

(19) 日本国特許庁 (JP)

(12) 公表特許公報 (A)

(11) 特許出願公表番号

特表2016-536364

(P2016-536364A)

(43) 公表日 平成28年11月24日 (2016. 11. 24)

(51) Int. Cl.	F I	テーマコード (参考)
C O 7 D 231/12 (2006. 01)	C O 7 D 231/12	C S P C 4 C O 5 6
A O 1 P 7/04 (2006. 01)	A O 1 P 7/04	4 C O 6 3
A O 1 P 7/02 (2006. 01)	A O 1 P 7/02	4 C O 6 9
A O 1 P 7/00 (2006. 01)	A O 1 P 7/00	4 C O 8 6
A O 1 N 43/56 (2006. 01)	A O 1 N 43/56	D 4 H O 1 1
審査請求 未請求 予備審査請求 未請求 (全 402 頁) 最終頁に続く		

(21) 出願番号 特願2016-551034 (P2016-551034)
 (86) (22) 出願日 平成26年11月5日 (2014. 11. 5)
 (85) 翻訳文提出日 平成28年7月4日 (2016. 7. 4)
 (86) 国際出願番号 PCT/EP2014/073795
 (87) 国際公開番号 W02015/067647
 (87) 国際公開日 平成27年5月14日 (2015. 5. 14)
 (31) 優先権主張番号 13191610.8
 (32) 優先日 平成25年11月5日 (2013. 11. 5)
 (33) 優先権主張国 欧州特許庁 (EP)
 (31) 優先権主張番号 14181149.7
 (32) 優先日 平成26年8月15日 (2014. 8. 15)
 (33) 優先権主張国 欧州特許庁 (EP)

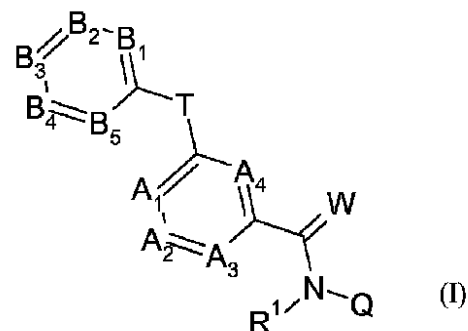
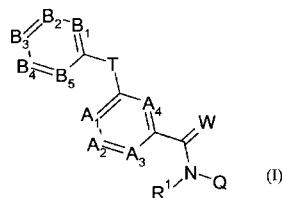
(71) 出願人 507203353
 バイエル・クロップサイエンス・アクチエ
 ンゲゼルシャフト
 ドイツ国、40789・モンハイム・アム
 ・ライン、アルフレート・ノベラーシュト
 ラーセ・50
 (74) 代理人 100091982
 弁理士 永井 浩之
 (74) 代理人 100091487
 弁理士 中村 行孝
 (74) 代理人 100082991
 弁理士 佐藤 泰和
 (74) 代理人 100105153
 弁理士 朝倉 悟

最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 節足動物を防除するための新規化合物

(57) 【要約】

本発明は、とりわけ、一般式 (I) の化合物に関し、



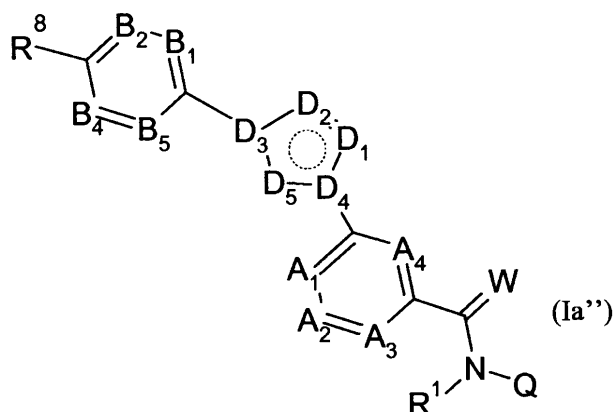
式中、 $A_1 \sim A_4$ 、 T 、 n 、 W 、 Q 、 R^1 および $B_1 \sim B_4$ ラジカルは、それぞれ本明細書で定義される通りである。また、式 (I) の化合物を製造するための方法も記載される。本発明の化合物は、農業における昆虫、クモ形類動物および線虫、ならびに獣医学における外部寄生生物の防除に特に適している。

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I a'') の化合物：

【化 1】



10

(式中、

D₁ は、C-R¹¹ または N および O から選択されるヘテロ原子であり、

D₂ は、C-R¹¹ または N および O から選択されるヘテロ原子であり、

20

D₃ は、C または N であり、

D₄ は、C または N であり、

D₅ は、C-R¹¹ または N であり、

D₁、D₂、D₃、D₄ および D₅ から選択される 1 つまたは 2 つ以下の部分はヘテロ原子であり、



は、芳香族系であり、

R¹ は、H、いずれの場合も任意に置換された C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-アルキニル、C₃-C₇-シクロアルキル、C₁-C₆-アルキルカルボニル、C₁-C₆-アルコキシカルボニル、アリール (C₁-C₃)-アルキルまたはヘテロアリール (C₁-C₃)-アルキルであり、

30

以下の部分は、以下の通り、

A₁ は C-R² または N であり、

A₂ は C-R³ または N であり、

A₃ は C-R⁴ または N であり、

A₄ は C-R⁵ または N であり、

B₁ は C-R⁶ または N であり、

B₂ は C-R⁷ または N であり、

40

B₄ は C-R⁹ または N であり、かつ、

B₅ は C-R¹⁰ または N であるが、

A₁ ~ A₄ 部分の 3 つ以下が N であり、B₁ ~ B₅ 部分の 3 つ以下が同時に N であり、

R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R⁷、R⁹ および R¹⁰ は、それぞれ独立して、H、ハロゲン、シアノ、ニトロ、いずれの場合も任意に置換された C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-シクロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ、N-C₁-C₆-アルコキシイミノ-C₁-C₃-アルキル、C₁-C₆-アルキルスルファニル、C₁-C₆-アルキルスルフィニル、C₁-C₆-アルキルスルホニル、N-C₁-C₆-アルキルアミノ、N、N-ジ-C₁-C₆-アルキルアミノまたは N-C₁-C₃-アルコキシ-C₁-C₄-アルキルアミノもしくは 1-ピロリジニルであり、

50

A₂ 部分および A₃ 部分のいずれも N、R³ および R⁴ でない場合、それらが結合する炭素原子と一緒にあって、0、1 もしくは 2 個の窒素原子および／または 0 もしくは 1 個の酸素原子および／または 0 もしくは 1 個の硫黄原子を含有する 5 もしくは 6 員環を形成してもよく、

A₁ 部分および A₂ 部分のいずれも N、R² および R³ でない場合、それらが結合する炭素原子と一緒にあって、0、1 または 2 個の窒素原子を含有する 6 員環を形成してもよく、

R⁸ は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、いずれの場合も任意に置換された C₁ - C₆ - アルキル、C₃ - C₆ - シクロアルキル、C₁ - C₆ - アルコキシ、N - C₁ - C₆ - アルコキシイミノ - C₁ - C₃ - アルキル、C₁ - C₆ - アルキルスルファニル、C₁ - C₆ - アルキルスルフィニル、C₁ - C₆ - アルキルスルホニル、N - C₁ - C₆ - アルキルアミノまたは N、N - ジ - C₁ - C₆ - アルキルアミノであり、

R¹¹ は独立して、H、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、または任意に置換された C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₆ - アルキルオキシ、C₁ - C₆ - アルキルカルボニル、C₁ - C₆ - アルキルスルファニル、C₁ - C₆ - アルキルスルフィニル、C₁ - C₆ - アルキルスルホニルであり、好ましくは H であり、

W は O または S であり、

Q は、H、ホルミル、ヒドロキシル、アミノ、またはいずれの場合も任意に置換された C₁ - C₆ - アルキル、C₂ - C₆ - アルケニル、C₂ - C₆ - アルキニル、C₃ - C₆ - シクロアルキル、C₁ - C₅ - ヘテロシクロアルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ、C₁ - C₆ - アルキル - C₃ - C₆ - シクロアルキル、C₃ - C₆ - シクロアルキル - C₁ - C₆ - アルキル、C₆ - 、C₁₀ - 、C₁₄ - アリール、C₁ - C₅ - ヘテロアリール、C₆ - 、C₁₀ - 、C₁₄ - アリール - (C₁ - C₃) - アルキル、C₁ - C₅ - ヘテロアリール - (C₁ - C₃) - アルキル、N - C₁ - C₄ - アルキルアミノ、N - C₁ - C₄ - アルキルカルボニルアミノもしくは N、N - ジ - C₁ - C₄ - アルキルアミノであるか、あるいは、

任意にポリ - V - 置換された不飽和 6 員炭素環であるか、あるいは、

任意にポリ - V - 置換された不飽和 4、5 または 6 員複素環式環であり、

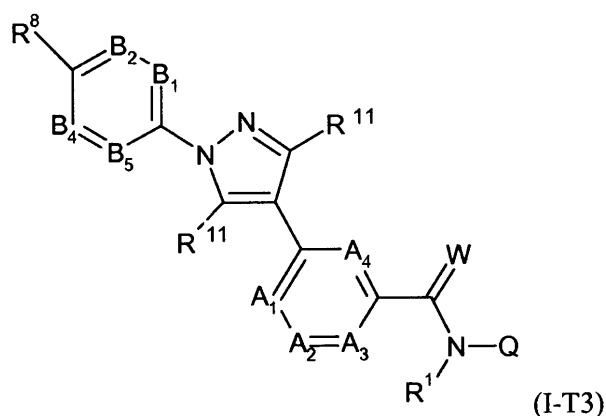
V は独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、いずれの場合も任意に置換された C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₄ - アルケニル、C₁ - C₄ - アルキニル、C₃ - C₆ - シクロアルキル、C₁ - C₆ - アルコキシ、N - C₁ - C₆ - アルコキシイミノ - C₁ - C₃ - アルキル、C₁ - C₆ - アルキルスルファニル、C₁ - C₆ - アルキルスルフィニル、C₁ - C₆ - アルキルスルホニルまたは N、N - ジ - (C₁ - C₆ - アルキル) アミノである)、

ならびに前記式 (I a'') の化合物の塩、N - 酸化物および互変異性型。

【請求項 2】

式 (I a'') の化合物が式 (I - T3) の化合物である、請求項 1 に記載の化合物：

【化 2】



10

20

30

40

50

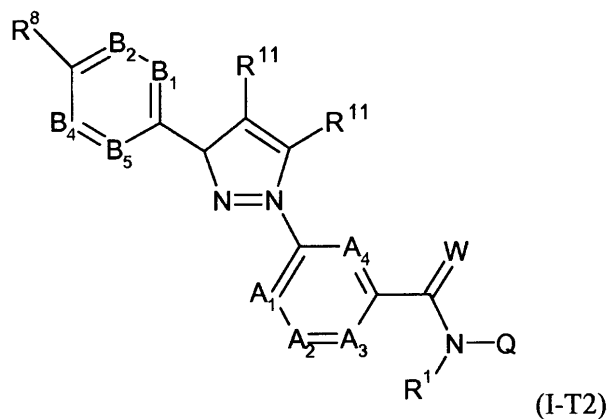
(式中、

R^1 、 A_1 、 A_2 、 A_3 、 A_4 、 R^{11} 、 B_1 、 B_2 、 B_4 、 B_5 、 R^8 、 Q および W は、それぞれ請求項1で定義される通りであり、 A_1 、 A_2 、 A_3 、 A_4 から選択される1つ以下の部分がNであり、 B_1 、 B_2 、 B_3 、 B_4 および B_5 から選択される1つ以下の部分がNである)。

【請求項3】

式(I a'')の化合物が式(I-T2)の化合物である、請求項1に記載の化合物：

【化3】



10

20

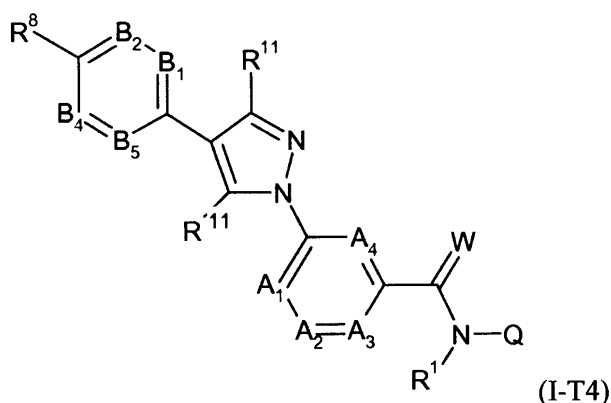
(式中、

R^1 、 A_1 、 A_2 、 A_3 、 A_4 、 R^{11} 、 B_1 、 B_2 、 B_4 、 B_5 、 R^8 、 Q および W は、それぞれ請求項1で定義される通りであり、 A_1 、 A_2 、 A_3 、 A_4 から選択される1つ以下の部分がNであり、 B_1 、 B_2 、 B_3 、 B_4 および B_5 から選択される1つ以下の部分がNである)。

【請求項4】

式(I a'')の化合物が式(I-T4)の化合物である、請求項1に記載の化合物：

【化4】



30

40

(式中、

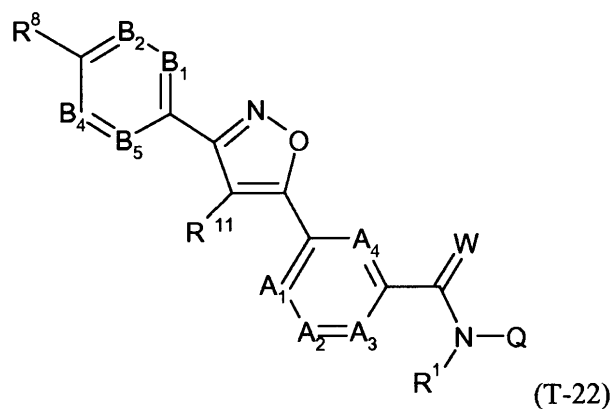
R^1 、 A_1 、 A_2 、 A_3 、 A_4 、 R^{11} 、 B_1 、 B_2 、 B_4 、 B_5 、 R^8 、 Q および W は、それぞれ請求項1で定義される通りであり、 A_1 、 A_2 、 A_3 、 A_4 から選択される1つ以下の部分がNであり、 B_1 、 B_2 、 B_3 、 B_4 および B_5 から選択される1つ以下の部分がNである)。

【請求項5】

式(I a'')の化合物が式(I-T22)の化合物である、請求項1に記載の化合物

50

【化 5】



10

(式中、

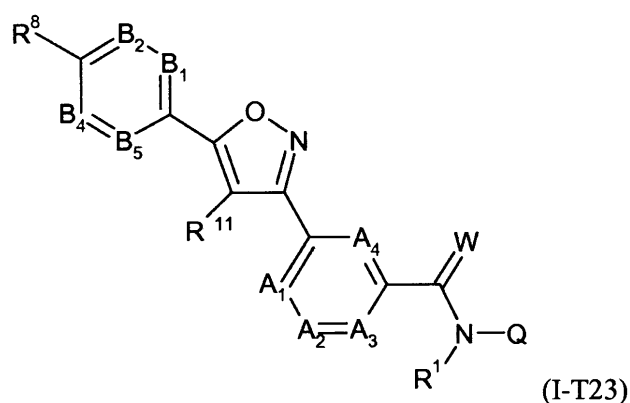
R^1 、 A_1 、 A_2 、 A_3 、 A_4 、 R^{11} 、 B_1 、 B_2 、 B_4 、 B_5 、 R^8 、 Q および W は、それぞれ請求項1で定義される通りであり、 A_1 、 A_2 、 A_3 、 A_4 から選択される1つ以下の部分がNであり、 B_1 、 B_2 、 B_3 、 B_4 および B_5 から選択される1つ以下の部分がNである)。

【請求項6】

20

式(I a'')の化合物が式(I-T23)の化合物である、請求項1に記載の化合物

【化 6】



30

(式中、

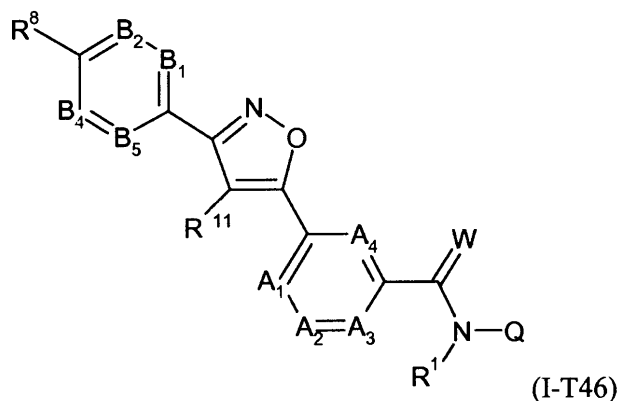
R^1 、 A_1 、 A_2 、 A_3 、 A_4 、 R^{11} 、 B_1 、 B_2 、 B_4 、 B_5 、 R^8 、 Q および W は、それぞれ請求項1で定義される通りであり、 A_1 、 A_2 、 A_3 、 A_4 から選択される1つ以下の部分がNであり、 B_1 、 B_2 、 B_3 、 B_4 および B_5 から選択される1つ以下の部分がNである)。

40

【請求項7】

式(I a'')の化合物が式(I-T46)の化合物である、請求項1に記載の化合物

【化 7】



10

(式中、

R^1 、 A_1 、 A_2 、 A_3 、 A_4 、 R^{11} 、 B_1 、 B_2 、 B_4 、 B_5 、 R^8 、 Q および W は、それぞれ請求項1で定義される通りであり、 A_1 、 A_2 、 A_3 、 A_4 から選択される1つ以下の部分がNであり、 B_1 、 B_2 、 B_3 、 B_4 および B_5 から選択される1つ以下の部分がNである)。

20

【請求項 8】

R^{11} が独立してHであり、 W がOである、請求項1～7のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 9】

R^{11} が独立してHであり、 W がOであり、 B_3 が $C-R^8$ であり、 R^8 がハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルキルまたはハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルコキシである、請求項1～8のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 10】

前記 $A_1 \sim A_4$ 部分および $B_1 \sim B_5$ 部分が、以下の通り、

A_1 は $C-H$ であり、

A_2 は CR^3 またはNであり、

A_3 は CR^4 であり、

A_4 は $C-H$ であり、

B_1 は CR^6 またはNであり、

B_2 は $C-H$ であり、

B_3 は CR^8 であり、

B_4 は $C-H$ であり、

B_5 は CR^{10} またはNである、請求項1～9のいずれか一項に記載の化合物。

30

【請求項 11】

R^1 がHである、請求項1～10のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 12】

Q が、 C_1-C_3 -アルキル、シクロプロピル、1-(シアノ)シクロプロピル、1-(過フッ化 C_1-C_3 -アルキル)シクロプロピル、1-(C_1-C_4 -アルキル)シクロプロピル、1-(チオカルバモイル)シクロプロピル、ハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルキル、チエタン-3-イル、N-メチルピラゾール-3-イルまたは2-オキソ-2(2,2,2-トリフルオロエチルアミノ)エチルである、請求項1～11のいずれか一項に記載の化合物。

40

【請求項 13】

R^8 が、フッ素で置換された C_1-C_4 -アルコキシまたはフッ素で置換された C_1-C_4 -アルキルである、請求項1～12のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 14】

50

請求項 1～13 のいずれか一項に記載の少なくとも 1 つの式 (I) の化合物ならびに増量剤および／または界面活性物質の含量によって特徴付けられる、殺虫組成物。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本出願は、トリフルオロ新規化合物、それらの製造方法、ならびに動物害虫、具体的には、節足動物、特に、昆虫、クモ形類動物および線虫を防除するためのそれらの使用に関する。

【背景技術】

【0002】

特定のハロゲン置換化合物が殺虫活性を有することが知られている（欧州特許第 1 9 1 1 7 5 1 号、国際公開第 2 0 1 2 / 0 6 9 3 6 6 号、国際公開第 2 0 1 2 / 0 8 0 3 7 6 号、国際公開第 2 0 1 2 / 1 0 7 4 3 4 号および国際公開第 2 0 1 2 / 1 7 5 4 7 4 号）。

【0003】

国際公開第 2 0 1 1 / 1 1 3 7 5 6 号は、殺虫活性を有するトリアゾール誘導体を開示している。

【0004】

特定のハロゲン置換化合物がサイトカイン阻害活性を有することも知られている（国際公開第 2 0 0 0 / 0 7 9 8 0 号）。

【0005】

現代の作物保護組成物は、例えば、作用の有効性、持続性および範囲、ならびに使用可能性に関して多くの要望を満たさなければならない。毒性および他の活性成分または製剤補助物質との組み合わせ可能性に関する問題は、活性成分の合成が必要とする費用の問題に関与する。加えて、抵抗も生じ得る。これらすべての理由のため、新規作物保護剤の探求が完了したと見なされることはなく、少なくとも個々の態様に関して既知の化合物よりも改善された特性を有する新規化合物が常に必要とされている。

【0006】

種々の態様における殺虫剤の範囲を広げ、かつ／またはそれらの活性を改善する化合物を提供することが本発明の目的であった。

【0007】

驚くべきことに、特定のハロゲン置換化合物およびその塩が生物学的特性を有し、動物害虫の防除に特に適しており、それ故に農薬分野および動物衛生分野において特に良好な有用性を有することが今日分かっている。

【0008】

同様の化合物が、国際公開第 2 0 1 0 / 0 5 1 9 2 6 号においてすでに知られている。

【発明の概要】

【0009】

殺虫活性、殺ダニ活性および／または寄生虫駆除活性を有し、一般式 (I) の新規のハロゲン置換化合物、ならびに式 (I) の化合物の塩、N-酸化物および互変異性型を見出した：

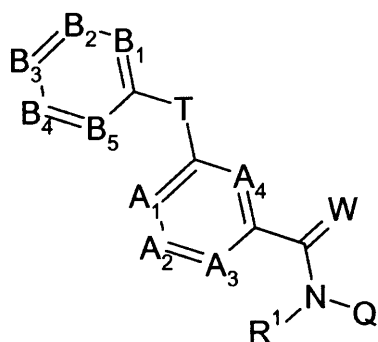
10

20

30

40

【化 1】



(I)

10

(式中、

R^1 は、H、いずれの場合も任意に置換された C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -アルキニル、 C_3-C_7 -シクロアルキル、 C_1-C_6 -アルキルカルボニル、 C_1-C_6 -アルコキシカルボニル、アリール (C_1-C_3)-アルキル、ヘテロアリール (C_1-C_3)-アルキルであるか、または任意に置換された C_1-C_6 -アルキルであり、好ましくはHであり、もしくは好ましくは C_1-C_2 -アルキルであり、最も好ましくはHもしくはメチル、特にHであり、

20

以下の部分は、以下の通り、

A_1 は CR^2 またはNであり、

A_2 は CR^3 またはNであり、

A_3 は CR^4 またはNであり、

A_4 は CR^5 またはNであり、

B_1 は CR^6 またはNであり、

B_2 は CR^7 またはNであり、

B_3 は CR^8 またはNであり、

B_4 は CR^9 またはNであり、かつ、

B_5 は CR^{10} またはNであるが、

30

$A_1 \sim A_4$ 部分の3つ以下がNであり、 $B_1 \sim B_5$ 部分の3つ以下がNであり、

R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^9 および R^{10} は、それぞれ独立して、H、ハロゲン、シアノ、ニトロ、いずれの場合も任意に置換された C_1-C_6 -アルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 $N-C_1-C_6$ -アルコキシイミノ- C_1-C_3 -アルキル、 C_1-C_6 -アルキルスルファニル、 C_1-C_6 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_6 -アルキルスルホニル、 $N-C_1-C_6$ -アルキルアミノ、N、N-ジ- C_1-C_6 -アルキルアミノ、またはN- C_1-C_3 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキルアミノもしくは1-ピロリジニルであり、

40

A_2 部分および A_3 部分のいずれも、N、 R^3 および R^4 でない場合、それらが結合する炭素原子と一緒にあって、0、1もしくは2個の窒素原子および／または0もしくは1個の酸素原子および／または0もしくは1個の硫黄原子を含有する5もしくは6員環を形成してもよく、

A_1 部分および A_2 部分のいずれも、N、 R^2 および R^3 でない場合、それらが結合する炭素原子と一緒にあって、0、1または2個の窒素原子を含有する6員環を形成してもよく、

R^8 は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、いずれの場合も任意に置換された C_1-C_6 -アルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 $N-C_1-C_6$ -アルコキシイミノ- C_1-C_3 -アルキル、 C_1-C_6 -アルキルスルファニル、 C_1-C_6 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_6 -アルキルスルホニル、 $N-C_1-C_6$ -アルキルアミノ、またはN、N-ジ- C_1-C_6 -アルキルアミノであり、

50

WはOまたはSであり、

Qは、H、ホルミル、ヒドロキシル、アミノ、またはいずれの場合も任意に置換された C_1-C_6 -アルキル、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -アルキニル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_5 -ヘテロシクロアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_6 -アルキル- C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_6 -アルキル、 C_6- 、 $C_{10}-$ 、 C_{14} -アリール、 C_1-C_5 -ヘテロアリール、 C_6- 、 $C_{10}-$ 、 C_{14} -アリール-(C_1-C_3)-アルキル、 C_1-C_5 -ヘテロアリール-(C_1-C_3)-アルキル、 $N-C_1-C_4$ -アルキルアミノ、 $N-C_1-C_4$ -アルキルカルボニルアミノ、もしくはN、N-ジ- C_1-C_4 -アルキルアミノであるか、あるいは、

任意にポリ-V-置換された不飽和6員炭素環であるか、あるいは、

任意にポリ-V-置換された不飽和4、5または6員複素環式環であり、

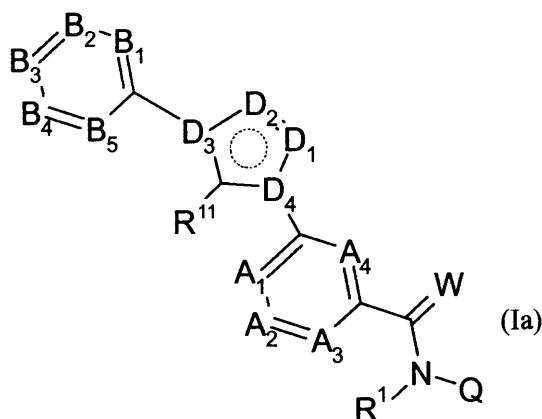
Vは独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、いずれの場合も任意に置換された C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_4 -アルケニル、 C_1-C_4 -アルキニル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 $N-C_1-C_6$ -アルコキシイミノ- C_1-C_3 -アルキル、 C_1-C_6 -アルキルスルファニル、 C_1-C_6 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_6 -アルキルスルホニル、またはN、N-ジ-(C_1-C_6 -アルキル)アミノであり、

Tは、4個の炭素原子および1個のヘテロ原子、好ましくは1個の窒素、1個の酸素もしくは1個の硫黄原子、または3個の炭素原子および2個のヘテロ原子、好ましくは、2個の窒素原子、1個の窒素原子および1個の酸素原子、または1個の窒素および1個の硫黄原子等の2個以下のヘテロ原子（1または2個のヘテロ原子）を含有する任意に置換された5員ヘテロ芳香族系である）。

【0010】

本発明の一態様は、式(Ia)の化合物、ならびに式(I)の化合物の塩、N-酸化物および互変異性型に関する：

【化2】



(式中、

D₁部分、D₂部分は、それぞれ独立して、 $C-R^{11}$ 、またはNおよびOから選択されるヘテロ原子であり、

D₃部分およびD₄部分は、それぞれ独立して、CまたはNから選択されるヘテロ原子であり（すなわち、D₃部分およびD₄部分は、それぞれ独立してCまたはNである）、

D₁、D₂、D₃およびD₄から選択される1つ以下または2つの部分がヘテロ原子であり、D₁、D₂、D₃およびD₄から選択される1つまたは2つの部分が、D₁およびD₂の場合はNおよびOから選択されるヘテロ原子であり、またはD₃およびD₄の場合はNであり、



は芳香族系であり、

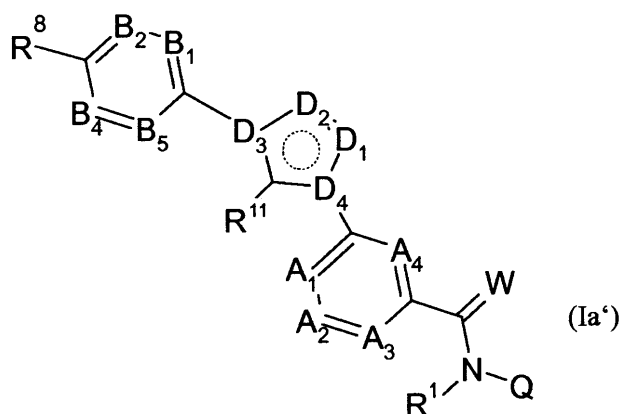
R^1 、 A_1 、 A_2 、 A_3 、 A_4 、 B_1 、 B_2 、 B_3 、 B_4 、 B_5 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 、 W 、 Q 、 V および T は、それぞれ本明細書に記載されるように定義され、 A_1 、 A_2 、 A_3 、 A_4 から選択される1つ以下の部分が N であり、 B_1 、 B_2 、 B_3 、 B_4 および B_5 から選択される1つ以下の部分が N であるか、または A_1 、 A_2 、 A_3 、 A_4 から選択される1つもしくは2つの部分が N であってもよく、 B_1 、 B_2 、 B_3 、 B_4 および B_5 から選択される1つ以下の部分が N である)。

10

【0011】

本発明の一実施形態は、式(Ⅰa')の化合物に関する：

【化3】



20

(式中、

R^1 、 R^{11} 、 Q 、 W 、 A_1 、 A_2 、 A_3 、 A_4 、 B_1 、 B_2 、 B_4 および B_5 は、それぞれ本明細書に記載されるように定義され、 A_1 、 A_2 、 A_3 、 A_4 から選択される1つ以下の部分が N であり、 B_1 、 B_2 、 B_3 、 B_4 および B_5 から選択される1つ以下の部分が N であるか、または A_1 、 A_2 、 A_3 、 A_4 から選択される1つもしくは2つの部分が N であってもよく、 B_1 、 B_2 、 B_3 、 B_4 および B_5 から選択される1つ以下の部分が N であり、

30

D_1 および D_2 は、それぞれ独立して、 $C-R^{11}$ またはヘテロ原子であり、好ましくは $C-R^{11}$ または N 、 O および S から選択されるヘテロ原子であり、より好ましくは $C-R^{11}$ または N および O から選択されるヘテロ原子であり、

D_3 部分および D_4 部分は、それぞれ独立して、 C または N から選択されるヘテロ原子であり、

D_1 、 D_2 、 D_3 および D_4 から選択される1つ以下または2つの部分がヘテロ原子であり、 D_1 、 D_2 、 D_3 および D_4 から選択される1つまたは2つの部分が、 D_1 および D_2 の場合は N および O から選択されるヘテロ原子であり、または D_3 および D_4 の場合は N であり、

40



は芳香族系であり、

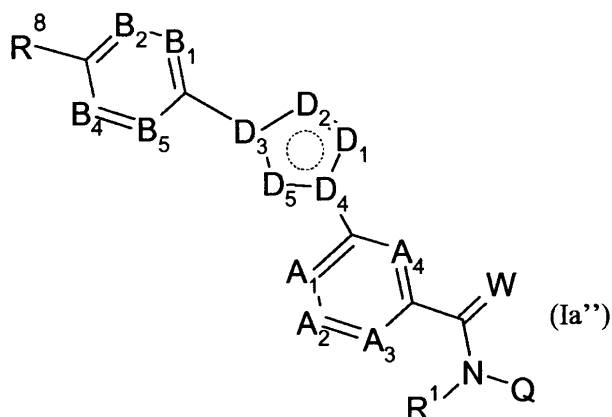
R^8 は、本明細書で定義される通りであり、好ましくは過フッ化 C_1-C_4 -アルキルである)。

【0012】

50

本発明のさらなる実施形態は、式 (I a'') の化合物、ならびに式 (I a'') の化合物の塩、N-酸化物および互変異性型に関する：

【化 4】



10

(式中、

D₁ は、C-R^{1 1} または N および O から選択されるヘテロ原子であり、

D₂ は、C-R^{1 1} または N および O から選択されるヘテロ原子であり、

20

D₃ は、C または N であり、

D₄ は、C または N であり、

D₅ は、C-R^{1 1} または N であり、

D₁、D₂、D₃、D₄ および D₅ から選択される 1 つ以下または 2 つの部分が、ヘテロ原子であり、



は芳香族系であり、

R¹ は、H、いずれの場合も任意に置換された C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-アルキニル、C₃-C₇-シクロアルキル、C₁-C₆-アルキルカルボニル、C₁-C₆-アルコキシカルボニル、アリール (C₁-C₃)-アルキルもしくはヘテロアリール (C₁-C₃)-アルキル、または任意に置換された C₁-C₆-アルキルであり、より好ましくは H であり、

30

以下の部分は、以下の通り、

A₁ は C-R² または N であり、

A₂ は C-R³ または N であり、

A₃ は C-R⁴ または N であり、

A₄ は C-R⁵ または N であり、

B₁ は C-R⁶ または N であり、

B₂ は C-R⁷ または N であり、

B₃ は C-R⁸ または N であり、

B₄ は C-R⁹ または N であり、かつ、

B₅ は C-R^{1 0} または N であるが、

40

A₁ ~ A₄ 部分の 3 つ以下が N であり、B₁ ~ B₅ 部分の 3 つ以下が同時に N であり、

R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R⁷、R⁹ および R^{1 0} は、それぞれ独立して、H、ハロゲン、シアノ、ニトロ、いずれの場合も任意に置換された C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-シクロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ、N-C₁-C₆-アルコキシイミノ-C₁-C₃-アルキル、C₁-C₆-アルキルスルファニル、C₁-C₆-アルキルスルフィニル、C₁-C₆-アルキルスルホニル、N-C₁-C₆-アルキルアミノまた

50

はN, N-ジ- C_1-C_6 -アルキルアミノであり、

A_2 部分および A_3 部分のいずれも、N、 R^3 および R^4 でない場合、それらが結合する炭素原子と一緒にあって、0、1もしくは2個の窒素原子および／または0もしくは1個の酸素原子および／または0もしくは1個の硫黄原子を含有する5もしくは6員環を形成してもよく、

A_1 部分および A_2 部分のいずれも、N、 R^2 および R^3 でない場合、それらが結合する炭素原子と一緒にあって、0、1または2個の窒素原子を含有する6員環を形成してもよく、

R^8 は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、いずれの場合も任意に置換された C_1-C_6 -アルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、N- C_1-C_6 -アルコキシイミノ- C_1-C_3 -アルキル、 C_1-C_6 -アルキルスルファニル、 C_1-C_6 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_6 -アルキルスルホニル、N- C_1-C_6 -アルキルアミノまたはN, N-ジ- C_1-C_6 -アルキルアミノであり、

R^{11} は独立して、H、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、または任意に置換された C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルキルオキシ、 C_1-C_6 -アルキルカルボニル、 C_1-C_6 -アルキルスルファニル、 C_1-C_6 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_6 -アルキルスルホニルであり、好ましくはHであり、

WはOまたはSであり、

Qは、H、ホルミル、ヒドロキシル、アミノ、またはいずれの場合も任意に置換された C_1-C_6 -アルキル、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -アルキニル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_5 -ヘテロシクロアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_6 -アルキル- C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_6 -アルキル、 C_6 -、 C_{10} -、 C_{14} -アリール、 C_1-C_5 -ヘテロアリール、 C_6 -、 C_{10} -、 C_{14} -アリール-(C_1-C_3)-アルキル、 C_1-C_5 -ヘテロアリール-(C_1-C_3)-アルキル、N- C_1-C_4 -アルキルアミノ、N- C_1-C_4 -アルキルカルボニルアミノ、もしくはN, N-ジ- C_1-C_4 -アルキルアミノであるか、あるいは、

任意にポリ-V-置換された不飽和6員炭素環であるか、あるいは、

任意にポリ-V-置換された不飽和4、5または6員複素環式環であり、

Vは独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、いずれの場合も任意に置換された C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_4 -アルケニル、 C_1-C_4 -アルキニル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、N- C_1-C_6 -アルコキシイミノ- C_1-C_3 -アルキル、 C_1-C_6 -アルキルスルファニル、 C_1-C_6 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_6 -アルキルスルホニル、またはN, N-ジ-(C_1-C_6 -アルキル)アミノである)。

【0013】

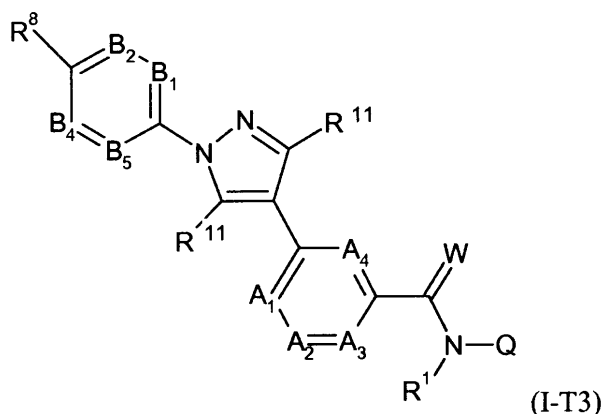
本発明のさらなる実施形態は、式(I a'')の化合物に関し、式(I a'')の化合物は、式(I-T3)の化合物である：

10

20

30

【化 5】



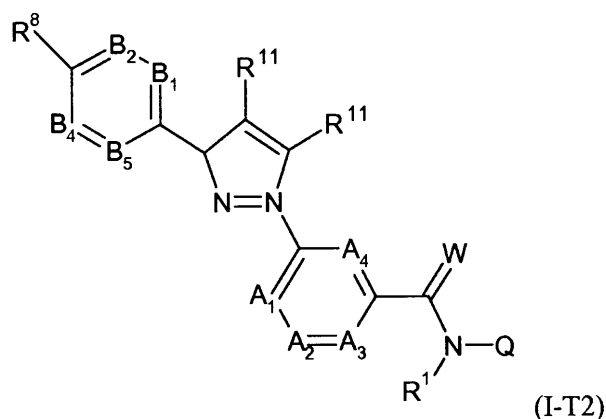
(式中、

R¹、A₁、A₂、A₃、A₄、R^{1 1}、B₁、B₂、B₄、B₅、R⁸、QおよびWは、それぞれ本明細書に記載されるように定義され、A₁、A₂、A₃、A₄から選択される1つ以下の部分がNであり、かつ、B₁、B₂、B₃、B₄およびB₅から選択される1つ以下の部分がNであるか、または、A₁、A₂、A₃、A₄から選択される1つもしくは2つの部分がNであってもよく、かつ、B₁、B₂、B₃、B₄およびB₅から選択される1つ以下の部分がNである）。

【 0 0 1 4 】

本発明のさらなる実施形態は、式 (I a'') の化合物に関し、式 (I a'') の化合物は、式 (I-T2) の化合物である：

【化 6】



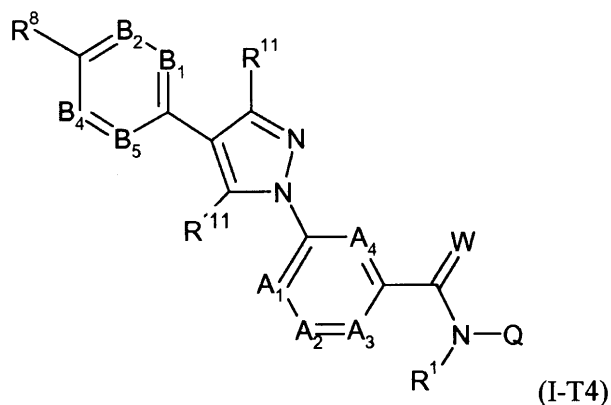
(式中、

R^1 、 A_1 、 A_2 、 A_3 、 A_4 、 R^{11} 、 B_1 、 B_2 、 B_4 、 B_5 、 R^8 、 Q および W は、それぞれ本明細書に記載されるように定義され、 A_1 、 A_2 、 A_3 、 A_4 から選択される1つ以下の部分が N であり、かつ、 B_1 、 B_2 、 B_3 、 B_4 および B_5 から選択される1つ以下の部分が N であるか、または、 A_1 、 A_2 、 A_3 、 A_4 から選択される1つもしくは2つの部分が N であってもよく、かつ、 B_1 、 B_2 、 B_3 、 B_4 および B_5 から選択される1つ以下の部分が N である）。

【 0 0 1 5 】

本発明のさらなる実施形態は、式 (I a'') の化合物に関し、式 (I a'') の化合物は、式 (I-T4) の化合物である：

【化 7】



10

(式中、

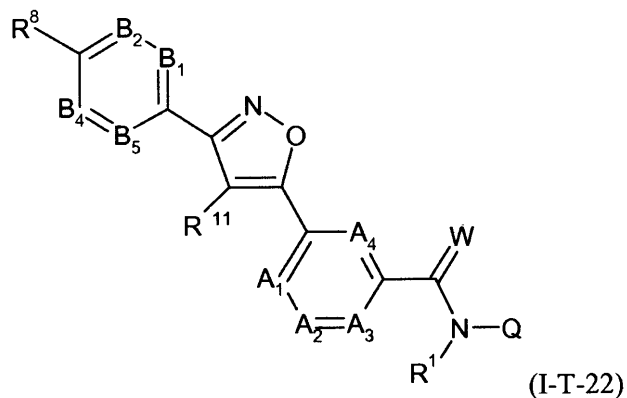
R^1 、 A_1 、 A_2 、 A_3 、 A_4 、 R^{11} 、 B_1 、 B_2 、 B_4 、 B_5 、 R^8 、 Q および W は、それぞれ本明細書に記載されるように定義され、 A_1 、 A_2 、 A_3 、 A_4 から選択される1つ以下の部分がNであり、かつ、 B_1 、 B_2 、 B_3 、 B_4 および B_5 から選択される1つ以下の部分がNであるか、または、 A_1 、 A_2 、 A_3 、 A_4 から選択される1つもしくは2つの部分がNであってもよく、かつ、 B_1 、 B_2 、 B_3 、 B_4 および B_5 から選択される1つ以下の部分がNである)。

20

【0016】

本発明のさらなる実施形態は、式(I a'')の化合物に関し、式(I a'')の化合物は、式(I-T22)の化合物である：

【化 8】



30

(式中、

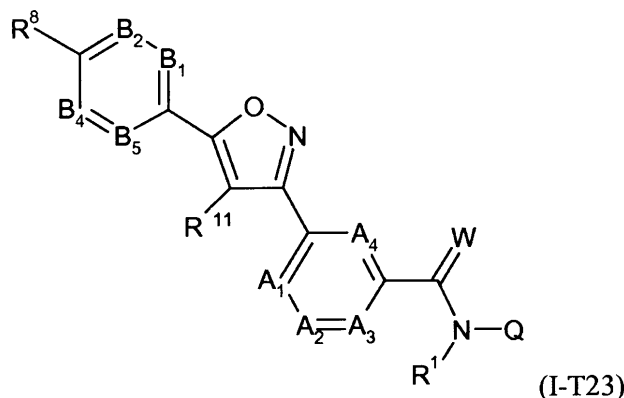
R^1 、 A_1 、 A_2 、 A_3 、 A_4 、 R^{11} 、 B_1 、 B_2 、 B_4 、 B_5 、 R^8 、 Q および W は、それぞれ本明細書に記載されるように定義され、 A_1 、 A_2 、 A_3 、 A_4 から選択される1つ以下の部分がNであり、かつ、 B_1 、 B_2 、 B_3 、 B_4 および B_5 から選択される1つ以下の部分がNであるか、または、 A_1 、 A_2 、 A_3 、 A_4 から選択される1つもしくは2つの部分がNであってもよく、かつ、 B_1 、 B_2 、 B_3 、 B_4 および B_5 から選択される1つ以下の部分がNである)。

40

【0017】

本発明のさらなる実施形態は、式(I a'')の化合物に関し、式(I a'')の化合物は、式(I-T23)の化合物である：

【化 9】



10

(式中、

R^1 、 A_1 、 A_2 、 A_3 、 A_4 、 R^{11} 、 B_1 、 B_2 、 B_4 、 B_5 、 R^8 、 Q および W は、それぞれ本明細書に記載されるように定義され、 A_1 、 A_2 、 A_3 、 A_4 から選択される1つ以下の部分がNであり、かつ、 B_1 、 B_2 、 B_3 、 B_4 および B_5 から選択される1つ以下の部分がNであるか、または、 A_1 、 A_2 、 A_3 、 A_4 から選択される1つもしくは2つの部分がNであってもよく、かつ、 B_1 、 B_2 、 B_3 、 B_4 および B_5 から選択される1つ以下の部分がNである)。

20

【0018】

本発明のさらなる実施形態は、式の化合物および本明細書に記載される実施形態に関し、 R^{11} は独立してHであり、 W はOである。

【0019】

本発明のさらなる実施形態は、式の化合物および本明細書に記載される実施形態に関し、 R^{11} は独立してHであり、 W はOであり、かつ、 B_3 は $C-R^8$ であり、 R^8 は、ハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルキル（好ましくは過ハロゲン化 C_1-C_3 -アルキル、より好ましくは過フッ化 C_1-C_3 -アルキル）、またはハロゲン置換 C_1-C_3 -アルコキシ（好ましくは過ハロゲン化 C_1-C_3 -アルコキシ、より好ましくは過フッ化 C_1-C_3 -アルコキシ）である。

30

【0020】

本発明のさらなる実施形態は、式の化合物および本明細書に記載される実施形態に関し、 $A_1 \sim A_4$ 部分および $B_1 \sim B_5$ 部分は以下の通り、

A_1 は $C-H$ であり、

A_2 は CR^3 またはNであり、

A_3 は CR^4 であり、

A_4 は $C-H$ であり、

B_1 は CR^6 またはNであり、

B_2 は $C-H$ であり、

B_3 は CR^8 であり、

B_4 は $C-H$ であり、かつ、

B_5 は CR^{10} またはNである。

40

【0021】

本発明のさらなる実施形態は、式の化合物および本明細書に記載される実施形態に関し、 R^1 はHである。

【0022】

本発明のさらなる実施形態は、式の化合物および本明細書に記載される実施形態に関し、 Q は、フッ素で置換された C_1-C_4 -アルキル、 C_3-C_4 -シクロアルキル、任意にシアノもしくはフッ素で置換された C_3-C_4 -シクロアルキル、 C_4-C_6 -ヘテロシクロアルキル、1-オキシドチエタン-3-イル、1, 1-ジオキシドチエタン-3-

50

イル、ベンジル、ピリジン-2-イルメチル、メチルスルホニル、または2-オキソ-2-(2, 2, 2-トリフルオロエチルアミノ)エチルである。

【0023】

本発明のさらなる実施形態は、式の化合物および本明細書に記載される実施形態に関し、 R^8 は、ハロゲンまたはハロゲンで置換された C_1-C_4 -アルキルである。

【0024】

本発明のさらなる実施形態は、本明細書に記載される式の化合物に関し、 R^{11} は独立してHである。

【0025】

本発明のさらなる実施形態は、本明細書に記載される式の化合物に関し、 R^6 、 R^7 、 R^9 および R^{10} は、それぞれ独立して、H、ハロゲン、シアノ、ニトロ、いずれの場合も任意に置換された C_1-C_4 -アルキル、 C_3-C_4 -シクロアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、N-アルコキシイミノアルキル、 C_1-C_4 -アルキルスルファニル、 C_1-C_4 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_4 -アルキルスルホニル、N- C_1-C_4 -アルキルアミノ、N、N-ジ- C_1-C_4 -アルキルアミノである。

10

【0026】

本発明のさらなる実施形態は、本明細書に記載される式の化合物に関し、 R^2 、 R^3 、 R^4 および R^5 は、それぞれ独立して、H、ハロゲン、シアノ、ニトロ、いずれの場合も任意に置換された C_1-C_4 -アルキル、 C_3-C_4 -シクロアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、N- C_1-C_4 -アルコキシイミノ- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキルスルファニル、 C_1-C_4 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_4 -アルキルスルホニル、N- C_1-C_4 -アルキルアミノ、またはN、N-ジ- C_1-C_4 -アルキルアミノである。

20

【0027】

本発明のさらなる実施形態は、本明細書に記載される式の化合物に関し、 $A_1 \sim A_4$ 部分および $B_1 \sim B_5$ 部分は、以下の通り、

A_1 はC-Hであり、

A_2 は CR^3 またはNであり、

A_3 は CR^4 であり、

A_4 はC-Hであり、

30

B_1 は CR^6 またはNであり、

B_2 はC-Hであり、

B_3 は CR^8 であり、

B_4 はC-Hであり、かつ、

B_5 は CR^{10} またはNである。

【0028】

本発明のさらなる実施形態は、本明細書に記載される式の化合物に関し、 R^1 はHである。

【0029】

本発明のさらなる実施形態は、本明細書に記載される式の化合物に関し、式中、Qは、フッ素またはカルボンアミド($-C(=O)N(R)_2$ であって、Rが独立して、H、 C_1-C_3 -アルキル、またはハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルキルである)で置換された C_1-C_4 -アルキル、任意にシアノもしくはフッ素で置換された C_3-C_4 -シクロアルキル、 C_4-C_6 -ヘテロシクロアルキル、1-オキシドチエタン-3-イル、1,1-ジオキシドチエタン-3-イル、ベンジル、ピリジン-2-イルメチル、メチルスルホニル、または2-オキソ-2-(2, 2, 2-トリフルオロエチルアミノ)エチルである。

40

【0030】

本発明のさらなる実施形態は、本明細書に記載される式の化合物に関し、Qは、2, 2, 2-トリフルオロエチル、2, 2-ジフルオロエチル、3, 3, 3-トリフルオロプロ

50

ピル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロプロピル、シクロブチル、1-シアノシクロプロピル、トランス-2-フルオロシクロプロピルもしくはシス-2-フルオロシクロプロピル、オキセタン-3-イル、チエタン-3-イル、1-オキシドチエタン-3-イル、1, 1-ジオキシドチエタン-3-イル、ベンジル、ピリジン-2-イルメチル、メチルスルホニル、または2-オキソ-2-(2, 2, 2-トリフルオロエチルアミノ)エチルである。

【0031】

本発明のさらなる実施形態は、本明細書に記載される式の化合物に関し、 R^8 は、ハロゲンまたはハロゲンで置換された C_1-C_4 -アルキルである。

【0032】

10

さらなる態様は、本明細書に記載される少なくとも1つの式(I)の化合物ならびに増量剤および／または界面活性物質の含量によって特徴付けられる殺虫組成物に関する。

【0033】

さらなる態様は、本明細書に記載される少なくとも1つの式(I)の化合物で種子を処理することを特徴とする、遺伝子組み換え種子または従来の子種、およびそれらの種子から生じた植物を害虫の侵入から保護するための方法に関する。

【0034】

さらなる態様は、本明細書に記載される式(I)の化合物または害虫を防除するための本明細書に記載される殺虫組成物の使用に関する。

【0035】

20

さらなる態様は、媒介体防除における本明細書に記載される式(I)の化合物の使用に関する。

【0036】

さらなる態様は、本明細書に記載される式(I)の化合物がコーティングの構成要素として、またはコーティングに加えてさらなる層として適用された種子に関する。

【0037】

したがって、さらなる態様は、コーティングに加えて層またはさらなる複数の層として種子に適用される、本明細書に記載される少なくとも1つの式(I)の化合物を含むコーティングを適用するための方法、または本明細書に記載される式(I)の化合物を適用するための方法に関し、a) 種子を本明細書に記載される式(I)の化合物からなるか、またはそれを含むコーティング材料と混合するステップと、b) 得られたコーティングされた種子組成物を改良する(enrich)ステップと、c) 得られた改良された種子組成物を乾燥させるステップと、d) 得られた乾燥させた種子組成物を非凝集(disagglomerating)または脱凝集(deagglomerating)させるステップとを含む。

30

【0038】

置換基の性質に応じて、本明細書に記載の式(I)の化合物は、任意に、幾何異性体および／もしくは光学活性異性体、または異なる組成物中の対応する異性体混合物の形態であってもよい。本発明は、純粋な異性体および異性体混合物の両方に関する。

【0039】

40

本発明の化合物は、金属錯体の形態であってもよい。

【0040】

定義

当業者であれば、明白に示されない限り、本出願で使用される「a」または「an」という表現は、状況に応じて、「1つ」、「1つ以上」、または「少なくとも1つ」を意味し得ることを理解する。

【0041】

環系および基等の本明細書に記載される構造のすべてに関して、隣接する原子は、-O-O-または-O-S-であってはならない。

【0042】

50

可変数の可能な炭素原子（C原子）を有する構造は、より具体的に規定されるように、本出願において、 $C_{L L}$ 炭素原子の下限－ $C_{U L}$ 炭素原子の上限構造（ $C_{L L}$ － $C_{U L}$ 構造）と称され得る。例えば、アルキル基は、3～10個の炭素原子からなり得、その場合、 C_3 － C_{10} －アルキルに対応する。炭素原子およびヘテロ原子で構成される環構造は、「 $L L \sim U L$ 員」構造と称され得る。6員環構造の一例は、トルエン（メチル基で置換された6員環構造）である。

【0043】

置換基の総称、例えば、（ $C_{L L}$ － $C_{U L}$ ）－アルキルが、複合置換基、例えば、（ $C_{L L}$ － $C_{U L}$ ）－シクロアルキル－（ $C_{L L}$ － $C_{U L}$ ）－アルキルの最後にある場合、その複合置換基の最初にある構成要素、例えば、（ $C_{L L}$ － $C_{U L}$ ）－シクロアルキルは、同一にまたは異なって、かつ独立して後者の置換基、例えば、（ $C_{L L}$ － $C_{U L}$ ）－アルキルで一置換または多置換されてもよい。本出願で使用される化学基、環系および環状基のすべての総称は、「 $C_{L L}$ － $C_{U L}$ 」または「 $L L \sim U L$ 員」の追加によって、より具体的に規定され得る。

【0044】

異なって定義されない限り、総称の定義は、複合置換基におけるこれらの総称にも適用される。例えば、 $C_{L L}$ － $C_{U L}$ －アルキルの定義は、複合置換基、例えば、 $C_{L L}$ － $C_{U L}$ －シクロアルキル－ $C_{L L}$ － $C_{U L}$ －アルキルの一部として $C_{L L}$ － $C_{U L}$ －アルキルにも適用される。

【0045】

本出願で挙げられる例は限定的なものとは見なされるべきではなく、単にいくつかの実施形態を詳細に説明するためのものであることが当業者には明らかだろう。

【0046】

上の式に示される記号の定義において、以下の置換基を一般に表す総称が使用される。

【0047】

ハロゲンは、第7主族の元素、好ましくは、フッ素、塩素、臭素およびヨウ素、より好ましくは、フッ素、塩素および臭素、さらにより好ましくは、フッ素および塩素に関する。

【0048】

ヘテロ原子の例は、N、O、S、P、B、Siである。好ましくは、「ヘテロ原子」という用語は、N、SおよびOに関する。

【0049】

本発明によれば、「アルキル」は、単独でまたは化学基の一部として、好ましくは1～6個の炭素原子を有する直鎖または分岐鎖炭化水素、例えば、メチル、エチル、*n*－プロピル、イソプロピル、*n*－ブチル、イソブチル、*s*－ブチル、*t*－ブチル、ペンチル、1－メチルブチル、2－メチルブチル、3－メチルブチル、1，2－ジメチルプロピル、1，1－ジメチルプロピル、2，2－ジメチルプロピル、1－エチルプロピル、ヘキシル、1－メチルペンチル、2－メチルペンチル、3－メチルペンチル、4－メチルペンチル、1，2－ジメチルプロピル、1，3－ジメチルブチル、1，4－ジメチルブチル、2，3－ジメチルブチル、1，1－ジメチルブチル、2，2－ジメチルブチル、3，3－ジメチルブチル、1，1，2－トリメチルプロピル、1，2，2－トリメチルプロピル、1－エチルブチルおよび2－エチルブチルを表す。とりわけ、メチル、エチル、*n*－プロピル、イソプロピル、*n*－ブチル、イソブチル、*s*－ブチルまたは*t*－ブチル等の1～4個の炭素原子を有するアルキルが好ましい。本発明におけるアルキルは、1つ以上の同一のまたは異なるラジカルで置換され得る。

【0050】

本発明によれば、「アルケニル」は、単独でまたは化学基の一部として、好ましくは2～6個の炭素原子および少なくとも1つの二重結合を有する直鎖または分岐鎖炭化水素、例えば、ビニル、2－プロペニル、2－ブテニル、3－ブテニル、1－メチル－2－プロペニル、2－メチル－2－プロペニル、2－ペンテニル、3－ペンテニル、4－ペンテニ

10

20

30

40

50

ル、1-メチル-2-ブテニル、2-メチル-2-ブテニル、3-メチル-2-ブテニル、1-メチル-3-ブテニル、2-メチル-3-ブテニル、3-メチル-3-ブテニル、1, 1-ジメチル-2-プロペニル、1, 2-ジメチル-2-プロペニル、1-エチル-2-プロペニル、2-ヘキセニル、3-ヘキセニル、4-ヘキセニル、5-ヘキセニル、1-メチル-2-ペンテニル、2-メチル-2-ペンテニル、3-メチル-2-ペンテニル、4-メチル-2-ペンテニル、3-メチル-3-ペンテニル、4-メチル-3-ペンテニル、1-メチル-4-ペンテニル、2-メチル-4-ペンテニル、3-メチル-4-ペンテニル、4-メチル-4-ペンテニル、1, 1-ジメチル-2-ブテニル、1, 1-ジメチル-3-ブテニル、1, 2-ジメチル-2-ブテニル、1, 2-ジメチル-3-ブテニル、1, 3-ジメチル-2-ブテニル、2, 2-ジメチル-3-ブテニル、2, 3-ジメチル-2-ブテニル、2, 3-ジメチル-3-ブテニル、1-エチル-2-ブテニル、1-エチル-3-ブテニル、2-エチル-2-ブテニル、2-エチル-3-ブテニル、1, 1, 2-トリメチル-2-プロペニル、1-エチル-1-メチル-2-プロペニルおよび1-エチル-2-メチル-2-プロペニルを表す。とりわけ、2-プロペニル、2-ブテニルまたは1-メチル-2-プロペニル等の2~4個の炭素原子を有するアルケニルが好ましい。本発明におけるアルケニルは、1つ以上の同一のまたは異なるラジカルで置換され得る。

10

【0051】

本発明によれば、「アルキニル」は、単独でまたは化学基の一部として、好ましくは2~6個の炭素原子および少なくとも1つの三重結合を有する直鎖または分岐鎖炭化水素、例えば、2-プロピニル、2-ブチニル、3-ブチニル、1-メチル-2-プロピニル、2-ペンチニル、3-ペンチニル、4-ペンチニル、1-メチル-3-ブチニル、2-メチル-3-ブチニル、1-メチル-2-ブチニル、1, 1-ジメチル-2-プロピニル、1-エチル-2-プロピニル、2-ヘキシニル、3-ヘキシニル、4-ヘキシニル、5-ヘキシニル、1-メチル-2-ペンチニル、1-メチル-3-ペンチニル、1-メチル-4-ペンチニル、2-メチル-3-ペンチニル、2-メチル-4-ペンチニル、3-メチル-4-ペンチニル、4-メチル-2-ペンチニル、1, 1-ジメチル-3-ブチニル、1, 2-ジメチル-3-ブチニル、2, 2-ジメチル-3-ブチニル、1-エチル-3-ブチニル、2-エチル-3-ブチニル、1-エチル-1-メチル-2-プロピニルおよび2, 5-ヘキサジニルを表す。とりわけ、エチニル、2-プロピニルまたは2-ブチニル-2-プロペニル等の2~4個の炭素原子を有するアルキニルが好ましい。本発明におけるアルキニルは、1つ以上の同一のまたは異なるラジカルで置換され得る。

20

30

【0052】

本発明によれば、「シクロアルキル」は、単独でまたは化学基の一部として、好ましくは3~10個の炭素を有する単環式、二環式または三環式炭化水素、例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、シクロオクチル、ビスシクロ[2.2.1]ヘプチル、ビスシクロ[2.2.2]オクチルまたはアダマンチルを表す。とりわけ、シクロプロピルまたはシクロブチル等の3、4、5、6または7個の炭素原子を有するシクロアルキルが好ましい。本発明におけるシクロアルキルは、1つ以上の同一のまたは異なるラジカルで置換され得る。

40

【0053】

本発明によれば、「アルキルシクロアルキル」は、好ましくは4~10個または4~7個の炭素原子を有する単環式、二環式または三環式アルキルシクロアルキル、例えば、メチルシクロプロピル、エチルシクロプロピル、イソプロピルシクロブチル、3-メチルシクロペンチルおよび4-メチルシクロヘキシルを表す。とりわけ、エチルシクロプロピルまたは4-メチルシクロヘキシル等の4、5もしくは7個の炭素原子を有するアルキルシクロアルキルが好ましい。本発明におけるアルキルシクロアルキルは、1つ以上の同一のまたは異なるラジカルで置換され得る。

【0054】

本発明によれば、「シクロアルキルアルキル」は、好ましくは4~10個もしくは4~

50

7 個の炭素原子を有する単環式、二環式または三環式シクロアルキルアルキル、例えば、シクロプロピルメチル、シクロブチルメチル、シクロペンチルメチル、シクロヘキシルメチルおよびシクロペンチルエチルを表す。とりわけ、シクロプロピルメチルまたはシクロブチルメチル等の 4、5 もしくは 7 個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキルが好ましい。本発明におけるシクロアルキルアルキルは、1 つ以上の同一のまたは異なるラジカルで置換され得る。

【0055】

本発明によれば、「ヒドロキシアルキル」は、好ましくは 1～6 個の炭素原子を有する直鎖または分岐鎖アルコール、例えば、メタノール、エタノール、n-プロパノール、イソプロパノール、n-ブタノール、イソブタノール、s-ブタノールおよび t-ブタノールを表す。1～4 個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル基が好ましい。本発明におけるヒドロキシアルキル基は、1 つ以上の同一のまたは異なるラジカルで置換され得る。

10

【0056】

本発明によれば、「アルコキシ」は、好ましくは 1～6 個の炭素原子を有する直鎖または分岐鎖 O-アルキル、例えば、メトキシ、エトキシ、n-プロポキシ、イソプロポキシ、n-ブトキシ、イソブトキシ、s-ブトキシおよび t-ブトキシを表す。1～4 個の炭素原子を有するアルコキシ基が好ましい。本発明におけるアルコキシ基は、1 つ以上の同一のまたは異なるラジカルで置換され得る。

【0057】

本発明によれば、「アルキルスルファニル」は、好ましくは 1～6 個の炭素原子を有する直鎖または分岐鎖 S-アルキル、例えば、メチルチオ、エチルチオ、n-プロピルチオ、イソプロピルチオ、n-ブチルチオ、イソブチルチオ、s-ブチルチオおよび t-ブチルチオを表す。1～4 個の炭素原子を有するアルキルスルファニル基が好ましい。本発明におけるアルキルスルファニル基は、1 つ以上の同一のまたは異なるラジカルで置換され得る。

20

【0058】

本発明によれば、「アルキルスルフィニル」は、好ましくは 1～6 個の炭素原子を有する直鎖または分岐鎖アルキルスルフィニル、例えば、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、n-プロピルスルフィニル、イソプロピルスルフィニル、n-ブチルスルフィニル、イソブチルスルフィニル、s-ブチルスルフィニルおよび t-ブチルスルフィニルを表す。1～4 個の炭素原子を有するアルキルスルフィニル基が好ましい。本発明におけるアルキルスルフィニル基は、1 つ以上の同一のまたは異なるラジカルで置換され得る。

30

【0059】

本発明によれば、「アルキルスルホニル」は、好ましくは 1～6 個の炭素原子を有する直鎖または分岐鎖アルキルスルホニル、例えば、メチルスルホニル、エチルスルホニル、n-プロピルスルホニル、イソプロピルスルホニル、n-ブチルスルホニル、イソブチルスルホニル、s-ブチルスルホニルおよび t-ブチルスルホニルを表す。1～4 個の炭素原子を有するアルキルスルホニル基が好ましい。本発明におけるアルキルスルホニル基は、1 つ以上の同一のまたは異なるラジカルで置換され得る。

【0060】

本発明によれば、「アルキルカルボニル」は、メチルカルボニル、エチルカルボニル、n-プロピルカルボニル、イソプロピルカルボニル、s-ブチルカルボニルおよび t-ブチルカルボニル等の、好ましくは 2～7 個の炭素原子を有する直鎖または分岐鎖アルキル-C(=O)を表す。1～4 個の炭素原子を有するアルキルカルボニルが好ましい。本発明におけるアルキルカルボニルは、1 つ以上の同一のまたは異なるラジカルで置換され得る。

40

【0061】

本発明によれば、「シクロアルキルカルボニル」は、シクロアルキル部分に好ましくは 3～10 個の炭素原子を有する直鎖または分岐鎖シクロアルキルカルボニル、例えば、シクロプロピルカルボニル、シクロブチルカルボニル、シクロペンチルカルボニル、シクロ

50

ヘキシルカルボニル、シクロヘプチルカルボニル、シクロオクチルカルボニル、ビスクロ [2. 2. 1] ヘプチル、ビスクロ [2. 2. 2] オクチルカルボニルおよびアダマンチルカルボニルを表す。シクロアルキル部分に3、5または7個の炭素原子を有するシクロアルキルカルボニルが好ましい。本発明におけるシクロアルキルカルボニル基は、1つ以上の同一のまたは異なるラジカルで置換され得る。

【0062】

本発明によれば、単独または化学基の構成要素としての「アルコキシカルボニル」は、アルコキシ部分に好ましくは1～6個の炭素原子を有する、もしくは1～4個の炭素原子を有する直鎖または分岐鎖アルコキシカルボニル、例えば、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、*n*-プロポキシカルボニル、イソプロポキシカルボニル、*s*-ブトキシカルボニルおよび*t*-ブトキシカルボニルを表す。本発明におけるアルコキシカルボニル基は、1つ以上の同一のまたは異なるラジカルで置換され得る。

10

【0063】

本発明によれば、「アルキルアミノカルボニル」は、アルキル部分に好ましくは1～6個の炭素原子、もしくは1～4個の炭素原子を有する直鎖または分岐鎖アルキルアミノカルボニル、例えば、メチルアミノカルボニル、エチルアミノカルボニル、*n*-プロピルアミノカルボニル、イソプロピルアミノカルボニル、*s*-ブチルアミノカルボニルおよび*t*-ブチルアミノカルボニルを表す。本発明におけるアルキルアミノカルボニル基は、1つ以上の同一のまたは異なるラジカルで置換され得る。

20

【0064】

本発明によれば、「N, N-ジアルキルアミノカルボニル」は、アルキル部分に好ましくは1～6個の炭素原子、もしくは1～4個の炭素原子を有する直鎖または分岐鎖N, N-ジアルキルアミノカルボニル、例えば、N, N-ジメチルアミノカルボニル、N, N-ジエチルアミノカルボニル、N, N-ジ(*n*-プロピルアミノ)カルボニル、N, N-ジ(イソプロピルアミノ)カルボニルおよびN, N-ジ(*s*-ブチルアミノ)カルボニルを表す。本発明におけるN, N-ジアルキルアミノカルボニル基は、1つ以上の同一のまたは異なるラジカルで置換され得る。

【0065】

本発明によれば、「アリール」は、好ましくは6～14個、特に6～10個の環炭素原子を有する単環式、二環式または多環式芳香族系、例えば、フェニル、ナフチル、アンスリル、フェナントレニル、好ましくはフェニルを表す。加えて、アリールは、結合部位が芳香族系上にあるテトラヒドロナフチル、インデニル、インダニル、フルオレニル、ビフェニル等の多環状系も表す。本発明におけるアリール基は、1つ以上の同一のまたは異なるラジカルで置換され得る。

30

【0066】

置換アリールの例は、C₁—C₄-アルキルおよび／またはC₆—C₁₄-アリール部分において1つ以上の同一もしくは異なるラジカルで同様に置換され得るアリールアルキルである。このようなアリールアルキルの例には、ベンジルおよび1-フェニルエチルが挙げられる。

【0067】

本発明によれば、「複素環」、「複素環式環」または「複素環式環系」は、少なくとも1つの炭素原子が、ヘテロ原子、好ましくはN、O、S、P、B、Si、Seからなる群のヘテロ原子で置き換えられ、飽和、不飽和、もしくはヘテロ芳香族であり、非置換もしくは置換されていてもよく、結合部位が環原子上にある、少なくとも1つの環を有する炭素環式環系を表す。異なって定義されない限り、複素環式環は、複素環式環中に、好ましくはN、OおよびSからなる群の、好ましくは3～9個の環原子、特に3～6個の環原子と、1個以上、好ましくは1～4個、特に1、2または3個のヘテロ原子とを含有するが、2個の酸素原子が直接隣接するべきではない。複素環式環は、通常、4個以下の窒素原子および／または2個以下の酸素原子および／または2個以下の硫黄原子を含有する。ヘテロシクリルラジカルまたは複素環式環が任意に置換される場合、他の炭素環式環または

40

50

複素環式環に縮合され得る。任意に置換されたヘテロシクリルの場合、本発明は、多環系、例えば、8-アザビシクロ[3.2.1]オクタニルまたは1-アザビシクロ[2.2.1]ヘプチルも包含する。任意に置換されたヘテロシクリルの場合、本発明は、スピロ環系、例えば、1-オキサ-5-アザスピロ[2.3]ヘキシルも包含する。

【0068】

本発明におけるヘテロシクリル基は、例えば、ピペリジニル、ピペラジニル、モルフォリニル、チオモルフォリニル、ジヒドロピラニル、テトラヒドロピラニル、ジオキサニル、ピロリニル、ピロリジニル、イミダゾリニル、イミダゾリジニル、チアゾリジニル、オキサゾリジニル、ジオキサラニル、ジオキサリル、ピラゾリジニル、テトラヒドロフラニル、ジヒドロフラニル、オキセタニル、オキシラニル、アゼチジニル、アジリジニル、オキサゼチジニル、オキサジリジニル、オキサゼパニル、オキサジナニル、アゼパニル、オキソピロリジニル、ジオキソピロリジニル、オキソモルフォリニル、オキソピペラジニルおよびオキセパニルである。

【0069】

ヘテロアリール、すなわち、ヘテロ芳香族系が特に重要である。本発明によれば、ヘテロアリールという用語は、ヘテロ芳香族化合物、すなわち、上述の複素環の定義に当てはまる完全に不飽和の芳香族複素環式化合物を表す。上述の群の1~3個、好ましくは1もしくは2個の同一または異なるヘテロ原子を有する5~7員環が好ましい。本発明におけるヘテロアリールは、例えば、フリル、チエニル、ピラゾリル、イミダゾリル、1,2,3-および1,2,4-トリアゾリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、1,2,3-, 1,3,4-, 1,2,4-および1,2,5-オキサジアゾリル、アゼピニル、ピロリル、ピリジル、ピリダジニル、ピリミジニル、ピラジニル、1,3,5-, 1,2,4-および1,2,3-トリアジニル、1,2,4-, 1,3,2-, 1,3,6-および1,2,6-オキサジニル、オキセピニル、チエピニル、1,2,4-トリアゾロニル、ならびに1,2,4-ジアゼピニルである。本発明におけるヘテロアリール基は、1つ以上の同一のまたは異なるラジカルでも置換され得る。

置換アルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシ、アルキルスルファニル、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、シクロアルキル、アリール、フェニル、ベンジル、ヘテロシクリルおよびヘテロアリールラジカル等の「(任意に)置換された」基/置換基という用語は、例えば、非置換塩基構造に由来する置換ラジカルを意味し、置換基、例えば、1個の置換基または複数の置換基、好ましくは1,2,3,4,5,6もしくは7個の置換基は、アミノ、ヒドロキシル、ハロゲン、ニトロ、シアノ、イソシアノ、メルカプト、イソチオシアナト、 C_1-C_4 -カルボキシル、カルボンアミド、 SF_5 、アミノスルホニル、 C_1-C_4 -アルキル、 C_3-C_4 -シクロアルキル、 C_2-C_4 -アルケニル、 C_3-C_4 -シクロアルケニル、 C_2-C_4 -アルキニル、 N -モノ- C_1-C_4 -アルキルアミノ、 N , N -ジ- C_1-C_4 -アルキルアミノ、 $N-C_1-C_4$ -アルカノイルアミノ、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_2-C_4 -アルケニルオキシ、 C_2-C_4 -アルキニルオキシ、 C_3-C_4 -シクロアルコキシ、 C_3-C_4 -シクロアルケニルオキシ、 C_1-C_4 -アルコキシカルボニル、 C_2-C_4 - C_2-C_4 -アルケニルオキシカルボニル、 C_2-C_4 -アルキニルオキシカルボニル、 C_6 -, C_{10} -, C_{14} -アリールオキシカルボニル、 C_1-C_4 -アルカノイル、 C_2-C_4 -アルケニルカルボニル、 C_2-C_4 -アルキニルカルボニル、 C_6 -, C_{10} -, C_{14} -アリールカルボニル、 C_1-C_4 -アルキルスルファニル、 C_3-C_4 -シクロアルキルスルファニル、 C_1-C_4 -アルキルチオ、 C_2-C_4 -アルケニルチオ、 C_3-C_4 -シクロアルケニルチオ、 C_2-C_4 -アルキニルチオ、 C_1-C_4 -アルキルスルフェニル、および、 C_1-C_4 -アルキルスルフィニル基の両鏡像異性体を含む C_1-C_4 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_4 -アルキルスルホニル、 N -モノ- C_1-C_4 -アルキルアミノスルホニル、 N , N -ジ- C_1-C_4 -アルキルアミノスルホニル、 C_1-C_4 -アルキルホスフィニルおよび C_1-C_4 -アルキルホスホニルの両鏡像異性体を含む C_1-C_4 -アルキルホスフィニル、 C_1-C_4 -アルキルホスホニル、 $N-C_1-C_4$ -アルキルアミノカ

ルボニル、N、N-ジ- C_1-C_4 -アルキルアミノカルボニル、N- C_1-C_4 -アルカノイルアミノカルボニル、N- C_1-C_4 -アルカノイル-N- C_1-C_4 -アルキルアミノカルボニル、 C_6- 、 $C_{10}-$ 、 C_{14} -アリール、 C_6- 、 $C_{10}-$ 、 C_{14} -アリールオキシ、ベンジル、ベンジルオキシ、ベンジルチオ、 C_6- 、 $C_{10}-$ 、 C_{14} -アリールチオ、 C_6- 、 $C_{10}-$ 、 C_{14} -アリールアミノ、ベンジルアミノ、ヘテロシクリル、およびトリアルキルシリル、 C_1-C_4 -アルキリデン（例えば、メチリデンもしくはエチリデン）等の二重結合を介して結合された置換基、オキソ基、チオキソ基、イミノ基、ならびに置換イミノ基からなる群から選択される。2つ以上のラジカルが1つ以上の環を形成する場合、これらは、炭素環式、複素環式、飽和、部分飽和、例えば、芳香族環を含む不飽和であってもよく、さらに置換されていてもよい。

10

【0070】

例として言及される置換基（「第1の置換基レベル」）は、それらが炭化水素質成分を含有する場合、任意に、例えば、それぞれ独立して、ハロゲン、ヒドロキシル、アミノ、ニトロ、シアノ、イソシアノ、アジド、アシルアミノ、オキソ基、およびイミノ基から選択される置換基のうちの1つ以上によるさらなる置換（「第2の置換基レベル」）をその中に有してもよい。「（任意に）置換された」基という用語は、好ましくは、1または2の置換基レベルのみを包含する。

【0071】

本発明におけるハロゲンで置換された化学基またはハロゲン化基（例えば、アルキルまたはアルコキシ）は、最大可能数の置換基までハロゲンで単置換または多置換されている。このような基は、ハロ基（例えば、ハロアルキル）とも称される。ハロゲンによる多置換の場合、ハロゲン原子は、同じまたは異なってもよく、すべてが1個の炭素原子に結合されてもよく、または複数の炭素原子に結合されてもよい。ハロゲンは、特に、フッ素、塩素、臭素またはヨウ素であり、好ましくはフッ素、塩素または臭素であり、より好ましくはフッ素である。より具体的には、ハロゲン置換基は、1-フルオロシクロプロピル、2-フルオロシクロプロピルまたは1-フルオロシクロブチル等のモノハロシクロアルキル、2-クロロエチル、2-フルオロエチル、1-クロロエチル、1-フルオロエチル、クロロメチルまたはフルオロメチル等のモノハロアルキル、トリクロロメチルもしくはトリフルオロメチルまたは CF_2CF_3 等のペルハロアルキル、ジフルオロメチル、2-フルオロ-2-クロロエチル、ジクロロメチル、1, 1, 2, 2-テトラフルオロエチルまたは2, 2, 2-トリフルオロエチル等のポリハロアルキルである。ハロアルキルのさらなる例は、トリクロロメチル、クロロジフルオロメチル、ジクロロフルオロメチル、クロロメチル、プロモメチル、1-フルオロエチル、2-フルオロエチル、2, 2-ジフルオロエチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、2, 2, 2-トリクロロエチル、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、3, 3, 3-トリフルオロプロピルおよびペンタフルオロ- γ -ブチルである。1~4個の炭素原子と、フッ素、塩素および臭素から選択される1~9個、好ましくは1~5個の同一または異なるハロゲン原子とを有するハロアルキルが好ましい。とりわけ、ジフルオロメチル、トリフルオロメチルまたは2, 2-ジフルオロエチル等の、1または2個の炭素原子と、フッ素および塩素から選択される1~5個の同一または異なるハロゲン原子とを有するハロアルキルが特に好ましい。ハロゲン置換化合物のさらなる例は、 OCF_3 、 $OCHF_2$ 、 OCH_2F 、 OCF_2CF_3 、 OCH_2CF_3 、 OCH_2CHF_2 および OCH_2CH_2Cl 等のハロアルコキシ、ジフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、トリクロロメチルチオ、クロロジフルオロメチルチオ、1-フルオロエチルチオ、2-フルオロエチルチオ、2, 2-ジフルオロエチルチオ、1, 1, 2, 2-テトラフルオロエチルチオ、2, 2, 2-トリフルオロエチルチオまたは2-クロロ-1, 1, 2-トリフルオロエチルチオ等のハロアルキルスルファニル、ジフルオロメチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルフィニル、トリクロロメチルスルフィニル、クロロジフルオロメチルスルフィニル、1-フルオロエチルスルフィニル、2-フルオロエチルスルフィニル、2, 2-ジフルオロエチルスルフィニル、1, 1, 2, 2-テトラフルオロエチルスルフィニル、2, 2, 2-トリフル

20

30

40

50

オロエチルスルフィニルおよび 2-クロロ-1, 1, 2-トリフルオロエチルスルフィニル等のハロアルキルスルフィニル、ジフルオロメチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルフィニル、トリクロロメチルスルフィニル、クロロジフルオロメチルスルフィニル、1-フルオロエチルスルフィニル、2-フルオロエチルスルフィニル、2, 2-ジフルオロエチルスルフィニル、1, 1, 2, 2-テトラフルオロエチルスルフィニル、2, 2, 2-トリフルオロエチルスルフィニルおよび 2-クロロ-1, 1, 2-トリフルオロエチルスルフィニル等のハロアルキルスルホニル、ジフルオロメチルスルホニル、トリフルオロメチルスルホニル、トリクロロメチルスルホニル、クロロジフルオロメチルスルホニル、1-フルオロエチルスルホニル、2-フルオロエチルスルホニル、2, 2-ジフルオロエチルスルホニル、1, 1, 2, 2-テトラフルオロエチルスルホニル、2, 2, 2-トリフルオロエチルスルホニルおよび 2-クロロ-1, 1, 2-トリフルオロエチルスルホニル等のハロアルキルスルホニル基である。

10

【0072】

炭素原子を有するラジカルの場合、1~4個の炭素原子、特に、1または2個の炭素原子を有するものが好ましい。ハロゲン、例えば、フッ素および塩素、(C₁-C₄)-アルキル、好ましくはメチルまたはエチル、(C₁-C₄)-ハロアルキル、好ましくはトリフルオロメチル、(C₁-C₄)-アルコキシ、好ましくはメトキシまたはエトキシ、(C₁-C₄)-ハロアルコキシ、ニトロ、およびシアノの基からの置換基が、一般的に好ましい。本明細書では、置換基、メチル、メトキシ、フッ素および塩素が特に好ましい。

20

【0073】

一置換または二置換アミノ等の置換アミノは、例えば、アルキル、ヒドロキシ、アミノ、アルコキシ、アシルおよびアリールの群の1または2個の同一もしくは異なるラジカルによって、N-置換された置換アミノラジカル群のラジカルを意味し、好ましくはN-モノおよびN, N-ジアルキルアミノ（例えば、メチルアミノ、エチルアミノ、N, N-ジメチルアミノ、N, N-ジエチルアミノ、N, N-ジ-n-プロピルアミノ、N, N-ジイソプロピルアミノまたはN, N-ジブチルアミノ）、N-モノまたはN, N-ジアルコキシアルキルアミノ基（例えば、N-メトキシメチルアミノ、N-メトキシエチルアミノ、N, N-ジ（メトキシメチル）アミノまたはN, N-ジ（メトキシエチル）アミノ）、N-モノおよびN, N-ジアリールアミノ、例えば、任意に置換されたアニリン、アシルアミノ、N, N-ジアシルアミノ、N-アルキル-N-アリールアミノ、N-アルキル-N-アシルアミノ、ならびに飽和N-複素環であり、本明細書では、1~4個の炭素原子を有するアルキルラジカルが好ましく、アリールは、好ましくはフェニルまたは置換されたフェニルであり、アシルに関しては、さらに以下に記載される定義が、好ましくは(C₁-C₄)-アルカノイルに適用される。同じ定義が、置換ヒドロキシルアミノまたはヒドラジノに適用される。

30

【0074】

本発明によれば、「環状アミノ基」という用語は、1つ以上の窒素原子を有するヘテロ芳香族環系または脂肪族環系を包含する。複素環は、飽和または不飽和であり、1つ以上の任意に縮合された環系からなり、任意にさらなるヘテロ原子、例えば、1もしくは2個の窒素、酸素および／または硫黄原子を含有する。加えて、この用語は、スピロ環または架橋環系を有する基も包含する。環状アミノ基を形成する原子の数は制限されず、例えば、一環系の場合は3~8個の環原子、二環系の場合は7~11個の原子からなり得る。

40

【0075】

ヘテロ原子として窒素原子を有する飽和および不飽和単環状基を有する環状アミノ基の例としては、1-アゼチジニル、ピロリジノ、2-ピロリジン-1-イル、1-ピロリル、ペペリジノ、1, 4-ジヒドロピラジン-1-イル、1, 2, 5, 6-テトラヒドロピラジン-1-イル、1, 4-ジヒドロピリジン-1-イル、1, 2, 5, 6-テトラヒドロピリジン-1-イル、ホモペペリジニルが挙げられ、ヘテロ原子として2個以上の窒素原子を有する飽和および不飽和単環状基を有する環状アミノ基の例としては、1-イミダ

50

ゾリジニル、1-イミダゾリル、1-ピラゾリル、1-トリアゾリル、1-テトラゾリル、1-ピペラジニル、1-ホモピペラジニル、1, 2-ジヒドロピペラジニ-1-イル、1, 2-ジヒドロピリミジニ-1-イル、ペルヒドロピリミジニ-1-イル、1, 4-ジアザシクロヘプタニ-1-イルが挙げられ、ヘテロ原子として1または2個の酸素原子および1~3個の窒素原子を有する飽和および不飽和単環状基を有する環状アミノ基の例としては、例えば、オキサゾリジニ-3-イル、2, 3-ジヒドロイソキサゾール-2-イル、イソキサゾール-2-イル、1, 2, 3-オキサジアジニ-2-イル、モルホリノ、ヘテロ原子として1~3個の窒素原子および1~2個の硫黄原子を有する飽和および不飽和単環状基を有する環状アミノ基の例としては、チアゾリジニ-3-イル、イソチアゾリニ-2-イル、チオモルホリノまたはジオキソチオモルホリノが挙げられ、飽和および不飽和縮合環状基を有する環状アミノ基の例としては、インドール-1-イル、1, 2-ジヒドロベンゾイミダゾール-1-イル、ペルヒドロピロロ[1, 2-a]ピラジニ-2-イルが挙げられ、スピロ環状基を有する環状アミノ基の例としては、2-アザスピロ[4, 5]デカン-2-イルが挙げられ、架橋ヘテロ環状基を有する環状アミノ基の例としては、2-アザビシクロ[2. 2. 1]ヘプタニ-7-イルが挙げられる。

10

【0076】

置換アミノは、窒素原子上に4つの有機置換基を有する四級アンモニウム化合物（塩）も含む。

【0077】

任意に置換されたフェニルは、好ましくは、置換されていないか、または、ハロゲン、 $(C_1 - C_4)$ -アルキル、 $(C_1 - C_4)$ -アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ -アルコキシ- $(C_1 - C_4)$ -アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ -アルコキシ- $(C_1 - C_4)$ -アルキル、 $(C_1 - C_4)$ -ハロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ -ハロアルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ -アルキルスルファニル、 $(C_1 - C_4)$ -ハロアルキルスルファニル、シアノ、イソシアノおよびニトロ、例えば、o-、m-およびp-トリル、ジメチルフェニル、2-、3-および4-クロロフェニル、2-、3-および4-フルオロフェニル、2-、3-および4-トリフルオロメチル-ならびに-トリクロロメチルフェニル、2, 4-、3, 5-、2, 5-および2, 3-ジクロロフェニル、o-、m-およびp-メトキシフェニル、4-ヘプタフルオロフェニルの基からの同一または異なるラジカルで一置換もしくは多置換された、好ましくは最大で三置換されたフェニルである。

20

30

【0078】

任意に置換されたシクロアルキルは、好ましくは、置換されていないか、または、ハロゲン、シアノ、 $(C_1 - C_4)$ -アルキル、 $(C_1 - C_4)$ -アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ -アルコキシ- $(C_1 - C_4)$ -アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ -アルコキシ- $(C_1 - C_4)$ -アルキル、 $(C_1 - C_4)$ -ハロアルキルおよび $(C_1 - C_4)$ -ハロアルコキシの基からの同一または異なるラジカルで、特に、1つまたは2つの $(C_1 - C_4)$ -アルキルラジカルで一置換もしくは多置換された、好ましくは最大で三置換されたシクロアルキルである。

【0079】

任意に置換されたヘテロシクリルは、好ましくは、置換されていないか、または、ハロゲン、シアノ、 $(C_1 - C_4)$ -アルキル、 $(C_1 - C_4)$ -アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ -アルコキシ- $(C_1 - C_4)$ -アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ -アルコキシ- $(C_1 - C_4)$ -アルキル、 $(C_1 - C_4)$ -ハロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ -ハロアルコキシ、ニトロおよびオキソの基からの同一または異なるラジカルで一置換もしくは多置換された、好ましくは最大で三置換されたヘテロシクリル、特にハロゲン、 $(C_1 - C_4)$ -アルキル、 $(C_1 - C_4)$ -アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ -ハロアルキルおよびオキソの基からのラジカルで一置換または多置換されたヘテロシクリル、最も好ましくは1つまたは2つの $(C_1 - C_4)$ -アルキルラジカルで置換されたヘテロシクリルである。

40

【0080】

アルキルで置換されたヘテロアリールの例は、フリルメチル、チエニルメチル、ピラゾ

50

リルメチル、イミダゾリルメチル、1, 2, 3-および1, 2, 4-トリアゾリルメチル、イソオキサゾリルメチル、チアゾリルメチル、イソチアゾリルメチル、1, 2, 3-, 1, 3, 4-, 1, 2, 4-および1, 2, 5-オキサジアゾリルメチル、アゼピニルメチル、ピロリルメチル、ピリジルメチル、ピリダジニルメチル、ピリミジニルメチル、ピラジニルメチル、1, 3, 5-, 1, 2, 4-および1, 2, 3-トリアジニルメチル、1, 2, 4-, 1, 3, 2-, 1, 3, 6-および1, 2, 6-オキサジニルメチル、オキセピニルメチル、チエピニルメチル、ならびに1, 2, 4-ジアゼピニルメチルである。

【0081】

本発明の化合物は、好ましい実施形態で存在し得る。本明細書に記載される個々の実施形態は、互いに組み合わせられてもよい。自然の法則に反し、したがって、当業者が、その専門知識の基盤を無視し得る組み合わせは含まれない。例えば、3個以上の隣接する酸素原子を有する環構造は除外される。

10

【0082】

本発明の化合物の実施形態

すべての実施形態は単独でまたは組み合わせて存在してもよいことは、当業者には明らかだろう。

【0083】

式(I)の化合物、特に、式(Ia)、(Ib)、(I-T2)、(I-T3)、(I-T4)、(I-T22)および(I-T23)の化合物は、適切な場合には、置換基の性質に応じて、塩、互変異性体、幾何異性体、および／もしくは光学活性異性体、または異なる組成物中の対応する異性体混合物の形態であり得る。

20

【0084】

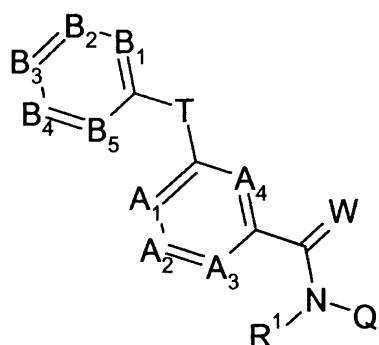
適切な場合には、本発明の化合物は、種々の多形性形態で、または異なる多形性形態の組み合わせの形態であってもよい。純粋な多形体および多形体混合物の両方が本発明の主題の一部を形成し、本発明によって使用され得る。

【0085】

式(I)の化合物の実施形態が、以下に詳細に記載される：

【化10】

30



(I)

40

(式中、

R^1 は、H、いずれの場合も任意に置換された C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -アルキニル、 C_3-C_7 -シクロアルキル、 C_1-C_6 -アルキルカルボニル、 C_1-C_6 -アルコキシカルボニル、アリール (C_1-C_3)-アルキル、ヘテロアリール (C_1-C_3)-アルキルであるか、または、任意に置換された C_1-C_6 -アルキルであり、好ましくはHであり、または好ましくは C_1-C_2 -アルキルであり、最も好ましくはHもしくはメチルであり、

以下の部分は、以下の通り、

A_1 は CR^2 またはNであり、

50

A_2 は CR^3 または N であり、
 A_3 は CR^4 または N であり、
 A_4 は CR^5 または N であり、
 B_1 は CR^6 または N であり、
 B_2 は CR^7 または N であり、
 B_3 は CR^8 または N であり、
 B_4 は CR^9 または N であり、かつ、
 B_5 は CR^{10} または N であるが、

$A_1 \sim A_4$ 部分の 3 つ以下が N であり、 $B_1 \sim B_5$ 部分の 3 つ以下が同時に N であり

10

R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^9 および R^{10} は、それぞれ独立して、 H 、ハロゲン、シアノ、ニトロ、いずれの場合も任意に置換された C_1-C_6 -アルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 $N-C_1-C_6$ -アルコキシイミノ- C_1-C_3 -アルキル、 C_1-C_6 -アルキルスルファニル、 C_1-C_6 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_6 -アルキルスルホニル、 $N-C_1-C_6$ -アルキルアミノ、 N 、 N -ジ- C_1-C_6 -アルキルアミノ、または $N-C_1-C_3$ -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキルアミノもしくは 1-ピロリジニルであり、

A_2 部分および A_3 部分のいずれも、 N 、 R^3 および R^4 でない場合、それらが結合する炭素原子と一緒にあって、0、1 もしくは 2 個の窒素原子および／または 0 もしくは 1 個の酸素原子および／または 0 もしくは 1 個の硫黄原子を含有する 5 もしくは 6 員環を形成してもよく、

20

A_1 部分および A_2 部分のいずれも、 N 、 R^2 および R^3 でない場合、それらが結合する炭素原子と一緒にあって、0、1 または 2 個の窒素原子を含有する 6 員環を形成してもよく、

R^8 は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、いずれの場合も任意に置換された C_1-C_6 -アルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 $N-C_1-C_6$ -アルコキシイミノ- C_1-C_3 -アルキル、 C_1-C_6 -アルキルスルファニル、 C_1-C_6 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_6 -アルキルスルホニル、 $N-C_1-C_6$ -アルキルアミノ、または N 、 N -ジ- C_1-C_6 -アルキルアミノであり、

W は O または S であり、

30

Q は、 H 、ホルミル、ヒドロキシル、アミノ、またはいずれの場合も任意に置換された C_1-C_6 -アルキル、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -アルキニル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_5 -ヘテロシクロアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_6 -アルキル- C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_6 -アルキル、 C_6 -、 C_{10} -、 C_{14} -アリール、 C_1-C_5 -ヘテロアリール、 C_6 -、 C_{10} -、 C_{14} -アリール- C_1-C_3 -アルキル、 C_1-C_5 -ヘテロアリール- C_1-C_3 -アルキル、 $N-C_1-C_4$ -アルキルアミノ、 $N-C_1-C_4$ -アルキルカルボニルアミノ、もしくは N 、 N -ジ- C_1-C_4 -アルキルアミノであるか、あるいは

任意にポリ- V -置換された不飽和 6 員炭素環であるか、あるいは、

40

任意にポリ- V -置換された不飽和 4、5 または 6 員複素環式環であり、

V は独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、いずれの場合も任意に置換された C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_4 -アルケニル、 C_1-C_4 -アルキニル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 $N-C_1-C_6$ -アルコキシイミノ- C_1-C_3 -アルキル、 C_1-C_6 -アルキルスルファニル、 C_1-C_6 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_6 -アルキルスルホニル、または N 、 N -ジ- (C_1-C_6 -アルキル) アミノであり、

T は、4 個の炭素原子および 1 個のヘテロ原子、好ましくは 1 個の窒素、1 個の酸素もしくは 1 個の硫黄原子、または 3 個の炭素原子および 2 個のヘテロ原子、好ましくは、2 個の窒素原子、1 個の窒素原子および 1 個の酸素原子、または 1 個の窒素および 1 個の硫

50

黄原子等の 2 個以下のヘテロ原子を含有する任意に置換された 5 員ヘテロ芳香族系である)、

ならびに式 (I) の化合物の塩、N-酸化物および互変異性型。

【0086】

R¹

好ましい実施形態では、式 (I) の化合物の R¹ は、H、いずれの場合も任意に置換されたメチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、イソブチル、s-ブチル、t-ブチル、メトキシメチル、エトキシメチル、プロポキシメチル、メチルカルボニル、エチルカルボニル、n-プロピルカルボニル、イソプロピルカルボニル、s-ブチルカルボニル、t-ブチルカルボニル、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、n-プロポキシカルボニル、イソプロポキシカルボニル、s-ブトキシカルボニル、t-ブトキシカルボニル、シアノメチル、2-シアノエチル、ベンジル、4-メトキシベンジル、ピリド-2-イルメチル、ピリド-3-イルメチル、ピリド-4-イルメチル、4-クロロピリド-3-イルメチルである。

【0087】

さらにより好ましい実施形態では、R¹ は H である。

【0088】

W

さらに好ましい実施形態では、W は O である。

【0089】

Q

さらに好ましい実施形態では、Q は、H、いずれの場合も任意に置換されたメチル、エチル、n-プロピル、1-メチルエチル、1, 1-ジメチルエチル、1-メチルプロピル、n-ブチル、2-メチルプロピル、2-メチルブチル、ヒドロキシメチル、2-ヒドロキシプロピル、シアノメチル、2-シアノエチル、2-フルオロエチル、2, 2-ジフルオロエチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、1-トリフルオロメチルエチル、2, 2-ジフルオロプロピル、3, 3, 3-トリフルオロプロピル、2, 2-ジメチル-3-フルオロプロピル、シクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、1-メトキシカルボニルシクロプロピル、1-(N-メチルカルバモイル)シクロプロピル、1-(N-シクロプロピルカルバモイル)シクロプロピル、1-(チオカルバモイル)シクロプロピル、シクロプロピルメチル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、1-シクロプロピルエチル、ビス(シクロプロピル)メチル、2, 2-ジメチルシクロプロピルメチル、2-フェニルシクロプロピル、2, 2-ジクロロシクロプロピル、トランス-2-クロロシクロプロピル、シス-2-クロロシクロプロピル、2, 2-ジフルオロシクロプロピル、トランス-2-フルオロシクロプロピル、シス-2-フルオロシクロプロピル、トランス-4-ヒドロキシシクロヘキシル、4-トリフルオロメチルシクロヘキシル、プロプ-2-エニル、2-メチルプロプ-2-エニル、プロプ-2-イニル、1, 1-ジメチルブタ-2-イニル、3-クロロプロプ-2-エニル、3, 3-ジクロロプロプ-2-エニル、3, 3-ジクロロ-1, 1-ジメチルプロプ-2-エニル、フェニル、2-クロロフェニル、3-クロロフェニル、4-クロロフェニル、オキセタン-3-イル、チエタン-3-イル、1-オキシドチエタン-3-イル、1, 1-ジオキシドチエタン-3-イル、イソキサゾール-3-イルメチル、2-オキソ-2-(2, 2, 2-トリフルオロエチルアミノ)エチル、1, 2, 4-トリアゾール-3-イルメチル、3-メチルオキセタン-3-イルメチル、ベンジル、2, 6-ジフルオロフェニルメチル、3-フルオロフェニルメチル、2-フルオロフェニルメチル、2, 5-ジフルオロフェニルメチル、1-フェニルエチル、4-クロロフェニルエチル、2-トリフルオロメチルフェニルエチル、1-ピリジン-2-イルエチル、ピリジン-2-イルメチル、5-フルオロピリジン-2-イルメチル、(6-クロロピリジン-3-イル)メチル、ピリミジン-2-イルメチル、メトキシ、2-エトキシエチル、2-(メチルスルファニル)エチル、1-メチル-2-(エチルスルファニル)エチル、2-メチル-1-(メチルスルファニル)プロパン-2-イル、

メトキシカルボニル、メトキシカルボニルメチル、 NH_2 、 N -エチルアミノ、 N -アリルアミノ、 N 、 N -ジメチルアミノ、 N 、 N -ジエチルアミノであるか、または、

Qは、0～4個のV置換基でそれぞれ置換された、次のもの：フェニル、ナフチル、ピリダジン、ピラジン、ピリミジン、トリアジン、ピリジン、ピラゾール、チアゾール、イソチアゾール、オキサゾール、イソキサゾール、トリアゾール、イミダゾール、フラン、チオフェン、ピロール、オキサジアゾール、チアジアゾールのうちの1つであり、

Vは独立して、F、Cl、Br、I、シアノ、ニトロ、メチル、エチル、ジフルオロメチル、トリクロロメチル、クロロジフルオロメチル、ジクロロフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロメチル、プロモメチル、1-フルオロエチル、2-フルオロエチル、2, 2-ジフルオロエチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、1, 2, 2, 2-テトラフルオロエチル、1-クロロ-1, 2, 2, 2-テトラフルオロエチル、2, 2, 2-トリクロロエチル、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエチル、1, 1-ジフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、ヘプタフルオロ-n-プロピル、ヘプタフルオロイソプロピル、ノナフルオロ-n-ブチル、シクロプロピル、シクロブチル、メトキシ、エトキシ、n-プロポキシ、1-メチルエトキシ、フルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、ジクロロフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエトキシ、ペンタフルオロエトキシ、N-メトキシイミノメチル、1-(N-メトキシイミノ)エチル、メチルスルファニル、メチルスルホニル、メチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルホニル、トリフルオロメチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルファニル、N, N-ジメチルアミノである。

10

20

【0090】

さらに好ましい実施形態では、Qは、任意に置換された C_1-C_4 -アルキルまたは任意に置換された C_3-C_6 -シクロアルキル、または1, 2もしくは3個のV置換基で任意に置換された不飽和4, 5もしくは6員複素環式環であり、Vは独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、オキソ(=O)、任意にハロゲンで置換された C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_4 -アルケニル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -アルキルスルファニル、 C_1-C_6 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_6 -アルキルスルホニルである。好ましくは、Qが、ハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルキルであり、シアノ、ヒドロキシルまたはカルボンアミド($-\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{R})_2$)を有し、Rが独立して、Hまたは C_1-C_3 -アルキル、置換 C_1-C_3 -アルキルであるか； C_3 -シクロアルキル、または、シアノで置換された、ハロゲンで置換された、ニトロで置換された、もしくはハロゲン化された C_1-C_2 -アルキルで置換された C_3 -シクロアルキルであるか；1, 2または3個のVで任意に置換され、N, OおよびSからなる群から選択される1または2個のヘテロ原子を含有する不飽和4, 5もしくは6員複素環式環であり、Vが独立してハロゲン、シアノ、ニトロ、オキソ(=O)、任意にハロゲンで置換された C_1-C_6 -アルキルである。より好ましくは、Qが、 CF_3 、 CH_2CF_3 または $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CF}_3$ 等のフッ化 C_1-C_3 -アルキルであるか、2-オキソ-2-(2, 2, 2-トリフルオロエチルアミノ)エチル等のカルボンアミド($-\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{R})_2$)で置換された C_1-C_3 -アルキルであって、Rが独立して、H、 C_1-C_3 -アルキルまたはハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルキルであるか；シクロプロピル、または、1-(シアノ)シクロプロピルもしくは1-(トリフルオロメチル)シクロプロピル等のシアノで置換されたまたはフッ化された C_1-C_2 -アルキル置換シクロプロピルであるか；チエタン-3-イル等のN, OおよびSからなる群から選択される1個のヘテロ原子を含有する4員複素環式環である。

30

40

【0091】

より好ましい実施形態では、Qは、2, 2, 2-トリフルオロエチル、2, 2-ジフルオロエチル、3, 3, 3-トリフルオロプロピル等のフッ素で置換された C_1-C_4 -アルキル；シクロプロピルもしくはシクロブチル等の C_3-C_4 -シクロアルキル；1-トリフルオロメチルシクロプロピル、1-tert-ブチルシクロプロピル、1-チオカル

50

バモイルシクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、トランス-2-フルオロシクロプロピル、シス-2-フルオロシクロプロピル等の任意に置換された C_3-C_4 -シクロアルキル；オキセタン-3-イル、チエタン-3-イル、1-オキシドチエタン-3-イルもしくは1, 1-ジオキシドチエタン-3-イル等の C_4-C_6 -ヘテロシクロアルキル；ベンジル；ピリジン-2-イルメチル；メチルスルホニル；または2-オキソ-2-(2, 2, 2-トリフルオロエチルアミノ)エチルである。

【0092】

特に好ましい実施形態では、Qは、2, 2, 2-トリフルオロエチルもしくは3, 3, 3-トリフルオロプロピル等のフッ素で置換された C_1-C_3 -アルキル；シクロプロピル；1-シアノシクロプロピルもしくは1-トリフルオロメチルシクロプロピル、チエタン-3-イル等の任意に置換されたシクロプロピル；または2-オキソ-2-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)アミノエチルである。

10

【0093】

A₁～A₄

好ましい実施形態では、1つ以下のA₁～A₄部分はNであるか（換言すると、1つのA₁～A₄（好ましくはA₂）はNである）；またはA₁～A₄はNではないか（換言すると、A₁～A₄はそれぞれ、CR²、CR³、CR⁴およびCR⁵である）；またはA₁、A₂、A₃、A₄から選択される1つもしくは2つの部分はNであってもよく、かつ、B₁、B₂、B₃、B₄およびB₅から選択される1つ以下の部分はNである。

【0094】

さらに好ましい実施形態では、式(I)の化合物のR²、R³、R⁴およびR⁵は（対応するA部分がCRである場合）、それぞれ独立して、H、ハロゲン、シアノ、ニトロ、いずれの場合も任意に置換された C_1-C_4 -アルキル、 C_3-C_4 -シクロアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、N- C_1-C_4 -アルコキシイミノ- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキルスルファニル、 C_1-C_4 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_4 -アルキルスルホニル、N- C_1-C_4 -アルキルアミノ、N、N-ジ- C_1-C_4 -アルキルアミノ、またはN- C_1-C_3 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキルアミノもしくは1-ピロリジニルである。

20

【0095】

さらに好ましい実施形態では、R²およびR⁵は、それぞれ独立して、H、メチル、F、およびClである。

30

【0096】

さらに好ましい実施形態では、R³およびR⁴は、それぞれ独立して、H、F、Cl、Br、I、シアノ、ニトロ、メチル、エチル、フルオロメチル、ジフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、トリフルオロメチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、メトキシ、エトキシ、n-プロポキシ、1-メチルエトキシ、フルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、ジクロロフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエトキシ、ペンタフルオロエトキシ、N-メトキシイミノメチル、1-(N-メトキシイミノ)エチル、メチルスルファニル、トリフルオロメチルスルファニル、メチルスルホニル、メチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルホニル、トリフルオロメチルスルフィニルである。

40

【0097】

B₁～B₅

好ましい実施形態では、1つ以下のB₁～B₅部分はNであるか（換言すると、1つのB₁～B₅はNである）；またはB₁～B₅はNではない（B₁～B₅はそれぞれ、CR⁶、CR⁷、CR⁸、CR⁹およびCR¹⁰である）。

【0098】

さらに好ましい実施形態では、R⁶、R⁷、R⁹およびR¹⁰は（対応するB部分がCRである場合）、それぞれ独立して、H、ハロゲン、シアノ、ニトロ、いずれの場合も任意に置換された C_1-C_4 -アルキル、 C_3-C_4 -シクロアルキル、 C_1-C_4 -アル

50

コキシ、N-アルコキシイミノアルキル、 C_1-C_4 -アルキルスルファニル、 C_1-C_4 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_4 -アルキルスルホニル、N- C_1-C_4 -アルキルアミノ、N、N-ジ- C_1-C_4 -アルキルアミノである。

【0099】

さらに好ましい実施形態では、 R^6 、 R^7 、 R^9 および R^{10} は、それぞれ独立して、H、ハロゲン、シアノ、ニトロ、メチル、エチル、フルオロメチル、ジフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、トリフルオロメチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、メトキシ、エトキシ、n-プロポキシ、1-メチルエトキシ、フルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、ジクロロフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエトキシ、ペンタフルオロエトキシ、N-メトキシイミノメチル、1-(N-メトキシイミノ)エチル、メチルスルファニル、トリフルオロメチルスルファニル、メチルスルホニル、メチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルホニル、トリフルオロメチルスルフィニルである。

10

【0100】

さらに好ましい実施形態では、 R^6 および R^{10} は、それぞれ独立して、H、ハロゲン（特に、塩素、臭素、フッ素）、シアノ、ニトロ、メチル、エチル、ジフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、1-メチルエトキシ、ジフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、ジクロロフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエトキシ、メチルスルファニル、トリフルオロメチルスルファニル、メチルスルホニル、メチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルホニル、トリフルオロメチルスルフィニルである。

20

【0101】

さらに好ましい実施形態では、 R^6 および R^{10} は、本明細書に記載される置換基であるが、1つの化合物中の R^6 および R^{10} は、両方がHではない。換言すると、化合物中の R^6 がHである場合、 R^{10} は、本明細書に記載される他の置換基のうちの1つであり、逆もまた同様である。

【0102】

さらに好ましい実施形態では、 R^6 および R^{10} はそれぞれ、ハロゲン（好ましくはCl、BrまたはF）、 C_1-C_3 -アルキル、ハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルキル、 C_1-C_3 -アルコキシおよびハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルコキシから選択される置換基である。

30

【0103】

さらに好ましい実施形態では、 R^6 および R^{10} はそれぞれ、ハロゲン（Cl、Br、またはF等）であるか、それぞれ、 C_1-C_3 -アルキルであるか、またはそれぞれ、ハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルキル、例えば、過フッ化 C_1-C_3 -アルキル（ペルフルオロメチル、ペルフルオロエチルまたはペルフルオロプロピル）である。

【0104】

さらに好ましい実施形態では、 R^6 は過フッ化 C_1-C_3 -アルキル（例えば、ペルフルオロメチル）であり、 R^{10} は、Cl、BrまたはFであり、より好ましくはClまたはBrである。

40

【0105】

R8

特に好ましい実施形態では、 B_3 は、 $C-R^8$ であり、 R^8 は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ハロゲンで置換された C_1-C_4 -アルキル、 C_3-C_4 -シクロアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、N- C_1-C_4 -アルコキシイミノ- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキルスルファニル、 C_1-C_4 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_4 -アルキルスルホニル、N- C_1-C_4 -アルキルアミノまたはN、N-ジ- C_1-C_4 -アルキルアミノである。

【0106】

50

さらに好ましい実施形態では、 R^8 は、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素等のハロゲン、またはハロゲンで置換された C_1-C_4 -アルキル、シアノ、ニトロ、メチル、エチル、ジフルオロメチル、トリクロロメチル、クロロジフルオロメチル、ジクロロフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロメチル、プロモメチル、1-フルオロエチル、2-フルオロエチル、2, 2-ジフルオロエチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、1, 2, 2, 2-テトラフルオロエチル、1-クロロ-1, 2, 2, 2-テトラフルオロエチル、2, 2, 2-トリクロロエチル、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエチル、1, 1-ジフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、ペンタフルオロ-tert-ブチル、ヘプタフルオロ-n-プロピル、ヘプタフルオロイソプロピル、ノナフルオロ-n-ブチル、ノナフルオロ-sec-ブチル、シクロプロピル、シクロブチル、メトキシ、エトキシ、n-プロポキシ、1-メチルエトキシ、フルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、ジクロロフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエトキシ、ペンタフルオロエトキシ、N-メトキシイミノメチル、1-(N-メトキシイミノ)エチル、メチルスルファニル、メチルスルホニル、メチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルホニル、トリフルオロメチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルファニル、N, N-ジメチルアミノである。

10

【0107】

より好ましい実施形態では、 R^8 は、ジフルオロメチル、トリクロロメチル、クロロジフルオロメチル、ジクロロフルオロメチル、トリフルオロメチル、1-フルオロエチル、2-フルオロエチル、2, 2-ジフルオロエチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、1, 2, 2, 2-テトラフルオロエチル、1-クロロ-1, 2, 2, 2-テトラフルオロエチル、2, 2, 2-トリクロロエチル、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエチル、1, 1-ジフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、ペンタフルオロ-tert-ブチル、ヘプタフルオロ-n-プロピル、ヘプタフルオロイソプロピル、ノナフルオロ-n-ブチル、ノナフルオロ-sec-ブチル、フルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、ジクロロフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエトキシ、ペンタフルオロエトキシ、トリフルオロメチルスルホニル、トリフルオロメチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルファニルである。

20

【0108】

さらなるより好ましい実施形態では、 R^8 は、ハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルキル（好ましくは過フッ化 C_1-C_3 -アルキル（ CF_3 、 C_2F_5 もしくは C_3F_7 ））またはハロゲンで置換されたアルコキシ（好ましくは過フッ化 C_1-C_3 -アルコキシ（ OCF_3 、 OC_2F_5 もしくは OC_3F_7 ））である。

30

【0109】

特に好ましい実施形態では、 R^8 は、過フッ化n-もしくはi-プロピル（ $-C_3F_7$ ）等の過フッ化 C_1-C_3 -アルキル、過フッ化エチル（ C_2F_5 ）、または過フッ化メチル（ CF_3 ）であり、より好ましくは過フッ化n-もしくはi-プロピル（ $-C_3F_7$ ）または過フッ化メチルである。

40

【0110】

AおよびB

さらに好ましい実施形態では、式(I)の化合物中の $A_1 \sim A_4$ 部分および $B_1 \sim B_5$ 部分は、以下の通り、

- A_1 はC-Hであり、
- A_2 は CR^3 またはNであり、
- A_3 は CR^4 であり、
- A_4 は CR^5 またはNであり、
- B_1 は CR^6 またはNであり、
- B_2 は CR^7 であり、
- B_3 は CR^8 であり、

50

B_4 は CR^9 であり、かつ、
 B_5 は CR^{10} または N である。

【0111】

さらにより好ましい実施形態では、式 (I) の化合物中の $A_1 \sim A_4$ 部分および $B_1 \sim B_5$ 部分は、以下の通り、

A_1 は $C-H$ であり、
 A_2 は CR^3 または N であり、
 A_3 は CR^4 であり、
 A_4 は $C-H$ であり、
 B_1 は CR^6 または N であり、
 B_2 は $C-H$ であり、
 B_3 は CR^8 であり、
 B_4 は $C-H$ であり、かつ、
 B_5 は CR^{10} または N である。

10

【0112】

さらにより好ましい実施形態では、式 (I) の化合物中の $A_1 \sim A_4$ 部分および $B_1 \sim B_5$ 部分は、以下の通り、

A_1 は $C-H$ であり、
 A_2 は CR^3 または N であり、
 A_3 は CR^4 であり、
 A_4 は $C-H$ または N であり、
 B_1 は CR^6 であり、
 B_2 は $C-H$ であり、
 B_3 は CR^8 であり、
 B_4 は $C-H$ であり、かつ、
 B_5 は CR^{10} または N である。

20

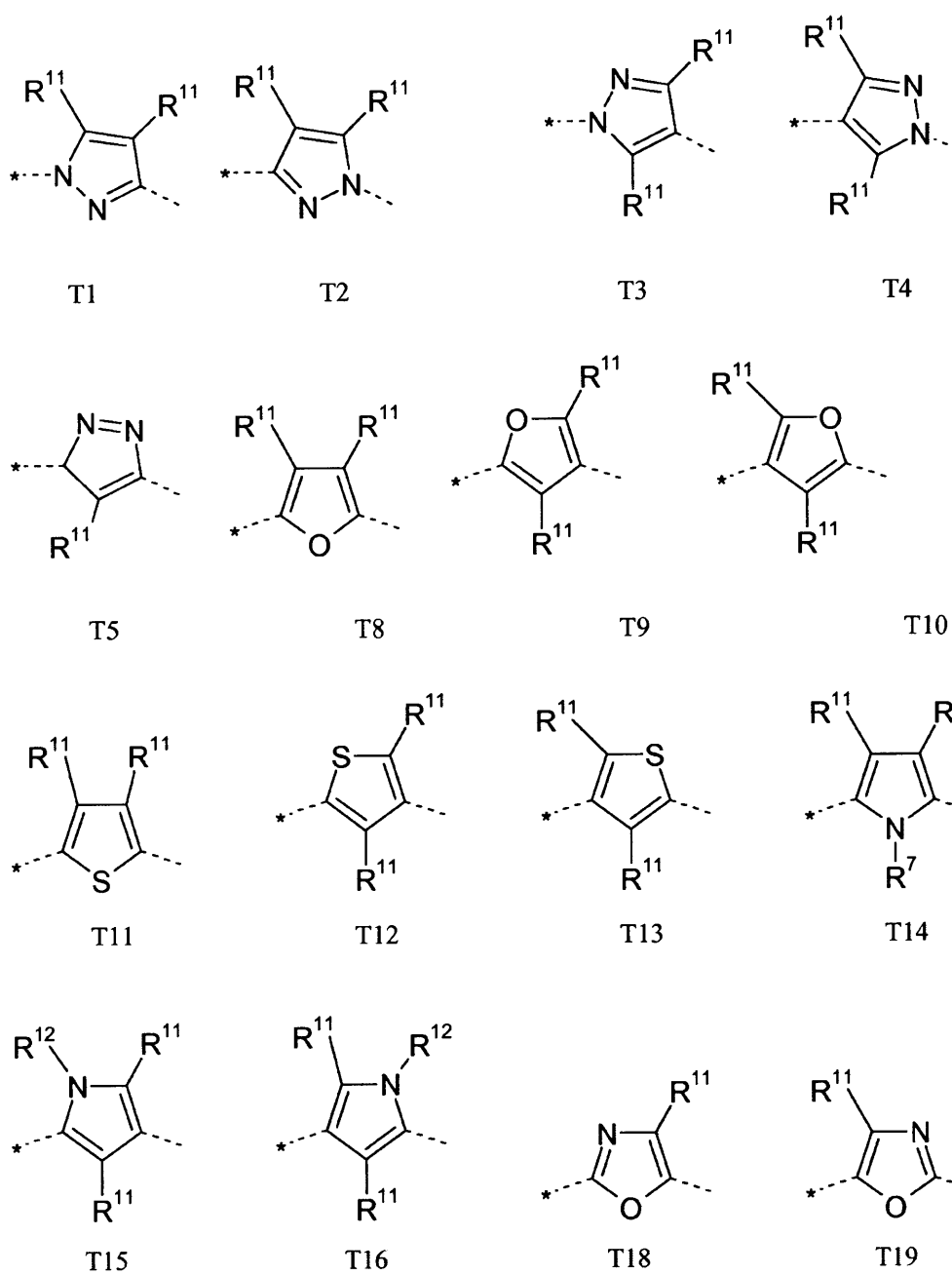
【0113】

T

さらに好ましい実施形態では、 T は、以下に示される 5 員ヘテロ芳香族系のうちの 1 つであり、 $(C-B_1-B_5)$ 環系の炭素原子との結合は、アスタリスクで印付けられた点線の結合で識別され、 $(C-A_1-A_2-A_3-C-A_4)$ 一環系の炭素原子との結合は、点線の結合で識別される。

30

【化 1 1 - 1】

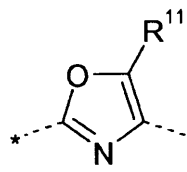


10

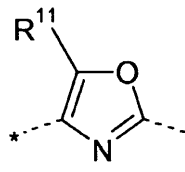
20

30

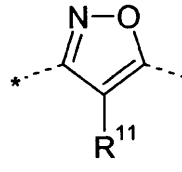
【化 1 1 - 2】



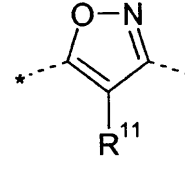
T20



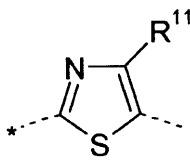
T21



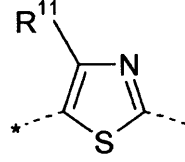
T22



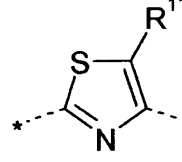
T23



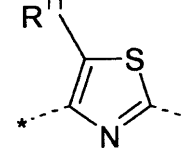
T24



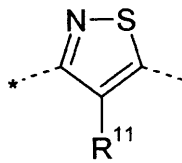
T25



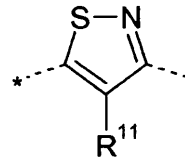
T26



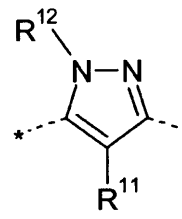
T27



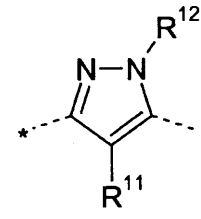
T28



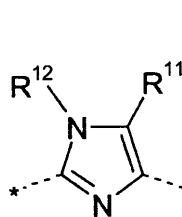
T29



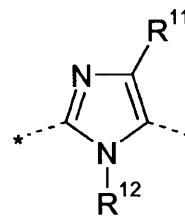
T30



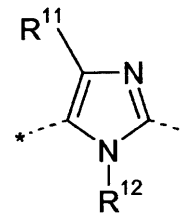
T31



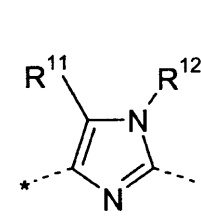
T32



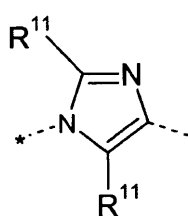
T33



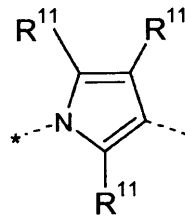
T34



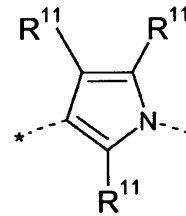
T35



T45



T46



T47

式中、

R^{11} は独立して、H、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、または任意に置換された C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルキルオキシ、 C_1-C_6 -アルキルカルボニル、 C_1-C_6 -アルキルスルファニル、 C_1-C_6 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_6 -アルキルスルホニルであり、好ましくはHであり、

R^{12} は、H、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、または任意に置換された C_1-C

10

20

30

40

50

C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルキルオキシ、 C_1-C_6 -アルキルカルボニル、 C_1-C_6 -アルキルスルファニル、 C_1-C_6 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_6 -アルキルスルホニルであり、好ましくはHまたはメチルである。

【0114】

さらに好ましい実施形態では、 R^{11} は独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、メチル、エチル、1-メチルエチル、tert-ブチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメトキシ、2,2-ジフルオロエトキシ、2,2,2-トリフルオロエトキシ、メチルカルボニル、エチルカルボニル、トリフルオロメチルカルボニル、メチルスルファニル、メチルスルフィニル、メチルスルホニル、トリフルオロメチルスルホニル、トリフルオロメチルスルファニルまたはトリフルオロメチルスルフィニルである。

10

【0115】

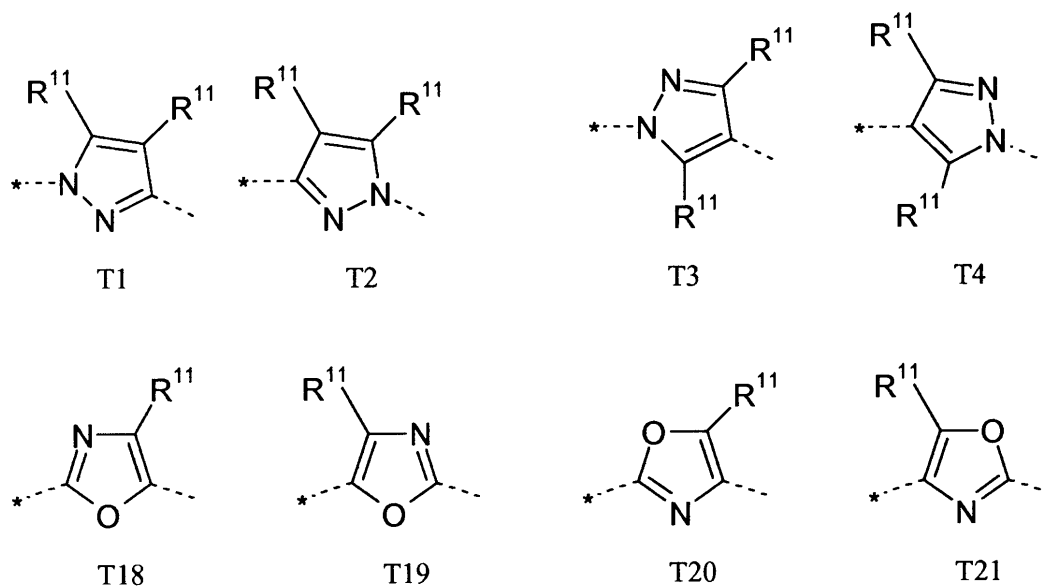
より好ましい実施形態では、 R^{11} は独立して、H、メチル、エチル、2-メチルエチル、2,2-ジメチルエチル、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、ニトロ、トリフルオロメチルまたはアミノである。

【0116】

さらに好ましい実施形態では、Tは、以下に示される5員ヘテロ芳香族系のうちの1つであり、(C-B₁-B₅)環系の炭素原子との結合は、アスタリスクで印付けられた点線の結合で識別され、(C-A₁-A₂-A₃-C-A₄)-環系の炭素原子との結合は、点線の結合で識別される。

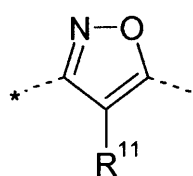
20

【化12-1】

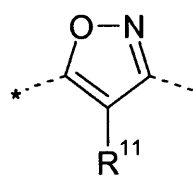


30

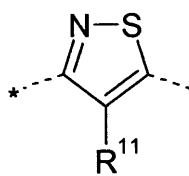
【化 1 2 - 2】



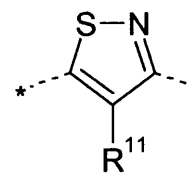
T22



T23

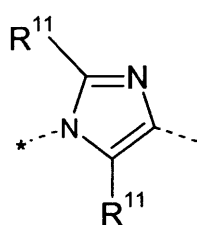


T28

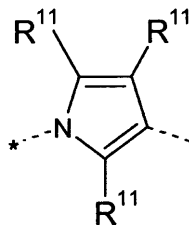


T29

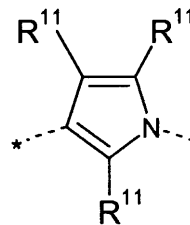
10



T45



T46



T47

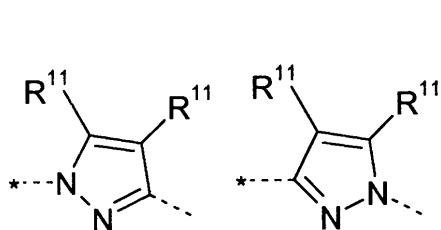
20

式中、 R^{11} は独立して、本明細書に記載されるように定義される。

【0 1 1 7】

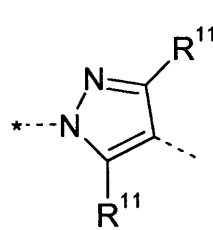
より好ましい実施形態では、Tは、以下に示される5員ヘテロ芳香族系のうちの1つであり、 $(C-B_1-B_5)$ 環系の炭素原子との結合は、アスタリスクで印付けられた点線の結合で識別され、 $(C-A_1-A_2-A_3-C-A_4)$ 環系の炭素原子との結合は、点線の結合で識別される。

【化 1 3 - 1】

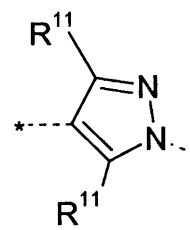


T1

T2

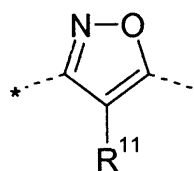


T3

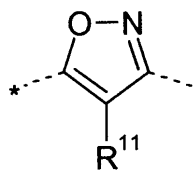


T4

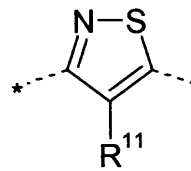
30



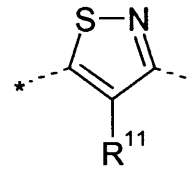
T22



T23



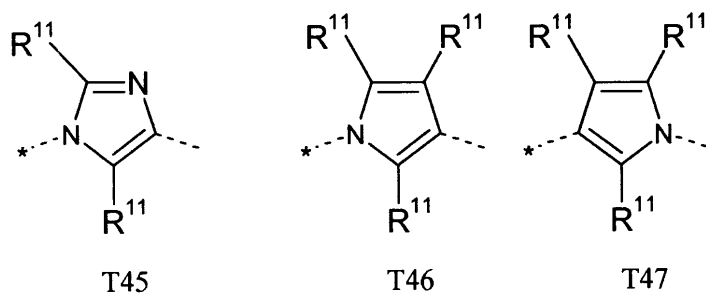
T28



T29

40

【化 1 3 - 2】



10

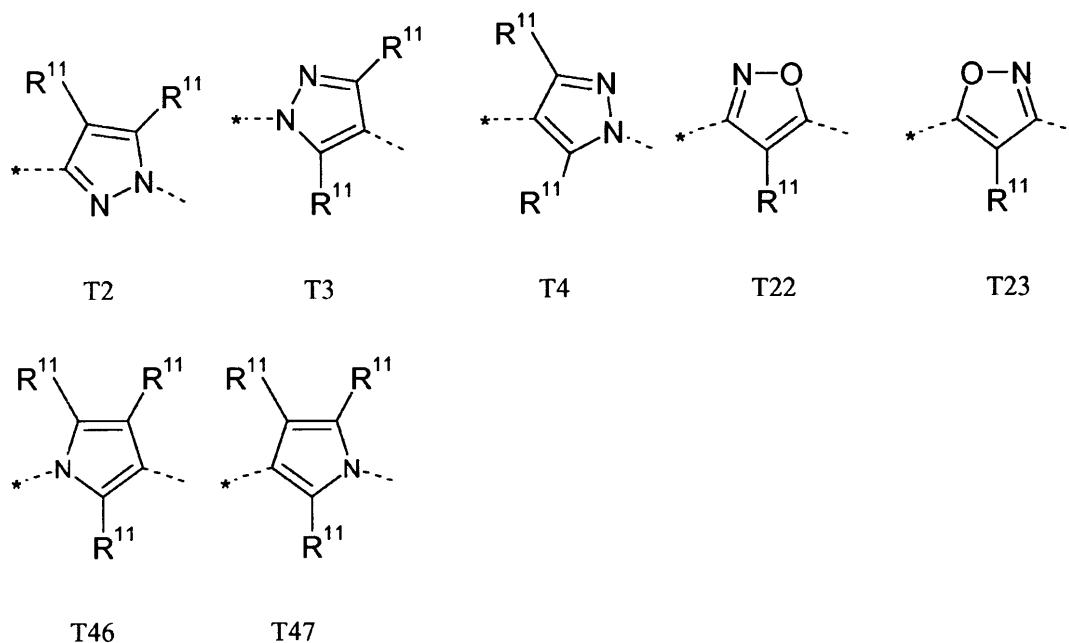
式中、 R^{11} は本明細書に記載されるように定義され、 n は 1 または 2 の値を有する。

【0 1 1 8】

特に好ましい実施形態では、 T は、以下に示される 5 員ヘテロ芳香族系のうちの 1 つであり、 $(C-B_1-B_5)$ 環系の炭素原子との結合は、アスタリスクで印付けられた点線の結合で識別され、 $(C-A_1-A_2-A_3-C-A_4)$ 環系の炭素原子との結合は、点線の結合で識別される。

【化 1 4】

20



30

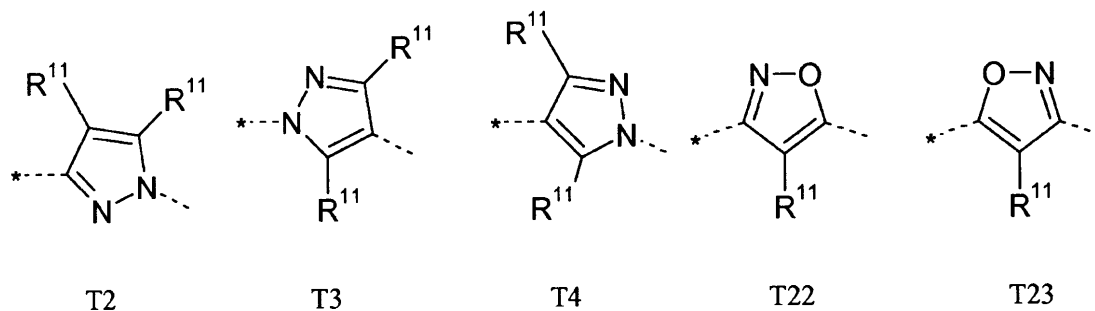
式中、 R^{11} は独立して、本明細書に記載されるように定義される。

【0 1 1 9】

40

さらなる特に好ましい実施形態では、 T は、以下に示される 5 員ヘテロ芳香族系のうちの 1 つであり、 $(C-B_1-B_5)$ 環系の炭素原子との結合は、アスタリスクで印付けられた点線の結合で識別され、 $(C-A_1-A_2-A_3-C-A_4)$ 環系の炭素原子との結合は、点線の結合で識別される。

【化 15】



10

式中、 R^{11} は独立して、本明細書に記載されるように定義される。

【0120】

さらにより好ましい実施形態では、式 (I) および本明細書に詳述されるさらなる一般式において、

A_1 は $C-R^2$ または N であり、好ましくは $C-R^2$ であり、

A_2 は CR^3 または N であり、

A_3 は CR^4 であり、

A_4 は $C-R^5$ または N であり、

B_1 は CR^6 であり、

B_2 は $C-H$ であり、

B_3 は CR^8 であり、

B_4 は $C-H$ であり、

B_5 は CR^{10} または N であり、

R^1 は水素であり、

R^2 は、水素、 C_1-C_3 -アルキル、フッ素または塩素であり、好ましくは H であり、

20

R^3 は、水素またはハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルキル（好ましくは過フッ化 C_1-C_3 -アルキル (CF_3 、 C_2F_5 もしくは C_3F_7)）であり、

R^4 は、水素、塩素、フッ素、 C_1-C_3 -アルキル ($-CH_3$ 等)、シクロプロピル、 C_1-C_3 -アルコキシ ($-O-CH_3$ 等)、 $N-C_1-C_4$ -アルキルアミノ ($-NH-CH_3$ 等の $-NH-C_1-C_3$ -アルキル)、 C_3 -シクロアルキルアミノ ($-NH-C_3H_5$ 等)、 $N-C_1-C_3$ -アルコキシ- C_1-C_3 -アルキルアミノ ($-NH-C_2H_4-O-CH_3$ 等) または 1-ピロリジニルであり、より好ましくは塩素であり、

30

R^5 は水素またはフッ素であり、好ましくは H であり、

R^6 および R^{10} は、それぞれ独立して、水素、 C_1-C_3 -アルキル（好ましくは、 R^6 および R^{10} はそれぞれ、 C_1-C_3 -アルキルである）、 C_1-C_3 -アルコキシ、ハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルキル（好ましくは過フッ化 C_1-C_3 -アルキル (CF_3 、 C_2F_5 もしくは C_3F_7)）、ハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルコキシ（好ましくは過フッ化 C_1-C_3 -アルコキシ (OCF_3 、 OC_2F_5 もしくは OC_3F_7)）、 C_1-C_3 -アルキルスルファニル、 C_1-C_3 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_3 -アルキルスルホニル、フッ素、臭素または塩素であり（好ましくは、 R^6 および R^{10} がそれぞれ塩素である）、

40

R^8 は、ハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルキル（好ましくは過フッ化 C_1-C_3 -アルキル (CF_3 、 C_2F_5 もしくは C_3F_7)）またはハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルコキシ（好ましくは過フッ化 C_1-C_3 -アルコキシ (OCF_3 、 OC_2F_5 もしくは OC_3F_7)）であり、

R^{11} は、水素、シアノ (CN) またはアミノ (NH_2) であり、

W は酸素または硫黄であり、好ましくは酸素であり、

Q は、 C_1-C_3 -アルキル、シクロプロピル、1-(シアノ)シクロプロピル、1-

50

(過フッ化 C_1-C_3 -アルキル) シクロプロピル ((1- (トリフルオロメチル) シクロプロピル) 等、1- (C_1-C_4 -アルキル) シクロプロピル (1- (tert-ブチル) シクロプロピル) 等)、1- (チオカルバモイル) シクロプロピル、ハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルキル (例えば、 CH_2CF_3 、 $CH_2CH_2CF_3$)、チエタン-3-イル、N-メチルピラゾール-3-イル、2-オキソ-2 (2, 2, 2-トリフルオロエチルアミノ) エチルであり、かつ、

T は、T1~T47 からなる群から選択される T であり、好ましくは T2、T3、T4、T22 または T23 (より好ましくは T22 または T23) である。

【0121】

さらにより好ましい実施形態では、式 (I) および本明細書に詳述されるさらなる一般式において、

A_1 は $C-R^2$ または N、好ましくは $C-R^2$ であり、

A_2 は CR^3 または N であり、

A_3 は CR^4 であり、

A_4 は $C-R^5$ または N であり、

B_1 は CR^6 であり、

B_2 は $C-H$ であり、

B_3 は CR^8 であり、

B_4 は $C-H$ であり、

B_5 は CR^{10} または N であり、

R^1 は C_1-C_2 -アルキル (メチルまたはエチル、より好ましくはメチル) であり、

R^2 は、水素、 C_1-C_3 -アルキル、フッ素、または塩素、好ましくは H であり、

R^3 は、水素またはハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルキル (好ましくは過フッ化 C_1-C_3 -アルキル (CF_3 、 C_2F_5 、もしくは C_3F_7)) であり、

