (1H, br s), 7.88 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 1 Hz), 8.49 (1H, dd, $J = 5\text{ Hz}$, 1 Hz), 9.87 (1H, br s)

30

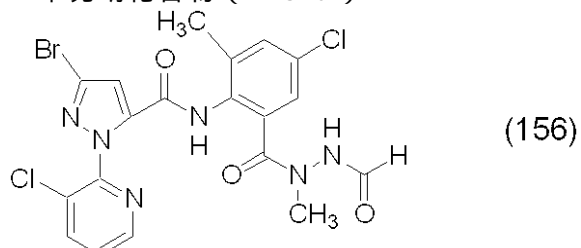
【0640】

製造例 156

3-ブロモ-N-[4-クロロ-2-(N-メチルヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド 0.50 g およびギ酸 5 ml を混合し、該混合物を 50 で 1 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を水洗後、無水硫酸マグネシウムで乾燥、減圧下濃縮した。得られた残渣をメチル *tert*-ブチルエーテルおよびヘキサンで洗浄し、本発明化合物 (156) 0.40 g を得た。

40

本発明化合物 (156)



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) (ppm): 2.02 (3H, s), 3.25 (

50

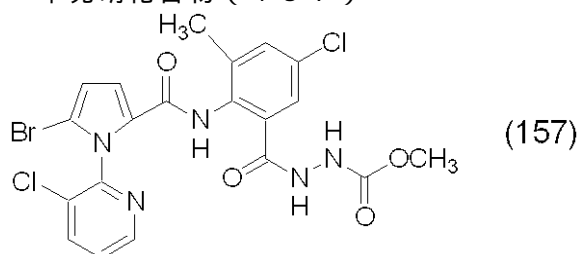
3 H, s), 6.99 (2 H, d, J = 4 Hz), 7.35 (1 H, s), 7.41 (1 H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 7.64 (1 H, s), 7.88 (1 H, dd, J = 8 Hz, 2 Hz), 8.47 (1 H, dd, J = 5 Hz, 2 Hz), 8.58 (1 H, s), 10.08 (1 H, s)

【0641】

製造例 157

4 - ブロモ - N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボキサミドの代わりに、5 - ブロモ - N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボキサミドを用い、製造例 93 と同様の方法で本発明化合物 (157) を得た。

本発明化合物 (157)



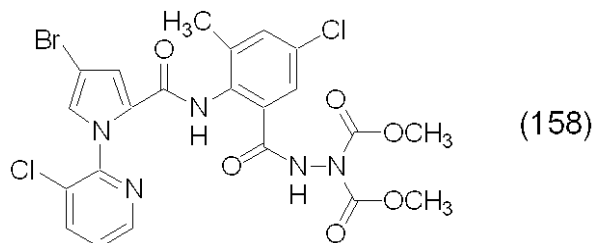
¹H - NMR (DMSO - d₆, TMS) (ppm) : 2.11 (3 H, s), 3.63 (3 H, s), 6.54 (1 H, d, J = 3 Hz), 7.24 (1 H, d, J = 3 Hz), 7.39 (1 H, s), 7.46 (1 H, s), 7.54 (1 H, dd, J = 8 Hz, 4 Hz), 8.09 (1 H, d, J = 8 Hz), 8.28 (1 H, d, J = 4 Hz), 9.30 (1 H, brs), 9.74 (1 H, brs), 10.13 (1 H, brs)

【0642】

製造例 158

本発明化合物 (93) 0.50 g、トリエチルアミン 0.26 ml およびテトラヒドロフラン 15 ml の混合物に、氷冷下、クロロギ酸メチル 0.14 ml を滴下した。該混合物を室温で 5 時間攪拌した後、反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで 3 回抽出した。有機層を合わせて、水および飽和食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウム乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、本発明化合物 (158) 0.21 g を得た。

本発明化合物 (158)



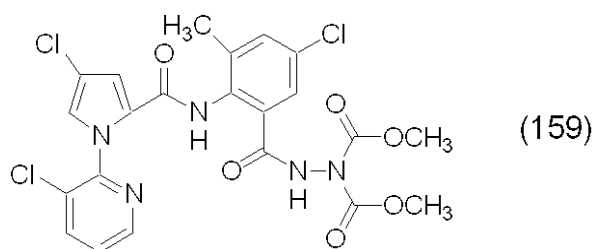
¹H - NMR (CDCl₃, TMS) (ppm) : 2.22 (3 H, s), 3.79 (6 H, s), 7.01 (1 H, d, J = 2 Hz), 7.07 (1 H, d, J = 2 Hz), 7.30 (1 H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 7.32 (1 H, s), 7.39 (1 H, s), 7.82 (1 H, d, J = 8 Hz), 8.33 (1 H, d, J = 5 Hz), 8.45 (1 H, brs), 8.88 (1 H, brs)

【0643】

製造例 159

本発明化合物 (93) の代わりに、本発明化合物 (153) を用い、製造例 158 と同様の方法で本発明化合物 (159) を得た。

本発明化合物 (159)



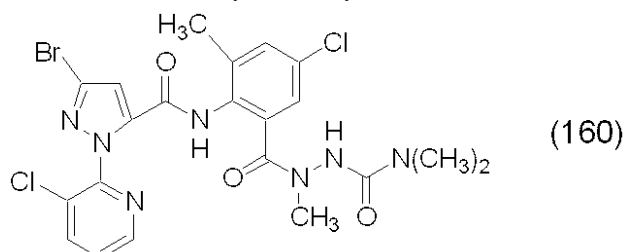
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) (ppm): 2.18 (3H, s), 3.73 (6H, s), 7.00 - 7.01 (2H, m), 7.24 - 7.28 (3H, m), 7.79 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.29 (1H, d, $J = 4\text{ Hz}$), 8.82 (1H, brs), 9.06 (1H, brs)

【0644】

製造例 160

3-プロモ-N-[4-クロロ-2-(N-メチルヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド 0.50 g、N,N-ジメチルカルバモイルクロライド 0.12 g、ピリジン 0.09 g およびテトラヒドロフラン 20 ml を氷冷下混合し、該混合物を 50 で 14 時間攪拌した。該混合物に、さらに、N,N-ジメチルカルバモイルクロライド 0.12 g およびピリジン 0.09 g を加え、該混合物を 50 で 9 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を水洗後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をメチル tert-ブチルエーテルおよびヘキサンで洗浄し、本発明化合物 (160) 0.15 g を得た。

本発明化合物 (160)



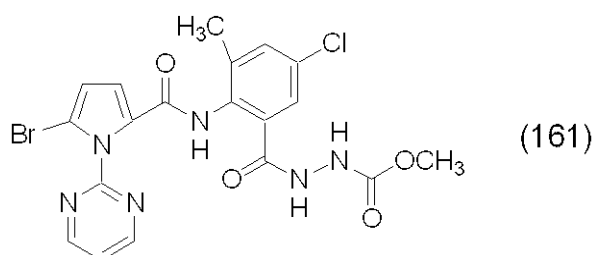
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) (ppm): 1.98 (3H, s), 2.46 (6H, s), 3.30 (3H, s), 6.95 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.05 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.37 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 5 Hz), 7.51 (1H, s), 7.81 (1H, s), 7.85 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 2 Hz), 8.45 (1H, dd, $J = 5\text{ Hz}$, 2 Hz), 10.34 (1H, brs).

【0645】

製造例 161

4-プロモ-N-[4-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-カルボキサミドの代わりに 5-プロモ-N-[4-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(2-ピリミジニル)-1H-ピロール-2-カルボキサミドを用い製造例 93 と同様の方法で本発明化合物 (161) を得た。

本発明化合物 (161)



10

20

30

40

50

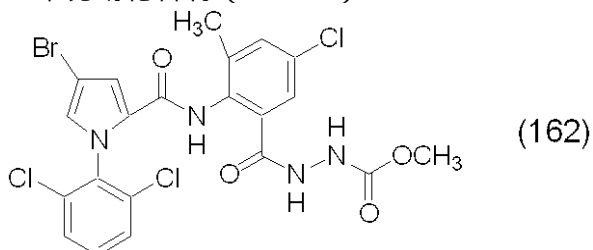
^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 2.14 (3H, s), 3.46 - 3.67 (3H, m), 6.08 - 6.50 (1H, m), 7.08 - 7.29 (1H, m), 7.38 (1H, s), 7.51 (1H, s), 7.58 - 7.65 (1H, m), 8.89 - 8.95 (2H, m), 9.09 - 9.39 (1H, m), 9.74 - 9.90 (1H, m), 10.11 (1H, brs)

【0646】

製造例 162

4-ブロモ-N-[4-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-カルボキサミドの代わりに4-ブロモ-N-[4-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(2,6-ジクロロフェニル)-1H-ピロール-2-カルボキサミドを用い製造例93と同様の方法で本発明化合物(162)を得た。

本発明化合物(162)



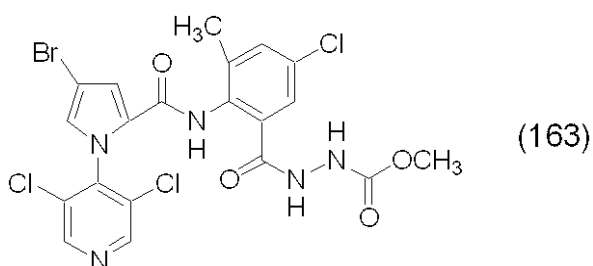
^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 2.11 (3H, s), 3.46 - 3.68 (3H, m), 7.27 (1H, s), 7.30 - 7.47 (3H, m), 7.50 (1H, s), 7.53 - 7.65 (2H, m), 9.02 - 9.38 (1H, m), 9.71 (1H, brs), 10.13 (1H, brs)

【0647】

製造例 163

4-ブロモ-N-[4-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-カルボキサミドの代わりに4-ブロモ-N-[4-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3,5-ジクロロ-4-ピリジニル)-1H-ピロール-2-カルボキサミドを用い製造例93と同様の方法で本発明化合物(163)を得た。

本発明化合物(163)



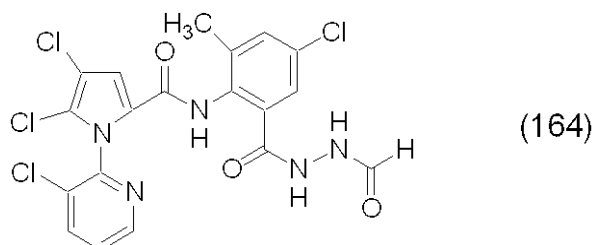
^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 2.12 (3H, s), 3.48 - 3.67 (3H, m), 7.33 - 7.40 (2H, m), 7.46 (1H, d, J = 2 Hz), 7.51 (1H, d, J = 2 Hz), 8.76 (2H, s), 9.31 (1H, brs), 9.82 (1H, brs), 10.14 (1H, brs)

【0648】

製造例 164

4-ブロモ-N-[4-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-カルボキサミドの代わりに、4,5-ジクロロ-N-[4-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-カルボキサミドを用い、製造例137と同様の方法で本発明化合物(164)を得た。

本発明化合物 (1 6 4)



^1H - NMR (DMSO - d_6 , TMS) (ppm) : 2 . 0 9 - 2 . 1 9 (3 H , s) , 7 . 3 4 - 7 . 5 3 (3 H , m) , 7 . 5 9 (1 H , dd , $J = 8 \text{ Hz}$, 5 Hz) , 8 . 0 6 (1 H , s) , 8 . 1 6 (1 H , d , $J = 8 \text{ Hz}$) , 8 . 5 2 (1 H , d , $J = 5 \text{ Hz}$) , 9 . 8 7 (1 H , brs) , 10 . 1 3 (1 H , brs) 10 . 3 8 (1 H , brs)

10

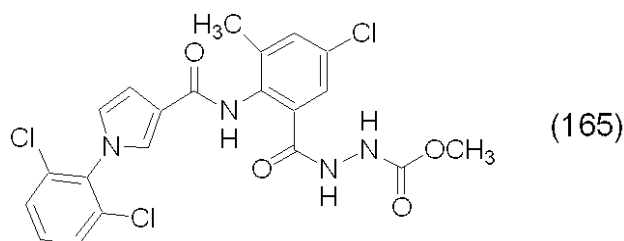
【 0 6 4 9 】

製造例 1 6 5

N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (2 , 6 - ジクロロフェニル) - 1 H - ピロール - 3 - カルボキサミド 0 . 4 3 g 、 クロロ炭酸メチル 0 . 1 5 g 、 ピリジン 2 m l およびアセトニトリル 1 0 m l を氷冷下混合し、該混合物を氷冷下 1 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで 3 回抽出した。有機層を合わせて、水および飽和食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮し、本発明化合物 (1 6 5) 0 . 1 6 g を得た。

20

本発明化合物 (1 6 5)



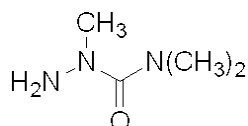
^1H - NMR (DMSO - d_6 , TMS) (ppm) : 2 . 2 4 (3 H , s) , 3 . 3 8 - 3 . 6 5 (3 H , m) , 6 . 8 1 (1 H , brs) , 6 . 9 6 (1 H , brs) , 7 . 3 3 - 7 . 6 1 (4 H , m) , 7 . 6 8 - 7 . 7 4 (2 H , m) , 9 . 3 7 (1 H , brs) , 9 . 5 2 (1 H , brs) , 10 . 2 1 (1 H , brs)

30

【 0 6 5 0 】

製造例 1 6 6

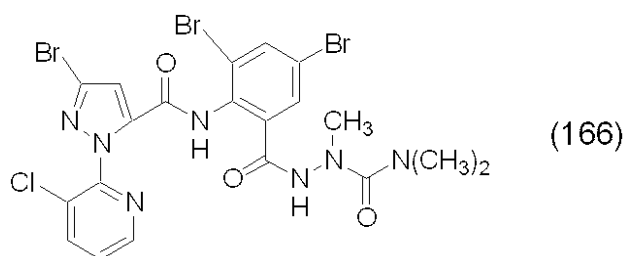
2 - [3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 6 , 8 - ジブロモ - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン 0 . 5 6 g 、 2 , 4 , 4 - トリメチルセミカルバジド



40

0 . 4 7 g および N - メチルピロリジノン 1 5 m l を混合し、該混合物を室温で 2 2 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を水洗後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣を酢酸エチルで洗浄し、本発明化合物 (1 6 6) 0 . 1 1 g を得た。

本発明化合物 (1 6 6)



^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 2.66 (6H, s), 2.68 (3H, s), 7.45 (1H, brs), 7.59 - 7.63 (2H, m), 8.15 - 8.17 (2H, m), 8.49 (1H, d, $J = 4\text{ Hz}$), 10.50 (1H, brs), 10.55 (1H, brs).

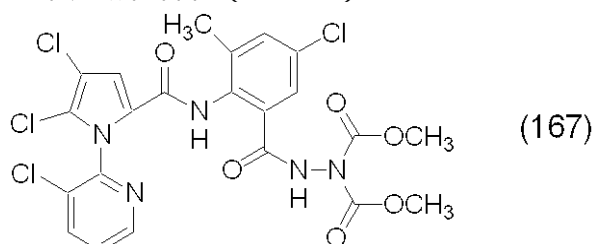
10

【0651】

製造例 167

本発明化合物(93)の代わりに、本発明化合物(132)を用い、製造例158と同様の方法で本発明化合物(167)を得た。

本発明化合物(167)



20

^1H -NMR (CDCl $_3$, TMS) (ppm): 2.18 (3H, s), 3.82 (6H, s), 7.00 (1H, s), 7.32 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.36 - 7.39 (2H, m), 7.86 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 2 Hz), 8.12 (1H, s), 8.43 (1H, dd, $J = 5\text{ Hz}$, 2 Hz), 8.85 (1H, brs)

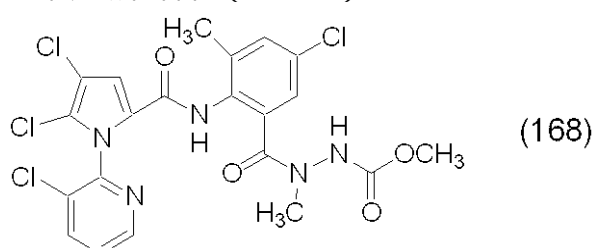
【0652】

製造例 168

4-プロモ-N-[4-クロロ-2-(N-メチルヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-カルボキサミドの代わりに、4,5-ジクロロ-N-[4-クロロ-2-(N-メチルヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-カルボキサミドを用い、製造例134と同様の方法で本発明化合物(168)を得た。

30

本発明化合物(168)



40

^1H -NMR (CDCl $_3$, TMS) (ppm): 2.02 - 2.11 (3H, m), 3.02 - 3.28 (3H, m), 3.54 - 3.89 (3H, m), 6.95 - 7.15 (1H, m), 7.22 - 7.31 (2H, m), 7.39 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 5 Hz), 7.70 (1H, brs), 7.87 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 2 Hz), 8.47 (1H, dd, $J = 5\text{ Hz}$, 2 Hz), 9.23 (1H, brs)

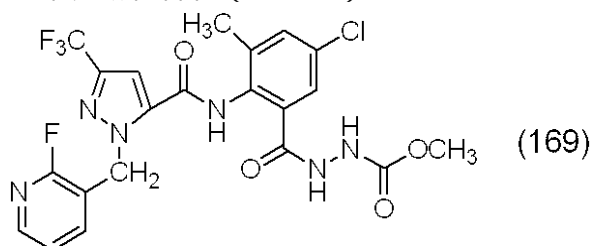
【0653】

製造例 169

50

N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミドの代わりに、N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - [(2 - フルオロ - 3 - ピリジニル) メチル] - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミドを用い、製造例 5 と同様の方法で本発明化合物 (1 6 9) を得た。

本発明化合物 (1 6 9)



10

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO - d_6 , TMS) (ppm) : 2 . 1 4 (3 H , s) , 3 . 5 2 - 3 . 6 2 (3 H , m) , 5 . 8 5 (2 H , s) , 7 . 3 0 - 7 . 3 6 (1 H , m) , 7 . 3 9 (1 H , s) , 7 . 5 1 (1 H , s) , 7 . 5 9 (1 H , d , J = 2 \text{ Hz}) , 7 . 6 1 - 7 . 7 1 (1 H , m) , 8 . 1 9 (1 H , d , J = 5 \text{ Hz}) , 9 . 2 6 (1 H , \text{brs}) , 10 . 2 0 (1 H , \text{brs}) , 10 . 2 5 (1 H , \text{brs})

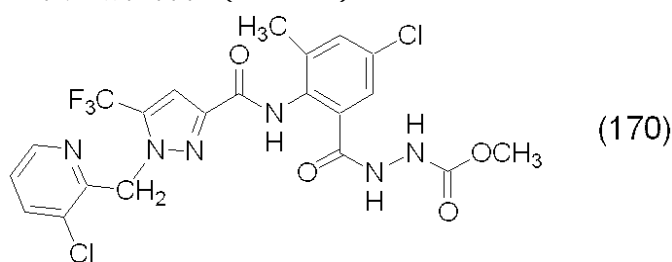
【 0 6 5 4 】

20

製造例 1 7 0

N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - [(3 - クロロ - 2 - ピリジニル) メチル] - 5 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボキサミド 0 . 0 8 g、クロロ炭酸メチル 0 . 0 5 g、ピリジン 1 m l およびアセトニトリル 1 0 m l を氷冷下混合し、該混合物を氷冷下 1 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで 3 回抽出した。有機層を合わせて、水および飽和食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮し、本発明化合物 (1 6 5) 0 . 0 6 g を得た。

本発明化合物 (1 7 0)



30

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO - d_6 , TMS) (ppm) : 2 . 2 0 (3 H , s) , 3 . 5 3 - 3 . 6 4 (3 H , m) , 5 . 8 6 (2 H , s) , 7 . 4 1 - 7 . 4 9 (3 H , m) , 7 . 5 9 (1 H , s) , 8 . 0 3 (1 H , d , J = 7 \text{ Hz}) , 8 . 4 4 (1 H , d , J = 4 \text{ Hz}) , 9 . 3 2 (1 H , \text{brs}) , 9 . 9 6 (1 H , \text{brs}) , 10 . 2 5 (1 H , \text{brs})

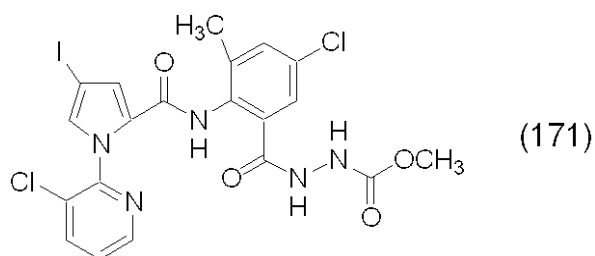
【 0 6 5 5 】

40

製造例 1 7 1

4 - ブロモ - N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボキサミドの代わりに N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 4 - ヨード - 1 H - ピロール - 2 - カルボキサミドを用い製造例 9 3 と同様の方法で本発明化合物 (1 7 1) を得た。

本発明化合物 (1 7 1)



^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 2.15 (3H, s), 3.63 (3H, s), 7.25 (1H, s), 7.38 (1H, s), 7.40 (1H, s), 7.49 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}, 5\text{ Hz}$), 7.51 (1H, s), 8.05 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}, 2\text{ Hz}$), 8.43 (1H, dd, $J = 5\text{ Hz}, 2\text{ Hz}$), 9.33 (1H, brs), 9.72 (1H, brs), 10.12 (1H, brs)

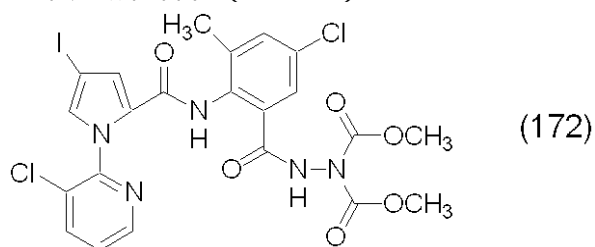
10

【0656】

製造例 172

本発明化合物(93)の代わりに、本発明化合物(171)を用い、製造例158と同様の方法で本発明化合物(172)を得た。

本発明化合物(172)



20

^1H -NMR (CDCl $_3$, TMS) (ppm): 2.19 (3H, s), 3.73 (6H, s), 7.10 (1H, d, $J = 1\text{ Hz}$), 7.14 (1H, d, $J = 1\text{ Hz}$), 7.25 - 7.31 (3H, m), 7.79 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}, 2\text{ Hz}$), 8.31 (1H, dd, $J = 5\text{ Hz}, 2\text{ Hz}$), 9.20 (1H, s), 9.23 (1H, brs)

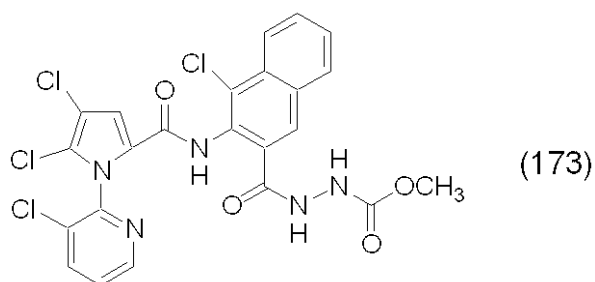
【0657】

30

製造例 173

2-[3-ブromo-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-イル]-10-クロロ-4H-ナフト[2,3-d][1,3]オキサジン-4-オンの代わりに、10-クロロ-2-[4,5-ジクロロ-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-イル]-4H-ナフト[2,3-d][1,3]オキサジン-4-オンを用い、製造例151と同様の方法で本発明化合物(173)を得た。

本発明化合物(173)



40

^1H -NMR (CDCl $_3$, TMS) (ppm): 3.60 (3H, s), 7.46 - 7.59 (2H, m), 7.69 - 7.81 (2H, m), 8.11 - 8.23 (4H, m), 8.48 - 8.52 (1H, m), 9.32 (1H, brs), 10.09 (1H, brs), 10.22 (1H, brs)

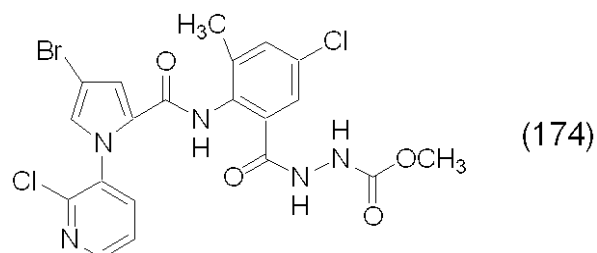
【0658】

50

製造例 174

4 - ブロモ - N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボキサミドの代わりに 4 - ブロモ - N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (2 - クロロ - 3 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボキサミドを用い製造例 93 と同様の方法で本発明化合物 (174) を得た。

本発明化合物 (174)



10

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO - d_6 , TMS) (ppm) : 2 . 15 (3 H , s) , 3 . 45 - 3 . 67 (3 H , m) , 7 . 27 (1 H , s) , 7 . 36 (1 H , s) , 7 . 42 (1 H , d , $J = 1\text{ Hz}$) , 7 . 48 - 7 . 54 (2 H , m) , 7 . 94 (1 H , dd , $J = 8\text{ Hz}$, 1 Hz) , 8 . 42 (1 H , dd , $J = 5\text{ Hz}$, 1 Hz) , 9 . 29 (1 H , brs) , 9 . 73 (1 H , brs) , 10 . 12 (1 H , brs)

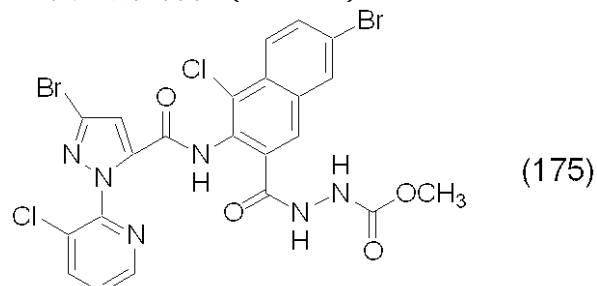
【 0659 】

20

製造例 175

2 - [3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 10 - クロロ - 4 H - ナフト [2 , 3 - d] [1 , 3] オキサジン - 4 - オンの代わりに、7 - ブロモ - 2 - [3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 10 - クロロ - 4 H - ナフト [2 , 3 - d] [1 , 3] オキサジン - 4 - オンを用い、製造例 151 と同様の方法で本発明化合物 (175) を得た。

本発明化合物 (175)



30

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO - d_6 , TMS) (ppm) : 3 . 58 - 3 . 70 (3 H , m) , 7 . 46 (1 H , s) , 7 . 59 (1 H , dd , $J = 8\text{ Hz}$, 5 Hz) , 7 . 93 (1 H , d , $J = 9\text{ Hz}$) , 8 . 08 - 8 . 21 (3 H , m) , 8 . 46 - 8 . 53 (2 H , m) , 9 . 36 (1 H , brs) , 10 . 33 (1 H , brs) , 10 . 62 (1 H , brs)

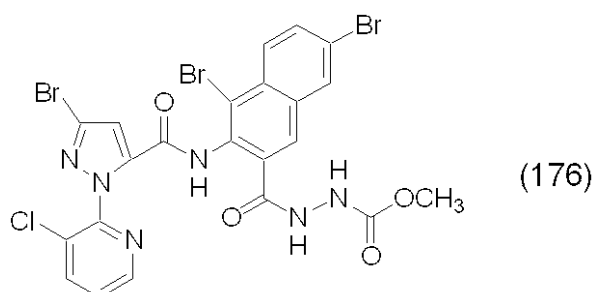
【 0660 】

40

製造例 176

2 - [3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 10 - クロロ - 4 H - ナフト [2 , 3 - d] [1 , 3] オキサジン - 4 - オンの代わりに、7 , 10 - ジブロモ - 2 - [3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 4 H - ナフト [2 , 3 - d] [1 , 3] オキサジン - 4 - オンを用い、製造例 151 と同様の方法で本発明化合物 (176) を得た。

本発明化合物 (176)



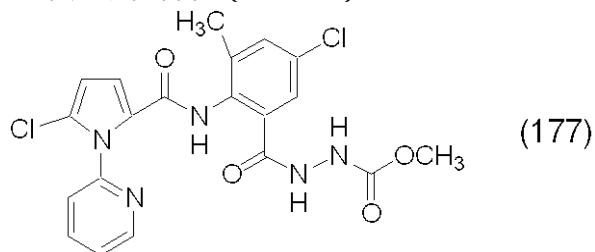
¹H-NMR (DMSO-d₆, TMS) (ppm): 3.59 - 3.69 (3H, m), 7.47 (1H, s), 7.56 - 7.62 (1H, m), 7.92 (1H, d, J = 9 Hz), 8.10 - 8.20 (3H, m), 8.45 - 8.54 (2H, m), 9.35 (1H, brs), 10.29 (1H, brs), 10.66 (1H, brs)

【0661】

製造例 177

4-ブロモ-N-[4-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-カルボキサミドの代わりに5-クロロ-N-[4-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-カルボキサミドを用い製造例93と同様の方法で本発明化合物(177)を得た。

本発明化合物(177)



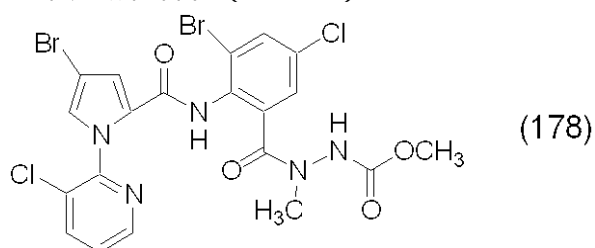
¹H-NMR (DMSO-d₆, TMS) (ppm): 2.13 (3H, s), 3.63 (3H, s), 6.42 (1H, d, J = 4 Hz), 7.13 (1H, d, J = 4 Hz), 7.37 (1H, s), 7.42 - 7.47 (2H, m), 7.50 (1H, d, J = 2 Hz), 7.94 (1H, td, J = 8 Hz, 2 Hz), 8.50 (1H, dd, J = 5 Hz, 2 Hz), 9.33 (1H, brs), 9.69 (1H, brs), 10.12 (1H, brs)

【0662】

製造例 178

4-ブロモ-N-[4-クロロ-2-(N-メチルヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-カルボキサミドの代わりに、4-ブロモ-N-[6-プロモ-4-クロロ-2-(N-メチルヒドラジノカルボニル)フェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-カルボキサミドを用い、製造例134と同様の方法で本発明化合物(178)を得た。

本発明化合物(178)



¹H-NMR (CDCl₃, TMS) (ppm): 3.15 (3H, s), 3.58 (

10

20

30

40

50

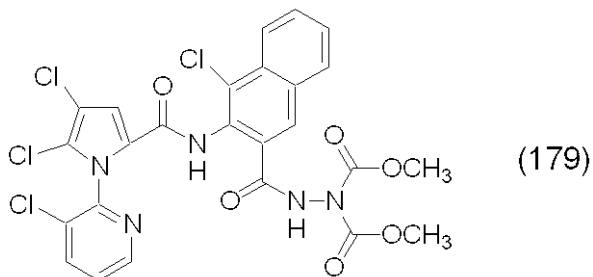
3 H, s), 7.04 (1 H, d, J = 2 Hz), 7.26 (1 H, s), 7.35 (1 H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 7.46 (1 H, d, J = 2 Hz), 7.70 (1 H, s), 7.82 (1 H, dd, J = 8 Hz, 2 Hz), 8.43 (1 H, dd, J = 5 Hz, 2 Hz), 8.55 (1 H, brs), 8.80 (1 H, brs)

【0663】

製造例 179

本発明化合物(93)の代わりに、本発明化合物(173)を用い、製造例158と同様の方法で本発明化合物(179)を得た。

本発明化合物(179)



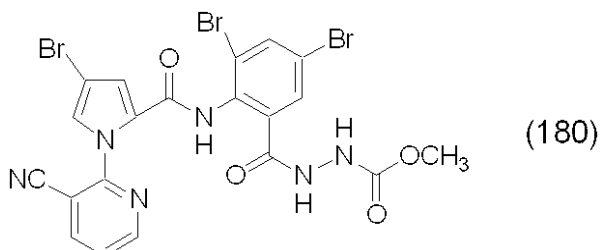
¹H-NMR (CDCl₃, TMS) (ppm): 3.81 (6 H, s), 7.15 (1 H, s), 7.35 (1 H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 7.52 - 7.63 (2 H, m), 7.84 (1 H, d, J = 8 Hz), 7.85 (1 H, d, J = 8 Hz), 8.04 (1 H, s), 8.15 (1 H, dd, J = 8 Hz, 2 Hz), 8.41 (1 H, dd, J = 5 Hz, 2 Hz), 8.46 (1 H, brs), 8.68 (1 H, brs)

【0664】

製造例 180

6,8-ジブromo-2-[4-ブromo-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-イル]-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オンの代わりに、6,8-ジブromo-2-[4-ブromo-1-(3-シアノ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-イル]-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オンを用い、製造例122と同様の方法で本発明化合物(180)を得た。

本発明化合物(180)



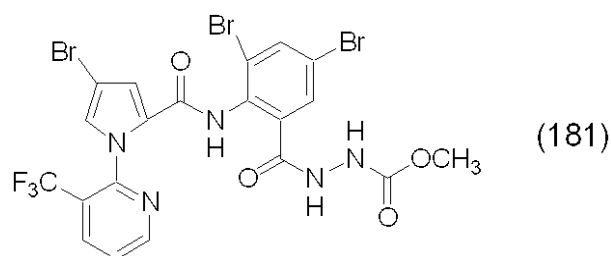
¹H-NMR (DMSO-d₆, TMS) (ppm): 3.62 (3 H, s), 7.36 (1 H, d, J = 2 Hz), 7.64 (1 H, d, J = 2 Hz), 7.64 (1 H, s), 7.67 (1 H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 8.11 (1 H, s), 8.47 (1 H, dd, J = 8 Hz, 2 Hz), 8.74 (1 H, dd, J = 5 Hz, 2 Hz), 9.24 (1 H, brs), 10.03 (1 H, brs), 10.14 (1 H, brs)

【0665】

製造例 181

6,8-ジブromo-2-[4-ブromo-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-イル]-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オンの代わりに、6,8-ジブromo-2-[4-ブromo-1-(3-トリフルオロメチル-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-イル]-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オンを用い、製造例122と同様の方法で本発明化合物(181)を得た。

本発明化合物(181)



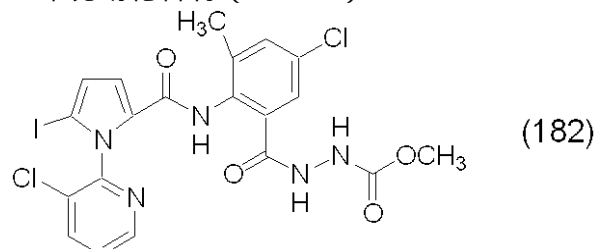
^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 3.62 (3H, s), 7.33 (1H, s), 7.50 (1H, s), 7.63 (1H, s), 7.72 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 5 Hz), 8.08 (1H, s), 8.33 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.74 (1H, d, $J = 5\text{ Hz}$), 9.35 (1H, brs), 9.88 (1H, brs), 10.11 (1H, brs)

【0666】

製造例 182

4-ブromo-N-[4-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-カルボキサミドの代わりに、N-[4-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-5-ヨード-1H-ピロール-2-カルボキサミドを用い、製造例 93 と同様の方法で本発明化合物 (182) を得た。

本発明化合物 (182)



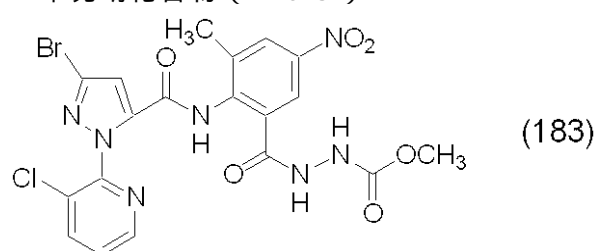
^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 2.11 (3H, s), 3.63 (3H, s), 6.63 (1H, d, $J = 4\text{ Hz}$), 7.19 (1H, d, $J = 4\text{ Hz}$), 7.40 (1H, s), 7.43 (1H, s), 7.52 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 5 Hz), 8.06 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 2 Hz), 8.48 (1H, dd, $J = 5\text{ Hz}$, 2 Hz), 9.28 (1H, brs), 9.71 (1H, brs), 10.13 (1H, brs)

【0667】

製造例 183

2-[3-ブromo-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-イル]-8-クロロ-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オンの代わりに、2-[3-ブromo-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-イル]-8-メチル-6-ニトロ-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オンを用い、製造例 72 と同様の方法で本発明化合物 (183) を得た。

本発明化合物 (183)



^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 2.29 (3H, s), 3.51-3.68 (3H, m), 7.37-7.42 (1H, m), 7.58-7.65 (1

10

20

30

40

50

H, m), 8.14 - 8.22 (2H, m), 8.32 - 8.39 (1H, m), 8.48 - 8.54 (1H, m), 9.39 (1H, brs), 10.41 (1H, brs), 10.58 (1H, brs)

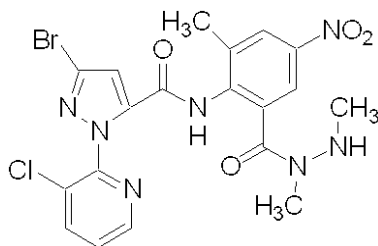
【0668】

製造例184

N, N' - ジメチルヒドラジン 2 塩酸塩 0.26 g、水 2 ml、炭酸カリウム 0.5 g および N, N - ジメチルホルムアミド 10 ml の混合物に、2 - [3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - メチル - 6 - ニトロ - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン 0.20 g を加え、該混合物を室温で 2 時間攪拌した。反応混合物を水に注加し、酢酸エチルで 3 回抽出した。有機層を合わせ、水および飽和食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮し、粗 3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - N - [2 - (N, N' - ジメチルヒドラジノカルボニル) - 6 - メチル - 4 - ニトロフェニル] - 1H - ピラゾール - 5 - カルボキサミドを得た。

10

3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - N - [2 - (N, N' - ジメチルヒドラジノカルボニル) - 6 - メチル - 4 - ニトロフェニル] - 1H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド

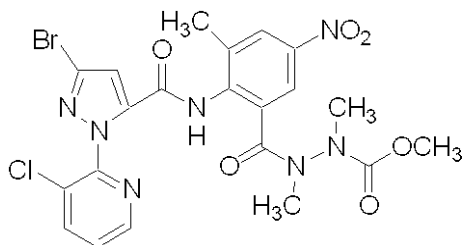


20

得られた粗 3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - N - [2 - (N, N' - ジメチルヒドラジノカルボニル) - 6 - メチル - 4 - ニトロフェニル] - 1H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド、ピリジン 1 ml およびアセトニトリル 10 ml の混合物に、氷冷下クロロ炭酸メチル 0.1 g を加え、該混合物を室温で 2 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで 2 回抽出した。有機層を合わせて水および飽和食塩水で順次洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、本発明化合物 (184) 0.07 g を得た。

30

本発明化合物 (184)



(184)

¹H - NMR (DMSO - d₆, TMS) (ppm): 2.27 - 2.37 (3H, m), 2.70 - 2.88 (3H, m), 2.88 - 3.11 (3H, m), 3.45 - 3.74 (3H, m), 7.38 - 7.46 (1H, m), 7.63 (1H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 7.92 - 8.04 (1H, m), 8.21 (1H, dd, J = 8 Hz, 1 Hz), 8.24 - 8.34 (1H, m), 8.51 (1H, dd, J = 5 Hz, 1 Hz), 10.40 - 10.75 (1H, m)

40

【0669】

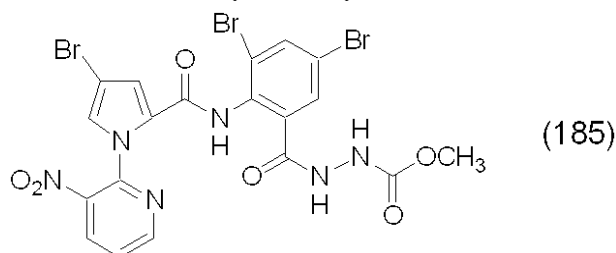
製造例185

6, 8 - ジブロモ - 2 - [4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - イル] - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンの代わりに、6, 8 - ジブロモ - 2 - [4 - ブロモ - 1 - (3 - ニトロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピロール

50

- 2 - イル] - 4 H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを用い、製造例 122 と同様の
方法で本発明化合物 (185) を得た。

本発明化合物 (185)



10

^1H - NMR (DMSO - d_6 , TMS) (ppm): 3.61 (3H, s), 7.36 (1H, s), 7.57 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.62 (1H, s), 7.78 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 5 Hz), 8.10 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 8.61 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 2 Hz), 8.79 (1H, dd, $J = 5\text{ Hz}$, 2 Hz), 9.24 (1H, brs), 9.95 (1H, brs), 10.12 (1H, brs)

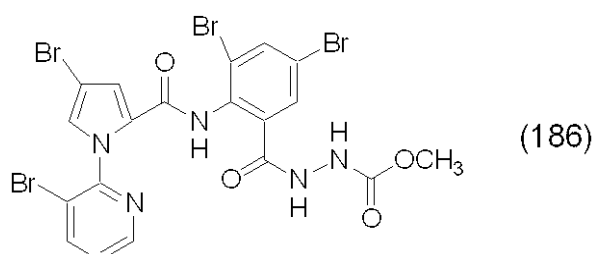
【0670】

製造例 186

6, 8 - ジブromo - 2 - [4 - ブromo - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - イル] - 4 H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンの代わりに、6, 8 - ジブromo - 2 - [4 - ブromo - 1 - (3 - ブromo - 2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - イル] - 4 H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを用い、製造例 122 と同様の
方法で本発明化合物 (186) を得た。

20

本発明化合物 (186)



30

^1H - NMR (DMSO - d_6 , TMS) (ppm): 3.61 (3H, s), 7.32 (1H, s), 7.40 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 5 Hz), 7.42 (1H, s), 7.63 (1H, s), 8.10 (1H, s), 8.17 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.46 (1H, d, $J = 5\text{ Hz}$), 9.36 (1H, brs), 9.90 (1H, brs), 10.16 (1H, brs)

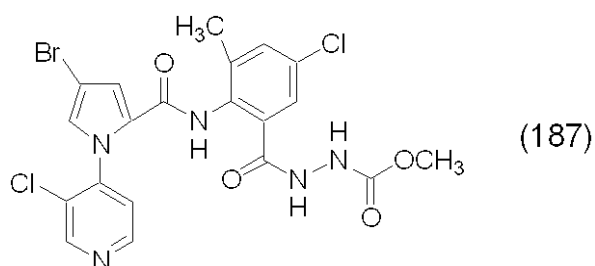
【0671】

製造例 187

4 - ブromo - N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - カルボキサミドの代わりに、4 - ブromo - N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 4 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - カルボキサミドを用い、製造例 93 と同様の方法で本発明化合物 (187) を得た。

40

本発明化合物 (187)



50

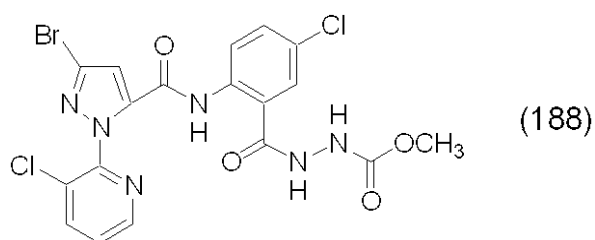
^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 2.16 (3H, s), 3.41-3.68 (3H, m), 7.29 (1H, brs), 7.33-7.40 (1H, m), 7.43 (1H, d, $J=2\text{ Hz}$), 7.52 (1H, d, $J=2\text{ Hz}$), 7.55 (1H, d, $J=5\text{ Hz}$), 8.59 (1H, d, $J=5\text{ Hz}$), 8.72 (1H, brs), 9.30 (1H, brs), 9.78 (1H, brs), 10.15 (1H, brs)

【0672】

製造例 188

2-[3-ブロモ-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-イル]-8-クロロ-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オンの代わりに、2-[3-ブロモ-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-イル]-6-クロロ-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オンを用い、製造例72と同様の方法で本発明化合物(188)を得た。

本発明化合物(188)



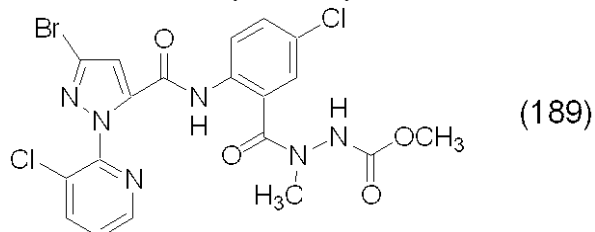
^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 3.68 (3H, brs), 7.23 (1H, brs), 7.62 (1H, dd, $J=9\text{ Hz}$, 2 Hz), 7.67 (1H, dd, $J=8\text{ Hz}$, 5 Hz), 7.88 (1H, s), 8.18 (1H, d, $J=9\text{ Hz}$), 8.25 (1H, dd, $J=8\text{ Hz}$, 1 Hz), 8.54 (1H, dd, $J=5\text{ Hz}$, 1 Hz), 9.49 (1H, brs), 10.78 (1H, brs), 11.77 (1H, brs)

【0673】

製造例 189

3-ブロモ-N-[4-クロロ-2-(N-メチルヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミドの代わりに、3-ブロモ-N-[4-クロロ-2-(N-メチルヒドラジノカルボニル)フェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミドを用い、製造例115と同様の方法で本発明化合物(189)を得た。

本発明化合物(189)



^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 3.07 (3H, s), 3.51 (3H, brs), 7.29 (2H, brs), 7.47-7.54 (2H, m), 7.65 (1H, dd, $J=8\text{ Hz}$, 5 Hz), 8.22 (1H, dd, $J=8\text{ Hz}$, 1 Hz), 8.52 (1H, dd, $J=5\text{ Hz}$, 1 Hz), 9.55 (1H, brs), 10.14 (1H, brs)

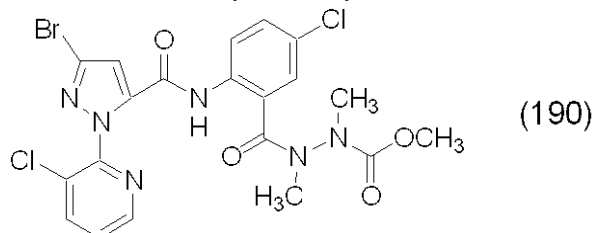
【0674】

製造例 190

3-ブロモ-N-[4-クロロ-2-(N,N'-ジメチルヒドラジノカルボニル)-

6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピラゾール - 5 - カルボキサミドの代わりに、3 - ブロモ - N - [4 - クロロ - 2 - (N, N' - ジメチルヒドラジノカルボニル)フェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピラゾール - 5 - カルボキサミドを用い、製造例 119 と同様の方法で本発明化合物 (190) を得た。

本発明化合物 (190)



10

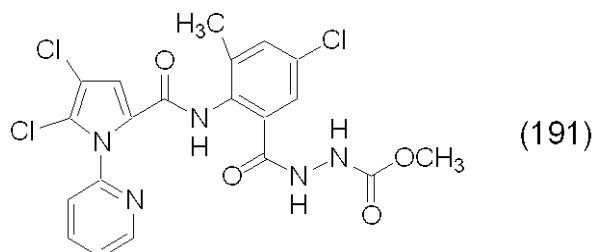
^1H - NMR (DMSO - d_6 , TMS) (ppm): 2.83 - 3.07 (6H, m), 3.52 - 3.70 (3H, m), 7.29 - 7.60 (4H, m), 7.64 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 5 Hz), 8.22 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 2 Hz), 8.51 (1H, dd, $J = 5\text{ Hz}$, 2 Hz), 10.53 - 10.68 (1H, brm).

【0675】

製造例 191

4 - ブロモ - N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - カルボキサミドの代わりに、4, 5 - ジクロロ - N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - カルボキサミドを用い、製造例 93 と同様の方法で本発明化合物 (191) を得た。

本発明化合物 (191)



30

^1H - NMR (DMSO - d_6 , TMS) (ppm): 2.13 (3H, s), 3.63 (3H, s), 7.24 (1H, s), 7.35 (1H, s), 7.49 - 7.51 (3H, m), 7.97 (1H, td, $J = 8\text{ Hz}$, 2 Hz), 8.52 (1H, dd, $J = 6\text{ Hz}$, 2 Hz), 9.31 (1H, brs), 9.78 (1H, brs), 10.12 (1H, brs)

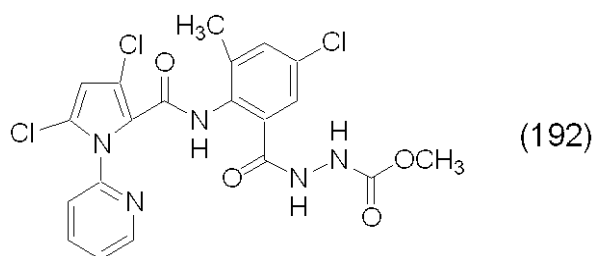
【0676】

製造例 192

4 - ブロモ - N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - カルボキサミドの代わりに、3, 5 - ジクロロ - N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - カルボキサミドを用い、製造例 93 と同様の方法で本発明化合物 (192) を得た。

本発明化合物 (192)

40



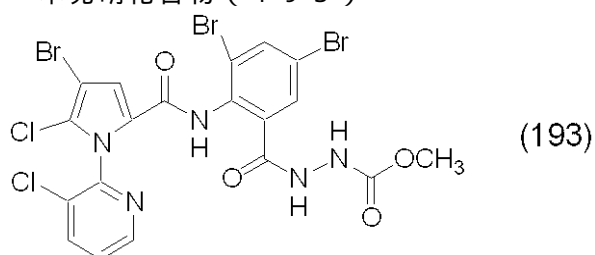
¹H - NMR (DMSO - d₆, TMS) (ppm): 2.09 (3H, s), 3.68 (3H, s), 6.69 (1H, s), 7.42 (1H, s), 7.48 - 7.60 (3H, m), 7.94 - 8.01 (1H, m), 8.51 (1H, d, J = 5 Hz), 9.37 (1H, brs), 9.71 (1H, brs), 10.33 (1H, brs)

【0677】

製造例 193

4 - ブロモ - N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボキサミドの代わりに 4 - ブロモ - N - [4 , 6 - ジブロモ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) フェニル] - 5 - クロロ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボキサミドを用い製造例 93 と同様の方法で本発明化合物 (193) を得た。

本発明化合物 (193)



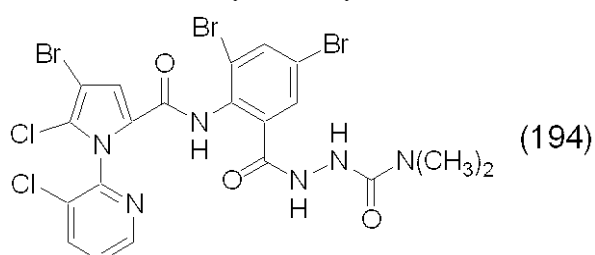
¹H - NMR (DMSO - d₆, TMS) (ppm): 3.62 (3H, s), 7.47 (1H, s), 7.58 (1H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 7.63 (1H, s), 8.10 (1H, s), 8.15 (1H, d, J = 8 Hz), 8.51 (1H, d, J = 5 Hz), 9.34 (1H, brs), 10.00 (1H, brs), 10.15 (1H, brs)

【0678】

製造例 194

4 , 5 - ジブロモ - N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボキサミドの代わりに、4 - ブロモ - N - [4 , 6 - ジブロモ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) フェニル] - 5 - クロロ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボキサミドを用い、製造例 128 と同様の方法で本発明化合物 (194) を得た。

本発明化合物 (194)



¹H - NMR (DMSO - d₆, TMS) (ppm): 2.85 (6H, s), 7.53 (1H, s), 7.59 (1H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 7.70 (1H, s), 8.06 (1H, s), 8.16 (1H, d, J = 8 Hz), 8.51 (1H, d, J = 5 Hz), 8.56 (1H, brs), 9.82 (1H, brs), 9.97 (1H, b

r s)

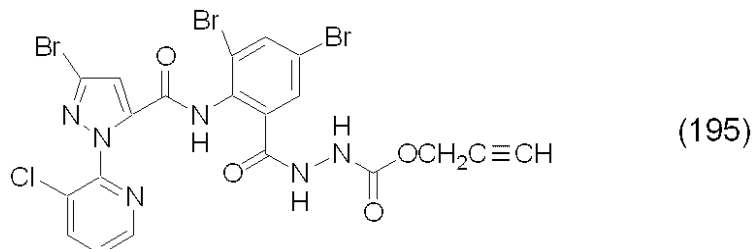
【 0 6 7 9 】

製造例 1 9 5

3 - ブロモ - N - [4 , 6 - ジブロモ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) フェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド 0 . 5 9 g 、クロロギ酸プロパルギル 0 . 2 3 g 、ピリジン 0 . 1 6 g およびアセトニトリル 2 m l を混合し、該混合物を室温で 1 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を水洗後、硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣を酢酸エチルで洗浄し、本発明化合物 (1 9 5) 0 . 2 2 g を得た。

本発明化合物 (1 9 5)

10



(195)

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO - d_6 , TMS) (ppm) : 3 . 5 6 (1 H , s) , 4 . 7 1 (2 H , s) , 7 . 4 1 (1 H , s) , 7 . 6 0 (1 H , dd , $J = 8 \text{ Hz}$, 5 Hz) , 7 . 6 6 (1 H , s) , 8 . 1 4 - 8 . 1 6 (2 H , m) , 8 . 5 0 (1 H , dd , $J = 5 \text{ Hz}$, 1 Hz) , 9 . 6 0 (1 H , brs) , 1 0 . 2 9 (1 H , brs) , 1 0 . 5 0 (1 H , brs) .

20

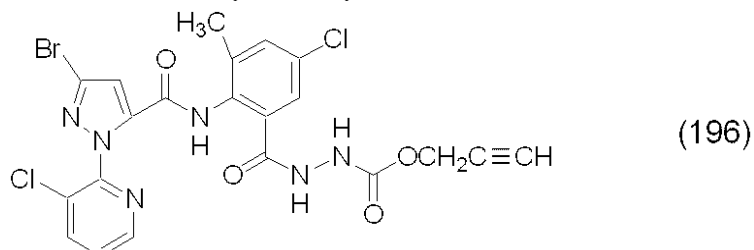
【 0 6 8 0 】

製造例 1 9 6

クロロギ酸メチルの代わりに、クロロギ酸プロパルギルを用い、製造例 3 4 と同様の方法で本発明化合物 (1 9 6) を得た。

本発明化合物 (1 9 6)

30



(196)

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO - d_6 , TMS) (ppm) : 2 . 1 5 (3 H , s) , 3 . 5 6 (1 H , brs) , 4 . 7 2 (2 H , s) , 7 . 3 5 (1 H , s) , 7 . 3 9 (1 H , brs) , 7 . 5 5 (1 H , s) , 7 . 6 1 (1 H , dd , $J = 8 \text{ Hz}$, 5 Hz) , 8 . 1 7 (1 H , dd , $J = 8 \text{ Hz}$, 1 Hz) , 8 . 5 0 (1 H , dd , $J = 5 \text{ Hz}$, 1 Hz) , 9 . 5 5 (1 H , s) , 1 0 . 2 3 - 1 0 . 2 6 (2 H , brm) .

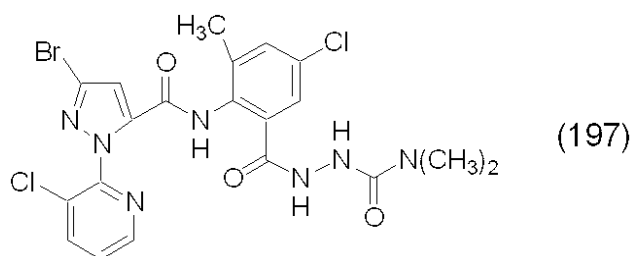
40

【 0 6 8 1 】

製造例 1 9 7

N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミドの代わりに、3 - ブロモ - N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミドを用い、製造例 1 0 と同様の方法で本発明化合物 (1 9 7) を得た。

本発明化合物 (1 9 7)



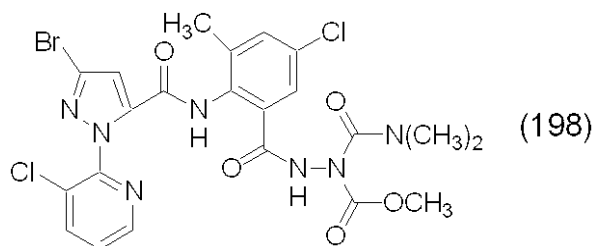
1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 2.20 (3H, s), 2.93 (6H, s), 7.50 - 7.52 (2H, m), 7.58 (1H, brs), 7.67 (1H, dd, $J = 8$ Hz, 5 Hz), 8.24 (1H, d, $J = 8$ Hz), 8.56 (1H, d, $J = 5$ Hz), 8.60 (1H, s), 9.89 (1H, brs), 10.23 (1H, brs)

【0682】

製造例 198

本発明化合物 (197) 0.20 g、トリエチルアミン 0.10 ml およびテトラヒドロフラン 5 ml の混合物に、氷冷下、クロロギ酸メチル 0.040 ml を滴下した後、該混合物を室温で 2.5 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで 3 回抽出した。有機層を合わせて、水および飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウム乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、本発明化合物 (198) 0.13 g を得た。

本発明化合物 (198)



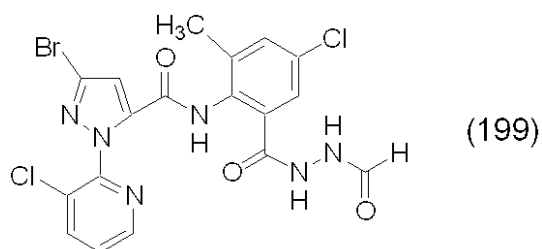
1H -NMR (CDCl $_3$, TMS) (ppm): 2.22 (3H, s), 3.05 (3H, brs), 3.15 (3H, brs), 3.76 (3H, s), 6.99 (1H, s), 7.35 - 7.38 (2H, m), 7.44 (1H, s), 7.86 (1H, d, $J = 8$ Hz), 8.39 (1H, s), 8.46 (1H, d, $J = 5$ Hz), 9.40 (1H, s)

【0683】

製造例 199

2-[3-ブロモ-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-イル]-6-クロロ-8-メチル-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オン 1.0 g、ギ酸ヒドラジド 1.33 g および N,N-ジメチルホルムアミド 40 ml を混合し、該混合物を 50 で 3.5 時間攪拌した後、70 で 7 時間攪拌した。室温まで放冷した反応混合物に水を注加した後、メチル tert-ブチルエーテルで抽出した。有機層を水および飽和食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、本発明化合物 (199) 0.36 g を得た。

本発明化合物 (199)



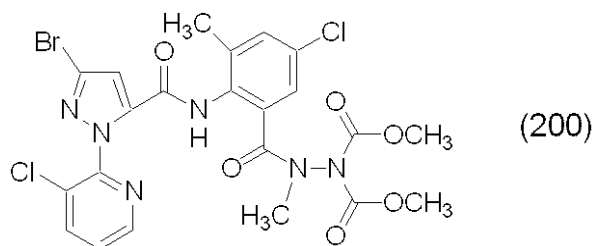
$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 2.10 - 2.21 (3.0 H, m), 7.25 - 7.62 (4.7 H, m), 7.79 - 7.81 (0.2 H, m), 8.05 (0.3 H, s), 8.16 (1.0 H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.49 (1.0 H, d, $J = 5\text{ Hz}$), 9.48 - 9.55 (0.7 H, m), 10.05 - 10.45 (2.1 H, m)

【0684】

製造例200

本発明化合物(115) 0.20 g、トリエチルアミン 0.14 ml およびアセトニトリル 10 ml の混合物に、クロロギ酸メチル 0.12 ml を室温で滴下した後、該混合物を室温で18時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで3回抽出した。有機層を合わせて、水および飽和食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウム乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、本発明化合物(198) 0.010 g を得た。

本発明化合物(200)



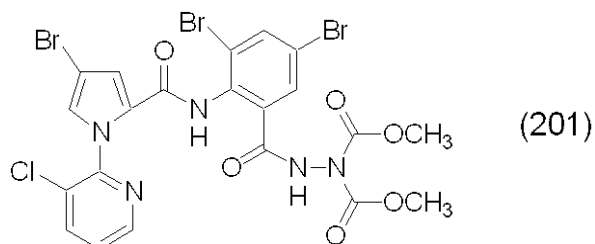
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl $_3$, TMS) (ppm): 2.21 (3 H, s), 3.23 (3 H, s), 3.89 (6 H, br s), 6.46 (1 H, s), 7.08 (1 H, s), 7.30 (1 H, s), 7.43 (1 H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 5 Hz), 8.92 (1 H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.51 (1 H, d, $J = 5\text{ Hz}$), 9.21 (1 H, s)

【0685】

製造例201

本発明化合物(93)の代わりに、本発明化合物(122)を用い、製造例158と同様の方法で本発明化合物(201)を得た。

本発明化合物(201)



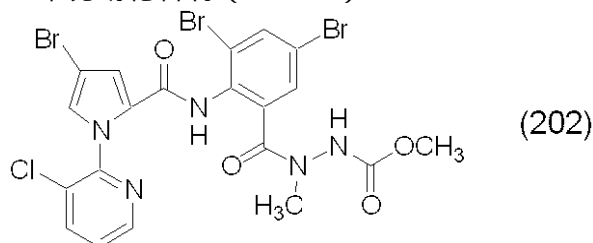
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl $_3$, TMS) (ppm): 3.74 (6 H, s), 7.08 (2 H, s), 7.30 (1 H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 5 Hz), 7.66 (1 H, s), 7.82 (1 H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 7.86 (1 H, s), 8.28 (1 H, br s), 8.32 (1 H, d, $J = 5\text{ Hz}$), 8.60 (1 H, br s)

【0686】

製造例202

4 - ブロモ - N - [4 - クロロ - 2 - (N - メチルヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボキサミドの代わりに、4 - ブロモ - N - [4 , 6 - ジブロモ - 2 - (N - メチルヒドラジノカルボニル) フェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボキサミドを用い、製造例 1 3 4 と同様の方法で本発明化合物 (2 0 2) を得た。

本発明化合物 (2 0 2)



10

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) (ppm) : 3 . 0 5 (0 . 5 H , b r s) , 3 . 1 3 (2 . 5 H , s) , 3 . 5 9 (2 . 5 H , s) , 3 . 8 2 (0 . 5 H , b r s) , 7 . 0 5 (1 . 0 H , d , $J = 2 \text{ Hz}$) , 7 . 2 1 (1 . 0 H , s) , 7 . 3 5 (1 . 3 H , d d , $J = 8 \text{ Hz}$, 5 Hz) , 7 . 4 2 (1 . 0 H , s) , 7 . 6 5 (2 . 0 H , s) , 7 . 8 2 (1 . 0 H , d , $J = 8 \text{ Hz}$) , 8 . 4 3 (1 . 0 H , d d , $J = 5 \text{ Hz}$, 2 Hz) , 8 . 5 7 (0 . 7 H , s)

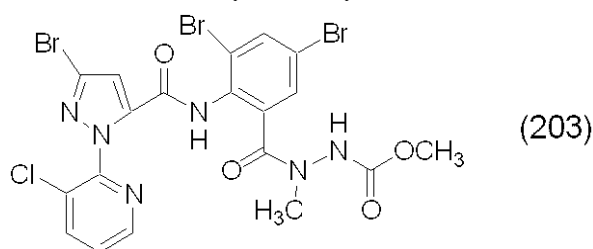
【 0 6 8 7 】

20

製造例 2 0 3

3 - ブロモ - N - [4 - クロロ - 2 - (N - メチルヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミドの代わりに、3 - ブロモ - N - [4 , 6 - ジブロモ - 2 - (N - メチルヒドラジノカルボニル) フェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミドを用い、製造例 1 1 5 と同様の方法で本発明化合物 (2 0 3) を得た。

本発明化合物 (2 0 3)



30

$^1\text{H-NMR}$ (1 0 0 , $\text{DMSO}-d_6$, TMS) (ppm) : 2 . 9 6 (3 H , s) , 3 . 0 4 (3 H , b r s) , 7 . 3 0 (1 H , s) , 7 . 3 8 (1 H , s) , 7 . 5 8 (1 H , d d , $J = 8 \text{ Hz}$, 5 Hz) , 7 . 9 6 (1 H , s) , 8 . 1 1 (1 H , d , $J = 8 \text{ Hz}$) , 8 . 4 7 (1 H , d , $J = 5 \text{ Hz}$) , 8 . 6 8 (1 H , b r s) , 1 0 . 0 8 (1 H , b r s)

【 0 6 8 8 】

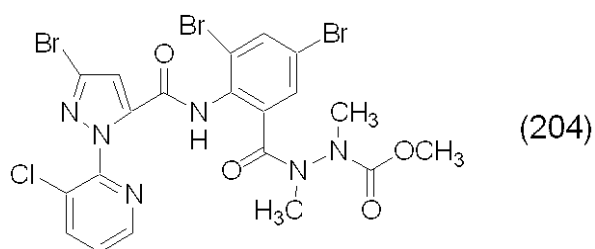
40

製造例 2 0 4

3 - ブロモ - N - [4 , 6 - ジブロモ - 2 - (N , N ' - ジメチルヒドラジノカルボニル) フェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド 0 . 3 0 g 、クロロギ酸メチル 0 . 1 5 m l およびピリジン 3 m l を混合し、該混合物を室温で 2 . 5 時間攪拌した。反応混合物にクロロギ酸メチル 0 . 0 8 m l 加え、さらに 1 時間攪拌した後、反応混合物にクロロギ酸メチル 0 . 0 8 m l 加え、さらに 0 . 5 時間攪拌した。反応混合物に水を注加した後、酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、本発明化合物 (2 0 4) 0 . 2 4 g を得た。

本発明化合物 (2 0 4)

50



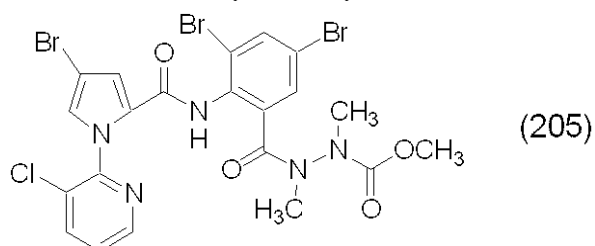
$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 2.71 (1.4H, s), 2.83 (1.6H, s), 2.94 (1.5H, s), 3.06 (1.5H, s), 3.35 - 3.70 (3.0H, m), 7.41 (0.5H, s), 7.45 (0.6H, s), 7.47 (0.6H, s), 7.60 - 7.64 (1.3H, m), 8.07 (0.5H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 8.13 (0.5H, s), 8.18 (1.0H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.50 (1.0H, m), 10.52 (0.5H, s), 10.67 (0.5H, s)

【0689】

製造例205

4-ブロモ-N-[4-クロロ-2-(N,N'-ジメチルヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-カルボキサミドの代わりに、4-ブロモ-N-[4,6-ジブロモ-2-(N,N'-ジメチルヒドラジノカルボニル)フェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-カルボキサミドを用い、製造例147と同様の方法で本発明化合物(205)を得た。

本発明化合物(205)



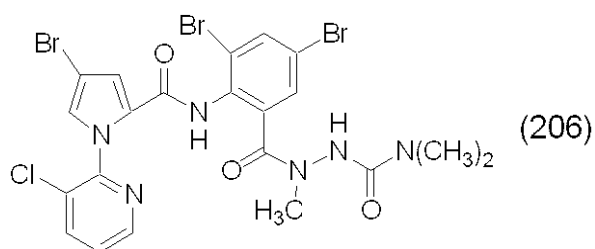
$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 2.73 (1.4H, s), 2.82 (1.8H, s), 2.89 (1.3H, s), 3.06 (1.5H, s), 3.35 - 3.70 (3.0H, m), 7.32 (0.5H, s), 7.34 - 7.38 (0.6H, m), 7.43 (0.5H, s), 7.48 - 7.53 (2.4H, m), 8.03 (0.4H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 8.07 - 8.10 (1.6H, m), 8.43 - 8.45 (1.0H, m), 9.93 (0.5H, s), 10.07 (0.5H, s)

【0690】

製造例206

4-ブロモ-N-[4-クロロ-2-(N-メチルヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-カルボキサミドの代わりに、4-ブロモ-N-[4,6-ジブロモ-2-(N-メチルヒドラジノカルボニル)フェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-カルボキサミドを用い、製造例136と同様の方法で本発明化合物(206)を得た。

本発明化合物(206)



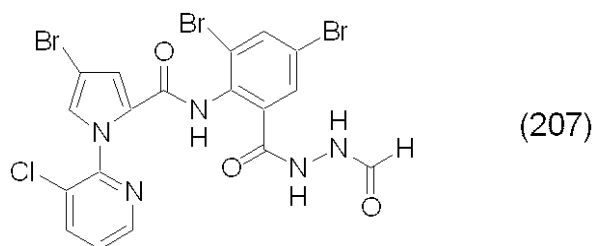
¹H - NMR (CDCl₃, TMS) (ppm): 2.47 (6H, s), 3.29 (3H, s), 7.04 (1H, d, J = 2 Hz), 7.31 (1H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 7.43 (1H, d, J = 2 Hz), 7.51 (1H, d, J = 2 Hz), 7.53 (1H, d, J = 2 Hz), 7.80 (1H, dd, J = 8 Hz, 2 Hz), 8.09 (1H, s), 8.41 (1H, dd, J = 5 Hz, 2 Hz), 9.67 (1H, s)

【 0 6 9 1 】

製造例 207

2 - [3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 6 - クロロ - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンの代わりに、6 , 8 - ジブロモ - 2 - [4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - イル] - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを用い、製造例 199 と同様の方法で本発明化合物 (207) を得た。

本發明化合物 (2 0 7)



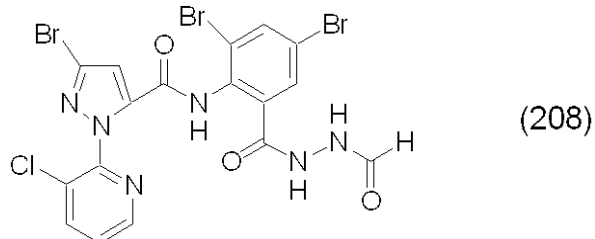
¹H - NMR (DMSO - d₆, TMS) (ppm): 7.31 (0.6 H, s), 7.38 (0.3 H, s), 7.44 (0.6 H, d, J = 2 Hz), 7.47 - 7.52 (1.5 H, m), 7.65 - 7.75 (1.3 H, m), 8.03 - 8.12 (2.7 H, m), 8.43 (1.0 H, dd, J = 5 Hz, 2 Hz), 9.49 - 9.52 (0.3 H, m), 9.94 - 9.99 (0.4 H, m), 10.17 (1.0 H, s), 10.39 - 10.44 (1.0 H, m)

【 0 6 9 2 】

製造例 208

2 - [3 - プロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イ
ル] - 6 - クロロ - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンの代わりに
、 2 - [3 - プロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イ
ル] - 6 , 8 - ジプロモ - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを用い、製造例 1
9 9 と同様の方法で本発明化合物 (2 0 8) を得た。

本發明化合物 (2 0 8)

¹ H - NMR (DMSO - d₆ , TMS) (ppm) : 7 . 41 (0 . 7 H , s) , 7

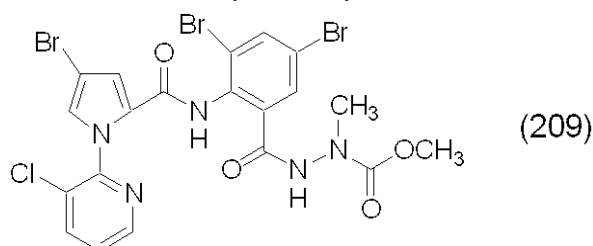
. 45 (0.3 H, s), 7.58 - 7.63 (1.0 H, m), 7.69 - 7.73 (1.0 H, m), 7.77 - 7.79 (0.4 H, m), 8.04 (0.6 H, s), 8.13 - 8.18 (2.0 H, m), 8.49 - 8.51 (1.0 H, m), 9.55 - 9.58 (0.4 H, m), 10.18 (0.6 H, s), 10.45 - 10.60 (2.0 H, m)

【0693】

製造例209

6, 8 - ジブromo - 2 - [4 - ブromo - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - イル] - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン 0.30 g、N - メチル - N - メトキシカルボニルヒドラジン 0.28 g および N, N - ジメチルホルムアミド 15 ml を混合し、該混合物を 80 で 35 時間攪拌した。室温まで放冷した反応混合物に水を注加し、メチル tert - ブチルエーテルで抽出した。有機層を水および飽和食塩水で順次洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮し。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、本発明化合物 (209) 0.18 g を得た。

本発明化合物 (209)



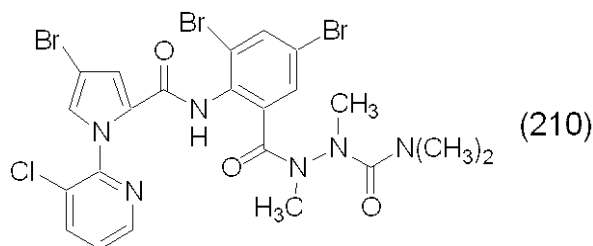
¹ H - NMR (DMSO - d₆ , TMS) (ppm) : 2.84 (3 H , s) , 3.45 - 3.70 (3 H , br m) , 7.38 (1 H , br s) , 7.47 (1 H , d , J = 2 Hz) , 7.50 (1 H , dd , J = 8 Hz , 5 Hz) , 7.54 (1 H , d , J = 2 Hz) , 8.05 (1 H , dd , J = 8 Hz , 2 Hz) , 8.12 (1 H , d , J = 2 Hz) , 8.41 (1 H , dd , J = 5 Hz , 2 Hz) , 9.95 (1 H , s) , 10.50 (1 H , s)

【0694】

製造例210

4 - ブromo - N - [4 , 6 - ジブromo - 2 - (N , N' - ジメチルヒドラジノカルボニル) フェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボキサミド 0.16 g、N, N - ジメチルカルバモイルクロライド 0.12 ml およびピリジン 0.2 ml を混合し、該混合物を 80 で 5 時間攪拌した。室温まで放冷した反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を水および飽和食塩水で順次洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、本発明化合物 (210) 0.15 g を得た。

本発明化合物 (210)



¹ H - NMR (DMSO - d₆ , TMS) (ppm) : 2.44 (4.5 H , s) , 2.58 (3.0 H , s) , 2.74 (1.5 H , br s) , 2.78 (1.0 H , s) , 3.12 (2.0 H , s) , 7.14 (0.7 H , d , J = 2 Hz) , 7.32 (0.7 H , d , J = 2 Hz) , 7.38 (0.3 H , s) , 7.47 - 7.54 (2.3 H , m) , 8.00 (0.7 H , d , J = 2 Hz) , 8.07 - 8.10 (1.3 H , m) , 8

. 42 - 8.45 (1.0 H, m), 9.95 (0.7 H, brs), 10.08 (0.3 H, brs)

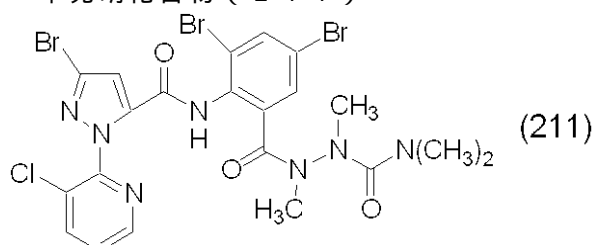
【0695】

製造例 211

3 - ブロモ - N - [4 , 6 - ジブロモ - 2 - (N , N' - ジメチルヒドラジノカルボニル) フェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド 0.16 g、N, N - ジメチルカルバモイルクロライド 0.12 ml およびピリジン 2 ml を混合し、該混合物を 80 で 5 時間攪拌した。室温まで放冷した反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を水および飽和食塩水で順次洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、本発明化合物 (211) 0.12 g を得た。

10

本発明化合物 (211)



¹ H - NMR (DMSO - d₆ , TMS) (ppm) : 2.35 (4.5 H , s) , 2.49 (2.0 H , s) , 2.57 (1.0 H , brs) , 2.67 (1.5 H , brs) , 2.73 (1.0 H , s) , 3.05 (2.0 H , s) , 7.10 (0.7 H , s) , 7.34 (0.7 H , s) , 7.39 (0.3 H , s) , 7.52 - 7.57 (1.3 H , m) , 7.97 (0.7 H , d , J = 2 Hz) , 8.06 (0.3 H , s) , 8.11 (1.0 H , dd , J = 8 Hz , 2 Hz) , 8.41 - 8.45 (1.0 H , m) , 10.49 (0.7 H , s) , 10.62 (0.3 H , s)

20

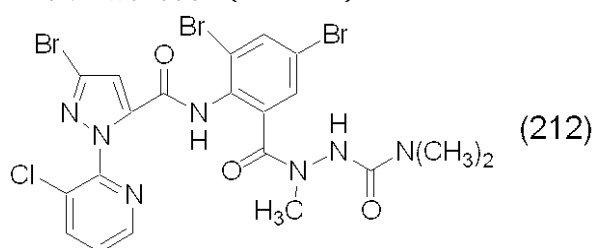
【0696】

製造例 212

3 - ブロモ - N - [4 - クロロ - 2 - (N - メチルヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミドの代わりに、3 - ブロモ - N - [4 , 6 - ジブロモ - 2 - (N - メチルヒドラジノカルボニル) フェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミドを用い、製造例 160 と同様の方法で本発明化合物 (212) を得た。

30

本発明化合物 (212)



40

¹ H - NMR (CDCl₃ , TMS) (ppm) : 2.50 (6 H , s) , 3.28 (3 H , s) , 7.38 (1 H , dd , J = 8 Hz , 5 Hz) , 7.46 (1 H , d , J = 2 Hz) , 7.50 (1 H , s) , 7.55 (1 H , d , J = 2 Hz) , 7.78 (1 H , s) , 7.86 (1 H , d , J = 8 Hz) , 8.46 (1 H , d , J = 5 Hz) , 10.20 (1 H , s) .