R^4 は、水素、塩素、フッ素、 C_1-C_3 -アルキル ($-CH_3$ 等)、シクロプロピル、 C_1-C_3 -アルコキシ ($-O-CH_3$ 等)、N- C_1-C_4 -アルキルアミノ ($-NH-CH_3$ 等の $-NH-C_1-C_3$ -アルキル)、 C_3 -シクロアルキルアミノ ($-NH-C_3H_5$ 等)、N- C_1-C_3 -アルコキシ- C_1-C_3 -アルキルアミノ ($-NH-C_2H_4-O-CH_3$ 等)、または 1-ピロリジニル、より好ましくは塩素であり、

R^5 は、水素またはフッ素、好ましくは H であり、

R^6 および R^{10} は、それぞれ独立して、水素、 C_1-C_3 -アルキル (好ましくは、 R^6 および R^{10} は、それぞれ C_1-C_3 -アルキル)、 C_1-C_3 -アルコキシ、ハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルキル (好ましくは過フッ化 C_1-C_3 -アルキル (CF_3 、 C_2F_5 、もしくは C_3F_7))、ハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルコキシ (好ましくは過フッ化 C_1-C_3 -アルコキシ (OCF_3 、 OC_2F_5 、もしくは OC_3F_7))、 C_1-C_3 -アルキルスルファニル、 C_1-C_3 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_3 -アルキルスルホニル、フッ素、臭素または塩素 (好ましくは、 R^6 および R^{10} は、それぞれ塩素) であり、

R^8 は、ハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルキル (好ましくは過フッ化 C_1-C_3 -アルキル (CF_3 、 C_2F_5 、もしくは C_3F_7)) またはハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルコキシ (好ましくは過フッ化 C_1-C_3 -アルコキシ (OCF_3 、 OC_2F_5 、もしくは OC_3F_7)) であり、

R^{11} は、水素、シアノ (CN)、またはアミノ (NH_2) であり、

W は、酸素または硫黄であり、好ましくは酸素であり、

Q は、 C_1-C_3 -アルキル、シクロプロピル、1- (シアノ) シクロプロピル、1- (過フッ化 C_1-C_3 -アルキル) シクロプロピル ((1- (トリフルオロメチル) シクロプロピル) 等、1- (C_1-C_4 -アルキル) シクロプロピル (1- (tert-ブチル) シクロプロピル) 等)、1- (チオカルバモイル) シクロプロピル、ハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルキル (例えば、 CH_2CF_3 、 $CH_2CH_2CF_3$)、チエタン-3-イル、N-メチルピラゾール-3-イル、2-オキソ-2 (2, 2, 2-トリフルオ

10

20

30

40

50

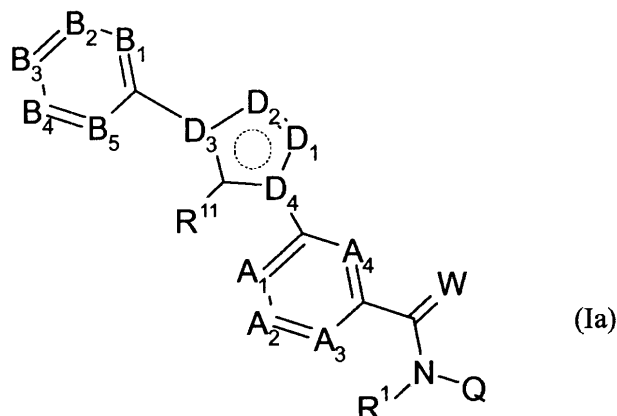
ロエチルアミノ) エチルであり、

Tは、T 1～T 47からなる群から選択されるTであり、好ましくはT 2、T 3、T 4、T 2 2またはT 2 3（より好ましくはT 2 2またはT 2 3）である。

【0122】

さらに好ましい実施形態は、さらに式(I a)の化合物に関する：

【化16】



10

(式中、

20

R¹、R^{1 1}、Q、W、A₁、A₂、A₃、A₄、B₁、B₂、B₃、B₄ および B₅ は、それぞれ本明細書に記載されるように定義され、A₁、A₂、A₃、A₄ から選択される1つ以下の部分がNであり、かつ、B₁、B₂、B₃、B₄ および B₅ から選択される1つ以下の部分がNであるか、または、A₁、A₂、A₃、A₄ から選択される1つもしくは2つの部分がNであってもよく、かつ、B₁、B₂、B₃、B₄ および B₅ から選択される1つ以下の部分がNであり、

D₁ および D₂ は、それぞれ独立して、C-R^{1 1} またはヘテロ原子であり、好ましくはC-R^{1 1} またはN、OおよびSから選択されるヘテロ原子であり、より好ましくはC-R^{1 1} またはNおよびOから選択されるヘテロ原子であり、

D₃ 部分および D₄ 部分は、それぞれ独立して、CまたはNから選択されるヘテロ原子であり、

30

D₁、D₂、D₃ および D₄ から選択される1つまたは2つの部分が、ヘテロ原子であり、

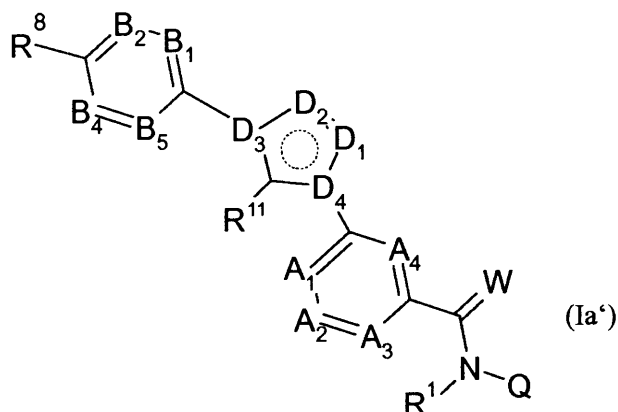


は芳香族系である)。

【0123】

さらに好ましい実施形態は、さらに式(I a')の化合物に関する：

【化 1 7】



10

(式中、

R^1 、 R^{11} 、 Q 、 W 、 A_1 、 A_2 、 A_3 、 A_4 、 B_1 、 B_2 、 B_4 および B_5 は、それぞれ本明細書に記載されるように定義され、 A_1 、 A_2 、 A_3 、 A_4 から選択される 1 つ以下の部分が N であり、かつ、 B_1 、 B_2 、 B_3 、 B_4 および B_5 から選択される 1 つ以下の部分が N であるか、または、 A_1 、 A_2 、 A_3 、 A_4 から選択される 1 つもしくは 2 つの部分が N であってもよく、かつ、 B_1 、 B_2 、 B_3 、 B_4 および B_5 から選択される 1 つ以下の部分が N であり、

20

D_1 および D_2 は、それぞれ独立して、 $C-R^{11}$ またはヘテロ原子であり、好ましくは $C-R^{11}$ または N、O および S から選択されるヘテロ原子であり、より好ましくは $C-R^{11}$ または N および O から選択されるヘテロ原子であり、

D_3 部分および D_4 部分は、それぞれ独立して、C または N から選択されるヘテロ原子であり、

D_1 、 D_2 、 D_3 および D_4 から選択される 1 つまたは 2 つの部分がヘテロ原子であり、換言すると、 D_1 、 D_2 、 D_3 および D_4 から選択される 1 つ以下または 2 つの部分がヘテロ原子であり、 D_1 、 D_2 、 D_3 および D_4 から選択される 1 つまたは 2 つの部分が、 D_1 および D_2 の場合は N および O から選択されるヘテロ原子であり、または D_3 および D_4 の場合は N であり、

30



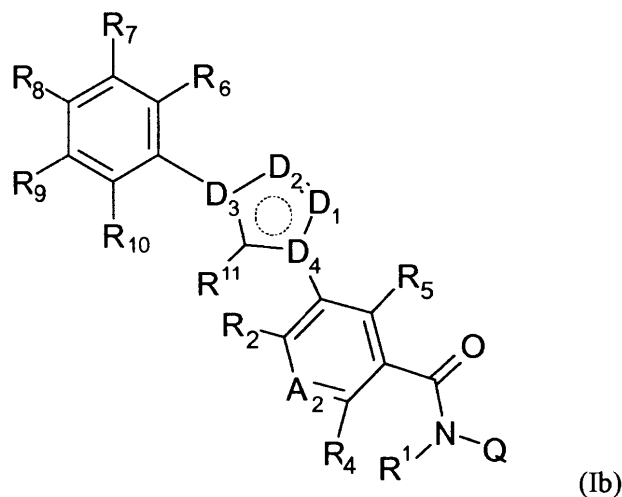
は芳香族系であり、かつ、

R^8 は本明細書で定義される通りであり、好ましくは過フッ化 C_1-C_4 -アルキルである)。

【0124】

さらに好ましい実施形態は、式 (I b) の化合物に関する：

【化 18】



10

(式中、 R_1 、 R_2 、 R_4 、 R_5 、 R_6 、 R_7 、 R_8 、 R_9 、 R_{10} 、 R_{11} 、 A_2 、 Q 、 D_1 、 D_2 、 D_3 、 D_4 および



20

は、それぞれ本明細書に記載されるように定義され、 D_1 、 D_2 、 D_3 および D_4 から選択される1つまたは2つの部分がヘテロ原子である)。

【0125】

2つの特に好ましい実施形態は、式(Ib)および(Ic)の化合物に関し、 D_1 はNであり、 D_2 はOであり、かつ、 D_3 および D_4 はCであるか、または、 D_1 は $C-R^1$ であり、 D_2 はNであり、かつ、 D_3 はNであり、 D_4 はCであり、 R_{13} は、H、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、または任意に置換された C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルキルオキシ、 C_1-C_6 -アルキルカルボニル、 C_1-C_6 -アルキルスルファニル、 C_1-C_6 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_6 -アルキルスルホニルであり、好ましくはH、またはF、Cl、BrもしくはI等のハロゲンであり、より好ましくはHであり、 R_1 は好ましくはHであるか、または、 R_1 は好ましくはメチルである。

30

【0126】

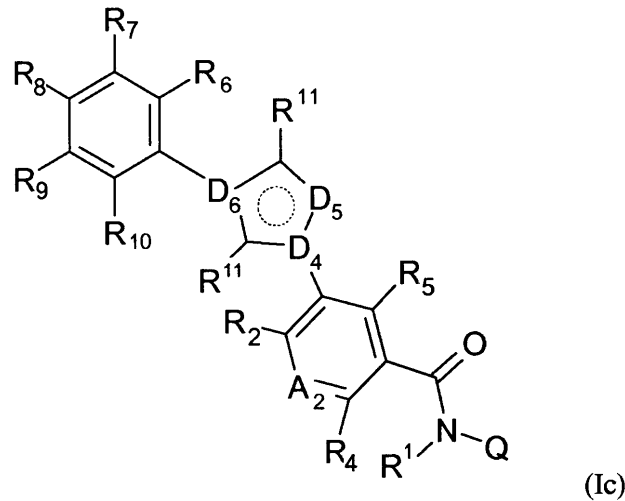
さらなる特に好ましい実施形態は、式(Ib)および(Ic)の化合物に関し、 D_1 はOであり、 D_2 はNであり、かつ、 D_3 および D_4 はCであり、 R_{13} は、H、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、または任意に置換された C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルキルオキシ、 C_1-C_6 -アルキルカルボニル、 C_1-C_6 -アルキルスルファニル、 C_1-C_6 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_6 -アルキルスルホニルであり、好ましくはH、またはF、Cl、BrもしくはI等のハロゲンであり、より好ましくはHであり、 R_1 は好ましくはHであるか、または、 R_1 は好ましくはメチルである。

40

【0127】

さらに好ましい実施形態は、式(Ic)の化合物に関する：

【化 1 9】



10

(式中、 R_1 、 R_2 、 R_4 、 R_5 、 R_6 、 R_7 、 R_8 、 R_9 、 R_{10} 、 R_{11} 、 A_2 および Q は、それぞれ本明細書に記載されるように定義され、



20

は芳香族系であり、かつ、

D_4 および D_6 から選択される部分は N であり、 D_4 および D_6 から選択されるそれぞれ他の部分は N または C であり、かつ、

D_5 は N または $C-R^{11}$ であり、

D_4 、 D_5 および D_6 から選択される 2 つ以下の部分が N である条件下にある)。

【0128】

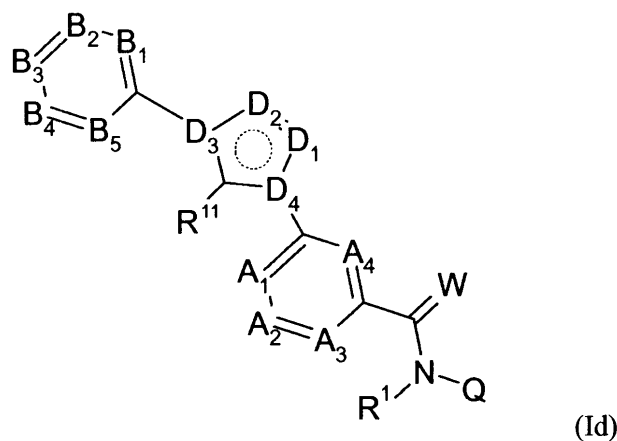
好ましい実施形態は、式 (Ic) の化合物に関し、 D_4 は N であり、 D_5 および D_6 はそれぞれ $C-R^{11}$ であるか、 D_6 は N であり、 D_5 および D_4 がそれぞれ、 $C-R^{11}$ であるか、または D_4 および D_5 がそれぞれ、 N であり、 D_6 が $C-R^{11}$ である。

30

【0129】

さらに好ましい実施形態は、式 (Id) の化合物に関する：

【化 20】



40

(式中、 R^1 、 R^{11} 、 Q 、 W 、 A_1 、 A_2 、 A_3 、 A_4 、 B_1 、 B_2 、 B_3 、 B_4 および B_5 、 D_1 、 D_2 、 D_3 および D_4 、ならびに、



は、それぞれ本明細書に記載されるように定義され、 D_1 、 D_2 、 D_3 および D_4 から選択される1つ以下または2つの部分がヘテロ原子であり、 A_1 、 A_2 、 A_3 、 A_4 から選択される1つ以下の部分がNであり、 B_1 、 B_2 、 B_3 、 B_4 および B_5 から選択される1つ以下の部分がNである)。

【0130】

特に好ましい実施形態は、式 (I a)、(I b)、(I c) または (I d) の化合物に関し、 R^8 は、 C_1-C_6 -アルキル、ハロゲンで置換された C_1-C_6 -アルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、ハロゲンで置換された C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、ハロゲンで置換された C_1-C_6 -アルコキシ、N-アルコキシイミノアルキル、ハロゲンで置換された C_1-C_6 -アルキルスルファニル、ハロゲンで置換された C_1-C_6 -アルキルスルフィニル、ハロゲンで置換された C_1-C_6 -アルキルスルホニル、N- C_1-C_6 -アルキルアミノ、N、N-ジ- C_1-C_4 -アルキルアミノであり、ハロゲン、シアノまたはニトロである。例としては、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、メチル、エチル、ジフルオロメチル、トリクロロメチル、クロロジフルオロメチル、ジクロロフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロメチル、ブromoメチル、1-フルオロエチル、2-フルオロエチル、2, 2-ジフルオロエチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、1, 2, 2, 2-テトラフルオロエチル、1-クロロ-1, 2, 2, 2-テトラフルオロエチル、2, 2, 2-トリクロロエチル、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエチル、1, 1-ジフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、ペンタフルオロ-tert-ブチル、ヘプタフルオロ-n-プロピル、ヘプタフルオロイソプロピル、ノナフルオロ-n-ブチル、ノナフルオロ-sec-ブチル、シクロプロピル、シクロブチル、メトキシ、エトキシ、n-プロポキシ、1-メチルエトキシ、フルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、ジクロロフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエトキシ、ペンタフルオロエトキシ、N-メトキシイミノメチル、1-(N-メトキシイミノ)エチル、メチルスルファニル、メチルスルホニル、メチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルホニル、トリフルオロメチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルファニル、N、N-ジメチルアミノである。より好ましくは、 R^8 は、ジフルオロメチル、トリクロロメチル、クロロジフルオロメチル、ジクロロフルオロメチル、トリフルオロメチル、1-フルオロエチル、2-フルオロエチル、2, 2-ジフルオロエチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、1, 2, 2, 2-テトラフルオロエチル、1-クロロ-1, 2, 2, 2-テトラフルオロエチル、2, 2, 2-トリクロロエチル、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエチル、1, 1-ジフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、ペンタフルオロ-tert-ブチル、ヘプタフルオロ-n-プロピル、ヘプタフルオロイソプロピル、ノナフルオロ-n-ブチル、ノナフルオロ-sec-ブチル等のハロゲンで置換された C_1-C_4 -アルキル；フルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、ジクロロフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエトキシ、ペンタフルオロエトキシ等のハロゲンで置換された C_1-C_4 -アルコキシ；トリフルオロメチルスルホニル；トリフルオロメチルスルフィニル；またはトリフルオロメチルスルファニルである。さらにより好ましくは、 R^8 は、ジフルオロメチル、トリクロロメチル、クロロジフルオロメチル、ジクロロフルオロメチル、トリフルオロメチル、1-フルオロエチル、2-フルオロエチル、2, 2-ジフルオロエチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、1, 2, 2, 2-テトラフルオロエチル、1-クロロ-1, 2, 2, 2-テトラフルオロエチル、2, 2, 2-トリクロロエチル、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエチル、1, 1-ジフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、ペンタフルオロ-tert-ブチル、ヘプタフルオロ-n-プロピル、ヘプタフルオロイソプロピル、ノナフルオロ-n-ブチル、ノナフルオロ-sec-ブ

10

20

30

40

50

チル、フルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、ジクロロフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエトキシ、ペンタフルオロエトキシ、トリフルオロメチルスルホン、トリフルオロメチルスルフィニルまたはトリフルオロメチルスルファニルである。より好ましくは、式 (I b) の化合物中の R^8 は、過フッ化プロピル ($-C_3F_7$)、過フッ化エチル (C_2F_5) もしくは過フッ化メチル (CF_3) 等の過フッ化 C_1-C_3 -アルキルであり、最も好ましくは過フッ化プロピル ($-C_3F_7$) または過フッ化メチルである。

【0131】

式 (I a) の化合物に対応する特に好ましい化合物は、式 (I-T2)、(I-T3)、(I-T4)、(I-T22) および (I-T23) の化合物である。 10

【0132】

本発明の一実施形態は、式 (I-T2) および (I-T4) の化合物に関する。

【0133】

さらなる実施形態は、式 (I-T3) の化合物に関する。

【0134】

さらなる実施形態は、式 (I-T22) および (I-T23) の化合物に関する。

【0135】

したがって、特により好ましい実施形態は、式 (I-T2) の化合物に関する。好ましい実施形態は、同様に、式 (I-T2) の化合物に関し、 R^1 はHである。さらに好ましい実施形態は、同様に、式 (I-T2) の化合物に関し、 R^1 はメチルである。 20

【0136】

さらに特に好ましい実施形態は、式 (I-T3) の化合物に関する。好ましい実施形態は、同様に、式 (I-T3) の化合物に関し、 R^1 はHである。さらに好ましい実施形態は、同様に、式 (I-T3) の化合物に関し、 R^1 はメチルである。

【0137】

さらに特に好ましい実施形態は、式 (I-T4) の化合物に関する。好ましい実施形態は、同様に、式 (I-T4) の化合物に関し、 R^1 はHである。さらに好ましい実施形態は、同様に、式 (I-T4) の化合物に関し、 R^1 はメチルである。

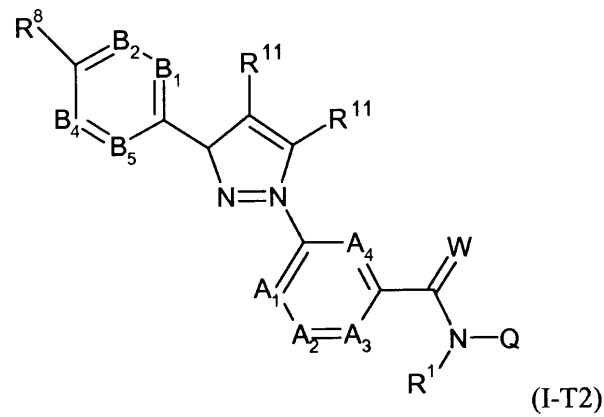
【0138】

さらに特に好ましい実施形態は、式 (I-T22) の化合物に関する。好ましい実施形態は、同様に、式 (I-T22) の化合物に関し、 R^1 はHである。さらに好ましい実施形態は、同様に、式 (I-T22) の化合物に関し、 R^1 はメチルである。 30

【0139】

さらに特に好ましい実施形態は、式 (I-T23) の化合物に関する。好ましい実施形態は、同様に、式 (I-T23) の化合物に関し、 R^1 はHである。さらに好ましい実施形態は、同様に、式 (I-T23) の化合物に関し、 R^1 はメチルである。

【化 2 1】



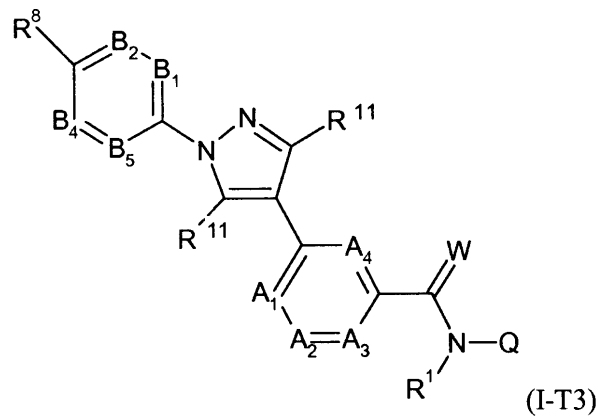
10

(式中、

R^1 、 A_1 、 A_2 、 A_3 、 A_4 、 R^{11} 、 B_1 、 B_2 、 B_4 、 B_5 、 R^8 、 R^{11} 、 Q および W は、それぞれ本明細書に記載されるように定義され、 A_1 、 A_2 、 A_3 、 A_4 から選択される 1 つ以下の部分が N であり、かつ、 B_1 、 B_2 、 B_3 、 B_4 および B_5 から選択される 1 つ以下の部分が N であるか、または、 A_1 、 A_2 、 A_3 、 A_4 から選択される 1 つもしくは 2 つの部分が N であってもよく、かつ、 B_1 、 B_2 、 B_3 、 B_4 および B_5 から選択される 1 つ以下の部分が N である)、または、

20

【化 2 2】



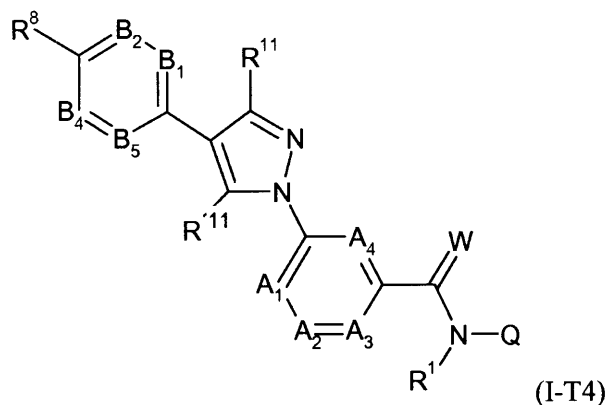
30

(式中、

R^1 、 A_1 、 A_2 、 A_3 、 A_4 、 R^{11} 、 B_1 、 B_2 、 B_4 、 B_5 、 R^8 、 R^{11} 、 Q および W は、それぞれ本明細書に記載されるように定義され、 A_1 、 A_2 、 A_3 、 A_4 から選択される 1 つ以下の部分が N であり、かつ、 B_1 、 B_2 、 B_3 、 B_4 および B_5 から選択される 1 つ以下の部分が N であるか、または、 A_1 、 A_2 、 A_3 、 A_4 から選択される 1 つもしくは 2 つの部分が N であってもよく、かつ、 B_1 、 B_2 、 B_3 、 B_4 および B_5 から選択される 1 つ以下の部分が N である)、または、

40

【化 2 3】



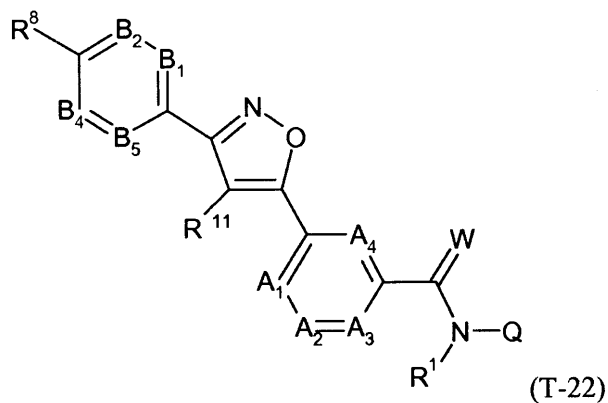
10

(式中、

R^1 、 A_1 、 A_2 、 A_3 、 A_4 、 R^{11} 、 B_1 、 B_2 、 B_4 、 B_5 、 R^8 、 R^{11} 、 Q および W は、それぞれ本明細書に記載されるように定義され、 A_1 、 A_2 、 A_3 、 A_4 から選択される 1 つ以下の部分が N であり、かつ、 B_1 、 B_2 、 B_3 、 B_4 および B_5 から選択される 1 つ以下の部分が N であるか、または、 A_1 、 A_2 、 A_3 、 A_4 から選択される 1 つもしくは 2 つの部分が N であってもよく、かつ、 B_1 、 B_2 、 B_3 、 B_4 、および B_5 から選択される 1 つ以下の部分が N である)、または、

20

【化 2 4】



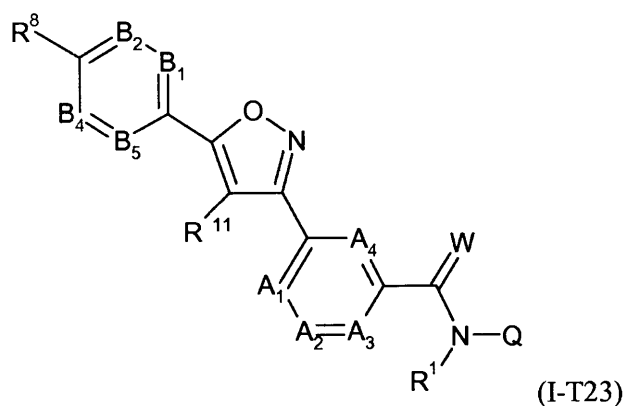
30

(式中、

R^1 、 A_1 、 A_2 、 A_3 、 A_4 、 R^{11} 、 B_1 、 B_2 、 B_4 、 B_5 、 R^8 、 R^{11} 、 Q および W は、それぞれ本明細書に記載されるように定義され、 A_1 、 A_2 、 A_3 、 A_4 から選択される 1 つ以下の部分が N であり、かつ、 B_1 、 B_2 、 B_3 、 B_4 および B_5 から選択される 1 つ以下の部分が N であるか、または、 A_1 、 A_2 、 A_3 、 A_4 から選択される 1 つもしくは 2 つの部分が N であってもよく、かつ、 B_1 、 B_2 、 B_3 、 B_4 および B_5 から選択される 1 つ以下の部分が N である)、または、

40

【化 2 5】



10

(式中、

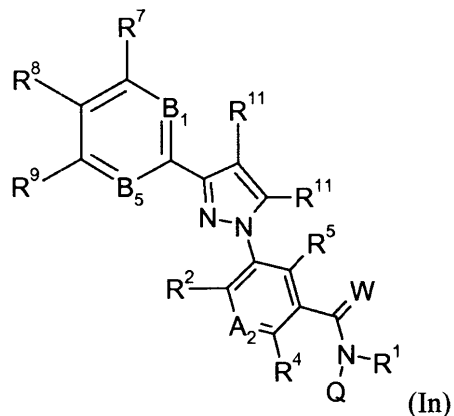
R^1 、 A_1 、 A_2 、 A_3 、 A_4 、 R^{11} 、 B_1 、 B_2 、 B_4 、 B_5 、 R^8 、 R^{11} 、 Q および W は、それぞれ本明細書に記載されるように定義され、 A_1 、 A_2 、 A_3 、 A_4 から選択される 1 つ以下の部分が N であり、かつ、 B_1 、 B_2 、 B_3 、 B_4 および B_5 から選択される 1 つ以下の部分が N であるか、または、 A_1 、 A_2 、 A_3 、 A_4 から選択される 1 つもしくは 2 つの部分が N であってもよく、かつ、 B_1 、 B_2 、 B_3 、 B_4 および B_5 から選択される 1 つ以下の部分が N である)。

20

【0140】

さらに好ましい実施形態は、式 (In) ($T = T2$) の化合物に関する：

【化 2 6】



30

(式中、 R^1 、 Q 、 W 、 A_2 、 B_1 、 B_5 、 R^2 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 および R^{11} は、それぞれ本明細書に記載されるように定義され、 R^1 は H を表すか、または R^1 はメチルを表す)。

40

【0141】

さらなる好ましい実施形態は、式 (In) の化合物に関し、式中、

W は O であり、

Q は、任意に置換された $C_1 - C_4$ -アルキルまたは任意に置換された $C_3 - C_6$ -シクロアルキルまたは 1、2 もしくは 3 個の V 置換基で任意に置換された不飽和 4、5 もしくは 6 員複素環式環であり、 V は独立してハロゲン、シアノ、ニトロ、オキシ ($=O$)、任意にハロゲンで置換された $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -アルケニル、 $C_1 - C_6$ -アルコキシ、 $C_1 - C_6$ -アルキルスルファニル、 $C_1 - C_6$ -アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$ -アルキルスルホニルであり；

好ましくは、ハロゲンで置換された $C_1 - C_3$ -アルキルであり、シアノ、ヒドロキシル

50

またはカルボンアミド ($-C(=O)N(R)_2$) を有し、Rが独立して、Hまたは C_1-C_3 -アルキル、置換された C_1-C_3 -アルキルであるか； C_3 -シクロアルキル、または、シアノで置換された、ハロゲンで置換された、ニトロで置換された、もしくはハロゲン化された C_1-C_2 -アルキルで置換された C_3 -シクロアルキルであるか；1、2または3個のVで任意に置換され、N、OおよびSからなる群から選択される1または2個のヘテロ原子を含有する不飽和4、5もしくは6員複素環式環であり、Vが独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、オキソ ($=O$)、任意にハロゲンで置換された C_1-C_6 -アルキルであり；

より好ましくは、 CF_3 、 CH_2CF_3 または $CH_2CH_2CF_3$ 等のフッ化 C_1-C_3 -アルキルであるか；2-オキソ-2-(2, 2, 2-トリフルオロエチルアミノ)エチル等のカルボンアミド ($-C(=O)N(R)_2$) で置換された C_1-C_3 -アルキルであって、Rが独立して、H、 C_1-C_3 -アルキルまたはハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルキルであるか；シクロプロピル、または、1-(シアノ)シクロプロピルもしくは1-(トリフルオロメチル)シクロプロピル等のシアノで置換されたまたはフッ化された C_1-C_2 -アルキル置換シクロプロピルであるか；チエタン-3-イル等のN、OおよびSからなる群から選択される1個のヘテロ原子を含有する4員複素環式環；であり、

R^7 および R^9 はそれぞれHであり、

R^{11} はいずれの場合もHであり、

R^1 はHであり、

R^2 は、H、ハロゲンまたは C_1-C_4 -アルキルであり、好ましくはH、フッ素、塩素またはメチルであり、

R^4 はHまたはハロゲンであり、好ましくはH、フルオロもしくはクロロであり、

R^5 はHまたはハロゲンであり、好ましくはH、フルオロもしくはクロロであり、

B_5 はNまたは $C-R^{10}$ であり、好ましくは $C-R^{10}$ であり、式中、

R^{10} は、水素、 C_1-C_3 -アルキル、 C_1-C_3 -アルコキシ、ハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルキル（好ましくは過フッ化 C_1-C_3 -アルキル (CF_3 、 C_2F_5 もしくは C_3F_7)）、ハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルコキシ（好ましくは過フッ化 C_1-C_3 -アルコキシ (OCF_3 、 OC_2F_5 もしくは OC_3F_7)）、 C_1-C_3 -アルキルスルファニル、 C_1-C_3 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_3 -アルキルスルホニル、フッ素、臭素または塩素であり、

A_2 はNまたは $C-R^3$ であり、好ましくは $C-R^3$ であり、式中、

R^3 は、H、ハロゲンまたは任意に置換された C_1-C_4 -アルキルであり、好ましくはH、フッ素、塩素または任意にハロゲンで置換された C_1-C_2 -アルキルであり、より好ましくはHまたはフルオロで置換されたメチルであり、例えば、ペルフルオロメチルであり、

R^6 は、水素、 C_1-C_3 -アルキル、 C_1-C_3 -アルコキシ、ハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルキル（好ましくは過フッ化 C_1-C_3 -アルキル (CF_3 、 C_2F_5 もしくは C_3F_7)）、ハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルコキシ（好ましくは過フッ化 C_1-C_3 -アルコキシ (OCF_3 、 OC_2F_5 もしくは OC_3F_7)）、 C_1-C_3 -アルキルスルファニル、 C_1-C_3 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_3 -アルキルスルホニル、フッ素、塩素または臭素であり、好ましくはフッ素、塩素、臭素、 C_1-C_2 -アルキル、ハロゲンで置換された C_1-C_2 -アルキル（例えば、ペルフルオロメチル）または任意にハロゲンで置換された C_1-C_2 -アルコキシであり、より好ましくはフッ素、臭素、塩素、メチル、エチル、フッ化メチルまたはフッ化エチル（より好ましくはペルフルオロメチルもしくはペルフルオロエチル）、フッ化メトキシまたはフッ化エトキシ（より好ましくはペルフルオロメトキシ）であり、

R^8 は、ハロゲンまたは任意にハロゲンで置換された C_1-C_4 -アルキルまたは任意にハロゲンで置換された C_1-C_4 -アルコキシであり、好ましくはハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルキルまたはハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルコキシであり、より好ましくはフッ化 C_1-C_3 -アルキル等のハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルキ

10

20

30

40

50

ル（例えば、ペルフルオロプロピル等のフッ化 C_3 - アルキル）である。

【0142】

さらなる好ましい実施形態は、式 (In) の化合物に関し、式中、

WはOであり、

Qは、任意に置換された $C_1 - C_4$ - アルキルまたは任意に置換された $C_3 - C_6$ - シクロアルキルまたは1、2もしくは3個のV置換基で任意に置換された不飽和4、5もしくは6員複素環式環であり、Vは独立してハロゲン、シアノ、ニトロ、オキソ (=O)、任意にハロゲンで置換された $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_4$ - アルケニル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ、 $C_1 - C_6$ - アルキルスルファニル、 $C_1 - C_6$ - アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$ - アルキルスルホニルであり；

好ましくは、ハロゲンで置換された $C_1 - C_3$ - アルキルであり、シアノ、ヒドロキシルまたはカルボンアミド ($-C(=O)N(R)_2$) を有し、Rが独立して、Hまたは $C_1 - C_3$ - アルキル、置換された $C_1 - C_3$ - アルキルであるか； C_3 - シクロアルキル、または、シアノで置換された、ハロゲンで置換された、ニトロで置換された、もしくはハロゲン化された $C_1 - C_2$ - アルキルで置換された C_3 - シクロアルキルであるか；1、2または3個のVで任意に置換され、N、OおよびSからなる群から選択される1または2個のヘテロ原子を含有する不飽和4、5もしくは6員複素環式環であり、Vが独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、オキソ (=O)、任意にハロゲンで置換された $C_1 - C_6$ - アルキルであり；

より好ましくは、 CF_3 、 CH_2CF_3 または $CH_2CH_2CF_3$ 等のフッ化 $C_1 - C_3$ - アルキルであるか；2-オキソ-2-(2, 2, 2-トリフルオロエチルアミノ)エチル等のカルボンアミド ($-C(=O)N(R)_2$) で置換された $C_1 - C_3$ - アルキルであって、Rが独立して、H、 $C_1 - C_3$ - アルキルまたはハロゲンで置換された $C_1 - C_3$ - アルキルであるか；シクロプロピル、または、1-(シアノ)シクロプロピルもしくは1-(トリフルオロメチル)シクロプロピル等のシアノで置換されたまたはフッ化された $C_1 - C_2$ - アルキル置換シクロプロピルであるか；チエタン-3-イル等のN、OおよびSからなる群から選択される1個のヘテロ原子を含有する4員複素環式環；であり、

R^7 および R^9 はそれぞれHであり、

R^{11} はいずれの場合もHであり、

R^1 はメチルであり、

R^2 は、H、ハロゲンまたは $C_1 - C_4$ - アルキルであり、好ましくはH、フッ素、塩素またはメチルであり、

R^4 は、Hまたはハロゲンであり、好ましくはH、フルオロもしくはクロロであり、

R^5 は、Hまたはハロゲンであり、好ましくはH、フルオロもしくはクロロであり、

B_5 はNまたは $C - R^{10}$ であり、好ましくは $C - R^{10}$ であり、式中、

R^{10} は、水素、 $C_1 - C_3$ - アルキル、 $C_1 - C_3$ - アルコキシ、ハロゲンで置換された $C_1 - C_3$ - アルキル（好ましくは過フッ化 $C_1 - C_3$ - アルキル (CF_3 、 C_2F_5 もしくは C_3F_7)）、ハロゲンで置換された $C_1 - C_3$ - アルコキシ（好ましくは過フッ化 $C_1 - C_3$ - アルコキシ (OCF_3 、 OC_2F_5 もしくは OC_3F_7)）、 $C_1 - C_3$ - アルキルスルファニル、 $C_1 - C_3$ - アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_3$ - アルキルスルホニル、フッ素、臭素または塩素であり、

A_2 はNまたは $C - R^3$ であり、好ましくは $C - R^3$ であり、式中、

R^3 は、H、ハロゲンまたは任意に置換された $C_1 - C_4$ - アルキルであり、好ましくはH、フッ素、塩素または任意にハロゲンで置換された $C_1 - C_2$ - アルキルであり、より好ましくはHまたはフルオロで置換されたメチルであり、例えば、ペルフルオロメチルであり、

R^6 は、水素、 $C_1 - C_3$ - アルキル、 $C_1 - C_3$ - アルコキシ、ハロゲンで置換された $C_1 - C_3$ - アルキル（好ましくは過フッ化 $C_1 - C_3$ - アルキル (CF_3 、 C_2F_5 もしくは C_3F_7)）、ハロゲンで置換された $C_1 - C_3$ - アルコキシ（好ましくは過フッ化 $C_1 - C_3$ - アルコキシ (OCF_3 、 OC_2F_5 もしくは OC_3F_7)）、 $C_1 - C$

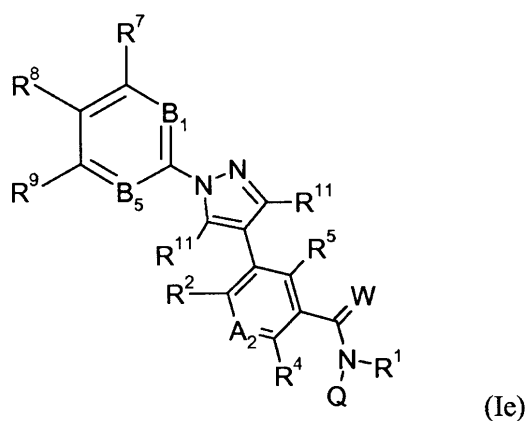
C_3 -アルキルスルファニル、 C_1-C_3 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_3 -アルキルスルホニル、フッ素、塩素または臭素であり、好ましくはフッ素、塩素、臭素、 C_1-C_2 -アルキル、ハロゲンで置換された C_1-C_2 -アルキル（例えば、ペルフルオロメチル）または任意にハロゲンで置換された C_1-C_2 -アルコキシであり、より好ましくはフッ素、臭素、塩素、メチル、エチル、フッ化メチルまたはフッ化エチル（より好ましくはペルフルオロメチルもしくはペルフルオロエチル）、フッ化メトキシまたはフッ化エトキシ（より好ましくはペルフルオロメトキシ）であり、

R^8 は、ハロゲンまたは任意にハロゲンで置換された C_1-C_4 -アルキルまたは任意にハロゲンで置換された C_1-C_4 -アルコキシであり、好ましくはハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルキルまたはハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルコキシであり、より好ましくはフッ化 C_1-C_3 -アルキル等のハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルキル（例えば、ペルフルオロプロピル等のフッ化 C_3 -アルキル）である。

【0143】

さらに好ましい実施形態は、式 (Ie) ($T = T3$) の化合物に関する：

【化27】



(式中、 R^1 、 Q 、 W 、 A_2 、 B_1 、 B_5 、 R^2 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 および R^{11} は、それぞれ本明細書に記載されるように定義され、 R^1 はHを表すか、または R^1 はメチルを表す)。

【0144】

さらなる好ましい実施形態は、式 (Ie) の化合物に関し、式中、 W はOであり、

Q は、任意に置換された C_1-C_4 -アルキルまたは任意に置換された C_3-C_6 -シクロアルキルまたは1、2もしくは3個のV置換基で任意に置換された不飽和4、5もしくは6員複素環式環であり、Vは独立してハロゲン、シアノ、ニトロ、オキソ(=O)、任意にハロゲンで置換された C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_4 -アルケニル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -アルキルスルファニル、 C_1-C_6 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_6 -アルキルスルホニルであり；

好ましくは、ハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルキルであり、シアノ、ヒドロキシルまたはカルボンアミド($-C(=O)N(R)_2$)を有し、Rが独立して、Hまたは C_1-C_3 -アルキル、置換された C_1-C_3 -アルキルであるか； C_3 -シクロアルキル、または、シアノで置換された、ハロゲンで置換された、ニトロで置換された、もしくはハロゲン化された C_1-C_2 -アルキルで置換された C_3 -シクロアルキルであるか；1、2または3個のVで任意に置換され、N、OおよびSからなる群から選択される1または2個のヘテロ原子を含有する不飽和4、5もしくは6員複素環式環であり、Vが独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、オキソ(=O)、任意にハロゲンで置換された C_1-C_6 -アルキルであり；

より好ましくは、 CF_3 、 CH_2CF_3 または $CH_2CH_2CF_3$ 等のフッ化 C_1-C_3

ーアルキルであるか；2-オキソ-2-(2, 2, 2-トリフルオロエチルアミノ)エチル等のカルボンアミド($-C(=O)N(R)_2$)で置換された C_1-C_3 -アルキルであって、Rが独立して、H、 C_1-C_3 -アルキルまたはハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルキルであるか；シクロプロピル、または、1-(シアノ)シクロプロピルもしくは1-(トリフルオロメチル)シクロプロピル等のシアノで置換されたまたはフッ化された C_1-C_2 -アルキル置換シクロプロピルであるか；チエタン-3-イル等のN、OおよびSからなる群から選択される1個のヘテロ原子を含有する4員複素環式環；であり、

R^7 および R^9 はそれぞれHであり、

R^{11} はいずれの場合もHであり、

R^1 はHであり、

R^2 はH、ハロゲンまたは C_1-C_4 -アルキルであり、好ましくはH、フッ素、塩素またはメチルであり、

R^4 はHまたはハロゲンであり、好ましくはH、フルオロもしくはクロロであり、

R^5 はHまたはハロゲンであり、好ましくはH、フルオロもしくはクロロであり、

B_5 はNまたは $C-R^{10}$ であり、好ましくは $C-R^{10}$ であり、式中、

R^{10} は、水素、 C_1-C_3 -アルキル、 C_1-C_3 -アルコキシ、ハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルキル(好ましくは過フッ化 C_1-C_3 -アルキル(CF_3 、 C_2F_5 もしくは C_3F_7))、ハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルコキシ(好ましくは過フッ化 C_1-C_3 -アルコキシ(OCF_3 、 OC_2F_5 もしくは OC_3F_7))、 C_1-C_3 -アルキルスルファニル、 C_1-C_3 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_3 -アルキルスルホニル、フッ素、臭素または塩素であり、

A_2 はNまたは $C-R^3$ であり、好ましくは $C-R^3$ であり、式中、

R^3 は、H、ハロゲンまたは任意に置換された C_1-C_4 -アルキルであり、好ましくはH、フッ素、塩素または任意にハロゲンで置換された C_1-C_2 -アルキルであり、より好ましくはHまたはフルオロで置換されたメチルであり、例えば、ペルフルオロメチルであり、

R^6 は、水素、 C_1-C_3 -アルキル、 C_1-C_3 -アルコキシ、ハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルキル(好ましくは過フッ化 C_1-C_3 -アルキル(CF_3 、 C_2F_5 もしくは C_3F_7))、ハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルコキシ(好ましくは過フッ化 C_1-C_3 -アルコキシ(OCF_3 、 OC_2F_5 もしくは OC_3F_7))、 C_1-C_3 -アルキルスルファニル、 C_1-C_3 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_3 -アルキルスルホニル、フッ素、塩素または臭素であり、好ましくはフッ素、塩素、臭素、 C_1-C_2 -アルキル、ハロゲンで置換された C_1-C_2 -アルキル(例えば、ペルフルオロメチル)または任意にハロゲンで置換された C_1-C_2 -アルコキシであり、より好ましくはフッ素、臭素、塩素、メチル、エチル、フッ化メチルまたはフッ化エチル(より好ましくはペルフルオロメチルもしくはペルフルオロエチル)、フッ化メトキシまたはフッ化エトキシ(より好ましくはペルフルオロメトキシ)であり、

R^8 は、ハロゲンまたは任意にハロゲンで置換された C_1-C_4 -アルキルまたは任意にハロゲンで置換された C_1-C_4 -アルコキシであり、好ましくはハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルキルまたはハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルコキシであり、より好ましくはフッ化 C_1-C_3 -アルキル等のハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルキル(例えば、ペルフルオロプロピル等のフッ化 C_3 -アルキル)である。

【0145】

さらなる好ましい実施形態は、式(Ie)の化合物に関し、式中、

WはOであり、

Qは、任意に置換された C_1-C_4 -アルキルまたは任意に置換された C_3-C_6 -シクロアルキルまたは1、2もしくは3個のV置換基で任意に置換された不飽和4、5もしくは6員複素環式環であり、Vは独立してハロゲン、シアノ、ニトロ、オキソ($=O$)、任意にハロゲンで置換された C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_4 -アルケニル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -アルキルスルファニル、 C_1-C_6 -アルキルスルフィニ

10

20

30

40

50

ル、 C_1-C_6 -アルキルスルホニルであり、
 好ましくは、ハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルキルであり、シアノ、ヒドロキシル
 またはカルボンアミド ($-C(=O)N(R)_2$) を有し、 R が独立して、 H または C_1-C_3 -
 C_3 -アルキル、置換された C_1-C_3 -アルキルであるか； C_3 -シクロアルキル、ま
 たは、シアノで置換された、ハロゲンで置換された、ニトロで置換された、もしくはハロ
 ゲン化された C_1-C_2 -アルキルで置換された C_3 -シクロアルキルであるか；1、2
 または3個の V で任意に置換され、 N 、 O および S からなる群から選択される1または2
 個のヘテロ原子を含有する不飽和4、5もしくは6員複素環式環であり、 V が独立して、
 ハロゲン、シアノ、ニトロ、オキソ ($=O$)、任意にハロゲンで置換された C_1-C_6 -
 アルキルであり；

より好ましくは、 CF_3 、 CH_2CF_3 または $CH_2CH_2CF_3$ 等のフッ化 C_1-C_3 -
 アルキルであるか；2-オキソ-2-(2, 2, 2-トリフルオロエチルアミノ)エチ
 ル等のカルボンアミド ($-C(=O)N(R)_2$) で置換された C_1-C_3 -アルキルであ
 って、 R が独立して、 H 、 C_1-C_3 -アルキルまたはハロゲンで置換された C_1-C_3 -
 アルキルであるか；シクロプロピル、または、1-(シアノ)シクロプロピルもしくは
 1-(トリフルオロメチル)シクロプロピル等のシアノで置換されたまたはフッ化され
 た C_1-C_2 -アルキル置換シクロプロピルであるか；チエタン-3-イル等の N 、 O お
 よび S からなる群から選択される1個のヘテロ原子を含有する4員複素環式環；であり、

R^7 および R^9 はそれぞれ H であり、

R^{11} はいずれの場合も H であり、

R^1 はメチルであり、

R^2 は H 、ハロゲンまたは C_1-C_4 -アルキルであり、好ましくは H 、フッ素、塩素
 またはメチルであり、

R^4 は H またはハロゲンであり、好ましくは H 、フルオロもしくはクロロであり、

R^5 は H またはハロゲンであり、好ましくは H 、フルオロもしくはクロロであり、

B_5 は N または $C-R^{10}$ であり、好ましくは $C-R^{10}$ であり、式中、

R^{10} は、水素、 C_1-C_3 -アルキル、 C_1-C_3 -アルコキシ、ハロゲンで置換さ
 れた C_1-C_3 -アルキル（好ましくは過フッ化 C_1-C_3 -アルキル (CF_3 、 C_2F_5
 もしくは C_3F_7)）、ハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルコキシ（好ましくは過
 フッ化 C_1-C_3 -アルコキシ (OCF_3 、 OC_2F_5 もしくは OC_3F_7)）、 C_1-C_3 -
 C_3 -アルキルスルファニル、 C_1-C_3 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_3 -アルキ
 ルスルホニル、フッ素、臭素または塩素であり、

A_2 は N または $C-R^3$ であり、好ましくは $C-R^3$ であり、式中、

R^3 は、 H 、ハロゲンまたは任意に置換された C_1-C_4 -アルキルであり、好ましく
 は H 、フッ素、塩素または任意にハロゲンで置換された C_1-C_2 -アルキルであり、よ
 り好ましくは H またはフルオロで置換されたメチルであり、例えば、ペルフルオロメチル
 であり、

R^6 は、水素、 C_1-C_3 -アルキル、 C_1-C_3 -アルコキシ、ハロゲンで置換され
 た C_1-C_3 -アルキル（好ましくは過フッ化 C_1-C_3 -アルキル (CF_3 、 C_2F_5
 もしくは C_3F_7)）、ハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルコキシ（好ましくは過フ
 ッ化 C_1-C_3 -アルコキシ (OCF_3 、 OC_2F_5 もしくは OC_3F_7)）、 C_1-C_3 -
 C_3 -アルキルスルファニル、 C_1-C_3 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_3 -アルキ
 ルスルホニル、フッ素、塩素または臭素であり、好ましくはフッ素、塩素、臭素、 C_1-C_2 -
 C_2 -アルキル、ハロゲンで置換された C_1-C_2 -アルキル（例えば、ペルフルオロメチ
 ル）または任意にハロゲンで置換された C_1-C_2 -アルコキシであり、より好ましくは
 フッ素、臭素、塩素、メチル、エチル、フッ化メチルまたはフッ化エチル（より好ましく
 はペルフルオロメチルもしくはペルフルオロエチル）、フッ化メトキシまたはフッ化エト
 キシ（より好ましくはペルフルオロメトキシ）であり、

R^8 は、ハロゲンまたは任意にハロゲンで置換された C_1-C_4 -アルキルまたは任意
 にハロゲンで置換された C_1-C_4 -アルコキシであり、好ましくはハロゲンで置換され

10

20

30

40

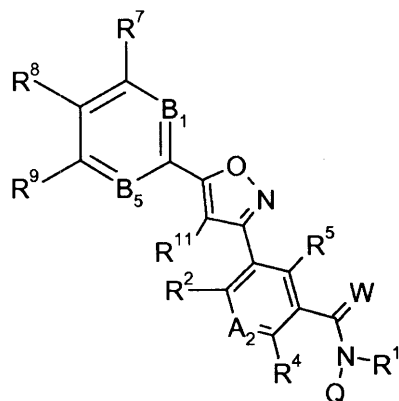
50

た C_1-C_3 -アルキルまたはハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルコキシであり、より好ましくはフッ化 C_1-C_3 -アルキル等のハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルキル（例えば、ペルフルオロプロピル等のフッ化 C_3 -アルキル）である。

【0146】

さらに好ましい実施形態は、式 (If) ($T = T_{23}$) の化合物に関する：

【化28】



(If)

10

(式中、 R^1 、 Q 、 W 、 A_2 、 B_1 、 B_5 、 R^2 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 および R^{11} は、それぞれ本明細書に記載されるように定義され、 R^1 はHを表すか、または R^1 はメチルを表す)。

20

【0147】

好ましい実施形態は、式 (If) の化合物に関し、式中、

W がOであり、

Q が、任意に置換された C_1-C_4 -アルキルまたは任意に置換された C_3-C_6 -シクロアルキルまたは1、2もしくは3個のV置換基で任意に置換された不飽和4、5もしくは6員複素環式環であり、Vは独立してハロゲン、シアノ、ニトロ、オキソ(=O)、任意にハロゲンで置換された C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_4 -アルケニル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -アルキルスルファニル、 C_1-C_6 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_6 -アルキルスルホニルであり；

30

好ましくは、ハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルキルであり、シアノ、ヒドロキシルまたはカルボンアミド($-C(=O)N(R)_2$)を有し、Rが独立して、Hまたは C_1-C_3 -アルキル、置換された C_1-C_3 -アルキルであるか； C_3 -シクロアルキル、または、シアノで置換された、ハロゲンで置換された、ニトロで置換された、もしくはハロゲン化された C_1-C_2 -アルキルで置換された C_3 -シクロアルキルであるか；1、2または3個のVで任意に置換され、N、OおよびSからなる群から選択される1または2個のヘテロ原子を含有する不飽和4、5もしくは6員複素環式環であり、Vが独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、オキソ(=O)、任意にハロゲンで置換された C_1-C_6 -アルキルであり；

より好ましくは、 CF_3 、 CH_2CF_3 または $CH_2CH_2CF_3$ 等のフッ化 C_1-C_3 -アルキルであるか；2-オキソ-2-(2, 2, 2-トリフルオロエチルアミノ)エチル等のカルボンアミド($-C(=O)N(R)_2$)で置換された C_1-C_3 -アルキルであって、Rが独立して、H、 C_1-C_3 -アルキルまたはハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルキルであるか；シクロプロピル、または、1-(シアノ)シクロプロピルもしくは1-(トリフルオロメチル)シクロプロピル等のシアノで置換されたまたはフッ化された C_1-C_2 -アルキル置換シクロプロピルであるか；チエタン-3-イル等のN、OおよびSからなる群から選択される1個のヘテロ原子を含有する4員複素環式環；であり、

40

R^7 および R^9 はそれぞれHであり、

R^{11} はいずれの場合もHであり、

R^1 はHであり、

50

R^2 はH、ハロゲンまたは $C_1 - C_4$ -アルキルであり、好ましくはH、フッ素、塩素またはメチルであり、

R^4 はHまたはハロゲンであり、好ましくはH、フッ素もしくは塩素であり、

R^5 はHまたはハロゲンであり、好ましくはH、フッ素もしくは塩素であり、

B_5 はNまたは $C - R^{10}$ であり、好ましくは $C - R^{10}$ であり、式中、

R^{10} は、H、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ -アルキルまたは $C_1 - C_4$ -アルコキシであり、好ましくはH、フッ素、臭素、塩素、 $C_1 - C_2$ -アルキルまたは $C_1 - C_2$ -アルコキシであり、より好ましくはH、塩素、臭素、フッ素、メチルまたはメトキシであり、

A_2 はNまたは $C - R^3$ であり、好ましくは $C - R^3$ であり、式中、

R^3 は、H、ハロゲンまたは任意に置換された $C_1 - C_4$ -アルキルであり、好ましくはH、フッ素、塩素または任意にハロゲンで置換された $C_1 - C_2$ -アルキルであり、より好ましくはHまたはフッ素で置換されたメチルであり、例えば、ペルフルオロメチルであり、

10

R^6 は、H、ハロゲン、任意に置換された $C_1 - C_4$ -アルキルまたは任意に置換された $C_1 - C_4$ -アルコキシであり、好ましくはフッ素、塩素、 $C_1 - C_2$ -アルキル、ハロゲンで置換された $C_1 - C_2$ -アルキル（例えば、ペルフルオロメチル）または任意にハロゲンで置換された $C_1 - C_2$ -アルコキシであり、より好ましくはフッ素、臭素、塩素、メチル、エチル、フッ化メチルまたはフッ化エチル（より好ましくはペルフルオロメチルまたはペルフルオロエチル）、フッ化メトキシまたはフッ化エトキシ（より好ましくはペルフルオロメトキシ）であり、

20

R^8 は、ハロゲンまたは任意にハロゲンで置換された $C_1 - C_4$ -アルキルまたは任意にハロゲンで置換された $C_1 - C_4$ -アルコキシであり、好ましくはハロゲンで置換された $C_1 - C_3$ -アルキルまたはハロゲンで置換された $C_1 - C_3$ -アルコキシであり、より好ましくはフッ化 $C_1 - C_3$ -アルキル等のハロゲンで置換された $C_1 - C_3$ -アルキル（例えば、ペルフルオロプロピル等のフッ化 C_3 -アルキル）である。

【0148】

好ましい実施形態は、式 (I f) の化合物に関し、式中、

WはOであり、

Qは、任意に置換された $C_1 - C_4$ -アルキルまたは任意に置換された $C_3 - C_6$ -シクロアルキルまたは1、2もしくは3個のV置換基で任意に置換された不飽和4、5もしくは6員複素環式環であり、Vは独立してハロゲン、シアノ、ニトロ、オキソ (=O)、任意にハロゲンで置換された $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -アルケニル、 $C_1 - C_6$ -アルコキシ、 $C_1 - C_6$ -アルキルスルファニル、 $C_1 - C_6$ -アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$ -アルキルスルホニルであり；

30

好ましくは、ハロゲンで置換された $C_1 - C_3$ -アルキルであり、シアノ、ヒドロキシルまたはカルボンアミド ($-C(=O)N(R)_2$) を有し、Rが独立して、Hまたは $C_1 - C_3$ -アルキル、置換された $C_1 - C_3$ -アルキルであるか； C_3 -シクロアルキル、または、シアノで置換された、ハロゲンで置換された、ニトロで置換された、もしくはハロゲン化された $C_1 - C_2$ -アルキルで置換された C_3 -シクロアルキルであるか；1、2または3個のVで任意に置換され、N、OおよびSからなる群から選択される1または2個のヘテロ原子を含有する不飽和4、5もしくは6員複素環式環であり、Vが独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、オキソ (=O)、任意にハロゲンで置換された $C_1 - C_6$ -アルキルであり；

40

より好ましくは、 CF_3 、 CH_2CF_3 または $CH_2CH_2CF_3$ 等のフッ化 $C_1 - C_3$ -アルキルであるか；2-オキソ-2-(2, 2, 2-トリフルオロエチルアミノ)エチル等のカルボンアミド ($-C(=O)N(R)_2$) で置換された $C_1 - C_3$ -アルキルであって、Rが独立して、H、 $C_1 - C_3$ -アルキルまたはハロゲンで置換された $C_1 - C_3$ -アルキルであるか；シクロプロピル、または、1-(シアノ)シクロプロピルもしくは1-(トリフルオロメチル)シクロプロピル等のシアノで置換されたまたはフッ化された $C_1 - C_2$ -アルキル置換シクロプロピルであるか；チエタン-3-イル等のN、Oお

50

よび S からなる群から選択される 1 個のヘテロ原子を含有する 4 員複素環式環；であり、
 R^7 および R^9 はそれぞれ H であり、
 R^{11} はいずれの場合も H であり、
 R^1 はメチルであり、
 R^2 は H、ハロゲンまたは C_1-C_4 -アルキルであり、好ましくは H、フッ素、塩素
 またはメチルであり、

R^4 は H または ハロゲン であり、好ましくは H、フッ素もしくは塩素であり、
 R^5 は H または ハロゲン であり、好ましくは H、フッ素もしくは塩素であり、
 B_5 は N または $C-R^{10}$ であり、好ましくは $C-R^{10}$ であり、式中、
 R^{10} は、水素、 C_1-C_3 -アルキル、 C_1-C_3 -アルコキシ、ハロゲンで置換さ
 れた C_1-C_3 -アルキル（好ましくは過フッ化 C_1-C_3 -アルキル（ CF_3 、 C_2F_5
 もしくは C_3F_7 ））、ハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルコキシ（好ましくは過
 フッ化 C_1-C_3 -アルコキシ（ OCF_3 、 OC_2F_5 もしくは OC_3F_7 ））、 C_1-C_3 -
 C_3 -アルキルスルファニル、 C_1-C_3 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_3 -アルキ
 ルスルホニル、フッ素、臭素または塩素であり、

10

A_2 は N または $C-R^3$ であり、好ましくは $C-R^3$ であり、式中、
 R^3 は H、ハロゲンまたは任意に置換された C_1-C_4 -アルキルであり、好ましくは
 H、フッ素、塩素または任意にハロゲンで置換された C_1-C_2 -アルキルであり、より
 好ましくは H または フルオロで置換されたメチルであり、例えば、ペルフルオロメチルで
 あり、

20

R^6 は、水素、 C_1-C_3 -アルキル、 C_1-C_3 -アルコキシ、ハロゲンで置換され
 た C_1-C_3 -アルキル（好ましくは過フッ化 C_1-C_3 -アルキル（ CF_3 、 C_2F_5
 もしくは C_3F_7 ））、ハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルコキシ（好ましくは過フ
 ッ化 C_1-C_3 -アルコキシ（ OCF_3 、 OC_2F_5 もしくは OC_3F_7 ））、 C_1-C_3 -
 C_3 -アルキルスルファニル、 C_1-C_3 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_3 -アルキ
 ルスルホニル、フッ素、塩素または臭素であり、好ましくはフッ素、塩素、臭素、 C_1-C_2 -
 C_2 -アルキル、ハロゲンで置換された C_1-C_2 -アルキル（例えば、ペルフルオロメチ
 ル）または任意にハロゲンで置換された C_1-C_2 -アルコキシであり、より好ましくは
 フッ素、臭素、塩素、メチル、エチル、フッ化メチルまたはフッ化エチル（より好ましく
 はペルフルオロメチルもしくはペルフルオロエチル）、フッ化メトキシまたはフッ化エト
 キシ（より好ましくはペルフルオロメトキシ）であり、

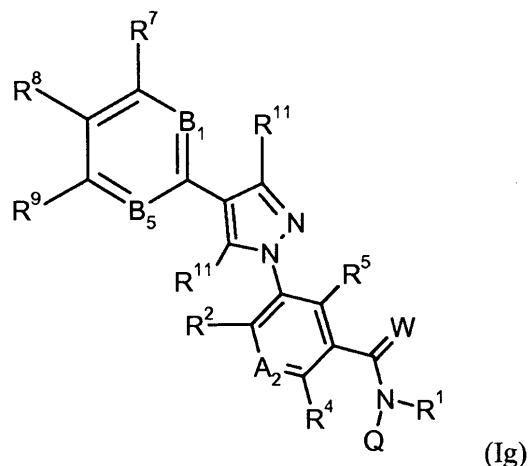
30

R^8 は、ハロゲンまたは任意にハロゲンで置換された C_1-C_4 -アルキルまたは任意
 にハロゲンで置換された C_1-C_4 -アルコキシであり、好ましくはハロゲンで置換され
 た C_1-C_3 -アルキルまたはハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルコキシであり、よ
 り好ましくはフッ化 C_1-C_3 -アルキル等のハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルキ
 ル（例えば、ペルフルオロプロピル等のフッ化 C_3 -アルキル）である。

【0149】

さらに好ましい実施形態は、式 (I g) ($T = T_4$) の化合物に関する：

【化 2 9】



10

(式中、 R^1 、 Q 、 W 、 A_2 、 B_1 、 B_5 、 R^2 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 および R^{11} は、それぞれ本明細書に記載されるように定義され、 R^1 はHを表すか、または R^1 はメチルを表す)。

【0150】

好ましい実施形態は、式 (I g) の化合物に関し、式中、

20

W はOであり、

Q は、任意に置換された $C_1 - C_4$ -アルキルまたは任意に置換された $C_3 - C_6$ -シクロアルキルまたは1、2もしくは3個のV置換基で任意に置換された不飽和4、5もしくは6員複素環式環であり、Vは独立してハロゲン、シアノ、ニトロ、オキソ (=O)、任意にハロゲンで置換された $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -アルケニル、 $C_1 - C_6$ -アルコキシ、 $C_1 - C_6$ -アルキルスルファニル、 $C_1 - C_6$ -アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$ -アルキルスルホニルであり；

好ましくは、ハロゲンで置換された $C_1 - C_3$ -アルキルであり、シアノ、ヒドロキシルまたはカルボンアミド ($-C(=O)N(R)_2$) を有し、Rが独立して、Hまたは $C_1 - C_3$ -アルキル、置換された $C_1 - C_3$ -アルキルであるか； C_3 -シクロアルキル、または、シアノで置換された、ハロゲンで置換された、ニトロで置換された、もしくはハロゲン化された $C_1 - C_2$ -アルキルで置換された C_3 -シクロアルキルであるか；1、2または3個のVで任意に置換され、N、OおよびSからなる群から選択される1または2個のヘテロ原子を含有する不飽和4、5もしくは6員複素環式環であり、Vが独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、オキソ (=O)、任意にハロゲンで置換された $C_1 - C_6$ -アルキルであり；

30

より好ましくは、 CF_3 、 CH_2CF_3 または $CH_2CH_2CF_3$ 等のフッ化 $C_1 - C_3$ -アルキルであるか；2-オキソ-2-(2, 2, 2-トリフルオロエチルアミノ)エチル等のカルボンアミド ($-C(=O)N(R)_2$) で置換された $C_1 - C_3$ -アルキルであって、Rが独立して、H、 $C_1 - C_3$ -アルキルまたはハロゲンで置換された $C_1 - C_3$ -アルキルであるか；シクロプロピル、または、1-(シアノ)シクロプロピルもしくは1-(トリフルオロメチル)シクロプロピル等のシアノで置換されたまたはフッ化された $C_1 - C_2$ -アルキル置換シクロプロピルであるか；チエタン-3-イル等のN、OおよびSからなる群から選択される1個のヘテロ原子を含有する4員複素環式環；であり、

40

R^7 および R^9 はそれぞれHであり、

R^{11} はいずれの場合もHであり、

R^1 はHであり、

R^2 はH、ハロゲンまたは $C_1 - C_4$ -アルキルであり、好ましくはH、フッ素、塩素またはメチルであり、

R^4 はHまたはハロゲンであり、好ましくはH、フッ素もしくは塩素であり、

50

R^5 はHまたはハロゲンであり、好ましくはH、フッ素もしくは塩素であり、

B_5 はNまたは $C-R^{10}$ であり、好ましくは $C-R^{10}$ であり、式中、

R^{10} は、水素、 C_1-C_3 -アルキル、 C_1-C_3 -アルコキシ、ハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルキル（好ましくは過フッ化 C_1-C_3 -アルキル（ CF_3 、 C_2F_5 もしくは C_3F_7 ））、ハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルコキシ（好ましくは過フッ化 C_1-C_3 -アルコキシ（ OCF_3 、 OC_2F_5 もしくは OC_3F_7 ））、 C_1-C_3 -アルキルスルファニル、 C_1-C_3 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_3 -アルキルスルホニル、フッ素、臭素または塩素であり、

A_2 はNまたは $C-R^3$ であり、好ましくは $C-R^3$ であり、式中、

R^3 はH、ハロゲンまたは任意に置換された C_1-C_4 -アルキルであり、好ましくはH、フッ素、塩素または任意にハロゲンで置換された C_1-C_2 -アルキルであり、より好ましくはHまたはフルオロで置換されたメチルであり、例えば、ペルフルオロメチルであり、

10

R^6 は、水素、 C_1-C_3 -アルキル、 C_1-C_3 -アルコキシ、ハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルキル（好ましくは過フッ化 C_1-C_3 -アルキル（ CF_3 、 C_2F_5 もしくは C_3F_7 ））、ハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルコキシ（好ましくは過フッ化 C_1-C_3 -アルコキシ（ OCF_3 、 OC_2F_5 もしくは OC_3F_7 ））、 C_1-C_3 -アルキルスルファニル、 C_1-C_3 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_3 -アルキルスルホニル、フッ素、塩素または臭素であり、好ましくはフッ素、塩素、臭素、 C_1-C_2 -アルキル、ハロゲンで置換された C_1-C_2 -アルキル（例えば、ペルフルオロメチル）または任意にハロゲンで置換された C_1-C_2 -アルコキシであり、より好ましくはフッ素、臭素、塩素、メチル、エチル、フッ化メチルまたはフッ化エチル（より好ましくはペルフルオロメチルもしくはペルフルオロエチル）、フッ化メトキシまたはフッ化エトキシ（より好ましくはペルフルオロメトキシ）であり、

20

R^8 は、ハロゲンまたは任意にハロゲンで置換された C_1-C_4 -アルキルまたは任意にハロゲンで置換された C_1-C_4 -アルコキシであり、好ましくはハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルキルまたはハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルコキシであり、より好ましくはフッ化 C_1-C_3 -アルキル等のハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルキル（例えば、ペルフルオロプロピル等のフッ化 C_3 -アルキル）である。

30

【0151】

好ましい実施形態は、式(Ig)の化合物に関し、式中、

WはOであり、

Qは、任意に置換された C_1-C_4 -アルキルまたは任意に置換された C_3-C_6 -シクロアルキルまたは1、2もしくは3個のV置換基で任意に置換された不飽和4、5もしくは6員複素環式環であり、Vは独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、オキソ(=O)、任意にハロゲンで置換された C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_4 -アルケニル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -アルキルスルファニル、 C_1-C_6 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_6 -アルキルスルホニルであり；

好ましくは、ハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルキルであり、シアノ、ヒドロキシルまたはカルボンアミド($-C(=O)N(R)_2$)を有し、Rが独立して、Hまたは C_1-C_3 -アルキル、置換された C_1-C_3 -アルキルであるか； C_3 -シクロアルキル、または、シアノで置換された、ハロゲンで置換された、ニトロで置換された、もしくはハロゲン化された C_1-C_2 -アルキルで置換された C_3 -シクロアルキルであるか；1、2または3個のVで任意に置換され、N、OおよびSからなる群から選択される1または2個のヘテロ原子を含有する不飽和4、5もしくは6員複素環式環であり、Vが独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、オキソ(=O)、任意にハロゲンで置換された C_1-C_6 -アルキルであり；

40

より好ましくは、 CF_3 、 CH_2CF_3 または $CH_2CH_2CF_3$ 等のフッ化 C_1-C_3 -アルキルであるか；2-オキソ-2-(2, 2, 2-トリフルオロエチルアミノ)エチル等のカルボンアミド($-C(=O)N(R)_2$)で置換された C_1-C_3 -アルキルであ

50

って、Rが独立して、H、 C_1-C_3 -アルキルまたはハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルキルであるか；シクロプロピル、または、1-(シアノ)シクロプロピルもしくは1-(トリフルオロメチル)シクロプロピル等のシアノで置換されたまたはフッ化された C_1-C_2 -アルキル置換シクロプロピルであるか；チエタン-3-イル等のN、OおよびSからなる群から選択される1個のヘテロ原子を含有する4員複素環式環；であり、

R^7 および R^9 はそれぞれHであり、

R^{11} はいずれの場合もHであり、

R^1 はメチルであり、

R^2 はH、ハロゲンまたは C_1-C_4 -アルキルであり、好ましくはH、フッ素、塩素またはメチルであり、

R^4 はHまたはハロゲンであり、好ましくはH、フッ素もしくは塩素であり、

R^5 はHまたはハロゲンであり、好ましくはH、フッ素もしくは塩素であり、

B_5 はNまたは $C-R^{10}$ であり、好ましくは $C-R^{10}$ であり、式中、

R^{10} は、水素、 C_1-C_3 -アルキル、 C_1-C_3 -アルコキシ、ハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルキル（好ましくは過フッ化 C_1-C_3 -アルキル（ CF_3 、 C_2F_5 もしくは C_3F_7 ））、ハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルコキシ（好ましくは過フッ化 C_1-C_3 -アルコキシ（ OCF_3 、 OC_2F_5 もしくは OC_3F_7 ））、 C_1-C_3 -アルキルスルファニル、 C_1-C_3 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_3 -アルキルスルホニル、フッ素、臭素または塩素であり、

A_2 はNまたは $C-R^3$ であり、好ましくは $C-R^3$ であり、式中、

R^3 はH、ハロゲンまたは任意に置換された C_1-C_4 -アルキルであり、好ましくはH、フッ素、塩素または任意にハロゲンで置換された C_1-C_2 -アルキルであり、より好ましくはHまたはフルオロで置換されたメチルであり、例えば、ペルフルオロメチルであり、

R^6 は、水素、 C_1-C_3 -アルキル、 C_1-C_3 -アルコキシ、ハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルキル（好ましくは過フッ化 C_1-C_3 -アルキル（ CF_3 、 C_2F_5 もしくは C_3F_7 ））、ハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルコキシ（好ましくは過フッ化 C_1-C_3 -アルコキシ（ OCF_3 、 OC_2F_5 もしくは OC_3F_7 ））、 C_1-C_3 -アルキルスルファニル、 C_1-C_3 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_3 -アルキルスルホニル、フッ素、塩素または臭素であり、好ましくはフッ素、塩素、臭素、 C_1-C_2 -アルキル、ハロゲンで置換された C_1-C_2 -アルキル（例えば、ペルフルオロメチル）または任意にハロゲンで置換された C_1-C_2 -アルコキシであり、より好ましくはフッ素、臭素、塩素、メチル、エチル、フッ化メチルまたはフッ化エチル（より好ましくはペルフルオロメチルもしくはペルフルオロエチル）、フッ化メトキシまたはフッ化エトキシ（より好ましくはペルフルオロメトキシ）であり、

R^8 は、ハロゲンまたは任意にハロゲンで置換された C_1-C_4 -アルキルまたは任意にハロゲンで置換された C_1-C_4 -アルコキシであり、好ましくはハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルキルまたはハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルコキシであり、より好ましくはフッ化 C_1-C_3 -アルキル等のハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルキル（例えば、ペルフルオロプロピル等のフッ化 C_3 -アルキル）である。

【0152】

さらに好ましい実施形態は、式(Io) (T=T22)の化合物に関する：

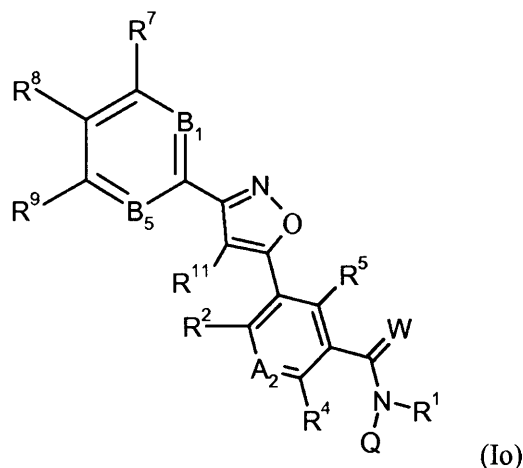
10

20

30

40

【化 3 0】



10

(式中、 R^1 、 Q 、 W 、 A_2 、 B_1 、 B_5 、 R^2 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 および R^{11} は、それぞれ本明細書に記載されるように定義され、 R^1 はHを表すか、または R^1 はメチルを表す)。

【0153】

好ましい実施形態は、式 (Io) の化合物に関し、式中、

20

W はOであり、

Q は、任意に置換された $C_1 - C_4$ -アルキルまたは任意に置換された $C_3 - C_6$ -シクロアルキルまたは1、2もしくは3個のV置換基で任意に置換された不飽和4、5もしくは6員複素環式環であり、Vは独立してハロゲン、シアノ、ニトロ、オキソ(=O)、任意にハロゲンで置換された $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -アルケニル、 $C_1 - C_6$ -アルコキシ、 $C_1 - C_6$ -アルキルスルファニル、 $C_1 - C_6$ -アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$ -アルキルスルホニルであり；

好ましくは、ハロゲンで置換された $C_1 - C_3$ -アルキルであり、シアノ、ヒドロキシルまたはカルボンアミド($-C(=O)N(R)_2$)を有し、Rが独立して、Hまたは $C_1 - C_3$ -アルキル、置換された $C_1 - C_3$ -アルキルであるか； C_3 -シクロアルキル、または、シアノで置換された、ハロゲンで置換された、ニトロで置換された、もしくはハロゲン化された $C_1 - C_2$ -アルキルで置換された C_3 -シクロアルキルであるか；1、2または3個のVで任意に置換され、N、OおよびSからなる群から選択される1または2個のヘテロ原子を含有する不飽和4、5もしくは6員複素環式環、式中、Vが独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、オキソ(=O)、任意にハロゲンで置換された $C_1 - C_6$ -アルキルであり；

30

より好ましくは、 CF_3 、 CH_2CF_3 または $CH_2CH_2CF_3$ 等のフッ化 $C_1 - C_3$ -アルキルであるか；2-オキソ-2-(2, 2, 2-トリフルオロエチルアミノ)エチル等のカルボンアミド($-C(=O)N(R)_2$)で置換された $C_1 - C_3$ -アルキルであって、Rが独立して、H、 $C_1 - C_3$ -アルキルまたはハロゲンで置換された $C_1 - C_3$ -アルキルであるか；シクロプロピル、または、1-(シアノ)シクロプロピルもしくは1-(トリフルオロメチル)シクロプロピル等のシアノで置換されたまたはフッ化された $C_1 - C_2$ -アルキル置換シクロプロピルであるか；チエタン-3-イル等のN、OおよびSからなる群から選択される1個のヘテロ原子を含有する4員複素環式環；であり、

40

R^7 および R^9 はそれぞれHであり、

R^{11} はいずれの場合もHであり、

R^1 はHであり、

R^2 はH、ハロゲンまたは $C_1 - C_4$ -アルキルであり、好ましくはH、フッ素、塩素またはメチルであり、

R^4 はHまたはハロゲンであり、好ましくはH、フッ素もしくは塩素であり、

50

R^5 はHまたはハロゲンであり、好ましくはH、フッ素もしくは塩素であり、

B_5 はNまたは $C-R^{10}$ であり、好ましくは $C-R^{10}$ であり、式中、

R^{10} は、水素、 C_1-C_3 -アルキル、 C_1-C_3 -アルコキシ、ハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルキル（好ましくは過フッ化 C_1-C_3 -アルキル（ CF_3 、 C_2F_5 もしくは C_3F_7 ））、ハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルコキシ（好ましくは過フッ化 C_1-C_3 -アルコキシ（ OCF_3 、 OC_2F_5 もしくは OC_3F_7 ））、 C_1-C_3 -アルキルスルファニル、 C_1-C_3 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_3 -アルキルスルホニル、フッ素、臭素または塩素であり、

A_2 はNまたは $C-R^3$ であり、好ましくは $C-R^3$ であり、式中、

R^3 はH、ハロゲンまたは任意に置換された C_1-C_4 -アルキルであり、好ましくはH、フッ素、塩素または任意にハロゲンで置換された C_1-C_2 -アルキルであり、より好ましくはHまたはフルオロで置換されたメチルであり、例えば、ペルフルオロメチルであり、

10

R^6 は、水素、 C_1-C_3 -アルキル、 C_1-C_3 -アルコキシ、ハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルキル（好ましくは過フッ化 C_1-C_3 -アルキル（ CF_3 、 C_2F_5 もしくは C_3F_7 ））、ハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルコキシ（好ましくは過フッ化 C_1-C_3 -アルコキシ（ OCF_3 、 OC_2F_5 もしくは OC_3F_7 ））、 C_1-C_3 -アルキルスルファニル、 C_1-C_3 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_3 -アルキルスルホニル、フッ素、塩素または臭素であり、好ましくはフッ素、塩素、臭素、 C_1-C_2 -アルキル、ハロゲンで置換された C_1-C_2 -アルキル（例えば、ペルフルオロメチル）または任意にハロゲンで置換された C_1-C_2 -アルコキシであり、より好ましくはフッ素、臭素、塩素、メチル、エチル、フッ化メチルまたはフッ化エチル（より好ましくはペルフルオロメチルもしくはペルフルオロエチル）、フッ化メトキシまたはフッ化エトキシ（より好ましくはペルフルオロメトキシ）であり、

20

R^8 は、ハロゲンまたは任意にハロゲンで置換された C_1-C_4 -アルキルまたは任意にハロゲンで置換された C_1-C_4 -アルコキシであり、好ましくはハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルキルまたはハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルコキシであり、より好ましくはフッ化 C_1-C_3 -アルキル等のハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルキル（例えば、ペルフルオロプロピル等のフッ化 C_3 -アルキル）である。

30

【0154】

好ましい実施形態は、式(Io)の化合物に関し、式中、

WはOであり、

Qは、任意に置換された C_1-C_4 -アルキルまたは任意に置換された C_3-C_6 -シクロアルキルまたは1、2もしくは3個のV置換基で任意に置換された不飽和4、5もしくは6員複素環式環であり、Vは独立してハロゲン、シアノ、ニトロ、オキソ(=O)、任意にハロゲンで置換された C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_4 -アルケニル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -アルキルスルファニル、 C_1-C_6 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_6 -アルキルスルホニルであり；

好ましくは、ハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルキルであり、シアノ、ヒドロキシルまたはカルボンアミド($-C(=O)N(R)_2$)を有し、Rが独立して、Hまたは C_1-C_3 -アルキル、置換された C_1-C_3 -アルキルであるか； C_3 -シクロアルキル、または、シアノで置換された、ハロゲンで置換された、ニトロで置換された、もしくはハロゲン化された C_1-C_2 -アルキルで置換された C_3 -シクロアルキルであるか；1、2または3個のVで任意に置換され、N、OおよびSからなる群から選択される1または2個のヘテロ原子を含有する不飽和4、5もしくは6員複素環式環であり、Vが独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、オキソ(=O)、任意にハロゲンで置換された C_1-C_6 -アルキルであり；

40

より好ましくは、 CF_3 、 CH_2CF_3 または $CH_2CH_2CF_3$ 等のフッ化 C_1-C_3 -アルキルであるか；2-オキソ-2-(2, 2, 2-トリフルオロエチルアミノ)エチル等のカルボンアミド($-C(=O)N(R)_2$)で置換された C_1-C_3 -アルキルであ

50

って、Rが独立して、H、 C_1-C_3 -アルキルまたはハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルキルであるか；シクロプロピル、または、1-(シアノ)シクロプロピルもしくは1-(トリフルオロメチル)シクロプロピル等のシアノで置換されたまたはフッ化された C_1-C_2 -アルキル置換シクロプロピルであるか；チエタン-3-イル等のN、OおよびSからなる群から選択される1個のヘテロ原子を含有する4員複素環式環；であり、

R^7 および R^9 はそれぞれHであり、

R^{11} はいずれの場合もHであり、

R^1 はメチルであり、

R^2 はH、ハロゲンまたは C_1-C_4 -アルキルであり、好ましくはH、フッ素、塩素またはメチルであり、

R^4 はHまたはハロゲンであり、好ましくはH、フッ素もしくは塩素であり、

R^5 はHまたはハロゲンであり、好ましくはH、フッ素もしくは塩素であり、

B_5 はNまたは $C-R^{10}$ であり、好ましくは $C-R^{10}$ であり、式中、

R^{10} は、水素、 C_1-C_3 -アルキル、 C_1-C_3 -アルコキシ、ハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルキル（好ましくは過フッ化 C_1-C_3 -アルキル（ CF_3 、 C_2F_5 もしくは C_3F_7 ））、ハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルコキシ（好ましくは過フッ化 C_1-C_3 -アルコキシ（ OCF_3 、 OC_2F_5 もしくは OC_3F_7 ））、 C_1-C_3 -アルキルスルファニル、 C_1-C_3 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_3 -アルキルスルホニル、フッ素、臭素または塩素であり、

A_2 はNまたは $C-R^3$ であり、好ましくは $C-R^3$ であり、式中、

R^3 はH、ハロゲンまたは任意に置換された C_1-C_4 -アルキルであり、好ましくはH、フッ素、塩素または任意にハロゲンで置換された C_1-C_2 -アルキルであり、より好ましくはHまたはフルオロで置換されたメチルであり、例えば、ペルフルオロメチルであり、

R^6 は、水素、 C_1-C_3 -アルキル、 C_1-C_3 -アルコキシ、ハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルキル（好ましくは過フッ化 C_1-C_3 -アルキル（ CF_3 、 C_2F_5 、もしくは C_3F_7 ））、ハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルコキシ（好ましくは過フッ化 C_1-C_3 -アルコキシ（ OCF_3 、 OC_2F_5 、もしくは OC_3F_7 ））、 C_1-C_3 -アルキルスルファニル、 C_1-C_3 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_3 -アルキルスルホニル、フッ素、塩素、または臭素、好ましくはフッ素、塩素、臭素、 C_1-C_2 -アルキル、ハロゲンで置換された C_1-C_2 -アルキル（例えば、ペルフルオロメチル）、または任意にハロゲンで置換された C_1-C_2 -アルコキシ、より好ましくはフッ素、臭素、塩素、メチル、エチル、フッ化メチルまたはフッ化エチル（より好ましくはペルフルオロメチルもしくはペルフルオロエチル）、フッ化メトキシまたはフッ化エトキシ（より好ましくはペルフルオロメトキシ）であり、

R^8 は、ハロゲンまたは任意にハロゲンで置換された C_1-C_4 -アルキルまたは任意にハロゲンで置換された C_1-C_4 -アルコキシであり、好ましくはハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルキルまたはハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルコキシであり、より好ましくはフッ化 C_1-C_3 -アルキル等のハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルキル（例えば、ペルフルオロプロピル等のフッ化 C_3 -アルキル）である。

【0155】

式(I)の化合物の例は、以下の構造、

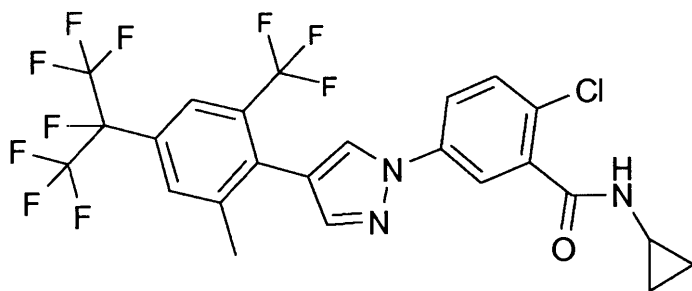
10

20

30

40

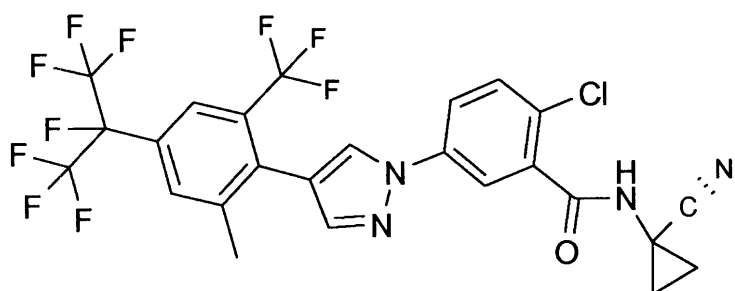
【化 3 1】



10

2-クロロ-N-シクロプロピル-5-[1-[4-(1,1,1,2,3,3,3-ヘ
プタフルオロプロパン-2-イル)-2-メチル-6-(トリフルオロメチル)フェニル
]-1H-ピラゾール-4-イル]ベンズアミド、

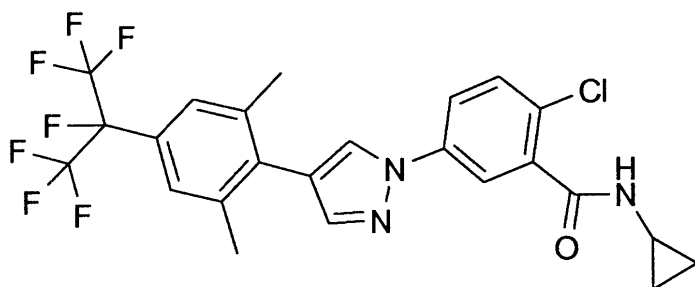
【化 3 2】



20

2-クロロ-N-(1-シアノシクロプロピル-5-[1-[4-(1,1,1,2,3
, 3, 3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル)-2-メチル-6-(トリフルオロメチル)
フェニル]-1H-ピラゾール-4-イル]ベンズアミド、

【化 3 3】

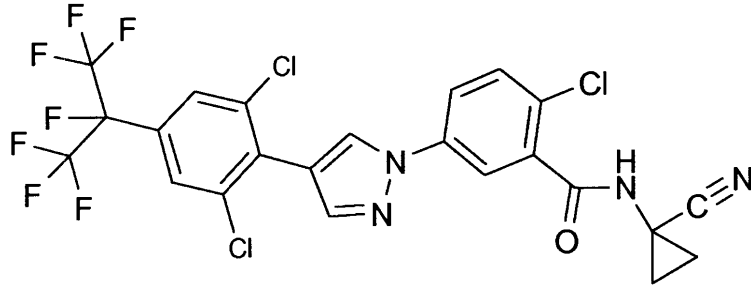


30

2-クロロ-N-シクロプロピル-5-[4-[2,6-ジメチル-4-[1,2,2,
2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル]ピラゾール-1-
イル]ベンズアミド、

40

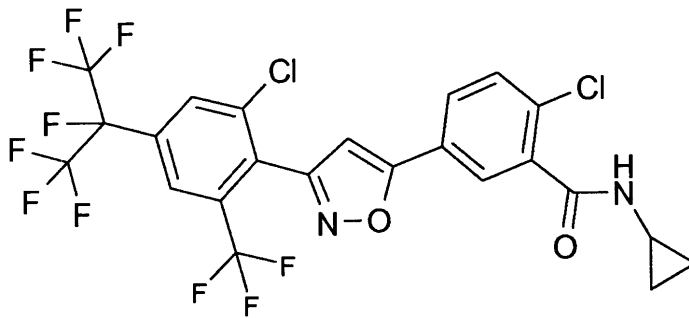
【化 3 4】



10

2-クロロ-N-(1-シアノシクロプロピル)-5-[4-[2,6-ジクロロ-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル]ピラゾール-1-イル]ベンズアミド、

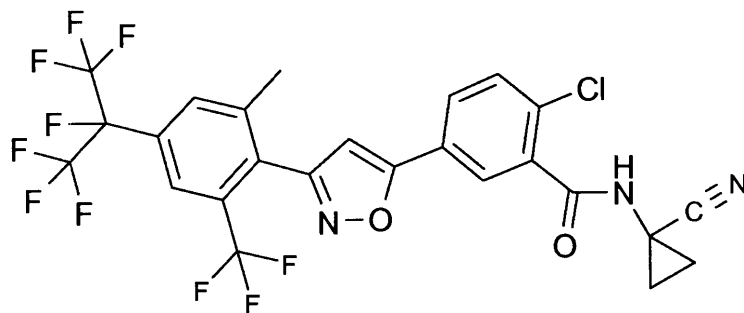
【化 3 5】



20

2-クロロ-5-[3-[2-クロロ-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]-6-(トリフルオロメチル)フェニル]イソキサゾール-5-イル]-N-シクロプロピルベンズアミド、

【化 3 6】

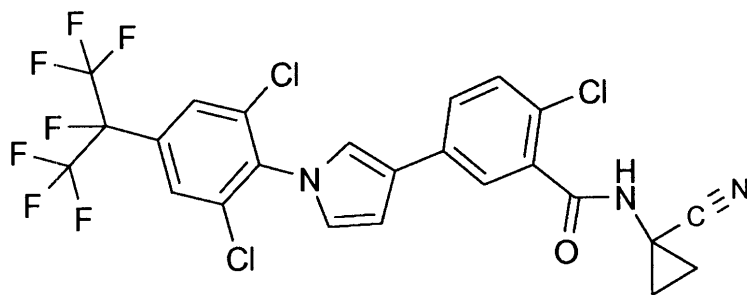


30

2-クロロ-N-(1-シアノシクロプロピル)-5-[3-[2-メチル-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]-6-(トリフルオロメチル)フェニル]イソキサゾール-5-イル]ベンズアミドを含み、さらなる本発明の化合物は、

40

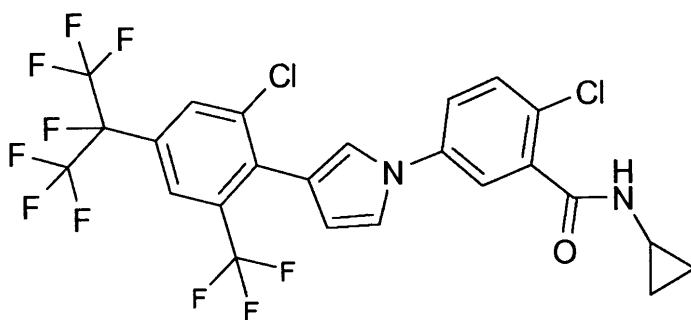
【化 3 7】



10

2-クロロ-N-(1-シアノシクロプロピル)-5-[1-[2,6-ジクロロ-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル]ピロール-3-イル]ベンズアミド、

【化 3 8】



20

2-クロロ-5-[3-[2-クロロ-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]-6-(トリフルオロメチル)フェニル]ピロール-1-イル]-N-シクロプロピルベンズアミドである。

【0156】

R¹ メチル

30

好ましい実施形態は、式 (I) の化合物に関し、式中、R¹ がメチルであり、すべての他のパラメータが、段落 [85] で定義される通りである。

【0157】

T³ -メチル

さらに好ましい実施形態は、式 (I) の化合物に関し、式中、R¹ がメチルであり、T が T³ であり、T³ 中の R^{1 1} が H であり、W が O であり、すべての他のパラメータが、段落 [85] および段落 [112] で定義される通りである。

【0158】

さらに好ましい実施形態は、式 (I) の化合物に関し、式中、R¹ がメチルであり、T が T³ であり、T³ 中の R^{1 1} が H であり、W が O であり、A₁ が CR² であり、A₂ が CR³ または N であり、A₃ が CR⁴ であり、A₄ が CR⁵ であり、B₁ が CR⁶ であり、B₂ が CR⁷ であり、B₃ が CR⁸ であり、B₄ が CR⁹ であり、B₅ が CR¹⁰ であり、すべての他のパラメータが、段落 [85] および段落 [112] で定義される通りである。

40

【0159】

さらに好ましい実施形態は、式 (I) の化合物に関し、式中、R¹ がメチルであり、T が T³ であり、T³ 中の R^{1 1} が H であり、W が O であり、A₁ が CH であり、A₂ が CH または N であり、A₃ が CR⁴ であり、A₄ が CH であり、B₁ が CR⁶ であり、B₂ が CH であり、B₃ が CR⁸ であり、B₄ が CH であり、B₅ が CR¹⁰ であり、R⁶ および R¹⁰ がそれぞれ、ハロゲン（好ましくは塩素、臭素もしくはフッ素）、C₁ - C₃

50

ーアルキル、ハロゲンで置換された C_1-C_3 ーアルキル、 C_1-C_3 ーアルコキシまたはハロゲンで置換された C_1-C_3 ーアルコキシから選択される置換基であり、すべての他のパラメータが、段落 [85] および段落 [112] で定義される通りである。

【0160】

さらに好ましい実施形態は、式 (I) の化合物に関し、式中、 R^1 がメチルであり、T が T3 であり、T3 中の R^{11} が H であり、W が O であり、 A_1 が CH であり、 A_2 が CH または N であり、 A_3 が CR^4 であり、 A_4 が CH であり、 B_1 が CR^6 であり、 B_2 が CH であり、 B_3 が CR^8 であり、 B_4 が CH であり、 B_5 が CR^{10} であり、 R^6 および R^{10} がそれぞれ、ハロゲン（好ましくは塩素、臭素もしくはフッ素）、 C_1-C_3 ーアルキル、ハロゲンで置換された C_1-C_3 ーアルキル、 C_1-C_3 ーアルコキシまたはハロゲンで置換された C_1-C_3 ーアルコキシから選択される置換基であり、すべての他のパラメータが、段落 [85] および段落 [112] で定義される通りである。

10

【0161】

T2ーメチル

さらに好ましい実施形態は、式 (I) の化合物に関し、式中、 R^1 がメチルであり、T が T2 であり、T2 中の R^{11} が H であり、W が O であり、すべての他のパラメータが、段落 [85] および段落 [112] で定義される通りである。

【0162】

さらに好ましい実施形態は、式 (I) の化合物に関し、式中、 R^1 がメチルであり、T が T2 であり、T2 中の R^{11} が H であり、W が O であり、 A_1 が CR^2 であり、 A_2 が CR^3 または N であり、 A_3 が CR^4 であり、 A_4 が CR^5 であり、 B_1 が CR^6 であり、 B_2 が CR^7 であり、 B_3 が CR^8 であり、 B_4 が CR^9 であり、 B_5 が CR^{10} であり、すべての他のパラメータが、段落 [85] および段落 [112] で定義される通りである。

20

【0163】

さらに好ましい実施形態は、式 (I) の化合物に関し、式中、 R^1 がメチルであり、T が T2 であり、T2 中の R^{11} が H であり、W が O であり、 A_1 が CH であり、 A_2 が CH または N であり、 A_3 が CR^4 であり、 A_4 が CH であり、 B_1 が CR^6 であり、 B_2 が CH であり、 B_3 が CR^8 であり、 B_4 が CH であり、 B_5 が CR^{10} であり、 R^6 および R^{10} がそれぞれ、ハロゲン（好ましくは塩素、臭素もしくはフッ素）、 C_1-C_3 ーアルキル、ハロゲンで置換された C_1-C_3 ーアルキル、 C_1-C_3 ーアルコキシまたはハロゲンで置換された C_1-C_3 ーアルコキシから選択される置換基であり、すべての他のパラメータが、段落 [85] および段落 [112] で定義される通りである。

30

【0164】

さらに好ましい実施形態は、式 (I) の化合物に関し、式中、 R^1 がメチルであり、T が T2 であり、T2 中の R^{11} が H であり、W が O であり、 A_1 が CH であり、 A_2 が CH または N であり、 A_3 が CR^4 であり、 A_4 が CH であり、 B_1 が CR^6 であり、 B_2 が CH であり、 B_3 が CR^8 であり、 B_4 が CH であり、 B_5 が CR^{10} であり、 R^6 および R^{10} がそれぞれ、ハロゲン（好ましくは塩素、臭素もしくはフッ素）、 C_1-C_3 ーアルキル、ハロゲンで置換された C_1-C_3 ーアルキル、 C_1-C_3 ーアルコキシまたはハロゲンで置換された C_1-C_3 ーアルコキシから選択される置換基であり、すべての他のパラメータが、段落 [85] および段落 [112] で定義される通りである。

40

【0165】

T4ーメチル

さらに好ましい実施形態は、式 (I) の化合物に関し、式中、 R^1 がメチルであり、T が T4 であり、T4 中の R^{11} が H であり、W が O であり、すべての他のパラメータが、段落 [85] および段落 [112] で定義される通りである。

【0166】

さらに好ましい実施形態は、式 (I) の化合物に関し、式中、 R^1 がメチルであり、T が T4 であり、T4 中の R^{11} が H であり、W が O であり、 A_1 が CR^2 、 A_2 が CR^3

50

またはNであり、 A_3 が CR^4 であり、 A_4 が CR^5 であり、 B_1 が CR^6 であり、 B_2 が CR^7 であり、 B_3 が CR^8 であり、 B_4 が CR^9 であり、 B_5 が CR^{10} であり、すべての他のパラメータが、段落[85]および段落[112]で定義される通りである。

【0167】

さらに好ましい実施形態は、式(I)の化合物に関し、式中、 R^1 がメチルであり、TがT4であり、T4中の R^{11} がHであり、WがOであり、 A_1 がCHであり、 A_2 がCHまたはNであり、 A_3 が CR^4 であり、 A_4 がCHであり、 B_1 が CR^6 であり、 B_2 がChであり、 B_3 が CR^8 であり、 B_4 がCHであり、 B_5 が CR^{10} であり、 R^6 および R^{10} がそれぞれ、ハロゲン（好ましくは塩素、臭素もしくはフッ素）、 C_1-C_3 -アルキル、ハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルキル、 C_1-C_3 -アルコキシまたはハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルコキシから選択される置換基であり、すべての他のパラメータが、段落[85]および段落[112]で定義される通りである。

10

【0168】

さらに好ましい実施形態は、式(I)の化合物に関し、式中、 R^1 がメチルであり、TがT4であり、T4中の R^{11} がHであり、WがOであり、 A_1 がCHであり、 A_2 がCHまたはNであり、 A_3 が CR^4 であり、 A_4 がCHであり、 B_1 が CR^6 であり、 B_2 がCHであり、 B_3 が CR^8 であり、 B_4 がCHであり、 B_5 が CR^{10} であり、 R^6 および R^{10} がそれぞれ、ハロゲン（好ましくは塩素、臭素もしくはフッ素）、 C_1-C_3 -アルキル、ハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルキル、 C_1-C_3 -アルコキシまたはハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルコキシから選択される置換基であり、すべての他のパラメータが、段落[85]および段落[112]で定義される通りである。

20

【0169】

T22-メチル

さらに好ましい実施形態は、式(I)の化合物に関し、式中、 R^1 がメチルであり、TがT22であり、T22中の R^{11} がHであり、WがOであり、すべての他のパラメータが、段落[85]および段落[112]で定義される通りである。

【0170】

さらに好ましい実施形態は、式(I)の化合物に関し、式中、 R^1 がメチルであり、TがT22であり、T22中の R^{11} がHであり、WがOであり、 A_1 が CR^2 、 A_2 が CR^3 またはNであり、 A_3 が CR^4 であり、 A_4 が CR^5 であり、 B_1 が CR^6 であり、 B_2 が CR^7 であり、 B_3 が CR^8 であり、 B_4 が CR^9 であり、 B_5 が CR^{10} であり、すべての他のパラメータが、段落[85]および段落[112]で定義される通りである。

30

【0171】

さらに好ましい実施形態は、式(I)の化合物に関し、式中、 R^1 がメチルであり、TがT22であり、T22中の R^{11} がHであり、WがOであり、 A_1 がCHであり、 A_2 がCHまたはNであり、 A_3 が CR^4 であり、 A_4 がCHであり、 B_1 が CR^6 であり、 B_2 がCHであり、 B_3 が CR^8 であり、 B_4 がCHであり、 B_5 が CR^{10} であり、 R^6 および R^{10} がそれぞれ、ハロゲン（好ましくは塩素、臭素もしくはフッ素）、 C_1-C_3 -アルキル、ハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルキル、 C_1-C_3 -アルコキシまたはハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルコキシから選択される置換基であり、すべての他のパラメータが、段落[85]および段落[112]で定義される通りである。

40

【0172】

さらに好ましい実施形態は、式(I)の化合物に関し、式中、 R^1 がメチルであり、TがT22であり、T22中の R^{11} がHであり、WがOであり、 A_1 がCHであり、 A_2 がCHまたはNであり、 A_3 が CR^4 であり、 A_4 がCHであり、 B_1 が CR^6 であり、 B_2 がCHであり、 B_3 が CR^8 であり、 B_4 がCHであり、 B_5 が CR^{10} であり、 R^6 および R^{10} がそれぞれ、ハロゲン（好ましくは塩素、臭素もしくはフッ素）、 C_1-C_3 -アルキル、ハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルキル、 C_1-C_3 -アルコキシまたはハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルコキシから選択される置換基であり、すべ

50

ての他のパラメータが、段落〔85〕および段落〔112〕で定義される通りである。

【0173】

T23-メチル

さらに好ましい実施形態は、式(I)の化合物に関し、式中、 R^1 がメチルであり、TがT23であり、T23中の R^{11} がHであり、WがOであり、すべての他のパラメータが、段落〔85〕および段落〔0113〕ならびに以下の段落で定義される通りである。

【0174】

さらに好ましい実施形態は、式(I)の化合物に関し、式中、 R^1 がメチルであり、TがT23であり、T23中の R^{11} がHであり、WがOであり、 A_1 が CR^2 、 A_2 が CR^3 またはNであり、 A_3 が CR^4 であり、 A_4 が CR^5 であり、 B_1 が CR^6 であり、 B_2 が CR^7 であり、 B_3 が CR^8 であり、 B_4 が CR^9 であり、 B_5 が CR^{10} であり、すべての他のパラメータが、段落〔85〕および段落〔0113〕ならびに以下の段落で定義される通りである。

10

【0175】

さらに好ましい実施形態は、式(I)の化合物に関し、式中、 R^1 がメチルであり、TがT23であり、T23中の R^{11} がHであり、WがOであり、 A_1 がCHであり、 A_2 がCHまたはNであり、 A_3 が CR^4 であり、 A_4 がCHであり、 B_1 が CR^6 であり、 B_2 がCHであり、 B_3 が CR^8 であり、 B_4 がCHであり、 B_5 が CR^{10} であり、 R^6 および R^{10} がそれぞれ、ハロゲン（好ましくは塩素、臭素もしくはフッ素）、 C_1-C_3 -アルキル、ハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルキル、 C_1-C_3 -アルコキシまたはハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルコキシから選択される置換基であり、すべての他のパラメータが、段落〔85〕および段落〔0113〕ならびに以下の段落で定義される通りである。

20

【0176】

さらに好ましい実施形態は、式(I)の化合物に関し、式中、 R^1 がメチルであり、TがT23であり、T23中の R^{11} がHであり、WがOであり、 A_1 がCHであり、 A_2 がCHまたはNであり、 A_3 が CR^4 であり、 A_4 がCHであり、 B_1 が CR^6 であり、 B_2 がCHであり、 B_3 が CR^8 であり、 B_4 がCHであり、 B_5 が CR^{10} であり、 R^6 および R^{10} がそれぞれ、ハロゲン（好ましくは塩素、臭素もしくはフッ素）、 C_1-C_3 -アルキル、ハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルキル、 C_1-C_3 -アルコキシまたはハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルコキシから選択される置換基であり、すべての他のパラメータが、段落〔85〕および段落〔0113〕ならびに以下の段落で定義される通りである。

30

【0177】

T3-H

好ましい実施形態は、式(I)の化合物に関し、式中、 R^1 が水素(H)であり、すべての他のパラメータが、段落〔0113〕および以下の段落で定義される通りである。

【0178】

さらに好ましい実施形態は、式(I)の化合物に関し、式中、 R^1 がHであり、TがT3であり、T3中の R^{11} がHであり、WがOであり、すべての他のパラメータが、段落〔85〕および段落〔0113〕ならびに以下の段落で定義される通りである。

40

【0179】

さらに好ましい実施形態は、式(I)の化合物に関し、式中、 R^1 がHであり、TがT3であり、T3中の R^{11} がHであり、WがOであり、 A_1 が CR^2 、 A_2 が CR^3 またはNであり、 A_3 が CR^4 であり、 A_4 が CR^5 であり、 B_1 が CR^6 であり、 B_2 が CR^7 であり、 B_3 が CR^8 であり、 B_4 が CR^9 であり、 B_5 が CR^{10} であり、すべての他のパラメータが、段落〔85〕および段落〔0113〕ならびに以下の段落で定義される通りである。

【0180】

さらに好ましい実施形態は、式(I)の化合物に関し、式中、 R^1 がHであり、TがT

50

3であり、T 3中の R^{11} がHであり、WがOであり、 A_1 がCHであり、 A_2 がCHまたはNであり、 A_3 が CR^4 であり、 A_4 がCHであり、 B_1 が CR^6 であり、 B_2 がCHであり、 B_3 が CR^8 であり、 B_4 がCHであり、 B_5 が CR^{10} であり、 R^6 および R^{10} がそれぞれ、ハロゲン（好ましくは塩素、臭素もしくはフッ素）、 C_1-C_3 -アルキル、ハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルキル、 C_1-C_3 -アルコキシまたはハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルコキシから選択される置換基であり、すべての他のパラメータが、段落[85]および段落[0113]ならびに以下の段落で定義される通りである。

【0181】

さらに好ましい実施形態は、式(I)の化合物に関し、式中、 R^1 がHであり、TがT 3であり、T 3中の R^{11} がHであり、WがOであり、 A_1 がCHであり、 A_2 がCHまたはNであり、 A_3 が CR^4 であり、 A_4 がCHであり、 B_1 が CR^6 であり、 B_2 がCHであり、 B_3 が CR^8 であり、 B_4 がCHであり、 B_5 が CR^{10} であり、 R^6 および R^{10} がそれぞれ、ハロゲン（好ましくは塩素、臭素もしくはフッ素）、 C_1-C_3 -アルキル、ハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルキル、 C_1-C_3 -アルコキシまたはハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルコキシから選択される置換基であり、すべての他のパラメータが、段落[85]および段落[0113]ならびに以下の段落で定義される通りである。

【0182】

T 2-H

さらに好ましい実施形態は、式(I)の化合物に関し、式中、 R^1 がHであり、TがT 2であり、T 2中の R^{11} がHであり、WがOであり、すべての他のパラメータが、段落[85]および段落[0113]ならびに以下の段落で定義される通りである。

【0183】

さらに好ましい実施形態は、式(I)の化合物に関し、式中、 R^1 がHであり、TがT 2であり、T 2中の R^{11} がHであり、WがOであり、 A_1 が CR^2 、 A_2 が CR^3 またはNであり、 A_3 が CR^4 であり、 A_4 が CR^5 であり、 B_1 が CR^6 であり、 B_2 が CR^7 であり、 B_3 が CR^8 であり、 B_4 が CR^9 であり、 B_5 が CR^{10} であり、すべての他のパラメータが、段落[85]および段落[0113]ならびに以下の段落で定義される通りである。

【0184】

さらに好ましい実施形態は、式(I)の化合物に関し、式中、 R^1 がHであり、TがT 2であり、T 2中の R^{11} がHであり、WがOであり、 A_1 がCHであり、 A_2 がCHまたはNであり、 A_3 が CR^4 であり、 A_4 がCHであり、 B_1 が CR^6 であり、 B_2 がCHであり、 B_3 が CR^8 であり、 B_4 がCHであり、 B_5 が CR^{10} であり、 R^6 および R^{10} がそれぞれ、ハロゲン（好ましくは塩素、臭素もしくはフッ素）、 C_1-C_3 -アルキル、ハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルキル、 C_1-C_3 -アルコキシまたはハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルコキシから選択される置換基であり、すべての他のパラメータが、段落[85]および段落[0113]ならびに以下の段落で定義される通りである。

【0185】

さらに好ましい実施形態は、式(I)の化合物に関し、式中、 R^1 がHであり、TがT 2であり、T 2中の R^{11} がHであり、WがOであり、 A_1 がCHであり、 A_2 がCHまたはNであり、 A_3 が CR^4 であり、 A_4 がCHであり、 B_1 が CR^6 であり、 B_2 がCHであり、 B_3 が CR^8 であり、 B_4 がCHであり、 B_5 が CR^{10} であり、 R^6 および R^{10} がそれぞれ、ハロゲン（好ましくは塩素、臭素もしくはフッ素）、 C_1-C_3 -アルキル、ハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルキル、 C_1-C_3 -アルコキシまたはハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルコキシから選択される置換基であり、すべての他のパラメータが、段落[85]および段落[0113]ならびに以下の段落で定義される通りである。

【0186】

T 4-H

さらに好ましい実施形態は、式 (I) の化合物に関し、式中、 R^1 が H であり、T が T 4 であり、T 4 中の R^{11} が H であり、W が O であり、すべての他のパラメータが、段落 [85] および段落 [0113] ならびに以下の段落で定義される通りである。

【0187】

さらに好ましい実施形態は、式 (I) の化合物に関し、式中、 R^1 が H であり、T が T 4 であり、T 4 中の R^{11} が H であり、W が O であり、 A_1 が CR^2 、 A_2 が CR^3 または N であり、 A_3 が CR^4 であり、 A_4 が CR^5 であり、 B_1 が CR^6 であり、 B_2 が CR^7 であり、 B_3 が CR^8 であり、 B_4 が CR^9 であり、 B_5 が CR^{10} であり、すべての他のパラメータが、段落 [85] および段落 [0113] ならびに以下の段落で定義される通りである。

10

【0188】

さらに好ましい実施形態は、式 (I) の化合物に関し、式中、 R^1 が H であり、T が T 4 であり、T 4 中の R^{11} が H であり、W が O であり、 A_1 が CH であり、 A_2 が CH または N であり、 A_3 が CR^4 であり、 A_4 が CH であり、 B_1 が CR^6 であり、 B_2 が CH であり、 B_3 が CR^8 であり、 B_4 が CH であり、 B_5 が CR^{10} であり、 R^6 および R^{10} がそれぞれ、ハロゲン（好ましくは塩素、臭素もしくはフッ素）、 C_1-C_3 -アルキル、ハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルキル、 C_1-C_3 -アルコキシまたはハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルコキシから選択される置換基であり、すべての他のパラメータが、段落 [85] および段落 [0113] ならびに以下の段落で定義される通りである。

20

【0189】

さらに好ましい実施形態は、式 (I) の化合物に関し、式中、 R^1 が H であり、T が T 4 であり、T 4 中の R^{11} が H であり、W が O であり、 A_1 が CH であり、 A_2 が CH または N であり、 A_3 が CR^4 であり、 A_4 が CH であり、 B_1 が CR^6 であり、 B_2 が CH であり、 B_3 が CR^8 であり、 B_4 が CH であり、 B_5 が CR^{10} であり、 R^6 および R^{10} がそれぞれ、ハロゲン（好ましくは塩素、臭素もしくはフッ素）、 C_1-C_3 -アルキル、ハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルキル、 C_1-C_3 -アルコキシまたはハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルコキシから選択される置換基であり、すべての他のパラメータが、段落 [85] および段落 [0113] ならびに以下の段落で定義される通りである。

30

【0190】

T 22-H

さらに好ましい実施形態は、式 (I) の化合物に関し、式中、 R^1 が H であり、T が T 22 であり、T 22 中の R^{11} が H であり、W が O であり、すべての他のパラメータが、段落 [85] および段落 [0113] ならびに以下の段落で定義される通りである。

【0191】

さらに好ましい実施形態は、式 (I) の化合物に関し、式中、 R^1 が H であり、T が T 22 であり、T 22 中の R^{11} が H であり、W が O であり、 A_1 が CR^2 、 A_2 が CR^3 または N であり、 A_3 が CR^4 であり、 A_4 が CR^5 であり、 B_1 が CR^6 であり、 B_2 が CR^7 であり、 B_3 が CR^8 であり、 B_4 が CR^9 であり、 B_5 が CR^{10} であり、すべての他のパラメータが、段落 [85] および段落 [0113] ならびに以下の段落で定義される通りである。

40

【0192】

さらに好ましい実施形態は、式 (I) の化合物に関し、式中、 R^1 が H であり、T が T 22 であり、T 22 中の R^{11} が H であり、W が O であり、 A_1 が CH であり、 A_2 が CH または N であり、 A_3 が CR^4 であり、 A_4 が CH であり、 B_1 が CR^6 であり、 B_2 が CH であり、 B_3 が CR^8 であり、 B_4 が CH であり、 B_5 が CR^{10} であり、 R^6 および R^{10} がそれぞれ、ハロゲン（好ましくは塩素、臭素もしくはフッ素）、 C_1-C_3

50

ーアルキル、ハロゲンで置換された C_1-C_3 ーアルキル、 C_1-C_3 ーアルコキシまたはハロゲンで置換された C_1-C_3 ーアルコキシから選択される置換基であり、すべての他のパラメータが、段落 [85] および段落 [0113] ならびに以下の段落で定義される通りである。

【0193】

さらに好ましい実施形態は、式 (I) の化合物に関し、式中、 R^1 が H であり、T が T22 であり、T22 中の R^{11} が H であり、W が O であり、 A_1 が CH であり、 A_2 が CH または N であり、 A_3 が CR^4 であり、 A_4 が CH であり、 B_1 が CR^6 であり、 B_2 が CH であり、 B_3 が CR^8 であり、 B_4 が CH であり、 B_5 が CR^{10} であり、 R^6 および R^{10} がそれぞれ、ハロゲン（好ましくは塩素、臭素もしくはフッ素）、 C_1-C_3 ーアルキル、ハロゲンで置換された C_1-C_3 ーアルキル、 C_1-C_3 ーアルコキシまたはハロゲンで置換された C_1-C_3 ーアルコキシから選択される置換基であり、すべての他のパラメータが、段落 [85] および段落 [0113] ならびに以下の段落で定義される通りである。

【0194】

T23-H

さらに好ましい実施形態は、式 (I) の化合物に関し、式中、 R^1 が H であり、T が T23 であり、T23 中の R^{11} が H であり、W が O であり、すべての他のパラメータが、段落 [85] および段落 [0113] ならびに以下の段落で定義される通りである。

【0195】

さらに好ましい実施形態は、式 (I) の化合物に関し、式中、 R^1 が H であり、T が T23 であり、T23 中の R^{11} が H であり、W が O であり、 A_1 が CR^2 、 A_2 が CR^3 または N であり、 A_3 が CR^4 であり、 A_4 が CR^5 であり、 B_1 が CR^6 であり、 B_2 が CR^7 であり、 B_3 が CR^8 であり、 B_4 が CR^9 であり、 B_5 が CR^{10} であり、すべての他のパラメータが、段落 [85] および段落 [0113] ならびに以下の段落で定義される通りである。

【0196】

さらに好ましい実施形態は、式 (I) の化合物に関し、式中、 R^1 が H であり、T が T23 であり、T23 中の R^{11} が H であり、W が O であり、 A_1 が CH であり、 A_2 が CH または N であり、 A_3 が CR^4 であり、 A_4 が CH であり、 B_1 が CR^6 であり、 B_2 が CH であり、 B_3 が CR^8 であり、 B_4 が CH であり、 B_5 が CR^{10} であり、 R^6 および R^{10} がそれぞれ、ハロゲン（好ましくは塩素、臭素もしくはフッ素）、 C_1-C_3 ーアルキル、ハロゲンで置換された C_1-C_3 ーアルキル、 C_1-C_3 ーアルコキシまたはハロゲンで置換された C_1-C_3 ーアルコキシから選択される置換基であり、すべての他のパラメータが、段落 [85] および段落 [0113] ならびに以下の段落で定義される通りである。

【0197】

さらに好ましい実施形態は、式 (I) の化合物に関し、式中、 R^1 が H であり、T が T23 であり、T23 中の R^{11} が H であり、W が O であり、 A_1 が CH であり、 A_2 が CH または N であり、 A_3 が CR^4 であり、 A_4 が CH であり、 B_1 が CR^6 であり、 B_2 が CH であり、 B_3 が CR^8 であり、 B_4 が CH であり、 B_5 が CR^{10} であり、 R^6 および R^{10} がそれぞれ、ハロゲン（好ましくは塩素、臭素もしくはフッ素）、 C_1-C_3 ーアルキル、ハロゲンで置換された C_1-C_3 ーアルキル、 C_1-C_3 ーアルコキシまたはハロゲンで置換された C_1-C_3 ーアルコキシから選択される置換基であり、すべての他のパラメータが、段落 [85] および段落 [0113] ならびに以下の段落で定義される通りである。

【0198】

さらに好ましい実施形態は、式 (I) の化合物に関し、式中、 B_1 が $C-R^6$ であり、 R^6 がハロゲン（好ましくは塩素もしくはフッ素）、 C_1-C_4 ーアルキル、 C_1-C_4 ーアルコキシ、 C_1-C_4 ーハロアルキル（好ましくは過フッ化 C_1-C_4 ーアルキル）

、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ（好ましくは過フッ化 C_1-C_4 -アルコキシ）、 C_1-C_4 -アルキルスルファニルまたは C_1-C_4 -アルキルスルホニルである。

【0199】

本発明において好適な本発明の化合物の塩、例えば、塩基を含む塩または酸付加塩は、すべて慣例的に非毒性の塩であり、好ましくは、農業的および／または生理学的に許容される塩である。無機塩基を含む塩、例えば、アルカリ金属塩（例えば、ナトリウム塩、カリウム塩もしくはセシウム塩）、アルカリ土類金属塩（例えば、カルシウム塩もしくはマグネシウム塩）、アンモニウム塩または有機塩基、特に有機アミンを含む塩、例えば、トリエチルアンモニウム、ジシクロヘキシルアンモニウム、 N, N' -ジベンジルエチレンジアンモニウム、ピリジニウム、ピコリニウムもしくはエタノールアンモニウム塩、無機酸を付加した塩（例えば、塩酸塩、臭化水素酸塩、ジヒドロ硫酸塩、トリヒドロ硫酸塩もしくはリン酸塩）、有機カルボン酸もしくは有機スルホン酸を含む塩（例えば、ギ酸塩、酢酸塩、トリフルオロ酢酸塩、マレイン酸塩、酒石酸塩、メタンスルホン酸塩、ベンゼンスルホン酸塩もしくは4-トルエンスルホン酸塩）が好ましい。ｔ-アミン、例えば、本発明の化合物のうちのいくつかは、 N -酸化物を形成することができ、本発明の塩も同様であることが周知である。

10

【0200】

置換基の性質によって、式（I）の化合物は、幾何異性体および／もしくは光学活性異性体、または異なる組成物中の対応する異性体混合物の形態であってもよい。これらの立体異性体は、例えば、鏡像異性体、ジアステレオマー、アトロプ異性体または幾何異性体である。したがって、本発明は、純粋な立体異性体およびこれらの異性体の任意の混合物の両方を包含する。

20

【0201】

本発明はまた、動物害虫を防除するための方法に関し、式（I）の化合物は、動物害虫および／またはそれらの生息地で作用する。動物害虫の防除は、好ましくは農業および林業において、ならびに原料保護において行われる。好ましくは、人体もしくは動物体の外科処置または治療処置のための方法および人体もしくは動物体上で行われる診断方法は除かれる。

【0202】

本発明はさらに、殺虫剤、特に作物保護剤としての式（I）の化合物の使用に関する。

30

【0203】

本出願の文脈において、「殺虫剤」という用語は、「作物保護剤」という用語も常に包含する。

【0204】

良好な植物耐性、好ましい恒温動物毒性および良好な環境適合性を持つ式（I）の化合物は、植物および植物器官の生物的ストレス要因および非生物的ストレス要因からの保護、収穫高の増加、収穫される原料の品質の改善、ならびに動物害虫、特に昆虫、クモ形類動物、蠕虫、線虫および軟体動物の防除に適しており、農業において、園芸学において、家畜学において、水文化において、森林において、庭園およびレジャー施設において、保管された製品および原料の保護において、ならびに衛生区域において見られる。それらは、好ましくは殺虫剤として使用することができる。それらは、通常、感受性なおよび耐性のある種に対して、ならびに発達段階のすべてまたは一部に対して有効である。上述の害虫には、

40

【0205】

節足動物門、特にクモ形綱の害虫、例えば、アカルス属（*Acarus* spp.）、例えば、アカルス・シロ（*Acarus siro*）、アセリア・クロ（*Aceria kuko*）、アセリア・シェルドニ（*Aceria sheldoni*）、アクロプス属（*Aculops* spp.）、アクルス属（*Aculus* spp.）、例えば、アクルス・フォッケウイ（*Aculus fockeui*）、アクルス・シュレクテンダリ（*Aculus schlechtendali*）、アンブリオンマ属（*Amblyomm*

50

a spp.)、アンフィテトラニクス・ヴィエネンシス (*Amphitetranychus viennensis*)、アルガス属 (*Argas* spp.)、ボオフィルス属 (*Boophilus* spp.)、ブレビパルプス属 (*Brevipalpus* spp.)、例えば、ブレビパルプス・ホエニシス (*Brevipalpus phoenicis*)、ブリオビア・グラビナム (*Bryobia graminum*)、ブリオビア・プラエチオーサ (*Bryobia praetiosa*)、セントルロイデス属 (*Centruroides* spp.)、コリオプテス属 (*Choriotptes* spp.)、デルマニュッサス・ガッリナエ (*Dermanyssus gallinae*)、デルマトファゴイデス・プテロニッシナス (*Dermatophagoides pteronyssinus*)、デルマトファゴイデス・ファリナエ (*Dermatophagoides farinae*)、デルマセントル属 (*Dermacentor* spp.)、エオテトラニクス属 (*Eotetranychus* spp.)、例えば、エオテトラニクス・ヒコリエ (*Eotetranychus hicoriae*)、エピトリメルス・ピリ (*Epitrimerus pyri*)、エウテトラニクス属 (*Eutetranychus* spp.)、例えば、エウテトラニクス・バンクシ (*Eutetranychus banksi*)、エリオフィエス属 (*Eriophyes* spp.)、例えば、エリオフィエス・ピリ (*Eriophyes pyri*)、グリシファグス・ドメスティクス (*Glycyphagus domesticus*)、ハロチデウス・デストルクトル (*Halotydeus destructor*)、ヘミタルソネムス属 (*Hemitarsonemus* spp.)、例えば、ヘミタルソネムス・レイタス (*Hemitarsonemus latus*) (=ポリファゴタルソネムス・レイタス (*Polyphogotarsonemus latus*))、ヒアロンマ属 (*Hyalomma* spp.)、イクソデス属 (*Ixodes* spp.)、ラトロデクツス属 (*Latrodectus* spp.)、ロクソスセレス属 (*Loxosceles* spp.)、ニュートロムビクラ・オータムナリス (*Neutrombicula autumnalis*)、ヌフェルサ属 (*Nuphersa* spp.)、オリゴニクス属 (*Oligonychus* spp.)、例えば、オリゴニクス・コニフェラルム (*Oligonychus coniferarum*)、オリゴニクス・イリシス (*Oligonychus ilicis*)、オリゴニクス・インディカス (*Oligonychus indicus*)、オリゴニクス・マンジフェルス (*Oligonychus mangiferus*)、オリゴニクス・プラテンシス (*Oligonychus pratensis*)、オリゴニクス・プニカエ (*Oligonychus punicae*)、オリゴニクス・ヨサルシ (*Oligonychus yothersi*)、オルニトドルス属 (*Ornithodoros* spp.)、オルニトニュッサス属 (*Ornithonyssus* spp.)、パノニクス属 (*Panonychus* spp.)、例えば、パノニクス・シトリ (*Panonychus citri*) (=メタテトラニクス・シトリ (*Metatetranychus citri*))、パノニクス・ウルミ (*Panonychus ulmi*) (=メタテトラニクス・ウルミ (*Metatetranychus ulmi*))、フィロコプツルタ・オレイボラ (*Phyllocoptruta oleivora*)、プラチテトラニクス・マルチジジツリ (*Platytetranychus multidentigulii*)、ポリファゴタルソネムス・レイタス (*Polyphogotarsonemus latus*)、プソロプテス属 (*Psoroptes* spp.)、リピセファルス属 (*Rhipicephalus* spp.)、リゾグリフス属 (*Rhizoglyphus* spp.)、サルコプテス属 (*Sarcoptes* spp.)、スコーピオマウルス (*Scorpio maurus*)、ステネオタルソネムス属 (*Steneotarsonemus* spp.)、ステネオタルソネムス・スピッキ (*Steneotarsonemus spiniki*)、タルソネムス属 (*Tarsonemus* spp.)、例えば、タルソネムス・コンフサス (*Tarsonemus confusus*)、タルソネムス・パリドゥス (*Tarsonemus pallidus*)、テトラニクス属 (*Tetranychus* spp.)、例えば、テトラニクス・カナデン

シス (*Tetranychus canadensis*)、テトラニクス・キンナバリヌス (*Tetranychus cinnabarinus*)、テトラニクス・ツルケスタニ (*Tetranychus turkestanii*)、テトラニクス・ウルティカエ (*Tetranychus urticae*)、トロムビクラ・アルフレデグエシ (*Trombicula alfreddugesi*)、バエジョビス属 (*Vaejovis* spp.)、バサテス・リコベルシシ (*Vasates lycopersici*)；
 唇脚綱の、例えば、ジムカデ属、スクティゲラ属；
 粘管目または粘管綱の、例えば、オニチウルス・アルマツス (*Onychiurus armatus*)；スミンスルス・ビリジス (*Sminthurus viridis*)；
 倍脚綱の、例えば、ブラニウルス・グッツラツス (*Blaniulus guttulatus*)；
 昆虫綱の、例えば、ゴキブリ目の、例えば、ブラッタ・オリエンタリス (*Blatta orientalis*)、ブラッタ・アサヒナイ (*Blattella asahinai*)、ブラッタ・ゲルマニカ (*Blattella germanica*)、レウコファエア・マデラエ (*Leucophaea maderae*)、パンクロラ属 (*Panchlora* spp.)、パルコブラッタ属 (*Parcoblatta* spp.)、ペリプラネタ属 (*Periplaneta* spp.)、例えば、ペリプラネタ・アメリカナ (*Periplaneta americana*)、ペリプラネタ・アウストララシアエ (*Periplaneta australasiae*)、スペラ・ロンギパルパ (*Suppella longipalpa*)；
 鞘翅目の、例えば、アカリマ・ビタツム (*Acalymma vittatum*)、アカントセリデス・オブテクツス (*Acanthoscelides obtectus*)、アドレッツス属 (*Adoretus* spp.)、アゲラスチカ・アルニ (*Agelastica alni*)、アグリオテス属 (*Agriotes* spp.)、例えば、アグリオテス・リネアツス (*Agriotes lineatus*)、アグリオテス・マンカス (*Agriotes mancus*)、アルフィトビウス・ジアペリヌス (*Alphitobius diaperinus*)、アンフィマロン・ソルスチチアリス (*Amphimallon solstitialis*)、アノビウム・プンクタツム (*Anobium punctatum*)、アノプロホラ属 (*Anoplophora* spp.)、アントノムス属 (*Anthonomus* spp.)、例えば、アントノムス グランジス (*Anthonomus grandis*)、アントレヌス属 (*Anthrenus* spp.)、アピオン属 (*Apion* spp.)、アボゴニア属 (*Apogonia* spp.)、アトマリア属 (*Atomaria* spp.)、例えば、アトマリア・リネアリス (*Atomaria linearis*)、アタゲヌス属 (*Attagenus* spp.)、バリス・カエルレセンス (*Baris caerulescens*)、ブルキジウス・オブテクツス (*Bruchidius obtectus*)、ブルクス属 (*Bruchus* spp.)、例えば、ブルクス・ピソルム (*Bruchus pisorum*)、ブルクス・ルフィマヌス (*Bruchus rufimanus*)、カシダ属 (*Cassida* spp.)、セロトマ・トリフルカタ (*Cerotoma trifurcata*)、セウトリンクス属 (*Ceutorrhynchus* spp.)、例えば、セウトリンクス・アシミリス (*Ceutorrhynchus assimilis*)、セウトリンクス・クアドリデンス (*Ceutorrhynchus quadridens*)、セウトリンクス・ラパエ (*Ceutorrhynchus rapae*)、カエトクネマ属 (*Chaetocnema* spp.)、例えば、カエトクネマ・コンフィニス (*Chaetocnema confinis*)、カエトクネマ・デンティクラタ (*Chaetocnema denticulata*)、カエトクネマ・エクチパ (*Chaetocnema ectypa*)、クレオヌス・メンジクス (*Cleonus mendicus*)、コノデルス属 (*Conoderus* spp.)、コスモポリテス属 (*Cosmopolites* spp.)、例えば、コスモポリテス・ソルジドス (*Cosmopolites sordidus*)、コステリトラ・ゼアランジカ (*Costelyt*

ra zealandica)、クテニセラ属 (*Ctenicera* spp.)、クル
 クリオ属 (*Curculio* spp.)、例えば、クルクリオ・カルエ (*Curculio caryae*)、クルクリオ・カルヤトリペス (*Curculio caryatrypes*)、クルクリオ・オブツス (*Curculio obtusus*)、クルクリオ・サイ (*Curculio sayi*)、クリプトレステス・フェルギネウス (*Cryptolestes ferrugineus*)、クリプトレステス・プシルス (*Cryptolestes pusillus*)、クリプトリンクス・ラパチ (*Cryptorhynchus lapathi*)、クリプトリンクス・マンガフェラエ (*Cryptorhynchus mangiferae*)、シリンドロコプツルス属 (*Cylindrocopturus* spp.)、シリンドロコプツルス・アドスペルサス (*Cylindrocopturus adspersus*)、シリンドロコプツルス・フルネッシ (*Cylindrocopturus furnissi*)、デルメステス属 (*Dermestes* spp.)、ジアブロチカ属 (*Diabrotica* spp.)、例えば、ジアブロチカ・バルテアタ (*Diabrotica balteata*)、ジアブロチカ・バルベリ (*Diabrotica barberi*)、ジアブロチカ・ウンデシンプンクタタ・ホワルジ (*Diabrotica undecimpunctata howardi*)、ジアブロチカ・ウンデシンプンクタタ・ウンデシンプンクタタ (*Diabrotica undecimpunctata undecimpunctata*)、ジ
 アブロチカ・ビルギフェラ・ビルギフェラ (*Diabrotica virgifera virgifera*)、ジアブロチカ・ビルギフェラ・ゼアエ (*Diabrotica virgifera zeae*)、ジコクロシス属 (*Dichocrocis* spp.)、ジクラジスパ・アルミゲラ (*Dicladispa armigera*)、ジロボ
 デルス属 (*Diloboderus* spp.)、エピラクナ属 (*Epilachna* spp.)、例えば、エピラクナ・ボレアリス (*Epilachna borealis*)、エピラクナ・バリベチス (*Epilachna varivestis*)、エピトリクス属 (*Epitrix* spp.)、例えば、エピトリクス・ククメリス (*Epitrix cucumeris*)、エピトリクス・フスクラ (*Epitrix fuscula*)、エピトリクス・ヒルチペンニス (*Epitrix hirtipennis*)、エ
 ピトリクス・スブクリニタ (*Epitrix subcrinita*)、エピトリクス・ツベリス (*Epitrix tuberis*)、ファウスチヌス属 (*Faustinus* spp.)、ギビウム・プシロイデス (*Gibbium psylloides*)、グ
 ナトセルス・コルヌツス (*Gnathocerus cornutus*)、ヘルラ・ウンダリス (*Hellula undalis*)、ヘテロニクス・アラトル (*Heteronychus arator*)、ヘテロニクス属 (*Heteronyx* spp.)、ヒラ
 モルファ・エレガンス (*Hylamorpha elegans*)、ヒロトルペス・バユルス (*Hylotrupes bajulus*)、ヒペラ・ポストチカ (*Hypera postica*)、ヒポメセス・スクアモス (*Hypomeces squamosus*)、ヒポテネムス属 (*Hypothenemus* spp.)、例えば、ヒポテネムス・ハムペイ (*Hypothenemus hampei*)、ヒポテネムス・オブスクルス (*Hypothenemus obscurus*)、ヒポテネムス・プベセン (*Hypothenemus pubescens*)、ラクノステルナ・コンサンギネア (*Lachnosterma consanguinea*)、ラシオデルマ・セリコルネ (*Lasioderma serricornis*)、ラテチクス・オリゼ (*Latheticus oryzae*)、ラトリジウス属 (*Lathridius* spp.)、レマ属 (*Lema* spp.)、レプチノタルサ・デセムリネアタ (*Leptinotarsa decemlineata*)、ロイコプテラ属 (*Leucoptera* spp.)、例えば、ロイコプテラ・コフェーラ (*Leucoptera coffeella*)、リソロプト
 ルス・オリゾフィルス (*Lissorhoptrus oryzophilus*)、リクス属 (*Lixus* spp.)、ルペロモルファ・キサントデラ (*Luperomorpha xanthodera*)、ルペロデス属 (*Luperodes* spp.)、リ

クツス属 (*Lyctus* spp.)、メガセリス属 (*Megascelis* spp.)、メラノツス属 (*Melanotus* spp.)、例えば、メラノツス・ロングルス・オレゴネンシス (*Melanotus longulus oregonensis*)、メリゲテス・エネウス (*Meligethes aeneus*)、メロロンタ属 (*Melolontha* spp.)、例えば、メロロンタ・メロロンタ (*Melolontha melolontha*)、ミグドルス属 (*Migdolus* spp.)、モノカムス属 (*Monochamus* spp.)、ナウバクツス・キサントグラフス (*Naupactus xanthographus*)、ネクロビア属 (*Necrobia* spp.)、ニプツス・ホロレウカス (*Niptus hololeucus*)、オリクテス・リノセロス (*Oryctes rhinoceros*)、オリゼフィルス・スリナメンシス (*Oryzaephilus surinamensis*)、オリザファグス・オリゼ (*Oryzaphagus oryzae*)、オチオリンクス属 (*Otiorthynchus* spp.)、例えば、オチオリンクス・クリブリコリス (*Otiorthynchus cribricollis*)、オチオリンクス・リグスチシ (*Otiorthynchus ligustici*)、オチオリンクス・オバツス (*Otiorthynchus ovatus*)、オチオリンクス・ルゴソストリアルス (*Otiorthynchus rugosostriatus*)、オチオリンクス・スルカツス (*Otiorthynchus sulcatus*)、オキシセトニア・ジュクンダ (*Oxycetonia jucunda*)、ファエドン・コクレアリエ (*Phaedon cochleariae*)、フィロファガ属 (*Phyllophaga* spp.)、フィロファガ・ヘレリ (*Phyllophaga helleri*)、フィロトレタ属 (*Phyllotreta* spp.)、例えば、フィロトレタ・アルモラシエ (*Phyllotreta armoraciae*)、フィロトレタ・プシラ (*Phyllotreta pusilla*)、フィロトレタ・ラモサ (*Phyllotreta ramosa*)、フィロトレタ・ストリオラタ (*Phyllotreta striolata*)、ポピリア・ジャポニカ (*Popillia japonica*)、プレムノトリペス属 (*Premnotrypes* spp.)、プロステファヌス・トルンカツス (*Prostephanus truncatus*)、プシリオデス属 (*Psylliodes* spp.)、例えば、プシリオデス・アフニス (*Psylliodes affinis*)、プシリオデス・クリソセファラ (*Psylliodes chrysocephala*)、プシリオデス・パンクツラタ (*Psylliodes punctulata*)、プチヌス属 (*Ptinus* spp.)、リゾビウス・ベントラリス (*Rhizobius ventralis*)、リゾベルタ・ドミニカ (*Rhizopertha dominica*)、シトフィルス属 (*Sitophilus* spp.)、例えば、シトフィルス・グラナリウス (*Sitophilus granarius*)、シトフィルス・リネアリス (*Sitophilus linearis*)、シトフィルス・オリゼ (*Sitophilus oryzae*)、シトフィルス・ゼアマイス (*Sitophilus zeamais*)、属 (*Sphenophorus* spp.)、ステゴビウム・パニセウム (*Stegobium paniceum*)、ステルネクス属 (*Sternechus* spp.)、例えば、ステルネクス・パルダツス (*Sternechus paludatus*)、シンフィレテス属 (*Symphyletes* spp.)、タニメクス属 (*Tanymecus* spp.)、例えば、タニメクス・ジラチコリス (*Tanymecus dilaticollis*)、タニメクス・インジクス (*Tanymecus indicus*)、タニメクス・パリアツス (*Tanymecus palliatus*)、テネブリオ・モリトル (*Tenebrio molitor*)、テネブリオイデス・マウレタニクス (*Tenebrio ides mauretanicus*)、トリボリウム属 (*Tribolium* spp.)、例えば、トリボリウム・アウダクス (*Tribolium audax*)、トリボリウム・カスタネウム (*Tribolium castaneum*)、トリボリウム・コン
 フスム (*Tribolium confusum*)、トロゴデルマ属 (*Trogoder*

ma spp.)、チキウス属 (*Tychius* spp.)、キシロトレクス属 (*Xylotrechus* spp.)、ザブルス属 (*Zabrus* spp.)、例えば、ザブルス・テネブリオイデス (*Zabrus tenebrioides*) ;
 双翅目の、例えば、アエデス属 (*Aedes* spp.)、例えば、アエデス・アエジプチ (*Aedes aegypti*)、アエデス・アルボピクトゥス (*Aedes albopictus*)、アエデス・スチクチクス (*Aedes sticticus*)、アエデス・ベクスアン (*Aedes vexans*)、アグロミザ属 (*Agromyza* spp.)、例えば、アグロミザ・フロンテラ (*Agromyza frontella*)、アグロミザ・パルヴィコルニス (*Agromyza parvicornis*)、アナストレファ属 (*Anastrepha* spp.)、アノフェレス属 (*Anopheles* spp.)、例えば、アノフェレス・クアドリマクラツス (*Anopheles quadrimaculatus*)、アノフェレス・ガンビエ (*Anopheles gambiae*)、アスホンジリア属 (*Asphondylia* spp.)、バクトロセラ属 (*Bactrocera* spp.)、例えば、バクトロセラ・ククルビタエ (*Bactrocera cucurbitae*)、バクトロセラ・ドルサイス (*Bactrocera dorsalis*)、バクトロセラ・オレア (*Bactrocera oleae*)、ビビオ・ホルツラヌス (*Bibio hortulanus*)、カリフォラ・エリトロセファラ (*Calliphora erythrocephala*)、カリフォラ・ビシナ (*Calliphora vicina*)、セラチチス・カピタタ (*Ceratitis capitata*)、キロノムス属 (*Chironomus* spp.)、クリソミア属 (*Chrysomya* spp.)、クリソプス属 (*Chrysops* spp.)、クリソゾナ・プルビアリス (*Chrysosona pluvialis*)、コクリオミア属 (*Cochliomya* spp.)、コンタリニア属 (*Contarinia* spp.)、例えば、コンタリニア・ジョンソニ (*Contarinia johnsoni*)、コンタリニア・ナスツルチ (*Contarinia nasturtii*)、コンタリニア・ピリボラ (*Contarinia pyrivora*)、コンタリニア・スクルジ (*Contarinia schulzi*)、コンタリニア・ソルギコラ (*Contarinia sorghicola*)、コンタリニア・トリチシ (*Contarinia tritici*)、コルジロビア・アントロポファガ (*Cordylobia anthropophaga*)、クリコトプス・シルベストリス (*Cricotopus sylvestris*)、クレクス属 (*Culex* spp.)、例えば、クレクス・ピピエンス (*Culex pipiens*)、クレクス・クインケファスキアトゥス (*Culex quinquefasciatus*)、クリコイデス属 (*Culicoides* spp.)、クリセタ属 (*Culiseta* spp.)、クテレブラ属 (*Cuterebra* spp.)、ダクス・オレアエ (*Dacus oleae*)、ダシネウラ属 (*Dasineura* spp.)、例えば、ダシネウラ・ブラッシカ (*Dasineura brassicae*)、デリア属 (*Delia* spp.)、例えば、デリア・アンティクア (*Delia antiqua*)、デリア・コアルクタータ (*Delia coarctata*)、デリア・フロリレーガ (*Delia florilega*)、デリア・プラツラ (*Delia platura*)、デリア・ラディカム (*Delia radicum*)、デルマトビア・ホミニス (*Dermatobia hominis*)、ドロソフィラ属 (*Drosophila* spp.)、例えば、ドロソフィラ・メラノガステル (*Drosophila melanogaster*)、ドロソフィラ・スズキイ (*Drosophila suzukii*)、エキノクネムス属 (*Echinocnemeus* spp.)、ファニア属 (*Fannia* spp.)、ガステロフィルス属 (*Gasterophilus* spp.)、グロシナ属 (*Glossina* spp.)、ヘマトポタ属 (*Haematopota* spp.)、ヒドレリア属 (*Hydrellia* spp.)、ヒドレリア・グリセオラ (*Hydrellia griseola*)、ヒレミア属 (*Hylemya* spp.)、ヒポボスカ属 (*Hippobosca* spp.)、ヒポデルマ属 (*Hypoderma* spp.)、リリオミザ属 (*Liriomyza* spp.)、

za spp.)、例えば、リリオミザ・ブラシカエ (*Liriomyza brassicae*)、リリオミザ・フイドブレンシス (*Liriomyza huidobrensis*)、リリオミザ・サチバエ (*Liriomyza sativae*)、ルシリア属 (*Lucilia* spp.)、例えば、ルシリア・クプリナ (*Lucilia cuprina*)、ルトゾミア属 (*Lutzomyia* spp.)、マンソニア属 (*Mansonia* spp.)、ムスカ属 (*Musca* spp.)、例えば、ムスカ・ドメスチカ (*Musca domestica*)、ムスカ・ドメスチカ・ビシナ (*Musca domestica vicina*)、オエストルス属 (*Oestrus* spp.)、オシネラ・フリト (*Oscinella frit*)、パラタニタルスス属 (*Paratanytarsus* spp.)、パララウテルボルニエラ・スブシンクタ (*Paralauterborniella subcincta*)、ペゴミア属 (*Pegomya* spp.)、例えば、ペゴミア・ベタエ (*Pegomya betae*)、ペゴミア・ヒョスシアミ (*Pegomya hyoscyami*)、ペゴミア・ルビボラ (*Pegomya rubivora*)、フレボトムス属 (*Phlebotomus* spp.)、フォルビア属 (*Phorbia* spp.)、フォルミア属 (*Phormia* spp.)、ピオフィラ・カセイ (*Piophilica casei*)、プロジプロシス属 (*Prodiplosis* spp.)、プシラ・ロサエ (*Psila rosae*)、ラゴレチス属 (*Rhagoletis* spp.)、例えば、ラゴレチス・シングラタ (*Rhagoletis cingulata*)、ラゴレチス・コンプレタ (*Rhagoletis completa*)、ラゴレチス・ファウスタ (*Rhagoletis fausta*)、ラゴレチス・インディファレンス (*Rhagoletis indifferens*)、ラゴレチス・メンダクス (*Rhagoletis mendax*)、ラゴレチス・ポモネラ (*Rhagoletis pomonella*)、サルコファガ属 (*Sarcophaga* spp.)、シムリウム属 (*Simulium* spp.)、例えば、シムリウム・メリジオナール (*Simulium meridionale*)、ストモキシス属 (*Stomoxys* spp.)、タバヌス属 (*Tabanus* spp.)、テタノプス属 (*Tetanops* spp.)、チブラ属 (*Tipula* spp.)、例えば、チブラ・パルドーサ (*Tipula paludosa*)、チブラ・シンプレクス (*Tipula simplex*) ;

異翅目の、例えば、アナサ・トリスチス (*Anasa tristis*)、アンテスチオプシス属 (*Antestiopsis* spp.)、ボイセア属 (*Boisea* spp.)、ブリスス属 (*Blissus* spp.)、カロコリス属 (*Calocoris* spp.)、カンピロマ・リビダ (*Campylomma livida*)、カベレリウス属 (*Cavelerius* spp.)、シメクス属 (*Cimex* spp.)、例えば、シメクス・アジュンクタス (*Cimex adjunctus*)、シメクス・ヘミプテルス (*Cimex hemipterus*)、シメクス・レクツラリウス (*Cimex lectularius*)、シメクス・ピロセルス (*Cimex pilosellus*)、コラリア属 (*Collaria* spp.)、クレオンチアデス・ジルツス (*Creontiades dilutus*)、ダシヌス・ピペリス (*Dasynus piperis*)、ジケロプス・フルカツス (*Dichelops furcatus*)、ジコノコリス・ヘウェチ (*Diconocoris hewetti*)、ジスデルクス属 (*Dysdercus* spp.)、ユーシスツス属 (*Euschistus* spp.)、例えば、ユーシスツス・ヘロス (*Euschistus heros*)、ユーシスツス・セルプス (*Euschistus servus*)、ユーシスツス・トリスチグムス (*Euschistus tristigmus*)、ユーシスツス・バリオラリウス (*Euschistus variolarius*)、ユーリガステル属 (*Eurygaster* spp.)、ハリモルファ・ハリス (*Halyomorpha halys*)、ヘリオペルチス属 (*Heliopeltis* spp.)、ホルシアス・ノビレルス (*Horcias nobilellus*)、レプトコリスア属 (*Leptocoris* spp.)、レプトコリスア・バリコルニス (*Leptocoris varicornis*)、

レプトグロスス・オクシデンタリス (*Leptoglossus occidentalis*)、レプトグロスス・フィロプス (*Leptoglossus phyllopus*)、リゴコリス属 (*Lygocoris* spp.)、例えば、リゴコリス・パブリヌス (*Lygocoris pabulinus*)、リグス属 (*Lygus* spp.)、例えば、リグス・エリス (*Lygus elisus*)、リグス・ヘスペルス (*Lygus hesperus*)、リグス・リネオラリス (*Lygus lineolaris*)、マクロペス・エキスカバツス (*Macropes excavatus*)、モナロニオン・アトラツム (*Monalunion atratum*)、ネザラ属 (*Nezara* spp.)、例えば、ネザラ・ビリヅラ (*Nezara viridula*)、オエバルス属 (*Oebalus* spp.)、ピエスマ・クアドラタ (*Piesma quadrata*)、ピエゾドルス属 (*Piezodorus* spp.)、例えば、ピエゾドルス・グイルディニ (*Piezodorus guildinii*)、サルス属 (*Psallus* spp.)、シューダシスタ・ペルセア (*Pseudacysta perseae*)、ロドニウス属 (*Rhodnius* spp.)、サルベルゲラ・シングラリス (*Sahlbergella singularis*)、スカプトコリス・カスタネア (*Scaptocoris castanea*)、スコチノフォラ属 (*Scotinophora* spp.)、ステファニチス・ナシ (*Stephanitis nashi*)、チブラカ属 (*Tibraca* spp.)、トリアトマ属 (*Triatoma* spp.)；
 同翅目の、例えば、アシジア・アカシエバイレイアナエ (*Acizzia acaciaebailleyanae*)、アシジア・ドドネアエ (*Acizzia dodonaea*)、アシジア・ウンカトイデス (*Acizzia uncatoides*)、アクリダ・ツリタ (*Acrida turrita*)、アキルトシボン属 (*Acyrtosiphon* spp.)、例えば、アキルトシボン・ピスム (*Acyrtosiphon pisum*)、アクロゴニア属 (*Acrogonia* spp.)、エネオラミア属 (*Aeneolamia* spp.)、アゴノセナ属 (*Agonosцена* spp.)、アレイロデス・プロレテラ (*Aleyrodes proletella*)、アレウロロブス・バロデンシス (*Aleurolobus barodensis*)、アレウロトリクス・フロコス (*Aleurothrixus floccosus*)、アロカリダラ・マライエンシス (*Allocaridara malayensis*)、アムラスカ属 (*Amrasca* spp.)、例えば、アムラスカ・ビグツラ (*Amrasca biguttula*)、アムラスカ・デバスタンス (*Amrasca devastans*)、アヌラフィス・カルドゥイ (*Anuraphis cardui*)、アオニジエラ属 (*Aonidiella* spp.)、例えば、アオニジエラ・アウランチイ (*Aonidiella aurantii*)、アオニジエラ・シトリナ (*Aonidiella citrina*)、アオニジエラ・イノルナタ (*Aonidiella inornata*)、アフアノスチグマ・ピリ (*Aphanostigma piri*)、アフイス属 (*Aphis* spp.)、例えば、アフイス・クラシボラ (*Aphis craccivora*)、アフイス・ファバエ (*Aphis fabae*)、アフイス・フォルベシ (*Aphis forbesi*)、アフイス・グリシネス (*Aphis glycines*)、ワタアブラムシ、アフイス・ヘデラ (*Aphis hederiae*)、アフイス・イリノイセンシス (*Aphis illinoisensis*)、アフイス・ミドレトニ (*Aphis middletoni*)、アフイス・ナスツルシ (*Aphis nasturtii*)、アフイス・ネリ (*Aphis nerii*)、アフイス・ボミ (*Aphis pomi*)、アフイス・スピラエコラ (*Aphis spiraecola*)、アフイス・ビブルニフィラ (*Aphis viburniphila*)、アルボリジア・アピカリス (*Arboridia apicalis*)、アリタイニラ属 (*Arytainilla* spp.)、アスピジエラ属 (*Aspidiella* spp.)、アスピジオツス属 (*Aspidiotus* spp.)、例えば、アスピジオツス・ネリ (*Aspidiotus nerii*)、アタヌス属 (*Atanus* spp.)、アウラコルツム・ソラニ (*Aulacorthum solani*)、ベミシア・タバシ (*Bemisia ta*

baci)、ブラストプシラ・オクシデンタリス (*Blastopsylla occidentalis*)、ボレイオグリカスピス・メラロイカエ (*Boreioglycaspis melaleucae*)、ブラキカウドゥス・ヘリクリシ (*Brachycaudus helichrysi*)、ブラキコルス属 (*Brachycolus* spp.)、ブレビコリネ・ブラシカエ (*Brevicoryne brassicae*)、カコプシラ属 (*Cacopsylla* spp.)、例えば、カコプシラ・ピリコラ (*Cacopsylla pyricola*)、カリギボナ・マルギナタ (*Calligypona marginata*)、カルネオセファラ・フルギダ (*Carneocephala fulgida*)、セラトバクナ・ラニゲラ (*Ceratovacuna lanigera*)、セルコピダエ (*Cercopidae*)、セロプラステス属 (*Ceroplastes* spp.)、ケトシフォン・フラガエフォリ (*Chaetosiphon fragaefolii*)、キオナスピス・テガレンシス (*Chionaspis tegalensis*)、クロリタ・オヌキ (*Chlorita onukii*)、コンドラクリス・ロセア (*Chondracris rosea*)、クロマフィス・ジュグランジコラ (*Chromaphis juglandicola*)、クリソムファルス・フィクス (*Chrysomphalus ficus*)、シカドゥリナ・ムビラ (*Cicadulina mbila*)、コッコミチルス・ハリ (*Coccomytilus halli*)、コックス属 (*Coccus* spp.)、例えば、コックス・ヘスペリズム (*Coccus hesperidum*)、コックス・ロングルス (*Coccus longulus*)、コックス・シュードマグノリアルム (*Coccus pseudomagnoliarum*)、コックス・ビリジス (*Coccus viridis*)、クリプトミズス・リビス (*Cryptomyzus ribis*)、クリプトネオサ属 (*Cryptoneossa* spp.)、クテナリタイナ属 (*Ctenarytaina* spp.)、ダルブルス属 (*Dalbulus* spp.)、ジアレウロデス・シトリ (*Dialeurodes citri*)、ジアフォリナ・シトリ (*Diaphorina citri*)、ジアスピス属 (*Diaspis* spp.)、ドロシカ属 (*Drosicha* spp.)、ジサフィス属 (*Dysaphis* spp.)、例えば、ジサフィス・アピフォリア (*Dysaphis apiifolia*)、ジサフィス・プランタギネア (*Dysaphis plantaginea*)、ジサフィス・ツリパエ (*Dysaphis tulipae*)、ジスミコックス属 (*Dysmicoccus* spp.)、エンポアスカ属 (*Empoasca* spp.)、例えば、エンポアスカ・アブルプタ (*Empoasca abrupta*)、エンポアスカ・ファバエ (*Empoasca fabae*)、エンポアスカ・マリグナ (*Empoasca maligna*)、エンポアスカ・ソラナ (*Empoasca solana*)、エンポアスカ・ステベンシ (*Empoasca stevensi*)、エリオソマ属 (*Eriosoma* spp.)、例えば、エリオソマ・アメリカヌム (*Eriosoma americanum*)、エリオソマ・ラニゲラム (*Eriosoma lanigerum*)、エリオソマ・ピリコラ (*Eriosoma pyricola*)、エリトロネウラ属 (*Erythroneura* spp.)、ユーカリプトリマ属 (*Eucalyptolyma* spp.)、ユーフィルラ属 (*Euphyllura* spp.)、ユーセリス・ビロバツス (*Euscelis bilobatus*)、フェリシア属 (*Ferrisia* spp.)、ゲオコックス・コフエアエ (*Geococcus coffeae*)、グリカスピス属 (*Glycaspis* spp.)、ヘテロプシラ・クバナ (*Heteropsylla cubana*)、ヘテロプシラ・スピヌロサ (*Heteropsylla spinulosa*)、ホマロジスカ・コアグラタ (*Homalodisca coagulata*)、ヒアロプテルス・アルンジニス (*Hyalopterus arundinis*)、ヒアロプテルス・プルニ (*Hyalopterus pruni*)、イセリア属 (*Icerya* spp.)、例えば、イセリア・プルチャシ (*Icerya purchasi*)、イジオセルス属 (*Idiocerus* spp.)、イジオスコプス属 (*Idioscopus* spp.)、ラオデルファクス・ストリアテルス (*Laodelphax striatellus*

)、レカニウム属 (*Lecanium* spp.)、例えば、レカニウム・コルニ (*Lecanium corni*) (=パルテノレカニウム・コルニ (*Parthenolecanium corni*))、レピドサフェス属 (*Lepidosaphes* spp.)、例えば、レピドサフェス・ウルミ (*Lepidosaphes ulmi*)、リパフィス・エリシミ (*Lipaphis erysimi*)、マクロシフム属 (*Macrosiphum* spp.)、例えば、マクロシフム・ユウフォルビア (*Macrosiphum euphorbiae*)、マクロシフム・リリイ (*Macrosiphum lili*)、マクロシフム・ロサエ (*Macrosiphum rosae*)、マクロステレス・ファシフロンズ (*Macrosteles fascifrons*)、マハナルバ属 (*Mahanarva* spp.)、メラナフィス・サッカリ (*Melanaphis sacchari*)、メトカルフィエラ属 (*Metcalfiella* spp.)、メトポロフィウム・ジロドゥム (*Metopolophium dirhodum*)、モネリア・コスタリス (*Monellia costalis*)、モネリオプシス・ペカニス (*Monelliopsis pecan*)、ミズス属 (*Myzus* spp.)、例えば、ミズス・アスカロニクス (*Myzus ascalonicus*)、ミズス・セラシ (*Myzus cerasi*)、ミズス・リグストリ (*Myzus ligustri*)、ミズス・オルナツス (*Myzus ornatus*)、ミズス・ペルシカエ (*Myzus persicae*)、ミズス・ニコチナエ (*Myzus nicotianae*)、ナソノビア・リビスニグリ (*Nasonovia ribisnigri*)、ネフォテチクス属 (*Nephotettix* spp.)、例えば、ネフォテチクス・シンクチセプス (*Nephotettix cincticeps*)、ネフォテチクス・ニグロピクツス (*Nephotettix nigropictus*)、ニラパルバタ・ルゲンス (*Nilaparvata lugens*)、オンコメトピア属 (*Oncometopia* spp.)、オルテジア・プレロンガ (*Orthezia praelonga*)、オキシア・キネンシス (*Oxya chinensis*)、パキプシラ属 (*Pachypsylla* spp.)、パラベミシア・ミリケ (*Parabemisia myricae*)、パラトリオザ属 (*Paratrioza* spp.)、例えば、パラトリオザ・コクケレリ (*Paratrioza cockerelli*)、パルトリオア属 (*Parlatoria* spp.)、ペムフィグス属 (*Pemphigus* spp.)、例えば、ペムフィグス・ブルサリウス (*Pemphigus bursarius*)、ペムフィグス・ポプリベナエ (*Pemphigus populivenae*)、ペレグリンウス・マイジス (*Peregrinus maidis*)、フェナコックス属 (*Phenacoccus* spp.)、例えば、フェナコックス・マデイレンシス (*Phenacoccus madeirensis*)、フロエオミズス・パセリニ (*Phloeomyzus passerinii*)、フォロドン・フムリ (*Phorodon humuli*)、フィロキセラ属 (*Phylloxera* spp.)、例えば、フィロキセラ・デバスタトリクス (*Phylloxera devastatrix*)、フィロキセラ・ノタビリス (*Phylloxera notabilis*)、ピナスピス・アスピジストラエ (*Pinnaspis aspidistrae*)、プラノコックス属 (*Planococcus* spp.)、例えば、プラノコックス・シトリ (*Planococcus citri*)、プロソピドプシラ・フラバ (*Prosopidopsylla flava*)、プロトプルビナリア・ピリホルミス (*Protopulvinaria pyriformis*)、シュードウラカスピス・ペンタゴナ (*Pseudaulacaspis pentagona*)、シュードコックス属 (*Pseudococcus* spp.)、例えば、シュードコックス・カルセオラリエ (*Pseudococcus calceolariae*)、シュードコックス・コムストキ (*Pseudococcus comstocki*)、シュードコックス・ロンギスピヌス (*Pseudococcus longispinus*)、シュードコックス・マリチムス (*Pseudococcus maritimus*)、シュードコックス・ビブルニ (*Pseudococcus viburni*)

i)、プシロプシス属 (*Psyllopsis* spp.)、プシラ属 (*Psylla* spp.)、例えば、プシラ・ブキシ (*Psylla buxi*)、プシラ・マリ (*Psylla mali*)、プシラ・ピリ (*Psylla pyri*)、プテロマルス属 (*Pteromalus* spp.)、ピリラ属 (*Pyrilla* spp.)、クアドラスピジオツス属 (*Quadraspidiotus* spp.)、例えば、クアドラスピジオツス・ジュグランスレギアエ (*Quadraspidiotus juglansregiae*)、クアドラスピジオツス・オストレアエフォルミス (*Quadraspidiotus ostreaeformis*)、クアドラスピジオツス・ペルニシオサス (*Quadraspidiotus perniciosus*)、クエサダ・ギガス (*Quesada gigas*)、ラストロコックス属 (*Rastrococcus* spp.) 10、ロパロシフム属 (*Rhopalosiphum* spp.)、例えば、ロパロシフム・マイデイス (*Rhopalosiphum maidis*)、ロパロシフム・オキシアカンタエ (*Rhopalosiphum oxyacanthae*)、ロパロシフム・パジ (*Rhopalosiphum padi*)、ロパロシフム・ルフニアブドミナル (*Rhopalosiphum rufiabdominale*)、サイセチア属 (*Saissetia* spp.)、例えば、サイセチア・コフェアエ (*Saissetia coffeae*)、サイセチア・ミランダ (*Saissetia miranda*)、サイセチア・ネグレクト (*Saissetia neglecta*)、サイセチア・オレアエ (*Saissetia oleae*)、スカフォイデウス・チタヌ (*Scaphoideus titanus*)、シザフィス・グラミヌ (*Schizaphis graminum*)、セレナスピドゥス・アルチクラツ (*Selenaspidus articulatus*)、シトビオン・アベナエ (*Sitobion avenae*)、ソガタ属 (*Sogata* spp.)、ソガテラ・フルシフェラ (*Sogatella furcifera*)、ソガトデス属 (*Sogatodes* spp.)、スティクトセファラ・フェスチナ (*Stictocephala festina*)、シフォニヌス・フィリレアエ (*Siphoninus phillyreae*)、テナラファラ・マラエンシス (*Tenalaphara malayensis*)、テトラゴノセフェラ属 (*Tetragonocephala* spp.)、チノカリス・カリエホリエ (*Tinocallis caryaefoliae*)、トマスピス属 (*Tomaspis* spp.)、トキシソプテラ属 (*Toxoptera* spp.)、例えば、トキシソプテラ・アウランチイ (*Toxoptera aurantii*)、トキシソプテラ・シトリシドス (*Toxoptera citricidus*)、トリアレウロデス・バボラリオルム (*Trialearodes vaporariorum*)、トリオザ属 (*Trioza* spp.)、例えば、トリオザ・ジオスピリ (*Trioza diospyri*)、チフロシバ属 (*Thlocyba* spp.)、ウナスピス属 (*Unaspis* spp.)、ビテウス・ビチホリ (*Viteus vitifolii*)、ジギナ属 (*Zygina* spp.) ; 30

膜翅目の、例えば、アクロミルメクス属 (*Acromyrmex* spp.)、アタリア属 (*Athalia* spp.)、例えば、アタリア・ロサエ (*Athalia rosae*)、アタ属 (*Atta* spp.)、ジブリオン属 (*Diprion* spp.)、例えば、ジブリオン・シミリス (*Diprion similis*)、ホプロカンパ属 (*Hoplocampa* spp.)、例えば、ホプロカンパ・コッケイ (*Hoplocampa cookei*)、ホプロカンパ・テストゥディネア (*Hoplocampa testudinea*)、ラシウス属 (*Lasius* spp.)、モノモリウム・ファラオニス (*Monomorium pharaonis*)、シレクス属 (*Sirex* spp.)、ソレノプシス・インビクタ (*Solenopsis invicta*)、タピノマ属 (*Tapinoma* spp.)、ウロセルス属 (*Urocerus* spp.)、ベスパ属 (*Vespa* spp.)、例えば、ベスパ・クラブロ (*Vespa crabro*)、キセリス属 (*Xeris* spp.) ; 40

等脚目の、例えば、アルマジリジウム・ブルガレ (*Armadillidium vul* 50

gare)、オニスクス・アセルス (*Oniscus asellus*)、ポルセリオ・スカベル (*Porcellio scaber*) ;

等翅目の、例えば、コプトテルメス属 (*Coptotermes* spp.)、例えば、コプトテルメス・フォルモサヌス (*Coptotermes formosanus*)、コルニテルメス・クムランズ (*Cornitermes cumulans*)、クリプトテルメス属 (*Cryptotermes* spp.)、インシシテルメス属 (*Incisitermes* spp.)、ミクロテルメス・オベシ (*Microtermes obesi*)、オドントテルメス属 (*Odontotermes* spp.)、レチクリテルメス属 (*Reticulitermes* spp.)、例えば、レチクリテルメス・フラビペス (*Reticulitermes flavipes*)、レチクリテルメス・ヘスペルス (*Reticulitermes hesperus*) ; 10

鱗翅目の、例えば、アクロイア・グリセラ (*Achroia grisella*)、アクロニクタ・マジョル (*Acronicta major*)、アドキソフィエス属 (*Adoxophyes* spp.)、例えば、アドキソフィエス・オラナ (*Adoxophyes orana*)、アエジア・レウコメラス (*Aedia leucomelas*)、アグロチス属 (*Agrotis* spp.)、例えば、アグロチス・セゲツム (*Agrotis segetum*)、アグロチス・イプシロン (*Agrotis ipsilon*)、アラバマ属 (*Alabama* spp.)、例えば、アラバマ・アルギラセア (*Alabama argillacea*)、アミエロイス・トランシテラ (*Amyelois transitella*)、アナルシア属 (*Anarsia* spp.)、アンチカルシア属 (*Anticarsia* spp.)、例えば、アンチカルシア・ゲマタリス (*Anticarsia gemmatalis*)、アルギロプロセ属 (*Argyroproctis* spp.)、バラトラ・ブラシカエ (*Barathra brassicae*)、ボルボ・シンナラ (*Borbo cinnara*)、ブクラトリクス・ツルベリエラ (*Bucculatrix thurberielia*)、ブパルス・ピニアリウス (*Bupalus piniarius*)、ブセオラ属 (*Busseola* spp.)、カコエシア属 (*Cacoecia* spp.)、カロプチリア・テイボラ (*Caloptilia theivora*)、カプア・レチクラナ (*Capua reticulana*)、カルポカプサ・ポモネラ (*Carpocapsa pomonella*)、カルポシナ・ニポネンシス (*Carposina niponensis*)、ケイマトビア・ブルマタ (*Cheimatobia brumata*)、キロ属 (*Chilo* spp.)、例えば、キロ・プレジャデルス (*Chilo plejadellus*)、キロ・スプレサリス (*Chilo suppressalis*)、コリストネウラ属 (*Choristoneura* spp.)、クリシア・アムビグエラ (*Clysia ambiguella*)、クナファロセルス属 (*Cnaphalocerus* spp.)、クナファロクロシス・メジナリス (*Cnaphalocrocis medinalis*)、クネファシア属 (*Cnephasia* spp.)、コノボモルファ属 (*Conopomorpha* spp.)、コノトラケルス属 (*Conotrachelus* spp.)、コピタルシア属 (*Copitarsia* spp.)、シジア属 (*Cydia* spp.)、例えば、シジア・ニグリカナ (*Cydia nigricana*)、シジア・ポモネラ (*Cydia pomonella*)、ダラカ・ノクツイデス (*Dalaca noctuides*)、ジアファニア属 (*Diaphania* spp.)、ジアトレア・サッカラリス (*Diatraea saccharalis*)、エアリアス属 (*Earias* spp.)、エクジトロファ・アウランチウム (*Ecdytolopha aurantium*)、エラスモバルプス・リグノセルス (*Elasmopalpus lignosellus*)、エルダナ・サッカリナ (*Eldana saccharina*)、エフェスチア属 (*Ephesia* spp.)、例えば、エフェスチア・エルテラ (*Ephesia elutella*)、エフェスチア・クエニエラ (*Ephesia kuehniella*)、エピノチア属 (*Epinotia* spp.)、エピフィアス・ポストビタナ (*Epiphyas postvittana*)、エチエラ属 (*Etiella* spp. 40 50

)、ユーリア属 (*Eulia* spp.)、ユーボエシリア・アムビグエラ (*Eupoe-
cilia ambigella*)、ユープロクチス属 (*Euproctis* spp.
.)、例えば、ユープロクチス・クリソルホエア (*Euproctis chrysor-
rhoea*)、ユーキソア属 (*Euxoa* spp.)、フェルチア属 (*Feltia*
spp.)、ガレリア・メロネラ (*Galleria mellonella*)、グラシ
ラリア属 (*Gracillaria* spp.)、グラフォリタ属 (*Grapholit-
ha* spp.)、例えば、グラフォリタ・モレスタ (*Grapholita mole-
sta*)、グラフォリタ・プルニボラ (*Grapholita prunivora*)、
ヘジレプタ属 (*Hedylepta* spp.)、ヘリコベルパ属 (*Helicover-
pa* spp.)、例えば、ヘリコベルパ・アルミゲラ (*Helicoverpa ar-
miger*)、ヘリコベルパ・ゼア (*Helicoverpa zea*)、ヘリオチス
属 (*Heliothis* spp.)、例えば、ヘリオチス・ビレスセンス (*Helio-
this virescens*)、ホフマノフィラ・シュードスプレテラ (*Hofman-
nophila pseudospretella*)、ホモエオソマ属 (*Homoeos-
oma* spp.)、ホモナ属 (*Homona* spp.)、ヒポノメウタ・パデラ (*Hy-
ponomeuta padella*)、カキボリア・フラボファスシアタ (*Kaki-
voria flavofasciata*)、ラフィグマ属 (*Laphygma* spp.
.)、ロイシノデス・オルボナリス (*Leucinodes orbonalis*)、ロ
イコプテラ属 (*Leucoptera* spp.)、例えば、ロイコプテラ・コフェーラ
(*Leucoptera coffeella*)、リトコレチス属 (*Lithocoll-
etis* spp.)、例えば、リトコレチス・ブランカルデラ (*Lithocolle-
tis blancardella*)、リトファネ・アンテナタ (*Lithophane
antennata*)、ロベシア属 (*Lobesia* spp.)、例えば、ロベシア
・ボトラナ (*Lobesia botrana*)、ロキサグロチス・アルビコスタ (*Lo-
xagrotis albicosta*)、リマントリア属 (*Lymantria* sp-
p.)、例えば、リマントリア・ジスバル (*Lymantria dispar*)、リオ
ネチア属 (*Lyonetia* spp.)、例えば、リオネチア・クラークラ (*Lyon-
etia clerkella*)、マラコソマ・ネウストリア (*Malacosoma
neustria*)、マルカ・テスツラリス (*Maruca testulalis*)、
マメストラ・ブラシカエ (*Mamestra brassicae*)、メランチス・レダ
(*Melanitis leda*)、モシス属 (*Mocis* spp.)、モノピス・オ
ブビエラ (*Monopis obviella*)、ミチムナ・セパラタ (*Mythimn-
a separata*)、ネマポゴン・クロアセルス (*Nemapogon cloac-
ellus*)、ニムフラ属 (*Nymphula* spp.)、オイケチクス属 (*Oike-
ticus* spp.)、オリア属 (*Oria* spp.)、オルタガ属 (*Orthag-
a* spp.)、オストリニア属 (*Ostrinia* spp.)、例えば、オストリニ-
ア・ヌビラリス (*Ostrinia nubilalis*)、オウレマ・メラノプス (*O-
ulema melanopus*)、オウレマ・オリゼ (*Oulema oryzae*)
、パノリス・フラメア (*Panolis flammea*)、パルナラ属 (*Parnar-
a* spp.)、ペクチノホラ属 (*Pectinophora* spp.)、例えば、ペ
クチノホラ・ゴッシピエラ (*Pectinophora gossypiella*)、ペ
リロイコプテラ属 (*Perileucoptera* spp.)、フトリメア属 (*Phthorim-
aea* spp.)、例えば、フトリメア・オペルクレラ (*Phthorim-
aea operculella*)、フィロクニスチス・シトレラ (*Phyllocni-
stis citrella*)、フィロノリクテル属 (*Phyllonorycter*
spp.)、例えば、フィロノリクテル・ブランカルデラ (*Phyllonorycte-
r blancardella*)、フィロノリクテル・クラタエゲラ (*Phyllono-
rycter crataegella*)、ピエリス属 (*Pieris* spp.)、例
えば、ピエリス・ラパエ (*Pieris rapae*)、プラチノタ・スツルタナ (*Pl-
atynota stultana*)、プロジア・インテルブンクテラ (*Plodia*

interpunctella)、プルシア属 (*Plusia* spp.)、プルテラ・キシロステラ (*Plutella xylostella*) (=プルテラ・マクリペニス (*Plutella maculipennis*))、プライス属 (*Prays* spp.)、プロデニア属 (*Prodenia* spp.)、プロトパルセ属 (*Protoparce* spp.)、シューダレチア属 (*Pseudaletia* spp.)、例えば、シューダレチア・ユニプンクタ (*Pseudaletia unipuncta*)、シュードプルシア・インクルデンス (*Pseudoplusia includens*)、ピラウスタ・ヌビラリス (*Pyrausta nubilalis*)、ラキプルシア・ヌ (*Rachiplusia nu*)、スコエノビウス属 (*Schoenobius* spp.)、例えば、スコエノビウス・ビプンクチファ (*Schoenobius bipunctifer*)、シルポファガ属 (*Scirpophaga* spp.)、例えば、シルポファガ・イノタタ (*Scirpophaga innotata*)、スコチア・セゲツム (*Scotia segetum*)、セサミア属 (*Sesamia* spp.)、例えば、セサミア・インフェレンス (*Sesamia inferens*)、スパルガノチス属 (*Sparganothis* spp.)、スポドプテラ属 (*Spodoptera* spp.)、例えば、スポドプテラ・エラジアナ (*Spodoptera eradiana*)、スポドプテラ・エクシグア (*Spodoptera exigua*)、スポドプテラ・フルギベルダ (*Spodoptera frugiperda*)、スポドプテラ・プラエフィカ (*Spodoptera praefica*)、スタトモポダ属 (*Stathmopoda* spp.)、ストモプテリクス・スブセシベラ (*Stomopteryx subsecivella*)、シナンテドン属 (*Synanthedon* spp.)、テシア・ソラニボラ (*Tecia solanivora*)、テルメシア・ゲンマタリス (*Thermesia gemmatalis*)、チネア・クロアセラ (*Tinea cloacella*)、チネア・ペリオネラ (*Tinea pellionella*)、チネオラ・ビセリエラ (*Tineola bisselliella*)、トルトリクス属 (*Tortrix* spp.)、トリコファガ・タペツェラ (*Trichophaga tapetzella*)、トリコプルシア属 (*Trichoplusia* spp.)、例えば、トリコプルシア・ニ (*Trichoplusia ni*)、トリポリザ・インセルツラス (*Tryporyza incertulas*)、ツタ・アブソルタ (*Tuta absoluta*)、ビラコラ属 (*Virachola* spp.) ;

直翅目または跳躍目 (*Saltatoria*) の、例えば、アケタ・ドメスチクス (*Achetia domesticus*)、ジクロプルス属 (*Dichroplus* spp.)、グリロタルパ属 (*Gryllotalpa* spp.)、例えば、グリロタルパ・グリロタルパ (*Gryllotalpa gryllotalpa*)、ヒエログリフス属 (*Hieroglyphus* spp.)、ロクスタ属 (*Locusta* spp.)、例えば、ロクスタ・ミグラトリア (*Locusta migratoria*)、メラノプルス属 (*Melanoplus* spp.)、例えば、メラノプルス・デバステーター (*Melanoplus devastator*)、シストセルカ・グレガリア (*Schistocerca gregaria*) ;

シラミ目の、例えば、ダマリニア属 (*Damalinia* spp.)、ヘマトピヌス属 (*Haematopinus* spp.)、リノグナトス属 (*Linognathus* spp.)、ベジクルス属 (*Pediculus* spp.)、フィロキセラ・バスタトリクス (*Phylloxera vastatrix*)、フスイルス・ピュービス (*Phthirus pubis*)、トリコデクテス属 (*Trichodectes* spp.) ;

チャタテムシ目の、例えば、レピノツス属 (*Lepinotus* spp.)、リポセリス属 (*Liposcelis* spp.) ;

ノミ目の、例えば、セラトフィルス属 (*Ceratophyllus* spp.)、クテノセファリデス属 (*Ctenocephalides* spp.)、例えば、クテノセファリデス・カニス (*Ctenocephalides canis*)、クテノセファリデ

ス・フェリス (*Ctenocephalides felis*)、プレックス・イリタンス (*Pulex irritans*)、ツンガ・ペネトランス (*Tunga penetrans*)、キセノプシラ・ケオピス (*Xenopsylla cheopis*) ;

総翅目の、例えば、アナフォトリプス・オブスクルス (*Anaphothrips obscurus*)、バリオトリプス・ビホルミス (*Baliothrips biformis*)、ドレパノトリプス・ロイテリ (*Drepanothrips reuteri*)、エネオトリプス・フラベンス (*Enneothrips flavens*)、フランク
 リニエラ属 (*Frankliniella* spp.)、例えば、フランクリニエラ・フ
 スカ (*Frankliniella fusca*)、フランクリニエラ・オクシデンタリ
 ス (*Frankliniella occidentalis*)、フランクリニエラ・シュ
 ルツゼイ (*Frankliniella schultzei*)、フランクリニエラ・
 トリチシ (*Frankliniella tritici*)、フランクリニエラ・バクチ
 ニ (*Frankliniella vaccini*)、フランクリニエラ・ウィリアム
 ジ (*Frankliniella williamsi*)、ヘリオトリプス属 (*Heli
 othrips* spp.)、ヘルシノトリプス・フェモラリス (*Hercinothri
 ps femoralis*)、リピフォロトリプス・クルエンタツス (*Rhipiph
 orothrips cruentatus*)、シルトトリプス属 (*Scirtothr
 ips* spp.)、テニオトリプス・カルダモミ (*Taeniothrips car
 damomi*)、トリプス属 (*Thrips* spp.)、例えば、トリプス・パルミ (*Thrips
 palmi*)、トリプス・タバシ (*Thrips tabaci*) ;

総尾目 (*Zygentoma*) (=シミ目) の、例えば、クテノレピスマ属 (*Cteno
 lepisma* spp.)、レピスマ・サカリナ (*Lepisma sacchari
 na*)、レピスモデス・インキリヌス (*Lepismodes inquilinus*)
 、テルモビア・ドメスチカ (*Thermobia domestica*) ;

結合綱の、例えば、スクチゲレラ属 (*Scutigerella* spp.)、例えば、
 スクチゲレラ・イマクラタ (*Scutigerella immaculata*) ;

【0206】

軟体動物門の害虫、例えば、双殻綱の、例えば、ドレイセナ属 (*Dreissena*
 spp.)、

および腹足綱の、例えば、アリオン属 (*Arion* spp.)、例えば、アリオン・ア
 ター・ルフス (*Arion ater rufus*)、ビオムファラリア属 (*Biomp
 halaria* spp.)、ブリヌス属 (*Bulinus* spp.)、デロセラ属
 (*Deroceras* spp.)、例えば、デロセラ・ラエベ (*Deroceras
 laeve*)、ガルバ属 (*Galba* spp.)、リムネア属 (*Lymnaea* s
 pp.)、オンコメラニア属 (*Oncomelania* spp.)、ポマセア属 (*Po
 macea* spp.)、スクシネア属 (*Succinea* spp.) ;

【0207】

扁形動物門および線形動物門の動物寄生虫、例えば、アンキロストマ属 (*Ancylo
 stoma* spp.)、例えば、アンキロストマ・デュオデナレ (*Ancylostoma
 duodenale*)、アンキロストマ・シラニクム (*Ancylostoma
 ceylanicum*)、アンキロストマ・ブラジリエンシス (*Ancylostoma
 braziliensis*)、アスカリス属 (*Ascaris* spp.)、ブルギア
 ・マライ (*Brugia malayi*)、ブルギア・チモリ (*Brugia timo
 ri*)、ブノストムム属 (*Bunostomum* spp.)、カベルチア属 (*Chab
 ertia* spp.)、クロノルキス属 (*Clonorchis* spp.)、コーペ
 リア属 (*Cooperia* spp.)、ジクロコエリウム属 (*Dicrocoelium
 spp.*)、ジクチオカウルス・フィラリア (*Dictyocaulus fila
 ria*)、ジフィロボツリウム・ラツム (*Diphyllbothrium latu
 m*)、ドラクンクルス・メジネンシス (*Dracunculus medinensis*
)、エキノコックス・グラヌロソス (*Echinococcus granulosus*

)、エキノコックス・ムルチロクラリス (*Echinococcus multilocularis*)、エンテロビウス・ベルミクラリス (*Enterobius vermicularis*)、ファシオラ属 (*Faciola* spp.)、ヘモンクス属 (*Haemonchus* spp.)、ヘテラキス属 (*Heterakis* spp.)、ヒメノレピス・ナナ (*Hymenolepis nana*)、ヒオストロングルス属 (*Hyostrongylus* spp.)、ロア・ロア (*Loa Loa*)、ネマトジルス属 (*Nematodirus* spp.)、エソファゴストムム属 (*Oesophagostomum* spp.)、オピストルキス属 (*Opisthorchis* spp.)、オンコセルカ・ボルブルス (*Onchocerca volvulus*)、オステルタギア属 (*Ostertagia* spp.)、パラゴニムス属 (*Paragonimus* sp 10
 p.)、シストソメン属 (*Schistosomen* spp.)、ストロンギロイデス・フエレボルニ (*Strongyloides fuelleborni*)、ストロンギロイデス・ステルコラリス (*Strongyloides stercoralis*)、ストロニロイデス属 (*Strongyloides* spp.)、タエニア・サギナタ (*Taenia saginata*)、タエニア・ソリウム (*Taenia solium*)、トリキネラ・スピラリス (*Trichinella spiralis*)、トリキネラ・ナチバ (*Trichinella nativa*)、トリキネラ・ブリトビ (*Trichinella britovi*)、トリキネラ・ネルソニ (*Trichinella nelsoni*)、トリキネラ・シュードブシラリス (*Trichinella pseudopsiralis*)、トリコストロングルス属 (*Trichostrongylus* spp.)、トリクリス・トリクリア (*Trichuris trichuria* 20
)、ウケレリア・バンクロフチ (*Wuchereria bancrofti*) ;

【0208】

線形動物門の植物害虫、すなわち、植物寄生性線虫、特にアグレンクス属 (*Aglenchus* spp.)、例えば、アグレンクス・アグリコラ (*Aglenchus agricola*)、アングイナ属 (*Anguina* spp.)、例えば、アングイナ・トリチシ (*Anguina tritici*)、アフエレンコイデス属 (*Aphelenchoides* spp.)、例えば、アフエレンコイデス・アラキジス (*Aphelenchoides arachidis*)、アフエレンコイデス・フラガリアエ (*Aphelenchoides fragariae*)、ベロノライムス属 (*Belonolaimus* spp.)、例えば、ベロノライムス・グラシリス (*Belonolaimus gracilis*)、ベロノライムス・ロングカウダツス (*Belonolaimus longicaudatus*)、ベロノライムス・ノルトニ (*Belonolaimus nortoni*)、ブルサフェレンクス属 (*Bursaphelenchus* sp 30
 p.)、例えば、ブルサフェレンクス・ココフィルス (*Bursaphelenchus cocophilus*)、ブルサフェレンクス・エレムス (*Bursaphelenchus eremus*)、ブルサフェレンクス・キシロフィラス (*Bursaphelenchus xylophilus*)、カコパウルス属 (*Cacopaurus* spp.)、例えば、カコパウルス・ペスチス (*Cacopaurus pestis*)、クリコネメラ属 (*Criconemella* spp.)、例えば、クリコネメラ・クルバタ 40
 (*Criconemella curvata*)、クリコネメラ・オノエンシス (*Criconemella onoensis*)、クリコネメラ・オルナタ (*Criconemella ornata*)、クリコネメラ・ルシウム (*Criconemella russium*)、クリコネメラ・キセノブラキス (*Criconemella xenoplax*) (=メソクリコネマ・キセノブラキス (*Mesocriconema xenoplax*))、クリコネモイデス属 (*Criconemoides* spp.)、例えば、クリコネモイデス・フェルニアエ (*Criconemoides ferniae*)、クリコネモイデス・オノエンセ (*Criconemoides onoense*)、クリコネモイデス・オルナツム (*Criconemoides ornatum*)、ジチレンクス属 (*Ditylenchus* spp.)、例えば、ジチレンクス・ジブサシ (*Dit 50*

ylenchus dipsaci)、ドリコドルス属(Dolichodorus spp.)、グロボデラ属(Globodera spp.)、例えば、グロボデラ・パリダ(Globodera pallida)、グロボデラ・ロストキエンシス(Globodera rostochiensis)、ヘリコチレンクス属(Helicotylenchus spp.)、例えば、ヘリコチレンクス・ジヒステラ(Helicotylenchus dihyssera)、ヘミクリコネモイデス属(Hemicriconemoides spp.)、ヘミシクリオフォラ属(Hemicycliophora spp.)、ヘテロデラ属(Heterodera spp.)、例えば、ヘテロデラ・アベナエ(Heterodera avenae)、ヘテロデラ・グリシネス(Heterodera glycines)、ヘテロデラ・スカハクチイ(Heterodera schachtii)、ホプロライムス属(Hoplolaimus spp.)、ロンギドルス属(Longidorus spp.)、例えば、ロンギドルス・アフリカヌス(Longidorus africanus)、メロイドギネ属(Meloidogyne spp.)、例えば、メロイドギネ・キトウォオジ(Meloidogyne chitwoodi)、メロイドギネ・ファラックス(Meloidogyne fallax)、メロイドギネ・ハブラ(Meloidogyne hapla)、メロイドギネ・インコグニタ(Meloidogyne incognita)、メロイネマ属(Meloinema spp.)、ナコブス属(Nacobbus spp.)、ネオチレンクス属(Neotylenchus spp.)、パラフェレンクス属(Paraphelenchus spp.)、パラトリコドルス属(Paratrichodorus spp.)、例えば、パラトリコドルス・ミノル(Paratrichodorus minor)、プラチレンクス属(Pratylenchus spp.)、例えば、プラチレンクス・ペネトランス(Pratylenchus penetrans)、シュードハレンクス属(Pseudohalenchus spp.)、プシレンクス属(Psilenchus spp.)、プンクトデラ属(Punctodera spp.)、キニスルシウス属(Quinisulcius spp.)、ラドフォルス属(Radopholus spp.)、例えば、ラドフォルス・シトロフィルス(Radopholus citrophilus)、ラドフォルス・シミリス(Radopholus similis)、ロチレンクルス属(Rotylenchulus spp.)、ロチレンクス属(Rotylenchus spp.)、スクテロネマ属(Scutellonema spp.)、スバングイナ属(Subanguina spp.)、トリコドルス属(Trichodorus spp.)、例えば、トリコドルス・オブツス(Trichodorus obtusus)、トリコドルス・プリミチブス(Trichodorus primitivus)、チレンコリンクス属(Tylenchorhynchus spp.)、例えば、チレンコリンクス・アヌラツス(Tylenchorhynchus annulatus)、チレンクルス属(Tylenchulus spp.)、例えば、チレンクルス・セミペネトランス(Tylenchulus semipenetrans)、キシフィネマ属(Xiphinema spp.)、例えば、キシフィネマ・インデキス(Xiphinema index)が挙げられる。

【0209】

さらに、原生動物の垂界の、コクシジウム目、例えば、エイメリア属(Eimeria spp.)を防除することが可能である。

【0210】

式(I)の化合物は任意に、特定の濃度または適用量で、除草剤、毒性緩和剤、成長調節剤もしくは植物特性の改善剤として、殺菌剤もしくは殺精剤として、例えば、抗真菌剤、殺糸状菌剤、殺菌剤、殺ウイルス剤(ウイロイドに対する薬剤を含む)として、またはMLO(マイコプラズマ様有機体)およびRLO(リケッチア様有機体)に対する薬剤として、使用することができる。適切な場合、それらは、他の活性成分の合成のための中間体または前駆体として使用することもできる。

【0211】

本発明は、さらに、製剤およびそこから調製される殺虫剤の使用形態に関し、例えば、少なくとも1つの式(I)の化合物を含む濃縮溶液で浸す、それを滴らせる、およびそれを噴霧する。場合によっては、使用形態は、さらに、殺虫剤、および／または浸透剤等の作用を改善するアジュバント、例えば、植物油、例えば、ナタネ油、ヒマワリ油、鉱油、例えば、パラフィン油、植物脂肪酸のアルキルエステル、例えば、ナタネ油メチルエステルもしくは大豆油メチルエステル、またはアルカノールアルコキシレート、および／またはスプレッド、例えば、アルキルシロキサン、および／または塩、例えば、有機もしくは無機アンモニウム塩またはホスホニウム塩、例えば、硫酸アンモニウムもしくはリン酸水素二アンモニウム、および／または保持促進剤、例えば、ジオクチルスルホコハク酸塩もしくはヒドロキシプロピルグアールポリマー、および／または保湿剤、例えば、グリセロール、および／または肥料、例えば、アンモニウム含有、カリウム含有もしくはリン含有肥料を含む。

10

【0212】

通常用いられる製剤は、例えば、水溶性液体(SL)、エマルジョン濃縮液(EC)、水中エマルジョン(EW)、懸濁液濃縮液(SC、SE、FS、OD)、水分散性顆粒(WG)、顆粒(GR)およびカプセル濃縮液(CS)であり、これらおよびさらに可能な製剤のタイプは、例えば、Crop Life Internationalによって、およびPesticide Specifications, Manual on development and use of FAO and WHO specifications for pesticides, FAO Plant Product and Protection Papers-173, prepared by the FAO/WHO Joint Meeting on Pesticide Specifications, 2004, ISBN: 9251048576に記載されている。製剤は、1つ以上の式(I)の化合物に加えて、任意にさらなる農薬活性成分を含む。

20

【0213】

これらは、好ましくは、補助剤、例えば、増量剤、溶媒、自発性促進剤、担体、乳化剤、分散剤、霜防止剤、殺生物剤、増粘剤および／またはさらなる補助剤、例えば、アジュバントを含む製剤または使用形態である。この文脈においてアジュバントは、任意の生物学的効果を有する成分自体を伴わずに、製剤の生物学的効果を増強させる成分である。アジュバントの例は、葉表面での保持、塗布、付着、または浸透を促進する薬剤である。

30

【0214】

これらの製剤は、既知の手法、例えば、式(I)の化合物を補助剤、例えば、増量剤、溶媒および／もしくは固形担体、ならびに／または他の補助剤、例えば、界面活性剤と混合することによって製造される。製剤は、好適な設備において製造されるか、あるいは適用の前または適用の間に製造される。

【0215】

使用される補助剤は、特定の物理的、技術的および／または生物学的特性等の特別な特性を、式(I)の化合物の製剤に、またはこれらの製剤から調製される使用形態(例えば、噴霧濃縮溶液または種子粉衣製品等の使用準備済の殺虫剤)に付与することに適した物質であり得る。

40

【0216】

好適な増量剤は、例えば、水、極性および非極性有機化学液体、例えば、芳香族および非芳香族炭化水素に分類されるもの(パラフィン、アルキルベンゼン、アルキルナフタレン、クロロベンゼン等)、アルコールおよびポリオール(任意に置換、エーテル化および／またはエステル化されてもよい)、ケトン(アセトン、シクロヘキサノン等)、エステル(脂肪および油を含む)および(ポリ)エーテル、非置換および置換アミン、アミド、ラクタム(N-アルキルピロリドン等)およびラクトン、スルホンおよびスルホキシド(ジメチルスルホキシド等)である。

【0217】

50

使用される増量剤が水である場合、補助溶媒として、例えば有機溶媒を使用することも可能である。有用な液体溶媒は、本質的に、キシレン、トルエンもしくはアルキルナフタレン等の芳香族、クロロベンゼン、クロロエチレンもしくは塩化メチレン等の塩素化された芳香族または塩素化された脂肪族の炭化水素、シクロヘキサンまたはパラフィン等の脂肪族炭化水素、例えば、鉱油留分、鉱油および植物油、ブタノールもしくはグリコール等のアルコールならびにそれらのエーテルおよびエステル、アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン、もしくはシクロヘキサノン等のケトン、ジメチルホルムアミドおよびジメチルスルホキシド等の強極性溶媒、ならびに同様に水である。

【0218】

原理上は、すべての好適な溶媒を使用することが可能である。好適な溶媒の例は、キシレン、トルエンもしくはアルキルナフタレン等の芳香族炭化水素、クロロベンゼン、クロロエチレンもしくは塩化メチレン等の塩素化された芳香族または脂肪族の炭化水素、シクロヘキサン、パラフィン等の脂肪族炭化水素、鉱油留分、鉱油および植物油、メタノール、エタノール、イソプロパノール、ブタノールもしくはグリコール等のアルコールならびにそれらのエーテルおよびエステル、アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトンもしくはシクロヘキサノン等のケトン、ジメチルスルホキシド等の強極性溶媒、ならびに水である。

【0219】

原理上は、すべての好適な担体を使用することが可能である。有用な担体としては、特に、例えば、アンモニウム塩、およびカオリン、粘土、タルク、白亜、石英、アタパルジャイト、モンモリロナイトもしくは珪藻土等の地中天然鉱物、ならびに微細化したシリカ、アルミナおよび天然もしくは合成ケイ酸塩等の地中合成材料、樹脂、ワックスならびに／または固形肥料が挙げられる。このような担体の混合物も、同様に使用することができる。顆粒に有用な担体には、例えば、粉碎および分画された方解石、大理石、軽石、セピオライト、ドロマイト等の天然石、ならびに無機および有機ミールの合成顆粒、ならびにオガクズ、紙、ヤシ殻、トウモロコシの穂軸およびタバコ茎等の有機材料の顆粒が挙げられる。

【0220】

液化されたガス状増量剤または溶媒も使用することができる。特に好適な増量剤または担体は、周囲温度および大気圧下でガス状であるもの、例えば、ハロ炭化水素等のエアロゾル噴霧剤ガス、ならびに、ブタン、プロパン、窒素および二酸化炭素である。

【0221】

乳化剤および／もしくは発泡剤、イオン性もしくは非イオン性特性を有する分散剤または湿潤剤、またはこれらの界面活性剤の混合物の例は、ポリアクリル酸の塩、リグノスルホン酸の塩、フェノールスルホン酸の塩またはナフタレンスルホン酸、脂肪アルコールを含む、もしくは脂肪酸を含む、もしくは脂肪アミンを含む、置換されたフェノール（好ましくはアルキルフェノールもしくはアリールフェノール）を含むエチレンオキシドの重縮合体、スルホコハク酸エステルの塩、タウリン誘導体（好ましくはアルキルタウレート）、ポリエトキシ化アルコールもしくはフェノールのリン酸エステル、ポリオールの脂肪酸エステル、ならびに硫酸塩、スルホン酸塩およびリン酸塩を含む化合物の誘導体、例えば、アルキルアリールポリグリコールエーテル、スルホン酸アルキル、硫酸アルキル、スルホン酸アリール、タンパク質加水分解物、リグノ亜硫酸廃液、およびメチルセルロースである。界面活性剤の存在は、式（I）の化合物のうちの1つおよび／または不活性担体のうちの1つが水中で不溶性であり、水中で用いられる場合に有利である。

【0222】

製剤およびそれに由来する使用形態中に存在し得るさらなる補助剤には、無機顔料等の染料、例えば、酸化鉄、酸化チタンおよびプルシアンブルー、ならびにアリザリン染料、アゾ染料および金属フタロシアニン染料等の有機染料、ならびに鉄、マンガン、ホウ素、銅、コバルト、モリブデンおよび亜鉛の塩等の栄養素および微量栄養素が挙げられる。

【0223】

10

20

30

40

50

追加成分は、冷却安定剤等の安定剤、防腐剤、酸化防止剤、光安定剤、または化学的および／もしくは物理的安定性を改善する他の薬剤であってもよい。発泡剤または消泡剤が存在してもよい。

【0224】

さらに、製剤およびそれに由来する使用形態は、追加補助剤として、アラビアゴム、ポリビニルアルコールおよびポリビニルアセテート等の粉末、顆粒もしくはラテックスの形態の、カルボキシメチルセルロースならびに天然および合成ポリマー等の固着剤、またはセファリンおよびレシチンならびに合成リン脂質等の天然リン脂質も含んでもよい。さらに可能な補助剤は、鉱油および植物油である。

【0225】

任意に、さらなる補助剤が製剤およびそれに由来する使用形態中に存在してもよい。このような添加物の例としては、芳香剤、保護コロイド、結合剤、接着剤、増粘剤、チキソトロップ剤、浸透剤、保持促進剤、安定剤、捕捉剤、錯化剤、保湿剤、スプレッドが挙げられる。概して、式(I)の化合物は、製剤目的で一般的に使用される任意の固体または液体添加物と組み合わせることができる。

【0226】

有用な保持促進剤としては、動的表面張力を低減するすべての物質、例えば、ジオクチルスルホコハク酸塩、または粘弾性を増加するすべての物質、例えば、ヒドロキシプロピルグアールポリマーが挙げられる。

【0227】

この文脈において有用な浸透剤とは、典型的には、活性農薬成分の植物中への浸透を改善するために使用されるすべての物質である。浸透剤は、この文脈において、(一般的に水性の)適用濃縮溶液から、および／またはスプレーコーティングから、植物の上皮中に浸透し、それにより上皮中の活性成分の流動性を改善する能力によって定義される。文献(Baur et al., 1997, Pesticide Science 51, 131-152)に記載される方法は、この特性を決定するために使用することができる。例としては、ヤシ脂肪エトキシレート(10)もしくはイソトリデシルエトキシレート(12)等のアルコールアルコキシレート、脂肪酸エステル、例えば、ナタネ油メチルエステルもしくは大豆油メチルエステル、脂肪アミンアルコキシレート、例えば、タロウアミン(tallowamine)エトキシレート(15)、またはアンモニウム塩および／もしくはホスホニウム塩、例えば、硫酸アンモニウムもしくはリン酸水素二アンモニウムが挙げられる。

【0228】

製剤は、製剤の重量に基づいて、好ましくは、0.000000001重量%~98重量%の式(I)の化合物、より好ましくは0.01重量%~95重量%の式(I)の化合物、最も好ましくは0.5重量%~90重量%の式(I)の化合物を含有する。

【0229】

製剤から調製される使用形態(特に殺虫剤)中の式(I)の化合物の含量は、幅広い範囲で異なり得る。使用形態中の式(I)の化合物の濃度は、典型的には、使用形態の重量に基づいて、0.000000001重量%~95重量%の式(I)の化合物、好ましくは0.00001重量%~1重量%であり得る。適用は、使用形態により適切な慣例的な方法で達成される。

【0230】

式(I)の化合物は、例えば、作用の範囲を広げるため、作用の期間を延長するため、作用の割合を増加させるため、反発作用を防ぐため、または耐性の進行を防ぐために、1つ以上の好適な抗真菌剤、殺菌剤、ダニ駆除剤、軟体動物駆除剤、線虫駆除剤、昆虫駆除剤、微生物学的に有益な有機体、除草剤、肥料、鳥忌避剤、フィトニックス(phytonics)、滅菌剤、毒性緩和剤、情報化学物質および／または植物成長調節剤との混合物として使用することができる。さらに、この種類の活性成分の組み合わせは、植物成長および／または非生物的要因、例えば、高温もしくは低温、日照り、または水分含

10

20

30

40

50

量もしくは土壌塩分の上昇に対する耐性を改善することができる。開花および結実の性能を改善する、発芽能力および根発達を最適化する、収穫を容易にし収量を改善する、成熟に影響を与える、収穫される生産物の品質および／もしくは栄養価を改善する、貯蔵寿命を延長する、ならびに／または収穫される生産物の加工性を改善することも可能である。

【0231】

さらに、式(I)の化合物は、誘引剤および／もしくは鳥忌避剤および／もしくは植物活性剤および／もしくは成長調節剤および／もしくは肥料等の他の活性成分または情報化学物質との混合物中に存在してもよい。同様に、式(I)の化合物は、植物特性、例えば、収穫される原料の成長、収量および品質を改善するための薬剤との混合物として使用することができる。

10

【0232】

本発明の特定の実施形態では、式(I)の化合物は、さらなる化合物、好ましくは以下に記載されるものとの混合物としての、製剤またはこれらの製剤から調製される使用形態の形態である。

【0233】

以下で言及される化合物のうちの1つが、種々の互変異性型で存在することができる場合、それぞれの場合について明白に言及されない場合であっても、これらの形態もまた含まれる。

【0234】

昆虫駆除剤／ダニ駆除剤／線虫駆除剤

20

「一般名」によって本明細書に記載される活性成分は既知であり、例えば、The Pesticide Manual, 16th ed., British Crop Protection Council 2012に記載されているか、またはインターネット(例えば、<http://www.alanwood.net/pesticides>)で検索することができる。

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

30

40

(2) GABA作動性クロライドチャネルアンタゴニスト、例えば、シクロジエンー有機塩素、例えば、クロルデンおよびエンドスルファン、またはフェニルピラゾール(フィプロールス)、例えば、エチプロールおよびフィプロニル。

(3) ナトリウムチャネル調節剤／電位作動型ナトリウムチャネル遮断薬、例えば、ピレスロイド、例えば、アクリナトリン、アレスリン、dーシースーランスアレスリン、dー

50

トランスアレスリン、ピフェントリン、ピオアレトリン、ピオアレトリン s-シクロペン
 テニル異性体、ピオレスメトリン、シクロプロトリン、シフルトリン、 β -シフルトリン
 、シハロトリン、 λ -シハロトリン、 γ -シハロトリン、シペルメトリン、 α -シペルメ
 トリン、 β -シペルメトリン、 θ -シペルメトリン、 ζ -シペルメトリン、シフェノトリ
 ン〔(1R)-トランス異性体〕、デルタメトリン、エンペントリン〔(EZ)- (1R)
)異性体〕、エスフェンバレレート、エトフェンプロックス、フェンプロパスリン、フェ
 ンバレレート、フルシトリネート、フルメトリン、 τ -フルバリネート、ハルフェンプロ
 ックス、イミプロスリン、カデトリン、ペルメトリン、フェノトリン〔(1R)-トラン
 ス異性体〕、プラレトリン、ピレトリン(ジョチュウギク)、レスメトリン、シラフルオ
 フェン、テフルトリン、テトラメトリン、テトラメトリン〔(1R)異性体〕、トラロ
 メトリンおよびトランスフルトリン、またはDDTもしくはメトキシシクロロ。

10

(4) ニコチン性アセチルコリン受容体(nAChR)アゴニスト、例えば、ネオニコチ
 ノイド、例えば、アセタミプリド、クロチアニジン、ジノテフラン、イミダクロプリド、
 ニテンピラム、チアクロプリドおよびチアメトキサム、またはニコチンもしくはスルホキ
 サフロール。

(5) ニコチン性アセチルコリン受容体(nAChR)のアロステリック活性化剤、例え
 ば、スピノシン、例えば、スピネトラムおよびスピノサド。

(6) クロライドチャネル活性化剤、例えば、エパーメクチン/ミルベマイシン、例えば
 、アバメクチン、エマメクチン安息香酸塩、レピメクチンおよびミルベメクチン。

(7) 幼若ホルモン模倣物、例えば、幼若ホルモン類似体、例えば、ヒドロブレン、キノ
 プレンおよびメトブレン、またはフェノキシカルブもしくはピリプロキシフェン。

20

(8) 未知の作用または非特異的機構を有する活性成分、例えば
 アルキルハロゲン化物、例えば、メチル臭化物および他のアルキルハロゲン化物；または
 クロロピクリンもしくはフッ化スルフルルもしくはホウ砂もしくは吐酒石。

(9) 選択性摂食抑制物質、例えば、ピメトロジンまたはフロニカミド。

(10) ダニ成長阻害剤、例えば、クロフェンテジン、ヘキシチアゾクスおよびジフロビ
 ダジン、またはエトキサゾール。

(11) 昆虫腸膜の微生物攪乱物質、例えば、バチルス・チューリングエンシス亜種イスラ
 エレンシス(*Bacillus thuringiensis subspecies israelensis*)、バチルス・スファエリクス(*Bacillus sphae*
ricus)、バチルス・チューリングエンシス亜種アイザワイ(*Bacillus th*
uringiensis subspecies aizawai)、バチルス・チュー
 リンゲンシス亜種クルスタキ(*Bacillus thuringiensis sub*
species kurstaki)、バチルス・チューリングエンシス亜種テネブリオニ
 ス(*Bacillus thuringiensis subspecies tene*
brionis)およびBT植物タンパク質:Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1F
 a、Cry2Ab、mCry3A、Cry3Ab、Cry3Bb、Cry34/35Ab
 1。

30

(12) 酸化的リン酸化反応阻害剤、ATP攪乱物質、例えば、ジアフェンチウロンまた
 は有機スズ化合物、例えば、アザシクロチン、シヘキサチンおよび酸化フェンブタスズ、
 またはプロパルギットもしくはテトラジホン。

40

(13) Hプロトン勾配を遮断する酸化的リン酸化反応脱共役剤、例えば、クロルフェナ
 ピル、DNOCおよびスルフルアミド。

(14) ニコチン性アセチルコリン受容体アンタゴニスト、例えば、ベンスルタップ、カ
 ルタップ塩酸塩、チオシクラムおよびチオスルタップーナトリウム。

(15) キチン質生合成阻害剤、0型、例えば、ビストリフルロン、クロルフルアズロン
 、ジフルベンズロン、フルシクロクスロン、フルフェノクスロン、ヘキサフルムロン、ル
 フェヌロン、ノバルロン、ノビフルムロン、テフルベンズロンおよびトリフルムロン。

(16) キチン質生合成阻害剤、1型、例えば、ブプロフェジン。

(17) 脱皮阻害剤(特に双翅目、すなわち双翅類)、例えば、シロマジン。

50

(18) エクジソン受容体アゴニスト、例えば、クロマフェノジド、ハロフェノジド、メトキシフェノジドおよびテブフェノジド。

(19) オクトパミン性 (Octopamine ergic) アゴニスト、例えば、アミトラズ。

(20) 複合体-I I I 電子伝達阻害剤、例えば、ヒドラメチルノン；またはアセキノシル；またはフルアクリピリム。

(21) 複合体-I 電子伝達阻害剤、例えば、MET I ダニ駆除剤の群の、例えば、フェナザキン、フェンピロキシメート、ピリミジフェン、ピリダベン、テブフェンピラドおよびトルフェンピラド、またはロテノン (Derri s)。

(22) 電位作動型ナトリウムチャネル遮断薬、例えば、インドキサカルブまたはメタフルミゾン。

(23) アセチル-CoAカルボキシラーゼの阻害剤、例えば、テترون酸およびテトラミン酸誘導体、例えば、スピロジクロフェン、スピロメシフェンならびにスピロテトラマト。

(24) 複合体-I V 電子伝達阻害剤、例えば、ホスフィン、例えば、リン化アルミニウム、リン化カルシウム、ホスフィンおよびリン化亜鉛、またはシアン化物。

(25) 複合体-I I 電子伝達阻害剤、例えば、シエノピラフェンおよびシフルメトフェン。

(28) リアノジン受容体エフェクター、例えば、ジアミド、例えば、クロラントラニリプロール、シアントラニリプロールおよびフルベンジアミド、

さらなる活性成分、例えば、アフィドピロベン、アザジラクチン、ベンクロチアズ、ベンゾキシメート、ビフェナゼート、プロモプロピレート、キノメチオナト、氷晶石、

ジコホル、ジフロビダジン、フルエンシルホン、フロメトキン、フルフェネリム、フルフェノキシストロビン、フルフィプロール、フルオピラム、フルピラジフロノ、フフェノジド、ヘプタフルスリン、イミダクロチズ、イプロジオン、メペルフルスリン、パイコンジン、ピフルブミド、ピリフルキナゾン、ピリミノストロビン、テトラメチルフルスリンおよびヨードメタン；およびバチルス・フィルムス (I-1582、BioNeem、Votivo) に基づく調製物、および以下の化合物：3-プロモ-N- {2-プロモ-4-クロロ-6- [(1-シクロプロピルエチル) カルバモイル] フェニル} -1- (3-クロロピリジン-2-イル) -1H-ピラゾール-5-カルボキサミド (国際公開第2005/077934号から既知である) および1- {2-フルオロ-4-メチル-5- [(2, 2, 2-トリフルオロエチル) スルフィニル] フェニル} -3- (トリフルオロメチル) -1H-1, 2, 4-トリアゾール-5-アミン (国際公開第2006/043635号から既知である)、{1'- [(2E) -3- (4-クロロフェニル) プロプ-2-エン-1-イル] -5-フルオロスピロ [インドール-3, 4'-ビペリジン] -1 (2H) -イル} (2-クロロピリジン-4-イル) メタノン (国際公開第2003/106457号から既知である)、2-クロロ-N- [2- {1- [(2E) -3- (4-クロロフェニル) プロプ-2-エン-1-イル] ビペリジン-4-イル} -4- (トリフルオロメチル) フェニル] イソニコチンアミド (国際公開第2006/003494号から既知である)、3- (2, 5-ジメチルフェニル) -4-ヒドロキシ-8-メトキシ-1, 8-ジアザスピロ [4. 5] デカ-3-エン-2-オン (国際公開第2009/049851号から既知である)、3- (2, 5-ジメチルフェニル) -8-メトキシ-2-オキソ-1, 8-ジアザスピロ [4. 5] デカ-3-エン-4-イル-エチルカルボネート (国際公開第2009/049851号から既知である)、4- (ブター-2-イン-1-イルオキシ) -6- (3, 5-ジメチルビペリジン-1-イル) -5-フルオロピリミジン (国際公開第2004/099160号から既知である)、4- (ブター-2-イン-1-イルオキシ) -6- (3-クロロフェニル) ピリミジン (国際公開第2003/076415号から既知である)、PF1364 (CAS Reg. No. 1204776-60-2)、4- [5- (3, 5-ジクロロフェニル) -5- (トリフルオロメチル) -4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-3-イル] -2-メチル-N- {2-オキソ-2

10

20

30

40

50

ー〔(2, 2, 2-トリフルオロエチル)アミノ〕エチル}ベンズアミド(国際公開第2005/085216号から既知である)、4-〔5-〔3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)フェニル〕-5-(トリフルオロメチル)-4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-3-イル〕-N-〔2-オキソ-2-〔(2, 2, 2-トリフルオロエチル)アミノ〕エチル〕-1-ナフタアミド(国際公開第2009/002809号から既知である)、メチル2-〔2-(〔〔3-プロモ-1-(3-クロロピリジン-2-イル)-1H-ピラゾール-5-イル〕カルボニル〕アミノ)-5-クロロ-3-メチルベンゾイル〕-2-メチルヒドラジンカルボン酸(国際公開第2005/085216号から既知である)、メチル2-〔2-(〔〔3-プロモ-1-(3-クロロピリジン-2-イル)-1H-ピラゾール-5-イル〕カルボニル〕アミノ)-5-シアノ-3-メチルベンゾイル〕-2-エチルヒドラジンカルボン酸(国際公開第2005/085216号から既知である)、メチル2-〔2-(〔〔3-プロモ-1-(3-クロロピリジン-2-イル)-1H-ピラゾール-5-イル〕カルボニル〕アミノ)-5-シアノ-3-メチルベンゾイル〕-2-メチルヒドラジンカルボン酸(国際公開第2005/085216号から既知である)、メチル2-〔3, 5-ジプロモ-2-(〔〔3-プロモ-1-(3-クロロピリジン-2-イル)-1H-ピラゾール-5-イル〕カルボニル〕アミノ)ベンゾイル〕-2-エチルヒドラジンカルボン酸(国際公開第2005/085216号から既知である)、1-(3-クロロピリジン-2-イル)-N-〔4-シアノ-2-メチル-6-(メチルカルバモイル)フェニル〕-3-〔〔5-(トリフルオロメチル)-2H-テトラゾール-2-イル〕メチル〕-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド(国際公開第2010/069502号から既知である)、N-〔2-(5-アミノ-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル)-4-クロロ-6-メチルフェニル〕-3-プロモ-1-(3-クロロピリジン-2-イル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド(中国特許第102057925号から既知である)、3-クロロ-N-(2-シアノプロパン-2-イル)-N-〔4-(1, 1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル)-2-メチルフェニル〕フタルアミド(国際公開第2012/034472号から既知である)、8-クロロ-N-〔(2-クロロ-5-メトキシフェニル)スルホニル〕-6-(トリフルオロメチル)イミダゾ〔1, 2-a〕ピリジン-2-カルボキサミド(国際公開第2010/129500号から既知である)、4-〔5-(3, 5-ジクロロフェニル)-5-(トリフルオロメチル)-4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-3-イル〕-2-メチル-N-(1-オキシドチエタン-3-イル)ベンズアミド(国際公開第2009/080250号から既知である)、4-〔5-(3, 5-ジクロロフェニル)-5-(トリフルオロメチル)-4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-3-イル〕-2-メチル-N-(1-オキシドチエタン-3-イル)ベンズアミド(国際公開第2012/029672号から既知である)、1-〔(2-クロロ-1, 3-チアジアゾール-5-イル)メチル〕-4-オキソ-3-フェニル-4H-ピリド〔1, 2-a〕ピリミジン-1-イウム-2-オレート(国際公開第2009/099929号から既知である)、1-〔(6-クロロピリジン-3-イル)メチル〕-4-オキソ-3-フェニル-4H-ピリド〔1, 2-a〕ピリミジン-1-イウム-2-オレート(国際公開第2009/099929号から既知である)、(5S, 8R)-1-〔(6-クロロピリジン-3-イル)メチル〕-9-ニトロ-2, 3, 5, 6, 7, 8-ヘキサヒドロ-1H-5, 8-エポキシイミダゾ〔1, 2-a〕アゼピン(国際公開第2010/069266号から既知である)、(2E)-1-〔(6-クロロピリジン-3-イル)メチル〕-N'-ニトロ-2-ペンチリデンヒドラジンカルボキシイミドアミド(国際公開第2010/060231号から既知である)、4-(3-〔2, 6-ジクロロ-4-〔(3, 3-ジクロロプロプ-2-エン-1-イル)オキシ〕フェノキシ〕プロポキシ)-2-メトキシ-6-(トリフルオロメチル)ピリミジン(中国特許第101337940号から既知である)、N-〔2-(tert-ブチルカルバモイル)-4-クロロ-6-メチルフェニル〕-1-(3-クロロピリジン-2-イル)-3-(フルオロメトキシ)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド(国際公開第2008/134969号から既知である)。

10

20

30

40

50

【0235】

抗真菌剤

一般名によって本明細書に記載される活性成分は既知であり、例えば、「Pesticide Manual」に、またはインターネット（例えば、<http://www.allanwood.net/pesticides>）に記載されている。

(1) エルゴステロール生合成阻害剤、例えば (1. 1) アルジモルフ、(1. 2) アザコナゾール、(1. 3) ビテルタノール、(1. 4) ブロムコナゾール、(1. 5) シプロコナゾール、(1. 6) ジクロブトラゾール、(1. 7) ジフェノコナゾール、(1. 8) ジニコナゾール、(1. 9) ジニコナゾール-M、(1. 10) ドデモルフ、(1. 11) ドデモルフ アセテート、(1. 12) エボキシコナゾール、(1. 13) エタコナゾール、(1. 14) フェナリモルフ、(1. 15) フェンブコナゾール、(1. 16) フェンヘキサミド、(1. 17) フェンプロピジン、(1. 18) フェンプロピモルフ、(1. 19) フルキンコナゾール、(1. 20) フルルプリミドール、(1. 21) フルシラゾール、(1. 22) フルトリアホル、(1. 23) フルコナゾール、(1. 24) フルコナゾール-cis、(1. 25) ヘキサコナゾール、(1. 26) イマザリル、(1. 27) イマザリル硫酸塩、(1. 28) イミベンコナゾール、(1. 29) イプロコナゾール、(1. 30) メトコナゾール、(1. 31) ミクロブタニル、(1. 32) ナフチフィン、(1. 33) ヌアリモルフ、(1. 34) オキシボコナゾール、(1. 35) パクロブトラゾール、(1. 36) ペフラゾエート、(1. 37) ペンコナゾール、(1. 38) ピペラリン、(1. 39) プロクロラズ、(1. 40) プロピコナゾール、(1. 41) プロチオコナゾール、(1. 42) ピリブチカルブ、(1. 43) ピリフェノックス、(1. 44) キンコナゾール、(1. 45) シメコナゾール、(1. 46) スピロキサミン、(1. 47) テブコナゾール、(1. 48) テルビナフィン、(1. 49) テトラコナゾール、(1. 50) トリアジメホン、(1. 51) トリアジメノール、(1. 52) トリデモルフ、(1. 53) トリフルミゾール、(1. 54) トリホリン、(1. 55) トリチコナゾール、(1. 56) ウニコナゾール、(1. 57) ウニコナゾール-P、(1. 58) ビニコナゾール、(1. 59) ボリコナゾール、(1. 60) 1-(4-クロロフェニル)-2-(1H-1, 2, 4-トリアゾル-1-イル) シクロヘプタノール、(1. 61) メチル 1-(2, 2-ジメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル)-1H-イミダゾール-5-カルボン酸塩、(1. 62) N'-{5-(ジフルオロメチル)-2-メチル-4-[3-(トリメチルシリル)プロポキシ]フェニル}-N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(1. 63) N-エチル-N-メチル-N'-{2-メチル-5-(トリフルオロメチル)-4-[3-(トリメチルシリル)プロポキシ]フェニル}イミドホルムアミドおよび(1. 64) O-[1-(4-メトキシフェノキシ)-3, 3-ジメチルブタン-2-イル]-1H-イミダゾール-1-カルボチオエート、(1. 65) ピリソキサゾール。

(2) 呼吸阻害剤（呼吸鎖阻害剤）、例えば (2. 1) ビキサフェン、(2. 2) ボスカリド、(2. 3) カルボキシシン、(2. 4) ジフルメトリム、(2. 5) フェンフラム、(2. 6) フルオピラム、(2. 7) フルトラニル、(2. 8) フルキサピロキサド、(2. 9) フラメトピル、(2. 10) フルメシクロックス、(2. 11) 合成エピマーラセミ体 1RS、4SR、9RS と、抗エンピメリック (empimeric) ラセミ体 1RS、4SR、9SR とのイソピラザム混合物、(2. 12) イソピラザム（抗エピマーラセミ体）、(2. 13) イソピラザム（抗エピマー鏡像異性体 1R、4S、9S）、(2. 14) イソピラザム（抗エピマー鏡像異性体 1S、4R、9R）、(2. 15) イソピラザム（合成エピマーラセミ体 1RS、4SR、9RS）、(2. 16) イソピラザム（合成エピマー鏡像異性体 1R、4S、9R）、(2. 17) イソピラザム（合成エピマー鏡像異性体 1S、4R、9S）、(2. 18) メプロニル、(2. 19) オキシカルボキシシン、(2. 20) ペンフルフェン、(2. 21) ペンチオピラド、(2. 22) セダキサン、(2. 23) チフルザミド、(2. 24) 1-メチル-N-[2-(1, 1, 2, 2-テトラフルオロエトキシ)フェニル]-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラ

10

20

30

40

50

- ゾールー 4-カルボキサミド、(2. 25) 3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-N-[2-(1, 1, 2, 2-テトラフルオロエトキシ)フェニル]-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2. 26) 3-(ジフルオロメチル)-N-[4-フルオロ-2-(1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘキサフルオロプロポキシ)フェニル]-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2. 27) N-[1-(2, 4-ジクロロフェニル)-1-メトキシプロパン-2-イル]-3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2. 28) 5, 8-ジフルオロ-N-[2-(2-フルオロ-4-{[4-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-イル]オキシ}フェニル)エチル]キナゾリン-4-アミン、(2. 29) ベンゾベンジフルピル、(2. 30) N-[(1S, 4R)-9-(ジクロロメチレン)-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1, 4-メタノナフタレン-5-イル]-3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミドおよび(2. 31) N-[(1R, 4S)-9-(ジクロロメチレン)-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1, 4-メタノナフタレン-5-イル]-3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2. 32) 3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-N-(1, 1, 3-トリメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル)-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2. 33) 1, 3, 5-トリメチル-N-(1, 1, 3-トリメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル)-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2. 34) 1-メチル-3-(トリフルオロメチル)-N-(1, 1, 3-トリメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル)-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2. 35) 1-メチル-3-(トリフルオロメチル)-N-[(3R)-1, 1, 3-トリメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル]-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2. 36) 1-メチル-3-(トリフルオロメチル)-N-[(3S)-1, 1, 3-トリメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル]-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2. 37) 3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-N-[(3S)-1, 1, 3-トリメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル]-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2. 38) 3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-N-[(3R)-1, 1, 3-トリメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル]-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2. 39) 1, 3, 5-トリメチル-N-[(3R)-1, 1, 3-トリメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル]-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2. 40) 1, 3, 5-トリメチル-N-[(3S)-1, 1, 3-トリメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル]-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2. 41) ペノダニル、(2. 42) 2-クロロ-N-(1, 1, 3-トリメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル)ピリジン-3-カルボキサミド、(2. 43) イソフェタミド
- (3) 呼吸鎖の複合体 I I I に作用する呼吸阻害剤(呼吸鎖阻害剤)、例えば(3. 1) アメトクトラジン、(3. 2) アミスルブロム、(3. 3) アゾキシストロビン、(3. 4) シアゾファミド、(3. 5) コウメトキシストロビン、(3. 6) クモキシストロビン、(3. 5) ジモキシストロビン、(3. 8) エネストロブリン、(3. 9) ファモキサドン、(3. 10) フェナミドン、(3. 11) フルフェノキシストロビン、(3. 12) フルオキサストロビン、(3. 13) クレソキシム-メチル、(3. 14) メトミノストロビン、(3. 15) オリサストロビン、(3. 16) ピコキシストロビン、(3. 17) ピラクロストロビン、(3. 18) ピラメトストロビン、(3. 19) ピラオキシストロビン、(3. 20) ピリベンカルブ、(3. 21) トリクロピリカルブ、(3. 22) トリフロキシストロビン、(3. 23) (2E)-2-(2-{[6-(3-クロロ-2-メチルフェノキシ)-5-フルオロピリミジン-4-イル]オキシ}フェニル)-2-(メトキシイミノ)-N-メチルエタナミド、(3. 24) (2E)-2-(メトキシイミノ)-N-メチル-2-(2-{[(1E)-1-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチリデン}アミノ]オキシ}メチル}フェニル)エタナミド、(3. 2

5) (2E)-2-(メトキシイミノ)-N-メチル-2-{2-[(E)-({1-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エトキシ}イミノ)メチル]フェニル}エタナミド、(3.26) (2E)-2-{2-[({ [(1E)-1-(3-{ [(E)-1-フルオロ-2-フェニルエチル]オキシ}フェニル)エチリデン]アミノ}オキシ)メチル]フェニル}-2-(メトキシイミノ)-N-メチルエタナミド、(3.27) (2E)-2-{2-[({ [(2E, 3E)-4-(2, 6-ジクロロフェニル)ブター3-エン-2-イリデン]アミノ}オキシ)メチル]フェニル}-2-(メトキシイミノ)-N-メチルエタナミド、(3.28) 2-クロロ-N-(1, 1, 3-トリメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル)ピリジン-3-カルボキサミド、(3.29) 5-メトキシ-2-メチル-4-(2-{ [({ (1E)-1-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチリデン]アミノ}オキシ)メチル]フェニル)-2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾル-3-オン、(3.30) メチル(2E)-2-{2-[({ シクロプロピル [(4-メトキシフェニル)イミノ]メチル}スルファニル)メチル]フェニル}-3-メトキシプロプ-2-エノエート、(3.31) N-(3-エチル-3, 5, 5-トリメチルシクロヘキシル)-3-(ホルミルアミノ)-2-ヒドロキシベンズアミド、(3.32) 2-{2-[(2, 5-ジメチルフェノキシ)メチル]フェニル}-2-メトキシ-N-メチルアセトアミド、(4) 有糸分裂および細胞分裂の阻害剤、例えば(4.1)ベノミル、(4.2)カルベンダジム、(4.3)クロルフェナゾール、(4.4)ジエトフェンカルブ、(4.5)エタボキサム、(4.6)フルオピコリド、(4.7)フベリダゾール、(4.8)ペンシクロン、(4.9)チアベンダゾール、(4.10)チオファネート-メチル、(4.11)チオファネート、(4.12)ゾキサミド、(4.13) 5-クロロ-7-(4-メチルピペリジン-1-イル)-6-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)[1, 2, 4]トリアゾロ[1, 5-a]ピリミジンおよび(4.14) 3-クロロ-5-(6-クロロピリジン-3-イル)-6-メチル-4-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)ピリダジン。

(5) 多部位活性を有する化合物、例えば、(5.1)ボルドー混合物、(5.2)カプタホール、(5.3)カプタン、(5.4)クロロタロニル、(5.5)水酸化銅等の銅調製物、(5.6)ナフテン酸銅、(5.7)酸化銅、(5.8)オキシ塩化銅、(5.9)硫酸銅、(5.10)ジクロフルアニド、(5.11)ジチアノン、(5.12)ドジン、(5.13)ドジン遊離塩基、(5.14)フェルバム、(5.15)フルオルホルベット、(5.16)ホルベット、(5.17)グアザチン、(5.18)グアザチンアセテート、(5.19)イミノクタジン、(5.20)イミノクタジンアルベシレート、(5.21)イミノクタジントリアセテート、(5.22)マンカップパー(mancopper)、(5.23)マンコゼブ、(5.24)マンネブ、(5.25)メチラム(metiram)、(5.26)亜鉛メチラム(zinc metiram)、(5.27)オキシシン銅、(5.28)プロバミジン、(5.29)プロピネブ、(5.30)硫黄および硫黄調製物、例えば、カルシウムポリサルファイド、(5.31)チラム、(5.32)トリフルアニド、(5.33)ジネブ、(5.34)ジラム、ならびに(5.35)アニラジン。

(6) 抵抗性誘導物、例えば、(6.1)アシベンゾラル-S-メチル、(6.2)イソチアニル、(6.3)プロベナゾール、(6.4)チアジニルおよび(6.5)ラミナリン。

(7) アミノ酸およびタンパク質生合成阻害剤、例えば、(7.1)、(7.2)プラスチジン-S、(7.3)シプロジニル、(7.4)カスガマイシン、(7.5)カスガマイシン塩酸塩水和物、(7.6)メバニピリム、(7.7)ピリメタニル、(7.8) 3-(5-フルオロ-3, 3, 4, 4-テトラメチル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリンおよび(7.9)オキシテトラサイクリンおよび(7.10)ストレプトマイシン。

(8) ATP産生阻害剤、例えば、(8.1)酢酸フェンチン、(8.2)塩化フェンチン、(8.3)水酸化フェンチンおよび(8.4)シルチオフアム。

10

20

30

40

50

(9) 細胞壁合成阻害剤、例えば、(9. 1) ベンチアバリカルブ、(9. 2) ジメトモルフ、(9. 3) フルモルフ、(9. 4) イプロバリカルブ、(9. 5) マンジプロパミド、(9. 6) ポリオキシシン、(9. 7) ポリオキシソリム、(9. 8) バリダマイシンA、(9. 9) バリフェナラートおよび(9. 10) ポリオキシシンB。

(10) 脂質および膜合成阻害剤、例えば、(10. 1) ビフェニル、(10. 2) クロルネブ、(10. 3) ジクロラン、(10. 4) エジフェンホス、(10. 5) エトリジアゾール、(10. 6) ヨードカルブ、(10. 7) イプロベンホス、(10. 8) イソプロチオラン、(10. 9) プロパモカルブ、(10. 10) 塩酸プロパモカルブ、(10. 11) プロチオカルブ、(10. 12) ピラゾホス、(10. 13) キントゼン、(10. 14) テクナゼンおよび(10. 15) トルククロホスーメチル。

(11) メラニン生合成阻害剤、例えば(11. 1) カルプロパミド、(11. 2) ジクロシメット、(11. 3) フェノキサニル、(11. 4) フサライド、(11. 5) ピロキロン、(11. 6) トリシクラゾールおよび(11. 7) 2, 2, 2-トリフルオロエチル {3-メチル-1-[(4-メチルベンゾイル) アミノ] ブタン-2-イル} カルバメート。

(12) 核酸合成阻害剤、例えば、(12. 1) ベナラキシル、(12. 2) ベナラキシルーM (キララキシル)、(12. 3) ブピリメート、(12. 4) クロジラコン、(12. 5) ジメチリモール、(12. 6) エチリモール、(12. 7) フララキシル、(12. 8) ヒメキサゾール、(12. 9) メタラキシル、(12. 10) メタラキシルーM (メフェノキサム)、(12. 11) オフレース、(12. 12) オキサジキシル、(12. 13) オキシソリニン酸および(12. 14) オクチリノン。

(13) シグナル伝達阻害剤、例えば、(13. 1) クロゾリナート、(13. 2) フェンピクロニル、(13. 3) フルジオキシソニル、(13. 4) イプロジオン、(13. 5) プロシミドン、(13. 6) キノキシフェン、(13. 7) ビンクロゾリンおよび(13. 8) プロキナジド。

(14) 脱共役剤、例えば、(14. 1) ビナバクリル、(14. 2) ジノカップ、(14. 3) フェリムゾン、(14. 4) フルアジナムおよび(14. 5) メプチルジノカップ。

(15) さらなる化合物、例えば、(15. 1) ベンチアゾール、(15. 2) ベトキサジン、(15. 3) カプシマイシン、(15. 4) カルボン、(15. 5) キノメチオナト、(15. 6) ピリオフェノン (クラザフェノン)、(15. 7) クフラネブ、(15. 8) シフルフェナミド、(15. 9) シモキサニル、(15. 10) シプロスルファミド、(15. 11) ダゾメット、(15. 12) デバカルブ、(15. 13) ジクロロフェン、(15. 14) ジクロメジン、(15. 15) ジフェンゾクワット、(15. 16) ジフェンゾクワット硫酸メチル、(15. 17) ジフェニルアミン、(15. 18) Ec o M a t e、(15. 19) フェンピラザミン、(15. 20) フルメトベル、(15. 21) フルオリミド、(15. 22) フルスルファミド、(15. 23) フルチアニル、(15. 24) ホセチルーアルミニウム、(15. 25) ホセチルーカルシウム、(15. 26) ホセチルーナトリウム、(15. 27) ヘキサクロロベンゼン、(15. 28) イルマイシン、(15. 29) メタスルホカルブ、(15. 30) メチルイソチオシアネート、(15. 31) メトラフェノン、(15. 32) ミルジオマイシン、(15. 33) ナタマイシン、(15. 34) ジメチルジチオカルバミン酸ニッケル、(15. 35) ニトロタールーイソプロピル、(15. 36) オクチリノン、(15. 37) オクサモカルブ、(15. 38) オキシフェンチン、(15. 39) ペンタクロロフェノールおよびその塩、(15. 40) フェノトリン、(15. 41) リン酸およびその塩、(15. 42) プロパモカルブ-ホセチレート、(15. 43) プロパノシン-ナトリウム、(15. 44) ピリモルフ、(15. 45) (2E)-3-(4-tert-ブチルフェニル)-3-(2-クロロピリジン-4-イル)-1-(モルホリン-4-イル) プロプ-2-エン-1-オン、(15. 46) (2Z)-3-(4-tert-ブチルフェニル)-3-(2-クロロピリジン-4-イル)-1-(モルホリン-4-イル) プロプ-2

10

20

30

40

50

-エン-1-オン、(15. 47) ピロールニトリン、(15. 48) テブフロキン、(15. 49) テクロフタラム、(15. 50) トルニファニド、(15. 51) トリアゾキシド、(15. 52) トリクラミド、(15. 53) ザリラミド、(15. 54) (3S, 6S, 7R, 8R) -8-ベンジル-3-[({3-[(イソブチリルオキシ) メトキシ] -4-メトキシピリジン-2-イル} カルボニル) アミノ] -6-メチル-4, 9-ジオキソ-1, 5-ジオキソナン-7-イル 2-メチルプロパノエート、(15. 55) 1-(4-{4-[(5R) -5-(2, 6-ジフルオロフェニル) -4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-3-イル] -1, 3-チアゾール-2-イル} ピペリジン-1-イル) -2-[5-メチル-3-(トリフルオロメチル) -1H-ピラゾール-1-イル] エタノン、(15. 56) 1-(4-{4-[(5S) -5-(2, 6-ジフルオロフェニル) -4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-3-イル] -1, 3-チアゾール-2-イル} ピペリジン-1-イル) -2-[5-メチル-3-(トリフルオロメチル) -1H-ピラゾール-1-イル] エタノン、(15. 57) 1-(4-{4-[5-(2, 6-ジフルオロフェニル) -4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-3-イル] -1, 3-チアゾール-2-イル} ピペリジン-1-イル) -2-[5-メチル-3-(トリフルオロメチル) -1H-ピラゾール-1-イル] エタノン、(15. 58) 1-(4-メトキシフェノキシ) -3, 3-ジメチルブタン-2-イル 1H-イミダゾール-1-カルボキシレート、(15. 59) 2, 3, 5, 6-テトラクロロ-4-(メチルスルホニル) ピリジン、(15. 60) 2, 3-ジブチル-6-クロロチエノ [2, 3-d] ピリミジン-4 (3H) -オン、(15. 61) 2, 6-ジメチル-1H, 5H-[1, 4] ジチイノ [2, 3-c: 5, 6-c'] ジピロール-1, 3, 5, 7 (2H, 6H) -テトロン、(15. 62) 2-[5-メチル-3-(トリフルオロメチル) -1H-ピラゾール-1-イル] -1-(4-{4-[(5R) -5-フェニル-4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-3-イル] -1, 3-チアゾール-2-イル} ピペリジン-1-イル) エタノン、(15. 63) 2-[5-メチル-3-(トリフルオロメチル) -1H-ピラゾール-1-イル] -1-(4-{4-[(5S) -5-フェニル-4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-3-イル] -1, 3-チアゾール-2-イル} ピペリジン-1-イル) エタノン、(15. 64) 2-[5-メチル-3-(トリフルオロメチル) -1H-ピラゾール-1-イル] -1-{4-[4-(5-フェニル-4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-3-イル) -1, 3-チアゾール-2-イル] ピペリジン-1-イル} エタノン、(15. 65) 2-ブトキシ-6-ヨード-3-プロピル-4H-クロメン-4-オン、(15. 66) 2-クロロ-5-[2-クロロ-1-(2, 6-ジフルオロ-4-メトキシフェニル) -4-メチル-1H-イミダゾール-5-イル] ピリジン、(15. 67) 2-フェニルフェノールおよび塩、(15. 68) 3-(4, 4, 5-トリフルオロ-3, 3-ジメチル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル) キノリン、(15. 69) 3, 4, 5-トリクロロピリジン-2, 6-ジカルボニトリル、(15. 70) 3-クロロ-5-(4-クロロフェニル) -4-(2, 6-ジフルオロフェニル) -6-メチルピリダジン、(15. 71) 4-(4-クロロフェニル) -5-(2, 6-ジフルオロフェニル) -3, 6-ジメチルピリダジン、(15. 72) 5-アミノ-1, 3, 4-チアジアゾール-2-チオール、(15. 73) 5-クロロ-N'-フェニル-N'- (プロプ-2-イン-1-イル) チオフェン-2-スルホノヒドラジド、(15. 74) 5-フルオロ-2-[(4-フルオロベンジル) オキシ] ピリミジン-4-アミン、(15. 75) 5-フルオロ-2-[(4-メチルベンジル) オキシ] ピリミジン-4-アミン、(15. 76) 5-メチル-6-オクチル [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5-a] ピリミジン-7-アミン、(15. 77) エチル (2Z) -3-アミノ-2-シアノ-3-フェニルアクリラート、(15. 78) N'- (4-{ [3-(4-クロロベンジル) -1, 2, 4-チアジアゾール-5-イル] オキシ} -2, 5-ジメチルフェニル) -N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(15. 79) N-(4-クロロベンジル) -3-[3-メトキシ-4-(プロプ-2-イン-1-イルオキシ) フェニル] プロパンアミド、(15. 80) N-[(4-クロロフェニル) (シアノ) メチル

10

20

30

40

50

] - 3 - [3 - メトキシ - 4 - (プロブ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) フェニル] プロパ
 ンアミド、 (15. 81) N - [(5 - プロモ - 3 - クロロピリジン - 2 - イル) メチル
] - 2, 4 - ジクロロニコチンアミド、 (15. 82) N - [1 - (5 - プロモ - 3 - ク
 ロロピリジン - 2 - イル) エチル] - 2, 4 - ジクロロニコチンアミド、 (15. 83)
 N - [1 - (5 - プロモ - 3 - クロロピリジン - 2 - イル) エチル] - 2 - フルオロ - 4
 - ヨードニコチンアミド、 (15. 84) N - { (E) - [(シクロプロピルメトキシ)
 イミノ] [6 - (ジフルオロメトキシ) - 2, 3 - ジフルオロフェニル] メチル } - 2 -
 フェニルアセトアミド、 (15. 85) N - { (Z) - [(シクロプロピルメトキシ) イ
 ミノ] [6 - (ジフルオロメトキシ) - 2, 3 - ジフルオロフェニル] メチル } - 2 - フ
 ェニルアセトアミド、 (15. 86) N' - { 4 - [(3 - tert - ブチル - 4 - シア
 ノ - 1, 2 - チアゾール - 5 - イル) オキシ] - 2 - クロロ - 5 - メチルフェニル } - N
 - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、 (15. 87) N - メチル - 2 - (1 - { [5 -
 メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] アセチル } ピ
 ペリジン - 4 - イル) - N - (1, 2, 3, 4 - テトラヒドロナフタレン - 1 - イル) -
 1, 3 - チアゾール - 4 - カルボキサミド、 (15. 88) N - メチル - 2 - (1 - { [5 -
 メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] アセチル } ピ
 ペリジン - 4 - イル) - N - [(1 R) - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロナフタレン - 1
 - イル] - 1, 3 - チアゾール - 4 - カルボキサミド、 (15. 89) N - メチル - 2 -
 (1 - { [5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] ア
 セチル } ピペリジン - 4 - イル) - N - [(1 S) - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロナフ
 タレン - 1 - イル] - 1, 3 - チアゾール - 4 - カルボキサミド、 (15. 90) ペンチ
 ル { 6 - [({ [(1 - メチル - 1 H - テトラゾール - 5 - イル) (フェニル) メチレン
] アミノ } オキシ) メチル] ピリジン - 2 - イル } カルバメート、 (15. 91) フェナ
 ジン - 1 - カルボン酸、 (15. 92) キノリン - 8 - オール、 (15. 93) キノリン
 - 8 - オール硫酸塩 (2 : 1)、 (15. 94) tert - ブチル { 6 - [({ [(1 -
 メチル - 1 H - テトラゾール - 5 - イル) (フェニル) メチレン] アミノ } オキシ) メチ
 ル] ピリジン - 2 - イル } カルバメート、 (15. 95) 1 - メチル - 3 - (トリフルオ
 ロメチル) - N - [2' - (トリフルオロメチル) ビフェニル - 2 - イル] - 1 H - ピラ
 ザール - 4 - カルボキサミド、 (15. 96) N - (4' - クロロビフェニル - 2 - イル)
 - 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、
 (15. 97) N - (2', 4' - ジクロロビフェニル - 2 - イル) - 3 - (ジフルオロ
 メチル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (15. 98) 3 - (ジ
 フルオロメチル) - 1 - メチル - N - [4' - (トリフルオロメチル) ビフェニル - 2
 - イル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (15. 99) N - (2', 5' -
 ジフルオロビフェニル - 2 - イル) - 1 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H -
 ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (15. 100) 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メ
 チル - N - [4' - (プロブ - 1 - イン - 1 - イル) ビフェニル - 2 - イル] - 1 H - ピ
 ラゾール - 4 - カルボキサミド、 (15. 101) 5 - フルオロ - 1, 3 - ジメチル - N
 - [4' - (プロブ - 1 - イン - 1 - イル) ビフェニル - 2 - イル] - 1 H - ピラゾール
 - 4 - カルボキサミド、 (15. 102) 2 - クロロ - N - [4' - (プロブ - 1 - イン
 - 1 - イル) ビフェニル - 2 - イル] ニコチンアミド、 (15. 103) 3 - (ジフルオ
 ロメチル) - N - [4' - (3, 3 - ジメチルブタ - 1 - イン - 1 - イル) ビフェニル -
 2 - イル] - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (15. 104) N
 - [4' - (3, 3 - ジメチルブタ - 1 - イン - 1 - イル) ビフェニル - 2 - イル] - 5
 - フルオロ - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (15. 105)
 3 - (ジフルオロメチル) - N - (4' - エチニルビフェニル - 2 - イル) - 1 - メ
 チル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (15. 106) N - (4' - エチニル
 ビフェニル - 2 - イル) - 5 - フルオロ - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カ
 ルボキサミド、 (15. 107) 2 - クロロ - N - (4' - エチニルビフェニル - 2 - イ
 ル) ニコチンアミド、 (15. 108) 2 - クロロ - N - [4' - (3, 3 - ジメチルブ

10

20

30

40

50

ター 1-イン-1-イル) ビフェニル-2-イル] ニコチンアミド、(15. 109) 4- (ジフルオロメチル)-2-メチル-N- [4'- (トリフルオロメチル) ビフェニル-2-イル]-1, 3-チアゾール-5-カルボキサミド、(15. 110) 5-フルオロ-N- [4'- (3-ヒドロキシ-3-メチルブター 1-イン-1-イル) ビフェニル-2-イル]-1, 3-ジメチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15. 111) 2-クロロ-N- [4'- (3-ヒドロキシ-3-メチルブター 1-イン-1-イル

ル) ビフェニル-2-イル] ニコチンアミド、(15. 112) 3- (ジフルオロメチル)-N- [4'- (3-メトキシ-3-メチルブター 1-イン-1-イル) ビフェニル-2-イル]-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15. 113) 5-フルオロ-N- [4'- (3-メトキシ-3-メチルブター 1-イン-1-イル) ビフェニル-2-イル]-1, 3-ジメチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15. 114) 2-クロロ-N- [4'- (3-メトキシ-3-メチルブター 1-イン-1-イル) ビフェニル-2-イル] ニコチンアミド、(15. 115) (5-プロモ-2-メトキシ-4-メチルピリジン-3-イル) (2, 3, 4-トリメトキシ-6-メチルフェニル) メタノン、(15. 116) N- [2- (4- { [3- (4-クロロフェニル) プロプ-2-イン-1-イル] オキシ} -3-メトキシフェニル) エチル]-N2- (メチルスルホニル) バリンアミド、(15. 117) 4-オキソ-4- [(2-フェニルエチル) アミノ] ブタン酸、(15. 118) ブター 3-イン-1-イル {6- [({ [(Z) - (1-メチル-1H-テトラゾール-5-イル) (フェニル) メチレン] アミノ} オキシ) メチル] ピリジン-2-イル} カルバメート、(15. 119) 4-アミノ-5-フルオロピリミジン-2-オール (互変異性型: 4-アミノ-5-フルオロピリミジン-2 (1H)-オン)、(15. 120) プロピル 3, 4, 5-トリヒドロキシ安息香酸塩、(15. 121) 1, 3-ジメチル-N- (1, 1, 3-トリメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル)-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15. 122) 1, 3-ジメチル-N- [(3R)-1, 1, 3-トリメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル]-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15. 123) 1, 3-ジメチル-N- [(3S)-1, 1, 3-トリメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル]-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15. 124) [3- (4-クロロ-2-フルオロフェニル)-5- (2, 4-ジフルオロフェニル)-1, 2-オキサゾール-4-イル] (ピリジン-3-イル) メタノール、(15. 125) (S)- [3- (4-クロロ-2-フルオロフェニル)-5- (2, 4-ジフルオロフェニル)-1, 2-オキサゾール-4-イル] (ピリジン-3-イル) メタノール、(15. 126) (R)- [3- (4-クロロ-2-フルオロフェニル)-5- (2, 4-ジフルオロフェニル)-1, 2-オキサゾール-4-イル] (ピリジン-3-イル) メタノール、(15. 127) 2- { [3- (2-クロロフェニル)-2- (2, 4-ジフルオロフェニル) オキシラン-2-イル] メチル}-2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-チオン、(15. 128) 1- { [3- (2-クロロフェニル)-2- (2, 4-ジフルオロフェニル) オキシラン-2-イル] メチル}-1H-1, 2, 4-トリアゾール-5-イルチオシアネート、(15. 129) 5- (アリルスルファニル)-1- { [3- (2-クロロフェニル)-2- (2, 4-ジフルオロフェニル) オキシラン-2-イル] メチル}-1H-1, 2, 4-トリアゾール、(15. 130) 2- [1- (2, 4-ジクロロフェニル)-5-ヒドロキシ-2, 6, 6-トリメチルヘプタン-4-イル]-2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-チオン、(15. 131) 2- { [rel (2R, 3S)-3- (2-クロロフェニル)-2- (2, 4-ジフルオロフェニル) オキシラン-2-イル] メチル}-2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-チオン、(15. 132) 2- { [rel (2R, 3R)-3- (2-クロロフェニル)-2- (2, 4-ジフルオロフェニル) オキシラン-2-イル] メチル}-2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-チオン、(15. 133) 1- { [rel (2R, 3S)-3- (2-クロロフェニル)-2-

10

20

30

40

50

(2, 4-ジフルオロフェニル) オキシラン-2-イル] メチル} -1H-1, 2, 4-
 トリアゾル-5-イルチオシアネート、(15. 134) 1- { [rel (2R, 3R)
 -3-(2-クロロフェニル)-2-(2, 4-ジフルオロフェニル) オキシラン-2-
 イル] メチル} -1H-1, 2, 4-トリアゾル-5-イルチオシアネート、(15. 1
 35) 5-(アリルスルファニル)-1- { [rel (2R, 3S)-3-(2-クロロ
 フェニル)-2-(2, 4-ジフルオロフェニル) オキシラン-2-イル] メチル} -1
 H-1, 2, 4-トリアゾール、(15. 136) 5-(アリルスルファニル)-1- {
 [rel (2R, 3R)-3-(2-クロロフェニル)-2-(2, 4-ジフルオロフェ
 ニル) オキシラン-2-イル] メチル} -1H-1, 2, 4-トリアゾール、(15. 1
 37) 2- [(2S, 4S, 5S)-1-(2, 4-ジクロロフェニル)-5-ヒドロキシ
 シ-2, 6, 6-トリメチルヘプタン-4-イル] -2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2,
 4-トリアゾール-3-チオン、(15. 138) 2- [(2R, 4S, 5S)-1-(
 2, 4-ジクロロフェニル)-5-ヒドロキシ-2, 6, 6-トリメチルヘプタン-4-
 イル] -2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-チオン、(15. 1
 39) 2- [(2R, 4R, 5R)-1-(2, 4-ジクロロフェニル)-5-ヒドロキシ
 シ-2, 6, 6-トリメチルヘプタン-4-イル] -2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2,
 4-トリアゾール-3-チオン、(15. 140) 2- [(2S, 4R, 5R)-1-(
 2, 4-ジクロロフェニル)-5-ヒドロキシ-2, 6, 6-トリメチルヘプタン-4-
 イル] -2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-チオン、(15. 1
 41) 2- [(2S, 4S, 5R)-1-(2, 4-ジクロロフェニル)-5-ヒドロキシ
 シ-2, 6, 6-トリメチルヘプタン-4-イル] -2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2,
 4-トリアゾール-3-チオン、(15. 142) 2- [(2R, 4S, 5R)-1-(
 2, 4-ジクロロフェニル)-5-ヒドロキシ-2, 6, 6-トリメチルヘプタン-4-
 イル] -2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-チオン、(15. 1
 43) 2- [(2R, 4R, 5S)-1-(2, 4-ジクロロフェニル)-5-ヒドロキシ
 シ-2, 6, 6-トリメチルヘプタン-4-イル] -2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2,
 4-トリアゾール-3-チオン、(15. 144) 2- [(2S, 4R, 5S)-1-(
 2, 4-ジクロロフェニル)-5-ヒドロキシ-2, 6, 6-トリメチルヘプタン-4-
 イル] -2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-チオン、(15. 1
 45) 2-フルオロ-6-(トリフルオロメチル)-N-(1, 1, 3-トリメチル-2
 , 3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル) ベンズアミド、(15. 146) 2-(6-
 -ベンジルピリジン-2-イル) キナゾリン、(15. 147) 2-[6-(3-フルオ
 ロ-4-メトキシフェニル)-5-メチルピリジン-2-イル] キナゾリン、(15. 1
 48) 3-(4, 4-ジフルオロ-3, 3-ジメチル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-
 1-イル) キノリン、(15. 149) アブシジン酸、(15. 150) 3-(ジフルオ
 ロメチル)-N-メトキシ-1-メチル-N-[1-(2, 4, 6-トリクロロフェニル)
) プロパン-2-イル] -1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15. 151) N
 ' -[5-プロモ-6-(2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-2-イルオキシ)-2-
 メチルピリジン-3-イル] -N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(15. 1
 52) N' -{5-プロモ-6-[1-(3, 5-ジフルオロフェニル) エトキシ]-2
 -メチルピリジン-3-イル} -N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(15.
 153) N' -{5-プロモ-6-[(1R)-1-(3, 5-ジフルオロフェニル) エ
 トキシ]-2-メチルピリジン-3-イル} -N-エチル-N-メチルイミドホルムアミ
 ド、(15. 154) N' -{5-プロモ-6-[(1S)-1-(3, 5-ジフルオロ
 フェニル) エトキシ]-2-メチルピリジン-3-イル} -N-エチル-N-メチルイミ
 ドホルムアミド、(15. 155) N' -{5-プロモ-6-[(シス-4-イソプロピ
 ルシクロヘキシル) オキシ]-2-メチルピリジン-3-イル} -N-エチル-N-メチ
 ルイミドホルムアミド、(15. 156) N' -{5-プロモ-6-[(トランス-4-
 イソプロピルシクロヘキシル) オキシ]-2-メチルピリジン-3-イル} -N-エチル
 -N-メチルイミドホルムアミド、(15. 157) N-シクロプロピル-3-(ジフル

10

20

30

40

50

オロメチル) - 5 - フルオロ - N - (2 - イソプロピルベンジル) - 1 - メチル - 1 H -
 ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15. 158) N - シクロプロピル - N - (2 - シ
 クロプロピルベンジル) - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H
 - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15. 159) N - (2 - tert - ブチルベン
 ジル) - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル -
 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15. 160) N - (5 - クロロ - 2 - エチ
 ルベンジル) - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メ
 チル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15. 161) N - (5 - クロロ - 2
 - イソプロピルベンジル) - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フル
 オロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15. 162) N - シク
 ロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - N - (2 - エチル - 5 - フルオロベンジル) -
 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15. 163)
 N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - N - (5 - フルオロ -
 2 - イソプロピルベンジル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(
 15. 164) N - シクロプロピル - N - (2 - シクロプロピル - 5 - フルオロベンジル)
 - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カ
 ルボキサミド、(15. 165) N - (2 - シクロペンチル - 5 - フルオロベンジル) -
 N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピ
 ラゾール - 4 - カルボキサミド、(15. 166) N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオ
 ロメチル) - 5 - フルオロ - N - (2 - フルオロ - 6 - イソプロピルベンジル) - 1 - メ
 チル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15. 167) N - シクロプロピル -
 3 - (ジフルオロメチル) - N - (2 - エチル - 5 - メチルベンジル) - 5 - フルオロ -
 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15. 168) N - シクロプロ
 ピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - N - (2 - イソプロピル - 5 - メチル
 ベンジル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15. 169) N
 - シクロプロピル - N - (2 - シクロプロピル - 5 - メチルベンジル) - 3 - (ジフルオ
 ロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(1
 5. 170) N - (2 - tert - ブチル - 5 - メチルベンジル) - N - シクロプロピル
 - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カル
 ボキサミド、(15. 171) N - [5 - クロロ - 2 - (トリフルオロメチル) ベンジル
] - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H
 - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15. 172) N - シクロプロピル - 3 - (ジフ
 ルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - N - [5 - メチル - 2 - (トリフルオロメ
 チル) ベンジル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15. 173) N - [2
 - クロロ - 6 - (トリフルオロメチル) ベンジル] - N - シクロプロピル - 3 - (ジフル
 オ
 ロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(1
 5. 174) N - [3 - クロロ - 2 - フルオロ - 6 - (トリフルオロメチル) ベンジル]
 - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H -
 ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15. 175) N - シクロプロピル - 3 - (ジフル
 オロメチル) - N - (2 - エチル - 4, 5 - ジメチルベンジル) - 5 - フルオロ - 1 - メ
 チル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15. 176) N - シクロプロピル -
 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - N - (2 - イソプロピルベンジル) - 1 - メ
 チル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボチオアミド、(15. 177) 3 - (ジフルオロメ
 チル) - N - (7 - フルオロ - 1, 1, 3 - トリメチル - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - イン
 デン - 4 - イル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15. 17
 8) 3 - (ジフルオロメチル) - N - [(3R) - 7 - フルオロ - 1, 1, 3 - トリメチ
 ル - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル] - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール -
 4 - カルボキサミド、(15. 179) 3 - (ジフルオロメチル) - N - [(3S) - 7
 - フルオロ - 1, 1, 3 - トリメチル - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル]

10

20

30

40

50

－１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－カルボキサミド、（１５．１８０）Ｎ’－（２，５－ジメチル－４－フェノキシフェニル）－Ｎ－エチル－Ｎ－メチルイミドホルムアミド、（１５．１８１）Ｎ’－〔４－〔（４，５－ジクロロ－１，３－チアゾール－２－イル）オキシ〕－２，５－ジメチルフェニル〕－Ｎ－エチル－Ｎ－メチルイミドホルムアミド、（１５．１８２）Ｎ－（４－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）－４－（２－クロロ－４－フルオロフェニル）－１，３－ジメチル－１Ｈ－ピラゾール－５－アミン。クラス（１）～（１５）において言及されるすべての混合パートナーは、場合によって、それらの官能基に基づいて好適な塩基または酸と塩を形成することができる場合は、そのようにしてもよい。

【０２３６】

混合成分としての生物殺虫剤

式（１）の化合物は、生物殺虫剤と組み合わせることができる。

【０２３７】

生物殺虫剤は、特に、細菌、菌類、酵母、植物抽出物、ならびにタンパク質および二次代謝物を含む微生物によって形成される生産物を含む。

【０２３８】

生物殺虫剤は、芽胞形成細菌、根コロニー形成細菌、および生物学的殺虫剤、抗真菌剤または線虫駆除剤として作用する細菌等の細菌を含む。

【０２３９】

生物殺虫剤として使用されるか、または使用され得る細菌の例は、バチルス・アミロリケファシエンス、株 F Z B 4 2 (D S M 2 3 1 1 7 9)、またはバチルス・セレウス、特に B. セレウス株 C N C M I - 1 5 6 2、またはバチルス・フィルムス、株 I - 1 5 8 2 (受託番号 C N C M I - 1 5 8 2)、またはバチルス・プミルス、特に株 G B 3 4 (受託番号 A T C C 7 0 0 8 1 4) および株 Q S T 2 8 0 8 (受託番号 N R R L B - 3 0 0 8 7)、またはバチルス・ズブチリス、特に株 G B 0 3 (受託番号 A T C C S D - 1 3 9 7)、またはバチルス・ズブチリス株 Q S T 7 1 3 (受託番号 N R R L B - 2 1 6 6 1)、またはバチルス・ズブチリス株 O S T 3 0 0 0 2 (受託番号 N R R L B - 5 0 4 2 1)、バチルス・チューリングゲンシス、特に B. チューリングゲンシス亜種 イスラエレンシス (セロタイプ H - 1 4)、株 A M 6 5 - 5 2 (受託番号 A T C C 1 2 7 6)、または B. チューリングゲンシス亜種 アイザワイ、特に株 A B T S - 1 8 5 7 (S D - 1 3 7 2)、または B. チューリングゲンシス亜種 クルスタキ株 H D - 1、または B. チューリングゲンシス亜種 テネブリオニス株 N B 1 7 6 (S D - 5 4 2 8)、パスツリア・ベネトランス、パスツリア属 (ロチレンクルス・レニホルミス・ネマトーダ) - P R 3 (受託番号 A T C C S D - 5 8 3 4)、ストレプトマイセス・マイクロフラブス株 A Q 6 1 2 1 (= Q R D 3 1 . 0 1 3、N R R L B - 5 0 5 5 0)、ストレプトマイセス・ガルブス株 A Q 6 0 4 7 (受託番号 N R R L 3 0 2 3 2) である。

【０２４０】

生物殺虫剤として使用されるか、または使用され得る菌類および酵母の例は、ビューベリア・バシアナ (*Beauveria bassiana*)、特に株 A T C C 7 4 0 4 0、コニオチリウム・ミニタンス (*Coniothyrium minitans*)、特に株 C O N / M / 9 1 - 8 (受託番号 D S M - 9 6 6 0)、レカニシリウム (*Lecanicillium*) 属、特に株 H R O L E C 1 2、レカニシリウム・レカニ (*Lecanicillium lecanii*)、(以前は、バーティシリウム・レカニ (*Verticillium lecanii*) として知られていた)、特に株 K V 0 1、メタリジウム・アニソプリエ (*Metarhizium anisopliae*)、特に株 F 5 2 (D S M 3 8 8 4 / A T C C 9 0 4 4 8)、メチニコビア・フルクチコラ (*Metschnikowia fructicola*)、特に株 N R R L Y - 3 0 7 5 2、ペキロマイセス・フモソロセウス (*Paecilomyces fumosoroseus*) (現在は、イサリア・フモソロセア (*Isaria fumosorosea*))、特に株 I F P C 2 0 0 6 1 3、または株 A p o p k a 9 7 (受託番号 A T C C

10

20

30

40

50

20874)、ペキロマイセス・リラキヌス (*Paecilomyces lilacinus*)、特にP. リラキヌス株251 (AGAL 89/030550)、タラロマイセス・フラブス (*Talaromyces flavus*)、特に株V117b、トリコデルマ・アトロビリデ (*Trichoderma atroviride*)、特に株SC1 (受託番号CBS 122089)、トリコデルマ・ハルジアヌム (*Trichoderma harzianum*)、特にT. ハルジアヌム・リファイ (*harzianum rifai*) T39 (受託番号CNCM I-952)である。

【0241】

生物殺虫剤として使用されるか、または使用され得るウイルスの例は、
アドキソフィエス・オラナ (サマーフルーツトトリックス (*summer fruit tortrix*)) 顆粒病ウイルス (GV)、シジア・ポモネラ (*Cydia pomonella*) (コドリング) 顆粒病ウイルス (GV)、ヘリコベルパ・アルミゲラ (コットンボールワーム (*cotton bollworm*)) 核多角体病ウイルス (NPV)、スポドプテラ・エキシグア (*Spodoptera exigua*) (ビートアワヨトウ) mNPV、スポドプテラ・フルギペルダ (ツマジロクサヨトウ) mNPV、スポドプテラ・リトラリス (*Spodoptera littoralis*) (アフリカンコットンリーフワーム (*African cotton leafworm*)) NPVである。

10

【0242】

また、「接種材料」として植物または植物部分もしくは植物器官に追加され、それらの特定の特性によって、植物成長および植物の健康を促進する細菌および菌類も含まれる。例としては、

20

アグロバクテリウム属、アゾリゾビウム・カウリノダンス、アゾスピリウム属、アゾトバクター属、ブラジリゾビウム属、バークホルデリア属、特にバークホルデリア・セパシア (以前は、シュードモナス・セパシアとして知られていた)、ギガスポラ属またはギガスポラ・モノスポラム、グロムス属、ラッカリア属、ラクトバシルス・ブケネリ、パラグロムス属、ピソリツス・チンクトルス、シュードモナス属、リゾビウム属、特にリゾビウム・トリフォリ、リゾポゴン属、スクレロデルマ属、スイルス属、ストレプトマイセス属が挙げられる。

【0243】

30

混合成分としての毒性緩和剤

式(I)の化合物は、毒性緩和剤、例えば、ベノキサコル、クロキントセット (ーメキシル)、シオメトリニル、シプロスルファミド、ジクロロミド、フェンクロラゾール (ーエチル)、フェンクロリム、フルラゾール、フルキソフェニム、フリラゾール、イソキサジフェン (ーエチル)、メフェンピル (ージエチル)、ナフタル酸無水物、オキサベトリニル、2ーメトキシーNー ({ 4ー [(メチルカルバモイル) アミノ] フェニル } スルホニル) ベンズアミド (CAS 129531-12-0)、4ー (ジクロロアセチル) ー1ーオキサー4ーアザスピロ [4. 5] デカン (CAS 71526-07-3)、2, 2, 5ートリメチルー3ー (ジクロロアセチル) ー1, 3ーオキサゾリジン (CAS 52836-31-4) と組み合わせることができる。

40

【0244】

植物および植物の部分

すべての植物および植物の部分が、本発明に従って処理され得る。植物は、本明細書において、望ましいおよび望ましくない野生植物または作物植物 (天然に生じる作物植物を含む)、例えば、穀草 (小麦、米、トリティケーレ、大麦、ライ麦、オート麦)、トウモロコシ、大豆、ジャガイモ、テンサイ、サトウキビ、トマト、エンドウおよび他の野菜種、綿、タバコ、アブラナ、ならびに果実植物 (果実、リンゴ、セイヨウナシ、柑橘類果実、およびブドウを含む) 等のすべての植物および植物の集団を意味することが理解される。作物植物は、従来の繁殖方法および最適化方法、または生物工学法および遺伝子工学法、またはこれらの方法の組み合わせによって得ることができる植物であってもよく、遺伝

50

子組み換え植物を含み、植物育成者権によって保護されているおよび保護されていない植物品種を含む。植物の部分は、芽、葉、花、および根等の地上および地下の植物のすべての部分および器官を意味することが理解されるべきであり、葉、針状葉、葉柄、茎、花、子実体、果実、および種子、ならびに塊茎、根、および地下茎が例として挙げられる。植物の部分は、収穫される材料、および生長し、生殖力のある繁殖材料、例えば、挿し木、塊茎、地下茎、接ぎ穂および種子も含む。

【0245】

式(I)の化合物を用いた植物および植物の部分の本発明の処理は、直接的に、または一般的な処理方法、例えば、浸漬、噴射、蒸発、噴霧、散乱、塗布、注入によって、および繁殖原料の場合、特に種子の場合、1つ以上のコーティングを適用することによって、その周囲、生息地、もしくは貯蔵空間でそれらを作用させることによって有効となる。

【0246】

すでに言及したように、本発明によって、すべての植物およびその部分を処理することが可能である。好ましい実施形態では、野生植物種および植物品種、または異種交配もしくは原形質融合等の従来の生物学的繁殖によって得られるもの、およびその部分が処理される。さらに好ましい実施形態では、遺伝子工学方法によって、適切な場合、従来の方法（遺伝子改変有機体）と組み合わせて得られる遺伝子組み換え植物および植物品種、ならびにそれらの部分が処理される。「部分」または「植物の部分」または「植物部分」は、上で説明されている。本発明において、それぞれ市販の一般的な品種または使用中の品種の植物を処理することが特に好ましい。植物品種は、新しい特性（「特徴」）を有し、従来の繁殖によって、突然変異誘発によって、または組換えDNA技法によって得られる植物を意味することが理解される。これらは、品種、変種、生物型または遺伝子型であってもよい。

【0247】

遺伝子組み換え植物、種子処理、および統合

本発明によって処理される好ましい遺伝子組み換え植物または植物品種（遺伝子工学により得られるもの）は、遺伝子改変を通して、特定の有利な有用な特徴が付与されたすべての遺伝子材料を含む。このような特性の例は、より良好な植物成長、高温もしくは低温に対する耐性の上昇、日照り、または水分もしくは土壌塩分に対する耐性の上昇、開花の性能の強化、より容易な収穫、熟成の加速、より高い収量、収穫される生産物のより高い品質および／またはより高い栄養価、収穫される生産物のより良好な貯蔵寿命および／または加工性である。このような特性のさらなる特に強調される例は、例えば、植物中で形成される毒素、具体的には、バチルス・チューリンゲンシスからの遺伝子原料によって（例えば、遺伝子CryIA(a)、CryIA(b)、CryIA(c)、CryIIA、CryIII A、CryIII B2、Cry9c、Cry2Ab、Cry3BbおよびCryIF、ならびにそれらの組み合わせによって）植物中で形成されるものによる、昆虫、クモ形類動物、線虫、ダニ、ナメクジおよびカタツムリ等に対する、動物および微生物の害虫に対する植物の耐性の上昇、ならびに、例えば、全身獲得抵抗性(SAR)、システミン、フィトアレキシン、エリシターおよび耐性遺伝子、ならびに相応して発現されるタンパク質および毒素によって生じる植物病原性菌類、細菌、および／またはウイルスに対する植物の耐性の上昇、ならびにある特定の活性除草成分、例えば、イミダゾリノン、スルホニルウレア、グリホサートまたはホスフィノトリシン（例えば、「PAT」遺伝子）に対する植物の耐性の上昇である。課題となる所望の特徴を付与する遺伝子は、遺伝子組み換え植物中に互いに組み合わせて存在してもよい。遺伝子組み換え植物の例には、穀草（小麦、米、トリティケーレ、大麦、ライ麦、オート麦）、トウモロコシ、大豆、ジャガイモ、テンサイ、サトウキビ、トマト、エンドウ、および他の種類の野菜、綿、タバコ、アブラナ、ならびに果実植物（果実、リンゴ、セイヨウナシ、柑橘類果実、およびブドウを含む）等の重要な作物植物を含み、トウモロコシ、大豆、小麦、米、ジャガイモ、綿、サトウキビ、タバコ、およびアブラナが特に強調される。特に強調される特徴は、昆虫、クモ形類動物、線虫、ならびにナメクジおよびカタツムリに対する植物の耐性の上昇

である。

【0248】

作物保護－処理の種類

式（I）の化合物を用いた植物および植物部分の処理は、直接的に、または一般的な処理方法による、例えば、浸漬、噴射、散布、灌漑、蒸発、散粉、噴霧、種蒔き、泡で覆う、塗布（painting）、塗布（spread-on）、注入、散水（浸す）、細流灌漑によって、および繁殖原料の場合、特に種子の場合、同様に、乾燥種子処理、湿潤種子処理、スラリー処理、外皮の被覆、1つ以上のコーティングでのコーティング等によるそれらの周囲、生息地、もしくは貯蔵空間における作用によって有効となる。極低体積の方法で式（I）の化合物を配置するか、または使用形態もしくは式（I）の化合物自体を

10

【0249】

植物の好ましい直接的な処理は葉面適用であり、式（I）の化合物が葉面に適用されることを意味し、処理頻度および適用量は、問題の害虫の侵入の程度によって調整されるべきである。

【0250】

全身的に活性のある化合物の場合、式（I）の化合物は、根系を介して植物にも入り込む。次いで、植物は、植物の生息地において式（I）の化合物の作用によって処理される。これは、例えば、土壌もしくは栄養溶液で浸すことによって、またはそれらと混合することによって（植物の位置（例えば、土壌または水耕系）が式（I）の化合物の液体形態で含浸されることを意味する）、または土壌適用によって（式（I）の化合物が固体形状（例えば、顆粒の形態）で植物の位置に導入されることを意味する）、達成することができる。水稻作物の場合、固体適用形態（例えば、顆粒）の式（I）の化合物を水田に計量することによっても達成することができる。

20

【0251】

種子処理

植物の種子の処理による動物害虫の防除は、長い間知られており、絶えず改善されているものである。しかしながら、種子の処理は、常に十分に解決することができない一連の問題を伴う。このため、貯蔵中、播種後、もしくは植物の出現後の殺虫剤の追加適用を必要としない、または少なくとも大幅に低減する種子および発芽植物を保護するための方法を開発することが望ましい。種子および発芽植物に動物害虫による攻撃からの最適な保護を提供するが、使用される活性成分によって植物自体を損傷することがないように、使用される活性成分の量を最適化することがさらに望ましい。特に、種子の処理のための方法は、作物保護製品の費用を最小にしながら種子および発芽植物の最適な保護を達成するために、害虫抵抗性もしくは害虫耐性の遺伝子組み換え植物の本来備わっている殺虫または殺線虫特性も考慮するべきである。

30

【0252】

したがって、本発明は、より具体的には、式（I）の化合物のうちの1つで種子を処理することによる、害虫による攻撃からの種子および発芽植物の保護のための方法にも関する。害虫による攻撃に対して種子および発芽植物を保護するための本発明の方法は、種子が式（I）の化合物および混合成分で同時に1回でまたは連続して処理される方法をさらに含む。種子が式（I）の化合物および混合成分で、異なる時点で処理される方法も含む。

40

【0253】

本発明は同様に、種子および結果として生じる植物の動物害虫からの保護のための種子の処理のための式（I）の化合物の使用に関する。

【0254】

本発明はさらに、動物害虫からの保護のために式（I）の化合物で処理された種子に関する。本発明は、式（I）の化合物および混合成分で同時に処理された種子にも関する。本発明はさらに、式（I）の化合物および混合成分で、異なる時点で処理された種子にも

50

関する。式（I）の化合物および混合成分で、異なる時点で処理された種子の場合、個々の物質は、異なる層で種子上に存在し得る。この場合、式（I）の化合物および混合成分を含む層は、中間層によって任意に隔てられてもよい。本発明は、式（I）の化合物および混合成分がコーティングの構成要素として、またはコーティングに加えてさらなる層として適用された種子にも関する。

【0255】

本発明はさらに、式（I）の化合物での処理後に、種子の埃による摩損を防ぐためのフィルムコーティングプロセスに供される種子にも関する。

【0256】

式（I）の化合物のうちの1つが全身的に作用するときに生じる利点の1つは、種子の処理が、種子自体だけではなく、それから生じる植物も出現後に、動物害虫から保護することである。このようにして、播種時点またはその直後の時点の作物の緊急の処理を省くことができる。

【0257】

さらなる利点は、式（I）の化合物の種子の処理が、処理された種子の発芽および出現を強化することができることである。

【0258】

同様に、式（I）の化合物を特に遺伝子組み換え種子にも使用することができることが有利であると考えられる。

【0259】

式（I）の化合物は、例えば、共生生物、例えば、根粒菌、菌根および／または内生細菌もしくは菌類によるより良好なコロニー形成、ならびに／または最適化された窒素固定をもたらす、シグナリング技術組成物と組み合わせて使用することもできる。

【0260】

式（I）の化合物は、農耕で、温室で、森林で、または園芸学で使用されるあらゆる植物品種の種子の保護に適している。より具体的には、これには、穀草（例えば、小麦、大麦、ライ麦、キビ、およびオート麦）、穀物、綿、大豆、米、ジャガイモ、ヒマワリ、コーヒー豆、タバコ、キャノーラ、アブラナ、ビート（例えば、テンサイおよび飼料ビート）、落花生、野菜（例えば、トマト、キュウリ、マメ、アブラナ科野菜、タマネギ、およびレタス）、果実植物、芝生、ならびに観賞植物の種子を含む。穀草（小麦、大麦、ライ麦、およびオート麦等）、トウモロコシ、大豆、綿、キャノーラ、アブラナ、ならびに米の種子の処理が特に重要である。

【0261】

すでに言及したように、式（I）の化合物による遺伝子組み換え種子の処理も特に重要である。これは、特に殺虫および／または殺線虫特性を有するポリペプチドの発現を制御する少なくとも1つの異種遺伝子を一般的に含有する植物の種子を含む。遺伝子組み換え種子中の異種遺伝子は、バチルス、リゾビウム、シュドモナス、セラチア、トリコデルマ、クラビバクター、グロムスまたはグリオクラジウム等の微生物に由来し得る。本発明は、バチルス種に由来する少なくとも1つの異種遺伝子を含有する遺伝子組み換え種子の処理に特に適している。異種遺伝子は、より好ましくは、バチルス・チューリングエンシスに由来する。

【0262】

本発明に関連して、式（I）の化合物は種子に適用される。種子は、好ましくは、処理中に損傷を生じないように十分に安定している状態で処理される。一般的に、種子は、収穫から播種の間の任意の時点で処理され得る。植物から分離され、穂軸、殻、葉柄、皮、毛または果実の果肉を除いた種子を使用することが一般的である。例えば、収穫され、清浄され、かつ貯蔵できる水分含量まで乾燥させた種子を使用することが可能である。あるいは、乾燥後、例えば、水で処理され、次いで再び乾燥させた、例えば、プライミングした種子を使用することも可能である。

【0263】

一般的に、種子の処理においては、種子に適用される式（I）の化合物および／またはさらなる添加物の量が、種子の発芽が損なわれず、それから生じる植物が損傷を受けないように選択されることを確実にしなければならない。これは、特に、特定の適用量で植物毒性を呈し得る活性成分の場合に確実にしなければならない。

【0264】

式（I）の化合物は、一般的に、好適な配合で種子に適用される。種子の処理に好適な配合およびプロセスは当業者には既知である。

【0265】

式（I）の化合物は、溶液、乳濁液、懸濁液、粉末、発泡体、スラリーまたは他の種子用コーティング組成物等の一般的な種子粉衣製剤に変換され得、ULV製剤にも変換され得る。

10

【0266】

これらの製剤は、式（I）の化合物を、一般的な添加物、例えば、一般的な増量剤および溶媒、または希釈剤、染料、湿潤剤、塗布剤、乳化剤、消泡剤、防腐剤、二次増粘剤、固着剤、ジベレリン、ならびに水と混合することによって、既知の手法で製造される。

【0267】

本発明において使用可能な種子粉衣製剤中に存在し得る有用な染料は、このような目的に一般的であるすべての染料である。わずかに水溶性である顔料、または水溶性である染料のいずれかを使用することが可能である。例としては、Rhodamine B、C、I、Pigment Red 112、およびC、I、Solvent Red 1の名称で知られる染料が挙げられる。

20

【0268】

本発明において使用可能な種子粉衣製剤中に存在し得る有用な湿潤剤は、湿潤を促進し、活性農薬成分の製剤に従来から使用されているすべての物質である。ジイソプロピルまたはジイソブチルナフタレンスルホン酸塩等のアルキルナフタレンスルホン酸塩を使用することが好ましい。

【0269】

本発明において使用可能な種子粉衣製剤中に存在し得る有用な分散剤および／または乳化剤は、活性農薬成分の製剤に従来から使用されるすべての非イオン性、陰イオン性、および陽イオン性分散剤である。非イオン性もしくは陰イオン性分散剤または非イオン性もしくは陰イオン性分散剤の混合物を使用することが好ましい。好適な非イオン性分散剤としては特に、エチレンオキシド／プロピレンオキシドブロックポリマー、アルキルフェノールポリグリコールエーテル、およびトリストリルフェノールポリグリコールエーテル、ならびにそれらのリン酸化または硫酸化誘導体が挙げられる。好適な陰イオン性分散剤は特に、リグノスルホン酸塩、ポリアクリル酸塩、およびスルホン酸アリール／ホルムアルデヒド縮合物である。

30

【0270】

本発明において使用可能な種子粉衣製剤中に存在し得る消泡剤は、活性農薬成分の製剤に従来から使用されるすべての発泡阻害物質である。好ましくは、シリコーン消泡剤およびステアリン酸マグネシウムが使用され得る。

40

【0271】

本発明において使用可能な種子粉衣製剤中に存在し得る防腐剤は、農薬組成物中でそのような目的のために使用可能なすべての物質である。例としては、ジクロロフェンおよびベンジルアルコールヘミホルマルである。

【0272】

本発明において使用可能な種子粉衣製剤中に存在し得る二次増粘剤は、農薬組成物中でそのような目的のために使用され得るすべての物質である。好ましい例としては、セルロース誘導体、アクリル酸誘導体、キサンタン、改質粘土および微粉化したシリカが挙げられる。

【0273】

50

本発明において使用可能な種子粉衣製剤中に存在し得る有用な固着剤は、種子粉衣製品で使用可能なすべての一般的な結合剤である。好ましい例としては、ポリビニルピロリドン、ポリビニルアセテート、ポリビニルアルコールおよびチロースが挙げられる。

【0274】

本発明において使用可能な種子粉衣製剤中に存在し得るジベレリンは、好ましくは、ジベレリンA1、A3（＝ジベレリン酸）、A4、およびA7であり、ジベレリン酸を使用することが特に好ましい。ジベレリンは既知である（R. Wegler “Chemie der Pflanzenschutz- und Schaedlingsbekämpfungsmittel” [Chemistry of the Crop Protection Compositions and Pesticides], vol. 2, Springer Verlag, 1970, p. 401-412を参照されたい）。

10

【0275】

本発明において使用可能な種子粉衣製剤は、直接的に、または水で予め希釈した後のいずれかで様々な異なる種類の種子を処理するために使用することができる。例えば、水による希釈によりそこから得られる調製物の濃縮液は、小麦、大麦、ライ麦、オート麦およびトリティケール等の穀草の種子、ならびにトウモロコシ、米、アブラナ、エンドウ、マメ、綿、ヒマワリ、大豆およびビートの種子、または様々な異なる野菜種子を粉衣するために使用され得る。本発明において使用可能な種子粉衣製剤またはそれらの希釈使用形態は、遺伝子組み換え植物の種子を粉衣するためにも使用することができる。

20

【0276】

本発明において使用可能な種子粉衣製剤またはそこから調製される使用形態での種子の処理に関して、種子粉衣に一般的に使用可能なすべての混合ユニットが有用である。具体的には、種子粉衣の手順は、種子をバッチ式または連続作業でミキサー内に置き、特定の所望の量の種子粉衣製剤をそのまましくは水で予め希釈した後に追加し、製剤が種子上に均質に分散されるまで混合することである。適切な場合、これに乾燥作業が続く。

【0277】

本発明において使用可能な種子粉衣製剤の適用量は、比較的広い範囲で異なり得る。製剤中の式（I）の化合物の特定の含量によって、および種子によって導かれる。式（I）の化合物の適用量は、概して、種子1キログラム当たり0.001～50g、好ましくは種子1キログラム当たり0.01～15gである。

30

【0278】

動物衛生における使用

動物衛生分野において、すなわち、獣医学の分野において、本発明による活性成分は、動物寄生虫、特に外寄生生物、またはさらなる実施形態では、内部寄生生物に対して作用する。「内部寄生生物」という用語は、特に条虫、線虫、または吸虫等の蠕虫、およびコクシジウム等の原生動物を含む。外寄生生物は、典型的かつ好ましくは、節足動物、特にハエ（サシバエおよびナメバエ）、寄生ハエ幼虫、シラミ、毛ジラミ、ハジラミ、ノミ等の昆虫、あるいは、マダニ、例えば、カタダニもしくはヒメダニ等のダニ、または黒星病ダニ、秋ダニ、トリダニ等のダニ、ならびにカイアシ等の水生外寄生生物である。

40

【0279】

獣医学の分野では、好適な恒温動物毒性を有する式（I）の化合物は、家畜、繁殖動物、動物園の動物、実験動物（laboratory animal）、実験動物（experimental animal）、および飼育動物の動物繁殖および家畜学で発生する寄生生物の防除に適している。それらは、寄生生物の発達のすべての、または特定の段階に対して活性である。

【0280】

農業用家畜としては、例えば、ヒツジ、ヤギ、ウマ、ロバ、ラクダ、スイギュウ、ウサギ、トナカイ、ダマジカ、特に畜牛およびブタ等の哺乳動物、シチメンチョウ、アヒル、ガチョウ、特にニワトリ等の家禽、例えば水産養殖では、魚および甲殻類、ならびに蜂等

50

の昆虫が挙げられる。

【0281】

飼育動物としては、例えば、ハムスター、モルモット、ラット、マウス、チンチラ、フェレット、および特にイヌ、ネコ、飼鳥等の哺乳動物、爬虫類、両生類、ならびに観賞魚が挙げられる。

【0282】

好ましい実施形態では、式(I)の化合物は哺乳動物に投与される。

【0283】

別の好ましい実施形態では、式(I)の化合物は鳥類、すなわち、飼鳥、特に家禽に投与される。

【0284】

動物寄生虫の防除のための式(I)の化合物の使用は、より経済的かつ簡便な動物維持を可能にし、より良好な動物衛生が達成可能であるように、疾病、死亡事例、および性能の低下(肉、牛乳、羊毛、皮革、卵、蜂蜜等の場合)を低減させるか、または防ぐことが意図される。

【0285】

動物衛生分野に関して、「防除する」または「防除すること」という用語は、式(I)の化合物が、寄生生物に感染している動物における特定の寄生生物の発生率を害のない程度まで低下させることに有効であることを意味する。より具体的には、この文脈において「防除すること」とは、式(I)の化合物が、それぞれの寄生生物を死滅させる、その成長を阻害する、またはその増殖を阻害することができることを意味する。

【0286】

これらの寄生生物には、次のものが挙げられる。

アノプルリダ(Anoplurida)目の、例えば、ハエマトピヌス属(Haematopinus spp.)、ケモノホソジラミ属、ペジクルス属(Pediculus spp.)、プティルス(Phthirus spp.)、ソレノポテス属(Solenopotes spp.)；具体的な例としては、リノグナサス・セトサス(Linognathus setosus)、リノグナサス・ビツリ(Linognathus vituli)、リノグナサス・オビラス(Linognathus ovillus)、リノグナサス・オビフォルミス(Linognathus oviiformis)、リノグナサス・ペダリス(Linognathus pedalis)、リノグナサス・ステノプシス(Linognathus stenopsis)、ヘマトピナス・アシニ・マクロセファルス(Haematopinus asini macrocephalus)、ヘマトピナス・ユーリステルナス(Haematopinus euryesternus)、ヘマトピナス・スイス(Haematopinus suis)、ペディキュラス・フマヌス・キャピティス(Pediculus humanus capitis)、ペディキュラス・フマヌス・コルポリス(Pediculus humanus corporis)、フィロエラ・バスタトリックス(Phylloera vastatrix)、フスイルス・ピュービス(Phthirus pubis)、ソレノポテス・キャピラタス(Solenopotes capillatus)である；

ハジラミ(Mallophagida)目ならびにマルツノハジラミ(Amblycerina)亜目およびホソツノハジラミ(Ichnocerina)亜目の、例えば、トリメノポン属(Trimenopon spp.)、メノポン属(Menopon spp.)、トリノトン属(Trinoton spp.)、ボビコラ属(Bovicola spp.)、ウェルネッキエラ属(Werneckieella spp.)、レピケンترون属(Lepikentron spp.)、ダマリナ属(Damalina spp.)、トリコデクテス属(Trichodectes spp.)、フェリコラ属(Felicola spp.)；具体的な例としては、ボビコラ・ボビス(Bovicola bovis)、ボビコラ・オビス(Bovicola ovis)、ボビコラ・リンバータ(Bovicola limbata)、ダマリナ・ボビス(Damalina

10

20

30

40

50

bovis)、トリコデクテス・カニス(Trichodectes canis)、フェリコラ・サブロストラタス(Felicola subrostratus)、ボビコラ・キャブラエ(Bovicola caprae)、レピケントロン・オビス(Lepikentron ovis)、ウェルネッキエラ・エクイ(Werneckiella equi)である;

双翅目ならびにネマトセリナ(Nematocerina)亜目およびブラキセリナ(Brachycerina)亜目の、例えば、アエデス属、アノフェレス属、クレクス属、シムリウム属、エウシムリウム属(Eusimulium spp.)、フレボトムス属、ルトゾミア属、クリコイデス属、クリソプス属、オダグミア属(Odagmia spp.)、ウィルヘルミア属(Wilhelmia spp.)、ヒボミトラ属(Hybomitra spp.)、アチロータス属(Atylotus spp.)、タバヌス属、ヘマトポタ属、フィリポミア属(Philipomyia spp.)、ブラウラ属(Braula spp.)、ムスカ属、ヒドロタエア属(Hydrotaea spp.)、ストモキシス属、ヘマトビア属(Haematobia spp.)、モレリア属(Morellia spp.)、ファニア属、グロシナ属、カリフォラ属(Calliphora spp.)、ルキリア属、クリソミア属(Chrysomyia spp.)、ウォールファルチア属(Wohlfahrtia spp.)、サルコファガ属、オエストルス属、ヒポデルマ属、ガステロフィルス属、ヒポボスカ属、リポプテナ属(Lipoptena spp.)、メロファガス属(Melophagus spp.)、リノエストラス属(Rhinoestrus spp.)、チブラ属; 具体的な例としては、アエデス・アエジプチ、アエデス・アルボピクトゥス、アエデス・タエニオリンクス(Aedes taeniorhynchus)、アノフェレス・ガンビエ、アノフェレス・マキュリベニス(Anopheles maculipennis)、カリフォラ・エリトロセファラ、クリソゾナ・プルビアルリス、クレクス・クィンクエファスキアトゥス、クレクス・ピピエンス、キュレックス・タルサリス(Culex tarsalis)、ファニア・カニクラリス(Fannia canicularis)、サルコファガ・カルナリア(Sarcophaga carnaria)、サシバエ(Stomoxys calcitrans)、チブラ・パルドーサ、ルキリア・クブリナ、ルシリア・セリカータ(Lucilia sericata)、シムリウム・レプタンス(Simulium reptans)、フレボトムス・パパタシ(Phlebotomus papatasi)、ヒゲナガサシチョウバエ、オダグミア・オルナタ(Odagmia ornata)、ウィルヘルミア・エキューイナ(Wilhelmia equina)、ボーフソラ・エリスロセファラ(Boopthora erythrocephala)、タバヌス・ブロミウス(Tabanus bromius)、タバヌス・スポドプテルス(Tabanus spodopterus)、タバヌス・アトラタス(Tabanus atratus)、タバヌス・スデティカス(Tabanus sudeticus)、ヒボミトラ・シウレア(Hybomitra ciurea)、クリソプス・カエキュチエンス(Chrysops caecutiens)、クリソプス・レリクタス(Chrysops relictus)、ヘマトポタ・プルビアルリス(Haematopota pluvialis)、ヘマトポタ・イタリカ(Haematopota italica)、ムスカ・オータムナリス(Musca autumnalis)、ムスカ・ドメスチカ、ヘマトビア・イリタンス・イリタンス(Haematobia irritans irritans)、ヘマトビア・イリタンス・エクシグア(Haematobia irritans exigua)、ヘマトビア・スティミュランス(Haematobia stimulans)、ヒドロタエア・イリタンス(Hydrotaea irritans)、ヒドロタエア・アルビパンクタ(Hydrotaea albipuncta)、クリソミア・クロロピガ(Chrysomya chloropyga)、クリソミア・ベジアナ(Chrysomya bezziana)、エストラス・オビス(Oestrus ovis)、ハイポデルマ・ボビス(Hypoderma bovis)、ハイポデルマ・リネアタム(Hypoderma lineatum)、ブルズヘバルス

キアナ・シレヌス (*Przhevalskiana silenus*)、デルマトビア・ホミニス、メロファガス・オビヌス (*Melophagus ovinus*)、リポプテナ・カプレオリ (*Lipoptena capreoli*)、リポプテナ・セルビ (*Lipoptena cervi*)、ヒポボスカ・バリエガタ (*Hippobosca variegata*)、ヒポボスカ・エクイナ (*Hippobosca equina*)、ガステロフィラス・インテスチナリス (*Gasterophilus intestinalis*)、ガステロフィラス・ヘモロイダリス (*Gasterophilus haemorrhoidalis*)、ガステロフィラス・イネルミス (*Gasterophilus inermis*)、ガステロフィラス・ナサリス (*Gasterophilus nasalis*)、ガステロフィラス・ニグリコルニス (*Gasterophilus nigricornis*)、ガステロフィラス・ペコラム (*Gasterophilus pecorum*)、ブラウラ・コエカ (*Braula coeca*) である；

シフォナプテリダ (*Siphonapterida*) 目の、例えば、プレキス属 (*Pulex* spp.)、クテノセファリデス属、ツンガ属 (*Tunga* spp.)、キセノプシラ属 (*Xenopsylla* spp.)、セラトフィルス属；具体的な例としては、クテノセファリデス・カニス、クテノセファリデス・フェリス、プレックス・イリタンス、ツンガ・ペネトランス、キセノプシラ・ケオピスである；

ヘテロプテリダ (*Heteroptera*) 目の、例えば、キメクス属、トリアトマ属、ロドニウス属、パンストロンギルス属 (*Panstrongylus* spp.)