【0697】

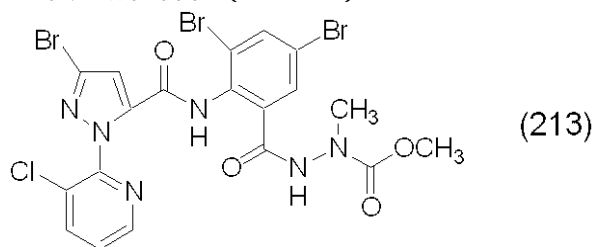
製造例 213

2 - [3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 6 - クロロ - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンの代わりに

50

、2-[3-ブロモ-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-イル]-6,8-ジプロモ-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オンを用い、製造例114と同様の方法で本発明化合物(213)を得た。

本発明化合物(213)



10

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) (ppm): 2.87 (3H, s), 3.46 - 3.66 (3H, br m), 7.46 (1H, s), 7.58 - 7.61 (2H, m), 8.13 - 8.18 (2H, m), 8.47 (1H, dd, $J = 5\text{ Hz}, 2\text{ Hz}$), 10.54 (1H, s), 10.61 (1H, s)

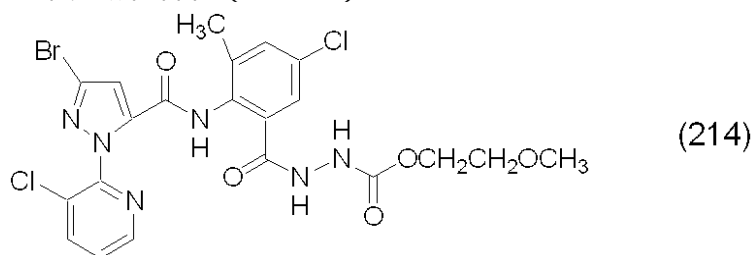
【0698】

製造例214

クロロギ酸メチルの代わりに、クロロギ酸2-メトキシエチルを用い、製造例34と同様の方法で本発明化合物(214)を得た。

本発明化合物(214)

20



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl $_3$, TMS) (ppm): 2.21 (3H, s), 3.39 (3H, br s), 3.61 (2H, br s), 4.31 (2H, br s), 6.96 (1H, br s), 7.01 (1H, s), 7.32 - 7.39 (3H, m), 7.85 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}, 2\text{ Hz}$), 8.03 (1H, br s), 8.41 (1H, d, $J = 5\text{ Hz}$), 9.47 (1H, s)

30

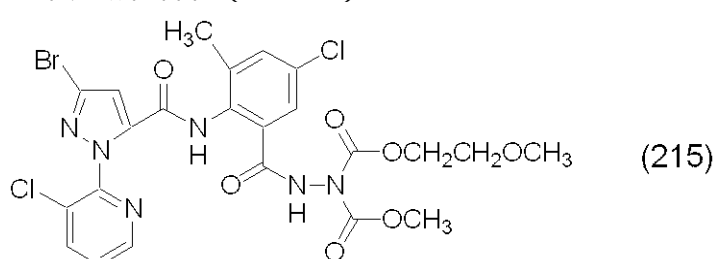
【0699】

製造例215

本発明化合物(34)の代わりに、本発明化合物(214)を用い、製造例95と同様の方法で本発明化合物(215)を得た。

本発明化合物(215)

40



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl $_3$, TMS) (ppm): 2.24 (3H, s), 3.31 (3H, s), 3.58 (2H, t, $J = 5\text{ Hz}$), 3.83 (3H, s), 4.32 (2H, br s), 6.98 (1H, s), 7.32 - 7.37 (2H, m), 7.46 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.88 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.34 (1H, d, $J = 5\text{ Hz}$), 8.70 (1H, s), 9.33 (1H, s)

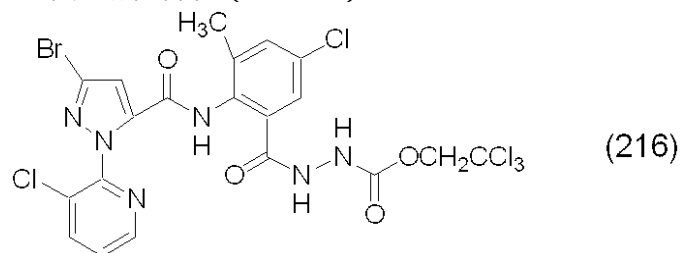
【0700】

50

製造例 216

クロロギ酸メチルの代わりに、クロロギ酸 2, 2, 2 - トリクロロエチルを用い、製造例 34 と同様の方法で本発明化合物 (216) を得た。

本発明化合物 (216)



10

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 2.22 (3.0 H, s), 4.89 (0.4 H, s), 4.97 (1.6 H, s), 7.41 (1.0 H, s), 7.46 (0.8 H, s), 7.53 (0.2 H, s), 7.62 (1.0 H, s), 7.67 (1.0 H, dd, $J = 8\text{ Hz}, 5\text{ Hz}$), 8.24 (1.0 H, dd, $J = 8\text{ Hz}, 2\text{ Hz}$), 8.56 (1.0 H, dd, $J = 5\text{ Hz}, 2\text{ Hz}$), 9.52 (0.2 H, s), 10.00 (0.8 H, s), 10.31 - 10.36 (1.0 H, brm), 10.41 (0.8 H, s), 10.50 (0.2 H, s)

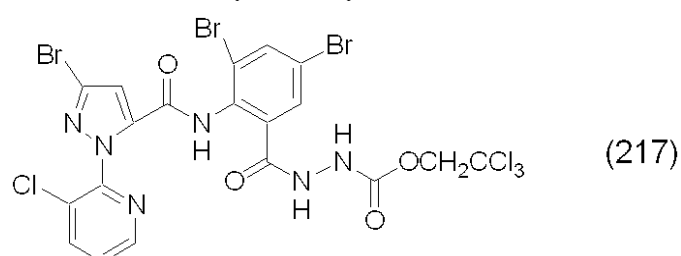
【0701】

製造例 217

20

クロロギ酸プロパルギルの代わりに、クロロギ酸 2, 2, 2 - トリクロロエチルを用い、製造例 195 と同様の方法で本発明化合物 (217) を得た。

本発明化合物 (217)



30

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 4.83 - 4.90 (2.0 H, brm), 7.40 (1.0 H, s), 7.60 (1.0 H, dd, $J = 8\text{ Hz}, 5\text{ Hz}$), 7.67 (0.7 H, s), 7.74 (0.3 H, s), 8.14 - 8.18 (2.0 H, m), 8.50 (1.0 H, d, $J = 5\text{ Hz}$), 9.51 (0.3 H, s), 9.99 (0.7 H, s), 10.41 (0.7 H, s), 10.48 - 10.54 (1.3 H, m)

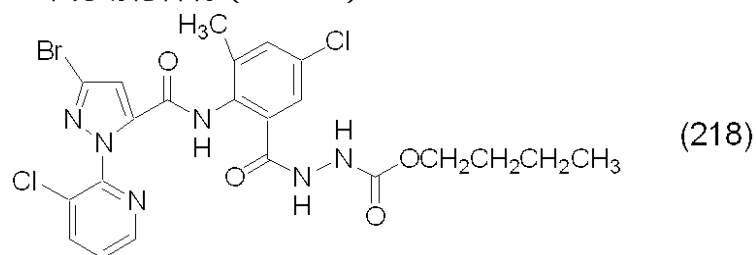
【0702】

製造例 218

クロロギ酸メチルの代わりに、クロロギ酸ブチルを用い、製造例 34 と同様の方法で本発明化合物 (218) を得た。

40

本発明化合物 (218)



$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 0.90 (3 H, brs), 1.36 (2 H, brs), 1.56 (2 H, brs), 2.15 (3 H, s), 3.92

50

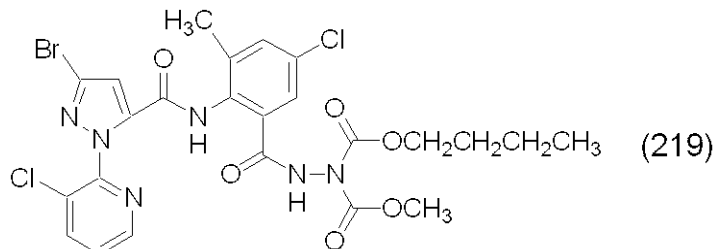
- 4.06 (2H, br m), 7.34 - 7.39 (2H, br m), 7.55 (1H, d, J = 2 Hz), 7.61 (1H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 8.17 (1H, dd, J = 8 Hz, 2 Hz), 8.49 (1H, dd, J = 5 Hz, 2 Hz), 9.26 (1H, s), 10.13 (1H, s), 10.23 (1H, s)

【0703】

製造例 219

本発明化合物(34)の代わりに、本発明化合物(218)を用い、製造例95と同様の方法で本発明化合物(219)を得た。

本発明化合物(219)



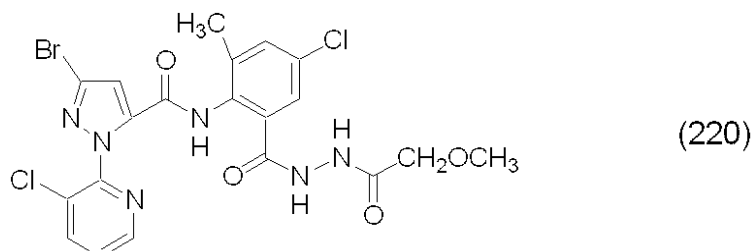
¹H-NMR (CDCl₃, TMS) (ppm): 0.93 (3H, t, J = 7 Hz), 1.38 (2H, qt, J = 7 Hz, 7 Hz), 1.65 (2H, tt, J = 7 Hz, 7 Hz), 2.23 (3H, s), 3.81 (3H, s), 4.24 (2H, t, J = 7 Hz), 6.97 (1H, s), 7.34 - 7.38 (2H, m), 7.44 (1H, d, J = 2 Hz), 7.88 (1H, dd, J = 8 Hz, 2 Hz), 8.35 (1H, s), 8.38 (1H, dd, J = 5 Hz, 2 Hz), 9.24 (1H, s)

【0704】

製造例 220

3-ブromo-N-[4-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド 0.30 g、メトキシアセチルクロライド 0.10 g およびピリジン 3 mL を混合し、該混合物を室温で 2.5 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで 3 回抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、本発明化合物(220) 0.21 g を得た。

本発明化合物(220)



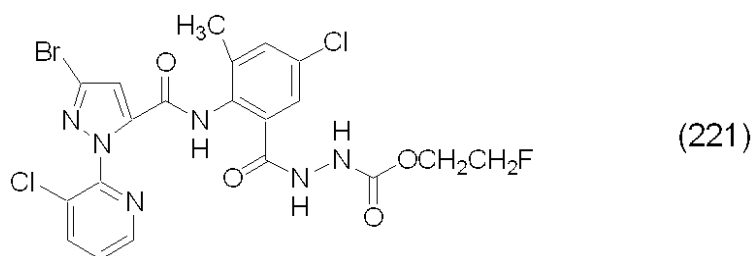
¹H-NMR (CDCl₃, TMS) (ppm): 2.21 (3H, s), 3.50 (3H, s), 4.08 (2H, s), 7.02 (1H, s), 7.34 - 7.40 (3H, m), 7.86 (1H, dd, J = 8 Hz, 2 Hz), 8.44 (1H, dd, J = 5 Hz, 2 Hz), 8.57 (1H, d, J = 5 Hz), 8.85 (1H, d, J = 5 Hz), 9.58 (1H, s).

【0705】

製造例 221

クロロギ酸メチルの代わりに、クロロギ酸 2-フルオロエチルを用い、製造例 34 と同様の方法で本発明化合物(221)を得た。

本発明化合物(221)



(221)

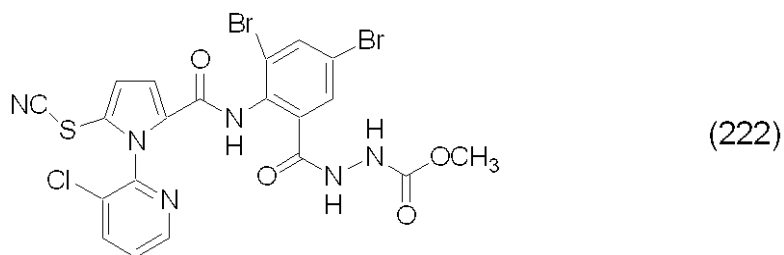
^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 2.13 (3H, s), 4.20 - 4.34 (2H, m), 4.53 - 4.70 (2H, m), 7.35 (1H, s), 7.39 (1H, s), 7.55 (1H, s), 7.61 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 5 Hz), 8.17 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 2 Hz), 8.50 (1H, dd, $J = 5\text{ Hz}$, 2 Hz), 9.49 (1H, s), 10.19 (1H, brs), 10.24 (1H, brs)

【0706】

製造例 222

6, 8-ジブromo-2-[4-ブromo-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-イル]-4H-3, 1-ベンズオキサジン-4-オンの代わりに、6, 8-ジブromo-2-[1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-5-チオシアナト(thiocyanato)-1H-ピロール-2-イル]-4H-3, 1-ベンズオキサジン-4-オンを用い、製造例 122 と同様の方法で本発明化合物 (222) を得た。

本発明化合物 (222)



(222)

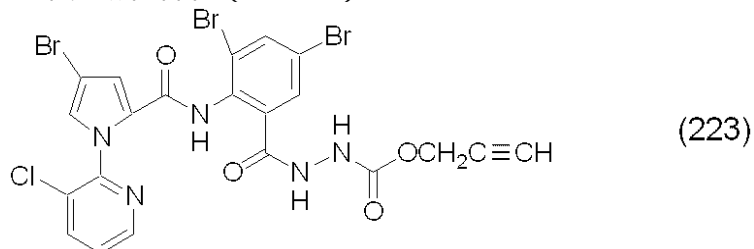
^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 3.61 (3H, s), 7.10 (1H, d, $J = 4\text{ Hz}$), 7.38 (1H, d, $J = 4\text{ Hz}$), 7.59 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 5 Hz), 7.64 (1H, brs), 8.11 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 8.15 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 1 Hz), 8.54 (1H, dd, $J = 5\text{ Hz}$, 1 Hz), 9.35 (1H, brs), 10.14 (2H, brs)

【0707】

製造例 223

4-ブromo-N-[4-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-カルボキサミドの代わりに 4-ブromo-N-[4, 6-ジブromo-2-(ヒドラジノカルボニル)フェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-カルボキサミドを用い、クロロギ酸メチルの代わりにクロロギ酸プロパルギルを用い、製造例 93 と同様の方法で本発明化合物 (223) を得た。

本発明化合物 (223)



(223)

^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 3.55 (1H, s), 4.7

10

20

30

40

50

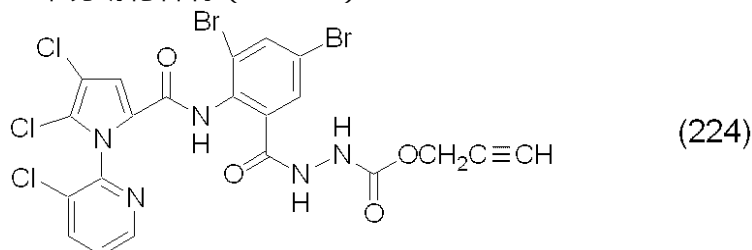
0 (2 H, s), 7.30 (1 H, s), 7.44 (1 H, d, J = 1 Hz), 7.49 (1 H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 7.64 (1 H, s), 8.05 (1 H, d, J = 8 Hz), 8.11 (1 H, s), 8.43 (1 H, dd, J = 5 Hz, 1 Hz), 9.60 (1 H, brs), 9.94 (1 H, brs), 10.22 (1 H, brs)

【0708】

製造例 224

4 - ブロモ - N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボキサミドの代わりに N - [4, 6 - ジブロモ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) フェニル] - 4, 5 - ジクロロ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボキサミドを用い、クロロギ酸メチルの代わりにクロロギ酸プロパルギルを用い、製造例 93 と同様の方法で本発明化合物 (224) を得た。

本発明化合物 (224)



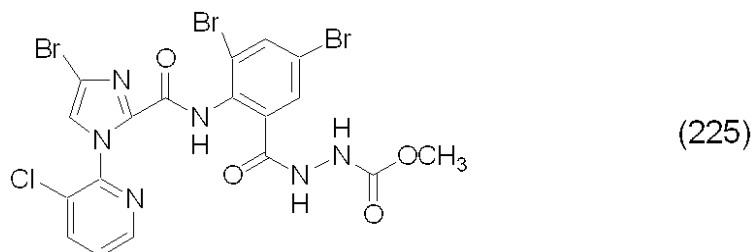
¹H - NMR (DMSO - d₆, TMS) (ppm): 3.55 (1 H, s), 4.71 (2 H, s), 7.44 (1 H, s), 7.56 - 7.64 (2 H, m), 8.10 (1 H, s), 8.15 (1 H, dd, J = 8 Hz, 1 Hz), 8.51 (1 H, dd, J = 5 Hz, 1 Hz), 9.58 (1 H, brs), 10.02 (1 H, brs), 10.23 (1 H, brs)

【0709】

製造例 225

6, 8 - ジブロモ - 2 - [4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - イミダゾール - 2 - イル] - 4 H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン 0.10 g、メチルカーバゼート 0.16 g および N, N - ジメチルホルムアミド 10 ml を混合し、該混合物を室温で 1 日間攪拌した。反応混合物を水に注加し、酢酸エチルで 3 回抽出した。有機層を合わせ、水、飽和食塩水で順次洗浄後、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付して、本発明化合物 (125) 0.080 g を得た。

本発明化合物 (225)



¹H - NMR (DMSO - d₆, TMS) (ppm): 3.63 (3 H, s), 7.59 (1 H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 7.90 (1 H, s), 8.04 (1 H, d, J = 2 Hz), 8.11 (1 H, d, J = 8 Hz), 8.24 (1 H, s), 8.49 (1 H, d, J = 5 Hz), 9.36 (1 H, brs), 10.17 (1 H, brs), 10.27 (1 H, brs)

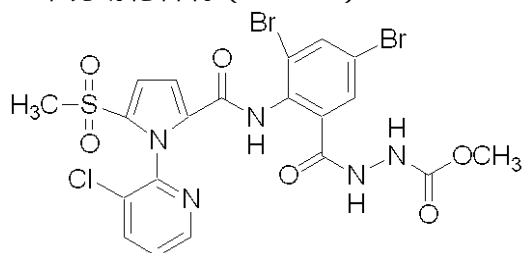
【0710】

製造例 226

6, 8 - ジブロモ - 2 - [4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H -

ピロール - 2 - イル] - 4 H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンの代わりに、6, 8 - ジブromo - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 5 - メチルスルホニル - 1 H - ピロール - 2 - イル] - 4 H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを用い、製造例 1 2 2 と同様の方法で本発明化合物 (2 2 6) を得た。

本発明化合物 (2 2 6)



(226)

10

¹H - NMR (DMSO - d₆, TMS) (ppm): 3.27 (3H, s), 3.61 (3H, s), 7.11 (1H, d, J = 4 Hz), 7.36 (1H, d, J = 4 Hz), 7.53 (1H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 7.65 (1H, brs), 8.04 (1H, dd, J = 8 Hz, 2 Hz), 8.12 (1H, d, J = 2 Hz), 8.46 (1H, dd, J = 5 Hz, 2 Hz), 9.36 (1H, brs), 10.16 (1H, brs)

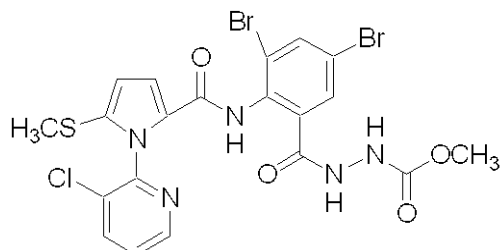
【0711】

製造例 2 2 7

20

6, 8 - ジブromo - 2 - [4 - ブromo - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - イル] - 4 H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンの代わりに、6, 8 - ジブromo - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 5 - メチルチオ - 1 H - ピロール - 2 - イル] - 4 H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを用い、製造例 1 2 2 と同様の方法で本発明化合物 (2 2 7) を得た。

本発明化合物 (2 2 7)



(227)

30

¹H - NMR (DMSO - d₆, TMS) (ppm): 2.25 (3H, s), 3.60 (3H, s), 6.52 (1H, d, J = 4 Hz), 7.27 (1H, d, J = 4 Hz), 7.49 (1H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 7.62 (1H, brs), 8.04 (1H, dd, J = 8 Hz, 1 Hz), 8.07 (1H, d, J = 2 Hz), 8.45 (1H, dd, J = 5 Hz, 1 Hz), 9.34 (1H, brs), 9.77 (1H, brs), 10.10 (1H, brs)

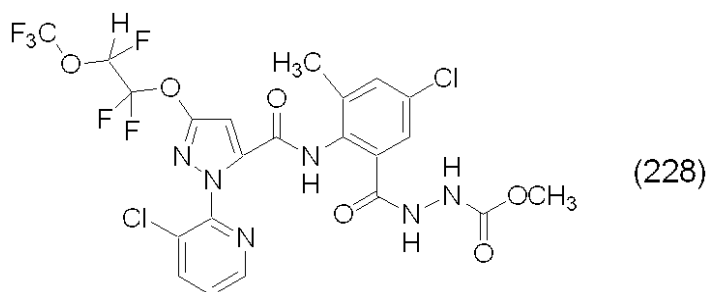
【0712】

製造例 2 2 8

40

2 - [3 - ブromo - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - クロロ - 4 H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンの代わりに、6 - クロロ - 2 - {1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - [1, 1, 2 - トリフルオロ - 2 - (トリフルオロメトキシ)エトキシ] - 1 H - ピラゾール - 5 - イル} - 8 - メチル - 4 H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを用い、製造例 7 2 と同様の方法で本発明化合物 (2 2 8) を得た。

本発明化合物 (2 2 8)



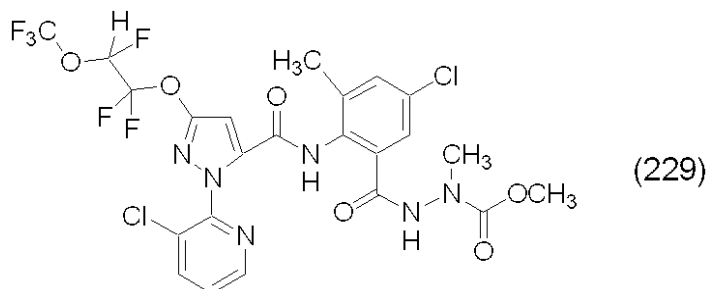
¹H - NMR (DMSO - d₆, TMS) (ppm): 2.16 (3H, s), 3.62 (3H, brs), 7.20 (1H, s), 7.37 (1H, dt, J = 5.1 Hz, 4 Hz), 7.38 (1H, s), 7.55 (1H, s), 7.61 (1H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 8.17 (1H, d, J = 8 Hz), 8.50 (1H, d, J = 5 Hz), 9.32 (1H, s), 10.16 (1H, s), 10.30 (1H, s)

【 0 7 1 3 】

製造例 229

2 - [3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 6 - クロロ - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンの代わりに、6 - クロロ - 2 - { 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - [1 , 1 , 2 - トリフルオロ - 2 - (トリフルオロメトキシ) エトキシ] - 1 H - ピラゾール - 5 - イル } - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを用い、製造例 1 1 4 と同様の方法で本発明化合物 (2 2 9) を得た。

本發明化合物 (2 2 9)



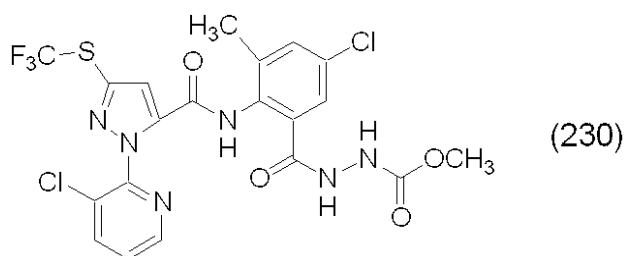
¹H - NMR (DMSO - d₆, TMS) (ppm): 2.22 (3H, s), 2.91 (3H, s), 3.47 - 3.68 (3H, br m), 7.24 (1H, s), 7.31 (1H, s), 7.37 (1H, dt, J = 5.1 Hz, 4 Hz), 7.57 (1H, d, J = 2 Hz), 7.61 (1H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 8.17 (1H, dd, J = 8 Hz, 1 Hz), 8.48 (1H, dd, J = 5 Hz, 1 Hz), 10.32 (1H, s), 10.53 (1H, s)

【 0 7 1 4 】

製造例 2 3 0

2 - [3 - プロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - クロロ - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンの代わりに、6 - クロロ - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - (トリフルオロメチルチオ) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを用い、製造例 7 2 と同様の方法で本発明化合物 (2 3 0) を得た。

本發明化合物 (2 3 0)



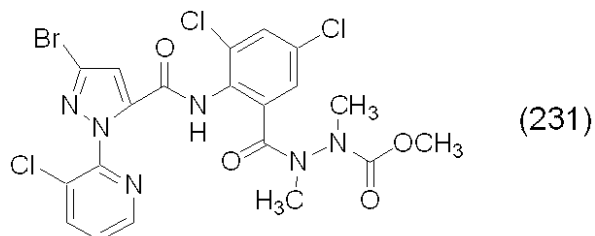
¹H-NMR (DMSO-d₆, TMS) (ppm): 2.15 (3H, s), 3.62 (3H, brs), 7.39 (1H, brs), 7.55 (1H, s), 7.62-7.68 (2H, m), 8.20 (1H, dd, J = 8 Hz, 2 Hz), 8.52 (1H, dd, J = 5 Hz, 2 Hz), 9.32 (1H, brs), 10.16 (1H, brs), 10.36 (1H, brs)

【0715】

製造例 231

3-ブromo-N-[4,6-ジクロロ-2-(N,N'-ジメチルヒドラジノカルボニル)フェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド 0.50 g、クロロギ酸メチル 0.18 g、ピリジン 0.16 g およびアセトニトリル 10 ml を氷冷下混合し、該混合物を氷冷下 3.5 時間攪拌した。反応混合物に水を注加した後、酢酸エチルで抽出した。有機層を水および飽和食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をメチル tert-ブチルエーテルとヘキサンとの混合溶媒で洗浄し、本発明化合物 (231) 0.47 g を得た。

本発明化合物 (231)



¹H-NMR (DMSO-d₆, TMS) (ppm): 2.73 (1.4H, s), 2.83 (1.6H, s), 2.95 (1.6H, s), 3.07 (1.4H, s), 3.49-3.68 (3.0H, m), 7.32-7.44 (2.0H, m), 7.62 (1.0H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 7.85 (0.5H, d, J = 2 Hz), 7.92 (0.5H, s), 8.19 (1.0H, dd, J = 8 Hz, 1 Hz), 8.49-8.52 (1.0H, m), 10.53 (0.5H, s), 10.71 (0.5H, s).

【0716】

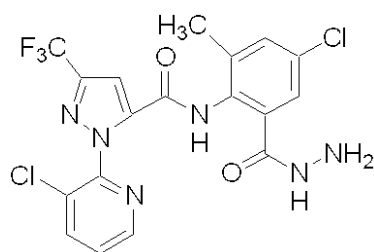
次に、製造例に用いられる中間体化合物の製造例を参考製造例に示す。

【0717】

参考製造例 1

6-クロロ-2-[1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-イル]-8-メチル-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オン 0.44 g、ヒドラジン 1 水和物 0.05 g およびテトラヒドロフラン 10 ml を混合し、該混合物を室温で 2 時間攪拌した。反応混合物を水および酢酸エチルと混合してから分液し、有機層を水洗した後、硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付して、N-[4-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド 0.10 g を得た。

N-[4-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド



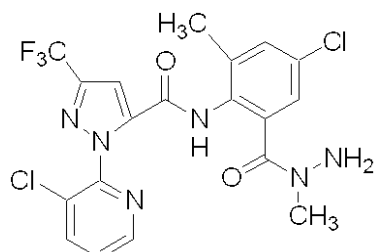
^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 2.16 (3H, s), 4.36 (2H, s), 7.32 (1H, s), 7.48 (1H, s), 7.66 (1H, dd, $J = 4\text{ Hz}$, 8 Hz), 7.74 (1H, s), 8.22 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.54 (1H, d, $J = 4\text{ Hz}$), 9.56 (1H, br s), 10.39 (1H, br s)

【0718】

参考製造例 2

6-クロロ-2-[1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-イル]-8-メチル-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オン 0.44 g、メチルヒドラジン 0.05 g およびテトラヒドロフラン 10 ml を混合し、該混合物を室温で 2 時間攪拌した。反応混合物を水および酢酸エチルと混合してから分液し、有機層を水洗した後、硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付して、N-[4-クロロ-2-(N-メチルヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド 0.40 g を得た。

N-[4-クロロ-2-(N-メチルヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド



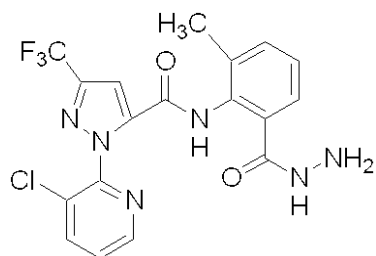
^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 2.17 (1.8H, s), 2.30 (1.2H, s), 2.76 (1.2H, s), 3.05 (1.8H, s), 4.54 (1.2H, br s), 4.99 (0.8H, br s), 7.16 - 7.23 (1H, m), 7.36 (0.6H, s), 7.46 (0.4H, s), 7.66 - 7.70 (2H, m), 8.24 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.54 (1H, d, $J = 4\text{ Hz}$), 10.25 (0.6H, br s), 10.51 (0.4H, br s)

【0719】

参考製造例 3

2-[1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-イル]-8-メチル-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オン 0.40 g、ヒドラジン 1 水和物 0.09 ml およびテトラヒドロフラン 20 ml を混合し、該混合物を室温で 3 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで 3 回抽出した。有機層を合わせて飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮することにより、1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-N-[2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド 0.26 g を得た。

1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-N-[2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド



^1H -NMR (CDCl₃, TMS) (ppm): 2.22 (3H, s), 4.05 (2H, s), 7.18 - 7.40 (5H, m), 7.42 (1H, dd, J = 8 Hz, 4 Hz), 7.89 (1H, dd, J = 8 Hz, 1 Hz), 8.48 (1H, dd, J = 4 Hz, 1 Hz), 10.04 (1H, s)

10

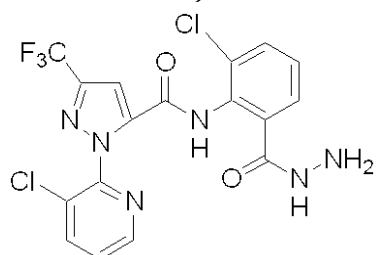
【0720】

参考製造例 4

8-クロロ-2-[1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-イル]-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オン 0.27 g、ヒドラジン 1 水和物 0.025 ml およびテトラヒドロフラン 10 ml を混合し、該混合物を室温で 3 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで 3 回抽出した。有機層を合わせて飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をクロロホルムおよびメチル t-ブチルエーテルの混合溶媒で洗浄することにより、N-[2-クロロ-6-(ヒドラジノカルボニル)フェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド 0.21 g を得た。

20

N-[2-クロロ-6-(ヒドラジノカルボニル)フェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド



30

^1H -NMR (DMSO-d₆) (ppm): 4.35 (2H, br s), 7.38 - 7.39 (2H, m), 7.61 - 7.66 (2H, m), 7.79 (1H, s), 8.20 (1H, d, J = 8 Hz), 8.53 (1H, d, J = 4 Hz), 9.52 (1H, s), 10.04 (1H, s)

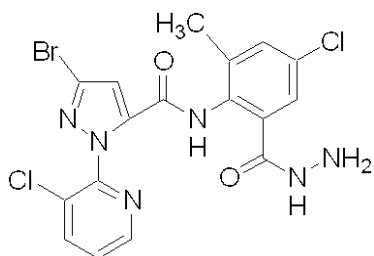
【0721】

参考製造例 5

2-[3-ブロモ-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-イル]-6-クロロ-8-メチル-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オン 0.40 g、ヒドラジン 1 水和物 0.08 ml およびテトラヒドロフラン 10 ml を混合し、該混合物を室温で 3 時間攪拌した。反応混合物を水に注加してから濾過し、得られた濾物を水およびメチル tert-ブチルエーテルで洗浄した。濾物を酢酸エチルに溶解し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮することにより、3-ブロモ-N-[4-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド 0.35 g を得た。

40

3-ブロモ-N-[4-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド



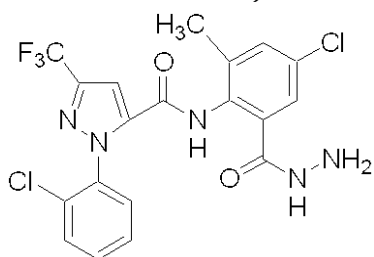
^1H -NMR (DMSO- d_6) (ppm): 2.14 (3H, s), 4.37 (2H, brs), 7.31 (1H, s), 7.38 (1H, s), 7.47 (1H, s), 7.61 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}, 4\text{ Hz}$), 8.17 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}, 1\text{ Hz}$), 8.50 (1H, dd, $J = 4\text{ Hz}, 1\text{ Hz}$), 9.55 (1H, brs), 10.26 (1H, brs)

【0722】

参考製造例 6

6-クロロ-2-[1-(2-クロロフェニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-イル]-8-メチル-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オン 0.88 g、ヒドラジン 1 水和物 0.19 ml およびテトラヒドロフラン 3 ml を混合し、該混合物を室温で 2 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで 3 回抽出した。有機層を合わせて飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮することにより、N-[4-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(2-クロロフェニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド 0.94 g を得た。

N-[4-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(2-クロロフェニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド



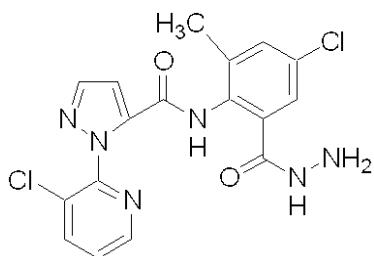
^1H -NMR (CDCl₃, TMS) (ppm): 2.18 (3H, s), 4.03 (2H, brs), 7.19 - 7.54 (8H, m), 9.74 (1H, s)

【0723】

参考製造例 7

6-クロロ-2-[1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-イル]-8-メチル-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オン 0.50 g、ヒドラジン 1 水和物 0.13 ml およびテトラヒドロフラン 20 ml を混合し、該混合物を室温で 4 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで 2 回抽出した。有機層を合わせて飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。得られた残渣を酢酸エチルとヘキサンとの混合溶媒で洗浄することにより、N-[4-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド 0.44 g を得た。

N-[4-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド



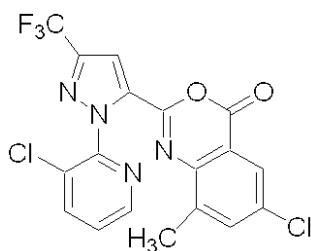
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) (ppm): 2.19 (3H, s), 4.03 (2H, brs), 7.05 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.19 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.36 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 4 Hz), 7.50 (1H, s), 7.83 - 7.86 (2H, m), 8.46 (1H, dd, $J = 4\text{ Hz}$, 1 Hz), 9.64 (1H, s)

【0724】

参考製造例 8

1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-カルボニルクロライド 3.1 g をアセトニトリル 100 ml に溶解し、2-アミノ-5-クロロ-3-メチル安息香酸 1.9 g を加え、該混合物を室温で 10 分間攪拌した。得られた混合物にトリエチルアミン 1.0 g を加え、室温で 20 分間攪拌した後、さらにトリエチルアミン 2.0 g を加え、室温で 20 分間攪拌してからメタンスルホニルクロライド 1.2 g を加え、室温で 3 時間攪拌した。反応混合物を減圧下濃縮してから、残渣に酢酸エチルおよび水を注加して分液した。有機層を水洗後、硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、6-クロロ-2-[1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-イル]-8-メチル-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オン 4.2 g を得た。

6-クロロ-2-[1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-イル]-8-メチル-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オン



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) (ppm): 1.73 (3H, s), 7.80 (1H, s), 7.82 (1H, dd, $J = 4\text{ Hz}$, 8 Hz), 7.90 (1H, s), 7.91 (1H, s), 8.39 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.66 (1H, d, $J = 4\text{ Hz}$)

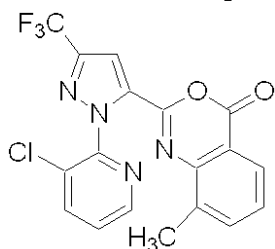
【0725】

参考製造例 9

1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-カルボニルクロライド 2.0 g をアセトニトリル 50 ml に溶解し、2-アミノ-3-メチル安息香酸 0.98 g を加え、該混合物を室温で 10 分間攪拌した。得られた混合物にトリエチルアミン 0.9 ml を加え、室温で 20 分間攪拌した後、さらにトリエチルアミン 1.8 ml を加え、室温で 20 分間攪拌してからメタンスルホニルクロライド 0.56 ml を加えて室温で 3 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで 2 回抽出した。有機層を合わせて飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、2-[1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-イル]

- 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン 1 . 1 7 g を得た。

2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン



10

^1H - NMR (CDCl_3 , TMS) (ppm) : 1 . 8 4 (3 H , s) , 7 . 3 9 (1 H , t , $J = 8 \text{ Hz}$) , 7 . 5 0 - 7 . 5 5 (3 H , m) , 7 . 9 9 (1 H , dd , $J = 8 \text{ Hz}$, 1 Hz) , 8 . 0 1 (1 H , d , $J = 8 \text{ Hz}$) , 8 . 5 9 (1 H , dd , $J = 4 . 5 \text{ Hz}$, 1 Hz)

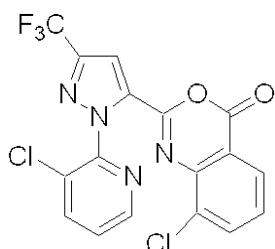
【 0 7 2 6 】

参考製造例 1 0

1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボニルクロライド 0 . 8 0 g をアセトニトリル 2 0 m l に溶解し、2 - アミノ - 3 - クロロ安息香酸 0 . 4 4 g を加え、該混合物を室温で 1 0 分間攪拌した。得られた混合物にトリエチルアミン 0 . 3 6 m l を加え、室温で 2 0 分間攪拌した後、さらにトリエチルアミン 0 . 7 2 m l を加え、室温で 2 0 分間攪拌してからメタンスルホニルクロライド 0 . 2 2 m l を加えて室温で 2 0 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで 2 回抽出した。有機層を合わせて飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、8 - クロロ - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン 1 . 1 7 g を得た。

20

8 - クロロ - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン



30

^1H - NMR (CDCl_3 , TMS) (ppm) : 7 . 4 3 (1 H , t , $J = 8 \text{ Hz}$) , 7 . 5 2 (1 H , dd , $J = 8 \text{ Hz}$, 4 Hz) , 7 . 5 3 (1 H , s) , 7 . 7 5 (1 H , dd , $J = 8 \text{ Hz}$, 1 Hz) , 8 . 0 0 (1 H , dd , $J = 8 \text{ Hz}$, 1 Hz) , 8 . 1 1 (1 H , dd , $J = 8 \text{ Hz}$, 1 Hz) , 8 . 5 7 (1 H , dd , $J = 4 \text{ Hz}$, 1 Hz)

【 0 7 2 7 】

40

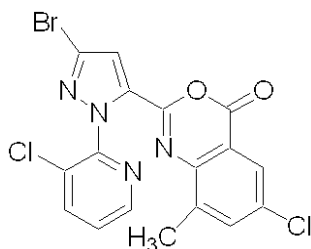
参考製造例 1 1

3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボン酸 0 . 4 4 g 、アセトニトリル 6 m l およびトリエチルアミン 0 . 2 0 g の混合物に、メタンスルホニルクロライド 0 . 1 2 5 m l を加え、得られた混合物を室温で 1 5 分間攪拌した後、そこに 2 - アミノ - 5 - クロロ - 3 - メチル安息香酸 0 . 2 7 g を加え、室温で 2 0 分間攪拌した。該混合物にトリエチルアミン 0 . 4 0 m l を加え、室温で 2 0 分間攪拌した後、メタンスルホニルクロライド 0 . 1 3 m l を加えて室温で 1 6 時間攪拌した。反応混合物を濾過し、濾物を、メチル tert - ブチルエーテルで洗浄した。得られた濾物を酢酸エチルに溶解し、水および飽和食塩水で順次洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下濃縮することにより、2 - [3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジ

50

ニル) - 1H - ピラゾール - 5 - イル] - 6 - クロロ - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン 0.098 g を得た。また、濾液を減圧下濃縮し、得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、2 - [3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピラゾール - 5 - イル] - 6 - クロロ - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン 0.093 g を得た。

2 - [3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピラゾール - 5 - イル] - 6 - クロロ - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン



10

^1H - NMR (CDCl_3 , TMS) (ppm): 1.81 (3H, s), 7.25 (1H, s), 7.48 - 7.51 (2H, m), 7.95 - 7.98 (2H, m), 8.56 (1H, dd, $J = 4\text{ Hz}$, 1 Hz)

【0728】

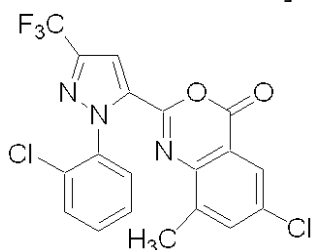
参考製造例 12

1 - (2 - クロロフェニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1H - ピラゾール - 5 - カルボニルクロライド 1.0 g とアセトニトリル 10 ml との混合物に、2 - アミノ - 5 - クロロ - 3 - メチル安息香酸 0.60 g を加え、得られた混合物を室温で 10 分間攪拌した。該混合物にトリエチルアミン 0.46 ml を加え、それを室温で 20 分間攪拌した後、さらにトリエチルアミン 0.92 ml を加え、室温で 20 分間攪拌してからメタンスルホンクロライド 0.28 ml を加えて室温で 3 時間攪拌した。反応混合物を濾過し、得られた濾液を減圧下濃縮し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、6 - クロロ - 2 - [1 - (2 - クロロフェニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン 0.98 g を得た。

20

6 - クロロ - 2 - [1 - (2 - クロロフェニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン

30



^1H - NMR (CDCl_3 , TMS) (ppm): 1.82 (3H, s), 7.45 - 7.60 (6H, m), 7.99 (1H, s)

40

【0729】

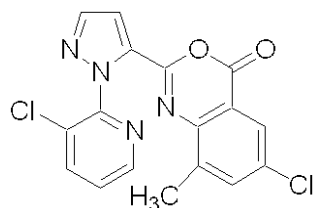
参考製造例 13

1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピラゾール - 5 - カルボン酸 1.22 g と塩化チオニル 1.15 ml との混合物を、2 時間加熱還流した。室温まで放冷した反応混合物を減圧下濃縮し、得られた残渣をアセトニトリル 15 ml に溶解し、2 - アミノ - 5 - クロロ - 3 - メチル安息香酸 0.27 g を加え、該混合物を室温で 10 分間攪拌した。該混合物にトリエチルアミン 0.73 ml を加え、室温で 20 分間攪拌した後、さらにトリエチルアミン 1.45 ml を加え、室温で 20 分間攪拌してからメタンスルホンクロライド 0.44 ml を加えて室温で 3 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで 2 回抽出した。有機層を合わせて飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾

50

燥後、減圧下濃縮した。得られた残渣をメチル *tert*-ブチルエーテルで洗浄し、6-クロロ-2-[1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1*H*-ピラゾール-5-イル]-8-メチル-4*H*-3,1-ベンズオキサジン-4-オン 0.68 g を得た。

6-クロロ-2-[1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1*H*-ピラゾール-5-イル]-8-メチル-4*H*-3,1-ベンズオキサジン-4-オン



10

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) (ppm): 1.82 (3H, s), 7.28 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.46 - 7.49 (2H, m), 7.91 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.95 - 7.99 (2H, m), 8.57 (1H, dd, $J = 4\text{ Hz}$, 1 Hz)

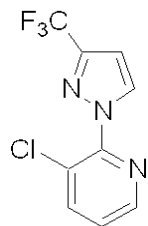
【0730】

参考製造例 14

3-トリフルオロメチル-1*H*-ピラゾール 15.30 g、2,3-ジクロロピリジン 16.64 g、炭酸カリウム 26.42 g および *N,N*-ジメチルホルムアミド 100 ml の混合物を 130 で 14 時間攪拌した。室温まで放冷した反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで 2 回抽出した。有機層を合わせて水および飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、3-クロロ-2-(3-トリフルオロメチル-1*H*-ピラゾール-1-イル)ピリジン 22.88 g を得た。

20

3-クロロ-2-(3-トリフルオロメチル-1*H*-ピラゾール-1-イル)ピリジン



30

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) (ppm): 6.75 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.37 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 4 Hz), 7.95 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 1 Hz), 8.14 (1H, d, $J = 1\text{ Hz}$), 8.49 (1H, dd, $J = 4\text{ Hz}$, 1 Hz)

【0731】

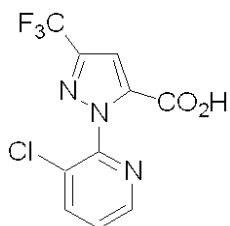
参考製造例 15

3-クロロ-2-(3-トリフルオロメチル-1*H*-ピラゾール-1-イル)ピリジン 15 g とテトラヒドロフラン 150 ml との混合物に、-78 で 2.0 mol/L リチウムジイソプロピルアミドのヘプタン/テトラヒドロフラン/エチルベンゼン溶液 39 ml を滴下し、-78 で 15 分間攪拌した。該混合物に内温が -60 以下に保たれる程度の速さで二酸化炭素を導入し、該混合物が黄色になってからさらに -78 で 10 分間攪拌した。反応混合物を室温まで昇温してから、水 200 ml およびヘキサン 200 ml を注加した。2*N* 水酸化ナトリウム水溶液を加えて水層の pH が 10 - 12 となるように調整してから分液した。有機層を 0.5*N* 水酸化ナトリウム水溶液で抽出した。水層を合わせてジエチルエーテルで洗浄後、水層の pH が 3 付近になるまで 2*N* 塩酸を注加し、メチル *tert*-ブチルエーテルで 3 回抽出し、有機層を合わせて飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮することにより、1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-トリフルオロメチル-1*H*-ピラゾール-5-カルボン酸 16.08 g を得た。

40

50

1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボン酸



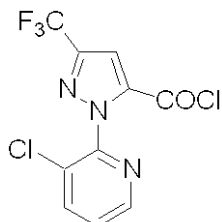
^1H - NMR (DMSO - d_6) (ppm) : 7.60 (1H, s), 7.74 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 4 Hz), 8.30 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 1 Hz), 8.60 (1H, dd, $J = 4\text{ Hz}$, 1 Hz) 10

【0732】

参考製造例 16

1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボン酸 16.08 g と塩化チオニル 12 ml との混合物を 2 時間加熱還流した。室温まで放冷した反応混合物を、減圧蒸留 (125 / 3mmHg) することにより、1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボニルクロライド 14.2 g を得た。

1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボニルクロライド 20



^1H - NMR (CDCl₃, TMS) (ppm) : 7.52 (1H, s), 7.52 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 4 Hz), 7.97 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 1 Hz), 8.53 (1H, dd, $J = 4\text{ Hz}$, 1 Hz)

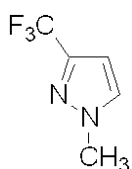
【0733】

30

参考製造例 17

4 - エトキシ - 1, 1, 1 - トリフルオロ - 3 - ブテン - 2 - オン 18 g とメタノール 50 ml との混合物に、メチルヒドラジン 5.7 ml を加え、該混合物を 4 時間加熱還流した。室温まで放冷した反応混合物を減圧下濃縮した後、減圧蒸留 (60 / 15mmHg) することにより、1 - メチル - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール 8.71 g を得た。

1 - メチル - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール



40

^1H - NMR (CDCl₃, TMS) (ppm) : 3.97 (3H, s), 6.51 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.40 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$)

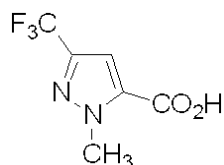
【0734】

参考製造例 18

1 - メチル - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール 8.71 g とテトラヒドロフラン 130 ml との混合物に、-78 で 2.0 mol/L リチウムジイソプロピルアミドのヘプタン/テトラヒドロフラン/エチルベンゼン溶液 32 ml を滴下し、-78 で 2 時間攪拌した。該混合液をドライアイスとテトラヒドロフラン 50 ml との混合物中に 50

注加し、室温付近まで昇温しながら2時間攪拌した。反応混合物に水とジエチルエーテルを注加し、2N水酸化ナトリウム水溶液を加えて水層のpHが10-12となるように調整してから分液し、得られた水層をジエチルエーテルで2回洗浄後、水層のpHが3付近になるまで2N塩酸を注加し、メチル tert - ブチルエーテルで3回抽出した。有機層を合わせて飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮し、1 - メチル - 3 - トリフルオロメチル - 1H - ピラゾール - 5 - カルボン酸8.19gを得た。

1 - メチル - 3 - トリフルオロメチル - 1H - ピラゾール - 5 - カルボン酸



10

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) (ppm): 4.13 (3H, s), 7.22 (1H, s)

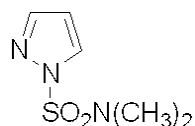
【0735】

参考製造例19

ピラゾール15gとトルエン200mlとの混合物に、室温でジメチルスルファモイルクロライド23.7mlを滴下した。次に、該混合物にトリエチルアミン40mlを加え、室温で18時間攪拌した。反応混合物を濾過し、濾液を減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、N, N - ジメチル - 1H - ピラゾール - 1 - スルホンアミド17.6gを得た。

20

N, N - ジメチル - 1H - ピラゾール - 1 - スルホンアミド



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) (ppm): 2.95 (6H, s), 6.40 (1H, dd, $J = 2\text{ Hz}$, $J = 1\text{ Hz}$), 7.75 (1H, d, $J = 1\text{ Hz}$), 7.95 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$,)

【0736】

参考製造例20

N, N - ジメチル - 1H - ピラゾール - 1 - スルホンアミド17.6gとテトラヒドロフラン200mlとの混合物に、-78℃で1.3Mのn - ブチルリチウムのヘキサン溶液80mlを滴下し、得られた混合物を-78℃で15分間攪拌した。該混合物に、1, 2 - ジブromo - 1, 1, 2, 2 - テトラクロロエタン35.8gをテトラヒドロフラン60mlに溶解した溶液を滴下し、得られた混合物を-78℃で15分間攪拌した。反応混合物を室温に戻し、1時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで3回抽出した。有機層を合わせて飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、5 - ブromo - N, N - ジメチル - 1H - ピラゾール - 1 - スルホンアミド21.3gを得た。

40

5 - ブromo - N, N - ジメチル - 1H - ピラゾール - 1 - スルホンアミド



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) (ppm): 3.08 (6H, s), 6.43 (1H, m), 7.61 (1H, m)

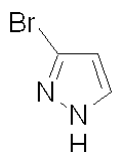
【0737】

参考製造例21

50

5 - ブロモ - N , N - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 1 - スルホンアミド 21 . 3 g とトリフルオロ酢酸 30 ml とを混合し、該混合物を室温で 2 時間攪拌した。反応混合物にヘキサンを注加してから濾過し、得られた濾液にメチル tert - ブチルエーテルを加え、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、水および飽和食塩水で順次洗浄した。これを硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下濃縮することにより、3 - ブロモ - 1 H - ピラゾール 10 . 7 g を得た。

3 - ブロモ - 1 H - ピラゾール



10

^1H - NMR (CDCl_3 , TMS) (ppm) : 6 . 37 (1 H , d , $J = 2 \text{ Hz}$) , 7 . 55 (1 H , d , $J = 2 \text{ Hz}$) , 12 . 6 (1 H , br s)

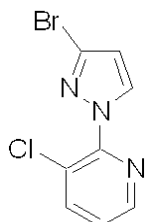
【 0738 】

参考製造例 22

3 - ブロモ - 1 H - ピラゾール 10 . 7 g、2 , 3 - ジクロロピリジン 11 . 8 g、炭酸セシウム 57 . 3 g および N , N - ジメチルホルムアミド 80 ml の混合物を 100 で 8 時間攪拌した。室温まで放冷した反応混合物に水を注加し、メチル tert - ブチルエーテルで 2 回抽出した。有機層を合わせて水および飽和食塩水で順次洗浄した後、硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、2 - (3 - ブロモ - 1 H - ピラゾール - 1 - イル) - 3 - クロロピリジン 12 . 9 g を得た。

20

2 - (3 - ブロモ - 1 H - ピラゾール - 1 - イル) - 3 - クロロピリジン



^1H - NMR (CDCl_3 , TMS) (ppm) : 6 . 51 (1 H , d , $J = 2 \text{ Hz}$) , 7 . 31 (1 H , dd , $J = 8 \text{ Hz}$, 4 Hz) , 7 . 91 (1 H , dd , $J = 8 \text{ Hz}$, 1 Hz) , 8 . 04 (1 H , d , $J = 2 \text{ Hz}$) , 8 . 45 (1 H , dd , $J = 4 \text{ Hz}$, 1 Hz)

30

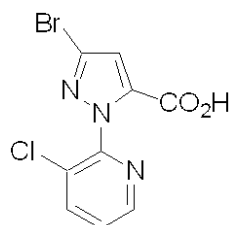
【 0739 】

参考製造例 23

2 - (3 - ブロモ - 1 H - ピラゾール - 1 - イル) - 3 - クロロピリジン 9 . 2 g とテトラヒドロフラン 80 ml との混合物に、- 78 で 2 . 0 M リチウムジイソプロピルアミドのヘプタン / テトラヒドロフラン / エチルベンゼン溶液 21 . 3 ml を滴下し、得られた混合物を - 78 で 15 分間攪拌した。該混合液をドライアイスとテトラヒドロフラン 50 ml との混合物中に注加し、室温付近まで昇温しながら 1 時間攪拌した。反応混合物に水とジエチルエーテルを注加した後、2 N 水酸化ナトリウム水溶液を加えて水層の pH が 10 - 12 となるように調整してから分液し、得られた水層をジエチルエーテルで 2 回洗浄後、水層の pH が 3 付近になるまで 2 N 塩酸を注加し、メチル tert - ブチルエーテルで 3 回抽出した。有機層を合わせて飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮し、3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボン酸 7 . 96 g を得た。

40

3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボン酸



^1H - NMR (DMSO - d_6) (ppm) : 7.25 (1H, s), 7.68 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 4 Hz), 8.24 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, $J = 1\text{ Hz}$), 8.56 (1H, dd, $J = 4\text{ Hz}$, 1 Hz)

【0740】

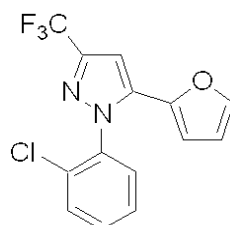
10

参考製造例 24

4, 4, 4 - トリフルオロ - 1 - (2 - フリル) - 1, 3 - ブタンジオン 12.96 g、酢酸ナトリウム 8.56 g および酢酸 40 ml の混合物に、室温で 2 - クロロフェニルヒドラジン塩酸塩 11.26 g を加え、該混合物を 60 で 1 時間攪拌した。反応混合物を減圧下濃縮してから水を注加し、クロロホルムで 3 回抽出した。有機層を合わせて飽和食塩水で洗浄後、硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、1 - (2 - クロロフェニル) - 5 - (2 - フリル) - 3 - トリフルオロメチル - 1H - ピラゾール 18.43 g を得た。

1 - (2 - クロロフェニル) - 5 - (2 - フリル) - 3 - トリフルオロメチル - 1H - ピラゾール

20



^1H - NMR (CDCl₃, TMS) (ppm) : 5.76 (1H, d, $J = 3\text{ Hz}$), 6.31 (1H, dd, $J = 3\text{ Hz}$, 2 Hz), 6.95 (1H, s), 7.40 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.43 - 7.59 (4H, m)

【0741】

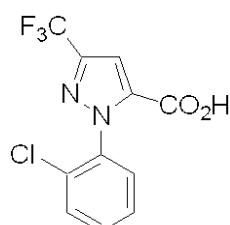
30

参考製造例 25

1 - (2 - クロロフェニル) - 5 - (2 - フリル) - 3 - トリフルオロメチル - 1H - ピラゾール 18.43 g とアセトン 250 ml との混合物を 40 以下に保ちながら、過マンガン酸カリウム 27.94 g を 100 ml の水に溶解した水溶液を滴下した後、該混合物を室温で 20 時間攪拌した。反応混合物をセライト (登録商標) を通して濾過して得られた濾液に 2 N 水酸化ナトリウム水溶液を加えて、pH を 10 - 12 となるように調整してから、酢酸エチルで 2 回洗浄した。水層の pH が 3 付近になるまで 2 N 塩酸を注加した後、メチル tert - ブチルエーテルで 3 回抽出した。有機層を合わせて飽和食塩水で洗浄した後、硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮することにより、1 - (2 - クロロフェニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1H - ピラゾール - 5 - カルボン酸 10.65 g を得た。

40

1 - (2 - クロロフェニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1H - ピラゾール - 5 - カルボン酸



^1H - NMR (CDCl₃, TMS) (ppm) : 7.33 (1H, s), 7.42 - 7

50

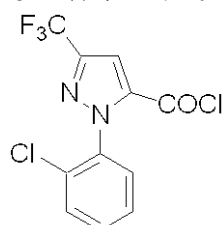
. 54 (4H, m)

【0742】

参考製造例 26

1 - (2 - クロロフェニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1H - ピラゾール - 5 - カルボン酸 10.65 g と塩化チオニル 8 ml とを混合し、該混合物を 2 時間加熱還流した。室温まで放冷した反応混合物を減圧下濃縮し、減圧蒸留 (110 / 5 mmHg) することにより、1 - (2 - クロロフェニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1H - ピラゾール - 5 - カルボニルクロライド 8.39 g を得た。

1 - (2 - クロロフェニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1H - ピラゾール - 5 - カルボニルクロライド



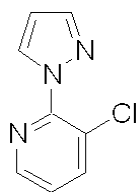
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, TMS) (ppm): 7.42 - 7.57 (5H, m)

【0743】

参考製造例 27

ピラゾール 2 g、2,3 - ジクロロピリジン 4.34 g、炭酸セシウム 9.58 g および N,N - ジメチルホルムアミド 40 ml の混合物を、100 で 8 時間攪拌した。室温まで放冷した反応混合物に水を注加し、メチル tert - ブチルエーテルで 3 回抽出した。有機層を合わせて水および飽和食塩水で順次洗浄した後、硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、3 - クロロ - 2 - (1H - ピラゾール - 1 - イル)ピリジン 3.57 g を得た。

3 - クロロ - 2 - (1H - ピラゾール - 1 - イル)ピリジン



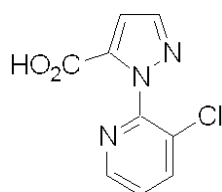
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, TMS) (ppm): 6.50 (1H, dd, J = 2 Hz, 1 Hz), 7.28 (1H, dd, J = 8 Hz, 4 Hz), 7.83 (1H, d, J = 1 Hz), 7.92 (1H, dd, J = 8 Hz, 1 Hz), 8.17 (1H, d, J = 2 Hz), 8.46 (1H, dd, J = 4 Hz, 1 Hz)

【0744】

参考製造例 28

3 - クロロ - 2 - (1H - ピラゾール - 1 - イル)ピリジン 2.0 g とテトラヒドロフラン 100 ml との混合物に、-78 で 2.0 mol/L リチウムジイソプロピルアミドのヘプタン/テトラヒドロフラン/エチルベンゼン溶液 6.7 ml を滴下し、-78 で 10 分間攪拌した。該混合液をドライアイスとテトラヒドロフラン 50 ml との混合物中に注加し、室温付近まで昇温しながら、0.5 時間攪拌した。反応混合物に水およびジエチルエーテルを注加した後、2 N 水酸化ナトリウム水溶液を加えて、水層の pH が 10 - 12 となるように調整してから分液した。水層をジエチルエーテルで 2 回洗浄後、液層の pH が 3 付近となるように 2 N 塩酸を注加し、メチル tert - ブチルエーテルで 3 回抽出した。有機層を合わせて飽和食塩水で洗浄した後、硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮することにより、1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピラゾール - 5 - カルボン酸 1.22 g を得た。

1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピラゾール - 5 - カルボン酸



^1H -NMR (CDCl₃, TMS) (ppm): 7.10 (1H, d, J = 2 Hz), 7.42 (1H, dd, J = 8 Hz, 4 Hz), 7.82 (1H, d, J = 2 Hz), 7.91 (1H, dd, J = 8 Hz, 1 Hz), 8.51 (1H, dd, J = 4 Hz, 1 Hz)

10

【0745】

参考製造例 29

無水イサト酸 16.3 g、エチルカーバゼート 10.4 g およびエタノール 50 ml の混合物を 3 時間加熱還流した。室温付近まで放冷した反応混合物に酢酸エチルを加え、2 回水洗した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をメチル tert - ブチルエーテルで洗浄することにより、N - (2 - アミノベンゾイル) - N' - エトキシカルボニルヒドラジン 14.9 g を得た。

N - (2 - アミノベンゾイル) - N' - エトキシカルボニルヒドラジン



20

^1H -NMR (CDCl₃, TMS) (ppm): 1.28 (3H, t, J = 8 Hz), 4.22 (2H, q, J = 8 Hz), 5.45 (2H, brs), 6.63 - 6.68 (2H, m), 6.85 (1H, brs), 7.22 (1H, brs), 7.43 (1H, d, J = 8 Hz), 7.95 (1H, brs)

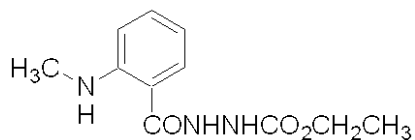
【0746】

参考製造例 30

N - メチル 無水イサト酸 8.86 g、エチルカーバゼート 5.73 g およびエタノール 25 ml の混合物を 2 時間加熱還流した。室温付近まで放冷した反応混合物に酢酸エチルを加え、2 回水洗した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をメチル tert - ブチルエーテルで洗浄することにより、N - (2 - メチルアミノベンゾイル) - N' - エトキシカルボニルヒドラジン 5.99 g を得た。

30

N - (2 - メチルアミノベンゾイル) - N' - エトキシカルボニルヒドラジン



^1H -NMR (CDCl₃, TMS) (ppm): 1.28 (3H, t, J = 7 Hz), 2.85 (3H, d, J = 5 Hz), 4.21 (2H, q, J = 7 Hz), 6.55 - 6.59 (1H, m), 6.66 (1H, d, J = 8 Hz), 6.78 (1H, brs), 7.29 - 7.37 (2H, m), 7.43 (1H, dd, J = 8 Hz, 1 Hz), 7.91 (1H, brs)

40

【0747】

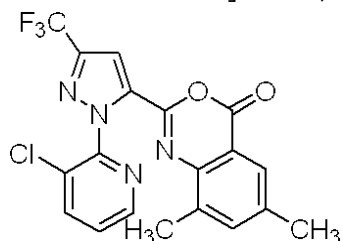
参考製造例 31 - (1)

1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1H - ピラゾール - 5 - カルボン酸 1.0 g と塩化チオニル 2 ml との混合物を、2 時間加熱還流した。室温まで放冷した反応混合物を減圧下濃縮した。得られた残渣をアセトニトリル 15 ml に溶解し、ここに 2 - アミノ - 3, 5 - ジメチル安息香酸 0.49 g を加え、該混合物を室温で 30 分間攪拌した。該混合物にトリエチルアミン 0.7 ml を加え、室温で 30 分間攪

50

拌した後、さらにトリエチルアミン 1.4 ml を加え、室温で 30 分間攪拌してからメタンスルホニルクロライド 0.5 ml を加えて室温で 5 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、減圧下濃縮した。得られた残渣を水およびメチル tert - ブチルエーテルで洗浄し、2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 6 , 8 - ジメチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン 0.71 g を得た。

2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 6 , 8 - ジメチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン



10

^1H - NMR (DMSO - d_6 , TMS) (ppm) : 1.72 (3 H , s) , 2.37 (3 H , s) , 7.54 (1 H , s) , 7.77 (1 H , s) , 7.78 - 7.85 (2 H , m) , 8.39 (1 H , d , J = 8 Hz) , 8.66 (1 H , d , J = 4 Hz)

【 0748 】

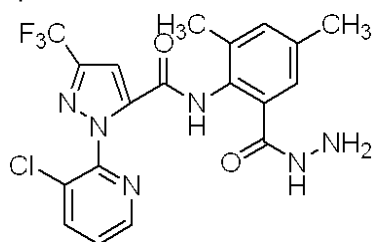
参考製造例 31 - (2)

20

6 - クロロ - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンの代わりに、2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 6 , 8 - ジメチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを用い、参考製造例 1 と同様の方法で N - [4 , 6 - ジメチル - 2 - (ヒドラジノカルボニル) フェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミドを得た。

N - [4 , 6 - ジメチル - 2 - (ヒドラジノカルボニル) フェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド

30



^1H - NMR (DMSO - d_6 , TMS) (ppm) : 2.11 (3 H , s) , 2.27 (3 H , s) , 4.34 (2 H , br s) , 7.11 (1 H , s) , 7.17 (1 H , s) , 7.66 (1 H , dd , J = 8 Hz , 4 Hz) , 7.74 (1 H , s) , 8.21 (1 H , d , J = 8 Hz) , 8.53 (1 H , d , J = 4 Hz) , 9.37 (1 H , br s) , 10.26 (1 H , br s)

40

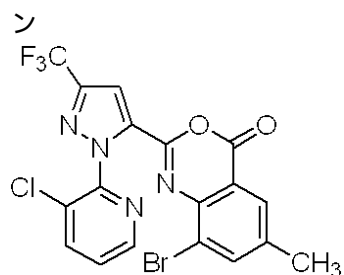
【 0749 】

参考製造例 32 - (1)

2 - アミノ - 3 , 5 - ジメチル安息香酸の代わりに、2 - アミノ - 3 - ブロモ - 5 - メチル安息香酸を用い、参考製造例 31 - (1) と同様の方法で、8 - ブロモ - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 6 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを得た。

8 - ブロモ - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 6 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オ

50



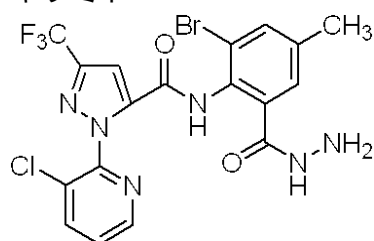
$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 2.41 (3H, s), 7.77 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 4 Hz), 7.87 (1H, s), 7.93 (1H, s), 7.98 (1H, s), 8.36 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.63 (1H, d, $J = 4\text{ Hz}$)

【0750】

参考製造例 32 - (2)

6-クロロ-2-[1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-イル]-8-メチル-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オンの代わりに、8-ブromo-2-[1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-イル]-6-メチル-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オンを用い、参考製造例 1 と同様の方法で、N-[6-ブromo-2-(ヒドラジノカルボニル)-4-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-カルボキサミドを得た。

N-[6-ブromo-2-(ヒドラジノカルボニル)-4-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド



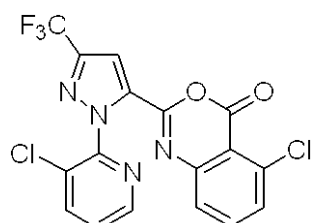
$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 2.31 (3H, s), 4.33 (2H, brs), 7.24 (1H, s), 7.43 (1H, s), 7.57-7.65 (2H, m), 8.15 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.49 (1H, d, $J = 4\text{ Hz}$), 9.38 (1H, brs), 10.31 (1H, brs)

【0751】

参考製造例 33 - (1)

2-アミノ-3,5-ジメチル安息香酸の代わりに、2-アミノ-6-クロロ安息香酸を用い、参考製造例 31 (1) と同様の方法で、5-クロロ-2-[1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-イル]-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オンを得た。

5-クロロ-2-[1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-イル]-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オン



$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 6.91 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$)

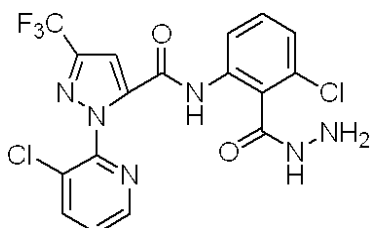
), 7.68 (1H, d, J = 8 Hz), 7.77 (1H, t, J = 8 Hz), 7.83 (1H, dd, J = 8 Hz, 4 Hz), 7.91 (1H, s), 8.37 (1H, d, J = 8 Hz), 8.64 (1H, d, J = 4 Hz)

【0752】

参考製造例 33 - (2)

6 - クロロ - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンの代わりに、5 - クロロ - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを用い、参考製造例 1 と同様の方法で、N - [3 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) フェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミドを得た。

N - [3 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) フェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド



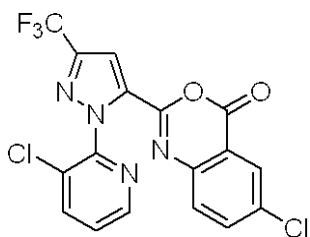
¹H - NMR (DMSO - d₆ , TMS) (ppm) : 4.47 (2 H , brs) , 7.32 - 7.50 (3 H , m) , 7.65 - 7.75 (2 H , m) , 8.25 (1 H , d , J = 8 Hz) , 8.56 (1 H , d , J = 4 Hz) , 9.58 (1 H , brs) , 10.29 (1 H , brs)

【0753】

参考製造例 34 - (1)

2 - アミノ - 3 , 5 - ジメチル安息香酸の代わりに、2 - アミノ - 5 - クロロ安息香酸を用い、参考製造例 31 - (1) と同様の方法で、6 - クロロ - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを得た。

6 - クロロ - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン



¹H - NMR (DMSO - d₆ , TMS) (ppm) : 7.02 (1 H , d , J = 8 Hz) , 7.83 (1 H , dd , J = 8 Hz , 4 Hz) , 7.87 - 7.92 (2 H , m) , 8.08 (1 H , s) , 8.37 (1 H , d , J = 8 Hz) , 8.64 (1 H , d , J = 4 Hz)

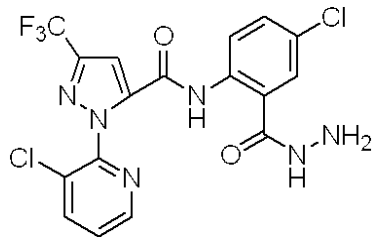
【0754】

参考製造例 34 - (2)

6 - クロロ - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンの代わりに、6 - クロロ - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを用い、参考製造例 1 と同様の方法で、N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) フェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H

- ピラゾール - 5 - カルボキサミドを得た。

N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) フェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 -
- ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド



10

^1H - NMR (DMSO - d_6 , TMS) (ppm) : 7 . 52 - 7 . 56 (2 H , m)
, 7 . 73 (1 H , dd , J = 8 Hz , 4 Hz) , 7 . 85 (1 H , s) , 8 . 19 (1
H , d , J = 8 Hz) , 8 . 29 (1 H , d , J = 8 Hz) , 8 . 58 (1 H , d , J =
4 Hz) , 10 . 30 (1 H , brs) , 12 . 52 (1 H , brs)

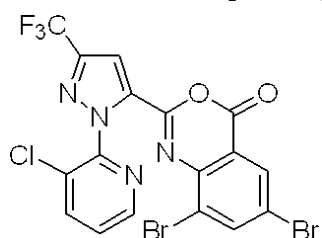
【 0755 】

参考製造例 35 - (1)

2 - アミノ - 3 , 5 - ジメチル安息香酸の代わりに、2 - アミノ - 3 , 5 - ジブromo安
息香酸を用い、参考製造例 31 (1) と同様の方法で、2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピ
リジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 6 , 8 - ジブ
romo - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを得た。

20

2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾ
ール - 5 - イル] - 6 , 8 - ジブromo - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン



^1H - NMR (DMSO - d_6 , TMS) (ppm) : 7 . 77 (1 H , dd , J = 8 H
z , 4 Hz) , 7 . 94 (1 H , s) , 8 . 19 - 8 . 21 (1 H , m) , 8 . 35 - 8
. 39 (2 H , m) , 8 . 63 (1 H , d , J = 4 Hz)

30

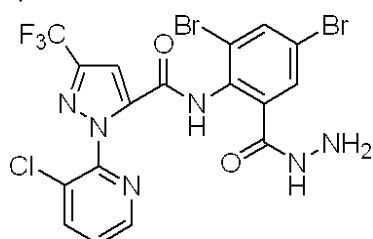
【 0756 】

参考製造例 35 - (2)

6 - クロロ - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル -
1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オ
ンの代わりに、2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル -
1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 6 , 8 - ジブromo - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン -
4 - オンを用い、参考製造例 1 と同様の方法で、N - [4 , 6 - ジブromo - 2 - (ヒドラ
ジノカルボニル) フェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロ
メチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミドを得た。

40

N - [4 , 6 - ジブromo - 2 - (ヒドラジノカルボニル) フェニル] - 1 - (3 - クロ
ロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミ
ド



50

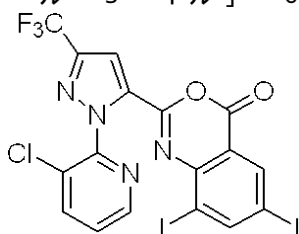
^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 4.40 (2H, brs), 7.61 (1H, s), 7.66 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 4 Hz), 7.79 (1H, s), 8.08 (1H, s), 8.21 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.54 (1H, d, $J = 4\text{ Hz}$), 9.60 (1H, brs), 10.62 (1H, brs)

【0757】

参考製造例 36 - (1)

2 - アミノ - 3, 5 - ジメチル安息香酸の代わりに、2 - アミノ - 3, 5 - ジョード安息香酸を用い、参考製造例 31 (1) と同様の方法で、2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1H - ピラゾール - 5 - イル] - 6, 8 - ジョード - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを得た。

2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1H - ピラゾール - 5 - イル] - 6, 8 - ジョード - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン



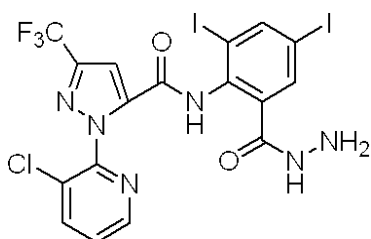
^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 7.74 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 4 Hz), 7.89 (1H, s), 8.31 - 8.35 (2H, m), 8.59 - 8.63 (2H, m)

【0758】

参考製造例 36 - (2)

6 - クロロ - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンの代わりに、2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1H - ピラゾール - 5 - イル] - 6, 8 - ジョード - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを用い、参考製造例 1 と同様の方法で、N - [4, 6 - ジョード - 2 - (ヒドラジノカルボニル) フェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1H - ピラゾール - 5 - カルボキサミドを得た。

N - [4, 6 - ジョード - 2 - (ヒドラジノカルボニル) フェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド



^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 4.39 (2H, brs), 7.66 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 4 Hz), 7.71 (1H, s), 7.79 (1H, s), 8.20 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.33 (1H, s), 8.53 (1H, d, $J = 4\text{ Hz}$), 9.51 (1H, brs), 10.58 (1H, brs)

【0759】

参考製造例 37 - (1)

2 - アミノ - 3, 5 - ジメチル安息香酸の代わりに、2 - アミノ - 4 - クロロ安息香酸を用い、参考製造例 31 (1) と同様の方法で、7 - クロロ - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1H - ピラゾール - 5 - イル] - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを得た。

10

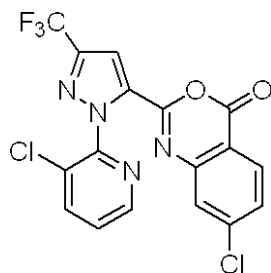
20

30

40

50

7 - クロロ - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン



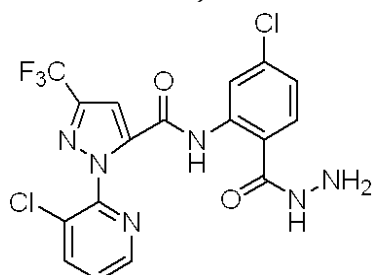
^1H - NMR (DMSO - d_6 , TMS) (ppm) : 7 . 0 2 (1 H , s) , 7 . 6 8 (1 H , d , J = 8 H z) , 7 . 8 4 (1 H , dd , J = 8 H z , 4 H z) , 7 . 9 1 (1 H , s) , 8 . 1 0 (1 H , d , J = 8 H z) , 8 . 3 8 (1 H , d , J = 8 H z) , 8 . 6 4 (1 H , d , J = 4 H z)

【 0 7 6 0 】

参考製造例 3 7 - (2)

6 - クロロ - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンの代わりに、7 - クロロ - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを用い、参考製造例 1 と同様の方法で、N - [5 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) フェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミドを得た。

N - [5 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) フェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド



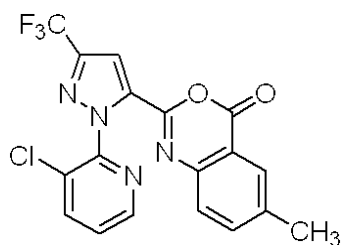
^1H - NMR (DMSO - d_6 , TMS) (ppm) : 7 . 3 1 (1 H , d , J = 8 H z) , 7 . 5 5 (1 H , s) , 7 . 7 5 (1 H , dd , J = 8 H z , 4 H z) , 7 . 8 2 (1 H , d , J = 8 H z) , 8 . 2 7 (1 H , s) , 8 . 3 1 (1 H , d , J = 8 H z) , 8 . 5 9 (1 H , d , J = 4 H z) , 1 0 . 3 2 (1 H , b r s) , 1 2 . 8 6 (1 H , b r s)

【 0 7 6 1 】

参考製造例 3 8 - (1)

2 - アミノ - 3 , 5 - ジメチル安息香酸の代わりに、2 - アミノ - 5 - メチル安息香酸を用い、参考製造例 3 1 - (1) と同様の方法で、2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 6 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを得た。

2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 6 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン



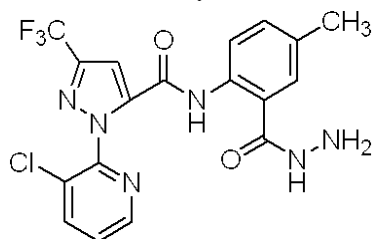
^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 2.43 (3H, s), 6.94 (1H, d, J = 8 Hz), 7.69 (1H, d, J = 8 Hz), 7.80 - 7.85 (2H, m), 7.92 (1H, s), 8.36 (1H, d, J = 8 Hz), 8.63 (1H, d, J = 4 Hz)

【0762】

参考製造例 38 - (2)

6-クロロ-2-[1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-イル]-8-メチル-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オンの代わりに、2-[1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-イル]-6-メチル-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オンを用い、参考製造例 1 と同様の方法で、N-[2-(ヒドラジノカルボニル)-4-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-カルボキサミドを得た。

N-[2-(ヒドラジノカルボニル)-4-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド



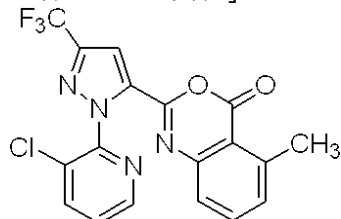
^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 2.29 (3H, s), 4.71 (2H, brs), 7.29 (1H, d, J = 8 Hz), 7.51 - 7.54 (1H, m), 7.61 - 7.63 (1H, m), 7.72 - 7.74 (1H, m), 8.07 (1H, d, J = 8 Hz), 8.29 (1H, d, J = 8 Hz), 8.56 - 8.59 (1H, m), 10.13 (1H, brs), 12.52 (1H, brs)

【0763】

参考製造例 39 - (1)

2-アミノ-3,5-ジメチル安息香酸の代わりに、2-アミノ-6-メチル安息香酸を用い、参考製造例 31 (1) と同様の方法で、2-[1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-イル]-5-メチル-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オンを得た。

2-[1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-イル]-5-メチル-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オン



^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 2.68 (3H, s), 6.82 (1H, d, J = 8 Hz), 7.44 (1H, d, J = 8 Hz), 7.70 (1H, t,

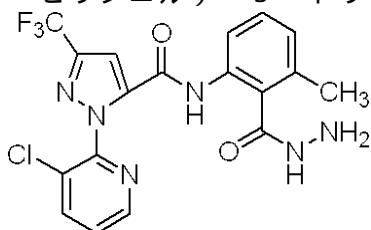
$J = 8 \text{ Hz}$), 7.82 (1 H, dd, $J = 8 \text{ Hz}$, 4 Hz), 7.85 (1 H, s), 8.36 (1 H, d, $J = 8 \text{ Hz}$), 8.64 (1 H, d, $J = 4 \text{ Hz}$)

【0764】

参考製造例 39 - (2)

6 - クロロ - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - メチル - 4 H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンの代わりに、2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 5 - メチル - 4 H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを用い、参考製造例 1 と同様の方法で、N - [2 - (ヒドラジノカルボニル) - 3 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミドを得た。

N - [2 - (ヒドラジノカルボニル) - 3 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド



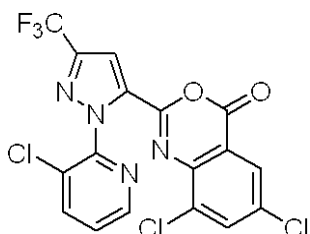
^1H - NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 2.27 (3 H, s), 4.48 (2 H, br s), 7.11 (1 H, d, $J = 8 \text{ Hz}$), $7.24 - 7.35$ (2 H, m), $7.65 - 7.72$ (2 H, m), 8.25 (1 H, d, $J = 8 \text{ Hz}$), 8.55 (1 H, d, $J = 4 \text{ Hz}$), 9.35 (1 H, br s), 10.15 (1 H, br s)

【0765】

参考製造例 40 - (1)

2 - アミノ - 3, 5 - ジメチル安息香酸の代わりに、2 - アミノ - 3, 5 - ジクロロ安息香酸を用い、参考製造例 31 (1) と同様の方法で、2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 6, 8 - ジクロロ - 4 H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを得た。

2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 6, 8 - ジクロロ - 4 H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン



^1H - NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 7.78 (1 H, dd, $J = 8 \text{ Hz}$, 4 Hz), 7.95 (1 H, s), 8.06 (1 H, s), 8.14 (1 H, s), 8.37 (1 H, d, $J = 8 \text{ Hz}$), 8.63 (1 H, d, $J = 4 \text{ Hz}$)

【0766】

参考製造例 40 - (2)

6 - クロロ - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - メチル - 4 H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンの代わりに、2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 6, 8 - ジクロロ - 4 H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを用い、参考製造例 1 と同様の方法で、N - [4, 6 - ジクロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) フェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミドを得た。

N - [4, 6 - ジクロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) フェニル] - 1 - (3 - クロ

10

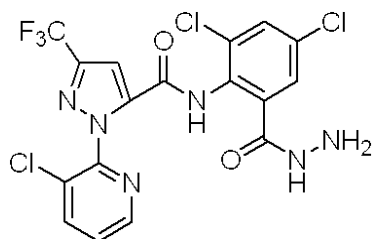
20

30

40

50

ロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド



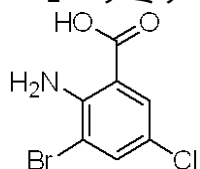
^1H - NMR (DMSO - d_6 , TMS) (ppm): 4.38 (2H, brs), 7.47 (1H, s), 7.66 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 4 Hz), 7.79 (1H, s), 7.86 (1H, s), 8.21 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.53 (1H, d, $J = 4\text{ Hz}$), 9.64 (1H, brs), 10.63 (1H, brs)

【0767】

参考製造例 41 - (1)

2 - アミノ - 5 - クロロ安息香酸 1.7 g および N, N - ジメチルホルムアミド 100 ml の混合物に、室温で N - ブロモスクシンイミド 1.8 g を加え、該混合物を室温で 10 時間攪拌した。反応混合物に水を注加した後、析出した沈殿を濾取し、2 - アミノ - 3 - ブロモ - 5 - クロロ安息香酸 1.1 g を得た。

2 - アミノ - 3 - ブロモ - 5 - クロロ安息香酸



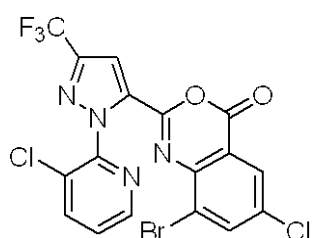
^1H - NMR (DMSO - d_6 , TMS) (ppm): 6.87 (2H, brs), 7.74 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.76 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$)

【0768】

参考製造例 41 - (2)

2 - アミノ - 3, 5 - ジメチル安息香酸の代わりに、2 - アミノ - 3 - ブロモ - 5 - クロロ安息香酸を用い、参考製造例 31 - (1) と同様の方法で 8 - ブロモ - 6 - クロロ - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 4 H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを得た。

8 - ブロモ - 6 - クロロ - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 4 H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン



^1H - NMR (DMSO - d_6 , TMS) (ppm): 7.77 (1H, dd, $J = 8$, 5 Hz), 7.94 (1H, s), 8.10 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 8.27 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 8.37 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.63 (1H, d, $J = 4\text{ Hz}$)

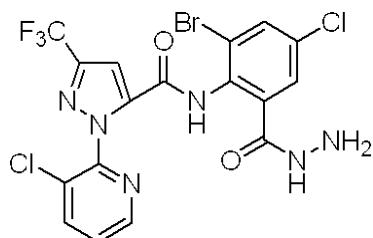
【0769】

参考製造例 41 - (3)

6 - クロロ - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - メチル - 4 H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン

ンの代わりに、8 - ブロモ - 6 - クロロ - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを用い、参考製造例 1 と同様の方法で N - [6 - ブロモ - 4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) フェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミドを得た。

N - [6 - ブロモ - 4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) フェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド



10

^1H - NMR (DMSO - d_6 , TMS) (ppm) : 4 . 3 5 (2 H , b r s) , 7 . 5 0 (1 H , s) , 7 . 6 6 (1 H , d d , $J = 8 \text{ Hz}$, 4 H z) , 7 . 7 9 (1 H , s) , 7 . 9 8 (1 H , s) , 8 . 2 1 (1 H , d , $J = 8 \text{ Hz}$) , 8 . 5 3 (1 H , d , $J = 4 \text{ Hz}$) , 9 . 6 0 (1 H , b r s) , 1 0 . 6 3 (1 H , b r s)

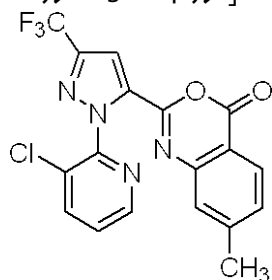
【 0 7 7 0 】

20

参考製造例 4 2 - (1)

2 - アミノ - 3 , 5 - ジメチル安息香酸の代わりに、2 - アミノ - 4 - メチル安息香酸を用い、参考製造例 3 1 - (1) と同様の方法で、2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 7 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを得た。

2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 7 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン



30

^1H - NMR (DMSO - d_6 , TMS) (ppm) : 2 . 4 1 (3 H , s) , 6 . 8 4 (1 H , s) , 7 . 4 6 (1 H , d , $J = 8 \text{ Hz}$) , 7 . 8 2 - 7 . 8 5 (2 H , m) , 8 . 0 0 (1 H , d , $J = 8 \text{ Hz}$) , 8 . 3 7 (1 H , d , $J = 8 \text{ Hz}$) , 8 . 6 4 (1 H , d , $J = 4 \text{ Hz}$)

【 0 7 7 1 】

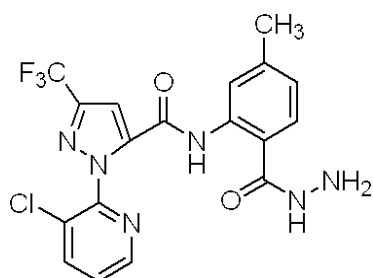
40

参考製造例 4 2 - (2)

6 - クロロ - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンの代わりに、2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 7 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを用い、参考製造例 1 と同様の方法で、N - [2 - (ヒドラジノカルボニル) - 5 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミドを得た。

N - [2 - (ヒドラジノカルボニル) - 5 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド

50



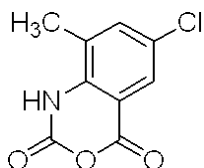
【0772】

参考製造例 43 - (1)

10

2 - アミノ - 5 - クロロ - 3 - メチル安息香酸 1.85 g、トリホスゲン 0.90 g およびテトラヒドロフラン 10 ml を混合し、該混合物を室温で 5 時間攪拌した。反応混合物を減圧下濃縮し、析出した結晶を水で洗浄して、6 - クロロ - 8 - メチル - 1H - ベンゾ[d]-1,3-オキサジン-2,4-ジオン 1.20 g を得た。

6 - クロロ - 8 - メチル - 1H - ベンゾ[d]-1,3-オキサジン-2,4-ジオン



20

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 2.33 (3H, s), 7.69 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.73 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 11.18 (1H, s)

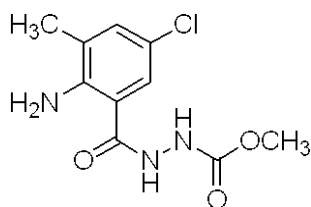
【0773】

参考製造例 43 - (2)

6 - クロロ - 8 - メチル - 1H - ベンゾ[d]-1,3-オキサジン-2,4-ジオン 1.05 g、メチルカーバゼート 0.46 g およびメタノール 20 ml の混合物を、3 時間加熱還流した。室温付近まで放冷した反応混合物を水を注加し、酢酸エチルで 3 回抽出した。得られた有機層を減圧下濃縮し、残渣をトルエンで洗浄することにより、N - (2 - アミノ - 5 - クロロ - 3 - メチルベンゾイル) - N' - メトキシカルボニルヒドラジン 0.77 g を得た。

30

N - (2 - アミノ - 5 - クロロ - 3 - メチルベンゾイル) - N' - メトキシカルボニルヒドラジン



$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 2.10 (3H, s), 3.63 (3H, s), 6.32 (2H, brs), 7.19 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.45 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 9.14 (1H, brs), 10.12 (1H, brs)

40

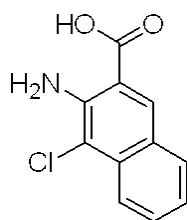
【0774】

参考製造例 44 - (1)

3 - アミノ - 2 - ナフトエ酸 1.9 g および N, N - ジメチルホルムアミド 100 ml の混合物に、室温で N - クロロスクシンイミド 1.3 g を加え、室温で 10 時間攪拌した。反応混合物に水を注加した後、析出した沈殿を濾取し、3 - アミノ - 4 - クロロ - 2 - ナフトエ酸 1.3 g を得た。

3 - アミノ - 4 - クロロ - 2 - ナフトエ酸

50



^1H - NMR (DMSO - d_6 , TMS) (ppm) : 7.27 - 7.31 (1H, m), 7.60 - 7.64 (1H, m), 7.88 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 7.93 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.53 (1H, s)

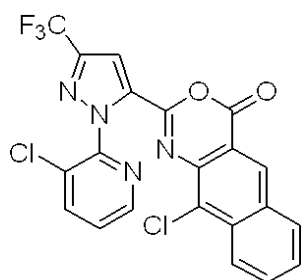
【0775】

10

参考製造例 44 - (2)

2 - アミノ - 3, 5 - ジメチル安息香酸の代わりに、3 - アミノ - 4 - クロロ - 2 - ナフトエ酸を用い、参考製造例 31 - (1) と同様の方法で、10 - クロロ - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1H - ピラゾール - 5 - イル] - 4H - ナフト[2, 3 - d][1, 3]オキサジン - 4 - オンを得た。

10 - クロロ - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1H - ピラゾール - 5 - イル] - 4H - ナフト[2, 3 - d][1, 3]オキサジン - 4 - オン



20

^1H - NMR (DMSO - d_6 , TMS) (ppm) : 7.77 (1H, t, $J = 7\text{ Hz}$), 7.84 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 4 Hz), 7.87 - 7.94 (2H, m), 8.24 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.35 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.42 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.67 (1H, d, $J = 4\text{ Hz}$), 8.91 (1H, s)

30

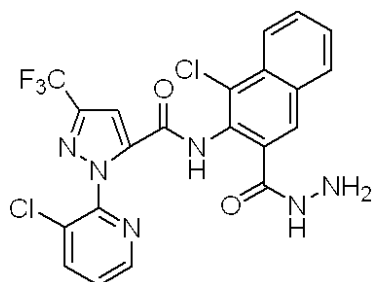
【0776】

参考製造例 44 - (3)

6 - クロロ - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンの代わりに、10 - クロロ - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1H - ピラゾール - 5 - イル] - 4H - ナフト[2, 3 - d][1, 3]オキサジン - 4 - オンを用い、参考製造例 1 と同様の方法で、N - [1 - クロロ - 3 - (ヒドラジノカルボニル) - 2 - ナフチル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1H - ピラゾール - 5 - カルボキサミドを得た。

N - [1 - クロロ - 3 - (ヒドラジノカルボニル) - 2 - ナフチル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド

40



50

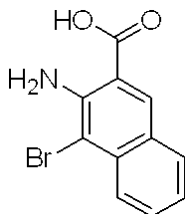
^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 4.39 (2H, brs), 7.65 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 4 Hz), 7.70 (1H, t, $J = 8\text{ Hz}$), 7.78 (1H, t, $J = 8\text{ Hz}$), 7.86 (1H, s), 8.05 - 8.11 (2H, m), 8.18 - 8.24 (2H, m), 8.53 (1H, d, $J = 4\text{ Hz}$), 9.70 (1H, brs), 10.77 (1H, brs)

【0777】

参考製造例 45 - (1)

N-クロロスクシンイミドの代わりに、N-ブロモスクシンイミドを用い、参考製造例 44 - (1) と同様の方法で、3-アミノ-4-ブロモ-2-ナフトエ酸を得た。

3-アミノ-4-ブロモ-2-ナフトエ酸



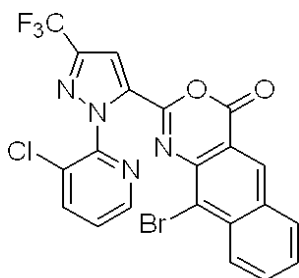
^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 7.28 (1H, t, $J = 8\text{ Hz}$), 7.61 (1H, t, $J = 8\text{ Hz}$), 7.86 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 7.92 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.57 (1H, s)

【0778】

参考製造例 45 - (2)

2-アミノ-3,5-ジメチル安息香酸の代わりに、3-アミノ-4-ブロモ-2-ナフトエ酸を用い、参考製造例 31 (1) と同様の方法で、10-ブロモ-2-[1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-イル]-4H-ナフト[2,3-d][1,3]オキサジン-4-オンを得た。

10-ブロモ-2-[1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-イル]-4H-ナフト[2,3-d][1,3]オキサジン-4-オン



^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 7.76 (1H, t, $J = 8\text{ Hz}$), 7.82 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 4 Hz), 7.87 - 7.94 (2H, m), 8.24 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.34 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.42 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.67 (1H, d, $J = 4\text{ Hz}$), 8.95 (1H, s)

【0779】

参考製造例 45 - (3)

6-クロロ-2-[1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-イル]-8-メチル-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オンの代わりに、10-ブロモ-2-[1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-イル]-4H-ナフト[2,3-d][1,3]オキサジン-4-オンを用い、参考製造例 1 と同様の方法で、N-[1-ブロモ-3-(ヒドラジノカルボニル)-2-ナフチル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-カルボキサミドを得た。

N-[1-ブロモ-3-(ヒドラジノカルボニル)-2-ナフチル]-1-(3-クロ

10

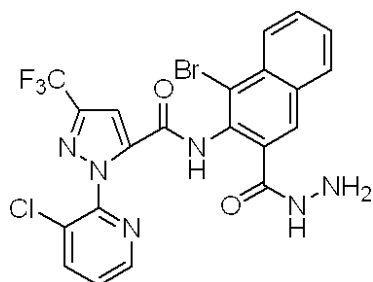
20

30

40

50

ロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド



10

^1H - NMR (DMSO - d_6 , TMS) (ppm): 4.37 (2H, brs), 7.64 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 4 Hz), 7.70 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 7.77 (1H, t, $J = 8\text{ Hz}$), 7.87 (1H, s), 8.05 - 8.10 (2H, m), 8.17 - 8.24 (2H, m), 8.53 (1H, d, $J = 4\text{ Hz}$), 9.66 (1H, brs), 10.80 (1H, brs)

【0780】

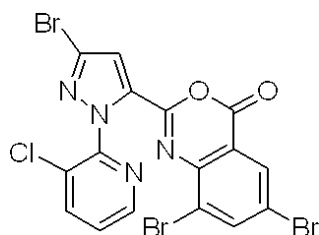
参考製造例 46 - (1)

3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボン酸 1.0 g と塩化チオニル 2 ml との混合物を、2 時間加熱還流した。室温まで放冷した反応混合物を減圧下濃縮し、得られた残渣をアセトニトリル 15 ml に溶解し、2 - アミノノ - 3, 5 - ジプロモ安息香酸 0.88 g を加え、室温で 30 分間攪拌した。該混合物にトリエチルアミン 0.7 ml を加え、該混合物を室温で 30 分間攪拌した後、さらにトリエチルアミン 1.4 ml を加え、室温で 30 分間攪拌してからメタンスルホニルクロライド 0.5 ml を加えて室温で 5 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、減圧下濃縮した。得られた残渣を水およびメチル tert - ブチルエーテルで洗浄し、2 - [3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 6, 8 - ジプロモ - 4 H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを得た。0.80 g を得た。

20

2 - [3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 6, 8 - ジプロモ - 4 H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン

30



^1H - NMR (DMSO - d_6 , TMS) (ppm): 7.56 (1H, s), 7.71 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 4 Hz), 8.18 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 8.32 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.35 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 8.59 (1H, d, $J = 4\text{ Hz}$)

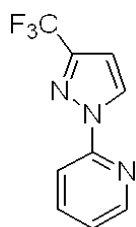
【0781】

40

参考製造例 47 - (1)

2, 3 - ジクロロピリジンの代わりに、2 - クロロピリジンを用い、参考製造例 14 と同様の方法で、2 - (3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 1 - イル)ピリジンを得た。

2 - (3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 1 - イル)ピリジン



^1H - NMR (CDCl₃, TMS) (ppm): 6.71 (1H, d, J = 2 Hz), 7.27 - 7.28 (1H, m), 7.86 (1H, t, J = 8 Hz), 8.04 (1H, d, J = 8 Hz), 8.44 (1H, d, J = 4 Hz), 8.63 (1H, d, J = 2 Hz)

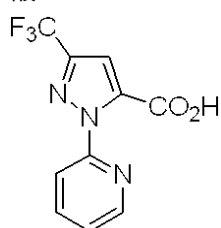
10

【0782】

参考製造例 47 - (2)

3 - クロロ - 2 - (3 - トリフルオロメチル - 1H - ピラゾール - 1 - イル) ピリジンの代わりに、2 - (3 - トリフルオロメチル - 1H - ピラゾール - 1 - イル) ピリジンを
用い、参考製造例 15 と同様の方法で、1 - (2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1H - ピラゾール - 5 - カルボン酸を得た。

1 - (2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1H - ピラゾール - 5 - カルボン
酸



20

^1H - NMR (DMSO - d₆) (ppm): 7.47 (1H, s), 7.59 (1H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 7.78 (1H, d, J = 8 Hz), 8.09 (1H, t, J = 8 Hz), 8.55 (1H, d, J = 5 Hz)

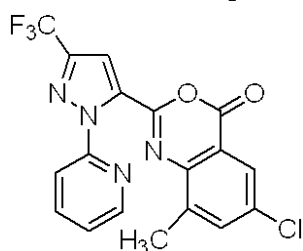
【0783】

参考製造例 47 - (3)

1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピラゾール - 5 - カルボン酸の代わりに、1 - (2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1H - ピラゾール - 5 - カルボン
酸を用い、参考製造例 13 と同様の方法で、6 - クロロ - 2 - [1 - (2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを得た。

30

6 - クロロ - 2 - [1 - (2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン



40

^1H - NMR (CDCl₃, TMS) (ppm): 2.15 (3H, s), 7.26 (1H, s), 7.42 (1H, dd, J = 8 Hz, 4 Hz), 7.58 (1H, s), 7.79 (1H, d, J = 8 Hz), 7.96 - 8.00 (2H, m), 8.43 (1H, d, J = 4 Hz)

【0784】

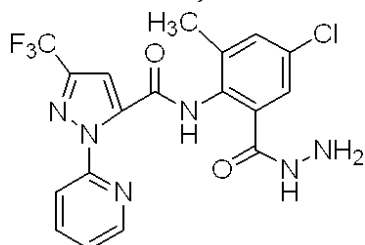
参考製造例 47 - (4)

6 - クロロ - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル -

50

1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンの代わりに、6 - クロロ - 2 - [1 - (2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを用い、参考製造例 1 と同様の方法で、N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミドを得た。

N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド



10

^1H - NMR (DMSO - d_6 , TMS) (ppm) : 2 . 3 1 (3 H , s) , 4 . 4 4 (2 H , s) , 7 . 3 4 - 7 . 3 5 (2 H , m) , 7 . 5 0 - 7 . 5 5 (2 H , m) , 7 . 8 1 (1 H , d , J = 8 Hz) , 8 . 0 7 (1 H , t , J = 8 Hz) , 8 . 4 8 (1 H , d , J = 4 Hz) , 9 . 5 5 (1 H , brs) , 10 . 3 9 (1 H , brs)

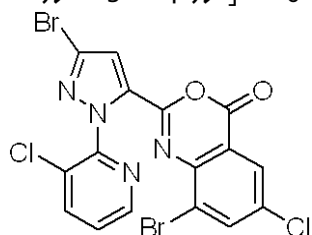
【 0 7 8 5 】

20

参考製造例 4 8 - (1)

2 - アミノ - 3 , 5 - ジブromo安息香酸の代わりに、2 - アミノ - 3 - ブromo - 5 - クロロ安息香酸を用い、参考製造例 4 6 (1) と同様の方法で、8 - ブromo - 2 - [3 - ブromo - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 6 - クロロ - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを得た。

8 - ブromo - 2 - [3 - ブromo - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 6 - クロロ - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン



30

^1H - NMR (DMSO - d_6 , TMS) (ppm) : 7 . 5 6 (1 H , s) , 7 . 7 2 (1 H , dd , J = 8 Hz , 4 Hz) , 8 . 0 8 (1 H , d , J = 2 Hz) , 8 . 2 5 (1 H , d , J = 2 Hz) , 8 . 3 2 (1 H , dd , J = 8 Hz , 2 Hz) , 8 . 5 9 (1 H , dd , J = 4 Hz , 2 Hz)

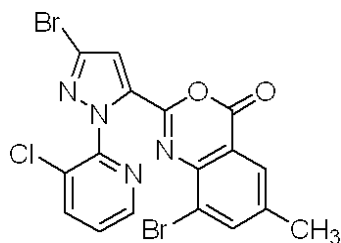
【 0 7 8 6 】

参考製造例 4 9 - (1)

2 - アミノ - 3 , 5 - ジブromo安息香酸の代わりに、2 - アミノ - 3 - ブromo - 5 - メチル安息香酸を用い、参考製造例 4 6 (1) と同様の方法で、8 - ブromo - 2 - [3 - ブromo - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 6 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを得た。

40

8 - ブromo - 2 - [3 - ブromo - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 6 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン



^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 2.40 (3H, s), 7.50 (1H, s), 7.71 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 4 Hz), 7.91 (1H, s), 7.96 (1H, s), 8.31 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.59 (1H, d, $J = 4\text{ Hz}$)

10

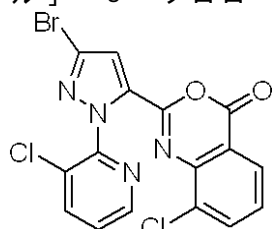
【0787】

参考製造例 50

2-アミノ-3,5-ジブロモ安息香酸の代わりに、2-アミノ-3-クロロ安息香酸を用い、参考製造例 46 (1) と同様の方法で、2-[3-ブロモ-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-イル]-8-クロロ-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オンを得た。

2-[3-ブロモ-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-イル]-8-クロロ-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オン

20



^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 7.52 - 7.61 (2H, m), 7.73 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 4 Hz), 7.93 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 2 Hz), 8.04 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 2 Hz), 8.32 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 2 Hz), 8.60 (1H, dd, $J = 4\text{ Hz}$, 2 Hz)

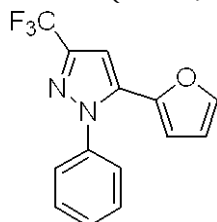
【0788】

30

参考製造例 51 - (1)

2-クロロフェニルヒドラジンの代わりに、フェニルヒドラジンを用い、参考製造例 24 と同様の方法で、5-(2-フリル)-1-フェニル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾールを得た。

5-(2-フリル)-1-フェニル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール



40

^1H -NMR (CDCl $_3$, TMS) (ppm): 5.96 (1H, d, $J = 4\text{ Hz}$), 6.33 (1H, dd, $J = 4\text{ Hz}$, 2 Hz), 6.90 (1H, s), 7.43 - 7.48 (6H, m)

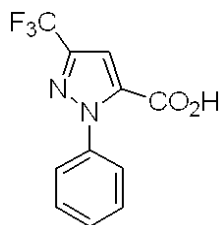
【0789】

参考製造例 51 - (2)

5-(2-フリル)-1-(2-クロロフェニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾールの代わりに、5-(2-フリル)-1-フェニル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾールを用い、参考製造例 25 と同様の方法で 1-フェニル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-カルボン酸を得た。

50

1 - フェニル - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボン酸



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) (ppm): 7.29 (1H, s), 7.46 - 7.51 (5H, m)

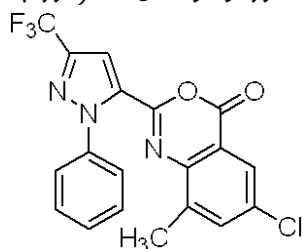
【0790】

10

参考製造例 51 - (3)

1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボン酸の代わりに、1 - フェニル - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボン酸を用い、参考製造例 13 と同様の方法で、6 - クロロ - 2 - (1 - フェニル - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル) - 8 - メチル - 4 H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを得た。

6 - クロロ - 2 - (1 - フェニル - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル) - 8 - メチル - 4 H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン



20

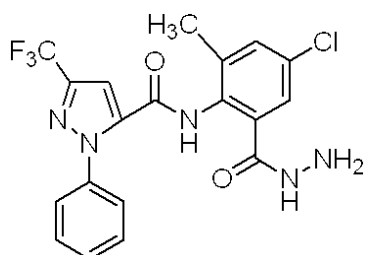
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) (ppm): 1.88 (3H, s), 7.47 - 7.54 (7H, m), 7.99 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$)

【0791】

参考製造例 51 - (4)

6 - クロロ - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - メチル - 4 H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンの代わりに、6 - クロロ - 2 - (1 - フェニル - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル) - 8 - メチル - 4 H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを用い、参考製造例 1 と同様の方法で、N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - フェニル - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミドを得た。

N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - フェニル - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド



40

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$, TMS) (ppm): 2.19 (3H, s), 4.41 (2H, brs), 7.32 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.46 - 7.52 (5H, m), 7.56 (2H, d, $J = 7\text{ Hz}$), 9.61 (1H, brs), 10.29 (1H, brs)

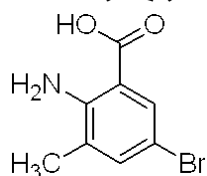
【0792】

50

参考製造例 52 - (1)

2 - アミノ - 5 - クロロ安息香酸 1.5 g および N, N - ジメチルホルムアミド 100 ml の混合物に、室温で N - プロモスクシンイミド 1.8 g を加え、該混合物を室温で 10 時間攪拌した。反応混合物に水 30 ml を注加した後、酢酸エチルで 3 回抽出した。有機層を合わせて、飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮し、2 - アミノ - 5 - ブロモ - 3 - メチル安息香酸 1.2 g を得た。

2 - アミノ - 5 - ブロモ - 3 - メチル安息香酸



10

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 2.11 (3H, s), 7.33 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.68 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$)

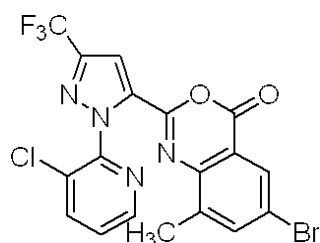
【0793】

参考製造例 52 - (2)

2 - アミノ - 3, 5 - ジメチル安息香酸の代わりに、2 - アミノ - 5 - ブロモ - 3 - メチル安息香酸を用い、参考製造例 31 - (1) と同様の方法で、6 - ブロモ - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを得た。

20

6 - ブロモ - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン



30

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 1.73 (3H, s), 7.81 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 4 Hz), 7.90 (1H, s), 7.93 (1H, s), 8.04 (1H, t, $J = 1\text{ Hz}$), 8.39 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.66 (1H, d, $J = 4\text{ Hz}$)

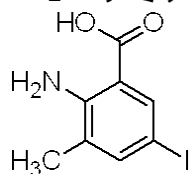
【0794】

参考製造例 53 - (1)

2 - アミノ - 3 - メチル安息香酸 2.6 g および N, N - ジメチルホルムアミド 100 ml の混合物に、室温で N - ヨードスクシンイミド 2.3 g を加え、該混合物を室温で 10 時間攪拌した。反応混合物に水を注加した後、析出した沈殿を濾取し、2 - アミノ - 5 - ヨード - 3 - メチル安息香酸 1.7 g を得た。

40

2 - アミノ - 5 - ヨード - 3 - メチル安息香酸



$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 2.08 (3H, s), 7.44 (1H, d, $J = 1\text{ Hz}$), 7.86 (1H, d, $J = 1\text{ Hz}$)

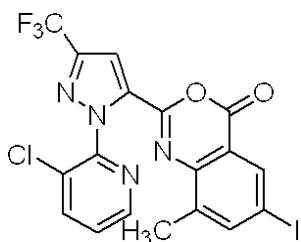
【0795】

参考製造例 53 - (2)

50

2 - アミノ - 3 , 5 - ジメチル安息香酸の代わりに、2 - アミノ - 5 - ヨード - 3 - メチル安息香酸を用い、参考製造例 3 1 (1) と同様の方法で、2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 6 - ヨード - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを得た。

2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 6 - ヨード - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン



10

^1H - NMR (DMSO - d_6 , TMS) (ppm) : 1 . 7 0 (3 H , s) , 7 . 8 1 (1 H , dd , J = 8 Hz , 4 Hz) , 7 . 8 9 (1 H , s) , 8 . 0 7 (1 H , s) , 8 . 1 9 (1 H , s) , 8 . 3 9 (1 H , d , J = 8 Hz) , 8 . 6 6 (1 H , d , J = 4 Hz)

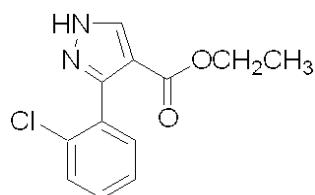
【 0 7 9 6 】

20

参考製造例 5 4 - (1)

2 - (2 - クロロベンゾイル) - 3 - (N , N - ジメチルアミノ) アクリル酸エチル (特開平 7 - 1 0 1 9 4 0 号に記載された化合物) 1 . 4 1 g 、ヒドラジン 1 水和物 0 . 3 0 g および酢酸 5 m l の混合物を室温で 1 0 時間攪拌した。反応混合物を減圧下濃縮した。残渣に水を注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を水洗後、無水硫酸ナトリウムで乾燥、減圧下濃縮し、3 - (2 - クロロフェニル) - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸エチルを得た。

3 - (2 - クロロフェニル) - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸エチル

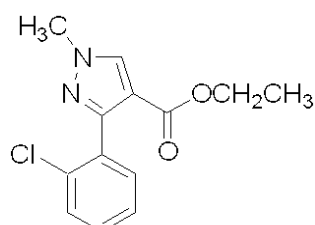


30

得られた 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸エチル、ヨウ化メチル 1 . 0 7 g 、炭酸カリウム 1 . 0 4 g および N , N - ジメチルホルムアミド 5 m l を氷冷下混合した後、該混合物を室温で 1 0 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を水洗後、無水硫酸ナトリウムで乾燥、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸エチル 0 . 7 2 g および 5 - (2 - クロロフェニル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸エチル 0 . 4 8 g を得た。

40

3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸エチル

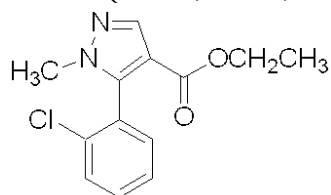


^1H - NMR (CDCl₃) (ppm) : 1 . 1 2 (3 H , t , J = 7 Hz) , 3 . 6

50

8 (3 H , s) , 4 . 0 9 - 4 . 1 5 (2 H , m) , 7 . 3 1 (1 H , d d , J = 7 H z , 2 H z) , 7 . 3 8 (1 H , t d , J = 7 H z , 1 H z) , 7 . 4 4 (1 H , t d , J = 8 H z , 2 H z) , 7 . 5 2 (1 H , d d , J = 8 H z , 1 H z) , 8 . 0 1 (1 H , s)

5 - (2 - クロロフェニル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸エチル



10

^1H - NMR (CDCl_3) (ppm) : 1 . 1 3 (3 H , t , J = 7 H z) , 3 . 9 8 (3 H , s) , 4 . 1 4 (2 H , q , J = 7 H z) , 7 . 2 7 - 7 . 3 5 (2 H , m) , 7 . 3 8 - 7 . 4 1 (1 H , m) , 7 . 4 3 - 7 . 4 5 (1 H , m) , 7 . 9 6 (1 H , s)

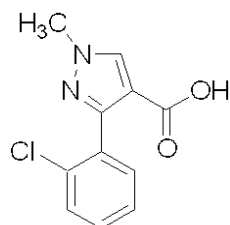
【 0 7 9 7 】

参考製造例 5 4 - (2)

3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸エチル 0 . 7 2 g、水酸化カリウム 0 . 2 3 g、水 1 m l およびエタノール 5 m l の混合物を、室温で 3 日間攪拌した。反応混合物を減圧下濃縮した後、得られた残渣に水を注加し、メチル tert - ブチルエーテルで洗浄した。水層の pH が 3 付近になるまで 1 0 % クエン酸水溶液を注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を水洗後、無水硫酸ナトリウムで乾燥、減圧下濃縮し、3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸 0 . 6 1 g を得た。

20

3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸



30

^1H - NMR (CDCl_3) (ppm) : 3 . 6 6 (3 H , s) , 7 . 3 0 (1 H , d d , J = 8 H z , 2 H z) , 7 . 3 7 (1 H , t d , J = 8 H z , 1 H z) , 7 . 4 3 (1 H , t d , J = 8 H z , 2 H z) , 7 . 5 1 (1 H , d d , J = 8 H z , 1 H z) , 8 . 0 2 (1 H , s)

【 0 7 9 8 】

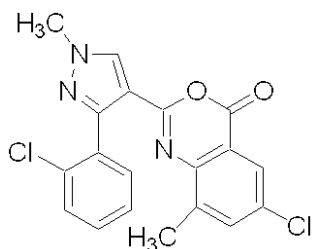
参考製造例 5 4 - (3)

3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸 0 . 6 1 g、塩化チオニル 0 . 2 8 m l およびトルエン 1 0 m l の混合物を、1 時間加熱還流した。室温まで放冷した反応混合物を減圧下濃縮した後、得られた残渣をアセトニトリル 1 0 m l に溶解した。そこへ、2 - アミノ - 5 - クロロ - 3 - メチル安息香酸 0 . 4 8 g を加え、得られた混合物を室温で 3 0 分間攪拌した。該混合物にトリエチルアミン 0 . 2 6 g を加え、室温で 3 0 分間攪拌した後、さらにトリエチルアミン 0 . 5 2 g を加え、得られた混合物を室温で 3 0 分間攪拌した。次に、反応混合物に、氷冷下、メタンスルホンクロライド 0 . 3 0 g を加えた後、室温で 1 0 時間攪拌した。反応混合物に水および酢酸エチルを注加し、0 . 2 6 g の固体を濾取した。また、濾液を分液し、有機層を水洗後、無水硫酸ナトリウムで乾燥、減圧下濃縮した。得られた残渣を酢酸エチルで洗浄し、0 . 2 5 g の固体を得た。これらの固体はいずれも、6 - クロロ - 2 - [3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル] - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンであった。

40

50

6 - クロロ - 2 - [3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル] - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン



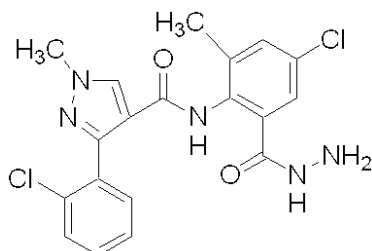
$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) (ppm) : 1.86 (3H, s), 3.68 (3H, s), 7.52 - 7.63 (3H, m), 7.69 - 7.72 (2H, m), 7.81 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 8.18 (1H, s)

【0799】

参考製造例 54 - (4)

6 - クロロ - 2 - [3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル] - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン 0.19 g、ヒドラジン 1 水和物 0.10 g および N - メチルピロリジノン 10 ml を氷冷下混合し、該混合物を室温で 8 時間攪拌した。反応混合物に水を注加した後、酢酸エチルで抽出した。有機層を水洗後、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮し、N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド 0.18 g を得た。

N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド



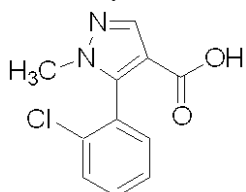
$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) (ppm) : 2.13 (3H, s), 3.60 (3H, s), 4.39 (2H, brs), 7.29 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.42 - 7.53 (4H, m), 7.60 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.11 (1H, s), 9.53 (2H, brs)

【0800】

参考製造例 55 - (1)

3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸エチルの代わりに、5 - (2 - クロロフェニル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸エチルを用い、参考製造例 54 - (2) と同様の方法で、5 - (2 - クロロフェニル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸を得た。

5 - (2 - クロロフェニル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸



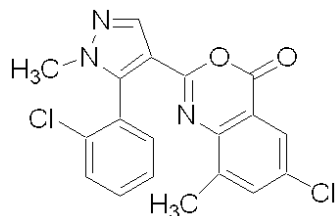
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl $_3$) (ppm) : 3.97 (3H, s), 7.26 - 7.35 (2H, m), 7.37 - 7.39 (1H, m), 7.42 - 7.44 (1H, m), 7.98 (1H, s)

【 0 8 0 1 】

参考製造例 5 5 - (2)

3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸の代わりに、5 - (2 - クロロフェニル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸を用い、参考製造例 5 4 - (3) と同様の方法で、6 - クロロ - 2 - [5 - (2 - クロロフェニル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル] - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを得た。

6 - クロロ - 2 - [5 - (2 - クロロフェニル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル] - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン



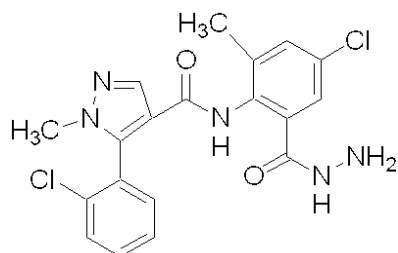
^1H - NMR (DMSO - d_6) (ppm) : 1 . 9 0 (3 H , s) , 3 . 9 9 (3 H , s) , 7 . 4 0 - 7 . 5 0 (3 H , m) , 7 . 5 6 (1 H , d , J = 8 H z) , 7 . 7 1 (1 H , d , J = 2 H z) , 7 . 8 2 (1 H , d , J = 2 H z) , 8 . 6 3 (1 H , s)

【 0 8 0 2 】

参考製造例 5 5 - (3)

6 - クロロ - 2 - [3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル] - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンの代わりに、6 - クロロ - 2 - [5 - (2 - クロロフェニル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル] - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを用い、参考製造例 5 4 - (4) と同様の方法で、N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 5 - (2 - クロロフェニル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミドを得た。

N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 5 - (2 - クロロフェニル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド



^1H - NMR (DMSO - d_6) (ppm) : 2 . 1 6 (3 H , s) , 3 . 9 4 (3 H , s) , 4 . 3 9 (2 H , b r s) , 7 . 3 0 (1 H , d , J = 2 H z) , 7 . 3 3 - 7 . 4 6 (5 H , m) , 8 . 3 6 (1 H , s) , 9 . 4 9 - 9 . 5 9 (2 H , b r m)

【 0 8 0 3 】

参考製造例 5 6 - (1)

2 - アミノ - 3 - メトキシ安息香酸 1 . 6 7 g および N , N - ジメチルホルムアミド 1 0 0 m l の混合物に、室温で N - クロロスクシンイミド 1 . 3 g を加え、得られた混合物を室温で 1 0 時間攪拌した。反応混合物に水を注加した後、析出した沈殿を濾取し、2 - アミノ - 5 - クロロ - 3 - メトキシ安息香酸 1 . 2 g を得た。

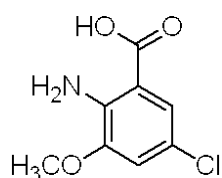
2 - アミノ - 5 - クロロ - 3 - メトキシ安息香酸

10

20

30

40



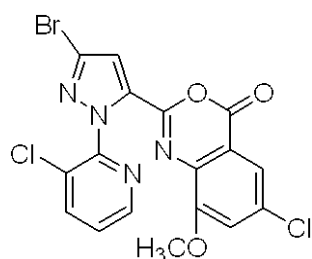
^1H - NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 3.84 (3H, s), 6.99 (1H, s), 7.28 (1H, s)

【0804】

参考製造例 56 - (2)

2 - アミノ - 3 , 5 - ジブromo安息香酸の代わりに、2 - アミノ - 5 - クロロ - 3 - メトキシ安息香酸を用い、参考製造例 46 - (1) と同様の方法で、2 - [3 - プロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピラゾール - 5 - イル] - 6 - クロロ - 8 - メトキシ - 4H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを得た。

2 - [3 - プロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピラゾール - 5 - イル] - 6 - クロロ - 8 - メトキシ - 4H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン



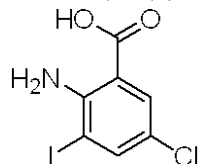
^1H - NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 3.71 (3H, s), 7.45 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.48 (1H, s), 7.57 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.78 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 4 Hz), 8.28 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 2 Hz), 8.57 (1H, dd, $J = 4\text{ Hz}$, 2 Hz)

【0805】

参考製造例 57 - (1)

2 - アミノ - 5 - クロロ安息香酸 1.5 g および N, N - ジメチルホルムアミド 100 ml の混合物に、室温で N - ヨードスクシンイミド 2.7 g を加え、該混合物を室温で 24 時間攪拌した。反応混合物に水 30 ml を注加した後、酢酸エチルで 3 回抽出した。有機層を合わせて、飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮し、2 - アミノ - 5 - クロロ - 3 - ヨード安息香酸 1.2 g を得た。

2 - アミノ - 5 - クロロ - 3 - ヨード安息香酸



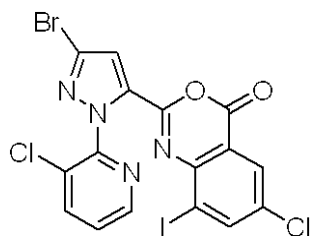
^1H - NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 6.76 (2H, brs), 7.75 (1H, d, $J = 1\text{ Hz}$), 7.87 (1H, d, $J = 1\text{ Hz}$)

【0806】

参考製造例 57 - (2)

2 - アミノ - 3 , 5 - ジブromo安息香酸の代わりに、2 - アミノ - 5 - クロロ - 3 - ヨード安息香酸を用い、参考製造例 46 - (1) と同様の方法で、2 - [3 - プロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピラゾール - 5 - イル] - 6 - クロロ - 8 - ヨード - 4H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを得た。

2 - [3 - プロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピラゾール - 5 - イル] - 6 - クロロ - 8 - ヨード - 4H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン



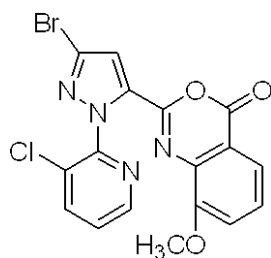
^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 7.53 (1H, s), 7.69 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 4 Hz), 8.08 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 8.29 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.38 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 8.57 (1H, d, $J = 4\text{ Hz}$)

【0807】

参考製造例 58

2-アミノ-3,5-ジブロモ安息香酸の代わりに、2-アミノ-3-メトキシ安息香酸を用い、参考製造例 46-(1)と同様の方法で、2-[3-ブロモ-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-イル]-8-メトキシ-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オンを得た。

2-[3-ブロモ-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-イル]-8-メトキシ-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オン



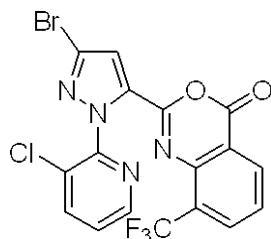
^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 3.67 (3H, s), 7.40 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 1 Hz), 7.46 (1H, s), 7.52 (1H, t, $J = 8\text{ Hz}$), 7.61 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 1 Hz), 7.78 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 4 Hz), 8.28 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 1 Hz), 8.57 (1H, dd, $J = 4\text{ Hz}$, 1 Hz)

【0808】

参考製造例 59

2-アミノ-3,5-ジブロモ安息香酸の代わりに、2-アミノ-3-トリフルオロメチル安息香酸を用い、参考製造例 46-(1)と同様の方法で、2-[3-ブロモ-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-イル]-8-トリフルオロメチル-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オンを得た。

2-[3-ブロモ-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-イル]-8-トリフルオロメチル-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オン



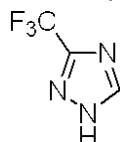
^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 7.56 (1H, s), 7.69 - 7.77 (2H, m), 8.15 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.29 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 1 Hz), 8.37 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.55 (1H, dd, $J = 4\text{ Hz}$, 1 Hz)

【0809】

参考製造例 60 - (1)

ヒドラジン 1 水和物 4.8 g をエタノール 160 ml に溶解し、ここにトリフルオロ酢酸エチル 14.2 g を滴下した。得られた混合物を室温で 1 時間攪拌した。反応混合物を減圧下濃縮した。得られた残渣をエタノール 100 ml に溶解し、ここにホルムアミジン酢酸塩 9.9 g を加え、加熱還流下で 3 時間攪拌した。室温まで放冷した反応混合物を減圧下濃縮した。得られた残渣に重曹水を注加し、酢酸エチルで 2 回抽出した。有機層を合わせて水および飽和食塩水で順次洗浄した後、硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、3 - トリフルオロメチル - 1 H - 1, 2, 4 - トリアゾール 7.0 g を得た。

3 - トリフルオロメチル - 1 H - 1, 2, 4 - トリアゾール



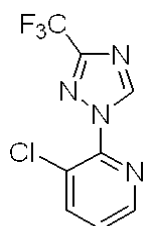
^1H - NMR (CDCl₃, TMS) (ppm): 8.48 (1H, s)

【0810】

参考製造例 60 - (2)

3 - トリフルオロメチル - 1 H - 1, 2, 4 - トリアゾール 3.5 g、2, 3 - ジクロロピリジン 3.8 g、炭酸カリウム 6.0 g および N, N - ジメチルホルムアミド 30 ml の混合物を 120 °C で 27 時間攪拌した。室温まで放冷した反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで 2 回抽出した。有機層を合わせて水および飽和食塩水で順次洗浄した後、硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、3 - クロロ - 2 - (3 - トリフルオロメチル - 1 H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル)ピリジン 0.72 g を得た。

3 - クロロ - 2 - (3 - トリフルオロメチル - 1 H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル)ピリジン



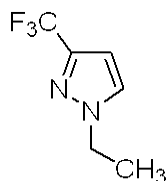
^1H - NMR (DMSO - d₆) (ppm): 7.47 (1H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 8.01 (1H, dd, J = 8 Hz, 2 Hz), 8.53 (1H, dd, J = 5 Hz, 2 Hz), 8.82 (1H, s)

【0811】

参考製造例 61 - (1)

メチルヒドラジンの代わりに、エチルヒドラジンをを用い、参考製造例 17 と同様の方法で、1 - エチル - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾールを得た。

1 - エチル - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール



^1H - NMR (CDCl₃, TMS) (ppm): 1.52 (3H, t, J = 7 Hz), 4.23 (2H, q, J = 7 Hz), 6.51 (1H, d, J = 2 Hz), 7.44 (1H, d, J = 2 Hz)

【0812】

10

20

30

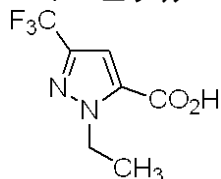
40

50

参考製造例 61 - (2)

1 - メチル - 3 - トリフルオロメチル - 1H - ピラゾールの代わりに、1 - エチル - 3 - トリフルオロメチル - 1H - ピラゾールを用い、参考製造例 18 と同様の方法で、1 - エチル - 3 - トリフルオロメチル - 1H - ピラゾール - 5 - カルボン酸を得た。

1 - エチル - 3 - トリフルオロメチル - 1H - ピラゾール - 5 - カルボン酸



10

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) (ppm): 1.51 (3H, t, $J = 7\text{ Hz}$), 4.68 (2H, q, $J = 7\text{ Hz}$), 7.21 (1H, s)

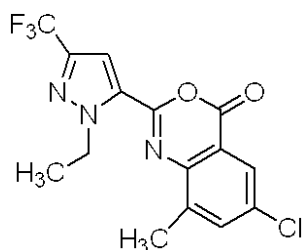
【0813】

参考製造例 61 - (3)

1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピラゾール - 5 - カルボン酸の代わりに、1 - エチル - 3 - トリフルオロメチル - 1H - ピラゾール - 5 - カルボン酸を用い、参考製造例 13 と同様の方法で、6 - クロロ - 2 - (1 - エチル - 3 - トリフルオロメチル - 1H - ピラゾール - 5 - イル) - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを得た。

6 - クロロ - 2 - (1 - エチル - 3 - トリフルオロメチル - 1H - ピラゾール - 5 - イル) - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン

20



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) (ppm): 1.58 (3H, t, $J = 7\text{ Hz}$), 2.59 (3H, s), 4.89 (2H, q, $J = 7\text{ Hz}$), 7.33 (1H, s), 7.69 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 8.07 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$),

30

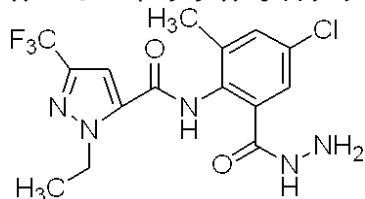
【0814】

参考製造例 61 - (4)

6 - クロロ - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンの代わりに、6 - クロロ - 2 - (1 - エチル - 3 - トリフルオロメチル - 1H - ピラゾール - 5 - イル) - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを用い、参考製造例 1 と同様の方法で、N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - エチル - 3 - トリフルオロメチル - 1H - ピラゾール - 5 - カルボキサミドを得た。

40

N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - エチル - 3 - トリフルオロメチル - 1H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) (ppm): 1.48 (3H, t, $J = 7\text{ Hz}$), 2.30 (3H, s), 4.04 (2H, s), 4.66 (2H, q, $J = 7\text{ Hz}$), 7.