ブラッタリダ (*Blattaria*) 目の、例えば、ブラッタ・オリエンタリス、ペリプラネタ・アメリカナ、ブラッテラ・ゲルマニカ (*Blattella germanica*)、およびスペラ属 (*Supella* spp.) (例えば、スッペラ・ロンギパルパ (*Supella longipalpa*))；

アカリ (*Acarina*) (アカリナ (*Acarina*)) 亜種ならびにメタ (*Meta*) およびメソスティグマタ (*Mesostigmata*) 目の、例えば、アルガス属、オルニトドルス属、オトビウス属 (*Otobius* spp.)、イクソデス属、アンブリオンマ属、リピセファルス (ボオフィルス) 属、デルマセントル属、ハエモフィサリス属 (*Haemophysalis* spp.)、ヒアロンマ属、デルマニسس属 (*Dermanyssus* spp.)、リピセファルス属 (多宿主ダニ類 (*ticks*) の原属)、オルニトニュッスス属、プネウモニسس属 (*Pneumonyssus* spp.)、ライリエチア属 (*Raillietia* spp.)、プネウモニسس属 (*Pneumonyssus* spp.)、ステルノストマ属 (*Sternostoma* spp.)、バロア属 (*Varroa* spp.)、アカラピス属 (*Acarapis* spp.)；具体的な例としては、アルガス・ペルシクス (*Argas persicus*)、アルガス・レフレキス (*Argas reflexus*)、オルニトドルス・モウバタ (*Ornithodoros moubata*)、オトビウス・メグニニ (*Otobius megnini*)、リピセファルス (ボオフィルス)・ミクロプルス (*Rhipicephalus (Boophilus) microplus*)、リピセファルス (ボオフィルス)・デコロラトゥス (*Rhipicephalus (Boophilus) decoloratus*)、リピセファルス (ボオフィルス)・アヌラトゥス (*Rhipicephalus (Boophilus) annulatus*)、リピセファルス (ボオフィルス)・カルケラトゥス (*Rhipicephalus (Boophilus) calceatus*)、ヒアロンマ・アナトリクム (*Hyalomma anatolicum*)、ヒアロンマ・アエジプティカム (*Hyalomma aegyptium*)、ヒアロンマ・マルギナタム (*Hyalomma marginatum*)、ヒアロンマ・トランジェンス (*Hyalomma transversum*)、リピセファルス・エウェルトシ (*Rhipicephalus evertsi*)、イクソデス・リシヌス (*Ixodes ricinus*)、イクソデス・ヘキサゴナス (*Ixodes hexagonus*)、イクソデス・キャニスガ (*Ixodes canisuga*)、イクソデス・ピロサス (*Ixodes pilosus*)、イクソデス・ルビキュンダス (*Ixodes rubi*

cundus)、イクソデス・スキャブラリス (*Ixodes scapularis*)
 、イクソデス・ホロシクルス (*Ixodes holocyclus*)、ヘマフィサリス
 ・コンシナ (*Haemaphysalis concinna*)、ヘマフィサリス・パン
 クタータ (*Haemaphysalis punctata*)、ヘマフィサリス・シニア
 バリナ (*Haemaphysalis cinnabarina*)、ヘマフィサリス・オ
 トフィラ (*Haemaphysalis otophila*)、ヘマフィサリス・レアチ
 (*Haemaphysalis leachi*)、ヘマフィサリス・ロンギコルニ (*Ha
 emaphysalis longicornis*)、デルマセントル・マルギナタス (*D
 ermacentor marginatus*)、デルマセントル・レティキュラタス (*D
 ermacentor reticulatus*)、デルマセントル・ピクタス (*D
 ermacentor pictus*)、デルマセントル・アルビピクタス (*D
 ermacentor albipictus*)、デルマセントル・アンデルソニ (*D
 ermacentor andersoni*)、デルマセントル・バリアビリス (*D
 ermacentor variabilis*)、ヒアロンマ・マウリタニカム (*Hyalomma ma
 uritanicum*)、リピセファルス・サングイネウス (*Rhipicephalu
 s sanguineus*)、リピセファルス・ブルサ (*Rhipicephalus
 bursa*)、リピセファルス・アッペンディキュラタス (*Rhipicephalus
 appendiculatus*)、リピセファルス・キャペンシス (*Rhipicep
 halus capensis*)、リピセファルス・ツラニカス (*Rhipicepha
 lus turanicus*)、リピセファルス・ザンベジエンシス (*Rhipicep
 halus zambeziensis*)、アンブリオマ・アメリカナム (*Amblyo
 mma americanum*)、アンブリオマ・バリエガタム (*Amblyomma
 variegatum*)、アンブリオマ・マキュラタム (*Amblyomma macu
 latum*)、アンブリオマ・ヘブラエウム (*Amblyomma hebraeum*)
 、アンブリオマ・カジェネンシス (*Amblyomma cajennense*)、デルマ
 ニュッサス・ガッリナエ、オルニソヌッサス・ブルサ (*Ornithonyssus b
 ursae*)、オルニソヌッサス・シルビアラム (*Ornithonyssus sylv
 iarum*)、バロア・ジャコブスコニ (*Varroa jacobsoni*) である；
 アクチネジダ (*Actiniedida*) (プロスティグマタ (*Prostigmata*)
) 目およびアカリディダ (*Acaridida*) (アスティグマタ (*Astigmata*
) 目の、例えば、アカラピス属、ケイレチエラ属 (*Cheyletiella spp*
 .)、オルニトケイレチア属 (*Ornithocheyletia spp.*)、ミオビ
 ア属 (*Myobia spp.*)、プソレルガテス属 (*Psorergates spp*
 .)、デモデクス属 (*Demodex spp.*)、トロムビクラ属 (*Trombicu
 la spp.*)、リストロホルス属 (*Listrophorus spp.*)、アカル
 ス属 (*Acarus spp.*)、チロファグス属 (*Tyrophagus spp.*)
 、カログリフス属 (*Caloglyphus spp.*)、ヒポデクテス属 (*Hypod
 ectes spp.*)、プテロリクス属 (*Pterolichus spp.*)、プソ
 ロプテス属、コリオプテス属、オトデクテス属 (*Otodectes spp.*)、サル
 コプテス属、ノトエドレス属 (*Notoedres spp.*)、クネミドコプテス属 (*40
 Knemidocoptes spp.*)、シトジテス属 (*Cytodites spp*
 .)、およびラミノシオプテス属 (*Laminosioptes spp.*)；具体的な
 例としては、ケイレチエラ・ヤスグリ (*Cheyletiella yasguri*)、
 ケイレチエラ・ブラケイ (*Cheyletiella blakei*)、デモデクス・カ
 ニス (*Demodex canis*)、デモデクス・ボビス (*Demodex bovi
 s*)、デモデクス・オビス (*Demodex ovis*)、デモデクス・カブラエ (*De
 modex caprae*)、デモデクス・エクイ (*Demodex equi*)、デモ
 デクス・カバリ (*Demodex caballi*)、デモデクス・スイス (*Demod
 ex suis*)、ネオトロムビクラ・オータムナリス (*Neotrombicula
 autumnalis*)、ネオトロムビクラ・デサレリ (*Neotrombicula 50*

desaleri)、ネオスコンガスティア・クセロテルモビア (Neoschongastia xerothermobia)、trombicula akamushi)、オトデクテス・キュノティス (Otodectes cynotis)、ノトエドレス・カチ (Notoedres cati)、サルコプティス・カニス (Sarcoptis canis)、サルコプテス・ボビス (Sarcoptes bovis)、サルコプテス・オビス (Sarcoptes ovis)、サルコプテス・ルピカプラエ (Sarcoptes rupicaprae) (=S. caprae)、サルコプテス・エクィ (Sarcoptes equi)、サルコプテス・スイス (Sarcoptes suis)、プソロプテス・オビス (Psoroptes ovis)、プソロプテス・クニクリ (Psoroptes cuniculi)、プソロプテス・エクィ (Psoroptes equi)、コリオプテス・ボビス (Chorioptes bovis)、プソエルガテス・オビス (Psoergates ovis)、プネウムモニュッソイディク・マング (Pneumonyssoidic mange)、プネウモニュッソイデス・カニヌム (Pneumonyssoides caninum)、アカラピス・ウォオジ (Acarapis woodi) である。

シフォノストマトイダ (Siphonostomatoidea) 目、特にレペオフテイルス (Lepeophtheirus) 属およびカリグス (Caligus) 属のカイアシの亜綱の、レペオフテイルス・サルモニス (Lepeophtheirus salmonis) 種、カリグス・エロンガツス (Caligus elongatus) 種、およびカリグス・クレメンシ (Caligus clemensi) 種が、例および特に好ましいものとして言及され得る。

【0287】

概して、本発明の活性成分は、動物の処理に使用されるときは、直接用いられ得る。それらは、好ましくは薬学的組成物の形態で使用（投与）され、先行技術において既知の薬学的に許容される賦形剤および／または補助剤を含んでもよい。

【0288】

動物衛生分野および家畜学では、活性成分は、例えば、錠剤、カプセル、薬、水薬、顆粒、ペースト、食塊、フィードスループロセス、および坐剤の形態で経腸投与によって、例えば、注射による（とりわけ、筋肉内、皮下、静脈内、腹腔内）、インプラント、鼻腔投与による、例えば、浸漬もしくは入浴、噴射、注入およびスポッティング、洗浄および粉末化の形態の真皮投与による非経口投与によって、ならびに首輪、耳標、尾標、四肢バンド、端綱、マーキング装置等の活性成分を含有する成形品を用いて、既知の手法で使用（投与）される。活性成分は、シャンプーとして、またはエアロゾルもしくは加圧されていないスプレー、例えば、ポンプスプレーおよび霧化スプレーに適用可能な好適な製剤として製剤化することができる。

【0289】

家畜、家禽、家庭用ペット等のために用いる場合は、本発明の活性成分は、直接もしくは希釈後（例えば100～10000倍希釈）に1重量%～80重量%の量で活性成分を含有する製剤（例えば、粉末、湿潤性粉末[“WP”]、乳濁液、乳化可能濃縮液[“EC”]、流動性組成物、均質溶液、および懸濁濃縮液[“SC”]）として用いることができ、またはそれらは化学浴として使用することができる。

【0290】

動物衛生分野で使用する場合は、本発明の活性成分は、活性の範囲を広げるために、好適な共力剤、忌避物質または他の活性成分、例えば、ダニ駆除剤、昆虫駆除剤、駆虫剤、抗原生動物剤と組み合わせて使用することができる。本発明の式(I)の化合物に対して使用可能な混合成分は、動物衛生用途の場合、群(In-1)～(In-25)の1つ以上の化合物であり得る。

(In-1) アセチルコリンエステラーゼ (ACHE) 阻害剤、例えば、カルバメート、例えば、アラニカルブ、アルジカルブ、ベンジオカルブ、ベンフラカルブ、ブトカルボキ

10

20

30

40

50

シム、プトキシカルボキシム、カルバリル、カルボフラン、カルボスルファン、エチオフェンカルブ、フェノブカルブ、ホルメタネート、フラチオカルブ、イソプロカルブ、メチオカルブ、メトミル、メトルカルブ、オキサミル、ピリミカルブ、プロボクスル、チオジカルブ、チオフアノックス、トリアザメート、トリメタカルブ、XMCおよびキシリルカルブ；本明細書において、外寄生生物に対する用途に関しては、ベンジオカルブ、カルバリル、メトミル、プロマシルおよびプロボクスルが特に好ましい；あるいは

有機リン酸塩、例えば、アセフェート、アザメチホス、アジンホス（一メチル、一エチル）、カズサホス、クロレトキシフォス、クロルフェンビンホス、クロルメホス、クロルピリホス（一メチル）、クマホス、シアノホス、デメトン-S一メチル、ダイアジノン、ジクロロボス/DDVP、ジクロトホス、ジメトエート、ジメチルビンホス、ジスルホトン、EPN、エチオン、エトプロホス、ファムフル、フェナミホス、フェントロチオン、フェンチオン、ホスチアゼート、ヘプテノホス、イソフェンホス、イソプロピル O-（メトキシアミノチオホスホリル）サリチル酸塩、イソキサチオン、マラチオン、メカルバム、メタミドホス、メチダチオン、メビンホス、モノクロトホス、ナレド、オメトエート、オキシデメトン一メチル、パラチオン、パラチオン一メチル、フェントエート、ホレート、ホサロン、ホスメット、ホスファミドン、ホキシム、ピリミホス（一メチル）、プロフェノホス、プロペタムホス、プロチオホス、ピラクロホス、ピリダフェンチオン、キナルホス、スルホテップ、テブピリムホス、テメホス、テルブホス、テトラクロルビンホス、チオメトン、トリアゾホス、トリクロルホンおよびバミドチオン；本明細書において、外寄生生物に対する用途に関しては、アザメチホス、クロルフェンビンホス、クロルピリホス、クマホス、シチオアート、ダイアジノン（ジミピラート）、ジクロロボス（DDVP）、ジクロトホス、ジメトエート、エチオン（ジェチオン）、ファムフル（ファモホス）、フェントロチオン、フェンチオン（MPP）、ヘプテノホス、マラチオン、ナレド、ホスメット（PMP、フタロホス）ホキシム、プロペタムホス、テメホス、テトラクロルビンホス（CVMP）およびトリクロルホン/メトリホナートが特に好ましい。

（In-2）GABA作動性クロライドチャネルアンタゴニスト、例えば、有機塩素、例えば、プロモシクレン、クロルデン、およびエンドスルファン（ α -）、ヘプタクロル、リンダン、ならびにトキサフェン；本明細書において、外寄生生物に対する用途に関しては、エンドスルファン（ α -）およびリンダンが特に好ましい；あるいは

フィプロール（フェニルピラゾール）、例えば、アセトプロール、エチプロール、フィプロニル、ピラフルプロール、ピリプロール、リザゾール；本明細書において、外寄生生物に対する用途に関しては、フィプロニルおよびピリプロールが特に好ましい；あるいはアリアルイソキサゾリン、アリアルピロリン、アリアルピロリジン、例えば、フルラネル（国際公開第2009/2024541号、実施例11-1から既知である；さらに、国際公開第2012007426号、国際公開第2012042006号、国際公開第2012042007号、国際公開第2012107533号、国際公開第2012120135号、国際公開第2012165186号、国際公開第2012155676号、国際公開第2012017359号、国際公開第2012127347号、国際公開第2012038851号、国際公開第2012120399号、国際公開第2012156400号、国際公開第2012163959号、国際公開第2011161130号、国際公開第2011073444号、国際公開第2011092287号、国際公開第2011075591号、国際公開第2011157748号、国際公開第2007/075459号、国際公開第2007/125984号、国際公開第2005/085216号、国際公開第2009/002809号の化合物）、アフォキシレイナー（例えば、国際公開第2011149749号に記載されている）および構造上関係があるアリアルピロリン（例えば、国際公開第2009/072621号、国際公開第2010020522号、国際公開第2009112275号、国際公開第2009097992号、国際公開第2009072621号、日本特許第2008133273号、日本特許第2007091708号から既知である）、またはアリアルピロリジン（例えば、国際公開第2012004326号、国際公開第2012035011号、国際公開第2012045700

10

20

30

40

50

号、国際公開第2010090344号、国際公開第2010043315号、国際公開第2008128711号、日本特許第2008110971号にある）、ならびにいわゆるメタジアミド（例えば、国際公開第2012020483号、国際公開第2012020484号、国際公開第2012077221号、国際公開第2012069366号、国際公開第2012175474号、国際公開第2011095462号、国際公開第2011113756号、国際公開第2011093415号、国際公開第2005073165号から既知である）の群の化合物；本明細書において、外寄生生物に対する用途に関しては、アフォキシレイナーおよびフルアララネルが特に好ましい。

（In-3）ナトリウムチャンネル調節剤／電位作動型ナトリウムチャンネル遮断薬、例えば、ピレスロイド、例えば、アクリナトリン、アレスリン（ d -シーストランス *trans*、 d -トランス）、ピフェントリン、ピオアレトリン、ピオアレトリン S -シクロペンテニル、ピオレスメトリン、シクロプロトリン、シフルトリン（ β -）、シハロトリン（ γ -、 λ -）、シペルメトリン（ α -、 β -、 θ -、 ζ -）、シフェノトリン〔（1R）-トランス異性体〕、デルタメトリン、ジメフルトリン（*dimefluthrin*）、エンペントリン〔（EZ）-（1R）異性体〕、エスフェンバレレート、エトフェンプロックス、フェンプロパスリン、フェンバレレート、フルシトリネート、フルメトリン、フルバリネート（ τ -）、ハルフェンプロックス、イミプロスリン、メトフルトリン、ペルメトリン、フェノトリン〔（1R）-トランス異性体〕、プラレトリン、プロフルトリン、ピレトリン（ジョチュウギク）、レスメトリン、RU 15525、シラフルオフエン、テフルトリン、テトラメトリン〔（1R）異性体〕、トラロメトリン、トランスフルトリンおよびZXI 8901；本明細書において、外寄生生物に対する用途に関しては、I型ピレスロイド アレスリン、ピオアレトリン、ペルメトリン、フェノトリン、レスメトリン、テトラメトリン、およびII型ピレスロイド（ α シアノピレスロイド） α -シペルメトリン、シフルトリン（ β -）、シハロトリン（ λ -）、シペルメトリン（ α -、 ζ -）、デルタメトリン、フェンバレレート、フルシトリネート、フルメトリン、フルバリネート（ τ -）、ならびにエステルを含まないピレスロイドエトフェンプロックス、およびシラフルオフエンが特に好ましい；または有機塩素化合物、例えば、DDTもしくはメトキシクロル。このクラスの活性成分は、長く続く接触拒絶作用を有し、それによりこの成分を含むように活性範囲を拡大するため、混合成分として特にとても好適である。

（In-4）ニコチン性アセチルコリン受容体アゴニスト、例えば、ネオニコチノイド、例えば、アセタミプリド、クロチアニジン、ジノテフラン、イミダクロプリド、イミダクロチン、ニテンピラム、チアクロプリド、チアメトキサム；本明細書において、外寄生生物に対する用途に関しては、クロチアニジン、ジノテフラン、イミダクロプリド、ニテンピラム、およびチアクロプリドが特に好ましい；またはニコチン。

（In-5）アロステリックアセチルコリン受容体調節剤（アゴニスト）、例えば、スピノシン、例えば、スピネトラムおよびスピノサド；本明細書において、外寄生生物に対する用途に関しては、スピノサドおよびスピネトラムが特に好ましい。

（In-6）クロライドチャンネル活性化剤、例えば、エバーメクチン／ミルベマイシン、例えば、アバメクチン、ドラメクチン、エマメクチン安息香酸塩、エプリノメクチン、イベルメクチン、ラチデクチン（*latidectin*）、レビメクチン、ミルベマイシンオキシム、ミルベメクチン、モキシデクチンおよびセラメクチン；インドールテルペノイド、例えば、ノズリスボル酸誘導体、特にノズリスボル酸A；本明細書において、外寄生生物に対する用途に関しては、ドラメクチン、エプリノメクチン、イベルメクチン、ミルベマイシンオキシム、モキシデクチン、セラメクチンおよびノズリスボル酸Aが特に好ましい。

（In-7）幼若ホルモン類似体、例えば、ヒドロプレレン（ S -）、キノプレレン、メトプレレン（ S -）；またはフェノキシカルブ；ピリプロキシフェン；本明細書において、外寄生生物に対する用途に関しては、メトプレレン（ S -）およびピリプロキシフェンが特に好ましい。

（In-8）ダニ成長阻害剤、例えば、クロフェンチジン、ジフロビダジン、ヘキシチア

10

20

30

40

50

ゾクス、エトキサゾール；本明細書において、外寄生生物に対する用途に関しては、エトキサゾールが特に好ましい。

(In-9) Slo-1 およびラトロフィリン受容体アゴニスト、例えば、環状デブシペプチド、例えば、エモデブシドおよびその前駆体 PF1022A (EP382173 から既知である、化合物 I)；本明細書において、外寄生生物に対する用途に関しては、エモデブシドが特に好ましい。

(In-10) 酸化的リン酸化反応阻害剤、ATP 攪乱物質、例えば、ジアフェンチウロン。

(In-12) ニコチン性アセチルコリン受容体アンタゴニスト、例えば、ベンスルタップ、カルタップ (塩酸塩)、チオシラム、およびチオスルタップ (ナトリウム)。

(In-13) キチン質生合成阻害剤、0 型、例えば、ベンゾイル尿素、例えば、ビストリフルロン、クロルフルアズロン、ジフルベンズロン、フルシクロクスロン、フルフェノクスロン、ヘキサフルムロン、ルフエヌロン、ノバルロン、ノビフルムロン、テフルベンズロンおよびトリフルムロン；本明細書において、外寄生生物に対する用途に関しては、ジフルベンズロン、フルアズロン、ルフエヌロン、およびトリフルムロンが特に好ましい。

(In-14) キチン質生合成阻害剤、1 型、例えば、ブプロフェジン。

(In-15) 脱皮阻害剤、例えば、シロマジンおよびジシクラニル；本明細書において、外寄生生物に対する用途に関しては、シロマジンおよびジシクラニルが特に好ましい。

(In-16) エクジソンアゴニスト／攪乱物質、例えば、ジアシルヒドラジン、例えば、クロマフェノジド、ハロフェノジド、メトキシフェノジドおよびテブフェノジド。

(In-17) オクトパミン性アゴニスト、例えば、アミトラズ、シミアゾール、クロルジメホルム、およびデミジトラズ；本明細書において、外寄生生物に対する用途に関しては、アミトラズ、シミアゾールおよびデミジトラズが特に好ましい。

(In-18) 複合体-I I I 電子伝達阻害剤、例えば、ヒドラメチルノン；アセキノシル；フルアクリピリム。

(In-19) 複合体-I 電子伝達阻害剤、例えば、METI ダニ駆除剤の群の、例えば、フェナザキン、フェンピロキシメート、ピリミジフェン、ピリダベン、テブフェンピラド、トルフェンピラド；本明細書において、外寄生生物に対する用途に関しては、フェンピロキシメート、ピリミジフェンおよびトルフェンピラドが特に好ましい；

(In-20) 電位作動型ナトリウムチャネル遮断薬、例えば、インドキサカルブおよびメタフルミゾン；本明細書において、外寄生生物に対する用途に関しては、インドキサカルブおよびメタフルミゾンが特に好ましい。

(In-21) アセチル-CoA カルボキシラーゼの阻害剤、例えば、テトロノ酸誘導体、例えば、スピロジクロフェンおよびスピロメシフェン；またはテトラミン酸誘導体、例えば、スピロテトラマト。

(In-22) 複合体-I I 電子伝達阻害剤、例えば、シエノピラフェン。

(In-23) リアノジン受容体エフェクター、例えば、ジアミド、例えば、フルデンジアミド、クロラントラニリプロール、シアントラニリプロールおよび 3-ブromo-N- {2-ブromo-4-クロロ-6-[(1-シクロプロピルエチル)カルバモイル]フェニル}-1-(3-クロロピリジン-2-イル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド (国際公開第 2005/077934 号から既知である) またはメチル 2-[3, 5-ジブromo-2-({ [3-ブromo-1-(3-クロロピリジン-2-イル)-1H-ピラゾール-5-イル]カルボニル} アミノ)ベンゾイル]-1, 2-ジメチルヒドラジンカルボキシレート (国際公開第 2007/043677 号から既知である)。

(In-24) 作用の未知の機構を持つさらなる活性成分、例えば、アザジラクチン、アミドフルメト、ベンゾキシメート、ピフェナゼート、キノメチオナト、氷晶石、シフルメトフェン、ジコホル、フルエンズルホン (5-クロロ-2-[(3, 4, 4-トリフルオロブタ-3-エン-1-イル)スルホニル]-1, 3-チアゾール)、フルフェネリム、ピリダリル、およびピリフルキナゾン；ならびにバチルス・フィルムス (I-1582、

10

20

30

40

50

BioNeem、Votivo)に基づくさらなる調製物および以下の既知の活性化合物：
 4- { [(6-プロモピリド-3-イル) メチル] (2-フルオロエチル) アミノ} フ
 ラン-2 (5H) -オン (国際公開第2007/115644号から既知である)、4-
 { [(6-フルオロピリド-3-イル) メチル] (2, 2-ジフルオロエチル) アミノ}
 フラン-2 (5H) -オン (国際公開第2007/115644号から既知である)、4-
 { [(2-クロロ-1, 3-チアゾール-5-イル) メチル] (2-フルオロエチル)
 アミノ} フラン-2 (5H) -オン (国際公開第2007/115644号から既知であ
 る)、4- { [(6-クロロピリド-3-イル) メチル] (2-フルオロエチル) アミノ
 } フラン-2 (5H) -オン (国際公開第2007/115644号から既知である)、
 4- { [(6-クロロピリド-3-イル) メチル] (2, 2-ジフルオロエチル) アミノ
 } フラン-2 (5H) -オン (国際公開第2007/115644号から既知である)、
 4- { [(6-クロロ-5-フルオロピリド-3-イル) メチル] (メチル) アミノ} フ
 ラン-2 (5H) -オン (国際公開第2007/115643号から既知である)、4-
 { [(5, 6-ジクロロピリド-3-イル) メチル] (2-フルオロエチル) アミノ} フ
 ラン-2 (5H) -オン (国際公開第2007/115646号から既知である)、4-
 { [(6-クロロ-5-フルオロピリド-3-イル) メチル] (シクロプロピル) アミノ
 } フラン-2 (5H) -オン (国際公開第2007/115643号から既知である)、
 4- { [(6-クロロピリド-3-イル) メチル] (シクロプロピル) アミノ} フラン-
 2 (5H) -オン (欧州特許第-A-0 539 588号から既知である)、4- { [
 (6-クロロピリド-3-イル) メチル] (メチル) アミノ} フラン-2 (5H) -オン
 (欧州特許-A-0 539 588号から既知である)、[(6-クロロピリジン-3-
 イル) メチル] (メチル) オキシド- λ^4 -スルファニリデンシアナミド (国際公開第
 2007/149134号から既知である)、[1- (6-クロロピリジン-3-イル)
 エチル] (メチル) オキシド- λ^4 -スルファニリデンシアナミド (国際公開第2007
 /149134号から既知である)、[(6-トリフルオロメチルピリジン-3-イル)
 メチル] (メチル) オキシド- λ^4 -スルファニリデンシアナミド (国際公開第2007
 /095229号から既知である)、スルホキサフロール (同様に国際公開第2007/
 149134号から既知である)、11- (4-クロロ-2, 6-ジメチルフェニル) -
 12-ヒドロキシ-1, 4-ジオキサ-9-アザジスピロ [4. 2. 4. 2] テトラデカ
 -11-エン-10-オン (国際公開第2006/089633号から既知である)、3
 - (4'-フルオロ-2, 4-ジメチルビフェニル-3-イル) -4-ヒドロキシ-8-
 オキサ-1-アザスピロ [4. 5] デカ-3-エン-2-オン (国際公開第2008/0
 67911号から既知である)、1- [2-フルオロ-4-メチル-5- [(2, 2, 2-
 ートリフルオロエチル) スルフィニル] フェニル] -3- (トリフルオロメチル) -1H
 -1, 2, 4-トリアゾール-5-アミン (国際公開第2006/043635号から既知
 である)、[(3S, 4aR, 12R, 12aS, 12bS) -3- [(シクロプロピル
 カルボニル) オキシ] -6, 12-ジヒドロキシ-4, 12b-ジメチル-11-オキソ
 -9- (ピリジン-3-イル) -1, 3, 4, 4a, 5, 6, 6a, 12, 12a, 12
 b-デカヒドロ-2H, 11H-ベンゾ [f] ピラノ [4, 3-b] クロメン-4-イル
] メチルシクロプロパンカルボキシレート (国際公開第2006/129714号から既
 知である)、2-シアノ-3- (ジフルオロメトキシ) -N-エチル-ベンゼンスルホン
 アミド (国際公開第2005/035486号から既知である)、N- [1- (2, 3-
 ジメチルフェニル) -2- (3, 5-ジメチルフェニル) エチル] -4, 5-ジヒドロ-
 2-チアゾールアミン (国際公開第2008/104503号から既知である) ; ペニジ
 キノロンA (欧州特許第2248422号 (化合物I) および国際公開第2009/06
 0015号 (化合物番号11) から既知である。

(In-25) 本明細書において外寄生生物駆除剤と共に使用される場合、好適な共力剤
 には、MGK264 (N-オクチルビスクロヘプテンカルボキサミド)、ピペロニルブト
 キシド (PBO)、およびベルブチンが挙げられる ; 本明細書において、ピペロニルブト
 キシドおよびMGK264が特に好ましい。

10

20

30

40

50

【0291】

これらの群に加えて、混合物中で、または併用して短期忌避物質を使用することも可能である。例としては、DEET（N，N－ジエチル－3－メチルベンズアミド）、イカリジン（1－ピペリジンカルボン酸）、（1S，20S）－2－メチルピペリジニル－3－シクロヘキセン－1－カルボキサミド（SS220）、インダロン（ブチル3，4－ジヒドロ－2，2－ジメチル－4－オキソ－2H－ピラン－6－カルボン酸塩）、ジヒドロネベタラクトン、ノートカトン、IR3535（3－[N－ブチル－N－アセチル]－アミノプロピオン酸エチルエステル）、2－エチルヘキサ－1，3－ジオール、（1R，2R，5R）－2－（2－ヒドロキシプロパン－2－イル）－5－メチル－シクロヘキサ－1－オール、ジメチルベンゼン－1，2－ジカルボン酸塩、ドデカン酸、ウンデカン－2－オン、N，N－ジエチル－2－フェニルアセトアミド、および精油または既知の忌避物質作用を持つ他の植物成分、例えば、ボルネオール、カリカルペナール、1，8－シネオール（ユーカリプトール）、カルバクロール、b－シトロネロール、a－コパエン、クマリン（または米国特許第20120329832号から既知のその合成誘導体）である。イカリジン、インダロンおよびIR3535（3－[N－ブチル－N－アセチル]－アミノプロピオン酸エチルエステル）が、外寄生生物に対する使用において特に好ましい。

10

【0292】

前述の群（I－1）～（I－25）から、混合成分として次の群が好ましい。（In－2）、（In－3）、（In－4）、（In－5）、（In－6）、（In－17）、（In－25）。

20

【0293】

本発明の式（I）の化合物の混合成分として殺虫的もしくは殺ダニ的な活性化合物、共力剤、または忌避物質の特に好ましい例は、アフォキシレイナー、アレスリン、アミトラズ、ピオアレトリン、クロチアニジン、シフルトリン（β－）、シハロトリン（λ－）、シミアゾール、シベルメトリン（α－、ζ－）、シフェノトリン、デルタメトリン、デミジトラズ、ジノテフラン、ドラメクチン、エプリノメクチン、エトフェンプロックス、フェンバレレート、フィプロニル、フルアズロン、フルシトリネート、フルメトリン、フルラネル、フルバリネート（τ－）、イカリジン、イミダクロプリド、イベルメクチン、MGK264、ミルベマイシンオキシム、モキシデクチン、ニテンピラム、ペルメトリン、フェノトリン、ピペロニルブトキシド、ピリプロール、レスメトリン、セラメクチン、シラフルオフエン、スピネトラム、スピノサド、テトラメトリン、チアクロプリドである。

30

【0294】

媒介体防除

式（I）の化合物は、媒介体防除においても使用することができる。本発明に関連して、媒介体とは、保有宿主（植物、動物、ヒト等）から宿主に病原体、例えば、ウイルス、虫、単細胞生物、および細菌を伝染させることができる節足動物、特に昆虫またはクモ形類動物である。病原体は、機械的に宿主に（例えば、刺さないハエによるトラコーマ）、または注入後に宿主に（例えば、蚊によるマラリア寄生生物）、伝染され得る。

【0295】

40

媒介体の例、およびそれらが伝染する疾患または病原体は、以下である。

1) 蚊

- －アノフェレス：マラリア、フィラリア；
- －クレックス：日本脳炎、フィラリア、他のウイルス性疾患、虫の伝染；
- －アエデス：黄熱病、デング熱、フィラリア、他のウイルス性疾患；
- －ブユ：虫、特に、オンコセルカ・ボルブルスの伝染；

2) シラミ：皮膚感染症、発疹チフス；

3) ノミ：伝染病、発疹熱；

4) ハエ：睡眠病（トリパノソーマ症）；コレラ、他の細菌疾患；

5) ダニ：ダニ感染、発疹チフス、リケッチア痘症、野兎病、セントルイス脳炎、ダニ媒

50

介脳炎（T B E）、クリミア・コンゴ出血熱、ボレリア症；

6）マダニ：回帰熱ボレリア等のボレリア症、ダニ媒介脳炎、Q熱（コクシエラ・ブルネッティ）、バベシア症（バベシア・カニス・カニス）。

【0296】

本発明に関する媒介体の例は、昆虫、例えば、アブラムシ、ハエ、ヨコバイ、またはアザミウマであり、植物ウイルスを植物に伝染させ得る。植物ウイルスを伝染することができる他の媒介体は、ハダニ、シラミ、甲虫および線虫である。

【0297】

本発明に関する媒介体のさらなる例は、蚊、特にアエデス属、アノフェレス、例えば、A. ガンビエ、A. アラビエンシス、A. フネストス、A. ジルス（マラリア）等の、ならびにイエカ、シラミ、ノミ、ハエ、ダニ、およびマダニ等の昆虫およびクモ形類動物であり、病原体を動物 および／またはヒトに伝染することができる。

【0298】

媒介体防除は、式（I）の化合物が抵抗を遮断する（resistance-breaking）場合も可能である。

【0299】

式（I）の化合物は、媒介体によって伝染する疾患および／または病原体の予防における使用に適している。このため、本発明のさらなる態様は、例えば、農業における、園芸学における、林業における、庭園における、およびレジャー施設における、ならびに原料および保管された製品の保護における、媒介体防除のための式（I）の化合物の使用である。

【0300】

工業原料の保護

式（I）の化合物は、昆虫、例えば、鞘翅目、膜翅目、等翅目、鱗翅目、チャタテムシ目および総尾目の昆虫による攻撃または破壊に対する工業原料の保護に適している。

【0301】

本文脈において工業原料は、好ましくは、プラスチック、接着剤、サイズ剤、紙およびカード、革、木材、加工木材製品、ならびにコーティング組成物等の無生原料を意味することが理解される。木材の保護のための本発明の使用が、特に好ましい。

【0302】

さらなる実施形態では、式（I）の化合物は、少なくとも1つのさらなる昆虫駆除剤および／または少なくとも1つの抗真菌剤と共に使用される。

【0303】

さらなる実施形態では、式（I）の化合物は、さらなる改変を伴わずに問題の原料に適用され得ることを意味する使用準備済殺虫剤の形態である。好適なさらなる昆虫駆除剤または抗真菌剤は、具体的には上に言及されるものである。

【0304】

驚くべきことに、式（I）の化合物は、塩水または汽水と接触している対象、特に船体、スクリーン、ネット、建物、係船および情報伝達システムを汚損から保護するためにも使用することができることも判明した。式（I）の化合物を単独で、または汚損防止剤として他の活性成分と組み合わせて使用することも同じく可能である。

【0305】

衛生区域における動物害虫の防除

式（I）の化合物は、衛生区域における動物害虫の防除に適している。より具体的には、本発明は、家庭内において、衛生区域において、および保管された製品の保護において、特に、閉鎖空間、例えば、住居、製造所、会社、車室で遭遇する昆虫、クモ形類動物、およびダニの防除のために使用することができる。動物害虫の防除に関して、式（I）の化合物は単独で、または他の活性成分および／もしくは補助剤と組み合わせて使用される。それらは、好ましくは、家庭用昆虫駆除製品において使用される。式（I）の化合物は、感受性なおよび耐性のある種に対して、ならびにすべての発生段階において有効である

。

【0306】

これらの害虫には、例えば、クモ形綱の、サソリ目、真正クモ目、およびザトウムシ目の、唇脚綱および倍脚綱の、昆虫綱ゴキブリ目の、鞘翅目、ハサミムシ目、双翅目、異翅目、膜翅目、等翅目、鱗翅目、シラミ目、チャタテムシ目、跳躍目、もしくは直翅目、ノミ目および総尾目の、ならびに軟甲綱等脚目の、害虫を含む。

【0307】

例えば、エアロゾル、加圧されていないスプレー製品、例えば、ポンプスプレーおよび霧化スプレー、自動噴霧システム、噴霧器、発泡体、ゲル、セルローズもしくはプラスチックで作製された蒸発装置用錠剤を用いる蒸発製品、液体蒸発装置、ゲルおよび膜蒸発装置、プロペラ駆動蒸発装置、エネルギーフリーの、もしくは受動性蒸発システム、モスペーパー (moth papers)、モスバッグ (moth bags)、およびモスゲル (moth gels)、顆粒もしくは塵状で、撒き餌、または餌置き場への適用が有効である。

10

【0308】

調製プロセス

本発明の化合物は、当業者に既知の一般的な方法で調製することができる。

【0309】

構造 (I-T1) および (I-T2) の化合物は、類似化合物に関する文献においてすでに記載されている方法で調製することができる。

20

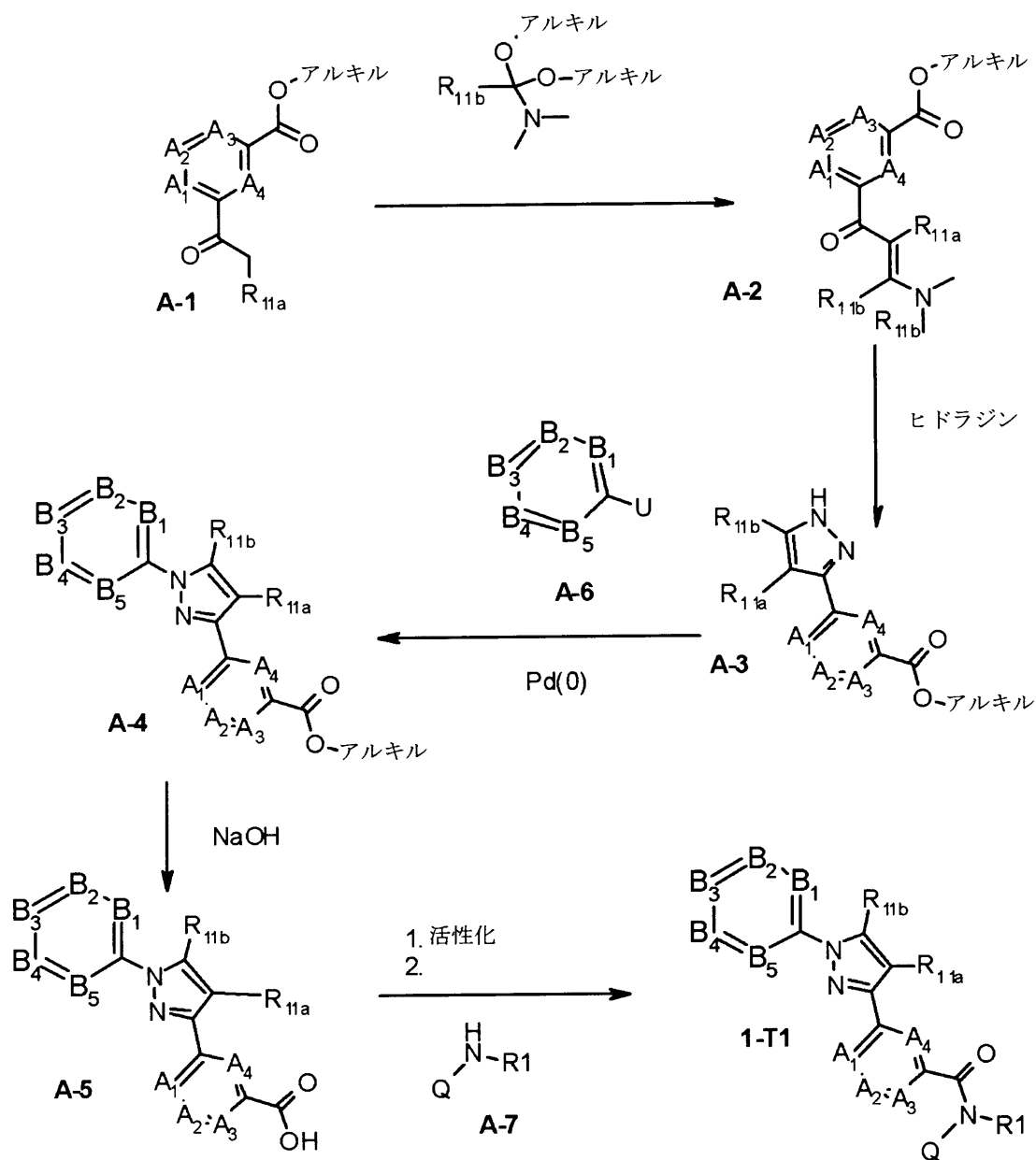
【0310】

プロセス I-T1

構造 (I-T1) の化合物は、反応スキーム 1 で規定されるプロセスによって調製することができる。

反応スキーム 1 :

【化 3 9】



【0311】

A₁～A₄、B₁～B₅、アルキル、Q、R¹およびR¹¹ラジカルは、それぞれ上で定義される通りである。Uは、例えば、臭素、ヨウ素またはトリフレートである。構造 (A-1) (例えば、国際公開第2004/099146号、75～76頁) および (A-7) (例えば、米国特許第5,739,083号、10頁、米国特許第2003/187233A1号、6頁) の出発化合物は、既知であるか、または既知の方法によって調製することができる。

【0312】

一般構造 (A-2) の化合物は、一般構造 (A-1) およびカルボキサミドアセタール (B-8) (例えば、国際公開第2013/009791号、50頁、実施例43；国際公開第2004/099146号、75～76頁) の化合物から、文献から既知の方法と同様に調製することができる。一般構造 (A-3) の化合物は、一般構造 (A-2) およびヒドラジン (例えば、国際公開第2013/009791号、50頁、実施例43；国

10

20

30

40

50

際公開第2004/099146号、75～76頁)の化合物から、文献から既知の方法と同様に調製することができる。一般構造(A-4)の化合物は、一般構造(A-3)および(A-6)(例えば、国際公開第2013/009791号、50頁、実施例44)の化合物から、文献から既知の方法と同様に調製することができる。一般構造(A-5)の化合物は、一般構造(A-4)(例えば、国際公開第2010/051926号または国際公開第2010/133312号を参照されたい)の化合物からエステル加水分解によって、文献から既知のプロセスと同様に調製することができる。一般構造(I-T1)の本発明の化合物は、出発材料(A-5)および(A-7)(例えば、国際公開第2010/051926号または国際公開第2010/133312号)から、文献から既知のペプチドカップリング方法と同様に調製することができる。

10

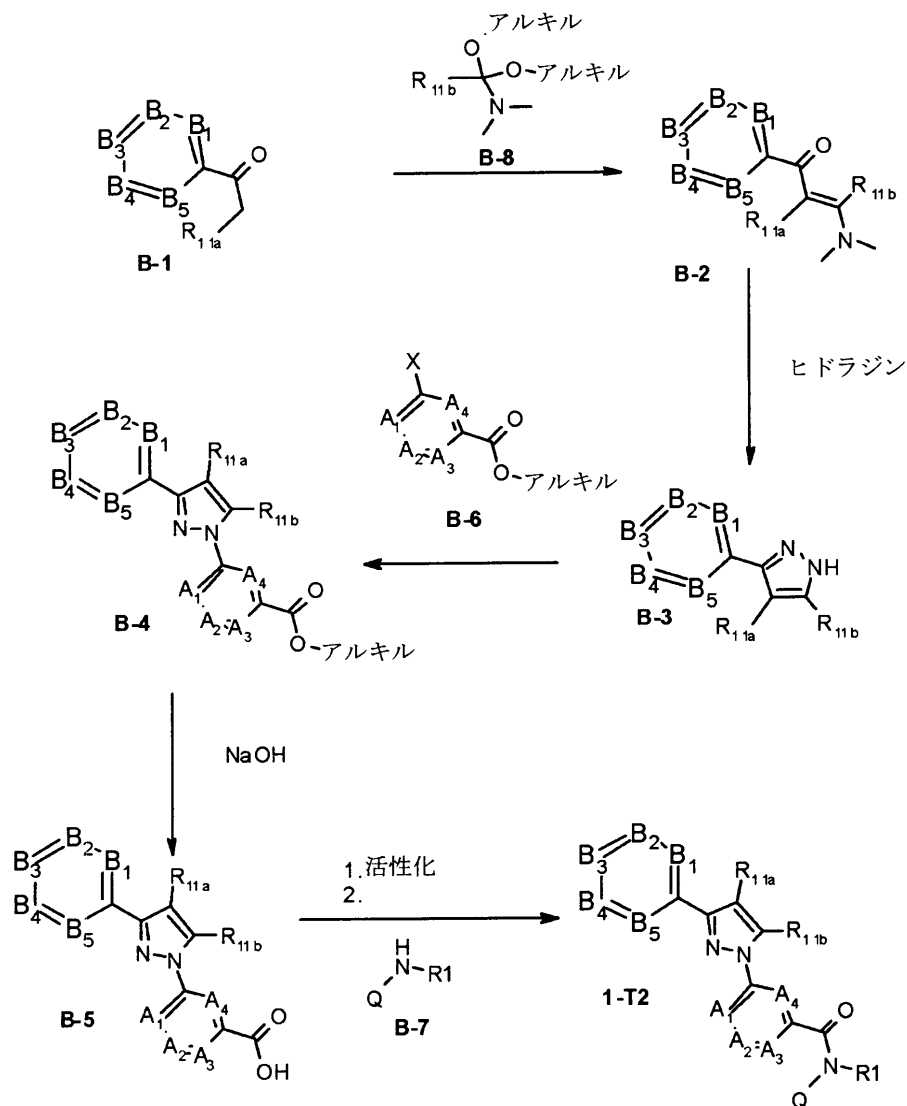
【0313】

プロセス I-T2

構造(I-T2)の化合物は、反応スキーム2で規定されるプロセスによって調製することができる。

反応スキーム2:

【化40】



20

30

40

【0314】

A₁～A₄、B₁～B₅、アルキル、Q、R¹およびR¹¹ラジカルは、それぞれ上で定義される通りである。Xは、例えば、Cl、Br、I、またはボロン酸もしくはボロン酸エステルラジカルである。構造(B-1)(例えば、Filler, Robert; K

50

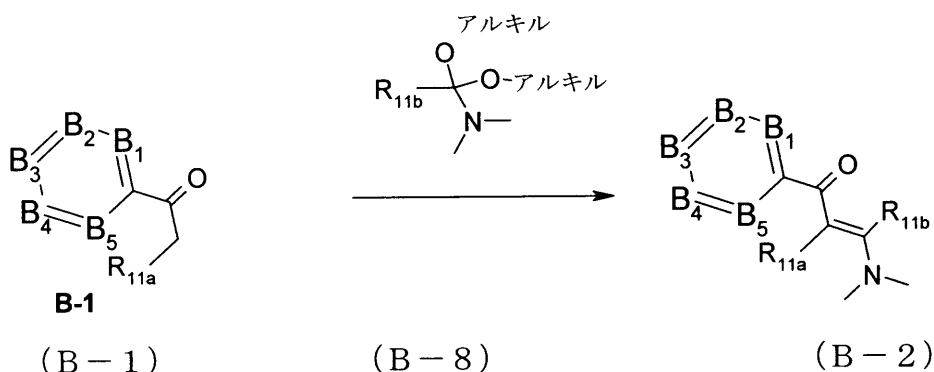
ong, Zhengrong; Zhang, Zhaoxu; Sinha, Arun Kr. ; Li, Xiaofang Journal of Fluorine Chemistry, 80 (1996) 71~76 頁; 米国特許第 2003/187233 号、14 頁、実施例 21) および (B-6) の出発化合物は、既知であるか、または既知の方法で調製することができる。

【0315】

一般構造 (B-2) の化合物は、一般構造 (B-1) およびカルボキサミドアセタール (B-8) (例えば、国際公開第 2006/044505 号、化合物 60、Part A; 国際公開第 2012/4604 号、中間体 2) の化合物から、文献から既知の方法と同様に調製することができる。一般構造 (B-3) の化合物は、一般構造 (B-2) およびヒドラジン (例えば、国際公開第 2013/009791 号、50 頁、実施例 43; 国際公開第 2004/099146 号、75~76 頁) の化合物から、文献から既知の方法と同様に調製することができる。一般構造 (B-4) の化合物は、一般構造 (B-3) および (B-6) (例えば、国際公開第 2013/009791 号、50 頁、実施例 44、X = Br) の化合物から、文献から既知の方法と同様に調製することができる。一般構造 (B-5) の化合物は、一般構造 (B-4) (例えば、国際公開第 2010/051926 号または国際公開第 2010/133312 号) の化合物からエステル加水分解によって、文献から既知のプロセスと同様に調製することができる。一般構造 (I-T1) の本発明の化合物は、出発材料 (B-5) および (B-7) (例えば、国際公開第 2010/051926 号または国際公開第 2010/133312 号) から、文献から既知のペプチドカップリング方法と同様に調製することができる。

段階 1 ジアルキルアミノアルケニル化

【化 41】

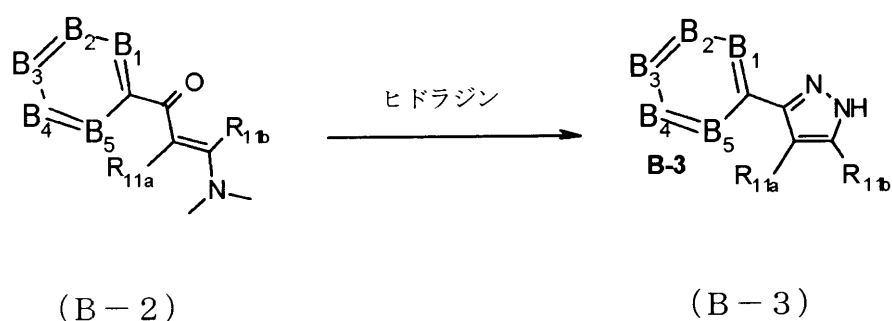


【0316】

一般構造 (B-2) の化合物は、構造 (B-1) および (B-8) の出発材料から、文献から既知の方法と同様に調製することができる。B¹~B⁵、アルキルおよび R¹¹ ラジカルは、それぞれ上で定義される通りである。構造 (B-1) (例えば、Filler, Robert; Kong, Zhengrong; Zhang, Zhaoxu; Sinha, Arun Kr. ; Li, Xiaofang Journal of Fluorine Chemistry, 80 (1996) 71~76 頁; 米国特許第 2003/187233 号、14 頁、実施例 21 [0294]、米国特許第 5739083 号、実施例 6) の出発化合物は、既知であるか、または既知の方法で調製することができる。反応は、化合物 (B-1) を化合物 (B-8) と、類似反応 (例えば、欧州特許第 1204323 号、25 頁、実施例 13) に関する文献で既知の条件下で反応させることによって行われる。

段階 2 ピラゾール閉環

【化 4 2】



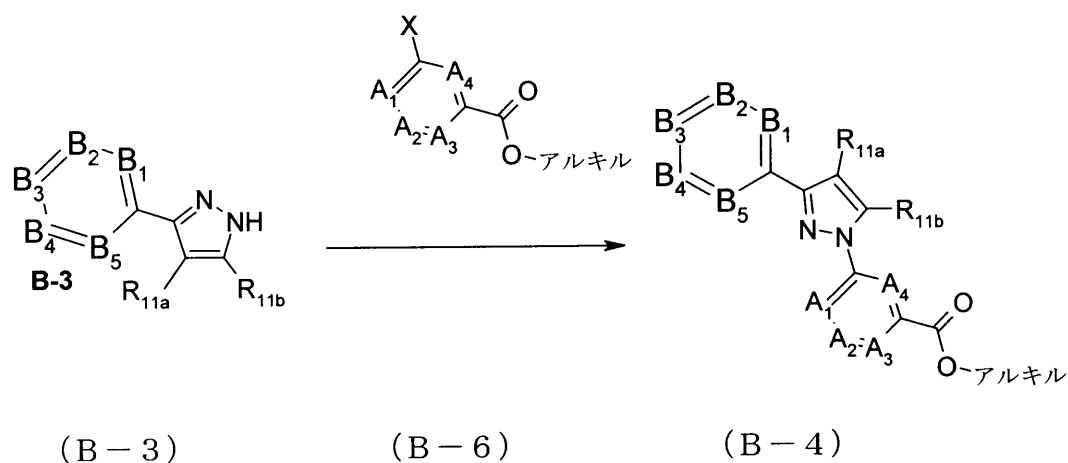
10

【0317】

一般構造 (B-2) の化合物は、構造 (B-2) の出発材料およびヒドラジンから、文献から既知の方法と同様に調製することができる。B¹ ~ B⁵ および R^{11a} ラジカルは、それぞれ上で定義される通りである。構造 (B-2) の出発化合物の調製は上述されている。反応は、化合物 (B-2) をヒドラジンと、類似反応 (欧州特許第 1 3 8 2 6 0 3 号、実施例 3、4 3 頁) に関する文献で既知の条件下で反応させることによって行われる。

段階 3 アリールカップリング

【化 4 3】



30

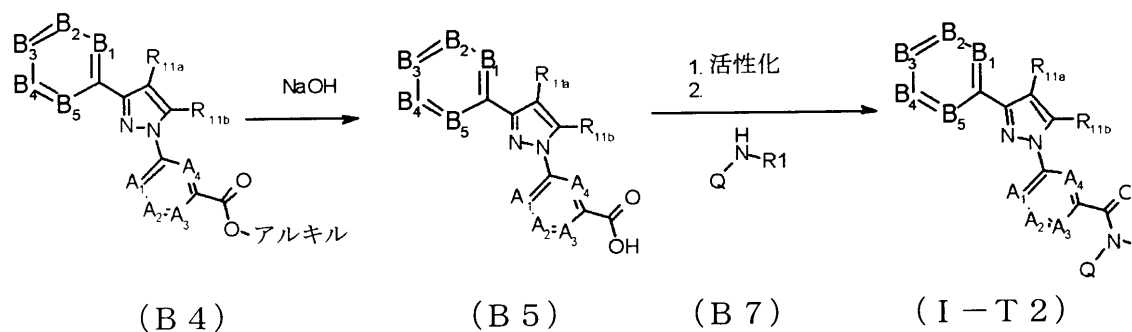
【0318】

一般構造 (B-4) の化合物は、構造 (B-3) および (B-6) の出発材料から、文献から既知の方法と同様に調製することができる。A¹ ~ A⁴、B¹ ~ B⁵、アルキル、R¹ および R¹¹ ラジカルは、それぞれ上で定義される通りである。X はボロン酸またはボロン酸エステルラジカルである。構造 (B-3) の出発化合物の調製は上述されている。一般構造 (B-6) の化合物は市販されているか、または当業者に既知のプロセスで調製することができる。反応は、類似反応 (国際公開第 2 0 0 9 1 4 0 3 4 2 号、9 6 頁) に関する文献で既知の条件下で行われる。

40

段階 4、5 加水分解、アミド化

【化 4 4】



10

【0319】

一般構造 (I - T 2) の本発明の化合物は、出発材料 (B 5) および (B 7) [国際公開第 2010-051926 号；国際公開第 2010-133312 号] から、文献から既知のペプチドカップリング方法と同様に調製することができる。一般構造 (B 5) の化合物は、一般構造 (B 4) [国際公開第 2010-051926 号；国際公開第 2010-133312 号] の化合物からエステル加水分解によって、文献から既知のプロセスと同様に調製することができる。A¹ ~ A⁴、B¹ ~ B⁵、アルキル、Q、R¹ および R¹ ラジカルは、それぞれ上で定義される通りである。構造 (B - 7) の化合物の調製は上

20

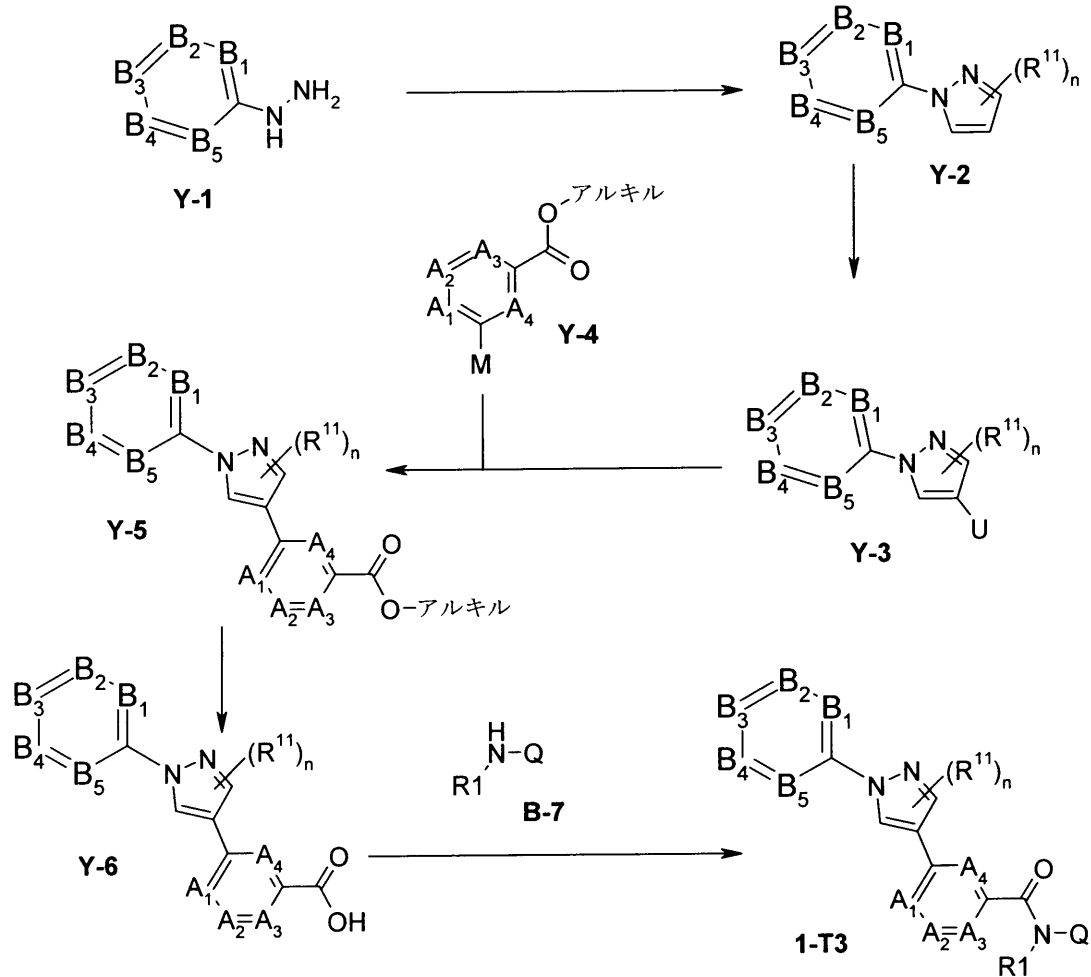
【0320】

プロセス I - T 3

構造 (I - T 3) の化合物は、反応スキーム 3 a で規定されるプロセスによって調製することができる。

反応スキーム 3 a

【化 4 5】



10

20

30

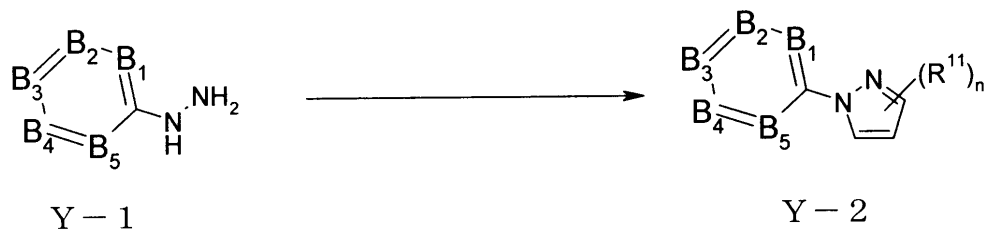
$A_1 \sim A_4$ 、 $B_1 \sim B_5$ 、アルキル、Q、 R^1 、 n および R^{11} ラジカルは、それぞれ上で定義される通りである。Mは、例えば、ボロン酸、ボロン酸エステルまたはトリフルオロボロネートである。Uは、例えば、臭素、ヨウ素またはトリフレートである。Xは、例えば、Cl、Br、Iである。

【0321】

段階1 ピラゾール

本発明の化合物（1-T3）の調製プロセスの段階1：

【化 4 6】



40

【0322】

一般構造（Y-2）の本発明の化合物は、構造（Y-1）の出発材料から、文献から既知の方法と同様に調製することができる。 $B_1 \sim B_5$ および R^{11} ラジカルは、それぞれ上で定義される通りである。構造（Y1）の出発化合物は既知であるか、または既知の方法で調製することができる。例としては、[2, 6-ジクロロ-4-(トリフルオロメチル)フェニル]ヒドラジン、[3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]ヒドラジン、[2, 6-ジクロロ-4-[1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1-(ト

50

リフルオロメチル) エチル] フェニル] ヒドラジン、[2, 6-ジメチル-4-[1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル) エチル] フェニル] ヒドラジン、[2-メチル-4-[1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル) エチル]-6-(トリフルオロメチル) フェニル] ヒドラジン、または[2-クロロ-4-[1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル) エチル]-6-(トリフルオロメチル) フェニル] ヒドラジンが挙げられる。これらは、例えば、米国特許第2003/187233号、13頁; Haga, Takahiro et al., *Heterocycles*, 22 (1984)、117~124頁に記載される方法で調製することができる。

【0323】

10

段階2 ヨードピラゾール

本発明の化合物(1-T3)の調製プロセスの段階2:

【化47】



Y-2

Y-3

20

【0324】

B₁~B₅、nおよびR¹¹ラジカルは、それぞれ上で定義される通りである。Uは、例えば、臭素またはヨウ素である。

【0325】

構造式(Y-3)の化合物は、例えば、1-(2, 6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-4-ヨードピラゾール、3-クロロ-2-(4-ヨードピラゾール-1-イル)-5-(トリフルオロメチル)ピリジン(CAS RN: 8611-89-2)、1-(2, 6-ジクロロ-4-ヘプタフルオロイソプロピルフェニル)-4-ヨードピラゾール、1-(2, 6-ジメチル-4-ヘプタフルオロイソプロピルフェニル)-4-ヨードピラゾール、1-[2-メチル-4-[1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル) エチル]-6-(トリフルオロメチル) フェニル]-4-ヨードピラゾール、1-[2-クロロ-4-[1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル) エチル]-6-(トリフルオロメチル) フェニル]-4-ヨードピラゾールまたは1-[2-エチル-6-メチル-4-[1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル) エチル] フェニル]-4-ヨードピラゾールである。

30

【0326】

一般構造(Y-3)の本発明の化合物は、構造(Y-2)のピラゾールをハロゲン化剤と反応させることによって調製される。B¹~B⁵およびR¹¹ラジカルは、それぞれ上で定義される通りである。好適なハロゲン化化合物は当業者に既知であり、例えば、塩素、臭素、ヨウ素N-クロロスクシンイミド、N-ブロモスクシンイミド、N-ヨードスクシンイミド、1, 3-ジクロロ-5, 5-ジメチルヒダントイン、1, 3-ジプロモ-5, 5-ジメチルヒダントイン、次亜塩素酸ナトリウムおよび一塩化ヨウ素である。臭素、ヨウ素およびヨードスクシンイミドを使用することが好ましい。酸化剤、例えば、過酸化水素の存在下で反応を行うことが有利であり得る。反応は、文献、例えば、Guo Li et al., *Tetrahedron Letters* 48 (2007), 4595-4599; Mary M. Kim et al., *Tetrahedron Letters* 49 (2008), 4026-4028から既知の条件に従う。

40

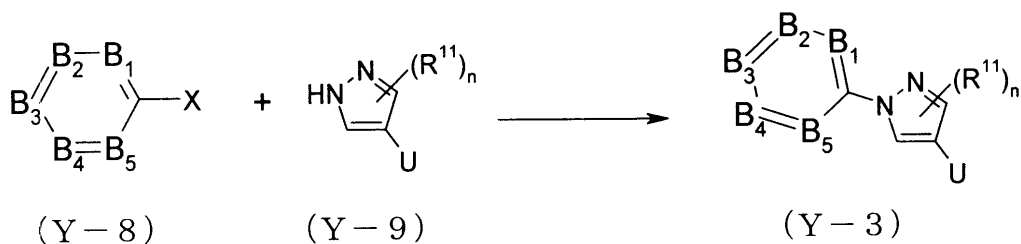
【0327】

ピラゾールとの代替カップリング

50

代替として、構造 Y-3 の化合物は、ヨードピラゾールと適切なアリールハロゲン化物（例えば、Sammelson, Robert E. et al., J. of Organic Chemistry, 68 (2003), 8075-8079）との直接カップリングにより、文献から既知の方法で調製することもできる。

【化 4 8】



10

【0328】

B₁ ~ B₅、n および R¹¹ ラジカルは、それぞれ上で定義される通りである。X は、例えば、ハロゲンである。U は、例えば、臭素、ヨウ素またはトリフレートである。

【0329】

構造 (Y-8) の出発化合物は既知であるか、または既知の方法で調製することができる。例としては、2-ブロモ-1, 3-ジクロロ-5-[1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]ベンゼン、2-ブロモ-1, 3-ジメチル-5-[1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]ベンゼン、2-ブロモ-1-エチル-3-メチル-5-[1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]ベンゼン、2-ブロモ-1-クロロ-5-[1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]-3-(トリフルオロメチル)ベンゼン、2-ブロモ-1-メチル-5-[1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]-3-(トリフルオロメチル)ベンゼン、2-ブロモ-1-クロロ-5-[1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]-3-(トリフルオロメトキシ)ベンゼン、2-ブロモ-1-メチル-5-[1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]-3-(トリフルオロメトキシ)ベンゼンが挙げられる。これらは、例えば、欧州特許第 1 2 5 3 1 2 8 号、8 ~ 10 頁に記載される方法で調製することができる。

20

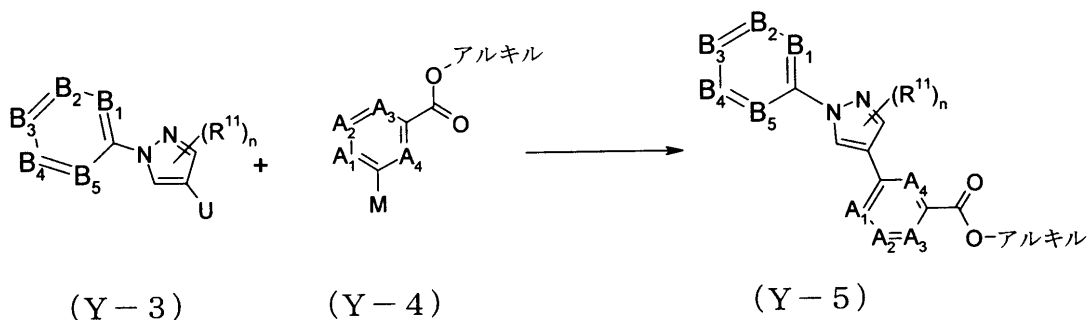
30

【0330】

段階 3 ボロン酸カップリング

本発明の化合物 (1-T3) の調製プロセスの段階 3 :

【化 4 9】



40

【0331】

A₁ ~ A₄、B₁ ~ B₅、アルキル、n および R¹¹ ラジカルは、それぞれ上で定義される通りである。U は、例えば、M がボロン酸、ボロン酸エステルもしくはトリフルオロ

50

【 0 3 3 2 】

段階 4、5 加水分解、アミド化

【化 5 0】



20

一般構造 (I-T3) の本発明の化合物は、出発材料 (Y-6) および (Y-7) (例えば、国際公開第 2010/051926 号または国際公開第 2010/133312 号) から、文献から既知のペプチドカップリング方法と同様に調製することができる。一般構造 (Y-6) の化合物は、一般構造 (Y-5) (例えば、国際公開第 2010/051926 号または国際公開第 2010/133312 号) の化合物からエステル加水分解によって、文献から既知のプロセスと同様に調製することができる。A₁ ~ A₄、B₁ ~ B₅、アルキル、Q、R¹ および R^{1 1} ラジカルは、それぞれ上で定義される通りである。

30

【 0 3 3 4 】

段階 3 の代替方法：アミドとのカップリング

代替として、本発明の化合物（I-T3）は、一般調製プロセス3bによって調製することができる。

反応スキーム 3 b

【化 5 1】



50

$A_1 \sim A_4$ 、 $B_1 \sim B_5$ 、アルキル、 Q 、 R^1 、 n および R^{11} ラジカルは、それぞれ上で定義される通りである。 U は、 M がボロン酸、ボロン酸エステルもしくはトリフルオロボロネートである場合、臭素、ヨウ素またはトリフレートである。 U は、 M が臭素、ヨウ素もしくはトリフレートである場合、ボロン酸、ボロン酸エステルまたはトリフルオロボロネートである。

【0336】

一般構造 (I-T3) の本発明の化合物は、共反応物質 (Y-3) および (Y-10) (例えば、国際公開第2005/040110号または国際公開第2009/089508号) からのパラジウム触媒反応によって、文献から既知の方法で調製することができる。一般構造 (Y-10) の化合物は市販されているか、または当業者に既知のプロセスで調製することができる。構造 (Y-3) の化合物の調製はすでに上述されている。

10

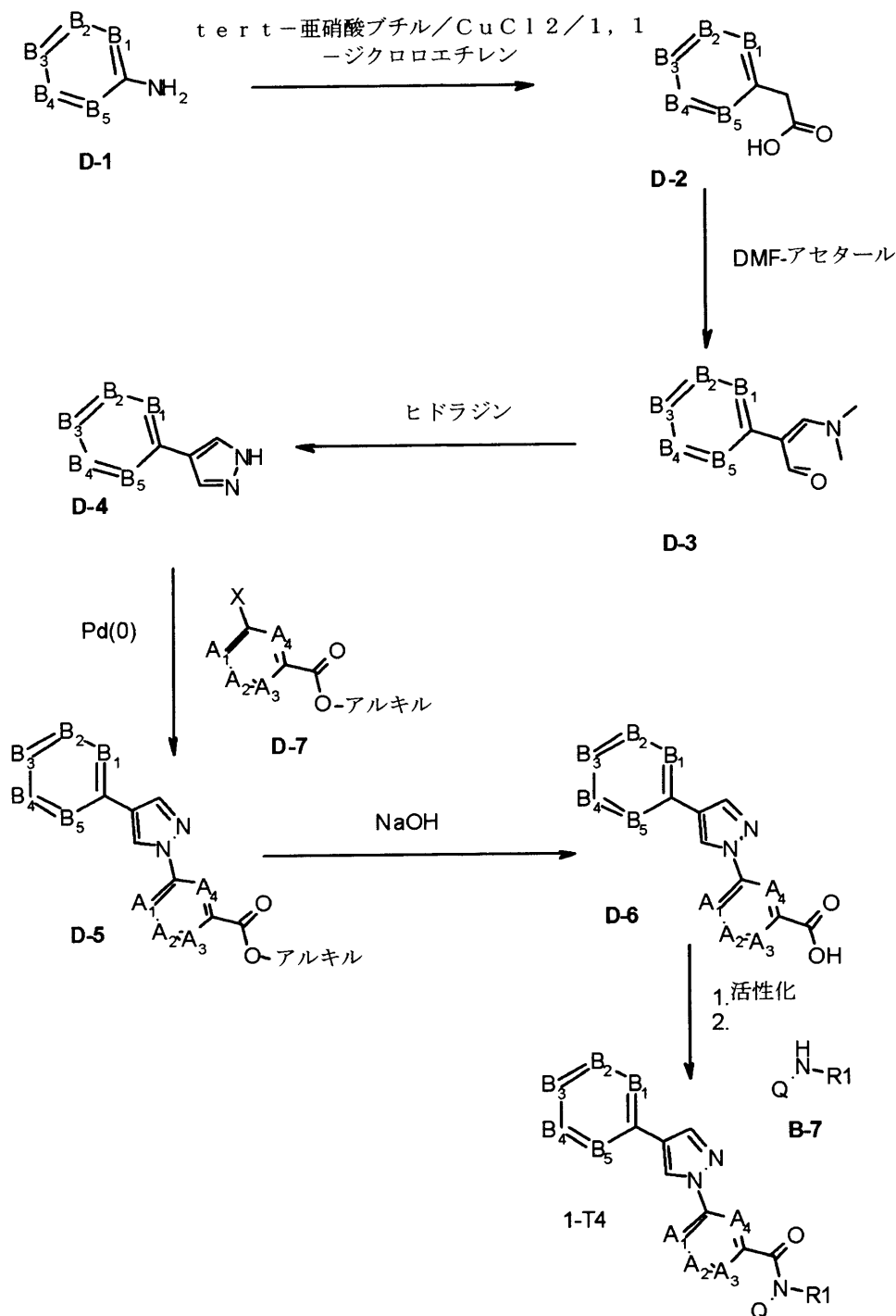
【0337】

プロセス I-T4

構造 (I-T4) の化合物は、反応スキーム4で規定されるプロセスによって調製することができる。

反応スキーム4

【化 5 2】



【0338】

$A_1 \sim A_4$ 、 $B_1 \sim B_5$ 、アルキル、Qおよび R^1 ラジカルは、それぞれ上で定義される通りである。XはCl、Br、Iである。構造(D-1)(例えば、欧州特許第2319830号、330頁)および(D-7)の出発化合物は既知であるか、または既知の方法で調製することができる。

【0339】

反応は、文献、例えば、国際公開第2012/149236号、Majumder, Supriyo et al., Advanced Synthesis and Catalysis, 351 (2009), 2013-2023、または米国特許第5,061,705号に記載されるプロセスによって行うことができる。

【0340】

一般構造 (D2) の化合物は、一般構造 (D1) (例えば、国際公開第 2008148868A1 号、87 頁) の化合物から、文献から既知の方法と同様に調製することができる。一般構造 (D3) の化合物は、一般構造 (D2) およびイミニウム塩 (例えば、Knorr, Rudolf; Loew, Peter; Hassel, Petra; Bronberger, Hildegard *Journal of Organic Chemistry*, 49 (1984)、1288~1290 頁) の化合物から、文献から既知の反応と同様に調製することができる。一般構造 (D4) の化合物は、一般構造 (D3) およびヒドラジン (例えば、国際公開第 2008080969 A1 号、102~103 頁、実施例 104) の化合物から、文献から既知の方法と同様に調製することができる。一般構造 (D5) の化合物は、一般構造 (D4) および (D7) (例えば、国際公開第 2013009791 号、50 頁、実施例 44) の化合物から、文献から既知の方法と同様に調製することができる。一般構造 (D6) の化合物は、一般構造 (D5) [国際公開第 2010-051926 号; 国際公開第 2010-133312 号] の化合物からエステル加水分解によって、文献から既知のプロセスと同様に調製することができる。一般構造 (I-T4) の本発明の化合物は、出発材料 (D6) および (D8) [国際公開第 2010-051926 号; 国際公開第 2010-133312 号] から、文献から既知のペプチドカップリング方法と同様に調製することができる。

10

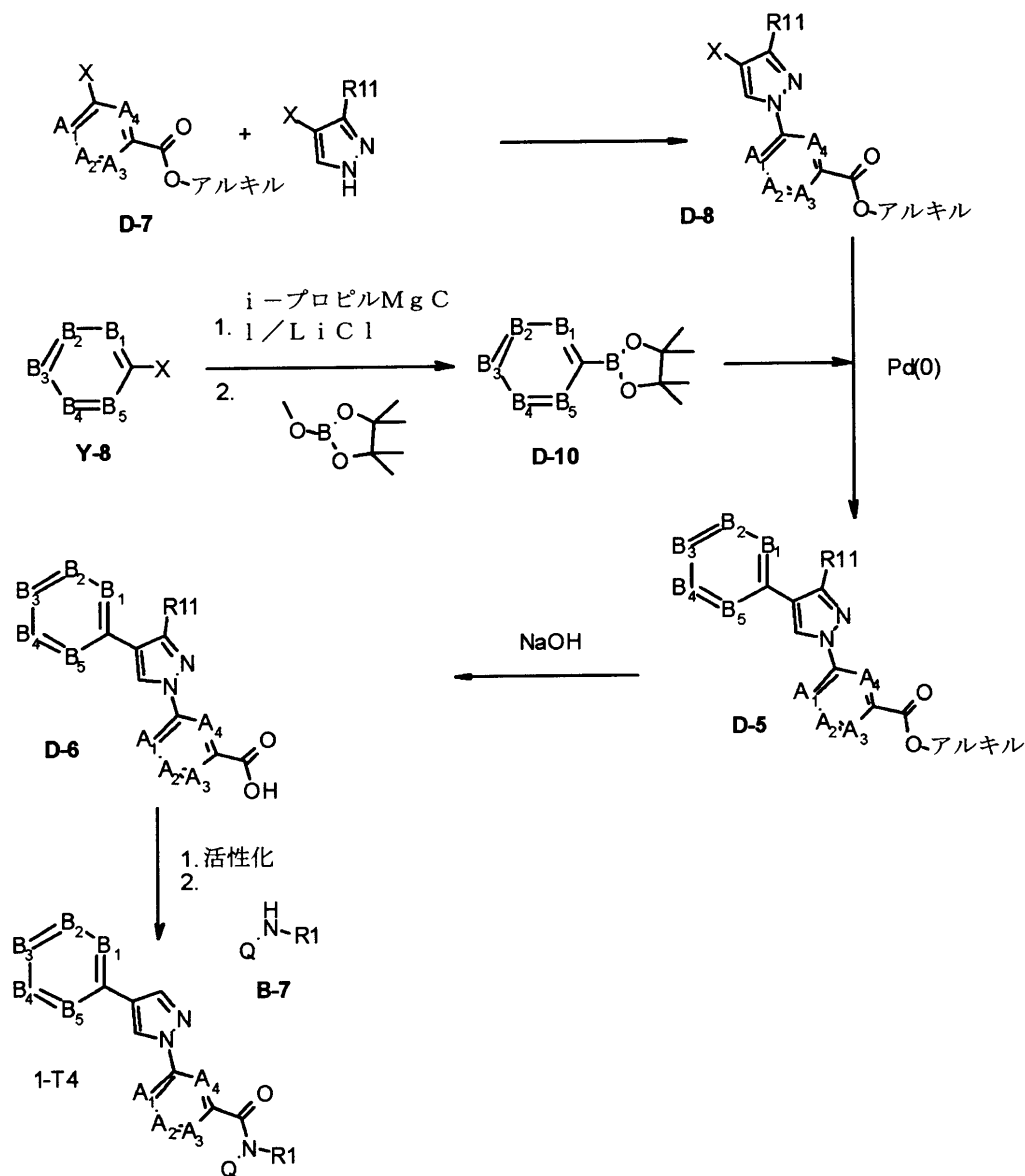
【0341】

構造 (I-T4) の化合物は、代替として、反応スキーム 5 で規定されるプロセスで調製することができる。

20

反応スキーム 5:

【化 5 3】



【0342】

$A_1 \sim A_4$ 、 $B_1 \sim B_5$ 、アルキル、Q、 R^1 および R^{11} ラジカルは、それぞれ本明細書で定義される通りである。XはCl、Br、Iである。構造(D-7)、(D-9)および(D-11)(例えば、欧州特許第1253128号、8~10頁)の出発化合物は既知であり、いくつかは市販されているか、または既知の方法で調製することができる。

【0343】

反応は、文献に記載されるプロセスによって行うことができる。

【0344】

段階1 ピラゾールカップリング

本発明の化合物(I-T4)の調製プロセスの段階1:

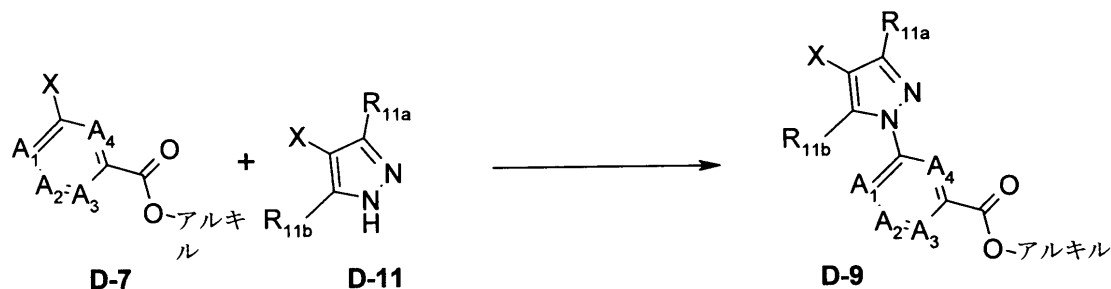
10

20

30

40

【化 5 4】



10

【0 3 4 5】

一般構造（D-9）の化合物は、構造（D-7）および（D-11）の出発材料から、文献から既知の方法と同様に調製することができる。A¹～A⁴、アルキルおよびXラジカルは、それぞれ上で定義される通りである。構造（D-7）の出発化合物は既知であるか（例えば、国際公開第2004099146A1号、68～69頁）、または既知の方法で調製することができる。例としては、メチル2-クロロ-5-ヨード安息香酸、エチル2-ブロモ-5-ヨード安息香酸、メチル5-ブロモ-2-クロロ-3-フルオロ安息香酸、エチル5-ブロモ-2-クロロニコチン酸が挙げられる。構造（D-11）の出発化合物は既知であり、それらのいくつかは、市販されているか、または既知の方法で調製することができる。例としては、4-ブロモピラゾール、4-ブロモ-3-メチルピラゾール、4-ブロモ-3, 5-ジメチルピラゾールおよび4-ブロモ-3-（トリフルオロメチル）ピラゾールが挙げられる。

20

【0 3 4 6】

まだ知られていない化合物（D-9）は、ピラゾールを芳香族系に結合するための既知のプロセス（例えば、国際公開第2013009791号、50頁、実施例44）と同様に調製することができる。

【0 3 4 7】

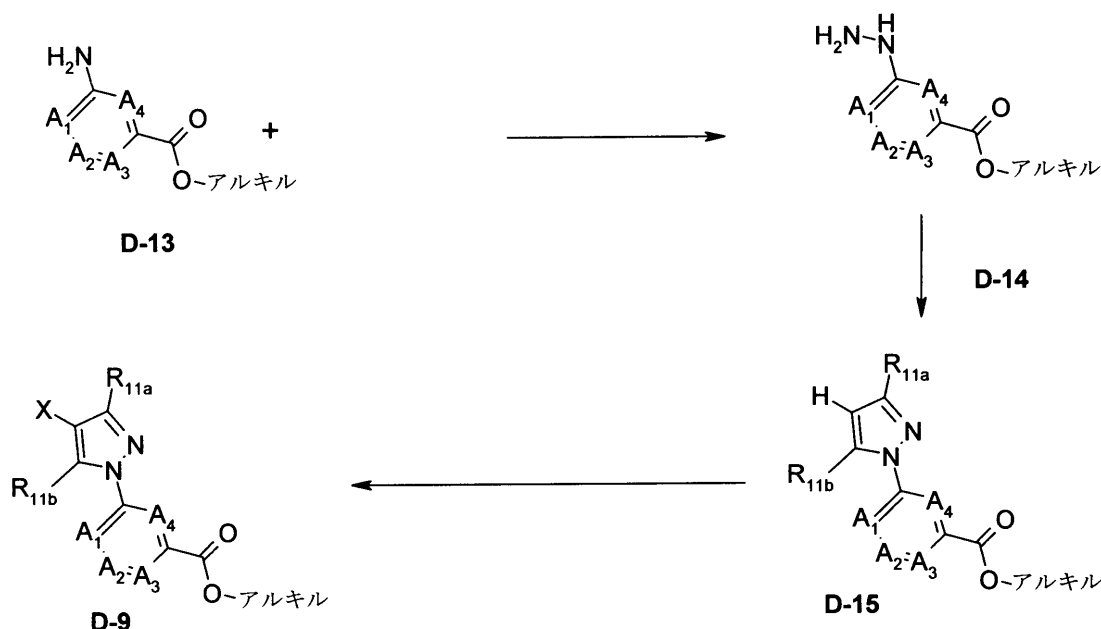
ピラゾールの代替調製

代替として、一般構造（D-9）の本発明の化合物は、反応スキーム6で規定される経路で得ることができる。

30

反応スキーム6：

【化 5 5】



40

50

【0348】

A₁～A₄、アルキルおよびR₁₁ラジカルは、それぞれ上で定義される通りである。XはCl、Br、Iである。構造(D-13)の出発化合物が既知である(例えば、国際公開第2004099146A1号、68～69頁)か、または既知の方法で調製することができる。例としては、メチル5-アミノ-2-クロロ安息香酸、エチル5-アミノ-2-クロロ安息香酸、メチル5-アミノ-2-クロロ-3-フルオロ安息香酸、エチル5-アミノ-2-クロロニコチン酸が挙げられる。

【0349】

まだ知られていない化合物(D-14)は、アリールヒドラジンを調製するための既知のプロセス(例えば、国際公開第2004058731号、65頁)と同様に調製することができる。

10

【0350】

一般構造(D-15)の本発明の化合物は、構造(D-14)の出発材料から、文献から既知の方法と同様に調製することができる。A₁～A₄、アルキルおよびR₁₁ラジカルは、それぞれ上で定義される通りである。構造(D-14)の出発化合物は既知であるか、または既知の方法で調製することができる。例としては、メチル2-クロロ-5-ヒドラジノ安息香酸、エチル2-クロロ-5-ヒドラジノ安息香酸、メチル2-クロロ-3-フルオロ-5-ヒドラジノ安息香酸、エチル2-クロロ-5-ヒドラジノニコチン酸が挙げられる。反応は、文献(例えば、Sachweh, Volker; Langhals, Heinz Chemische Berichte, 119 (1986) 1627-1639)において既知のピラゾール閉環の条件と同様に行うことができる。

20

【0351】

一般構造(D9)の本発明の化合物は、構造(D-15)のピラゾールをハロゲン化剤と反応させることによって調製される。A₁～A₄、アルキルおよびR₁₁ラジカルは、それぞれ上で定義される通りである。構造(D15)の好ましい化合物には、メチル2-クロロ-5-(ピラゾール-1-イル)安息香酸、エチル2-クロロ-5-(ピラゾール-1-イル)安息香酸、メチル2-クロロ-3-フルオロ-5-(ピラゾール-1-イル)安息香酸、エチル2-クロロ-5-(ピラゾール-1-イル)-ニコチン酸が挙げられる。

30

【0352】

好適なハロゲン化化合物は当業者に既知であり、例えば、塩素、臭素、ヨウ素、N-クロロスクシンイミド、N-ブロモスクシンイミド、N-ヨードスクシンイミド、1,3-ジクロロ-5,5-ジメチルヒダントイン、1,3-ジプロモ-5,5-ジメチルヒダントイン、次亜塩素酸ナトリウムおよび一塩化ヨウ素である。臭素、ヨウ素、ブロモスクシンイミドおよびヨードスクシンイミドを使用することが好ましい。酸化剤、例えば、過酸化水素の存在下で反応を行うことが有利であり得る。反応は、文献、例えば、Guo Li et al., Tetrahedron Letters 48 (2007), 4595-4599; Mary M. Kim et al., Tetrahedron Letters 49 (2008), 4026-4028から既知の条件に従う。

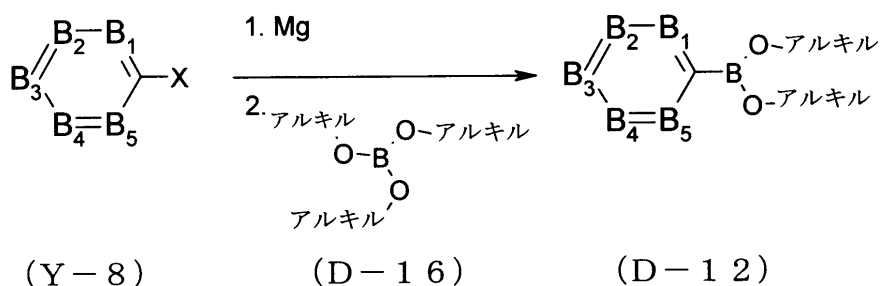
40

【0353】

段階2 ボロン酸エステル

段階2：構造(D12)の出発化合物の調製

【化 5 6】



10

【0354】

一般構造 (D-12) の本発明の化合物は、構造 (D-10) の出発材料から、マグネシウムとの反応および構造 (D-16) のホウ酸エステルとの後続の反応により、文献 (Chien, Yuh-Yih; Chou, Meng-Yen; Leung, Man-Kit; Liao, Yuan-Li; Lin, Chang-Chih; Wong, Ken-Tsung; Journal of Organic Chemistry, 67 (2002)、1041~1044頁) から既知の方法と同様に調製することができる。

【0355】

B¹ ~ B⁵ およびアルキルラジカルは、それぞれ上で定義される通りである。

20

【0356】

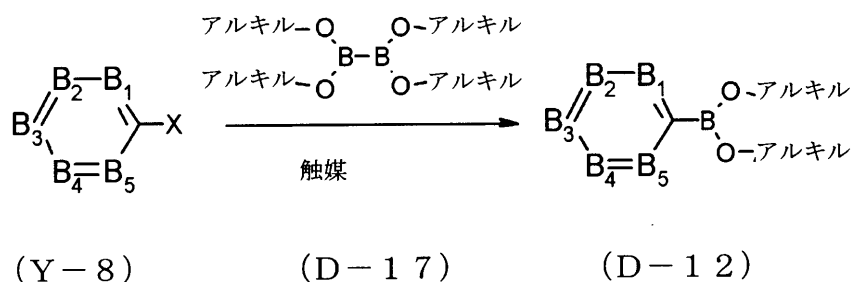
反応で使用される構造 (D-13) のホウ酸エステルは既知であるか、または既知の方法で調製することができる。例としては、ホウ酸トリメチル、ホウ酸トリエチルおよび 2-メトキシ-4, 4, 5, 5-テトラメチル-1, 3, 2-ジオキサボロランが挙げられる。

【0357】

あるいは、一般構造 (D-12) の本発明の化合物は、構造 (D-10) の出発材料から、触媒の存在下で構造 (D-14) のジボラン誘導体との反応により、文献 (Tang, Wenjun; Keshipeddy, Santosh; Zhang, Yongda; Wei, Xudong; Savoie, Jolaine; Patel, Nitinchaandra D.; Yee, Nathan K.; Senanayake, Chris H.; Organic Letters, 13 (2011) S. 1366-1369) から既知の方法と同様に調製することができる。

30

【化 5 7】



40

【0358】

反応で使用される構造 (D-17) のホウ酸エステルは既知であるか、または既知の方法で調製することができる。例としては、4, 4, 5, 5-テトラメチル-2-(4, 4, 5, 5-テトラメチル-1, 3, 2-ジオキサボロラン-2-イル)-1, 3, 2-ジオキサボロラン (ビス (ピナコラート) ニホウ素) が挙げられる。

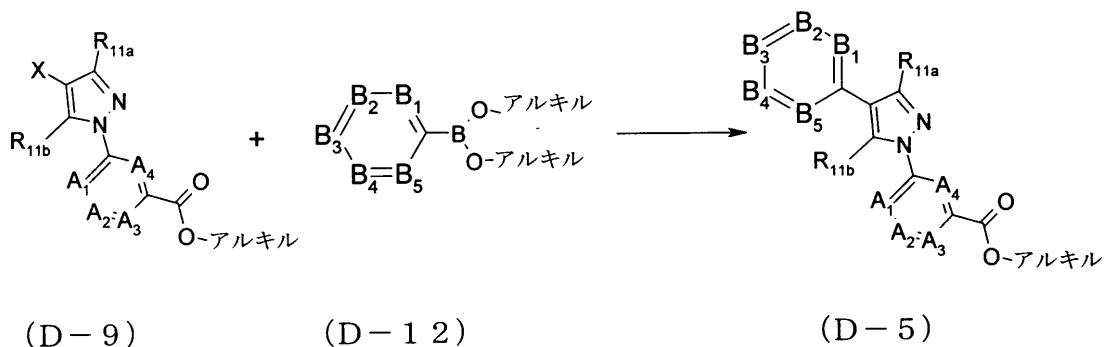
【0359】

50

使用される触媒は、具体的には、パラジウムと Cu (I) との化合物および複合体であり得る。

段階 3 アリールカップリング

【化 5 8】



10

【0360】

一般構造 (D-5) の本発明の化合物は、構造 (D-9) の化合物を構造 (D-12) のボロン酸エステルと反応させることによって調製される。

【0361】

A¹ ~ A⁴、B¹ ~ B⁵、R¹¹、アルキルおよび X ラジカルは、それぞれ上で定義される通りである。

20

【0362】

構造 (D-9) および (D-12) の化合物の調製は上述されている。

【0363】

構造 (D-9) の化合物の例としては、メチル 5- (4-プロモピラゾール-1-イル)-2-クロロ安息香酸、メチル 5- (4-ヨードピラゾール-1-イル)-2-クロロ安息香酸、エチル 5- (4-プロモ-3-メチルピラゾール-1-イル)-2-クロロ安息香酸、メチル 5- (4-プロモ-3- (トリフルオロメチル) ピラゾール-1-イル)-2-クロロ安息香酸、メチル 5- (4-プロモ-3- (トリフルオロメチル) ピラゾール-1-イル)-2-クロロ安息香酸、メチル 5- (4-プロモ-3, 5-ジメチルピラゾール-1-イル)-2-クロロ安息香酸およびエチル 5- (4-プロモ-3-メチルピラゾール-1-イル)-2-クロロニコチン酸が挙げられる。

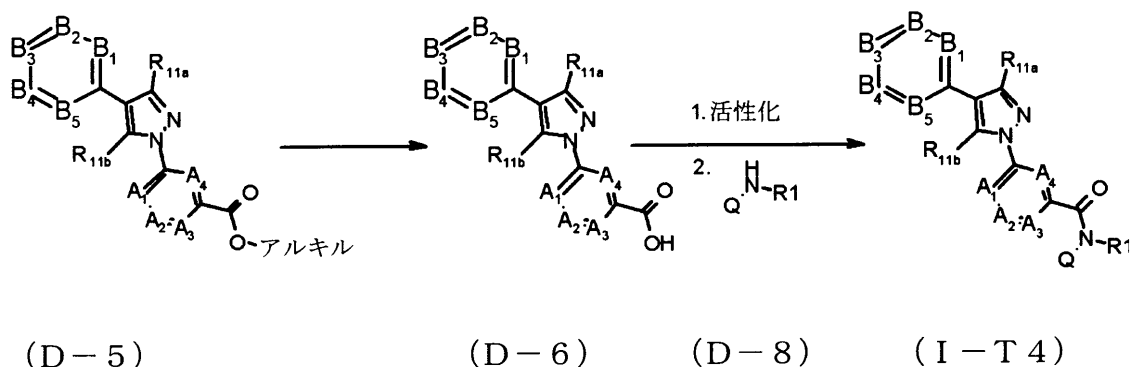
30

【0364】

反応は、文献、例えば、国際公開第 2005040110 号または国際公開第 2009089508 号に記載される条件下で行われる。

段階 4、5 加水分解、アミド化

【化 5 9】



40

【0365】

50

一般構造 (I-T4) の本発明の化合物は、出発材料 (D-6) および (D-8) [国際公開第 2010051926 号; 国際公開第 2010133312 号] から、文献から既知のペプチドカップリング方法と同様に調製することができる。一般構造 (D-6) の化合物は、一般構造 (D-5) [国際公開第 2010-051926 号; 国際公開第 2010133312 号] の化合物からエステル加水分解によって、文献から既知のプロセスと同様に調製することができる。A₁~A₄、B₁~B₅、アルキル、Q、R¹ および R¹¹ ラジカルは、それぞれ上で定義される通りである。構造 (D5) の化合物の調製は上述されている。

【0366】

(I-T5) : 式 (I-T5) の化合物は、例えば、Friedrich, L. E. et al. Journal of Organic Chemistry, 43 (1978), 34-38、または Huettel, R. et al. Chemische Berichte, 93 (1960), 1425~1432 頁、または Sato, T et al., Bulletin of the Chemical Society of Japan, 41 (1968), 3017~3018 頁と同様に調製することができる。

10

【0367】

(I-T8) : 式 (I-T8) の化合物は、例えば、欧州特許第 1 405 636 号、実施例 5、または欧州特許第 2 301 538 号、162 頁、または Schmidt, Bernd et al., European Journal of Organic Chemistry, (2011), 4814~4822 頁と同様に調製することができる。

20

【0368】

(I-T9) : 式 (I-T9) の化合物は、例えば、Ma, Shengming et al., Chemistry-A European Journal, 9 (2003), 2447~2456 頁と同様に調製することができる。

【0369】

(I-T10) : 式 (I-T10) の化合物は、例えば、欧州特許第 2 301 538 号、162 頁と同様に調製することができる。

【0370】

(I-T11) : 式 (I-T11) の化合物は、例えば、欧州特許第 2 301 538 号、165 頁と同様に調製することができる。

30

【0371】

(I-T12) : 式 (I-T12) の化合物は、例えば、欧州特許第 2 301 538 号、164 頁と同様に調製することができる。

【0372】

(I-T13) : 式 (I-T13) の化合物は、例えば、欧州特許第 2 301 538 号、164 頁と同様に調製することができる。

【0373】

(I-T14) : 式 (I-T14) の化合物は、例えば、Hibi, Shigeki et al., Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters, 10 (2000), 623~626 頁または Wang, Xiang et al. Journal of Organic Chemistry, 72 (2007), 1476-1479; 欧州特許第 1 405 636 号、31 頁と同様に調製することができる。

40

【0374】

(I-T15) : 式 (I-T15) の化合物は、例えば、Chattopadhyay, Buddhadeb et al., Organic Letters, 13 (2011), 3746~3749 頁と同様に調製することができる。

【0375】

(I-T16) : 式 (I-T16) の化合物は、例えば、Campi, Eva M. e

50

t al. Tetrahedron Letters, 32 (1991)、1093～1094頁；またはThompson, Benjamin B. et al., Organic Letters, 13 (2011)、3289～3291頁；またはKloetzel et al. Journal of the American Chemical Society, 79 (1957)、4222頁；またはChi, Yonggui Robin et al., Journal of the American Chemical Society, 135 (2013)、8113～8116頁と同様に調製することができる。

【0376】

(I-T18)：式(I-T18)の化合物は、例えば、欧州特許第2 311 455号、150頁；またはBalaban, A. T. et al. Tetrahedron, 19 (1963)、2199～2207頁と同様に調製することができる。

10

【0377】

(I-T19)：式(I-T19)の化合物は、例えば、国際公開第2004/14366号、108頁と同様に調製することができる。

【0378】

(I-T20)：式(I-T20)の化合物は、例えば、Araki, Hiroshi；Kato, Tadao；Inoue, Munenori；Synlett, (2006)、555～558頁；米国特許第6, 545, 009号、27頁、実施例1と同様に調製することができる。

20

【0379】

(I-T21)：式(I-T21)の化合物は、例えば、国際公開第2004/72050号、13頁；または米国特許第6, 545, 009号、27頁と同様に調製することができる。

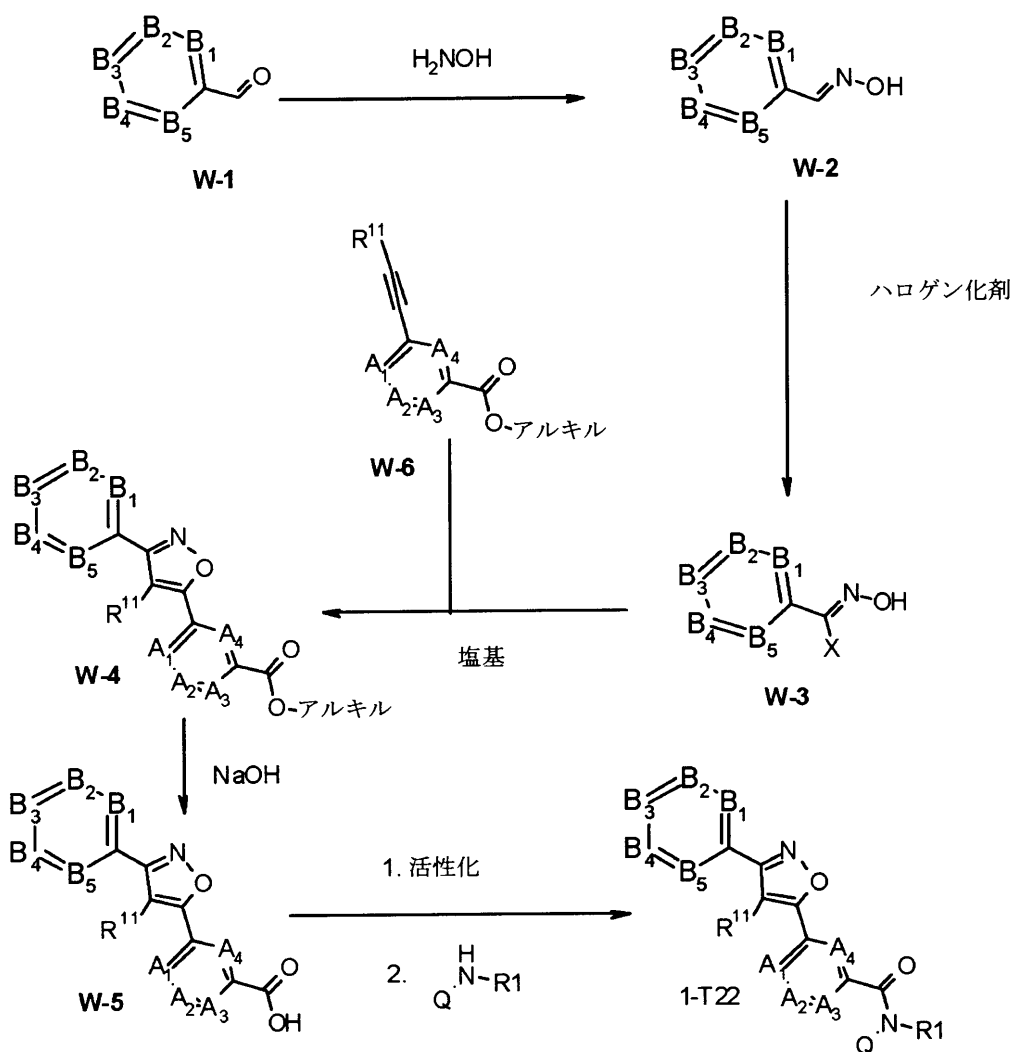
【0380】

プロセスI-T22

構造(I-T22)の化合物は、スキーム7で規定されるプロセスによって調製することができる。

反応スキーム7：

【化 6 0】



10

20

30

【0381】

$A_1 \sim A_4$ 、 $B_1 \sim B_5$ 、アルキル、Q、 R^1 および R^{11} ラジカルは、それぞれ上で定義される通りである。XはCl、Br、Iである。構造(W-1)および(W-6)の出発化合物は既知であるか(W-1は、例えば米国特許第2011/53904号、19頁、W-6は、例えば国際公開第2012/175474号、117~118頁)、または既知の方法で調製することができる。反応は、化合物(I-T23)の調製に対して指定される条件と同様に行われる。

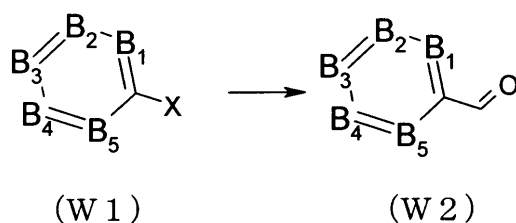
【0382】

段階1 アルデヒド

40

本発明の化合物(I-T22)の調製プロセスの段階1:

【化 6 1】



50

一般構造（W2）の本発明の化合物は、構造（W1）の出発材料から、文献（米国特許第5739083号、実施例2；国際公開第2011／23667号、34頁）から既知の方法と同様に調製することができる。

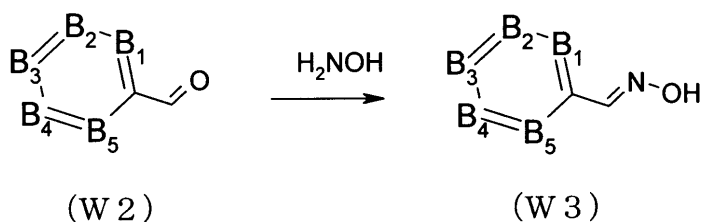
B¹ ~ B⁵ および X ラジカルは、それぞれ上で定義される通りである。X は、例えば、塩素、臭素またはヨウ素である。

構造（Ｂ１）の出発化合物は既知であるか、または既知の方法で調製することができる。例としては、２－ブロモ－１，３－ジクロロ－５－〔１，２，２，２－テトラフルオロ－１－（トリフルオロメチル）エチル〕ベンゼン、２－ブロモ－１，３－ジメチル－５－〔１，２，２，２－テトラフルオロ－１－（トリフルオロメチル）エチル〕ベンゼン、２－ブロモ－１－エチル－３－メチル－５－〔１，２，２，２－テトラフルオロ－１－（トリフルオロメチル）エチル〕ベンゼン、２－ブロモ－１－クロロ－５－〔１，２，２，２－テトラフルオロ－１－（トリフルオロメチル）エチル〕－３－（トリフルオロメチル）ベンゼン、２－ブロモ－１－メチル－５－〔１，２，２，２－テトラフルオロ－１－（トリフルオロメチル）エチル〕－３－（トリフルオロメチル）ベンゼン、２－ブロモ－１－クロロ－５－〔１，２，２，２－テトラフルオロ－１－（トリフルオロメチル）エチル〕－３－（トリフルオロメトキシ）ベンゼン、２－ブロモ－１－メチル－５－〔１，２，２，２－テトラフルオロ－１－（トリフルオロメチル）エチル〕－３－（トリフルオロメトキシ）ベンゼン、１，３－ジメチル－２－ヨード－５－〔１，２，２，２－テトラフルオロ－１－（トリフルオロメチル）エチル〕ベンゼン、２－ヨード－１－メチル－５－〔１，２，２，２－テトラフルオロ－１－（トリフルオロメチル）エチル〕－３－（トリフルオロメチル）ベンゼンが挙げられる。これらは、例えば、欧州特許第１２５３１２８号、８～１０頁に記載される方法で調製することができる。

段階 2 オキシム

本発明の化合物（1-T22）の調製プロセスの段階2：

$$\begin{array}{ccc}
 \begin{array}{c} \text{B}_2 \text{---} \text{B}_1 \\ \diagup \quad \diagdown \\ \text{B}_3 \quad \text{C=O} \\ \diagdown \quad \diagup \\ \text{B}_4 \text{---} \text{B}_5 \end{array} & \xrightarrow{\text{H}_2\text{NOH}} & \begin{array}{c} \text{B}_2 \text{---} \text{B}_1 \\ \diagup \quad \diagdown \\ \text{B}_3 \quad \text{C=N-OH} \\ \diagdown \quad \diagup \\ \text{B}_4 \text{---} \text{B}_5 \end{array} \\
 \text{(W 2)} & & \text{(W 3)}
 \end{array}$$



一般構造（W3）の本発明の化合物は、構造（W2）の出発材料から、文献から既知の方法と同様に調製することができる。B₁～B₅ラジカルは、それぞれ上で定義される通りである。構造（W2）の出発化合物の調製は、上述されている。例としては、2，6-ジクロロ-4-[1，2，2，2-テトラフルオロ-1-（トリフルオロメチル）エチル]ベンズアルデヒド、2，6-ジメチル-4-[1，2，2，2-テトラフルオロ-1-（トリフルオロメチル）エチル]ベンズアルデヒド、2-エチル-6-メチル-5-[1，2，2，2-テトラフルオロ-1-（トリフルオロメチル）エチル]ベンズアルデヒド、2-クロロ-4-[1，2，2，2-テトラフルオロ-1-（トリフルオロメチル）エチル]-6-（トリフルオロメチル）ベンズアルデヒド、2-メチル-4-[1，2，2，2-テトラフルオロ-1-（トリフルオロメチル）エチル]-6-（トリフルオロメチル）ベンズアルデヒド、2-クロロ-4-[1，2，2，2-テトラフルオロ-1-（ト

リフルオロメチル) エチル] - 6 - (トリフルオロメトキシ) ベンズアルデヒド、2 - メチル - 4 - [1, 2, 2, 2 - テトラフルオロ - 1 - (トリフルオロメチル) エチル] - 6 - (トリフルオロメトキシ) ベンズアルデヒドが挙げられる。それらの調製は上述されている。

【0388】

構造式 (W3) の化合物は新規である。まだ知られていない化合物 (W3) は、アルデヒドからオキシムを調製するための既知のプロセスと同様に調製することができる (H. Metzger in Houben-Weyl, volume X/4, page 55 ff., Georg Thieme Verlag Stuttgart 1968)。構造式 (W3) の化合物は、純粋な立体異性体の形態であってもよいが、立体異性体の混合物の形態であってもよい。

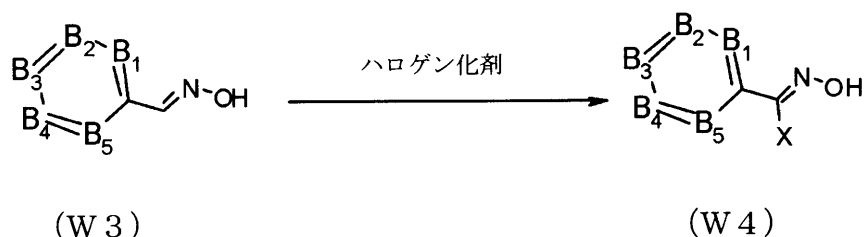
10

【0389】

段階3 ヒドロキサミル (Hydroxamyl) 塩化物

本発明の化合物 (1-T22) の調製プロセスの段階3:

【化63】



20

【0390】

一般構造 (W4) の本発明の化合物は、構造 (W3) のオキシムをハロゲン化剤と反応させることによって調製される。

【0391】

B1~B5ラジカルは、それぞれ上で定義される通りである。Xは塩素、臭素またはヨウ素である。

【0392】

30

構造 (W4) の典型的な化合物は、例えば、2, 6 - ジクロロ - 4 - [1, 2, 2, 2 - テトラフルオロ - 1 - (トリフルオロメチル) エチル] - N - ヒドロキシベンジミドイル (hydroxybenzimidoyl) 塩化物、2, 6 - ジメチル - 4 - [1, 2, 2, 2 - テトラフルオロ - 1 - (トリフルオロメチル) エチル] - N - ヒドロキシベンジミドイル塩化物、2 - エチル - 6 - メチル - 5 - [1, 2, 2, 2 - テトラフルオロ - 1 - (トリフルオロメチル) エチル] - N - ヒドロキシベンジミドイル塩化物、2 - クロロ - 4 - [1, 2, 2, 2 - テトラフルオロ - 1 - (トリフルオロメチル) エチル] - 6 - (トリフルオロメチル) - N - ヒドロキシベンジミドイル塩化物、2 - メチル - 4 - [1, 2, 2, 2 - テトラフルオロ - 1 - (トリフルオロメチル) エチル] - 6 - (トリフルオロメチル) - N - ヒドロキシベンジミドイル塩化物、2 - クロロ - 4 - [1, 2, 2, 2 - テトラフルオロ - 1 - (トリフルオロメチル) エチル] - 6 - (トリフルオロメトキシ) - N - ヒドロキシベンジミドイル塩化物、2 - メチル - 4 - [1, 2, 2, 2 - テトラフルオロ - 1 - (トリフルオロメチル) エチル] - 6 - (トリフルオロメトキシ) - N - ヒドロキシベンジミドイル塩化物、2 - メチル - 4 - [1, 2, 2, 2 - テトラフルオロ - 1 - (トリフルオロメチル) エチル] - 6 - (トリフルオロメトキシ) - N - ヒドロキシベンジミドイル臭化物である。

40

【0393】

好適なハロゲン化化合物は当業者に既知であり、例えば、塩素、臭素、ヨウ素、N - クロロスクシンイミド、N - ブロモスクシンイミド、N - ヨードスクシンイミド、1, 3 - ジクロロ - 5, 5 - ジメチルヒダントイン、1, 3 - ジブロモ - 5, 5 - ジメチルヒダン

50

トイン、ベンジルトリメチルアンモニウムテトラクロロヨウ素酸塩および次亜塩素酸ナトリウムである。塩素化試薬を使用することが好ましい。

【0394】

反応は、好適な溶媒を使用して行うことができる。

【0395】

原理上、本発明によるプロセスを行うために有用な希釈剤または溶媒には、特定の反応条件下で不活性であるすべての有機溶媒が含まれる。例としては、ヒドロハロカーボン（例えば、テトラエチレン、テトラクロロエタン、ジクロロプロパン、塩化メチレン、ジクロロブタン、クロロホルム、四塩化炭素、トリクロロエタン、トリクロロエチレン、ペンタクロロエタン、ジフルオロベンゼン、1, 2-ジクロロエタン、クロロベンゼン、プロモベンゼン、ジクロロベンゼン、クロロトルエン、トリクロロベンゼン等のヒドロクロカーボン）、アルコール（例えば、メタノール、エタノール、イソプロパノール、ブタノール）、エーテル（例えば、エチルプロピルエーテル、メチルtert-ブチルエーテル、n-ブチルエーテル、アニソール、フェネトール、シクロヘキシルメチルエーテル、ジメチルエーテル、ジエチルエーテル、ジプロピルエーテル、ジイソプロピルエーテル、ジ-n-ブチルエーテル、ジイソブチルエーテル、ジイソアミルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジクロロジエチルエーテル、ならびにエチレンオキシドおよび／またはプロピレンオキシドのポリエーテル）、アミン（例えば、トリメチル、トリエチル、トリプロピル、トリブチルアミン、N-メチルモルホリン、ピリジン、およびテトラメチレンジアミン）、ニトロ炭化水素（例えば、ニトロメタン、ニトロエタン、ニトロプロパン、ニトロベンゼン、クロロニトロベンゼン、o-ニトロトルエン；アセトニトリル、プロピオニトリル、ブチロニトリル、イソブチロニトリル、ベンゾニトリル、m-クロロベンゾニトリル等のニトリル）、二酸化テトラヒドロチオフエン、ジメチルスルホキシド、テトラメチレンスルホキシド、ジプロピルスルホキシド、ベンジルメチルスルホキシド、ジイソブチルスルホキシド、ジブチルスルホキシド、ジイソアミルスルホキシド、スルホン（例えば、ジメチル、ジエチル、ジプロピル、ジブチル、ジフェニル、ジヘキシル、メチルエチル、エチルプロピル、エチルイソブチル、およびペンタメチレンスルホン）、脂肪族、シクロ脂肪族、または芳香族炭化水素（例えば、ペンタン、ヘキサン、ヘプタン、オクタン、ノナン、および工業用炭化水素）、ならびに例えば、40℃～250℃の範囲の沸点を有する成分を含む「揮発油」と称されるもの、シメン、70℃～190℃の範囲で沸騰する石油留分、シクロヘキサン、メチルシクロヘキサン、石油エーテル、リグロイン、オクタン、ベンゼン、トルエン、クロロベンゼン、プロモベンゼン、ニトロベンゼン、キシレン、エステル（例えば、メチル、エチル、ブチルおよびイソ酢酸ブチル、ジメチル、ジブチル、ならびにエチレンカーボネート）；アミド（例えば、ヘキサメチレンホスホルアミド、ホルムアミド、N-メチルホルムアミド、N, N-ジメチルホルムアミド、N, N-ジプロピルホルムアミド、N, N-ジブチルホルムアミド、N-メチルピロリジン、N-メチルカプロラクタム、1, 3-ジメチル-3, 4, 5, 6-テトラヒドロ-2 (1H)-ピリミジン、オクチルピロリドン、オクチルカプロラクタム、1, 3-ジメチル-2-イミダゾリンジオン、N-ホルミルピペリジン、N, N'-1, 4-ジホルミルピペラジン）、ならびにケトン（例えば、アセトン、アセトフェノン、メチルエチルケトン、メチルブチルケトン）が挙げられる。

【0396】

使用される好ましい希釈剤は、反応を損なわない任意の溶媒、例えば、水であり得る。有用な例は、ベンゼン、トルエン、キシレンまたはクロロベンゼン等の芳香族炭化水素；ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタンまたは四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素、ジエチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、もしくは1, 2-ジメトキシエタン等の開鎖または環状エーテル；酢酸エチルおよび酢酸ブチル等のエステル；ケトン、例えば、アセトン、メチルイソブチルケトンおよびシクロヘキサノン；ジメチルホルムアミドおよびジメチルアセトアミド等のアミド、N-メチルピロリドン；アセトニトリルまたはプロピオニトリル等のニトリル；1, 3-ジメチル-2-イミダゾリジノ

10

20

30

40

50

ン等のならびに他の不活性溶媒であり、溶媒は、単体でまたは２つ以上の組み合わせで使用され得る。

【０３９７】

反応は、幅広い温度範囲内で実行することができる。通常は、 $-78^{\circ}\text{C} \sim 200^{\circ}\text{C}$ の温度範囲内で、好ましくは $-10 \sim 150^{\circ}\text{C}$ の温度で行われる。反応は、昇圧または減圧下で実行することができる。しかし標準圧力下で行われることが好ましい。反応時間は、 $0.1 \sim 72$ 時間であり、好ましくは $1 \sim 24$ 時間である。