50

0.8 (1H, s), 7.29 (1H, s), 7.40 (1H, s), 7.45 (1H, brs), 9.81 (1H, brs)

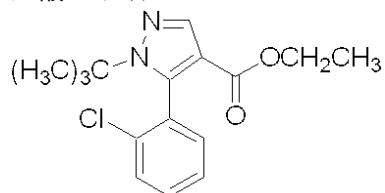
【0815】

参考製造例 62 - (1)

2 - (2 - クロロベンゾイル) - 3 - (N, N - ジメチルアミノ) アクリル酸エチル (特開平 7 - 101940 号に記載の化合物) 2.82 g、tert - ブチルヒドラジン塩酸塩 1.25 g およびエタノール 10 ml の混合物を 8 時間加熱還流した。室温まで放冷した反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を水洗後、無水硫酸ナトリウムで乾燥、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、1 - tert - ブチル - 5 - (2 - クロロフェニル) - 1H - ピラゾール - 4 - カルボン酸エチル 0.48 g を得た。

10

1 - tert - ブチル - 5 - (2 - クロロフェニル) - 1H - ピラゾール - 4 - カルボン酸エチル



¹H - NMR (CDCl₃) (ppm): 1.04 (3H, t, J = 7 Hz), 1.47 (9H, s), 3.98 - 4.12 (2H, m), 7.28 - 7.35 (2H, m), 7.38 - 7.42 (1H, m), 7.45 - 7.48 (1H, m), 7.99 (1H, s)

20

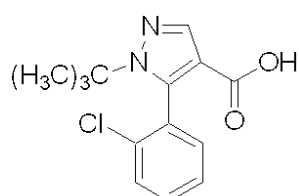
【0816】

参考製造例 62 - (2)

3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボン酸エチルの代わりに、1 - tert - ブチル - 5 - (2 - クロロフェニル) - 1H - ピラゾール - 4 - カルボン酸エチルを用い、参考製造例 54 - (2) と同様の方法で、1 - tert - ブチル - 5 - (2 - クロロフェニル) - 1H - ピラゾール - 4 - カルボン酸を得た。

1 - tert - ブチル - 5 - (2 - クロロフェニル) - 1H - ピラゾール - 4 - カルボン酸

30



¹H - NMR (CDCl₃) (ppm): 1.45 (9H, s), 7.25 - 7.33 (2H, m), 7.39 (1H, td, J = 7 Hz, 2 Hz), 7.44 (1H, dd, J = 8 Hz, 1 Hz), 8.00 (1H, s)

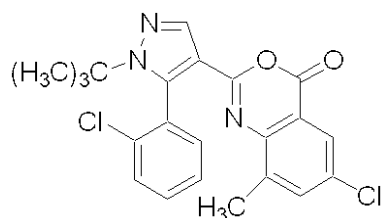
40

【0817】

参考製造例 62 - (3)

3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボン酸の代わりに、1 - tert - ブチル - 5 - (2 - クロロフェニル) - 1H - ピラゾール - 4 - カルボン酸を用い、参考製造例 54 - (3) と同様の方法で、2 - [1 - tert - ブチル - 5 - (2 - クロロフェニル) - 1H - ピラゾール - 4 - イル] - 6 - クロロ - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを得た。

2 - [1 - tert - ブチル - 5 - (2 - クロロフェニル) - 1H - ピラゾール - 4 - イル] - 6 - クロロ - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン



$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) (ppm): 1.44 (9H, s), 1.77 (3H, s), 7.47 - 7.59 (3H, m), 7.65 - 7.68 (2H, m), 7.80 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 8.18 (1H, s)

【0818】

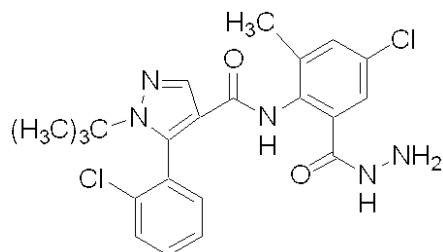
10

参考製造例 62 - (4)

6 - クロロ - 2 - [3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - イル] - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンの代わりに、2 - [1 - tert - ブチル - 5 - (2 - クロロフェニル) - 1H - ピラゾール - 4 - イル] - 6 - クロロ - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを用い、参考製造例 54 - (4) と同様の方法で、1 - tert - ブチル - N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 5 - (2 - クロロフェニル) - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミドを得た。

1 - tert - ブチル - N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 5 - (2 - クロロフェニル) - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド

20



$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) (ppm): 1.40 (9H, s), 2.06 (3H, s), 4.37 (2H, br s), 7.28 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.38 - 7.53 (5H, m), 8.10 (1H, s), 9.36 (1H, br s), 9.53 (1H, br s)

30

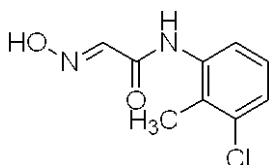
【0819】

参考製造例 63 - (1)

抱水クロラル 4.62 g、3 - クロロ - 2 - メチルアニリン 3.5 g、無水硫酸ナトリウム 30 g、水 120 mL および 2 N 塩酸 2 mL の混合物を、室温で 2 時間攪拌した。次に、得られた混合物にヒドロキシアミン塩酸塩 1.8 g を加え 30 分間加熱還流した。反応混合物を氷冷し、析出した沈殿を濾取することにより、N - (3 - クロロ - 2 - メチルフェニル) - 2 - (ヒドロキシイミノ) アセトアミド 2.5 g を得た。

N - (3 - クロロ - 2 - メチルフェニル) - 2 - (ヒドロキシイミノ) アセトアミド

40



$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 2.22 (3H, s), 7.22 (1H, t, $J = 8\text{ Hz}$), 7.33 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 7.38 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 7.67 (1H, s), 9.78 (1H, br s), 12.21 (1H, s)

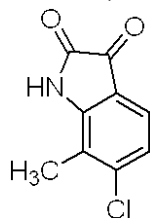
【0820】

参考製造例 63 - (2)

50

濃硫酸 2.5 g に、50 で N - (3 - クロロ - 2 - メチルフェニル) - 2 - (ヒドロキシミノ) アセトアミド 2.5 g を加え、該混合物を 80 で 30 分間攪拌した。反応混合物を 200 g の氷に注加し、析出した沈殿を濾取して、6 - クロロ - 7 - メチル - 1 H - インドール - 2 , 3 - ジオン 1.3 g 得た。

6 - クロロ - 7 - メチル - 1 H - インドール - 2 , 3 - ジオン



10

^1H - NMR (DMSO - d_6 , TMS) (ppm) : 2.22 (3 H , s) , 7.15 (1 H , d , J = 8 Hz) , 7.37 (1 H , d , J = 8 Hz) , 11.28 (1 H , s)

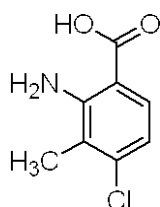
【 0821 】

参考製造例 63 - (3)

6 - クロロ - 7 - メチル - 1 H - インドール - 2 , 3 - ジオン 1.3 g および 2 N 水酸化ナトリウム水溶液 50 mL の混合液を、過酸化水素水 (30 %) 2 g に室温で滴下した後、該混合物を 1 時間室温で攪拌した。反応混合物に 2 N 塩酸を pH が 4 になるまで注加し、析出した沈殿を濾取して、2 - アミノ - 4 - クロロ - 3 - メチル安息香酸 0.6 g を得た。

20

2 - アミノ - 4 - クロロ - 3 - メチル安息香酸



^1H - NMR (DMSO - d_6 , TMS) (ppm) : 2.18 (3 H , s) , 6.62 (1 H , d , J = 9 Hz) , 7.61 (1 H , d , J = 9 Hz)

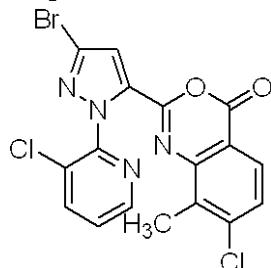
30

【 0822 】

参考製造例 63 - (4)

2 - アミノ - 3 , 5 - ジブromo安息香酸の代わりに、2 - アミノ - 4 - クロロ - 3 - メチル安息香酸を用い、参考製造例 46 (1) と同様の方法で、2 - [3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 7 - クロロ - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを得た。

2 - [3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 7 - クロロ - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン



40

^1H - NMR (DMSO - d_6 , TMS) (ppm) : 1.76 (3 H , s) , 7.55 (1 H , s) , 7.65 (1 H , d , J = 9 Hz) , 7.77 (1 H , dd , J = 8 Hz , 4 Hz) , 7.94 (1 H , d , J = 9 Hz) , 8.35 (1 H , dd , J = 8 Hz , 1 Hz) , 8.64 (1 H , dd , J = 4 Hz , 1 Hz)

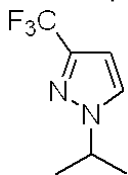
【 0823 】

50

参考製造例 64 - (1)

2, 3 - ジクロロピリジンの代わりに、ヨウ化イソプロピルを用い参考製造例 14 と同様の方法で、1 - イソプロピル - 3 - トリフルオロメチル - 1H - ピラゾールを得た。

1 - イソプロピル - 3 - トリフルオロメチル - 1H - ピラゾール



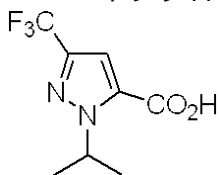
^1H - NMR (CDCl₃, TMS) (ppm): 1.53 (6H, d, J = 7 Hz), 4.53 - 4.60 (1H, m), 6.50 (1H, d, J = 2 Hz), 7.45 (1H, d, J = 2 Hz)

【0824】

参考製造例 64 - (2)

1 - メチル - 3 - トリフルオロメチル - 1H - ピラゾールの代わりに、1 - イソプロピル - 3 - トリフルオロメチル - 1H - ピラゾールを用い、参考製造例 18 と同様の方法で、1 - イソプロピル - 3 - トリフルオロメチル - 1H - ピラゾール - 5 - カルボン酸を得た。

1 - イソプロピル - 3 - トリフルオロメチル - 1H - ピラゾール - 5 - カルボン酸



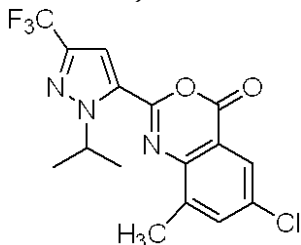
^1H - NMR (CDCl₃, TMS) (ppm): 1.53 (6H, d, J = 7 Hz), 5.49 - 5.56 (1H, m), 7.17 (1H, s)

【0825】

参考製造例 64 - (3)

1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピラゾール - 5 - カルボン酸の代わりに、1 - イソプロピル - 3 - トリフルオロメチル - 1H - ピラゾール - 5 - カルボン酸を用い、参考製造例 13 と同様の方法で、6 - クロロ - 2 - (1 - イソプロピル - 3 - トリフルオロメチル - 1H - ピラゾール - 5 - イル) - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを得た。

6 - クロロ - 2 - (1 - イソプロピル - 3 - トリフルオロメチル - 1H - ピラゾール - 5 - イル) - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン



^1H - NMR (CDCl₃, TMS) (ppm): 1.62 (6H, d, J = 7 Hz), 2.59 (3H, s), 5.83 - 5.90 (1H, m), 7.31 (1H, s), 7.68 (1H, s), 8.07 (1H, s)

【0826】

参考製造例 64 - (4)

6 - クロロ - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンの代わりに、6 - クロロ - 2 - (1 - イソプロピル - 3 - トリフルオロメチル - 1H -

10

20

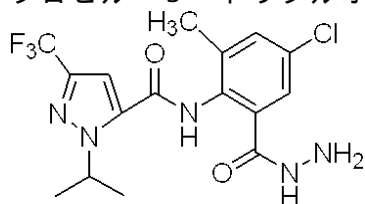
30

40

50

ピラゾール - 5 - イル) - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを用い、参考製造例 1 と同様の方法で、N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - イソプロピル - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミドを得た。

N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - イソプロピル - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド



10

^1H - NMR (DMSO - d_6 , TMS) (ppm) : 1.44 (6 H, d, $J = 7\text{ Hz}$), 2.25 (3 H, s), 4.36 (2 H, s), 5.42 - 5.47 (1 H, m), 7.34 (1 H, s), 7.36 (1 H, s), 7.50 (1 H, s), 9.61 (1 H, brs), 10.16 (1 H, brs)

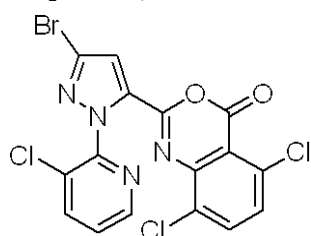
【0827】

参考製造例 6 5

2 - アミノ - 3 , 5 - ジブromo安息香酸の代わりに、2 - アミノ - 3 , 6 - ジクロロ安息香酸を用い、参考製造例 4 6 - (1) と同様の方法で、2 - [3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 5 , 8 - ジクロロ - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを得た。

20

2 - [3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 5 , 8 - ジクロロ - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン



30

^1H - NMR (DMSO - d_6 , TMS) (ppm) : 7.57 (1 H, s), 7.62 (1 H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 7.72 (1 H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 4 Hz), 7.87 (1 H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.31 (1 H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.59 (1 H, d, $J = 4\text{ Hz}$)

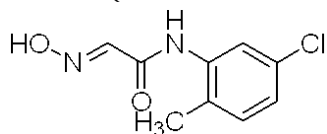
【0828】

参考製造例 6 6 - (1)

3 - クロロ - 2 - メチルアニリンの代わりに、5 - クロロ - 2 - メチルアニリンを用い、参考製造例 6 3 - (1) と同様の方法で、N - (5 - クロロ - 2 - メチルフェニル) - 2 - (ヒドロキシイミノ) アセトアミドを得た。

N - (5 - クロロ - 2 - メチルフェニル) - 2 - (ヒドロキシイミノ) アセトアミド

40



^1H - NMR (DMSO - d_6 , TMS) (ppm) : 2.20 (3 H, s), 7.17 (1 H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 2 Hz), 7.27 (1 H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 7.64 (1 H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.70 (1 H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 9.56 (1 H, s), 12.27 (1 H, s)

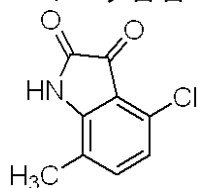
【0829】

参考製造例 6 6 - (2)

50

N - (3 - クロロ - 2 - メチルフェニル) - 2 - (ヒドロキシイミノ) アセトアミドの代わりに、N - (5 - クロロ - 2 - メチルフェニル) - 2 - (ヒドロキシイミノ) アセトアミドを用い、参考製造例 6 3 - (2) と同様の方法で、4 - クロロ - 7 - メチル - 1 H - インドール - 2 , 3 - ジオンを得た。

4 - クロロ - 7 - メチル - 1 H - インドール - 2 , 3 - ジオン



10

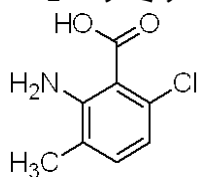
^1H - NMR (DMSO - d_6 , TMS) (ppm) : 2 . 1 6 (3 H , s) , 6 . 9 9 (1 H , d , J = 8 Hz) , 7 . 4 0 (1 H , d , J = 8 Hz) , 1 1 . 2 4 (1 H , s)

【 0 8 3 0 】

参考製造例 6 6 - (3)

6 - クロロ - 7 - メチル - 1 H - インドール - 2 , 3 - ジオンの代わりに、4 - クロロ - 7 - メチル - 1 H - インドール - 2 , 3 - ジオンを用い、参考製造例 6 3 - (3) と同様の方法で、2 - アミノ - 6 - クロロ - 3 - メチル安息香酸を得た。

2 - アミノ - 6 - クロロ - 3 - メチル安息香酸



20

^1H - NMR (DMSO - d_6 , TMS) (ppm) : 2 . 0 7 (3 H , s) , 6 . 5 7 (1 H , d , J = 8 Hz) , 7 . 0 1 (1 H , d , J = 8 Hz)

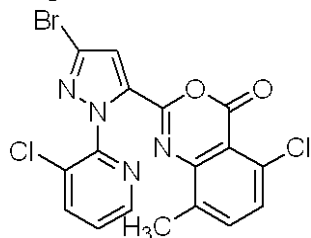
【 0 8 3 1 】

参考製造例 6 6 - (4)

2 - アミノ - 3 , 5 - ジブromo安息香酸の代わりに、2 - アミノ - 6 - クロロ - 3 - メチル安息香酸を用い、参考製造例 4 6 - (1) と同様の方法で、2 - [3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 5 - クロロ - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを得た。

30

2 - [3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 5 - クロロ - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン



40

^1H - NMR (DMSO - d_6 , TMS) (ppm) : 1 . 6 6 (3 H , s) , 7 . 5 2 - 7 . 5 6 (2 H , m) , 7 . 6 2 (1 H , d , J = 8 Hz) , 7 . 7 6 (1 H , dd , J = 8 Hz , 4 Hz) , 8 . 3 4 (1 H , d , J = 8 Hz) , 8 . 6 3 (1 H , d , J = 4 Hz)

【 0 8 3 2 】

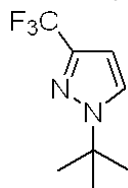
参考製造例 6 7 - (1)

4 - エトキシ - 1 , 1 , 1 - トリフルオロ - 3 - ブテン - 2 - オン 5 g、酢酸ナトリウム 3 g およびエタノール 1 5 m l の混合物に、tert - ブチルヒドラジン塩酸塩 4 . 6 g を加え、該混合物を 2 日間加熱還流した。反応混合物に水を注加した後、ジエチルエー

50

テルで3回抽出した。有機層を合わせて、飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウム乾燥し、減圧下濃縮することにより、1-tert-ブチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール3.0gを得た。

1-tert-ブチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール



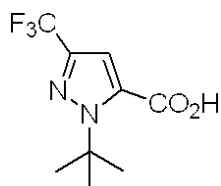
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) (ppm): 1.61 (9H, s), 6.48 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.54 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$)

【0833】

参考製造例67-(2)

1-メチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾールの代わりに、1-tert-ブチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾールを用い、参考製造例18と同様の方法で、1-tert-ブチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-カルボン酸を得た。

1-tert-ブチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-カルボン酸



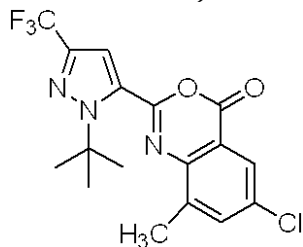
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) (ppm): 1.75 (9H, s), 7.28 (1H, s)

【0834】

参考製造例67-(3)

1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-カルボン酸の代わりに、1-tert-ブチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-カルボン酸を用い、参考製造例13と同様の方法で、6-クロロ-2-(1-tert-ブチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-イル)-8-メチル-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オンを得た。

6-クロロ-2-(1-tert-ブチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-イル)-8-メチル-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オン



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) (ppm): 1.86 (9H, s), 2.61 (3H, s), 7.32 (1H, s), 7.68 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 8.08 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$)

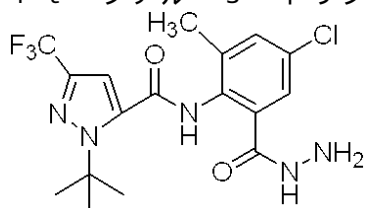
【0835】

参考製造例67-(4)

6-クロロ-2-[1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-イル]-8-メチル-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オンの代わりに、6-クロロ-2-(1-tert-ブチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-イル)-8-メチル-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オン

を用い、参考製造例 1 と同様の方法で、N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (2 - tert - ブチル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミドを得た。

N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - tert - ブチル - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド



10

^1H - NMR (DMSO - d_6 , TMS) (ppm) : 1 . 67 (9 H , s) , 2 . 27 (3 H , s) , 4 . 36 (2 H , s) , 7 . 11 (1 H , s) , 7 . 34 (1 H , s) , 7 . 48 (1 H , s) , 9 . 63 (1 H , brs) , 10 . 22 (1 H , brs)

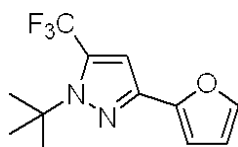
【 0836 】

参考製造例 68 - (1)

2 - クロロフェニルヒドラジン塩酸塩の代わりに、tert - ブチルヒドラジン塩酸塩を用い、参考製造例 24 と同様の方法で、1 - tert - ブチル - 3 - (2 - フリル) - 5 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾールを得た。

1 - tert - ブチル - 3 - (2 - フリル) - 5 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール

20



^1H - NMR (CDCl₃ , TMS) (ppm) : 1 . 53 (9 H , s) , 6 . 48 - 6 . 51 (2 H , m) , 6 . 59 (1 H , s) , 7 . 55 (1 H , dd , J = 2 Hz , 1 Hz)

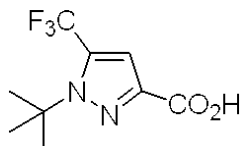
【 0837 】

参考製造例 68 - (2)

30

1 - (2 - クロロフェニル) - 5 - (2 - フリル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾールの代わりに、1 - tert - ブチル - 3 - (2 - フリル) - 5 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾールを用い、参考製造例 25 と同様の方法で、1 - tert - ブチル - 5 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボン酸を得た。

1 - tert - ブチル - 5 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボン酸



^1H - NMR (CDCl₃ , TMS) (ppm) : 1 . 73 (9 H , s) , 7 . 90 (1 H , brs)

40

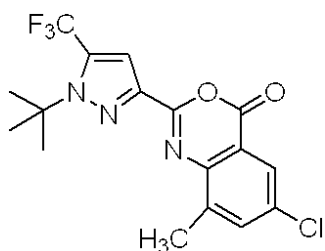
【 0838 】

参考製造例 68 - (3)

1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボン酸の代わりに、1 - tert - ブチル - 5 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボン酸を用い、参考製造例 13 と同様の方法で、6 - クロロ - 2 - [1 - tert - ブチル - 5 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イル] - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを得た。

6 - クロロ - 2 - [1 - tert - ブチル - 5 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イル] - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン

50



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) (ppm): 1.76 (9H, s), 2.58 (3H, s), 7.57 (1H, s), 7.74 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 8.12 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$)

10

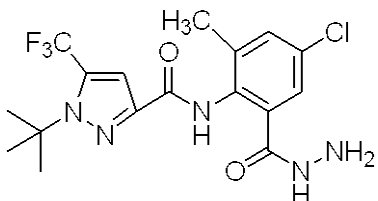
【0839】

参考製造例 68 - (4)

6-クロロ-2-[1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-イル]-8-メチル-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オンの代わりに、6-クロロ-2-[1-tert-ブチル-5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-3-イル]-8-メチル-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オンを用い、参考製造例 1 と同様の方法で、N-[4-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-tert-ブチル-5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-3-カルボキサミドを得た。

N-[4-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-tert-ブチル-5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-3-カルボキサミド

20



$^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$, TMS) (ppm): 1.70 (9H, s), 2.26 (3H, s), 4.39 (2H, s), 7.37 (1H, s), 7.50 (1H, s), 7.85 (1H, s), 9.75 (1H, brs), 10.67 (1H, brs)

30

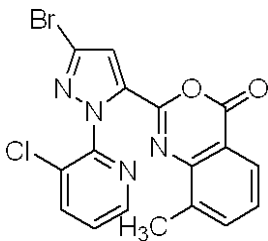
【0840】

参考製造例 69

2-アミノ-3,5-ジブromo安息香酸の代わりに、2-アミノ-3-メチル安息香酸を用い、参考製造例 46 - (1) と同様の方法で、2-[3-ブromo-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-イル]-8-メチル-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オンを得た。

2-[3-ブromo-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-イル]-8-メチル-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オン

40



$^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$, TMS) (ppm): 1.74 (3H, s), 7.46 - 7.51 (2H, m), 7.68 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 7.76 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 4 Hz), 7.94 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.35 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 1 Hz), 8.63 (1H, dd, $J = 4\text{ Hz}$, 1 Hz)

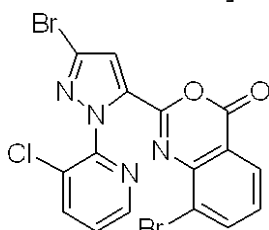
【0841】

50

参考製造例 70

2 - アミノ - 3 , 5 - ジブromo安息香酸の代わりに、2 - アミノ - 3 - ブromo安息香酸を用い、参考製造例 46 - (1) と同様の方法で、8 - ブromo - 2 - [3 - ブromo - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを得た。

8 - ブromo - 2 - [3 - ブromo - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン



10

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO-d_6 , TMS) (ppm) : 7 . 49 (1 H , t , $J = 8 \text{ Hz}$) , 7 . 54 (1 H , s) , 7 . 72 (1 H , dd , $J = 8 \text{ Hz}$, 4 Hz) , 8 . 08 (1 H , s) , 8 . 10 (1 H , s) , 8 . 32 (1 H , t , $J = 4 \text{ Hz}$) , 8 . 60 (1 H , d , $J = 4 \text{ Hz}$)

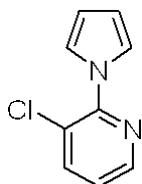
【 0842 】

参考製造例 71 - (1)

ピロール 1 . 0 g 、 3 - クロロ - 2 - メタンスルホニルピリジン 3 . 0 g 、炭酸セシウム 6 . 6 g および N,N - ジメチルホルムアミド 10 ml の混合物を 60 で 27 時間攪拌した。室温まで放冷した反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで 2 回抽出した。有機層を合わせて水および飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、3 - クロロ - 2 - (1 H - ピロール - 1 - イル) ピリジン 1 . 7 g を得た。

20

3 - クロロ - 2 - (1 H - ピロール - 1 - イル) ピリジン



30

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) (ppm) : 6 . 35 (2 H , t , $J = 2 \text{ Hz}$) , 7 . 15 (1 H , dd , $J = 8 \text{ Hz}$, 5 Hz) , 7 . 42 (2 H , t , $J = 2 \text{ Hz}$) , 7 . 83 (1 H , dd , $J = 8 \text{ Hz}$, 2 Hz) , 8 . 39 (1 H , dd , $J = 5 \text{ Hz}$, 2 Hz)

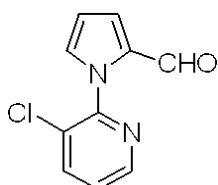
【 0843 】

参考製造例 71 - (2)

N,N - ジメチルホルムアミド 3 . 8 ml にオキシ塩化リン 4 . 2 ml を室温で滴下し、室温で 30 分間攪拌した。ここに 3 - クロロ - 2 - (1 H - ピロール - 1 - イル) ピリジン 1 . 6 g を加え、得られた混合物を 60 で 2 時間攪拌した。室温まで放冷した反応混合物を氷水にゆっくり加えた。ここに 2 N 水酸化ナトリウム水溶液を加えて、pH が 4 となるように調整した。析出した沈殿を濾取することにより、3 - クロロ - 2 - (2 - ホルミル - 1 H - ピロール - 1 - イル) ピリジン 1 . 7 g を得た。

40

3 - クロロ - 2 - (2 - ホルミル - 1 H - ピロール - 1 - イル) ピリジン



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) (ppm) : 6 . 48 (1 H , dd , $J = 4 \text{ Hz}$,

50

3 H z) , 7 . 1 4 - 7 . 1 5 (2 H , m) , 7 . 3 9 (1 H , d d , J = 8 H z , 5 H z) , 7 . 8 9 (1 H , d d , J = 8 H z , 2 H z) , 8 . 4 7 (1 H , d d , J = 5 H z , 2 H z) , 9 . 5 7 (1 H , d , J = 1 H z)

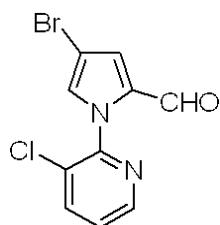
【 0 8 4 4 】

参考製造例 7 1 - (3)

3 - クロロ - 2 - (2 - ホルミル - 1 H - ピロール - 1 - イル) ピリジン 1 . 5 g を N , N - ジメチルホルムアミド 2 0 m l に溶解し、N - ブロモコハク酸イミド 1 . 3 g を加えた。該混合物を室温で 3 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、析出した沈殿を濾取することにより、4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボアルデヒド 1 . 9 g を得た。

10

4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボアルデヒド



^1H - NMR (CDCl_3 , TMS) (ppm) : 7 . 1 1 (1 H , d , J = 2 H z) , 7 . 1 4 (1 H , d d , J = 2 H z , 1 H z) , 7 . 4 1 (1 H , d d , J = 8 H z , 5 H z) , 7 . 8 9 (1 H , d d , J = 8 H z , 2 H z) , 8 . 4 6 (1 H , d d , J = 5 H z , 2 H z) , 9 . 5 1 (1 H , d , J = 1 H z)

20

【 0 8 4 5 】

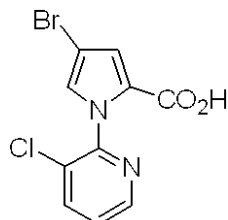
参考製造例 7 1 - (4)

4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボアルデヒド 0 . 7 2 g とアセトン 1 5 m l との混合物を 4 0 ℃ に保ちながら、ここに過マンガン酸カリウム 1 . 2 g を 1 0 m l の水に溶解した水溶液を滴下した後、この混合物を 6 0 ℃ で 8 時間攪拌した。析出物を濾去して得られた濾液に 2 N 水酸化ナトリウム水溶液を加えて、pH を 1 0 - 1 2 となるように調整してから、クロロホルムで 2 回洗浄した。水層

30

の pH が 3 付近になるまで 2 N 塩酸を注加した。析出した沈殿を濾取することにより、4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸 0 . 5 6 g を得た。

4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸



^1H - NMR ($\text{DMSO}-d_6$, TMS) (ppm) : 6 . 9 9 (1 H , d , J = 2 H z) , 7 . 3 8 (1 H , d , J = 2 H z) , 7 . 5 6 (1 H , d d , J = 8 H z , 5 H z) , 8 . 1 0 (1 H , d d , J = 8 H z , 2 H z) , 8 . 4 8 (1 H , d d , J = 5 H z , 2 H z)

40

【 0 8 4 6 】

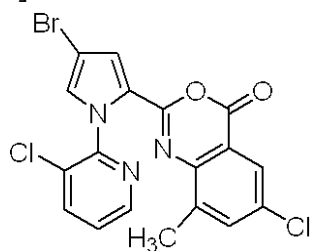
参考製造例 7 1 - (5)

4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸 0 . 5 6 g と塩化チオニル 0 . 4 0 m l との混合物をアセトニトリル中で 2 時間加熱還流した。室温まで放冷した反応混合物を減圧下濃縮し、得られた残渣をアセトニトリル 1 0 m l に溶解した。ここに 2 - アミノ - 5 - クロロ - 3 - メチル安息香酸 0 . 3 5 g を加え

50

、得られた混合物を室温で10分間攪拌した。該混合物にピリジン0.53mlを加え、室温で6時間攪拌してから、メタンスルホニルクロライド0.19mlを加えて室温で1時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、析出した沈殿を濾取することにより、2-[4-ブromo-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-イル]-6-クロロ-8-メチル-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オン0.29gを得た。

2-[4-ブromo-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-イル]-6-クロロ-8-メチル-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オン



10

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) (ppm): 1.73 (3H, s), 7.07 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.32 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.42 - 7.44 (2H, m), 7.91 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}, 2\text{ Hz}$), 7.93 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 8.51 (1H, dd, $J = 5\text{ Hz}, 2\text{ Hz}$)

【0847】

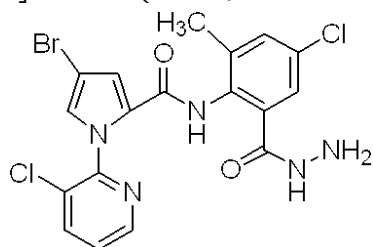
参考製造例71-(6)

20

2-[4-ブromo-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-イル]-6-クロロ-8-メチル-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オン0.29g、ヒドラジン1水和物0.10gおよびテトラヒドロフラン10mlを混合し、該混合物を室温で2時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで3回抽出した。有機層を合わせて飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮することにより、4-ブromo-N-[4-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-カルボキサミド0.30gを得た。

4-ブromo-N-[4-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-カルボキサミド

30



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) (ppm): 2.20 (3H, s), 4.04 (2H, brs), 7.02 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.04 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.21 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.28 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.31 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}, 5\text{ Hz}$), 7.34 (1H, brs), 7.80 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}, 2\text{ Hz}$), 8.41 (1H, dd, $J = 5\text{ Hz}, 2\text{ Hz}$), 9.27 (1H, brs)

40

【0848】

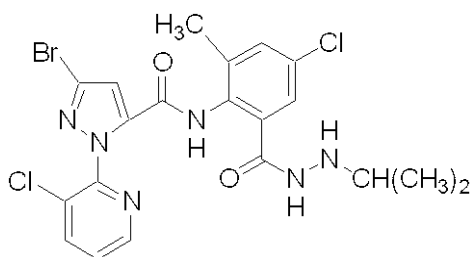
参考製造例72

2-[3-ブromo-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-イル]-6-クロロ-8-メチル-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オン0.60g、イソプロピルヒドラジン塩酸塩0.29g、トリエチルアミン0.27gおよびテトラヒドロフラン6mlを混合し、該混合物を室温で3時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで2回抽出した。合せた有機層を飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグ

50

ネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、3 - ブロモ - N - [4 - クロロ - 2 - (N ' - イソプロピルヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド 0.35 g を得た。

3 - ブロモ - N - [4 - クロロ - 2 - (N ' - イソプロピルヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド



10

^1H - NMR (CDCl_3 , TMS) (ppm) : 1.08 (6 H , d , $J = 6\text{ Hz}$) , 2.11 (3 H , s) , 3.12 (1 H , hept. , $J = 6\text{ Hz}$) , 4.60 (1 H , brs) , 7.11 (1 H , s) , 7.14 (1 H , d , $J = 2\text{ Hz}$) , 7.20 (1 H , d , $J = 2\text{ Hz}$) , 7.37 (1 H , dd , $J_1 = 8\text{ Hz}$, $J_2 = 4\text{ Hz}$) , 7.79 (1 H , brs) , 7.84 (1 H , dd , $J_1 = 8\text{ Hz}$, $J_2 = 1\text{ Hz}$) , 8.44 (1 H , dd , $J = 4\text{ Hz}$, 1 Hz) , 9.93 (1 H , brs)

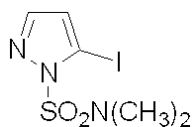
20

【 0849 】

参考製造例 73 - (1)

1, 2 - ジブロモ - 1, 1, 2, 2 - テトラクロロエタンの代わりに、N - ヨードスクシンイミドを用い、参考製造例 20 と同様の方法で、N, N - ジメチル - 5 - ヨード - 1 H - ピラゾール - 1 - スルホンアミドを得た。

N, N - ジメチル - 5 - ヨード - 1 H - ピラゾール - 1 - スルホンアミド



30

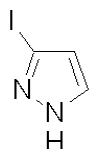
^1H - NMR (CDCl_3 , TMS) (ppm) : 3.07 (6 H , s) , 6.60 (1 H , d , $J = 1\text{ Hz}$) , 7.62 (1 H , d , $J = 1\text{ Hz}$)

【 0850 】

参考製造例 73 - (2)

5 - ブロモ - N, N - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 1 - スルホンアミドの代わりに、N, N - ジメチル - 5 - ヨード - 1 H - ピラゾール - 1 - スルホンアミドを用い、参考製造例 21 と同様の方法で、3 - ヨード - 1 H - ピラゾールを得た。

3 - ヨード - 1 H - ピラゾール



40

^1H - NMR (CDCl_3 , TMS) (ppm) : 6.74 (1 H , d , $J = 3\text{ Hz}$) , 8.10 (1 H , d , $J = 3\text{ Hz}$) .

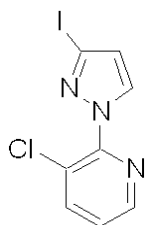
【 0851 】

参考製造例 73 - (3)

3 - ブロモ - 1 H - ピラゾールの代わりに、3 - ヨード - 1 H - ピラゾールを用い、参考製造例 22 と同様の方法で、3 - クロロ - 2 - (3 - ヨード - 1 H - ピラゾール - 1 - イル) ピリジンを得た。

3 - クロロ - 2 - (3 - ヨード - 1 H - ピラゾール - 1 - イル) ピリジン

50



^1H -NMR (CDCl₃, TMS) (ppm): 6.65 (1H, d, J = 2 Hz), 7.31 (1H, dd, J = 8 Hz, 4 Hz), 7.91 (1H, dd, J = 8 Hz, 1 Hz), 7.95 (1H, d, J = 2 Hz), 8.46 (1H, dd, J = 4 Hz, 1 Hz)

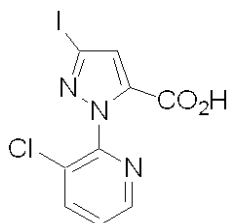
10

【0852】

参考製造例 73 - (4)

2 - (3 - ブロモ - 1H - ピラゾール - 1 - イル) - 3 - クロロピリジンの代わりに、3 - クロロ - 2 - (3 - ヨード - 1H - ピラゾール - 1 - イル)ピリジンをを用い、参考製造例 23 と同様の方法で、1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - ヨード - 1H - ピラゾール - 5 - カルボン酸を得た。

1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - ヨード - 1H - ピラゾール - 5 - カルボン酸



20

^1H -NMR (CDCl₃, TMS) (ppm): 7.20 (1H, s), 7.44 (1H, dd, J = 8 Hz, 4 Hz), 7.91 (1H, dd, J = 8 Hz, 1 Hz), 8.50 (1H, dd, J = 4 Hz, 1 Hz)

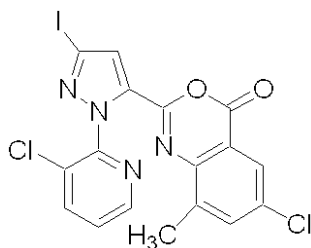
【0853】

参考製造例 73 - (5)

1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピラゾール - 5 - カルボン酸の代わりに、1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - ヨード - 1H - ピラゾール - 5 - カルボン酸を用い、参考製造例 13 と同様の方法で、6 - クロロ - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - ヨード - 1H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを得た。

30

6 - クロロ - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - ヨード - 1H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン



40

^1H -NMR (CDCl₃, TMS) (ppm): 1.82 (3H, s), 7.39 (1H, s), 7.47 7.50 (2H, m), 7.95 7.98 (2H, m), 8.56 (1H, dd, J = 4 Hz, 1 Hz)

【0854】

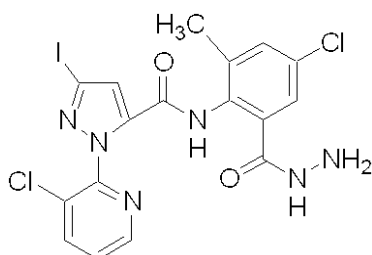
参考製造例 73 - (6)

6 - クロロ - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンの代わりに、6 - クロロ

50

- 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - ヨード - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを用い、参考製造例 7 と同様の方法で、N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - ヨード - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミドを得た。

N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - ヨード - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド



10

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) (ppm): 2.13 (3H, s), 4.36 (2H, brs), 7.31 (1H, brs), 7.42 (1H, brs), 7.46 (1H, brs), 7.59 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}, 4\text{ Hz}$), 8.15 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.49 (1H, dd, $J = 4\text{ Hz}, 1\text{ Hz}$), 9.54 (1H, brs), 10.20 (1H, brs)

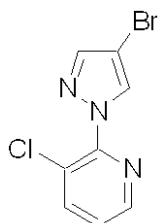
【0855】

20

参考製造例 74 - (1)

3 - ブロモ - 1 H - ピラゾールの代わりに、4 - ブロモ - 1 H - ピラゾールを用い、参考製造例 22 と同様の方法で、2 - (4 - ブロモ - 1 H - ピラゾール - 1 - イル) - 3 - クロロピリジンを得た。

2 - (4 - ブロモ - 1 H - ピラゾール - 1 - イル) - 3 - クロロピリジン



30

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl $_3$, TMS) (ppm): 7.31 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}, 4\text{ Hz}$), 7.77 (1H, s), 7.92 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}, 1\text{ Hz}$), 8.19 (1H, s), 8.45 (1H, dd, $J = 4\text{ Hz}, 1\text{ Hz}$)

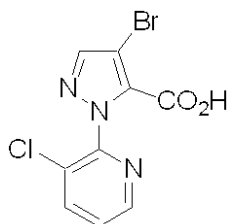
【0856】

参考製造例 74 - (2)

2 - (3 - ブロモ - 1 H - ピラゾール - 1 - イル) - 3 - クロロピリジンの代わりに、2 - (4 - ブロモ - 1 H - ピラゾール - 1 - イル) - 3 - クロロピリジンを用い、参考製造例 23 と同様の方法で、4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボン酸を得た。

40

4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボン酸



$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) (ppm): 7.66 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}, 4\text{ Hz}$), 8.06 (1H, s), 8.23 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}, 1\text{ Hz}$), 8.5

50

4 (1 H , d d , J = 4 H z , 1 H z)

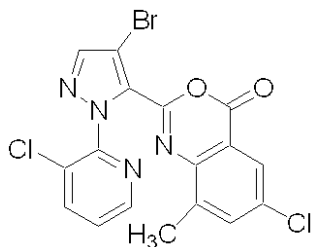
【 0 8 5 7 】

参考製造例 7 4 - (3)

1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボン酸の代わりに、4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボン酸を用い、参考製造例 1 3 と同様の方法で、2 - [4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 6 - クロロ - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを得た。

2 - [4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 6 - クロロ - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン

10



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) (ppm) : 2 . 0 0 (3 H , s) , 7 . 4 6 (1 H , d d , J = 8 H z , 4 H z) , 7 . 5 3 (1 H , d , J = 2 H z) , 7 . 8 7 (1 H , s) , 7 . 9 5 (1 H , d d , J = 8 H z , 1 H z) , 7 . 9 8 (1 H , d , J = 2 H z) , 8 . 5 1 (1 H , d d , J = 4 H z , 1 H z)

20

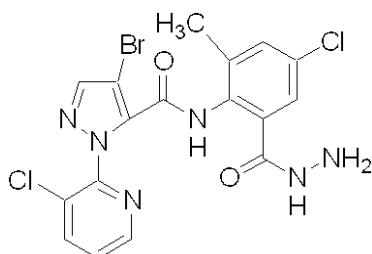
【 0 8 5 8 】

参考製造例 7 4 - (4)

6 - クロロ - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンの代わりに、2 - [4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 6 - クロロ - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを用い、参考製造例 7 と同様の方法で、4 - ブロモ - N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミドを得た。

30

4 - ブロモ - N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド



$^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$) (ppm) : 2 . 1 3 (3 H , s) , 4 . 4 7 (2 H , b r s) , 7 . 3 7 (1 H , s) , 7 . 4 8 (1 H , s) , 7 . 6 2 (1 H , d d , J = 8 H z , 4 H z) , 8 . 1 2 (1 H , s) , 8 . 1 9 (1 H , d , J = 8 H z) , 8 . 5 0 (1 H , d , J = 4 H z) , 9 . 6 9 (1 H , b r s) , 1 0 . 2 4 (1 H , b r s)

40

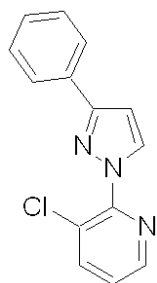
【 0 8 5 9 】

参考製造例 7 5 - (1)

3 - ブロモ - 1 H - ピラゾールの代わりに、3 - フェニル - 1 H - ピラゾールを用い、参考製造例 2 2 と同様の方法で、3 - クロロ - 2 - (3 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 1 - イル) ピリジンを得た。

3 - クロロ - 2 - (3 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 1 - イル) ピリジン

50



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) (ppm): 6.82 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.27 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 4 Hz), 7.35 (1H, m), 7.43 (2H, m), 7.93 (3H, m), 8.20 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 8.48 (1H, dd, $J = 4\text{ Hz}$, 1 Hz)

10

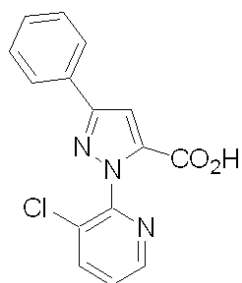
【0860】

参考製造例 75 - (2)

2 - (3 - ブロモ - 1H - ピラゾール - 1 - イル) - 3 - クロロピリジンの代わりに、3 - クロロ - 2 - (3 - フェニル - 1H - ピラゾール - 1 - イル)ピリジンを用い、参考製造例 23 と同様の方法で、1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - フェニル - 1H - ピラゾール - 5 - カルボン酸を得た。

1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - フェニル - 1H - ピラゾール - 5 - カルボン酸

20



$^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$) (ppm): 7.36 - 7.45 (3H, m), 7.57 (1H, s), 7.67 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 4 Hz), 7.90 - 7.92 (2H, m), 8.24 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 1 Hz), 8.57 (1H, dd, $J = 4\text{ Hz}$, 1 Hz)

30

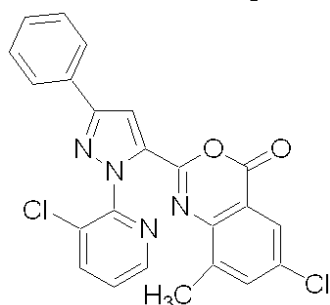
【0861】

参考製造例 75 - (3)

1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピラゾール - 5 - カルボン酸の代わりに、1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - フェニル - 1H - ピラゾール - 5 - カルボン酸を用い、参考製造例 13 と同様の方法で、6 - クロロ - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - フェニル - 1H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを得た。

6 - クロロ - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - フェニル - 1H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン

40



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) (ppm): 1.83 (3H, s), 7.39 -

50

7.52 (5H, m), 7.59 (1H, s), 7.92 - 8.00 (4H, m), 8.59 (1H, dd, J = 4 Hz, 1 Hz)

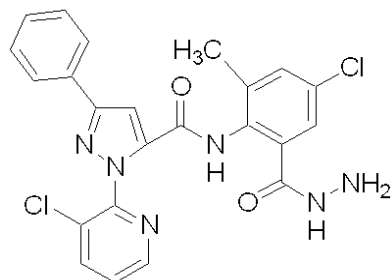
【0862】

参考製造例 75 - (4)

6 - クロロ - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンの代わりに、6 - クロロ - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - フェニル - 1H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを用い、参考製造例 7 と同様の方法で、N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - フェニル - 1H - ピラゾール - 5 - カ

10

ルボキサミドを得た。



20

¹H - NMR (DMSO - d₆) (ppm): 2.19 (3H, s), 4.40 (2H, brs), 7.33 (1H, d, J = 2 Hz), 7.42 - 7.92 (4H, m), 7.60 (1H, dd, J = 8 Hz, 4 Hz), 7.70 (1H, s), 7.88 (2H, d, J = 7 Hz), 8.17 (1H, d, J = 8 Hz), 8.53 (1H, d, J = 4 Hz), 9.58 (1H, brs), 10.27 (1H, brs)

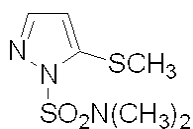
【0863】

参考製造例 76 - (1)

N, N - ジメチル - 1H - ピラゾール - 1 - スルホンアミド 4.0 g とテトラヒドロフラン 45 ml との混合物に、- 78 で 1.6 M の n - ブチルリチウムのヘキサン溶液 15.7 ml を滴下し、- 78 で 10 分間攪拌した。該混合物に、ジメチルジスルフィド 2.3 ml を加えた後、徐々に反応温度を室温に戻しながら、4 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、メチル t - ブチルエーテルで 3 回抽出した。合せた有機層を 1 N 水酸化ナトリウム水溶液および飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、N, N - ジメチル - 5 - メチルチオ - 1H - ピラゾール - 1 - スルホンアミド 4.87 g を得た。

30

N, N - ジメチル - 5 - メチルチオ - 1H - ピラゾール - 1 - スルホンアミド



40

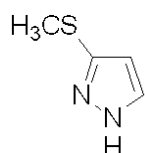
¹H - NMR (CDCl₃, TMS) (ppm): 2.49 (3H, s), 3.01 (6H, s), 6.10 (1H, d, J = 2 Hz), 7.63 (1H, d, J = 2 Hz)

【0864】

参考製造例 76 - (2)

5 - ブロモ - N, N - ジメチル - 1H - ピラゾール - 1 - スルホンアミドの代わりに、N, N - ジメチル - 5 - メチルチオ - 1H - ピラゾール - 1 - スルホンアミドを用い、参考製造例 21 と同様の方法で、3 - メチルチオ - 1H - ピラゾールを得た。

3 - メチルチオ - 1H - ピラゾール



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) (ppm): 2.61 (3H, s), 6.45 (1H, d, $J = 3\text{ Hz}$), 8.19 (1H, d, $J = 3\text{ Hz}$)

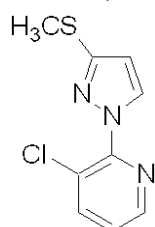
【0865】

参考製造例 76 - (3)

3 - ブロモ - 1H - ピラゾールの代わりに、3 - メチルチオ - 1H - ピラゾールを用い、参考製造例 22 と同様の方法で、3 - クロロ - 2 - (3 - メチルチオ - 1H - ピラゾール - 1 - イル) ピリジンを得た。

10

3 - クロロ - 2 - (3 - メチルチオ - 1H - ピラゾール - 1 - イル) ピリジン



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) (ppm): 2.61 (3H, s), 6.40 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.25 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 4 Hz), 7.89 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 1 Hz), 8.12 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 8.43 (1H, dd, $J = 4\text{ Hz}$, 1 Hz)

20

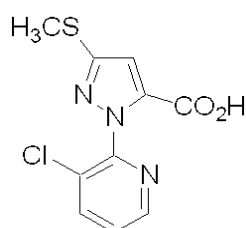
【0866】

参考製造例 76 - (4)

2 - (3 - ブロモ - 1H - ピラゾール - 1 - イル) - 3 - クロロピリジンの代わりに、3 - クロロ - 2 - (3 - メチルチオ - 1H - ピラゾール - 1 - イル) ピリジンを用い、参考製造例 23 と同様の方法で、1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - メチルチオ - 1H - ピラゾール - 5 - カルボン酸を得た。

1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - メチルチオ - 1H - ピラゾール - 5 - カルボン酸

30



$^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$) (ppm): 2.49 (3H, s), 7.02 (1H, s), 7.62 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 4 Hz), 8.19 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 1 Hz), 8.51 (1H, dd, $J = 4\text{ Hz}$, 1 Hz)

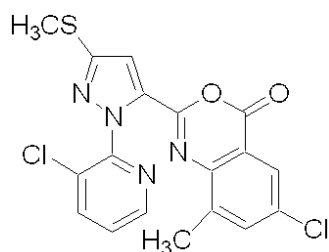
【0867】

40

参考製造例 76 - (5)

1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピラゾール - 5 - カルボン酸の代わりに、1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - メチルチオ - 1H - ピラゾール - 5 - カルボン酸を用い、参考製造例 13 と同様の方法で、6 - クロロ - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - メチルチオ - 1H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを得た。

6 - クロロ - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - メチルチオ - 1H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) (ppm): 1.81 (3H, s), 2.61 (3H, s), 7.15 (1H, s), 7.45 - 7.48 (2H, m), 7.94 - 7.98 (2H, m), 8.56 (1H, d, $J = 4\text{ Hz}$)

10

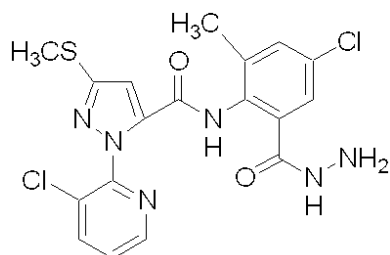
【0868】

参考製造例 76 - (6)

6 - クロロ - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンの代わりに、6 - クロロ - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - メチルチオ - 1H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを用い、参考製造例 7 と同様の方法で、N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - メチルチオ - 1H - ピラゾール - 5 - カルボキサミドを得た。

N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - メチルチオ - 1H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド

20



$^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$) (ppm): 2.14 (3H, s), 2.53 (3H, s), 4.37 (2H, brs), 7.20 (1H, s), 7.30 (1H, s), 7.46 (1H, s), 7.56 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 4 Hz), 8.12 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.47 (1H, d, $J = 4\text{ Hz}$), 9.54 (1H, brs), 10.16 (1H, brs)

30

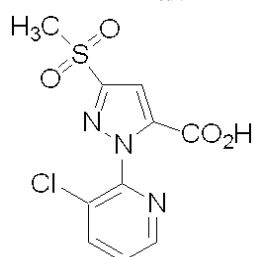
【0869】

参考製造例 77 - (1)

1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - メチルチオ - 1H - ピラゾール - 5 - カルボン酸 0.50 g およびトリフルオロ酢酸 5 ml の混合物に、30%過酸化水素水 0.4 ml を加え、得られた混合物を室温で 4 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、メチルト - ブチルエーテルで 3 回抽出した。合せた有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸ナトリウムで乾燥、減圧下濃縮し、1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - メチルスルホニル - 1H - ピラゾール - 5 - カルボン酸 0.44 g を得た。

40

1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - メチルスルホニル - 1H - ピラゾール - 5 - カルボン酸



50

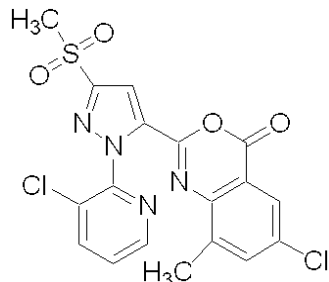
^1H -NMR (DMSO- d_6) (ppm): 3.39 (3H, s), 7.57 (1H, s), 7.75 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 4 Hz), 8.31 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 1 Hz), 8.61 (1H, dd, $J = 4\text{ Hz}$, 1 Hz).

【0870】

参考製造例 77 - (2)

1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピラゾール - 5 - カルボン酸の代わりに、1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - メチルスルホニル - 1H - ピラゾール - 5 - カルボン酸を用い、参考製造例 13 と同様の方法で、6 - クロロ - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - メチルスルホニル - 1H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを得た。

6 - クロロ - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - メチルスルホニル - 1H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン



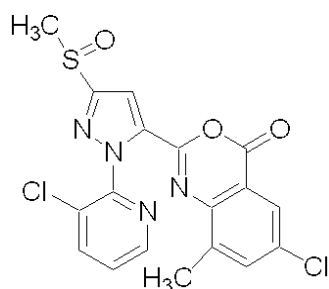
^1H -NMR (CDCl₃, TMS) (ppm): 1.85 (3H, s), 3.30 (3H, s), 7.52 - 7.57 (2H, m), 7.72 (1H, s), 7.99 - 8.03 (2H, m), 8.58 (1H, dd, $J = 4\text{ Hz}$, 1 Hz)

【0871】

参考製造例 78

6 - クロロ - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - メチルチオ - 1H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン 0.20 g、ジクロロメタン 5 ml および水 0.5 ml の混合物に、マグネシウムビス(モノペロキソフタレート) 6水和物 (MMP) 0.18 g を加え、得られた混合物を室温で 22 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、メチル t - ブチルエーテルで抽出した。有機層を水および飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下濃縮し、6 - クロロ - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - メチルスルフィニル - 1H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン 0.20 g を得た。

6 - クロロ - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - メチルスルフィニル - 1H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン



^1H -NMR (CDCl₃, TMS) (ppm): 1.85 (3H, s), 3.04 (3H, s), 7.52 - 7.55 (2H, m), 7.74 (1H, s), 7.99 - 8.01 (2H, m), 8.58 (1H, dd, $J = 4\text{ Hz}$, 1 Hz)

【0872】

参考製造例 79 - (1)

10

20

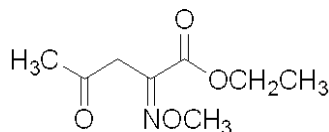
30

40

50

2, 4 - ジオキソ吉草酸エチル 2.5 g、O - メチルヒドロキシルアミン塩酸塩 1.45 g およびエタノール 10 ml の混合物を、2 時間加熱還流した。反応混合物を室温まで放冷した後、水と酢酸エチルとで分液した。有機層を水および飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、2 - メトキシイミノ - 4 - オキソペンタン酸エチル 1.34 g を得た。

2 - メトキシイミノ - 4 - オキソペンタン酸エチル



10

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) (ppm): 1.35 (3H, t, $J = 7\text{ Hz}$), 2.21 (3H, s), 3.71 (2H, s), 4.07 (3H, s), 4.34 (2H, q, $J = 7\text{ Hz}$)

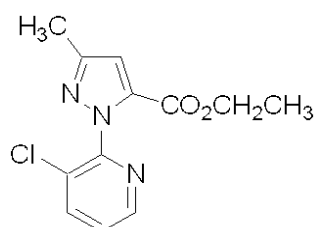
【0873】

参考製造例 79 - (2)

2 - メトキシイミノ - 4 - オキソペンタン酸エチル 1.34 g、3 - クロロ - 2 - ヒドラジノピリジン 1.23 g、テトラヒドロフラン 25 ml および酢酸 50 ml の混合物を、8 時間加熱還流した。反応混合物を減圧下濃縮した。残渣に水を注加し、メチル t - ブチルエーテルで 2 回抽出した。合せた有機層を 1 N 水酸化ナトリウム水溶液、水および飽和食塩水で順次洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - メチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボン酸エチル 0.30 g を得た。

20

1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - メチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボン酸エチル



30

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) (ppm): 1.20 (3H, t, $J = 7\text{ Hz}$), 2.40 (3H, s), 4.20 (2H, q, $J = 7\text{ Hz}$), 6.84 (1H, s), 7.40 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 4 Hz), 7.88 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.51 (1H, d, $J = 4\text{ Hz}$)

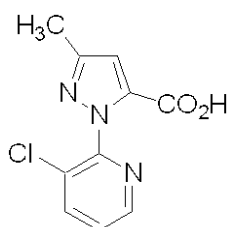
【0874】

参考製造例 79 - (3)

1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - メチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボン酸エチル 0.30 g、メタノール 5 ml および 2 N 水酸化ナトリウム水溶液 5 ml の混合物を、3 時間加熱還流した。放冷した反応混合物に水を注加し、該水層をメチル t - ブチルエーテルで 2 回洗浄した。水層に pH が 3 付近になるまで 2 N 塩酸を注加し、メチル t - ブチルエーテルで 3 回抽出した。合せた有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下濃縮し、1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - メチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボン酸 0.24 g を得た。

40

1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - メチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボン酸



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) (ppm): 2.40 (3H, s), 6.89 (1H, s), 7.40 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 4 Hz), 7.89 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 1 Hz), 8.49 (1H, dd, $J = 4\text{ Hz}$, 1 Hz)

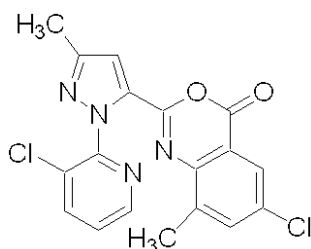
【0875】

10

参考製造例 79 - (4)

1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピラゾール - 5 - カルボン酸の代わりに、1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - メチル - 1H - ピラゾール - 5 - カルボン酸を用い、参考製造例 13 と同様の方法で、6 - クロロ - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - メチル - 1H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを得た。

6 - クロロ - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - メチル - 1H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン



20

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) (ppm): 1.81 (3H, s), 2.45 (3H, s), 7.07 (1H, s), 7.437.47 (2H, m), 7.92 - 7.98 (2H, m), 8.56 (1H, dd, $J = 4\text{ Hz}$, 1 Hz)

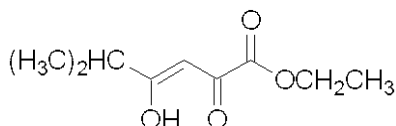
【0876】

参考製造例 80 - (1)

30

3 - メチル - 2 - ブタノン 17.2 g、シュウ酸ジエチル 27.1 g およびエタノール 130 ml の混合物に、ナトリウムエトキシド (20% エタノール溶液) 95 ml を加え、得られた混合物を 60 で 5 時間攪拌した。室温まで放冷後、析出した沈殿を濾取し、エタノールで洗浄した。濾物を 2N 塩酸およびメチル t - ブチルエーテルで分液した。有機層を飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮することにより、4 - ヒドロキシ - 5 - メチル - 2 - オキソ - 3 - ヘキセン酸エチル 28.8 g を得た。

4 - ヒドロキシ - 5 - メチル - 2 - オキソ - 3 - ヘキセン酸エチル



40

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) (ppm): 1.19 (6H, d, $J = 7\text{ Hz}$), 1.38 (3H, t, $J = 7\text{ Hz}$), 2.66 (1H, hept., $J = 7\text{ Hz}$), 4.36 (2H, q, $J = 7\text{ Hz}$), 6.41 (1H, s)

【0877】

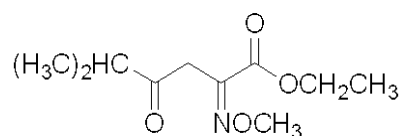
参考製造例 80 - (2)

4 - ヒドロキシ - 5 - メチル - 2 - オキソ - 3 - ヘキセン酸エチル 5.0 g、O - メチルヒドロキシルアミン塩酸塩 2.46 g およびエタノール 10 ml の混合物を、室温で 6 時間攪拌した。反応混合物に酢酸エチルを注加した後、有機層を水および飽和食塩水で洗

50

浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下濃縮し、2 - メトキシイミノ - 5 - メチル - 4 - オキソヘキサン酸エチル 5.32 g を得た。

2 - メトキシイミノ - 5 - メチル - 4 - オキソヘキサン酸エチル



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) (ppm): 1.15 (6H, d, $J = 7\text{ Hz}$), 1.34 (3H, t, $J = 7\text{ Hz}$), 2.68 (1H, hept., $J = 7\text{ Hz}$), 3.76 (2H, s), 4.05 (3H, s), 4.33 (2H, q, $J = 7\text{ Hz}$)

10

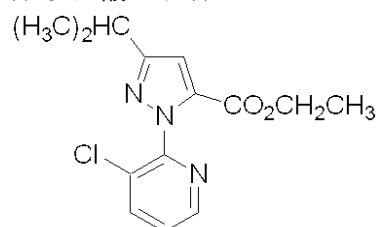
【0878】

参考製造例 80 - (3)

2 - メトキシイミノ - 5 - メチル - 4 - オキソヘキサン酸エチル 3.0 g、3 - クロロ - 2 - ヒドラジノピリジン 2.4 g、テトラヒドロフラン 50 ml および酢酸 100 ml の混合物を、室温で 20 時間攪拌した後、4 時間加熱還流した。反応混合物を減圧下濃縮した。残渣に水を注加し、メチル *t* - ブチルエーテルで 2 回抽出した合せた有機層を 1 N 水酸化ナトリウム水溶液、水および飽和食塩水で順次洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - イソプロピル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボン酸エチル 1.07 g を得た。

20

1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - イソプロピル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボン酸エチル



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) (ppm): 1.20 (3H, t, $J = 7\text{ Hz}$), 1.34 (6H, d, $J = 7\text{ Hz}$), 3.11 (1H, hept., $J = 7\text{ Hz}$), 4.20 (2H, q, $J = 7\text{ Hz}$), 6.88 (1H, s), 7.40 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 4 Hz), 7.88 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.52 (1H, d, $J = 4\text{ Hz}$)

30

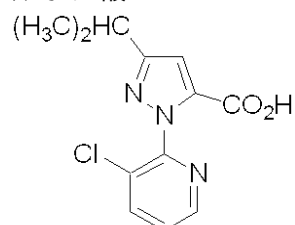
【0879】

参考製造例 80 - (4)

1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - イソプロピル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボン酸エチル 1.07 g、メタノール 15 ml および 2 N 水酸化ナトリウム水溶液 15 ml の混合物を、1.5 時間加熱還流した。放冷した反応混合物に水を注加し、メチル *t* - ブチルエーテルで 2 回洗浄した。水層の pH に 3 付近になるまで 2 N 塩酸を注加し、該水層メチル *t* - ブチルエーテルで 3 回抽出した。合せた有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下濃縮し、1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - イソプロピル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボン酸 0.97 g を得た。

40

1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - イソプロピル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボン酸



50

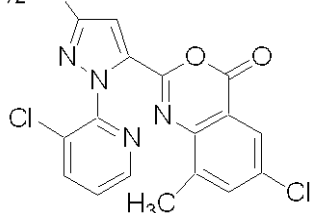
^1H -NMR (CDCl_3 , TMS) (ppm): 1.33 (6H, d, $J = 7\text{ Hz}$), 3.10 (1H, hept., $J = 7\text{ Hz}$), 6.93 (1H, s), 7.39 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 4 Hz), 7.88 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.49 (1H, d, $J = 4\text{ Hz}$)

【0880】

参考製造例 80 - (5)

1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピラゾール - 5 - カルボン酸の代わりに、1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - イソプロピル - 1H - ピラゾール - 5 - カルボン酸を用い、参考製造例 13 と同様の方法で、6 - クロロ - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - イソプロピル - 1H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを得た。

6 - クロロ - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - イソプロピル - 1H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン
(H_3C)₂HC



^1H -NMR (CDCl_3 , TMS) (ppm): 1.37 (6H, d, $J = 7\text{ Hz}$), 1.81 (3H, s), 3.15 (1H, hept., $J = 7\text{ Hz}$), 7.12 (1H, s), 7.45 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 4 Hz), 7.47 (1H, d, $J = 1\text{ Hz}$), 7.93 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 1 Hz), 7.98 (1H, d, $J = 1\text{ Hz}$), 8.56 (1H, dd, $J = 4\text{ Hz}$, 1 Hz)

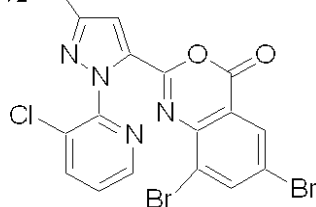
【0881】

参考製造例 81

3 - プロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピラゾール - 5 - カルボン酸の代わりに、1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - イソプロピル - 1H - ピラゾール - 5 - カルボン酸を用い、参考製造例 46 と同様の方法で、2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - イソプロピル - 1H - ピラゾール - 5 - イル] - 6, 8 - ジプロモ - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを得た。

2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - イソプロピル - 1H - ピラゾール - 5 - イル] - 6, 8 - ジプロモ - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン

(H_3C)₂HC



^1H -NMR (CDCl_3 , TMS) (ppm): 1.35 (6H, d, $J = 7\text{ Hz}$), 3.16 (1H, hept., $J = 7\text{ Hz}$), 7.16 (1H, s), 7.43 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 4 Hz), 7.94 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 1 Hz), 8.03 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 8.25 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 8.56 (1H, dd, $J = 4\text{ Hz}$, 1 Hz)

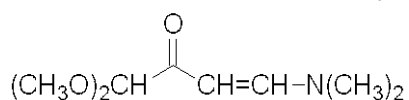
【0882】

参考製造例 82 - (1)

ピルビンアルデヒドジメチルアセタール 23.6 g と N, N - ジメチルホルムアミドジメチルアセタール 23.8 g とを混合し、該混合物を生成するメタノールを留去しながら

80 で4時間攪拌することにより、4 - ジメチルアミノ - 1 , 1 - ジメトキシ - 3 - ブテン - 2 - オン 38 . 8 g (純度約 80 %) を得た。

4 - ジメチルアミノ - 1 , 1 - ジメトキシ - 3 - ブテン - 2 - オン



^1H - NMR (CDCl_3 , TMS) (ppm) : 2 . 87 (3 H , s) , 3 . 11 (3 H , s) , 3 . 41 (6 H , s) , 4 . 58 (1 H , s) , 5 . 35 (1 H , d , $J = 12\text{ Hz}$) , 7 . 74 (1 H , d , $J = 12\text{ Hz}$) .

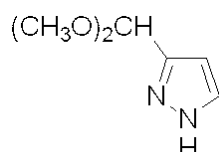
【 0883 】

10

参考製造例 82 - (2)

4 - ジメチルアミノ - 1 , 1 - ジメトキシ - 3 - ブテン - 2 - オン 5 g、ヒドラジン 1 水和物 1 . 7 mL およびメタノール 15 mL の混合物を加熱還流下 8 時間攪拌した。反応混合物を減圧下濃縮することにより、3 - (ジメトキシメチル) - 1 H - ピラゾール 4 . 07 g を得た。

3 - (ジメトキシメチル) - 1 H - ピラゾール



^1H - NMR (CDCl_3 , TMS) (ppm) : 3 . 37 (6 H , s) , 5 . 58 (1 H , s) , 6 . 35 (1 H , d , $J = 2\text{ Hz}$) , 7 . 58 (1 H , d , $J = 2\text{ Hz}$) .

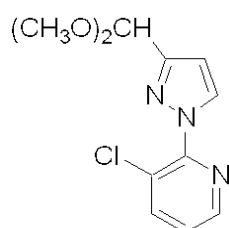
【 0884 】

20

参考製造例 82 - (3)

3 - ブロモ - 1 H - ピラゾールの代わりに、3 - (ジメトキシメチル) - 1 H - ピラゾールを用い、参考製造例 22 と同様の方法で 3 - クロロ - 2 - [3 - (ジメトキシメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] ピリジンを得た。

3 - クロロ - 2 - [3 - (ジメトキシメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] ピリジン



^1H - NMR (CDCl_3 , TMS) (ppm) : 3 . 44 (6 H , s) , 5 . 58 (1 H , s) , 6 . 57 (1 H , d , $J = 2\text{ Hz}$) , 7 . 29 (1 H , dd , $J = 8\text{ Hz}$, 5 Hz) , 7 . 90 (1 H , dd , $J = 8\text{ Hz}$, 2 Hz) , 8 . 07 (1 H , d , 2 Hz) , 8 . 47 (1 H , dd , 5 Hz , 2 Hz) .

【 0885 】

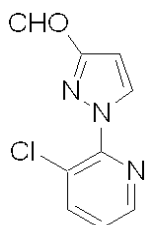
30

40

参考製造例 82 - (4)

3 - クロロ - 2 - [3 - (ジメトキシメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] ピリジン 3 . 35 g、ギ酸 24 mL および水 6 mL の混合物を 60 で 1 時間攪拌した。反応混合物を減圧下濃縮した。残渣に氷水を注加し、析出した固体を濾取することにより、1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボアルデヒド 2 . 38 g を得た。

1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボアルデヒド



^1H -NMR (CDCl_3 , TMS) (ppm): 7.01 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.40 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 5 Hz), 7.98 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 2 Hz), 8.18 (1H, dd, $J = 3\text{ Hz}$, 2 Hz), 8.52 (1H, dd, 5 Hz , 2 Hz), 10.14 (1H, d, 2 Hz).

10

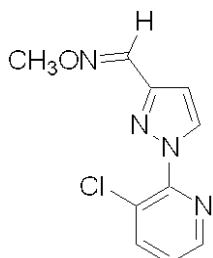
【0886】

参考製造例 82 - (5)

1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-3-カルボアルデヒド 2.00 g、O-メチルヒドロキシルアミン塩酸塩 1.21 g およびピリジン 8 mL を混合し、該混合物を 1 時間加熱還流した。反応混合物を減圧下濃縮した後、残渣に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を注加し、メチル t-ブチルエーテルで 3 回抽出した。有機層を合わせ、水、飽和食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮することにより、1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-3-カルボアルデヒド・O-メチルオキシム 2.23 g を E 体と Z 体の混合物 (E 体: Z 体 = 3:1) として得た。

20

1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-3-カルボアルデヒド・O-メチルオキシム



^1H -NMR (CDCl_3 , TMS) (ppm):

30

E 体: 3.99 (3H, s), 6.84 (1H, d, $J = 3\text{ Hz}$), 7.30 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 5 Hz), 7.92 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 2 Hz), 8.12 (1H, dd, $J = 3\text{ Hz}$, 1 Hz), 8.25 (1H, s), 8.48 (1H, dd, $J = 5\text{ Hz}$, 2 Hz).

Z 体: 4.07 (3H, s), 7.18 (1H, d, $J = 3\text{ Hz}$), 7.33 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 5 Hz), 7.67 (1H, s), 7.93 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 2 Hz), 8.14 (1H, dd, $J = 3\text{ Hz}$, 1 Hz), 8.49 (1H, dd, $J = 5\text{ Hz}$, 2 Hz).

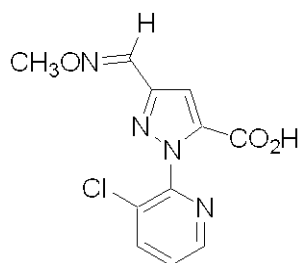
【0887】

参考製造例 82 - (6)

40

2-(3-ブromo-1H-ピラゾール-1-イル)-3-クロロピリジンの代わりに、1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-3-カルボアルデヒド・O-メチルオキシムを用い、参考製造例 23 と同様の方法で 1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-メトキシイミノメチル-1H-ピラゾール-5-カルボン酸を E 体と Z 体の混合物 (E 体: Z 体 = 3:1) として得た。

1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-メトキシイミノメチル-1H-ピラゾール-5-カルボン酸



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) (ppm):

E体: 4.00 (3H, s), 7.39 (1H, s), 7.45 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 5 Hz), 7.92 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 2 Hz), 8.15 (1H, s), 8.51 (1H, dd, $J = 5\text{ Hz}$, 2 Hz).

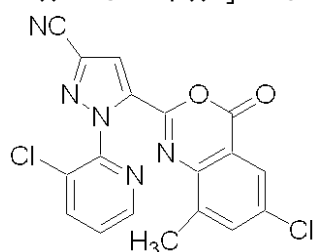
Z体: 4.08 (3H, s), 7.38 (1H, s), 7.51 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 5 Hz), 7.60 (1H, s), 7.94 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 2 Hz), 8.51 (1H, dd, $J = 5\text{ Hz}$, 2 Hz).

【0888】

参考製造例 82 - (7)

1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-メトキシイミノメチル-1H-ピラゾール-5-カルボン酸 0.70 g と塩化チオニル 0.55 mL との混合物を、1時間加熱還流した。室温まで放冷した反応混合物を減圧下濃縮し、得られた残渣をアセトニトリル 10 mL に溶解し、2-アミノ-5-クロロ-3-メチル安息香酸 0.46 g を加え、該混合物を室温で 10 分間攪拌した。該混合物にトリエチルアミン 0.35 mL を加え、室温で 20 分間攪拌した後、さらにトリエチルアミン 70 mL を加え、室温で 20 分間攪拌してからメタンスルホニルクロライド 0.21 mL を加えて室温で 17 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、クロロホルムで 3 回抽出した。有機層を合わせて飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下濃縮した。シリカゲルクロマトグラフィーに付し、6-クロロ-2-[1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-シアノ-1H-ピラゾール-5-イル]-8-メチル-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オン 0.16 g を得た。

6-クロロ-2-[1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-シアノ-1H-ピラゾール-5-イル]-8-メチル-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オン



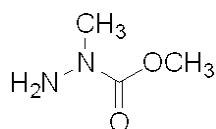
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) (ppm): 1.83 (3H, s), 7.52 (1H, dd, $J = 2\text{ Hz}$, 1 Hz), 7.56 (1H, dd, 8 Hz, 5 Hz), 7.58 (1H, s), 7.99 - 8.03 (2H, m), 8.58 (1H, dd, $J = 5\text{ Hz}$, 2 Hz).

【0889】

参考製造例 83

メチルヒドラジン 10.6 mL、メタノール 50 mL および水酸化ナトリウム 8.0 g の混合物に、氷冷下、クロロギ酸メチル 15.4 mL を滴下した後、該混合物を室温で 1 時間攪拌した。反応混合物を濾過し、濾液を濃縮した。残渣を減圧蒸留し (50 - 80 / 15 mmHg) N-メチル-N-メトキシカルボニルヒドラジン 13.4 g を得た。

N-メチル-N-メトキシカルボニルヒドラジン



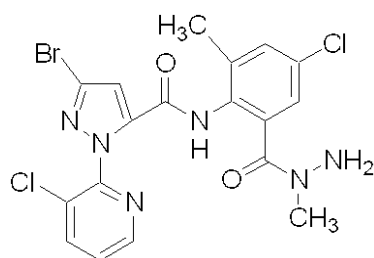
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) (ppm): 3.11 (3H, s), 3.73 (3H, s), 4.13 (2H, brs).

【0890】

参考製造例 84

2-[3-プロモ-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-イル]-6-クロロ-8-メチル-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オン 1.0g、メチルヒドラジン 0.35mL および テトラヒドロフラン 20mL の混合物を室温で 24 時間攪拌した。反応混合物に水を注加した後、酢酸エチルで 3 回抽出した。合せた有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、3-プロモ-N-[4-クロロ-2-(N-メチルヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド 0.85g を得た。

3-プロモ-N-[4-クロロ-2-(N-メチルヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド



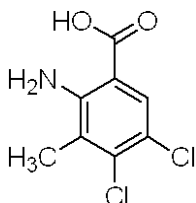
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) (ppm): 2.20 (3H, s), 3.21 (3H, s), 3.74 (3H, brs), 7.05 (1H, s), 7.26-7.38 (3H, m), 7.86 (1H, dd, $J=8\text{Hz}$, 2Hz), 8.03 (1H, s), 8.42 (1H, dd, $J=5\text{Hz}$, 2Hz), 9.47 (1H, s).

【0891】

参考製造例 85 - (1)

2-アミノ-4-クロロ-3-メチル安息香酸 0.34g および N,N-ジメチルホルムアミド 10mL の混合物に、室温で N-クロロスクシンイミド 0.26g を加え、該混合物を室温で 5 時間攪拌した。反応混合物に水 30mL を注加した後、酢酸エチルで 3 回抽出した。有機層を合わせて、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮し、2-アミノ-4,5-ジクロロ-3-メチル安息香酸 0.22g を得た。

2-アミノ-4,5-ジクロロ-3-メチル安息香酸



$^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$, TMS) : 2.25 (3H, s), 7.76 (1H, s).

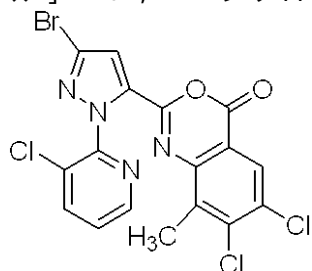
【0892】

参考製造例 85 - (2)

2-アミノ-3,5-ジプロモ安息香酸の代わりに 2-アミノ-4,5-ジクロロ-3-メチル安息香酸を用い参考製造例 46 - (1) と同様の方法で 2-[3-プロモ-1-

(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-イル]-6,7-ジクロロ-8-メチル-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オンを得た。

2-[3-ブromo-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-イル]-6,7-ジクロロ-8-メチル-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オン



10

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6 , TMS) : 1.82 (3H, s), 7.57 (1H, s), 7.77 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 5 Hz), 8.14 (1H, s), 8.36 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.64 (1H, d, $J = 5\text{ Hz}$).

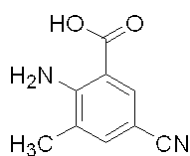
【0893】

参考製造例 86 - (1)

2-アミノ-5-ヨード-3-メチル安息香酸 1.0 g、シアン化銅 0.45 g および N,N-ジメチルホルムアミド 10 mL の混合物を、150 で 9 時間攪拌した。反応混合物を減圧下濃縮した。残渣に水 20 mL およびエチレンジアミン 2 mL を注加し、室温で 1 時間攪拌した。反応混合物を濾過した後、濾液に pH が 5 付近となるように濃塩酸を注加し、該混合物を酢酸エチルで 3 回抽出した。合せた有機層を硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮することによって、2-アミノ-5-シアノ-3-メチル安息香酸 0.40 g を得た。

20

2-アミノ-5-シアノ-3-メチル安息香酸



$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6 , TMS) : 2.13 (3H, s), 7.34 (2H, brs), 7.51 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.97 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$).

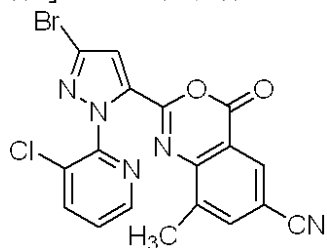
30

【0894】

参考製造例 86 - (2)

2-アミノ-3,5-ジブromo安息香酸の代わりに 2-アミノ-5-シアノ-3-メチル安息香酸を用い参考製造例 46 - (1) と同様の方法で 2-[3-ブromo-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-イル]-8-メチル-6-シアノ-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オンを得た。

2-[3-ブromo-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-イル]-8-メチル-6-シアノ-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オン



40

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6 , TMS) : 1.73 (3H, s), 7.60 (1H, s), 7.77 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 5 Hz), 8.10 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 8.34 - 8.39 (2H, m), 8.63 (1H, d, $J = 5\text{ Hz}$).

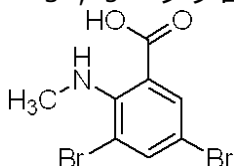
【0895】

参考製造例 87 - (1)

50

メチルアントラニル酸(N-Methyl anthranilic acid) 15.1 g および酢酸 300 mL の混合物に、臭素 3.2 g を 15 分かけて滴下した。得られた混合物を室温で 5 時間攪拌し、ここにさらに臭素 1.6 g を 15 分かけて滴下し室温で 3 時間攪拌した。反応混合物を濾過し、得られた固体を酢酸、酢酸エチルおよびアセトンで順次洗浄することにより、3, 5 - ジブロモ - 2 - メチルアミノ安息香酸 23 g を得た。

3, 5 - ジブロモ - 2 - メチルアミノ安息香酸



10

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6 , TMS) : 2.89 - 2.92 (3H, m), 7.76 - 7.79 (1H, m), 7.83 - 7.86 (1H, m).

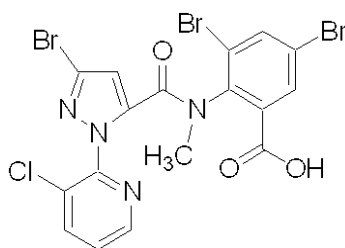
【0896】

参考製造例 87 - (2)

3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピラゾール - 5 - カルボン酸 1.0 g、塩化チオニル 2 mL および N, N - ジメチルホルムアミド 1 滴を混合し、該混合物を 80 で 1 時間攪拌した。反応混合物を減圧下濃縮し、ヘキサン 10 mL を加えさらに減圧下濃縮した。得られた残渣をアセトニトリル 20 mL および 3, 5 - ジブロモ - 2 - メチルアミノ安息香酸 0.93 g と混合し、該混合物を室温で 1 時間攪拌した後、トリエチルアミン 0.6 g を加え、さらに室温で 1 時間攪拌した。反応混合物を水 30 mL に注加し、酢酸エチルで 3 回抽出した。有機層を合わせ、水、飽和食塩水で順次洗浄後、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮した。残渣をメチル t - ブチルエーテルで洗浄し、3, 5 - ジブロモ - 2 - {N - [3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピラゾール - 5 - カルボニル] - N - メチルアミノ}安息香酸 1.3 g を得た。

20

3, 5 - ジブロモ - 2 - {N - [3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピラゾール - 5 - カルボニル] - N - メチルアミノ}安息香酸



30

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6 , TMS) : 2.98 - 3.34 (3H, m), 5.95 (1H, s), 7.62 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 5 Hz), 7.70 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.89 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 8.18 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.49 (1H, d, $J = 5\text{ Hz}$).

40

【0897】

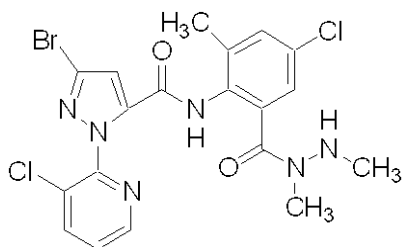
参考製造例 88

N, N' - ジメチルヒドラジン 2 塩酸塩 0.13 g、水 1 mL、炭酸カリウム 0.14 g およびテトラヒドロフラン 10 mL の混合物に、3 - ブロモ - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピラゾール - 5 - イル] - 6 - クロロ - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン 0.23 g を加え、得られた混合物を室温で 3 時間攪拌した。反応混合物を水 30 mL に注加し、酢酸エチルで 3 回抽出した。有機層を合わせ、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮した。残渣を酢酸エチルで洗浄し、3 - ブロモ - N - [4 - クロロ - 2 - (N, N' - ジメチルヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピラゾール - 5 - カルボキ

50

サミド 0.35 g を得た。

3 - プロモ - N - [4 - クロロ - 2 - (N , N' - ジメチルヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド



10

^1H - NMR (DMSO - d_6 , TMS) : 1.99 - 2.40 (6 H , m) , 2.98 - 3.09 (3 H , m) , 4.61 (0.7 H , b r s) , 5.68 (0.3 H , b r s) , 7.14 - 7.51 (3 H , m) , 7.61 (1 H , d d , $J = 8\text{ Hz}$, 5 Hz) , 8.18 (1 H , d , $J = 5\text{ Hz}$) , 8.50 (1 H , d , $J = 2\text{ Hz}$) , 10.03 (0.6 H , b r s) , 10.39 (0.4 H , b r s) .

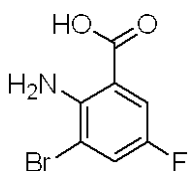
【 0898 】

参考製造例 89 - (1)

2 - アミノ - 5 - フルオロ安息香酸 0.78 g および N , N - ジメチルホルムアミド 100 ml の混合物に、室温で N - プロモスクシンイミド 1.1 g を加え、室温で 5 時間攪拌した。反応混合物に水を注加した後、析出した沈殿を濾取し、アセトンで洗浄することにより、2 - アミノ - 3 - プロモ - 5 - フルオロ安息香酸 0.43 g を得た。

20

2 - アミノ - 3 - プロモ - 5 - フルオロ安息香酸



^1H - NMR (DMSO - d_6 , TMS) : 7.55 (1 H , d d , $J = 8\text{ Hz}$, 3 Hz) , 7.71 (1 H , d d , $J = 8\text{ Hz}$, 3 Hz) .

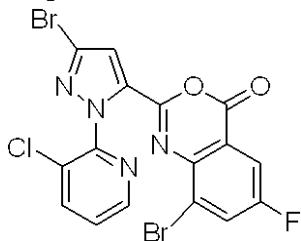
30

【 0899 】

参考製造例 89 - (2)

2 - アミノ - 3 , 5 - ジプロモ安息香酸の代わりに 2 - アミノ - 3 - プロモ - 5 - フルオロ安息香酸を用い参考製造例 46 - (1) と同様の方法で 2 - [3 - プロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - プロモ - 6 - フルオロ - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを得た。

2 - [3 - プロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - プロモ - 6 - フルオロ - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン



40

^1H - NMR (DMSO - d_6 , TMS) : 7.54 (1 H , s) , 7.72 (1 H , d d , $J = 8\text{ Hz}$, 5 Hz) , 7.92 (1 H , d d , $J = 8\text{ Hz}$, 3 Hz) , 8.15 (1 H , d d , $J = 8\text{ Hz}$, 3 Hz) , 8.32 (1 H , d d , $J = 8\text{ Hz}$, 1 Hz) , 8.59 (1 H , d d , $J = 5\text{ Hz}$, 1 Hz) .

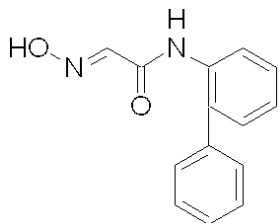
【 0900 】

50

参考製造例 90 - (1)

3 - クロロ - 2 - メチルアニリンの代わりに 2 - フェニルアニリンを用い参考製造例 63 - (1) と同様の方法で N - (ビフェニル - 2 - イル) - 2 - (ヒドロキシイミノ) アセトアミドを得た。

N - (ビフェニル - 2 - イル) - 2 - (ヒドロキシイミノ) アセトアミド



10

^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) : 7.27 - 7.48 (9H, m), 7.83 (1H, d, J = 8 Hz), 9.18 (1H, s), 12.14 (1H, s).

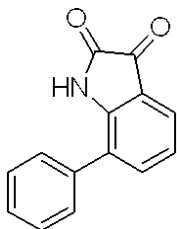
【0901】

参考製造例 90 - (2)

N - (3 - クロロ - 2 - メチルフェニル) - 2 - (ヒドロキシイミノ) アセトアミドの代わりに N - (ビフェニル - 2 - イル) - 2 - (ヒドロキシイミノ) アセトアミドを用い参考製造例 63 - (2) と同様の方法で 7 - フェニル - 1 H - インドール - 2 , 3 - ジオンを得た。

7 - フェニル - 1 H - インドール - 2 , 3 - ジオン

20



^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) : 7.18 (1H, t, J = 8 Hz), 7.40 - 7.63 (7H, m), 10.91 (1H, s).

【0902】

参考製造例 90 - (3)

6 - クロロ - 7 - メチル - 1 H - インドール - 2 , 3 - ジオンの代わりに 7 - フェニル - 1 H - インドール - 2 , 3 - ジオンを用い参考製造例 63 - (3) と同様の方法で 2 - アミノ - 3 - フェニル安息香酸を得た。

2 - アミノ - 3 - フェニル安息香酸



40

^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) : 6.65 (1H, t, J = 8 Hz), 7.17 (1H, d, J = 7 Hz), 7.35 - 7.55 (5H, m), 7.78 (1H, d, J = 8 Hz).

【0903】

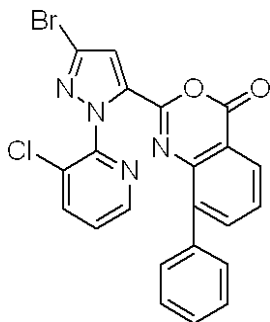
参考製造例 90 - (4)

2 - アミノ - 3 , 5 - ジブロモ安息香酸の代わりに 2 - アミノ - 3 - フェニル安息香酸を用い参考製造例 46 - (1) と同様の方法で 2 - [3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - フェニル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを得た。

2 - [3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イ

50

ル] - 8 - フェニル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン



10

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6 , TMS) : 7.05 - 7.48 (7H, m), 7.61 - 7.89 (3H, m), 8.09 - 8.28 (2H, m).

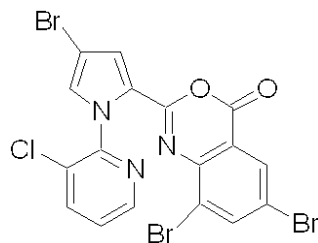
【0904】

参考製造例 9 1

2 - アミノ - 5 - クロロ - 3 - メチル安息香酸の代わりに 2 - アミノ - 3 , 5 - ジブromo安息香酸を用い参考製造例 7 1 - (5) と同様の方法で 6 , 8 - ジブromo - 2 - [4 - ブromo - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - イル] - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを得た。

6 , 8 - ジブromo - 2 - [4 - ブromo - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - イル] - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン

20



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl $_3$, TMS) (ppm) : 7.11 (1H, d, J = 2 Hz), 7.37 (1H, d, J = 2 Hz), 7.41 (1H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 7.92 (1H, dd, J = 8 Hz, 2 Hz), 7.97 (1H, d, J = 2 Hz), 8.20 (1H, d, J = 2 Hz), 8.51 (1H, dd, J = 5 Hz, 2 Hz)

30

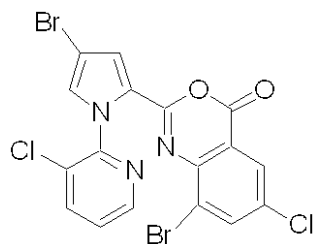
【0905】

参考製造例 9 2

2 - アミノ - 5 - クロロ - 3 - メチル安息香酸の代わりに 2 - アミノ - 3 - ブromo - 5 - クロロ安息香酸を用い参考製造例 7 1 - (5) と同様の方法で 8 - ブromo - 2 - [4 - ブromo - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - イル] - 6 - クロロ - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを得た。

8 - ブromo - 2 - [4 - ブromo - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - イル] - 6 - クロロ - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン

40



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl $_3$, TMS) (ppm) : 7.11 (1H, d, J = 2 Hz), 7.37 (1H, d, J = 2 Hz), 7.41 (1H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 7.82 (1H, d, J = 2 Hz), 7.92 (1H, dd, J = 8 Hz, 2 Hz), 8.05 (1H, d, J = 2 Hz), 8.51 (1H, dd, J = 5 Hz, 2 Hz)

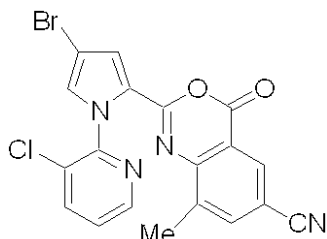
50

【0906】

参考製造例 9 3

2 - アミノ - 5 - クロロ - 3 - メチル安息香酸の代わりに 2 - アミノ - 5 - シアノ - 3 - メチル安息香酸を用い参考製造例 7 1 - (5) と同様の方法で 2 - [4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - イル] - 6 - シアノ - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを得た。

2 - [4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - イル] - 6 - シアノ - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン



10

^1H - NMR (DMSO - d_6 , TMS) (ppm) : 1 . 6 8 (3 H , s) , 7 . 3 5 (1 H , d , J = 2 H z) , 7 . 6 7 (1 H , dd , J = 8 H z , 5 H z) , 7 . 7 0 (1 H , d , J = 2 H z) , 7 . 9 7 (1 H , s) , 8 . 2 3 (1 H , dd , J = 8 H z , 2 H z) , 8 . 2 8 (1 H , s) , 8 . 5 7 (1 H , dd , J = 5 H z , 2 H z)

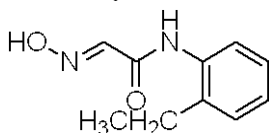
【0907】

20

参考製造例 9 4 - (1)

3 - クロロ - 2 - メチルアニリンの代わりに 2 - エチルアニリンを用い参考製造例 6 3 - (1) と同様の方法で N - (2 - エチルフェニル) - 2 - (ヒドロキシイミノ) アセトアミドを得た。

N - (2 - エチルフェニル) - 2 - (ヒドロキシイミノ) アセトアミド



^1H - NMR (DMSO - d_6 , TMS) : 1 . 1 2 (3 H , t , J = 8 H z) , 2 . 5 9 (2 H , q , J = 8 H z) , 7 . 1 5 - 7 . 2 7 (3 H , m) , 7 . 4 3 (1 H , dd , J = 6 H z , 4 H z) , 7 . 6 7 (1 H , s) , 9 . 4 9 (1 H , s) , 1 2 . 1 7 (1 H , s) .

30

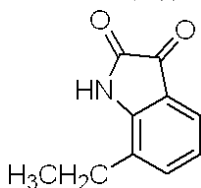
【0908】

参考製造例 9 4 - (2)

N - (3 - クロロ - 2 - メチルフェニル) - 2 - (ヒドロキシイミノ) アセトアミドの代わりに N - (2 - エチルフェニル) - 2 - (ヒドロキシイミノ) アセトアミドを用い参考製造例 6 3 - (2) と同様の方法で 7 - エチル - 1 H - インドール - 2 , 3 - ジオンの粗生成物を得た。

7 - エチル - 1 H - インドール - 2 , 3 - ジオン

40



【0909】

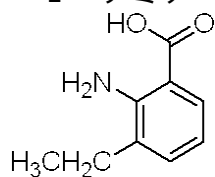
参考製造例 9 4 - (3)

7 - エチル - 1 H - インドール - 2 , 3 - ジオンの粗生成物 1 . 0 g および 2 N 水酸化ナトリウム水溶液 3 m L の混合物を、過酸化水素水 (3 0 %) 2 g に室温で滴下した後、得られた混合物を室温で 1 時間攪拌した。反応混合物に 2 N 塩酸を pH が 4 になるまで注

50

加し、析出した沈殿を濾取した。得られた濾物を酢酸エチルと飽和炭酸水素ナトリウム溶液とで分液した。水層に2 N塩酸をpHが4になるまで注加し、析出した沈殿を濾取することにより、2 - アミノ - 3 - エチル安息香酸0.42 gを得た。

2 - アミノ - 3 - エチル安息香酸



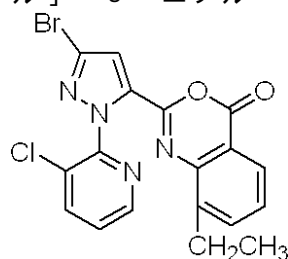
$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6 , TMS) : 1.15 (3H, t, $J = 7\text{ Hz}$), 2.44 - 2.53 (2H, m), 6.50 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 7 Hz), 7.15 (1H, d, $J = 7\text{ Hz}$), 7.62 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$). 10

【0910】

参考製造例94 - (4)

2 - アミノ - 3, 5 - ジブromo安息香酸の代わりに2 - アミノ - 3 - エチル安息香酸を用い参考製造例46 - (1)と同様の方法で2 - [3 - ブromo - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - エチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを得た。

2 - [3 - ブromo - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - エチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン 20



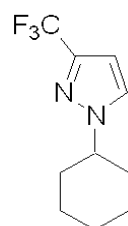
$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6 , TMS) : 0.81 (3H, t, $J = 7\text{ Hz}$), 2.07 (2H, q, $J = 7\text{ Hz}$), 7.47 - 7.57 (2H, m), 7.70 (1H, d, $J = 7\text{ Hz}$), 7.79 (1H, dd, $J = 8$, 5 Hz), 7.95 (1H, d, $J = 7\text{ Hz}$), 8.37 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.64 (1H, d, $J = 5\text{ Hz}$). 30

【0911】

参考製造例95 - (1)

tert - ブチルヒドラジン塩酸塩の代わりにシクロヘキシルヒドラジン塩酸塩を用い参考製造例67 - (1)と同様の方法で1 - シクロヘキシル - 3 - トリフルオロメチル - 1H - ピラゾールを得た。

1 - シクロヘキシル - 3 - トリフルオロメチル - 1H - ピラゾール



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl $_3$, TMS) (ppm) : 1.19 - 1.33 (3H, m), 1.67 - 1.77 (2H, m), 1.93 - 1.99 (4H, m), 2.16 - 2.19 (1H, m), 4.13 - 4.20 (1H, m), 6.49 (1H, s), 7.45 (1H, s) 40

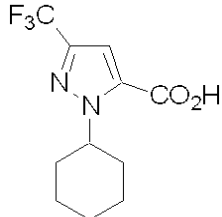
【0912】

参考製造例95 - (2)

3 - クロロ - 2 - (3 - トリフルオロメチル - 1H - ピラゾール - 1 - イル)ピリジン 50

の代わりに 1 - シクロヘキシル - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾールを用い参考製造例 15 と同様の方法で 1 - シクロヘキシル - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボン酸を得た。

1 - シクロヘキシル - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボン酸



10

^1H - NMR (CDCl₃, TMS) (ppm): 1.26 - 2.00 (10H, m), 5.10 - 5.18 (1H, m), 7.15 (1H, s)

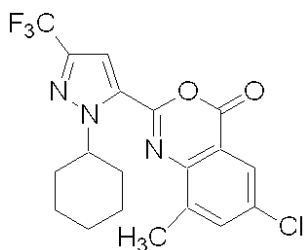
【0913】

参考製造例 95 - (3)

1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボン酸の代わりに 1 - シクロヘキシル - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボン酸を用い参考製造例 13 と同様の方法で 6 - クロロ - 2 - (1 - シクロヘキシル - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル) - 8 - メチル - 4 H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを得た。

6 - クロロ - 2 - (1 - シクロヘキシル - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル) - 8 - メチル - 4 H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン

20



^1H - NMR (CDCl₃, TMS) (ppm): 1.26 - 1.54 (4H, m), 1.77 (1H, d, J = 2 Hz), 1.96 - 2.62 (5H, m), 2.62 (3H, s), 5.51 - 5.58 (1H, m), 7.31 (1H, s), 7.69 (1H, d, J = 2 Hz), 8.07 (1H, d, J = 2 Hz)

30

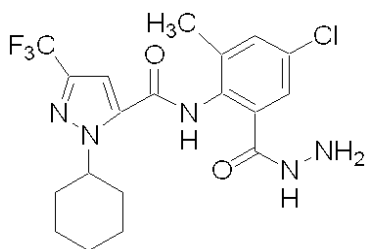
【0914】

参考製造例 95 - (4)

6 - クロロ - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - メチル - 4 H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンの代わりに 6 - クロロ - 2 - (1 - シクロヘキシル - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル) - 8 - メチル - 4 H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを用い参考製造例 1 と同様の方法で N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - シクロヘキシル - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミドを得た。

40

N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - シクロヘキシル - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド



50

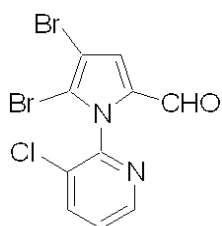
^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 1.20 - 1.39 (3H, m), 1.66 (1H, d, $J = 12\text{ Hz}$), 1.75 - 1.84 (4H, m), 1.98 (2H, d, $J = 10\text{ Hz}$), 2.25 (3H, s), 4.36 (2H, brs), 5.03 - 5.09 (1H, m), 7.35 (2H, s), 7.52 (1H, s), 9.62 (1H, brs), 10.17 (1H, brs)

【0915】

参考製造例 96 - (1)

3-クロロ-2-(2-ホルミル-1H-ピロール-1-イル)ピリジン 1.0 g を N, N-ジメチルホルムアミド 15 ml に溶解し、N-プロモコハク酸イミド 1.9 g を加えた。該混合物を室温で 3 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで 3 回抽出した。有機層を合わせて飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮することにより、4,5-ジブromo-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-カルボアルデヒド 1.2 g を得た。

4,5-ジブromo-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-カルボアルデヒド



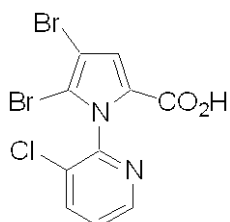
^1H -NMR (CDCl₃, TMS) (ppm): 7.14 (1H, s), 7.47 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 5 Hz), 7.93 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 2 Hz), 8.53 (1H, dd, $J = 5\text{ Hz}$, 2 Hz), 9.33 (1H, s)

【0916】

参考製造例 96 - (2)

4,5-ジブromo-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-カルボアルデヒド 1.0 g、アセトン 15 ml および水 7 ml の混合物に、過マンガン酸カリウム 1.3 g を 40 °C でゆっくりと加えた。得られた混合物を 60 °C で 2 時間攪拌した。反応混合物中の析出物を濾過により除去した。得られた濾液をクロロホルムで 2 回洗浄し、水層に pH が 3 付近になるまで 2 N 塩酸を注加した。これを酢酸エチルで 3 回抽出した。有機層を合わせて飽和食塩水で洗浄した。無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮して、4,5-ジブromo-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-カルボン酸 0.69 g を得た。

4,5-ジブromo-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-カルボン酸



^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 7.15 (1H, m), 7.64 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 5 Hz), 8.19 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 2 Hz), 8.56 (1H, dd, $J = 5\text{ Hz}$, 2 Hz)

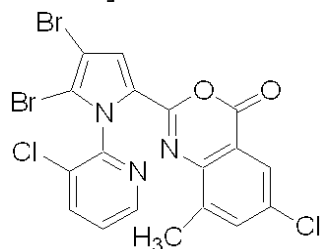
【0917】

参考製造例 96 - (3)

4-プロモ-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-カルボン酸の代わりに 4,5-ジブromo-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-カルボン酸を用い参考製造例 71 - (5) と同様の方法で 2-[4,5-ジブromo-

1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - イル] - 6 - クロロ - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを得た。

2 - [4 , 5 - ジブromo - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - イル] - 6 - クロロ - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン



10

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) (ppm) : 1 . 7 2 (3 H , s) , 7 . 4 0 (2 H , s) , 7 . 4 8 (1 H , dd , $J = 8 \text{ Hz}$, 5 Hz) , 7 . 9 2 (1 H , s) , 7 . 9 8 (1 H , dd , $J = 8 \text{ Hz}$, 2 Hz) , 8 . 5 8 (1 H , dd , $J = 5 \text{ Hz}$, 2 Hz)

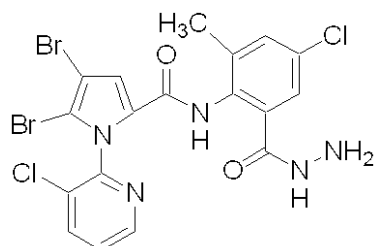
【 0 9 1 8 】

参考製造例 9 6 - (4)

2 - [4 - ブromo - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - イル] - 6 - クロロ - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンの代わりに 2 - [4 , 5 - ジブromo - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - イル] - 6 - クロロ - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを用い参考製造例 7 1 - (6) と同様の方法で 4 , 5 - ジブromo - N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボキサミドを得た。

20

4 , 5 - ジブromo - N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボキサミド



30

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) (ppm) : 2 . 1 5 (3 H , s) , 4 . 0 3 (2 H , brs) , 7 . 1 5 (1 H , s) , 7 . 2 2 (1 H , d , $J = 3 \text{ Hz}$) , 7 . 2 5 (1 H , d , $J = 3 \text{ Hz}$) , 7 . 3 7 (1 H , dd , $J = 8 \text{ Hz}$, 5 Hz) , 7 . 7 0 (1 H , brs) , 7 . 8 6 (1 H , dd , $J = 8 \text{ Hz}$, 2 Hz) , 8 . 4 7 (1 H , dd , $J = 5 \text{ Hz}$, 2 Hz) , 9 . 5 0 (1 H , brs)

【 0 9 1 9 】

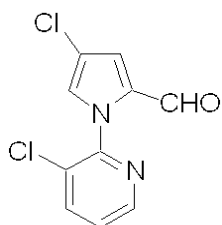
参考製造例 9 7 - (1)

40

3 - クロロ - 2 - (2 - ホルミル - 1 H - ピロール - 1 - イル) ピリジン 1 . 0 g を N , N - ジメチルホルムアミド 1 5 m l に溶解し、N - クロロコハク酸イミド 0 . 6 8 g を加えた。該混合物を 5 0 で 2 日間攪拌した。反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで 2 回抽出した。有機層を合わせ、水および飽和食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、4 - クロロ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボアルデヒド 0 . 3 5 g および、5 - クロロ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボアルデヒド 0 . 3 1 g を得た。

4 - クロロ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボアルデヒド

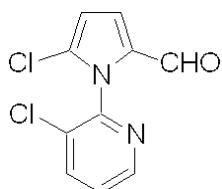
50



^1H -NMR (CDCl₃, TMS) (ppm): 7.04 (1H, d, J = 2 Hz), 7.10 (1H, dd, J = 2 Hz, 1 Hz), 7.41 (1H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 7.89 (1H, dd, J = 8 Hz, 2 Hz), 8.46 (1H, dd, J = 5 Hz, 2 Hz), 9.50 (1H, d, J = 1 Hz)

10

5 - クロロ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボアルデヒド



^1H -NMR (CDCl₃, TMS) (ppm): 6.41 (1H, d, J = 4 Hz), 7.08 (1H, d, J = 4 Hz), 7.45 (1H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 7.92 (1H, dd, J = 8 Hz, 2 Hz), 8.54 (1H, dd, J = 5 Hz, 2 Hz), 9.41 (1H, s)

20

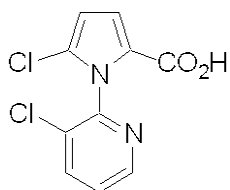
【 0 9 2 0 】

参考製造例 97 - (2)

4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボアルデヒドの代わりに、5 - クロロ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボアルデヒドを用い、参考製造例 71 - (4) と同様の方法で、5 - クロロ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸を得た。

5 - クロロ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸

30



^1H -NMR (DMSO-d₆, TMS) (ppm): 6.39 (1H, d, J = 4 Hz), 7.01 (1H, d, J = 4 Hz), 7.62 (1H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 8.13 (1H, d, J = 8 Hz), 8.54 (1H, d, J = 5 Hz)

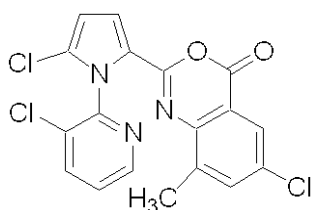
【 0 9 2 1 】

参考製造例 97 - (3)

4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸の代わりに、5 - クロロ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸を用い、参考製造例 71 - (5) と同様の方法で、2 - [5 - クロロ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - イル] - 6 - クロロ - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを得た。

2 - [5 - クロロ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - イル] - 6 - クロロ - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン

40



^1H -NMR (CDCl₃, TMS) (ppm): 1.71 (3H, s), 6.43 (1H, d, J = 4 Hz), 7.32 (1H, d, J = 4 Hz), 7.38 (1H, d, J = 2 Hz), 7.47 (1H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 7.92 (1H, d, J = 2 Hz), 7.97 (1H, dd, J = 8 Hz, 2 Hz), 8.59 (1H, dd, J = 5 Hz, 2 Hz)

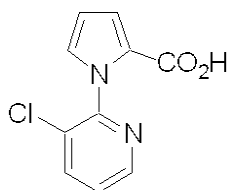
10

【0922】

参考製造例 98 - (1)

4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - カルボアルデヒドの代わりに、1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - カルボアルデヒドを用い、参考製造例 71 - (4) と同様の方法で、1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - カルボン酸を得た。

1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - カルボン酸



20

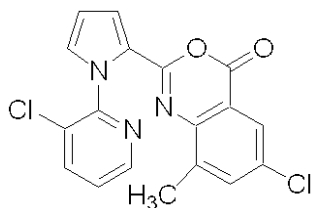
^1H -NMR (DMSO-d₆, TMS) (ppm): 6.33 - 6.34 (1H, m), 6.97 (1H, d, J = 4 Hz), 7.18 (1H, brs), 7.54 (1H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 8.10 (1H, d, J = 8 Hz), 8.47 - 8.49 (1H, m)

【0923】

参考製造例 98 - (2)

4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - カルボン酸の代わりに、1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - カルボン酸を用い、参考製造例 71 - (5) と同様の方法で、2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - イル] - 6 - クロロ - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを得た。

2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - イル] - 6 - クロロ - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン



40

^1H -NMR (CDCl₃, TMS) (ppm): 1.73 (3H, s), 6.50 (1H, dd, J = 4 Hz, 3 Hz), 7.09 (1H, dd, J = 3 Hz, 2 Hz), 7.36 (1H, dd, J = 4 Hz, 2 Hz), 7.39 (1H, s), 7.41 (1H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 7.90 (1H, dd, J = 8 Hz, 2 Hz), 7.93 (1H, s), 8.52 (1H, dd, J = 5 Hz, 2 Hz)

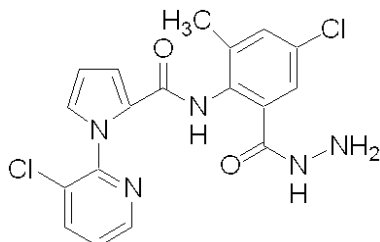
【0924】

参考製造例 98 - (3)

50

2 - [4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - イル] - 6 - クロロ - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンの代わりに、2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - イル] - 6 - クロロ - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを用い、参考製造例 7 1 - (6) と同様の方法で、N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボキサミドを得た。

N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボキサミド



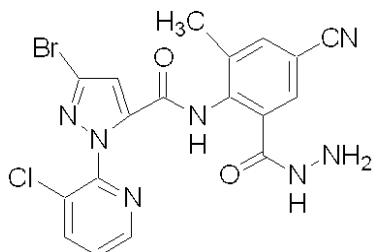
^1H - NMR (DMSO - d_6 , TMS) (ppm) : 2 . 1 6 (3 H , s) , 4 . 4 0 (2 H , b r s) , 6 . 3 7 (1 H , d d , J = 4 H z , 3 H z) , 7 . 1 3 - 7 . 1 6 (2 H , m) , 7 . 3 1 (1 H , d , J = 2 H z) , 7 . 4 1 (1 H , b r s) , 7 . 4 7 (1 H , d d , J = 8 H z , 5 H z) , 8 . 0 2 (1 H , d , J = 8 H z) , 8 . 4 2 (1 H , d , J = 5 H z) , 9 . 5 6 (1 H , b r s) , 9 . 8 4 (1 H , b r s)

【 0 9 2 5 】

参考製造例 9 9

6 - クロロ - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンの代わりに、2 - [3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 6 - シアノ - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを用い、参考製造例 1 と同様の方法で、3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - N - [4 - シアノ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミドを得た。

3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - N - [4 - シアノ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド



^1H - NMR (DMSO - d_6) : 2 . 1 9 (3 H , s) , 4 . 4 1 (2 H , b r s) , 7 . 4 1 (1 H , s) , 7 . 6 1 (1 H , d d , J = 8 H z , 5 H z) , 7 . 7 2 (1 H , s) , 7 . 8 8 (1 H , s) , 8 . 1 7 (1 H , d , J = 8 H z) , 8 . 5 0 (1 H , d , J = 5 H z) , 9 . 6 5 (1 H , b r s) , 1 0 . 5 2 (1 H , b r s)

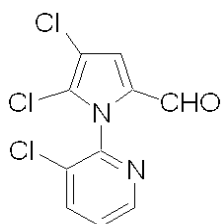
【 0 9 2 6 】

参考製造例 1 0 0 - (1)

3 - クロロ - 2 - (2 - ホルミル - 1 H - ピロール - 1 - イル) ピリジン 3 . 0 g を N , N - ジメチルホルムアミド 1 0 m l に溶解し、N - クロロコハク酸イミド 4 . 5 g を加えた。該混合物を 5 0 で 2 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで 2 回抽出した。有機層を合わせ、水および飽和食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下濃縮し、4 , 5 - ジクロロ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル)

- 1 H - ピロール - 2 - カルボアルデヒド 3 . 6 g を得た。

4 , 5 - ジクロロ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボアルデヒド



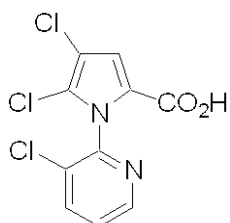
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) (ppm) : 7 . 0 6 (1 H , s) , 7 . 4 7 (1 H , dd , J = 8 H z , 5 H z) , 7 . 9 3 (1 H , dd , J = 8 H z , 2 H z) , 8 . 5 3 (1 H , dd , J = 5 H z , 2 H z) , 9 . 3 7 (1 H , s) 10

【 0 9 2 7 】

参考製造例 1 0 0 - (2)

4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボアルデヒドの代わりに、4 , 5 - ジクロロ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボアルデヒドを用い、参考製造例 7 1 - (4) と同様の方法で、4 , 5 - ジクロロ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸を得た。

4 , 5 - ジクロロ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸 20



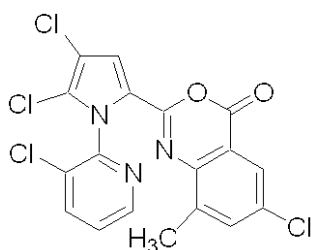
$^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$, TMS) (ppm) : 7 . 1 8 (1 H , s) , 7 . 6 8 (1 H , dd , J = 8 H z , 5 H z) , 8 . 2 5 (1 H , dd , J = 8 H z , 2 H z) , 8 . 5 9 (1 H , dd , J = 5 H z , 2 H z) 30

【 0 9 2 8 】

参考製造例 1 0 0 - (3)

4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸の代わりに、4 , 5 - ジクロロ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸を用い、参考製造例 7 1 - (5) と同様の方法で、2 - [4 , 5 - ジクロロ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - イル] - 6 - クロロ - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを得た。

2 - [4 , 5 - ジクロロ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - イル] - 6 - クロロ - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) (ppm) : 1 . 7 1 (3 H , s) , 7 . 3 1 (1 H , s) , 7 . 4 0 (1 H , s) , 7 . 4 9 (1 H , dd , J = 8 H z , 5 H z) , 7 . 9 2 (1 H , s) , 7 . 9 8 (1 H , d , J = 8 H z) , 8 . 5 8 (1 H , d , J = 5 H z) 50

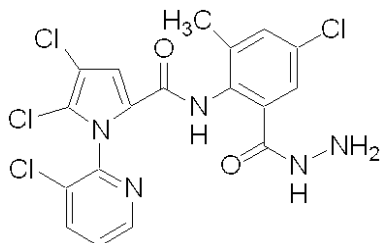
【0929】

参考製造例100-(4)

2-[4-ブromo-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-イル]-6-クロロ-8-メチル-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オンの代わりに、2-[4,5-ジクロロ-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-イル]-6-クロロ-8-メチル-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オンを用い、参考製造例71-(6)と同様の方法で、4,5-ジクロロ-N-[4-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-カルボキサミドを得た。

4,5-ジクロロ-N-[4-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-カルボキサミド

10



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) (ppm): 2.01 (3H, s), 4.03 (2H, brs), 7.07 (1H, s), 7.16 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.22 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.37 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}, 5\text{ Hz}$), 7.47 (1H, brs), 7.86 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}, 2\text{ Hz}$), 8.47 (1H, dd, $J = 5\text{ Hz}, 2\text{ Hz}$), 9.41 (1H, brs)

20

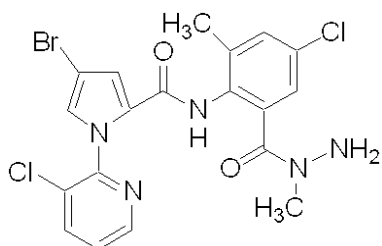
【0930】

参考製造例101

2-[4-ブromo-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-イル]-6-クロロ-8-メチル-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オン 0.86 g、メチルヒドラジン 0.11 g および テトラヒドロフラン 15 ml を混合し、該混合物を室温で2時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を水洗した後、硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付して、4-ブromo-N-[4-クロロ-2-(N-メチルヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-カルボキサミド 0.17 g を得た。

30

4-ブromo-N-[4-クロロ-2-(N-メチルヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-カルボキサミド



40

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) (ppm): 2.14 - 2.16 (3H, m), 3.02 - 3.23 (3H, m), 4.04 (0.7H, brs), 4.60 (1.3H, brs), 7.03 (2H, s), 7.11 (0.5H, s), 7.19 (0.5H, s), 7.31 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}, 4\text{ Hz}$), 7.80 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.41 (1H, d, $J = 4\text{ Hz}$), 8.56 (1H, brs)

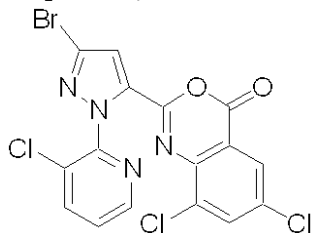
【0931】

参考製造例102

50

2 - アミノ - 3 , 5 - ジブロモ安息香酸の代わりに、2 - アミノ - 3 , 5 - ジクロロ安息香酸を用い、参考製造例 46 (1) と同様の方法で、2 - [3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 6 , 8 - ジクロロ - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを得た。

2 - [3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 6 , 8 - ジクロロ - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン



10

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO - d_6 , TMS) (ppm) : 7 . 57 (1 H , s) , 7 . 73 (1 H , dd , $J = 8\text{ Hz}$, 5 Hz) , 8 . 03 (1 H , d , $J = 2\text{ Hz}$) , 8 . 12 (1 H , d , $J = 2\text{ Hz}$) , 8 . 32 (1 H , dd , $J = 8\text{ Hz}$, 2 Hz) , 8 . 60 (1 H , dd , $J = 5\text{ Hz}$, 2 Hz) .

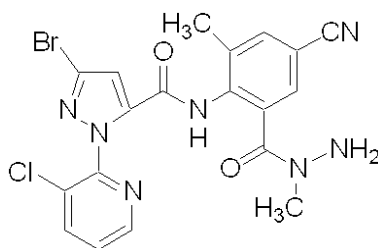
【 0932 】

参考製造例 103

2 - [3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 6 - クロロ - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンの代わりに、2 - [3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 6 - シアノ - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを用い、参考製造例 84 と同様の方法で、3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - N - [4 - シアノ - 2 - (N - メチルヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミドを得た。

20

3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - N - [4 - シアノ - 2 - (N - メチルヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド



30

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO - d_6 , TMS) (ppm) : 2 . 22 (3 H , s) , 2 . 75 - 3 . 10 (3 H , m) , 4 . 51 - 5 . 03 (2 H , m) , 7 . 36 (1 H , s) , 7 . 60 - 7 . 71 (2 H , m) , 7 . 74 - 7 . 88 (1 H , m) , 8 . 20 (1 H , d , $J = 8\text{ Hz}$) , 8 . 51 (1 H , d , $J = 4\text{ Hz}$) , 10 . 27 - 10 . 63 (1 H , m)

40

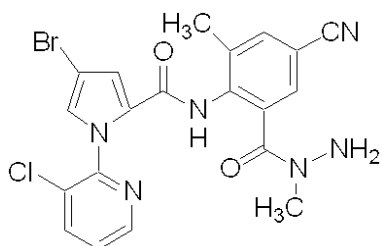
【 0933 】

参考製造例 104

2 - [4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - イル] - 6 - クロロ - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンの代わりに、2 - [4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - イル] - 6 - シアノ - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを用い、参考製造例 101 と同様の方法で、4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - N - [4 - シアノ - 2 - (N - メチルヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 H - ピロール - 2 - カルボキサミドを得た。

50

4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - N - [4 - シアノ - 2 - (N - メチルヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 H - ピロール - 2 - カルボキサミド



10

^1H - NMR (DMSO - d_6 , TMS) (ppm) : 2 . 2 1 (3 H , s) , 2 . 7 4 - 3 . 1 0 (3 H , m) , 4 . 5 1 - 4 . 9 9 (2 H , m) , 7 . 2 2 - 7 . 2 8 (1 H , m) , 7 . 4 6 - 7 . 5 6 (2 H , m) , 7 . 5 6 - 7 . 6 5 (1 H , m) , 7 . 7 0 - 7 . 8 4 (1 H , m) , 8 . 0 9 (1 H , d , $J = 8 \text{ Hz}$) , 8 . 4 4 (1 H , d , $J = 4 \text{ Hz}$) , 9 . 7 6 - 10 . 0 4 (1 H , m)

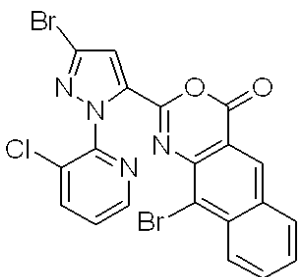
【 0 9 3 4 】

参考製造例 105 - (1)

2 - アミノ - 3 , 5 - ジブロモ安息香酸の代わりに、3 - アミノ - 4 - ブロモ - 2 - ナフトエ酸を用い、参考製造例 46 - (1) と同様の方法で、10 - ブロモ - 2 - [3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 4 H - ナフト[2 , 3 - d][1 , 3]オキサジン - 4 - オンを得た。

20

10 - ブロモ - 2 - [3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 4 H - ナフト[2 , 3 - d][1 , 3]オキサジン - 4 - オン



30

^1H - NMR (DMSO - d_6 , TMS) (ppm) : 7 . 5 5 (1 H , s) , 7 . 7 2 - 7 . 7 9 (2 H , m) , 7 . 8 9 (1 H , t , $J = 8 \text{ Hz}$) , 8 . 2 3 (1 H , d , $J = 8 \text{ Hz}$) , 8 . 3 2 (1 H , d , $J = 8 \text{ Hz}$) , 8 . 3 7 (1 H , dd , $J = 8 \text{ Hz}$, 1 Hz) , 8 . 6 3 (1 H , dd , $J = 5 \text{ Hz}$, 1 Hz) , 8 . 9 3 (1 H , s)

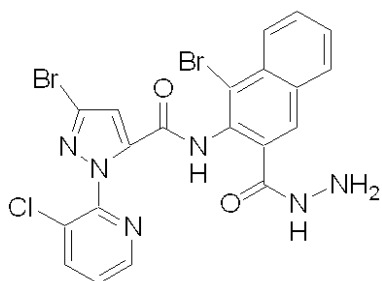
【 0 9 3 5 】

参考製造例 105 - (2)

6 - クロロ - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンの代わりに、10 - ブロモ - 2 - [3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 4 H - ナフト[2 , 3 - d][1 , 3]オキサジン - 4 - オンを用い、参考製造例 1 と同様の方法で、3 - ブロモ - N - [1 - ブロモ - 3 - (ヒドラジノカルボニル) - 2 - ナフチル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミドを得た。

40

3 - ブロモ - N - [1 - ブロモ - 3 - (ヒドラジノカルボニル) - 2 - ナフチル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド



^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 4.37 (2H, brs), 7.52 (1H, s), 7.59 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 4 Hz), 7.69 (1H, t, $J = 8\text{ Hz}$), 7.77 (1H, t, $J = 8\text{ Hz}$), 8.04 - 8.09 (2H, m), 8.15 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.21 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.50 (1H, d, $J = 4\text{ Hz}$), 9.63 (1H, brs), 10.65 (1H, brs)

10

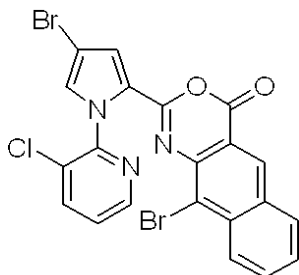
【0936】

参考製造例106-(1)

2-アミノ-5-クロロ-3-メチル安息香酸の代わりに、3-アミノ-4-ブromo-2-ナフトエ酸を用い、参考製造例71(5)と同様の方法で、10-ブromo-2-[4-ブromo-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-イル]-4H-ナフト[2,3-d][1,3]オキサジン-4-オンを得た。

10-ブromo-2-[4-ブromo-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-イル]-4H-ナフト[2,3-d][1,3]オキサジン-4-オン

20



^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 7.33 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.65 - 7.75 (3H, m), 7.84 (1H, t, $J = 8\text{ Hz}$), 8.17 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.28 (2H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.57 - 8.61 (1H, m), 8.87 (1H, s)

30

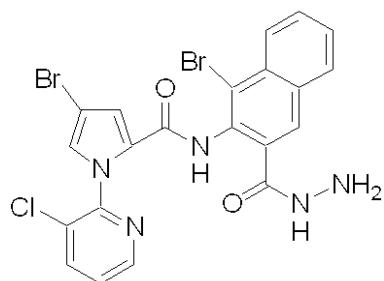
【0937】

参考製造例106-(2)

2-[4-ブromo-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-イル]-6-クロロ-8-メチル-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オンの代わりに、10-ブromo-2-[4-ブromo-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-イル]-4H-ナフト[2,3-d][1,3]オキサジン-4-オンを用い、参考製造例71-(6)と同様の方法で、4-ブromo-N-[1-ブromo-3-(ヒドラジノカルボニル)-2-ナフチル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-カルボキサミドを得た。

40

4-ブromo-N-[1-ブromo-3-(ヒドラジノカルボニル)-2-ナフチル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-カルボキサミド



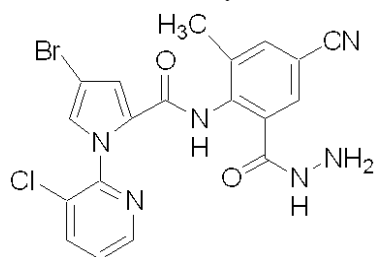
^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 4.37 (2H, brs), 7.40 (1H, s), 7.43-7.52 (2H, m), 7.66 (1H, t, $J=7\text{ Hz}$), 7.75 (1H, t, $J=7\text{ Hz}$), 8.01-8.08 (3H, m), 8.20 (1H, d, $J=8\text{ Hz}$), 8.43 (1H, d, $J=5\text{ Hz}$), 9.55 (1H, brs), 10.12 (1H, brs)

【0938】

参考製造例107

2-[4-ブromo-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-イル]-6-クロロ-8-メチル-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オンの代わりに、2-[4-ブromo-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-イル]-6-シアノ-8-メチル-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オンを用い、参考製造例71-(6)と同様の方法で、4-ブromo-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-N-[4-シアノ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1H-ピロール-2-カルボキサミドを得た。

4-ブromo-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-N-[4-シアノ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1H-ピロール-2-カルボキサミド



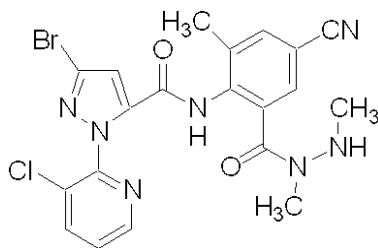
^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 2.18 (3H, s), 4.42 (2H, brs), 7.28 (1H, s), 7.45-7.55 (2H, m), 7.71 (1H, s), 7.84 (1H, s), 8.07 (1H, d, $J=8\text{ Hz}$), 8.44 (1H, d, $J=4\text{ Hz}$), 9.68 (1H, brs), 10.16 (1H, brs)

【0939】

参考製造例108

2-[3-ブromo-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-イル]-6-クロロ-8-メチル-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オンの代わりに、2-[4-ブromo-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-イル]-6-シアノ-8-メチル-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オンを用い、参考製造例88と同様の方法で、3-ブromo-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-N-[4-シアノ-2-(N,N'-ジメチルヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1H-ピラゾール-5-カルボキサミドを得た。

3-ブromo-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-N-[4-シアノ-2-(N,N'-ジメチルヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド



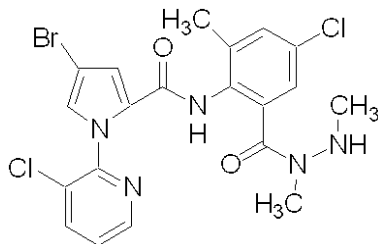
^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 2.14 - 2.33 (6H, m), 2.70 - 3.09 (3H, m), 4.55 - 6.05 (1H, m), 7.37 (1H, s), 7.58 - 7.66 (2H, m), 7.71 - 7.90 (1H, m), 8.15 - 8.21 (1H, m), 8.48 - 8.52 (1H, m), 10.25 - 10.62 (1H, m)

【0940】

参考製造例 109

N, N'-ジメチルヒドラジン 2 塩酸塩 0.29 g、水 1 ml、炭酸カリウム 0.31 g および N, N'-ジメチルホルムアミド 10 ml の混合物に、2-[4-ブromo-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-イル]-6-クロロ-8-メチル-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オン 1.0 g を加え、該混合物を室温で 6 時間攪拌した後、反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで 3 回抽出した。有機層を合わせ、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付して、4-ブromo-N-[4-クロロ-2-(N, N'-ジメチルヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-カルボキサミド 0.26 g を得た。

4-ブromo-N-[4-クロロ-2-(N, N'-ジメチルヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-カルボキサミド



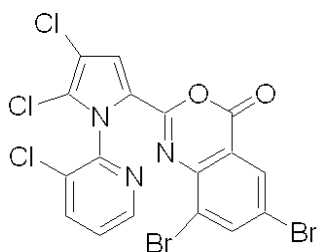
^1H -NMR (CDCl $_3$, TMS) (ppm): 2.16 (3H, s), 2.43 (1H, d, J = 6 Hz), 2.61 (2H, d, J = 6 Hz), 2.95 (2H, s), 3.19 (1H, s), 3.54 (0.3H, d, J = 6 Hz), 5.62 (0.7H, d, J = 6 Hz), 7.01 - 7.07 (3H, m), 7.14 - 7.18 (1H, m), 7.30 (1H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 7.79 (1H, d, J = 8 Hz), 8.40 (1H, d, J = 5 Hz), 8.56 (1H, br s)

【0941】

参考製造例 110 - (1)

4-ブromo-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-カルボン酸の代わりに、4,5-ジクロロ-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-カルボン酸を用い、2-アミノ-5-クロロ-3-メチル安息香酸の代わりに 2-アミノ-3,5-ジブromo安息香酸を用いて参考製造例 71 - (5) と同様の方法で、6,8-ジブromo-2-[4,5-ジクロロ-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-イル]-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オンを得た。

6,8-ジブromo-2-[4,5-ジクロロ-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-イル]-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オン



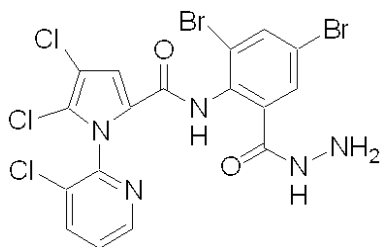
^1H -NMR (CDCl₃, TMS) (ppm): 7.36 (1H, s), 7.47 (1H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 7.95 (1H, d, J = 2 Hz), 7.99 (1H, dd, J = 8 Hz, 2 Hz), 8.19 (1H, d, J = 2 Hz), 8.57 (1H, dd, J = 5 Hz, 2 Hz)

【0942】

参考製造例 110 - (2)

2 - [4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - イル] - 6 - クロロ - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンの代わりに、6, 8 - ジブロモ - 2 - [4, 5 - ジクロロ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - イル] - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを用い、参考製造例 71 - (6) と同様の方法で、N - [4, 6 - ジブロモ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) フェニル] - 4, 5 - ジクロロ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - カルボキサミドを得た。

N - [4, 6 - ジブロモ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) フェニル] - 4, 5 - ジクロロ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - カルボキサミド



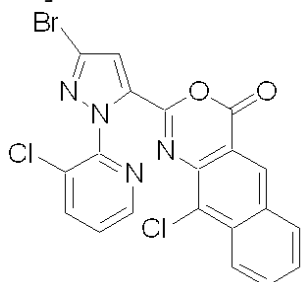
^1H -NMR (DMSO - d₆, TMS) (ppm): 4.40 (2H, brs), 6.47 (1H, s), 7.65 (1H, s), 7.75 - 7.76 (1H, m), 7.89 (1H, s), 8.05 - 8.06 (1H, m), 8.27 - 8.28 (1H, m), 9.64 (1H, brs), 10.20 (1H, brs)

【0943】

参考製造例 111

2 - アミノ - 3, 5 - ジブロモ安息香酸の代わりに、3 - アミノ - 4 - クロロ - 2 - ナフトエ酸を用い、参考製造例 46 - (1) と同様の方法で、2 - [3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピラゾール - 5 - イル] - 10 - クロロ - 4H - ナフト[2, 3 - d][1, 3]オキサジン - 4 - オンを得た。

2 - [3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピラゾール - 5 - イル] - 10 - クロロ - 4H - ナフト[2, 3 - d][1, 3]オキサジン - 4 - オン



^1H -NMR (DMSO - d₆, TMS) (ppm): 7.56 (1H, s), 7.7

3 - 7 . 8 1 (2 H , m) , 7 . 8 9 (1 H , t , J = 8 H z) , 8 . 2 3 (1 H , d , J = 8 H z) , 8 . 3 4 (1 H , d , J = 8 H z) , 8 . 3 7 (1 H , d d , J = 8 H z , 1 H z) , 8 . 6 4 (1 H , d d , J = 5 H z , 1 H z) , 8 . 8 9 (1 H , s)

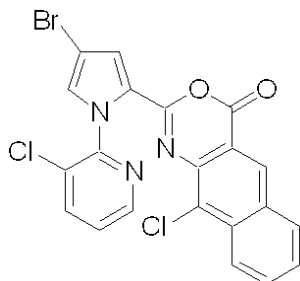
【 0 9 4 4 】

参考製造例 1 1 2

2 - アミノ - 5 - クロロ - 3 - メチル安息香酸の代わりに、3 - アミノ - 4 - クロロ - 2 - ナフトエ酸を用い、参考製造例 7 1 - (5) と同様の方法で、2 - [4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - イル] - 1 0 - クロロ - 4 H - ナフト[2 , 3 - d][1 , 3]オキサジン - 4 - オンを得た。

2 - [4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - イル] - 1 0 - クロロ - 4 H - ナフト[2 , 3 - d][1 , 3]オキサジン - 4 - オン

10



^1H - NMR (DMSO - d_6 , TMS) (ppm) : 7 . 3 3 (1 H , d , J = 2 H z) , 7 . 6 7 - 7 . 7 3 (2 H , m) , 7 . 7 4 (1 H , d , J = 2 H z) , 7 . 8 2 - 7 . 8 7 (1 H , m) , 8 . 1 7 (1 H , d , J = 8 H z) , 8 . 2 6 - 8 . 3 1 (2 H , m) , 8 . 5 9 (1 H , d d , J = 5 H z , 1 H z) , 8 . 8 4 (1 H , s)

20

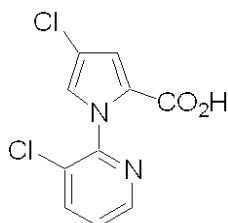
【 0 9 4 5 】

参考製造例 1 1 3 - (1)

4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボアルデヒドの代わりに、4 - クロロ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボアルデヒドを用い、参考製造例 7 1 - (4) と同様の方法で、4 - クロロ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸を得た。

4 - クロロ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸

30



^1H - NMR (DMSO - d_6 , TMS) (ppm) : 6 . 9 7 (1 H , d , J = 2 H z) , 7 . 4 8 (1 H , d , J = 2 H z) , 7 . 5 9 (1 H , d d , J = 8 H z , 5 H z) , 8 . 1 6 (1 H , d d , J = 8 H z , 2 H z) , 8 . 5 0 (1 H , d d , J = 5 H z , 2 H z)

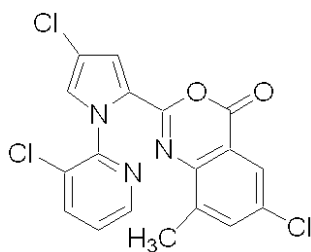
40

【 0 9 4 6 】

参考製造例 1 1 3 - (2)

4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸の代わりに、4 - クロロ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸を用い、参考製造例 7 1 - (5) と同様の方法で、2 - [4 - クロロ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - イル] - 6 - クロロ - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを得た。

2 - [4 - クロロ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - イル] - 6 - クロロ - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン



^1H -NMR (CDCl₃, TMS) (ppm): 1.73 (3H, s), 7.03 (1H, d, J = 2 Hz), 7.26 (1H, d, J = 2 Hz), 7.41 (1H, d, J = 2 Hz), 7.43 (1H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 7.91 (1H, dd, J = 8 Hz, 2 Hz), 7.94 (1H, d, J = 2 Hz), 8.51 (1H, dd, J = 5 Hz, 2 Hz)

10

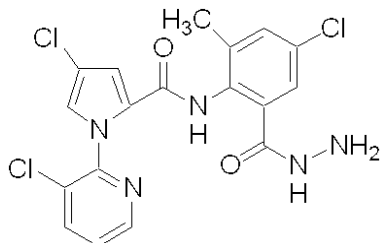
【0947】

参考製造例 113 - (3)

2 - [4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - イル] - 6 - クロロ - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンの代わりに、2 - [4 - クロロ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - イル] - 6 - クロロ - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを用い、参考製造例 71 - (6) と同様の方法で、4 - クロロ - N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - カルボキサミドを得た。

20

4 - クロロ - N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - カルボキサミド



30

^1H -NMR (CDCl₃, TMS) (ppm): 2.19 (3H, s), 6.97 (1H, d, J = 2 Hz), 7.00 (1H, d, J = 2 Hz), 7.26 (1H, s), 7.30 (1H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 7.48 (1H, s), 7.79 (1H, dd, J = 8 Hz, 2 Hz), 8.40 (1H, dd, J = 5 Hz, 2 Hz), 9.29 (1H, brs)

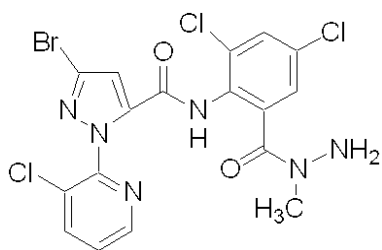
【0948】

参考製造例 114

2 - [3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピラゾール - 5 - イル] - 6 - クロロ - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンの代わりに、2 - [3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピラゾール - 5 - イル] - 6, 8 - ジクロロ - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを用い、参考製造例 84 と同様の方法で、3 - ブロモ - N - [4, 6 - ジクロロ - 2 - (N - メチルヒドラジノカルボニル) フェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピラゾール - 5 - カルボキサミドを得た。

40

3 - ブロモ - N - [4, 6 - ジクロロ - 2 - (N - メチルヒドラジノカルボニル) フェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド



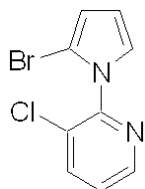
^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 2.76 (0.6H, s), 3.06 (2.4H, s), 4.55 (1.6H, s), 5.02 (0.4H, s), 7.38 - 7.46 (2.0H, m), 7.60 - 7.64 (1.0H, m), 7.71 (0.8H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.83 (0.2H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 8.17 - 8.20 (1.0H, m), 8.51 (1.0H, dd, $J = 5\text{ Hz}$, 2 Hz), 10.38 (0.8H, s), 10.64 (0.2H, s).