【０３９８】

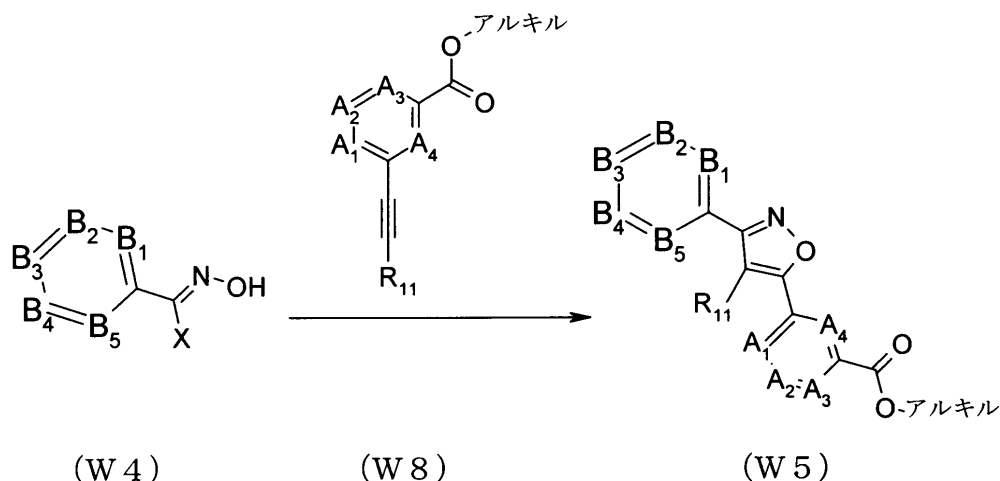
反応を実施するために、溶媒、例えば、ジメチルホルムアミド（DMF）中、構造（W 3）の化合物 1 モル当たり $1 \sim 3$ モル、好ましくは $1 \sim 1.5$ モルのハロゲン化剤が使用される。

【０３９９】

段階 4 閉環

本発明の化合物（1-T 2 2）の調製プロセスの段階 4：

【化 6 4】



一般構造（W 5）の本発明の化合物は、構造（W 4）のヒドロキサミル塩化物を構造（W 8）のアセチレンと反応させることによって調製される。

【０４００】

$A_1 \sim A_4$ 、 $B_1 \sim B_5$ 、 R^{11} およびアルキルラジカルは、それぞれ上で定義される通りである。X は塩素、臭素、ヨウ素等のハロゲンである。

【０４０１】

構造（W 4）の化合物の調製は上述されている。構造（W 4）の典型的な化合物は、例えば、2, 6-ジクロロ-4-[1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]-N-ヒドロキシベンジミドイル塩化物、2, 6-ジメチル-4-[1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]-N-ヒドロキシベンジミドイル塩化物、2-エチル-6-メチル-5-[1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]-N-ヒドロキシベンジミドイル塩化物、2-クロロ-4-[1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]-6-(トリフルオロメチル)-N-ヒドロキシベンジミドイル塩化物、2-メチル-4-[1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]-6-(トリフルオロメチル)-N-ヒドロキシベンジミドイル塩化物、2-クロロ-4-[1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]-6-(トリフルオロメトキシ)-N-ヒドロキシベンジミドイル塩化物、2-メチル-4-[1, 2, 2, 2-テトラ

フルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]-6-(トリフルオロメチル)-N-ヒドロキシベンジミドイル臭化物である。

【0402】

構造(W8)の化合物は既知であるか(国際公開第2012107434号、103頁)、または文献から既知の方法で調製することができる(Chinchilla, Rafael; Najera, Carmen, Chemical Society Reviews (2011), 40(10), 5084-5121, Chinchilla, Rafael; Najera, Carmen, Chemical Reviews (Washington, DC, United States) (2007), 107(3), 874-922)。構造(W8)の典型的な化合物は、例えば、メチル2-クロロ-5-エチニル安息香酸、エチル2-ブロモ-5-エチニル安息香酸、メチル2-クロロ-5-エチニル-3-フルオロ安息香酸、エチル2-クロロ-5-エチニルニコチン酸、エチル5-エチニル-2-メチルニコチン酸である。

10

【0403】

反応は、好適な溶媒を使用して行うことができる。

【0404】

原理上、本発明によるプロセスを行うために有用な希釈剤または溶媒には、特定の反応条件下で不活性であるすべての有機溶媒が含まれる。例としては、ヒドロハロカーボン(例えば、テトラエチレン、テトラクロロエタン、ジクロロプロパン、塩化メチレン、ジクロロブタン、クロロホルム、四塩化炭素、トリクロロエタン、トリクロロエチレン、ペンタクロロエタン、ジフルオロベンゼン、1,2-ジクロロエタン、クロロベンゼン、ブロモベンゼン、ジクロロベンゼン、クロロトルエン、トリクロロベンゼン等のヒドロクロカーボン)、アルコール(例えば、メタノール、エタノール、イソプロパノール、ブタノール)、エーテル(例えば、エチルプロピルエーテル、メチルtert-ブチルエーテル、n-ブチルエーテル、アニソール、フェネトール、シクロヘキシルメチルエーテル、ジメチルエーテル、ジエチルエーテル、ジプロピルエーテル、ジイソプロピルエーテル、ジ-n-ブチルエーテル、ジイソブチルエーテル、ジイソアミルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジクロロジエチルエーテル、ならびにエチレンオキシドおよび/またはプロピレンオキシドのポリエーテル)、アミン(例えば、トリメチル、トリエチル、トリプロピル、トリブチルアミン、N-メチルモルホリン、ピリジンおよびテトラメチレンジアミン)、ニトロ炭化水素(例えば、ニトロメタン、ニトロエタン、ニトロプロパン、ニトロベンゼン、クロロニトロベンゼン、o-ニトロトルエン;アセトニトリル、プロピオニトリル、ブチロニトリル、イソブチロニトリル、ベンゾニトリル、m-クロロベンゾニトリル等のニトリル)、二酸化テトラヒドロチオフェン、ジメチルスルホキシド、テトラメチレンスルホキシド、ジプロピルスルホキシド、ベンジルメチルスルホキシド、ジイソブチルスルホキシド、ジブチルスルホキシド、ジイソアミルスルホキシド、スルホン(例えば、ジメチル、ジエチル、ジプロピル、ジブチル、ジフェニル、ジヘキシル、メチルエチル、エチルプロピル、エチルイソブチルおよびペンタメチレンスルホン)、脂肪族、シクロ脂肪族、または芳香族炭化水素(例えば、ペンタン、ヘキサン、ヘプタン、オクタン、ノナンおよび工業用炭化水素)、ならびに、例えば、40℃~250℃の範囲の沸点を有する成分を含む「揮発油」と称されるもの、シメン、70℃~190℃の範囲で沸騰する石油留分、シクロヘキサン、メチルシクロヘキサン、石油エーテル、リグロイン、オクタン、ベンゼン、トルエン、クロロベンゼン、ブロモベンゼン、ニトロベンゼン、キシレン、エステル(例えば、メチル、エチル、ブチルおよびイソ酢酸ブチル、ジメチル、ジブチル、ならびにエチレンカーボネート);アミド(例えば、ヘキサメチレンホスホルアミド、ホルムアミド、N-メチルホルムアミド、N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジプロピルホルムアミド、N,N-ジブチルホルムアミド、N-メチルピロリジン、N-メチルカプロラクタム、1,3-ジメチル-3,4,5,6-テトラヒドロ-2(1H)-ピリミジン、オクチルピロリドン、オクチルカプロラクタム、1,3-ジメチル-2-イミダゾリンジオン、N-ホルミルピペ

20

30

40

50

リジン、N, N' - 1, 4 - ジホルミルピペラジン)、ならびにケトン (例えば、アセトン、アセトフェノン、メチルエチルケトン、メチルブチルケトン) が挙げられる。

【0405】

使用される好ましい希釈剤は、反応を損なわない任意の溶媒、例えば、水であり得る。有用な例は、ベンゼン、トルエン、キシレンまたはクロロベンゼン等の芳香族炭化水素；ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2 - ジクロロエタンまたは四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素、ジエチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、もしくは1, 2 - ジメトキシエタン等の開鎖または環状エーテル；酢酸エチルおよび酢酸ブチル等のエステル；ケトン、例えば、アセトン、メチルイソブチルケトンおよびシクロヘキサノン；ジメチルホルムアミドおよびジメチルアセトアミド等のアミド、N - メチルピロリドン；アセトニトリルまたはプロピオニトリル等のニトリル；1, 3 - ジメチル - 2 - イミダゾリジノン等のならびに他の不活性溶媒であり、溶媒は、単体でまたは2つ以上の組み合わせで使用され得る。

10

【0406】

構造 (W4) の化合物と構造 (W8) のアセチレンとの反応において、塩基を追加することが可能である。例としては、アルカリ土類金属またはアルカリ金属化合物 (例えば、リチウム、ナトリウム、カリウム、マグネシウム、カルシウムおよびバリウムの水酸化物、水素化物、酸化物および炭酸塩)、アミジン塩基またはグアニジン塩基 (例えば、7 - メチル - 1, 5, 7 - トリアザビシクロ [4. 4. 0] デカ - 5 - エン (MTBD)；ジアザビシクロ [4. 3. 0] ノネン (DBN)、ジアザビシクロ [2. 2. 2] オクタン (DABCO)、1, 8 - ジアザビシクロ [5. 4. 0] ウンデセン (DBU)、シクロヘキシルテトラブチルグアニジン (CyTBG)、シクロヘキシルテトラメチルグアニジン (CyTMG)、N, N, N, N - テトラメチル - 1, 8 - ナフタレンジアミン、ペンタメチルピペリジン)、ならびにアミン、特に三級アミン (例えば、トリエチルアミン、トリメチルアミン、トリベンジルアミン、トリイソプロピルアミン、トリブチルアミン、トリシクロヘキシルアミン、トリアミルアミン、トリヘキシルアミン、N, N - ジメチルアニリン、N, N - ジメチルトルイジン、N, N - ジメチル - p - アミノピリジン、N - メチルピロリジン、N - メチルピペリジン、N - メチルイミダゾール、N - メチルピラゾール、N - メチルモルホリン、N - メチルヘキサメチレンジアミン、ピリジン、4 - ピロリジノピリジン、4 - ジメチルアミノピリジン、キノリン、 α - ピコリン、 β - ピコリン、イソキノリン、ピリミジン、アクリジン、N, N, N', N' - テトラメチレンジアミン、N, N, N', N' - テトラエチレンジアミン、キノキサリン、N - プロピルジイソプロピルアミン、N - エチルジイソプロピルアミン、N, N' - ジメチルシクロヘキシルアミン、2, 6 - ールチジン、2, 4 - ールチジン、またはトリエチレンジアミン) が挙げられる。

20

30

【0407】

使用される好ましい塩基性反応補助剤は、トリエチルアミン、エチルジイソプロピルアミン、トリ - n - ブチルアミン、ピリジンおよび4 - ジメチルアミノピリジン等の有機塩基であってもよく、加えて、例えば、以下の塩基を使用することが可能である：アルカリ金属水酸化物、例えば、水酸化ナトリウムおよび水酸化カリウム；炭酸水素ナトリウムおよび炭酸カリウム等の炭酸塩；リン酸水素二カリウムおよびリン酸三ナトリウム等のリン酸塩。

40

【0408】

反応は、幅広い温度範囲内で実行することができる。通常は、 -78°C ~ 200°C の温度範囲内で、好ましくは -10 ~ 150°C の温度で行われる。反応は、昇圧または減圧下で実行することができる。しかし標準圧力下で行われることが好ましい。反応時間は、0.1 ~ 72時間であり、好ましくは1 ~ 24時間である。

【0409】

反応を行うために、例えば、構造 (W4) の化合物1モル当たり1 ~ 2モル当量の構造 (W8) の化合物および最大でも1モル当量を若干超える塩基を、溶媒、例えば、ジメチ

50

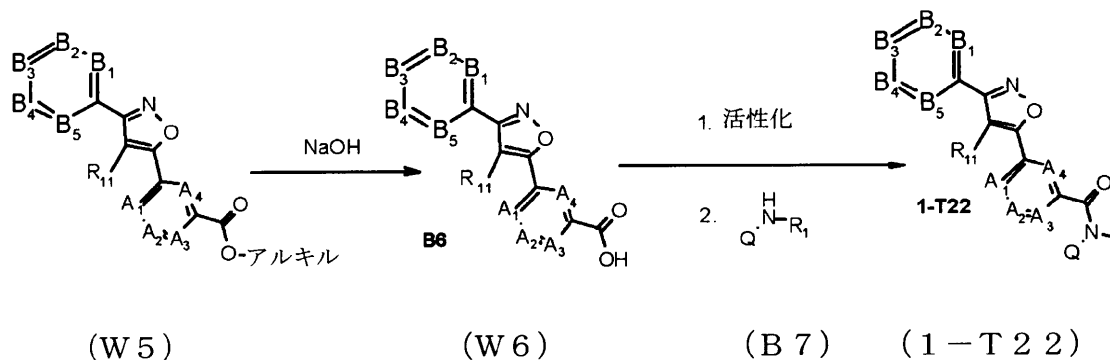
ルホルムアミド (DMF) 中で反応させる。

【0410】

構造 (W5) の化合物の調製のための段階3および4は、個別のステップで、またはワッポット反応で行うことができる。

段階5、6 加水分解、アミド化

【化65】



10

【0411】

一般構造 (I-T22) の本発明の化合物は、出発材料 (W6) および (W9) (国際公開第2010051926号、国際公開第2010133312号) から、文献から既知のペプチドカップリング方法と同様に調製することができる。一般構造 (W6) の化合物は、一般構造 (W5) (国際公開第2010051926号、国際公開第2010133312号) の化合物からエステル加水分解によって、文献から既知のプロセスと同様に調製することができる。A₁~A₄、B₁~B₅、アルキル、Q、R¹およびR¹¹ラジカルは、それぞれ上で定義される通りである。

20

【0412】

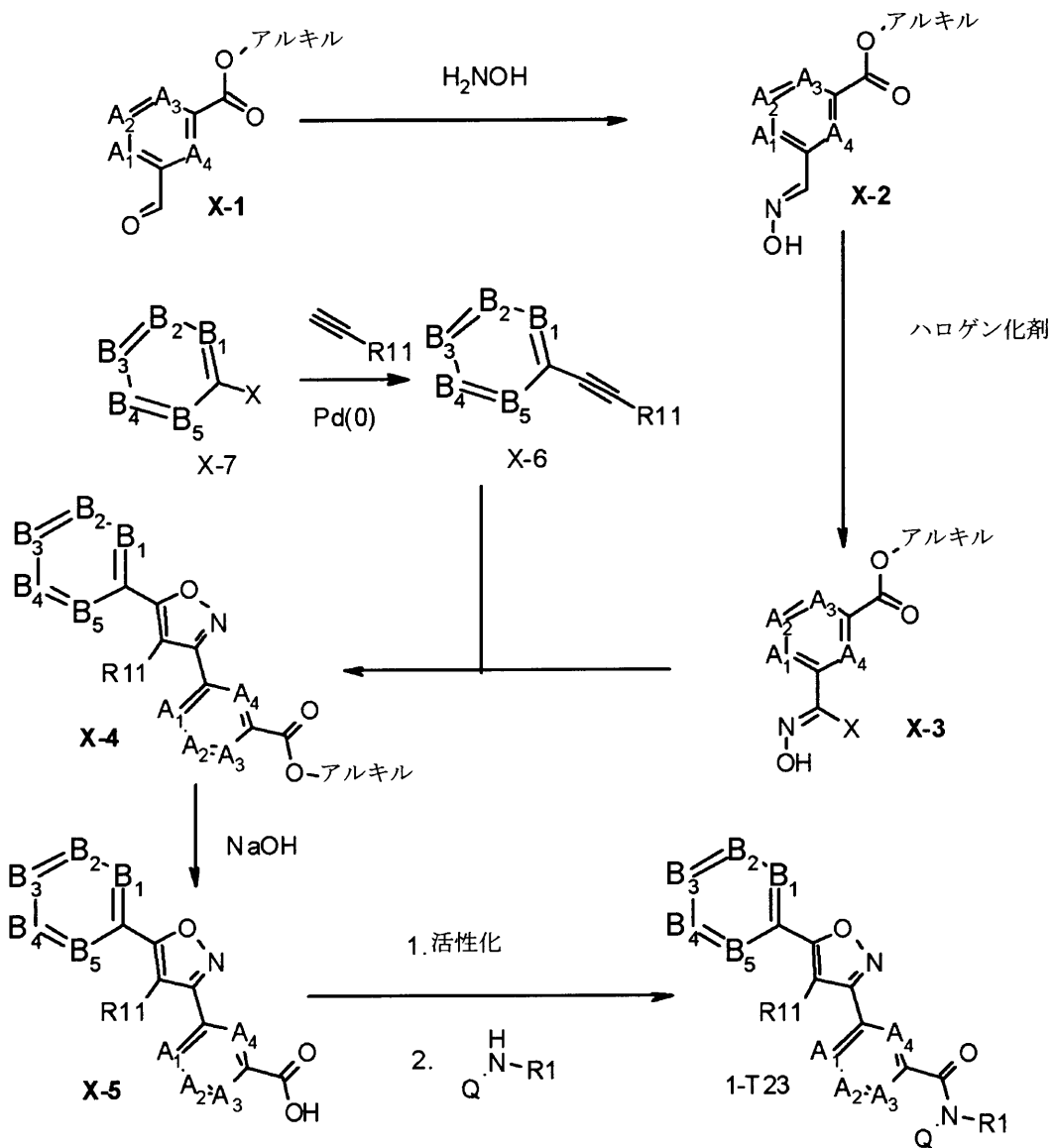
プロセス I-T23

構造 (I-T23) の化合物は、反応スキーム8で規定されるプロセスによって調製することができる。

反応スキーム8：

30

【化 6 6】



【0413】

$\text{A}_1 \sim \text{A}_4$ 、 $\text{B}_1 \sim \text{B}_5$ 、アルキル、Q、 R^1 および R^{11} ラジカルは、それぞれ上で定義される通りである。Xは、例えば、Cl、Br、Iである。

【0414】

段階1 オキシム

本発明の化合物（I-T23）の調製プロセスの段階1：

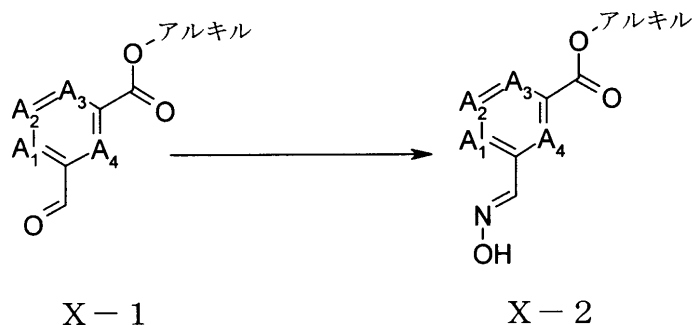
10

20

30

40

【化 6 7】



10

【0415】

一般構造 (X-2) の本発明の化合物は、構造 (X-1) の出発材料から、文献から既知の方法と同様に調製することができる。A¹ ~ A⁴ およびアルキルラジカルは、それぞれ上で定義される通りである。構造 (X-1) の出発化合物は既知であるか、または既知の方法で調製することができる。例としては、3-カルボメトキシベンズアルデヒド、3-カルボメトキシ-4-クロロベンズアルデヒド、3-カルボメトキシ-4-ブロモベンズアルデヒド、3-カルボメトキシ-4-フルオロベンズアルデヒド、3-カルボメトキシ-4-クロロ-5-フルオロベンズアルデヒド、および対応するエチルエステルが挙げられる。これらは、例えば、国際公開第2010/011584号、19~20頁；Journal of Organic Chemistry, 76 (2011)、1062~1071頁；国際公開第2012/114268号、137頁；Journal of the American Chemical Society, 108 (1986)、452~461頁に記載される方法によって調製することができる。

20

【0416】

まだ知られていない化合物 (X-2) は、アルデヒドからオキシムを調製するための既知のプロセスと同様に調製することができる (H. Metzger in Houben-Weyl, volume X/4, p. 55 ff., Georg Thieme Verlag Stuttgart 1968)。構造式 (X-2) の化合物は、純粋な立体異性体の形態であってもよいが、立体異性体の混合物の形態であってもよい。

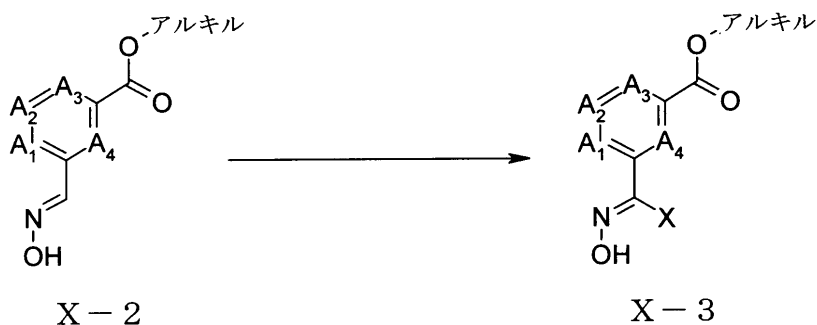
30

【0417】

段階2 ヒドロキサミル塩化物

本発明の化合物 (I-T23) の調製プロセスの段階2：

【化 6 8】



40

【0418】

一般構造 (X-3) の本発明の化合物は、構造 (X-2) のオキシムをハロゲン化剤と反応させることによって調製される。

50

【0419】

A₁～A₄ およびアルキルラジカルは、それぞれ上で定義される通りである。

【0420】

構造(X-3)の典型的な化合物は、例えば、カルボメトキシ-4-クロロ-N-ヒドロキシベンジミドイル塩化物、3-カルボメトキシ-4-フルオロ-N-ヒドロキシベンジミドイル塩化物、3-カルボメトキシ-4-クロロ-5-フルオロ-N-ヒドロキシベンジミドイル塩化物、3-カルボメトキシ-4-ブromo-N-ヒドロキシベンジミドイル塩化物である。

【0421】

好適なハロゲン化合物は当業者に既知であり、例えば、塩素、臭素、ヨウ素、N-クロロスクシンイミド、N-ブロモスクシンイミド、N-ヨードスクシンイミド、1, 3-ジクロロ-5, 5-ジメチルヒダントイン、1, 3-ジブromo-5, 5-ジメチルヒダントイン、ベンジルトリメチルアンモニウムテトラクロロヨウ素酸塩および次亜塩素酸ナトリウムである。塩素化試薬を使用することが好ましい。

【0422】

原理上、本発明によるプロセスを行うために有用な希釈剤または溶媒には、特定の反応条件下で不活性であるすべての有機溶媒が含まれる。例としては、ヒドロハロカーボン（例えば、テトラエチレン、テトラクロロエタン、ジクロロプロパン、塩化メチレン、ジクロロブタン、クロロホルム、四塩化炭素、トリクロロエタン、トリクロロエチレン、ペンタクロロエタン、ジフルオロベンゼン、1, 2-ジクロロエタン、クロロベンゼン、ブromoベンゼン、ジクロロベンゼン、クロロトルエン、トリクロロベンゼン等のヒドロクロカーボン）、アルコール（例えば、メタノール、エタノール、イソプロパノール、ブタノール）、エーテル（例えば、エチルプロピルエーテル、メチルtert-ブチルエーテル、n-ブチルエーテル、アニソール、フェネトール、シクロヘキシルメチルエーテル、ジメチルエーテル、ジエチルエーテル、ジプロピルエーテル、ジイソプロピルエーテル、ジ-n-ブチルエーテル、ジイソブチルエーテル、ジイソアミルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジクロロジエチルエーテル、ならびにエチレンオキシドおよび／またはプロピレンオキシドのポリエーテル）、アミン（例えば、トリメチル、トリエチル、トリプロピル、トリブチルアミン、N-メチルモルホリン、ピリジンおよびテトラメチレンジアミン）、ニトロ炭化水素（例えば、ニトロメタン、ニトロエタン、ニトロプロパン、ニトロベンゼン、クロロニトロベンゼン、o-ニトロトルエン；アセトニトリル、プロピオニトリル、ブチロニトリル、イソブチロニトリル、ベンゾニトリル、m-クロロベンゾニトリル等のニトリル）、二酸化テトラヒドロチオフェン、ジメチルスルホキシド、テトラメチレンスルホキシド、ジプロピルスルホキシド、ベンジルメチルスルホキシド、ジイソブチルスルホキシド、ジブチルスルホキシド、ジイソアミルスルホキシド、スルホン（例えば、ジメチル、ジエチル、ジプロピル、ジブチル、ジフェニル、ジヘキシル、メチルエチル、エチルプロピル、エチルイソブチルおよびペンタメチレンスルホン）、脂肪族、シクロ脂肪族、または芳香族炭化水素（例えば、ペンタン、ヘキサン、ヘプタン、オクタン、ノナンおよび工業用炭化水素）、ならびに例えば、40℃～250℃の範囲の沸点を有する成分を含む「揮発油」と称されるもの、シメン、70℃～190℃の範囲で沸騰する石油留分、シクロヘキサン、メチルシクロヘキサン、石油エーテル、リグロイン、オクタン、ベンゼン、トルエン、クロロベンゼン、ブromoベンゼン、ニトロベンゼン、キシレン、エステル（例えば、メチル、エチル、ブチルおよびイソ酢酸ブチル、ジメチル、ジブチル、ならびにエチレンカーボネート）；アミド（例えば、ヘキサメチレンホスホルアミド、ホルムアミド、N-メチルホルムアミド、N, N-ジメチルホルムアミド、N, N-ジプロピルホルムアミド、N, N-ジブチルホルムアミド、N-メチルピロリジン、N-メチルカプロラクタム、1, 3-ジメチル-3, 4, 5, 6-テトラヒドロ-2(1H)-ピリミジン、オクチルピロリドン、オクチルカプロラクタム、1, 3-ジメチル-2-イミダゾリンジオン、N-ホルミルピペリジン、N, N'-1, 4-ジホルミルピペラジン）、ならびにケトン（例えば、アセトン

10

20

30

40

50

、アセトフェノン、メチルエチルケトン、メチルブチルケトン）が挙げられる。

【0423】

使用される好ましい希釈剤は、反応を損なわない任意の溶媒、例えば、水であり得る。有用な例は、ベンゼン、トルエン、キシレンまたはクロロベンゼン等の芳香族炭化水素；ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタンまたは四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素、ジエチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、もしくは1, 2-ジメトキシエタン等の開鎖または環状エーテル；酢酸エチルおよび酢酸ブチル等のエステル；ケトン、例えば、アセトン、メチルイソブチルケトンおよびシクロヘキサノン；ジメチルホルムアミドおよびジメチルアセトアミド等のアミド、N-メチルピロリドン；アセトニトリルまたはプロピオニトリル等のニトリル；1, 3-ジメチル-2-イミダゾリジノ

10

【0424】

反応は、幅広い温度範囲内で実行することができる。通常は、 $-78^{\circ}\text{C} \sim 200^{\circ}\text{C}$ の温度範囲内で、好ましくは $-10 \sim 150^{\circ}\text{C}$ の温度で行われる。反応は、昇圧または減圧下で実行することができる。しかし標準圧力下で行われることが好ましい。反応時間は、0.1～72時間であり、好ましくは1～24時間である。

【0425】

反応を実施するために、溶媒、例えば、ジメチルホルムアミド（DMF）中、構造（X-2）の化合物1モル当たり、1～3モル、好ましくは1～1.5モルのハロゲン化剤が

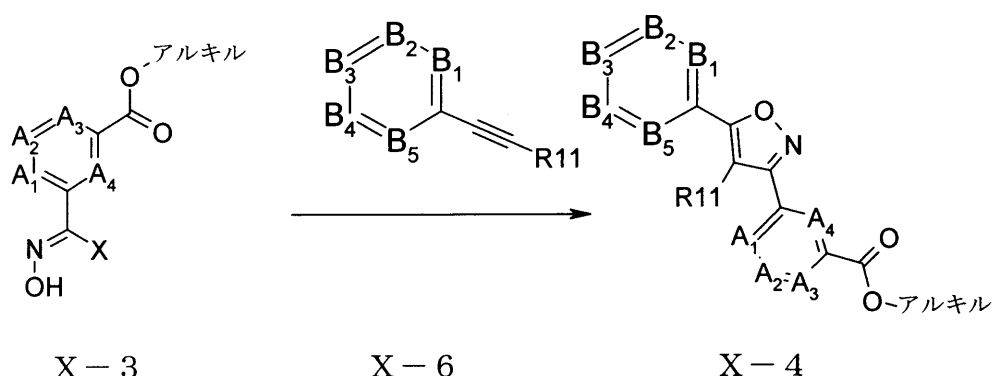
20

【0426】

段階3 閉環

本発明の化合物（1-T23）の調製プロセスの段階3：

【化69】



30

【0427】

一般構造（X-4）の本発明の化合物は、構造（X-3）のヒドロキサミル塩化物を構造（X-6）のアセチレンと反応させることによって調製される。

40

【0428】

$A^1 \sim A^4$ 、 $B^1 \sim B^5$ 、 R^{11} およびアルキルラジカルは、それぞれ上で定義される通りである。

【0429】

構造（X-3）の典型的な化合物は、例えば、カルボメトキシ-4-クロロ-N-ヒドロキシベンジミドイル塩化物、3-カルボメトキシ-4-フルオロ-N-ヒドロキシベンジミドイル塩化物、3-カルボメトキシ-4-クロロ-5-フルオロ-N-ヒドロキシベンジミドイル塩化物、3-カルボメトキシ-4-ブromo-N-ヒドロキシベンジミドイル塩化物である。

50

【0430】

原理上、本発明によるプロセスを行うために有用な希釈剤または溶媒には、特定の反応条件下で不活性であるすべての有機溶媒が含まれる。例としては、ヒドロハロカーボン（例えば、テトラエチレン、テトラクロロエタン、ジクロロプロパン、塩化メチレン、ジクロロブタン、クロロホルム、四塩化炭素、トリクロロエタン、トリクロロエチレン、ペンタクロロエタン、ジフルオロベンゼン、1, 2-ジクロロエタン、クロロベンゼン、ブromoベンゼン、ジクロロベンゼン、クロロトルエン、トリクロロベンゼン等のヒドロクロカーボン）、アルコール（例えば、メタノール、エタノール、イソプロパノール、ブタノール）、エーテル（例えば、エチルプロピルエーテル、メチルtert-ブチルエーテル、n-ブチルエーテル、アニソール、フェネトール、シクロヘキシルメチルエーテル、ジメチルエーテル、ジエチルエーテル、ジプロピルエーテル、ジイソプロピルエーテル、ジ-n-ブチルエーテル、ジイソブチルエーテル、ジイソアミルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジクロロジエチルエーテル、ならびにエチレンオキシドおよび／またはプロピレンオキシドのポリエーテル）、アミン（例えば、トリメチル、トリエチル、トリプロピル、トリブチルアミン、N-メチルモルホリン、ピリジンおよびテトラメチレンジアミン）、ニトロ炭化水素（例えば、ニトロメタン、ニトロエタン、ニトロプロパン、ニトロベンゼン、クロロニトロベンゼン、o-ニトロトルエン；アセトニトリル、プロピオニトリル、ブチロニトリル、イソブチロニトリル、ベンゾニトリル、m-クロロベンゾニトリル等のニトリル）、二酸化テトラヒドロチオフェン、ジメチルスルホキシド、テトラメチレンスルホキシド、ジプロピルスルホキシド、ベンジルメチルスルホキシド、ジイソブチルスルホキシド、ジブチルスルホキシド、ジイソアミルスルホキシド、スルホン（例えば、ジメチル、ジエチル、ジプロピル、ジブチル、ジフェニル、ジヘキシル、メチルエチル、エチルプロピル、エチルイソブチルおよびペンタメチレンスルホン）、脂肪族、シクロ脂肪族、または芳香族炭化水素（例えば、ペンタン、ヘキサン、ヘプタン、オクタン、ノナンおよび工業用炭化水素）、ならびに、例えば、40℃～250℃の範囲の沸点を有する成分を含む「揮発油」と称されるもの、シメン、70℃～190℃の範囲で沸騰する石油留分、シクロヘキサン、メチルシクロヘキサン、石油エーテル、リグロイン、オクタン、ベンゼン、トルエン、クロロベンゼン、ブromoベンゼン、ニトロベンゼン、キシレン、エステル（例えば、メチル、エチル、ブチルおよびイソ酢酸ブチル、ジメチル、ジブチル、ならびにエチレンカーボネート）；アミド（例えば、ヘキサメチレンホスホルアミド、ホルムアミド、N-メチルホルムアミド、N, N-ジメチルホルムアミド、N, N-ジプロピルホルムアミド、N, N-ジブチルホルムアミド、N-メチルピロリジン、N-メチルカプロラクタム、1, 3-ジメチル-3, 4, 5, 6-テトラヒドロ-2 (1H)-ピリミジン、オクチルピロリドン、オクチルカプロラクタム、1, 3-ジメチル-2-イミダゾリンジオン、N-ホルミルピペリジン、N, N'-1, 4-ジホルミルピペラジン）、ならびにケトン（例えば、アセトン、アセトフェノン、メチルエチルケトン、メチルブチルケトン）が挙げられる。

【0431】

使用される好ましい希釈剤は、反応を損なわない任意の溶媒、例えば、水であり得る。有用な例は、ベンゼン、トルエン、キシレンまたはクロロベンゼン等の芳香族炭化水素；ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタンまたは四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素、ジエチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、もしくは1, 2-ジメトキシエタン等の開鎖または環状エーテル；酢酸エチルおよび酢酸ブチル等のエステル；ケトン、例えば、アセトン、メチルイソブチルケトン、およびシクロヘキサノン；ジメチルホルムアミドおよびジメチルアセトアミド等のアミド、N-メチルピロリドン；アセトニトリルまたはプロピオニトリル等のニトリル；1, 3-ジメチル-2-イミダゾリンジノン等のならびに他の不活性溶媒であり、溶媒は、単体でまたは2つ以上の組み合わせで使用され得る。

【0432】

構造(X-3)の化合物と構造(X-6)のアセチレンとの反応において、塩基を追加

10

20

30

40

50

することが可能である。例としては、アルカリ土類金属またはアルカリ金属化合物（例えば、リチウム、ナトリウム、カリウム、マグネシウム、カルシウムおよびバリウムの水酸化物、水素化物、酸化物および炭酸塩）、アミジン塩基またはグアニジン塩基（例えば、7-メチル-1, 5, 7-トリアザビシクロ[4. 4. 0]デカ-5-エン(MTBD)；ジアザビシクロ[4. 3. 0]ノネン(DBN)、ジアザビシクロ[2. 2. 2]オクタン(DABCO)、1, 8-ジアザビシクロ[5. 4. 0]ウンデセン(DBU)、シクロヘキシルテトラブチルグアニジン(CyTBG)、シクロヘキシルテトラメチルグアニジン(CyTMG)、N, N, N, N-テトラメチル-1, 8-ナフトレンジアミン、ペンタメチルピペリジン)、ならびにアミン、特に三級アミン（例えば、トリエチルアミン、トリメチルアミン、トリベンジルアミン、トリイソプロピルアミン、トリブチルアミン、トリシクロヘキシルアミン、トリアミルアミン、トリヘキシルアミン、N, N-ジメチルアニリン、N, N-ジメチルトルイジン、N, N-ジメチル-p-アミノピリジン、N-メチルピロリジン、N-メチルピペリジン、N-メチルイミダゾール、N-メチルピラゾール、N-メチルモルホリン、N-メチルヘキサメチレンジアミン、ピリジン、4-ピロリジノピリジン、4-ジメチルアミノピリジン、キノリン、 α -ピコリン、 β -ピコリン、イソキノリン、ピリミジン、アクリジン、N, N, N', N'-テトラメチレンジアミン、N, N, N', N'-テトラエチレンジアミン、キノキサリン、N-プロピルジイソプロピルアミン、N-エチルジイソプロピルアミン、N, N'-ジメチルシクロヘキシルアミン、2, 6-ルチジン、2, 4-ルチジンまたはトリエチレンジアミン)が挙げられる。

10

20

【0433】

使用される好ましい塩基性反応補助剤は、トリエチルアミン、エチルジイソプロピルアミン、トリ-n-ブチルアミン、ピリジンおよび4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基であってもよく、加えて、例えば、以下の塩基を使用することが可能である：アルカリ金属水酸化物、例えば、水酸化ナトリウムおよび水酸化カリウム；炭酸水素ナトリウムおよび炭酸カリウム等の炭酸塩；リン酸水素二カリウムおよびリン酸三ナトリウム等のリン酸塩。

【0434】

反応は、幅広い温度範囲内で実行することができる。通常は、 -78°C ～ 200°C の温度範囲内で、好ましくは -10 ～ 150°C の温度で行われる。反応は、昇圧または減圧下で実行することができる。しかし標準圧力下で行われることが好ましい。反応時間は、0.1～72時間であり、好ましくは1～24時間である。

30

【0435】

反応を行うために、例えば、構造(X-3)の化合物1モル当たり、1～2モル当量の構造(X-6)の化合物および最大でも1モル当量を若干超える塩基を、溶媒、例えば、ジメチルホルムアミド(DMF)中で反応させる。

【0436】

構造(X-4)の化合物の調製のための段階2および3は、個別のステップで、またはワンポット反応で行うことができる。

【0437】

段階4、5 加水分解、アミド化

本発明の化合物(1-T23)の調製のための最終段階(段階4および5)、カルボン酸エステル(X-4)の加水分解およびカルボン酸X-5のアミド化は、エステル加水分解およびカルボン酸のアミド化のための上述の一般的プロセス(反応スキーム)によって行うことができる。

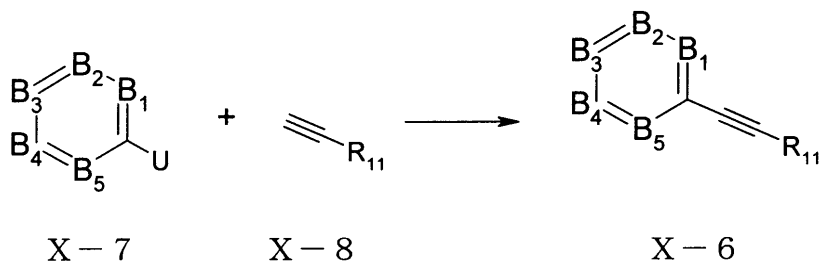
40

【0438】

段階6 アセチレンの調製

段階6 構造(X-6)の出発化合物の調製

【化 7 0】



10

【0 4 3 9】

B₁ ~ B₅、R¹¹ および U ラジカルは、それぞれ上で定義される通りである。U は、例えば、臭素、ヨウ素またはトリフレートである。

【0 4 4 0】

一般構造 (X-6) の本発明の化合物は、構造 (X-7) の出発材料から、パラジウムおよび銅を含む遷移金属触媒による触媒作用によって、文献 (Chinchilla, Rafael et al., Chemical Society Reviews (2011), 40 (10), p. 5084-5121, Chinchilla, Rafael et al., Chemical Reviews (Washington, DC, United States) (2007), 107 (3), p. 874-922) から既知の方法と同様に調製することができる。

20

【0 4 4 1】

構造 (X-7) の出発化合物は既知であるか、または既知の方法で調製することができる。例としては、2-ブロモ-1, 3-ジクロロ-5-[1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]ベンゼン、2-ブロモ-1, 3-ジメチル-5-[1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]ベンゼン、2-ブロモ-1-エチル-3-メチル-5-[1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]ベンゼン、2-ブロモ-1-クロロ-5-[1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]-3-(トリフルオロメチル)ベンゼン、2-ブロモ-1-メチル-5-[1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]-3-(トリフルオロメチル)ベンゼン、2-ブロモ-1-クロロ-5-[1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]-3-(トリフルオロメトキシ)ベンゼン、2-ブロモ-1-メチル-5-[1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]-3-(トリフルオロメトキシ)ベンゼンが挙げられる。これらは、例えば、欧州特許第 1 253 128 号、8 ~ 10 頁に記載される方法で調製することができる。

30

【0 4 4 2】

構造 (X-8) の出発化合物は既知であるか、または既知の方法で調製することができる。R⁶ = H である場合、このプロセスにおいて、R⁶ ではなく、保護基を使用することが可能である。好適な保護基は、例えば、トリメチルシリル、トリエチルシリル、およびジメチルヒドロキシメチルである。導入および脱離のためのさらに好適な保護基は、文献に記載されている [Greene's protective groups in organic synthesis, 4th edition, P. G. M. Wuts, T. W. Greene, John Wiley & Sons, Inc., Hoboken, New Jersey, 2007, pages 927-933 の一覧を参照されたい。]

40

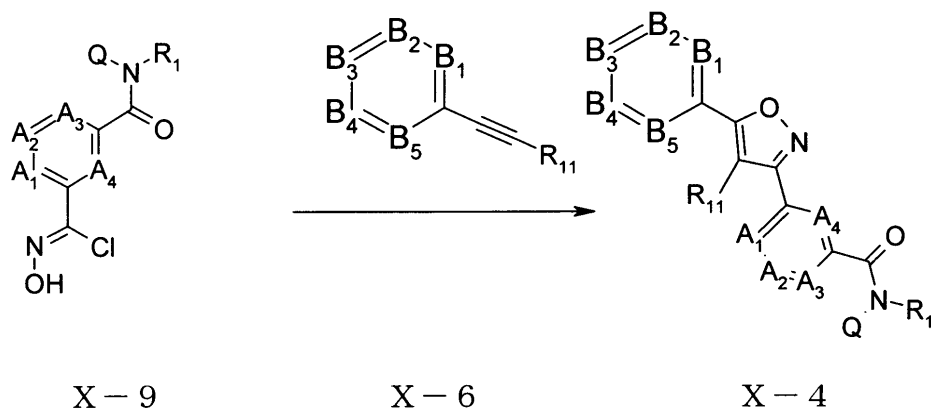
【0 4 4 3】

段階 3 代替方法：アミドとのカップリング

代替として、本発明の化合物 (I-T23) は、一般調製プロセス B (反応スキーム 9) によって調製することができる。

50

反応スキーム 9 :
【化 7 1】



10

【0444】

$A_1 \sim A_4$ 、 $B_1 \sim B_5$ 、 Q 、 R^1 および R^{11} ラジカルは、それぞれ上で定義される通りである。

【0445】

一般構造 (X-4) の本発明の化合物は、構造 (X-9) のヒドロキサミル塩化物を構造 (X-6) のアセチレンと反応させることによって調製される。

20

【0446】

構造 (X-6) の化合物の調製は上述されている。構造 (X-9) の化合物は、構造 (X-3) の化合物の上述の調製と同様に調製される。

【0447】

構造 (X-3) の典型的な化合物は、例えば、4-クロロ-3-(シクロプロピルカルバモイル)-N-ヒドロキシベンジミドイル塩化物、3-(シクロプロピルカルバモイル)-4-フルオロ-N-ヒドロキシベンジミドイル塩化物、4-クロロ-3-(シクロプロピルカルバモイル)-5-フルオロ-N-ヒドロキシベンジミドイル塩化物、4-ブromo-3-(シクロプロピルカルバモイル)-N-ヒドロキシベンジミドイル塩化物である。

30

【0448】

(I-T24)：式 (I-24) の化合物は、例えば、Furukawa, Hiroto et al. *Heterocycles*, 79 (2009), p. 303-309；米国特許第6,545,009号、34頁、実施例111と同様に調製することができる。

【0449】

(I-T25)：式 (I-25) の化合物は、例えば、国際公開第2004/14366号、113頁と同様に調製することができる。

【0450】

(I-T26)：式 (I-26) の化合物は、例えば、Chihiro, Masato et al., *Journal of Medicinal Chemistry*, 38 (1995), p. 353-358と同様に調製することができる。

40

【0451】

(I-T27)：式 (I-27) の化合物は、例えば、米国特許第6,545,009号、31頁、実施例74と同様に調製することができる。

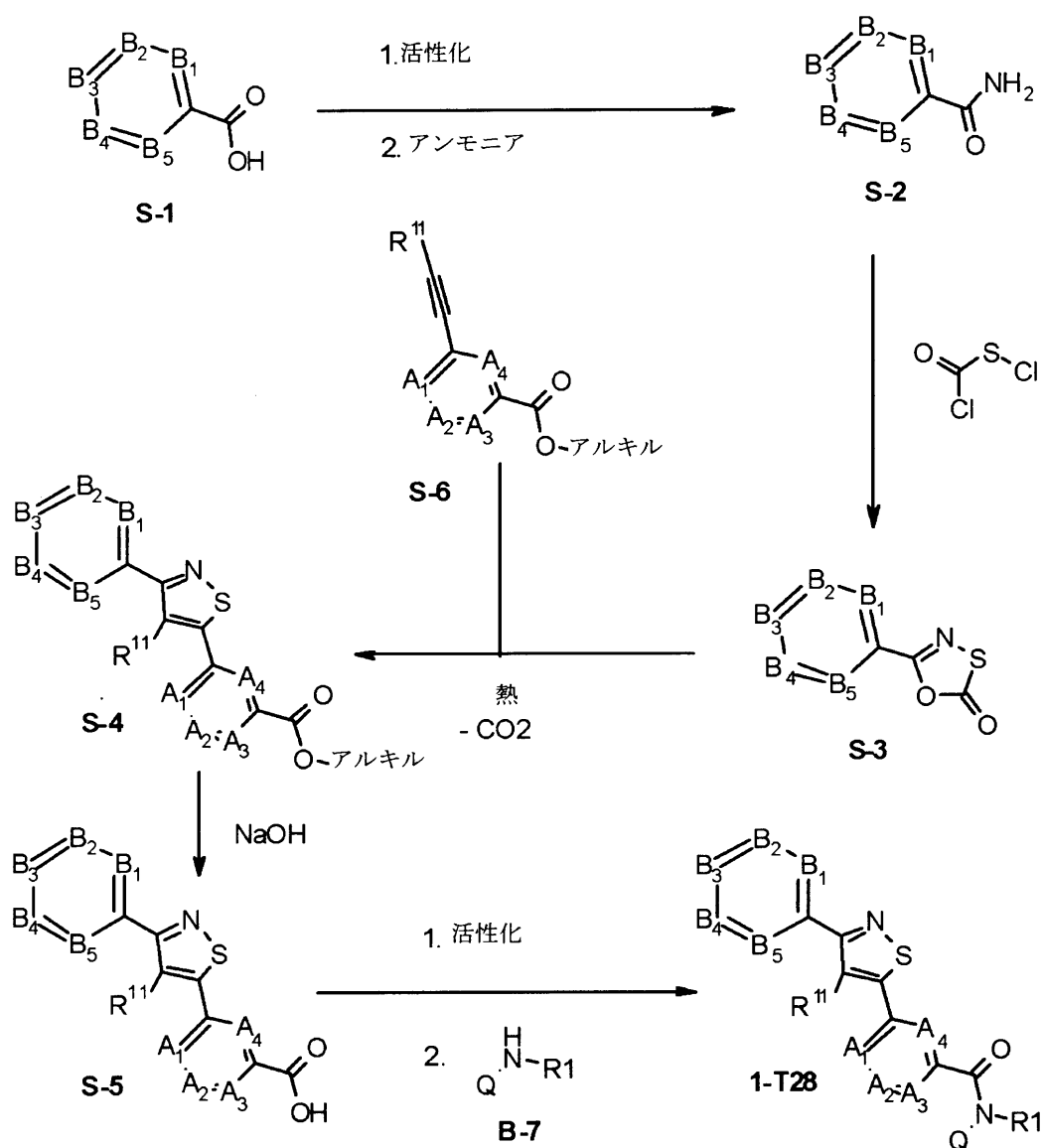
【0452】

構造 (I-T28) の化合物は、反応スキーム10で規定されるプロセスによって調製することができる。

反応スキーム 10

50

【化 7 2】



10

20

30

【0453】

$\text{A}^1 \sim \text{A}^4$ 、 $\text{B}^1 \sim \text{B}^5$ 、アルキル、Q、 R^1 および R^{11} ラジカルは、それぞれ上で定義される通りである。構造(S-1)の出発化合物は既知であるか(例えば、米国特許第5,739,083号、10頁または国際公開第2012/175474号、117~118頁)、または既知の方法で調製することができる。反応は、文献(例えば、Abdelrahman S. Mayhoub et al., Bioorg. Med. Chem. 20(2012) p. 2427-2434または国際公開第2009/023372号)に記載される条件下で行われる。

40

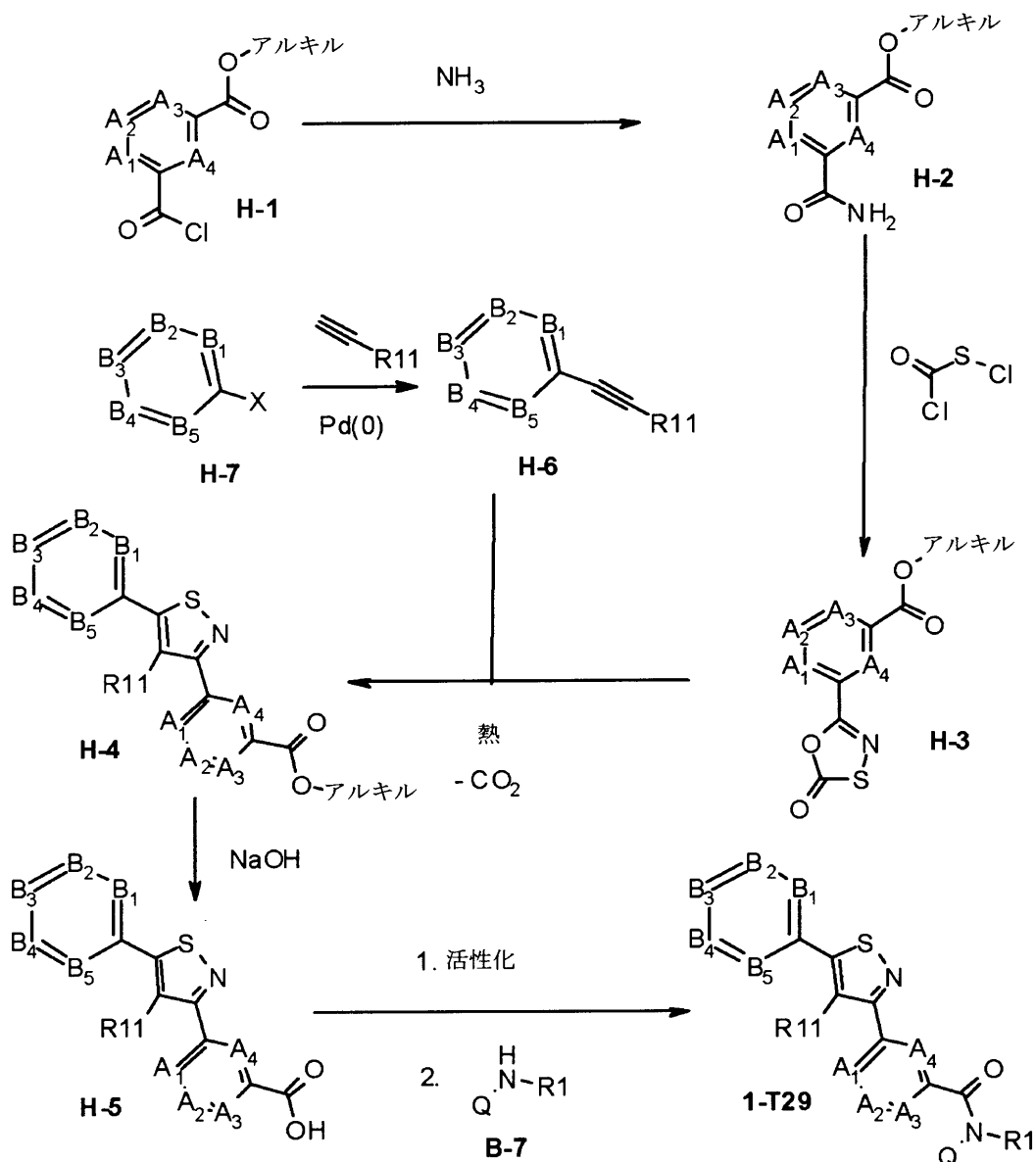
【0454】

プロセスI-T29

構造(I-T29)の化合物は、反応スキーム11で規定されるプロセスによって調製することができる。

反応スキーム3:

【化 7 3】



【0455】

$\text{A}^1 \sim \text{A}^4$ 、 $\text{B}^1 \sim \text{B}^5$ 、アルキル、 Q 、 R^1 および R^{11} ラジカルは、それぞれ上で定義される通りである。構造(H-1)および(H-7)の出発化合物は既知であるか(例えば、米国特許第3,725,417号、7頁もしくは国際公開第2012/175474号、117~118頁)、または既知の方法で調製することができる。反応は、文献(例えば、Abdelrahman S. Mayhoub et al., Bioorg. Med. Chem. 20(2012) p. 2427-2434または国際公開第2009/023372号)に記載される条件下で行われる。

【0456】

プロセスI-T30

(I-T30): 式(I-T30)の化合物は、例えば、国際公開第2011/9484号、104頁;またはGamber, Gabriel G. et al., Bioorganic and Medicinal Chemistry Letters, 21(2011), p. 1447-1451と同様に調製することができる。

【0457】

(I-T31): 式(I-T31)の化合物は、例えば、Bishop, Brian C. et al., Synthesis, (2004), p. 43-52;またはHel

ler, Stephen T. et al., Organic Letters, 8 (2006), p. 2675-2678; または Baddar, F. G. et al. Journal of Heterocyclic Chemistry, 15 (1978), p. 385-393 と同様に調製することができる。

【0458】

(I-T32): 式 (I-T32) の化合物は、例えば、Joo, Jung Min et al., Journal of Organic Chemistry, 75 (2010), p. 4911-4920 と同様に調製することができる。

【0459】

(I-T33): 式 (I-T33) の化合物は、例えば、Joo, Jung Min et al., Journal of Organic Chemistry, 75 (2010), p. 4911-4920; または国際公開第 2004/91610 号、70 頁と同様に調製することができる。

10

【0460】

(I-T34): 式 (I-T34) の化合物は、例えば、Al-Tel, Taleb et al., Journal of Medicinal Chemistry, 54 (2011), p. 8373-8385 と同様に調製することができる。

【0461】

(I-T35): 式 (I-T35) の化合物は、例えば、Yang, Shu-wie et al., Bioorganic and Medicinal Chemistry Letters, 21 (2011), p. 182-185; または Kennedy, Andrew J. et al., Journal of Medicinal Chemistry, 54 (2011), p. 3524-3548 と同様に調製することができる。

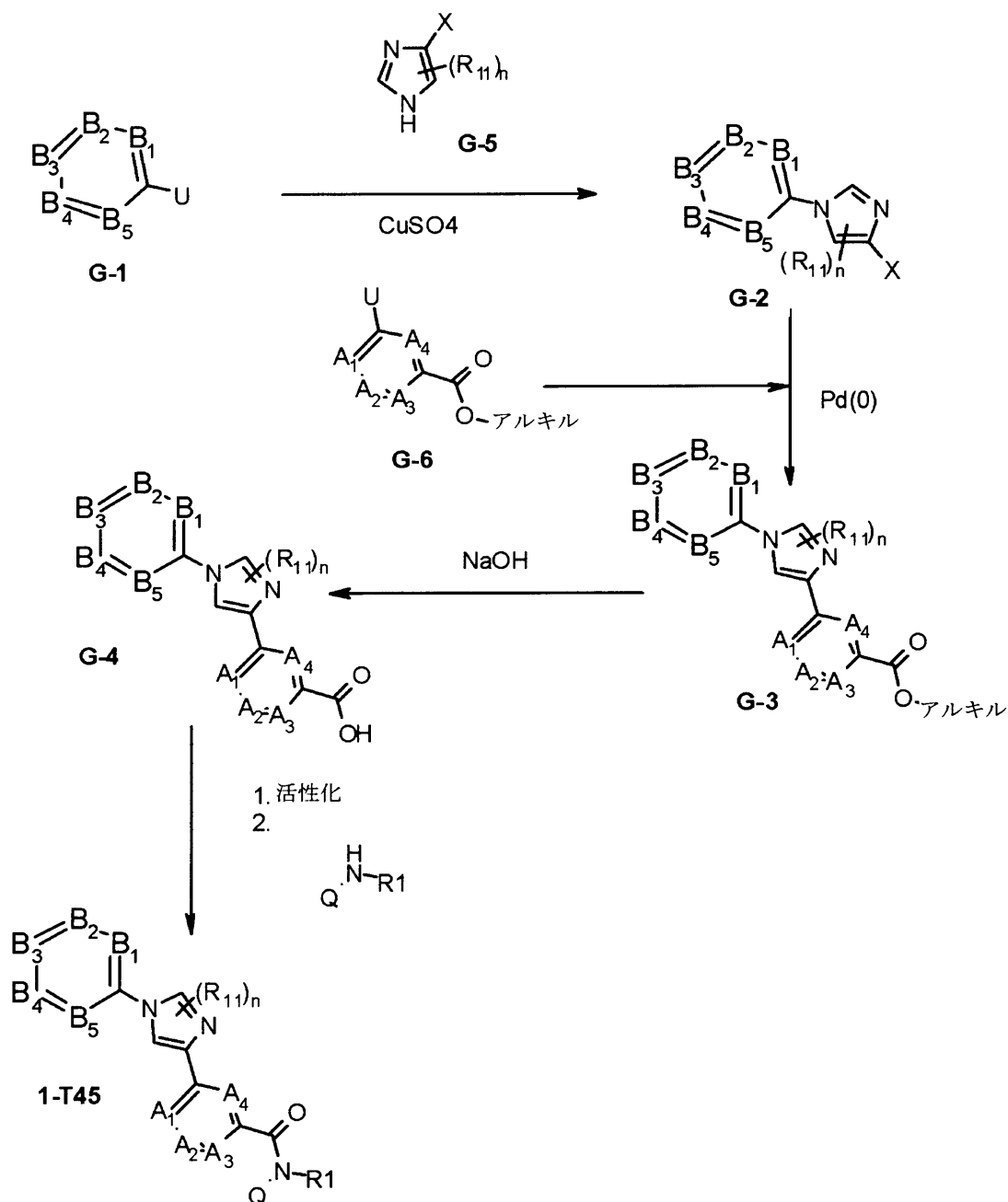
20

【0462】

構造 (I-T45) の化合物は、反応スキーム 12 で規定されるプロセスによって調製することができる。

反応スキーム 12

【化 7 4】



【0463】

$A_1 \sim A_4$ 、 $B_1 \sim B_5$ 、アルキル、Q、 R^1 および R^{11} ラジカルは、それぞれ上で定義される通りである。U はボロン酸、ボロン酸エステルまたはトリフルオロボロネートである。X は臭素、ヨウ素またはトリフレートである。構造 (G-1)、(G-5) および (G-6) の出発化合物は既知であるか、または既知の方法で調製することができる。

【0464】

反応は、文献に記載されるプロセスによって行うことができる (例えば、段階 G1 → G2 米国特許第 2013/0012532 号、29 頁を参照されたい)。

【0465】

プロセス I-T46

構造 (I-T46) の化合物は、反応スキーム 13 で規定されるプロセスによって調製することができる。

反応スキーム 13

10

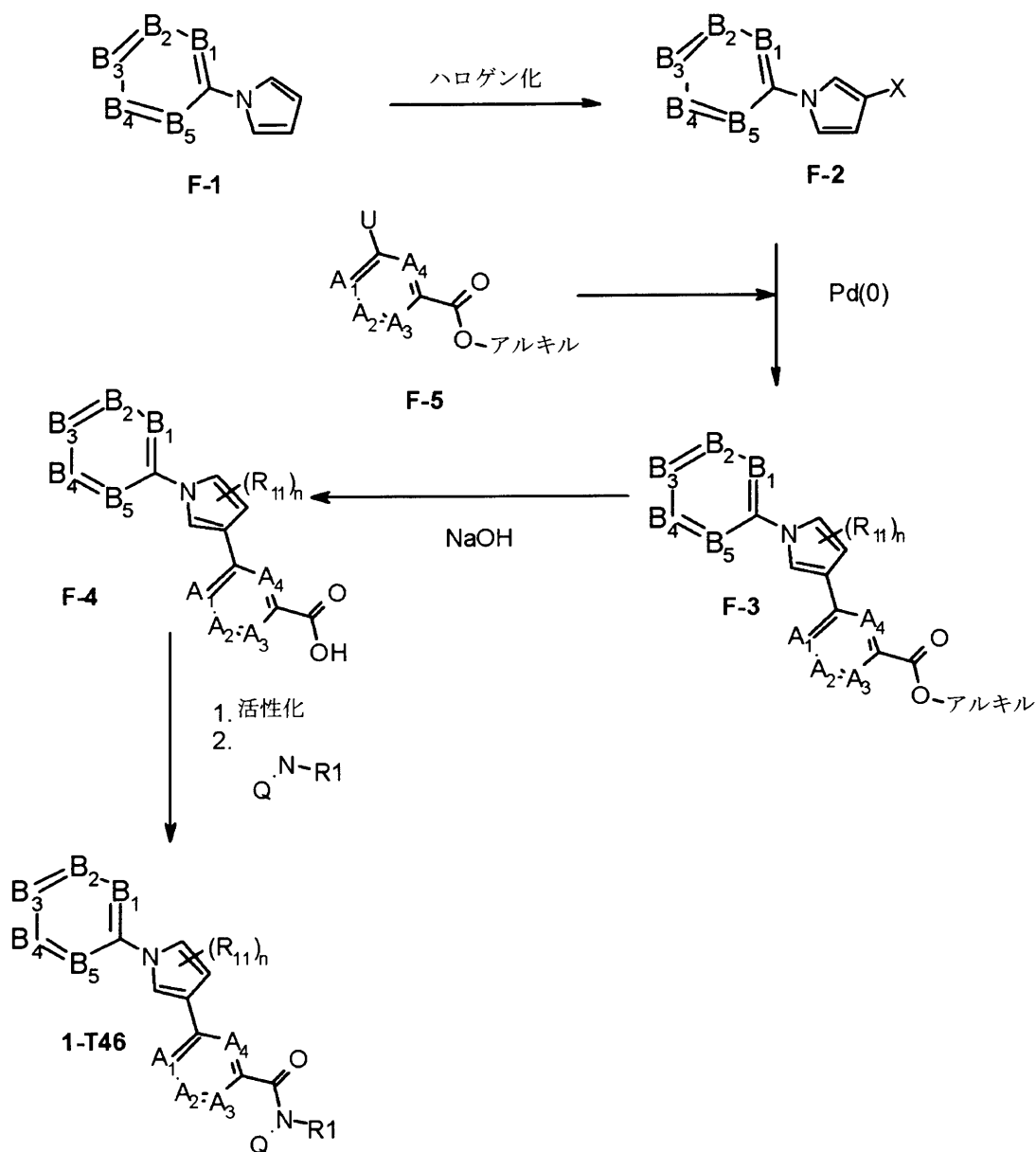
20

30

40

50

【化 7 5】



【0466】

A₁～A₄、B₁～B₅、アルキル、Q、R¹およびR¹¹ラジカルは、それぞれ上で定義される通りである。Uはボロン酸、ボロン酸エステルまたはトリフルオロボロネートである。Xは臭素、ヨウ素またはトリフレートである。構造(F-1)および(F-5)の出発化合物は、既知である(例えば、F-1: Hulcoop, David G. et al., Organic Letters, 9(2007), p. 1761-1764)、または既知の方法で調製することができる。

【0467】

反応は、文献、例えば、米国特許第2009/209476号、18～19頁に記載のプロセスによって行うことができる。

【0468】

プロセスI-T47

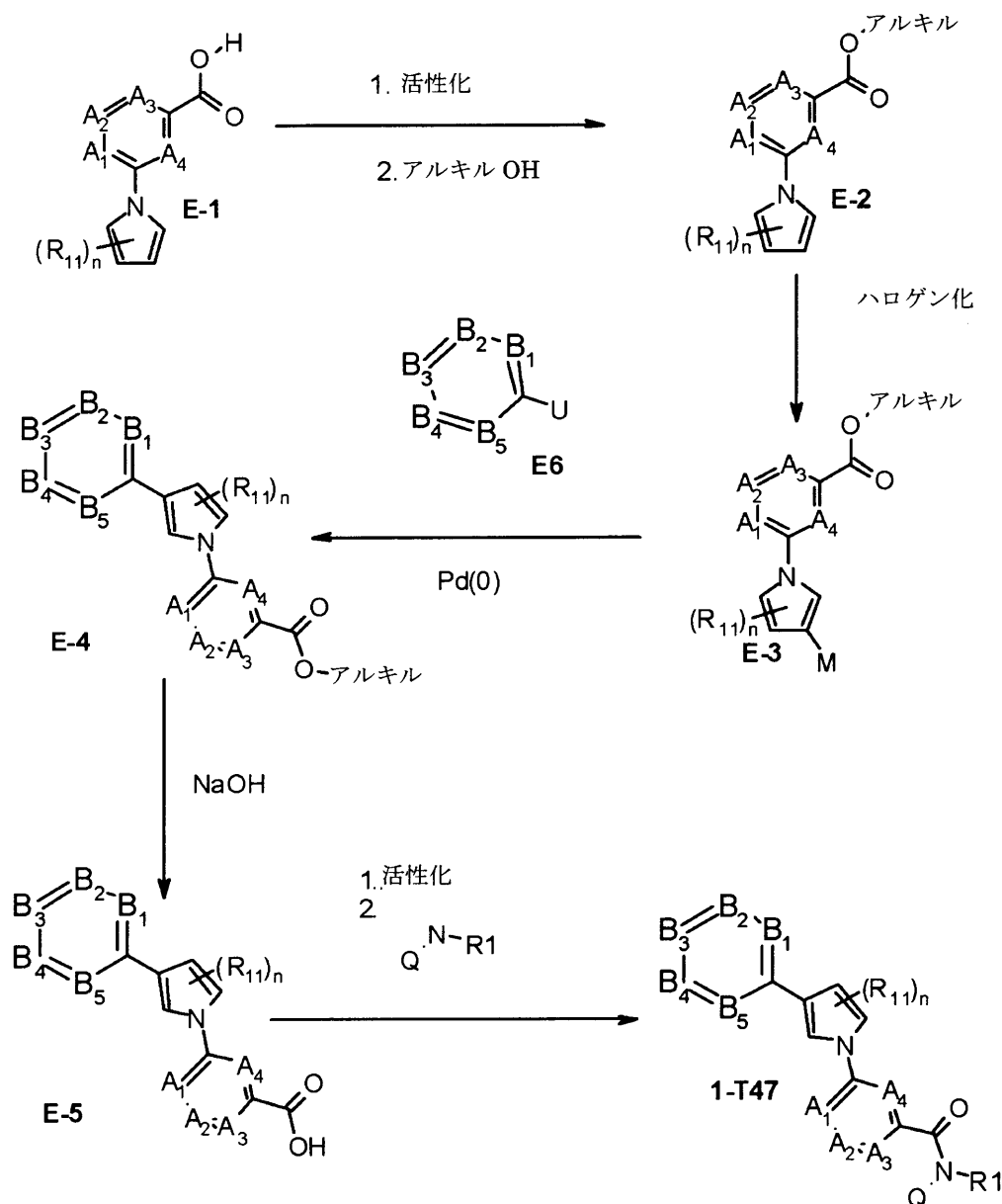
構造(I-T47)の化合物は、反応スキーム14で規定されるプロセスによって調製することができる。

反応スキーム14

40

50

【化 7 6】



10

20

30

【0469】

A₁ ~ A₄、B₁ ~ B₅、アルキル、Q、R¹およびR^{1 1}ラジカルは、それぞれ上で定義される通りである。Uは、Mがボロン酸、ボロン酸エステルまたはトリフルオロボロネートである場合、臭素、ヨウ素またはトリフレートである。Uは、Mが臭素、ヨウ素またはトリフレートである場合、ボロン酸、ボロン酸エステルまたはトリフルオロボロネートである。構造(E-1)および(E-6)の出発化合物は既知であるか(例えば、Li u, Kun et al., Journal of Medicinal Chemistry, 51(2008), p. 7843-7854; もしくは Cornet, Stephanie M. et al., Transactions, (2003), p. 4395-4405)、または既知の方法で調製することができる。

40

【0470】

反応は、文献、例えば、米国特許第2009/209476号、18~19頁に記載のプロセスによって行うことができる。

【0471】

チオアミドを調製するためのプロセス

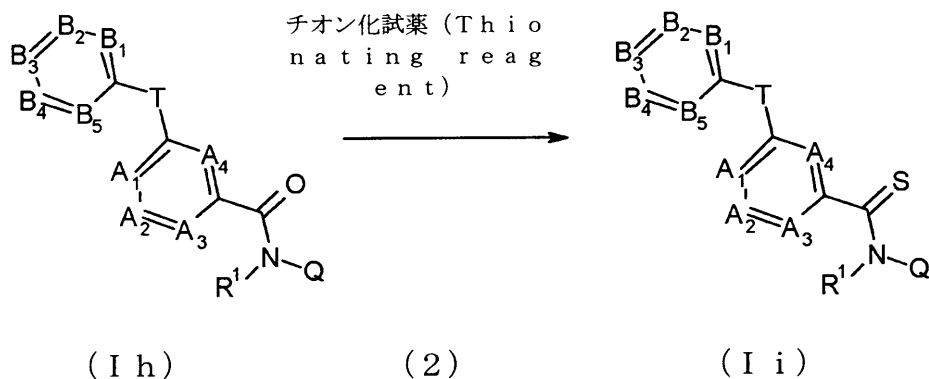
構造(I i)の化合物は、構造(I h)の化合物から硫黄転移試薬との反応により、反

50

応スキーム 15 で規定されるプロセスによって調製することができる。

反応スキーム 15 :

【化 77】



10

【0472】

$A_1 \sim A_4$ 、 $B_1 \sim B_5$ 、アルキル、Q、T および R^1 ラジカルは、それぞれ上で定義される通りである。使用されるチオン化試薬 (2) は、例えば、 P_4S_{10} またはローソン試薬 (2, 4-ビス (4-メトキシフェニル) -1, 3, 2, 4-ジチアジホスフェタン 2, 4-ジスルフィド) であり得る。

20

【0473】

化合物 (Ih) の調製は上述されている。

【0474】

チオン化試薬は市販されているか、または当業者に既知のプロセスで、もしくはこれらのプロセスと同様に調製することができる。

【0475】

反応は、カルボンアミドのチオン化に関する文献 (例えば、国際公開第 2012056372 号、77 頁; 国際公開第 2003066050 号、31 頁) から既知の方法と同様に行われる。

【0476】

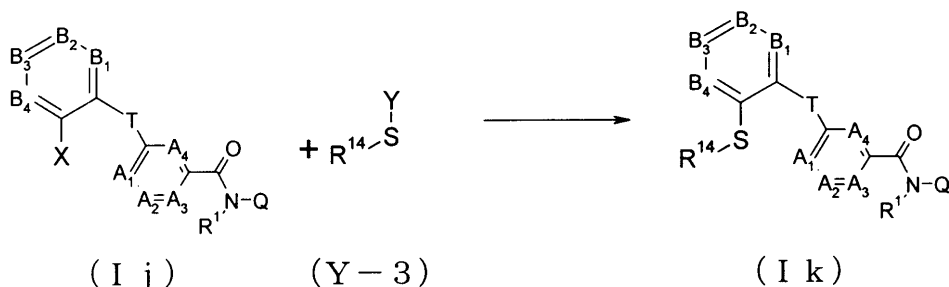
30

(Ik) を調製するためのプロセス

本発明の化合物 (Ik) は、化合物 (Ij) から構造 (Y-3) の硫黄化合物との反応により、反応スキーム 16 で規定されるプロセスによって調製することができる。

反応スキーム 16

【化 78】



40

【0477】

$A_1 \sim A_4$ 、 $B_1 \sim B_4$ 、アルキル、Q、 R^1 、n および R^{11} ラジカルは、それぞれ上で定義される通りである。X は好適な脱離基、例えば、フッ素、塩素、臭素またはヨウ素である。 R^{14} は任意に置換された $C_1 - C_6$ -アルキルである。Y は水素またはアルカリ金属、例えば、ナトリウムまたはリチウムである。

50

【0478】

反応は、アルキルチオラジカルの芳香族系への導入に関する文献〔例えば、Organometallics 1989, 8 (5), 1303-1308; 国際公開第1998056761号、実施例63、97頁〕から既知の方法と同様に行われる。

【0479】

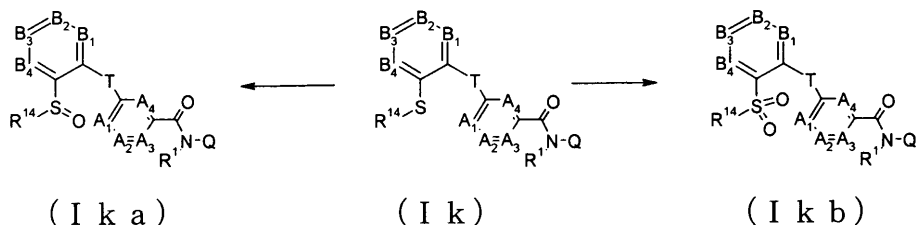
(Ika) および (Ik) を調製するためのプロセス

本発明の化合物 (Ika) および (Ik) は、構造 (Ik) の化合物から酸化試薬との反応により、反応スキーム17で規定されるプロセスによって調製することができる。

反応スキーム17:

【化79】

10



【0480】

20

$A_1 \sim A_4$ 、 $B_1 \sim B_4$ 、アルキル、Q、 R^1 、n および R^{11} ラジカルは、それぞれ上で定義される通りである。 R^{14} は任意に置換された $C_1 - C_6$ - アルキルである。

【0481】

構造 (Ik) の化合物の調製は上述されている。

【0482】

使用される酸化剤は、スルホキシドおよびスルホンの調製に関する文献から当業者に既知の試薬であり得る。これらは市販されているか、または当業者に既知のプロセスで、もしくはこれらのプロセスと同様に調製することができる。例としては、過酸化水素、ペルオキシ酢酸、3-クロロ過安息香酸およびトリフルオロペルオキシ酢酸が挙げられる。

【0483】

30

反応は、スルホキシドおよびスルホンの調製に関する文献から既知の方法と同様に行われる〔スルホキシド誘導体：国際公開第2006/097766号；国際公開第2005/019151号；スルホン誘導体：国際公開第2008/125214号；国際公開第2005/121087号〕。

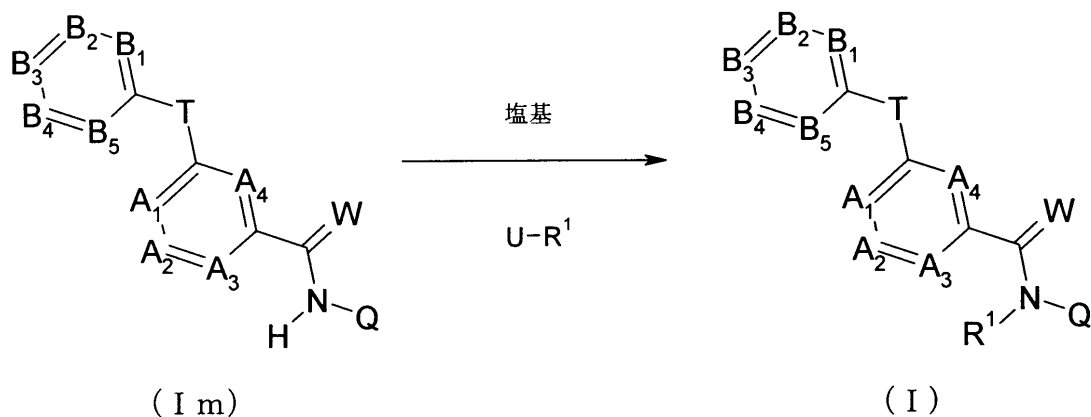
【0484】

N-アルキル化合物を調製するためのプロセス

構造 (I) の化合物は、構造 (Im) の化合物からアルキル化剤との反応により、反応スキーム18で規定されるプロセスによって調製することができる。

反応スキーム18:

【化 8 0】



10

【0485】

A₁ ~ A₄、B₁ ~ B₅、アルキルおよびQラジカルは、それぞれ上で定義される通りである。Uは、例えば、臭素、ヨウ素またはトリフレートである。R¹は、いずれの場合も一級もしくは二級の、任意に置換されたC₁ - C₆ - アルキル、C₃ - C₆ - アルケニル、C₃ - C₆ - アルキニル、C₄ - C₇ - シクロアルキル、C₁ - C₆ - アルキルカルボニル、C₁ - C₆ - アルコキシカルボニル、アリール - (C₁ - C₃) - アルキル、ヘテロアリール - (C₁ - C₃) - アルキルである。Wは酸素である。

20

【0486】

構造U - R¹の化合物は市販されているか、または文献から既知であるか、もしくは文献から既知の方法と同様に調製することができる。例としては、塩化メチル、臭化メチル、ヨウ化メチル、硫酸ジメチル、メチルトリフレート、臭化エチル、ヨウ化エチル、硫酸ジエチルおよびエチルトリフレートが挙げられる。

【0487】

反応のために使用される塩基は市販されている。例としては、アルカリ土類金属およびアルカリ金属化合物（例えば、リチウム、ナトリウム、カリウム、マグネシウム、カルシウムおよびバリウムの水酸化物、水素化物、酸化物および炭酸塩）、例えば、水素化ナトリウム、水酸化ナトリウムおよび水酸化カリウム；炭酸水素ナトリウムおよび炭酸カリウム等の炭酸塩が挙げられる。

30

【0488】

反応は、二級アミドのN - アルキル化に関する文献から既知の方法と同様に行われる（例えば、G. L. Gisele, A. Luttringhaus, Synthesis (1971) p. 266、概要に関しては、B. C. Challis, J. A. Challis in: The Chemistry of Functional Groups, The Chemistry of Amides, S. Patai, J. Zabicky, editors, Interscience Publishers, London, 1970, p. 734 ffを参照されたい）。

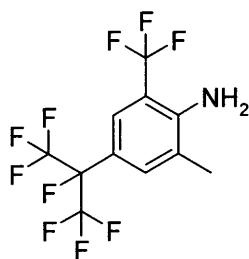
40

【0489】

4 - ヘプタフルオロイソプロピル - 2 - メチル - 6 - トリフルオロメチルアニリン出発材料の調製

構造(D - 1 a)の4 - ヘプタフルオロイソプロピル - 2 - メチル - 6 - トリフルオロメチルアニリン出発材料は、現在まで文献に記載されていない。調製は2つの異なるプロセスによって行うことができる。

【化 8 1】



D-1 a

10

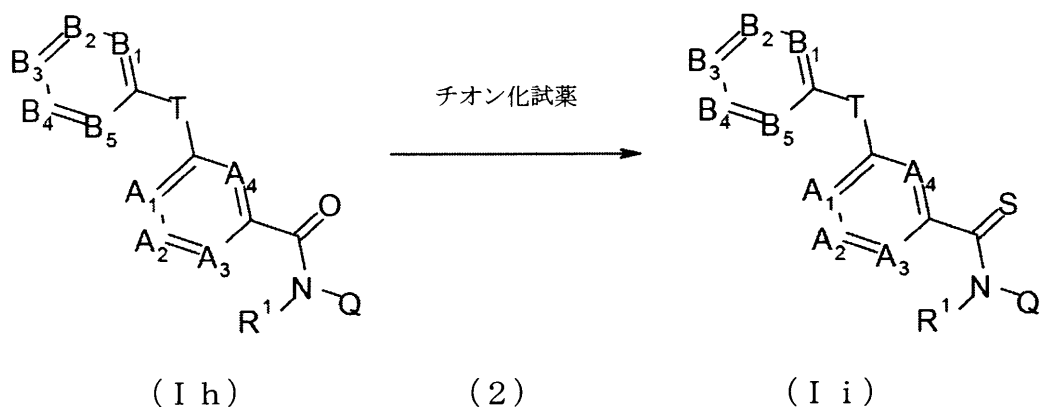
【0490】

チオアミドを調製するためのプロセス

構造 (I i) の化合物は、構造 (I h) の化合物から硫黄転移試薬との反応により、反応スキーム 15 に記載されるプロセスで調製することができる。

反応スキーム 15

【化 8 2】



20

30

【0491】

$A_1 \sim A_4$ 、 $B_1 \sim B_5$ 、アルキル、Q、T および R^1 ラジカルは、それぞれ上で定義される通りである。使用されるチオン化試薬 (2) は、例えば、 P_4S_{10} またはローソン試薬 (2, 4-ビス (4-メトキシフェニル) -1, 3, 2, 4-ジチアジホスフェタン 2, 4-ジスルフィド) であり得る。

【0492】

化合物 (I h) の調製は上述されている。

【0493】

チオン化試薬は市販されているか、または当業者に既知のプロセスで、もしくはこれらのプロセスと同様に調製することができる。

40

【0494】

反応は、カルボンアミドのチオン化に関する文献から既知の方法と同様に行われる (例えば、国際公開第 2012056372 号、77 頁; 国際公開第 2003066050 号、31 頁)。

【0495】

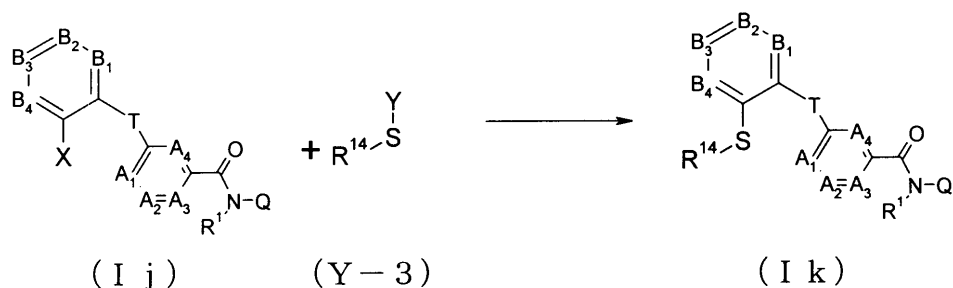
(I k) を調製するためのプロセス

本発明の化合物 (I k) は、化合物 (I j) から構造 (Y-3) の硫黄化合物との反応により、反応スキーム 16 で規定されるプロセスによって調製することができる。

50

反応スキーム 16

【化 8 3】



10

【0496】

$A_1 \sim A_4$ 、 $B_1 \sim B_4$ 、アルキル、 Q 、 R^1 、 n および R^{11} ラジカルは、それぞれ上で定義される通りである。 X は好適な脱離基、例えば、フッ素、塩素、臭素またはヨウ素である。 R^{14} は任意に置換された $C_1 - C_6$ -アルキルである。 Y は水素またはアルカリ金属、例えば、ナトリウムまたはリチウムである。

【0497】

反応は、アルキルチオラジカルの芳香族への導入に関する文献〔例えば、Organometallics 1989, 8 (5), 1303-1308; 国際公開第1998056761号、実施例63、97頁〕から既知の方法と同様に行われる。

20

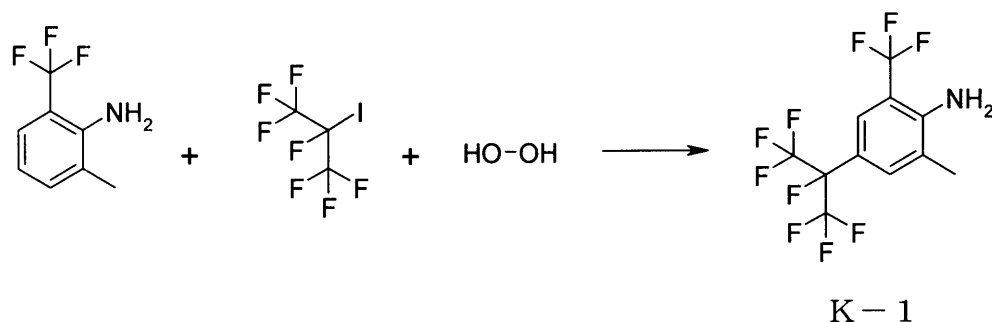
【0498】

プロセス1:

構造(K-1)の4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチル-6-トリフルオロメチルアニリンは、反応スキーム1で規定されるプロセスによって2-メチル-6-トリフルオロメチルアニリンから発生し、過酸化水素の存在下でヘプタフルオロイソプロピルヨウ化物との反応により調製することができる。

反応スキーム 4

【化 8 4】



30

40

【0499】

2-メチル-6-トリフルオロメチルアニリンは、文献(John P. Chupp, Terry M. Balthazor, Michael J. Miller, and Mark J. Pozzo, J. Org. Chem. 49 (1984), 4711-4716またはThomas E. Nickson J. Org. Chem. 51 (1986) 3903-3904)から既知であり、ヘプタフルオロイソプロピルヨウ化物は市販されている。

【0500】

反応は、芳香族のトリフルオロメチル化に関する既知のプロセスと同様に行われる(T

50

atsuhito Kino, Yu Nagase, Yuhki Ohtsuka, Kyoko Yamamoto, Daisuke Uruguchi, Kenji Tokuhisa and Tetsu Yamakawa, Journal of Fluorine Chemistry 131 (2010) 98-105)。

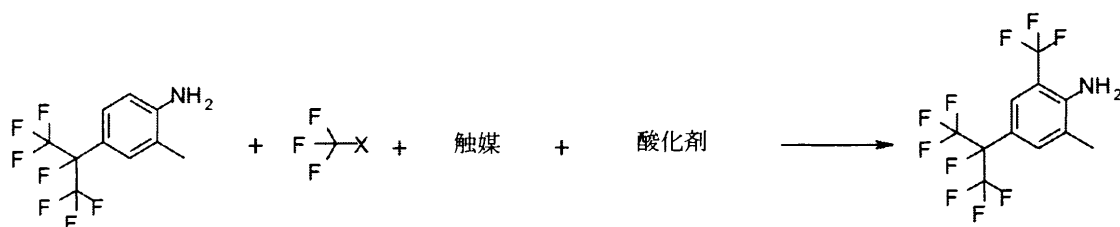
【0501】

プロセス2

さらに、構造 (K-1) の4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチル-6-トリフルオロメチルアニリンは、スキーム2で規定されるプロセスによって4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチルアニリンから発生し、酸化剤および遷移金属触媒の存在下でトリフルオロメチルスルフィン酸ナトリウムとの反応により調製することができる。

反応スキーム5

【化85】



D-1 a

XはBr、I、 NaSO_2^- (トリフルオロメチルスルフィン酸ナトリウム)、 KSO_2^- (トリフルオロメチルスルフィン酸カリウム) である。トリフルオロメチルスルフィン酸ナトリウムが特に好ましい。

【0502】

4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチルアニリンは既知である (米国特許第2004/92762号)。

【0503】

好適な触媒は硫酸鉄 (II)、硝酸鉄 (III)、トリフレート銅 (II) またはフェロセン等の遷移金属である。硫酸鉄 (II) が特に好ましい。

【0504】

好適な酸化剤は、特に、過酸化水素、tert-ブチルヒドロペルオキシド、またはペルオキシ二硫酸ナトリウム、ペルオキシ二硫酸カリウム、ペルオキシモノ硫酸ナトリウム、もしくはペルオキシモノ硫酸カリウム等の過酸化物である。tert-ブチルヒドロペルオキシドが特に好ましい。

【0505】

反応の実施において、好適な溶媒が使用され得る。

【0506】

原理上、本発明によるプロセスの性能のために有用な希釈剤または溶媒には、特定の反応条件下で不活性であるすべての有機溶媒が含まれる。例としては、アセトニトリル、プロピオニトリル、ブチロニトリル、イソブチロニトリル等のニトリル；水、二酸化テトラヒドロチオフェン、ジメチルスルホキシド、テトラメチレンスルホキシド、ジプロピルスルホキシド、ジイソブチルスルホキシド、ジブチルスルホキシド、ジイソアミルスルホキシド、スルホン (例えば、ジメチル、ジエチル、ジプロピル、ジブチル、ジヘキシル、メチルエチル、エチルプロピル、エチルイソブチルおよびペンタメチレンスルホン)；脂肪族、シクロ脂肪族 (例えば、ペンタン、ヘキサン、ヘプタン、オクタン、ノナンおよび工業用炭化水素)、ならびに、例えば、 $40^\circ\text{C} \sim 250^\circ\text{C}$ の範囲の沸点を有する成分を有する「揮発油」と称されるもの、 $70^\circ\text{C} \sim 190^\circ\text{C}$ の沸騰範囲内の石油留分、シクロヘキサン、メチルシクロヘキサン、石油エーテル、リグロイン、オクタンが挙げられる。

【0507】

使用される好ましい希釈剤は、反応を損なわない任意の溶媒、例えば、水；アセトニトリル、プロピオニトリル、ブチロニトリル、イソブチロニトリル等のニトリルであり得る。溶媒は、単体でまたは2つ以上の組み合わせで使用され得る。

【0508】

反応において塩基が使用されてもよい。例としては、アルカリ土類金属またはアルカリ金属化合物（例えば、リチウム、ナトリウム、カリウム、マグネシウム、カルシウムおよびバリウムの水酸化物、水素化物、酸化物および炭酸塩）が挙げられる。

【0509】

使用される好ましい塩基性反応補助剤は炭酸水素ナトリウムであってもよく、さらに、例えば、以下の塩基を使用することが可能である：アルカリ金属水酸化物、例えば、水酸化ナトリウムおよび水酸化カリウム；炭酸水素ナトリウムおよび炭酸カリウム等の炭酸塩；リン酸二水素ナトリウム、リン酸水素二カリウムおよびリン酸三ナトリウム等のリン酸塩。

10

【0510】

反応は、幅広い温度範囲内で行うことができる。通常は $-78 \sim 200^{\circ}\text{C}$ の温度範囲内で、好ましくは $-10 \sim 150^{\circ}\text{C}$ の温度で行われる。反応は、昇圧または減圧下で実行することができる。しかし標準圧力下で行われることが好ましい。反応時間は0.1～72時間であり、好ましくは1～24時間である。

【0511】

反応を行うために、4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチル-6-トリフルオロメチルアニリンの1モル当たり1～10モル、好ましくは1～4モルのトリフルオロメチル化剤；1～20モル、好ましくは1～8モルの酸化剤、および0.01～1モル、好ましくは0.05～0.4 molの触媒が、溶媒または溶媒混合物中で、例えば、アセトニトリルと水との混合物中で使用される。

20

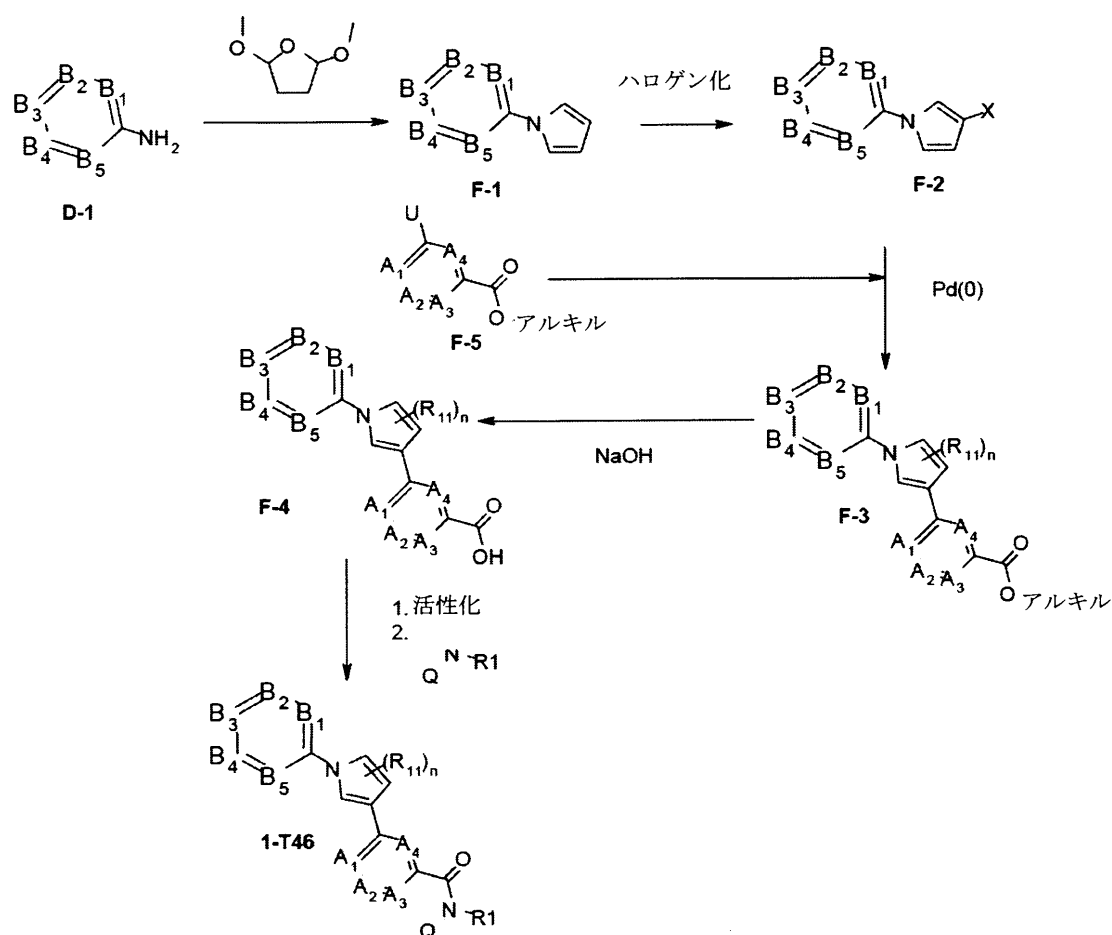
【0512】

プロセス I-T 46 延長

構造（I-T 46）の化合物は、反応スキームで規定されるプロセスによって調製することができる。

反応スキーム 6

【化 8 6】



10

20

【0513】

$A_1 \sim A_4$ 、 $B_1 \sim B_5$ 、アルキル、Q、 R^1 および R^{11} ラジカルは、それぞれ上で定義される通りである。U はボロン酸、ボロン酸エステルまたはトリフルオロボロネートである。X は臭素、ヨウ素またはトリフレートである。構造 (F-1) および (F-5) の出発化合物は既知であるか (例えば、F-1: Hulcoop, David G. et al., Organic Letters, 9 (2007), p. 1761-1764, Supporting information pages 1ff.)、または既知の方法で調製することができる (例えば、D-1 から)。

30

【0514】

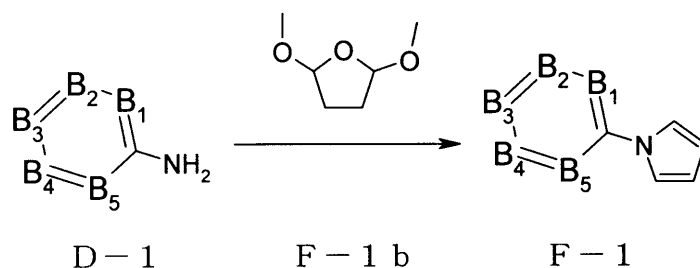
反応は、文献、例えば、米国特許第 2009/209476 号、18~19 頁に記載のプロセスによって行うことができる。

段階 1 ピロール閉環

本発明の化合物 (I-T46) の調製プロセスの段階 1:

40

【化 8 7】



50

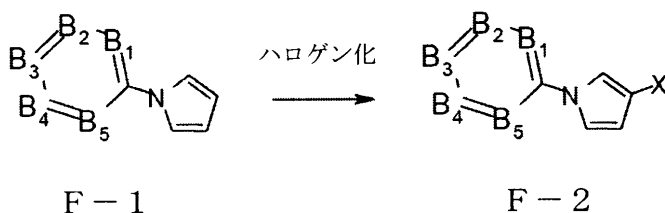
【0515】

一般構造 (F-1) の本発明の化合物は、構造 (D-1) および (F-1b) の出発材料から、文献から既知の方法と同様に調製することができる。B¹ ~ B⁵ ラジカルは、それぞれ上で定義される通りである。構造 (D-1) の化合物は、文献 (例えば、米国特許第 2002/198399 号、国際公開第 2009/30457 号、28 頁) から既知であるか、または文献から既知の方法で調製することができる。化合物 (F1-b) は市販されている。構造 (D-1) の化合物の典型的な代表物としては、2-アミノ-1, 3-ジクロロ-5-[1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]ベンゼン、2-アミノ-1, 3-ジメチル-5-[1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]ベンゼン、2-アミノ-1-エチル-3-メチル-5-[1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]ベンゼン、2-アミノ-1-クロロ-5-[1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]-3-(トリフルオロメチル)ベンゼン、2-アミノ-1-メチル-5-[1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]-3-(トリフルオロメチル)ベンゼン、2-アミノ-1-クロロ-5-[1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]-3-(トリフルオロメトキシ)ベンゼン、2-アミノ-1-メチル-5-[1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]-3-(トリフルオロメトキシ)ベンゼンが挙げられる。反応は、文献 (例えば、Hulcoop, David G. et al., Organic Letters, 9 (2007), p. 1761-1764, Supporting information pages 1ff) の類似化合物に対する既知の条件下で行われる。

段階2 ハロゲン化

本発明の化合物 (I-T46) の調製プロセスの段階1:

【化88】



【0516】

一般構造 (F-2) の本発明の化合物は、構造 (F-1) の出発材料からハロゲン化により、文献から既知の方法と同様に調製することができる。B¹ ~ B⁵ ラジカルは、それぞれ上で定義される通りである。構造 (F-1) の化合物は、文献 (例えば、F-1: Hulcoop, David G. et al., Organic Letters, 9 (2007), p. 1761-1764, Supporting information page 1ff.) から既知であるか、または上述の方法で調製することができる。構造 (F-1) の化合物の典型的な代表物としては、1-[2, 6-ジクロロ-4-[1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル]ピロール、1-[2, 6-ジメチル-4-[1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル]ピロール、1-[2-エチル-6-メチル-4-[1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル]ピロール、1-[2-クロロ-4-[1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]-6-(トリフルオロメチル)フェニル]ピロール、1-[2-メチル-4-[1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]-6-(トリフルオロメチル)フェニル]ピロール、1-[1-クロロ-5-[1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]-6-(トリフルオロメトキシ)フェニル]ピロール、1-[1-メチル-5-[1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1-(

トリフルオロメチル) エチル] - 6 - (トリフルオロメトキシ) フェニル] ピロールが挙げられる。

【0517】

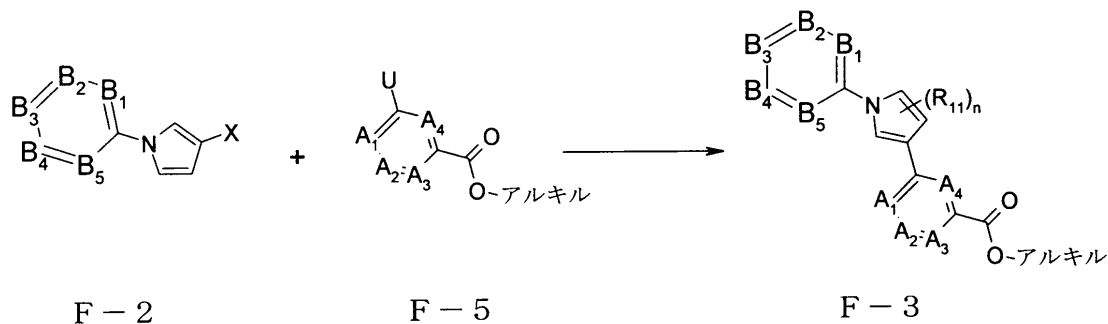
好適なハロゲン化合物は当業者に既知であり、例えば、臭素、ヨウ素、N-ブロモスクシンイミド、N-ヨードスクシンイミド、1, 3-ジブロモ-5, 5-ジメチルヒダントインおよびベンジルトリメチルアンモニウムテトラクロロヨウ素酸塩である。臭素、ヨウ素、およびヨードスクシンイミドを使用することが好ましい。反応は、文献（例えば、Tatsuta; Itoh Bulletin of the Chemical Society of Japan, 67 (1994) 1449-1455）から既知の条件に従う。

10

段階3 ボロン酸カップリング

本発明の化合物 (I-T46) の調製プロセスの段階3：

【化89】



20

【0518】

A₁ ~ A₄、B₁ ~ B₅、アルキル、n および R¹¹ ラジカルは、それぞれ上で定義される通りである。U は、例えば、ボロン酸、ボロン酸エステルまたはトリフルオロボロネートであり、X は臭素、ヨウ素またはトリフレートである。

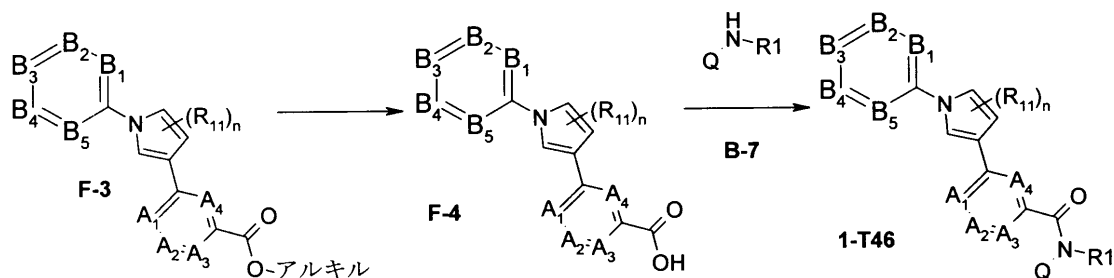
【0519】

一般構造 (F-3) の本発明の化合物は、一般構造 (F-2) および (F-5) (例えば、国際公開第 2005/040110 号または国際公開第 2009/089508 号) の共反応物質からパラジウム触媒反応により、文献から既知のプロセスで調製することができる。一般構造 (F-5) の化合物は市販されているか、または当業者に既知のプロセスで調製することができる。

30

段階4、5 加水分解、アミド化

【化90】



40

【0520】

一般構造 (I-T46) の本発明の化合物は、(F-4) および (B-7) (例えば、国際公開第 2010/051926 号または国際公開第 2010/133312 号) の出発材料から、文献から既知のペプチドカップリング方法と同様に調製することができる。一般構造 (F-4) の化合物は、一般構造 (F-3) (例えば、国際公開第 2010/0

50

51926号または国際公開第2010/133312号)の化合物からエステル加水分解によって、文献から既知のプロセスと同様に調製することができる。A₁～A₄、B₁～B₅、アルキル、Q、R¹およびR¹¹ラジカルは、それぞれ上で定義される通りである。

【0521】

Q

より好ましい実施形態では、式(I)または(Ia'')または(IT-2)または(IT-3)または(IT-4)または(IT-22)または(IT-23)または(IT-46)の化合物のQは、C₁-C₄-アルキル、2-オキソ-2-(2, 2, 2-トリフルオロエチルアミノ)エチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、2, 2-ジフルオロエチル、3, 3, 3-トリフルオロプロピル、ピリジン-2-イルメチルもしくは(1-シアノシクロプロピル)メチル等の、フッ素で、または1-シアノプロピルで、またはピリジンで置換されたC₁-C₄-アルキル；シクロプロピルまたはシクロブチル等のC₃-C₄-シクロアルキル；任意にフッ素で置換されたC₁-C₄-アルキル置換シクロプロピル(例えば、1-トリフルオロメチルシクロプロピル、1-tert-ブチルシクロプロピル)、1-チオカルバモイルシクロプロピル、1-カルバモイルシクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、トランス-2-フルオロシクロプロピル、シス-2-フルオロシクロプロピル等の任意に置換されたC₃-C₄-シクロアルキル；オキセタン-3-イル、チエタン-3-イル、1-オキシドチエタン-3-イル、もしくは1, 1-ジオキシドチエタン-3-イル等のC₄-C₆-ヘテロシクロアルキル；またはいずれの場合も、任意にC₁-C₄-アルキルで置換されたベンジル；ピラゾール(N-メチルピラゾール-3-イル等)、ピリジン；メチルスルホニル；または2-オキソ-2-(2, 2, 2-トリフルオロエチルアミノ)エチルである。

10

20

【0522】

特に好ましい実施形態では、式(I)または(Ia'')または(IT-2)または(IT-3)または(IT-4)または(IT-22)または(IT-23)または(IT-46)の化合物のQは、2, 2, 2-トリフルオロエチルもしくは3, 3, 3-トリフルオロプロピル等のフッ素で置換されたC₁-C₃-アルキル；シクロプロピル；1-シアノシクロプロピルもしくは1-トリフルオロメチルシクロプロピル等の任意にシアノで、C₁-C₄-アルキルで置換されたシクロプロピル；チエタン-3-イル；または2-オキソ-2-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)アミノエチルである。

30

【0523】

式(I)

さらに好ましい実施形態は、式(I)の化合物に関し、式中、TがT₂、T₃、T₄、T₂₂、T₂₃またはT₄₆であり、すべての他のパラメータは段落[9]で定義される通りである。

【0524】

さらに好ましい実施形態は、式(I)の化合物に関し、式中、TがT₂、T₃、T₄、T₂₂、T₂₃またはT₄₆であり、すべての他のパラメータは段落[9]で定義される通りである。

40

【0525】

さらに好ましい実施形態は、式(I)の化合物に関し、式中、TがT₂またはT₄であり、すべての他のパラメータは段落[9]で定義される通りである。

【0526】

さらに好ましい実施形態は、式(I)の化合物に関し、式中、TがT₃またはT₄₆であり、すべての他のパラメータは段落[9]で定義される通りである。

【0527】

さらに好ましい実施形態は、式(I)の化合物に関し、式中、TがT₂₂またはT₂₃であり、すべての他のパラメータは段落[9]で定義される通りである。

【0528】

50

さらに好ましい実施形態は、式 (I) の化合物に関し、式中、T が T₂、T₃、T₄、T₂₂、T₂₃ または T₄₆ であり、B₃ が C-R₈ であり、R₈ が (C₁-C₆)-アルキル、(C₁-C₆)-アルコキシまたはアルキルスルファニルであり、そのそれぞれが置換されており、置換基がハロゲンおよびヒドロキシルから選択され、少なくとも 1 つの置換基がハロゲンであり、すべての他のパラメータは段落 [9] で定義される通りである。

【0529】

さらに好ましい実施形態は、式 (I) の化合物に関し、式中、T が T₂、T₃、T₄、T₂₂、T₂₃ または T₄₆ であり、B₃ が C-R₈ であり、R₈ が (C₁-C₆)-アルキル、(C₁-C₆)-アルコキシまたはアルキルスルファニルであり、そのそれぞれが置換されており、置換基がハロゲンおよびヒドロキシルから選択され、少なくとも 1 つの置換基がハロゲンであり、すべての他のパラメータは段落 [9] で定義される通りである。

10

【0530】

さらに好ましい実施形態は、式 (I) の化合物に関し、式中、T が T₂ または T₄ であり、B₃ が C-R₈ であり、R₈ が (C₁-C₆)-アルキル、(C₁-C₆)-アルコキシまたはアルキルスルファニルであり、そのそれぞれが置換されており、置換基がハロゲンおよびヒドロキシルから選択され、少なくとも 1 つの置換基がハロゲンであり、すべての他のパラメータは段落 [9] で定義される通りである。

20

【0531】

さらに好ましい実施形態は、式 (I) の化合物に関し、式中、T が T₃ または T₄₆ であり、B₃ が C-R₈ であり、R₈ が (C₁-C₆)-アルキル、(C₁-C₆)-アルコキシまたはアルキルスルファニルであり、そのそれぞれが置換されており、置換基がハロゲンおよびヒドロキシルから選択され、少なくとも 1 つの置換基がハロゲンであり、すべての他のパラメータは段落 [9] で定義される通りである。

【0532】

さらに好ましい実施形態は、式 (I) の化合物に関し、式中、T が T₂₂ または T₂₃ であり、B₃ が C-R₈ であり、R₈ が (C₁-C₆)-アルキル、(C₁-C₆)-アルコキシまたはアルキルスルファニルであり、そのそれぞれが置換されており、置換基がハロゲンおよびヒドロキシルから選択され、少なくとも 1 つの置換基がハロゲンであり、すべての他のパラメータは段落 [9] で定義される通りである。これに関連して、特に好ましい実施形態は、R⁸ が過フッ化 (C₁-C₆)-アルキル、(C₁-C₆)-アルコキシまたはアルキルスルファニルであり、最も好ましくは過フッ化 (C₁-C₄)-アルキル、(C₁-C₄)-アルコキシである化合物に関する。

30

【0533】

さらに好ましい実施形態は、式 (I) の化合物に関し、式中、T が T₂、T₃、T₄、T₂₂、T₂₃ または T₄₆ であり、B₃ が C-R₈ であり、R₈ が (C₁-C₆)-アルキル、(C₁-C₆)-アルコキシまたはアルキルスルファニルであり、そのそれぞれが置換されており、置換基がハロゲンおよびヒドロキシルから選択され、少なくとも 1 つの置換基がハロゲンであり、より好ましくは、式中、R₈ が過フッ化 (C₁-C₆)-アルキル、(C₁-C₆)-アルコキシまたはアルキルスルファニルであり、最も好ましくは過フッ化 (C₁-C₄)-アルキル、(C₁-C₄)-アルコキシであり、式中、B₁、B₂、B₄ および B₅ が、それぞれ、C R⁶、C R⁷、C R⁹ および C R¹⁰ であり、式中、R⁶、R⁷、R⁹ および R¹⁰ が、それぞれ独立して、H、ハロゲン、シアノ、ニトロ、または C₁-C₄-アルキル、C₃-C₄-シクロアルキル、C₁-C₄-アルコキシ、N-アルコキシイミノアルキル、C₁-C₄-アルキルスルファニル、C₁-C₄-アルキルスルフィニル、C₁-C₄-アルキルスルホニル、N-C₁-C₄-アルキルアミノ、N、N-ジ-C₁-C₄-アルキルアミノであり、そのそれぞれが、ハロゲンおよびヒドロキシルから選択される少なくとも 1 つの置換基で置換されており、少なくとも 1 つの置換基がハロゲンであり、すべての他のパラメータは段落 [9] で定義される通り

40

50

である。さらに好ましい実施形態では、 R^6 および R^{10} が、それぞれハロゲン (C_1 、 Br 、もしくは F 等) であるか、それぞれ C_1-C_3 -アルキルであるか、またはそれぞれハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルキル、例えば、過フッ化 C_1-C_3 -アルキル (ペルフルオロメチル、ペルフルオロエチルもしくはペルフルオロプロピル) である。

【0534】

さらに好ましい実施形態は、式 (I) の化合物に関し、式中、 T が T_2 、 T_3 、 T_4 、 T_{22} 、 T_{23} または T_{46} であり、 B_3 が $C-R_8$ であり、 R_8 が (C_1-C_6)-アルキル、(C_1-C_6)-アルコキシまたはアルキルスルファニルであり、そのそれぞれが置換されており、置換基がハロゲンおよびヒドロキシルから選択され、少なくとも1つの置換基がハロゲンであり、より好ましくは、式中、 R_8 が過フッ化 (C_1-C_6)-アルキル、(C_1-C_6)-アルコキシまたはアルキルスルファニルであり、最も好ましくは過フッ化 (C_1-C_4)-アルキル、(C_1-C_4)-アルコキシであり、式中、 B_1 、 B_2 および B_4 が、それぞれ CR^6 、 CR^7 および CR^9 であり、 B^5 が N であり、式中、 R^6 、 R^7 および R^9 が、それぞれ独立して、 H 、ハロゲン、シアノ、ニトロ、または C_1-C_4 -アルキル、 C_3-C_4 -シクロアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、 N -アルコキシイミノアルキル、 C_1-C_4 -アルキルスルファニル、 C_1-C_4 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_4 -アルキルスルホニル、 $N-C_1-C_4$ -アルキルアミノ、 N 、 N -ジ- C_1-C_4 -アルキルアミノであり、そのそれぞれが、ハロゲンおよびヒドロキシルから選択される少なくとも1つの置換基で置換されており、少なくとも1つの置換基がハロゲンであり、すべての他のパラメータは段落 [9] で定義される通りである。

【0535】

さらに好ましい実施形態は、式 (I) の化合物に関し、式中、 T が T_2 、 T_3 、 T_4 、 T_{22} 、 T_{23} または T_{46} であり、 B_3 が $C-R_8$ であり、 R_8 が (C_1-C_6)-アルキル、(C_1-C_6)-アルコキシまたはアルキルスルファニルであり、そのそれぞれが置換されており、置換基がハロゲンおよびヒドロキシルから選択され、少なくとも1つの置換基がハロゲンであり、より好ましくは、式中、 R_8 が過フッ化 (C_1-C_6)-アルキル、(C_1-C_6)-アルコキシまたはアルキルスルファニルであり、最も好ましくは過フッ化 (C_1-C_4)-アルキル、(C_1-C_4)-アルコキシであり、式中、 B_1 、 B_2 、 B_4 および B_5 が、それぞれ CR^6 、 CR^7 、 CR^9 および CR^{10} であり、式中、 R^6 、 R^7 、 R^9 および R^{10} が、それぞれ独立して、 H 、ハロゲン、シアノ、ニトロ、または C_1-C_4 -アルキル、 C_3-C_4 -シクロアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、 N -アルコキシイミノアルキル、 C_1-C_4 -アルキルスルファニル、 C_1-C_4 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_4 -アルキルスルホニル、 $N-C_1-C_4$ -アルキルアミノ、 N 、 N -ジ- C_1-C_4 -アルキルアミノであり、そのそれぞれが、ハロゲンおよびヒドロキシルから選択される少なくとも1つの置換基で置換されており、少なくとも1つの置換基がハロゲンであり、それぞれ R^{11} が独立して、 H 、アミノ (NH_2) またはシアノであり、好ましくは H であり、 W が O であり、 R^1 が H 、メチル、エチル、 n -プロピル、イソプロピル、 n -ブチル、イソブチル、 s -ブチル、 t -ブチルであり、好ましくは H またはメチルであり、すべての他のパラメータは段落 [9] で定義される通りである。さらに好ましい実施形態では、 R^6 および R^{10} が、それぞれハロゲン (C_1 、 Br 、もしくは F 等) であるか、それぞれ C_1-C_3 -アルキルであるか、またはそれぞれハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルキル、例えば、過フッ化 C_1-C_3 -アルキル (ペルフルオロメチル、ペルフルオロエチルもしくはペルフルオロプロピル) である。

【0536】

さらに好ましい実施形態は、式 (I) の化合物に関し、式中、 T が T_2 、 T_3 、 T_4 、 T_{22} 、 T_{23} または T_{46} であり、 B_3 が $C-R_8$ であり、 R_8 が (C_1-C_6)-アルキル、(C_1-C_6)-アルコキシまたはアルキルスルファニルであり、そのそれぞれが置換されており、置換基がハロゲンおよびヒドロキシルから選択され、少なくとも1つの置換基がハロゲンであり、より好ましくは、式中、 R_8 が過フッ化 (C_1-C_6)-アルキル、(C_1-C_6)-アルコキシまたはアルキルスルファニルであり、最も好ましく

は過フッ化 (C₁ - C₄) - アルキル、(C₁ - C₄) - アルコキシであり、式中、B₁、B₂ および B₄ が、それぞれ CR⁶、CR⁷ および CR⁹ であり、B⁵ が N であり、式中、R⁶、R⁷ および R⁹ が、それぞれ独立して、H、ハロゲン、シアノ、ニトロまたは C₁ - C₄ - アルキル、C₃ - C₄ - シクロアルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ、N - アルコキシイミノアルキル、C₁ - C₄ - アルキルスルファニル、C₁ - C₄ - アルキルスルフィニル、C₁ - C₄ - アルキルスルホニル、N - C₁ - C₄ - アルキルアミノ、N、N - ジ - C₁ - C₄ - アルキルアミノであり、そのそれぞれが、ハロゲンおよびヒドロキシルから選択される少なくとも 1 つの置換基で置換されており、少なくとも 1 つの置換基がハロゲンであり、それぞれ R¹¹ が独立して、H、アミノ (NH₂) またはシアノであり、好ましくは H であり、W が O であり、R¹ が H、メチル、エチル、n - プロピル、イソプロピル、n - ブチル、イソブチル、s - ブチル、t - ブチルであり、好ましくは H またはメチルであり、すべての他のパラメータは段落 [9] で定義される通りである。

【0537】

さらに好ましい実施形態は、式 (I) の化合物に関し、式中、T が T₂、T₃、T₄、T₂₂、T₂₃ または T₄₆ であり、B₃ が C - R₈ であり、R₈ が (C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - アルコキシまたはアルキルスルファニルであり、そのそれぞれが置換されており、置換基がハロゲンおよびヒドロキシルから選択され、少なくとも 1 つの置換基がハロゲンであり、より好ましくは、式中、R₈ が過フッ化 (C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - アルコキシまたはアルキルスルファニルであり、最も好ましくは過フッ化 (C₁ - C₄) - アルキル、(C₁ - C₄) - アルコキシであり、式中、B₁、B₂、B₄ および B₅ が、それぞれ CR⁶、CR⁷、CR⁹ および CR¹⁰ であり、式中、R⁶、R⁷、R⁹ および R¹⁰ が、それぞれ独立して、H、ハロゲン、シアノ、ニトロ、または C₁ - C₄ - アルキル、C₃ - C₄ - シクロアルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ、N - アルコキシイミノアルキル、C₁ - C₄ - アルキルスルファニル、C₁ - C₄ - アルキルスルフィニル、C₁ - C₄ - アルキルスルホニル、N - C₁ - C₄ - アルキルアミノ、N、N - ジ - C₁ - C₄ - アルキルアミノであり、そのそれぞれが、ハロゲンおよびヒドロキシルから選択される少なくとも 1 つの置換基で置換されており、少なくとも 1 つの置換基がハロゲンであり、それぞれ R¹¹ が独立して、H、アミノ (NH₂) またはシアノであり、好ましくは H であり、W が O であり、R¹ が H、メチル、エチル、n - プロピル、イソプロピル、n - ブチル、イソブチル、s - ブチル、t - ブチルであり、好ましくは H またはメチルであり、Q が C₁ - C₄ - アルキル、2 - オキソ - 2 - (2, 2, 2 - トリフルオロエチルアミノ) エチル、2, 2, 2 - トリフルオロエチル、2, 2 - ジフルオロエチル、3, 3, 3 - トリフルオロプロピル、ピリジン - 2 - イルメチルもしくは (1 - シアノシクロプロピル) メチル等の、フッ素で、または 1 - シアノプロピルで、またはピリジンで置換された C₁ - C₄ - アルキル；シクロプロピルまたはシクロブチル等の C₃ - C₄ - シクロアルキル；任意にフッ素で置換された C₁ - C₄ - アルキル置換シクロプロピル (例えば、1 - トリフルオロメチルシクロプロピル、1 - tert - ブチルシクロプロピル)、1 - チオカルバモイルシクロプロピル、1 - カルバモイルシクロプロピル、1 - シアノシクロプロピル、トランス - 2 - フルオロシクロプロピル、シス - 2 - フルオロシクロプロピル等の任意に置換された C₃ - C₄ - シクロアルキル；オキセタン - 3 - イル、チエタン - 3 - イル、1 - オキシドチエタン - 3 - イルまたは 1, 1 - ジオキシドチエタン - 3 - イル等の C₄ - C₆ - ヘテロシクロアルキル；またはいずれの場合も任意に C₁ - C₄ - アルキルで置換されたベンジル；ピラゾール (N - メチルピラゾール - 3 - イル等)、ピリジン；メチルスルホニル；または 2 - オキソ - 2 - (2, 2, 2 - トリフルオロエチルアミノ) エチル、好ましくは、2, 2, 2 - トリフルオロエチルまたは 3, 3, 3 - トリフルオロプロピル等のフッ素で置換された C₁ - C₃ - アルキル；シクロプロピル；1 - シアノシクロプロピルまたは 1 - トリフルオロメチルシクロプロピル等の任意に置換されたシクロプロピル、チエタン - 3 - イル；または 2 - オキソ - 2 - (2, 2, 2 - トリフルオロエチル) アミノエチルであり、すべての他のパラメータは段落 [9] で定義される通りである。さらに好ましい実施形態では、R⁶ および R¹⁰ が

10

20

30

40

50

、それぞれハロゲン（C l、B rもしくはF等）であるか、それぞれC₁－C₃－アルキルであるか、またはそれぞれハロゲンで置換されたC₁－C₃－アルキル、例えば、過フッ化C₁－C₃－アルキル（ペルフルオロメチル、ペルフルオロエチルもしくはペルフルオロプロピル）である。

【0538】

さらに好ましい実施形態は、式（I）の化合物に関し、式中、TがT₂、T₃、T₄、T₂₂、T₂₃またはT₄₆であり、B₃がC－R₈であり、R₈が（C₁－C₆）－アルキル、（C₁－C₆）－アルコキシまたはアルキルスルファニルであり、そのそれぞれが置換されており、置換基がハロゲンおよびヒドロキシルから選択され、少なくとも1つの置換基がハロゲンであり、より好ましくは、式中、R₈が過フッ化（C₁－C₆）－アルキル、（C₁－C₆）－アルコキシまたはアルキルスルファニルであり、最も好ましくは過フッ化（C₁－C₄）－アルキル、（C₁－C₄）－アルコキシであり、式中、B₁、B₂、およびB₄が、それぞれCR⁶、CR⁷およびCR⁹であり、B⁵がNであり、式中、R⁶、R⁷およびR⁹が、それぞれ独立して、H、ハロゲン、シアノ、ニトロ、またはC₁－C₄－アルキル、C₃－C₄－シクロアルキル、C₁－C₄－アルコキシ、N－アルコキシイミノアルキル、C₁－C₄－アルキルスルファニル、C₁－C₄－アルキルスルフィニル、C₁－C₄－アルキルスルホニル、N－C₁－C₄－アルキルアミノ、N、N－ジ－C₁－C₄－アルキルアミノであり、そのそれぞれが、ハロゲンおよびヒドロキシルから選択される少なくとも1つの置換基で置換されており、少なくとも1つの置換基がハロゲンであり、それぞれR¹¹が独立して、H、アミノ（NH₂）またはシアノであり、好ましくはHであり、WがOであり、R¹がH、メチル、エチル、n－プロピル、イソプロピル、n－ブチル、イソブチル、s－ブチル、t－ブチルであり、好ましくはHまたはメチルであり、QがC₁－C₄－アルキル、2－オキソ－2－（2，2，2－トリフルオロエチルアミノ）エチル、2，2，2－トリフルオロエチル、2，2－ジフルオロエチル、3，3，3－トリフルオロプロピル、ピリジン－2－イルメチルもしくは（1－シアノシクロプロピル）メチル等の、フッ素で、または1－シアノプロピルで、またはピリジンで置換されたC₁－C₄－アルキル；シクロプロピルまたはシクロブチル等のC₃－C₄－シクロアルキル；任意にフッ素で置換されたC₁－C₄－アルキル置換シクロプロピル（例えば、1－トリフルオロメチルシクロプロピル、1－tert－ブチルシクロプロピル）、1－チオカルバモイルシクロプロピル、1－カルバモイルシクロプロピル、1－シアノシクロプロピル、トランス－2－フルオロシクロプロピル、シス－2－フルオロシクロプロピル等の任意に置換されたC₃－C₄－シクロアルキル；オキセタン－3－イル、チエタン－3－イル、1－オキシドチエタン－3－イルまたは1，1－ジオキシドチエタン－3－イル等のC₄－C₆－ヘテロシクロアルキル；またはいずれの場合も任意にC₁－C₄－アルキルで置換されたベンジル；ピラゾール（N－メチルピラゾール－3－イル等）、ピリジン；メチルスルホニル；または2－オキソ－2－（2，2，2－トリフルオロエチルアミノ）エチルであり、好ましくは、2，2，2－トリフルオロエチルまたは3，3，3－トリフルオロプロピル等のフッ素で置換されたC₁－C₃－アルキル；シクロプロピル；1－シアノシクロプロピルまたは1－トリフルオロメチルシクロプロピル等の任意に置換されたシクロプロピル、チエタン－3－イル；または2－オキソ－2－（2，2，2－トリフルオロエチル）アミノエチルであり、すべての他のパラメータは段落〔9〕で定義される通りである。

【0539】

さらに好ましい実施形態は、式（I）の化合物に関し、式中、TがT₂、T₃、T₄、T₂₂、T₂₃またはT₄₆であり、B₃がC－R₈であり、R₈が（C₁－C₆）－アルキル、（C₁－C₆）－アルコキシまたはアルキルスルファニルであり、そのそれぞれが置換されており、置換基がハロゲンおよびヒドロキシルから選択され、少なくとも1つの置換基がハロゲンであり、より好ましくは、式中、R₈が過フッ化（C₁－C₆）－アルキル、（C₁－C₆）－アルコキシまたはアルキルスルファニルであり、最も好ましくは過フッ化（C₁－C₄）－アルキル、（C₁－C₄）－アルコキシであり、式中、B₁

、 B_2 、 B_4 および B_5 が、それぞれ CR^6 、 CR^7 、 CR^9 および CR^{10} であり、式中、 R^6 、 R^7 、 R^9 および R^{10} が、それぞれ独立して、H、ハロゲン、シアノ、ニトロ、または C_1-C_4 -アルキル、 C_3-C_4 -シクロアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、N-アルコキシ-イミノアルキル、 C_1-C_4 -アルキルスルファニル、 C_1-C_4 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_4 -アルキルスルホニル、N- C_1-C_4 -アルキルアミノ、N、N-ジ- C_1-C_4 -アルキルアミノであり、そのそれぞれが、ハロゲンおよびヒドロキシルから選択される少なくとも1つの置換基で置換されており、少なくとも1つの置換基がハロゲンであり、それぞれ R^{11} が独立して、H、アミノ (NH_2) またはシアノであり、好ましくはHであり、WがOであり、 R^1 がH、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、イソブチル、s-ブチル、t-ブチルであり、好ましくはHまたはメチルであり、Qが C_1-C_4 -アルキル、2-オキソ-2-(2, 2, 2-トリフルオロエチル-アミノ)エチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、2, 2-ジフルオロ-エチル、3, 3, 3-トリフルオロプロピル、ピリジン-2-イルメチルもしくは(1-シアノシクロプロピル)メチル等の、フッ素で、または1-シアノプロピルで、またはピリジンで置換された C_1-C_4 -アルキル；シクロプロピルまたはシクロブチル等の C_3-C_4 -シクロアルキル；任意にフッ素で置換された C_1-C_4 -アルキル置換シクロプロピル（例えば、1-トリフルオロメチルシクロプロピル、1-tert-ブチルシクロプロピル）、1-チオカルバモイルシクロプロピル、1-カルバモイルシクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、トランス-2-フルオロ-シクロプロピル、シス-2-フルオロシクロプロピル等の任意に置換された C_3-C_4 -シクロアルキル；オキセタン-3-イル、チエタン-3-イル、1-オキシドチエタン-3-イルまたは1, 1-ジオキシドチエタン-3-イル等の C_4-C_6 -ヘテロシクロアルキル；またはいずれの場合も任意に C_1-C_4 -アルキルで置換されたベンジル；ピラゾール（N-メチルピラゾール-3-イル等）、ピリジン；メチルスルホニル；または2-オキソ-2-(2, 2, 2-トリフルオロエチルアミノ)エチル、好ましくは、2, 2, 2-トリフルオロエチルまたは3, 3, 3-トリフルオロプロピル等のフッ素で置換された C_1-C_3 -アルキル；シクロプロピル；1-シアノシクロプロピルまたは1-トリフルオロメチルシクロプロピル等の任意に置換されたシクロプロピル、チエタン-3-イル；または2-オキソ-2-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)-アミノエチルであり、 A_1 が CR^2 またはNであり、 A_2 が CR^3 またはNであり、 A_3 が CR^4 であり、 A_4 が CR^5 またはNであり、 R^2 がH、 C_1-C_4 -アルキルまたはハロゲン（メチル、F、ClもしくはH等）であり、 R^3 がHまたはハロゲン化 C_1-C_4 -アルキル（Hもしくは $-CF_3$ 等）であり、 R^4 がH、 C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキルアミン（ $-NH-CH_3$ 等）、シクロプロピルアミン、 C_1-C_4 -アルコキシ（ $-O-CH_3$ 等）、 C_1-C_4 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキルアミン（ $NH-CH_2-CH_2-O-CH_3$ 等）、ハロゲン（FまたはCl）である。さらに好ましい実施形態では、 R^6 および R^{10} が、それぞれハロゲン（Cl、Br、もしくはF等）であるか、それぞれ C_1-C_3 -アルキルであるか、またはそれぞれハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルキル、例えば、過フッ化 C_1-C_3 -アルキル（ペルフルオロメチル、ペルフルオロエチルもしくはペルフルオロプロピル）である。

【0540】

さらに好ましい実施形態は、式(I)の化合物に関し、式中、TがT2、T3、T4、T22、T23またはT46であり、B3がC-R8であり、R8が(C_1-C_6)-アルキル、(C_1-C_6)-アルコキシまたはアルキルスルファニルであり、そのそれぞれが置換されており、置換基がハロゲンおよびヒドロキシルから選択され、少なくとも1つの置換基がハロゲンであり、より好ましくは、式中、R8が過フッ化(C_1-C_6)-アルキル、(C_1-C_6)-アルコキシまたはアルキルスルファニルであり、最も好ましくは過フッ化(C_1-C_4)-アルキル、(C_1-C_4)-アルコキシであり、式中、 B_1 、 B_2 および B_4 が、それぞれ CR^6 、 CR^7 および CR^9 であり、 B_5 がNであり、式中、 R^6 、 R^7 および R^9 が、それぞれ独立して、H、ハロゲン、シアノ、ニトロまたは

10

20

30

40

50

C₁ - C₄ - アルキル、C₃ - C₄ - シクロアルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ、N - アルコキシイミノアルキル、C₁ - C₄ - アルキルスルファニル、C₁ - C₄ - アルキルスルフィニル、C₁ - C₄ - アルキルスルホニル、N - C₁ - C₄ - アルキルアミノ、N、N - ジ - C₁ - C₄ - アルキルアミノであり、そのそれぞれが、ハロゲンおよびヒドロキシルから選択される少なくとも1つの置換基で置換されており、少なくとも1つの置換基がハロゲンであり、それぞれ R¹ が独立して、H、アミノ (NH₂) またはシアノであり、好ましくはHであり、WがOであり、R¹ がH、メチル、エチル、n - プロピル、イソプロピル、n - ブチル、イソブチル、s - ブチル、t - ブチルであり、好ましくはHまたはメチルであり、QがC₁ - C₄ - アルキル、2 - オキソ - 2 - (2, 2, 2 - トリフルオロエチルアミノ) エチル、2, 2, 2 - トリフルオロエチル、2, 2 - ジフルオロエチル、3, 3, 3 - トリフルオロプロピル、ピリジン - 2 - イルメチルもしくは(1 - シアノ - シクロプロピル) メチル等の、フッ素で、または1 - シアノプロピルで、またはピリジンで置換されたC₁ - C₄ - アルキル；シクロプロピルまたはシクロブチル等のC₃ - C₄ - シクロアルキル；任意にフッ素で置換されたC₁ - C₄ - アルキル置換シクロプロピル（例えば、1 - トリフルオロメチルシクロプロピル、1 - tert - ブチルシクロプロピル）、1 - チオカルバモイルシクロプロピル、1 - カルバモイル - シクロプロピル、1 - シアノシクロプロピル、トランス - 2 - フルオロシクロプロピル、シス - 2 - フルオロシクロプロピル等の任意に置換されたC₃ - C₄ - シクロアルキル；オキセタン - 3 - イル、チエタン - 3 - イル、1 - オキシドチエタン - 3 - イルまたは1, 1 - ジオキシドチエタン - 3 - イル等のC₄ - C₆ - ヘテロ - シクロアルキル；またはいずれの場合も任意にC₁ - C₄ - アルキルで置換されたベンジル；ピラゾール (N - メチルピラゾール - 3 - イル等)、ピリジン；メチルスルホニル；または2 - オキソ - 2 - (2, 2, 2 - トリフルオロエチルアミノ) エチルであり、好ましくは、2, 2, 2 - トリフルオロエチルまたは3, 3, 3 - トリフルオロプロピル等のフッ素で置換されたC₁ - C₃ - アルキル；シクロプロピル；1 - シアノシクロプロピルまたは1 - トリフルオロメチルシクロプロピル等の任意に置換されたシクロプロピル、チエタン - 3 - イル；または2 - オキソ - 2 - (2, 2, 2 - トリフルオロエチル) アミノエチルであり、A₁ がCR² またはNであり、A₂ がCR³ またはNであり、A₃ がCR⁴ であり、A₄ がCR⁵ またはNであり、R² がH、C₁ - C₄ - アルキルまたはハロゲン (メチル、F、Cl、もしくはH等) であり、R³ がHまたはハロゲン化C₁ - C₄ - アルキル (Hもしくは - CF₃ 等) であり、R⁴ がH、C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - アルキルアミン (-NH-CH₃ 等)、シクロプロピルアミン、C₁ - C₄ - アルコキシ (-O-CH₃ 等)、C₁ - C₄ - アルコキシ - C₁ - C₄ - アルキルアミン (NH-CH₂-CH₂-O-CH₃ 等) またはハロゲン (FもしくはCl等) である。

10

20

30

【0541】

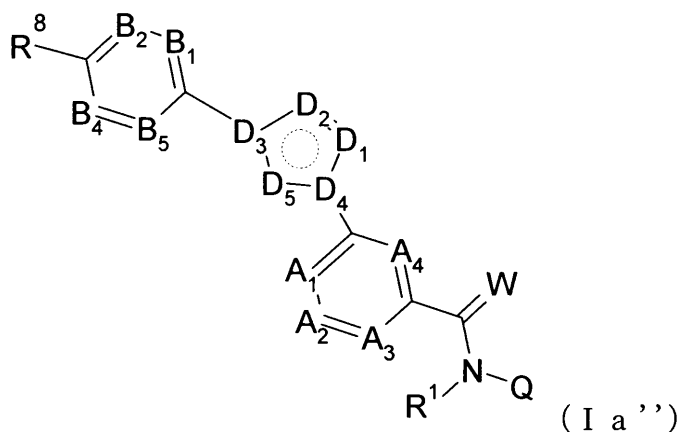
さらに好ましい実施形態では、R⁶ は過フッ化C₁ - C₃ - アルキル (例えば、ペルフルオロメチル) であり、R¹⁰ はCl、BrまたはFであり、より好ましくはClまたはBrである。

式 (I a ' ')

さらに好ましい実施形態は、式 (I a ' ') の化合物に関する：

40

【化 9 1】



10

(式中、D₁およびD₂から選択される一方のDがNであり、D₁およびD₂から選択されるそれぞれ他方のDがOである；またはD₄がNであり、D₁およびD₅から選択される一方のDがNである；またはD₃がNであり、D₁、D₂およびD₅がそれぞれC-R₁₁であり、D₄がCであり、すべての他のパラメータは段落〔12〕で定義される通りである。

さらに好ましい実施形態は、式(I a'')の化合物に関し、式中、R₈が(C₁-C₆)-アルキル、(C₁-C₆)-アルコキシまたはアルキルスルファニルであり、そのそれぞれが置換されており、置換基がハロゲンおよびヒドロキシルから選択され、少なくとも1つの置換基がハロゲンであり、D₁およびD₂から選択される一方のDがNであり、D₁およびD₂から選択されるそれぞれ他方のDがOである；またはD₄がNであり、D₁およびD₅から選択される一方のDがNである；またはD₃がNであり、D₁、D₂およびD₅がそれぞれC-R₁₁であり、D₄がCであり、すべての他のパラメータは段落〔12〕で定義される通りである)。

20

【0542】

好ましい実施形態では、1つ以下のB₁~B₅部分がNである(換言すると、1つのB₁~B₅がNである)；または、B₁~B₅がNではない(B₁~B₅がC-R⁶、C-R⁷、C-R⁸、C-R⁹およびC-R¹⁰である)。