【0949】

参考製造例 115 - (1)

3-クロロ-2-(1H-ピロール-1-イル)ピリジン 3.0 g を N,N-ジメチルホルムアミド 30 ml に溶解し、N-ブromoコハク酸イミド 3.1 g を加えた。該混合物を室温で 6 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで 2 回抽出した。有機層を合わせ、飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、2-(2-ブromo-1H-ピロール-1-イル)-3-クロロピリジン 1.1 g を得た。

2-(2-ブromo-1H-ピロール-1-イル)-3-クロロピリジン



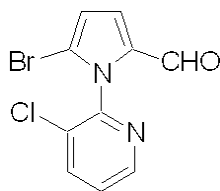
^1H -NMR (CDCl $_3$, TMS) (ppm): 6.37 - 6.41 (2H, m), 6.93 (1H, dd, $J = 3\text{ Hz}$, 2 Hz), 7.38 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 5 Hz), 7.91 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 2 Hz), 8.52 (1H, dd, $J = 5\text{ Hz}$, 2 Hz)

【0950】

参考製造例 115 - (2)

3-クロロ-2-(1H-ピロール-1-イル)ピリジンの代わりに、2-(2-ブromo-1H-ピロール-1-イル)-3-クロロピリジンを用い、参考製造例 71 - (2) と同様の方法で、5-ブromo-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-カルボアルデヒドを得た。

5-ブromo-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-カルボアルデヒド



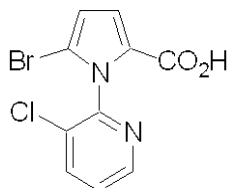
^1H -NMR (CDCl $_3$, TMS) (ppm): 6.53 (1H, d, $J = 4\text{ Hz}$), 7.07 (1H, d, $J = 4\text{ Hz}$), 7.45 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 5 Hz), 7.92 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 2 Hz), 8.54 (1H, dd, $J = 5\text{ Hz}$, 2 Hz), 9.36 (1H, s)

【 0 9 5 1 】

参考製造例 1 1 5 - (3)

4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボアルデヒドの代わりに、5 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボアルデヒドを用い、参考製造例 7 1 - (4) と同様の方法で、5 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸を得た。

5 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸



10

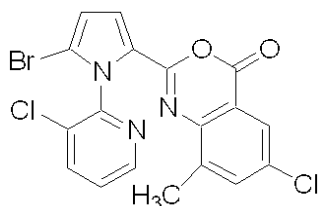
^1H - NMR (DMSO - d_6 , TMS) (ppm) : 6 . 5 4 (1 H , d , J = 4 H z) , 7 . 0 2 (1 H , d , J = 4 H z) , 7 . 6 3 (1 H , dd , J = 8 H z , 5 H z) , 8 . 2 1 (1 H , d , J = 8 H z) , 8 . 5 6 (1 H , d , J = 5 H z) , 1 2 . 5 4 (1 H , brs)

【 0 9 5 2 】

参考製造例 1 1 5 - (4)

4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸の代わりに、5 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸を用い、参考製造例 7 1 - (5) と同様の方法で、2 - [5 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - イル] - 6 - クロロ - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを得た。

2 - [5 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - イル] - 6 - クロロ - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン



30

^1H - NMR (CDCl₃ , TMS) (ppm) : 1 . 5 7 (3 H , s) , 6 . 5 5 (1 H , d , J = 4 H z) , 7 . 3 3 (1 H , d , J = 4 H z) , 7 . 3 8 (1 H , d , J = 2 H z) , 7 . 4 7 (1 H , dd , J = 8 H z , 5 H z) , 7 . 9 2 (1 H , d , J = 2 H z) , 7 . 9 7 (1 H , dd , J = 8 H z , 2 H z) , 8 . 5 9 (1 H , dd , J = 5 H z , 2 H z)

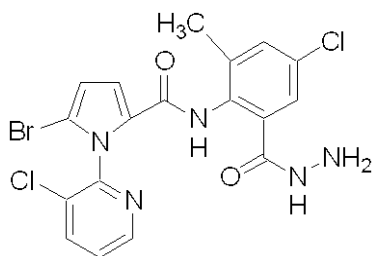
【 0 9 5 3 】

参考製造例 1 1 5 - (5)

2 - [4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - イル] - 6 - クロロ - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンの代わりに、2 - [5 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - イル] - 6 - クロロ - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを用い、参考製造例 7 1 - (6) と同様の方法で、5 - ブロモ - N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボキサミドを得た。

5 - ブロモ - N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボキサミド

40



^1H -NMR (CDCl_3 , TMS) (ppm): 2.17 (3H, s), 4.02 (2H, brs), 6.47 (1H, d, $J = 4\text{ Hz}$), 7.03 (1H, d, $J = 4\text{ Hz}$), 7.20 (1H, s), 7.27 (1H, s), 7.36 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 5 Hz), 7.86 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 2 Hz), 8.40 (1H, dd, $J = 5\text{ Hz}$, 2 Hz), 9.22 (1H, brs)

10

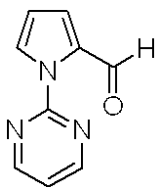
【0954】

参考製造例 116 - (1)

2 - ピロールカルバルデヒド 1.9 g、2 - クロロピリミジン 2.3 g、炭酸セシウム 7.8 g および N - メチルピロリドン 20 ml の混合物を 130 で 13 時間攪拌した。室温まで放冷した反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで 2 回抽出した。有機層を合わせて水および飽和食塩水で順次洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、1 - (2 - ピリミジニル) - 1H - ピロール - 2 - カルバルデヒド 0.94 g を得た。

20

1 - (2 - ピリミジニル) - 1H - ピロール - 2 - カルバルデヒド



^1H -NMR (CDCl_3 , TMS) (ppm): 6.40 - 6.41 (1H, m), 7.22 (1H, t, $J = 5\text{ Hz}$), 7.29 (1H, dd, $J = 4\text{ Hz}$, 2 Hz), 7.96 (1H, dd, $J = 3\text{ Hz}$, 2 Hz), 8.73 (2H, d, $J = 5\text{ Hz}$), 10.61 (1H, s)

30

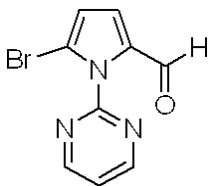
【0955】

参考製造例 116 - (2)

1 - (2 - ピリミジニル) - 1H - ピロール - 2 - カルバルデヒド 0.5 g を N, N - ジメチルホルムアミド 10 ml に溶解し、N - プロモコハク酸イミド 0.6 g を加えた。該混合物を室温で 1 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで 2 回抽出した。有機層を合わせて水および飽和食塩水で順次洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、5 - ブロモ - 1 - (2 - ピリミジニル) - 1H - ピロール - 2 - カルバルデヒド 0.43 g を得た。

5 - ブロモ - 1 - (2 - ピリミジニル) - 1H - ピロール - 2 - カルバルデヒド

40



^1H -NMR ($\text{DMSO}-d_6$, TMS) (ppm): 6.67 (1H, d, $J = 4\text{ Hz}$), 7.28 (1H, d, $J = 4\text{ Hz}$), 7.75 (1H, t, $J = 5\text{ Hz}$), 9.02 (2H, d, $J = 5\text{ Hz}$), 9.39 (1H, s)

【0956】

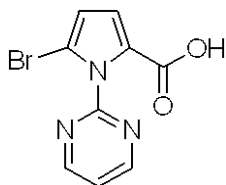
参考製造例 116 - (3)

5 - ブロモ - 1 - (2 - ピリミジニル) - 1H - ピロール - 2 - カルバルデヒド 0.7

50

6 g とアセトン 18 ml との混合物を 40 に保ちながら、ここに過マンガン酸カリウム 2.0 g を 10 ml の水に溶解した水溶液を滴下した後、この混合物を 40 で 4 時間攪拌した。析出物を濾去して得られた濾液に 2 N 水酸化ナトリウム水溶液を加えて、pH を 10 - 12 となるように調整してから、クロロホルムで 2 回洗浄した。水層の pH が 3 付近になるまで 2 N 塩酸を注加し、酢酸エチルで 2 回抽出した。有機層を合わせて水および飽和食塩水で順次洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、減圧下濃縮することにより、5 - ブロモ - 1 - (2 - ピリミジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸 0.28 g を得た。

5 - ブロモ - 1 - (2 - ピリミジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸



10

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 6.40 - 6.51 (1H, m), 6.89 - 7.16 (1H, m), 7.66 - 7.75 (1H, m), 8.99 (2H, d, $J = 5\text{ Hz}$)

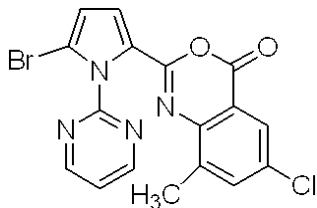
【0957】

参考製造例 116 - (4)

4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸の代わりに、5 - ブロモ - 1 - (2 - ピリミジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸を用い、参考製造例 71 - (5) と同様の方法で、2 - [5 - ブロモ - 1 - (2 - ピリミジニル) - 1 H - ピロール - 2 - イル] - 6 - クロロ - 8 - メチル - 4 H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを得た。

20

2 - [5 - ブロモ - 1 - (2 - ピリミジニル) - 1 H - ピロール - 2 - イル] - 6 - クロロ - 8 - メチル - 4 H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン



30

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 1.67 (3H, s), 6.62 (1H, d, $J = 4\text{ Hz}$), 7.20 - 7.30 (1H, m), 7.67 - 7.72 (1H, m), 7.77 - 7.88 (2H, m), 9.06 - 9.12 (2H, m)

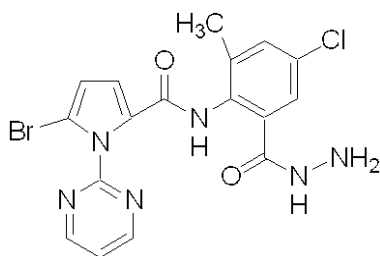
【0958】

参考製造例 116 - (5)

2 - [4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - イル] - 6 - クロロ - 8 - メチル - 4 H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンの代わりに、2 - [5 - ブロモ - 1 - (2 - ピリミジニル) - 1 H - ピロール - 2 - イル] - 6 - クロロ - 8 - メチル - 4 H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを用い、参考製造例 71 - (6) と同様の方法で、5 - ブロモ - N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (2 - ピリミジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボキサミドを得た。

40

5 - ブロモ - N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (2 - ピリミジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボキサミド



$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 2.13 (3H, s), 6.45 (1H, d, $J = 4\text{ Hz}$), 7.12 (1H, brs), 7.30 (1H, brs), 7.44 (1H, brs), 7.59 - 7.66 (1H, m), 8.90 - 8.95 (2H, m), 9.51 (1H, brs), 9.92 (1H, brs)

10

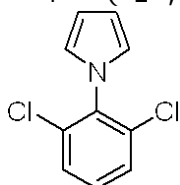
【0959】

参考製造例 117 - (1)

2,6-ジクロロアニリン 5 g、2,5-ジメトキシテトラヒドロフラン 4.5 g および酢酸 30 ml を混合し、該混合物を 10 時間加熱還流した。反応混合物を放冷した後、水に注加し、酢酸エチルで 2 回抽出した。有機層を合わせて水および飽和食塩水で順次洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、1-(2,6-ジクロロフェニル)-1H-ピロール 5.45 g を得た。

1-(2,6-ジクロロフェニル)-1H-ピロール

20



$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 6.26 (2H, t, $J = 2\text{ Hz}$), 6.82 (2H, t, $J = 2\text{ Hz}$), 7.50 (1H, t, $J = 8\text{ Hz}$), 7.66 (2H, d, $J = 8\text{ Hz}$)

【0960】

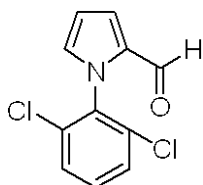
参考製造例 117 - (2)

30

N,N-ジメチルホルムアミド 4 g にオキシ塩化リン 7.67 g を氷冷下滴下し、室温で 30 分間攪拌した。ここに 1-(2,6-ジクロロフェニル)-1H-ピロール 2.1 g を加え、得られた混合物を 60 で 2 時間攪拌した。室温まで放冷した反応混合物を氷水に注加した。ここに 2N 水酸化ナトリウム水溶液を加えて、pH が 4 となるように調整し、酢酸エチルで 2 回抽出した。有機層を合わせて水および飽和食塩水で順次洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、1-(2,6-ジクロロフェニル)-1H-ピロール-2-カルバルデヒド 0.80 g および 1-(2,6-ジクロロフェニル)-1H-ピロール-3-カルバルデヒド 1.00 g を得た。

1-(2,6-ジクロロフェニル)-1H-ピロール-2-カルバルデヒド

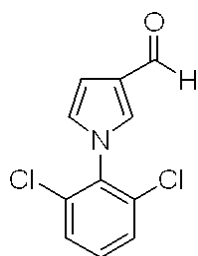
40



$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 6.54 (1H, dd, $J = 4\text{ Hz}$, 3 Hz), 7.29 (1H, dd, $J = 4\text{ Hz}$, 2 Hz), 7.35 (1H, ddd, $J = 3\text{ Hz}$, 2 Hz , 1 Hz), 7.53 (1H, dd, $J = 9\text{ Hz}$, 7 Hz), 7.63 - 7.67 (2H, m), 9.50 (1H, d, $J = 1\text{ Hz}$)

1-(2,6-ジクロロフェニル)-1H-ピロール-3-カルバルデヒド

50



$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 6.69 (1H, dd, $J = 3$, 2 Hz), 7.07 (1H, ddd, $J = 3$ Hz, 2 Hz, 1 Hz), 7.58 (1H, dd, $J = 9$ Hz, 8 Hz), 7.71 - 7.75 (2H, m), 7.85 (1H, brs), 9.78 (1H, d, $J = 1$ Hz)

10

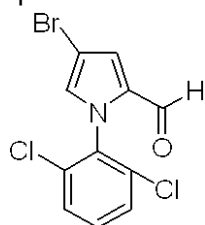
【0961】

参考製造例 117 - (3)

1 - (2, 6 - ジクロロフェニル) - 1H - ピロール - 2 - カルバルデヒド 0.65 g を N, N - ジメチルホルムアミド 10 ml に溶解し、N - ブロモコハク酸イミド 0.53 g を加えた。該混合物を室温で 1 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、析出した沈殿を濾取することにより、4 - ブロモ - 1 - (2, 6 - ジクロロフェニル) - 1H - ピロール - 2 - カルバルデヒド 0.85 g を得た。

4 - ブロモ - 1 - (2, 6 - ジクロロフェニル) - 1H - ピロール - 2 - カルバルデヒド

20



$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 7.43 (1H, d, $J = 2$ Hz), 7.56 (1H, dd, $J = 9$ Hz, 7 Hz), 7.65 - 7.69 (3H, m), 9.46 (1H, s)

【0962】

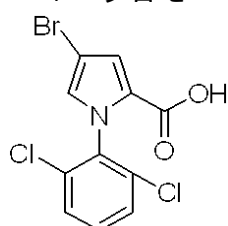
30

参考製造例 117 - (4)

4 - ブロモ - 1 - (2, 6 - ジクロロフェニル) - 1H - ピロール - 2 - カルバルデヒド 0.85 g とアセトン 18 ml との混合物を 40℃ に保ちながら、ここに過マンガン酸カリウム 2.0 g を 10 ml の水に溶解した水溶液を滴下した後、この混合物を 40℃ で 2 時間攪拌した。析出物を濾去して得られた濾液に 2 N 水酸化ナトリウム水溶液を加えて、pH を 10 - 12 となるように調整してから、クロロホルムで 2 回洗浄した。水層の pH が 3 付近になるまで 2 N 塩酸を注加し、酢酸エチルで 2 回抽出した。有機層を合わせて水および飽和食塩水で順次洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、減圧下濃縮することにより、4 - ブロモ - 1 - (2, 6 - ジクロロフェニル) - 1H - ピロール - 2 - カルボン酸 0.66 g を得た。

40

4 - ブロモ - 1 - (2, 6 - ジクロロフェニル) - 1H - ピロール - 2 - カルボン酸



$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 7.05 (1H, brs), 7.40 (1H, brs), 7.51 (1H, t, $J = 8$ Hz), 7.60 - 7.67 (2H, m), 12.65 (1H, s)

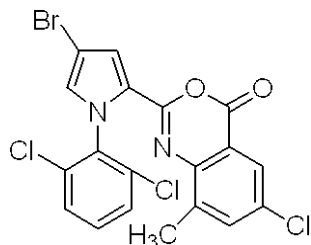
50

【 0 9 6 3 】

参考製造例 1 1 7 - (5)

4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸の代わりに、4 - ブロモ - 1 - (2 , 6 - ジクロロフェニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸を用い、参考製造例 7 1 - (5) と同様の方法で、2 - [4 - ブロモ - 1 - (2 , 6 - ジクロロフェニル) - 1 H - ピロール - 2 - イル] - 6 - クロロ - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを得た。

2 - [4 - ブロモ - 1 - (2 , 6 - ジクロロフェニル) - 1 H - ピロール - 2 - イル] - 6 - クロロ - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン



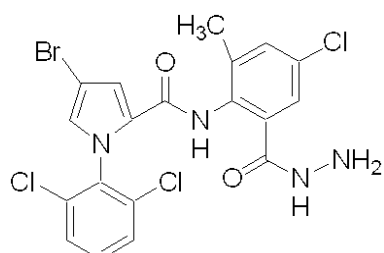
$^1\text{H-NMR}$ (DMSO - d_6 , TMS) (ppm) : 1 . 6 8 (3 H , s) , 7 . 3 2 (1 H , d , $J = 1\text{ Hz}$) , 7 . 5 4 - 7 . 6 4 (2 H , m) , 7 . 6 7 - 7 . 7 7 (3 H , m) , 7 . 8 3 (1 H , d , $J = 2\text{ Hz}$)

【 0 9 6 4 】

参考製造例 1 1 7 - (6)

2 - [4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - イル] - 6 - クロロ - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンの代わりに、2 - [4 - ブロモ - 1 - (2 , 6 - ジクロロフェニル) - 1 H - ピロール - 2 - イル] - 6 - クロロ - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを用い、参考製造例 7 1 - (6) と同様の方法で、4 - ブロモ - N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (2 , 6 - ジクロロフェニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボキサミドを得た。

4 - ブロモ - N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (2 , 6 - ジクロロフェニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボキサミド



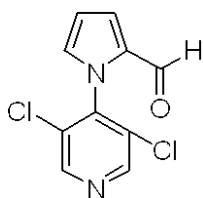
$^1\text{H-NMR}$ (DMSO - d_6 , TMS) (ppm) : 2 . 1 1 (3 H , s) , 4 . 3 8 (2 H , b r s) , 7 . 2 7 - 7 . 3 0 (2 H , m) , 7 . 3 4 (1 H , d , $J = 2\text{ Hz}$) , 7 . 4 0 - 7 . 4 6 (2 H , m) , 7 . 5 6 (2 H , d , $J = 8\text{ Hz}$) , 9 . 5 1 (1 H , b r s) , 9 . 8 1 (1 H , b r s)

【 0 9 6 5 】

参考製造例 1 1 8 - (1)

2 - ピロールカルバルデヒド 2 . 6 g 、 3 , 4 , 5 - トリクロロピリジン 5 . 0 g 、 炭酸セシウム 1 0 . 7 g および N - メチルピロリドン 3 0 m l の混合物を 1 0 0 で 2 時間攪拌した。室温まで放冷した反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで 2 回抽出した。有機層を合わせて水および飽和食塩水で順次洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、1 - (3 , 5 - ジクロロ - 4 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルバルデヒド 2 . 1 4 g を得た。

1 - (3 , 5 - ジクロロ - 4 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルバルデヒド



$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 6.61 (1H, dd, $J = 4\text{ Hz}$, 3 Hz), 7.37 (1H, dd, $J = 4\text{ Hz}$, 2 Hz), 7.46 (1H, ddd, $J = 3\text{ Hz}$, 2 Hz , 1 Hz), 8.85 (2H, s), 9.54 (1H, d, $J = 1\text{ Hz}$)

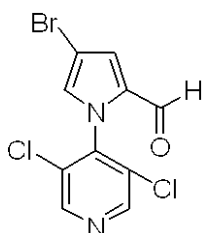
【0966】

10

参考製造例 118 - (2)

1 - (3, 5 - ジクロロ - 4 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - カルバルデヒド 2.14 g を N, N - ジメチルホルムアミド 10 ml に溶解し、N - ブロモコハク酸イミド 1.7 g を加えた。該混合物を室温で 2 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、析出した沈殿を濾取することにより、4 - ブロモ - 1 - (3, 5 - ジクロロ - 4 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - カルバルデヒド 2.9 g を得た。

4 - ブロモ - 1 - (3, 5 - ジクロロ - 4 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - カルバルデヒド



20

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 7.52 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.74 (1H, dd, $J = 2\text{ Hz}$, 1 Hz), 8.88 (2H, s), 9.51 (1H, d, $J = 1\text{ Hz}$)

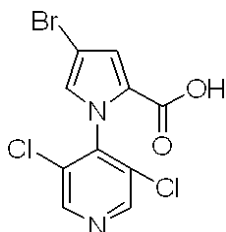
【0967】

参考製造例 118 - (3)

4 - ブロモ - 1 - (3, 5 - ジクロロ - 4 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - カルバルデヒド 2.86 g とアセトン 30 ml との混合物を 40 ℃ に保ちながら、ここに過マンガン酸カリウム 2.9 g を 15 ml の水に溶解した水溶液を滴下した後、この混合物を 40 ℃ で 2 時間攪拌した。析出物を濾去して得られた濾液に 2 N 水酸化ナトリウム水溶液を加えて、pH を 10 - 12 となるように調整してから、クロロホルムで 2 回洗浄した。水層の pH が 3 付近になるまで 2 N 塩酸を注加した。析出した沈殿を濾取することにより、4 - ブロモ - 1 - (3, 5 - ジクロロ - 4 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - カルボン酸 2.08 g を得た。

30

4 - ブロモ - 1 - (3, 5 - ジクロロ - 4 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - カルボン酸



40

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 7.12 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.51 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 8.85 (2H, s)

【0968】

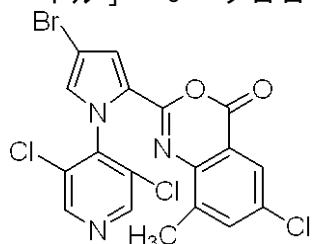
参考製造例 118 - (4)

4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - カルボン酸

50

の代わりに、4 - ブロモ - 1 - (3 , 5 - ジクロロ - 4 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸を用い、参考製造例 7 1 - (5) と同様の方法で、2 - [4 - ブロモ - 1 - (3 , 5 - ジクロロ - 4 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - イル] - 6 - クロロ - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを得た。

2 - [4 - ブロモ - 1 - (3 , 5 - ジクロロ - 4 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - イル] - 6 - クロロ - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン



10

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO - d_6 , TMS) (ppm) : 1 . 6 4 (3 H , s) , 7 . 3 9 (1 H , b r s) , 7 . 7 2 (2 H , s) , 7 . 8 5 (1 H , b r s) , 8 . 9 5 (2 H , s)

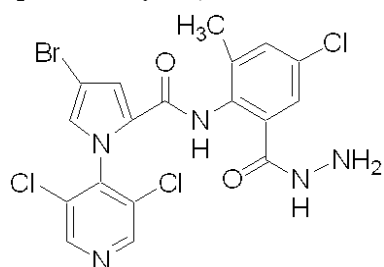
【 0 9 6 9 】

参考製造例 1 1 8 - (5)

2 - [4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - イル] - 6 - クロロ - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンの代わりに、2 - [4 - ブロモ - 1 - (3 , 5 - ジクロロ - 4 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - イル] - 6 - クロロ - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを用い、参考製造例 7 1 - (6) と同様の方法で、4 - ブロモ - N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 , 5 - ジクロロ - 4 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボキサミドを得た。

20

4 - ブロモ - N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 , 5 - ジクロロ - 4 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボキサミド



30

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO - d_6 , TMS) (ppm) : 2 . 1 3 (3 H , s) , 4 . 3 5 (2 H , b r s) , 7 . 2 8 (1 H , d , J = 2 H z) , 7 . 3 7 (1 H , d , J = 2 H z) , 7 . 4 3 - 7 . 4 7 (2 H , m) , 8 . 7 6 (2 H , s) , 9 . 5 2 (1 H , b r s) , 9 . 8 9 (1 H , b r s)

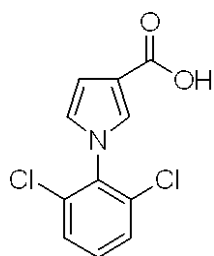
【 0 9 7 0 】

参考製造例 1 1 9 - (1)

40

1 - (2 , 6 - ジクロロフェニル) - 1 H - ピロール - 3 - カルバルデヒド 0 . 5 8 g とアセトン 2 0 m l との混合物を 4 0 ℃ に保ちながら、ここに過マンガン酸カリウム 0 . 9 g を 1 0 m l の水に溶解した水溶液を滴下した後、この混合物を 4 0 ℃ で 2 時間攪拌した。析出物を濾去して得られた濾液に 2 N 水酸化ナトリウム水溶液を加えて、pH を 1 0 - 1 2 となるように調整してから、クロロホルムで 2 回洗浄した。水層の pH が 3 付近になるまで 2 N 塩酸を注加し、酢酸エチルで 2 回抽出した。有機層を合わせて水および飽和食塩水で順次洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、減圧下濃縮することにより 1 - (2 , 6 - ジクロロフェニル) - 1 H - ピロール - 3 - カルボン酸 0 . 3 4 g を得た。

1 - (2 , 6 - ジクロロフェニル) - 1 H - ピロール - 3 - カルボン酸



^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 6.60 (1H, dd, $J = 3\text{ Hz}$, 2 Hz), 6.92 (1H, dd, $J = 3\text{ Hz}$, 1 Hz), 7.48 (1H, dd, $J = 2\text{ Hz}$, 1 Hz), 7.55 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 7 Hz), 7.67 - 7.72 (2H, m), 12.05 (1H, brs)

10

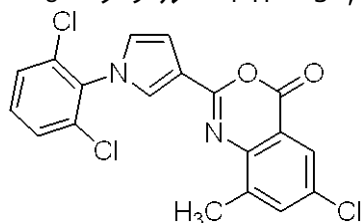
【0971】

参考製造例 119 - (2)

4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - カルボン酸の代わりに、1 - (2, 6 - ジクロロフェニル) - 1H - ピロール - 3 - カルボン酸を用い、参考製造例 71 - (5) と同様の方法で、6 - クロロ - 2 - [1 - (2, 6 - ジクロロフェニル) - 1H - ピロール - 3 - イル] - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを得た。

6 - クロロ - 2 - [1 - (2, 6 - ジクロロフェニル) - 1H - ピロール - 3 - イル] - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン

20



^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 2.53 (3H, s), 6.89 (1H, s), 7.10 (1H, s), 7.43 - 7.64 (2H, m), 7.67 - 7.77 (2H, m), 7.82 - 7.91 (2H, m)

【0972】

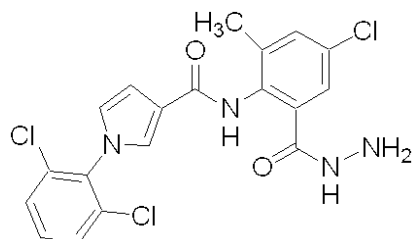
30

参考製造例 119 - (3)

2 - [4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - イル] - 6 - クロロ - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンの代わりに、6 - クロロ - 2 - [1 - (2, 6 - ジクロロフェニル) - 1H - ピロール - 3 - イル] - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを用い、参考製造例 71 - (6) と同様の方法で、N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (2, 6 - ジクロロフェニル) - 1H - ピロール - 3 - カルボキサミドを得た。

N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (2, 6 - ジクロロフェニル) - 1H - ピロール - 3 - カルボキサミド

40



^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 2.22 (3H, s), 4.59 (2H, brs), 6.79 (1H, brs), 6.97 (1H, brs), 7.37 (1H, brs), 7.47 - 7.59 (3H, m), 7.71 (2H, d, $J = 8\text{ Hz}$)

50

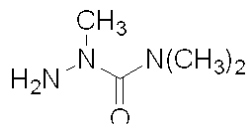
), 9.66 (1H, brs), 9.70 (1H, brs)

【0973】

参考製造例120

メチルヒドラジン 4.61 g、メタノール 25 ml および水酸化ナトリウム 4.0 g の混合物に、氷冷下、N, N - ジメチルカルバモイルクロライド 10.8 g を滴下した後、該混合物を室温で 1 時間攪拌した。反応混合物を濾過し、濾液を減圧下濃縮した。残渣を減圧蒸留し (90 - 99 / 22 mmHg) 2, 4, 4 - トリメチルセミカルバジド 5.70 g を得た。

2, 4, 4 - トリメチルセミカルバジド



10

¹H - NMR (CDCl₃, TMS) (ppm): 2.90 (6H, s), 2.95 (3H, s), 3.94 (2H, brs).

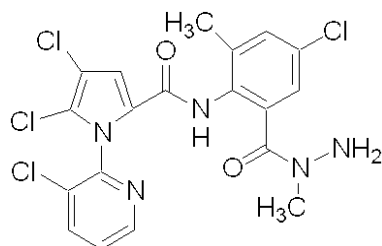
【0974】

参考製造例121

2 - [4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - イル] - 6 - クロロ - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンの代わりに、2 - [4, 5 - ジクロロ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - イル] - 6 - クロロ - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを用い、参考製造例101と同様の方法で、4, 5 - ジクロロ - N - [4 - クロロ - 2 - (N - メチルヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - カルボキサミドを得た。

20

4, 5 - ジクロロ - N - [4 - クロロ - 2 - (N - メチルヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - カルボキサミド



30

¹H - NMR (CDCl₃, TMS) (ppm): 2.01 - 2.05 (3H, m), 2.92 (2H, s), 3.21 (1H, s), 4.05 (0.7H, brs), 4.59 (1.3H, brs), 6.95 - 7.10 (2H, m), 7.19 (0.6H, s), 7.29 (0.4H, s), 7.37 (1H, dd, J = 8 Hz, 4 Hz), 7.86 (1H, d, J = 8 Hz), 8.48 (1H, d, J = 5 Hz), 9.11 (0.6H, brs), 9.42 (0.4H, brs)

40

【0975】

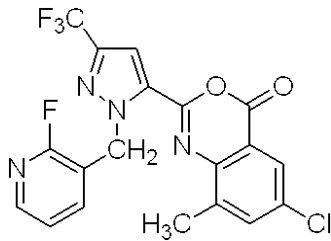
参考製造例122 - (1)

1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピラゾール - 5 - カルボン酸の代わりに、1 - [(2 - フルオロ - 3 - ピリジニル)メチル] - 3 - トリフルオロメチル - 1H - ピラゾール - 5 - カルボン酸を用い、参考製造例13と同様の方法で、6 - クロロ - 2 - [1 - [(2 - フルオロ - 3 - ピリジニル)メチル] - 3 - トリフルオロメチル - 1H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを得た。

6 - クロロ - 2 - [1 - [(2 - フルオロ - 3 - ピリジニル)メチル] - 3 - トリフルオロメチル - 1H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサ

50

ジン - 4 - オン



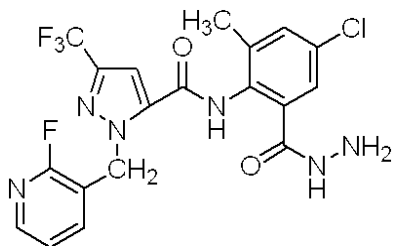
$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 2.25 (3H, s), 6.16 (2H, s), 7.30 - 7.36 (1H, m), 7.39 - 7.46 (1H, m), 7.69 (1H, s), 7.90 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.98 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 8.20 (1H, d, $J = 4\text{ Hz}$)

【0976】

参考製造例 122 - (2)

6 - クロロ - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - トリフルオロメチル - 1H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンの代わりに、6 - クロロ - 2 - [1 - [(2 - フルオロ - 3 - ピリジニル)メチル] - 3 - トリフルオロメチル - 1H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを用い、参考製造例 1 と同様の方法で、N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - [(2 - フルオロ - 3 - ピリジニル)メチル] - 3 - トリフルオロメチル - 1H - ピラゾール - 5 - カルボキサミドを得た。

N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - [(2 - フルオロ - 3 - ピリジニル)メチル] - 3 - トリフルオロメチル - 1H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド



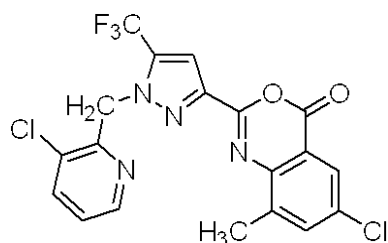
$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 2.13 (3H, s), 4.37 (2H, brs), 5.86 (2H, s), 7.32 - 7.38 (2H, m), 7.50 - 7.57 (2H, m), 7.57 - 7.64 (1H, m), 8.16 - 8.21 (1H, m), 9.62 (1H, brs), 10.28 (1H, brs)

【0977】

参考製造例 123 - (1)

1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピラゾール - 5 - カルボン酸の代わりに、1 - [(3 - クロロ - 2 - ピリジニル)メチル] - 5 - トリフルオロメチル - 1H - ピラゾール - 3 - カルボン酸を用い、参考製造例 13 と同様の方法で、2 - [1 - [(3 - クロロ - 2 - ピリジニル)メチル] - 5 - トリフルオロメチル - 1H - ピラゾール - 3 - イル] - 6 - クロロ - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを得た。

2 - [1 - [(3 - クロロ - 2 - ピリジニル)メチル] - 5 - トリフルオロメチル - 1H - ピラゾール - 3 - イル] - 6 - クロロ - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン



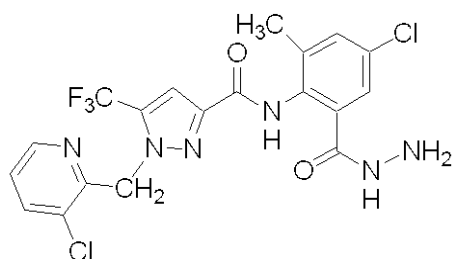
$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 2.56 (3H, s), 5.92 (2H, s), 7.44 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 5 Hz), 7.67 (1H, s), 7.89 - 7.95 (2H, m), 8.04 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.42 (1H, d, $J = 5\text{ Hz}$)

【0978】

参考製造例 123 - (2)

6-クロロ-2-[1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-イル]-8-メチル-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オンの代わりに、2-[1-[(3-クロロ-2-ピリジニル)メチル]-5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-3-イル]-6-クロロ-8-メチル-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オンを用い、参考製造例 1 と同様の方法で、N-[4-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-[(3-クロロ-2-ピリジニル)メチル]-5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-3-カルボキサミドを得た。

N-[4-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-[(3-クロロ-2-ピリジニル)メチル]-5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-3-カルボキサミド



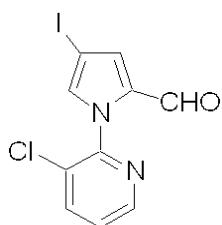
$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 2.19 (3H, s), 4.45 (2H, brs), 5.87 (2H, s), 7.37 (1H, brs), 7.41 - 7.50 (2H, m), 7.52 (1H, brs), 8.04 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.45 (1H, d, $J = 4\text{ Hz}$), 9.71 (1H, brs), 10.12 (1H, brs)

【0979】

参考製造例 124 - (1)

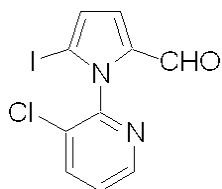
3-クロロ-2-(2-ホルミル-1H-ピロール-1-イル)ピリジン 5.0 g を N, N-ジメチルホルムアミド 50 ml に溶解し、N-ヨードコハク酸イミド 5.4 g を加えた。該混合物を室温で 1 日間攪拌した。反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで 2 回抽出した。有機層を合わせ、飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-4-ヨード-1H-ピロール-2-カルボアルデヒド 3.2 g および、1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-5-ヨード-1H-ピロール-2-カルボアルデヒド 0.90 g を得た。

1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-4-ヨード-1H-ピロール-2-カルボアルデヒド



^1H -NMR (CDCl₃, TMS) (ppm): 7.19 - 7.20 (2H, m), 7.38 - 7.42 (1H, m), 7.89 (1H, d, J = 8 Hz), 8.45 - 8.47 (1H, m), 9.51 (1H, s)

1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 5 - ヨード - 1 H - ピロール - 2 - カルボアルデヒド 10



^1H -NMR (CDCl₃, TMS) (ppm): 6.72 (1H, d, J = 4 Hz), 7.04 (1H, d, J = 4 Hz), 7.47 (1H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 7.93 (1H, dd, J = 8 Hz, 2 Hz), 8.55 (1H, dd, J = 5 Hz, 2 Hz), 9.26 (1H, s)

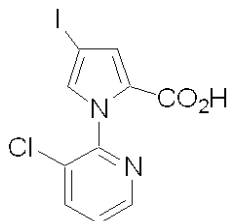
20

【0980】

参考製造例 124 - (2)

4 - プロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボアルデヒドの代わりに、1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 4 - ヨード - 1 H - ピロール - 2 - カルボアルデヒドを用い、参考製造例 71 - (4) と同様の方法で、1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 4 - ヨード - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸を得た。

1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 4 - ヨード - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸



30

^1H -NMR (DMSO-d₆, TMS) (ppm): 7.05 (1H, d, J = 2 Hz), 7.45 (1H, d, J = 2 Hz), 7.57 (1H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 8.15 (1H, dd, J = 8 Hz, 2 Hz), 8.49 (1H, dd, J = 5 Hz, 2 Hz), 12.65 (1H, brs)

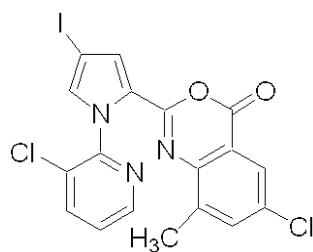
【0981】

参考製造例 124 - (3)

40

4 - プロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸の代わりに、1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 4 - ヨード - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸を用い、参考製造例 71 - (5) と同様の方法で、6 - クロロ - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 4 - ヨード - 1 H - ピロール - 2 - イル] - 8 - メチル - 4 H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを得た。

6 - クロロ - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 4 - ヨード - 1 H - ピロール - 2 - イル] - 8 - メチル - 4 H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン



^1H -NMR (CDCl₃, TMS) (ppm): 1.67 (3H, s), 7.30 (1H, d, J = 2 Hz), 7.61 (1H, d, J = 2 Hz), 7.63 - 7.67 (2H, m), 7.82 (1H, d, J = 3 Hz), 8.22 (1H, dd, J = 8 Hz, 2 Hz), 8.56 (1H, dd, J = 5 Hz, 2 Hz)

10

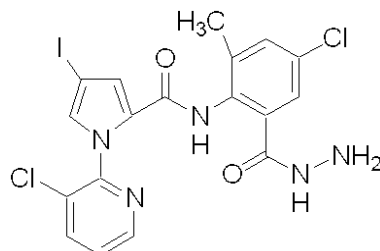
【0982】

参考製造例 124 - (4)

2 - [4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - イル] - 6 - クロロ - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンの代わりに、6 - クロロ - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 4 - ヨード - 1H - ピロール - 2 - イル] - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを用い、参考製造例 71 - (6) と同様の方法で、N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 4 - ヨード - 1H - ピロール - 2 - カルボキサミドを得た。

20

N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 4 - ヨード - 1H - ピロール - 2 - カルボキサミド



^1H -NMR (DMSO-d₆, TMS) (ppm): 2.13 (3H, s), 4.39 (2H, brs), 7.26 (1H, s), 7.30 (1H, s), 7.39 (1H, s), 7.42 (1H, s), 7.49 (1H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 8.05 (1H, dd, J = 8 Hz, 2 Hz), 8.43 (1H, dd, J = 5 Hz, 2 Hz), 9.52 (1H, brs), 9.84 (1H, brs)

30

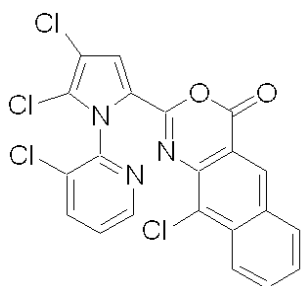
【0983】

参考製造例 125

4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - カルボン酸の代わりに、4, 5 - ジクロロ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - カルボン酸を用い、2 - アミノ - 5 - クロロ - 3 - メチル安息香酸の代わりに、3 - アミノ - 7 - ブロモ - 4 - クロロ - 2 - ナフトエ酸を用い参考製造例 71 - (5) と同様の方法で、10 - クロロ - 2 - [4, 5 - ジクロロ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - イル] - 4H - ナフト[2, 3 - d][1, 3]オキサジン - 4 - オンを得た。

40

10 - クロロ - 2 - [4, 5 - ジクロロ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - イル] - 4H - ナフト[2, 3 - d][1, 3]オキサジン - 4 - オン



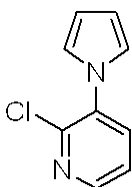
$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 7.51 (1H, s), 7.70 (1H, t, $J = 8\text{ Hz}$), 7.78 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}, 5\text{ Hz}$), 7.84 (1H, t, $J = 8\text{ Hz}$), 8.16 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.28 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.40 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}, 2\text{ Hz}$), 8.68 (1H, dd, $J = 5\text{ Hz}, 2\text{ Hz}$), 8.82 (1H, s)

【0984】

参考製造例 126 - (1)

2 - クロロ - 3 - ピリジニルアミン 5.0 g と 2, 5 - ジメトキシテトラヒドロフラン 5.6 g を酢酸 30 ml に加え、2 時間加熱還流した。室温まで放冷した反応混合物を水に注加し、酢酸エチルで 2 回抽出した。有機層を合わせて水および飽和食塩水で順次洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、1 - (2 - クロロ - 3 - ピリジニル) - 1H - ピロール 6.5 g

1 - (2 - クロロ - 3 - ピリジニル) - 1H - ピロール



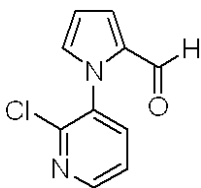
$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 6.29 (2H, t, $J = 2\text{ Hz}$), 7.09 (2H, t, $J = 2\text{ Hz}$), 7.58 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}, 5\text{ Hz}$), 7.95 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}, 2\text{ Hz}$), 8.45 (1H, dd, $J = 5\text{ Hz}, 2\text{ Hz}$)

【0985】

参考製造例 126 - (2)

N, N - ジメチルホルムアミド 14.6 g にオキシ塩化リン 8.3 g を氷冷下滴下し、室温で 30 分間攪拌した。ここに 1 - (2 - クロロ - 3 - ピリジニル) - 1H - ピロール 6.5 g を加え、得られた混合物を 60 で 2 時間攪拌した。室温まで放冷した反応混合物を氷水にゆっくり加えた。ここに 2 N 水酸化ナトリウム水溶液を加えて、pH が 4 となるように調整し、酢酸エチルで 2 回抽出した。有機層を合わせて水および飽和食塩水で順次洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、1 - (2 - クロロ - 3 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - カルバルデヒド 6.05 g を得た。

1 - (2 - クロロ - 3 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - カルバルデヒド



$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 6.53 (1H, t, $J = 2\text{ Hz}$), 7.30 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.43 (1H, br s), 7.59 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}, 5\text{ Hz}$), 8.00 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.52 (1H, d

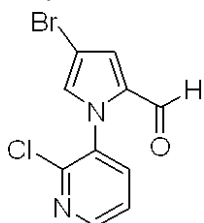
, $J = 5 \text{ Hz}$), $9.51 (1 \text{ H}, \text{s})$

【0986】

参考製造例 126 - (3)

1 - (2 - クロロ - 3 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルバルデヒド 6.05 g を N, N - ジメチルホルムアミド 20 ml に溶解し、 N - ブロモコハク酸イミド 5.72 g を加えた。該混合物を室温で 1 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、析出した沈殿を濾取することにより、4 - ブロモ - 1 - (2 - クロロ - 3 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルバルデヒド 4.22 g を得た。

4 - ブロモ - 1 - (2 - クロロ - 3 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルバルデヒド



^1H - NMR ($\text{DMSO}-d_6$, TMS) (ppm): $7.42 (1 \text{ H}, \text{d}, J = 2 \text{ Hz})$, $7.60 (1 \text{ H}, \text{dd}, J = 8 \text{ H}, 5 \text{ Hz})$, $7.70 (1 \text{ H}, \text{dd}, J = 2 \text{ H}, 1 \text{ Hz})$, $8.06 (1 \text{ H}, \text{dd}, J = 8 \text{ H}, 2 \text{ Hz})$, $8.54 (1 \text{ H}, \text{dd}, J = 5 \text{ H}, 2 \text{ Hz})$, $9.47 (1 \text{ H}, \text{d}, J = 1 \text{ Hz})$

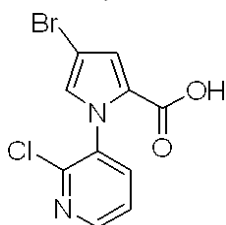
【0987】

参考製造例 126 - (4)

4 - ブロモ - 1 - (2 - クロロ - 3 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルバルデヒド 4.22 g とアセトン 30 ml との混合物を 40°C に保ちながら、ここに過マンガン酸カリウム 4.43 g を 15 ml の水に溶解した水溶液を滴下した後、この混合物を 40°C

で 2 時間攪拌した。析出物を濾去して得られた濾液に 2 N 水酸化ナトリウム水溶液を加えて、 pH を $10 - 12$ となるように調整してから、クロロホルムで 2 回洗浄した。水層の pH が 3 付近になるまで 2 N 塩酸を注加し、酢酸エチルで 2 回抽出した。有機層を合わせて水および飽和食塩水で順次洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、減圧下濃縮することにより、4 - ブロモ - 1 - (2 - クロロ - 3 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸 3.02 g を得た。

4 - ブロモ - 1 - (2 - クロロ - 3 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸



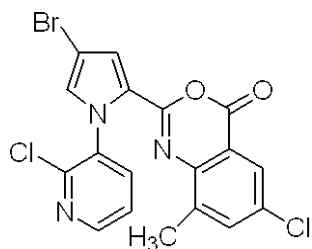
^1H - NMR ($\text{DMSO}-d_6$, TMS) (ppm): $7.05 (1 \text{ H}, \text{s})$, $7.46 (1 \text{ H}, \text{s})$, $7.57 (1 \text{ H}, \text{dd}, J = 8 \text{ H}, 4 \text{ Hz})$, $8.02 (1 \text{ H}, \text{d}, J = 8 \text{ Hz})$, $8.49 (1 \text{ H}, \text{d}, J = 4 \text{ Hz})$, $12.70 (1 \text{ H}, \text{brs})$

【0988】

参考製造例 126 - (5)

4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸の代わりに、4 - ブロモ - 1 - (2 - クロロ - 3 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸を用い、参考製造例 71 - (5) と同様の方法で、2 - [4 - ブロモ - 1 - (2 - クロロ - 3 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - イル] - 6 - クロロ - 8 - メチル - 4 H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを得た。

2 - [4 - ブロモ - 1 - (2 - クロロ - 3 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - イル] - 6 - クロロ - 8 - メチル - 4 H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン



$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 1.65 (3H, s), 7.31 (1H, s), 7.62-7.73 (3H, m), 7.84 (1H, s), 8.10 (1H, d, $J = 6\text{ Hz}$), 8.57 (1H, s)

10

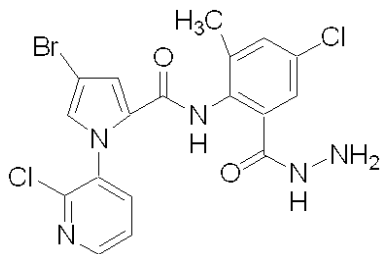
【0989】

参考製造例126-(6)

2-[4-ブromo-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-イル]-6-クロロ-8-メチル-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オンの代わりに、2-[4-ブromo-1-(2-クロロ-3-ピリジニル)-1H-ピロール-2-イル]-6-クロロ-8-メチル-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オンを用い、参考製造例71-(6)と同様の方法で、4-ブromo-N-[4-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(2-クロロ-3-ピリジニル)-1H-ピロール-2-カルボキサミドを得た。

4-ブromo-N-[4-クロロ-2-(ヒドラジノカルボニル)-6-メチルフェニル]-1-(2-クロロ-3-ピリジニル)-1H-ピロール-2-カルボキサミド

20



$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 2.14 (3H, s), 4.37 (2H, br s), 7.28 (2H, s), 7.40-7.46 (2H, m), 7.52 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 4 Hz), 7.95 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.42 (1H, d, $J = 4\text{ Hz}$), 9.51 (1H, br s), 9.82 (1H, br s)

30

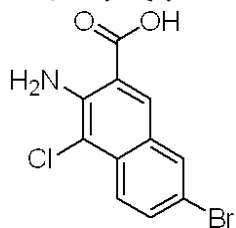
【0990】

参考製造例127-(1)

3-アミノ-4-クロロ-2-ナフトエ酸0.56gおよび酢酸20mlの混合物に、臭素0.4gを室温で滴下し、該混合物を室温で1時間攪拌した。析出した沈殿を濾取し、得られた固体を酢酸および酢酸エチルで順次洗浄することにより、3-アミノ-7-ブromo-4-クロロ-2-ナフトエ酸0.36gを得た。

3-アミノ-7-ブromo-4-クロロ-2-ナフトエ酸

40



$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 7.70 (1H, d, $J = 9\text{ Hz}$), 7.81 (1H, d, $J = 9\text{ Hz}$), 8.24 (1H, s), 8.53 (1H, s)

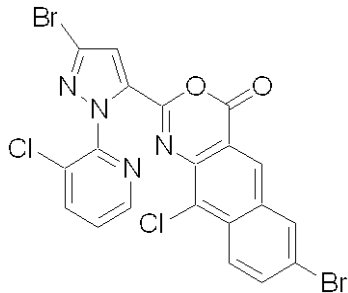
【0991】

参考製造例127-(2)

50

2 - アミノ - 3 , 5 - ジブromo安息香酸の代わりに、3 - アミノ - 7 - ブromo - 4 - クロロ - 2 - ナフトエ酸を用い、参考製造例 46 - (1) と同様の方法で、7 - ブromo - 2 - [3 - ブromo - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 10 - クロロ - 4 H - ナフト[2 , 3 - d][1 , 3]オキサジン - 4 - オンを得た。

7 - ブromo - 2 - [3 - ブromo - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 10 - クロロ - 4 H - ナフト[2 , 3 - d][1 , 3]オキサジン - 4 - オン



10

^1H - NMR (DMSO - d_6 , TMS) (ppm) : 7 . 56 (1 H , s) , 7 . 75 - 7 . 81 (1 H , m) , 7 . 99 (1 H , d , $J = 10\text{ Hz}$) , 8 . 14 (1 H , d , $J = 10\text{ Hz}$) , 8 . 37 (1 H , d , $J = 8\text{ Hz}$) , 8 . 61 - 8 . 68 (2 H , m) , 8 . 85 (1 H , brs)

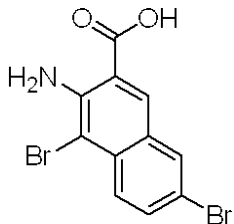
【 0992 】

20

参考製造例 128 - (1)

3 - アミノ - 2 - ナフトエ酸 0 . 47 g および酢酸 20 ml の混合物に、臭素 0 . 8 g を室温で滴下し、該混合物を室温で 1 時間攪拌した。析出した沈殿を濾取し、得られた固体を酢酸および酢酸エチルで順次洗浄することにより、3 - アミノ - 4 , 7 - ジブromo - 2 - ナフトエ酸 0 . 61 g を得た。

3 - アミノ - 4 , 7 - ジブromo - 2 - ナフトエ酸



30

^1H - NMR (DMSO - d_6 , TMS) (ppm) : 7 . 70 (1 H , dd , $J = 9$, 2 Hz) , 7 . 80 (1 H , d , $J = 9\text{ Hz}$) , 8 . 22 (1 H , d , $J = 2\text{ Hz}$) , 8 . 57 (1 H , s)

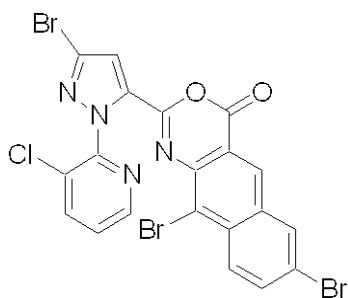
【 0993 】

参考製造例 128 - (2)

2 - アミノ - 3 , 5 - ジブromo安息香酸の代わりに、3 - アミノ - 4 , 7 - ジブromo - 2 - ナフトエ酸を用い、参考製造例 46 - (1) と同様の方法で、7 , 10 - ジブromo - 2 - [3 - ブromo - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 4 H - ナフト[2 , 3 - d][1 , 3]オキサジン - 4 - オンを得た。

40

7 , 10 - ジブromo - 2 - [3 - ブromo - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 4 H - ナフト[2 , 3 - d][1 , 3]オキサジン - 4 - オン



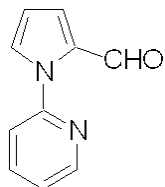
^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 7.56 (1H, s), 7.76 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 5 Hz), 7.99 (1H, d, $J = 9\text{ Hz}$), 8.14 (1H, d, $J = 9\text{ Hz}$), 8.37 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.61 - 8.67 (2H, m), 8.90 (1H, brs)

【0994】

参考製造例 129 - (1)

2 - ピロールカルバルデヒド 10 g、2 - フルオロピリジン 10 g、炭酸セシウム 24 g および N - メチルピロリドン 100 ml の混合物を 120 で 1 日間攪拌した。室温まで放冷した反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで 2 回抽出した。有機層を合わせて水および飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、1 - (2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボアルデヒド 7.7 g を得た。

1 - (2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボアルデヒド



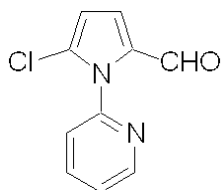
^1H -NMR (CDCl $_3$, TMS) (ppm): 6.44 (1H, dd, $J = 4\text{ Hz}$, 3 Hz), 7.21 (1H, dd, $J = 4\text{ Hz}$, 2 Hz), 7.30 - 7.33 (1H, m), 7.44 - 7.47 (2H, m), 7.81 - 7.86 (1H, m), 8.53 (1H, dd, $J = 5\text{ Hz}$, 2 Hz), 9.77 (1H, s)

【0995】

参考製造例 129 - (2)

3 - クロロ - 2 - (2 - ホルミル - 1 H - ピロール - 1 - イル) ピリジンの代わりに、1 - (2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボアルデヒドを用い、参考製造例 97 - (1) と同様の方法で、5 - クロロ - 1 - (2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボアルデヒドを得た。

5 - クロロ - 1 - (2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボアルデヒド



^1H -NMR (CDCl $_3$, TMS) (ppm): 6.36 (1H, d, $J = 4\text{ Hz}$), 7.07 (1H, d, $J = 4\text{ Hz}$), 7.38 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 7.44 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 5 Hz), 7.87 - 7.91 (1H, m), 8.61 (1H, d, $J = 5\text{ Hz}$), 9.41 (1H, s)

【0996】

参考製造例 129 - (3)

10

20

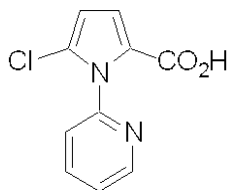
30

40

50

4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボアルデヒドの代わりに 5 - クロロ - 1 - (2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボアルデヒドを用い、参考製造例 71 - (4) と同様の方法で、5 - クロロ - 1 - (2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸を得た。

5 - クロロ - 1 - (2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸



10

^1H - NMR (DMSO - d_6 , TMS) (ppm) : 6 . 3 6 (1 H , d , J = 4 Hz) , 6 . 9 8 (1 H , d , J = 4 Hz) , 7 . 4 5 (1 H , d , J = 8 Hz) , 7 . 5 0 - 7 . 5 3 (1 H , m) , 7 . 9 7 - 8 . 0 0 (1 H , m) , 8 . 5 6 (1 H , d , J = 5 Hz) , 1 2 . 3 4 (1 H , b r s)

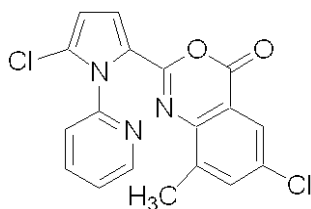
【 0 9 9 7 】

参考製造例 129 - (4)

4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸の代わりに、5 - クロロ - 1 - (2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸を用い、参考製造例 71 - (5) と同様の方法で、2 - [5 - クロロ - 1 - (2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - イル] - 6 - クロロ - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを得た。

20

2 - [5 - クロロ - 1 - (2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - イル] - 6 - クロロ - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン



30

^1H - NMR (CDCl₃ , TMS) (ppm) : 1 . 7 0 (3 H , s) , 6 . 3 8 (1 H , d , J = 4 Hz) , 7 . 2 9 (1 H , d , J = 4 Hz) , 7 . 3 8 (1 H , s) , 7 . 4 1 - 7 . 4 9 (2 H , m) , 7 . 9 1 - 7 . 9 4 (2 H , m) , 8 . 6 6 (1 H , b r s)

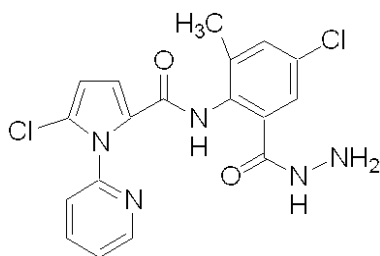
【 0 9 9 8 】

参考製造例 129 - (5)

2 - [4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - イル] - 6 - クロロ - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンの代わりに、2 - [5 - クロロ - 1 - (2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - イル] - 6 - クロロ - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを用い、参考製造例 71 - (6) と同様の方法で、5 - クロロ - N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボキサミドを得た。

40

5 - クロロ - N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボキサミド



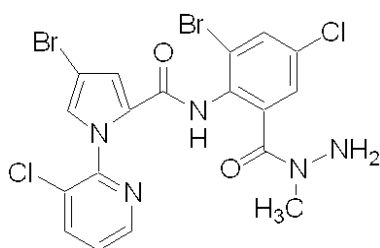
^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 2.13 (3H, s), 4.43 (2H, brs), 6.40 (1H, d, $J = 4\text{ Hz}$), 7.11 (1H, d, $J = 4\text{ Hz}$), 7.30 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.40 - 7.47 (3H, m), 7.94 (1H, td, $J = 7\text{ Hz}, 2\text{ Hz}$), 8.51 (1H, dd, $J = 5\text{ Hz}, 2\text{ Hz}$), 9.51 (1H, brs), 9.85 (1H, brs)

【0999】

参考製造例 130

2-[4-ブromo-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-イル]-6-クロロ-8-メチル-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オンの代わりに、8-ブromo-2-[4-ブromo-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-イル]-6-クロロ-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オンを用い、参考製造例 101 と同様の方法で、4-ブromo-N-[6-ブromo-4-クロロ-2-(N-メチルヒドラジノカルボニル)フェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-カルボキサミドを得た。

4-ブromo-N-[6-ブromo-4-クロロ-2-(N-メチルヒドラジノカルボニル)フェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-カルボキサミド



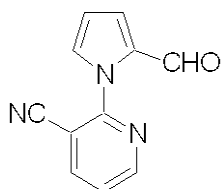
^1H -NMR (CDCl $_3$, TMS) (ppm): 2.96 (1.5H, s), 3.15 (1.5H, s), 4.05 (1H, brs), 4.49 (1H, brs), 7.03 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.16 (1H, dd, $J = 7\text{ Hz}, 4\text{ Hz}$), 7.20 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.29 - 7.34 (1H, m), 7.47 (0.5H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.53 (0.5H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.83 - 7.79 (1H, m), 8.40 - 8.43 (1H, m), 8.67 (0.5H, brs), 8.77 (0.5H, brs)

【1000】

参考製造例 131 - (1)

2-フルオロピリジンの代わりに、2-クロロ-3-シアノピリジンを用い、参考製造例 129 - (1) と同様の方法で、2-(2-ホルミル-1H-ピロール-1-イル)-3-シアノピリジンを得た。

2-(2-ホルミル-1H-ピロール-1-イル)-3-シアノピリジン



10

20

30

40

50

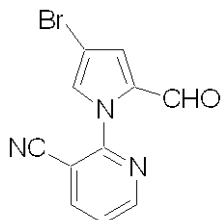
^1H -NMR (CDCl₃, TMS) (ppm): 6.53 (1H, dd, J = 4 Hz, 3 Hz), 7.22 (1H, dd, J = 4 Hz, 2 Hz), 7.29 - 7.31 (1H, m), 7.51 (1H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 8.12 (1H, dd, J = 8 Hz, 2 Hz), 8.74 (1H, dd, J = 5 Hz, 2 Hz) 9.65 (1H, s)

【1001】

参考製造例 131 - (2)

3 - クロロ - 2 - (2 - ホルミル - 1H - ピロール - 1 - イル) ピリジンの代わりに、2 - (2 - ホルミル - 1H - ピロール - 1 - イル) - 3 - シアノピリジンをを用い、参考製造例 71 - (3) と同様の方法で、2 - (4 - ブロモ - 2 - ホルミル - 1H - ピロール - 1 - イル) ニコチノニトリルを得た。

2 - (4 - ブロモ - 2 - ホルミル - 1H - ピロール - 1 - イル) - 3 - シアノピリジン



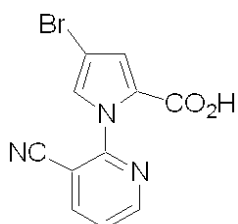
^1H -NMR (CDCl₃, TMS) (ppm): 7.18 (1H, d, J = 2 Hz), 7.29 (1H, d, J = 2 Hz), 7.54 (1H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 8.13 (1H, dd, J = 8 Hz, 2 Hz), 8.74 (1H, dd, J = 5 Hz, 2 Hz), 9.59 (1H, s)

【1002】

参考製造例 131 - (3)

4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - カルボアルデヒドの代わりに 2 - (4 - ブロモ - 2 - ホルミル - 1H - ピロール - 1 - イル) - 3 - シアノピリジンをを用い、参考製造例 71 - (4) と同様の方法で、4 - ブロモ - 1 - (3 - シアノ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - カルボン酸を得た。

4 - ブロモ - 1 - (3 - シアノ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - カルボン酸



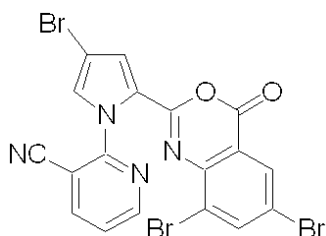
^1H -NMR (DMSO-d₆, TMS) (ppm): 7.10 (1H, d, J = 2 Hz), 7.65 (1H, d, J = 2 Hz), 7.75 (1H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 8.55 (1H, dd, J = 8 Hz, 2 Hz), 8.82 (1H, dd, J = 5 Hz, 2 Hz)

【1003】

参考製造例 131 - (4)

4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - カルボン酸の代わりに、4 - ブロモ - 1 - (3 - シアノ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - カルボン酸を用い、2 - アミノ - 5 - クロロ - 3 - メチル安息香酸の代わりに 2 - アミノ - 3, 5 - ジブロモ安息香酸を用いて参考製造例 71 - (5) と同様の方法で、6, 8 - ジブロモ - 2 - [4 - ブロモ - 1 - (3 - シアノ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - イル] - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを得た。

6, 8 - ジブロモ - 2 - [4 - ブロモ - 1 - (3 - シアノ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - イル] - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン



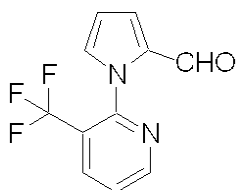
^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 7.39 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.77 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 5 Hz), 7.81 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 8.14 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 8.21 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 8.58 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 2 Hz), 8.83 (1H, dd, $J = 5\text{ Hz}$, 2 Hz) 10

【1004】

参考製造例 132 - (1)

2-フルオロピリジンの代わりに、2-クロロ-3-トリフルオロメチルピリジンを用い、参考製造例 129 - (1) と同様の方法で、1-(3-トリフルオロメチル-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-カルボアルデヒドを得た。

1-(3-トリフルオロメチル-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-カルボアルデヒド



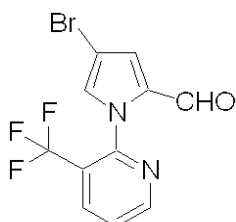
^1H -NMR (CDCl $_3$, TMS) (ppm): 6.47 (1H, dd, $J = 4\text{ Hz}$, 3 Hz), 7.12 - 7.14 (2H, m), 7.59 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 5 Hz), 8.18 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.75 (1H, d, $J = 5\text{ Hz}$), 9.54 (1H, d, $J = 1\text{ Hz}$) 20

【1005】

参考製造例 132 - (2)

3-クロロ-2-(2-ホルミル-1H-ピロール-1-イル)ピリジンの代わりに、1-(3-トリフルオロメチル-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-カルボアルデヒドを用い、参考製造例 71 - (3) と同様の方法で、4-ブromo-1-(3-トリフルオロメチル-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-カルボアルデヒドを得た。

4-ブromo-1-(3-トリフルオロメチル-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-カルボアルデヒド



^1H -NMR (CDCl $_3$, TMS) (ppm): 7.11 (2H, s), 7.62 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 5 Hz), 8.18 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.74 (1H, d, $J = 5\text{ Hz}$), 9.47 (1H, s) 40