30

【0543】

さらに好ましい実施形態では、R⁶、R⁷、R⁹およびR¹⁰(対応するB部分がC-Rである場合)は、それぞれ独立して、H、ハロゲン、シアノ、ニトロ、いずれの場合も任意に置換されたC₁-C₄-アルキル、C₃-C₄-シクロアルキル、C₁-C₄-アルコキシ、N-アルコキシイミノアルキル、C₁-C₄-アルキルスルファニル、C₁-C₄-アルキルスルフィニル、C₁-C₄-アルキルスルホニル、N-C₁-C₄-アルキルアミノ、N、N-ジ-C₁-C₄-アルキルアミノである。

【0544】

さらに好ましい実施形態では、R⁶、R⁷、R⁹およびR¹⁰が、それぞれ独立して、H、ハロゲン、シアノ、ニトロ、メチル、エチル、フルオロメチル、ジフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、トリフルオロメチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、メトキシ、エトキシ、n-プロポキシ、1-メチルエトキシ、フルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、ジクロロフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエトキシ、ペンタフルオロエトキシ、N-メトキシイミノメチル、1-(N-メトキシイミノ)エチル、メチルスルファニル、トリフルオロメチルスルファニル、メチルスルホニル、メチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルホニル、トリフルオロメチルスルフィニルである。

40

【0545】

さらに好ましい実施形態では、R⁶およびR¹⁰が、それぞれ独立して、H、ハロゲン

50

(特に塩素、臭素、フッ素)、シアノ、ニトロ、メチル、エチル、ジフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、1-メチルエトキシ、ジフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、ジクロロフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエトキシ、メチルスルファニル、トリフルオロメチルスルファニル、メチルスルホニル、メチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルホニル、トリフルオロメチルスルフィニルである。

【0546】

さらに好ましい実施形態では、 R^6 および R^{10} が、本明細書に記載される置換基であるが、1つの化合物の R^6 および R^{10} は、両方Hではない。換言すると、化合物の R^6 がHである場合、 R^{10} は、本明細書に記載される他の置換基のうちの1つであり、逆もまた同様である。

10

【0547】

さらに好ましい実施形態では、 R^6 および R^{10} が、それぞれ、ハロゲン（好ましくはCl、Br、もしくはF）、 C_1-C_3 -アルキル、ハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルキル、 C_1-C_3 -アルコキシまたはハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルコキシから選択される置換基である。

【0548】

さらに好ましい実施形態では、 R^6 および R^{10} が、それぞれハロゲン（Cl、Br、もしくはF等）であるか、それぞれ C_1-C_3 -アルキルであるか、またはそれぞれハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルキル、例えば、過フッ化 C_1-C_3 -アルキル（ペルフルオロメチル、ペルフルオロエチルもしくはペルフルオロプロピル）である。

20

【0549】

さらに好ましい実施形態では、 R^6 は過フッ化 C_1-C_3 -アルキル（例えば、ペルフルオロメチル）であり、 R^{10} はCl、BrまたはFであり、より好ましくはClまたはBrである。

【0550】

T46-メチル

さらに好ましい実施形態は、式(I)の化合物に関し、式中、 R^1 がメチルであり、TがT46であり、T46の R^{11} がHであり、WがOであり、すべての他のパラメータは段落[85] および段落[0113] ならびにそれ以降の段落で定義される通りである。

30

【0551】

さらに好ましい実施形態は、式(I)の化合物に関し、式中、 R^1 がメチルであり、TがT46であり、T46の R^{11} がHであり、WがOであり、 A_1 が CR^2 であり、 A_2 が CR^3 またはNであり、 A_3 が CR^4 であり、 A_4 が CR^5 であり、 B_1 が CR^6 であり、 B_2 が CR^7 であり、 B_3 が CR^8 であり、 B_4 が CR^9 であり、 B_5 が CR^{10} であり、すべての他のパラメータは段落[85] および段落[0113] ならびにそれ以降の段落で定義される通りである。

【0552】

さらに好ましい実施形態は、式(I)の化合物に関し、式中、 R^1 がメチルであり、TがT46であり、T46中の R^{11} がHであり、WがOであり、 A_1 がCHであり、 A_2 がCHまたはNであり、 A_3 が CR^4 であり、 A_4 がCHであり、 B_1 が CR^6 であり、 B_2 がCHであり、 B_3 が CR^8 であり、 B_4 がCHであり、 B_5 が CR^{10} であり、 R^6 および R^{10} が、それぞれ、ハロゲン（好ましくは塩素、臭素もしくはフッ素）、 C_1-C_3 -アルキル、ハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルキル、 C_1-C_3 -アルコキシまたはハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルコキシから選択される置換基であり、すべての他のパラメータは段落[85] および段落[0113] ならびにそれ以降の段落で定義される通りである。

40

【0553】

さらに好ましい実施形態は、式(I)の化合物に関し、式中、 R^1 がメチルであり、T

50

が T 4 6 であり、T 4 6 中の R^{11} が H であり、W が O であり、 A_1 が CH であり、 A_2 が CH または N であり、 A_3 が CR^4 であり、 A_4 が CH であり、 B_1 が CR^6 であり、 B_2 が CH であり、 B_3 が CR^8 であり、 B_4 が CH であり、 B_5 が CR^{10} であり、 R^6 および R^{10} が、それぞれ、ハロゲン（好ましくは塩素、臭素もしくはフッ素）、 C_1-C_3 -アルキル、ハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルキル、 C_1-C_3 -アルコキシまたはハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルコキシから選択される置換基であり、すべての他のパラメータは段落 [85] および段落 [0113] ならびにそれ以降の段落で定義される通りである。

【0554】

T 4 6 - H

さらに好ましい実施形態は、式 (I) の化合物に関し、式中、 R^1 が H であり、T が T 4 6 であり、T 4 6 中の R^{11} が H であり、W が O であり、すべての他のパラメータは段落 [85] および段落 [0112] で定義される通りである。

【0555】

さらに好ましい実施形態は、式 (I) の化合物に関し、式中、 R^1 が H であり、T が T 4 6 であり、T 4 6 の R^{11} が H であり、W が O であり、 A_1 が CR^2 であり、 A_2 が CR^3 または N であり、 A_3 が CR^4 であり、 A_4 が CR^5 であり、 B_1 が CR^6 であり、 B_2 が CR^7 であり、 B_3 が CR^8 であり、 B_4 が CR^9 であり、 B_5 が CR^{10} であり、すべての他のパラメータは段落 [85] および段落 [0113] ならびにそれ以降の段落で定義される通りである。

【0556】

さらに好ましい実施形態は、式 (I) の化合物に関し、式中、 R^1 が H であり、T が T 4 6 であり、T 4 6 中の R^{11} が H であり、W が O であり、 A_1 が CH であり、 A_2 が CH または N であり、 A_3 が CR^4 であり、 A_4 が CH であり、 B_1 が CR^6 であり、 B_2 が CH であり、 B_3 が CR^8 であり、 B_4 が CH であり、 B_5 が CR^{10} であり、 R^6 および R^{10} が、それぞれ、ハロゲン（好ましくは塩素、臭素もしくはフッ素）、 C_1-C_3 -アルキル、ハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルキル、 C_1-C_3 -アルコキシまたはハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルコキシから選択される置換基であり、すべての他のパラメータが、段落 [85] および段落 [0113] ならびにそれ以降の段落で定義される通りである。

【0557】

さらに好ましい実施形態は、式 (I) の化合物に関し、式中、 R^1 が H であり、T が T 4 6 であり、T 4 6 中の R^{11} が H であり、W が O であり、 A_1 が CH であり、 A_2 が CH または N であり、 A_3 が CR^4 であり、 A_4 が CH であり、 B_1 が CR^6 であり、 B_2 が CH であり、 B_3 が CR^8 であり、 B_4 が CH であり、 B_5 が CR^{10} であり、 R^6 および R^{10} が、それぞれ、ハロゲン（好ましくは塩素、臭素もしくはフッ素）、 C_1-C_3 -アルキル、ハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルキル、 C_1-C_3 -アルコキシまたはハロゲンで置換された C_1-C_3 -アルコキシから選択される置換基であり、すべての他のパラメータは段落 [85] および段落 [0113] ならびにそれ以降の段落で定義される通りである。

【0558】

さらなる実施形態は、式 (I - T 4 6) の化合物を対象とする：

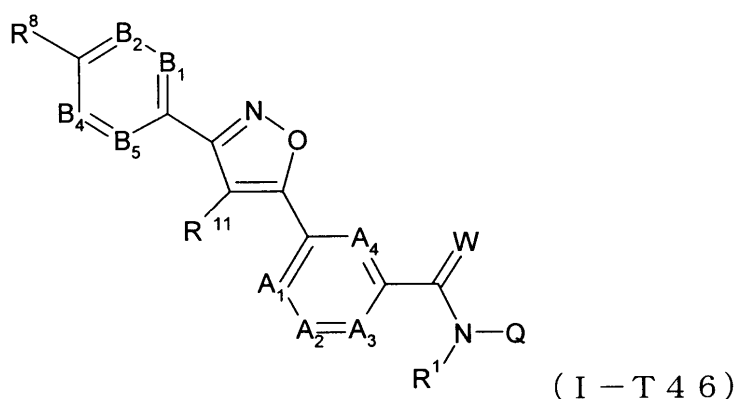
10

20

30

40

【化 9 2】



10

(式中、

R^1 、 A_1 、 A_2 、 A_3 、 A_4 、 R^{11} 、 B_1 、 B_2 、 B_4 、 B_5 、 R^8 、 R^{11} 、 Q および W は、それぞれ、本明細書に記載されるように定義され、 A_1 、 A_2 、 A_3 、 A_4 から選択される 1 つ以下の部分が N であり、かつ、 B_1 、 B_2 、 B_3 、 B_4 および B_5 から選択される 1 つ以下の部分が N であるか、または、 A_1 、 A_2 、 A_3 、 A_4 から選択される 1 つもしくは 2 つの部分が N であってもよく、かつ、 B_1 、 B_2 、 B_3 、 B_4 、および B_5 から選択される 1 つ以下の部分が N である)。

20

【0559】

さらなる実施形態は、式 (I-T 2)、(I-T 3)、(I-T 4)、(I-T 22)、(I-T 23) または (I-T 46) の化合物を対象とし、式中、 R^1 、 A_1 、 A_2 、 A_3 、 A_4 、 R^{11} 、 B_1 、 B_2 、 B_4 、 B_5 、 R^8 、 Q および W は、それぞれ段落 [0120] に記載される通りである。

【0560】

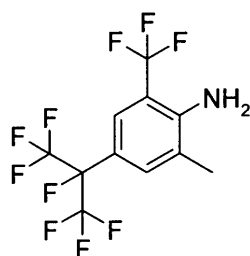
さらなる実施形態は、式 (I-T 2)、(I-T 3)、(I-T 4)、(I-T 22)、(I-T 23) または (I-T 46) の化合物を対象とし、式中、 R^1 、 A_1 、 A_2 、 A_3 、 A_4 、 R^{11} 、 B_1 、 B_2 、 B_4 、 B_5 、 R^8 、 Q および W は、それぞれ段落 [0121] に記載される通りである。

30

【0561】

さらに好ましい実施形態は、化合物 D-1a を対象とする。

【化 9 3】



D-1a

40

【0562】

さらなる実施形態は、式 (I) の化合物の調製のための化合物 D-1a の使用を対象とする。

【0563】

さらなる実施形態は、式 (I) の化合物を調製するためのプロセスを対象とし、好ましくは、式中、 $T = T4$ であり、化合物 D-1a の使用を含み、好ましくは反応スキーム 4

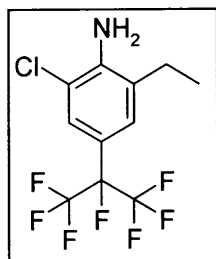
50

に一致する反応順序である。

【0564】

さらなる実施形態は、化合物 D-1b を対象とする。

【化94】



D-1b

10

【0565】

さらなる実施形態は、式 (I) の化合物の調製のための化合物 D-1b の使用を対象とする。

【0566】

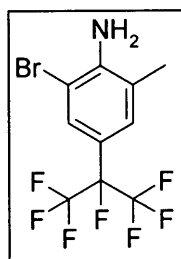
さらなる実施形態は、式 (I) の化合物を調製するためのプロセスを対象とし、好ましくは、式中、T = T4 であり、化合物 D-1b の使用を含み、好ましくは反応スキーム 4 に一致する反応順序である。

20

【0567】

さらなる実施形態は、化合物 D-1c を対象とする。

【化95】



D-1c

30

【0568】

さらなる実施形態は、式 (I) の化合物の調製のための化合物 D-1c の使用を対象とする。

【0569】

さらなる実施形態は、式 (I) の化合物を調製するためのプロセスを対象とし、好ましくは、式中、T = T4 であり、化合物 D-1c の使用を含み、好ましくは反応スキーム 4 に一致する反応順序である。

40

【0570】

さらなる実施形態は、化合物 2-(3, 5-ジクロロ-4-ヒドラジノフェニル)-1, 1, 1, 3, 3, 3-ヘキサフルオロプロパン-2-オールを対象とする。

【0571】

さらなる実施形態は、式 (I) の化合物の調製のための化合物 2-(3, 5-ジクロロ-4-ヒドラジノフェニル)-1, 1, 1, 3, 3, 3-ヘキサフルオロプロパン-2-オールの使用を対象とする。

50

【0572】

さらなる実施形態は、式（I）の化合物を調製するためのプロセスを対象とし、好ましくは、式中、T=T4であり、化合物2-（3，5-ジクロロ-4-ヒドラジノ-フェニル）-1，1，1，3，3，3-ヘキサフルオロプロパン-2-オールの使用を含み、好ましくは反応スキーム4に一致する反応順序である。

【実施例】

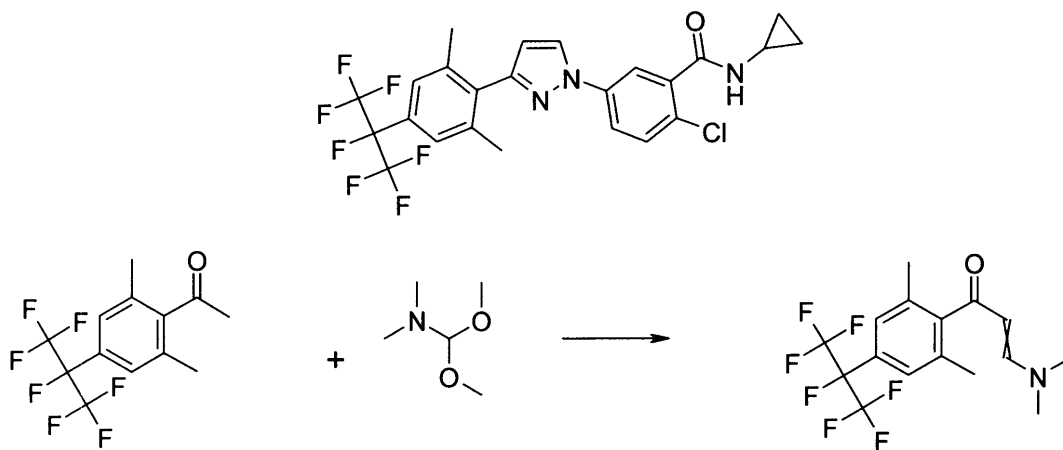
【0573】

実験

調製プロセスI-T2

実施例I-T2-1

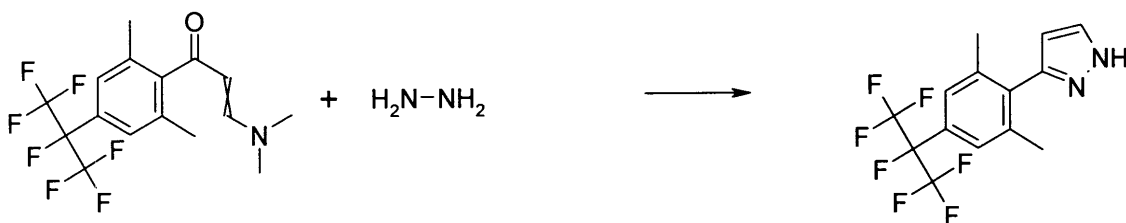
【化96】



【0574】

710 mg (2.24 mmol) の1-[2,6-ジメチル-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル]エタノンを401 mg (3.36 mmol) のN,N-ジメチルホルムアミドジメチルアセタールに添加し、この混合物を5時間加熱還流した。後処理として、この混合物を少し冷却し、すべての揮発性成分を減圧下のロータリーエバポレーター上で留去した。40 g のシリカゲルを含有するカートリッジを使用し、シクロヘキサン/酢酸エチルに90:10~50:50 (v/v) のグラジエントをかけて、残留物をクロマトグラフした。675 mg の3-(ジメチルアミノ)-1-[2,6-ジメチル-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル]プロパン-2-エン-1-オンを得た。

【化97】

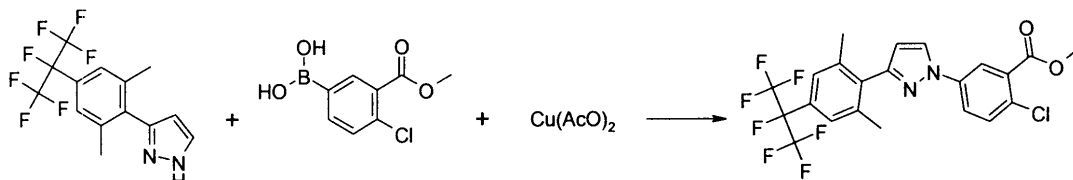


【0575】

1.2 g (3.23 mmol) の3-(ジメチルアミノ)-1-[2,6-ジメチル-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル]プロパン-2-エン-1-オンを15.5 ml のエタノールに添加し、170 mg (3.39 mmol) のヒドラジン水和物および192 mg (3.2 mmol) の氷酢酸を添加した。この混合物を室温で7時間攪拌した。次いで、さらに170 mg (3.39 mmol) のヒドラジン水和物を添加し、この混合物を室温でさらに4時間攪拌した。この変換

がまだ不完全であるため、さらに190mg (3.2mmol)の水酢酸を添加し、この混合物を60℃で17時間撹拌した。後処理として、この混合物を減圧下のロータリーエバポレーター上で濃縮し、残留物を酢酸エチルと水との間で分離した。有機相を除去し、水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させて、減圧下のロータリーエバポレーター上で濃縮した。残留物として、1.04gの(3-[2,6-ジメチル-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル]-1H-ピラゾールが残存した。

【化98】



10

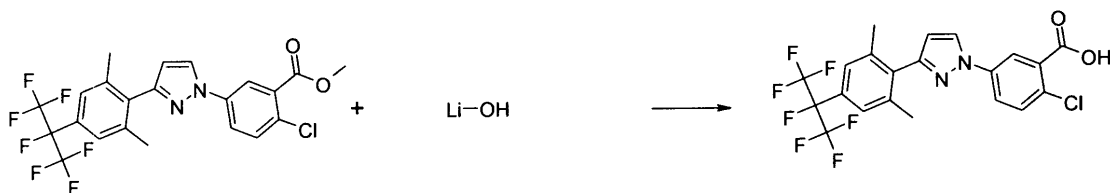
【0576】

23mlのジクロロメタン、353mg (4.46mmol)のピリジン、609mg (3.35mmol)の酢酸銅(II)、958mg (4.46mmol)の3-カルボキシメチル-4-クロロフェニルボロン酸および760mg (2.23mmol)の(3-[2,6-ジメチル-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル]-1H-ピラゾールを最初に充填し、次いで、1.1gの粉碎したばかりの(freshly ground) 3Å分子篩物を添加した。次いで、この混合物を室温で20時間撹拌した。後処理として、この混合物を珪藻土の層を通して濾過し、ジクロロメタンで洗浄した。この濾液を減圧下のロータリーエバポレーター上で濃縮した。精製のため、まず、40gのシリカゲルを含有するカートリッジを使用し、シクロヘキサン/酢酸エチルに95:5~75:25(v/v)のグラジエントをかけて、クロマトグラフィーを行った。生成物を含有する留分を濃縮して、溶離剤としてトルエンを含む40gのシリカゲルを含有する第2のカートリッジを使用してクロマトグラフした。濃縮後、628mgのメチル2-クロロ-5-[3-[2,6-ジメチル-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル]ピラゾール-1-イル]安息香酸塩を得た。

20

30

【化99】



【0577】

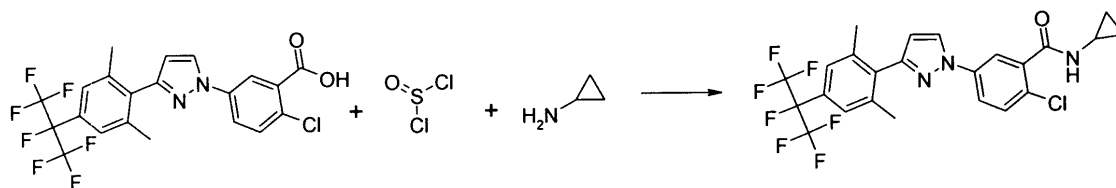
609mg (1.19mmol)のメチル2-クロロ-5-[3-[2,6-ジメチル-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル]ピラゾール-1-イル]安息香酸塩を、14mlのジオキサンと5mlの水との混合物に最初に充填し、53mg (1.25mmol)の水酸化リチウム水和物を添加して、この混合物を室温で撹拌した。2時間後、さらに25mg (0.6mmol)の水酸化リチウム水和物を添加し、この混合物を室温でさらに1時間撹拌した。その後、揮発性成分を減圧下のロータリーエバポレーター上で除去した。残留物を希塩酸とジクロロメタンとの間で分離した。有機相を除去し、水相をジクロロメタンで2回抽出した。次いで、混合した有機相を飽和塩化ナトリウム水溶液で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下のロータリーエバポレーター上で濃縮した。残留物として、554mgの2-クロロ-5-

40

50

[3-[2,6-ジメチル-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル]ピラゾール-1-イル]安息香酸を得た。

【化100】



10

【0578】

100mg (0.2mmol)の2-クロロ-5-[3-[2,6-ジメチル-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル]ピラゾール-1-イル]安息香酸を2mlの乾燥トルエンに最初に充填し、次いで、120mg (1mmol)の塩化チオニル(SOCl₂)および1滴のジメチルホルムアミド(DMF)を添加し、この混合物を加熱還流した。ガスの発生が終了した後、この混合物を還流しながらさらに30分間攪拌し、次いで、減圧下のロータリーエバポレーター上で濃縮した。残留物を1mlの乾燥ジクロロメタン中に溶解し、0℃で1mlのジクロロメタン中29mg (0.5mmol)のシクロプロピルアミンの溶液に滴下した。次いで、この混合物を室温で2時間攪拌した。後処理として、この混合物を5%炭酸水素ナトリウム水溶液上に注ぎ、有機相を除去し、飽和塩化ナトリウム水溶液で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下のロータリーエバポレーター上で濃縮した。精製のため、40gのシリカゲルを含有するカートリッジを使用し、シクロヘキサン/酢酸エチルに90:10~50:50(v/v)のグラジエントをかけて、クロマトグラフィーを行った。159.5mgの2-クロロ-N-シクロプロピル-5-[3-[2,6-ジメチル-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル]ピラゾール-1-イル]ベンズアミド(化合物I-T2-1)を得た。

20

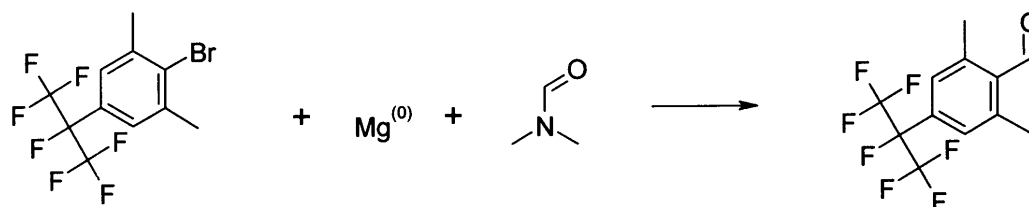
HPLC-MS^{a)}: log P = 4.9、質量(m/z) = 534 [M+H]⁺。

¹H NMR (400MHz, d₃-アセトニトリル): δ(ppm) = 8.29 (d, J = 2.5Hz, 1H)、7.82-7.85 (m, 2H)、7.52 (d, J = 8.8Hz, 1H)、7.44 (s, 2H)、6.97 (s (ブロード), 1H (N-H))、6.54 (d, J = 2.5Hz, 1H)、2.82-2.86 (m, 1H)、0.74-0.79 (m, 2H)、0.59-0.61 (m, 2H)。

30

出発化合物の調製:

【化101】



40

【0579】

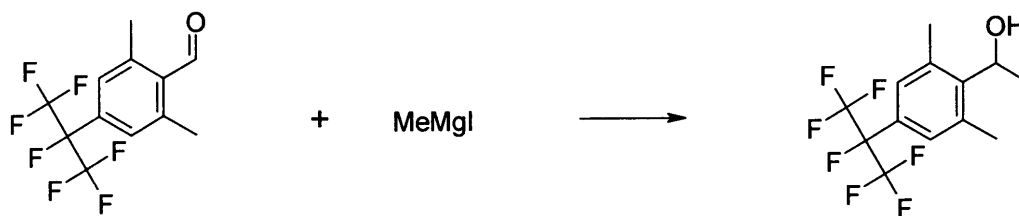
271mg (1.1mg原子)のマグネシウムターニングを最初に充填し、少量の乾燥テトラヒドロフランで被覆し、10mlの乾燥テトラヒドロフラン中3g (8.49mmol)の2-ブロモ-1,3-ジメチル-5-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]ベンゼン(米国特許第2003/187233号、6頁、実施例2/4[0080]に従って調製される)の溶液を数滴添加した後、少量のヨウ素を添加した。反応を開始するために、この混合物を60℃まで加熱した。反応が開始

50

した後、2-ブロモ-1,3-ジメチル-5-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]ベンゼンを含有する溶液の残りを60℃で滴下した。添加が終了した後、この混合物を60℃でさらに1時間攪拌した。その後、この混合物を氷浴で0℃まで冷却し、1.86g(25.4mmol)のN,N-ジメチルホルムアミドを5mlの乾燥テトラヒドロフラン中に溶解して、滴下した。次いで、この混合物が室温に達するまで、混合物を冷却せずに攪拌した。後処理として、この混合物を飽和塩化アンモニウム水溶液上に注いだ。この相を分離し、水相を酢酸エチルで抽出した。混合した有機相を飽和塩化ナトリウム水溶液で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下のロータリーエバポレーター上で濃縮した。残留物として、2.34gの2,6-ジメチル-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]ベンズアルデヒドが残存し、これを精製せずに次の段階で使用した。

10

【化102】



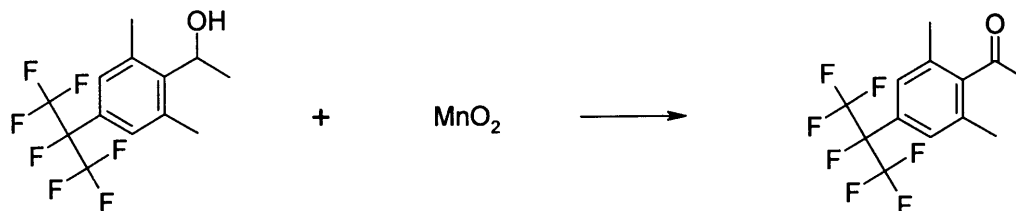
20

【0580】

2.34g(7.74mmol)の2,6-ジメチル-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]ベンズアルデヒドを15.5mlの乾燥テトラヒドロフランに最初に充填し、ジエチルエーテル中ヨウ化メチルマグネシウムの3M溶液2.58ml(7.74mmol)を氷浴で冷却しながら滴下した。その後、この混合物を冷却せずにさらに1時間攪拌した。後処理として、この混合物を100mlの飽和塩化アンモニウム水溶液上に注いだ。この混合物を酢酸エチルで2回抽出した。混合した有機相を飽和塩化ナトリウム水溶液で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下のロータリーエバポレーター上で濃縮した。シリカゲルを含有する40gのカートリッジを使用し、シクロヘキサン/酢酸エチルに90:10~70:30(v/v)のグラジエントをかけて、この残留物をクロマトグラフし、1.0gの1-[2,6-ジメチル-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル]エタノールを得た。

30

【化103】



40

【0581】

1.49g(4.68mmol)の1-[2,6-ジメチル-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル]エタノールを84mlのトルエンに最初に充填し、10.8g(124mmol)の酸化マンガン(IV)を添加した。この混合物を1時間攪拌しながら加熱還流した。この後、冷却、珪藻土の層を通した濾過、および酢酸エチルによる洗浄を行った。この濾液を減圧下のロータリーエバポレーター上で濃縮した。50gのシリカゲルを含有するカートリッジを使用し、シクロヘキサン/酢酸エチルに95:5~70:30(v/v)のグラジエントをかけて、残留物

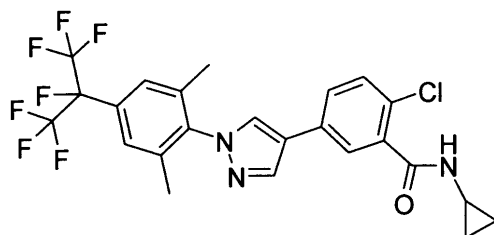
50

をクロマトグラフした。1. 03 g の 1- [2, 6-ジメチル-4- [1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1- (トリフルオロメチル) エチル] フェニル] エタノンを得た。

調製プロセス I-T 3

実施例 I-T 3-1 :

【化 104】

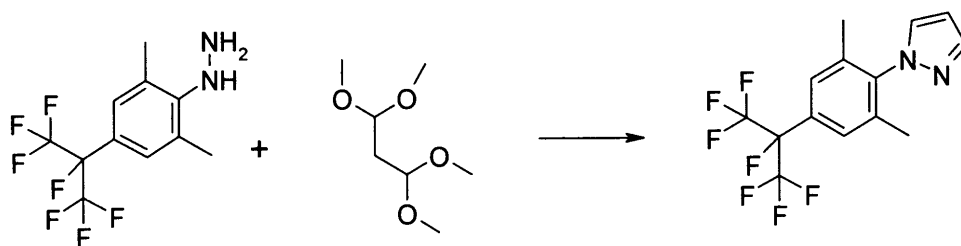


10

【0582】

前駆体 [2, 6-ジメチル-4- [1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1- (トリフルオロメチル) エチル] フェニル] ヒドラジンの調製は、文献 (米国特許第 2003/187233 号) に記載されている。

【化 105】



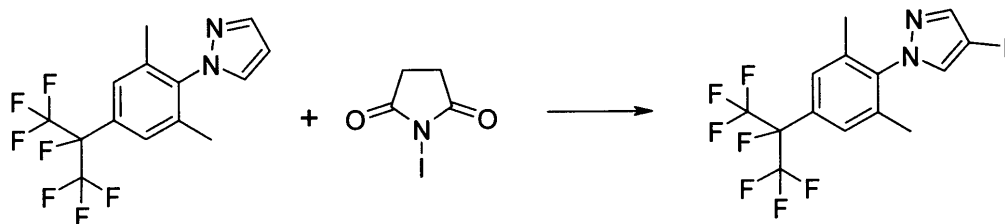
20

【0583】

25 ml フラスコに、13 ml のエタノール中 3.41 g (11.2 mmol) の [2, 6-ジメチル-4- [1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1- (トリフルオロメチル) エチル] フェニル] ヒドラジン (遊離塩基) を最初に充填した。次いで、1.84 g (11.2 mmol) のテトラメトキシプロパン、および続いて 0.55 g (5.6 mmol) の 96% 硫酸を添加した。この反応混合物を 2 時間加熱還流した。エタノールを減圧下のロータリーエバポレーター上で留去した。この残留物を酢酸エチルと飽和炭酸水素ナトリウム水溶液との間で分離した。有機相を除去し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下のロータリーエバポレーター上で濃縮した。この残留物を減圧下のクーゲルロールで、1 mbar および 150 °C で蒸留し、2.5 g の 1- [2, 6-ジメチル-4- [1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1- (トリフルオロメチル) エチル] フェニル] ピラゾールを得た。

30

【化 106】



40

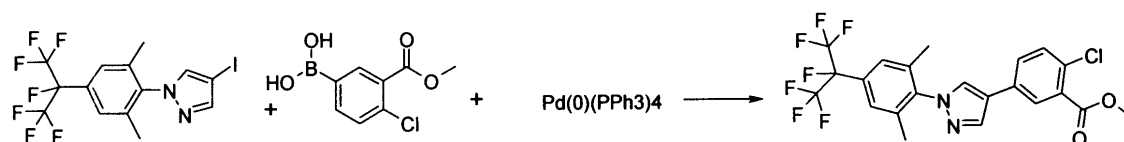
【0584】

250 ml フラスコに、30 ml のアセトニトリル中 2.5 g (7.34 mmol) の 1- [2, 6-ジメチル-4- [1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1- (トリフルオロ

50

メチル) エチル] フェニル] ピラゾールを最初に充填し、50 ml のアセトニトリル中 8.3 g (36.9 mmol) の N-ヨードスクシンイミドを滴下した。その後、この混合物を加熱還流した。後処理として、この混合物を濃縮し、残留物を水と酢酸エチルとの間で分離した。有機相を除去し、最初に飽和亜硫酸水素ナトリウム水溶液で、次いで飽和塩化ナトリウム溶液で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させて濃縮した。シクロヘキサン/酢酸エチルに 90:10~70:30 (v/v) のグラジエントをかけたシリカゲルを用いたクロマトグラフィーによって、この残留物を精製した。生成物を含有する留分の濃縮後、1-[2, 6-ジメチル-4-[1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル) エチル] フェニル]-4-ヨードピラゾールおよび多少のトルエンで構成される 2.5 g の残留物を得た。

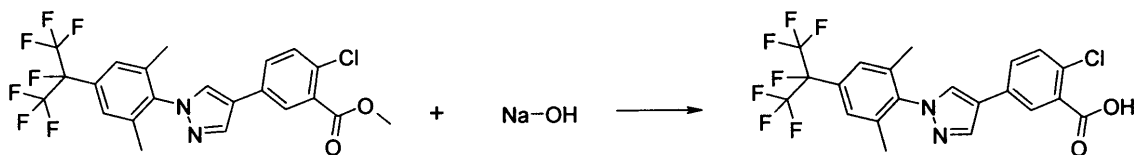
【化 107】



【0585】

100 ml フラスコに、21 ml のイソプロパノール中 280 mg (0.6 mmol) の 1-[2, 6-ジメチル-4-[1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル) エチル] フェニル]-4-ヨードピラゾールおよび 0.129 g (0.60 mmol) の [4-クロロ-3-(メトキシカルボニル) フェニル] ボロン酸を最初に充填し、最後に 1.84 ml (1.84 mmol) の脱気した 1 モル炭酸水素ナトリウム溶液を添加した。0.035 g (0.03 mmol) のテトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(0)を添加した。次いで、この混合物を加熱還流した。後処理として、この混合物をロータリーエバポレーター上で濃縮し、残留物を水と酢酸エチルとの間で分離した。有機相を除去し、飽和塩化ナトリウム溶液で 1 回洗浄し、減圧下のロータリーエバポレーター上で濃縮した。シクロヘキサン/酢酸エチルに 90:10~70:30 (v/v) のグラジエントをかけたシリカゲルを用いたクロマトグラフィーによって、この残留物を精製し、151 mg のメチル 2-クロロ-5-[1-[2, 6-ジメチル-4-[1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル) エチル] フェニル] ピラゾール-4-イル] 安息香酸塩を得た。

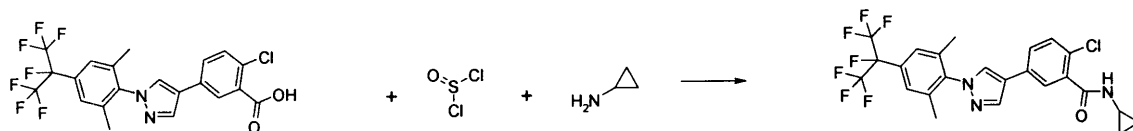
【化 108】



【0586】

0.151 g (0.29 mmol) のメチル 2-クロロ-5-[1-[2, 6-ジメチル-4-[1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル) エチル] フェニル] ピラゾール-4-イル] 安息香酸塩を 11 ml のメタノールに最初に充填し、0.3 ml (0.3 mmol) の 1 M 水酸化ナトリウム溶液を添加した。その後、この混合物を 6 時間加熱還流し、過剰な溶媒を減圧下で留去し、残留物を希塩酸に取り込み、酢酸エチルで 3 回抽出した。混合した抽出物を飽和塩化ナトリウム溶液で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させて濃縮し、130 mg の 2-クロロ-5-[1-[2, 6-ジメチル-4-[1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル) エチル] フェニル] ピラゾール-4-イル] 安息香酸を得た。

【化 1 0 9】



【0 5 8 7】

0.134 g (0.27 mmol) の 2-クロロ-5-[1-[2,6-ジメチル-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル]ピラゾール-4-イル]安息香酸を 1.26 ml のトルエン中に溶解し、0.161 g (1.35 mmol) の塩化チオニルを添加した。この混合物を 80℃まで 2 時間かけて加熱した。その後、これを減圧下で濃縮した。この残留物を 1.26 ml のジクロロメタン中に溶解し、0℃で冷却しながら 0.63 ml のジクロロメタン中 39 mg (0.67 mmol) のシクロプロピルアミンの溶液に滴下し、溶液を冷却した。後処理として、5%リン酸二水素ナトリウム水溶液を添加し、有機相を除去し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下のロータリーエバポレーター上で濃縮した。この残留物をシリカゲルで、シクロヘキサン/酢酸エチルに 9:1~7:3 (v/v) のグラジエントをかけて分離し、46 mg の 2-クロロ-N-シクロプロピル-5-[1-[2,6-ジメチル-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル]ピラゾール-4-イル]ベンズアミド (化合物 I-T3-1) を得た。

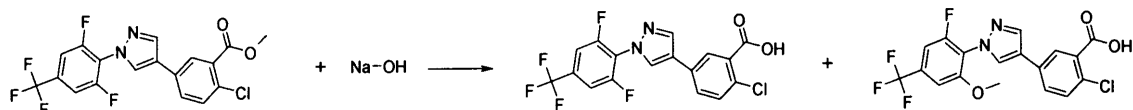
HPLC-MS^{a)}: log P = 4.36、質量 (m/z) = 534 [M+H]⁺。

¹H NMR (400 MHz、d₃-アセトニトリル): δ = 8.11 (s、1H)、8.06 (s、1H)、7.68 (d、J₁ = 2.2 Hz、1H)、7.62-7.65 (dd、J₁ = 8.4 Hz、J₂ = 2.2 Hz、1H)、7.45 (d、J = 8.4 Hz、1H)、6.9 (s (ブロード)、1H (N-H))、3.97 (s、3H)、2.82-2.88 (m、1H)、0.76-0.8 (m、2H)、0.57-0.61 (m、2H)。

【0 5 8 8】

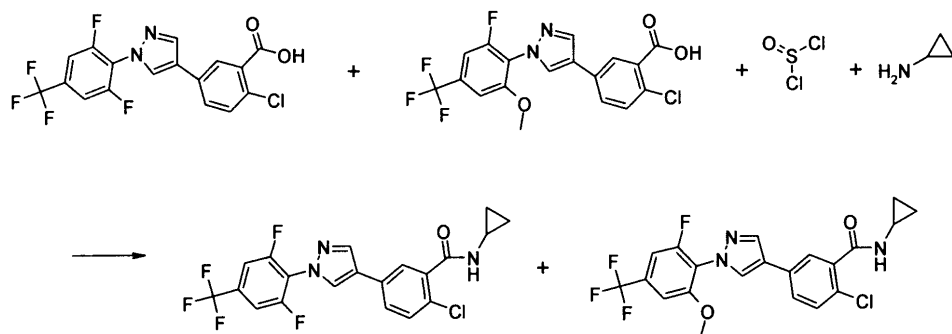
実施例 I-T3-48 および I-T3-50

【化 1 1 0】



2.46 g (5.9 mmol) のメチル 2-クロロ-5-[1-[2,6-ジフルオロ-4-(トリフルオロメチル)フェニル]ピラゾール-4-イル]安息香酸塩を 127 ml のメタノールに最初に充填し、5.9 mg (5.9 mmol) の 1 モル水酸化ナトリウム溶液を添加した。この混合物を 2 時間加熱還流した。その後、この混合物を冷却し、メタノールの大部分を減圧下のロータリーエバポレーター上で除去した。水性残留物をジクロロメタンで抽出した。この抽出物を処分した。水相を 33%塩酸で pH 1 に設定し、ジクロロメタンで 2 回抽出した。混合した抽出物を飽和塩化ナトリウム水溶液で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濃縮した。2-クロロ-5-[1-[2,6-ジフルオロ-4-(トリフルオロメチル)フェニル]ピラゾール-4-イル]安息香酸および 2-クロロ-5-[1-[2-フルオロ-6-メトキシ-4-(トリフルオロメチル)フェニル]ピラゾール-4-イル]安息香酸の 45:55 (LC-MS 面積) 混合物である、1.41 g の残留物を得た。

【化 1 1 1】



10

【0589】

2-クロロ-5-[1-[2,6-ジフルオロ-4-(トリフルオロメチル)フェニル]ピラゾール-4-イル]安息香酸および2-クロロ-5-[1-[2-フルオロ-6-メトキシ-4-(トリフルオロメチル)フェニル]ピラゾール-4-イル]安息香酸の700mg(約1.7mmol)の45:55(LC-MS面積)混合物を6.6mlのトルエン中に溶解し、1.34g(8.7mmol)の塩化チオニルを添加した。この混合物を80℃まで2時間かけて加熱した。その後、すべての揮発性成分を減圧下のロータリーエバポレーター上で除去した。この残留物を3.3mlのジクロロメタン中に溶解し、0℃で3.3mlのジクロロメタン中248mg(4.34mmol)のシクロプロピルアミンの溶液に滴下した。次いで、この混合物を冷却せずに2時間攪拌した。その後、この溶液を5%リン酸二水素ナトリウム水溶液で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濃縮した。40gのシリカゲルを含有するカートリッジを使用し、シクロヘキサン/酢酸エチルに90:10~50:50(v/v)のグラジエントをかけて、残留物をクロマトグラフした。240mgの2-クロロ-N-シクロプロピル-5-[1-[2,6-ジフルオロ-4-(トリフルオロメチル)フェニル]ピラゾール-4-イル]ベンズアミド(実施例I-T3-48)

20

HPLC-MS^{a)}: log P=3.2、質量(m/z)=442[M+H]⁺。

¹H NMR(400MHz, d₃-アセトニトリル): δ(ppm)=8.26(s, 1H)、8.19(s, 1H)、7.61-7.69(m, 4H)、7.46(d, J=8.3Hz, 1H)、6.94(s, 1H(ブロード))、2.82-2.88(m, 1H)、0.75-0.80(m, 2H)、0.58-0.62(m, 2H)。

30

また、2-クロロ-N-シクロプロピル-5-[1-[2-フルオロ-6-メトキシ-4-(トリフルオロメチル)フェニル]ピラゾール-4-イル]ベンズアミド(実施例I-T3-50)を得た。

HPLC-MS^{a)}: log P=3.1、質量(m/z)=454[M+H]⁺。

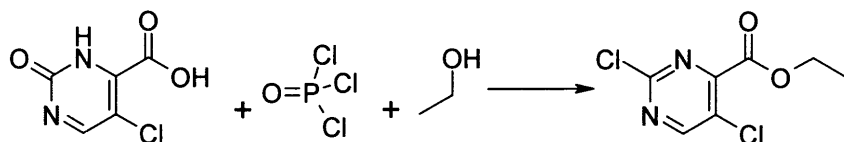
¹H NMR(400MHz, d₃-アセトニトリル): δ(ppm)=8.13(s, 1H)、8.11(s, 1H)、7.67(d, J=2.2Hz, 1H)、7.62(dd, J₁=8.3Hz, J₂=2.2Hz, 1H)、7.45(d, J=8.3Hz, 1H)、7.32(s, 1H)、7.30(s, 1H)、6.91(s, 1H(ブロード))、3.90(s, 3H)、2.83-2.87(m, 1H)、0.75-0.79(m, 2H)、0.57-0.61(m, 2H)。

40

【0590】

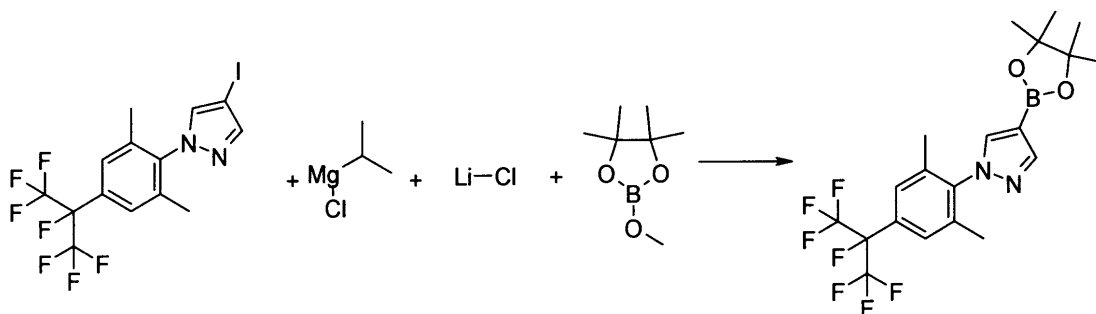
実施例I-T3-121:

【化 1 1 2】



4. 6 ml (49.6 mmol) のオキシ塩化リンを最初に充填し、1.3 g (7.4 mmol) の 5-クロロ-2-オキソ-1H-ピリミジン-6-カルボン酸（市販のものか、または文献（例えば、Gacek, Michel; Ongstad, Leif; U
ndheim, Kjell; Acta Chemica Scandinavica, Series B: Organic Chemistry and Biochemistry B33 (2), (1979), p. 150-1) から既知の方法で調製することができる）を導入した。この混合物を徐々に加熱し、還流しながら2時間保持した。その後、この混合物を少し冷却し、過剰なオキシ塩化リンを減圧下のロータリーエバポレーター上で除去した。20 ml の乾燥エタノールをこの残留物に添加し、次いで、混合物を室温で一晩攪拌した。その後、過剰なエタノールを減圧下のロータリーエバポレーター上で除去した。この残留物をジクロロメタン中に取り込み、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液で3回洗浄した。水相をジクロロメタンで再度抽出し、次いで、混合した有機相を飽和塩化ナ
トリウム水溶液で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下のロータリーエバポレーター上で濃縮した。15 g のシリカゲルを含有するカートリッジを使用し、シクロヘキサン／酢酸エチルに純粋なシクロヘキサン～50：50 (v/v) のグラジエントをかけて、この残留物をクロマトグラフし、115 mg のエチル 2, 5-ジクロロピリミジン-4-
カルボン酸塩を得た。

【化 1 1 3】

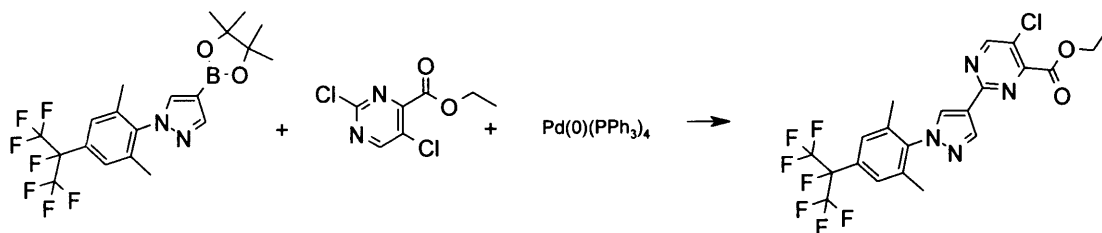


【0 5 9 1】

ベークアウト (baked-out) 25 ml の三口フラスコに、i-プロピル塩化マグネシウム／塩化リチウムの複合体の1.3モル溶液5.94 ml (7.72 mmol) を最初に充填し、3.4 ml の乾燥テトラヒドロフラン中4-ヨード-1-[2-メチル-4-[1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]-6-(トリフルオロメチル)フェニル]ピラゾール（調製に関しては、実施例 I-T3-1 を参照されたい）の溶液を滴下した。混合物の攪拌を室温で一晩継続し、次いで、混合物を-20℃に冷却し、1.63 g (10.2 mmol) の2-メトキシ-4, 4, 5, 5-テトラメチル-1, 3, 2-ジオキサボロランを滴下した。混合物を0～10℃でさらに1時間攪拌した。後処理として、この混合物を30 ml の飽和塩化アンモニウム水溶液上に注ぎ、シクロヘキサンで希釈した。相を分離し、水相をシクロヘキサンで再度抽出した。混合した有機相を、最初に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液で、次いで飽和塩化ナトリウム水溶液で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下のロータリーエバポレーター上で濃縮した。シリカゲルを含有する40 g のカートリッジを使用して、シクロヘキサン／酢酸エチルに純粋なシクロヘキサン～80：20 (v/v) のグラジエントをかけたクロ

マトグラフィーの後、0.6 g の 1- [2, 6-ジメチル-4- [1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1- (トリフルオロメチル) エチル] フェニル] -4- (4, 4, 5, 5-テトラメチル-1, 3, 2-ジオキサボロラン-2-イル) ピラゾールを得た。

【化 1 1 4】



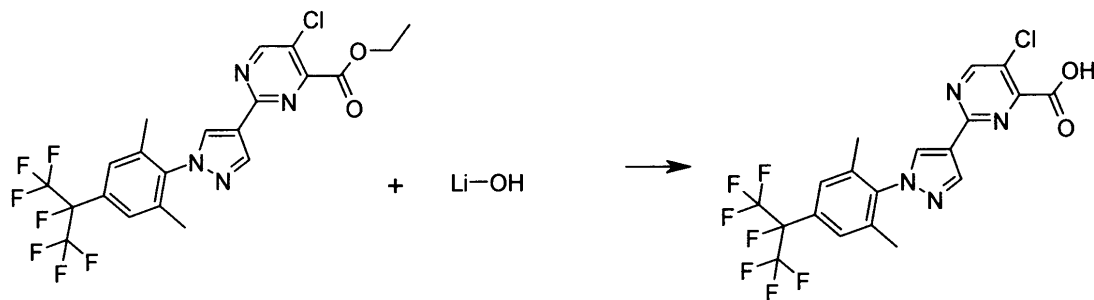
10

【0 5 9 2】

25 ml のジオキサン中 155 mg (0.7 mmol) のエチル 2, 5-ジクロロピリミジン-4-カルボン酸塩および 327 mg (0.7 mmol) の 1- [2, 6-ジメチル-4- [1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1- (トリフルオロメチル) エチル] フェニル] -4- (4, 4, 5, 5-テトラメチル-1, 3, 2-ジオキサボロラン-2-イル) ピラゾールを最初に充填し、234 mg (2.2 mmol) の炭酸ナトリウムおよび 1.25 ml の水を添加した。この混合物をアルゴンで脱気し、次いで、81 mg (0.07 mmol) のテトラキス (トリフェニルホスフィン) パラジウム (0) を添加した。この混合物を再度アルゴンで 1 回脱気し、100 °C で一晩撹拌した。翌朝、この混合物を冷却し、溶媒を減圧下のロータリーエバポレーター上で除去した。残留物を水と酢酸エチルとの間で分離した。有機相を除去し、飽和塩化ナトリウム水溶液で 1 回洗浄し、次いで、減圧下のロータリーエバポレーター上で濃縮した。精製のため、15 g のシリカゲルを含有するカートリッジおよびシクロヘキサン/酢酸エチルに純粋なシクロヘキサンから 70 : 30 (v/v) の混合物までのグラジエントをかけてクロマトグラフィーを行った。120 mg のエチル 5-クロロ-2- [1- [2, 6-ジメチル-4- [1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1- (トリフルオロメチル) エチル] フェニル] ピラゾール-4-イル] ピリミジン-4-カルボン酸塩を得た。

20

【化 1 1 5】



30

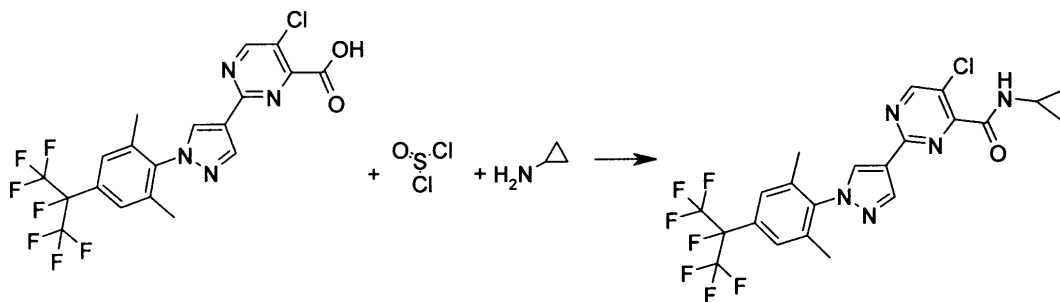
【0 5 9 3】

0.120 g (0.23 mmol) のエチル 5-クロロ-2- [1- [2, 6-ジメチル-4- [1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1- (トリフルオロメチル) エチル] フェニル] ピラゾール-4-イル] ピリミジン-4-カルボン酸塩を 4.1 ml のジオキサンと 1.44 ml の水との混合物に最初に充填し、31 mg (0.74 mmol) の水酸化リチウム水和物を添加した。その後、この混合物を室温で 4 時間撹拌し、次いで、過剰な溶媒を減圧下で留去し、残留物を希塩酸に取り込み、ジクロロメタンで 3 回抽出した。混合した抽出物を飽和塩化ナトリウム水溶液で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させて濃縮し、115 mg の粗 5-クロロ-2- [1- [2, 6-ジメチル-4- [1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1- (トリフルオロメチル) エチル] フェニル] ピラゾール-4-イル] ピリミジン-4-カルボン酸を得た。

40

50

【化 1 1 6】



10

【0 5 9 4】

0.110 g (0.22 mmol) の粗 5-クロロ-2-[1-[2,6-ジメチル-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル]ピラゾール-4-イル]ピリミジン-4-カルボン酸を 2 ml のトルエン中に溶解し、0.132 g (1.1 mmol) の塩化チオニルおよび 1 滴のジメチルホルムアミドを添加した。この混合物を 80℃まで 2 時間かけて加熱した。その後、これを減圧下で濃縮した。この残留物を 1 ml のジクロロメタン中に溶解し、冷却しながら 0℃で 1 ml のジクロロメタン中 32 mg (0.55 mmol) のシクロプロピルアミンの溶液に滴下し、次いで、この混合物を冷却せずに 2 時間撹拌した。後処理として、5%リン酸二水素ナトリウム水溶液を添加し、有機相を除去し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下のロータリーエバポレーター上で濃縮した。15 g のシリカゲルを含有するカートリッジを使用し、シクロヘキサン/酢酸エチルに 9:1~7:3 (v/v) のグラジエントをかけて、この残留物を分離し、49 mg の 5-クロロ-N-シクロプロピル-2-[1-[2,6-ジメチル-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル]ピラゾール-4-イル]ピリミジン-4-カルボキサミド (化合物 I-T3-121) を得た。

20

HPLC-MS^{a)}: log P = 4.5、質量 (m/z) = 536 [M+H]⁺。

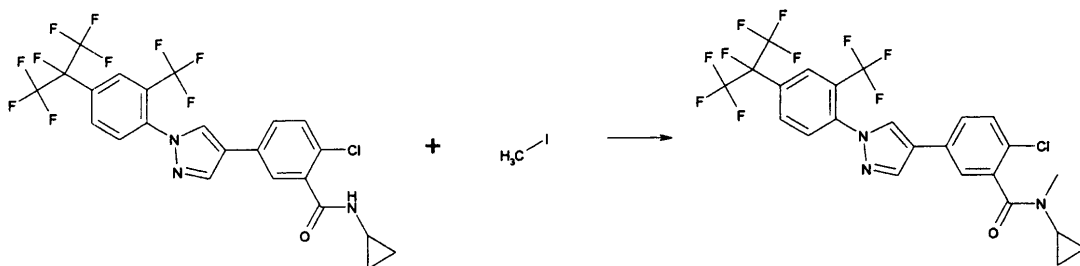
¹H NMR (400 MHz, d₃-アセトニトリル): δ (ppm) = 8.84 (s, 1H)、8.46 (s, 1H)、8.44 (s, 1H)、7.87 (s, 1H (ブロード))、7.55 (s, 2H)、2.84-2.91 (m, 1H)、2.2 (s, 6H)、0.79-0.83 (m, 2H)、0.64-0.68 (m, 2H)。

30

実施例 I-T3-134:

【0 5 9 5】

【化 1 1 7】



40

2 ml の乾燥テトラヒドロフラン中 6.5 mg (0.163 mmol) の水素化ナトリウム (鉱油中 60%) の 0℃に冷却した混合物に、49.3 mg (0.08 mmol) の 2-クロロ-N-シクロプロピル-5-{1-[4-(1,1,1,2,3,3,3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル)-2-(トリフルオロメチル)フェニル]-1H-ピラゾール-4-イル}ベンズアミドを添加した。30 分後、35 mg (0.24 mmol) のヨウ化メチルを添加し、この混合物を 0℃で 1 時間撹拌し、次いで、1 時間かけて室温まで温め、室温でさらに 14 時間撹拌した。その後、この混合物を水に添加し、酢酸エ

50

チルで抽出し、有機相を硫酸ナトリウム上で乾燥させ、溶媒を減圧下で除去した。溶離剤として水／アセトニトリル（グラジエント）を含む逆相シリカゲル（C18）を用いたクロマトグラフィーによって残留物を精製した。40.0 mg（0.068 mmol、78%）の2-クロロ-N-シクロプロピル-5-[5-[2,6-ジクロロ-4-[1,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル]イソキサゾール-3-イル]ベンズアミド（化合物I-T3-134）を得た。

HPLC-MS^{a)} : log P = 4.88、質量 (m/z) = 588 [M+H]⁺。

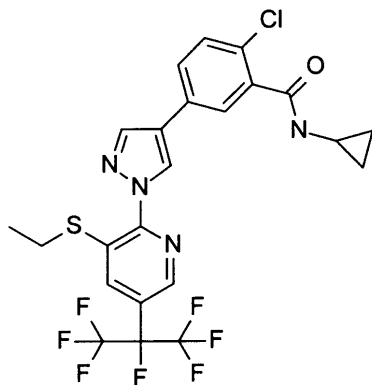
¹H NMR (400 MHz, d₆-DMSO) : δ (ppm) = 8.82 (s, 1H)、8.43 (s, 1H)、8.25 (d, 1H)、8.11 (d, 1H)、8.06 (d, 1H)、7.81 (d, 1H)、7.75 (m, 1H)、7.54 (d, 1H)、3.02 (s, 3H)、2.72 (m, 1H)、0.55 (m, 2H)、0.46 (m, 2H)。

【0596】

実施例 I-T3-156 :

2-クロロ-N-シクロプロピル-5-{1-[3-(エチルスルファニル)-5-(1,1,1,2,3,3,3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル)ピリジン-2-イル]-1H-ピラゾール-4-イル}ベンズアミド

【化118】



【0597】

2-(4-ブロモ-1H-ピラゾール-1-イル)-3-クロロ-5-(1,1,1,2,3,3,3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル)ピリジン

1.0 g (3.16 mmol) の2,3-ジクロロ-5-(1,1,1,2,3,3,3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル)ピリジンを、10.0 ml のジメチルホルムアミド p. a. 中 0.51 g (3.48 mmol) の4-ブロモ-1H-ピラゾールおよび 2.58 g (7.91 mmol) の炭酸セシウムの懸濁液に滴下した。反応物を室温で3時間攪拌した。次いで、反応混合物を酢酸エチルで希釈し、準飽和塩化アンモニウム水溶液で洗浄した。次いで、水相を酢酸エチルで繰り返し抽出し、その後、混合した有機相を蒸留水および飽和塩化ナトリウム溶液で洗浄した。有機相を硫酸マグネシウム上で乾燥させ、濾過し、減圧下のロータリーエバポレーター上で濃縮した。粗生成物をシリカゲル上でのカラムクロマトグラフィーによって精製した。

【0598】

これにより、無色油である、1.34 g (3.14 mmol) の2-(4-ブロモ-1H-ピラゾール-1-イル)-3-クロロ-5-(1,1,1,2,3,3,3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル)ピリジンを得た。

HPLC-MS^{a)} : log P = 4.74、質量 (m/z) = 428 [M+H]⁺。

¹H NMR (400 MHz, D₆-DMSO) : 8.90 (s, 1H)、8.67 (s, 1H)、8.63 (d, 1H)、8.06 (s, 1H)。

【0599】

2-クロロ-5-{1-[3-クロロ-5-(1, 1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル)ピリジン-2-イル]-1H-ピラゾール-4-イル}-N-シクロプロピルベンズアミド

150mg (0.35mmol) の2-(4-ブロモ-1H-ピラゾール-1-イル)-3-クロロ-5-(1, 1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル)ピリジン、136mg (0.42mmol) の2-クロロ-N-シクロプロピル-5-(4, 4, 5, 5-テトラメチル-1, 3, 2-ジオキサボロラン-2-イル)ベンズアミド、59mg (0.70mmol) の炭酸水素ナトリウム、および20mg のテトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(0.01mmol)を1.5ml のジオキサソと0.5ml の蒸留水との混合物中に溶解した。アルゴンガスを溶媒に通すことによって、溶媒を使用前に約30分間アルゴンで飽和した。この反応混合物を16時間かけて100℃まで油浴中で加熱した。この反応混合物を室温まで冷却した後、混合物を水と混ぜ、粗生成物を酢酸エチルで繰り返し抽出した。混合した有機相を硫酸マグネシウム上で乾燥させ、シリカゲルを通して濾過した。溶媒を減圧下のロータリーエバポレーター上で除去した。粗生成物をシリカゲル上でのカラムクロマトグラフィーによって精製した。

10

【0600】

これにより、無色固体である、25mg (0.05mmol) の2-クロロ-5-{1-[3-クロロ-5-(1, 1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル)ピリジン-2-イル]-1H-ピラゾール-4-イル}-N-シクロプロピルベンズアミドを得た。

20

HPLC-MS^{a)}: log P = 4.08、質量(m/z) = 541 [M+H]⁺.

¹H NMR (400MHz, D₆-DMSO): 9.02 (s, 1H)、8.89 (s, 1H)、8.61 (d, 1H)、8.54-8.52 (m, 1H)、8.50 (s, 1H)、7.83-7.81 (m, 2H)、7.52 (d, 1H)、2.87-2.81 (m, 1H)、0.74-0.65 (m, 2H)、0.60-0.50 (m, 2H)

【0601】

2-クロロ-N-シクロプロピル-5-{1-[3-(エチルスルファニル)-5-(1, 1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル)ピリジン-2-イル]-1H-ピラゾール-4-イル}ベンズアミド

300mg (0.55mmol) の2-クロロ-5-{1-[3-クロロ-5-(1, 1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル)ピリジン-2-イル]-1H-ピラゾール-4-イル}-N-シクロプロピルベンズアミドを5.0ml のDMF a b s中に溶解し、乾燥水/アセトン浴で冷却した。冷却した反応混合物に、5ml のDMF a b s中81.6mg (0.97mmol) のナトリウムエタンチオラートの溶液を滴下した。3時間後、この反応混合物を室温まで温め、ゆっくりと水に注いだ。粗生成物を酢酸エチルで繰り返し抽出した。混合した有機相を飽和塩化ナトリウム水溶液で洗浄し、硫酸マグネシウム上で乾燥させ、濾過し、減圧下のロータリーエバポレーター上で濃縮した。粗生成物をシリカゲル上でのカラムクロマトグラフィーによって精製した。

30

【0602】

これにより、無色固体である、226mg (0.40mmol) の2-クロロ-N-シクロプロピル-5-{1-[3-(エチルスルファニル)-5-(1, 1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル)ピリジン-2-イル]-1H-ピラゾール-4-イル}ベンズアミドを得た。

40

HPLC-MS^{a)}: log P = 4.69、質量(m/z) = 567 [M+H]⁺.

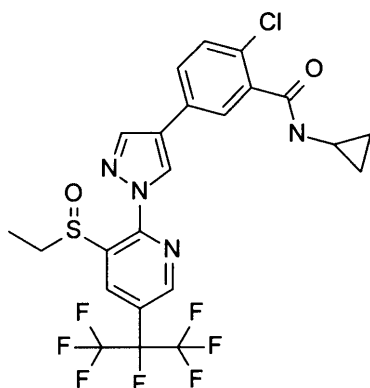
¹H NMR (400MHz, D₆-DMSO): 9.08 (d, 1H)、8.59 (d, 1H)、8.53 (d, 1H)、8.47 (s, 1H)、8.02 (d, 1H)、7.85-7.82 (m, 2H)、7.53-7.50 (m, 1H)、3.08 (q, 2H)、2.87-2.81 (m, 1H)、1.22 (t, 3H)、0.74-0.69 (m, 2H)、0.58-0.54 (m, 2H)。

【0603】

50

実施例 I - T 3 - 1 5 7 :

2-クロロ-N-シクロプロピル-5- { 1 - [3 - (エチルスルフィニル) - 5 - (1 , 1 , 1 , 2 , 3 , 3 , 3 -ヘプタフルオロプロパン-2-イル) ピリジン-2-イル] - 1 H-ピラゾール-4-イル } ベンズアミド
【化 1 1 9】



10

100 mg (0.17 mmol) の 2-クロロ-N-シクロプロピル-5- { 1 - [3 - (エチルスルフィニル) - 5 - (1 , 1 , 1 , 2 , 3 , 3 , 3 -ヘプタフルオロプロパン-2-イル) ピリジン-2-イル] - 1 H-ピラゾール-4-イル } ベンズアミドを 10.0 ml のジクロロメタン中に溶解し、氷浴で冷却した。43.5 mg の 3-クロロ過安息香酸を少しずつ添加した。この反応混合物を氷で冷却しながら 2 時間攪拌した。この反応混合物を 5 ml の 1 N 水酸化ナトリウム溶液と混ぜた。5 分後、水相を除去した。過酸化物を確認した後、有機相を減圧下のロータリーエバポレーター上で濃縮した。粗生成物をシリカゲル上でのカラムクロマトグラフィーによって精製した。

20

【0604】

これにより、無色固体である、61 mg の 2-クロロ-N-シクロプロピル-5- { 1 - [3 - (エチルスルフィニル) - 5 - (1 , 1 , 1 , 2 , 3 , 3 , 3 -ヘプタフルオロプロパン-2-イル) ピリジン-2-イル] - 1 H-ピラゾール-4-イル } ベンズアミドを得た。

HPLC-MS^{a)} : log P = 3.79、質量 (m/z) = 583 [M+H]⁺.

30

¹H NMR (400 MHz, D₆-DMSO) : 9.36 (s, 1H)、8.96 (d, 1H)、8.63 (s, 1H)、8.58 (s, 1H)、8.53 (d, 1H)、7.91 (s, 1H)、7.89 (d, 1H)、7.53 (d, 1H)、3.45-3.30 (m, 1H 水面下)、2.95-2.88 (m, 1H)、2.86-2.81 (m, 1H)、1.08 (t, 3H)、0.74-0.69 (m, 2H)、0.60-0.50 (m, 2H)。

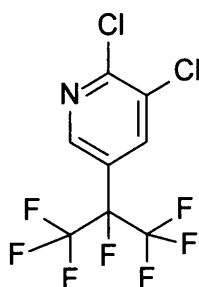
【0605】

出発化合物の調製

2,3-ジクロロ-5-(1,1,1,2,3,3,3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル)ピリジン

40

【化 1 2 0】



50

第1の段階：3-クロロ-5-(1, 1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル)ピリジン-2-アミン

130.6g (750mmol)の亜ジチオン酸ナトリウムを、保護ガス下で、アセトニトリル/水(v/v)の3:1混合物2000ml中64.3g (500mmol)の3-クロロピリジン-2-アミン、222g (750mmol)の1, 1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘプタフルオロ-2-ヨードプロパン、および126g (1500mmol)の炭酸水素ナトリウムの0~5℃まで冷却した混合物に添加した。この反応混合物を室温で48時間攪拌した。次いで、アセトニトリルを減圧下のロータリーエバポレーター上で除去した。この残留物を500mlの水で希釈した。粗生成物を酢酸エチルで水相から繰り返し抽出した。混合した有機相を硫酸ナトリウム上で乾燥させ、濾過し、次いで、減圧下のロータリーエバポレーター上で濃縮した。粗生成物をシリカゲル上でのカラムクロマトグラフィーによって精製した。

10

【0606】

第2の段階：3-クロロ-5-(1, 1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル)ピリジン-2-(1H)-オン

5.8g (19.5mmol)の3-クロロ-5-(1, 1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル)ピリジン-2-アミンを150mlの硫酸(20%, w/w)中に溶解し、0~5℃まで冷却した。この溶液を2.7g (40mmol)の亜硝酸ナトリウムと少しずつ混ぜた。この反応混合物を室温で16時間攪拌した。粗生成物をジクロロメタン(DCM)で反応混合物から繰り返し抽出した。混合した有機相を硫酸ナトリウム上で乾燥させ、濾過し、次いで、減圧下のロータリーエバポレーター上で濃縮した。この粗生成物を精製せずに次の段階で使用した。

20

【0607】

第3の段階：2, 3-ジクロロ-5-(1, 1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル)ピリジン

15.4g (51.7mmol)の3-クロロ-5-(1, 1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル)ピリジン-2-(1H)-オンおよび150mlの塩化ホスホリルを5時間かけて105℃まで加熱した。この反応混合物を炭酸水素ナトリウム溶液でゆっくりと中和した。粗生成物をDCMで反応混合物から繰り返し抽出した。混合した有機相を飽和塩化ナトリウム水溶液で洗浄し、硫酸ナトリウム上で乾燥させ、濾過し、次いで、減圧下のロータリーエバポレーター上で濃縮した。真空蒸留によって生成物を得た(1mbarで沸点40℃)。

30

【0608】

これにより、無色液体である、14.8gの2, 3-ジクロロ-5-(1, 1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル)ピリジンを得た。

MS: 質量(m/z) = 315 [M]⁺。

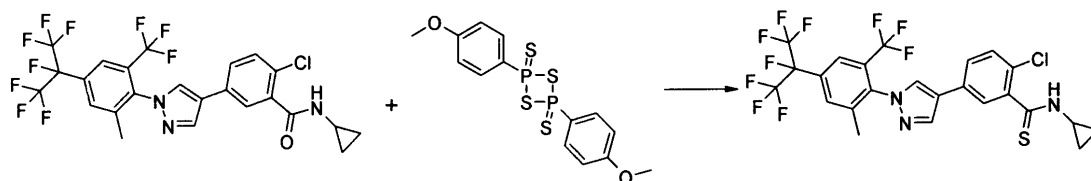
¹H NMR (400MHz, d1-クロロホルム): 8.48 (s, 1H)、7.95 (s, 1H)。

【0609】

実施例 I-T 3-161:

40

【化121】



294mg (0.5mmol)の2-クロロ-N-シクロプロピル-5-[1-[2-メチル-4-[1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]

50

ー 6 ー (トリフルオロメチル) フェニル] ピラゾールー 4 ー イル] ベンズアミドを 0.5 ml のエタノールを含まないトリクロロメタンと 1.5 ml の 1, 2 ー ジメトキシエタンとの混合物に最初に充填し、101 mg (0.25 mmol) のローソン試薬 (2, 4 ー ビス (4 ー メトキシフェニル) ー 1, 3, 2, 4 ー ジチアジホスフェタン 2, 4 ー ジスフィド) を添加した。この混合物を 50℃ まで 4 時間かけて加熱した。その後、この混合物を冷却し、溶媒を減圧下のロータリーエバポレーター上で除去した。この残留物を酢酸エチルと飽和炭酸水素ナトリウム水溶液との間で分離し、水相を酢酸エチルで 1 回再度抽出した。混合した有機相を硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下のロータリーエバポレーター上で濃縮した。精製のため、40 g のシリカゲルを含有するカートリッジを使用し、シクロヘキサン／酢酸エチルに 90 : 10 ~ 50 : 50 (v/v) のグラジエントをかけて、クロマトグラフィーを行った。248 mg の 2 ー クロロ ー N ー シクロプロピル ー 5 ー [1 ー [2 ー メチル ー 4 ー [1, 2, 2, 2 ー テトラフルオロ ー 1 ー (トリフルオロメチル) エチル] ー 6 ー (トリフルオロメチル) フェニル] ピラゾール ー 4 ー イル] ベンゼンカルボチオアミド (化合物 I ー T 3 ー 161) を得た。

10

HPLC-MS^{a)} : log P = 5.0、質量 (m/z) = 604 [M+H]⁺。

¹H-NMR (400 MHz、d₃-アセトニトリル) : δ (ppm) = 8.62 (s、1H (ブロード))、8.14 (s、1H)、8.10 (s、1H)、8.0 (s、1H)、7.95 (s、1H)、7.63 (d、J = 2.2 Hz、1H)、7.57-7.60 (m、1H)、7.42 (d、J = 8.4 Hz、1H)、3.02 (s、3H)、3.37-3.44 (m、1H)、0.92-0.95 (m、2H)、0.74-0.78 (m、2H)。

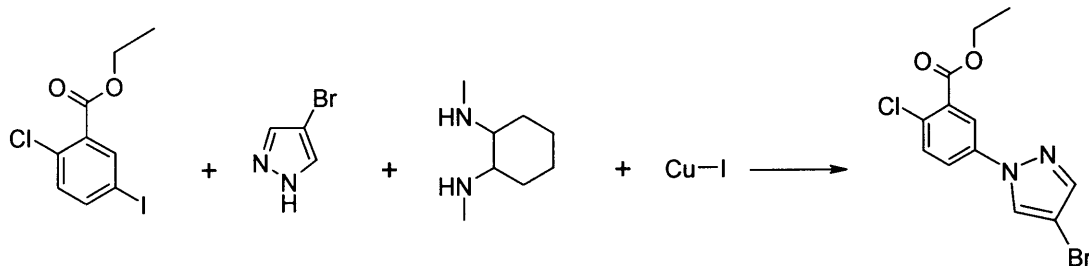
20

【0610】

調製プロセス I ー T 4

実施例 I ー T 4 ー 1 :

【化 122】

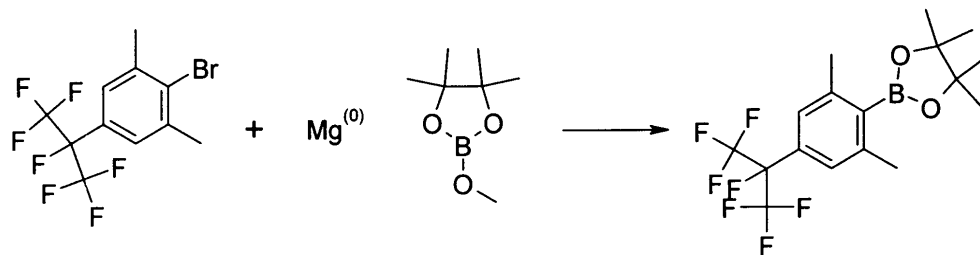


30

3.81 g (12.2 mmol) のエチル 2 ー クロロ ー 5 ー ヨード安息香酸を 37 ml のジメチルホルムアミドに最初に充填し、2.885 g (19.6 mmol) の 4 ー ブロモピラゾール、5.09 g (36.8 mmol) の粉碎したばかりの炭酸カリウム、0.349 g (2.4 mmol) の 1, 2 ー ビス (メチルアミノ) シクロヘキサン (ラセミ、トランス)、および 0.234 g (1.22 mmol) のヨウ化銅 (I) を添加した。この混合物をアルゴンで脱気し、次いで、1 時間加熱還流した。後処理として、この混合物を冷却し、100 ml の水の上に注ぎ、各回 100 ml の酢酸エチルで 2 回抽出した。混合した有機相を 100 ml の水で 2 回、次いで飽和塩化ナトリウム溶液で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下のロータリーエバポレーター上で濃縮した。精製のため、シリカゲルを含有する 120 g のカートリッジを使用し、シクロヘキサン／酢酸エチルに 90 : 10 ~ 70 : 30 (v/v) のグラジエントをかけて、この残留物をクロマトグラフした。1.41 g のエチル 5 ー (4 ー ブロモピラゾール ー 1 ー イル) ー 2 ー クロロ安息香酸を得た。

40

【化 1 2 3】



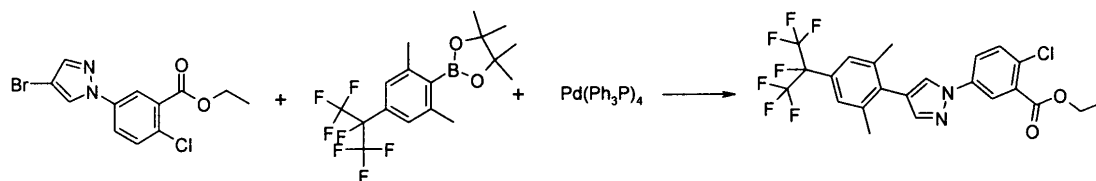
【0 6 1 1】

10

0.158 g (6.49 mmol) のマグネシウムターニングを1.5 ml の乾燥テトラヒドロフランで被覆した。2.5 ml の乾燥テトラヒドロフラン中1.75 g (4.95 mmol) の2-ブロモ-1,3-ジメチル-5-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]ベンゼンの溶液(米国特許第2003/187233号、6頁に従って調製される)を数滴添加した。反応を開始するために少量のヨウ素を添加し、この混合物を約55℃まで加熱した。反応が開始した後、2-ブロモ-1,3-ジメチル-5-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]ベンゼンの残りの溶液を55℃の温度で滴下した。滴下が終了した後、55℃でさらに1時間攪拌を続け、次いで、この混合物を0℃に冷却し、2.5 ml の乾燥テトラヒドロフラン中2-メトキシ-4,4,5,5-テトラメチル-1,3,2-ジオキサボロランの溶液を滴下した。次いで、この混合物を室温にした。後処理として、この混合物を飽和塩化アンモニウム水溶液上に注いだ。相を分離し、水相を酢酸エチルで再度抽出し、次いで、混合した有機相を飽和塩化ナトリウム水溶液で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下のロータリーエバポレーター上で濃縮した。残留物を1 mbar の真空および220℃で、クーゲルロールで蒸留した。1.85 g の2-[2,6-ジメチル-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル]-4,4,5,5-テトラメチル-1,3,2-ジオキサボロランを得た。

20

【化 1 2 4】



30

【0 6 1 2】

0.947 g (2.87 mmol) のエチル5-(4-ブロモピラゾール-1-イル)-2-クロロ安息香酸および1.15 g (2.87 mmol) の2-[2,6-ジメチル-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル]-4,4,5,5-テトラメチル-1,3,2-ジオキサボロランを62 ml のイソプロパノールに最初に充填し、8.7 ml (8.7 mmol) の脱気した1モル炭酸水素ナトリウム水溶液を添加した。この混合物をアルゴンで脱気し、0.166 g (0.14 mmol) のテトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(0)を添加し、この混合物を一晩加熱還流した。

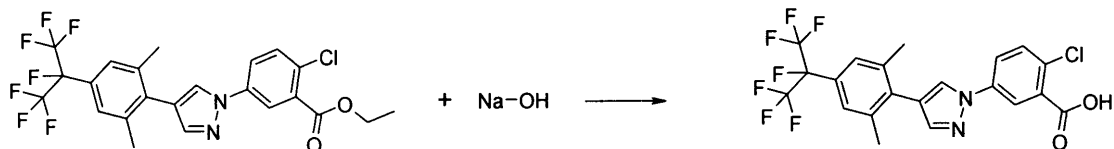
40

【0 6 1 3】

後処理として、この混合物を減圧下のロータリーエバポレーター上で濃縮し、この残留物を水と酢酸エチルとの間で分離した。有機相を除去し、水相を酢酸エチルで再度抽出した。次いで、混合した有機相を飽和塩化ナトリウム水溶液で1回洗浄し、減圧下のロータリーエバポレーター上で濃縮した。残留物として、1.17 g の粗エチル2-クロロ-5-[4-[2,6-ジメチル-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル]ピラゾール-1-イル]安息香酸塩を得た。

50

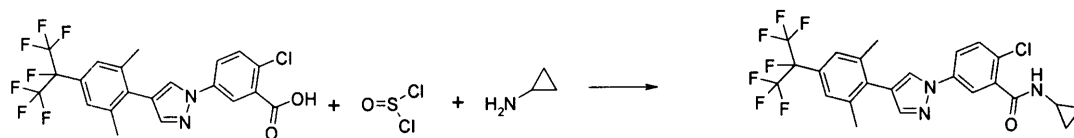
【化 1 2 5】



【0 6 1 4】

1. 76 g (3.36 mmol) のエチル 2-クロロ-5-[4-[2,6-ジメチル-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル]ピラゾール-1-イル]安息香酸塩を 72 ml のメタノールに最初に充填し、4.03 ml (4.03 mmol) の 1 モル水酸化ナトリウム溶液を添加した。次いで、この混合物を 3 時間加熱還流した。後処理として、この混合物を減圧下のロータリーエバポレーター上で濃縮し、この残留物を希塩酸に取り込み、酢酸エチルで 3 回抽出した。混合した抽出物を飽和塩化ナトリウム溶液で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させて濃縮し、1.36 g の粗 2-クロロ-5-[4-[2,6-ジメチル-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル]ピラゾール-1-イル]安息香酸を得た。

【化 1 2 6】



【0 6 1 5】

1. 36 g (2.76 mmol) の粗 2-クロロ-5-[4-[2,6-ジメチル-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル]ピラゾール-1-イル]安息香酸を 14 ml の乾燥トルエン中に溶解し、1 ml (13.8 mmol) の塩化チオニルを添加し、次いで、この混合物を 2 時間かけて 80 °C まで加熱した。その後、この混合物を減圧下のロータリーエバポレーター上で濃縮し、1 ml の乾燥トルエンを添加し、この混合物を再度濃縮した。残留物である 1.4 g の粗酸塩化物を得た。0.7 g のこの残留物を 5 ml のジクロロメタン中に溶解し、室温で 2 ml のジクロロメタン中 0.195 g (3.41 mmol) のシクロプロピルアミンの溶液に滴下した。この混合物を室温でさらに 2 時間攪拌し、次いで、20 ml の 5 % リン酸二水素ナトリウム水溶液の上に注いだ。有機相を除去し、飽和塩化ナトリウム溶液で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下のロータリーエバポレーター上で濃縮した。この残留物を、15 g のシリカゲルを含有するカートリッジを使用し、シクロヘキサン/酢酸エチルに 90 : 10 ~ 50 : 50 (v/v) のグラジエントをかけて 2 つのクロマトグラフィーを行うことによって、精製した。91 mg (1.36 mmol) の N-シクロプロピル-2-クロロ-5-[4-[2,6-ジメチル-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル]ピラゾール-1-イル]ベンズアミド (化合物 I-T4-1) を得た。

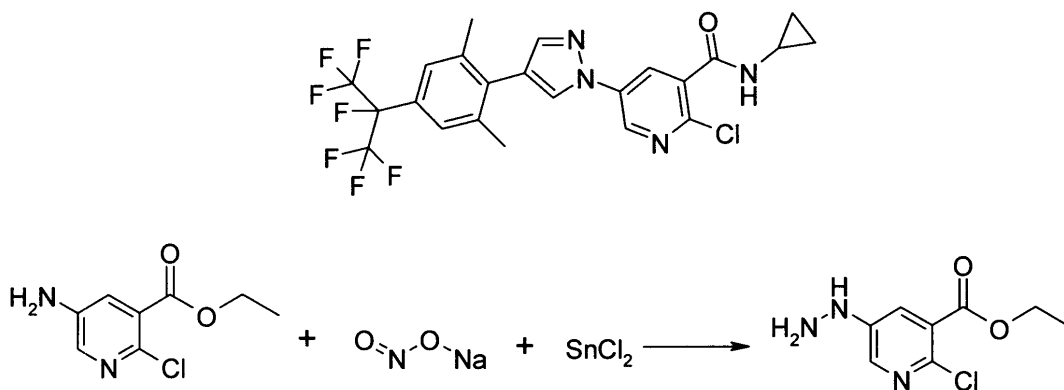
HPLC-MSa) : log P = 4.74、質量 (m/z) = 534 [M+H]⁺。

¹H NMR (400 MHz、d3-アセトニトリル) : δ = (ppm) 8.17 (s、1H)、7.86 (s、1H)、7.84 (d、J1 = 2.7 Hz、1H)、7.69 (s、1H)、7.54 (d、J1 = 8.8 Hz、1H)、7.44 (s、2H)、6.97 (s (ブロード)、1H (N-H))、2.83-2.87 (m、1H)、2.25 (s、6H)、0.76-0.8 (m、2H)、0.58-0.62 (m、2H)。

【0 6 1 6】

実施例 I - T 4 - 3 :

【化 1 2 7】



10

2 g (9.96 mmol) のエチル 5-アミノ-2-クロロニコチン酸（市販されている）を 8.6 ml の 33% 含水塩酸に最初に充填し、この混合物を室温で 30 分間撹拌した。その後、7 ml の水を添加し、この混合物を氷浴で 0℃ まで冷却した。この混合物に、6.92 ml の水中 750 mg (10.8 mmol) の亜硝酸ナトリウムの溶液を 30 分以内に滴下した。温度を氷浴で +5℃ 未満に維持した。撹拌を 0℃ で 15 分間続けた。

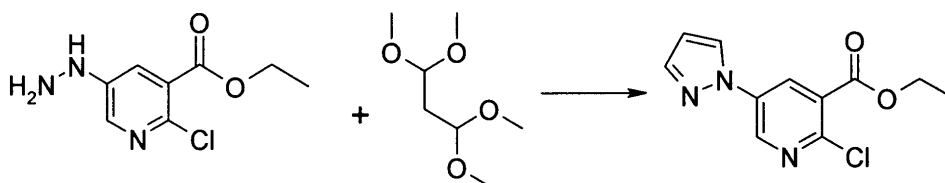
20

【0617】

第 2 のフラスコに、24 ml の 16% 含水塩酸中 5.77 g (25.5 mmol) の塩化スズ (I I) 二水和物を最初に充填し、上で調製されたジアゾニウム塩懸濁液を 0℃ でゆっくりと滴下した。撹拌を 0℃ で 1 時間続けた。その後、50 ml のアセトニトリルおよび 40 ml の飽和塩化ナトリウム水溶液を添加した。形成された相を分離した。水相を各回 50 ml のアセトニトリルで 2 回抽出した。混合した有機相を硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下のロータリーエバポレーター上で濃縮した。得られた残留物は、10.7 g の粗エチル 2-クロロ-5-ヒドラジノニコチン酸であった。

【化 1 2 8】

30

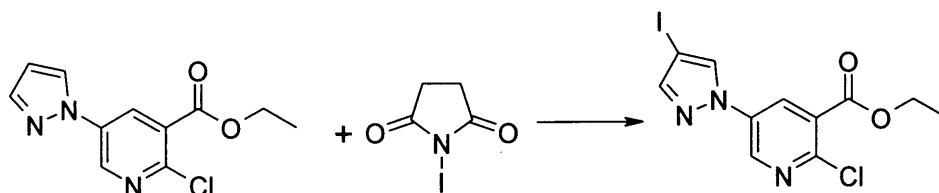


【0618】

10.7 g の粗エチル 2-クロロ-5-ヒドラジノニコチン酸を 50 ml のエタノールに最初に充填し、次いで、1.63 g (9.92 mmol) の 1, 1, 3, 3-テトラメトキシプロパンおよび 487 mg の 96% 硫酸を添加した。その後、この混合物を 2 時間加熱還流した。エタノールの大部分を減圧下のロータリーエバポレーター上で除去し、この残留物を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液と酢酸エチルとの間で分離した。有機相を除去し、飽和塩化ナトリウム水溶液で洗浄し、硫酸ナトリウム上で乾燥させ、減圧下のロータリーエバポレーター上で濃縮した。この残留物を、15 g のシリカゲルを含有するカートリッジおよび純粋なシクロヘキサンから 50 : 50 (v/v) シクロヘキサン/酢酸エチルまでのグラジエントを用いてクロマトグラフした。396 mg のエチル 2-クロロ-5-(ピラゾール-1-イル)ニコチン酸を得た。

40

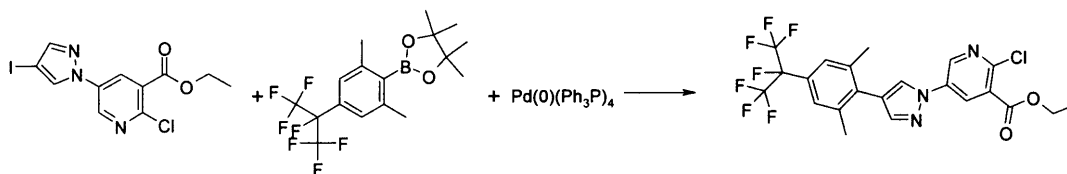
【化 1 2 9】



【0 6 1 9】

396 mg (1.57 mmol) のエチル 2-クロロ-5-(ピラゾール-1-イル)-ニコチン酸を 10 ml のアセトニトリルに最初に充填し、1.062 g (4.72 mmol) の N-ヨードスクシンイミドを添加した。その後、この混合物をアルゴン下で還流しながら 3 時間加熱した。この混合物を少し冷却し、溶媒を減圧下のロータリーエバポレーター上で除去した。残留物を水と酢酸エチルとの間で分離した。有機相を除去し、最初に飽和亜硫酸水素ナトリウム水溶液で、次いで飽和炭酸水素ナトリウム水溶液で、最後に飽和塩化ナトリウム水溶液で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下のロータリーエバポレーター上で濃縮した。この残留物を、15 g のシリカゲルを含有するカートリッジおよび純粋なシクロヘキサンから 50 : 50 (v/v) シクロヘキサン/酢酸エチルまでのグラジエントを用いてクロマトグラフした。

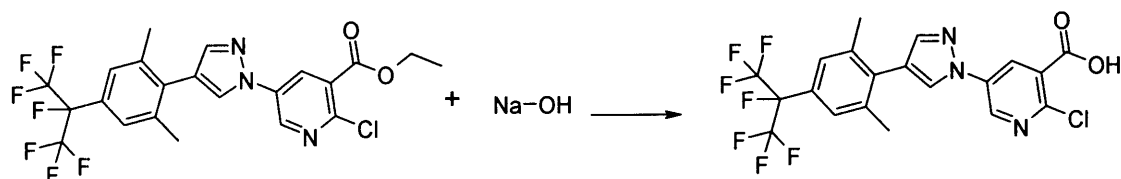
【化 1 3 0】



【0 6 2 0】

401 mg (1.06 mmol) のエチル 2-クロロ-5-(4-ヨードピラゾール-1-イル)ピリジン-3-カルボン酸塩および 425 mg (1.06 mmol) の 2-[2,6-ジメチル-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル]-4,4,5,5-テトラメチル-1,3,2-ジオキサボロランを 23 ml のイソプロパノールに最初に充填し、3.24 ml (3.24 mmol) の脱気した 1 モル炭酸水素ナトリウム水溶液および 61 mg (0.05 mmol) のテトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(0)を添加した。この混合物を再度アルゴンで 1 回脱気し、一晩加熱還流した。その後、この混合物を冷却し、揮発性成分を減圧下のロータリーエバポレーター上で除去した。残留物を水と酢酸エチルとの間で分離した。有機相を除去し、飽和塩化ナトリウム水溶液で 1 回洗浄し、減圧下のロータリーエバポレーター上で濃縮した。415 mg の粗エチル 2-クロロ-5-[4-[2,6-ジメチル-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル]ピラゾール-1-イル]ピリジン-3-カルボン酸塩を得た。

【化 1 3 1】



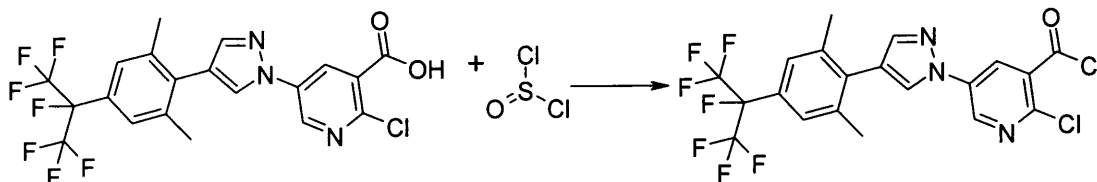
【0 6 2 1】

416 mg (0.79 mmol) の粗エチル 2-クロロ-5-[4-[2,6-ジメチル-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェ

ニル] ピラゾール-1-イル] ピリジン-3-カルボン酸塩を16.9 ml のメタノール中に溶解し、0.952 ml (0.95 mmol) の1 M水酸化ナトリウム溶液を添加した。この混合物を還流しながら6時間加熱し、次いで冷却し、減圧下のロータリーエバポレーター上で濃縮した。この残留物を酢酸エチルと希塩酸との間で分離した。水相を酢酸エチルで2回再度抽出した。混合した有機相を飽和塩化ナトリウム水溶液で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下のロータリーエバポレーター上で濃縮した。380 mg の粗2-クロロ-5-[4-[2,6-ジメチル-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル]ピラゾール-1-イル]ピリジン-3-カルボン酸を得た。

【化132】

10

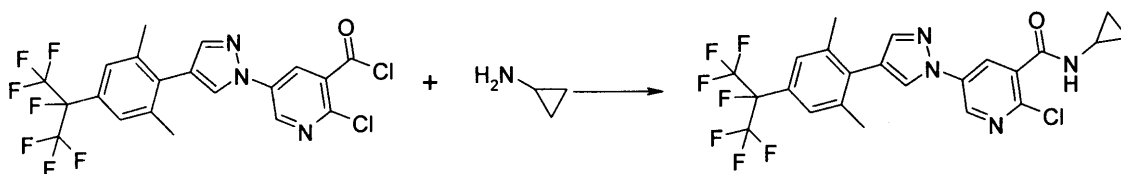


【0622】

380 mg (0.76 mmol) の粗2-クロロ-5-[4-[2,6-ジメチル-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル]ピラゾール-1-イル]ピリジン-3-カルボン酸をトルエン中に溶解し、456 mg (3.83 mmol) の塩化チオニルを添加した。この混合物を2時間かけて80℃まで加熱し、次いで、減圧下のロータリーエバポレーター上で濃縮した。400 mg の粗2-クロロ-5-[4-[2,6-ジメチル-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル]ピラゾール-1-イル]ピリジン-3-塩化カルボニルを得た。

20

【化133】



30

【0623】

138 mg (0.26 mmol) の2-クロロ-5-[4-[2,6-ジメチル-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル]ピラゾール-1-イル]ピリジン-3-塩化カルボニルを1 ml のジクロロメタン中に溶解し、室温で1 ml のジクロロメタン中38 mg のシクロプロピルアミンの溶液に滴下した。この混合物を室温でさらに2時間攪拌した。次いで、この混合物を5%リン酸二水素ナトリウム溶液で、次いで飽和塩化ナトリウム水溶液で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下のロータリーエバポレーター上で濃縮した。精製のため、15 g のシリカゲルを含有するカートリッジを使用し、シクロヘキサン/酢酸エチルに90:10~50:50 (v/v) のグラジエントをかけて、クロマトグラフィーを行った。30 mg の2-クロロ-N-シクロプロピル-5-[4-[2,6-ジメチル-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル]ピラゾール-1-イル]ピリジン-3-カルボキサミドを得た。

40

HPLC-MSa): log P = 4.42、質量 (m/z) = 534 [M+H]⁺。

¹H NMR (400 MHz, d3-アセトニトリル): δ (ppm) = 8.92 (d, J = 2.8 Hz, 1H)、8.22 (d, J1 = 2.8 Hz, 1H)、8.20 (s, 1H)、7.75 (s, 1H)、7.44 (s, 2H)、5.1 (s (ブロード), 1H (N-H))、2.84-2.88 (m, 1H)、2.25 (s, 6H)、0.78-0.

50

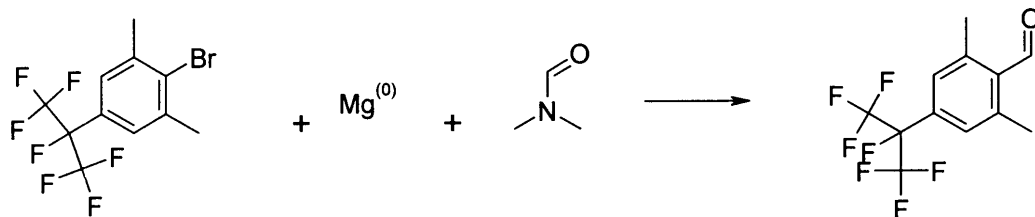
8 1 (m、2 H)、0. 5 9 – 0. 6 3 (m、2 H)。

【0 6 2 4】

調製プロセス I – T 2 2

実施例 I – T 2 2 – 1：

【化 1 3 4】



10

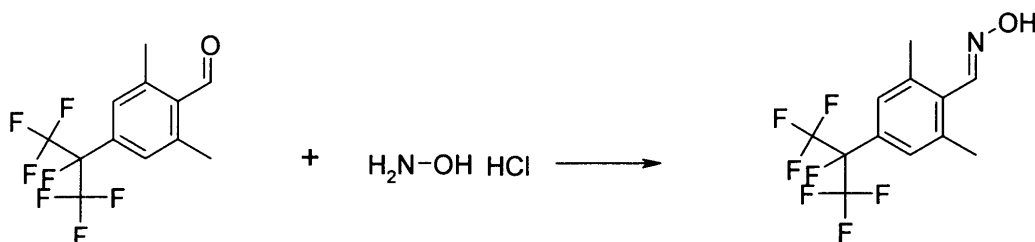
2, 6 – ジメチル – 4 – ヘプタフルオロイソプロピルプロモベンゼンの調製は、米国特許第 2 0 0 3 / 1 8 7 2 3 3 号、6 頁 [0 0 8 0] に記載されている。

【0 6 2 5】

2 5 m l の三口フラスコ中で、1 5 8 m g (6. 5 m g 原子) のマグネシウムターニングを乾燥テトラヒドロフラン (T H F) で被覆した。次いで、2. 5 m l の乾燥 T H F 中 1. 7 5 g (4. 9 5 m m o l) の 2, 6 – ジメチル – 4 – ヘプタフルオロイソプロピルプロモベンゼンの溶液を数滴添加した。反応を開始するために少量のヨウ素を添加し、この混合物を約 6 0 °C まで加熱した。反応が開始した後、2, 6 – ジメチル – 4 – ヘプタフルオロイソプロピルプロモベンゼンの溶液の残りを約 6 0 °C で滴下した。滴下が終了した後、攪拌を 6 0 °C でさらに 1 時間続け、次いで、この混合物を 0 °C まで冷却し、2. 5 m l の乾燥 T H F 中 1. 0 9 g (1 4. 8 m m o l) のジメチルホルムアミドの溶液を滴下した。次いで、この混合物を室温にした。後処理として、過剰な飽和塩化アンモニウム水溶液を添加し、相を分離し、水相を酢酸エチルで再度抽出した。混合した有機相を飽和塩化ナトリウム溶液で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下のロータリーエバポレーター上で濃縮した。残留物として、1. 3 g の粗 2, 6 – ジメチル – 4 – ヘプタフルオロイソプロピルベンズアルデヒド (純度約 8 0 %) が残存し、これをさらなる精製は行わずに使用した。

20

【化 1 3 5】



30

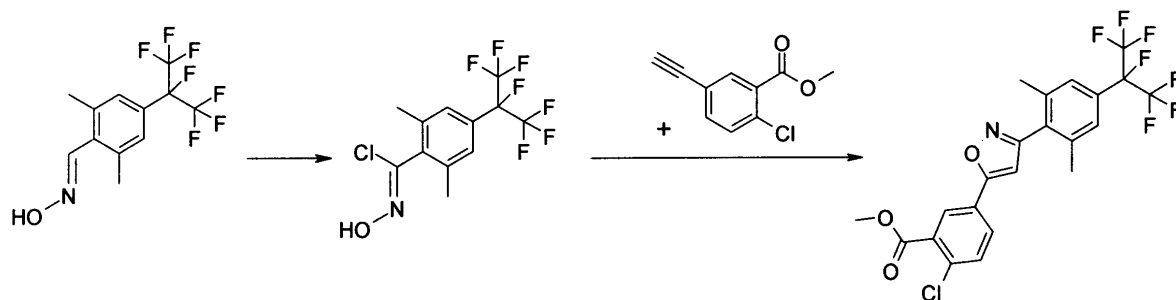
【0 6 2 6】

1. 3 g (約 3. 4 4 m m o l) の粗 2, 6 – ジメチル – 4 – ヘプタフルオロイソプロピルベンズアルデヒドを 2 6 m l のメタノール中に溶解し、3 6 1 m g (4. 3 m m o l) の炭酸水素ナトリウムを添加し、この混合物を 0 °C まで冷却した。その後、1. 2 g (1 7. 2 m m o l) の塩化ヒドロキシルアンモニウムを添加し、この混合物を室温で一晩攪拌した。後処理として、この混合物を減圧下のロータリーエバポレーター上で濃縮し、この残留物を 1 0 0 m l の酢酸エチル中に取り込んだ。溶解されていない構成成分を濾過し、この濾液を減圧下のロータリーエバポレーター上で濃縮した。次いで、この残留物を、シリカを含有する 4 0 g のカートリッジおよび純粋なシクロヘキサンから 7 0 : 3 0 (v / v) シクロヘキサン / 酢酸エチルまでのグラジエントを用いてクロマトグラフィーによって精製した。0. 5 g の 2, 6 – ジメチル – 4 – ヘプタフルオロイソプロピルベンズアルデヒドオキシムを得た。

40

50

【化 1 3 6】



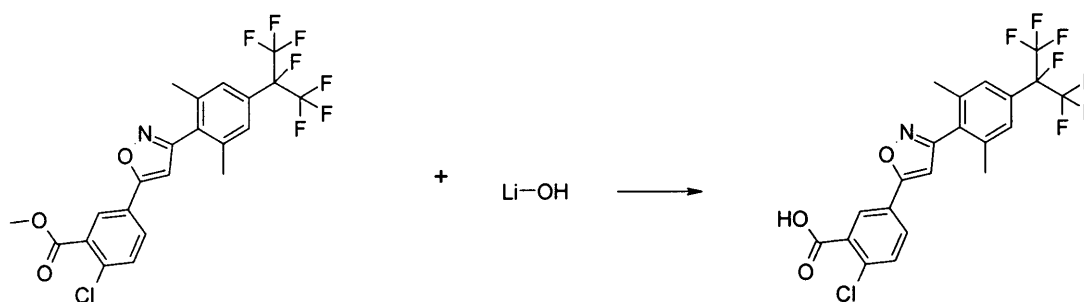
10

【0 6 2 7】

505 mg (1.59 mmol) の 2, 6-ジメチル-4-ヘプタフルオロイソプロピルベンズアルデヒドオキシムを 3.5 ml のジメチルホルムアミド (DMF) に最初に充填し、234 mg (1.75 mmol) の N-クロロスクシンイミドを添加した。この混合物を室温で 3.5 時間攪拌した。次いで、この混合物を 0℃ まで冷却し、1.5 ml の DMF 中 310 mg (1.59 mmol) のメチル 2-クロロ-5-エチル安息香酸の溶液 (国際公開第 2012/107434 号、103 頁に従って調製される) を、続いて 355 mg (3.5 mmol) のトリエチルアミンを滴下した。次いで、この反応混合物を室温で一晩攪拌した。後処理として、この混合物を水の上に注ぎ、ジクロロメタンで 2 回抽出し、この混合した抽出物を水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下のロータリーエバポレーター上で濃縮した。精製のため、シリカゲルを含有する 40 g のカートリッジおよび純粋なシクロヘキサンから 80:20 (v/v) シクロヘキサン/酢酸エチルまでのグラジエントを用いて、精製を行った。488 mg のメチル 2-クロロ-5-[3-[2, 6-ジメチル-4-[1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル]イソキサゾール-5-イル]安息香酸塩を得た。

20

【化 1 3 7】



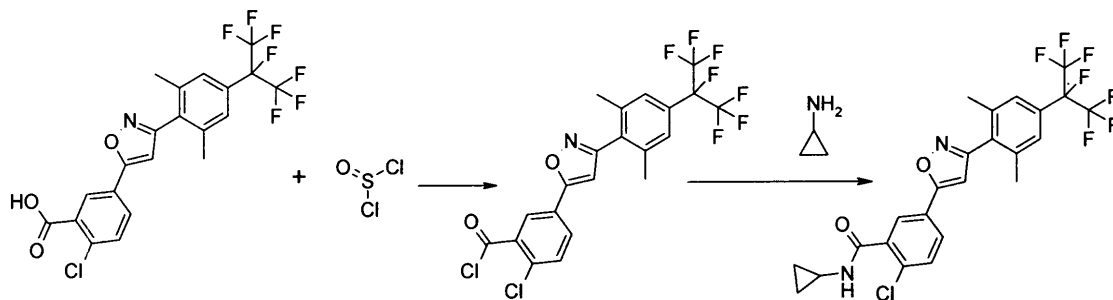
30

【0 6 2 8】

0.8 g (1.56 mmol) のメチル 2-クロロ-5-[3-[2, 6-ジメチル-4-[1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル]イソキサゾール-5-イル]安息香酸塩を 18 ml のジオキサンと 6.5 ml の水との混合物に最初に充填し、86 mg (2.04 mmol) の水酸化リチウム-水和物を添加し、この混合物を室温で一晩攪拌した。後処理として、この混合物を減圧下で濃縮し、この残留物を希塩酸の混合物とジクロロメタンとの間で分離した。有機相を除去し、水相をまずジクロロメタンで、次いで酢酸エチルで抽出した。混合した有機相を飽和塩化ナトリウム水溶液で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下のロータリーエバポレーター上で濃縮した。680 mg の 2-クロロ-5-[3-[2, 6-ジメチル-4-[1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル]イソキサゾール-5-イル]安息香酸を得た。

40

【化 1 3 8】



10

【0 6 2 9】

680 mg (1.37 mmol) の 2-クロロ-5-[3-[2,6-ジメチル-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル]イソキサゾール-5-イル]安息香酸を 7 ml のトルエン中に溶解し、0.5 ml (6.89 mmol) の塩化チオニルを添加した。この混合物を 2 時間かけて 80℃まで加熱し、次いで、減圧下のロータリーエバポレーター上で濃縮した。このように得られた 200 mg (0.38 mmol) の粗酸塩化物を 1 ml のジクロロメタン中に溶解し、室温で 0.95 ml のジクロロメタン中 56 mg (0.97 mmol) のシクロプロピルアミンの溶液に滴下した。次いで、この混合物を室温で一晩攪拌した。後処理として、この混合物を 5%リン酸二水素ナトリウム水溶液の上に注ぎ、有機相を除去し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下のロータリーエバポレーター上で濃縮した。精製のため、この残留物を、15 g のシリカゲルを含有するカートリッジを使用し、純粋なシクロヘキサンから 80:20 (v/v) シクロヘキサン/酢酸エチルまでのグラジエントをかけてクロマトグラフした。165 mg の 2-クロロ-N-シクロプロピル-5-[3-[2,6-ジメチル-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル]イソキサゾール-5-イル]ベンズアミド (化合物 I-T22-1) を得た。

20

HPLC-MS^{a)}: log P = 4.75、質量 (m/z) = 535 [M+H]⁺。

¹H NMR (400 MHz、d₃-アセトニトリル): δ (ppm) = 7.93 (d、J = 2.2 Hz、1H)、7.89 (dd、J₁ = 8.4 Hz、J₂ = 2.2 Hz、1H)、7.6 (d、J = 8.4 Hz、1H)、7.49 (s、2H)、7.03 (s (ブロード)、1H (N-H))、6.86 (s、1H)、2.83-2.88 (m、1H)、0.75-0.79 (m、2H)、0.59-0.62 (m、2H)。

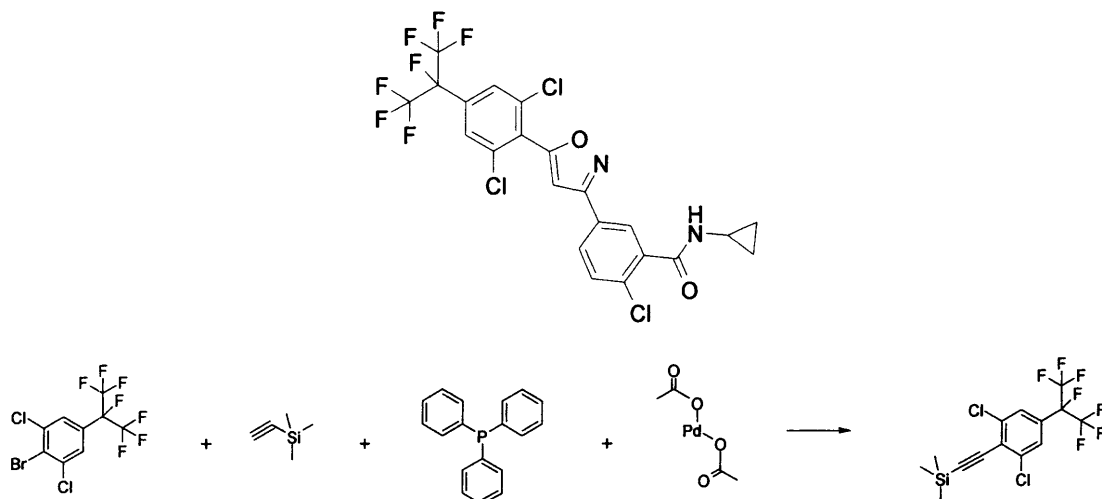
30

【0 6 3 0】

調製プロセス I-T23

実施例 I-T23-1:

【化 1 3 9】



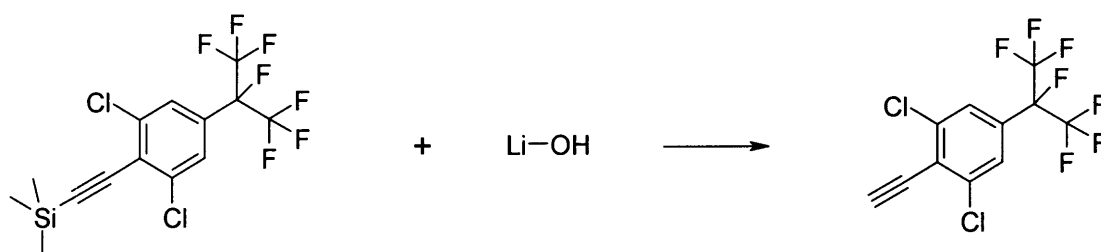
10

3 g (7.61 mmol) の 2-ブロモ-1,3-ジクロロ-5-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]ベンゼン (調製に関しては、欧州特許第 1 253 128 号、10 頁を参照されたい)、1.21 g (12.3 mmol) のエチニルトリメチルシラン、86 mg (0.38 mmol) の酢酸パラジウム (II)、および 260 mg (1.0 mmol) のトリフェニルホスフィン を 20 ml の乾燥トリエチルアミンに最初に充填し、加熱還流した。30℃で、ロータリーエバポレーター上で体積を濃縮した後、この残留物を 20 ml の飽和炭酸水素ナトリウム溶液と混ぜ、ジクロロメタンで 3 回抽出した。混合した抽出物を 5% NaH_2PO_4 水溶液で、次いで飽和塩化ナトリウム溶液で洗浄した。溶液を硫酸ナトリウムで乾燥させ、30℃で、ロータリーエバポレーター上で体積を濃縮した後、溶離剤としてシクロヘキサンを含むシリカゲル上でのクロマトグラフィーによって精製を行った。収率：約 50% の純度で 1.4 g の 2-[2,6-ジクロロ-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル]エチニルトリメチルシラン (LC-MS 面積)。

20

30

【化 1 4 0】



【0 6 3 1】

40

1.4 g (3.4 mmol) の 2-[2,6-ジクロロ-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル]エチニルトリメチルシランを 7 ml のテトラヒドロフラン中に溶解し、7 ml のメタノールと 214 mg (5.1 mmol) の水酸化リチウム一水和物との混合物を室温で添加した。この反応溶液をロータリーエバポレーター上で濃縮し、この残留物をジクロロメタンと水との混合物に取り込んだ。有機相を除去し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下のロータリーエバポレーター上で濃縮し、880 mg の約 50% の 1,3-ジクロロ-2-エチニル-5-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]ベンゼンを得た。

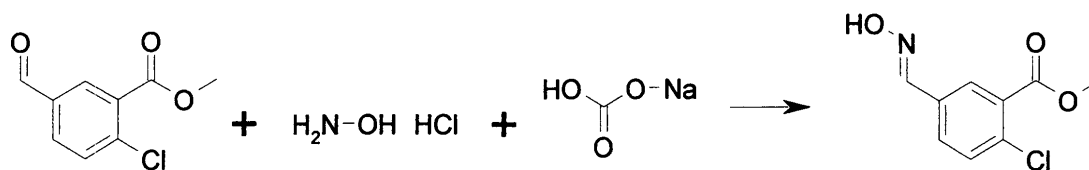
【0 6 3 2】

4-クロロ-3-カルボメトキシベンズアルデヒドの調製は、文献 (例えば、国際公開

50

第2010/011584号、19～20頁を参照されたい) にすでに記載されている。

【化141】



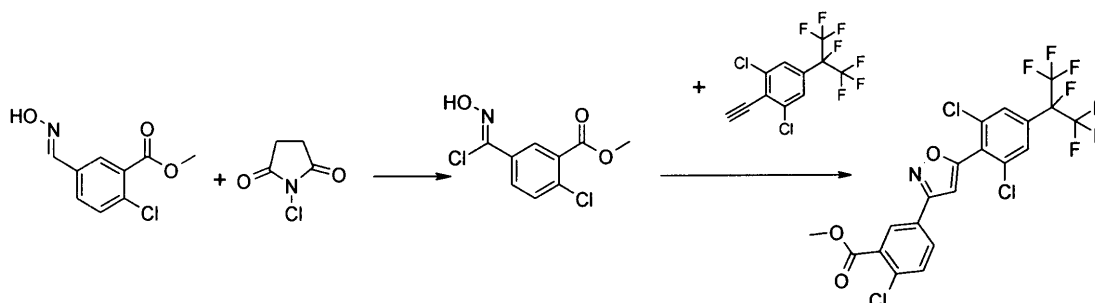
10

【0633】

4. 1 g (20.6 mmol) の4-クロロ-3-カルボメトキシベンズアルデヒドを82 ml のメタノール中に溶解し、1.734 mg (20.6 mmol) の炭酸水素ナトリウムを添加し、この混合物を0℃まで冷却した。次いで、5.738 g (82.5 mmol) のヒドロキシラミン塩酸塩を添加し、この混合物を攪拌した。後処理として、この混合物をロータリーエバポレーター上で濃縮し、この残留物を100 ml の酢酸エチル中に取り込んだ。固体を濾過し、この濾液を減圧下のロータリーエバポレーター上で濃縮した。精製のため、この残留物を、9:1～7:3 (v/v) シクロヘキサン/酢酸エチルのグラジエントによりシリカゲルでクロマトグラフし、2.68 g のエチル2-クロロ-5-[(E)-ヒドロキシイミノメチル]安息香酸塩を得た。

20

【化142】



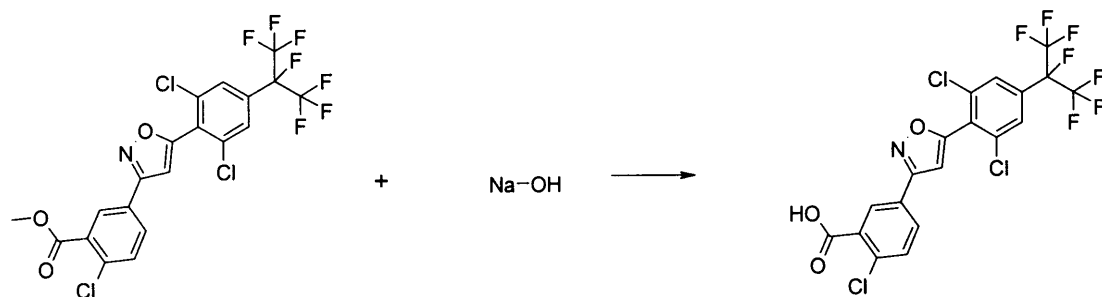
30

【0634】

277 mg (1.29 mmol) のエチル2-クロロ-5-[(E)-ヒドロキシイミノメチル]安息香酸塩を4.6 ml のジメチルホルムアミドに最初に充填し、381 mg (2.84 mmol) のN-クロロスクシンイミドを添加し、この混合物を室温で攪拌した。次いで、この混合物を氷浴で0℃に冷却し、1.5 ml のジメチルホルムアミド中880 mg (約50%濃度、1.29 mmol) の1,3-ジクロロ-2-エチニル-5-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]ベンゼンの溶液、続いて289 mg (2.85 mmol) のトリエチルアミンを滴下した。この混合物を室温で攪拌した。後処理として、この反応物を水で希釈し、ジクロロメタンで2回抽出した。混合した抽出物を水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させて、ロータリーエバポレーター上で濃縮した。この残留物を、シリカ上で溶離剤として純粋なシクロヘキサンから80:20 (v/v) シクロヘキサン/酢酸エチルのグラジエントを用いて2つのクロマトグラフィーを行うことによって精製し、410 mg のメチル2-クロロ-5-[5-[2,6-ジクロロ-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル]イソキサゾール-3-イル]安息香酸塩を得た。

40

【化 1 4 3】



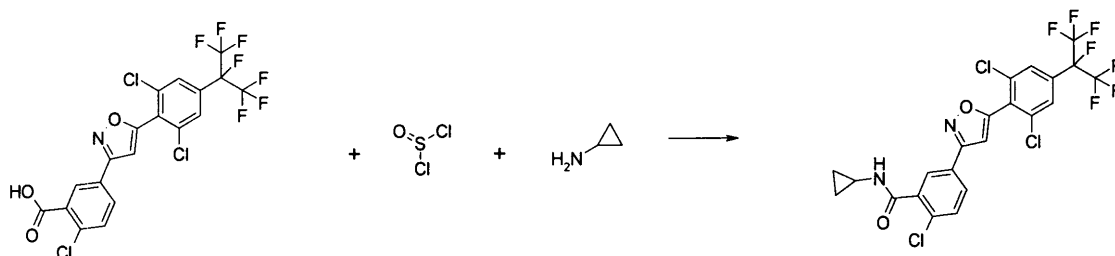
10

【0 6 3 5】

410 mg (0.74 mmol) のメチル 2-クロロ-5-[5-[2,6-ジクロロ-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル]イソキサゾール-3-イル]安息香酸塩を 21 ml のメタノールに最初に充填し、0.74 ml (0.74 mmol) の 1 M 水酸化ナトリウム溶液を添加し、この混合物を還流しながら攪拌した。その後、メタノールをロータリーエバポレーター上で除去した。この残留物を希塩酸と混ぜて、酢酸エチルで 3 回抽出した。混合した抽出物を硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下のロータリーエバポレーター上で濃縮した。残留物である、405 mg の 2-クロロ-5-[5-[2,6-ジクロロ-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル]イソキサゾール-3-イル]安息香酸を得た。

20

【化 1 4 4】



30

【0 6 3 6】

125 mg (0.23 mmol) の 2-クロロ-5-[5-[2,6-ジクロロ-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル]イソキサゾール-3-イル]安息香酸を 1.1 ml の乾燥トルエン中に溶解し、0.14 g (1.16 mmol) の塩化チオニルを添加した。この混合物を 80℃まで加熱し、次いで、ロータリーエバポレーター上で濃縮した。この残留物を 0.25 ml のジクロロメタン中に溶解し、0℃で 0.75 ml のジクロロメタン中 33 mg (0.58 mmol) のシクロプロピルアミンの溶液に滴下し、この混合物を室温で 2 時間攪拌した。後処理として、5%リン酸二水素ナトリウム水溶液を添加し、次いで、有機相を除去した。有機相を硫酸ナトリウムで乾燥させ、ロータリーエバポレーター上で濃縮した。この残留物を、シリカゲルおよび溶離剤として 70:30 (v/v) シクロヘキサン/酢酸エチルを用いて、クロマトグラフィーによって精製した。49 mg の 2-クロロ-N-シクロプロピル-5-[5-[2,6-ジクロロ-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル]イソキサゾール-3-イル]ベンズアミド (化合物 I-T23-1) を得た。

40

HPLC-MS^{a)}: log P = 4.96、質量 (m/z) = 575 [M+H]⁺。

¹H NMR (400 MHz, d₃-アセトニトリル): δ = 7.96 (s, 1H)、7.94-7.96 (dd, J₁ = 8.4 Hz, J₂ = 2.2 Hz, 1H)、7.86 (s, 2H)、7.6 (d, J₁ = 7.6 Hz, J₂ = 1.2, 1H)、7.15 (s, 1H)、6.9 (s (ブロード), 1H (N-H))、3.97 (s, 3H)、2.83-2

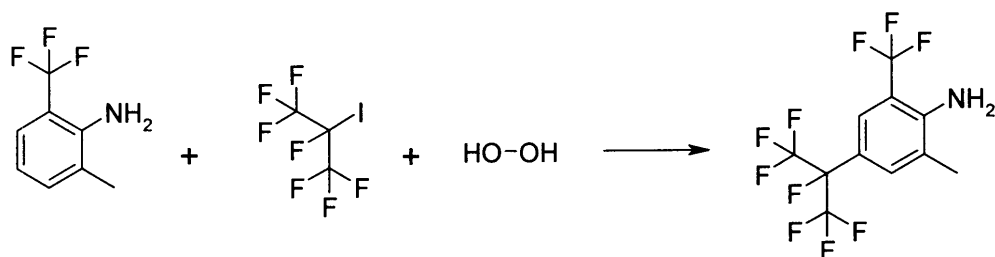
50

. 88 (m, 1H)、0.75–0.79 (m, 2H)、0.58–0.62 (m, 2H)。

【0637】

プロセス1 実施例4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチル-6-トリフルオロメチルアニリン

【化145】



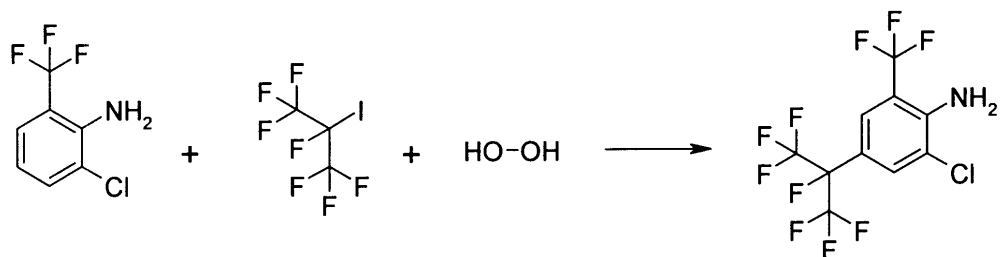
D-1a

三つ口フラスコに、498 ml のジメチルスルホキシド中 17.48 g (100 mmol) の 2-メチル-6-トリフルオロメチルアニリンを最初に充填し、次いで、44.3 g (21.095 ml, 150 mmol) の 2-ヨードヘプタフルオロプロパン、水中 29.9 ml (29.9 mmol) の 1 モル硫酸鉄 (II) 溶液、および 5.43 ml (104 mmol) の 96% 硫酸を添加した。次いで、この混合物をアルゴンで脱気し、次いで、シリンジポンプを使用して、15 分以内に 20.4 ml の 30% 過酸化水素水溶液を滴下した。温度を 54℃ まで上昇させた。滴下の終了時に、この混合物を簡単に 60℃ まで加熱した。この混合物を加熱せずにさらに 20 分間攪拌し、この間に温度を 36℃ まで下げた。後処理として、この混合物を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液の上に注ぎ、生成物を酢酸エチルで抽出した。混合した抽出物をまず水で、次いで飽和塩化ナトリウム水溶液で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下のロータリーエバポレーター上で濃縮した。精製のため、2 回に分けて 120 g のシリカゲルを含有するカラムを通して、純粋なシクロヘキサンから 95:5 シクロヘキサン/酢酸エチル (v/v) のグラジエントをかけて、クロマトグラフィーを行った。18.9 g の 4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチル-6-トリフルオロメチルアニリンを得た。

【0638】

同様に、2-クロロ-6-トリフルオロメチルアニリンおよび 2-ヨードヘプタフルオロプロパンから発生する 2-クロロ-4-ヘプタフルオロイソプロピル-6-トリフルオロメチルアニリンも得た：

【化146】



【0639】

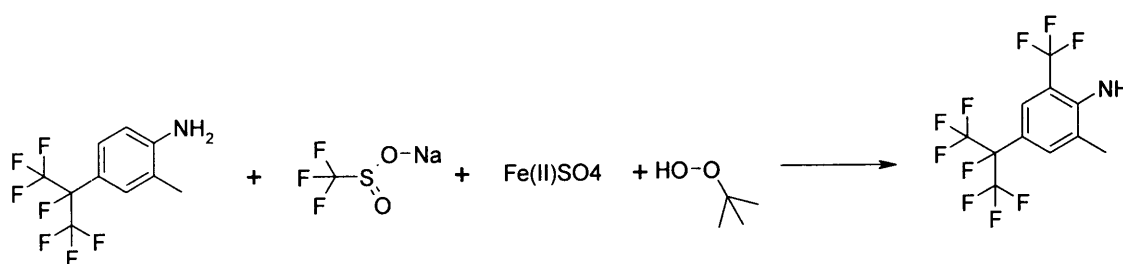
三つ口フラスコに、765 ml のジメチルスルホキシド (DMSO) 中 30 g (0.153 mol) の 2-クロロ-6-トリフルオロメチルアニリン (市販されている) を最初に充填し、次いで、68.1 g (0.23 mol) の 2-ヨードヘプタフルオロプロパン、46 ml の 1 モル硫酸鉄 (II) 水溶液、および 15.4 g の 98% 硫酸を添加した。

この混合物をアルゴンで脱気し、次いで、シリンジポンプを使用して、30分以内に34.8 gの30%過酸化水素水溶液を滴下した。この間に、温度を70℃まで上昇させた。この混合物をさらに20分間攪拌し、この間に温度を30℃まで下げた。次いで、この反応混合物を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液の上に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。混合した抽出物をまず水で、次いで飽和亜硫酸水素塩水溶液および飽和塩化ナトリウム水溶液で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下のロータリーエバポレーター上で濃縮した。精製のため、330 gのシリカゲルを含有するカートリッジおよび純粋なシクロヘキサンから90:10 (v/v) シクロヘキサン/酢酸エチルまでのグラジエントを用いて、クロマトグラフィーを行った。46.1 gの2-クロロ-4-ヘプタフルオロイソプロピル-6-トリフルオロメチルアニリンを得た。

10

【0640】

プロセス2 実施例4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチル-6-トリフルオロメチルアニリン
【化147】



20

D-1 a

1000 mlの三口フラスコ中で、25 g (91 mmol)の4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチルアニリンを363.4 mlの水と181.7 mlのアセトニトリルとの混合物に添加した。次いで、27.3 ml (27.3 mmol)の1モル硫酸鉄(II)水溶液および31.19 g (200 mmol)のトリフルオロメチルスルフィン酸ナトリウムを添加した。この混合物をアルゴンで覆い、次いで、シリンジポンプを用いて4.5時間以内に冷却せずに、35.1 g (273 mmol)の70%tert-ブチルヒドロペルオキシド水溶液を計量した。温度を34℃まで上昇させた。添加が終了した後、攪拌をさらに1時間続けた。後処理として、この混合物を425 mlの飽和亜硫酸水素ナトリウム水溶液の上に注ぎ、15分間攪拌した。次いで、425 mlの飽和炭酸水素ナトリウム溶液を添加し、この混合物を酢酸エチルで3回抽出した。混合した有機相をまず水で、次いで飽和塩化ナトリウム水溶液で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下のロータリーエバポレーター上で濃縮した。粗生成物を、2回に分けて120 gのシリカゲルを含有するカートリッジおよび95:5~85:15 (v/v)のシクロヘキサン/酢酸エチルグラジエントを使用して、クロマトグラフした。19.5 gの4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチル-6-トリフルオロメチルアニリンを得た。

30

40

HPLC-MS^{a)}: log P = 4.67

GC/MS: 質量(m/z) = 343、保持時間: 2.98分、コバッツ指数: 1089 (Agilent 6890 GC、HP5979 MSD、10m DB-1、iD = 0.18 mm、FILM = 0.4 μm、Inj.: 250℃、一定流量: 1.6 mm/分 He、Det.: MSD: 280℃、FID: 320℃、オープン: 50℃(1分) - 40℃/分 - 320℃(3.25分))

¹H NMR (AV400、400 MHz、d₃-アセトニトリル): δ(ppm) = 7.50 (s, 1H)、7.48 (s, 1H)、5.03 (s, 2H、ブロード)、2.23 (s, 3H)。

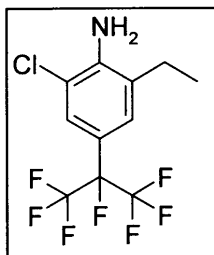
【0641】

50

2-クロロ-6-エチル-4-ヘptaフルオロイソプロピルアニリン出発材料の調製

構造 (D-1 b) の 2-クロロ-6-エチル-4-ヘptaフルオロイソプロピルアニリン出発材料は、まだ文献に記載されていない。文献 (例えば、米国特許第 2002/198399 号) から既知の 2-エチル-4-ヘptaフルオロイソプロピルアニリンから既知の塩素化方法によって調製することができる。

【化 148】



D-1 b

10

【0642】

4.9 g (16.9 mmol) の 2-エチル-4-ヘptaフルオロイソプロピルアニリン (米国特許第 2002/198399 号に従って調製される) を 100 ml のクロロホルムに最初に充填し、この混合物を 45~50 °C まで加熱し、次いで、400 ml のクロロホルム中に溶解した 2.18 ml (26.7 mmol) の塩化スルフルをゆっくりと滴下した。この混合物を 50 °C で一晩攪拌し、次いでさらに、2 ml のクロロホルム中に溶解した 0.34 ml (4.2 mmol) の塩化スルフルを滴下し、この混合物を 50 °C でさらに 3 時間攪拌した。その後、この混合物を冷却し、溶媒を減圧下のロータリーエバポレーター上で除去した。この残留物をジクロロメタン中に取り込み、まず亜硫酸水素ナトリウムで、次いで希釈水酸化ナトリウム溶液で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、溶媒を減圧下のロータリーエバポレーター上で蒸留除去した。精製のため、120 g のシリカゲルを含有するカートリッジを使用し、純粋なシクロヘキサンから 90:10 シクロヘキサン/酢酸エチル (v/v) のグラジエントを用いて、クロマトグラフィーを行った。4.25 g の 2-クロロ-6-エチル-4-ヘptaフルオロイソプロピルアニリンを得た。

20

30

HPLC-MS^a) : log P = 4.67、質量 (m/z) = 324 [M+H]⁺。

¹H NMR (AV400、400 MHz、d₃-アセトニトリル) : δ (ppm) = 7.84 (s、1H)、7.82 (s、1H)、7.53-7.56 (s、2H、ブロード)、2.37 (q、J = 7.6 Hz、2H)、1.06 (t、J = 7.6 Hz、3H)。

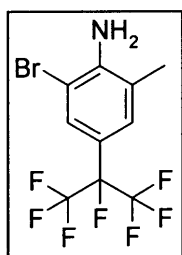
【0643】

2-ブロモ-6-メチル-4-ヘptaフルオロイソプロピルアニリン出発材料の調製

構造 (D-1 c) の 2-ブロモ-6-メチル-4-ヘptaフルオロイソプロピルアニリン出発材料は、まだ文献に記載されていない。文献 (例えば、米国特許第 2004/92762 号) から既知の 2-メチル-4-ヘptaフルオロイソプロピルアニリンから既知の臭素化方法 (例えば、欧州特許第 2319830 号、327 頁) によって調製することができる。

40

【化 1 4 9】



D-1 c

10

【0 6 4 4】

3.4 g (12.356 mmol) の 2-メチル-4-ヘプタフルオロイソプロピルアニリンを 27 ml のジメチルホルムアミド中に溶解し、次いで、2.44 g (13.6 mmol) の N-ブロモスクシンイミドを添加し、この混合物を 60 °C で 1 時間攪拌した。この混合物を冷却し、水と混ぜて、各回 15 ml の n-ヘキサンで 3 回抽出した。混合した有機相を水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下のロータリーエバポレーター上で濃縮した。シリカゲルを含有する 120 g のカートリッジを使用し、純粋なシクロヘキサンから始まり 90 : 10 シクロヘキサン / 酢酸エチル (v / v) までのグラジエント

20

をかけたクロマトグラフィーにより、2.44 g の 2-ブロモ-6-エチル-4-ヘプタフルオロイソプロピルアニリンを得た。

HPLC-MS^{a)} : log P = 4.38、質量 (m/z) = 354 [M+H]⁺。

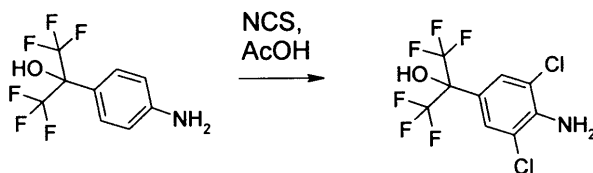
¹H NMR (AV400、400 MHz、d₃-アセトニトリル) : δ (ppm) = 7.51 (s、1H)、7.23 (s、1H)、4.86 (s、2H、ブロード)、2.23 (s、3H)。

【0 6 4 5】

出発化合物 2-(3,5-ジクロロ-4-ヒドラジノフェニル)-1,1,1,3,3,3-ヘキサフルオロプロパン-2-オール

【化 1 5 0】

30



氷酢酸 (40 ml) 中 2-(4-アミノフェニル)-1,1,1,3,3,3-ヘキサフルオロプロパン-2-オール (2.50 g、9.64 mmol) (調製物、例えば、W. A. Sheppard, J. Am. Chem. Soc. 1965, 87, 2410-2420) の溶液に、N-クロロスクシンイミド (2.71 g、20.2 mmol) を室温で添加した。この混合物を 75 °C で 3 時間、次いで室温で 14 時間攪拌した。その後、この混合物を水に添加し、EtOAc で抽出した。有機相を水および飽和 NaHCO₃ 水溶液で洗浄し、硫酸マグネシウム上で乾燥させた。溶媒を除去した後、この残留物を MTBE 中に取り込み、固体を濾過して取り除いた。この濾液を減圧下で濃縮し、粗生成物を、SiO₂ (n-ヘキサン / EtOAc グラジエント) 上でのカラムクロマトグラフィーによって精製した。2.89 g (91%) の 2-(3,5-ジクロロ-4-アミノ-2,2,3,3,4,4-hexafluorophenyl)-2,2,3,3,4,4-hexafluoropropan-1-ol を得た。

40

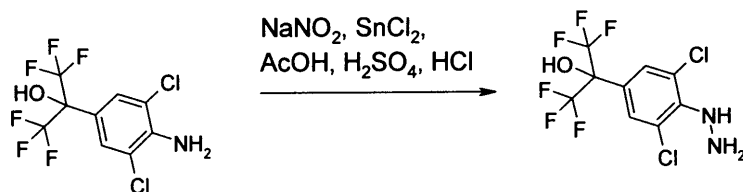
HPLC-MS^{a)} : log P = 3.04、質量 (m/z) = 328 [M+H]⁺。

¹H NMR (400 MHz、d₃-アセトニトリル) : δ = 5.13 (br s、2H

50

)、6.02 (br s、1H)、7.51 (s、2H)。

【化151】



10

【0646】

55℃に加熱した5mlの水酢酸中2-(4-アミノ-3,5-ジクロロフェニル)-1,1,1,3,3,3-ヘキサフルオロプロパン-2-オール(1.88g、5.73mmol)の溶液に、2.5mlの硫酸中亜硝酸ナトリウム(455mg、6.59mmol)の溶液を滴加し、この混合物をこの温度でさらに1時間攪拌した。その後、この混合物を0℃まで冷却し、濃縮HCl(10ml)中塩化スズ(II)(3.37g、17.7mmol)の溶液を滴下した。この混合物を0℃でさらに1時間攪拌し、次いで水に添加し、水酸化ナトリウム溶液でアルカリ性にし、EtOAcで抽出した。有機相を飽和塩化ナトリウム溶液で洗浄し、硫酸マグネシウム上で乾燥させ、溶媒を減圧下で除去した。1.41g(純度90%、理論値64%)の2-(3,5-ジクロロ-4-ヒドラジノフェニル)-1,1,1,3,3,3-ヘキサフルオロプロパン-2-オールを得た。

20

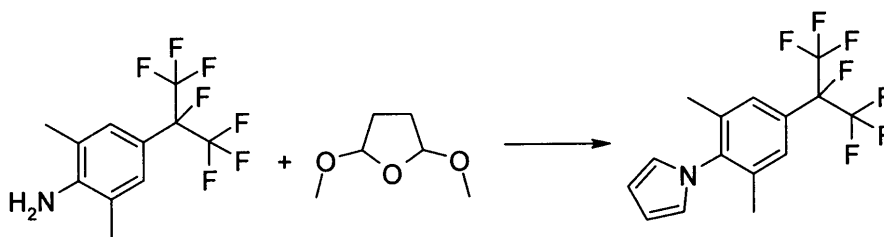
HP LC-MS^{a)}: log P=1.92、質量(m/z)=343 [M+H]⁺。

¹H NMR(600MHz、d₃-アセトニトリル): δ=4.14(br s、2H)、5.90(br s、1H)、6.50(br s、1H)、7.58(s、2H)。

【0647】

実施例I-T46-1

【化152】

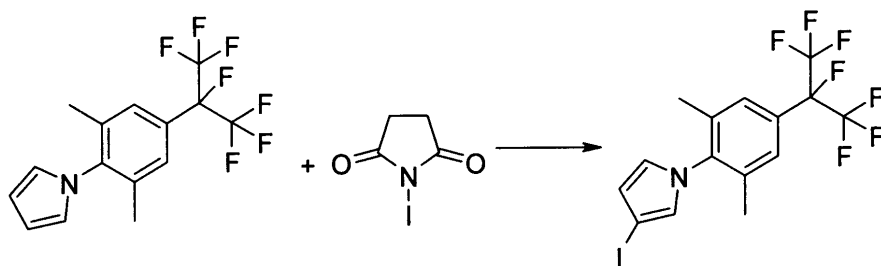


30

10g(34.6mmol)の2,6-ジメチル-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]アニリンを60mlの水酢酸に最初に充填し、5.02g(38.04mmol)の2,6-ジメトキシテトラヒドロフランを添加した。結果として生じる溶液を120℃で2時間加熱した。その後、それを少し冷却し、揮発性成分を減圧下のロータリーエバポレーター上で留去した。この残留物を水で攪拌し、固体を吸水管で濾過して取り除いた。次いで、濾過ケーキをジクロロメタン中に溶解し、溶液を硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下のロータリーエバポレーター上で濃縮した。10.38gの1-[2,6-ジメチル-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル]ピロールを得た。

40

【化 1 5 3】



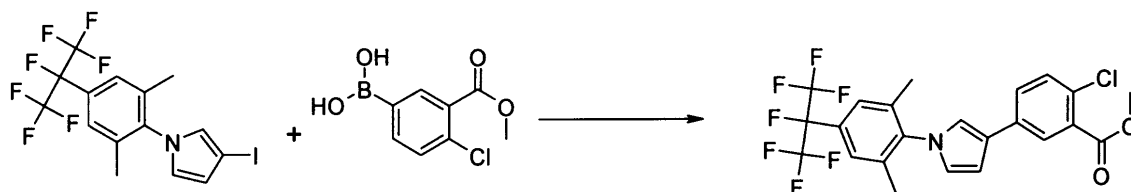
10

【0 6 4 8】

1. 5 g (4.293 mmol) 1-[2,6-ジメチル-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル]-ピロールを60 mlのn-ヘキサン中に溶解し、966 mg (4.3 mmol)のN-ヨードスクシンイミドを添加した。その後、この混合物を室温にし、室温で6日間攪拌した。次いで、さらに242 mg (1.1 mmol)のN-ヨードスクシンイミドを添加し、混合物を室温で一晩攪拌した。その後、過剰な水素-亜硫酸ナトリウム水溶液および少量の酢酸エチルを添加した。有機相を除去し、まず亜硫酸水素ナトリウム水溶液で2回、次いで飽和塩化ナトリウム溶液で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させて濃縮した。精製のため、120 gのシリカゲルを含有するカートリッジおよび純粋なシクロヘキサンから95:5シクロヘキサン/酢酸エチル(v/v)のグラジエントを用いて、クロマトグラフィーを行った。80%1-[2,6-ジメチル-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル]-3-ヨードピロールと16%1-[2,6-ジメチル-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル]-2-ヨードピロールとの混合物を453 mg得た。

20

【化 1 5 4】



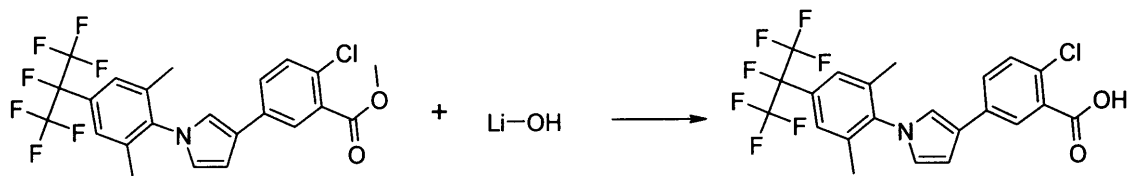
30

【0 6 4 9】

80%の1-[2,6-ジメチル-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル]-3-ヨードピロールと16%1-[2,6-ジメチル-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル]-2-ヨードピロールとの混合物を998 mg (1.696 mmol)および364 mg (1.7 mmol)の4-クロロ-3-(メトキシカルボニル)フェニルボロン酸を10 mlの2-プロパノールに最初に充填した。その後、空気をアルゴンで脱気し、5.2 mlの1モル炭酸水素ナトリウム水溶液および98 mg (0.085 mmol)のテトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(0)をアルゴン下で添加した。その後、この混合物を3時間加熱還流した。後処理として、この混合物を少し冷却し、次いで、減圧下のロータリーエバポレーター上で濃縮した。この残留物を酢酸エチルと水との間で分離した。有機相を除去し、飽和塩化ナトリウム溶液で洗浄し、減圧下のロータリーエバポレーター上で濃縮した。1.57 gの粗メチル2-クロロ-5-[1-[2,6-ジメチル-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル]ピロール-3-イル]安息香酸塩を得た。

40

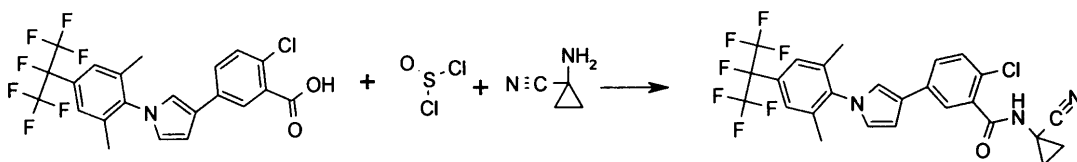
【化 1 5 5】



【0 6 5 0】

416 mg (0.33 mmol、純度約40%)の粗メチル2-クロロ-5-[1-[2,6-ジメチル-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル]ピロール-3-イル]安息香酸塩を18 mlのジオキサンと6 mlの水との混合物に最初に充填し、61 mg (1.46 mmol)の水酸化リチウム水和物を添加する。この混合物を室温で溶解が完了するまで攪拌し、次いで、還流しながら2時間加熱した。次いで、この混合物を減圧下のロータリーエバポレーター上で濃縮し、この残留物を少量の水と混ぜて、濃塩酸でpH 1に調整した。次いで、この混合物を酢酸エチルで2回抽出し、混合した抽出物を飽和塩化ナトリウム溶液で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させて濃縮した。残留物として、207 mgの粗2-クロロ-5-[1-[2,6-ジメチル-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル]ピロール-3-イル]-安息香酸が残存した。

【化 1 5 6】



【0 6 5 1】

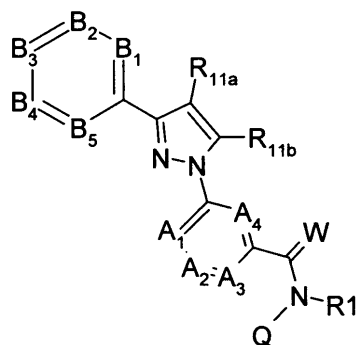
137 mg (0.11 mmol、純度約38%)の粗2-クロロ-5-[1-[2,6-ジメチル-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル]ピロール-3-イル]安息香酸を15 mlのトルエン中に溶解し、230 mg (1.93 mmol)の塩化チオニルを添加した。この混合物を3時間加熱還流した。その後、すべての揮発性成分を減圧下のロータリーエバポレーター上で除去した。この残留物を4 mlのジクロロメタン中に取り込み、2 mlのジクロロメタン中82 mg (0.69 mmol)の1-シアノシクロプロピルアミン塩酸塩と98 mg (0.96 mmol)のトリエチルアミンとの混合物に0℃で滴下した。その後、この混合物を室温で一晩攪拌した。後処理として、この混合物を5%リン酸二水素ナトリウム水溶液で、次いで飽和塩化ナトリウム溶液で洗浄し、有機相を硫酸ナトリウムで乾燥させて濃縮した。この残留物を、15 gのシリカゲルを含有するカートリッジおよび85:15シクロヘキサン/酢酸エチル(v/v)を使用してクロマトグラフした。生成物を含有する留分を濃縮し、アセトニトリル/0.1%含水H₃PO₄のグラジエントで調製HPLC (Zorbax Eclipse Plus C18 1.8 μm、50×4.6 mmによって精製した。13 mgの2-クロロ-N-シクロプロピル-5-[1-[2,6-ジメチル-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル]ピロール-3-イル]ベンズアミド (化合物 I-T46-1) を得た。

HPLC-MS^a) : log P = 4.90、質量 (m/z) = 558 [M+H]⁺。

¹H NMR (400 MHz、d₃-アセトニトリル) : δ = 7.63–7.67 (m、2H)、7.56 (s (ブロード)、1H (N-H))、7.51 (s、2H)、7.41 (d、J = 8.3 Hz、1H)、7.16–7.17 (m、1H)、6.75–6.7

7 (m、1 H)、6.72–6.73 (m、1 H)、2.14 (s、6 H)、1.55–1.59 (m、2 H)、1.32–1.39 (m、2 H)。

表 I – T 2
【化 1 5 7】



10

I – T 2

B₂ および B₄ = C – H、W = O

【表 1】

実施例 番号	B ₁	B ₃	B ₅	R ₁	R _{11a}	R _{11b}	A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	Q	logP _{a)}	質量 [m/z] a)1)
I-T2-1	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	シクロプロピル	4.9	534
I-T2-2	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	1- (シアノ) シクロプロピル	4.8	559

10

20

30

40

【表 2】

実施例 番号	B ₁	B ₃	B ₅	R ^{11a}	R ^{11b}	A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	W	R ₁	Q	logP _a	質量 [m/z] a)1)
I-T3-1	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	4.4	534
I-T3-2	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	CH ₂ CF ₃	4.7	577
I-T3-3	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	4.2	559
I-T3-4	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	チエタン-3-イル	4.7	566
I-T3-5	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1- (トリフルオロメチル) シクロプロピル	4.6	602
I-T3-6	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	2-オキソ-2- (2, 2, 2- トリフルオロエチルアミノ) -エチル	4.1	633
I-T3-7	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	C-H	N	C-H	C-H	O	H	シクロプロピル	3.4	501
I-T3-8	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	C-H	N	C-H	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	3.4	526
I-T3-9	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	C-H	C-H	C-H	CF	O	H	シクロプロピル	4.3	518
I-T3-10	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	C-H	C-H	C-H	CF	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	4.2	543
I-T3-11	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	C-Cl	C-H	C-F	C-H	O	H	シクロプロピル	4.9	552

10

20

30

40

実施例 番号	B ₁	B ₃	B ₅	R ^{IIa}	R ^{IIb}	A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	W	R ₁	Q	logP _a	質量 [m/z] a))
I-T3-12	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	C-Cl	C-H	C-F	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	4.7	577
I-T3-13	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	CF	C-H	C-H	C-H	O	H	シクロプロピル	4.5	518
I-T3-14	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	CF	C-H	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	4.5	552
I-T3-15	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	C-H	C-CF ₃	C-H	C-H	O	H	シクロプロピル	4.9	568
I-T3-16	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	C-CH ₃	C-H	C-H	C-H	O	H	シクロプロピル	4.4	514
I-T3-17	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	CF	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	4.4	577
I-T3-18	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	C-H	C-CF ₃	C-H	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	4.7	593
I-T3-19	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	CF	C-H	C-H	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	4.3	543
I-T3-20	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	3.8	535
I-T3-21	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	3.7	560
I-T3-22	C-Cl	C-i-C ₃ F ₇	C-Cl	H	H	C-H	C-H	C-H	C-F	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	4.1	583
I-T3-23	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	4.2	599

10

20

30

40

実施例 番号	B ₁	B ₃	B ₅	R ^{11a}	R ^{11b}	A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	W	R1	Q	logP _a	質量 [m/z] a))
I-T3-24	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	4.3	574
I-T3-25	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	CH ₂ CF ₃	4.7	616
I-T3-26	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	CH ₂ CH ₂ CF ₃	4.7	630
I-T3-27	C-CH ₃	C-CF ₃	C-CH ₃	H	H	C-H	C-H	C-Cl	H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	3.4	499
I-T3-28	C-CH ₃	C-CF ₃	C-CH ₃	H	H	C-H	C-H	C-Cl	H	O	H	シクロプロピル	3.5	474
I-T3-29	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	C-H	N	C-H	C-H	O	H	シクロプロピル	3.3	541
I-T3-30	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	C-H	N	C-H	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	3.2	566
I-T3-31	C-Cl	C-i-C ₃ F ₇	C-H	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	4.3	540
I-T3-32	C-Cl	C-i-C ₃ F ₇	C-H	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	CH ₂ CF ₃	4.7	582
I-T3-33	C-Cl	C-i-C ₃ F ₇	C-H	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	CH ₂ CH ₂ CF ₃	4.7	596
I-T3-34	C-OCF ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-H	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	4.6	615
I-T3-35	C-OCF ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-H	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	4.7	590
I-T3-36	C-OCF ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-H	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	CH ₂ CF ₃	5.0	632
I-T3-37	C-OCF ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-H	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	チエタン-3-イル	4.9	622

実施例 番号	B ₁	B ₃	B ₅	R ^{IIa}	R ^{IIb}	A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	W	R _I	Q	logP _a	質量 [m/z] a))
I-T3-38	C-C ₂ H ₅	C-i-C ₃ F ₇	C-H	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	4.5	559
I-T3-39	C-C ₂ H ₅	C-i-C ₃ F ₇	C-H	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	4.6	534
I-T3-40	C-C ₂ H ₅	C-i-C ₃ F ₇	C-H	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	CH ₂ CF ₃	4.9	576
I-T3-41	C-C ₂ H ₅	C-i-C ₃ F ₇	C-H	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	チエタン-3-イル	4.9	566
I-T3-42	C-Cl	C-i-C ₃ F ₇	C-Cl	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	3.8	575
I-T3-43	C-Cl	C-i-C ₃ F ₇	C-Cl	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	3.8	600
I-T3-44	C-C ₂ H ₅	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	4.7	548
I-T3-45	C-C ₂ H ₅	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	CH ₂ CF ₃	5.0	590
I-T3-46	C-C ₂ H ₅	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	4.6	573
I-T3-47	C-C ₂ H ₅	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	チエタン-3-イル	5.0	580
I-T3-48	C-F	C-CF ₃	C-F	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	3.2	442
I-T3-49	C-F	C-CF ₃	C-F	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	3.2	467
I-T3-50	C-F	C-CF ₃	C-OCH ₃	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	3.1	454

10

20

30

40

実施例 番号	B ₁	B ₃	B ₅	R ^{11a}	R ^{11b}	A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	W	R1	Q	logP _{a)}	質量 [m/z] a))
I-T3-51	C-F	C-CF ₃	C-OCH ₃	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	3.1	479
I-T3-52	C-CF ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-H	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	4.3	574
I-T3-53	C-CF ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-H	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	4.3	599
I-T3-54	C-CF ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	4.4	588
I-T3-55	C-CF ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	4.3	613
I-T3-56	C-CF ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-Cl	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	4.4	608
I-T3-57	C-CF ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-Cl	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	4.3	633
I-T3-58	C-CF ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-Cl	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	CH ₂ CF ₃	4.7	650
I-T3-59	C-Cl	C-CF ₃	N	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	3.1	466
I-T3-60	C-Cl	C-CF ₃	N	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	3.2	441
I-T3-61	C-F	C-i-C ₃ F ₇	C-F	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	4.0	542
I-T3-62	C-F	C-i-C ₃ F ₇	C-F	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	3.9	567
I-T3-63	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-Cl	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	4.4	554
I-T3-64	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-Cl	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	4.2	579

実施例 番号	B ₁	B ₃	B ₅	R ^{11a}	R ^{11b}	A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	W	R ₁	Q	logP _a	質量 [m/z] a))
I-T3-65	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-F	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	4.4	577
I-T3-66	C-C ₂ H ₅	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-F	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	4.6	591
I-T3-67	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-F	O	H	シクロプロピル	4.4	552
I-T3-68	C-C ₂ H ₅	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-F	O	H	シクロプロピル	4.6	566
I-T3-69	C-C ₂ H ₅	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	C-H	C-H	C-H	C-F	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	4.3	557
I-T3-70	C-C ₂ H ₅	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	C-H	C-H	C-H	C-F	O	H	シクロプロピル	4.3	532
I-T3-71	C-C ₂ H ₅	C-i-C ₃ F ₇	C-Cl	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	4.5	593
I-T3-72	C-C ₂ H ₅	C-i-C ₃ F ₇	C-Cl	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	4.6	568
I-T3-73	C-Cl	C-i-C ₃ F ₇	C-Cl	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-F	O	H	シクロプロピル	4.5	592
I-T3-74	C-C ₂ H ₅	C-i-C ₃ F ₇	C-H	H	H	C-H	C-H	C-H	C-F	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	4.1	543
I-T3-75	C-C ₂ H ₅	C-i-C ₃ F ₇	C-H	H	H	C-H	C-H	C-H	C-F	O	H	シクロプロピル	4.2	518
I-T3-76	C-C ₂ H ₅	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	C-H	N	C-H	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	3.4	540
I-T3-77	C-C ₂ H ₅	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	C-H	N	C-H	C-H	O	H	シクロプロピル	3.4	515
I-T3-78	C-C ₂ H ₅	C-i-C ₃ F ₇	C-H	H	H	C-H	N	C-H	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	3.2	526

10

20

30

40

実施例 番号	B ₁	B ₃	B ₅	R ^{11a}	R ^{11b}	A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	W	R1	Q	logP _{a)}	質量 [m/z] a)1)
I-T3-79	C-C ₂ H ₅	C-i-C ₃ F ₇	C-H	H	H	C-H	N	C-H	C-H	O	H	シクロプロピル	3.3	501
I-T3-80	C-C ₂ H ₅	C-C ₂ F ₅	C-CH ₃	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	4.2	523
I-T3-81	C-C ₂ H ₅	C-C ₂ F ₅	C-CH ₃	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	4.3	498
I-T3-82	C-C ₂ H ₅	C-C ₂ F ₅	C-CH ₃	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	CH ₂ CF ₃	4.0	540
I-T3-83	C-C ₂ H ₅	C-C ₂ F ₅	C-CH ₃	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	チエタン-3-イル	4.6	530
I-T3-84	C-CF ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	CH ₂ CF ₃	4.7	630
I-T3-85	C-CF ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	チエタン-3-イル	4.7	620
I-T3-86	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-Br	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	4.5	598
I-T3-87	C-Cl	C-OCF ₃	C-Cl	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	3.6	515
I-T3-88	C-Cl	C-OCF ₃	C-Cl	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	3.6	490
I-T3-89	C-Cl	C-OCF ₃	C-H	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	3.5	481
I-T3-90	C-Cl	C-OCF ₃	C-H	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	3.6	456
I-T3-91	C-Cl	C-i-C ₃ F ₇	C-Cl	H	H	C-H	N	C-CH ₃	C-H	O	H	シクロプロピル	3.3	555
I-T3-92	C-Cl	C-i-C ₃ F ₇	C-Cl	H	H	C-H	N	C-CH ₃	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	3.4	580
I-T3-93	C-Cl	C-i-C ₃ F ₇	C-Cl	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1- (tert. ブチル) シクロプロピル	4.7	588

10

20

30

40

実施例 番号	B ₁	B ₃	B ₅	R ^{11a}	R ^{11b}	A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	W	RI	Q	logP _{a)}	質量 [m/z] a)1)
I-T3-94	C-CF ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1- (tert. ブチル) シクロプロピル	4.7	602
I-T3-95	C-Cl	C-CF ₃	C-Cl	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	3.1	500
I-T3-96	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	C-H	N	C-CH ₃	C-H	O	H	シクロプロピル	3.3	515
I-T3-97	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	C-H	N	C-CH ₃	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	3.4	540
I-T3-98	C-Cl	C-CF ₃	C-Cl	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	3.1	475
I-T3-99	C-Cl	C-CF ₃	C-Cl	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	O	CH ₃	シクロプロピル	3.5	489
I-T3-100	C-Cl	C-i-C ₃ F ₇	C-Cl	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	O	CH ₃	シクロプロピル	4.4	589
I-T3-101	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	O	CH ₃	シクロプロピル	4.4	549
I-T3-102	C-Cl	C-i-C ₃ F ₇	C-Cl	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	O	CH ₃	1- (シアノ) シクロプロピル	4.3	614
I-T3-103	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	O	CH ₃	1- (シアノ) シクロプロピル	4.3	574
I-T3-104	C-C ₂ H ₅	C-i-C ₃ F ₈	C-H	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	4.2	535
I-T3-105	C-C ₂ H ₅	C-i-C ₃ F ₈	C-H	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	4.1	560
I-T3-106	C-CF ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	4.0	589
I-T3-107	C-CF ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	O	CH ₃	シクロプロピル	4.5	603

10

20

30

40

実施例 番号	B ₁	B ₃	B ₅	R ^{11a}	R ^{11b}	A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	W	R ₁	Q	logP _{a)}	質量 [m/z] a)1)
I-T3-108	C-CF ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	4.0	614
I-T3-109	C-C ₂ H ₅	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	4.2	549
I-T3-110	C-C ₂ H ₅	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	4.1	574
I-T3-111	C-CF ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	O	CH ₃	1- (シアノ) シクロプロピル	4.4	628
I-T3-112	C-CF ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-Cl	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	4.0	609
I-T3-113	C-CF ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-Cl	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	O	CH ₃	シクロプロピル	4.0	623
I-T3-114	C-CF ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-Cl	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	4.0	634
I-T3-115	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	C-H	N	C-CH ₃	C-H	O	CH ₃	1- (シアノ) シクロプロピル	3.8	554
I-T3-116	C-CF ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-Cl	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	O	CH ₃	1- (シアノ) シクロプロピル	4.3	648
I-T3-117	C-CF ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	C-H	N	C-CH ₃	C-H	O	H	シクロプロピル	3.5	569
I-T3-118	C-CF ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	C-H	N	C-CH ₃	C-H	O	CH ₃	シクロプロピル	3.8	583
I-T3-119	C-CF ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	C-H	N	C-CH ₃	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	3.6	594
I-T3-120	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	C-H	N	C-CH ₃	C-H	O	CH ₃	シクロプロピル	3.6	529
I-T3-121	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	N	C-H	C-Cl	N	O	H	シクロプロピル	4.5	536

10

20

30

40

実施例 番号	B ₁	B ₃	B ₅	R ^{IIa}	R ^{IIb}	A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	W	R1	Q	logP _{a)}	質量 [m/z] a))
I-T3-122	C-Cl	C-CF ₃	N	H	H	C-H	C-H	C-H	C-H	O	H	シクロプロピル	3.0	407
I-T3-123	C-CF ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	C-H	N	C-CH ₃	C-H	O	CH ₃	1 - (シアノ) シクロプロピル	3.9	608
I-T3-124	C-CF ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-Cl	H	H	C-H	N	C-CH ₃	C-H	O	H	シクロプロピル	3.5	589
I-T3-125	C-CF ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-Cl	H	H	C-H	N	C-CH ₃	C-H	O	H	1 - (シアノ) シクロプロピル	3.8	614
I-T3-126	C-Cl	C-i-C ₃ F ₇	C-Cl	CN	NH ₂	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1 - (シアノ) シクロプロピル	4.1	639
I-T3-127	C-Cl	C-CF ₃	C-Cl	H	H	C-H	N	C-CH ₃	C-H	O	H	シクロプロピル	2.5	455
I-T3-128	C-Cl	C-CF ₃	C-Cl	H	H	C-H	N	C-CH ₃	C-H	O	CH ₃	シクロプロピル	2.8	469
I-T3-129	C-Cl	C-CF ₃	C-Cl	H	H	C-H	N	C-CH ₃	C-H	O	H	1 - (シアノ) シクロプロピル	2.6	480
I-T3-130	C-CF ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-Cl	H	H	C-H	N	C-CH ₃	C-H	O	CH ₃	シクロプロピル	3.8	603
I-T3-131	C-CF ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-Cl	H	H	C-H	N	C-CH ₃	C-H	O	CH ₃	1 - (シアノ) シクロプロピル	3.9	628
I-T3-132	C-Cl	C-CF ₃	C-Cl	H	H	C-H	N	C-CH ₃	C-H	O	CH ₃	1 - (シアノ) シクロプロピル	2.9	494
I-T3-133	C-Cl	C-i-C ₃ F ₇	C-Cl	H	H	C-H	N	C-CH ₃	C-H	O	CH ₃	シクロプロピル	3.7	569
I-T3-134	C-CF ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-H	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	CH ₃	シクロプロピル	4.9	588
I-T3-135	C-Cl	C-i-C ₃ F ₇	C-Cl	H	H	C-H	N	C - (1 - ピ ロリジニル)	C-H	O	H	シクロプロピル	4.3	610

10

20

30

40

実施例 番号	B ₁	B ₃	B ₅	R ^{11a}	R ^{11b}	A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	W	R ₁	Q	logP _{a)}	質量 [m/z] a))
I-T3-136	C-Cl	C-i-C ₃ F ₇	C-Cl	H	H	C-H	N	C-NH CH ₃	C-H	O	H	シクロプロピル	3.5	570
I-T3-137	C-Cl	C-i-C ₃ F ₇	C-Cl	H	H	C-H	N	C-NH-シクロ プロピル	C-H	O	H	シクロプロピル	3.4	596
I-T3-138	C-Cl	C-i-C ₃ F ₇	C-Cl	H	H	C-H	N	C-NH-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	C-H	O	H	シクロプロピル	4.1	614
I-T3-139	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	C-H	N	C-シクロ プロピル	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	4.1	566
I-T3-140	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	C-H	N	C-シクロ プロピル	C-H	O	H	シクロプロピル	4.2	541
I-T3-141	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	C-H	N	C-OCH ₃	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	4.4	556
I-T3-142	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	C-H	N	C-シクロ プロピル	C-H	O	CH ₃	シクロプロピル	4.6	555
I-T3-143	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	C-H	N	C-OCH ₃	C-H	O	H	シクロプロピル	4.6	531
I-T3-144	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	C-H	N	C-OCH ₃	C-H	O	CH ₃	シクロプロピル	4.4	545
I-T3-145	C-Cl	C-CF ₃	C-Cl	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	O	C ₂ H ₅	シクロプロピル	3.8	503
I-T3-146	C-Cl	C-CF ₃	C-Cl	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	O	H	N-メチル-ピラゾール -3-イル	2.8	515
I-T3-147	C-Cl	C-CF ₃	C-Cl	H	H	C-H	N	C-CH ₃	C-H	O	H	C ₂ H ₅	4.0	443
I-T3-148	C-CF ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-Br	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	4.5	652

10

20

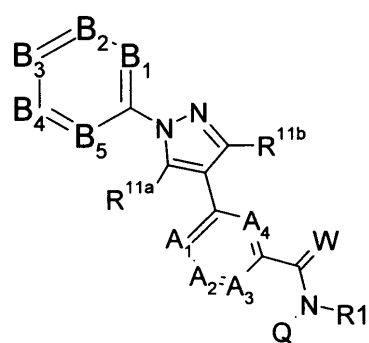
30

40

実施例 番号	B ₁	B ₃	B ₅	R ^{11a}	R ^{11b}	A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	W	R1	Q	logP _{a)}	質量 [m/z] a))
I-T3-149	C-CF ₃	C-CF ₃	N	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	3.5	500
I-T3-150	C-CF ₃	C-CF ₃	N	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	3.6	475
I-T3-151	C-Cl	C-i-C ₃ F ₇	N	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	4.0	566
I-T3-152	C-Cl	C-i-C ₃ F ₇	N	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	4.1	541
I-T3-153	C-S(O) C ₂ H ₅	C-i-C ₃ F ₇	N	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	3.7	608
I-T3-154	C-S(O ₂) C ₂ H ₅	C-i-C ₃ F ₇	N	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	3.8	624
I-T3-155	C-CF ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-Br	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	4.4	677
I-T3-156	C-SC ₂ H ₅	C-i-C ₃ F ₇	N	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	4.7	567
I-T3-157	C-S(O) C ₂ H ₅	C-i-C ₃ F ₇	N	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	3.8	583
I-T3-158	C-S(O ₂) C ₂ H ₅	C-i-C ₃ F ₇	N	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	3.9	599
I-T3-159	C-CF ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-Cl	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	O	H	1- (チオカルバモイル) -シクロプロピル	3.8	668
I-T3-160	C-CF ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-Br	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	4.0	653

実施例 番号	B ₁	B ₃	B ₅	R ^{11a}	R ^{11b}	A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	W	R1	Q	logP _{a)}	質量 [m/z] a))
I-T3-161	C-CF ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	S	H	シクロプロピル	5.0	604
I-T3-162	C-OCF ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-Cl	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	4.6	624
I-T3-163	C-OCF ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-Cl	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	4.5	649

【化 1 5 8】



I - T 3

B₂ および B₄ = C - H

【表 3】

実施例 番号	B ₁	B ₂	B ₃	B ₄	B ₅	R ^{11a}	R ^{11b}	A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	W	R1	Q	logP _{a)}	質量 [m/z] a)1)
I-T3-1	C-CH ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-CH ₃	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	4.4	534
I-T3-2	C-CH ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-CH ₃	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	CH ₂ CF ₃	4.7	577
I-T3-3	C-CH ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-CH ₃	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	4.2	559
I-T3-4	C-CH ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-CH ₃	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	チエタン-3-イル	4.7	566
I-T3-5	C-CH ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-CH ₃	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1- (トリフルオロ メチル) シクロプロピ ル	4.6	602
I-T3-6	C-CH ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-CH ₃	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	2-オキソ-2- (2, 2, 2-トリフルオロ エチルアミノ) -エチ ル	4.1	633
I-T3-7	C-CH ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-CH ₃	H	H	C-H	N	C-H	C-H	O	H	シクロプロピル	3.4	501
I-T3-8	C-CH ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-CH ₃	H	H	C-H	N	C-H	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	3.4	526
I-T3-9	C-CH ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-CH ₃	H	H	C-H	C-H	C-H	C-F	O	H	シクロプロピル	4.3	518
I-T3-10	C-CH ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-CH ₃	H	H	C-H	C-H	C-H	C-F	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	4.2	543
I-T3-11	C-CH ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-CH ₃	H	H	C-Cl	C-H	C-F	C-H	O	H	シクロプロピル	4.9	552

10

20

30

40

実施例 番号	B ₁	B ₂	B ₃	B ₄	B ₅	R ^{11a}	R ^{11b}	A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	W	R1	Q	logP _{a)}	質量 [m/z] a))
I-T3-12	C-CH ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-CH ₃	H	H	C-Cl	C-H	C-F	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	4.7	577
I-T3-13	C-CH ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-CH ₃	H	H	C-F	C-H	C-H	C-H	O	H	シクロプロピル	4.5	518
I-T3-14	C-CH ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-CH ₃	H	H	C-F	C-H	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	4.5	552
I-T3-15	C-CH ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-CH ₃	H	H	C-H	C-CF ₃	C-H	C-H	O	H	シクロプロピル	4.9	568
I-T3-16	C-CH ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-CH ₃	H	H	C-CH ₃	C-H	C-H	C-H	O	H	シクロプロピル	4.4	514
I-T3-17	C-CH ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-CH ₃	H	H	C-F	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	4.4	577
I-T3-18	C-CH ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-CH ₃	H	H	C-H	C-CF ₃	C-H	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	4.7	593
I-T3-19	C-CH ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-CH ₃	H	H	C-F	C-H	C-H	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	4.3	543
I-T3-20	C-CH ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-CH ₃	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	3.8	535
I-T3-21	C-CH ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-CH ₃	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	3.7	560
I-T3-22	C-Cl	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-Cl	H	H	C-H	C-H	C-H	C-F	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	4.1	583
I-T3-23	C-CH ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-CH ₃	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	4.2	599
I-T3-24	C-CH ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-CH ₃	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	4.3	574

実施例 番号	B ₁	B ₂	B ₃	B ₄	B ₅	R ^{11a}	R ^{11b}	A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	W	R1	Q	logP a)	質量 [m/z] a))
I-T3-25	C-CH ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-CH ₃	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	CH ₂ CF ₃	4.7	616
I-T3-26	C-CH ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-CH ₃	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	CH ₂ CH ₂ CF ₃	4.7	630
I-T3-27	C-CH ₃	C-H	C-CF ₃	C-H	C-CH ₃	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	3.4	499
I-T3-28	C-CH ₃	C-H	C-CF ₃	C-H	C-CH ₃	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	3.5	474
I-T3-29	C-CH ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-CH ₃	H	H	C-H	N	C-H	C-H	O	H	シクロプロピル	3.3	541
I-T3-30	C-CH ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-CH ₃	H	H	C-H	N	C-H	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	3.2	566
I-T3-31	C-Cl	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-H	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	4.3	540
I-T3-32	C-Cl	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-H	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	CH ₂ CF ₃	4.7	582
I-T3-33	C-Cl	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-H	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	CH ₂ CH ₂ CF ₃	4.7	596
I-T3-34	C-OCF ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-H	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	4.6	615
I-T3-35	C-OCF ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-H	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	4.7	590
I-T3-36	C-OCF ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-H	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	CH ₂ CF ₃	5.0	632
I-T3-37	C-OCF ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-H	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	チエタノン-3-イル	4.9	622
I-T3-38	C-C ₂ H ₅	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-H	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	4.5	559
I-T3-39	C-C ₂ H ₅	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-H	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	4.6	534

10

20

30

40

実施例 番号	B ₁	B ₂	B ₃	B ₄	B ₅	R ^{IIa}	R ^{IIb}	A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	W	R _I	Q	logP _a	質量 [m/z] a))
I-T3-40	C-C ₂ H ₅	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-H	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	CH ₂ CF ₃	4.9	576
I-T3-41	C-C ₂ H ₅	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-H	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	チエタン-3-イル	4.9	566
I-T3-42	C-Cl	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-Cl	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	3.8	575
I-T3-43	C-Cl	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-Cl	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	O	H	1-(シアノ) シクロプロピル	3.8	600
I-T3-44	C-C ₂ H ₅	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-CH ₃	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	4.7	548
I-T3-45	C-C ₂ H ₅	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-CH ₃	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	CH ₂ CF ₃	5.0	590
I-T3-46	C-C ₂ H ₅	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-CH ₃	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1-(シアノ) シクロプロピル	4.6	573
I-T3-47	C-C ₂ H ₅	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-CH ₃	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	チエタン-3-イル	5.0	580
I-T3-48	C-F	C-H	C-CF ₃	C-H	C-F	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	3.2	442
I-T3-49	C-F	C-H	C-CF ₃	C-H	C-F	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1-(シアノ) シクロプロピル	3.2	467
I-T3-50	C-F	C-H	C-CF ₃	C-H	C-OCH ₃	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	3.1	454
I-T3-51	C-F	C-H	C-CF ₃	C-H	C-OCH ₃	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1-(シアノ) シクロプロピル	3.1	479
I-T3-52	C-CF ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-H	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	4.3	574
I-T3-53	C-CF ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-H	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1-(シアノ) シクロプロピル	4.3	599

10

20

30

40

実施例 番号	B ₁	B ₂	B ₃	B ₄	B ₅	R ^{11a}	R ^{11b}	A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	W	R ¹	Q	logP _{a)}	質量 [m/z] a))
I-T3-54	C-CF ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-CH ₃	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	4.4	588
I-T3-55	C-CF ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-CH ₃	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	4.3	613
I-T3-56	C-CF ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-Cl	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	4.4	608
I-T3-57	C-CF ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-Cl	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	4.3	633
I-T3-58	C-CF ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-Cl	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	CH ₂ CF ₃	4.7	650
I-T3-59	C-Cl	C-H	C-CF ₃	C-H	N	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	3.1	466
I-T3-60	C-Cl	C-H	C-CF ₃	C-H	N	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	3.2	441
I-T3-61	C-F	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-F	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	4.0	542
I-T3-62	C-F	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-F	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	3.9	567
I-T3-63	C-CH ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-Cl	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	4.4	554
I-T3-64	C-CH ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-Cl	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	4.2	579
I-T3-65	C-CH ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-CH ₃	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-F	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	4.3	577
I-T3-66	C-C ₂ H ₅	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-CH ₃	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-F	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	4.6	591
I-T3-67	C-CH ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-CH ₃	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-F	O	H	シクロプロピル	4.4	552

実施例 番号	B ₁	B ₂	B ₃	B ₄	B ₅	R ^{11a}	R ^{11b}	A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	W	R _I	Q	logP _a	質量 [m/z] a))
I-T3-68	C-C ₂ H ₅	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-CH ₃	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-F	O	H	シクロプロピル	4.8	566
I-T3-69	C-C ₂ H ₅	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-CH ₃	H	H	C-H	C-H	C-H	C-F	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	4.5	557
I-T3-70	C-C ₂ H ₅	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-CH ₃	H	H	C-H	C-H	C-H	C-F	O	H	シクロプロピル	4.7	532
I-T3-71	C-C ₂ H ₅	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-Cl	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	4.5	593
I-T3-72	C-C ₂ H ₅	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-Cl	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	4.6	568
I-T3-73	C-Cl	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-Cl	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-F	O	H	シクロプロピル	4.5	592
I-T3-74	C-C ₂ H ₅	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-H	H	H	C-H	C-H	C-H	C-F	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	4.5	543
I-T3-75	C-C ₂ H ₅	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-H	H	H	C-H	C-H	C-H	C-F	O	H	シクロプロピル	4.7	518
I-T3-76	C-C ₂ H ₅	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-CH ₃	H	H	C-H	N	C-H	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	3.4	540
I-T3-77	C-C ₂ H ₅	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-CH ₃	H	H	C-H	N	C-H	C-H	O	H	シクロプロピル	3.4	515
I-T3-78	C-C ₂ H ₅	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-H	H	H	C-H	N	C-H	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	3.8	526
I-T3-79	C-C ₂ H ₅	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-H	H	H	C-H	N	C-H	C-H	O	H	シクロプロピル	3.3	501
I-T3-80	C-C ₂ H ₅	C-H	C-C ₂ F ₅	C-H	C-CH ₃	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	4.2	523
I-T3-81	C-C ₂ H ₅	C-H	C-C ₂ F ₅	C-H	C-CH ₃	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	4.3	498
I-T3-82	C-C ₂ H ₅	C-H	C-C ₂ F ₅	C-H	C-CH ₃	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	CH ₂ CF ₃	4.0	540

実施例 番号	B ₁	B ₂	B ₃	B ₄	B ₅	R ^{11a}	R ^{11b}	A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	W	R1	Q	logP _{a)}	質量 [m/z] a))
I-T3-83	C-C ₂ H ₅	C-H	C-C ₂ F ₅	C-H	C-CH ₃	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	チエタン-3-イル	4.6	530
I-T3-84	C-CF ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-CH ₃	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	CH ₂ CF ₃	4.7	630
I-T3-85	C-CF ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-CH ₃	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	チエタン-3-イル	4.7	620
I-T3-86	C-CH ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-Br	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	4.5	598
I-T3-87	C-Cl	C-H	C-OCF ₃	C-H	C-Cl	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	3.6	515
I-T3-88	C-Cl	C-H	C-OCF ₃	C-H	C-Cl	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	3.6	490
I-T3-89	C-Cl	C-H	C-OCF ₃	C-H	C-H	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	3.5	481
I-T3-90	C-Cl	C-H	C-OCF ₃	C-H	C-H	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	3.6	456
I-T3-91	C-Cl	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-Cl	H	H	C-H	N	C-CH ₃	C-H	O	H	シクロプロピル	3.3	555
I-T3-92	C-Cl	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-Cl	H	H	C-H	N	C-CH ₃	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	3.4	580
I-T3-93	C-Cl	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-Cl	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1- (tert. ブチル) シクロプロピル	4.7	588
I-T3-94	C-CF ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-CH ₃	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1- (tert. ブチル) シクロプロピル	4.7	602
I-T3-95	C-Cl	C-H	C-CF ₃	C-H	C-Cl	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	3.1	500

実施例 番号	B ₁	B ₂	B ₃	B ₄	B ₅	R ^{11a}	R ^{11b}	A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	W	R ₁	Q	logP _a)	質量 [m/z] a)1)
I-T3-96	C-CH ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-CH ₃	H	H	C-H	N	C-CH ₃	C-H	O	H	シクロプロピル	3.3	515
I-T3-97	C-CH ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-CH ₃	H	H	C-H	N	C-CH ₃	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	3.4	540
I-T3-98	C-Cl	C-H	C-CF ₃	C-H	C-Cl	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	3.1	475
I-T3-99	C-Cl	C-H	C-CF ₃	C-H	C-Cl	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	O	CH ₃	シクロプロピル	3.5	489
I-T3-100	C-Cl	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-Cl	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	O	CH ₃	シクロプロピル	4.4	589
I-T3-101	C-CH ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-CH ₃	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	O	CH ₃	シクロプロピル	4.4	549
I-T3-102	C-Cl	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-Cl	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	O	CH ₃	1- (シアノ) シクロプロピル	4.3	614
I-T3-103	C-CH ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-CH ₃	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	O	CH ₃	1- (シアノ) シクロプロピル	4.3	574
I-T3-104	C-C ₂ H ₅	C-H	C-i-C ₃ F ₈	C-H	C-H	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	4.2	535
I-T3-105	C-C ₂ H ₅	C-H	C-i-C ₃ F ₈	C-H	C-H	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	4.1	560
I-T3-106	C-CF ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-CH ₃	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	4.0	589
I-T3-107	C-CF ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-CH ₃	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	O	CH ₃	シクロプロピル	4.5	603
I-T3-108	C-CF ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-CH ₃	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	4.0	614
I-T3-109	C-C ₂ H ₅	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-CH ₃	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	4.2	549
I-T3-110	C-C ₂ H ₅	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-CH ₃	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	4.1	574

実施例 番号	B ₁	B ₂	B ₃	B ₄	B ₅	R ^{11a}	R ^{11b}	A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	W	R1	Q	logP _{a)}	質量 [m/z] a1)
I-T3-111	C-CF ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-CH ₃	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	O	CH ₃	1 - (シアノ) シクロプロピル	4.4	628
I-T3-112	C-CF ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-Cl	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	4.0	609
I-T3-113	C-CF ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-Cl	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	O	CH ₃	シクロプロピル	4.0	623
I-T3-114	C-CF ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-Cl	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	O	H	1 - (シアノ) シクロプロピル	4.0	634
I-T3-115	C-CH ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-CH ₃	H	H	C-H	N	C-CH ₃	C-H	O	CH ₃	1 - (シアノ) シクロプロピル	3.8	554
I-T3-116	C-CF ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-Cl	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	O	CH ₃	1 - (シアノ) シクロプロピル	4.3	648
I-T3-117	C-CF ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-CH ₃	H	H	C-H	N	C-CH ₃	C-H	O	H	シクロプロピル	3.5	569
I-T3-118	C-CF ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-CH ₃	H	H	C-H	N	C-CH ₃	C-H	O	CH ₃	シクロプロピル	3.8	583
I-T3-119	C-CF ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-CH ₃	H	H	C-H	N	C-CH ₃	C-H	O	H	1 - (シアノ) シクロプロピル	3.6	594
I-T3-120	C-CH ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-CH ₃	H	H	C-H	N	C-CH ₃	C-H	O	CH ₃	シクロプロピル	3.6	529
I-T3-121	C-CH ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-CH ₃	H	H	N	C-H	C-Cl	N	O	H	シクロプロピル	4.5	536
I-T3-122	C-Cl	C-H	C-CF ₃	C-H	N	H	H	C-H	C-H	C-H	C-H	O	H	シクロプロピル	3.0	407
I-T3-123	C-CF ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-CH ₃	H	H	C-H	N	C-CH ₃	C-H	O	CH ₃	1 - (シアノ) シクロプロピル	3.9	608
I-T3-124	C-CF ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-Cl	H	H	C-H	N	C-CH ₃	C-H	O	H	シクロプロピル	3.5	589

10

20

30

40

実施例 番号	B ₁	B ₂	B ₃	B ₄	B ₅	R ^{IIa}	R ^{IIb}	A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	W	R ₁	Q	logP _a	質量 [m/z] a)1)
I-T3-125	C-CF ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-Cl	H	H	C-H	N	C-CH ₃	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	3.8	614
I-T3-126	C-Cl	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-Cl	CN	NH ₂	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	4.1	639
I-T3-127	C-Cl	C-H	C-CF ₃	C-H	C-Cl	H	H	C-H	N	C-CH ₃	C-H	O	H	シクロプロピル	2.5	455
I-T3-128	C-Cl	C-H	C-CF ₃	C-H	C-Cl	H	H	C-H	N	C-CH ₃	C-H	O	CH ₃	シクロプロピル	2.8	469
I-T3-129	C-Cl	C-H	C-CF ₃	C-H	C-Cl	H	H	C-H	N	C-CH ₃	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	2.6	480
I-T3-130	C-CF ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-Cl	H	H	C-H	N	C-CH ₃	C-H	O	CH ₃	シクロプロピル	3.8	603
I-T3-131	C-CF ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-Cl	H	H	C-H	N	C-CH ₃	C-H	O	CH ₃	1- (シアノ) シクロプロピル	3.9	628
I-T3-132	C-Cl	C-H	C-CF ₃	C-H	C-Cl	H	H	C-H	N	C-CH ₃	C-H	O	CH ₃	1- (シアノ) シクロプロピル	2.9	494
I-T3-133	C-Cl	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-Cl	H	H	C-H	N	C-CH ₃	C-H	O	CH ₃	シクロプロピル	3.7	569
I-T3-134	C-CF ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-H	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	CH ₃	シクロプロピル	4.9	588
I-T3-135	C-Cl	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-Cl	H	H	C-H	N	C- (1- ピロリジ ニル)	C-H	O	H	シクロプロピル	4.3	610
I-T3-136	C-Cl	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-Cl	H	H	C-H	N	C-NHCH ₃	C-H	O	H	シクロプロピル	3.5	570

10

20

30

40

実施例 番号	B ₁	B ₂	B ₃	B ₄	B ₅	R ^{11a}	R ^{11b}	A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	W	R ₁	Q	logP _{a)}	質量 [m/z] a))
I-T3-137	C-Cl	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-Cl	H	H	C-H	N	C-NH-シクロ プロピル	C-H	O	H	シクロプロピル	3.4	596
I-T3-138	C-Cl	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-Cl	H	H	C-H	N	C-NH-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	C-H	O	H	シクロプロピル	4.1	614
I-T3-139	C-CH ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-CH ₃	H	H	C-H	N	C-シクロ プロピル	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	4.1	566
I-T3-140	C-CH ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-CH ₃	H	H	C-H	N	C-シクロ プロピル	C-H	O	H	シクロプロピル	4.2	541
I-T3-141	C-CH ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-CH ₃	H	H	C-H	N	C-OCH ₃	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	4.4	556
I-T3-142	C-CH ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-CH ₃	H	H	C-H	N	C-シクロ プロピル	C-H	O	CH ₃	シクロプロピル	4.6	555
I-T3-143	C-CH ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-CH ₃	H	H	C-H	N	C-OCH ₃	C-H	O	H	シクロプロピル	4.6	531
I-T3-144	C-CH ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-CH ₃	H	H	C-H	N	C-OCH ₃	C-H	O	CH ₃	シクロプロピル	4.4	545
I-T3-145	C-Cl	C-H	C-CF ₃	C-H	C-Cl	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	O	C ₂ H ₅	シクロプロピル	3.8	503
I-T3-146	C-Cl	C-H	C-CF ₃	C-H	C-Cl	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	O	H	N-メチル-ピラゾ ル-3-イル	2.8	515
I-T3-147	C-Cl	C-H	C-CF ₃	C-H	C-Cl	H	H	C-H	N	C-CH ₃	C-H	O	H	C ₂ H ₅	4.0	443
I-T3-148	C-CF ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-Br	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	4.5	652

10

20

30

40

実施例 番号	B ₁	B ₂	B ₃	B ₄	B ₅	R ^{IIa}	R ^{IIb}	A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	W	RI	Q	logP _{a)}	質量 [m/z] a))
I-T3-149	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H	N	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	3.5	500
I-T3-150	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H	N	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	3.6	475
I-T3-151	C-Cl	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	N	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	4.0	566
I-T3-152	C-Cl	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	N	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	4.1	541
I-T3-153	C-S(O) ₂ C ₂ H ₅	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	N	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	3.7	608
I-T3-154	C-S(O) ₂ C ₂ H ₅	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	N	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	3.8	624
I-T3-155	C-CF ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-Br	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	4.4	677
I-T3-156	C-SC ₂ H ₅	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	N	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	4.7	567
I-T3-157	C-S(O) ₂ C ₂ H ₅	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	N	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	3.8	583
I-T3-158	C-S(O) ₂ C ₂ H ₅	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	N	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	3.9	599
I-T3-159	C-CF ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-Cl	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	O	H	1- (チオカルバモイ ル) -シクロプロピル	3.8	668
I-T3-160	C-CF ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-Br	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	4.0	653
I-T3-161	C-CF ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-CH ₃	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	S	H	シクロプロピル	5.0	604
I-T3-162	C-OCF ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-Cl	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	4.6	624

実施例 番号	B ₁	B ₂	B ₃	B ₄	B ₅	R ^{IIa}	R ^{IIb}	A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	W	R1	Q	logP _a	質量 [m/z] a)1)
I-T3-163	C-OCF ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-Cl	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1-(シアノ) シクロプロピル	4.5	649
I-T3-164	C-Cl	C-H	C-CF ₃	C-H	C-CN	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1-(シアノ) シクロプロピル	3.1	490
I-T3-165	C-CF ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-Br	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	O	H	1-(シアノ) シクロプロピル	3.9	678
I-T3-166	C-SCH ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	N	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1-(シアノ) シクロプロピル	4.3	578
I-T3-167	C-SC ₂ H ₅	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	N	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1-(シアノ) シクロプロピル	4.6	592
I-T3-168	C-Cl	C-H	C-CF ₃	C-H	C-NO ₂	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	3.3	485
I-T3-169	C-Cl	C-H	C-CF ₃	C-H	C-NO ₂	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1-(シアノ) シクロプロピル	3.2	510
I-T3-170	C-SC ₂ H ₅	C-H	C-CF ₃	C-H	C-Cl	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1-(シアノ) シクロプロピル	3.7	525
I-T3-171	C-SCH ₂ CF ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	N	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1-(シアノ) シクロプロピル	4.5	646
I-T3-172	C-SC ₂ H ₅	C-H	C-CF ₃	C-H	C-Cl	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	3.9	500
I-T3-173	C-Cl	C-H	C-CF ₃	C-H	C-Cl	H	H	C-H	N	C-OCH ₃	C-H	O	CH ₃	シクロプロピル	4.4	585
I-T3-174	C-Cl	C-H	C-CF ₃	C-H	C-CN	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	3.1	465
I-T3-175	C-CH ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-I	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	4.5	646

実施例 番号	B ₁	B ₂	B ₃	B ₄	B ₅	R ^{11a}	R ^{11b}	A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	W	R1	Q	logP _{a)}	質量 [m/z] a1)
I-T3-176	C-CH ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-I	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	4.4	671
I-T3-177	C-SC ₂ H ₅	C-H	C-CF ₃	C-H	C-CN	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	3.4	516
I-T3-178	C-S(O) ₂ C ₂ H ₅	C-H	C-CF ₃	C-H	C-Cl	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	3.2	532
I-T3-179	C-S(O)C ₂ H ₅	C-H	C-CF ₃	C-H	C-Cl	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	3.0	516
I-T3-180	C-S(O) ₂ C ₂ H ₅	C-H	C-CF ₃	C-H	C-CN	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	2.8	523
I-T3-181	C-S(O)C ₂ H ₅	C-H	C-CF ₃	C-H	C-CN	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	2.7	507
I-T3-182	C-S(O)C ₂ H ₅	C-H	C-CF ₃	C-H	C-CN	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	3.0	541
I-T3-183	C-S(O) ₂ C ₂ H ₅	C-H	C-CF ₃	C-H	C-Cl	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	3.1	557
I-T3-184	C-Cl	C-F	C-CF ₃	C-H	C-Cl	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	3.6	492
I-T3-185	C-Cl	C-F	C-CF ₃	C-H	C-Cl	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	3.6	517
I-T3-186	C-Cl	C-H	C-CF ₃	C-H	C-F	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	3.6	458
I-T3-187	C-Cl	C-H	C-CF ₃	C-H	C-F	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	3.3	483
I-T3-188	C-F	C-F	C-CF ₃	C-F	C-F	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	3.4	503
I-T3-189	C-OCF ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	Cl	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	4.3	625

実施例 番号	B ₁	B ₂	B ₃	B ₄	B ₅	R ^{11a}	R ^{11b}	A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	W	RI	Q	logP _{a)}	質量 [m/z] a))
I-T3-190	C-S(O ₂)C ₂ H ₅	C-H	C-CF ₃	C-H	C-CN	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	2.9	548
I-T3-191	C-SC ₂ H ₅	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-SC ₂ H ₅	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	4.7	651
I-T3-192	C-SC ₂ H ₅	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-Cl	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロ プロピル	4.5	625
I-T3-193	C-CHF ₂	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-Cl	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	4.4	590
I-T3-194	C-F	C-F	C-CF ₃	C-F	C-F	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1- (カルバモイル) -シクロプロピル	2.8	521
I-T3-195	C-S(O)C ₂ H ₅	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-Cl	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	3.8	641
I-T3-196	C-OCHF ₂	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	Cl	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	3.9	607
I-T3-197	C-CF ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-CH ₃	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	O	H	(1-シアノ-シクロ プロピル) メチル	4.0	628
I-T3-198	C-S(O ₂)C ₂ H ₅	C-H	C-i-C ₃ F ₈	C-H	C-S(O ₂) C ₂ H ₅	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	3.7	715
I-T3-199	C-CF ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-Cl	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	O	H	(1-シアノ-シクロ プロピル) メチル	1.17 min ^{b)}	648
I-T3-200	C-OCF ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-Cl	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	4.1	650

10

20

30

40

実施例 番号	B ₁	B ₂	B ₃	B ₄	B ₅	R ^{11a}	R ^{11b}	A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	W	R1	Q	logP _{a)}	質量 [m/z] a))
I-T3-201	C-S(O ₂)C ₂ H ₅	C-H	C-i-C ₃ F ₈	C-H	C-Cl	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	4.0	657
I-T3-202	C-SC ₂ H ₅	C-H	C-i-C ₃ F ₈	C-H	C-CH ₃	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	4.5	605
I-T3-203	C-SC ₂ H ₅	C-H	C-i-C ₃ F ₈	C-H	C-CH ₃	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	4.6	580
I-T3-204	C-CN	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-Cl	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	O	CH ₃	シクロプロピル	3.9	580
I-T3-205	C-CN	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-Cl	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	3.5	566
I-T3-206	C-S(O)C ₂ H ₅	C-H	C-i-C ₃ F ₈	C-H	C-CH ₃	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	3.6	621
I-T3-207	C-CN	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-Cl	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	3.5	591
I-T3-208	C-OCF ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-Cl	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	O	CH ₃	シクロプロピル	4.6	639
I-T3-209	C-S(O ₂)C ₂ H ₅	C-H	C-i-C ₃ F ₈	C-H	C-CH ₃	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	3.8	637
I-T3-210	C-S(O ₂)C ₂ H ₅	C-H	C-i-C ₃ F ₈	C-H	C-CH ₃	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	3.9	612
I-T3-211	C-OC ₂ H ₅	C-H	C-i-C ₃ F ₉	C-H	C-OC ₂ H ₅	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	O	CH ₃	シクロプロピル	4.7	609
I-T3-212	C-I	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-Cl	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	4.3	691
I-T3-213	C-I	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-Cl	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	4.4	666
I-T3-214	C-OCHF ₂	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-Cl	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	4.3	606

10

20

30

40

実施例 番号	B ₁	B ₂	B ₃	B ₄	B ₅	R ^{11a}	R ^{11b}	A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	W	R ₁	Q	logP _{a)}	質量 [m/z] a1)
I-T3-215	C-OCHF ₂	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-Cl	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	4.1	631
I-T3-216	C-OCHF ₂	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-Cl	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	CH ₃	シクロプロピル	4.7	620
I-T3-217	C-OCHF ₂	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-Cl	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	O	CH ₃	シクロプロピル	4.2	621
I-T3-218	C-OCHF ₂	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-Cl	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	3.7	632
I-T3-219	C-OCF ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-Cl	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	CH ₃	シクロプロピル	5.1	638
I-T3-220	C-Cl	C-H	C-C(CF ₃) ₂ OH	C-H	C-Cl	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	O	CH ₃	シクロプロピル	3.4	587
I-T3-221	C-Cl	C-H	C-C(CF ₃) ₂ OH	C-H	C-Cl	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	3.0	573
I-T3-222	C-Cl	C-H	C-C(CF ₃) ₂ OH	C-H	C-Cl	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	3.0	598
I-T3-223	C-Cl	C-H	C-C(CF ₃) ₂ OH	C-H	C-Cl	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	O	CH ₃	1- (シアノ) シクロプロピル	3.3	612
I-T3-224	C-OCF ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-Cl	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	4.7	716
I-T3-225	C-OCF ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-Cl	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	CH ₃	シクロプロピル	5.2	729
I-T3-226	C-OCF ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-Cl	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	4.6	740
I-T3-227	C-OCF ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-Cl	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	4.5	700

10

20

30

40

実施例 番号	B ₁	B ₂	B ₃	B ₄	B ₅	R ^{IIa}	R ^{IIb}	A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	W	R ^I	Q	logP _a	質量 [m/z] a)1)
I-T3-228	C-CF ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-I	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1 - (シアノ) シクロプロピル	4.4	725
I-T3-229	C-CF ₃	C-H	C-i-C ₃ F ₇	C-H	C-I	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	CH ₃	シクロプロピル	5.1	714

10

20

30

40

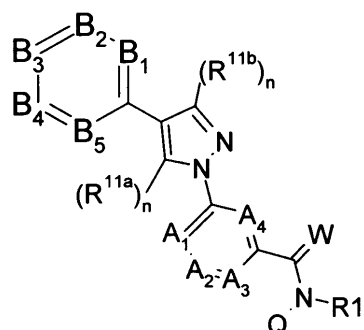
* b) 以下のもので測定された保持時間：

50

器具：Waters ACQUITY SQD UPLC system、カラム：Waters Acquity UPLC HSS T3 1.8 μ 50 x 1 mm、溶離剤 A：1 l 水 + 0.25 ml 99% 強ギ酸、溶離剤 B：1 l アセトニトリル + 0.25 ml 99% 強ギ酸、グラジエント：0.0 分 90% A $\rightarrow$ 1.2 分 5% A $\rightarrow$ 2.0 分 5% A、炉：50 $^{\circ}$ C、流速：0.40 ml / 分、UV 検出：208 ~ 400 nm。

表 I - T 4

【化 1 5 9】



I - T 4

10

20

B₂ および B₄ = C - H

【表 4】

実施例 番号	B ₁	B ₃	B ₅	R ₁	R ^{11a}	R ^{11b}	A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	W	R ₁	Q	logP _{a)}	質量 [m/z] a)1)
I-T4-1	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	4.7	534
I-T4-2	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	4.6	559
I-T4-3	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	4.4	535
I-T4-4	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	4.3	560

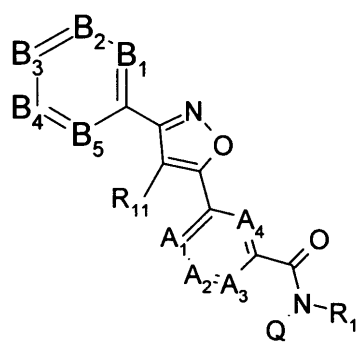
10

20

30

40

【化 1 6 0】



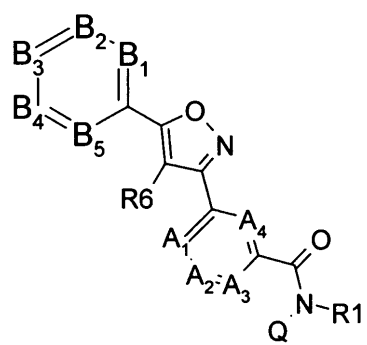
I - T 2 2

B₂ および B₄ = C - H、W = O

【表 5】

実施例 番号	B ₁	B ₃	B ₅	R ₁	R ₁₁	A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	Q	logP _{a)}	質量 [m/z] a))
I-T22-1	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	シクロプロピル	4.8	535
I-T22-2	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	1- (シアノ) シクロプロピル	4.6	560
I-T22-3	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	CH ₂ CF ₃	5	577
I-T22-4	C-CF ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	1- (シアノ) シクロプロピル	4.4	615
I-T22-5	C-CF ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	シクロプロピル	4.9	589
I-T22-6	C-CF ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	シクロプロピル	4.5	590
I-T22-7	C-CF ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	1- (シアノ) シクロプロピル	4.7	614

【化 1 6 1】



10

 $B_2 \text{ および } B_4 = C - H$

【表 6】

実施例 番号	B ₁	B ₃	B ₅	R ¹	R ¹¹	A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	W	Q	logP _a	質量 [m/z] a))
I-T23-1	C-Cl	C-i-C ₃ F ₇	C-Cl	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	シクロプロピル	5.0	575
I-T23-2	C-Cl	C-i-C ₃ F ₇	C-Cl	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	1- (シアノ) シクロプロピル	4.8	600

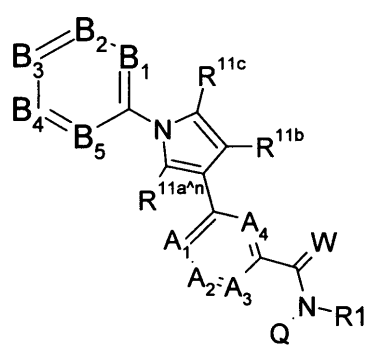
10

20

30

40

【化 1 6 2】



I - T 4 6

10

B₂ および B₄ = C - H

【表 7】

実施例 番号	B ₁	B ₃	B ₅	R ^{11a}	R ^{11b}	R ^{11c}	A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	W	R ₁	Q	logP _{a)}	質量 [m/z] a))
I-T46-1	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	4.9	558
I-T46-2	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	5.0	533
I-T46-3	C-Cl	C-i-C ₃ F ₇	C-Cl	H	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	O	CH ₃	シクロプロピル	5.0	588
I-T46-4	C-Cl	C-i-C ₃ F ₇	C-Cl	H	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	O	H	シクロプロピル	4.5	574
I-T46-5	C-Cl	C-i-C ₃ F ₇	C-Cl	H	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	O	H	1- (シアノ) シクロプロピル	4.4	599
I-T46-6	C-Cl	C-i-C ₃ F ₇	C-Cl	H	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	O	CH ₃	1- (シアノ) シクロプロピル	4.8	613

10

20

30

40

選択された実施例 (B e i s p i e l) の N M R データ

【 0 6 5 2 】

選択された実施例の ¹H NMR データは、¹H NMR ピークリストの形式で報告さ

50

れる。各シグナルピークでは、まず p p m の δ 値、次に丸括弧内にシグナル強度が列記される。異なるシグナルピークに対する δ 値とシグナル強度数の対は、互いにセミコロンで隔てて列記される。

【0653】

したがって、1つの例に対するピークリストは、次のような形式となる：

δ_1 (強度₁) ; δ_2 (強度₂) ; …… ; δ_i (強度_i) ; …… ; δ_n (強度_n)

【0654】

シャープシグナルの強度は、NMR スペクトルの印刷された例における c m のシグナルの高さと相関し、シグナル強度の実際の比率を示す。ブロードシグナルの場合は、いくつかのピークまたはシグナルの中央およびその相対強度は、そのスペクトルの最も強いシグナルと比較して示され得る。

10

【0655】

^1H NMR スペクトルの化学シフトの較正に関して、本発明者らは、テトラメチルシラン、および／または特に DMSO 中で測定されたスペクトルの場合は溶媒の化学シフトを使用する。したがって、テトラメチルシランのピークは、NMR ピークリストで生じ得るが、生じる必要はない。

【0656】

^1H NMR ピークのリストは、従来の ^1H NMR プリントアウトと類似しており、このため通常は、従来の NMR の解釈において列記されるすべてのピークを含む。

【0657】

また、従来の ^1H NMR プリントアウトのように、これらは、溶媒シグナル、同様に本発明の主題の一部を形成する標的化合物の立体異性体のシグナル、および／または不純物のピークを示し得る。

20

【0658】

溶媒および／または水の δ 範囲の化合物シグナルのレポートにおいて、本発明者らの ^1H NMR ピークリストは、通常の溶媒ピーク、例えば、DMSO- D_6 の DMSO のピーク、および水のピークを示し、これは通常平均して高い強度を有する。

【0659】

標的化合物の立体異性体のピークおよび／または不純物のピークは、通常、標的化合物のピーク（例えば、90%を超える純度）よりも平均して低い強度を有する。

30

【0660】

このような立体異性体および／または不純物は、特定の調製プロセスに特有であり得る。このため、それらのピークは、この場合、「副生成物のフィンガープリント」を参照しながら本発明者らの調製プロセスの再現の特定に有用である。

【0661】

既知の方法 (MestReC、ACD シミュレーション、実験的に評価された期待値と共に) による標的化合物のピークの専門家による算出は、必要に応じて、任意に追加の強度フィルタを使用して、標的化合物のピークを分離することができる。この分離は、従来の ^1H NMR 解釈における関連するピークのピッキングと同様である。

【0662】

^1H NMR ピークのリストのさらなる詳細は、Research Disclosure Database Number 564025 で確認することもできる。

40

【表 8】

実施例 (B e i s p i e l) I-T2-1 : ^1H-NMR (400, 0MHz、CD3CN) : $\delta=8, 297 (5, 2); 8, 291 (5, 1); 7, 846 (9, 6); 7, 825 (3, 3); 7, 818 (2, 0); 7, 545 (3, 5); 7, 525 (2, 9); 7, 523 (2, 8); 7, 443 (9, 1); 6, 977 (1, 2); 6, 544 (5, 1); 6, 538 (4, 9); 4, 085 (0, 4); 4, 068 (1, 3); 4, 050 (1, 4); 4, 032 (0, 5); 3, 440 (0, 4); 3, 374 (0, 4); 2, 862 (0, 8); 2, 853 (1, 2); 2, 844 (1, 9); 2, 834 (1, 8); 2, 826 (1, 3); 2, 816 (0, 9); 2, 240 (41, 5); 2, 150 (23, 6); 2, 086 (3, 2); 1, 972 (6, 1); 1, 965 (1, 2); 1, 958 (2, 9); 1, 953 (13, 9); 1, 947 (24, 8); 1, 941 (32, 9); 1, 934 (22, 7); 1, 928 (11, 7); 1, 436 (16, 0); 1, 269 (0, 5); 1, 221 (1, 6); 1, 204 (3, 1); 1, 186 (1, 5); 0, 790 (1, 0); 0, 778 (3, 2); 0, 773 (4, 1); 0, 760 (4, 2); 0, 755 (3, 2); 0, 743 (1, 4); 0, 614 (1, 3); 0, 604 (3, 7); 0, 597 (3, 9); 0, 593 (3, 4); 0, 588 (3, 3); 0, 575 (1, 0); 0, 000 (3, 0)$	10
実施例 I-T2-2 : ^1H-NMR (400, 0MHz、CD3CN) : $\delta=8, 311 (4, 9); 8, 304 (5, 0); 7, 898 (10, 0); 7, 878 (3, 3); 7, 872 (2, 0); 7, 624 (2, 0); 7, 583 (3, 2); 7, 561 (2, 8); 7, 444 (9, 7); 6, 555 (4, 9); 6, 549 (4, 9); 5, 447 (0, 7); 4, 086 (0, 5); 4, 068 (1, 6); 4, 050 (1, 6); 4, 032 (0, 6); 2, 240 (45, 7); 2, 146 (80, 1); 2, 114 (0, 7); 2, 108 (0, 7); 2, 102 (0, 5); 1, 972 (7, 1); 1, 964 (3, 1); 1, 958 (8, 0); 1, 953 (36, 5); 1, 946 (65, 9); 1, 940 (87, 5); 1, 934 (62, 1); 1, 928 (33, 1); 1, 775 (0, 4); 1, 769 (0, 6); 1, 763 (0, 4); 1, 591 (2, 0); 1, 576 (5, 7); 1, 569 (5, 7); 1, 556 (2, 8); 1, 516 (0, 4); 1, 437 (16, 0); 1, 410 (0, 4); 1, 369 (2, 8); 1, 356 (5, 7); 1, 349 (6, 0); 1, 334 (2, 1); 1, 296 (0, 3); 1, 269 (1, 9); 1, 222 (1, 9); 1, 204 (3, 6); 1, 186 (1, 8); 0, 000 (4, 5)$	30
実施例 I-T3-1 : ^1H-NMR (400, 0MHz、CD3CN) : $\delta=8, 118 (11, 7); 8, 061 (12, 6); 7, 689 (7, 9); 7, 683 (8, 6); 7, 667 (0, 7); 7, 652 (4, 9); 7, 646 (3,$	40

5); 7, 631 (5, 5); 7, 625 (4, 3); 7, 535 (16, 0); 7, 463 (7, 8); 7, 442 (6, 2); 6, 895 (2, 5); 4, 068 (0, 8); 4, 050 (0, 8); 3, 912 (0, 7); 2, 881 (0, 5); 2, 871 (1, 5); 2, 862 (2, 1); 2, 853 (3, 2); 2, 844 (3, 2); 2, 835 (2, 2); 2, 826 (1, 5); 2, 816 (0, 5); 2, 270 (0, 5); 2, 261 (0, 3); 2, 143 (107, 9); 2, 138 (145, 5); 2, 111 (71, 2); 1, 972 (5, 1); 1, 964 (10, 3); 1, 958 (27, 0); 1, 952 (94, 0); 1, 946 (160, 4); 1, 940 (199, 1); 1, 934 (136, 5); 1, 928 (68, 3); 1, 780 (0, 5); 1, 774 (0, 9); 1, 768 (1, 1); 1, 762 (0, 8); 1, 756 (0, 4); 1, 437 (13, 0); 1, 271 (1, 0); 1, 222 (1, 0); 1, 204 (1, 9); 1, 186 (0, 9); 0, 794 (1, 7); 0, 782 (6, 4); 0, 777 (7, 2); 0, 764 (7, 9); 0, 759 (5, 7); 0, 747 (2, 4); 0, 725 (0, 3); 0, 610 (2, 4); 0, 600 (7, 1); 0, 592 (7, 5); 0, 588 (6, 7); 0, 584 (5, 9); 0, 571 (1, 7); 0, 146 (0, 4); 0, 000 (86, 0); -0, 008 (5, 2); -0, 150 (0, 4)

実施例 I-T3-2: ^1H -NMR (400, 0MHz、 CD_3CN):

$\delta=8$, 131 (12, 6); 8, 084 (13, 3); 7, 735 (7, 6); 7, 729 (9, 9); 7, 710 (5, 2); 7, 704 (3, 5); 7, 689 (5, 8); 7, 683 (4, 6); 7, 537 (16, 0); 7, 514 (8, 9); 7, 493 (7, 4); 7, 458 (1, 9); 4, 140 (1, 8); 4, 124 (2, 1); 4, 117 (5, 8); 4, 100 (5, 9); 4, 093 (6, 2); 4, 077 (5, 9); 4, 069 (2, 6); 4, 053 (2, 1); 3, 914 (0, 6); 2, 891 (0, 7); 2, 773 (0, 6); 2, 480 (0, 7); 2, 475 (1, 3); 2, 470 (1, 8); 2, 466 (1, 3); 2, 461 (0, 7); 2, 325 (0, 4); 2, 273 (1, 9); 2, 221 (979, 0); 2, 115 (79, 7); 2, 097 (1, 4); 1, 973 (3, 4); 1, 966 (10, 4); 1, 960 (22, 6); 1, 954 (102, 7); 1, 948 (182, 7); 1, 942 (241, 3); 1, 936 (167, 3); 1, 930 (87, 0); 1, 783 (0, 7); 1, 777 (1, 1); 1, 770 (1, 5); 1, 764 (1, 1); 1, 758 (0, 6); 1, 437 (15, 2); 1, 296 (0, 5); 1, 270 (1, 7); 1, 222 (0, 7); 1, 204 (1, 3); 1, 186 (0, 6); 0, 146 (0, 3); 0, 008 (2, 7); 0, 000 (69, 9); -0, 008 (3, 3)

実施例 I-T3-3: ^1H -NMR (400, 0MHz、 CD_3CN):

$\delta=8$, 129 (2, 6); 8, 075 (2, 6); 7, 738 (1, 6); 7, 73

2 (2、0); 7, 701 (1、1); 7, 696 (0、8); 7, 681 (1、2);
 7, 675 (1、1); 7, 572 (0、5); 7, 536 (3、2); 7, 496 (1、
 8); 7, 475 (1、5); 2, 146 (33、6); 2, 113 (16、5); 1,
 972 (0、4); 1, 964 (2、4); 1, 958 (5、6); 1, 953 (29、
 5); 1, 946 (53、8); 1, 940 (72、5); 1, 934 (50、1); 1,
 928 (25、8); 1, 769 (0、4); 1, 599 (0、8); 1, 585 (1、
 9); 1, 578 (2、0); 1, 564 (1、1); 1, 437 (16、0); 1, 3
 59 (1、1); 1, 345 (2、0); 1, 338 (2、0); 1, 324 (0、8);
 1, 269 (0、6); 0, 008 (1、9); 0, 000 (51、3); -0, 00
 9 (2、0)

10

実施例 I-T3-4: ^1H -NMR (400, 0MHz、CD₃CN):

δ =8, 132 (5、7); 8, 077 (6、1); 7, 719 (3、4); 7, 71
 4 (4、3); 7, 678 (2、2); 7, 673 (1、8); 7, 657 (2、6);
 7, 652 (2、3); 7, 537 (7、8); 7, 515 (1、0); 7, 495 (1、
 0); 7, 486 (4、3); 7, 465 (3、3); 5, 338 (0、9); 5, 31
 6 (1、8); 5, 296 (1、8); 5, 274 (1、0); 3, 544 (2、3);
 3, 521 (4、7); 3, 499 (3、1); 3, 370 (3、0); 3, 349 (4、
 6); 3, 346 (4、3); 3, 325 (2、4); 2, 469 (0、4); 2, 27
 4 (0、4); 2, 206 (300、4); 2, 154 (0、5); 2, 115 (36、
 2); 1, 973 (1、3); 1, 966 (3、0); 1, 960 (6、3); 1, 95
 4 (30、3); 1, 948 (55、1); 1, 942 (73、7); 1, 935 (5
 2、5); 1, 929 (28、5); 1, 776 (0、4); 1, 770 (0、5); 1,
 764 (0、4); 1, 437 (16、0); 1, 269 (1、6); 1, 222 (0、
 3); 1, 204 (0、6); 0, 008 (0、7); 0, 000 (20、8)

20

30

実施例 I-T3-5: ^1H -NMR (601, 6MHz、CD₃CN):

δ =8, 125 (8、3); 8, 124 (8、5); 8, 072 (9、3); 8, 07
 1 (9、2); 7, 680 (16、0); 7, 677 (5、7); 7, 668 (5、3);
 7, 664 (3、0); 7, 537 (9、4); 7, 485 (4、7); 7, 482 (2、
 1); 7, 473 (1、9); 7, 470 (4、3); 7, 461 (2、3); 2, 14
 6 (139、0); 2, 113 (53、4); 2, 060 (0、5); 2, 056 (0、
 9); 2, 052 (1、3); 2, 048 (0、9); 2, 044 (0、4); 1, 96
 6 (5、4); 1, 958 (14、4); 1, 953 (16、2); 1, 950 (93、
 5); 1, 945 (166、6); 1, 941 (244、5); 1, 937 (162、
 8); 1, 933 (81、9); 1, 924 (1、3); 1, 835 (0、5); 1, 8
 31 (0、9); 1, 827 (1、4); 1, 822 (0、9); 1, 818 (0、5);
 1, 393 (2、4); 1, 383 (5、5); 1, 380 (5、9); 1, 370 (3、

40

2); 1, 343 (0、4); 1, 269 (0、6); 1, 251 (1、3); 1, 248 (1、4); 1, 238 (4、5); 1, 228 (1、0); 1, 225 (1、0); 0, 096 (0、4); 0, 005 (3、0); 0, 000 (105、8); -0, 006 (3、3); -0, 100 (0、4)

実施例 I-T3-6: ^1H -NMR (601, 6MHz、 CD_3CN):

$\delta=8, 130$ (11、9); $8, 129$ (12、8); $8, 082$ (13、1); $8, 081$ (13、4); $7, 809$ (8、6); $7, 805$ (9、0); $7, 697$ (5、1); $7, 693$ (4、8); $7, 683$ (5、9); $7, 679$ (5、7); $7, 538$ (13、6); $7, 508$ (9、3); $7, 494$ (8、0); $7, 304$ (1、1); $7, 295$ (1、9); $7, 286$ (1、1); $7, 069$ (1、2); $4, 045$ (16、0); $4, 036$ (15、9); $3, 973$ (1、6); $3, 962$ (1、8); $3, 957$ (5、2); $3, 946$ (5、2); $3, 941$ (5、5); $3, 930$ (5、3); $3, 926$ (2、0); $3, 915$ (1、8); $2, 220$ (0、4); $2, 153$ (19、3); $2, 115$ (73、8); $2, 104$ (1、0); $2, 052$ (0、4); $2, 006$ (0、4); $1, 966$ (1、4); $1, 958$ (3、8); $1, 953$ (4、5); $1, 950$ (25、7); $1, 945$ (45、5); $1, 941$ (67、9); $1, 937$ (46、1); $1, 933$ (22、7); $1, 827$ (0、4); $1, 268$ (1、1); $0, 005$ (0、8); $0, 000$ (28、7); -0, 006 (0、9)

実施例 I-T3-7: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):

$\delta=9, 043$ (1、2); $9, 038$ (1、2); $8, 803$ (1、3); $8, 798$ (1、3); $8, 672$ (3、2); $8, 648$ (0、9); $8, 638$ (0、9); $8, 405$ (3、2); $8, 390$ (1、1); $8, 384$ (1、9); $8, 379$ (1、0); $8, 316$ (0、3); $7, 602$ (3、5); $3, 902$ (9、7); $3, 330$ (83、7); $3, 243$ (0、6); $3, 169$ (0、4); $2, 903$ (0、3); $2, 893$ (0、5); $2, 885$ (0、7); $2, 875$ (0、7); $2, 867$ (0、4); $2, 857$ (0、3); $2, 676$ (0、4); $2, 672$ (0、5); $2, 667$ (0、4); $2, 525$ (1、4); $2, 512$ (30、7); $2, 507$ (61、4); $2, 503$ (80、2); $2, 498$ (57、8); $2, 494$ (27、6); $2, 334$ (0、3); $2, 329$ (0、5); $2, 325$ (0、3); $2, 131$ (16、0); $1, 909$ (0、3); $0, 763$ (0、4); $0, 750$ (1、1); $0, 745$ (1、6); $0, 733$ (1、5); $0, 727$ (1、3); $0, 716$ (0、6); $0, 619$ (0、6); $0, 608$ (1、7); $0, 602$ (1、4); $0, 598$ (1、4); $0, 593$ (1、2); $0, 580$ (0、4); $0, 000$ (9、2)

実施例 I-T3-8: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):

$\delta=9, 538$ (2、0); $9, 102$ (1、4); $9, 097$ (1、4); $8, 82$

7 (1、4); 8, 823 (1、5); 8, 695 (3、2); 8, 444 (1、1);
 8, 439 (1、9); 8, 434 (1、2); 8, 424 (3、3); 7, 605 (3、
 8); 3, 902 (6、0); 3, 374 (0、4); 3, 330 (90、4); 3, 2
 43 (0、4); 3, 169 (2、1); 2, 676 (0、4); 2, 672 (0、6);
 2, 667 (0、5); 2, 542 (0、5); 2, 507 (75、8); 2, 503
 (97、5); 2, 498 (74、7); 2, 334 (0、4); 2, 329 (0、6);
 2, 325 (0、5); 2, 132 (16、0); 1, 628 (0、7); 1, 614
 (2、0); 1, 607 (2、1); 1, 594 (0、9); 1, 347 (0、9); 1,
 334 (2、1); 1, 327 (2、1); 1, 313 (0、7); 0, 000 (8、
 2)

10

実施例 I-T3-9: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):

δ =8, 508 (2、0); 8, 506 (2、0); 8, 473 (1、0); 8, 46
 3 (1、0); 8, 276 (2、2); 7, 895 (0、5); 7, 876 (1、0);
 7, 861 (0、5); 7, 592 (4、1); 7, 399 (0、5); 7, 383 (1、
 0); 7, 368 (0、7); 7, 305 (1、1); 7, 286 (1、7); 7, 26
 6 (0、7); 3, 902 (5、7); 3, 330 (72、5); 3, 243 (0、4);
 3, 175 (0、4); 3, 162 (0、3); 2, 875 (0、4); 2, 865 (0、
 5); 2, 857 (0、7); 2, 847 (0、7); 2, 838 (0、5); 2, 82
 8 (0、3); 2, 672 (0、5); 2, 507 (63、9); 2, 503 (80、
 2); 2, 329 (0、5); 2, 114 (16、0); 0, 725 (0、4); 0, 7
 07 (1、8); 0, 695 (1、7); 0, 689 (1、5); 0, 678 (0、6);
 0, 556 (0、6); 0, 545 (1、8); 0, 539 (1、8); 0, 530 (1、
 6); 0, 518 (0、5); 0, 000 (6、1)

20

30

実施例 I-T3-10: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):

δ =9, 369 (2、0); 8, 535 (1、8); 8, 532 (1、9); 8, 29
 0 (2、0); 7, 968 (0、4); 7, 965 (0、5); 7, 949 (0、9);
 7, 946 (0、9); 7, 931 (0、5); 7, 927 (0、5); 7, 595 (3、
 9); 7, 479 (0、4); 7, 475 (0、4); 7, 459 (0、9); 7, 44
 3 (0、6); 7, 440 (0、5); 7, 352 (1、0); 7, 333 (1、7);
 7, 314 (0、8); 3, 903 (8、2); 3, 372 (0、4); 3, 329 (1
 04、6); 3, 243 (0、6); 3, 175 (0、3); 2, 675 (0、4); 2,
 671 (0、5); 2, 667 (0、4); 2, 541 (0、5); 2, 507 (70、
 8); 2, 502 (89、6); 2, 498 (66、7); 2, 333 (0、4); 2,
 329 (0、5); 2, 324 (0、4); 2, 115 (16、0); 1, 598 (0、
 8); 1, 584 (2、0); 1, 577 (2、1); 1, 564 (0、9); 1, 29
 2 (0、9); 1, 278 (2、1); 1, 272 (2、2); 1, 257 (0、8);

40

1, 169 (0、3); 1, 068 (0、4); 0, 007 (0、4); 0, 000 (7、5); -0, 008 (0、4)

实施例 I-T3-11: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):

$\delta=8, 522$ (0、9); $8, 512$ (0、9); $8, 500$ (3、3); $8, 211$ (3、2); $7, 818$ (1、8); $7, 799$ (1、8); $7, 646$ (1、8); $7, 621$ (1、8); $7, 590$ (3、5); $3, 902$ (3、1); $3, 330$ (117、7); $3, 304$ (0、3); $2, 861$ (0、3); $2, 851$ (0、4); $2, 842$ (0、7); $2, 832$ (0、7); $2, 824$ (0、4); $2, 676$ (0、4); $2, 671$ (0、5); $2, 667$ (0、3); $2, 525$ (1、5); $2, 511$ (29、4); $2, 507$ (58、1); $2, 502$ (75、7); $2, 498$ (54、9); $2, 493$ (26、6); $2, 334$ (0、3); $2, 329$ (0、5); $2, 324$ (0、3); $2, 127$ (16、0); $0, 733$ (0、4); $0, 720$ (1、2); $0, 715$ (1、7); $0, 703$ (1、6); $0, 697$ (1、3); $0, 685$ (0、6); $0, 575$ (0、6); $0, 564$ (1、7); $0, 558$ (1、5); $0, 554$ (1、4); $0, 548$ (1、3); $0, 536$ (0、4); $0, 000$ (7、9)

实施例 I-T3-12: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):

$\delta=9, 396$ (1、8); $8, 522$ (3、2); $8, 223$ (3、2); $7, 906$ (1、6); $7, 887$ (1、6); $7, 712$ (1、6); $7, 687$ (1、6); $7, 593$ (3、7); $3, 903$ (2、7); $3, 332$ (98、2); $2, 672$ (0、5); $2, 542$ (0、4); $2, 507$ (67、0); $2, 503$ (83、7); $2, 498$ (62、0); $2, 334$ (0、4); $2, 329$ (0、5); $2, 325$ (0、4); $2, 129$ (16、0); $1, 604$ (0、8); $1, 590$ (2、0); $1, 583$ (2、1); $1, 570$ (0、9); $1, 312$ (0、9); $1, 299$ (2、0); $1, 292$ (2、0); $1, 278$ (0、8); $0, 000$ (7、1)

实施例 I-T3-13: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):

$\delta=8, 514$ (1、8); $8, 510$ (1、9); $8, 480$ (0、9); $8, 470$ (0、9); $8, 285$ (2、1); $8, 226$ (0、8); $8, 220$ (0、8); $8, 207$ (0、8); $8, 202$ (0、8); $7, 767$ (0、4); $7, 762$ (0、5); $7, 755$ (0、5); $7, 749$ (0、6); $7, 746$ (0、6); $7, 740$ (0、5); $7, 734$ (0、5); $7, 728$ (0、4); $7, 595$ (3、7); $7, 402$ (0、9); $7, 380$ (0、9); $7, 375$ (1、0); $7, 354$ (0、8); $3, 902$ (1、5); $3, 444$ (0、4); $3, 425$ (0、6); $3, 405$ (1、1); $3, 353$ (438、8); $3, 292$ (0、5); $3, 273$ (0、3); $2, 864$ (0、5); $2, 855$ (0、7); $2, 846$ (0、7); $2, 837$ (0、5); $2, 827$ (0、3); $2, 678$ (0、4); $2, 673$ (0、5);

2, 669 (0, 4); 2, 509 (61, 5); 2, 504 (78, 8); 2, 500 (57, 5); 2, 335 (0, 4); 2, 331 (0, 5); 2, 327 (0, 4); 2, 121 (16, 0); 0, 746 (0, 4); 0, 733 (1, 2); 0, 728 (1, 7); 0, 716 (1, 6); 0, 710 (1, 3); 0, 699 (0, 6); 0, 602 (0, 6); 0, 592 (1, 7); 0, 585 (1, 6); 0, 576 (1, 3); 0, 564 (0, 4)

実施例 I-T3-14: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):

$\delta=8, 600$ (1, 8); 8, 596 (1, 8); 8, 536 (1, 1); 8, 525 (1, 1); 8, 352 (1, 9); 7, 977 (1, 6); 7, 960 (1, 6); 7, 594 (3, 7); 7, 437 (1, 7); 7, 411 (1, 7); 3, 902 (4, 8); 3, 332 (129, 0); 2, 826 (0, 4); 2, 817 (0, 7); 2, 807 (0, 7); 2, 799 (0, 4); 2, 789 (0, 3); 2, 676 (0, 4); 2, 672 (0, 5); 2, 667 (0, 4); 2, 511 (32, 0); 2, 507 (61, 8); 2, 503 (79, 3); 2, 498 (57, 6); 2, 494 (28, 2); 2, 334 (0, 3); 2, 329 (0, 5); 2, 325 (0, 4); 2, 115 (16, 0); 0, 733 (0, 4); 0, 720 (1, 2); 0, 715 (1, 6); 0, 703 (1, 5); 0, 697 (1, 3); 0, 685 (0, 5); 0, 567 (0, 5); 0, 557 (1, 7); 0, 551 (1, 5); 0, 547 (1, 4); 0, 541 (1, 3); 0, 529 (0, 4); 0, 000 (6, 1)

実施例 I-T3-15: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):

$\delta=8, 711$ (3, 3); 8, 694 (1, 1); 8, 684 (1, 0); 8, 450 (3, 3); 8, 369 (1, 8); 8, 174 (1, 8); 7, 971 (1, 8); 7, 601 (3, 9); 3, 903 (1, 0); 3, 331 (150, 2); 2, 910 (0, 3); 2, 901 (0, 5); 2, 892 (0, 7); 2, 882 (0, 7); 2, 874 (0, 5); 2, 865 (0, 4); 2, 672 (0, 5); 2, 507 (59, 3); 2, 503 (74, 7); 2, 499 (55, 2); 2, 334 (0, 4); 2, 330 (0, 5); 2, 133 (16, 0); 0, 769 (0, 4); 0, 755 (1, 3); 0, 751 (1, 7); 0, 738 (1, 6); 0, 733 (1, 4); 0, 721 (0, 6); 0, 630 (0, 6); 0, 620 (1, 8); 0, 613 (1, 7); 0, 604 (1, 4); 0, 592 (0, 4)

実施例 I-T3-16: ^1H -NMR (601, 6MHz、 d_6 -DMSO):

$\delta=8, 439$ (0, 8); 8, 433 (0, 9); 8, 344 (3, 1); 8, 343 (3, 2); 8, 082 (3, 2); 8, 081 (3, 3); 7, 912 (1, 7); 7, 909 (1, 7); 7, 670 (0, 9); 7, 667 (0, 9); 7, 657 (1, 0); 7, 654 (1, 0); 7, 600 (3, 4); 7, 368 (1, 3); 7, 354 (1, 2); 3, 376 (0, 5); 3, 367 (1, 1); 3, 351 (401, 1)

9); 3, 328 (0、5); 3, 324 (0、5); 2, 997 (3、2); 2, 856 (0、4); 2, 850 (0、7); 2, 844 (0、7); 2, 838 (0、4); 2, 831 (0、3); 2, 618 (0、4); 2, 615 (0、6); 2, 612 (0、4); 2, 543 (5、5); 2, 524 (1、0); 2, 521 (1、3); 2, 518 (1、2); 2, 509 (30、4); 2, 506 (67、4); 2, 503 (93、3); 2, 500 (68、5); 2, 497 (31、5); 2, 438 (7、5); 2, 390 (0、4); 2, 387 (0、6); 2, 384 (0、4); 2, 146 (16、0); 0, 715 (0、4); 0, 707 (1、2); 0, 703 (1、6); 0, 695 (1、5); 0, 692 (1、3); 0, 684 (0、5); 0, 590 (0、6); 0, 583 (1、6); 0, 579 (1、4); 0, 576 (1、3); 0, 572 (1、3); 0, 564 (0、4); 0, 000 (2、6)

10

実施例 I-T3-17: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):

δ =9, 576 (0、4); 9, 437 (2、3); 8, 736 (0、7); 8, 625 (1、7); 8, 621 (1、8); 8, 472 (0、7); 8, 411 (0、4); 8, 375 (1、8); 8, 372 (1、9); 8, 316 (0、5); 8, 243 (0、4); 8, 030 (1、7); 8, 013 (1、6); 7, 993 (0、3); 7, 597 (3、8); 7, 547 (1、7); 7, 521 (1、9); 4, 036 (1、1); 3, 903 (6、7); 3, 630 (0、4); 3, 623 (0、4); 3, 614 (0、4); 3, 608 (0、3); 3, 597 (0、3); 3, 392 (0、7); 3, 332 (259、6); 3, 287 (0、3); 3, 175 (0、4); 3, 162 (0、5); 3, 155 (0、4); 3, 145 (0、5); 3, 138 (0、4); 3, 127 (0、5); 3, 056 (0、4); 3, 022 (4、3); 2, 751 (0、4); 2, 690 (1、7); 2, 676 (0、8); 2, 672 (1、1); 2, 667 (0、9); 2, 525 (3、7); 2, 511 (72、5); 2, 507 (143、5); 2, 503 (187、7); 2, 498 (136、4); 2, 494 (66、3); 2, 338 (0、4); 2, 334 (0、8); 2, 329 (1、1); 2, 325 (0、8); 2, 134 (3、5); 2, 116 (16、0); 1, 614 (0、5); 1, 607 (1、1); 1, 593 (1、9); 1, 586 (2、0); 1, 573 (0、8); 1, 344 (0、5); 1, 337 (0、5); 1, 310 (0、9); 1, 296 (1、9); 1, 289 (2、1); 1, 274 (3、8); 1, 259 (6、5); 1, 244 (6、0); 1, 225 (1、2); 0, 008 (0、5); 0, 000 (16、5); -0, 009 (0、5)

20

30

40

実施例 I-T3-18: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):

δ =9, 576 (2、0); 8, 736 (3、2); 8, 472 (3、3); 8, 411 (1、7); 8, 316 (0、3); 8, 243 (1、6); 7, 994 (1、6); 7, 605 (3、6); 3, 903 (10、2); 3, 372 (0、7); 3, 333

(1 5 2、4); 3, 2 4 3 (1、3); 3, 1 7 5 (0、4); 3, 1 6 2 (0、4);
 2, 6 9 0 (0、4); 2, 6 7 6 (0、4); 2, 6 7 2 (0、6); 2, 6 6 7 (0、
 4); 2, 5 4 2 (0、6); 2, 5 2 5 (1、9); 2, 5 1 2 (3 9、2); 2, 5
 0 7 (7 7、8); 2, 5 0 3 (1 0 1、6); 2, 4 9 8 (7 3、7); 2, 4 9 4
 (3 5、7); 2, 3 3 4 (0、4); 2, 3 3 0 (0、6); 2, 3 2 5 (0、4);
 2, 1 3 4 (1 6、0); 2, 1 1 6 (0、5); 1, 6 2 9 (0、7); 1, 6 1 4
 (1、8); 1, 6 0 7 (2、0); 1, 5 9 4 (0、9); 1, 3 5 8 (0、9); 1,
 3 4 5 (1、9); 1, 3 3 8 (2、0); 1, 3 2 3 (0、7); 1, 2 5 9 (0、
 5); 1, 2 4 4 (0、4); 1, 0 1 7 (0、6); 1, 0 0 1 (0、6); 0, 0 0
 0 (9、1)

10

実施例 I-T3-19: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):
 $\delta=9, 367$ (1、9); $8, 537$ (1、8); $8, 534$ (1、9); $8, 30$
 0 (2、2); $8, 277$ (0、8); $8, 271$ (0、9); $8, 259$ (0、9);
 $8, 253$ (0、8); $7, 796$ (0、4); $7, 791$ (0、5); $7, 784$ (0、
 5); $7, 778$ (0、6); $7, 775$ (0、6); $7, 769$ (0、6); $7, 76$
 3 (0、5); $7, 757$ (0、5); $7, 598$ (3、8); $7, 457$ (0、8);
 $7, 435$ (0、8); $7, 430$ (1、0); $7, 409$ (0、7); $3, 903$ (4、
 8); $3, 335$ (1 0 4、3); $2, 672$ (0、4); $2, 542$ (0、3); $2,$
 507 (5 4、0); $2, 503$ (6 9、3); $2, 499$ (5 2、7); $2, 330$
 (0、4); $2, 122$ (1 6、0); $1, 609$ (0、8); $1, 595$ (2、0);
 $1, 588$ (2、1); $1, 575$ (0、9); $1, 323$ (0、9); $1, 309$ (2、
 0); $1, 303$ (2、1); $1, 288$ (0、8); $0, 000$ (5、6)

20

実施例 I-T3-20: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):
 $\delta=8, 816$ (2、3); $8, 810$ (2、3); $8, 695$ (3、4); $8, 68$
 1 (1、1); $8, 670$ (1、1); $8, 451$ (3、4); $8, 184$ (2、3);
 $8, 178$ (2、2); $7, 601$ (3、8); $3, 903$ (7、0); $3, 333$ (1
 $73、9$); $3, 289$ (0、4); $3, 242$ (0、9); $3, 175$ (0、6); $3,$
 162 (0、5); $2, 859$ (0、4); $2, 850$ (0、7); $2, 840$ (0、
 7); $2, 832$ (0、4); $2, 822$ (0、3); $2, 676$ (0、4); $2, 67$
 1 (0、5); $2, 667$ (0、4); $2, 542$ (0、4); $2, 511$ (3 4、1);
 $2, 507$ (6 6、3); $2, 502$ (8 5、9); $2, 498$ (6 3、0); $2, 4$
 94 (3 1、0); $2, 333$ (0、4); $2, 329$ (0、5); $2, 325$ (0、
 4); $2, 132$ (0、7); $2, 117$ (1 6、0); $1, 016$ (0、4); $1, 0$
 01 (0、4); $0, 755$ (0、5); $0, 742$ (1、3); $0, 737$ (1、7);
 $0, 725$ (1、6); $0, 719$ (1、4); $0, 707$ (0、5); $0, 564$ (0、
 6); $0, 553$ (1、7); $0, 547$ (1、6); $0, 543$ (1、5); $0, 53$

30

40

8 (1、4); 0, 526 (0、4); 0, 000 (7、1)	
実施例 I-T3-21: ^1H -NMR (600, 1MHz、 d_6 -DMSO): $\delta=9, 593$ (1、8); $8, 868$ (2、3); $8, 864$ (2、3); $8, 709$ (3、3); $8, 456$ (3、4); $8, 262$ (2、3); $8, 258$ (2、2); $7, 603$ (3、7); $3, 388$ (0、4); $3, 383$ (0、4); $3, 381$ (0、5); $3, 369$ (0、8); $3, 340$ (1164, 0); $2, 994$ (0、7); $2, 617$ (0、6); $2, 615$ (0、8); $2, 612$ (0、6); $2, 542$ (39、9); $2, 523$ (1、4); $2, 520$ (1、7); $2, 517$ (1、8); $2, 508$ (48、7); $2, 505$ (103、1); $2, 502$ (140、8); $2, 499$ (100、9); $2, 497$ (46、2); $2, 389$ (0、6); $2, 386$ (0、8); $2, 383$ (0、6); $2, 117$ (16、0); $1, 636$ (0、8); $1, 627$ (2、0); $1, 622$ (2、1); $1, 613$ (0、8); $1, 288$ (0、9); $1, 278$ (1、9); $1, 274$ (2、1); $1, 264$ (0、8); $0, 005$ (0、8); $0, 000$ (21、9); $-0, 006$ (0、7)	10
実施例 I-T3-22: ^1H -NMR (400, 1MHz、 d_6 -DMSO): $\delta=9, 397$ (6、5); $8, 682$ (5、3); $8, 677$ (5、1); $8, 405$ (7、9); $8, 366$ (0、3); $8, 087$ (16、0); $8, 060$ (0、3); $8, 041$ (0、7); $7, 981$ (1、7); $7, 966$ (2、6); $7, 963$ (2、7); $7, 948$ (1、5); $7, 944$ (1、4); $7, 763$ (0、3); $7, 505$ (1、2); $7, 501$ (1、3); $7, 486$ (2、7); $7, 470$ (1、8); $7, 466$ (1、6); $7, 384$ (0、6); $7, 374$ (3、1); $7, 365$ (1、1); $7, 355$ (5、1); $7, 345$ (0、8); $7, 336$ (2、3); $5, 761$ (0、8); $3, 348$ (68、6); $3, 028$ (1、2); $2, 875$ (1、0); $2, 712$ (0、4); $2, 671$ (0、3); $2, 542$ (99、6); $2, 507$ (38、4); $2, 502$ (50、3); $2, 498$ (38、2); $2, 368$ (0、4); $2, 087$ (0、3); $1, 601$ (2、4); $1, 587$ (6、3); $1, 580$ (6、5); $1, 567$ (2、8); $1, 288$ (3、1); $1, 275$ (6、2); $1, 268$ (6、6); $1, 254$ (2、5); $1, 234$ (0、8); $1, 169$ (0、9); $0, 146$ (0、3); $0, 000$ (72、5); $-0, 008$ (4、9); $-0, 150$ (0、4)	20
実施例 I-T3-23: ^1H -NMR (400, 0MHz、 CD_3CN): $\delta=8, 202$ (5、5); $8, 187$ (0、5); $8, 161$ (5、9); $8, 146$ (0、5); $7, 931$ (0、4); $7, 900$ (9、0); $7, 886$ (0、8); $7, 739$ (3、5); $7, 734$ (4、4); $7, 720$ (0、5); $7, 707$ (2、6); $7, 701$ (1、9); $7, 686$ (3、0); $7, 680$ (2、5); $7, 648$ (1、5); $7, 507$ (4、1); $7, 486$ (3、4); $4, 360$ (0、5);	30
	40

4, 342 (0、5); 4, 086 (1、0); 4, 068 (2、9); 4, 050 (3、0); 4, 032 (1、1); 2, 162 (61、1); 2, 149 (10、3); 2, 120 (0、4); 2, 114 (0、4); 2, 108 (0、5); 2, 102 (0、4); 1, 972 (13、4); 1, 965 (4、8); 1, 959 (8、2); 1, 953 (30、5); 1, 947 (52、3); 1, 940 (68、1); 1, 934 (48、2); 1, 928 (27、3); 1, 769 (0、4); 1, 596 (1、8); 1, 581 (4、5); 1, 574 (4、4); 1, 561 (2、8); 1, 437 (16、0); 1, 422 (1、2); 1, 401 (0、5); 1, 371 (0、6); 1, 361 (2、6); 1, 353 (1、9); 1, 347 (4、6); 1, 341 (4、6); 1, 336 (1、5); 1, 326 (2、3); 1, 268 (1、6); 1, 222 (3、7); 1, 204 (7、2); 1, 186 (3、8); 0, 000 (2、2)

10

実施例 I-T3-24: ^1H -NMR (600, 1MHz、CD₃CN):

δ =8, 189 (6、2); 8, 144 (6、7); 7, 897 (10、1); 7, 690 (3、8); 7, 687 (4、5); 7, 652 (2、6); 7, 648 (2、1); 7, 638 (2、8); 7, 634 (2、4); 7, 471 (4、4); 7, 457 (3、7); 6, 891 (1、0); 5, 446 (2、0); 4, 077 (2、0); 4, 065 (6、2); 4, 053 (6、2); 4, 041 (2、1); 2, 864 (0、8); 2, 857 (1、1); 2, 852 (1、7); 2, 845 (1、7); 2, 839 (1、1); 2, 833 (0、8); 2, 129 (55、4); 2, 054 (0、5); 2, 050 (0、7); 2, 046 (0、5); 1, 971 (27、5); 1, 963 (6、3); 1, 955 (8、8); 1, 951 (10、1); 1, 947 (46、9); 1, 943 (78、2); 1, 939 (115、2); 1, 935 (77、9); 1, 931 (39、3); 1, 922 (0、5); 1, 828 (0、4); 1, 824 (0、6); 1, 820 (0、4); 1, 437 (16、0); 1, 270 (0、4); 1, 216 (7、4); 1, 204 (14、6); 1, 192 (7、3); 0, 786 (1、0); 0, 777 (2、8); 0, 774 (3、6); 0, 765 (3、6); 0, 762 (2、7); 0, 754 (1、2); 0, 606 (1、1); 0, 599 (2、9); 0, 598 (2、9); 0, 595 (3、0); 0, 591 (2、8); 0, 588 (2、8); 0, 580 (0、9); 0, 005 (2、1); 0, 000 (69、9); -0, 006 (2、2)

20

30

実施例 I-T3-25: ^1H -NMR (601, 6MHz、CD₃CN):

δ =8, 201 (9、9); 8, 163 (10、8); 7, 899 (16、0); 7, 738 (5、9); 7, 734 (7、4); 7, 710 (4、2); 7, 706 (3、3); 7, 696 (4、6); 7, 693 (4、0); 7, 522 (6、8); 7, 508 (5、8); 7, 328 (1、4); 7, 265 (0、6); 7, 251 (1、5); 7, 239 (1、1); 7, 195 (1、4); 7, 183 (1、0); 7, 162 (0、

40

5); 7, 150 (0、7); 5, 446 (1、0); 4, 127 (1、3); 4, 116 (1、5); 4, 111 (4、2); 4, 100 (4、3); 4, 095 (4、5); 4, 085 (4、3); 4, 080 (1、7); 4, 069 (1、4); 2, 328 (5、9); 2, 134 (32、5); 2, 132 (53、6); 2, 058 (0、4); 2, 054 (0、6); 2, 050 (1、0); 2, 046 (0、7); 1, 971 (1、2); 1, 964 (7、9); 1, 955 (12、2); 1, 951 (13、8); 1, 947 (67、1); 1, 943 (113、1); 1, 939 (165、4); 1, 935 (111、4); 1, 931 (56、0); 1, 833 (0、5); 1, 829 (0、7); 1, 825 (0、9); 1, 821 (0、7); 1, 437 (5、7); 1, 269 (0、8); 1, 204 (0、6); 1, 192 (0、3); 0, 000 (1、4)

実施例 I-T3-26: ^1H -NMR (601, 6MHz、CD₃CN):

δ =8, 222 (8、5); 8, 184 (9、2); 8, 183 (8、4); 7, 933 (13、8); 7, 743 (5、6); 7, 739 (6、7); 7, 712 (3、8); 7, 709 (3、0); 7, 699 (4、2); 7, 695 (3、6); 7, 530 (6、3); 7, 516 (5、4); 7, 228 (0、3); 7, 216 (0、4); 7, 172 (1、1); 5, 481 (0、5); 4, 022 (0、9); 3, 653 (2、8); 3, 641 (6、5); 3, 631 (6、6); 3, 620 (2、9); 2, 605 (0、6); 2, 594 (1、2); 2, 586 (2、0); 2, 582 (0、9); 2, 575 (3、7); 2, 568 (2、2); 2, 564 (2、1); 2, 556 (3、9); 2, 549 (0、9); 2, 545 (2、0); 2, 538 (1、3); 2, 527 (0、6); 2, 505 (0、6); 2, 502 (1、0); 2, 499 (1、4); 2, 496 (1、0); 2, 361 (1、2); 2, 216 (233、1); 2, 214 (233、8); 2, 213 (216、8); 2, 211 (239、7); 2, 210 (216、4); 2, 206 (358、9); 2, 092 (0、7); 2, 088 (1、2); 2, 084 (1、6); 2, 080 (1、2); 2, 076 (0、6); 2, 005 (1、3); 1, 998 (14、1); 1, 990 (21、9); 1, 985 (26、7); 1, 982 (121、7); 1, 978 (205、2); 1, 973 (304、1); 1, 969 (210、4); 1, 965 (107、9); 1, 867 (0、7); 1, 863 (1、2); 1, 859 (1、7); 1, 855 (1、2); 1, 850 (0、6); 1, 470 (16、0); 1, 303 (0、4); 1, 237 (0、6); 0, 033 (1、8)

実施例 I-T3-27: ^1H -NMR (400, 0MHz、d₆-DMSO):

δ =9, 439 (6、6); 8, 693 (9、5); 8, 441 (9、4); 8, 317 (0、9); 8, 274 (16、0); 7, 807 (2、2); 7, 802 (3、8); 7, 792 (5、8); 7, 786 (9、9); 7, 569 (5、1); 7, 553 (1、2); 7, 546 (4、2); 4, 020 (0、3); 3, 568 (10、9); 3, 3

28 (401、1); 2, 675 (2、2); 2, 671 (2、9); 2, 666 (2、2); 2, 506 (372、0); 2, 502 (465、0); 2, 497 (338、4); 2, 333 (2、3); 2, 328 (2、9); 2, 324 (2、1); 1, 989 (1、3); 1, 615 (2、4); 1, 601 (6、2); 1, 594 (6、2); 1, 581 (2、5); 1, 398 (5、4); 1, 287 (2、8); 1, 274 (6、1); 1, 267 (6、2); 1, 253 (2、2); 1, 235 (0、4); 1, 192 (0、4); 1, 175 (0、7); 1, 157 (0、4); 0, 146 (0、7); 0, 000 (164、4); -0, 008 (7、8); -0, 150 (0、8)

10

実施例 I-T3-28: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):

δ =8, 684 (0、4); 8, 672 (9、5); 8, 535 (3、2); 8, 524 (3、2); 8, 453 (0、3); 8, 427 (9、5); 8, 271 (16、0); 7, 749 (2、3); 7, 744 (3、3); 7, 723 (12、2); 7, 519 (4、6); 7, 498 (3、9); 4, 056 (0、5); 4, 038 (1、4); 4, 020 (1、4); 4, 002 (0、5); 3, 568 (7、8); 3, 329 (74、2); 2, 857 (0、9); 2, 848 (1、3); 2, 839 (1、9); 2, 829 (2、0); 2, 820 (1、3); 2, 811 (0、9); 2, 801 (0、3); 2, 676 (0、4); 2, 671 (0、6); 2, 667 (0、4); 2, 524 (1、5); 2, 511 (34、6); 2, 507 (68、9); 2, 502 (89、7); 2, 498 (64、3); 2, 493 (30、8); 2, 333 (0、4); 2, 329 (0、6); 2, 324 (0、4); 1, 989 (6、1); 1, 397 (15、9); 1, 193 (1、6); 1, 175 (3、1); 1, 157 (1、6); 0, 728 (1、3); 0, 716 (3、7); 0, 711 (4、9); 0, 698 (4、7); 0, 693 (3、9); 0, 681 (1、6); 0, 561 (1、7); 0, 551 (5、1); 0, 544 (4、7); 0, 535 (4、1); 0, 523 (1、2); 0, 008 (1、4); 0, 000 (37、7); -0, 008 (1、4)

20

30

実施例 I-T3-29: ^1H -NMR (400, 1MHz、 d_6 -DMSO):

δ =9, 042 (6、2); 9, 036 (6、0); 8, 962 (0、4); 8, 831 (6、4); 8, 826 (6、3); 8, 807 (9、8); 8, 678 (3、3); 8, 668 (3、2); 8, 507 (9、6); 8, 478 (0、5); 8, 385 (3、9); 8, 379 (6、4); 8, 374 (3、5); 8, 111 (16、0); 3, 368 (0、3); 3, 367 (0、3); 3, 365 (0、4); 3, 362 (0、5); 3, 361 (0、6); 3, 360 (0、6); 3, 357 (0、7); 3, 356 (0、8); 3, 350 (1、8); 3, 330 (278、8); 3, 313 (3、5); 3, 309 (2、7); 3, 308 (2、6); 3, 306 (2、5); 3, 297 (1、0); 3, 295 (1、0); 3, 294 (0、9); 3, 287 (0、6); 3, 284 (0、5); 3, 281 (0、4); 3, 279 (0、4); 3, 277 (0、4);

40

2, 915 (0、4); 2, 905 (1、0); 2, 896 (1、5); 2, 887 (2、2); 2, 877 (2、3); 2, 869 (1、5); 2, 859 (1、1); 2, 849 (0、4); 2, 711 (0、4); 2, 671 (0、3); 2, 565 (0、4); 2, 564 (0、5); 2, 563 (0、5); 2, 562 (0、6); 2, 560 (0、7); 2, 559 (0、8); 2, 558 (0、9); 2, 557 (1、1); 2, 555 (1、4); 2, 542 (109、1); 2, 533 (2、6); 2, 532 (2、3); 2, 530 (2、0); 2, 529 (1、9); 2, 528 (1、8); 2, 527 (1、8); 2, 525 (1、9); 2, 524 (2、0); 2, 523 (2、0); 2, 511 (15、9); 2, 507 (30、0); 2, 502 (38、9); 2, 498 (28、5); 2, 494 (14、2); 2, 368 (0、4); 2, 130 (0、7); 1, 234 (0、5); 0, 765 (1、4); 0, 752 (4、2); 0, 747 (5、5); 0, 735 (5、4); 0, 729 (4、4); 0, 717 (2、0); 0, 696 (0、3); 0, 618 (2、1); 0, 608 (5、9); 0, 602 (5、4); 0, 592 (4、5); 0, 580 (1、5); 0, 146 (0、5); 0, 022 (0、4); 0, 021 (0、5); 0, 020 (0、6); 0, 019 (0、7); 0, 017 (0、7); 0, 016 (0、9); 0, 008 (6、5); 0, 000 (110、7); -0, 009 (5、4); -0, 013 (2、0); -0, 014 (1、7); -0, 015 (1、6); -0, 016 (1、4); -0, 018 (1、3); -0, 019 (1、2); -0, 020 (1、1); -0, 021 (1、0); -0, 023 (1、0); -0, 024 (0、9); -0, 025 (0、9); -0, 026 (0、8); -0, 027 (0、7); -0, 029 (0、7); -0, 031 (0、5); -0, 034 (0、5); -0, 035 (0、4); -0, 036 (0、4); -0, 150 (0、5)

実施例 I-T3-30: ^1H -NMR (400, 1MHz、 d_6 -DMSO):
 δ =9, 562 (6、5); 9, 101 (6、1); 9, 095 (6、1); 8, 989 (0、4); 8, 855 (6、3); 8, 850 (6、4); 8, 829 (9、9); 8, 5253 (9、7); 8, 5245 (9、7); 8, 496 (0、5); 8, 438 (3、7); 8, 432 (6、4); 8, 427 (3、6); 8, 115 (16、0); 5, 759 (0、5); 3, 361 (0、8); 3, 329 (283、9); 2, 712 (0、5); 2, 671 (0、4); 2, 568 (0、3); 2, 567 (0、4); 2, 565 (0、4); 2, 564 (0、5); 2, 563 (0、5); 2, 562 (0、6); 2, 560 (0、7); 2, 559 (0、7); 2, 558 (0、9); 2, 557 (1、0); 2, 555 (1、2); 2, 554 (1、5); 2, 542 (137、6); 2, 533 (2、7); 2, 532 (2、2); 2, 530 (2、0); 2, 529 (1、9); 2, 528 (1、8); 2, 527 (1、7); 2, 525 (1、8); 2, 524 (1、8); 2, 523 (1、9); 2, 511 (16、2); 2, 507

(31、6); 2, 502 (41、8); 2, 498 (30、6); 2, 493 (15、2); 2, 368 (0、5); 1, 631 (2、6); 1, 617 (6、5); 1, 610 (6、6); 1, 597 (3、0); 1, 348 (3、1); 1, 334 (6、6); 1, 328 (6、6); 1, 313 (2、5); 1, 234 (0、4); 0, 146 (0、5); 0, 026 (0、3); 0, 025 (0、4); 0, 024 (0、4); 0, 022 (0、5); 0, 021 (0、6); 0, 020 (0、6); 0, 019 (0、7); 0, 016 (0、9); 0, 008 (5、8); 0, 000 (109、7); -0, 008 (4、9); -0, 014 (1、3); -0, 015 (1、2); -0, 016 (1、1); -0, 018 (1、0); -0, 019 (0、9); -0, 020 (0、9); -0, 023 (0、7); -0, 024 (0、6); -0, 025 (0、6); -0, 027 (0、5); -0, 029 (0、4); -0, 030 (0、4); -0, 031 (0、4); -0, 150 (0、5)

10

実施例 I-T3-31: ^1H -NMR (601, 6MHz、CD₃CN):

δ = 19, 953 (0、4); 8, 476 (0、6); 8, 461 (16、0); 8, 193 (0、3); 8, 170 (0、6); 8, 156 (14、9); 8, 148 (0、5); 8, 052 (0、3); 7, 934 (7、1); 7, 931 (7、2); 7, 901 (0、6); 7, 866 (5、7); 7, 852 (8、0); 7, 779 (4、3); 7, 765 (3、1); 7, 707 (9、8); 7, 703 (11、5); 7, 689 (0、7); 7, 669 (6、5); 7, 665 (5、3); 7, 655 (7、3); 7, 651 (6、3); 7, 609 (0、4); 7, 477 (11、0); 7, 463 (9、5); 6, 905 (2、4); 3, 912 (2、1); 2, 873 (0、6); 2, 866 (1、9); 2, 860 (2、7); 2, 854 (4、1); 2, 848 (4、3); 2, 842 (2、7); 2, 836 (2、0); 2, 830 (0、7); 2, 145 (513、7); 2, 068 (0、6); 2, 064 (0、6); 2, 060 (3、3); 2, 056 (5、5); 2, 052 (8、1); 2, 048 (5、6); 2, 044 (2、9); 1, 966 (31、6); 1, 958 (83、8); 1, 953 (98、4); 1, 950 (560、5); 1, 945 (964、6); 1, 941 (1429、4); 1, 937 (989、8); 1, 933 (503、8); 1, 925 (8、1); 1, 843 (0、3); 1, 835 (3、0); 1, 831 (5、4); 1, 827 (7、9); 1, 823 (5、4); 1, 818 (2、7); 1, 340 (0、3); 1, 285 (0、7); 1, 269 (2、9); 1, 123 (0、4); 0, 882 (0、7); 0, 790 (2、5); 0, 782 (6、8); 0, 779 (9、4); 0, 770 (9、0); 0, 767 (7、4); 0, 759 (3、0); 0, 744 (0、4); 0, 732 (0、4); 0, 636 (0、4); 0, 609 (2、9); 0, 601 (7、4); 0, 598 (7、8); 0, 595 (7、3); 0, 592 (7、5); 0, 583 (2、4); 0, 097 (2、5); 0, 005 (17、5); 0, 000 (598、4); -0,

20

30

40

006 (20、1); -0, 100 (2、5)

実施例 I-T3-32: $^1\text{H-NMR}$ (601, 6MHz、 CD_3CN):

$\delta=19, 978$ (0、8); $8, 505$ (16、0); $8, 234$ (0、7); $8, 197$ (15、1); $7, 962$ (7、3); $7, 933$ (1、0); $7, 901$ (6、0); $7, 887$ (8、2); $7, 812$ (4、3); $7, 798$ (3、2); $7, 785$ (9、1); $7, 781$ (11、3); $7, 755$ (6、0); $7, 752$ (4、8); $7, 742$ (6、5); $7, 738$ (5、8); $7, 557$ (10、5); $7, 543$ (9、3); $7, 451$ (1、9); $7, 284$ (1、2); $7, 272$ (0、9); $7, 228$ (1、1); $7, 216$ (0、9); $7, 183$ (0、6); $5, 481$ (0、6); $4, 162$ (2、0); $4, 151$ (2、3); $4, 147$ (6、6); $4, 136$ (6、5); $4, 131$ (7、2); $4, 120$ (6、5); $4, 115$ (3、0); $4, 104$ (2、2); $3, 946$ (0、8); $2, 497$ (1、3); $2, 361$ (4、7); $2, 211$ (114、1); $2, 208$ (135、0); $2, 203$ (158、6); $2, 200$ (140、9); $2, 198$ (164、0); $2, 092$ (0、8); $2, 088$ (1、1); $2, 084$ (1、6); $2, 080$ (1、1); $1, 997$ (12、7); $1, 989$ (19、6); $1, 985$ (22、3); $1, 981$ (108、3); $1, 977$ (181、4); $1, 973$ (268、0); $1, 969$ (184、4); $1, 965$ (94、6); $1, 862$ (1、0); $1, 858$ (1、5); $1, 854$ (1、1); $1, 303$ (1、1); $0, 033$ (2、1)

実施例 I-T3-33: $^1\text{H-NMR}$ (601, 6MHz、 CD_3CN):

$\delta=8, 489$ (10、8); $8, 221$ (0、7); $8, 184$ (10、0); $7, 966$ (4、8); $7, 932$ (1、1); $7, 902$ (4、0); $7, 888$ (5、4); $7, 813$ (3、0); $7, 799$ (2、1); $7, 759$ (6、4); $7, 755$ (7、3); $7, 725$ (4、1); $7, 722$ (3、2); $7, 712$ (4、4); $7, 708$ (3、5); $7, 533$ (7、0); $7, 519$ (5、9); $7, 111$ (1、4); $3, 659$ (3、4); $3, 648$ (7、7); $3, 637$ (7、6); $3, 626$ (3、3); $2, 609$ (0、8); $2, 598$ (1、4); $2, 591$ (2、3); $2, 579$ (4、4); $2, 572$ (2、5); $2, 568$ (2、5); $2, 561$ (4、4); $2, 549$ (2、4); $2, 542$ (1、5); $2, 531$ (0、8); $2, 184$ (375、5); $2, 182$ (324、4); $2, 181$ (324、2); $2, 177$ (394、7); $2, 173$ (444、9); $2, 092$ (1、2); $2, 088$ (2、1); $2, 084$ (3、3); $2, 080$ (2、2); $2, 076$ (1、1); $1, 998$ (27、5); $1, 990$ (42、2); $1, 985$ (47、1); $1, 981$ (234、7); $1, 977$ (393、2); $1, 973$ (581、0); $1, 969$ (400、8); $1, 965$ (207、8); $1, 867$ (1、2); $1, 863$ (2、2); $1, 859$ (3、3); $1, 855$ (2、2); $1, 850$ (1、2); $1, 471$ (1

6、0); 1, 303 (1、3); 0, 033 (3、4)	
実施例 I-T3-34: $^1\text{H-NMR}$ (400, 0MHz、CD_3CN): $\delta=8, 493$ (16、0); $8, 193$ (15、4); $8, 099$ (0、4); $8, 087$ (6、7); $8, 065$ (8、0); $7, 850$ (4、4); $7, 827$ (4、3); $7, 815$ (7、2); $7, 752$ (9、3); $7, 747$ (11、6); $7, 720$ (6、3); $7, 715$ (4、4); $7, 699$ (7、2); $7, 694$ (5、8); $7, 569$ (4、2); $7, 514$ (10、8); $7, 493$ (8、8); $4, 012$ (0、8); $3, 891$ (0、5); $3, 458$ (0、5); $3, 452$ (0、5); $3, 236$ (1、8); $3, 067$ (0、5); $3, 056$ (0、5); $2, 848$ (0、4); $2, 140$ (115、1); $2, 120$ (1、0); $2, 114$ (1、4); $2, 108$ (1、6); $2, 102$ (1、2); $2, 095$ (0、6); $1, 972$ (1、7); $1, 965$ (8、4); $1, 958$ (21、0); $1, 953$ (103、8); $1, 947$ (185、9); $1, 940$ (245、9); $1, 934$ (166、9); $1, 928$ (84、5); $1, 781$ (0、6); $1, 775$ (1、1); $1, 769$ (1、5); $1, 763$ (1、0); $1, 756$ (0、6); $1, 605$ (4、6); $1, 591$ (11、9); $1, 584$ (11、8); $1, 570$ (6、0); $1, 530$ (0、8); $1, 437$ (6、2); $1, 407$ (0、7); $1, 367$ (6、3); $1, 353$ (11、8); $1, 346$ (12、0); $1, 332$ (4、7); $1, 294$ (0、6); $1, 269$ (5、1); $1, 204$ (0、6); $0, 882$ (0、6); $0, 146$ (1、2); $0, 008$ (11、5); $0, 000$ (282、0); $-0, 009$ (9、7); $-0, 150$ (1、3)	10 20
実施例 I-T3-35: $^1\text{H-NMR}$ (400, 0MHz、CD_3CN): $\delta=8, 496$ (0、7); $8, 480$ (16、0); $8, 182$ (15、3); $8, 181$ (14、8); $8, 087$ (6、6); $8, 065$ (7、9); $7, 848$ (4、7); $7, 825$ (4、8); $7, 812$ (7、7); $7, 702$ (9、9); $7, 697$ (11、9); $7, 670$ (6、9); $7, 664$ (4、9); $7, 649$ (7、8); $7, 643$ (6、3); $7, 481$ (10、8); $7, 460$ (8、6); $6, 929$ (2、9); $2, 887$ (0、7); $2, 877$ (2、1); $2, 868$ (2、9); $2, 859$ (4、5); $2, 849$ (4、5); $2, 841$ (2、9); $2, 831$ (2、1); $2, 822$ (0、7); $2, 467$ (0、4); $2, 463$ (0、5); $2, 458$ (0、4); $2, 153$ (188、6); $2, 120$ (0、8); $2, 114$ (1、1); $2, 108$ (1、3); $2, 102$ (0、9); $2, 096$ (0、5); $1, 972$ (2、2); $1, 965$ (8、7); $1, 959$ (23、3); $1, 953$ (95、7); $1, 947$ (167、7); $1, 941$ (215、6); $1, 934$ (146、4); $1, 928$ (73、1); $1, 781$ (0、5); $1, 775$ (0、9); $1, 769$ (1、2); $1, 763$ (0、8); $1, 757$ (0、4); $1, 437$ (6、9);	30 40

1, 269 (0、6); 1, 204 (0、5); 0, 800 (2、4); 0, 788 (7、7); 0, 783 (9、7); 0, 770 (10、2); 0, 765 (7、3); 0, 753 (3、1); 0, 731 (0、4); 0, 713 (0、4); 0, 656 (0、4); 0, 646 (0、4); 0, 617 (3、3); 0, 605 (8、7); 0, 599 (9、2); 0, 595 (8、3); 0, 590 (7、6); 0, 577 (2、2); 0, 522 (0、3); 0, 146 (1、0); 0, 000 (233、4); -0, 009 (9、6); -0, 150 (1、0)

10

実施例 I-T3-36: ^1H -NMR (400, 0MHz、CD₃CN):

δ =8, 496 (16、0); 8, 192 (15、3); 8, 093 (6、4); 8, 071 (7、7); 7, 850 (4、3); 7, 827 (4、3); 7, 814 (7、1); 7, 749 (9、1); 7, 743 (11、5); 7, 726 (6、8); 7, 721 (4、1); 7, 706 (7、6); 7, 700 (5、6); 7, 532 (10、3); 7, 511 (8、3); 7, 340 (2、4); 4, 149 (2、3); 4, 132 (2、8); 4, 125 (7、1); 4, 109 (7、4); 4, 102 (7、4); 4, 085 (7、2); 4, 078 (2、6); 4, 061 (2、3); 2, 137 (51、6); 2, 120 (0、6); 2, 114 (0、9); 2, 108 (1、0); 2, 102 (0、7); 2, 095 (0、4); 1, 965 (6、7); 1, 958 (18、2); 1, 953 (74、7); 1, 946 (129、6); 1, 940 (165、9); 1, 934 (111、8); 1, 928 (55、4); 1, 781 (0、4); 1, 775 (0、7); 1, 769 (1、0); 1, 763 (0、6); 1, 437 (3、7); 1, 270 (0、3); 0, 146 (0、8); 0, 008 (11、2); 0, 000 (188、1); -0, 009 (6、3); -0, 150 (0、8)

20

実施例 I-T3-37: ^1H -NMR (400, 0MHz、CD₃CN):

δ =8, 518 (0、5); 8, 490 (16、0); 8, 238 (0、5); 8, 193 (14、9); 8, 090 (6、7); 8, 069 (7、7); 7, 850 (4、2); 7, 827 (4、0); 7, 814 (6、7); 7, 735 (9、2); 7, 729 (11、3); 7, 717 (0、4); 7, 696 (6、1); 7, 690 (4、5); 7, 675 (7、0); 7, 669 (5、9); 7, 587 (0、4); 7, 536 (0、3); 7, 514 (0、6); 7, 504 (11、0); 7, 494 (0、6); 7, 483 (9、1); 7, 459 (1、7); 7, 445 (1、6); 6, 694 (0、4); 6, 666 (0、3); 5, 364 (0、6); 5, 343 (2、4); 5, 322 (4、7); 5, 301 (4、6); 5, 280 (2、4); 5, 259 (0、7); 4, 006 (0、5); 3, 589 (0、4); 3, 567 (0、4); 3, 549 (6、1); 3, 545 (3、8); 3, 525 (11、4); 3, 507 (4、3); 3, 503 (7、9); 3, 379 (8、1); 3, 375 (5、1); 3, 358 (11、5); 3, 355 (10、8); 3, 338 (3、6); 3, 334 (6、2); 3, 067

30

40

(0、5); 2, 848 (0、5); 2, 472 (0、5); 2, 468 (1、0); 2, 463 (1、3); 2, 458 (1、0); 2, 453 (0、5); 2, 264 (0、3); 2, 245 (0、4); 2, 151 (305、9); 2, 120 (1、6); 2, 114 (2、3); 2, 107 (2、8); 2, 101 (2、0); 2, 095 (1、0); 2, 022 (1、9); 2, 003 (0、5); 1, 964 (14、6); 1, 958 (33、8); 1, 952 (185、3); 1, 946 (333、6); 1, 940 (449、3); 1, 934 (307、4); 1, 928 (157、3); 1, 915 (1、9); 1, 781 (1、0); 1, 775 (1、8); 1, 768 (2、5); 1, 762 (1、7); 1, 756 (0、8); 1, 269 (2、1); 0, 146 (3、1); 0, 025 (0、7); 0, 008 (22、9); 0, 000 (696、9); -0, 009 (23、3); -0, 150 (3、1)

10

実施例 I-T3-38: ^1H -NMR (400, 0MHz、CD₃CN):

δ =8, 238 (7、9); 8, 119 (7、5); 7, 748 (4、6); 7, 742 (5、7); 7, 729 (4、0); 7, 711 (3、1); 7, 706 (2、3); 7, 690 (3、5); 7, 685 (2、8); 7, 666 (1、4); 7, 644 (2、6); 7, 595 (5、4); 7, 574 (4、0); 7, 500 (5、1); 7, 479 (4、2); 4, 068 (1、0); 4, 050 (1、0); 4, 032 (0、3); 2, 800 (1、9); 2, 781 (5、9); 2, 762 (6、0); 2, 744 (2、0); 2, 139 (27、7); 2, 120 (0、5); 2, 113 (0、5); 2, 107 (0、6); 2, 101 (0、4); 1, 972 (4、6); 1, 964 (2、9); 1, 958 (7、5); 1, 952 (33、5); 1, 946 (58、9); 1, 940 (77、3); 1, 933 (53、2); 1, 927 (27、2); 1, 774 (0、4); 1, 768 (0、5); 1, 762 (0、3); 1, 601 (2、2); 1, 587 (6、0); 1, 580 (6、0); 1, 566 (3、0); 1, 526 (0、4); 1, 402 (0、3); 1, 362 (3、0); 1, 348 (6、0); 1, 342 (6、1); 1, 327 (2、3); 1, 270 (1、6); 1, 221 (1、2); 1, 204 (2、3); 1, 186 (1、1); 1, 113 (7、7); 1, 095 (16、0); 1, 076 (7、4); 0, 146 (1、1); 0, 008 (13、7); 0, 000 (231、5); -0, 009 (10、7); -0, 150 (1、1)

20

30

実施例 I-T3-39: ^1H -NMR (400, 0MHz、CD₃CN):

δ =8, 226 (8、7); 8, 120 (0、4); 8, 108 (8、2); 7, 726 (4、1); 7, 700 (4、7); 7, 694 (5、9); 7, 680 (0、5); 7, 663 (4、5); 7, 657 (3、5); 7, 642 (6、1); 7, 637 (5、3); 7, 593 (5、2); 7, 572 (2、8); 7, 467 (5、6); 7, 447 (4、6); 6, 927 (1、4); 3, 874 (0、7); 3, 051 (0、4); 2, 938 (0、4); 2, 875 (0、9); 2, 865 (1、4); 2, 857 (2、

40

1); 2, 847 (2、1); 2, 838 (1、4); 2, 829 (1、0); 2, 819 (0、3); 2, 798 (2、0); 2, 780 (6、2); 2, 761 (6、4); 2, 742 (2、2); 2, 463 (0、4); 2, 160 (108、1); 2, 120 (0、8); 2, 114 (0、9); 2, 108 (1、0); 2, 101 (0、7); 2, 095 (0、4); 1, 972 (0、6); 1, 964 (3、4); 1, 958 (8、7); 1, 952 (47、6); 1, 946 (86、2); 1, 940 (115、8); 1, 934 (80、2); 1, 928 (41、7); 1, 781 (0、4); 1, 775 (0、5); 1, 768 (0、7); 1, 762 (0、5); 1, 437 (6、6); 1, 270 (1、4); 1, 112 (7、8); 1, 102 (1、0); 1, 093 (16、0); 1, 074 (7、6); 0, 797 (1、2); 0, 784 (3、7); 0, 779 (4、7); 0, 766 (4、9); 0, 761 (3、7); 0, 749 (1、7); 0, 614 (1、6); 0, 602 (4、5); 0, 596 (4、5); 0, 592 (4、0); 0, 587 (4、0); 0, 574 (1、2); 0, 146 (1、3); 0, 008 (10、2); 0, 007 (10、2); 0, 000 (266、8); -0, 008 (11、5); -0, 150 (1、3)

実施例 I-T3-40: ^1H -NMR (400, 0MHz、 CD_3CN):

δ =8, 241 (8、2); 8, 240 (8、8); 8, 117 (8、2); 7, 746 (4、6); 7, 741 (6、2); 7, 727 (4、2); 7, 718 (3、5); 7, 712 (2、4); 7, 697 (3、6); 7, 691 (3、1); 7, 664 (1、4); 7, 642 (2、6); 7, 597 (5、2); 7, 576 (2、7); 7, 516 (5、5); 7, 495 (4、5); 7, 352 (0、9); 4, 144 (1、2); 4, 128 (1、3); 4, 121 (3、6); 4, 104 (3、6); 4, 097 (3、8); 4, 081 (3、6); 4, 074 (1、4); 4, 057 (1、2); 2, 800 (2、0); 2, 781 (6、2); 2, 763 (6、3); 2, 744 (2、1); 2, 153 (11、7); 2, 149 (14、3); 1, 971 (0、5); 1, 964 (1、3); 1, 958 (3、1); 1, 952 (16、8); 1, 946 (30、8); 1, 940 (41、6); 1, 934 (28、7); 1, 927 (14、8); 1, 436 (10、4); 1, 268 (0、4); 1, 114 (7、8); 1, 095 (16、0); 1, 076 (7、6); 0, 146 (0、6); 0, 008 (4、4); 0, 000 (116、7); -0, 008 (5、1); -0, 150 (0、6)

実施例 I-T3-41: ^1H -NMR (400, 0MHz、 CD_3CN):