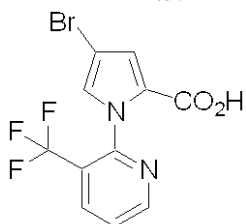
【1006】

参考製造例 132 - (3)

4-ブromo-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-カルボアルデヒドの代わりに、4-ブromo-1-(3-トリフルオロメチル-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-カルボアルデヒドを用い、参考製造例 71 - (4) と同様の方法で、 50

4 - ブロモ - 1 - (3 - トリフルオロメチル - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸を得た。

4 - ブロモ - 1 - (3 - トリフルオロメチル - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸



10

^1H - NMR (DMSO - d_6 , TMS) (ppm) : 7 . 0 2 (1 H , d , J = 2 H z) , 7 . 5 6 (1 H , d , J = 2 H z) , 7 . 8 0 (1 H , dd , J = 7 H z , 5 H z) , 8 . 4 2 (1 H , d , J = 7 H z) , 8 . 8 2 (1 H , d , J = 5 H z) , 1 2 . 6 6 (1 H , br s)

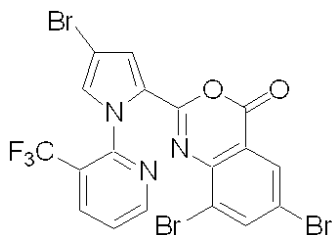
【 1 0 0 7 】

参考製造例 1 3 2 - (4)

4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸の代わりに、4 - ブロモ - 1 - (3 - トリフルオロメチル - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸を用い、2 - アミノ - 5 - クロロ - 3 - メチル安息香酸の代わりに、2 - アミノ - 3 , 5 - ジブromo安息香酸を用いて参考製造例 7 1 - (5) と同様の方法で、6 , 8 - ジブromo - 2 - [4 - ブロモ - 1 - (3 - トリフルオロメチル - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - イル] - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを得た。

20

6 , 8 - ジブromo - 2 - [4 - ブロモ - 1 - (3 - トリフルオロメチル - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - イル] - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン



30

^1H - NMR (DMSO - d_6 , TMS) (ppm) : 7 . 3 4 (1 H , s) , 7 . 7 1 (1 H , s) , 7 . 8 3 (1 H , dd , J = 8 H z , 5 H z) , 8 . 1 0 (1 H , d , J = 2 H z) , 8 . 1 9 (1 H , d , J = 2 H z) , 8 . 4 8 (1 H , d , J = 8 H z) , 8 . 8 4 (1 H , d , J = 5 H z)

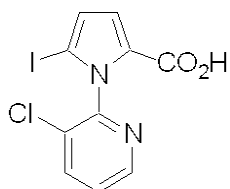
【 1 0 0 8 】

参考製造例 1 3 3 - (1)

4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボアルデヒドの代わりに、1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 5 - ヨード - 1 H - ピロール - 2 - カルボアルデヒドを用い、参考製造例 7 1 - (4) と同様の方法で、1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 5 - ヨード - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸を得た。

40

1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 5 - ヨード - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸



^1H - NMR (DMSO - d_6 , TMS) (ppm) : 6 . 6 3 (1 H , d , J = 4 H z

50

), 6.97 (1H, d, J = 4 Hz), 7.62 (1H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 8.20 (1H, d, J = 8 Hz), 8.56 (1H, d, J = 5 Hz), 12.43 (1H, brs)

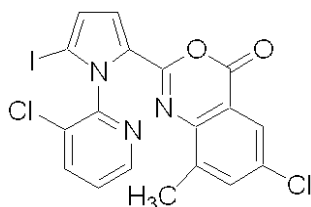
【1009】

参考製造例 133 - (2)

4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - カルボン酸の代わりに、1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 5 - ヨード - 1H - ピロール - 2 - カルボン酸を用い、参考製造例 71 - (5) と同様の方法で、6 - クロロ - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 5 - ヨード - 1H - ピロール - 2 - イル] - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを得た。

10

6 - クロロ - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 5 - ヨード - 1H - ピロール - 2 - イル] - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン



¹H - NMR (DMSO - d₆, TMS) (ppm): 1.65 (3H, s), 6.82 (1H, d, J = 3 Hz), 7.23 (1H, d, J = 3 Hz), 7.67 (1H, s), 7.71 (1H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 7.81 (1H, s), 8.32 (1H, d, J = 8 Hz), 8.65 (1H, d, J = 5 Hz)

20

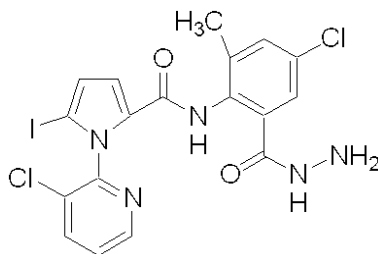
【1010】

参考製造例 133 - (3)

2 - [4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - イル] - 6 - クロロ - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンの代わりに、6 - クロロ - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 5 - ヨード - 1H - ピロール - 2 - イル] - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを用い、参考製造例 71 - (6) と同様の方法で、N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 5 - ヨード - 1H - ピロール - 2 - カルボキサミドを得た。

30

N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 5 - ヨード - 1H - ピロール - 2 - カルボキサミド



40

¹H - NMR (CDCl₃, TMS) (ppm): 2.16 (3H, s), 4.02 (2H, brs), 6.66 (1H, s), 7.05 (1H, s), 7.19 (1H, s), 7.24 (1H, s), 7.37 (1H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 7.50 (1H, brs), 7.86 (1H, d, J = 8 Hz), 8.49 (1H, d, J = 5 Hz), 9.28 (1H, brs)

【1011】

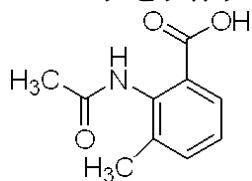
参考製造例 134 - (1)

2 - アミノ - 3 - メチル安息香酸 1.51 g、無水酢酸 1.0 g およびテトラヒドロフラン 20 ml を混合し、該混合物を 80 で 13 時間攪拌した。室温まで放冷した反応混合物を水に注加した後、酢酸エチルで 2 回抽出した。有機層を合わせて水および飽和食塩

50

水で順次洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。得られた残渣を酢酸エチルで洗浄することにより、2 - アセチルアミノ - 3 - メチル安息香酸 0.72 g を得た。

2 - アセチルアミノ - 3 - メチル安息香酸



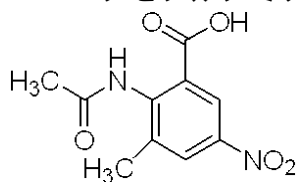
$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 2.00 (3H, s), 2.19 (3H, s), 7.21 (1H, t, $J = 8\text{ Hz}$), 7.41 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 7.58 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 9.47 (1H, brs) 10

【1012】

参考製造例 134 - (2)

2 - アセチルアミノ - 3 - メチル安息香酸 0.72 g および濃硫酸 8 ml の混合物に発煙硝酸 1.6 g を室温で滴下した。該混合物を室温で 2 時間攪拌した後、反応混合物を氷水に注加した。析出した沈殿を濾取することにより、2 - アセチルアミノ - 3 - メチル - 5 - ニトロ安息香酸 0.45 g を得た。

2 - アセチルアミノ - 3 - メチル - 5 - ニトロ安息香酸



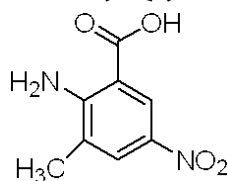
$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 2.06 (3H, s), 2.34 (3H, s), 8.31 (2H, s), 9.93 (1H, brs) 20

【1013】

参考製造例 134 - (3)

2 - アセチルアミノ - 3 - メチル - 5 - ニトロ安息香酸 0.45 g、水酸化カリウム 0.45 g、メタノール 5 ml および水 20 ml を混合し、該混合物を 80 で 2 時間加熱還流した。室温まで放冷した反応混合物に水を注加した後、2N塩酸を加えて、pHが3になるように調整した。析出した沈殿を濾取することにより、2 - アミノ - 3 - メチル - 5 - ニトロ安息香酸 0.28 g を得た。 30

2 - アミノ - 3 - メチル - 5 - ニトロ安息香酸



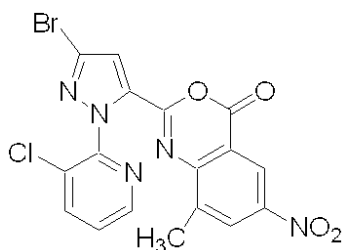
$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 2.19 (3H, s), 7.99 (1H, s), 8.56 (1H, s) 40

【1014】

参考製造例 134 - (4)

2 - アミノ - 3, 5 - ジブromo安息香酸の代わりに、2 - アミノ - 3 - メチル - 5 - ニトロ安息香酸を用い、参考製造例 46 - (1) と同様の方法で、2 - [3 - プロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - メチル - 6 - ニトロ - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを得た。

2 - [3 - プロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - メチル - 6 - ニトロ - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン



^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 1.81 (3H, s), 7.64 (1H, s), 7.79 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 4 Hz), 8.38 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.48 (1H, s), 8.55 (1H, s), 8.64 (1H, d, $J = 4\text{ Hz}$)

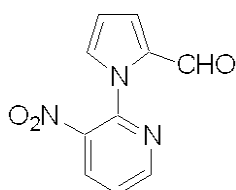
10

【1015】

参考製造例 135 - (1)

2-フルオロピリジンの代わりに、2-クロロ-3-ニトロピリジンを用い、参考製造例 129 - (1) と同様の方法で、1-(3-ニトロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-カルボアルデヒドを得た。

1-(3-ニトロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-カルボアルデヒド



20

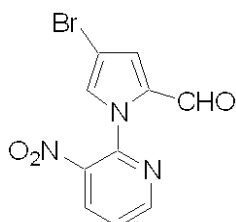
^1H -NMR (CDCl $_3$, TMS) (ppm): 6.54 (1H, dd, $J = 4\text{ Hz}$, 3 Hz), 7.18 (1H, dd, $J = 4\text{ Hz}$, 2 Hz), 7.34 - 7.35 (1H, m), 7.60 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 5 Hz), 8.51 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 2 Hz), 8.75 (1H, dd, $J = 5\text{ Hz}$, 2 Hz), 9.48 (1H, d, $J = 1\text{ Hz}$)

【1016】

参考製造例 135 - (2)

3-クロロ-2-(2-ホルミル-1H-ピロール-1-イル)ピリジンの代わりに、1-(3-ニトロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-カルボアルデヒドを用い、参考製造例 71 - (3) と同様の方法で、4-ブロモ-1-(3-ニトロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-カルボアルデヒドを得た。

4-ブロモ-1-(3-ニトロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-カルボアルデヒド



40

^1H -NMR (CDCl $_3$, TMS) (ppm): 7.14 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.33 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.63 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 5 Hz), 8.53 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 2 Hz), 8.75 (1H, dd, $J = 5\text{ Hz}$, 2 Hz), 9.42 (1H, s)

【1017】

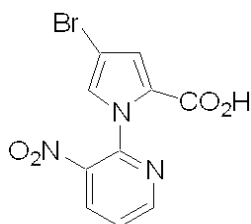
参考製造例 135 - (3)

4-ブロモ-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-カルボアルデヒドの代わりに、4-ブロモ-1-(3-ニトロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール

50

- 2 - カルボアルデヒドを用い、参考製造例 7 1 - (4) と同様の方法で、4 - ブロモ - 1 - (3 - ニトロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸を得た。

4 - ブロモ - 1 - (3 - ニトロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸



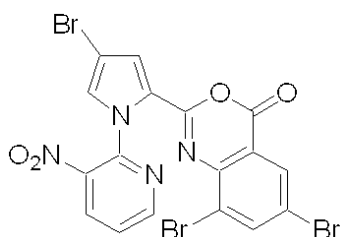
^1H - NMR (DMSO - d_6 , TMS) (ppm) : 7 . 0 5 (1 H , d , J = 2 H z) , 7 . 6 0 (1 H , d , J = 2 H z) , 7 . 8 4 (1 H , dd , J = 8 H z , 5 H z) , 8 . 6 8 (1 H , d , J = 8 H z , 2 H z) , 8 . 8 4 (1 H , d , J = 5 H z , 2 H z)

【 1 0 1 8 】

参考製造例 1 3 5 - (4)

4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸の代わりに、4 - ブロモ - 1 - (3 - ニトロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸を用い、2 - アミノ - 5 - クロロ - 3 - メチル安息香酸の代わりに、2 - アミノ - 3 , 5 - ジブromo安息香酸を用いて参考製造例 7 1 - (5) と同様の方法で、6 , 8 - ジブromo - 2 - [4 - ブロモ - 1 - (3 - ニトロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - イル] - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを得た。

6 , 8 - ジブromo - 2 - [4 - ブロモ - 1 - (3 - ニトロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - イル] - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン



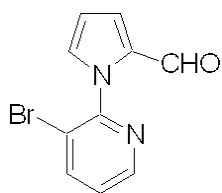
^1H - NMR (DMSO - d_6 , TMS) (ppm) : 7 . 3 8 (1 H , d , J = 2 H z) , 7 . 8 0 (1 H , d , J = 2 H z) , 7 . 9 2 (1 H , dd , J = 8 H z , 5 H z) , 8 . 1 1 (1 H , d , J = 2 H z) , 8 . 2 6 (1 H , d , J = 2 H z) , 8 . 8 4 (1 H , d , J = 8 H z) , 8 . 6 5 (1 H , d , J = 5 H z)

【 1 0 1 9 】

参考製造例 1 3 6 - (1)

2 - フルオロピリジンの代わりに、3 - ブロモ - 2 - クロロピリジンを用い、参考製造例 1 2 9 - (1) と同様の方法で、1 - (3 - ブロモ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボアルデヒドを得た。

1 - (3 - ブロモ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボアルデヒド



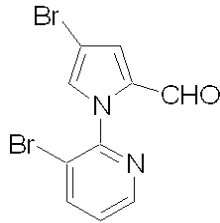
^1H - NMR (CDCl₃ , TMS) (ppm) : 6 . 4 8 (1 H , dd , J = 4 H z , 3 H z) , 7 . 1 0 - 7 . 1 7 (2 H , m) , 7 . 3 1 (1 H , dd , J = 8 H z , 5 H z) , 8 . 0 5 (1 H , dd , J = 8 H z , 2 H z) , 8 . 5 1 (1 H , dd , J = 5 H z , 2 H z) , 9 . 5 7 (1 H , s)

【 1 0 2 0 】

参考製造例 1 3 6 - (2)

3 - クロロ - 2 - (2 - ホルミル - 1 H - ピロール - 1 - イル) ピリジンの代わりに、1 - (3 - ブロモ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボアルデヒドを用い、参考製造例 7 1 - (3) と同様の方法で、4 - ブロモ - 1 - (3 - ブロモ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボアルデヒドを得た。

4 - ブロモ - 1 - (3 - ブロモ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボアルデヒド



10

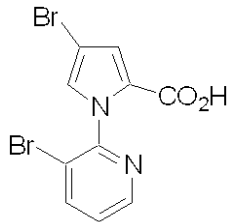
^1H - NMR (CDCl_3 , TMS) (ppm) : 7 . 1 1 - 7 . 1 4 (2 H , m) , 7 . 3 3 (1 H , dd , $J = 8 \text{ Hz}$, 5 Hz) , 8 . 0 6 (1 H , dd , $J = 8 \text{ Hz}$, 2 Hz) , 8 . 5 0 (1 H , dd , $J = 5 \text{ Hz}$, 2 Hz) , 9 . 5 0 (1 H , d , $J = 1 \text{ Hz}$)

【 1 0 2 1 】

参考製造例 1 3 6 - (3)

4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボアルデヒドの代わりに 4 - ブロモ - 1 - (3 - ブロモ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボアルデヒドを用い、参考製造例 7 1 - (4) と同様の方法で、4 - ブロモ - 1 - (3 - ブロモ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸を得た。

4 - ブロモ - 1 - (3 - ブロモ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸



30

^1H - NMR ($\text{DMSO}-d_6$, TMS) (ppm) : 7 . 0 1 (1 H , s) , 7 . 4 8 - 7 . 5 1 (2 H , m) , 8 . 2 8 (1 H , d , $J = 8 \text{ Hz}$) , 8 . 5 2 (1 H , d , $J = 5 \text{ Hz}$) , 1 2 . 6 7 (1 H , br s)

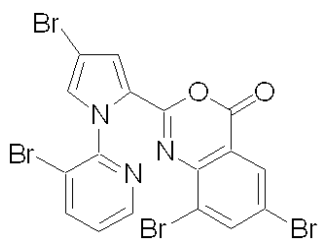
【 1 0 2 2 】

参考製造例 1 3 6 - (4)

4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸の代わりに、4 - ブロモ - 1 - (3 - ブロモ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸を用い、2 - アミノ - 5 - クロロ - 3 - メチル安息香酸の代わりに 2 - アミノ - 3 , 5 - ジブロモ安息香酸を用いて参考製造例 7 1 - (5) と同様の方法で、6 , 8 - ジブロモ - 2 - [4 - ブロモ - 1 - (3 - ブロモ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - イル] - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを得た。

6 , 8 - ジブロモ - 2 - [4 - ブロモ - 1 - (3 - ブロモ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - イル] - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン

40



^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 7.33 (1H, s), 7.53 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 5 Hz), 7.72 (1H, s), 8.12 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 8.27 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 8.36 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.57 (1H, d, $J = 5\text{ Hz}$)

10

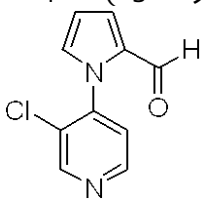
【1023】

参考製造例 137 - (1)

2-ピロールカルバルデヒド 2.0 g、3,4-ジクロロピリジン 3.0 g、炭酸セシウム 8.0 g および N-メチルピロリドン 30 ml の混合物を 120 で 25 時間攪拌した。室温まで放冷した反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで 2 回抽出した。有機層を合わせて水および飽和食塩水で順次洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、1-(3-クロロ-4-ピリジニル)-1H-ピロール-2-カルバルデヒド 2.95 g を得た。

1-(3-クロロ-4-ピリジニル)-1H-ピロール-2-カルバルデヒド

20



^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 6.55 (1H, dd, $J = 4\text{ Hz}$, 3 Hz), 7.33 (1H, dd, $J = 4\text{ Hz}$, 2 Hz), 7.44 (1H, dd, $J = 3\text{ Hz}$, 2 Hz , 1 Hz), 7.60 (1H, d, $J = 5\text{ Hz}$), 8.66 (1H, d, $J = 5\text{ Hz}$), 8.83 (1H, s), 9.52 (1H, d, $J = 1\text{ Hz}$)

【1024】

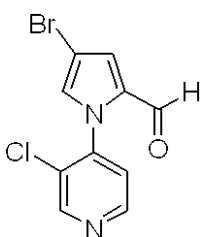
30

参考製造例 137 - (2)

1-(3-クロロ-4-ピリジニル)-1H-ピロール-2-カルバルデヒド 2.95 g を N,N-ジメチルホルムアミド 20 ml に溶解し、N-プロモコハク酸イミド 2.66 g を加えた。該混合物を室温で 10 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、析出した沈殿を濾取することにより、4-プロモ-1-(3-クロロ-4-ピリジニル)-1H-ピロール-2-カルバルデヒド 1.2 g を得た。

4-プロモ-1-(3-クロロ-4-ピリジニル)-1H-ピロール-2-カルバルデヒド

40



^1H -NMR (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 7.44 - 7.46 (1H, m), 7.66 (1H, d, $J = 5\text{ Hz}$), 7.69 - 7.72 (1H, m), 8.68 (1H, d, $J = 5\text{ Hz}$), 8.85 (1H, s), 9.47 (1H, s)

【1025】

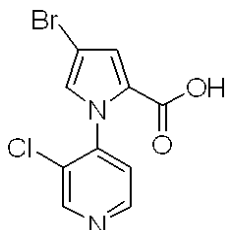
参考製造例 137 - (3)

4-プロモ-1-(3-クロロ-4-ピリジニル)-1H-ピロール-2-カルバルデ

50

ヒド 1.2 g とアセトン 30 ml との混合物を 40 に保ちながら、ここに過マンガン酸カリウム 2.0 g を 10 ml の水に溶解した水溶液を滴下した後、この混合物を 60 で 1 時間攪拌した。析出物を濾去して得られた濾液に 2 N 水酸化ナトリウム水溶液を加えて、pH を 10 - 12 となるように調整してから、クロロホルムで 2 回洗浄した。水層の pH が 3 付近になるまで 2 N 塩酸を注加し、酢酸エチルで 2 回抽出した。有機層を合わせて水および飽和食塩水で順次洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、減圧下濃縮することにより、4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 4 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸 0.43 g を得た。

4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 4 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸



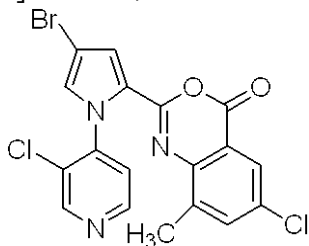
^1H - NMR (DMSO - d_6 , TMS) (ppm): 7.07 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.47 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.63 (1H, d, $J = 5\text{ Hz}$), 8.65 (1H, d, $J = 5\text{ Hz}$), 8.81 (1H, s)

【1026】

参考製造例 137 - (4)

4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸の代わりに、4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 4 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸を用い、参考製造例 71 - (5) と同様の方法で、2 - [4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 4 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - イル] - 6 - クロロ - 8 - メチル - 4 H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを得た。

2 - [4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 4 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - イル] - 6 - クロロ - 8 - メチル - 4 H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン



^1H - NMR (DMSO - d_6 , TMS) (ppm): 1.63 (3H, s), 7.33 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.68 - 7.74 (3H, m), 7.85 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 8.73 (1H, d, $J = 5\text{ Hz}$), 8.91 (1H, s)

【1027】

参考製造例 137 - (5)

2 - [4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - イル] - 6 - クロロ - 8 - メチル - 4 H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンの代わりに、2 - [4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 4 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - イル] - 6 - クロロ - 8 - メチル - 4 H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを用い、参考製造例 71 - (6) と同様の方法で、4 - ブロモ - N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 4 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボキサミドを得た。

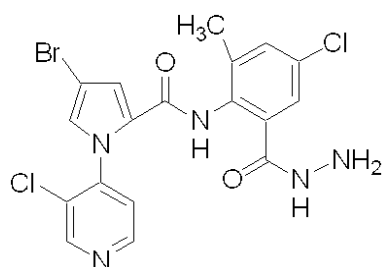
4 - ブロモ - N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 4 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボキサミド

10

20

30

40



$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 2.15 (3H, s), 4.39 (2H, brs), 7.27 - 7.31 (2H, m), 7.42 - 7.46 (2H, m), 7.56 (1H, d, $J = 5\text{ Hz}$), 8.60 (1H, d, $J = 5\text{ Hz}$), 8.72 (1H, s), 9.54 (1H, brs), 9.87 (1H, brs)

10

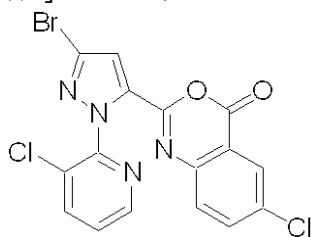
【1028】

参考製造例 138 - (1)

2 - アミノ - 3, 5 - ジブromo安息香酸の代わりに、2 - アミノ - 5 - クロロ安息香酸を用い、参考製造例 46 - (1) と同様の方法で、2 - [3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピラゾール - 5 - イル] - 6 - クロロ - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを得た。

2 - [3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピラゾール - 5 - イル] - 6 - クロロ - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン

20



$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 7.01 (1H, d, $J = 9\text{ Hz}$), 7.53 (1H, s), 7.78 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 5 Hz), 7.88 (1H, dd, $J = 9\text{ Hz}$, 3 Hz), 8.06 (1H, d, $J = 3\text{ Hz}$), 8.32 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 1 Hz), 8.60 (1H, dd, $J = 5\text{ Hz}$, 1 Hz).

30

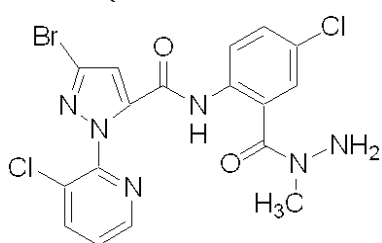
【1029】

参考製造例 139

2 - [3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピラゾール - 5 - イル] - 6 - クロロ - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンの代わりに、2 - [3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピラゾール - 5 - イル] - 6 - クロロ - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを用い、参考製造例 84 と同様の方法で、3 - ブロモ - N - [4 - クロロ - 2 - (N - メチルヒドラジノカルボニル) フェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピラゾール - 5 - カルボキサミドを得た。

3 - ブロモ - N - [4 - クロロ - 2 - (N - メチルヒドラジノカルボニル) フェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド

40



$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 2.88 (0.6H, s), 3.10 (2.4H, s), 4.71 (1.6H, s), 5.01 (0.4H, s), 7.

50

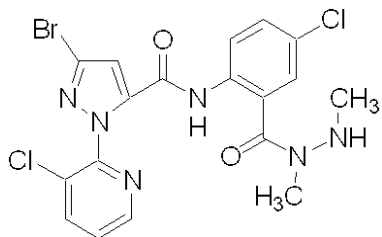
2.9 - 7.34 (1.0H, br m), 7.38 - 7.52 (3.0H, m), 7.65 (1.0H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 8.22 (1.0H, dd, J = 8 Hz, 2 Hz), 8.52 (1.0H, dd, J = 5 Hz, 2 Hz), 10.40 - 10.50 (1.0H, br m).

【1030】

参考製造例 140

2 - [3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピラゾール - 5 - イル] - 6 - クロロ - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンの代わりに、2 - [3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピラゾール - 5 - イル] - 6 - クロロ - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを用い、参考製造例 88 と同様の方法で、3 - ブロモ - N - [4 - クロロ - 2 - (N, N' - ジメチルヒドラジノカルボニル)フェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピラゾール - 5 - カルボキサミドを得た。

3 - ブロモ - N - [4 - クロロ - 2 - (N, N' - ジメチルヒドラジノカルボニル)フェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド



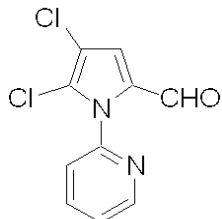
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) (ppm): 2.69 (3H, br s), 3.28 (3H, s), 6.92 (1H, s), 7.30 - 7.46 (3H, m), 7.91 (1H, dd, J = 8 Hz, 2 Hz), 8.17 (1H, d, J = 9 Hz), 8.49 (1H, dd, J = 5 Hz, 2 Hz), 10.29 (1H, br s).

【1031】

参考製造例 141 - (1)

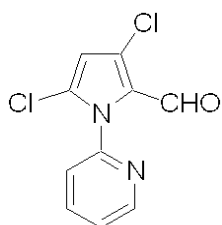
3 - クロロ - 2 - (2 - ホルミル - 1H - ピロール - 1 - イル)ピリジンの代わりに、2 - (2 - ホルミル - 1H - ピロール - 1 - イル)ピリジンを用い、参考製造例 100 - (1) と同様の方法で、4, 5 - ジクロロ - 1 - (2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - カルボアルデヒドおよび、3, 5 - ジクロロ - 1 - (2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - カルボアルデヒドを得た。

4, 5 - ジクロロ - 1 - (2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - カルボアルデヒド



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) (ppm): 7.08 (1H, s), 7.38 - 7.41 (1H, m), 7.47 - 7.50 (1H, m), 7.91 - 7.95 (1H, m), 8.63 - 8.65 (1H, m), 9.40 (1H, s)

3, 5 - ジクロロ - 1 - (2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - カルボアルデヒド



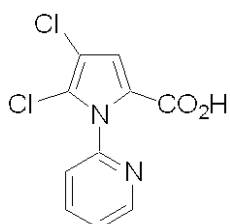
^1H -NMR (CDCl₃, TMS) (ppm): 6.35 (1H, s), 7.33 - 7.36 (1H, m), 7.45 - 7.48 (1H, m), 7.89 - 7.93 (1H, m), 8.61 - 8.62 (1H, m), 9.64 (1H, s)

【1032】

参考製造例 141 - (2)

4 - プロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - カルボアルデヒドの代わりに、4, 5 - ジクロロ - 1 - (2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - カルボアルデヒドを用い、参考製造例 71 - (4) と同様の方法で、4, 5 - ジクロロ - 1 - (2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - カルボン酸を得た。

4, 5 - ジクロロ - 1 - (2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - カルボン酸



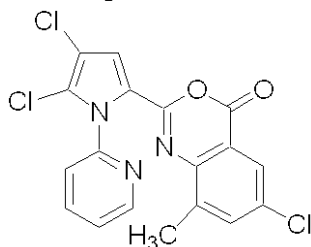
^1H -NMR (DMSO-d₆, TMS) (ppm): 7.11 (1H, s), 7.56 - 7.58 (2H, m), 8.03 (1H, td, J = 8 Hz, 2 Hz), 8.58 (1H, dd, J = 4 Hz, 2 Hz)

【1033】

参考製造例 141 - (3)

4 - プロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - カルボン酸の代わりに、4, 5 - ジクロロ - 1 - (2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - カルボン酸を用い、参考製造例 71 - (5) と同様の方法で、6 - クロロ - 2 - [4, 5 - ジクロロ - 1 - (2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - イル] - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを得た。

6 - クロロ - 2 - [4, 5 - ジクロロ - 1 - (2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - イル] - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン



^1H -NMR (DMSO-d₆, TMS) (ppm): 2.07 (3H, s), 7.35 (1H, s), 7.62 - 7.67 (3H, m), 7.81 (1H, s), 8.11 (1H, t, J = 8 Hz), 8.65 (1H, d, J = 5 Hz)

【1034】

参考製造例 141 - (4)

2 - [4 - プロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - イル] - 6 - クロロ - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンの代わりに、6 - クロロ - 2 - [4, 5 - ジクロロ - 1 - (2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - イル] - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを用い、参考製造例 7

10

20

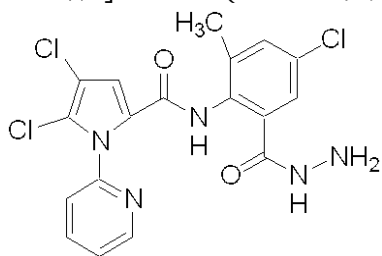
30

40

50

1 - (6) と同様の方法で、4, 5 - ジクロロ - N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - カルボキサミドを得た。

4, 5 - ジクロロ - N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - カルボキサミド



10

^1H - NMR (CDCl₃, TMS) (ppm): 2.16 (3H, s), 7.01 (1H, s), 7.25 (2H, s), 7.36 - 7.41 (2H, m), 7.87 (1H, td, J = 8 Hz, 2 Hz), 7.95 (1H, brs), 8.55 - 8.57 (1H, m), 9.42 (1H, brs)

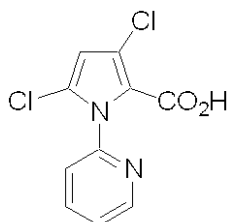
【1035】

参考製造例 142 - (1)

4 - プロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - カルボアルデヒドの代わりに、3, 5 - ジクロロ - 1 - (2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - カルボアルデヒドを用い、参考製造例 71 - (4) と同様の方法で、3, 5 - ジクロロ - 1 - (2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - カルボン酸を得た。

20

3, 5 - ジクロロ - 1 - (2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - カルボン酸



^1H - NMR (DMSO - d₆, TMS) (ppm): 6.64 (1H, s), 7.53 - 7.57 (2H, m), 8.02 (1H, td, J = 8 Hz, 2 Hz), 8.55 - 8.57 (1H, m)

30

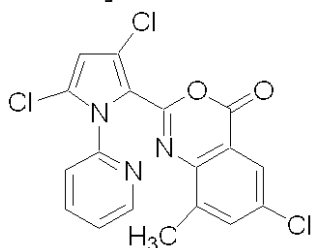
【1036】

参考製造例 142 - (2)

4 - プロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - カルボン酸の代わりに、3, 5 - ジクロロ - 1 - (2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - カルボン酸を用い、参考製造例 71 - (5) と同様の方法で、6 - クロロ - 2 - [3, 5 - ジクロロ - 1 - (2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - イル] - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを得た。

6 - クロロ - 2 - [3, 5 - ジクロロ - 1 - (2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - イル] - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン

40



^1H - NMR (DMSO - d₆, TMS) (ppm): 1.82 (3H, s), 6.97 (1H, s), 7.60 - 7.70 (3H, m), 7.81 - 7.83 (1H, m), 8

50

. 04 - 8.12 (1H, m), 8.58 (1H, d, J = 6 Hz)

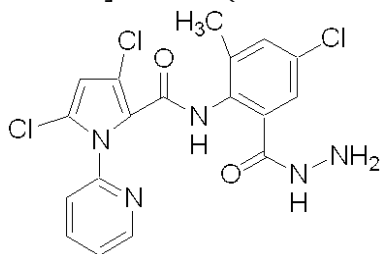
【1037】

参考製造例 142 - (3)

2 - [4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - イル] - 6 - クロロ - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンの代わりに、6 - クロロ - 2 - [3, 5 - ジクロロ - 1 - (2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - イル] - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを用い、参考製造例 71 - (6) と同様の方法で、3, 5 - ジクロロ - N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - カルボキサミドを得た。

10

3, 5 - ジクロロ - N - [4 - クロロ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) - 6 - メチルフェニル] - 1 - (2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - カルボキサミド



^1H - NMR (CDCl₃, TMS) (ppm): 2.14 (3H, s), 6.26 (1H, s), 7.20 - 7.23 (2H, s), 7.28 - 7.34 (2H, m), 7.61 - 7.65 (1H, m), 7.76 - 7.81 (1H, m), 8.49 (1H, brs), 8.79 (1H, brs)

20

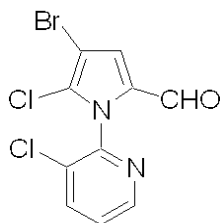
【1038】

参考製造例 143 - (1)

3 - クロロ - 2 - (4 - ブロモ - 2 - ホルミル - 1H - ピロール - 1 - イル)ピリジン 3.0 g をテトラヒドロフラン 30 ml に溶解し、N - クロロコハク酸イミド 1.5 g を加えた。該混合物を室温で2日間攪拌した。反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで2回抽出した。有機層を合わせ、飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、4 - ブロモ - 5 - クロロ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - カルボアルデヒド 2.5 g を得た。

30

4 - ブロモ - 5 - クロロ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - カルボアルデヒド



40

^1H - NMR (CDCl₃, TMS) (ppm): 7.12 (1H, s), 7.47 (1H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 7.94 (1H, dd, J = 8 Hz, 2 Hz), 8.53 (1H, dd, J = 5 Hz, 2 Hz), 9.38 (1H, s)

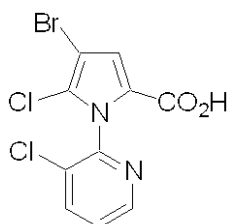
【1039】

参考製造例 143 - (2)

4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - カルボアルデヒドの代わりに、4 - ブロモ - 5 - クロロ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - カルボアルデヒドを用い、参考製造例 71 - (4) と同様の方法で、4 - ブロモ - 5 - クロロ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピロール - 2 - カルボン酸を得た。

50

4 - ブロモ - 5 - クロロ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸



^1H - NMR (DMSO - d_6 , TMS) (ppm) : 7 . 2 0 (1 H , s) , 7 . 6 7 (1 H , dd , J = 8 Hz , 5 Hz) , 8 . 2 5 (1 H , dd , J = 8 Hz , 2 Hz) , 8 . 5 8 (1 H , dd , J = 5 Hz , 2 Hz) , 1 2 . 9 9 (1 H , brs)

10

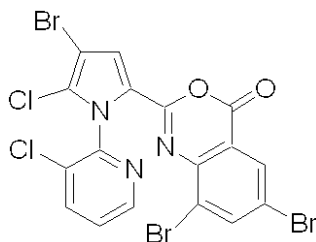
【 1 0 4 0 】

参考製造例 1 4 3 - (3)

4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸の代わりに、4 - ブロモ - 5 - クロロ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸を用い、2 - アミノ - 5 - クロロ - 3 - メチル安息香酸の代わりに、2 - アミノ - 3 , 5 - ジブロモ安息香酸を用いて参考製造例 7 1 - (5) と同様の方法で、2 - [4 - ブロモ - 5 - クロロ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - イル] - 6 , 8 - ジブロモ - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを得た。

20

2 - [4 - ブロモ - 5 - クロロ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - イル] - 6 , 8 - ジブロモ - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン



^1H - NMR (CDCl $_3$, TMS) (ppm) : 7 . 4 9 (1 H , s) , 7 . 7 1 (1 H , dd , J = 8 Hz , 5 Hz) , 8 . 1 1 (1 H , d , J = 2 Hz) , 8 . 2 6 (1 H , d , J = 2 Hz) , 8 . 3 4 (1 H , dd , J = 8 Hz , 1 Hz) , 8 . 6 3 (1 H , dd , J = 5 Hz , 1 Hz)

30

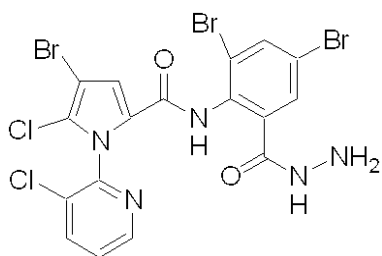
【 1 0 4 1 】

参考製造例 1 4 3 - (4)

2 - [4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - イル] - 6 - クロロ - 8 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンの代わりに、2 - [4 - ブロモ - 5 - クロロ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - イル] - 6 , 8 - ジブロモ - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを用い、参考製造例 7 1 - (6) と同様の方法で、4 - ブロモ - N - [4 , 6 - ジブロモ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) フェニル] - 5 - クロロ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボキサミドを得た。

40

4 - ブロモ - N - [4 , 6 - ジブロモ - 2 - (ヒドラジノカルボニル) フェニル] - 5 - クロロ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボキサミド



^1H -NMR (CDCl_3 , TMS) (ppm): 7.21 (1H, s), 7.39 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}, 5\text{ Hz}$), 7.42 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.70 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.88 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}, 2\text{ Hz}$), 8.49 (1H, dd, $J = 5\text{ Hz}, 2\text{ Hz}$), 8.71 (1H, s)

10

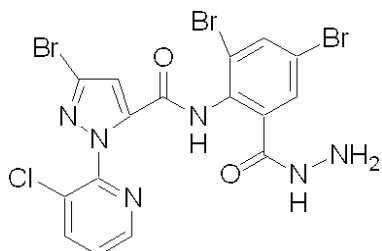
【1042】

参考製造例 144

2-[3-ブromo-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-イル]-6,8-ジブromo-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オン 8.42 g、ヒドラジン 1 水和物 3.0 g およびテトラヒドロフラン 60 ml を氷冷下混合し、該混合物を室温で 3 時間攪拌した。析出した沈殿を濾取した後、テトラヒドロフランおよびメチル tert-ブチルエーテルで順次洗浄することにより、3-ブromo-N-[4,6-ジブromo-2-(ヒドラジノカルボニル)フェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド 4.85 g を得た。

20

3-ブromo-N-[4,6-ジブromo-2-(ヒドラジノカルボニル)フェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド



^1H -NMR ($\text{DMSO}-d_6$, TMS) (ppm): 4.35 (2H, brs), 7.42 (1H, s), 7.58-7.62 (2H, m), 8.07 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 8.16 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}, 2\text{ Hz}$), 8.50 (1H, dd, $J = 5\text{ Hz}, 2\text{ Hz}$), 9.61 (1H, brs)

30

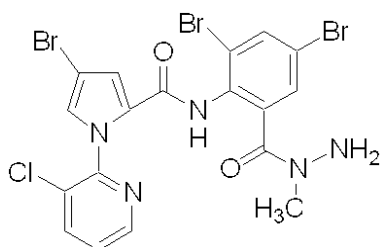
【1043】

参考製造例 145

6,8-ジブromo-2-[4-ブromo-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-イル]-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オン 0.50 g、メチルヒドラジン 0.15 ml およびテトラヒドロフラン 8 ml を混合し、該混合物を室温で 20 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を水および飽和食塩水で順次水洗した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付して、4-ブromo-N-[4,6-ジブromo-2-(N-メチルヒドラジノカルボニル)フェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-カルボキサミド 0.39 g を得た。

40

4-ブromo-N-[4,6-ジブromo-2-(N-メチルヒドラジノカルボニル)フェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-カルボキサミド



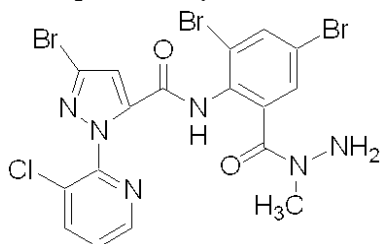
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) (ppm): 2.96 (1.5H, s), 3.15 (1.5H, s), 4.05 (1.0H, s), 4.48 (1.0H, s), 7.03 (1.0H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.18 (0.5H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.21 (0.5H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.29 - 7.34 (2.0H, m), 7.63 (0.5H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.68 (0.5H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.79 - 7.83 (1.0H, m), 8.40 - 8.44 (1.0H, m), 8.67 (0.5H, s), 8.77 (0.5H, s)

【1044】

参考製造例 146

2-[3-ブromo-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-イル]-6,8-ジブromo-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オン 1.0 g、メチルヒドラジン 0.28 ml およびテトラヒドロフラン 16 ml を混合し、該混合物を室温で 19 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を水および飽和食塩水で順次水洗した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付して、3-ブromo-N-[[4,6-ジブromo-2-(N-メチルヒドラジノカルボニル)フェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド 0.97 g を得た。

3-ブromo-N-[[4,6-ジブromo-2-(N-メチルヒドラジノカルボニル)フェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド



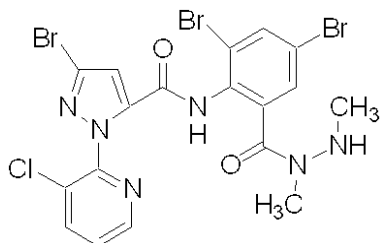
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) (ppm): 2.97 (1.5H, s), 3.17 (1.5H, s), 3.99 (1.0H, s), 4.51 (1.0H, s), 7.31 (1.0H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.35 - 7.41 (2.0H, m), 7.61 (0.5H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.67 (0.5H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.84 - 7.89 (1.0H, m), 8.45 - 8.50 (1.0H, m), 9.32 (0.5H, s), 9.45 (0.5H, s)

【1045】

参考製造例 147

N, N'-ジメチルヒドラジン 2 塩酸塩 0.42 g、水 5 滴、炭酸カリウム 0.87 g およびテトラヒドロフラン 10 mL の混合物に、2-[3-ブromo-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-イル]-6,8-ジブromo-4H-3,1-ベンズオキサジン-4-オン 0.60 g を加え、得られた混合物を室温で 19 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を水および飽和食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付して、3-ブromo-N-[[4,6-ジブromo-2-(N,N'-ジメチルヒドラジノカルボニル)フェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド 0.51 g を得た。

3 - ブロモ - N - [4 , 6 - ジブロモ - 2 - (N , N ' - ジメチルヒドラジノカルボニル) フェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド



10

^1H - NMR (CDCl_3 , TMS) (ppm) : 2 . 4 9 (1 . 5 H , d , $J = 6 \text{ Hz}$) , 2 . 5 8 (1 . 5 H , d , $J = 6 \text{ Hz}$) , 2 . 9 2 (1 . 5 H , s) , 3 . 1 1 (1 . 5 H , s) , 3 . 5 2 (0 . 5 H , q , $J = 6 \text{ Hz}$) , 5 . 4 3 (0 . 5 H , q , $J = 6 \text{ Hz}$) , 7 . 2 1 (0 . 5 H , s) , 7 . 2 4 (0 . 5 H , s) , 7 . 3 0 (0 . 5 H , d , $J = 2 \text{ Hz}$) , 7 . 3 2 (0 . 5 H , d , $J = 2 \text{ Hz}$) , 7 . 3 5 - 7 . 3 9 (1 . 0 H , m) , 7 . 6 1 (0 . 5 H , d , $J = 2 \text{ Hz}$) , 7 . 6 7 (0 . 5 H , d , $J = 2 \text{ Hz}$) , 7 . 8 3 - 7 . 8 7 (1 . 0 H , m) , 8 . 4 4 - 8 . 4 7 (1 . 0 H , m) , 9 . 2 4 (0 . 5 H , s) , 9 . 4 2 (0 . 5 H , s)

【 1 0 4 6 】

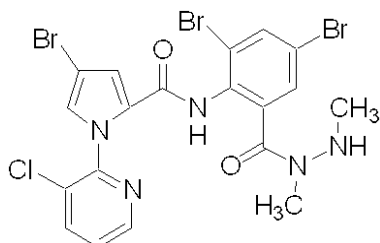
参考製造例 1 4 8

20

N , N ' - ジメチルヒドラジン 2 塩酸塩 0 . 4 2 g 、水 5 滴、炭酸カリウム 0 . 8 7 g およびテトラヒドロフラン 1 0 m L の混合物に、6 , 8 - ジブロモ - 2 - [4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - イル] - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン 0 . 5 9 g を加え、得られた混合物を室温で 2 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を水および飽和食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付して、4 - ブロモ - N - [4 , 6 - ジブロモ - 2 - (N , N ' - ジメチルヒドラジノカルボニル) フェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボキサミド 0 . 5 2 g を得た。

4 - ブロモ - N - [4 , 6 - ジブロモ - 2 - (N , N ' - ジメチルヒドラジノカルボニル) フェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボキサミド

30



^1H - NMR (CDCl_3) : 2 . 4 7 (1 . 5 H , d , $J = 6 \text{ Hz}$) , 2 . 5 5 (1 . 5 H , b r s) , 2 . 9 1 (1 . 5 H , s) , 3 . 0 8 (1 . 5 H , s) , 3 . 5 4 (0 . 5 H , q , $J = 6 \text{ Hz}$) , 5 . 4 6 (0 . 5 H , b r s) , 7 . 0 3 (1 . 0 H , d , $J = 2 \text{ Hz}$) , 7 . 1 0 (0 . 5 H , d , $J = 2 \text{ Hz}$) , 7 . 1 5 (0 . 5 H , d , $J = 2 \text{ Hz}$) , 7 . 2 8 - 7 . 3 2 (2 . 0 H , m) , 7 . 6 5 (0 . 5 H , d , $J = 2 \text{ Hz}$) , 7 . 6 9 (0 . 5 H , d , $J = 2 \text{ Hz}$) , 7 . 7 7 - 7 . 8 1 (1 . 0 H , m) , 8 . 3 9 - 8 . 4 1 (1 . 5 H , m) , 8 . 6 2 (0 . 5 H , s) .

40

【 1 0 4 7 】

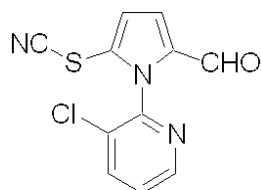
参考製造例 1 4 9 - (1)

3 - クロロ - 2 - (2 - ホルミル - 1 H - ピロール - 1 - イル) ピリジン 1 . 0 g とチオシアン酸ナトリウム 1 . 4 g をメタノール 1 0 m l に加えた。臭素 1 . 0 g を飽和臭化

50

ナトリウム - メタノール溶液 5 m l に溶解して - 2 0 でゆっくり滴下した。2 時間攪拌した後、反応液を氷水に 1 0 0 m l に加えた。クロロホルムで 2 回抽出し、有機層を合わせ、飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮することにより、1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 5 - チオシアナト - 1 H - ピロール - 2 - カルボアルデヒド 1 . 6 g を得た。

1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 5 - チオシアナト - 1 H - ピロール - 2 - カルボアルデヒド



10

^1H - NMR (CDCl_3 , TMS) (ppm) : 6 . 9 5 (1 H , d , $J = 4 \text{ Hz}$) , 7 . 1 6 (1 H , d , $J = 4 \text{ Hz}$) , 7 . 5 2 (1 H , dd , $J = 8 \text{ Hz}$, 5 Hz) , 7 . 9 7 (1 H , dd , $J = 8 \text{ Hz}$, 2 Hz) , 8 . 5 7 (1 H , dd , $J = 5 \text{ Hz}$, 2 Hz) , 9 . 5 8 (1 H , s)

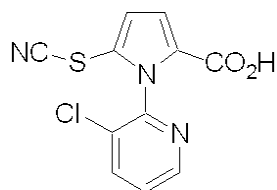
【 1 0 4 8 】

参考製造例 1 4 9 - (2)

4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボアルデヒドの代わりに、1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 5 - チオシアナト - 1 H - ピロール - 2 - カルボアルデヒドを用い、参考製造例 7 1 - (4) と同様の方法で、1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 5 - チオシアナト - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸を得た。

20

1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 5 - チオシアナト - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸



30

^1H - NMR ($\text{DMSO}-d_6$, TMS) (ppm) : 7 . 0 7 (1 H , d , $J = 4 \text{ Hz}$) , 7 . 1 1 (1 H , d , $J = 4 \text{ Hz}$) , 7 . 6 9 (1 H , dd , $J = 8 \text{ Hz}$, 5 Hz) , 8 . 2 7 (1 H , d , $J = 8 \text{ Hz}$) , 8 . 6 2 (1 H , d , $J = 5 \text{ Hz}$)

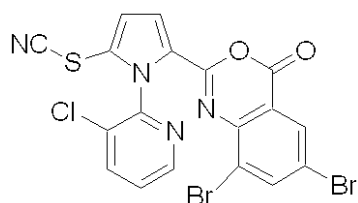
【 1 0 4 9 】

参考製造例 1 4 9 - (3)

4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸の代わりに、1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 5 - チオシアナト - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸を用い、2 - アミノ - 5 - クロロ - 3 - メチル安息香酸の代わりに、2 - アミノ - 3 , 5 - ジブロモ安息香酸を用いて参考製造例 7 1 - (5) と同様の方法で、6 , 8 - ジブロモ - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 5 - チオシアナト - 1 H - ピロール - 2 - イル] - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを得た。

40

6 , 8 - ジブロモ - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 5 - チオシアナト - 1 H - ピロール - 2 - イル] - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン



$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6 , TMS) (ppm): 7.23 (1H, d, $J = 4\text{ Hz}$), 7.41 (1H, d, $J = 4\text{ Hz}$), 7.72 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}, 5\text{ Hz}$), 8.14 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 8.29 (1H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.34 (1H, d, $J = 8\text{ Hz}$), 8.66 (1H, d, $J = 5\text{ Hz}$)

10

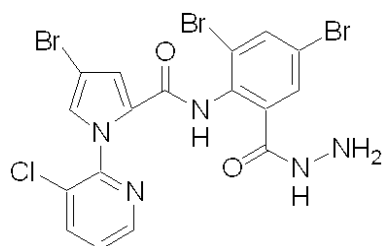
【1050】

参考製造例 150

6, 8-ジブromo-2-[4-ブromo-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-イル]-4H-3, 1-ベンズオキサジン-4-オン 0.569 g、ヒドラジン 1 水和物 0.20 g およびテトラヒドロフラン 2 ml を氷冷下混合し、該混合物を室温で 1 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を水洗し、硫酸ナトリウムで乾燥した後、減圧下濃縮することにより、4-ブromo-N-[4, 6-ジブromo-2-(ヒドラジノカルボニル)フェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-カルボキサミド 0.53 g を得た。

4-ブromo-N-[4, 6-ジブromo-2-(ヒドラジノカルボニル)フェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピロール-2-カルボキサミド

20



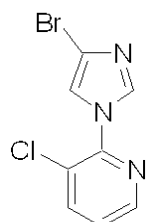
【1051】

参考製造例 151-(1)

30

4-ブromoイミダゾール 1.0 g、3-クロロ-2-(メタンスルホニル)ピリジン 1.3 g、炭酸セシウム 2.7 g および N, N-ジメチルホルムアミド 10 ml の混合物を 100 で 6 時間攪拌した。室温まで放冷した反応混合物に水を注加し、析出した沈殿を濾取することにより、2-(4-ブromo-1H-イミダゾール-1-イル)-3-クロロピリジン 1.7 g を得た。

2-(4-ブromo-1H-イミダゾール-1-イル)-3-クロロピリジン



40

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl $_3$, TMS) (ppm): 7.33 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}, 5\text{ Hz}$), 7.63 (1H, s), 7.93 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}, 2\text{ Hz}$), 8.13 (1H, s), 8.45 - 8.46 (1H, m)

【1052】

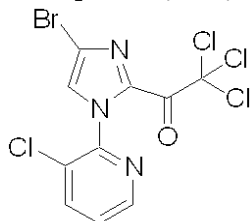
参考製造例 151-(2)

2-(4-ブromo-1H-イミダゾール-1-イル)-3-クロロピリジン 1.0 g のジクロロメタン 5 ml 溶液にトリクロロアセチルクロライド 0.45 ml のジクロロメタン 5 ml 溶液を室温で滴下し、該混合物を室温で 1 日間攪拌した。ここにトリエチルアミ

50

ン 0.57 ml を加え、得られた混合物を室温で 2 時間攪拌した。反応混合物を減圧下濃縮し、得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、1 - [4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - イミダゾール - 2 - イル] - 2, 2, 2 - トリクロロエタノン 1.0 g を得た。

1 - [4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - イミダゾール - 2 - イル] - 2, 2, 2 - トリクロロエタノン



10

^1H -NMR (CDCl₃, TMS) (ppm): 7.35 (1H, s), 7.49 (1H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 7.95 (1H, dd, J = 8 Hz, 2 Hz), 8.51 (1H, dd, J = 5 Hz, 2 Hz)

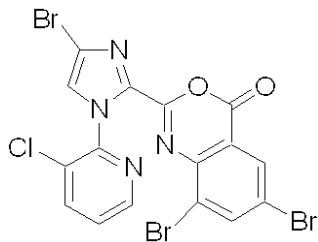
【 1053 】

参考製造例 151 - (3)

1 - [4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - イミダゾール - 2 - イル] - 2, 2, 2 - トリクロロエタノン 0.50 g と 2 - アミノ - 3, 5 - ジブプロモ安息香酸 0.37 g をアセトニトリル 10 ml に溶解し、ここにトリエチルアミン 0.43 ml を加えた。該混合物を室温で 1 日間攪拌してから、メタンスルホンクロライド 0.12 ml を加えて室温で 3 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで 3 回抽出した。有機層を合わせて飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、2 - [4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - イミダゾール - 2 - イル] - 6, 8 - ジブプロモ - 4 H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン 0.29 g を得た。

20

2 - [4 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - イミダゾール - 2 - イル] - 6, 8 - ジブプロモ - 4 H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン



30

^1H -NMR (DMSO-d₆, TMS) (ppm): 7.70 (1H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 8.18 (1H, d, J = 3 Hz), 8.18 (1H, s), 8.31 (1H, dd, J = 8 Hz, 1 Hz), 8.33 (1H, d, J = 3 Hz), 8.59 (1H, dd, J = 5 Hz, 1 Hz)

【 1054 】

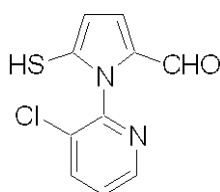
40

参考製造例 152 - (1)

1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 5 - チオシアナト - 1 H - ピロール - 2 - カルボアルデヒド 0.70 g と硫化ナトリウム 9 水和物 0.64 g を水 10 ml に溶解した。該混合物を加熱還流下で 1 時間攪拌した。室温まで放冷した反応混合物に酢酸を加えて、pH を 5 となるように調整してから、酢酸エチルで 2 回抽出した。有機層を合わせ、飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。残渣をメチル tert - ブチルエーテルで洗浄し、1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 5 - メルカプト - 1 H - ピロール - 2 - カルボアルデヒド 0.50 g を得た。

1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 5 - メルカプト - 1 H - ピロール - 2 - カルボアルデヒド

50



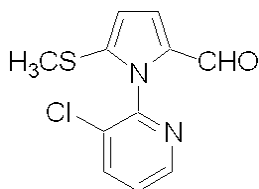
^1H -NMR (CDCl₃, TMS) (ppm): 6.56 (1H, d, J = 4 Hz), 7.07 (1H, d, J = 4 Hz), 7.46 (1H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 7.93 (1H, dd, J = 8 Hz, 2 Hz), 8.54 (1H, dd, J = 5 Hz, 2 Hz), 9.42 (1H, s)

【1055】

参考製造例 152 - (2)

1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 5 - メルカプト - 1H - ピロール - 2 - カルボアルデヒド 0.50 g、ヨウ化メチル 0.36 g、炭酸カリウム 0.43 g および N, N - ジメチルホルムアミド 50 ml の混合物を室温で 1 日間攪拌した。反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで 3 回抽出した。有機層を合わせて水および飽和食塩水で順次洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 5 - メチルチオ - 1H - ピロール - 2 - カルボアルデヒド 0.34 g を得た。

1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 5 - メチルチオ - 1H - ピロール - 2 - カルボアルデヒド



^1H -NMR (CDCl₃, TMS) (ppm): 2.39 (3H, s), 6.45 (1H, d, J = 4 Hz), 7.10 (1H, d, J = 4 Hz), 7.43 (1H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 7.90 (1H, dd, J = 8 Hz, 2 Hz), 8.52 (1H, dd, J = 5 Hz, 2 Hz), 9.41 (1H, s)

【1056】

参考製造例 152 - (3)

1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 5 - メチルチオ - 1H - ピロール - 2 - カルボアルデヒド 0.38 g、アセトン 5 ml および水 3 ml の混合物に、過マンガン酸カリウム 0.38 g を 40 °C でゆっくりと加え、該混合物を 50 °C で 4 時間攪拌した。室温まで放冷した反応混合物を濾過し、得られた濾液をクロロホルムで 2 回洗浄した。水層に pH が 3 付近になるまで 2 N 塩酸を注加し、析出した結晶をろ取して、1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 5 - メチルスルホニル - 1H - ピロール - 2 - カルボン酸と 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 5 - メチルチオ - 1H - ピロール - 2 - カルボン酸の混合物を 0.38 g 得た。得られた混合物と塩化チオニル 0.29 ml との混合物をアセトニトリル 10 ml 中で 1 時間加熱還流した。室温まで放冷した反応混合物を減圧下濃縮し、得られた残渣をアセトニトリル 10 ml に溶解した。ここに 2 - アミノ - 3, 5 - ジブロモ安息香酸 0.39 g とトリエチルアミン 0.65 ml を加え、室温で 6 時間攪拌してから、メタンスルホニルクロライド 0.13 ml を加えて室温で 1 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで 3 回抽出した。有機層を合わせて飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、6, 8 - ジブロモ - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 5 - メチルスルホニル - 1H - ピロール - 2 - イル] - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン 0.05 g と 6, 8 - ジブロモ - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 5 -

10

20

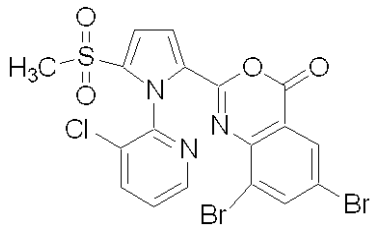
30

40

50

メチルチオ - 1 H - ピロール - 2 - イル] - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン
0 . 0 5 g を得た。

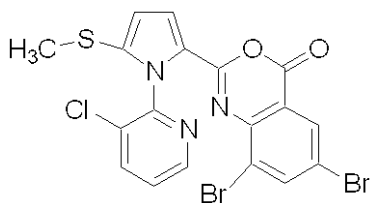
6 , 8 - ジブromo - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 5 - メチルスルホニ
ル - 1 H - ピロール - 2 - イル] - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン



10

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) (ppm) : 3 . 2 3 (3 H , s) , 7 . 2 1 (1 H , d , $J = 4 \text{ Hz}$) , 7 . 4 1 (1 H , d , $J = 4 \text{ Hz}$) , 7 . 5 0 (1 H , dd , $J = 8 \text{ Hz}$, 4 Hz) , 7 . 9 5 (1 H , d , $J = 8 \text{ Hz}$) , 8 . 0 2 (1 H , d , $J = 2 \text{ Hz}$) , 8 . 2 4 (1 H , d , $J = 2 \text{ Hz}$) , 8 . 5 6 (1 H , d , $J = 4 \text{ Hz}$)

6 , 8 - ジブromo - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 5 - メチルチオ - 1
H - ピロール - 2 - イル] - 4 H - 3 , 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン



20

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) (ppm) : 2 . 3 9 (3 H , s) , 6 . 6 3 (1 H , d , $J = 4 \text{ Hz}$) , 7 . 3 5 (1 H , d , $J = 4 \text{ Hz}$) , 7 . 6 3 (1 H , dd , $J = 8 \text{ Hz}$, 5 Hz) , 8 . 0 8 (1 H , d , $J = 2 \text{ Hz}$) , 8 . 2 2 (1 H , d , $J = 2 \text{ Hz}$) , 8 . 2 5 (1 H , dd , $J = 8 \text{ Hz}$, 2 Hz) , 8 . 5 8 (1 H , dd , $J = 5 \text{ Hz}$, 2 Hz)

【 1 0 5 7 】

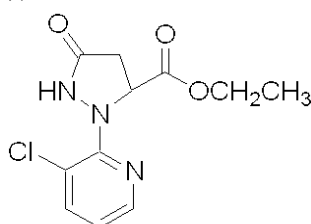
参考製造例 1 5 3 - (1)

30

3 - クロロ - 2 - ヒドラジノピリジン 2 0 g 、 2 1 % ナトリウムエトキシド (エタノール溶液) 5 6 m l およびエタノール 7 5 m l の混合物に、マレイン酸ジエチル 2 7 m l を滴下した後、該混合物を 1 0 分間加熱還流した。6 5 まで冷却した反応混合物に酢酸 1 5 m l を注加した後、室温まで放冷した。該反応混合物に水 1 9 0 m l を注加した後、6 N 塩酸を加えて、pH を 2 となるように調整してから、メチル tert - ブチルエーテルで 3 回抽出した。有機層を合わせ、飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣にジエチルエーテルを加え、固体を濾取することにより、2 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 5 - オキソ - 3 - ピラゾリジンカルボン酸エチル 4 . 2 8 g を得た。

2 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 5 - オキソ - 3 - ピラゾリジンカルボン酸エチル

40



$^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$, TMS) (ppm) : 1 . 2 2 (3 H , t , $J = 7 \text{ Hz}$) , 2 . 3 6 (1 H , d , $J = 1 7 \text{ Hz}$) , 2 . 9 2 (1 H , dd , $J = 1 7 \text{ Hz}$, $1 0 \text{ Hz}$) , 4 . 2 0 (2 H , q , $J = 7 \text{ Hz}$) , 4 . 8 3 (1 H , d , $J = 1 0 \text{ Hz}$) ,

50

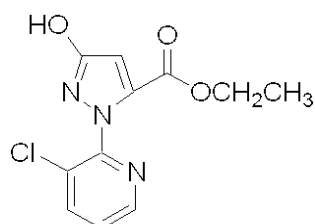
7.20 (1H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 7.93 (1H, d, J = 8 Hz), 8.27 (1H, d, J = 5 Hz), 10.17 (1H, s)

【1058】

参考製造例 153 - (2)

2 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 5 - オキソ - 3 - ピラゾリジンカルボン酸エチル 12.0 g、アセトニトリル 90 ml および硫酸 4.8 ml の混合物に、過硫酸ナトリウム 14.5 g を加え、該混合物を 3.5 時間加熱還流した。室温まで放冷した反応混合物を濾過し、得られた濾液に水を注加した後、メチル tert - ブチルエーテルで 3 回抽出した。有機層を合わせ、飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - ヒドロキシ - 1H - ピラゾール - 5 - カルボン酸エチル 7.23 g を得た。

1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - ヒドロキシ - 1H - ピラゾール - 5 - カルボン酸エチル



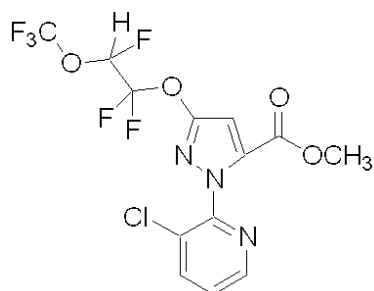
¹H - NMR (DMSO - d₆, TMS) (ppm): 1.06 (3H, t, J = 7 Hz), 4.11 (2H, q, J = 7 Hz), 6.34 (1H, s), 7.59 - 7.63 (1H, m), 8.17 - 8.23 (1H, m), 8.50 - 8.52 (1H, m), 10.65 (1H, s)

【1059】

参考製造例 153 - (3)

1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - ヒドロキシ - 1H - ピラゾール - 5 - カルボン酸エチル 1.0 g、水酸化カリウム 0.042 g、メタノール 10 ml およびジメチルスルホキシド 10 ml の混合物を氷冷し、そこへ、トリフルオロメチルトリフルオロビニルエーテルのガスを導入した。該混合物を室温に 4 日間攪拌した。反応混合物に水を注加した後、ジエチルエーテルで 2 回抽出した。有機層を合わせ、水および飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - [1, 1, 2 - トリフルオロ - 2 - (トリフルオロメトキシ)エトキシ] - 1H - ピラゾール - 5 - カルボン酸メチル 1.32 g を得た。

1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - [1, 1, 2 - トリフルオロ - 2 - (トリフルオロメトキシ)エトキシ] - 1H - ピラゾール - 5 - カルボン酸メチル



¹H - NMR (CDCl₃, TMS) (ppm): 3.80 (3H, s), 6.04 (1H, dt, J = 5.4 Hz, 3 Hz), 6.80 (1H, s), 7.45 (1H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 7.92 (1H, dd, J = 8 Hz, 2 Hz), 8.51 (1H, dd, J = 5 Hz, 2 Hz)

【1060】

10

20

30

40

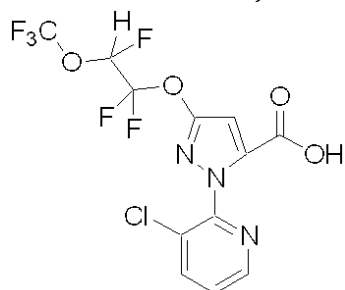
50

参考製造例 153 - (4)

1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - [1, 1, 2 - トリフルオロ - 2 - (トリフルオロメトキシ) エトキシ] - 1H - ピラゾール - 5 - カルボン酸メチル 1.32 g およびメタノール 15 ml の混合物に、2 N 水酸化ナトリウム水溶液 5 ml を加えた。該混合物を室温で 3 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、メチル tert - ブチルエーテルで洗浄した。水層に 6 N 塩酸を加えて、pH を 2 となるように調整した後、メチル tert - ブチルエーテルで 2 回抽出した。有機層を合わせ、飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮し、1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - [1, 1, 2 - トリフルオロ - 2 - (トリフルオロメトキシ) エトキシ] - 1H - ピラゾール - 5 - カルボン酸 1.18 g を得た。

10

1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - [1, 1, 2 - トリフルオロ - 2 - (トリフルオロメトキシ) エトキシ] - 1H - ピラゾール - 5 - カルボン酸



20

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) (ppm): 6.04 (1H, dt, $J = 5.4\text{ Hz}$, 3 Hz), 6.84 (1H, s), 7.46 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 5 Hz), 7.93 (1H, dd, $J = 8\text{ Hz}$, 2 Hz), 8.50 (1H, dd, $J = 5\text{ Hz}$, 2 Hz)

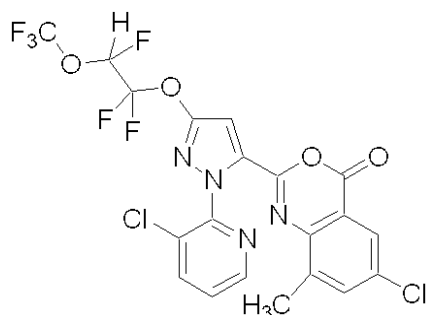
【1061】

参考製造例 153 - (5)

1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピラゾール - 5 - カルボン酸の代わりに、1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - [1, 1, 2 - トリフルオロ - 2 - (トリフルオロメトキシ) エトキシ] - 1H - ピラゾール - 5 - カルボン酸を用い、参考製造例 13 と同様の方法で、6 - クロロ - 2 - {1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - [1, 1, 2 - トリフルオロ - 2 - (トリフルオロメトキシ) エトキシ] - 1H - ピラゾール - 5 - イル} - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを得た。

30

6 - クロロ - 2 - {1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - [1, 1, 2 - トリフルオロ - 2 - (トリフルオロメトキシ) エトキシ] - 1H - ピラゾール - 5 - イル} - 8 - メチル - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン



40

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) (ppm): 1.83 (3H, s), 6.06 (1H, dt, $J = 5.4\text{ Hz}$, 3 Hz), 7.04 (1H, s), 7.48 - 7.51 (2H, m), 7.96 - 8.00 (2H, m), 8.55 (1H, dd, $J = 5\text{ Hz}$, 2 Hz)

【1062】

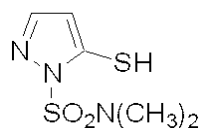
参考製造例 154 - (1)

50

N, N - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 1 - スルホンアミド 4 . 0 g とテトラヒドロフラン 5 0 m l との混合物に、 - 7 8 で 1 . 6 M の n - ブチルリチウムのヘキサン溶液 1 5 . 7 m l を滴下し、 - 7 8 で 1 0 分間攪拌した。該混合物に、硫黄 1 . 4 6 g とテトラヒドロフラン 2 0 m l との混合物を加えた後、該混合物を - 7 8 で 1 時間攪拌した。徐々に反応温度を室温に戻しながら、1 . 5 時間攪拌した。析出した沈殿を濾取し、ジエチルエーテルで洗浄した。得られた固体を水に溶解させ、p H が 3 付近になるまで 6 N 塩酸を注加した後、メチル t - ブチルエーテルで 3 回抽出した。合せた有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮することにより、N, N - ジメチル - 5 - メルカプト - 1 H - ピラゾール - 1 - スルホンアミド 3 . 9 2 g を得た。

N, N - ジメチル - 5 - メルカプト - 1 H - ピラゾール - 1 - スルホンアミド

10



^1H - NMR (CDCl_3 , TMS) (ppm) : 3 . 0 3 (6 H , s) , 4 . 3 9 (1 H , s) , 6 . 2 7 (1 H , d , J = 2 \text{ Hz }) , 7 . 5 9 (1 H , d , J = 2 \text{ Hz })

【 1 0 6 3 】

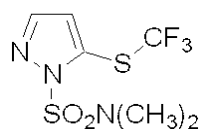
参考製造例 1 5 4 - (2)

N, N - ジメチル - 5 - メルカプト - 1 H - ピラゾール - 1 - スルホンアミド 1 . 0 g 、 5 0 % 水素化ナトリウム (油性) 0 . 3 0 g およびテトラヒドロフラン 2 5 m l を混合し、該混合物を室温で 0 . 5 時間攪拌した後、 - 6 0 に冷却した。反応混合物に、S - (トリフルオロメチル) ジベンゾチオフェニウム・トリフルオロメタンスルホネート 1 . 9 4 g を加え、該混合物を - 6 0 で 0 . 5 時間攪拌した後、室温で 2 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで 3 回抽出した。合せた有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、N, N - ジメチル - 5 - (トリフルオロメチルチオ) - 1 H - ピラゾール - 1 - スルホンアミド 1 . 3 0 g を得た。

20

N, N - ジメチル - 5 - (トリフルオロメチルチオ) - 1 H - ピラゾール - 1 - スルホンアミド

30



^1H - NMR (CDCl_3 , TMS) (ppm) : 3 . 0 8 (6 H , s) , 6 . 7 3 (1 H , s) , 7 . 7 3 (1 H , s)

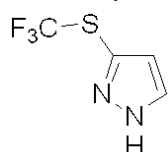
【 1 0 6 4 】

参考製造例 1 5 4 - (3)

5 - プロモ - N, N - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 1 - スルホンアミドの代わりに、N, N - ジメチル - 5 - (トリフルオロメチルチオ) - 1 H - ピラゾール - 1 - スルホンアミドを用い、参考製造例 2 1 と同様の方法で、3 - (トリフルオロメチルチオ) - 1 H - ピラゾールを得た。

40

3 - (トリフルオロメチルチオ) - 1 H - ピラゾール



^1H - NMR (CDCl_3 , TMS) (ppm) : 6 . 7 0 (1 H , d , J = 3 \text{ Hz }) , 7 . 7 4 (1 H , d , J = 3 \text{ Hz }) , 1 2 . 4 7 (1 H , \text{brs})

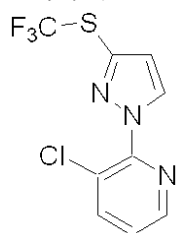
【 1 0 6 5 】

参考製造例 1 5 4 - (4)

50

3 - ブロモ - 1 H - ピラゾールの代わりに、3 - (トリフルオロメチルチオ) - 1 H - ピラゾールを用い、参考製造例 2 2 と同様の方法で、3 - クロロ - 2 - [3 - (トリフルオロメチルチオ) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] ピリジンを得た。

3 - クロロ - 2 - [3 - (トリフルオロメチルチオ) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] ピリジン



10

^1H - NMR (CDCl₃, TMS) (ppm): 6.78 (1H, d, J = 3 Hz), 7.35 (1H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 7.94 (1H, dd, J = 8 Hz, 2 Hz), 8.17 (1H, d, J = 3 Hz), 8.47 (1H, dd, J = 5 Hz, 2 Hz)

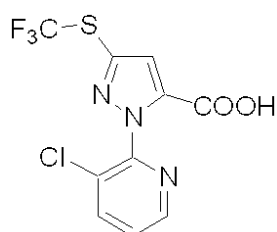
【1066】

参考製造例 154 - (5)

2 - (3 - ブロモ - 1 H - ピラゾール - 1 - イル) - 3 - クロロピリジンの代わりに、3 - クロロ - 2 - [3 - (トリフルオロメチルチオ) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] ピリジンを用い、参考製造例 2 3 と同様の方法で、1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - (トリフルオロメチルチオ) - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボン酸を得た。

20

1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - (トリフルオロメチルチオ) - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボン酸



30

^1H - NMR (CDCl₃, TMS) (ppm): 7.35 (1H, s), 7.47 (1H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 7.94 (1H, d, J = 8 Hz), 8.52 (1H, d, J = 5 Hz)

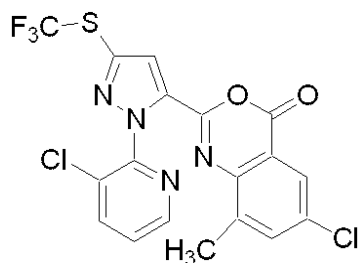
【1067】

参考製造例 154 - (6)

1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボン酸の代わりに、1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - (トリフルオロメチルチオ) - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボン酸を用い、参考製造例 1 3 と同様の方法で、6 - クロロ - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - (トリフルオロメチルチオ) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - メチル - 4 H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンを得た。

40

6 - クロロ - 2 - [1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - (トリフルオロメチルチオ) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 8 - メチル - 4 H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン



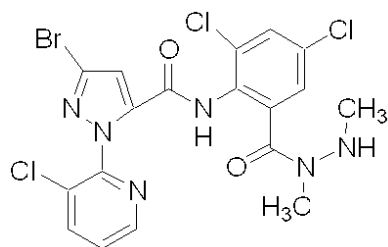
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) (ppm): 1.82 (3H, s), 7.50 - 7.54 (3H, m), 7.98 - 8.00 (2H, m), 8.57 (1H, dd, $J = 5\text{ Hz}$, 2 Hz)

【1068】

参考製造例 155

2 - [3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピラゾール - 5 - イル] - 6, 8 - ジブプロモ - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オンの代わりに、2 - [3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピラゾール - 5 - イル] - 6, 8 - ジクロロ - 4H - 3, 1 - ベンズオキサジン - 4 - オン用い、参考製造例 147 と同様の方法で、3 - ブロモ - N - [4, 6 - ジクロロ - 2 - (N, N' - ジメチルヒドラジノカルボニル) フェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピラゾール - 5 - カルボキサミドを得た。

3 - ブロモ - N - [4, 6 - ジクロロ - 2 - (N, N' - ジメチルヒドラジノカルボニル) フェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド



$^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$, TMS) (ppm): 2.20 (2.4H, d, $J = 5\text{ Hz}$), 2.39 (0.6H, d, $J = 6\text{ Hz}$), 2.72 (0.6H, s), 3.02 (2.4H, s), 4.59 (0.8H, q, $J = 5\text{ Hz}$), 5.68 (0.2H, q, $J = 6\text{ Hz}$), 7.38 (0.8H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.40 (1.0H, s), 7.53 (0.2H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.60 - 7.64 (1.0H, m), 7.70 (0.8H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 7.84 (0.2H, d, $J = 2\text{ Hz}$), 8.16 - 8.19 (1.0H, m), 8.49 - 8.50 (1.0H, m), 10.34 (0.8H, s), 10.65 (0.2H, s).

【1069】

次に製剤例を示す。なお、部は重量部を表す。

【1070】

製剤例 1

本発明化合物 (1) ~ (231) の各々 10 部を、キシレン 35 部と N, N - ジメチルホルムアミド 35 部との混合物に溶解し、ポリオキシエチレンスチリルフェニルエーテル 14 部およびドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム 6 部を加え、良く攪拌混合して各々の 10% 乳剤を得る。

【1071】

製剤例 2

本発明化合物 (1) ~ (231) の各々 20 部を、ラウリル硫酸ナトリウム 4 部、リグニンスルホン酸カルシウム 2 部、合成含水酸化珪素微粉末 20 部および珪藻土 54 部を混合した中に加え、良く攪拌混合して各々の 20% 水和剤を得る。

【 1 0 7 2 】

製剤例 3

本発明化合物 (1) ~ (2 3 1) の各々 2 部に、合成含水酸化珪素微粉末 1 部、リグニンスルホン酸カルシウム 2 部、ペントナイト 3 0 部およびカオリンクレー 6 5 部を加え充分攪拌混合する。ついでこれらの混合物に適量の水を加え、さらに攪拌し、増粒機で製粒し、通風乾燥して各々の 2 % 粒剤を得る。

【 1 0 7 3 】

製剤例 4

本発明化合物 (1) ~ (2 3 1) の各々 1 部を適量のアセトンに溶解し、これに合成含水酸化珪素微粉末 5 部、PAP 0 . 3 部およびフバサミクレー 9 3 . 7 部を加え、充分攪拌混合し、アセトンを蒸発除去して各々の 1 % 粉剤を得る。

10

【 1 0 7 4 】

製剤例 5

本発明化合物 (1) ~ (2 3 1) の各々 1 0 部；ポリオキシエチレンアルキルエーテルサルフェートアンモニウム塩 5 0 部を含むホワイトカーボン 3 5 部；および水 5 5 部を混合し、湿式粉碎法で微粉碎することにより、各々の 1 0 % フロアブル剤を得る。

【 1 0 7 5 】

製剤例 6

本発明化合物 (1) ~ (2 3 1) の各々 0 . 1 部をキシレン 5 部およびトリクロロエタン 5 部に溶解し、これを脱臭灯油 8 9 . 9 部に混合して各々の 0 . 1 % 油剤を得る。

20

【 1 0 7 6 】

製剤例 7

本発明化合物 (1) ~ (2 3 1) の各々 1 0 m g をアセトン 0 . 5 m l に溶解し、この溶液を、動物用固形飼料粉末（飼育繁殖用固形飼料粉末 C E - 2、日本クレア株式会社商品）5 g に処理し、均一に混合する。ついでアセトンを蒸発乾燥させて各々の毒餌を得る。

【 1 0 7 7 】

製剤例 8

本発明化合物 (5) 1 0 部と、下記の A 群に示される殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤、除草剤、植物ホルモン剤、または、植物成長調節物質等（異性体およびその塩を含む）、共力剤、あるいは、薬害軽減剤 1 0 部とを、ラウリル硫酸ナトリウム 4 部、リグニンスルホン酸カルシウム 2 部、合成含水酸化珪素微粉末 2 0 部および珪藻土 5 4 部を混合した中に加え、良く攪拌、混合して混合水和剤を得る。

30

【 1 0 7 8 】

A 群：

殺虫剤として、

(1) 有機リン系化合物

アセフェート (acephate)、りん化アルミニウム (Aluminium phosphide)、ブタチオホス (butathiofos)、キャドサホス (cadusafos)、クロルエトキシホス (chlorethoxyfos)、クロルフェンビンホス (chlorfenvinphos)、クロルピリホス (chlorpyrifos)、クロルピリホスメチル (chlorpyrifos-methyl)、シアノホス (cyanophos : CYAP)、ダイアジノン (diazinon)、D C I P (dichlorodiisopropyl ether)、ジクロフェンチオン (dichlofenthion : ECP)、ジクロロボス (dichlorvos : DDVP)、ジメトエート (dimethoate)、ジメチルビンホス (dimethylvinphos)、ジスルホトン (disulfoton)、EPN、エチオン (ethion)、エトプロホス (ethoprophos)、エトリムホス (etrimfos)、フェンチオン (fenthion : MPP)、フェニトロチオン (fenitrothion : MEP)、ホスチアゼート (fosthiazate)、ホルモチオン (formothion)、りん化水素 (Hydrogen phosphide)、イソフェンホス (isofenphos)、イソキサチオン (isoxathion)、馬拉チオン (malathion)、メスルフェンホス (mesulfenfos)、メチダチオン (methidathion : DMTP)、モノクロトホス (monocrotophos)、ナレド (naled : BRP)、オキシデプロホス (oxydeprofos)

40

50

: ESP)、パラチオン(parathion)、ホサロン(phosalone)、ホスメット(phosmet: PM P)、ピリミホスメチル(pirimiphos-methyl)、ピリダフェンチオン(pyridafenthion)、キナルホス(quinalphos)、フェントエート(phenthoate: PAP)、プロフェノホス(propofenofos)、プロパホス(propaphos)、プロチオホス(prothiofos)、ピラクロホス(pyraclorfos)、サリチオン(salithion)、スルプロホス(sulprofos)、テブピリムホス(tebupirimfos)、テムホス(temephos)、テトラクロルビンホス(tetrachlorvinphos)、テルブホス(terbufos)、チオメトン(thiometon)、トリクロルホン(trichlorphon: DEP)、バミドチオン(vamidothion)等;

(2) カーバメート系化合物

アラニカルブ(alanycarb)、ベンダイオカルブ(bendiocarb)、ベンフラカルブ(benfuracarb)、BPMC、カルバリル(carbaryl)、カルボフラン(carbofuran)、カルボスルファン(carbosulfan)、クロエトカルブ(cloethocarb)、エチオフエンカルブ(ethiofencarb)、フェノブカルブ(fenobucarb)、フェノチオカルブ(fenothiocarb)、フェノキシカルブ(fenoxycarb)、フラチオカルブ(furathiocarb)、イソプロカルブ(isoproc carb: MIPC)、メトルカルブ(metolcarb)、メソミル(methomyl)、メチオカルブ(methiocarb)、NAC、オキサミル(oxamyl)、ピリミカーブ(pirimicarb)、プロポキスル(propoxur: PHC)、XMC、チオジカルブ(thiodicarb)、キシリルカルブ(xylylcarb)等;

(3) 合成ピレスロイド系化合物

アクリナトリン(acrinathrin)、アレスリン(allethrin)、ベンフルスリン(benfluthrin)、ベータ-シフルトリン(beta-cyfluthrin)、ピフェントリン(bifenthrin)、シクロプロトリン(cycloprothrin)、シフルトリン(cyfluthrin)、シハロトリン(cyhalothrin)、シペルメトリン(cypermethrin)、デルタメトリン(deltamethrin)、エスフェンバレレート(esfenvalerate)、エトフェンプロックス(ethofenprox)、フェンプロパトリン(fenpropathrin)、フェンバレレート(fenvalerate)、フルシトリネート(flucythrinate)、フルフェンプロックス(flufenoprox)、フルメスリン(flumethrin)、フルバリネート(fluvalinate)、ハルフェンプロックス(halfenprox)、イミプロトリン(imiprothrin)、ペルメトリン(permethrin)、プラレトリン(prallethrin)、ピレトリン(pyrethrins)、レスメトリン(resmethrin)、シグマ-サイパーメスリン(sigma-cypermethrin)、シラフルオフエン(silafluofen)、テフルトリン(tefluthrin)、トラロメトリン(tralomethrin)、トランスフルトリン(transfluthrin)、2, 3, 5, 6-テトラフルオロ-4-(メトキシメチル)ベンジル(EZ)-(1RS, 3RS; 1RS, 3SR)-2, 2-ジメチル-3-プロブ-1-エニルシクロプロパンカルボキシレート、2, 3, 5, 6-テトラフルオロ-4-メチルベンジル(EZ)-(1RS, 3RS; 1RS, 3SR)-2, 2-ジメチル-3-プロブ-1-エニルシクロプロパンカルボキシレート、2, 3, 5, 6-テトラフルオロ-4-(メトキシメチル)ベンジル(1RS, 3RS; 1RS, 3SR)-2, 2-ジメチル-3-(2-メチル-1-プロペニル)シクロプロパンカルボキシレート等;

(4) ネライストキシン系化合物

カルタップ(cartap)、ベンスルタップ(bensultap)、チオシクラム(thiocyclam)、モノスルタップ(monosultap)、ビスルタップ(bisultap)等;

(5) ネオニコチノイド系化合物

イミダクロプリド(imidacloprid)、ニテンピラム(nitenpyram)、アセタミプリド(acetamiprid)、チアメトキサム(thiamethoxam)、チアクロプリド(thiacloprid)、ジノテフラン(dinotefuran)、クロチアニジン(clothianidin)等;

(6) ベンゾイル尿素系化合物

クロルフルアズロン(chlorfluazuron)、ビストリフルロン(bistrifluron)、ジアフェンチウロン(diafenthion)、ジフルベンズロン(diflubenzuron)、フルアズロン(fluzuron)、フルシクロクスロン(flucycloxuron)、フルフェノクスロン(flufenoxuron)、ヘキサフルムロン(hexaflumuron)、ルフエヌロン(lufenuron)、ノバルロン(n

10

20

30

40

50

ovaluron)、ノビフルムロン(noviflumuron)、テフルベンズロン(teflubenzuron)、トリフルムロン(triflumuron)等;

(7) フェニルピラゾール系化合物

アセトプロール(acetoprole)、エチプロール(ethiprole)、フィプロニル(fipronil)、バニリプロール(vaniliprole)、ピリプロール(pyriprole)、ピラフルプロール(pyrafluprole)等;

(8) B t トキシシン系殺虫剤

バチルス・チューリングゲンシス菌由来の生芽胞および産生結晶毒素、並びにそれらの混合物;

(9) ヒドラジン系化合物

クロマフェノジド(chromafenozide)、ハロフェノジド(halofenozide)、メトキシフェノジド(methoxyfenozide)、テブフェノジド(tebufenozide)等;

(10) 有機塩素系化合物

アルドリン(aldrin)、ディルドリン(dieldrin)、ジエノクロル(dienochlor)、エンドスルファン(endosulfan)、メトキシクロル(methoxychlor)等;

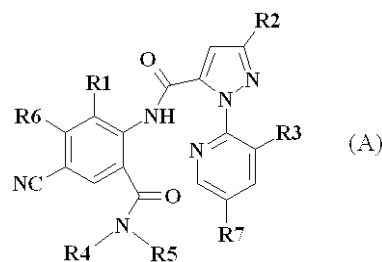
(11) 天然系殺虫剤

マシン油(machine oil)、硫酸ニコチン(nicotine-sulfate);

(12) その他の殺虫剤

アベルメクチン(ivermectin-B)、ブロモプロピレート(bromopropylate)、ブプロフェジン(buprofezin)、クロルフェナピル(chlorphenapyr)、シロマジン(cyromazine)、D-D(1,3-Dichloropropene)、エマメクチンベンゾエート(emamectin-benzoate)、フェナザキン(fenazaquin)、フルピラゾホス(flupyrzofos)、ハイドロプレネ(hydroprene)、インドキサカルブ(indoxacarb)、メトキサジアゾン(metoxadiazon)、ミルベマイシンA(milbemycin-A)、ピメトロジン(pymetrozine)、ピリダリル(pyridalyl)、ピリプロキシフェン(pyriproxyfen)、スピノサッド(spinosad)、スルフラミド(sulfluramid)、トルフェンピラド(tolfenpyrad)、トリアゼメイト(triazamate)、フルベンジアミド(flubendiamide)、S I - 0 0 0 9、シフルメトフェン(cyflumetofen)、亜ひ酸(Arsenic acid)、ベンクロチアズ(benclothiaz)、石灰窒素(Calcium cyanamide)、石灰硫黄合剤(Calcium polysulfide)、クロルデン(chlordane)、D D T、D S P、フルフェネリウム(flufennerim)、フロニックアミド(flonicamid)、フルリムフェン(flurimfen)、ホルメタネート(formetanate)、メタム・アンモニウム(metam-ammonium)、メタム・ナトリウム(metam-sodium)、臭化メチル(Methyl bromide)、ニディノテフラン(nidinetefuran)、オレイン酸カリウム(Potassium oleate)、プロトリフェンビュート(protrifenbute)、スピロメシフェン(spiromesifen)、硫黄(Sulfur)、メタフルミゾン(metaflumizone)、スピロテトラマトット(spirotetramat)、N N I - 0 1 0 1、S - 1 9 4 7、クロラントラニリプロール(Chlorantraniliprole)、下記式(A)

式(A):



[式中、

R1は、Me、Cl、BrまたはF、

R2は、F、Cl、Br、C1 - C4 ハロアルキル、またはC1 - C4 ハロアルコキシ、

R3は、F、ClまたはBr、

10

20

30

40

50

R4は、H、1個またはそれ以上のハロゲン原子；CN；SMe；S(O)Me；S(O)₂MeおよびOMeで置換されていてもよいC1-C4アルキル、C3-C4アルケニル、C3-C4アルキニル、または、C3-C5シクロアルキル、

R5は、HまたはMe、

R6は、H、FまたはCl、

R7は、H、FまたはClを表す。]

に示される化合物。

【1079】

殺ダニ剤（殺ダニ活性成分）として、

アセキノシル（acequinocyl）、アミトラズ（amitraz）、ベンゾキシメート（benzoximate）、ピフェナゼート（bifenazate）、フェニソプロモレート（bromopropylate）、キノメチオネート（chinomethionate）、クロルベンジレート（chlorobenzilate）、CPCBS（chlorfenson）、クロフェンテジン（clofentezine）、シフルメトフェン（cyflumetofen）、ケルセン（ジコホル：dicofol）、エトキサゾール（etoxazole）、酸化フェンブタズ（fenbutatin oxide）、フェノチオカルブ（fenothiocarb）、フェンピロキシメート（fenpyroximate）、フルアクリピリム（fluacrypyrim）、フルプロキシフェン（fluproxyfen）、ヘキシチアゾクス（hexythiazox）、プロパルギット（propargite：BPPS）、ポリナクチン複合体（polynactins）、ピリダベン（pyridaben）、ピリミジフェン（Pyrimidifen）、テブフェンピラド（tebufenpyrad）、テトラジホン（tetradifon）、スピロクロフェン（spirodiclofen）、アミドフルメット（amidoflumet）。

【1080】

殺線虫剤（殺線虫活性成分）として、

DCIP、フォスチアゼート（fosthiazate）、塩酸レバミゾール（levamisol）、メチルイソチオシアネート（methyisothiocyanate）、酒石酸モランテル（morantel tartarate）。

【1081】

殺菌剤として、

アシベンゾラル-S-メチル（acibenzolar-S-methyl）、アンバム（amobam）、アムプロピルホス（ampropylfos）、アニラジン（anilazine）、アゾキシストロビン（azoxystrobin）、ベナラキシル（benalaxyl）、ベノダニル（benodanil）、ベノミル（benomyl）、ベンチアバリカルブ（benthiavalicarb）、ベンチアゾール（benthiazole）、ベソキサジン（bethoxazin）、ピテルタノール（bitertanol）、ブラストサイジン-S（blastidin-S）、ボルドー液（Bordeaux mixture）、ボスカリド（boscalid）、ブロムコナゾール（bromconazole）、ブチオベート（buthiobate）、次亜塩素酸カルシウム（Calcium hypochlorite）、石灰硫黄合剤（Calcium polysulfide）、キャプタン（captan）、カルベンダゾール（carbendazol）、カルボキシシン（carboxin）、カルプロパミド（carpropamid）、クロベンチアゾン（chlobenthiazone）、クロロネブ（chloroneb）、クロルピクリン（chloropicrin）、クロロタロニル（chlorothalonil：TPN）、クロルチオホス（chlorthiophos）、桂皮アルデヒド（Cinnamaldehyde）、クロジラコン（clozylacon）、CNA（2,6-Dichloro-4-nitroaniline）、水酸化第二銅（Copper hydroxide）、硫酸銅（Copper sulfate）、シアゾファミド（cyazofamid）、シフルフェンアミド（cyfluphenamid）、シモキサニル（cymoxanil）、シプロコナゾール（cyproconazole）、シプロジニル（cyprodinil）、シプロフラム（cyprofuram）、ダゾメット（dazomet）、デバカルブ（decarb）、ジクロフルアニド（dichlofluanid）、D-D（1,3-Dichloropropene）、ジクロシメット（diclocymet）、ジクロメジン（diclomezine）、ジエトフェンカルブ（diethofencarb）、ジフェノコナゾール（difenoconazole）、ジフルメトリム（diflumetorim）、ジメフルアゾール（dimefluaazole）、ジメチリモール（dimethirimol）、ジメトモルフ（dimethomorph）、ジニコナゾール-M（diniconazole-M）、ジノカップ（dinocap）、エジフェンホス（edifenphos）、エポキシコナゾール（epoxiconazole）、ジメチルジチオカルバミン酸ニッケル、エタコナゾール（etaconazole）、エタボキサム（ethaboxam）、

エチリモル (ethirimol)、エトリジアゾール (etridiazole)、ファモキサドン (famoxadone)、フェナミドン (fenamidone)、フェナリモル (fenarimol)、フェンブコナゾール (fenbuconazole)、フェンダゾスラム (Fendazosulam)、フェンヘキサミド (fenhexamid)、フェノキサニル (fenoxanil)、フェンピクロニル (fempiclonil)、フェンプロピジン (fenpropidin)、フェンプロピモルフ (fenpropimorph)、フェンチアゾン (fentiazon)、水酸化トリフェニルスズ (fentin hydroxide)、フェリムゾン (ferimzone)、フルアジナム (fluazinam)、フルジオキシニル (fludioxonil)、フルメトバー (flumetover)、フルモルフ (flumorph)、フルオルイミド (fluoroimide)、フルオトリマゾール (fluotrimazole)、フルオキサストロビン (fluoxastrobin)、フルキンコナゾール (fluquinconazole)、フルシラゾール (flusilazole)、フルスルファミド (flusulfamide)、フルトラニル (flutolanil)、フルトリアホル (flutriafol)、ホセチル (fosetyl-Al)、フサライド (fthalide)、フベリダゾール (fuberidazole)、フララキシル (furalaxyl)、フラメトピル (furametpyr)、フルカルバニル (furcarbanil)、フルコナゾール-シス (furconazole-cis)、ヘキサコナゾール (hexaconazole)、ヒメキサゾール (hymexazol)、I B P (IBP)、イマザリル (imazalil)、イミベンコナゾール (imibenconazole)、イミノクタジン・アルベシル酸塩 (iminooctadine-albesilate)、イミノクタジン酢酸塩 (iminooctadine-triacetate)、ヨードカルブ (iodocarb)、イブコナゾール (ipconazole)、イブプロジオン (iprodone)、イブプロバリカルブ (iprovalicarb)、イソプロチオラン (isoprothiolane)、カスガマイシン (kasugamycin)、クレソキシム・メチル (kresoxim-methyl)、マンコゼブ (mancozeb)、マンネブ (maneb)、メパニピリム (mepanipyrim)、メプロニル (mepronil)、メタラキシル (metalaxyl)、メタラキシル・M (metalaxyl-M)、メタム・ナトリウム (metam-sodium)、メタスルホカルブ (methasulfocarb)、臭化メチル (Methyl bromide)、メトコナゾール (metconazole)、メトフロキサム (methfuroxam)、メトミノストロビン (metominostrobin)、メトラフェノン (metrafenone)、メトスルホバックス (metsulfobax)、ミルディオマイシン (mildiomycin)、ミルネブ (milneb)、ミクロブタニル (myclobutanil)、ミクロゾリン (myclozolin)、ナーバム (nabam)、オリサストロビン (orysastrobin)、オフレース (ofurace)、オキサジキシル (oxadixyl)、オキシリニック酸 (oxolinic acid)、オキシポコナゾール (oxpoconazole)、オキシカルボキシ (oxycarboxin)、オキシテトラサイクリン (oxytetracycline)、ペフラゾエート (pefurazoate)、ペンコナゾール (penconazole)、ペンシクロン (pencycuron)、ピコキシストロビン (picoxystrobin)、ポリカーバメート (polycarbamate)、ポリオキシ (polyoxin)、炭酸水素カリウム (Potassium hydrogen carbonate)、プロベナゾール (probenazole)、プロクロラズ (prochloraz)、プロシミドン (procymidone)、プロパモカルブ塩酸塩 (propamocarb-hydrochloride)、プロピコナゾール (propiconazole)、プロピネブ (propineb)、プロキナジド (proquinazid)、プロチオカーブ (prothiocarb)、プロチオコナゾール (prothioconazole)、ピラカルボリド (pyracarbolid)、ピラクロストロビン (pyraclostrobin)、ピラゾホス (pyrazophos)、ピリブチカルブ (pyributicarb)、ピリフェノックス (pyrifenoxy)、ピリメタニル (pyrimethanil)、ピロキロン (pyroquilon)、キノキシフェン (quinoxifen)、キントゼン (quintozene: PCNB)、シルチオフアーム (silthiopham)、シメコナゾール (simeconazole)、シブコナゾール (sipconazole)、炭酸水素ナトリウム (Sodium bicarbonate)、次亜塩素酸ナトリウム (sodium hypochlorite)、スピロキサミン (spiroxamine)、SSF-129 ((E)-2-[2-(2,5-dimethylphenoxy)methyl]phenyl]-2-methoxyimino-N-methylacetamide)、ストレプトマイシン (streptomycin)、硫黄 (Sulfur)、テブコナゾール (tebuconazole)、テクロフタラム (tecloftalam)、テトラコナゾール (tetraconazole)、チアベンダゾール (thiabendazole)、チアジニル (thiadinil)、チウラム (thiram: TMTD)、チフルザミド (thifluzamide)、チオフアネートメチル (thiophanate-methyl)、トルクロホス・メチル (tolclofos-methyl)、TPN (TPN)、トリアジメホン (triadimefon)、トリアジメノール (triadimenol)、トリアゾキシド (triazoxide)、トリクラミド (triclamide)、トリシクラゾール (tricyclazole)、トリ

10

20

30

40

50

デモルフ (tridemorph)、トリフルミゾール (triflumizole)、トリフロキシストロビン (trifloxystrobin)、トリホリン (triforine)、トリチコナゾール (triticonazole)、バリダマイシン (validamycin)、ビンクロゾリン (vinclozolin)、ビニコナゾール (viniconazole)、ジネブ (zineb)、ジラム (ziram)、ゾキサミド (zoxamide)。

【 1 0 8 2 】

除草剤、植物ホルモン剤、植物成長調節物質として、

アブシジン酸 (Absciscic acid)、アセトクロール (acetochlor)、アシフルオルフェン (acifluorfen-sodium)、アラクロール (alachlor)、アロキシジム (alloydim)、アメトリン (ametryn)、アミカルバゾン (amicarbazone)、アミドスルフロン (amidosulfuron)、アミノエトキシビニルグリシン (aminoethoxyvinylglycine)、アミノピラリド (aminopyralid)、AC94, 377、アミプロホスメチル (amiprofos-methyl)、アンシミドール (ancymidol)、アシュラム (asulam)、アトラジン (atrazine)、アビグリシン (aviglycine)、アジムスルフロン (azimsulfuron)、ベフルブタミド (beflubutamid)、ベンフルラリン (benfluralin)、ベンフレセート (benfuresate)、ベンスルフロン・メチル (bensulfuron-methyl)、ベンスリド (bensulide : SAP)、ベントゾン (bentazone)、ベンチオカーブ (benthiocarb)、ベンザミゾール (benzamizole)、ベンズフェンディゾン (benzfendizone)、ベンゾビシクロン (benzobicyclon)、ベンゾフェナップ (benzofenap)、ベンジルアデニン (benzyl adenine)、ベンジルアミノプリン (benzylaminopurine)、ピアラホス (bialaphos)、ビフェノックス (bifenox)、ブラシノライド (Brassinolide)、ブロマシル (bromacil)、プロモブチド (bromobutide)、ブタクロール (butachlor)、ブタフェナシル (butafenacil)、ブタミホス (butamifos)、ブチレート (butylate)、カフェンストロール (cafenstrole)、炭酸カルシウム (Calcium carbonate)、過酸化カルシウム (Calcium peroxide)、カルバリル (carbaryl)、クロメトキシニル (chlomethoxynil)、クロリダゾン (chloridazon)、クロリムロン・エチル (chlorimuron-ethyl)、クロルフタリム (chlorphthalim)、クロルプロファム (chlorpropham)、クロルスルフロン (chlorsulfuron)、クロルタル・ジメチル (chlorthal-dimethyl)、クロルチアミド (chlorthiamid : DCBN)、塩化コリン (choline chloride)、シニドンエチル (cinidon-ethyl)、シンメチリン (cinmethylin)、シノスルフロン (cinosulfuron)、クレトジム (clethodim)、クロメプロップ (clomeprop)、クロキシホナック (cloxyfonac-sodium)、クロルメコート (chlormequat chloride)、4 - C P A (4-chlorophenoxyacetic acid)、クロプロップ (cliprop)、クロフェンセット (clofence t)、クミルロン (cumyluron)、シアナジン (cyanazine)、シクラニリド (cyclanilide)、シクロスルフアムロン (cyclosulfamron)、シハロホップ・ブチル (cyhalofop-butyl)、2, 4 - D 塩 (2, 4-Dichlorophenoxyacetic acid salts)、ジクロルプロップ (dichloroprop : 2, 4-DP)、ダイムロン (daimuron)、ダラポン (dalapon : DPA)、ジメテンアミド-P (dimethenamid-P)、ダミノジット (daminozide)、ダゾメット (dazomet)、デシルアルコール (n-Decyl alcohol)、ジカンバ (dicamba-sodium : MDBA)、ジクロベニル (dichlobenil : DBN)、ジフルフェニカン (diflufenican)、ジケグラック (dikegulac)、ジメピペレート (dimepiperate)、ジメタメトリン (dimethametryn)、ジメテナミド (dimethenamid)、ジクワット (diquat)、ジチオピル (dithiopyr)、ジウロン (diuron)、エンドタル (endothal)、エポコレオン (epocholeone)、エスプロカルブ (esprocarb)、エテホン (ethephon)、エチジムロン (ethidimuron)、エトキシスルフロン (ethoxysulfuron)、エチクロゼート (ethychlozate)、エトベンザニド (etobenzanid)、フェナリモル (fenarimol)、フェノキサプロップ・エチル (fenoxaprop-ethyl)、フェントラザミド (fentrazamide)、フラザスルフロン (flazasulfuron)、フロラスラム (florasulam)、フルアジホップ (fluazifop-butyl)、フルアゾレート (flauazolate)、フルカルバゾン (flucarbazone)、フルフェナセット (flufenacet)、フルフェンピル (flufenpyr)、フルメトラリン (flumetralin)、フルミオキサジン (flumioxazin)、フルプロパネート・ナトリウム (flupropanate-sodium)、フルピルスルフロン・メチル・ナトリウム (flupyrsulfuron-methyl-sodium)、フルルプリミドール (flurprimidol)

)、フルチアセット・メチル (fluthiacet-methyl)、フォラムスルフロン (foramsulfuron)、ホルクロルフェニユロン (forchlorfenuron)、ホメサフェン (formesafen)、ジベレリン (gibberellin)、グルホシネート (glufosinate)、グリホサート (glyphosate)、ハロスルフロン・メチル (halosulfuron-methyl)、ヘキサジノン (hexazinone)、イマザモックス (imazamox)、イマザピック (imazapic)、イマザビル (imazapyr)、イマザキン (imazaquin)、イマゾスルフロン (imazosulfuron)、イナベンフィド (inabenzifide)、インドール酢酸 (Indole acetic acid: IAA)、インドール酪酸 (Indole butyric acid)、ヨードスルフロン (iodosulfuron)、アイオキシニル (ioxynil-octanoate)、イソウロン (isouron)、イソオキサクロロトール (isoxachlortole)、イソオキサデイフェン (isoxadifen)、カルブチレート (karbutilate)、ラクトフェン (lactofen)、レナシル (lenacil)、リニユロン (linuron)、L G C - 4 2 1 5 3 (LGC-42153)、マレイン酸ヒドラジド (Maleic hydrazide)、メコプロップ (mecoprop: MCPP)、M C P 塩 (2-Methyl-4-chlorophenoxyacetic acid salts)、M C P A・チオエチル (MCPA-thioethyl)、M C P B (2-Methyl-4-chlorophenoxybutanoic acid ethyl ester)、メフェナセット (mefenacet)、メフルイジド (mefluidide)、メピコート (mepiquat)、メソスルフロン (mesosulfuron)、メソトリオン (mesotrione)、メチルダイムロン (methyl daimuron)、メタミホップ (metamifop)、メトラクロール (metolachlor)、メトリブジン (metribuzin)、メトスルフロン・メチル (metsulfuron-methyl)、モリネート (molinate)、ナフタリン酢酸 (naphthylacetic acid)、N A D (1-naphthaleneacetamide)、ナプロアニリド (naproanilide)、ナプロパミド (napropamide)、デシルアルコール (n-decyl alcohol)、ニコスルフロン (nicosulfuron)、フェニルフタルアミド酸 (n-phenylphthalamic acid)、オルベンカルブ (orbencarb)、オキサジアゾン (oxadiazon)、オキサジクロメホン (oxaziclonofone)、オキシシ硫酸塩 (oxine-sulfate)、パクロブトラゾール (paclobutrazol)、パラコート (paraquat)、ペラルゴン酸 (Pelargonic acid)、ペンディメタリン (pendimethalin)、ペノックスラム (penoxsulam)、ペントキサゾン (pentoxazone)、ペトキサミド (pethoxamide)、フェンメディファム (phenmedipham)、ピクロラム (picloram)、ピコリナフェン (picolinafen)、ピペロニルブトキシド (piperonyl butoxide)、ピペロホス (piperophos)、プレチラクロール (pretilachlor)、プリミスルフロン (primisulfuron-methyl)、プロカルバゾン (procarbazone)、プロジアミン (prodiamine)、プロフルアゾール (proflumazone)、プロフォキシディム (profoxydim)、プロヘキサジオン・カルシウム (prohexadione-calcium)、プロハイドロジャスモン (prohydrojasmon)、プロメトリン (prometryn)、プロパニル (propanil)、プロボキシカルバゾン (propoxycarbazone)、プロピザミド (propyzamide)、ピラクロニル (pyraclonil)、ピラフルフェン・エチル (pyraflufen-ethyl)、ピラゾレート (pyrazolate)、ピラゾスルフロン・エチル (pyrazosulfuron-ethyl)、ピラゾキシフェン (pyrazoxyfen)、ピリベンゾキシム (pyribenzoxim)、ピリブチカルブ (pyributicarb)、ピリダフォール (pyridafol)、ピリデート (pyridate)、ピリフタリド (pyriftalid)、ピリミノバック・メチル (pyriminobac-methyl)、ピリチオバック (pyrithiobac)、キンクロラック (quiclorac)、キノクラミン (quinoclamine)、キザロホップ・エチル (quizalofop-ethyl)、リムスルフロン (rimsulfuron)、セトキシジム (sethoxydim)、シデュロン (siduron)、シマジン (simazine)、シメトリン (simetryn)、塩素酸ナトリウム (Sodium chlorate)、スルホスルフロン (sulfosulfuron)、スエップ (swep: MCC)、テブチウロン (tebuthiuron)、テブラロキシディム (tepraloxym)、ターバシル (terbacil)、テルブカルブ (terbucarb: MBPMC)、テニルクロール (thenylchlor)、チアザフルロン (thiazafuron)、チジアズロン (ティジアズロン)、チフェンスルフロン・メチル (thifensulfuron-methyl)、トリアジフラム (triaziflam)、トリブフォス (tribufos)、トリクロピル (triclopyr)、トリジファン (tridiphan)、トリフロキシスルフロン (trifloxysulfuron)、トリフルラリン (trifluralin)、トリネキサバック・エチル (trinexapac-ethyl)、トリトスルフロン (tritosulfuron)、ユニコナゾール・P (uniconazole-P)、バーナレート (vemolate: PPTC)。

10

20

30

40

50

【 1 0 8 3 】

共力剤として、

ピペロニル ブトキサイド (piperonyl butoxide)、セサメックス (sesamex)、N - (2 - エチルヘキシル) - 8 , 9 , 1 0 - トリノルボルン - 5 - エン - 2 , 3 - ジカルボキシイミド (MGK 264)、W A R F - アンチレジスタント (WARF-antiresistant)、ジエチルマレエート (diethylmaleate)。

【 1 0 8 4 】

薬害軽減剤として、

ベノキサノール (benoxacor)、クロキントセト - メキシル (cloquintocet-mexyl)、シオメトリニル (cyometrinil)、ダイムロン (daimuron)、ジクロルミド (dichlormid)、フェンクロラゾール - エチル (fenchlorazole-ethyl)、フェンクロリム (fencloirim)、フルラゾール (flurazole)、フルフェニム (fluxofenim)、フリラゾール (furilazole)、メフェンピル - ジエチル (mefenpyr-diethyl)、MG191、無水ナフタル酸 (naphthalic anhydride)、オキサベトリニル (oxabetrinil)。

【 1 0 8 5 】

製剤例 9

本発明化合物 (2 1) 1 0 部と、上記の A 群に示される殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤、除草剤、植物ホルモン剤、または、植物成長調節物質等 (異性体およびその塩を含む)、共力剤、あるいは、薬害軽減剤 1 0 部とを、ラウリル硫酸ナトリウム 4 部、リグニンスルホン酸カルシウム 2 部、合成含水酸化珪素微粉末 2 0 部および珪藻土 5 4 部を混合した中に加え、良く攪拌、混合して混合水和剤を得る。

【 1 0 8 6 】

製剤例 1 0

本発明化合物 (3 4) 1 0 部と、上記の A 群に示される殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤、除草剤、植物ホルモン剤、または、植物成長調節物質等 (異性体およびその塩を含む)、共力剤、あるいは、薬害軽減剤 1 0 部とを、ラウリル硫酸ナトリウム 4 部、リグニンスルホン酸カルシウム 2 部、合成含水酸化珪素微粉末 2 0 部および珪藻土 5 4 部を混合した中に加え、良く攪拌、混合して混合水和剤を得る。

【 1 0 8 7 】

製剤例 1 1

本発明化合物 (4 9) 1 0 部と、上記の A 群に示される殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤、除草剤、植物ホルモン剤、または、植物成長調節物質等 (異性体およびその塩を含む)、共力剤、あるいは、薬害軽減剤 1 0 部とを、ラウリル硫酸ナトリウム 4 部、リグニンスルホン酸カルシウム 2 部、合成含水酸化珪素微粉末 2 0 部および珪藻土 5 4 部を混合した中に加え、良く攪拌、混合して混合水和剤を得る。

【 1 0 8 8 】

製剤例 1 2

本発明化合物 (5 6) 1 0 部と、上記の A 群に示される殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤、除草剤、植物ホルモン剤、または、植物成長調節物質等 (異性体およびその塩を含む)、共力剤、あるいは、薬害軽減剤 1 0 部とを、ラウリル硫酸ナトリウム 4 部、リグニンスルホン酸カルシウム 2 部、合成含水酸化珪素微粉末 2 0 部および珪藻土 5 4 部を混合した中に加え、良く攪拌、混合して混合水和剤を得る。

【 1 0 8 9 】

製剤例 1 3

本発明化合物 (5 9) 1 0 部と、上記の A 群に示される殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤、除草剤、植物ホルモン剤、または、植物成長調節物質等 (異性体およびその塩を含む)、共力剤、あるいは、薬害軽減剤 1 0 部とを、ラウリル硫酸ナトリウム 4 部、リグニンスルホン酸カルシウム 2 部、合成含水酸化珪素微粉末 2 0 部および珪藻土 5 4 部を混合した中に加え、良く攪拌、混合して混合水和剤を得る。

【 1 0 9 0 】

10

20

30

40

50

製剤例 1 4

本発明化合物（ 6 8 ） 1 0 部と、上記の A 群に示される殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤、除草剤、植物ホルモン剤、または、植物成長調節物質等（異性体およびその塩を含む）、共力剤、あるいは、薬害軽減剤 1 0 部とを、ラウリル硫酸ナトリウム 4 部、リグニンスルホン酸カルシウム 2 部、合成含水酸化珪素微粉末 2 0 部および珪藻土 5 4 部を混合した中に加え、良く攪拌、混合して混合水和剤を得る。

【 1 0 9 1 】

製剤例 1 5

本発明化合物（ 7 0 ） 1 0 部と、上記の A 群に示される殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤、除草剤、植物ホルモン剤、または、植物成長調節物質等（異性体およびその塩を含む）、共力剤、あるいは、薬害軽減剤 1 0 部とを、ラウリル硫酸ナトリウム 4 部、リグニンスルホン酸カルシウム 2 部、合成含水酸化珪素微粉末 2 0 部および珪藻土 5 4 部を混合した中に加え、良く攪拌、混合して混合水和剤を得る。

10

【 1 0 9 2 】

製剤例 1 6

本発明化合物（ 7 4 ） 1 0 部と、上記の A 群に示される殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤、除草剤、植物ホルモン剤、または、植物成長調節物質等（異性体およびその塩を含む）、共力剤、あるいは、薬害軽減剤 1 0 部とを、ラウリル硫酸ナトリウム 4 部、リグニンスルホン酸カルシウム 2 部、合成含水酸化珪素微粉末 2 0 部および珪藻土 5 4 部を混合した中に加え、良く攪拌、混合して混合水和剤を得る。

20

【 1 0 9 3 】

製剤例 1 7

本発明化合物（ 1 1 4 ） 1 0 部と、上記の A 群に示される殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤、除草剤、植物ホルモン剤、または、植物成長調節物質等（異性体およびその塩を含む）、共力剤、あるいは、薬害軽減剤 1 0 部とを、ラウリル硫酸ナトリウム 4 部、リグニンスルホン酸カルシウム 2 部、合成含水酸化珪素微粉末 2 0 部および珪藻土 5 4 部を混合した中に加え、良く攪拌、混合して混合水和剤を得る。

【 1 0 9 4 】

製剤例 1 8

本発明化合物（ 1 1 5 ） 1 0 部と、上記の A 群に示される殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤、除草剤、植物ホルモン剤、または、植物成長調節物質等（異性体およびその塩を含む）、共力剤、あるいは、薬害軽減剤 1 0 部とを、ラウリル硫酸ナトリウム 4 部、リグニンスルホン酸カルシウム 2 部、合成含水酸化珪素微粉末 2 0 部および珪藻土 5 4 部を混合した中に加え、良く攪拌、混合して混合水和剤を得る。

30

【 1 0 9 5 】

製剤例 1 9

本発明化合物（ 1 1 7 ） 1 0 部と、上記の A 群に示される殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤、除草剤、植物ホルモン剤、または、植物成長調節物質等（異性体およびその塩を含む）、共力剤、あるいは、薬害軽減剤 1 0 部とを、ラウリル硫酸ナトリウム 4 部、リグニンスルホン酸カルシウム 2 部、合成含水酸化珪素微粉末 2 0 部および珪藻土 5 4 部を混合した中に加え、良く攪拌、混合して混合水和剤を得る。

40

【 1 0 9 6 】

製剤例 2 0

本発明化合物（ 1 1 9 ） 1 0 部と、上記の A 群に示される殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤、除草剤、植物ホルモン剤、または、植物成長調節物質等（異性体およびその塩を含む）、共力剤、あるいは、薬害軽減剤 1 0 部とを、ラウリル硫酸ナトリウム 4 部、リグニンスルホン酸カルシウム 2 部、合成含水酸化珪素微粉末 2 0 部および珪藻土 5 4 部を混合した中に加え、良く攪拌、混合して混合水和剤を得る。

【 1 0 9 7 】

製剤例 2 1

50

本発明化合物（１３５）１０部と、上記のＡ群に示される殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤、除草剤、植物ホルモン剤、または、植物成長調節物質等（異性体およびその塩を含む）、共力剤、あるいは、薬害軽減剤１０部とを、ラウリル硫酸ナトリウム４部、リグニンスルホン酸カルシウム２部、合成含水酸化珪素微粉末２０部および珪藻土５４部を混合した中に加え、良く攪拌、混合して混合水和剤を得る。

【１０９８】

製剤例２２

本発明化合物（１３８）１０部と、上記のＡ群に示される殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤、除草剤、植物ホルモン剤、または、植物成長調節物質等（異性体およびその塩を含む）、共力剤、あるいは、薬害軽減剤１０部とを、ラウリル硫酸ナトリウム４部、リグニンスルホン酸カルシウム２部、合成含水酸化珪素微粉末２０部および珪藻土５４部を混合した中に加え、良く攪拌、混合して混合水和剤を得る。

10

【１０９９】

製剤例２３

本発明化合物（１４４）１０部と、上記のＡ群に示される殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤、除草剤、植物ホルモン剤、または、植物成長調節物質等（異性体およびその塩を含む）、共力剤、あるいは、薬害軽減剤１０部とを、ラウリル硫酸ナトリウム４部、リグニンスルホン酸カルシウム２部、合成含水酸化珪素微粉末２０部および珪藻土５４部を混合した中に加え、良く攪拌、混合して混合水和剤を得る。

20

【１１００】

製剤例２４

本発明化合物（１５４）１０部と、上記のＡ群に示される殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤、除草剤、植物ホルモン剤、または、植物成長調節物質等（異性体およびその塩を含む）、共力剤、あるいは、薬害軽減剤１０部とを、ラウリル硫酸ナトリウム４部、リグニンスルホン酸カルシウム２部、合成含水酸化珪素微粉末２０部および珪藻土５４部を混合した中に加え、良く攪拌、混合して混合水和剤を得る。

【１１０１】

製剤例２５

本発明化合物（２０３）１０部と、上記のＡ群に示される殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤、除草剤、植物ホルモン剤、または、植物成長調節物質等（異性体およびその塩を含む）、共力剤、あるいは、薬害軽減剤１０部とを、ラウリル硫酸ナトリウム４部、リグニンスルホン酸カルシウム２部、合成含水酸化珪素微粉末２０部および珪藻土５４部を混合した中に加え、良く攪拌、混合して混合水和剤を得る。

30

【１１０２】

製剤例２６

本発明化合物（２０４）１０部と、上記のＡ群に示される殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤、除草剤、植物ホルモン剤、または、植物成長調節物質等（異性体およびその塩を含む）、共力剤、あるいは、薬害軽減剤１０部とを、ラウリル硫酸ナトリウム４部、リグニンスルホン酸カルシウム２部、合成含水酸化珪素微粉末２０部および珪藻土５４部を混合した中に加え、良く攪拌、混合して混合水和剤を得る。

40

【１１０３】

製剤例２７

本発明化合物（２１３）１０部と、上記のＡ群に示される殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤、除草剤、植物ホルモン剤、または、植物成長調節物質等（異性体およびその塩を含む）、共力剤、あるいは、薬害軽減剤１０部とを、ラウリル硫酸ナトリウム４部、リグニンスルホン酸カルシウム２部、合成含水酸化珪素微粉末２０部および珪藻土５４部を混合した中に加え、良く攪拌、混合して混合水和剤を得る。

【１１０４】

製剤例２８

本発明化合物（２３１）１０部と、上記のＡ群に示される殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤

50

、殺菌剤、除草剤、植物ホルモン剤、または、植物成長調節物質等（異性体およびその塩を含む）、共力剤、あるいは、薬害軽減剤 10 部とを、ラウリル硫酸ナトリウム 4 部、リグニンスルホン酸カルシウム 2 部、合成含水酸化珪素微粉末 20 部および珪藻土 54 部を混合した中に加え、良く攪拌、混合して混合水和剤を得る。

【1105】

次に、本発明化合物の有害節足動物防除効力を試験例により示す。

【1106】

試験例 1

製剤例 5 より得られた本発明化合物 (1)、(4) ~ (53)、(55) ~ (74)、(76) ~ (83)、(85) ~ (120)、(122) ~ (156)、(158) ~ (167)、(170) ~ (171)、(173)、(175) ~ (176)、(178)、(181) ~ (184)、(188) ~ (190)、(195) ~ (197)、(200) ~ (216)、(218) ~ (219)、(221) ~ (223) および (231) の製剤を有効成分濃度が 500 ppm となるように水で希釈し、試験用散布液を調製した。

10

一方、ポリエチレンカップにキャベツを植え、第3本葉ないしは第4本葉が展開するまで生育させた。そのキャベツに上記の試験用散布液を 20 ml / カップの割合で散布した。

【1107】

キャベツに散布処理された薬液が乾燥した後、コナガ (*Plutella xylostella*) の 3 齢幼虫 10 頭を寄生させ、5 日後にコナガの数を調査し、下記の基準により防除価を求めた。

20

$$\text{防除価 (\%)} = \{ 1 - (C b \times T a i) / (C a i \times T b) \} \times 100$$

なお、式中の文字は以下の意味を表す。

C b : 無処理区の処理前の虫数

C a i : 無処理区の観察時の虫数

T b : 処理区の処理前の虫数

T a i : 処理区の観察時の虫数

その結果、本発明化合物 (1)、(4) ~ (53)、(55) ~ (74)、(76) ~ (83)、(85) ~ (120)、(122) ~ (156)、(158) ~ (167)、(170) ~ (171)、(173)、(175) ~ (176)、(178)、(181) ~ (184)、(188) ~ (190)、(195) ~ (197)、(200) ~ (216)、(218) ~ (219)、(221) ~ (223) および (231) の試験用散布液の処理区は、各々、防除価 80 % 以上を示した。

30

【1108】

試験例 2

製剤例 5 により得られた本発明化合物 (4) ~ (7)、(9) ~ (12)、(17) ~ (23)、(27)、(29)、(32) ~ (44)、(48) ~ (51)、(56) ~ (61)、(65) ~ (68)、(70) ~ (72)、(74) ~ (75)、(78) ~ (81)、(83) ~ (85)、(87) ~ (88)、(91) ~ (97)、(99) ~ (102)、(104) ~ (120)、(122) ~ (125)、(127) ~ (135)、(137) ~ (144)、(147) ~ (149)、(151) ~ (161)、(164)、(166) ~ (168)、(171) ~ (173)、(175) ~ (184)、(186) ~ (188)、(191)、(193) ~ (205)、(208) ~ (209)、(213) ~ (215)、(218) ~ (224)、(226) ~ (230) および (231) の製剤を有効成分濃度が 500 ppm となるように水で希釈し、試験用散布液を調製した。

40

一方、ポリエチレンカップにキュウリを植え、第 1 本葉が展開するまでに生育させ、そこにワタアブラムシ (*Aphis gossypii*) 約 30 頭を寄生させた。1 日後、そのキュウリに上記の試験用散布液を 20 ml / カップの割合で散布した。散布 6 日後にワタアブラムシ

50

の数を調査し、次の式により防除価を求めた。

$$\text{防除価}(\%) = \{ 1 - (C b \times T a i) / (C a i \times T b) \} \times 100$$

なお、式中の文字は以下の意味を表す。

C b : 無処理区の処理前の虫数

C a i : 無処理区の観察時の虫数

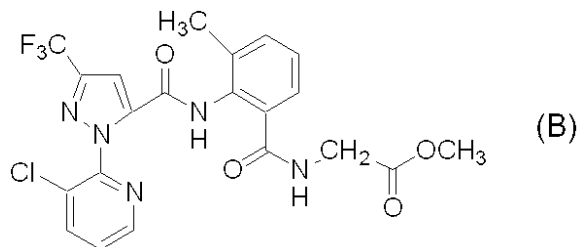
T b : 処理区の処理前の虫数

T a i : 処理区の観察時の虫数

その結果、本発明化合物(4)~(7)、(9)~(12)、(17)~(23)、(27)、(29)、(32)~(44)、(48)~(51)、(56)~(61)、(65)~(68)、(70)~(72)、(74)~(75)、(78)~(81)、(83)~(85)、(87)~(88)、(91)~(97)、(99)~(102)、(104)~(120)、(122)~(125)、(127)~(135)、(137)~(144)、(147)~(149)、(151)~(161)、(164)、(166)~(168)、(171)~(173)、(175)~(184)、(186)~(188)、(191)、(193)~(205)、(208)~(209)、(213)~(215)、(218)~(224)、(226)~(230)および(231)の試験用散布液の処理区は、各々、防除価90%以上を示した。

【1109】

さらに、下記式(B)で示されるWO03/015518号公報明細書の第109頁に記載された化合物354



(以下、比較化合物(B)と記す。)を試験例2と同様の試験に供したところ、比較化合物(B)の試験用散布液の処理区は、防除価30%未満であった。

【1110】

試験例3

製剤例5より得られた本発明化合物(4)~(13)、(15)~(23)、(25)~(44)、(48)~(51)、(56)~(58)、(61)、(65)~(74)、(80)~(81)、(85)~(97)、(100)、(102)、(104)~(120)、(122)~(125)、(127)~(137)、(139)~(156)、(158)~(167)、(170)~(171)、(173)、(175)~(176)、(178)、(181)~(184)、(188)~(190)、(195)~(197)、(200)~(208)、(210)~(216)、(218)~(219)、(221)~(224)および(231)の製剤を有効成分濃度が500ppmとなるように水で希釈し、試験用散布液を調製した。

一方、ポリエチレンカップにキャベツを植え、第3本葉ないしは第4本葉が展開するまで生育させた。そのキャベツに上記の試験用散布液を20ml/カップの割合で散布した。該キャベツに散布処理された薬液が乾燥した後、ハスモンヨトウ(*Spodoptera litura*)の4齢幼虫10頭を寄生させた。4日後にキャベツ葉上のハスモンヨトウの生存虫数を調査し、次の式により防除価を求めた。

$$\text{防除価}(\%) = \{ 1 - (C b \times T a i) / (C a i \times T b) \} \times 100$$

なお、式中の文字は以下の意味を表す。

10

20

30

40

50

C b : 無処理区の処理前の虫数

C a i : 無処理区の観察時の虫数

T b : 処理区の処理前の虫数

T a i : 処理区の観察時の虫数

その結果、本発明化合物 (4) ~ (1 3)、(1 5) ~ (2 3)、(2 5) ~ (4 4)、(4 8) ~ (5 1)、(5 6) ~ (5 8)、(6 1)、(6 5) ~ (7 4)、(8 0) ~ (8 1)、(8 5) ~ (9 7)、(1 0 0)、(1 0 2)、(1 0 4) ~ (1 2 0)、(1 2 2) ~ (1 2 5)、(1 2 7) ~ (1 3 7)、(1 3 9) ~ (1 5 6)、(1 5 8) ~ (1 6 7)、(1 7 0) ~ (1 7 1)、(1 7 3)、(1 7 5) ~ (1 7 6)、(1 7 8)、(1 8 1) ~ (1 8 4)、(1 8 8) ~ (1 9 0)、(1 9 5) ~ (1 9 7)、(2 0 0) ~ (2 0 8)、(2 1 0) ~ (2 1 6)、(2 1 8) ~ (2 1 9)、(2 2 1) ~ (2 2 4) および (2 3 1) の試験用散布液の処理区は各々防除価 8 0 % 以上を示した。

【 1 1 1 1 】

試験例 4

製剤例 5 により得られた本発明化合物 (4) ~ (1 3)、(1 5) ~ (2 3)、(2 5) ~ (4 5)、(4 7) ~ (5 1)、(5 3)、(5 5) ~ (6 1)、(6 5) ~ (7 2)、(7 4)、(7 8) ~ (8 1)、(8 3)、(8 5) ~ (1 0 2)、(1 0 4) ~ (1 0 5)、(1 0 7) ~ (1 1 7)、(1 1 9) ~ (1 2 0)、(1 2 2) ~ (1 2 5)、(1 2 7) ~ (1 5 6)、(1 5 8) ~ (1 6 4)、(1 6 6) ~ (1 6 7)、(1 7 1)、(1 7 3)、(1 7 5) ~ (1 7 6)、(1 7 8)、(1 8 1) ~ (1 8 4)、(1 8 8) ~ (1 9 0)、(1 9 5) ~ (1 9 7)、(2 0 0) ~ (2 1 1)、(2 1 3) ~ (2 1 6)、(2 1 8) ~ (2 1 9)、(2 2 1) ~ (2 2 4) および (2 3 1) の製剤を有効成分濃度が 5 0 0 p p m となるように水で希釈し、試験用散布液を調整した。

一方、プラスチックカップに植えたリンゴ幼苗 (播種 2 8 日後、樹高約 1 5 c m) に上記の試験用散布液 2 0 m l を各々散布処理した。該リンゴに散布処理された薬液が乾く程度に風乾した後、約 3 0 頭のリンゴコカクモンハマキ (*Adoxophyes orana fasciata*) 1 齢幼虫を放った。散布 7 日後にリンゴ幼苗上の生存虫数を調査し、次の式により防除価を求めた。

$$\text{防除価}(\%) = \{ 1 - (C b \times T a i) / (C a i \times T b) \} \times 1 0 0$$

なお、式中の文字は以下の意味を表す。

C b : 無処理区の処理前の虫数

C a i : 無処理区の観察時の虫数

T b : 処理区の処理前の虫数

T a i : 処理区の観察時の虫数

その結果、本発明化合物 (4) ~ (1 3)、(1 5) ~ (2 3)、(2 5) ~ (4 5)、(4 7) ~ (5 1)、(5 3)、(5 5) ~ (6 1)、(6 5) ~ (7 2)、(7 4)、(7 8) ~ (8 1)、(8 3)、(8 5) ~ (1 0 2)、(1 0 4) ~ (1 0 5)、(1 0 7) ~ (1 1 7)、(1 1 9) ~ (1 2 0)、(1 2 2) ~ (1 2 5)、(1 2 7) ~ (1 5 6)、(1 5 8) ~ (1 6 4)、(1 6 6) ~ (1 6 7)、(1 7 1)、(1 7 3)、(1 7 5) ~ (1 7 6)、(1 7 8)、(1 8 1) ~ (1 8 4)、(1 8 8) ~ (1 9 0)、(1 9 5) ~ (1 9 7)、(2 0 0) ~ (2 1 1)、(2 1 3) ~ (2 1 6)、(2 1 8) ~ (2 1 9)、(2 2 1) ~ (2 2 4) および (2 3 1) の試験用散布液の処理区は各々防除価 9 0 % 以上を示した。

【 1 1 1 2 】

試験例 5

製剤例 5 により得られた本発明化合物 (4) ~ (5)、(9) ~ (1 0)、(1 7)、

(1 9) ~ (2 2)、(2 7)、(2 9)、(3 2) ~ (4 4)、(4 8) ~ (5 1)、
 (5 6) ~ (6 1)、(6 6) ~ (6 8)、(7 0) ~ (7 2)、(7 4) ~ (7 5)、
 (7 9)、(8 1)、(8 5)、(8 8)、(9 1) ~ (9 2)、(9 4) ~ (9 5)、
 (9 9)、(1 0 1) ~ (1 0 2)、(1 0 4) ~ (1 2 0)、(1 2 2) ~ (1 2 4)
 、(1 2 7) ~ (1 2 9)、(1 3 1) ~ (1 3 2)、(1 3 5) ~ (1 3 6)、(1 4
 0)、(1 4 2) ~ (1 4 5)、(1 4 7) ~ (1 5 1)、(1 5 3) ~ (1 5 7)、(1
 5 9)、(1 6 3) ~ (1 6 4)、(1 6 7)、(1 7 1) ~ (1 7 2)、(1 7 5)
 ~ (1 7 6)、(1 8 3)、(1 8 7)、(1 9 3) ~ (1 9 4)、(1 9 6) ~ (2 0
 4)、(2 0 6)、(2 0 8) ~ (2 0 9)、(2 1 3) ~ (2 2 1)、(2 2 6) ~ (2
 2 7) および (2 3 1) の製剤を有効成分濃度が 5 0 0 p p m となるように水で希釈し
 、試験用散布液を調製した。

10

一方、ポリエチレンカップにキュウリを植え、第 1 本葉が展開するまで生育させ、その
 キュウリに上記の試験用散布液を 2 0 m l / カップの割合で散布した。該キュウリに散布
 処理された薬液が乾燥した後、第 1 本葉を切り取ってポリエチレンカップ (直径 1 1 0 m m
) 内の水を含ませたろ紙 (直径 7 0 m m) の上に置いた。このキュウリ葉上にミカンキイロ
 アザミウマ (*Frankliniella occidentalis*) の幼虫を 2 0 頭放してポリエチレンカップ
 の蓋をした。散布 7 日後に、キュウリ葉上の生存虫数を調査し、次の式により防除価を求
 めた。

$$\text{防除価 (\%)} = \{ 1 - (C b \times T a i) / (C a i \times T b) \} \times 1 0 0$$

20

なお、式中の文字は以下の意味を表す。

C b : 無処理区の処理前の虫数

C a i : 無処理区の観察時の虫数

T b : 処理区の処理前の虫数

T a i : 処理区の観察時の虫数

その結果、本発明化合物 (4) ~ (5)、(9) ~ (1 0)、(1 7)、(1 9) ~ (2 2)、
 (2 7)、(2 9)、(3 2) ~ (4 4)、(4 8) ~ (5 1)、(5 6) ~ (6 1)、(6 6) ~ (6 8)、
 (7 0) ~ (7 2)、(7 4) ~ (7 5)、(7 9)、(8 1)、(8 5)、(8 8)、(9 1) ~ (9 2)、
 (9 4) ~ (9 5)、(9 9)、(1 0 1) ~ (1 0 2)、(1 0 4) ~ (1 2 0)、(1 2 2) ~ (1 2 4)、
 (1 2 7) ~ (1 2 9)、(1 3 1) ~ (1 3 2)、(1 3 5) ~ (1 3 6)、(1 4 0)、(1 4
 2) ~ (1 4 5)、(1 4 7) ~ (1 5 1)、(1 5 3) ~ (1 5 7)、(1 5 9)、(1 6 3) ~ (1 6 4)、
 (1 6 7)、(1 7 1) ~ (1 7 2)、(1 7 5) ~ (1 7 6)、(1 8 3)、(1 8 7)、(1 9 3) ~ (1 9 4)、
 (1 9 6) ~ (2 0 4)、(2 0 6)、(2 0 8) ~ (2 0 9)、(2 1 3) ~ (2 2 1)、(2 2 6) ~ (2 2 7) およ
 び (2 3 1) の試験用散布液の処理区は各々防除価 9 0 % 以上を示した。

30

【 1 1 1 3 】

試験例 6

製剤例 5 により得られた本発明化合物 (5)、(3 2)、(3 4)、(4 3) ~ (4 4)
)、(4 9) ~ (5 0)、(5 6)、(5 9)、(9 3)、(9 5) ~ (9 6)、(1 0
 7)、(1 1 1) ~ (1 1 2)、(1 1 4)、(1 1 9)、(1 2 7)、(1 2 9)、(1
 3 2) ~ (1 3 3)、(1 4 4)、(1 4 7) ~ (1 4 8)、(1 5 3)、(1 5 8)
 、(1 6 7) ~ (1 6 8)、(1 7 1) ~ (1 7 2)、(1 7 7) ~ (1 7 8)、(1 8
 2) ~ (1 8 4)、(1 8 6) ~ (1 8 7)、(1 9 3) ~ (1 9 4)、(1 9 7) ~ (1
 9 9)、(2 0 1)、(2 0 4)、(2 0 9)、(2 1 3)、(2 1 5)、(2 1 9)
 ~ (2 2 0)、(2 2 1)、(2 2 3)、(2 2 6) および (2 3 1) の製剤を有効成分
 濃度が 5 0 0 p p m となるように水で希釈し、試験用散布液を調製した。

40

一方、ポリエチレンカップにキャベツを植え、第 1 本葉が展開するまで生育させ、第 1
 本葉を残して他の葉は切除し、これにシルバーリーフコナジラミ (*Bemisia argentifolii*

50

成虫を放して約 24 時間産卵させた。該キャベツを 8 日間温室内に保持し、産下された卵から幼虫が孵化してきた状態のところに上記の試験用散布液を 20 ml / カップの割合で散布した。散布 7 日後にキャベツ葉上の生存幼虫数の調査を行い、次の式により防除価を求めた。

$$\text{防除価}(\%) = \{ 1 - (C b \times T a i) / (C a i \times T b) \} \times 100$$

なお、式中の文字は以下の意味を表す。

C b : 無処理区の処理前の虫数

C a i : 無処理区の観察時の虫数

T b : 処理区の処理前の虫数

T a i : 処理区の観察時の虫数

その結果、本発明化合物 (5)、(32)、(34)、(43) ~ (44)、(49) ~ (50)、(56)、(59)、(93)、(95) ~ (96)、(107)、(111) ~ (112)、(114)、(119)、(127)、(129)、(132) ~ (133)、(144)、(147) ~ (148)、(153)、(158)、(167) ~ (168)、(171) ~ (172)、(177) ~ (178)、(182) ~ (184)、(186) ~ (187)、(193) ~ (194)、(197) ~ (199)、(201)、(204)、(209)、(213)、(215)、(219) ~ (220)、(221)、(223)、(226) および (231) の試験用散布液の処理区は各々防除価 90 % 以上を示した。

【産業上の利用可能性】

【1114】

本発明によると、本発明のヒドラジド化合物は有害生物に対して優れた防除効力を有することから、有害生物防除剤として有用である。

10

20

フロントページの続き

- (72)発明者 野倉 吉彦
兵庫県宝塚市高司四丁目2番1号 住友化学株式会社内
- (72)発明者 岩田 知江美
兵庫県宝塚市高司四丁目2番1号 住友化学株式会社内

審査官 藤原 浩子

- (56)参考文献 特表2004-538327(JP,A)
特表2005-502716(JP,A)
特表2005-085216(JP,A)
特開昭62-209053(JP,A)
特開平01-275554(JP,A)

- (58)調査した分野(Int.Cl., DB名)
C07D
A01N
CA/REGISTRY(STN)