δ =8, 239 (7、9); 8, 122 (7、5); 7, 732 (8、1); 7, 727 (9、3); 7, 689 (3、0); 7, 684 (2、4); 7, 668 (4、6); 7, 663 (4、2); 7, 644 (2、6); 7, 598 (4、8); 7, 577 (2、6); 7, 491 (5、3); 7, 470 (4、9); 5, 342 (1、2); 5, 320 (2、4); 5, 300 (2、4); 5, 279 (1、2); 3, 548 (3、0);

3, 524 (6、0); 3, 502 (4、1); 3, 374 (4、1); 3, 371 (2、6); 3, 354 (6、0); 3, 351 (5、6); 3, 330 (3、2); 2, 803 (1、9); 2, 784 (5、9); 2, 765 (6、0); 2, 746 (2、1); 2, 468 (0、8); 2, 464 (0、9); 2, 459 (0、7); 2, 156 (336、8); 2, 120 (1、6); 2, 114 (2、0); 2, 107 (2、3); 2, 101 (1、6); 2, 095 (1、0); 1, 964 (10、5); 1, 958 (27、4); 1, 952 (132、9); 1, 946 (239、9); 1, 940 (318、6); 1, 934 (221、8); 1, 928 (114、5); 1, 781 (0、8); 1, 775 (1、4); 1, 769 (1、9); 1, 762 (1、3); 1, 756 (0、7); 1, 437 (0、8); 1, 269 (2、2); 1, 115 (7、6); 1, 096 (16、0); 1, 078 (7、4); 0, 146 (3、8); 0, 008 (39、2); 0, 000 (832、6); -0, 008 (44、8); -0, 150 (4、0)

10

実施例 I-T3-42: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):

δ =8, 830 (5、8); 8, 821 (4、0); 8, 815 (4、0); 8, 694 (1、8); 8, 683 (1、8); 8, 548 (5、3); 8, 547 (5、5); 8, 315 (0、6); 8, 192 (4、1); 8, 186 (3、9); 8, 107 (8、4); 3, 902 (16、0); 3, 333 (334、0); 3, 243 (1、4); 3, 175 (0、9); 3, 162 (0、9); 2, 870 (0、5); 2, 861 (0、7); 2, 852 (1、1); 2, 842 (1、1); 2, 833 (0、7); 2, 824 (0、5); 2, 680 (0、3); 2, 676 (0、7); 2, 672 (0、9); 2, 667 (0、7); 2, 662 (0、3); 2, 542 (0、6); 2, 525 (2、7); 2, 511 (58、6); 2, 507 (116、6); 2, 502 (152、6); 2, 498 (110、8); 2, 493 (53、8); 2, 338 (0、3); 2, 334 (0、7); 2, 329 (0、9); 2, 325 (0、7); 1, 909 (0、5); 1, 016 (0、6); 1, 001 (0、6); 0, 757 (0、7); 0, 744 (2、0); 0, 739 (2、8); 0, 727 (2、6); 0, 721 (2、2); 0, 709 (0、9); 0, 566 (0、9); 0, 555 (2、6); 0, 549 (2、4); 0, 545 (2、3); 0, 540 (2、2); 0, 528 (0、7); 0, 008 (0、5); 0, 000 (16、2); -0, 009 (0、5)

20

30

実施例 I-T3-43: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):

δ =9, 603 (7、1); 8, 876 (6、9); 8, 870 (6、9); 8, 843 (10、4); 8, 833 (0、4); 8, 554 (10、3); 8, 315 (0、8); 8, 280 (7、0); 8, 274 (6、8); 8, 110 (16、0); 3, 903 (14、5); 3, 434 (0、4); 3, 333 (565、4); 3, 045 (0、5); 2, 869 (0、5); 2, 676 (1、3); 2, 671 (1、7); 2, 66

40

7 (1、3); 2, 662 (0、7); 2, 542 (1、5); 2, 524 (5、6);
 2, 511 (106、6); 2, 507 (206、6); 2, 502 (266、2);
 2, 498 (191、5); 2, 493 (91、5); 2, 338 (0、5); 2, 3
 34 (1、1); 2, 329 (1、5); 2, 325 (1、1); 1, 643 (2、4);
 1, 629 (5、7); 1, 622 (6、0); 1, 609 (2、6); 1, 298 (2、
 9); 1, 284 (5、7); 1, 277 (6、1); 1, 263 (2、3); 1, 24
 9 (0、4); 1, 236 (0、4); 0, 008 (0、8); 0, 000 (22、4);
 -0, 009 (0、7)

10

実施例 I-T3-44: ^1H -NMR (400, 0MHz、CD₃CN):

δ =8, 115 (9、4); 8, 071 (10、0); 7, 690 (6、4); 7, 6
 85 (6、3); 7, 668 (1、1); 7, 653 (3、9); 7, 632 (4、2);
 7, 586 (0、3); 7, 549 (8、1); 7, 509 (0、4); 7, 463 (5、
 6); 7, 442 (4、5); 6, 896 (2、5); 4, 068 (0、5); 4, 05
 1 (0、5); 2, 871 (1、3); 2, 862 (1、9); 2, 853 (2、6);
 2, 844 (2、5); 2, 835 (1、9); 2, 826 (1、2); 2, 816 (0、
 5); 2, 452 (2、7); 2, 434 (7、4); 2, 415 (7、5); 2, 39
 6 (2、8); 2, 251 (0、5); 2, 143 (127、4); 2, 113 (3、
 7); 2, 092 (29、0); 1, 971 (7、1); 1, 952 (73、0); 1,
 946 (111、8); 1, 943 (112、2); 1, 940 (130、1); 1,
 937 (90、9); 1, 934 (90、5); 1, 928 (48、4); 1, 774
 (0、6); 1, 768 (0、7); 1, 437 (3、1); 1, 221 (0、7); 1,
 204 (1、2); 1, 186 (0、6); 1, 082 (8、3); 1, 063 (16、
 0); 1, 044 (7、9); 0, 794 (1、7); 0, 780 (6、1); 0, 77
 7 (6、2); 0, 764 (6、6); 0, 747 (2、1); 0, 726 (0、4);
 0, 610 (2、4); 0, 600 (6、7); 0, 592 (7、0); 0, 572 (1、
 7); 0, 535 (0、4); 0, 528 (0、3); 0, 524 (0、3); 0, 14
 7 (1、4); 0, 000 (240、4); -0, 149 (1、3)

20

30

実施例 I-T3-45: ^1H -NMR (400, 0MHz、CD₃CN):

δ =8, 126 (9、0); 8, 092 (9、4); 7, 735 (4、9); 7, 73
 0 (6、5); 7, 710 (3、2); 7, 705 (2、4); 7, 689 (3、6);
 7, 684 (3、1); 7, 549 (5、9); 7, 542 (5、8); 7, 513 (5、
 6); 7, 492 (4、6); 7, 422 (1、5); 4, 140 (1、2); 4, 12
 3 (1、5); 4, 116 (3、7); 4, 100 (3、9); 4, 093 (4、1);
 4, 076 (3、7); 4, 069 (1、6); 4, 052 (1、2); 3, 545 (1、
 6); 2, 464 (1、4); 2, 455 (2、7); 2, 436 (6、7); 2, 41
 7 (6、9); 2, 398 (2、4); 2, 378 (0、9); 2, 253 (0、5);

40

2, 221 (1、4); 2, 176 (369、0); 2, 126 (0、6); 2, 120 (0、7); 2, 114 (1、0); 2, 108 (1、5); 2, 094 (27、0); 1, 953 (71、9); 1, 947 (129、9); 1, 941 (173、4); 1, 935 (125、8); 1, 928 (67、7); 1, 781 (0、4); 1, 775 (0、7); 1, 769 (1、1); 1, 763 (0、7); 1, 757 (0、4); 1, 436 (9、9); 1, 269 (0、4); 1, 102 (0、5); 1, 084 (8、0); 1, 065 (16、0); 1, 046 (7、7); 1, 025 (0、5); 0, 146 (2、0); 0, 000 (393、0); -0, 150 (2、0)

10

実施例 I-T3-46: ^1H -NMR (400, 0MHz、CD₃CN):

δ =8, 127 (4、1); 8, 085 (4、4); 7, 738 (2、5); 7, 732 (3、1); 7, 702 (1、6); 7, 697 (1、2); 7, 681 (1、8); 7, 676 (1、5); 7, 625 (0、9); 7, 551 (2、4); 7, 543 (2、3); 7, 495 (2、9); 7, 474 (2、3); 2, 453 (1、1); 2, 435 (3、1); 2, 416 (3、2); 2, 397 (1、1); 2, 158 (61、0); 2, 114 (0、4); 2, 108 (0、5); 2, 092 (12、6); 1, 964 (2、0); 1, 958 (4、9); 1, 953 (25、4); 1, 946 (45、6); 1, 940 (61、1); 1, 934 (42、3); 1, 928 (21、8); 1, 769 (0、4); 1, 598 (1、2); 1, 583 (3、1); 1, 576 (3、1); 1, 563 (1、6); 1, 437 (16、0); 1, 358 (1、6); 1, 345 (3、1); 1, 338 (3、2); 1, 323 (1、3); 1, 269 (1、8); 1, 083 (4、2); 1, 064 (8、8); 1, 045 (4、0); 0, 146 (0、7); 0, 017 (0、4); 0, 008 (5、9); 0, 000 (150、8); -0, 009 (6、1); -0, 150 (0、7)

20

30

実施例 I-T3-47: ^1H -NMR (400, 0MHz、CD₃CN):

δ =8, 128 (3、6); 8, 084 (3、8); 7, 721 (2、0); 7, 715 (2、5); 7, 678 (1、2); 7, 673 (1、0); 7, 657 (1、4); 7, 652 (1、2); 7, 551 (2、1); 7, 544 (2、1); 7, 485 (2、4); 7, 464 (2、2); 5, 338 (0、6); 5, 316 (1、1); 5, 296 (1、1); 5, 275 (0、6); 3, 544 (1、4); 3, 520 (2、8); 3, 498 (1、8); 3, 370 (1、7); 3, 349 (2、6); 3, 346 (2、4); 3, 325 (1、4); 2, 456 (0、9); 2, 437 (2、6); 2, 418 (2、7); 2, 399 (0、9); 2, 166 (9、4); 2, 153 (19、8); 2, 107 (0、4); 2, 095 (10、7); 1, 964 (1、2); 1, 958 (3、1); 1, 952 (15、2); 1, 946 (27、1); 1, 940 (36、2); 1, 934 (25、2); 1, 928 (13、1); 1, 437 (16、0); 1, 085 (3、2); 1, 066 (6、7); 1, 047 (3、1); 0, 146 (0、

40

4); 0, 008 (3、9); 0, 000 (86、8); -0, 008 (4、3); -0, 150 (0、5)

実施例 I-T3-48: ^1H -NMR (400, 0MHz、CD₃CN):

δ =8, 261 (10、8); 8, 206 (0、8); 8, 193 (16、0); 7, 692 (9、7); 7, 686 (12、3); 7, 675 (1、0); 7, 657 (6、5); 7, 652 (4、9); 7, 637 (9、5); 7, 630 (13、3); 7, 608 (11、0); 7, 475 (11、5); 7, 455 (9、1); 6, 940 (2、5); 3, 911 (0、6); 2, 882 (0、7); 2, 872 (2、0); 2, 863 (2、8); 2, 854 (4、4); 2, 845 (4、3); 2, 836 (2、9); 2, 827 (2、0); 2, 817 (0、7); 2, 467 (0、3); 2, 463 (0、4); 2, 163 (117、4); 2, 120 (0、3); 2, 114 (0、5); 2, 108 (0、7); 2, 102 (0、5); 1, 972 (1、7); 1, 965 (3、3); 1, 959 (8、5); 1, 953 (43、3); 1, 947 (77、6); 1, 941 (103、6); 1, 934 (71、4); 1, 928 (36、7); 1, 775 (0、4); 1, 769 (0、6); 1, 763 (0、4); 1, 437 (2、0); 1, 269 (0、7); 1, 221 (0、4); 1, 204 (0、7); 1, 186 (0、3); 0, 795 (2、4); 0, 783 (7、5); 0, 778 (9、7); 0, 765 (10、2); 0, 760 (7、3); 0, 748 (3、3); 0, 726 (0、4); 0, 708 (0、4); 0, 654 (0、4); 0, 644 (0、4); 0, 614 (3、3); 0, 604 (8、6); 0, 597 (9、0); 0, 593 (7、8); 0, 588 (7、7); 0, 575 (2、3); 0, 514 (0、4); 0, 146 (1、3); 0, 026 (0、4); 0, 008 (10、5); 0, 000 (259、4); -0, 009 (10、3); -0, 150 (1、2)

実施例 I-T3-49: ^1H -NMR (400, 0MHz、CD₃CN):

δ =8, 277 (10、6); 8, 206 (16、0); 7, 740 (9、1); 7, 735 (12、1); 7, 709 (6、2); 7, 704 (4、7); 7, 688 (7、6); 7, 683 (7、1); 7, 669 (3、6); 7, 645 (1、5); 7, 631 (10、9); 7, 611 (10、7); 7, 574 (0、5); 7, 510 (11、0); 7, 500 (0、6); 7, 489 (9、0); 7, 475 (0、4); 7, 221 (0、4); 5, 448 (8、3); 4, 034 (0、9); 3, 914 (1、0); 3, 906 (0、7); 3, 897 (0、5); 2, 469 (1、1); 2, 464 (1、5); 2, 460 (1、1); 2, 243 (0、4); 2, 175 (509、2); 2, 120 (1、2); 2, 114 (1、7); 2, 108 (2、0); 2, 102 (1、5); 2, 096 (0、9); 1, 965 (8、1); 1, 959 (21、5); 1, 953 (116、7); 1, 947 (211、5); 1, 941 (284、4); 1, 934 (197、6); 1, 928 (103、4); 1, 781 (0、8); 1, 775

(1、3); 1, 769 (1、8); 1, 763 (1、3); 1, 757 (0、7); 1, 635 (0、4); 1, 598 (4、6); 1, 584 (12、3); 1, 577 (12、3); 1, 563 (6、3); 1, 523 (0、8); 1, 437 (0、7); 1, 403 (0、8); 1, 363 (6、4); 1, 349 (12、1); 1, 342 (12、8); 1, 328 (4、9); 1, 290 (0、6); 1, 270 (2、7); 1, 206 (1、3); 1, 190 (1、2); 0, 882 (0、3); 0, 146 (3、5); 0, 008 (26、4); 0, 000 (693、0); -0, 008 (31、4); -0, 048 (0、4); -0, 150 (3、5)

10

実施例 I-T3-50: ^1H -NMR (400, 0MHz、 CD_3CN):

δ =8, 131 (3、8); 8, 120 (0、3); 8, 108 (3、8); 7, 670 (2、4); 7, 664 (2、9); 7, 636 (1、7); 7, 630 (1、2); 7, 615 (1、9); 7, 609 (1、6); 7, 462 (2、8); 7, 441 (2、1); 7, 320 (3、0); 7, 300 (1、2); 6, 909 (0、6); 4, 085 (0、5); 4, 068 (1、4); 4, 050 (1、4); 4, 032 (0、5); 3, 901 (16、0); 2, 870 (0、5); 2, 861 (0、7); 2, 852 (1、1); 2, 843 (1、1); 2, 834 (0、7); 2, 825 (0、5); 2, 147 (64、0); 2, 114 (0、3); 2, 107 (0、4); 1, 972 (6、8); 1, 964 (3、1); 1, 958 (6、8); 1, 952 (27、1); 1, 946 (46、5); 1, 940 (60、6); 1, 934 (41、2); 1, 928 (20、8); 1, 768 (0、3); 1, 437 (1、1); 1, 221 (1、7); 1, 204 (3、2); 1, 186 (1、6); 0, 793 (0、6); 0, 781 (1、8); 0, 776 (2、3); 0, 763 (2、4); 0, 758 (1、7); 0, 746 (0、8); 0, 610 (0、9); 0, 599 (2、1); 0, 593 (2、1); 0, 589 (1、9); 0, 584 (1、8); 0, 571 (0、5); 0, 146 (0、7); 0, 008 (9、0); 0, 000 (144、6); -0, 009 (5、4); -0, 150 (0、7)

20

30

実施例 I-T3-51: ^1H -NMR (400, 0MHz、 CD_3CN):

δ =8, 206 (0、4); 8, 147 (3、5); 8, 120 (3、6); 7, 717 (2、2); 7, 712 (2、8); 7, 686 (1、6); 7, 680 (1、3); 7, 675 (0、4); 7, 665 (2、0); 7, 659 (1、9); 7, 654 (0、6); 7, 644 (0、5); 7, 630 (0、5); 7, 610 (0、3); 7, 503 (0、4); 7, 495 (2、6); 7, 482 (0、3); 7, 474 (2、1); 7, 321 (2、8); 7, 302 (1、1); 4, 068 (0、9); 4, 050 (0、9); 3, 902 (16、0); 2, 170 (60、8); 2, 114 (0、4); 2, 108 (0、5); 2, 102 (0、3); 1, 972 (4、1); 1, 965 (2、3); 1, 959 (5、7); 1, 953 (31、1); 1, 947 (56、0); 1,

40

9 4 0 (7 4、9); 1, 9 3 4 (5 1、0); 1, 9 2 8 (2 5、9); 1, 7 7 5 (0、3); 1, 7 6 9 (0、4); 1, 5 9 5 (1、1); 1, 5 8 1 (2、7); 1, 5 7 4 (2、7); 1, 5 6 0 (1、5); 1, 4 3 7 (1、0); 1, 3 5 9 (1、5); 1, 3 4 6 (2、7); 1, 3 3 9 (2、8); 1, 3 2 4 (1、1); 1, 2 2 2 (1、1); 1, 2 0 4 (2、1); 1, 1 8 6 (1、0); 1, 1 4 0 (0、5); 1, 1 3 2 (0、6); 0, 9 2 8 (0、6); 0, 9 2 1 (0、6); 0, 1 4 6 (0、8); 0, 0 0 8 (7、0); 0, 0 0 0 (1 8 7、7); -0, 0 0 9 (6、3); -0, 1 5 0 (0、8)

10

実施例 I - T 3 - 5 2 : ^1H -NMR (4 0 0, 0MHz、CD 3 CN) :

δ = 8, 2 7 6 (6、4); 8, 1 6 3 (0、3); 8, 1 5 1 (6、6); 8, 1 4 9 (7、0); 8, 1 2 8 (3、5); 8, 1 0 4 (1、6); 8, 0 8 2 (1、8); 7, 8 6 3 (2、9); 7, 8 4 2 (2、4); 7, 6 9 4 (4、0); 7, 6 8 9 (5、1); 7, 6 8 0 (0、5); 7, 6 6 0 (3、0); 7, 6 5 4 (2、2); 7, 6 3 9 (3、3); 7, 6 3 3 (2、8); 7, 4 7 4 (4、9); 7, 4 5 4 (3、9); 6, 9 3 5 (1、1); 4, 0 8 6 (0、7); 4, 0 6 8 (2、0); 4, 0 5 0 (2、1); 4, 0 3 2 (0、7); 2, 8 7 3 (0、8); 2, 8 6 3 (1、2); 2, 8 5 5 (1、8); 2, 8 4 5 (1、9); 2, 8 3 6 (1、2); 2, 8 2 7 (0、9); 2, 1 6 5 (6 6、0); 2, 1 6 3 (7 5、8); 1, 9 7 2 (9、5); 1, 9 6 5 (1、3); 1, 9 5 9 (3、0); 1, 9 5 3 (1 6、9); 1, 9 4 7 (3 0、5); 1, 9 4 1 (4 1、0); 1, 9 3 5 (2 8、3); 1, 9 2 8 (1 4、5); 1, 4 3 6 (1 6、0); 1, 2 6 9 (0、5); 1, 2 2 1 (2、5); 1, 2 0 4 (4、8); 1, 1 8 6 (2、4); 0, 7 9 6 (1、0); 0, 7 8 4 (2、9); 0, 7 7 8 (3、9); 0, 7 6 6 (4、1); 0, 7 6 1 (3、0); 0, 7 4 8 (1、4); 0, 6 1 3 (1、4); 0, 6 0 2 (3、5); 0, 5 9 6 (3、5); 0, 5 9 2 (3、2); 0, 5 8 7 (3、2); 0, 5 7 4 (1、0); 0, 0 0 8 (2、1); 0, 0 0 0 (6 2、9); -0, 0 0 9 (2、3)

20

30

実施例 I - T 3 - 5 3 : ^1H -NMR (4 0 0, 0MHz、CD 3 CN) :

δ = 8, 2 9 1 (3、8); 8, 1 6 2 (4、2); 8, 1 3 0 (2、0); 8, 1 0 8 (0、9); 8, 0 8 6 (1、0); 7, 8 6 6 (1、8); 7, 8 4 4 (1、5); 7, 7 4 2 (2、5); 7, 7 3 6 (3、2); 7, 7 0 9 (2、0); 7, 7 0 3 (1、5); 7, 6 8 8 (2、7); 7, 6 8 2 (2、4); 7, 5 0 6 (3、0); 7, 4 8 5 (2、4); 2, 1 9 6 (8、5); 2, 1 8 3 (2 4、4); 1, 9 7 2 (1、1); 1, 9 6 5 (0、6); 1, 9 5 9 (1、4); 1, 9 5 4 (7、8); 1, 9 4 7 (1 4、2); 1, 9 4 1 (1 9、1); 1, 9 3 5 (1 3、1); 1, 9 2 9 (6、7); 1, 5 9 9 (1、3); 1, 5 8 5 (3、1); 1, 5 7 8 (3、1); 1, 5 6 4 (1、7); 1, 4 3 6 (1 6、0); 1, 3 6 2 (1、7); 1, 3 4 9 (3、0); 1, 3

40

4 2 (3、1); 1, 3 2 7 (1、3); 1, 2 0 4 (0、6); 0, 0 0 8 (1、6);
0, 0 0 0 (4 4、8); -0, 0 0 9 (1、6)

実施例 I - T 3 - 5 4 : ^1H -NMR (4 0 0, 0MHz、CD 3 CN) :

δ = 8, 1 6 2 (0、9); 8, 1 5 3 (15、7); 8, 1 0 8 (12、4); 7,
9 9 6 (6、8); 7, 9 5 2 (7、0); 7, 6 8 3 (9、7); 7, 6 7 8 (12、
2); 7, 6 6 6 (0、8); 7, 6 5 0 (6、7); 7, 6 4 4 (4、9); 7, 6 2
9 (7、9); 7, 6 2 4 (6、4); 7, 5 1 3 (0、4); 7, 4 6 9 (11、7);
7, 4 4 8 (9、3); 6, 9 3 1 (2、4); 5, 4 4 8 (0、6); 4, 2 3 5 (0、
4); 4, 2 1 8 (0、4); 4, 0 8 6 (0、6); 4, 0 6 8 (1、8); 4, 0 5
7 (0、4); 4, 0 5 0 (1、8); 4, 0 3 2 (0、6); 2, 8 7 9 (0、8);
2, 8 7 0 (2、2); 2, 8 6 0 (2、8); 2, 8 5 2 (4、7); 2, 8 4 2 (4、
7); 2, 8 3 4 (2、9); 2, 8 2 4 (2、2); 2, 8 1 4 (0、7); 2, 4 7
3 (0、6); 2, 4 6 8 (1、0); 2, 4 6 3 (1、4); 2, 4 5 9 (1、0);
2, 4 5 4 (0、5); 2, 2 7 6 (0、4); 2, 2 6 4 (0、4); 2, 2 4 5 (0、
6); 2, 2 2 6 (0、8); 2, 1 5 9 (388、9); 2, 1 1 6 (47、5); 2,
1 0 8 (3、9); 2, 1 0 1 (1、9); 2, 0 9 5 (1、0); 2, 0 5 0 (0、
8); 2, 0 3 5 (0、7); 2, 0 1 7 (1、1); 1, 9 9 8 (1、0); 1, 9 7
2 (9、4); 1, 9 6 4 (12、6); 1, 9 5 8 (30、5); 1, 9 5 3 (16
5、9); 1, 9 4 6 (298、2); 1, 9 4 0 (398、5); 1, 9 3 4 (27
2、4); 1, 9 2 8 (139、0); 1, 9 1 5 (1、9); 1, 7 8 1 (0、9);
1, 7 7 5 (1、6); 1, 7 6 9 (2、3); 1, 7 6 2 (1、6); 1, 7 5 6 (0、
8); 1, 5 0 9 (0、3); 1, 4 3 7 (13、5); 1, 3 4 1 (0、4); 1, 3
0 7 (1、0); 1, 2 8 9 (1、9); 1, 2 6 9 (16、0); 1, 2 2 2 (2、
4); 1, 2 0 4 (4、5); 1, 1 8 6 (2、2); 0, 8 9 8 (0、7); 0, 8 8
1 (2、2); 0, 8 6 4 (1、0); 0, 7 9 3 (2、4); 0, 7 8 0 (7、3);
0, 7 7 5 (9、5); 0, 7 6 2 (10、1); 0, 7 5 7 (6、9); 0, 7 4 5
(3、2); 0, 7 2 3 (0、5); 0, 7 0 5 (0、5); 0, 6 5 0 (0、4); 0,
6 4 0 (0、5); 0, 6 3 1 (0、5); 0, 6 2 6 (0、6); 0, 6 1 0 (3、
5); 0, 6 0 0 (7、9); 0, 5 9 8 (7、8); 0, 5 9 3 (8、2); 0, 5 8
8 (7、1); 0, 5 8 3 (7、2); 0, 5 7 1 (2、4); 0, 5 2 3 (0、3);
0, 3 9 3 (0、5); 0, 3 8 5 (0、5); 0, 3 8 1 (0、5); 0, 3 7 6 (0、
5); 0, 1 4 6 (3、4); 0, 0 0 8 (28、7); 0, 0 0 0 (825、5); -
0, 0 0 9 (28、8); -0, 0 3 0 (0、5); -0, 1 5 0 (3、4)

実施例 I - T 3 - 5 5 : ^1H -NMR (6 0 1, 6MHz、CD 3 CN) :

δ = 8, 1 6 6 (3、1); 8, 1 6 5 (3、2); 8, 1 2 4 (2、4); 8, 0 0
0 (1、2); 7, 9 5 4 (1、2); 7, 7 3 2 (2、0); 7, 7 2 9 (2、3);

7, 697 (1、3); 7, 693 (1、1); 7, 683 (1、5); 7, 679 (1、3); 7, 499 (2、3); 7, 485 (2、0); 2, 180 (8、0); 2, 177 (8、1); 2, 175 (8、7); 2, 172 (9、0); 2, 169 (10、1); 2, 167 (8、6); 2, 163 (12、2); 2, 117 (8、6); 1, 973 (0、6); 1, 966 (0、7); 1, 958 (1、9); 1, 954 (2、1); 1, 950 (12、7); 1, 946 (22、2); 1, 942 (32、1); 1, 938 (21、1); 1, 934 (10、5); 1, 591 (1、0); 1, 581 (2、2); 1, 577 (2、2); 1, 568 (1、1); 1, 436 (16、0); 1, 354 (1、2); 1, 345 (2、2); 1, 341 (2、3); 1, 331 (1、0); 1, 204 (0、4); 0, 005 (1、3); 0, 000 (42、8); -0, 006 (1、2)

10

実施例 I-T3-56: ^1H -NMR (400, 0MHz、 CD_3CN):

$\delta=8, 210$ (7、6); 8, 194 (0、9); 8, 186 (15、9); 8, 185 (16、0); 8, 161 (0、7); 8, 149 (14、1); 8, 059 (7、6); 7, 686 (9、6); 7, 681 (12、3); 7, 653 (6、8); 7, 647 (5、0); 7, 632 (7、9); 7, 626 (6、5); 7, 517 (0、3); 7, 473 (11、6); 7, 452 (9、1); 6, 900 (2、7); 2, 878 (0、7); 2, 869 (2、1); 2, 859 (2、9); 2, 851 (4、6); 2, 841 (4、6); 2, 832 (2、9); 2, 823 (2、2); 2, 813 (0、7); 2, 136 (41、9); 2, 120 (0、5); 2, 113 (0、6); 2, 107 (0、8); 2, 101 (0、5); 2, 086 (0、4); 1, 964 (15、3); 1, 958 (9、2); 1, 952 (49、0); 1, 946 (88、5); 1, 940 (118、3); 1, 934 (80、8); 1, 927 (41、2); 1, 915 (0、5); 1, 774 (0、5); 1, 768 (0、7); 1, 762 (0、5); 1, 270 (0、4); 0, 792 (2、4); 0, 780 (7、2); 0, 775 (9、6); 0, 762 (10、1); 0, 757 (7、0); 0, 745 (3、3); 0, 723 (0、4); 0, 705 (0、4); 0, 650 (0、4); 0, 640 (0、4); 0, 610 (3、3); 0, 600 (8、0); 0, 599 (8、0); 0, 593 (8、4); 0, 589 (7、4); 0, 584 (7、5); 0, 571 (2、4); 0, 520 (0、4); 0, 146 (0、9); 0, 008 (7、4); 0, 000 (218、3); -0, 009 (7、6); -0, 150 (0、9)

20

30

実施例 I-T3-57: ^1H -NMR (400, 0MHz、 CD_3CN):

$\delta=8, 211$ (2、2); 8, 197 (4、2); 8, 163 (3、5); 8, 060 (2、1); 7, 735 (2、4); 7, 730 (3、0); 7, 704 (1、6); 7, 699 (1、1); 7, 683 (1、8); 7, 678 (1、5); 7, 553 (1、2); 7, 508 (2、8); 7, 487 (2、3); 2, 133 (61、2); 2, 1

40

13 (0、8); 2, 107 (0、9); 2, 101 (0、7); 2, 095 (0、4);
1, 964 (4、3); 1, 958 (11、3); 1, 952 (55、5); 1, 94
6 (99、8); 1, 940 (134、0); 1, 934 (93、4); 1, 927 (4
8、7); 1, 774 (0、6); 1, 768 (0、8); 1, 762 (0、5); 1,
596 (1、1); 1, 582 (3、0); 1, 575 (3、1); 1, 561 (1、
6); 1, 437 (16、0); 1, 361 (1、6); 1, 348 (3、0); 1, 3
41 (3、1); 1, 326 (1、2); 1, 269 (0、3); 0, 146 (1、1);
0, 008 (9、0); 0, 000 (233、2); -0, 009 (12、0); -0,
150 (1、0)

10

実施例 I-T3-58: ^1H -NMR (400, 0MHz、 CD_3CN):

δ =8, 212 (1、1); 8, 196 (2、4); 8, 168 (2、0); 8, 06
2 (1、1); 7, 732 (1、4); 7, 727 (2、0); 7, 710 (1、1);
7, 704 (0、7); 7, 689 (1、2); 7, 683 (1、0); 7, 523 (1、
8); 7, 502 (1、4); 4, 139 (0、4); 4, 123 (0、4); 4, 11
6 (1、2); 4, 099 (1、2); 4, 092 (1、3); 4, 076 (1、2);
4, 068 (0、5); 4, 052 (0、4); 2, 154 (2、8); 2, 152 (3、
0); 1, 958 (0、6); 1, 952 (3、2); 1, 946 (5、8); 1, 94
0 (7、8); 1, 934 (5、3); 1, 928 (2、7); 1, 436 (16、0);
0, 008 (0、5); 0, 000 (14、4); -0, 009 (0、5)

20

実施例 I-T3-59: ^1H -NMR (601, 6MHz、 d_6 -DMSO):

δ =19, 976 (2、1); 9, 451 (11、5); 9, 045 (16、0); 8,
978 (7、7); 8, 792 (7、9); 8, 789 (7、8); 8, 502 (16、
0); 8, 320 (2、2); 7, 918 (8、4); 7, 914 (11、9); 7, 9
04 (7、1); 7, 900 (4、5); 7, 890 (6、8); 7, 886 (5、6);
7, 573 (10、3); 7, 560 (9、7); 4, 034 (1、6); 4, 022
(1、5); 3, 338 (576、9); 2, 615 (4、0); 2, 524 (5、6);
2, 521 (7、1); 2, 518 (8、3); 2, 509 (220、0); 2, 50
6 (474、2); 2, 503 (654、0); 2, 500 (473、2); 2, 49
7 (216、3); 2, 387 (3、5); 1, 990 (4、8); 1, 615 (4、
4); 1, 606 (10、1); 1, 602 (10、7); 1, 593 (4、6); 1,
398 (2、2); 1, 300 (4、9); 1, 291 (9、5); 1, 286 (10、
1); 1, 277 (4、3); 1, 175 (3、1); 0, 096 (2、5); 0, 00
5 (23、7); 0, 000 (635、1); -0, 006 (20、4); -0, 10
0 (2、7)

30

40

実施例 I-T3-60: ^1H -NMR (400, 0MHz、 CDCl_3):

δ =8, 687 (8、6); 8, 685 (8、5); 8, 596 (15、9); 8, 5

77 (0、6); 8, 173 (8、6); 8, 168 (8、5); 8, 114 (16、0); 7, 901 (10、7); 7, 896 (11、0); 7, 567 (5、3); 7, 561 (5、3); 7, 555 (1、2); 7, 546 (7、0); 7, 540 (6、9); 7, 483 (0、4); 7, 426 (11、9); 7, 406 (8、9); 7, 264 (25、7); 6, 415 (3、4); 5, 301 (12、8); 2, 991 (0、6); 2, 982 (1、7); 2, 973 (3、0); 2, 964 (4、1); 2, 955 (4、1); 2, 946 (3、1); 2, 937 (1、8); 2, 928 (0、7); 1, 601 (5、6); 1, 378 (1、1); 1, 333 (0、6); 1, 327 (0、4); 1, 285 (1、1); 1, 255 (5、4); 0, 938 (2、5); 0, 921 (10、0); 0, 907 (9、8); 0, 903 (8、2); 0, 890 (3、5); 0, 880 (1、2); 0, 868 (0、9); 0, 862 (0、7); 0, 850 (0、9); 0, 836 (0、6); 0, 742 (0、4); 0, 733 (0、4); 0, 703 (3、0); 0, 689 (8、1); 0, 685 (8、5); 0, 680 (8、2); 0, 676 (7、9); 0, 662 (2、4); 0, 557 (0、5); 0, 551 (0、5); 0, 008 (0、6); 0, 000 (19、7); -0, 008 (1、0)

10

20

実施例 I-T3-61: ^1H -NMR (400, 0MHz、CD₃CN):

δ =8, 266 (6、2); 8, 208 (0、5); 8, 195 (8、9); 7, 692 (5、7); 7, 687 (6、8); 7, 678 (0、7); 7, 658 (3、7); 7, 652 (2、8); 7, 637 (4、3); 7, 632 (3、5); 7, 593 (5、8); 7, 572 (5、8); 7, 475 (6、2); 7, 454 (4、9); 6, 962 (1、7); 5, 449 (0、9); 4, 086 (0、3); 4, 068 (1、1); 4, 050 (1、1); 4, 032 (0、4); 2, 882 (0、4); 2, 873 (1、2); 2, 863 (1、6); 2, 855 (2、6); 2, 845 (2、6); 2, 837 (1、7); 2, 827 (1、2); 2, 817 (0、4); 2, 181 (57、5); 1, 972 (4、8); 1, 965 (1、5); 1, 959 (3、8); 1, 953 (16、3); 1, 947 (29、0); 1, 941 (37、9); 1, 935 (26、4); 1, 929 (13、7); 1, 436 (16、0); 1, 268 (0、8); 1, 221 (1、3); 1, 204 (2、5); 1, 186 (1、2); 0, 795 (1、3); 0, 783 (4、5); 0, 777 (5、6); 0, 765 (5、9); 0, 760 (4、4); 0, 747 (1、8); 0, 615 (1、8); 0, 605 (5、0); 0, 603 (5、0); 0, 598 (5、5); 0, 593 (4、9); 0, 588 (4、6); 0, 576 (1、4); 0, 000 (58、7); -0, 009 (3、0)

30

40

実施例 I-T3-62: ^1H -NMR (601, 6MHz、CD₃CN):

δ =8, 282 (5、8); 8, 209 (9、7); 7, 742 (5、2); 7, 738 (6、1); 7, 705 (3、5); 7, 702 (2、9); 7, 692 (4、0); 7, 688 (3、5); 7, 644 (0、8); 7, 594 (5、2); 7, 580 (5、

1); 7, 506 (6、4); 7, 493 (5、6); 2, 197 (13、4); 2, 194 (14、8); 2, 191 (16、6); 2, 188 (16、2); 2, 186 (16、6); 2, 184 (16、2); 2, 181 (15、5); 2, 179 (16、7); 1, 973 (1、0); 1, 967 (1、1); 1, 959 (2、7); 1, 954 (3、0); 1, 951 (18、5); 1, 947 (31、7); 1, 942 (46、4); 1, 938 (30、9); 1, 934 (15、5); 1, 594 (2、6); 1, 584 (6、6); 1, 580 (6、4); 1, 571 (3、2); 1, 544 (0、3); 1, 436 (16、0); 1, 359 (3、2); 1, 350 (6、2); 1, 345 (6、8); 1, 336 (2、7); 1, 266 (0、4); 1, 204 (0、5); 0, 005 (1、2); 0, 000 (39、8); -0, 006 (1、3)

10

実施例 I-T3-63: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):

$\delta=8, 666$ (5、1); 8, 523 (1、9); 8, 512 (2、0); 8, 389 (5、2); 7, 850 (2、9); 7, 814 (2、7); 7, 736 (1、2); 7, 730 (1、9); 7, 710 (7、1); 7, 511 (2、5); 7, 490 (2、1); 3, 327 (42、2); 2, 856 (0、5); 2, 846 (0、8); 2, 838 (1、2); 2, 828 (1、2); 2, 819 (0、8); 2, 810 (0、5); 2, 671 (0、4); 2, 506 (46、0); 2, 502 (59、6); 2, 498 (46、8); 2, 438 (0、6); 2, 329 (0、4); 2, 203 (0、6); 2, 188 (12、9); 1, 398 (16、0); 0, 727 (0、7); 0, 714 (2、3); 0, 709 (3、0); 0, 697 (2、8); 0, 691 (2、5); 0, 680 (0、9); 0, 560 (0、9); 0, 549 (3、0); 0, 543 (3、1); 0, 534 (2、7); 0, 522 (0、7); 0, 000 (42、2)

20

実施例 I-T3-64: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):

$\delta=9, 432$ (2、1); 8, 689 (2、8); 8, 404 (2、9); 7, 853 (1、5); 7, 816 (1、5); 7, 795 (0、6); 7, 789 (1、2); 7, 780 (1、7); 7, 775 (2、6); 7, 560 (1、6); 7, 552 (0、4); 7, 538 (1、4); 3, 327 (22、2); 2, 507 (17、7); 2, 502 (23、3); 2, 498 (17、9); 2, 436 (0、3); 2, 189 (6、9); 1, 989 (0、4); 1, 615 (0、7); 1, 600 (1、8); 1, 594 (1、9); 1, 581 (0、8); 1, 398 (16、0); 1, 284 (0、8); 1, 270 (1、8); 1, 264 (2、0); 1, 249 (0、7); 0, 008 (0、7); 0, 000 (19、4)

30

40

実施例 I-T3-65: ^1H -NMR (500, 1MHz、 d_6 -DMSO):

$\delta=9, 726$ (2、4); 8, 559 (1、7); 8, 556 (1、8); 8, 306 (2、2); 7, 930 (0、7); 7, 914 (1、5); 7, 897 (0、8); 7, 588 (3、9); 7, 467 (1、5); 7, 450 (1、4); 3, 305 (1

3、5); 2, 508 (2、9); 2, 504 (6、0); 2, 501 (8、2); 2, 497 (6、1); 2, 494 (3、0); 2, 106 (16、0); 1, 645 (0、8); 1, 634 (2、0); 1, 628 (2、1); 1, 617 (0、8); 1, 239 (1、1); 1, 228 (2、0); 1, 222 (2、1); 1, 211 (0、8); 0, 000 (5、4)

実施例 I-T3-66: ^1H -NMR (400, 2MHz、 d_6 -DMSO):

δ =9, 726 (4、5); 8, 587 (3、6); 8, 583 (3、6); 8, 305 (4、5); 7, 934 (1、5); 7, 913 (3、1); 7, 892 (1、7); 7, 597 (3、1); 7, 562 (3、1); 7, 468 (3、1); 7, 447 (2、9); 5, 753 (0、4); 3, 427 (0、5); 3, 307 (130、4); 3, 283 (0、9); 3, 236 (0、8); 2, 669 (0、5); 2, 504 (61、2); 2, 500 (82、9); 2, 496 (61、6); 2, 431 (1、1); 2, 412 (3、4); 2, 394 (3、5); 2, 375 (1、2); 2, 327 (0、5); 2, 322 (0、4); 2, 087 (16、0); 1, 987 (0、6); 1, 648 (1、6); 1, 634 (4、0); 1, 628 (4、2); 1, 614 (1、7); 1, 463 (0、4); 1, 240 (2、1); 1, 227 (4、0); 1, 220 (4、2); 1, 206 (1、5); 1, 174 (0、4); 1, 031 (5、0); 1, 012 (10、6); 0, 993 (4、8); 0, 146 (0、6); 0, 008 (5、8); 0, 000 (128、9); -0, 150 (0、6)

実施例 I-T3-67: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):

δ =8, 778 (1、2); 8, 767 (1、2); 8, 544 (1、7); 8, 539 (1、8); 8, 297 (2、1); 7, 876 (0、8); 7, 855 (1、5); 7, 834 (0、8); 7, 593 (3、9); 7, 418 (1、5); 7, 397 (1、4); 3, 903 (3、9); 3, 331 (120、3); 2, 855 (0、5); 2, 846 (0、7); 2, 836 (0、7); 2, 827 (0、5); 2, 818 (0、3); 2, 676 (0、5); 2, 671 (0、7); 2, 667 (0、6); 2, 524 (2、0); 2, 511 (45、1); 2, 507 (87、8); 2, 502 (113、1); 2, 498 (83、2); 2, 333 (0、5); 2, 329 (0、7); 2, 324 (0、5); 2, 120 (0、9); 2, 105 (16、0); 0, 752 (0、4); 0, 739 (1、3); 0, 734 (1、7); 0, 721 (1、7); 0, 716 (1、4); 0, 704 (0、5); 0, 522 (0、6); 0, 511 (1、6); 0, 505 (1、6); 0, 501 (1、5); 0, 496 (1、5); 0, 483 (0、5); 0, 000 (6、3)

実施例 I-T3-68: ^1H -NMR (500, 1MHz、 d_6 -DMSO):

δ =8, 752 (2、4); 8, 743 (2、4); 8, 561 (3、4); 8, 558 (3、7); 8, 289 (4、4); 7, 868 (1、5); 7, 851 (3、0);

7, 834 (1、6); 7, 597 (3、0); 7, 563 (3、0); 7, 411 (3、0); 7, 394 (2、9); 3, 304 (38、0); 2, 861 (0、6); 2, 854 (0、9); 2, 847 (1、4); 2, 839 (1、4); 2, 831 (0、9); 2, 824 (0、7); 2, 507 (6、9); 2, 504 (14、1); 2, 500 (19、4); 2, 497 (14、5); 2, 493 (7、2); 2, 426 (1、2); 2, 411 (3、5); 2, 396 (3、6); 2, 381 (1、2); 2, 101 (1、1); 2, 089 (16、0); 1, 029 (5、5); 1, 013 (11、1); 0, 998 (5、0); 0, 746 (0、9); 0, 736 (2、7); 0, 732 (3、5); 0, 722 (3、4); 0, 718 (2、8); 0, 708 (1、0); 0, 521 (1、1); 0, 512 (3、3); 0, 508 (3、3); 0, 505 (3、1); 0, 500 (3、1); 0, 490 (0、9); 0, 006 (0、7); 0, 000 (14、7); -0, 007 (0、6)

10

実施例 I-T3-69: ^1H -NMR (400, 2MHz、 d_6 -DMSO):
 δ =9, 352 (4、3); 8, 553 (4、2); 8, 286 (4、4); 7, 965 (1、0); 7, 946 (2、0); 7, 927 (1、1); 7, 601 (3、3); 7, 567 (3、5); 7, 478 (0、9); 7, 460 (2、0); 7, 444 (1、3); 7, 350 (2、0); 7, 331 (3、4); 7, 312 (1、5); 3, 342 (0、4); 3, 308 (118、1); 3, 290 (0、6); 2, 669 (0、3); 2, 504 (47、2); 2, 500 (55、9); 2, 496 (39、1); 2, 443 (1、2); 2, 425 (3、6); 2, 406 (3、6); 2, 387 (1、2); 2, 327 (0、3); 2, 097 (16、0); 1, 595 (1、7); 1, 581 (4、8); 1, 574 (4、3); 1, 561 (1、8); 1, 293 (2、0); 1, 279 (4、8); 1, 273 (4、3); 1, 258 (1、6); 1, 236 (0、8); 1, 041 (4、9); 1, 022 (10、0); 1, 003 (4、6); 0, 000 (32、0); -0, 008 (1、3)

20

30

実施例 I-T3-70: ^1H -NMR (400, 2MHz、 d_6 -DMSO):
 δ =8, 528 (3、4); 8, 524 (3、6); 8, 456 (1、7); 8, 445 (1、7); 8, 270 (4、0); 7, 896 (0、9); 7, 891 (0、9); 7, 877 (1、7); 7, 873 (1、8); 7, 858 (1、0); 7, 854 (0、9); 7, 598 (2、8); 7, 565 (2、8); 7, 403 (0、8); 7, 399 (0、8); 7, 384 (1、7); 7, 368 (1、2); 7, 364 (1、1); 7, 303 (2、5); 7, 284 (3、9); 7, 265 (1、7); 3, 309 (77、4); 2, 875 (0、6); 2, 866 (0、8); 2, 857 (1、3); 2, 847 (1、4); 2, 839 (0、8); 2, 829 (0、6); 2, 509 (11、1); 2, 505 (23、7); 2, 500 (33、3); 2, 496 (24、3); 2, 491 (11、5); 2, 442 (1、1); 2, 423 (3、4); 2, 404 (3、

40

5); 2, 386 (1、2); 2, 096 (16、0); 1, 236 (0、6); 1, 040 (5、1); 1, 021 (11、2); 1, 002 (5、0); 0, 725 (0、9); 0, 712 (2、5); 0, 707 (3、5); 0, 695 (3、3); 0, 689 (2、7); 0, 677 (1、2); 0, 557 (1、2); 0, 546 (3、4); 0, 540 (3、0); 0, 536 (2、8); 0, 530 (2、8); 0, 518 (0、9); 0, 008 (0、7); 0, 000 (21、2); -0, 009 (0、8)

実施例 I-T3-71: ^1H -NMR (400, 0MHz、CD₃CN):

δ =8, 160 (3、6); 8, 139 (3、7); 7, 764 (2、0); 7, 739 (2、0); 7, 733 (2、7); 7, 704 (1、3); 7, 699 (1、2); 7, 683 (3、4); 7, 678 (2、3); 7, 553 (1、2); 7, 502 (2、4); 7, 481 (1、9); 3, 060 (0、5); 2, 851 (0、5); 2, 520 (0、8); 2, 501 (2、5); 2, 482 (2、5); 2, 463 (0、9); 2, 134 (30、8); 2, 114 (0、4); 2, 107 (0、5); 2, 101 (0、4); 1, 964 (2、0); 1, 958 (4、9); 1, 952 (28、1); 1, 946 (52、7); 1, 940 (72、6); 1, 934 (52、6); 1, 928 (28、4); 1, 768 (0、4); 1, 762 (0、3); 1, 598 (1、0); 1, 583 (2、5); 1, 577 (2、7); 1, 563 (1、4); 1, 437 (16、0); 1, 361 (1、3); 1, 347 (2、7); 1, 340 (2、9); 1, 326 (1、1); 1, 102 (3、5); 1, 083 (7、4); 1, 064 (3、4); 0, 146 (0、4); 0, 008 (3、1); 0, 000 (97、3); -0, 150 (0、4)

実施例 I-T3-72: ^1H -NMR (400, 0MHz、CD₃CN):

δ =8, 150 (5、4); 8, 130 (5、6); 7, 764 (2、7); 7, 689 (4、2); 7, 684 (6、5); 7, 655 (1、9); 7, 650 (1、5); 7, 634 (2、2); 7, 629 (1、9); 7, 469 (3、6); 7, 448 (2、9); 6, 939 (0、9); 2, 871 (0、6); 2, 862 (0、9); 2, 853 (1、4); 2, 843 (1、4); 2, 834 (1、0); 2, 825 (0、6); 2, 518 (1、2); 2, 499 (3、7); 2, 480 (3、8); 2, 462 (1、4); 2, 168 (77、5); 2, 114 (0、3); 2, 108 (0、4); 1, 965 (1、9); 1, 959 (4、8); 1, 953 (25、8); 1, 947 (47、0); 1, 941 (63、4); 1, 935 (44、6); 1, 929 (23、7); 1, 769 (0、4); 1, 437 (16、0); 1, 100 (5、0); 1, 081 (10、2); 1, 062 (4、8); 0, 794 (0、8); 0, 781 (2、3); 0, 776 (3、1); 0, 763 (3、2); 0, 758 (2、4); 0, 746 (1、1); 0, 611 (1、0); 0, 600 (2、8); 0, 594 (2、9); 0, 590 (2、6); 0, 585 (2、6); 0, 572 (0、8); 0, 146 (0、3);

0, 008 (2、6); 0, 000 (69、9); -0, 008 (4、3); -0, 149 (0、3)

実施例 I-T3-73: ^1H -NMR (400, 1MHz、 d_6 -DMSO):

δ =8, 77 (0, 0325); 8, 76 (0, 0329); 8, 67 (0, 0447); 8, 40 (0, 0688); 8, 07 (0, 1396); 7, 89 (0, 0039); 7, 88 (0, 0202); 7, 87 (0, 0405); 7, 43 (0, 0406); 7, 42 (0, 0383); 3, 78 (0, 0029); 3, 59 (0, 0071); 3, 30 (1, 0000); 3, 17 (0, 0044); 3, 16 (0, 0042); 2, 85 (0, 0123); 2, 84 (0, 0187); 2, 83 (0, 0088); 2, 64 (0, 0025); 2, 50 (0, 4120); 2, 37 (0, 0016); 1, 24 (0, 0054); 0, 73 (0, 0482); 0, 72 (0, 0467); 0, 71 (0, 0149); 0, 52 (0, 0154); 0, 50 (0, 0420); 0, 49 (0, 0128); 0, 12 (0, 0012); 0, 00 (0, 2886); -0, 12 (0, 0012)

実施例 I-T3-74: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):

δ =9, 381 (5、5); 8, 653 (5、5); 8, 317 (0、7); 8, 293 (5、6); 7, 988 (1、2); 7, 984 (1、3); 7, 969 (2、4); 7, 965 (2、4); 7, 950 (1、4); 7, 946 (1、3); 7, 747 (4、4); 7, 734 (1、5); 7, 713 (7、2); 7, 706 (4、3); 7, 683 (0、7); 7, 493 (1、1); 7, 489 (1、2); 7, 474 (2、5); 7, 458 (1、6); 7, 454 (1、5); 7, 362 (3、0); 7, 343 (5、1); 7, 324 (2、2); 3, 903 (11、7); 3, 333 (264、8); 3, 267 (0、3); 3, 174 (0、6); 3, 162 (0、6); 2, 802 (1、7); 2, 783 (5、4); 2, 765 (5、5); 2, 746 (1、8); 2, 676 (1、4); 2, 672 (1、9); 2, 667 (1、4); 2, 542 (1、1); 2, 525 (5、6); 2, 511 (121、2); 2, 507 (238、9); 2, 503 (309、3); 2, 498 (228、5); 2, 494 (115、5); 2, 334 (1、3); 2, 329 (1、8); 2, 325 (1、4); 1, 603 (2、2); 1, 589 (5、6); 1, 582 (6、0); 1, 569 (2、6); 1, 298 (2、8); 1, 285 (5、7); 1, 278 (6、1); 1, 264 (2、3); 1, 237 (0、5); 1, 060 (7、3); 1, 042 (16、0); 1, 023 (7、2); 0, 008 (0、6); 0, 000 (17、6); -0, 008 (0、7)

実施例 I-T3-75: ^1H -NMR (400, 2MHz、 d_6 -DMSO):

δ =8, 621 (4、9); 8, 618 (5、3); 8, 463 (2、4); 8, 452 (2、4); 8, 277 (5、0); 8, 274 (5、4); 7, 913 (1、3); 7, 909 (1、4); 7, 894 (2、4); 7, 890 (2、5); 7, 875 (1、

4); 7, 871 (1、3); 7, 742 (4、3); 7, 730 (1、5); 7, 709 (7、2); 7, 702 (4、2); 7, 679 (0、7); 7, 416 (1、1); 7, 412 (1、2); 7, 397 (2、4); 7, 381 (1、7); 7, 377 (1、6); 7, 313 (3、4); 7, 294 (5、4); 7, 275 (2、3); 3, 333 (0、6); 3, 324 (0、5); 3, 307 (125、1); 3, 285 (0、5); 2, 879 (0、8); 2, 870 (1、2); 2, 861 (1、9); 2, 851 (1、9); 2, 842 (1、2); 2, 833 (0、9); 2, 822 (0、4); 2, 798 (1、7); 2, 780 (5、3); 2, 761 (5、5); 2, 742 (1、8); 2, 509 (17、8); 2, 505 (38、4); 2, 500 (54、1); 2, 496 (39、8); 2, 491 (19、1); 2, 327 (0、3); 1, 235 (0、5); 1, 061 (7、3); 1, 042 (16、0); 1, 023 (7、1); 0, 729 (1、2); 0, 716 (3、4); 0, 711 (4、8); 0, 699 (4、5); 0, 693 (3、7); 0, 682 (1、6); 0, 562 (1、6); 0, 552 (4、7); 0, 546 (4、2); 0, 542 (4、0); 0, 536 (3、9); 0, 524 (1、2); 0, 008 (1、4); 0, 000 (45、5); -0, 009 (1、9)

実施例 I - T3 - 76 : ^1H -NMR (400, 1MHz、 d_6 -DMSO) :
 δ = 9, 531 (3、2); 9, 102 (3、2); 9, 096 (3、3); 8, 822 (3、2); 8, 817 (3、3); 8, 727 (5、1); 8, 442 (1、9); 8, 436 (3、4); 8, 428 (5、4); 7, 617 (2、1); 7, 582 (2、1); 5, 759 (16、0); 3, 568 (2、8); 3, 437 (0、3); 3, 424 (0、4); 3, 326 (355、3); 3, 303 (1、2); 2, 711 (0、5); 2, 675 (0、6); 2, 670 (0、7); 2, 667 (0、5); 2, 557 (0、4); 2, 554 (0、7); 2, 552 (0、9); 2, 551 (1、1); 2, 541 (159、1); 2, 530 (1、2); 2, 528 (1、0); 2, 527 (1、0); 2, 524 (1、3); 2, 510 (33、8); 2, 506 (67、9); 2, 502 (90、5); 2, 497 (63、3); 2, 493 (29、5); 2, 458 (0、9); 2, 440 (2、5); 2, 421 (2、5); 2, 402 (0、9); 2, 368 (0、6); 2, 333 (0、6); 2, 329 (0、7); 2, 324 (0、6); 2, 111 (12、0); 2, 086 (1、1); 1, 629 (1、2); 1, 615 (2、9); 1, 608 (3、2); 1, 595 (1、5); 1, 346 (1、4); 1, 332 (2、9); 1, 325 (3、2); 1, 311 (1、1); 1, 072 (0、6); 1, 055 (1、3); 1, 048 (4、1); 1, 037 (0、9); 1, 029 (8、8); 1, 010 (3、8); 0, 008 (2、0); 0, 000 (66、6); -0, 008 (2、4); -0, 014 (0、4)

実施例 I - T3 - 77 : ^1H -NMR (400, 1MHz、 d_6 -DMSO) :

$\delta = 9, 043 (4, 2); 9, 038 (4, 3); 8, 798 (4, 2); 8, 793 (4, 4); 8, 705 (6, 6); 8, 645 (1, 9); 8, 635 (2, 0); 8, 409 (6, 8); 8, 389 (2, 6); 8, 384 (4, 6); 8, 379 (2, 6); 7, 613 (2, 8); 7, 580 (2, 9); 5, 759 (4, 7); 3, 327 (158, 6); 2, 902 (0, 6); 2, 892 (1, 0); 2, 884 (1, 5); 2, 874 (1, 5); 2, 866 (1, 0); 2, 856 (0, 7); 2, 671 (0, 4); 2, 541 (65, 9); 2, 511 (20, 9); 2, 506 (42, 9); 2, 502 (59, 0); 2, 498 (43, 4); 2, 493 (22, 4); 2, 458 (2, 1); 2, 438 (3, 5); 2, 419 (3, 4); 2, 401 (1, 3); 2, 367 (0, 3); 2, 329 (0, 4); 2, 110 (16, 0); 2, 086 (1, 2); 1, 989 (0, 4); 1, 072 (0, 4); 1, 055 (1, 0); 1, 048 (5, 3); 1, 029 (11, 6); 1, 010 (5, 3); 0, 763 (0, 9); 0, 750 (2, 3); 0, 745 (3, 4); 0, 733 (3, 3); 0, 727 (2, 8); 0, 716 (1, 4); 0, 617 (1, 2); 0, 607 (3, 5); 0, 600 (3, 1); 0, 591 (2, 8); 0, 579 (1, 0); 0, 008 (1, 3); 0, 000 (40, 7); -0, 008 (2, 2)$

10

20

实施例 I-T3-78: $^1\text{H-NMR}$ (400, 1MHz、 $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

$\delta = 9, 542 (5, 5); 9, 127 (5, 7); 9, 122 (5, 9); 8, 857 (8, 8); 8, 834 (5, 6); 8, 829 (5, 9); 8, 472 (3, 3); 8, 467 (5, 7); 8, 461 (3, 2); 8, 434 (8, 9); 7, 757 (4, 0); 7, 724 (7, 7); 7, 699 (0, 6); 5, 759 (5, 9); 4, 020 (0, 4); 3, 611 (0, 6); 3, 568 (1, 5); 3, 426 (0, 9); 3, 326 (364, 4); 3, 303 (1, 4); 3, 235 (1, 3); 2, 821 (1, 6); 2, 802 (5, 1); 2, 783 (5, 1); 2, 765 (1, 7); 2, 711 (0, 6); 2, 670 (0, 9); 2, 666 (0, 7); 2, 541 (164, 7); 2, 510 (48, 8); 2, 506 (100, 5); 2, 502 (137, 3); 2, 497 (98, 8); 2, 493 (47, 9); 2, 367 (0, 6); 2, 329 (0, 8); 1, 989 (1, 5); 1, 633 (2, 1); 1, 619 (5, 2); 1, 612 (5, 6); 1, 599 (2, 4); 1, 350 (2, 6); 1, 337 (5, 3); 1, 330 (5, 5); 1, 316 (2, 0); 1, 234 (0, 4); 1, 192 (0, 4); 1, 174 (0, 8); 1, 156 (0, 5); 1, 146 (0, 5); 1, 069 (7, 2); 1, 050 (16, 0); 1, 032 (7, 1); 0, 146 (0, 4); 0, 008 (2, 9); 0, 000 (90, 5); -0, 008 (3, 5)$

30

40

实施例 I-T3-79: $^1\text{H-NMR}$ (500, 1MHz、 $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

$\delta = 9, 064 (5, 0); 9, 059 (5, 1); 8, 821 (8, 9); 8, 81$

1 (5、2); 8, 807 (5、3); 8, 630 (2、5); 8, 622 (2、5);
 8, 413 (3、8); 8, 408 (13、3); 7, 748 (4、3); 7, 738
 (1、8); 7, 721 (6、6); 7, 712 (3、8); 7, 695 (0、9); 5,
 752 (1、0); 3, 305 (76、3); 3, 281 (0、4); 2, 910 (0、
 4); 2, 902 (0、9); 2, 895 (1、3); 2, 888 (2、0); 2, 88
 0 (2、0); 2, 873 (1、3); 2, 865 (1、0); 2, 858 (0、4);
 2, 813 (1、7); 2, 798 (5、5); 2, 783 (5、6); 2, 768 (1、
 9); 2, 508 (13、7); 2, 504 (28、5); 2, 501 (39、3); 2,
 497 (29、3); 2, 494 (14、5); 1, 908 (2、7); 1, 236 (0、
 5); 1, 068 (7、4); 1, 053 (16、0); 1, 038 (7、3); 0, 7
 61 (1、2); 0, 751 (3、5); 0, 747 (4、8); 0, 737 (4、6);
 0, 733 (3、8); 0, 723 (1、6); 0, 620 (1、6); 0, 612 (4、
 7); 0, 607 (4、4); 0, 604 (4、2); 0, 599 (4、0); 0, 58
 9 (1、2); 0, 006 (1、3); 0, 000 (30、6); -0, 007 (1、
 4)

10

20

実施例 I-T3-80: ^1H -NMR (400, 0MHz、 CD_3CN):

$\delta=8, 128$ (2、6); 8, 082 (2、8); 7, 736 (1、6); 7, 73
 1 (2、1); 7, 701 (1、1); 7, 696 (0、8); 7, 680 (1、2);
 7, 675 (1、1); 7, 608 (0、4); 7, 562 (1、4); 7, 549 (1、
 4); 7, 494 (1、9); 7, 473 (1、5); 2, 448 (0、6); 2, 42
 9 (1、9); 2, 410 (2、0); 2, 391 (0、7); 2, 164 (9、8);
 2, 155 (20、2); 2, 088 (7、6); 1, 965 (1、0); 1, 959
 (2、5); 1, 953 (13、9); 1, 946 (25、4); 1, 940 (34、
 2); 1, 934 (24、1); 1, 928 (12、6); 1, 598 (0、8); 1,
 583 (2、0); 1, 577 (2、0); 1, 563 (1、1); 1, 437 (16、
 0); 1, 358 (1、0); 1, 345 (2、0); 1, 338 (2、1); 1, 32
 3 (0、8); 1, 268 (0、7); 1, 092 (2、7); 1, 073 (5、7);
 1, 054 (2、6); 0, 008 (1、1); 0, 000 (34、6); -0, 00
 9 (1、5)

30

実施例 I-T3-81: ^1H -NMR (400, 0MHz、 CD_3CN):

$\delta=8, 115$ (7、2); 8, 067 (7、4); 7, 688 (4、4); 7, 68
 3 (5、6); 7, 667 (0、5); 7, 652 (3、0); 7, 646 (2、4);
 7, 631 (3、5); 7, 625 (3、0); 7, 560 (4、1); 7, 546 (4、
 1); 7, 462 (5、2); 7, 441 (4、2); 6, 903 (1、2); 2, 88
 0 (0、3); 2, 871 (0、9); 2, 861 (1、3); 2, 853 (2、1);
 2, 843 (2、1); 2, 835 (1、3); 2, 825 (1、0); 2, 815 (0、

40

4); 2, 447 (1、8); 2, 428 (5、5); 2, 409 (5、7); 2, 390 (1、9); 2, 141 (55、3); 2, 120 (1、0); 2, 113 (0、9); 2, 107 (1、0); 2, 101 (0、9); 2, 086 (21、5); 1, 964 (4、2); 1, 958 (10、5); 1, 952 (54、5); 1, 946 (98、5); 1, 940 (132、1); 1, 934 (92、1); 1, 927 (48、4); 1, 774 (0、5); 1, 768 (0、8); 1, 762 (0、5); 1, 437 (1、3); 1, 270 (1、0); 1, 090 (7、7); 1, 071 (16、0); 1, 052 (7、4); 0, 794 (1、1); 0, 781 (3、3); 0, 776 (4、4); 0, 763 (4、7); 0, 758 (3、4); 0, 746 (1、6); 0, 610 (1、5); 0, 598 (3、8); 0, 592 (4、0); 0, 588 (3、6); 0, 583 (3、6); 0, 571 (1、1); 0, 146 (1、8); 0, 031 (0、4); 0, 030 (0、4); 0, 0272 (0、4); 0, 0265 (0、4); 0, 026 (0、4); 0, 022 (0、6); 0, 008 (16、0); 0, 000 (381、4); -0, 009 (18、6); -0, 150 (1、8)

10

実施例 I-T3-82: ^1H -NMR (400, 0MHz、CD₃CN):

δ =8, 127 (7、5); 8, 085 (7、7); 7, 734 (4、3); 7, 729 (5、7); 7, 708 (3、2); 7, 703 (2、2); 7, 688 (3、6); 7, 682 (2、9); 7, 561 (3、9); 7, 548 (3、8); 7, 512 (5、3); 7, 491 (4、4); 7, 365 (0、9); 4, 141 (1、1); 4, 124 (1、2); 4, 117 (3、5); 4, 100 (3、5); 4, 093 (3、7); 4, 077 (3、5); 4, 070 (1、3); 4, 053 (1、2); 2, 462 (0、4); 2, 457 (0、4); 2, 450 (1、8); 2, 431 (5、5); 2, 412 (5、7); 2, 393 (1、9); 2, 150 (76、9); 2, 120 (0、5); 2, 113 (0、7); 2, 107 (0、8); 2, 101 (0、8); 2, 090 (21、3); 1, 964 (3、5); 1, 958 (8、4); 1, 952 (45、7); 1, 946 (82、9); 1, 940 (111、8); 1, 934 (77、5); 1, 927 (40、4); 1, 774 (0、4); 1, 768 (0、6); 1, 762 (0、4); 1, 437 (1、0); 1, 269 (1、0); 1, 093 (7、7); 1, 074 (16、0); 1, 055 (7、4); 0, 146 (1、4); 0, 008 (11、1); 0, 000 (291、0); -0, 009 (12、7); -0, 150 (1、4)

20

30

実施例 I-T3-83: ^1H -NMR (400, 0MHz、CD₃CN):

δ =8, 128 (7、9); 8, 079 (8、4); 7, 719 (4、9); 7, 713 (6、1); 7, 677 (3、1); 7, 671 (2、5); 7, 656 (3、5); 7, 650 (3、1); 7, 562 (4、8); 7, 548 (4、7); 7, 484 (5、6); 7, 463 (5、1); 7, 436 (1、2); 5, 447 (1、2); 5, 337 (1、3); 5, 316 (2、5); 5, 295 (2、5); 5, 274 (1、3);

40

4, 068 (0、4); 4, 050 (0、4); 3, 543 (3、2); 3, 540 (2、1); 3, 520 (6、4); 3, 498 (4、2); 3, 370 (4、2); 3, 367 (2、8); 3, 350 (6、2); 3, 346 (5、9); 3, 326 (3、3); 2, 462 (0、3); 2, 451 (2、0); 2, 432 (6、0); 2, 413 (6、2); 2, 394 (2、1); 2, 150 (115、6); 2, 120 (0、5); 2, 114 (0、7); 2, 107 (0、9); 2, 091 (23、5); 1, 972 (1、9); 1, 964 (3、0); 1, 958 (7、9); 1, 952 (39、4); 1, 946 (71、5); 1, 940 (96、0); 1, 934 (68、4); 1, 928 (36、7); 1, 774 (0、4); 1, 768 (0、6); 1, 762 (0、4); 1, 437 (2、7); 1, 268 (1、0); 1, 221 (0、4); 1, 204 (0、8); 1, 186 (0、4); 1, 094 (7、8); 1, 075 (16、0); 1, 056 (7、5); 0, 146 (1、1); 0, 008 (9、8); 0, 000 (220、9); -0, 150 (1、1)

10

実施例 I-T3-84: ^1H -NMR (400, 0MHz、CD₃CN):

δ =8, 162 (9、4); 8, 125 (7、5); 7, 997 (4、3); 7, 952 (4、4); 7, 729 (4、8); 7, 724 (6、8); 7, 707 (3、5); 7, 701 (2、3); 7, 686 (3、9); 7, 680 (3、2); 7, 519 (6、1); 7, 498 (4、9); 7, 348 (1、3); 4, 140 (1、3); 4, 123 (1、4); 4, 116 (3、9); 4, 100 (3、9); 4, 092 (4、2); 4, 076 (3、9); 4, 069 (1、7); 4, 052 (1、4); 2, 146 (92、5); 2, 120 (27、2); 2, 108 (1、6); 2, 101 (0、9); 2, 095 (0、5); 1, 971 (0、9); 1, 964 (3、5); 1, 958 (9、1); 1, 952 (47、9); 1, 946 (87、4); 1, 940 (118、0); 1, 934 (83、5); 1, 928 (44、7); 1, 774 (0、5); 1, 768 (0、7); 1, 762 (0、5); 1, 437 (16、0); 1, 270 (0、6); 0, 146 (0、9); 0, 008 (6、8); 0, 000 (179、6); -0, 008 (10、9); -0, 150 (0、9)

20

30

実施例 I-T3-85: ^1H -NMR (400, 0MHz、CD₃CN):

δ =8, 163 (5、2); 8, 118 (4、2); 7, 998 (2、5); 7, 953 (2、5); 7, 716 (3、0); 7, 710 (3、7); 7, 675 (1、9); 7, 669 (1、5); 7, 654 (2、2); 7, 648 (1、9); 7, 490 (3、5); 7, 469 (2、8); 7, 418 (0、8); 7, 400 (0、8); 5, 335 (0、8); 5, 314 (1、6); 5, 293 (1、6); 5, 272 (0、8); 3, 542 (2、0); 3, 538 (1、3); 3, 518 (4、0); 3, 496 (2、6); 3, 370 (2、6); 3, 367 (1、7); 3, 349 (3、8); 3, 346 (3、6); 3, 326 (2、0); 2, 133 (15、0); 2, 120 (15、

40

4); 2, 101 (0、5); 1, 971 (1、1); 1, 964 (1、7); 1, 958 (4、3); 1, 952 (19、7); 1, 946 (35、3); 1, 940 (47、2); 1, 934 (33、6); 1, 927 (18、1); 1, 437 (16、0); 1, 204 (0、4); 0, 146 (0、4); 0, 008 (3、9); 0, 000 (78、7); -0, 150 (0、4)

実施例 I-T3-86: ^1H -NMR (400, 0MHz、CD₃CN):

δ =8, 252 (0、3); 8, 146 (2、7); 8, 110 (0、4); 8, 102 (2、9); 7, 899 (1、3); 7, 708 (1、4); 7, 690 (1、7); 7, 685 (2、2); 7, 655 (1、2); 7, 649 (0、9); 7, 634 (1、5); 7, 628 (1、4); 7, 468 (2、2); 7, 447 (1、8); 6, 891 (0、5); 2, 871 (0、4); 2, 862 (0、5); 2, 853 (0、8); 2, 843 (0、8); 2, 835 (0、5); 2, 825 (0、4); 2, 415 (1、0); 2, 171 (8、3); 2, 132 (10、6); 1, 971 (0、5); 1, 964 (1、1); 1, 958 (2、6); 1, 952 (13、9); 1, 946 (25、2); 1, 940 (34、0); 1, 933 (23、7); 1, 927 (12、5); 1, 437 (16、0); 1, 269 (0、4); 0, 794 (0、4); 0, 781 (1、3); 0, 776 (1、7); 0, 764 (1、8); 0, 758 (1、3); 0, 746 (0、6); 0, 611 (0、6); 0, 599 (1、5); 0, 593 (1、6); 0, 589 (1、4); 0, 584 (1、4); 0, 571 (0、5); 0, 008 (2、3); 0, 000 (63、9); -0, 009 (3、1)

実施例 I-T3-87: ^1H -NMR (400, 0MHz、CD₃CN):

δ =8, 171 (11、0); 8, 170 (11、0); 8, 122 (12、2); 8, 120 (11、4); 7, 729 (6、8); 7, 724 (8、7); 7, 697 (4、9); 7, 691 (3、7); 7, 676 (5、6); 7, 670 (4、6); 7, 606 (16、0); 7, 604 (15、8); 7, 551 (3、2); 7, 500 (8、3); 7, 479 (6、7); 5, 446 (0、7); 4, 085 (0、6); 4, 068 (2、0); 4, 050 (2、0); 4, 032 (0、7); 3, 240 (0、6); 2, 132 (42、8); 2, 119 (0、5); 2, 113 (0、7); 2, 107 (0、9); 2, 101 (0、6); 2, 095 (0、3); 1, 971 (9、0); 1, 964 (4、0); 1, 958 (10、1); 1, 952 (56、8); 1, 946 (103、2); 1, 940 (138、6); 1, 933 (95、2); 1, 927 (49、0); 1, 914 (0、7); 1, 780 (0、3); 1, 774 (0、6); 1, 768 (0、8); 1, 762 (0、6); 1, 595 (3、6); 1, 581 (8、5); 1, 574 (8、5); 1, 560 (4、6); 1, 520 (0、5); 1, 437 (11、1); 1, 400 (0、6); 1, 360 (4、7); 1, 346 (8、6); 1, 340 (8、8); 1, 325 (3、6); 1, 317 (0、8); 1, 287 (0、

4); 1, 269 (1、4); 1, 221 (2、5); 1, 204 (4、7); 1, 186 (2、3); 0, 146 (1、8); 0, 008 (14、1); 0, 000 (400、9); -0, 009 (15、1); -0, 150 (1、8)

実施例 I-T3-88: ^1H -NMR (400, 0MHz、 CD_3CN):

δ =8, 160 (10、6); 8, 111 (11、3); 7, 681 (6、2); 7, 675 (7、9); 7, 647 (3、9); 7, 642 (3、1); 7, 627 (4、5); 7, 621 (4、0); 7, 605 (16、0); 7, 467 (7、2); 7, 447 (5、7); 6, 936 (2、0); 5, 448 (0、4); 4, 067 (0、5); 4, 049 (0、5); 2, 879 (0、4); 2, 869 (1、3); 2, 860 (2、0); 2, 851 (2、8); 2, 842 (2、9); 2, 833 (2、0); 2, 824 (1、4); 2, 814 (0、5); 2, 467 (1、2); 2, 462 (1、7); 2, 458 (1、3); 2, 253 (0、6); 2, 226 (0、4); 2, 158 (239、6); 2, 120 (1、0); 2, 113 (1、3); 2, 107 (1、6); 2, 101 (1、2); 2, 095 (0、7); 1, 971 (3、4); 1, 964 (8、0); 1, 958 (20、3); 1, 952 (98、7); 1, 946 (178、8); 1, 940 (240、6); 1, 934 (170、9); 1, 928 (91、2); 1, 781 (0、5); 1, 774 (1、0); 1, 768 (1、3); 1, 762 (1、0); 1, 756 (0、5); 1, 437 (3、0); 1, 269 (0、9); 1, 221 (0、5); 1, 203 (1、0); 1, 185 (0、5); 0, 792 (1、7); 0, 779 (4、8); 0, 774 (6、6); 0, 761 (6、5); 0, 756 (5、1); 0, 744 (2、2); 0, 610 (2、2); 0, 599 (6、0); 0, 592 (6、3); 0, 583 (5、4); 0, 571 (1、6); 0, 146 (3、3); 0, 007 (29、1); 0, 000 (640、2); -0, 150 (3、3)

実施例 I-T3-89: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):

δ =9, 437 (11、1); 8, 788 (15、9); 8, 367 (16、0); 8, 317 (0、8); 7, 986 (0、4); 7, 903 (6、6); 7, 897 (6、7); 7, 824 (9、1); 7, 810 (13、0); 7, 805 (11、4); 7, 802 (13、2); 7, 797 (8、0); 7, 791 (3、7); 7, 614 (3、7); 7, 610 (3、5); 7, 591 (2、9); 7, 588 (2、9); 7, 560 (9、0); 7, 551 (1、7); 7, 546 (1、5); 7, 537 (7、7); 3, 903 (8、5); 3, 332 (418、5); 3, 174 (0、7); 3, 162 (0、6); 2, 676 (2、0); 2, 671 (2、7); 2, 667 (2、1); 2, 541 (1、6); 2, 507 (359、7); 2, 502 (464、1); 2, 498 (346、7); 2, 333 (2、1); 2, 329 (2、9); 2, 325 (2、2); 1, 618 (3、7); 1, 604 (9、3); 1, 597 (9、9); 1, 584 (4、2); 1, 543 (0、4); 1, 327 (0、4); 1, 287 (4、3);

1, 274 (9、4); 1, 267 (9、9); 1, 253 (3、8); 1, 234 (1、5); 1, 215 (0、5); 1, 181 (0、4); 1, 177 (0、4); 0, 861 (0、4); 0, 853 (0、4); 0, 843 (0、4); 0, 834 (0、4); 0, 824 (0、4); 0, 813 (0、3); 0, 008 (0、9); 0, 000 (24、6); -0, 008 (1、1)

実施例 I-T3-90: ^1H -NMR (400, 0MHz、 CD_3CN):

δ =8, 565 (0、4); 8, 349 (0、6); 8, 333 (14、0); 8, 123 (0、6); 8, 109 (13、1); 8, 096 (0、6); 7, 904 (0、4); 7, 881 (0、4); 7, 712 (8、7); 7, 689 (16、0); 7, 683 (10、7); 7, 672 (1、0); 7, 654 (5、5); 7, 648 (4、2); 7, 633 (6、1); 7, 627 (5、3); 7, 617 (5、0); 7, 611 (5、5); 7, 475 (0、5); 7, 467 (9、7); 7, 454 (0、7); 7, 446 (9、4); 7, 438 (3、3); 7, 422 (2、4); 7, 419 (2、6); 7, 416 (2、5); 6, 891 (2、1); 5, 446 (0、4); 3, 899 (0、6); 2, 881 (0、6); 2, 872 (1、7); 2, 862 (2、4); 2, 854 (3、8); 2, 844 (3、9); 2, 835 (2、5); 2, 826 (1、8); 2, 816 (0、6); 2, 132 (62、2); 2, 113 (1、1); 2, 107 (1、3); 2, 101 (0、9); 2, 095 (0、5); 1, 996 (0、3); 1, 971 (0、9); 1, 964 (5、7); 1, 958 (14、2); 1, 952 (81、0); 1, 946 (147、9); 1, 940 (200、1); 1, 933 (139、4); 1, 927 (72、6); 1, 780 (0、5); 1, 774 (0、8); 1, 768 (1、1); 1, 762 (0、8); 1, 756 (0、4); 1, 268 (2、3); 0, 881 (0、3); 0, 796 (2、0); 0, 783 (5、8); 0, 778 (7、9); 0, 765 (8、2); 0, 760 (6、0); 0, 748 (2、8); 0, 726 (0、4); 0, 709 (0、4); 0, 653 (0、3); 0, 643 (0、3); 0, 613 (2、8); 0, 601 (6、7); 0, 595 (7、1); 0, 591 (6、3); 0, 586 (6、3); 0, 574 (2、0); 0, 146 (2、4); 0, 008 (17、6); 0, 000 (508、1); -0, 009 (24、9); -0, 150 (2、4)

実施例 I-T3-91: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):

δ =8, 837 (3、4); 8, 831 (3、6); 8, 747 (6、3); 8, 532 (1、9); 8, 521 (2、0); 8, 474 (6、2); 8, 100 (9、7); 7, 954 (3、3); 7, 949 (3、5); 4, 109 (0、4); 4, 095 (0、4); 3, 904 (16、0); 3, 335 (287、0); 3, 267 (0、5); 3, 243 (0、4); 3, 174 (2、4); 3, 162 (2、5); 2, 877 (0、6); 2, 868 (0、9); 2, 859 (1、3); 2, 849 (1、3); 2, 84

10

20

30

40

0 (0、9); 2, 831 (0、6); 2, 676 (1、0); 2, 671 (1、3);
 2, 667 (1、0); 2, 507 (156、9); 2, 502 (206、2); 2,
 498 (158、4); 2, 334 (0、9); 2, 329 (1、2); 2, 325 (0、
 9); 1, 258 (0、4); 1, 002 (1、3); 0, 986 (1、2); 0, 74
 0 (0、8); 0, 727 (2、3); 0, 722 (3、1); 0, 710 (2、9);
 0, 704 (2、4); 0, 693 (1、0); 0, 568 (1、0); 0, 558 (3、
 1); 0, 552 (2、9); 0, 548 (2、7); 0, 542 (2、5); 0, 53
 0 (0、7); 0, 000 (1、8)

10

実施例 I-T3-92: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):
 δ =9, 415 (4、9); 8, 892 (4、2); 8, 886 (4、4); 8, 76
 5 (7、6); 8, 488 (7、3); 8, 104 (11、7); 8, 044 (4、2);
 8, 039 (4、3); 3, 904 (16、0); 3, 593 (0、4); 3, 336
 (427、9); 3, 173 (1、6); 3, 163 (1、6); 2, 676 (1、4);
 2, 672 (1、7); 2, 667 (1、3); 2, 518 (32、9); 2, 511
 (114、6); 2, 507 (211、5); 2, 503 (266、6); 2, 498
 (196、7); 2, 334 (1、1); 2, 329 (1、5); 2, 325 (1、1);
 1, 613 (1、8); 1, 599 (4、5); 1, 592 (4、8); 1, 579 (2、
 0); 1, 315 (2、1); 1, 301 (4、6); 1, 295 (4、7); 1, 28
 0 (1、7); 1, 235 (0、3); 0, 000 (2、1)

20

実施例 I-T3-93: ^1H -NMR (400, 0MHz、 CD_3CN):
 δ =8, 187 (3、1); 8, 146 (3、3); 7, 899 (4、8); 7, 65
 3 (1、3); 7, 648 (2、7); 7, 639 (0、5); 7, 624 (1、5);
 7, 618 (1、0); 7, 462 (1、9); 7, 441 (1、5); 7, 115 (0、
 7); 5, 449 (1、2); 4, 068 (0、5); 4, 050 (0、5); 2, 17
 4 (33、4); 1, 972 (2、4); 1, 965 (0、8); 1, 959 (1、9);
 1, 953 (10、3); 1, 947 (18、6); 1, 941 (24、9); 1, 9
 34 (16、9); 1, 928 (8、7); 1, 448 (9、5); 1, 437 (16、
 0); 1, 270 (0、5); 1, 221 (0、6); 1, 204 (1、2); 1, 18
 6 (0、6); 0, 837 (0、7); 0, 824 (2、1); 0, 820 (2、2);
 0, 808 (0、9); 0, 673 (1、1); 0, 661 (2、4); 0, 656 (2、
 5); 0, 644 (0、8); 0, 008 (0、4); 0, 000 (10、3); -0,
 009 (0、3)

30

実施例 I-T3-94: ^1H -NMR (400, 0MHz、 CD_3CN):
 δ =8, 149 (5、3); 8, 106 (4、3); 7, 996 (2、3); 7, 95
 1 (2、4); 7, 645 (2、3); 7, 639 (5、5); 7, 632 (0、8);
 7, 618 (2、7); 7, 612 (1、8); 7, 457 (3、0); 7, 436 (2、

40

4); 7, 098 (1、2); 2, 468 (0、4); 2, 464 (0、5); 2, 459 (0、4); 2, 165 (184、2); 2, 116 (15、3); 2, 102 (0、5); 1, 972 (1、1); 1, 965 (3、0); 1, 959 (7、6); 1, 953 (41、5); 1, 947 (74、8); 1, 940 (100、0); 1, 934 (68、4); 1, 928 (35、0); 1, 775 (0、4); 1, 769 (0、6); 1, 763 (0、4); 1, 447 (16、0); 1, 437 (3、0); 1, 270 (2、2); 1, 204 (0、3); 0, 835 (1、1); 0, 822 (3、7); 0, 818 (3、8); 0, 807 (1、5); 0, 673 (1、8); 0, 662 (4、3); 0, 656 (4、3); 0, 644 (1、3); 0, 008 (1、2); 0, 000 (38、1); -0, 009 (1、4)

10

実施例 I-T3-95: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):
 δ =9, 596 (2、3); 8, 893 (2、0); 8, 887 (2、0); 8, 791 (3、3); 8, 545 (3、3); 8, 315 (0、5); 8, 300 (2、2); 8, 294 (2、3); 8, 283 (5、7); 4, 038 (0、4); 4, 020 (0、4); 3, 322 (38、3); 2, 671 (0、6); 2, 502 (83、6); 2, 328 (0、6); 1, 989 (1、8); 1, 643 (0、8); 1, 628 (2、2); 1, 621 (2、3); 1, 609 (0、9); 1, 398 (16、0); 1, 298 (1、0); 1, 285 (2、2); 1, 278 (2、3); 1, 264 (0、8); 1, 193 (0、5); 1, 175 (0、9); 1, 157 (0、5); 0, 146 (0、4); 0, 000 (75、9); -0, 150 (0、4)

20

実施例 I-T3-96: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):
 δ =8, 838 (2、0); 8, 833 (2、0); 8, 618 (3、2); 8, 513 (1、0); 8, 502 (1、0); 8, 377 (3、3); 7, 954 (1、9); 7, 949 (1、9); 7, 596 (3、6); 4, 104 (0、3); 3, 903 (10、1); 3, 409 (0、5); 3, 350 (346、6); 3, 302 (0、5); 3, 175 (1、8); 3, 162 (1、8); 2, 865 (0、4); 2, 857 (0、7); 2, 847 (0、7); 2, 838 (0、4); 2, 677 (0、4); 2, 672 (0、6); 2, 668 (0、4); 2, 526 (1、8); 2, 512 (37、4); 2, 508 (74、7); 2, 503 (97、3); 2, 499 (71、2); 2, 494 (35、6); 2, 489 (12、6); 2, 335 (0、4); 2, 330 (0、6); 2, 325 (0、5); 2, 117 (16、0); 1, 003 (0、6); 0, 987 (0、6); 0, 739 (0、5); 0, 726 (1、2); 0, 721 (1、7); 0, 709 (1、6); 0, 703 (1、3); 0, 692 (0、6); 0, 568 (0、6); 0, 557 (1、7); 0, 551 (1、5); 0, 547 (1、4); 0, 542 (1、4); 0, 529 (0、4); 0, 000 (0、7)

30

40

実施例 I-T3-97: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):

$\delta=9, 395 (2, 2); 8, 892 (2, 0); 8, 886 (2, 0); 8, 640 (3, 3); 8, 391 (3, 4); 8, 040 (1, 9); 8, 035 (1, 9); 7, 599 (3, 7); 4, 108 (0, 5); 4, 095 (0, 5); 3, 904 (1, 0, 2); 3, 333 (130, 8); 3, 174 (2, 4); 3, 161 (2, 4); 2, 676 (0, 4); 2, 671 (0, 6); 2, 667 (0, 5); 2, 541 (0, 4); 2, 525 (1, 8); 2, 511 (39, 6); 2, 507 (81, 0); 2, 502 (95, 3); 2, 498 (69, 0); 2, 493 (34, 2); 2, 334 (0, 4); 2, 329 (0, 6); 2, 324 (0, 4); 2, 118 (16, 0); 1, 613 (0, 8); 1, 599 (1, 9); 1, 592 (2, 1); 1, 579 (0, 9); 1, 311 (0, 9); 1, 297 (2, 0); 1, 291 (2, 1); 1, 276 (0, 8); 1, 002 (0, 5); 0, 987 (0, 5); 0, 000 (1, 2)$

10

実施例 I-T3-98: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):

$\delta=8, 839 (6, 0); 8, 833 (6, 2); 8, 791 (0, 5); 8, 781 (9, 8); 8, 692 (3, 1); 8, 681 (3, 2); 8, 549 (0, 5); 8, 540 (9, 8); 8, 282 (16, 0); 8, 217 (6, 2); 8, 210 (6, 1); 5, 756 (1, 1); 3, 326 (37, 2); 2, 871 (0, 8); 2, 861 (1, 2); 2, 852 (1, 8); 2, 842 (1, 9); 2, 833 (1, 2); 2, 824 (0, 9); 2, 814 (0, 3); 2, 671 (0, 4); 2, 525 (0, 9); 2, 511 (20, 9); 2, 507 (43, 3); 2, 502 (58, 6); 2, 498 (44, 1); 2, 494 (22, 5); 2, 329 (0, 4); 1, 989 (0, 4); 1, 397 (0, 4); 0, 757 (1, 2); 0, 744 (3, 4); 0, 739 (4, 7); 0, 726 (4, 5); 0, 721 (3, 8); 0, 709 (1, 5); 0, 568 (1, 5); 0, 557 (4, 5); 0, 551 (4, 2); 0, 548 (4, 1); 0, 542 (3, 9); 0, 530 (1, 2); 0, 146 (0, 5); 0, 008 (3, 4); 0, 000 (97, 0); -0, 008 (4, 2); -0, 150 (0, 5)$

20

30

実施例 I-T3-99: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):

$\delta=8, 851 (0, 6); 8, 845 (0, 8); 8, 840 (3, 5); 8, 834 (3, 6); 8, 770 (6, 0); 8, 525 (5, 8); 8, 337 (3, 6); 8, 331 (3, 5); 8, 283 (11, 0); 8, 226 (0, 6); 8, 220 (0, 6); 3, 328 (25, 7); 3, 030 (16, 0); 2, 798 (0, 7); 2, 790 (0, 8); 2, 781 (1, 3); 2, 771 (0, 9); 2, 758 (2, 9); 2, 543 (55, 4); 2, 525 (0, 6); 2, 508 (28, 1); 2, 503 (37, 2); 2, 499 (27, 6); 0, 814 (0, 3); 0, 773 (0, 4); 0, 604 (0, 5); 0, 585 (2, 1); 0, 576 (2, 8); 0, 566 (1, 0); 0, 543 (1, 2); 0, 532 (2, 2); 0, 514 (2, 0);$

40

0, 501 (0、4); 0, 495 (0、4); 0, 008 (1、0); 0, 000 (2、8、2); -0, 008 (1、0)

実施例 I-T3-100: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):

δ =8, 826 (5、3); 8, 817 (2、9); 8, 811 (2、8); 8, 531 (4、2); 8, 320 (2、7); 8, 314 (2、7); 8, 206 (0、4); 8, 200 (0、4); 8, 111 (7、7); 3, 904 (16、0); 3, 395 (0、6); 3, 337 (288、8); 3, 257 (0、4); 3, 243 (0、4); 3, 175 (0、9); 3, 162 (1、0); 3, 029 (12、3); 2, 795 (0、5); 2, 788 (0、6); 2, 778 (1、0); 2, 768 (0、8); 2, 757 (2、2); 2, 676 (0、8); 2, 672 (1、1); 2, 668 (0、8); 2, 512 (73、1); 2, 507 (138、1); 2, 503 (175、3); 2, 499 (129、8); 2, 334 (0、7); 2, 330 (1、0); 2, 325 (0、7); 1, 002 (1、0); 0, 987 (1、0); 0, 833 (0、4); 0, 815 (0、3); 0, 603 (0、4); 0, 584 (1、7); 0, 574 (2、2); 0, 565 (0、8); 0, 542 (0、9); 0, 531 (1、7); 0, 513 (1、5); 0, 000 (1、8)

実施例 I-T3-101: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):

δ =8, 828 (0、4); 8, 823 (0、4); 8, 815 (2、1); 8, 809 (2、2); 8, 690 (3、8); 8, 442 (0、7); 8, 435 (3、3); 8, 293 (2、2); 8, 287 (2、1); 8, 190 (0、4); 8, 184 (0、3); 7, 603 (4、3); 3, 904 (8、8); 3, 339 (233、4); 3, 175 (0、6); 3, 162 (0、6); 3, 027 (9、9); 2, 795 (0、4); 2, 787 (0、5); 2, 778 (0、8); 2, 768 (0、6); 2, 756 (1、8); 2, 676 (0、6); 2, 672 (0、8); 2, 667 (0、6); 2, 512 (51、7); 2, 507 (99、0); 2, 503 (126、8); 2, 498 (93、4); 2, 494 (47、1); 2, 334 (0、6); 2, 330 (0、8); 2, 325 (0、6); 2, 130 (16、0); 2, 122 (3、6); 1, 002 (0、4); 0, 987 (0、4); 0, 583 (1、3); 0, 574 (1、7); 0, 565 (0、6); 0, 543 (0、7); 0, 531 (1、3); 0, 514 (1、1); 0, 000 (0、9)

実施例 I-T3-102: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):

δ =8, 908 (0、7); 8, 879 (2、4); 8, 874 (2、4); 8, 833 (4、2); 8, 820 (1、2); 8, 538 (3、8); 8, 496 (1、0); 8, 431 (0、7); 8, 427 (0、7); 8, 288 (2、4); 8, 283 (2、4); 8, 111 (9、5); 3, 904 (16、0); 3, 591 (0、4); 3, 341 (514、4); 3, 175 (1、0); 3, 162 (1、0); 3, 136 (2、

9); 2, 914 (11、4); 2, 676 (1、1); 2, 672 (1、5); 2, 668 (1、1); 2, 507 (189、0); 2, 503 (242、9); 2, 499 (186、3); 2, 334 (1、1); 2, 330 (1、5); 2, 326 (1、1); 1, 713 (2、7); 1, 489 (2、0); 0, 000 (2、0)

実施例 I-T3-103: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):
 δ =8, 907 (0、4); 8, 878 (1、3); 8, 872 (1、3); 8, 702 (2、2); 8, 685 (0、6); 8, 443 (2、1); 8, 406 (0、9); 8, 270 (1、3); 8, 264 (1、3); 7, 604 (4、3); 3, 904 (12、6); 3, 395 (0、4); 3, 338 (210、6); 3, 270 (0、4); 3, 256 (0、3); 3, 175 (0、8); 3, 162 (0、9); 3, 133 (1、6); 2, 915 (6、3); 2, 676 (0、6); 2, 672 (0、8); 2, 668 (0、6); 2, 525 (2、1); 2, 507 (102、9); 2, 503 (131、5); 2, 498 (97、6); 2, 334 (0、7); 2, 330 (0、9); 2, 325 (0、6); 2, 122 (16、0); 1, 718 (1、3); 1, 713 (1、4); 1, 484 (1、0); 1, 002 (0、8); 0, 987 (0、8); 0, 000 (1、9)

実施例 I-T3-104: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):
 δ =8, 865 (9、2); 8, 857 (0、5); 8, 845 (6、3); 8, 839 (6、4); 8, 694 (3、1); 8, 683 (3、1); 8, 470 (0、5); 8, 459 (9、4); 8, 229 (6、5); 8, 223 (6、4); 7, 751 (4、6); 7, 728 (0、3); 7, 710 (11、3); 4, 457 (0、4); 4, 403 (0、4); 4, 392 (0、4); 4, 121 (0、3); 4, 108 (1、0); 4, 095 (1、0); 4, 082 (0、4); 3, 904 (15、4); 3, 395 (0、4); 3, 334 (355、6); 3, 243 (0、4); 3, 175 (4、8); 3, 161 (4、8); 2, 883 (0、3); 2, 873 (0、9); 2, 864 (1、2); 2, 855 (1、9); 2, 845 (1、9); 2, 836 (1、2); 2, 827 (0、9); 2, 816 (0、5); 2, 807 (1、7); 2, 788 (5、3); 2, 769 (5、4); 2, 751 (1、8); 2, 680 (0、6); 2, 676 (1、1); 2, 671 (1、4); 2, 667 (1、1); 2, 542 (1、0); 2, 525 (4、5); 2, 511 (90、6); 2, 507 (178、4); 2, 502 (231、0); 2, 498 (168、2); 2, 494 (82、9); 2, 334 (1、0); 2, 329 (1、4); 2, 325 (1、0); 1, 056 (7、2); 1, 038 (16、0); 1, 019 (7、1); 1, 002 (1、6); 0, 987 (1、5); 0, 759 (1、2); 0, 746 (3、5); 0, 741 (4、8); 0, 729 (4、5); 0, 723 (3、7); 0, 711 (1、5); 0, 568 (1、5); 0, 557 (4、5); 0, 551 (4、3); 0, 547 (4、0); 0, 542 (3、9);

0, 529 (1、2); 0, 000 (3、5)	
実施例 I-T3-105: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO): $\delta=9, 606$ (5、9); $8, 899$ (6、1); $8, 893$ (6、2); $8, 882$ (8、7); $8, 466$ (9、0); $8, 308$ (6、0); $8, 302$ (5、8); $7, 753$ (4、6); $7, 730$ (0、3); $7, 712$ (11、2); $3, 904$ (12、3); $3, 332$ (328、2); $3, 175$ (1、4); $3, 161$ (1、4); $3, 047$ (0、5); $2, 866$ (0、5); $2, 807$ (1、7); $2, 789$ (5、3); $2, 770$ (5、4); $2, 751$ (1、8); $2, 676$ (1、1); $2, 671$ (1、5); $2, 667$ (1、1); $2, 524$ (4、8); $2, 511$ (97、8); $2, 507$ (190、1); $2, 502$ (244、3); $2, 498$ (178、1); $2, 493$ (87、7); $2, 333$ (1、1); $2, 329$ (1、5); $2, 324$ (1、1); $1, 650$ (2、1); $1, 636$ (5、3); $1, 629$ (5、6); $1, 616$ (2、3); $1, 295$ (2、5); $1, 281$ (5、3); $1, 275$ (5、7); $1, 260$ (2、1); $1, 055$ (7、3); $1, 037$ (16、0); $1, 018$ (7、1); $0, 000$ (3、2)	10
実施例 I-T3-106: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO): $\delta=8, 824$ (4、0); $8, 818$ (4、1); $8, 781$ (4、7); $8, 694$ (1、9); $8, 683$ (1、9); $8, 515$ (6、0); $8, 223$ (2、4); $8, 196$ (4、1); $8, 190$ (4、0); $7, 937$ (2、5); $4, 456$ (0、3); $4, 402$ (0、4); $4, 391$ (0、4); $4, 107$ (0、7); $4, 094$ (0、8); $3, 904$ (16、0); $3, 332$ (223、1); $3, 243$ (0、4); $3, 174$ (4、3); $3, 161$ (4、4); $2, 868$ (0、5); $2, 859$ (0、8); $2, 850$ (1、2); $2, 840$ (1、2); $2, 831$ (0、8); $2, 822$ (0、6); $2, 676$ (0、9); $2, 671$ (1、2); $2, 667$ (0、9); $2, 541$ (0、7); $2, 525$ (3、7); $2, 511$ (78、4); $2, 507$ (154、9); $2, 502$ (201、4); $2, 498$ (148、3); $2, 493$ (74、4); $2, 334$ (0、9); $2, 329$ (1、2); $2, 325$ (0、9); $2, 147$ (13、7); $1, 002$ (1、6); $0, 987$ (1、6); $0, 755$ (0、8); $0, 742$ (2、2); $0, 737$ (3、1); $0, 725$ (2、9); $0, 719$ (2、4); $0, 708$ (1、0); $0, 563$ (1、0); $0, 552$ (2、9); $0, 546$ (2、7); $0, 542$ (2、6); $0, 536$ (2、5); $0, 524$ (0、8); $0, 000$ (2、7)	20 30
実施例 I-T3-107: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO): $\delta=8, 833$ (0、5); $8, 826$ (0、6); $8, 819$ (2、8); $8, 813$ (2、8); $8, 770$ (3、5); $8, 503$ (0、9); $8, 495$ (4、3); $8, 312$ (2、8); $8, 306$ (2、6); $8, 223$ (2、0); $8, 207$ (0、	40

5); 8, 201 (0、4); 7, 939 (2、1); 3, 904 (16、0); 3, 332 (177、8); 3, 175 (1、5); 3, 162 (1、6); 3, 027 (12、7); 2, 794 (0、5); 2, 787 (0、6); 2, 778 (1、0); 2, 767 (0、8); 2, 760 (2、8); 2, 751 (0、4); 2, 676 (0、8); 2, 672 (1、0); 2, 667 (0、7); 2, 525 (3、3); 2, 511 (67、3); 2, 507 (128、5); 2, 503 (163、4); 2, 498 (118、9); 2, 494 (59、0); 2, 334 (0、7); 2, 329 (1、0); 2, 325 (0、7); 2, 158 (9、9); 1, 002 (1、1); 0, 987 (1、1); 0, 830 (0、3); 0, 813 (0、3); 0, 606 (0、4); 0, 586 (1、6); 0, 577 (2、2); 0, 568 (0、8); 0, 545 (1、0); 0, 534 (1、7); 0, 516 (1、5); 0, 000 (2、1)

10

実施例 I-T3-108: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):
 $\delta=9, 604$ (5、0); 8, 878 (4、1); 8, 872 (4、2); 8, 793 (5、7); 8, 519 (7、0); 8, 277 (4、3); 8, 271 (4、2); 8, 225 (3、2); 7, 938 (3、2); 4, 458 (0、3); 4, 404 (0、4); 4, 393 (0、4); 4, 123 (0、4); 4, 110 (1、1); 4, 097 (1、1); 4, 083 (0、4); 3, 904 (16、0); 3, 433 (0、4); 3, 337 (510、1); 3, 270 (0、6); 3, 256 (0、4); 3, 242 (0、4); 3, 175 (4、2); 3, 162 (4、3); 3, 043 (0、4); 2, 872 (0、4); 2, 672 (1、4); 2, 506 (184、9); 2, 503 (232、7); 2, 499 (181、4); 2, 329 (1、4); 2, 148 (15、6); 1, 643 (1、6); 1, 629 (4、1); 1, 622 (4、4); 1, 609 (1、8); 1, 293 (1、8); 1, 280 (4、1); 1, 273 (4、3); 1, 259 (1、6); 1, 002 (1、2); 0, 987 (1、2); 0, 000 (0、9)

20

30

実施例 I-T3-109: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):
 $\delta=8, 821$ (4、5); 8, 815 (4、5); 8, 727 (6、7); 8, 683 (2、3); 8, 672 (2、3); 8, 456 (6、9); 8, 191 (4、6); 8, 185 (4、4); 7, 611 (3、0); 7, 577 (3、0); 4, 112 (0、4); 4, 099 (0、5); 3, 904 (16、0); 3, 433 (0、3); 3, 422 (0、4); 3, 341 (478、8); 3, 283 (0、5); 3, 272 (0、4); 3, 269 (0、4); 3, 257 (0、4); 3, 243 (0、3); 3, 175 (2、2); 3, 162 (2、3); 2, 868 (0、6); 2, 858 (0、9); 2, 850 (1、4); 2, 840 (1、4); 2, 831 (0、9); 2, 821 (0、7); 2, 676 (0、9); 2, 672 (1、2); 2, 667 (0、9); 2, 542 (0、7); 2, 525 (3、9); 2, 511 (83、9); 2, 507 (159、

40

5); 2, 503 (202、9); 2, 498 (149、6); 2, 443 (1、3);
 2, 424 (3、5); 2, 405 (3、5); 2, 387 (1、2); 2, 334 (0、
 9); 2, 330 (1、2); 2, 325 (0、9); 2, 096 (16、0); 1, 1
 69 (1、4); 1, 035 (5、1); 1, 016 (10、9); 1, 002 (2、
 2); 0, 997 (5、0); 0, 987 (1、4); 0, 755 (0、9); 0, 74
 2 (2、7); 0, 737 (3、5); 0, 725 (3、4); 0, 719 (2、8);
 0, 708 (1、1); 0, 563 (1、1); 0, 553 (3、4); 0, 547 (3、
 3); 0, 543 (3、1); 0, 537 (3、0); 0, 525 (0、9); 0, 00
 0 (2、0)

10

実施例 I-T3-110: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):
 $\delta=9, 594$ (4、6); $8, 875$ (3、8); $8, 869$ (3、9); $8, 74$
 2 (6、3); $8, 462$ (6、5); $8, 272$ (3、9); $8, 266$ (3、9);
 $7, 613$ (3、3); $7, 578$ (3、3); $4, 108$ (0、5); $4, 095$ (0、
 5); $3, 904$ (12、4); $3, 405$ (0、3); $3, 334$ (307、0); $3,$
 269 (0、5); $3, 256$ (0、4); $3, 242$ (0、4); $3, 175$ (2、
 2); $3, 161$ (2、3); $3, 043$ (0、4); $2, 871$ (0、4); $2, 67$
 1 (1、3); $2, 502$ (210、6); $2, 445$ (1、6); $2, 426$ (3、
 6); $2, 407$ (3、7); $2, 388$ (1、4); $2, 329$ (1、3); $2, 09$
 7 (16、0); $1, 645$ (1、5); $1, 630$ (4、1); $1, 624$ (4、4);
 $1, 610$ (1、8); $1, 291$ (1、8); $1, 277$ (4、2); $1, 271$ (4、
 6); $1, 256$ (1、7); $1, 235$ (0、5); $1, 169$ (1、0); $1, 03$
 6 (4、8); $1, 018$ (10、0); $0, 999$ (5、0); $0, 987$ (1、2);
 $0, 000$ (2、4)

20

30

実施例 I-T3-111: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):
 $\delta=8, 917$ (0、5); $8, 913$ (0、5); $8, 882$ (1、9); $8, 87$
 6 (1、9); $8, 782$ (2、6); $8, 753$ (0、7); $8, 503$ (3、1);
 $8, 461$ (0、8); $8, 419$ (0、5); $8, 414$ (0、5); $8, 284$ (1、
 9); $8, 279$ (1、8); $8, 223$ (2、2); $7, 938$ (2、3); $3, 90$
 4 (16、0); $3, 334$ (271、2); $3, 175$ (0、9); $3, 162$ (1、
 0); $3, 131$ (2、1); $2, 919$ (9、2); $2, 676$ (0、8); $2, 67$
 2 (1、0); $2, 667$ (0、8); $2, 525$ (3、1); $2, 511$ (66、1);
 $2, 507$ (129、1); $2, 503$ (166、9); $2, 498$ (121、9);
 $2, 494$ (60、4); $2, 334$ (0、8); $2, 329$ (1、0); $2, 325$
 (0、8); $2, 149$ (11、9); $1, 718$ (1、7); $1, 712$ (1、9);
 $1, 487$ (1、3); $0, 000$ (2、6)

40

実施例 I-T3-112: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):

$\delta = 8, 843 (5, 5); 8, 825 (4, 0); 8, 819 (4, 0); 8, 701 (2, 1); 8, 690 (2, 0); 8, 561 (6, 3); 8, 513 (3, 0); 8, 198 (3, 9); 8, 192 (3, 8); 8, 094 (2, 9); 4, 109 (0, 4); 4, 096 (0, 5); 3, 904 (16, 0); 3, 333 (218, 4); 3, 267 (0, 4); 3, 174 (2, 5); 3, 162 (2, 6); 2, 870 (0, 6); 2, 860 (0, 9); 2, 851 (1, 3); 2, 841 (1, 3); 2, 833 (0, 9); 2, 823 (0, 6); 2, 676 (0, 9); 2, 671 (1, 2); 2, 667 (0, 9); 2, 524 (3, 8); 2, 507 (149, 9); 2, 502 (194, 0); 2, 498 (144, 0); 2, 333 (0, 9); 2, 329 (1, 2); 2, 325 (0, 9); 1, 002 (1, 2); 0, 987 (1, 2); 0, 756 (0, 8); 0, 743 (2, 5); 0, 738 (3, 3); 0, 726 (3, 1); 0, 720 (2, 6); 0, 709 (1, 0); 0, 564 (1, 0); 0, 553 (3, 2); 0, 547 (3, 1); 0, 544 (2, 9); 0, 538 (2, 8); 0, 526 (0, 8); 0, 000 (2, 3)$

10

实施例 I-T3-113: $^1\text{H-NMR}$ (400, 0MHz, d_6 -DMSO):
 $\delta = 8, 831 (3, 5); 8, 818 (2, 5); 8, 812 (2, 5); 8, 547 (0, 8); 8, 540 (3, 7); 8, 512 (1, 9); 8, 325 (2, 4); 8, 319 (2, 4); 8, 213 (0, 4); 8, 207 (0, 4); 8, 096 (1, 8); 3, 904 (16, 0); 3, 381 (0, 4); 3, 332 (195, 5); 3, 175 (1, 3); 3, 161 (1, 4); 3, 028 (11, 1); 2, 794 (0, 5); 2, 787 (0, 5); 2, 777 (0, 9); 2, 767 (0, 7); 2, 760 (2, 4); 2, 676 (0, 7); 2, 672 (0, 9); 2, 667 (0, 7); 2, 525 (2, 8); 2, 511 (58, 6); 2, 507 (114, 3); 2, 502 (147, 1); 2, 498 (107, 3); 2, 494 (52, 8); 2, 334 (0, 6); 2, 329 (0, 9); 2, 325 (0, 6); 1, 002 (1, 0); 0, 987 (0, 9); 0, 585 (1, 4); 0, 577 (1, 9); 0, 568 (0, 7); 0, 545 (0, 8); 0, 534 (1, 4); 0, 516 (1, 3); 0, 000 (2, 0)$

20

30

实施例 I-T3-114: $^1\text{H-NMR}$ (400, 0MHz, d_6 -DMSO):
 $\delta = 9, 607 (2, 4); 8, 880 (2, 4); 8, 874 (2, 4); 8, 854 (3, 1); 8, 566 (3, 7); 8, 515 (1, 6); 8, 282 (2, 4); 8, 276 (2, 4); 8, 095 (1, 6); 4, 108 (0, 4); 4, 095 (0, 4); 3, 904 (16, 0); 3, 334 (175, 5); 3, 175 (2, 1); 3, 161 (2, 1); 3, 044 (0, 5); 2, 872 (0, 5); 2, 676 (0, 6); 2, 672 (0, 8); 2, 667 (0, 6); 2, 541 (0, 5); 2, 525 (2, 4); 2, 511 (50, 8); 2, 507 (99, 8); 2, 502 (12$

40

9、1); 2, 498 (94、9); 2, 494 (47、4); 2, 334 (0、6);
2, 329 (0、7); 2, 325 (0、6); 1, 643 (0、8); 1, 629 (2、
0); 1, 622 (2、2); 1, 608 (0、9); 1, 298 (1、0); 1, 28
4 (2、0); 1, 278 (2、2); 1, 263 (0、8); 1, 002 (0、9);
0, 987 (0、8); 0, 000 (1、0)

実施例 I-T3-115: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):
 δ =8, 898 (1、1); 8, 630 (1、1); 8, 376 (0、7); 7, 97
2 (0、4); 7, 595 (4、0); 3, 903 (4、3); 3, 328 (177、
7); 2, 876 (1、2); 2, 675 (0、9); 2, 671 (1、2); 2, 66
7 (0、9); 2, 541 (0、9); 2, 506 (159、0); 2, 502 (20
5、8); 2, 498 (157、5); 2, 385 (2、8); 2, 333 (1、0);
2, 329 (1、3); 2, 324 (1、0); 2, 122 (16、0); 1, 686
(0、6); 1, 487 (0、8); 0, 000 (1、2)

実施例 I-T3-116: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):
 δ =8, 911 (1、0); 8, 880 (3、4); 8, 874 (3、4); 8, 84
2 (5、1); 8, 810 (1、3); 8, 548 (5、6); 8, 512 (4、5);
8, 423 (0、9); 8, 292 (3、4); 8, 286 (3、4); 8, 093 (4、
3); 3, 904 (4、9); 3, 327 (229、2); 3, 133 (3、9); 2,
918 (16、0); 2, 675 (1、2); 2, 671 (1、6); 2, 667 (1、
3); 2, 541 (1、5); 2, 506 (202、4); 2, 502 (261、5);
2, 498 (200、6); 2, 333 (1、1); 2, 329 (1、5); 2, 32
5 (1、2); 1, 711 (3、8); 1, 488 (2、6); -0, 001 (1、3)

実施例 I-T3-117: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):
 δ =8, 837 (3、9); 8, 832 (3、9); 8, 696 (5、5); 8, 52
8 (2、3); 8, 517 (2、3); 8, 440 (6、7); 8, 213 (3、3);
7, 955 (3、9); 7, 949 (3、9); 7, 929 (3、4); 3, 904 (3、
8); 3, 328 (223、0); 2, 875 (0、7); 2, 865 (1、0); 2,
857 (1、5); 2, 847 (1、5); 2, 838 (1、1); 2, 828 (0、
7); 2, 671 (1、5); 2, 502 (230、7); 2, 329 (1、4); 2,
145 (16、0); 0, 738 (0、9); 0, 720 (3、6); 0, 708 (3、
4); 0, 702 (3、0); 0, 691 (1、1); 0, 566 (1、2); 0, 55
5 (3、7); 0, 549 (3、6); 0, 540 (3、2); 0, 527 (0、9);
0, 000 (1、2)

実施例 I-T3-118: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):
 δ =8, 825 (3、2); 8, 820 (3、1); 8, 700 (5、9); 8, 43
8 (7、3); 8, 213 (3、4); 8, 037 (3、0); 8, 031 (3、0);

10

20

30

40

7, 930 (3、5); 7, 908 (0、5); 3, 904 (11、1); 3, 330 (239、1); 3, 022 (14、7); 2, 779 (0、4); 2, 764 (0、9); 2, 753 (1、3); 2, 743 (1、0); 2, 737 (1、0); 2, 723 (2、0); 2, 676 (1、0); 2, 671 (1、3); 2, 667 (1、0); 2, 542 (1、0); 2, 524 (4、1); 2, 511 (78、7); 2, 507 (153、6); 2, 502 (199、9); 2, 498 (148、4); 2, 392 (13、3); 2, 364 (1、8); 2, 333 (0、9); 2, 329 (1、2); 2, 325 (0、9); 2, 154 (16、0); 0, 817 (0、5); 0, 802 (0、5); 0, 755 (0、6); 0, 484 (4、8); 0, 466 (2、5); 0, 000 (1、4)

10

实施例 I-T3-119: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):
 $\delta=9, 408$ (4、7); $8, 892$ (3、9); $8, 886$ (3、9); $8, 716$ (5、6); $8, 452$ (7、3); $8, 217$ (2、9); $8, 041$ (3、8); $8, 035$ (3、8); $7, 932$ (3、0); $3, 904$ (9、3); $3, 330$ (168、1); $3, 175$ (1、1); $3, 162$ (1、1); $2, 676$ (0、7); $2, 671$ (1、0); $2, 667$ (0、8); $2, 541$ (0、9); $2, 511$ (82、5); $2, 507$ (129、7); $2, 502$ (165、2); $2, 498$ (122、9); $2, 333$ (0、7); $2, 329$ (1、0); $2, 325$ (0、7); $2, 147$ (16、0); $1, 612$ (1、5); $1, 598$ (4、0); $1, 591$ (4、3); $1, 578$ (1、8); $1, 312$ (1、8); $1, 299$ (4、1); $1, 292$ (4、2); $1, 278$ (1、5); $0, 000$ (1、1)

20

实施例 I-T3-120: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):
 $\delta=8, 826$ (1、6); $8, 821$ (1、6); $8, 621$ (4、1); $8, 375$ (3、7); $8, 025$ (1、5); $8, 020$ (1、6); $7, 593$ (4、8); $3, 903$ (7、6); $3, 331$ (235、6); $3, 022$ (7、6); $2, 756$ (0、7); $2, 743$ (0、5); $2, 720$ (1、0); $2, 671$ (1、1); $2, 541$ (0、9); $2, 507$ (130、2); $2, 502$ (168、8); $2, 498$ (127、0); $2, 386$ (6、8); $2, 359$ (0、9); $2, 329$ (1、0); $2, 129$ (16、0); $0, 482$ (2、7); $0, 465$ (1、4); $0, 000$ (1、0)

30

实施例 I-T3-121: ^1H -NMR (400, 0MHz、 CD_3CN):
 $\delta=8, 836$ (16、0); $8, 460$ (13、4); $8, 441$ (12、5); $7, 871$ (1、5); $7, 554$ (14、8); $2, 909$ (0、5); $2, 899$ (1、4); $2, 890$ (2、1); $2, 881$ (3、1); $2, 871$ (3、2); $2, 862$ (2、1); $2, 853$ (1、6); $2, 843$ (0、5); $2, 469$ (0、5); $2, 464$ (0、6); $2, 460$ (0、5); $2, 287$ (0、5); $2, 263$ (0、

40

4); 2, 245 (0、8); 2, 226 (0、6); 2, 164 (134、4); 2, 128 (74、2); 2, 108 (1、2); 2, 102 (0、8); 2, 096 (0、5); 1, 976 (0、8); 1, 965 (34、9); 1, 959 (10、4); 1, 953 (53、7); 1, 947 (97、8); 1, 941 (132、8); 1, 935 (92、8); 1, 928 (48、6); 1, 829 (0、7); 1, 781 (0、4); 1, 775 (0、6); 1, 769 (0、8); 1, 763 (0、5); 1, 540 (0、4); 1, 470 (0、3); 1, 429 (0、3); 1, 320 (1、0); 1, 269 (9、8); 1, 135 (0、4); 0, 897 (0、4); 0, 881 (1、1); 0, 864 (0、5); 0, 834 (1、8); 0, 821 (4、8); 0, 816 (6、9); 0, 803 (6、8); 0, 798 (5、3); 0, 786 (2、4); 0, 764 (0、4); 0, 746 (0、4); 0, 721 (0、4); 0, 710 (0、4); 0, 681 (2、4); 0, 669 (6、3); 0, 663 (6、5); 0, 659 (5、7); 0, 653 (5、3); 0, 641 (1、6); 0, 000 (1、3)

10

実施例 I-T3-122: ^1H -NMR (400, 0MHz、 CD_3CN):

δ =8, 795 (7、1); 8, 792 (7、1); 8, 712 (16、0); 8, 398 (7、3); 8, 393 (7、2); 8, 249 (14、8); 8, 230 (0、4); 8, 035 (5、4); 8, 031 (10、0); 8, 027 (5、8); 7, 832 (3、6); 7, 830 (4、9); 7, 826 (3、7); 7, 821 (2、0); 7, 814 (5、0); 7, 810 (5、4); 7, 716 (5、3); 7, 700 (3、9); 7, 697 (5、2); 7, 585 (0、4); 7, 519 (5、8); 7, 500 (9、9); 7, 480 (4、3); 7, 146 (1、9); 4, 086 (0、4); 4, 068 (1、3); 4, 050 (1、3); 4, 033 (0、5); 2, 907 (0、6); 2, 897 (1、9); 2, 888 (2、8); 2, 879 (4、2); 2, 869 (4、1); 2, 861 (2、8); 2, 851 (2、0); 2, 842 (0、7); 2, 468 (0、7); 2, 463 (0、9); 2, 459 (0、7); 2, 266 (0、3); 2, 250 (0、4); 2, 144 (668、5); 2, 120 (3、2); 2, 114 (4、0); 2, 108 (5、1); 2, 101 (3、3); 2, 095 (1、7); 2, 016 (0、5); 2, 014 (0、5); 1, 972 (7、8); 1, 964 (22、3); 1, 958 (55、1); 1, 952 (312、9); 1, 946 (568、6); 1, 940 (766、2); 1, 934 (526、3); 1, 928 (270、3); 1, 787 (0、4); 1, 781 (1、7); 1, 775 (3、2); 1, 769 (4、4); 1, 762 (3、0); 1, 756 (1、5); 1, 437 (5、8); 1, 356 (0、3); 1, 338 (0、6); 1, 319 (0、4); 1, 285 (0、5); 1, 270 (2、2); 1, 222 (1、6); 1, 204 (3、0); 1, 186 (1、6); 1, 089 (0、9); 0, 881 (0、4); 0, 793 (2、2); 0, 781 (6、2); 0, 775 (8、7); 0, 763 (8、9); 0, 75

20

30

40

7 (6、5); 0, 746 (3、2); 0, 724 (0、5); 0, 707 (0、5);
0, 687 (0、5); 0, 677 (0、4); 0, 647 (3、3); 0, 637 (8、
3); 0, 630 (8、0); 0, 626 (7、0); 0, 620 (6、8); 0, 60
8 (2、2); 0, 008 (1、7); 0, 000 (60、4); -0, 009 (2、
1)

実施例 I-T3-123: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):
 δ =8, 894 (2、1); 8, 708 (1、4); 8, 439 (1、2); 8, 21
3 (2、9); 7, 984 (0、8); 7, 930 (3、0); 3, 904 (15、2);
3, 331 (445、1); 3, 174 (0、5); 3, 161 (0、5); 3, 12
1 (0、5); 2, 877 (2、5); 2, 675 (1、3); 2, 671 (1、8);
2, 667 (1、4); 2, 542 (1、7); 2, 506 (224、4); 2, 50
2 (292、1); 2, 498 (219、8); 2, 389 (5、1); 2, 333 (1、
3); 2, 329 (1、8); 2, 325 (1、4); 2, 148 (16、0); 1, 6
87 (1、2); 1, 492 (1、5); 1, 416 (0、6); 1, 249 (0、4);
1, 235 (0、4); 0, 000 (1、8)

実施例 I-T3-124: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):
 δ =8, 836 (5、2); 8, 831 (5、2); 8, 756 (7、5); 8, 54
4 (2、8); 8, 534 (2、9); 8, 502 (4、3); 8, 488 (8、8);
8, 087 (4、0); 7, 952 (5、0); 7, 946 (5、0); 4, 467 (0、
8); 4, 454 (2、0); 4, 440 (0、8); 4, 113 (0、5); 4, 10
0 (0、5); 3, 904 (16、0); 3, 507 (0、4); 3, 482 (0、5);
3, 468 (0、5); 3, 456 (0、5); 3, 395 (5、7); 3, 388 (4、
9); 3, 381 (6、3); 3, 340 (838、4); 3, 174 (2、4); 3,
161 (2、3); 2, 886 (0、3); 2, 876 (0、9); 2, 867 (1、
2); 2, 858 (1、9); 2, 848 (1、9); 2, 840 (1、3); 2, 83
0 (0、9); 2, 820 (0、4); 2, 676 (1、6); 2, 672 (2、1);
2, 667 (1、7); 2, 507 (264、8); 2, 503 (344、8); 2,
498 (274、4); 2, 334 (1、5); 2, 329 (2、0); 2, 325 (1、
5); 1, 273 (0、4); 1, 258 (0、8); 1, 242 (0、8); 0, 87
3 (0、4); 0, 739 (1、2); 0, 726 (3、4); 0, 721 (4、6);
0, 709 (4、3); 0, 703 (3、7); 0, 692 (1、5); 0, 567 (1、
5); 0, 556 (4、6); 0, 550 (4、3); 0, 546 (4、1); 0, 54
0 (3、8); 0, 528 (1、1); 0, 008 (2、2); 0, 000 (60、2);
-0, 008 (2、5)

実施例 I-T3-125: ^1H -NMR (400, 1MHz、 d_6 -DMSO):
 δ =9, 41 (0, 0144); 8, 89 (0, 0123); 8, 83 (0, 0014);

8, 77 (0, 0184); 8, 49 (0, 0301); 8, 23 (0, 0012);
 8, 09 (0, 0103); 8, 03 (0, 0119); 3, 31 (1, 0000);
 2, 54 (0, 6709); 2, 50 (0, 2387); 1, 59 (0, 0138);
 1, 30 (0, 0136); 0, 15 (0, 0007); 0, 00 (0, 1822);
 -0, 16 (0, 0004)

実施例 I-T3-126: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):
 $\delta=9, 406$ (0、9); 8, 069 (2、0); 7, 667 (0、4); 7, 64
 6 (1、1); 7, 621 (0、6); 7, 616 (0、6); 7, 538 (0、8);
 7, 533 (0、7); 6, 479 (0、9); 3, 322 (20、1); 2, 524
 (0、4); 2, 519 (0、7); 2, 511 (11、8); 2, 506 (24、6);
 2, 502 (33、4); 2, 497 (24、8); 2, 493 (12、4); 1, 9
 89 (0、8); 1, 608 (0、4); 1, 594 (0、8); 1, 587 (0、9);
 1, 574 (0、4); 1, 398 (16、0); 1, 291 (0、4); 1, 278
 (0、7); 1, 271 (0、8); 1, 257 (0、3); 1, 175 (0、5); 0,
 008 (0、6); 0, 000 (18、6); -0, 009 (0、7)

実施例 I-T3-127: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):
 $\delta=8, 850$ (5、1); 8, 845 (5、4); 8, 692 (9、2); 8, 53
 0 (3、1); 8, 520 (3、2); 8, 464 (9、2); 8, 273 (16、0);
 7, 973 (5、1); 7, 967 (5、3); 4, 105 (0、5); 4, 091 (0、
 5); 3, 903 (5、0); 3, 329 (87、9); 3, 175 (1、9); 3, 1
 62 (1、8); 2, 877 (0、8); 2, 868 (1、2); 2, 859 (1、9);
 2, 849 (1、9); 2, 840 (1、3); 2, 831 (0、9); 2, 820 (0、
 3); 2, 672 (0、6); 2, 667 (0、5); 2, 507 (79、2); 2, 5
 02 (111、9); 2, 463 (0、7); 2, 334 (0、5); 2, 329 (0、
 6); 0, 740 (1、1); 0, 727 (3、5); 0, 722 (4、8); 0, 71
 0 (4、4); 0, 704 (4、0); 0, 693 (1、5); 0, 571 (1、5);
 0, 561 (4、6); 0, 555 (4、7); 0, 551 (4、6); 0, 545 (4、
 2); 0, 533 (1、1); 0, 000 (0、4)

実施例 I-T3-128: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):
 $\delta=8, 840$ (3、6); 8, 835 (3、5); 8, 698 (8、9); 8, 46
 5 (8、7); 8, 272 (15、4); 8, 058 (3、3); 8, 053 (3、4);
 7, 922 (0、5); 3, 903 (5、1); 3, 328 (66、8); 3, 175
 (1、0); 3, 162 (1、0); 3, 026 (16、0); 2, 891 (0、3);
 2, 784 (0、4); 2, 767 (0、9); 2, 756 (1、4); 2, 746 (1、
 0); 2, 721 (1、9); 2, 676 (0、5); 2, 672 (0、6); 2, 66
 7 (0、5); 2, 542 (0、7); 2, 511 (37、1); 2, 507 (71、

3); 2, 503 (93、3); 2, 498 (71、7); 2, 395 (14、5); 2, 369 (1、9); 2, 334 (0、4); 2, 329 (0、6); 2, 325 (0、4); 0, 819 (0、5); 0, 803 (0、5); 0, 758 (0、6); 0, 481 (5、4); 0, 463 (2、8); 0, 000 (0、4)

実施例 I-T3-129: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):
 δ =9, 412 (6、2); 8, 906 (4、7); 8, 900 (5、0); 8, 710 (9、0); 8, 478 (8、5); 8, 276 (16、0); 8, 063 (4、7); 8, 058 (4、9); 3, 903 (5、3); 3, 434 (0、4); 3, 334 (71、6); 3, 169 (3、4); 2, 672 (0、8); 2, 520 (27、6); 2, 507 (94、6); 2, 503 (122、2); 2, 499 (100、6); 2, 329 (0、7); 1, 612 (1、9); 1, 598 (5、2); 1, 591 (5、7); 1, 578 (2、3); 1, 317 (2、3); 1, 304 (5、3); 1, 297 (5、6); 1, 283 (1、9); 0, 000 (0、4)

実施例 I-T3-130: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):
 δ =8, 821 (3、6); 8, 815 (3、5); 8, 760 (6、9); 8, 499 (4、1); 8, 484 (8、5); 8, 085 (3、9); 8, 046 (3、3); 8, 040 (3、3); 7, 911 (0、5); 3, 904 (10、2); 3, 327 (87、7); 3, 176 (0、7); 3, 163 (0、7); 3, 025 (16、0); 2, 779 (0、4); 2, 768 (0、8); 2, 762 (0、9); 2, 753 (1、5); 2, 742 (1、1); 2, 736 (1、1); 2, 724 (2、2); 2, 676 (0、5); 2, 672 (0、7); 2, 667 (0、5); 2, 525 (2、4); 2, 512 (41、2); 2, 507 (81、2); 2, 503 (106、8); 2, 498 (80、2); 2, 494 (41、1); 2, 398 (14、3); 2, 369 (1、8); 2, 334 (0、5); 2, 330 (0、7); 2, 325 (0、5); 0, 820 (0、5); 0, 803 (0、5); 0, 757 (0、6); 0, 485 (4、9); 0, 467 (2、7); 0, 000 (0、5)

実施例 I-T3-131: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):
 δ =8, 891 (3、3); 8, 768 (2、3); 8, 499 (5、4); 8, 485 (2、0); 8, 085 (4、9); 7, 990 (1、3); 3, 903 (16、0); 3, 327 (119、4); 3, 175 (0、8); 3, 162 (0、9); 3, 122 (0、7); 2, 879 (3、8); 2, 676 (0、7); 2, 672 (1、0); 2, 667 (0、8); 2, 542 (0、7); 2, 525 (3、3); 2, 511 (61、8); 2, 507 (121、8); 2, 503 (160、9); 2, 498 (122、6); 2, 494 (64、2); 2, 396 (8、3); 2, 334 (0、8); 2, 329 (1、0); 2, 325 (0、8); 1, 686 (1、8); 1, 497 (2、2); 1, 420 (0、8); 0, 000 (0、7)

実施例 I-T3-132: ^1H -NMR (400, 1MHz, d_6 -DMSO):
 $\delta = 8, 907$ (3、3); $8, 699$ (3、2); $8, 461$ (1、9); $8, 269$ (16、0); $8, 002$ (1、1); $4, 088$ (0、5); $4, 075$ (0、5);
 $3, 311$ (245、5); $3, 269$ (0、3); $3, 175$ (2、1); $3, 162$ (2、1); $3, 123$ (0、6); $2, 875$ (3、1); $2, 710$ (0、5);
 $2, 674$ (0、4); $2, 670$ (0、5); $2, 540$ (120、2); $2, 505$ (48、9); $2, 501$ (64、0); $2, 497$ (45、6); $2, 464$ (0、3); $2, 396$ (8、6); $2, 367$ (0、8); $2, 328$ (0、5); $2, 323$ (0、4); $1, 686$ (1、6); $1, 495$ (2、0); $1, 431$ (0、8);
 $1, 423$ (0、8); $0, 146$ (0、4); $0, 008$ (3、2); $0, 000$ (89、8); $-0, 008$ (4、5); $-0, 150$ (0、4)

10

実施例 I-T3-133: ^1H -NMR (400, 1MHz, d_6 -DMSO):
 $\delta = 8, 822$ (3、7); $8, 817$ (3、4); $8, 750$ (9、7); $8, 470$ (9、1); $8, 094$ (15、1); $8, 040$ (3、3); $8, 035$ (3、3);
 $7, 903$ (0、4); $3, 311$ (86、3); $3, 287$ (0、3); $3, 026$ (16、0); $2, 781$ (0、4); $2, 765$ (1、0); $2, 754$ (1、5);
 $2, 743$ (1、1); $2, 738$ (1、1); $2, 721$ (1、6); $2, 711$ (0、7); $2, 555$ (0、4); $2, 554$ (0、5); $2, 553$ (0、6); $2, 552$ (0、7); $2, 550$ (0、8); $2, 549$ (1、0); $2, 540$ (89、5);
 $2, 529$ (0、7); $2, 528$ (0、6); $2, 527$ (0、6); $2, 525$ (0、6); $2, 524$ (0、6); $2, 523$ (0、6); $2, 522$ (0、6); $2, 510$ (12、1); $2, 505$ (23、8); $2, 501$ (31、3); $2, 497$ (21、3); $2, 492$ (9、9); $2, 395$ (14、5); $2, 371$ (1、7); $0, 819$ (0、4); $0, 804$ (0、5); $0, 755$ (0、6); $0, 482$ (5、8); $0, 464$ (3、0); $0, 013$ (0、3); $0, 011$ (0、4); $0, 008$ (2、1); $0, 007$ (1、4); $0, 000$ (61、4); $-0, 006$ (1、7); $-0, 009$ (2、2); $-0, 013$ (0、4); $-0, 014$ (0、3)

20

30

実施例 I-T3-134: ^1H -NMR (400, 0MHz, d_6 -DMSO):
 $\delta = 8, 823$ (4、4); $8, 427$ (4、3); $8, 403$ (0、4); $8, 263$ (1、3); $8, 242$ (1、6); $8, 112$ (2、9); $8, 071$ (2、1);
 $8, 050$ (1、8); $7, 818$ (2、7); $7, 813$ (2、7); $7, 760$ (1、6); $7, 755$ (1、5); $7, 747$ (1、0); $7, 739$ (1、8); $7, 734$ (1、5); $7, 724$ (0、9); $7, 560$ (1、0); $7, 553$ (2、6);
 $7, 540$ (1、0); $7, 532$ (2、1); $3, 327$ (28、9); $3, 321$ (6、8); $3, 015$ (11、5); $2, 766$ (0、4); $2, 756$ (0、8);
 $2, 748$ (1、0); $2, 740$ (1、3); $2, 730$ (1、2); $2, 716$ (2、

40

7); 2, 676 (0、4); 2, 673 (0、4); 2, 507 (45、7); 2, 503 (53、0); 2, 499 (41、0); 2, 330 (0、4); 2, 076 (16、0); 2, 068 (2、0); 1, 170 (0、4); 0, 820 (0、4); 0, 812 (0、4); 0, 804 (0、4); 0, 757 (0、5); 0, 748 (0、5); 0, 559 (2、6); 0, 551 (2、5); 0, 503 (0、4); 0, 472 (2、1); 0, 455 (2、2); 0, 000 (51、7); -0, 009 (7、9)

実施例 I-T3-135: ^1H -NMR (400, 1MHz、 d_6 -DMSO):
 δ =8, 547 (0、5); 8, 505 (10、0); 8, 454 (9、8); 8, 448 (8、1); 8, 442 (4、1); 8, 281 (10、0); 8, 068 (16、0); 7, 686 (6、9); 7, 680 (6、8); 3, 568 (0、4); 3, 410 (4、1); 3, 394 (11、2); 3, 378 (4、3); 3, 309 (165、8); 3, 286 (0、7); 2, 832 (0、3); 2, 822 (0、9); 2, 812 (1、3); 2, 804 (2、0); 2, 794 (2、0); 2, 785 (1、3); 2, 776 (0、9); 2, 765 (0、4); 2, 710 (0、9); 2, 674 (0、5); 2, 669 (0、6); 2, 665 (0、5); 2, 560 (0、6); 2, 540 (226、8); 2, 523 (1、6); 2, 509 (31、4); 2, 505 (60、7); 2, 500 (78、7); 2, 496 (53、0); 2, 492 (24、2); 2, 366 (0、8); 2, 332 (0、4); 2, 327 (0、6); 2, 323 (0、4); 1, 887 (4、2); 1, 871 (11、1); 1, 854 (3、9); 1, 235 (0、4); 0, 704 (1、4); 0, 691 (3、7); 0, 686 (5、2); 0, 674 (4、8); 0, 668 (4、0); 0, 657 (1、7); 0, 547 (1、8); 0, 536 (5、3); 0, 530 (4、6); 0, 526 (4、3); 0, 520 (4、2); 0, 508 (1、3); 0, 146 (0、5); 0, 008 (4、2); 0, 000 (120、8); -0, 008 (4、5); -0, 150 (0、5)

実施例 I-T3-136: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):
 δ =8, 510 (2、6); 8, 502 (7、1); 8, 497 (6、4); 8, 441 (8、5); 8, 259 (8、4); 8, 129 (2、2); 8, 117 (2、5); 8, 106 (1、0); 8, 088 (5、7); 8, 080 (16、0); 4, 467 (1、4); 4, 453 (4、0); 4, 439 (1、5); 4, 111 (0、4); 4, 099 (0、4); 3, 904 (15、8); 3, 804 (0、4); 3, 483 (0、4); 3, 470 (0、5); 3, 455 (0、4); 3, 395 (8、9); 3, 388 (7、6); 3, 381 (9、5); 3, 338 (810、3); 3, 174 (1、7); 3, 161 (1、6); 2, 953 (0、4); 2, 932 (11、5); 2, 920 (11、5); 2, 847 (0、4); 2, 837 (0、9); 2, 828 (1、3); 2, 819 (1、9); 2, 810 (1、9); 2, 801 (1、3); 2, 79

2 (0、9); 2, 783 (0、4); 2, 671 (2、2); 2, 616 (0、3);
 2, 506 (280、8); 2, 502 (354、5); 2, 498 (275、8);
 2, 329 (2、2); 1, 234 (0、6); 0, 873 (0、6); 0, 854 (0、
 5); 0, 742 (1、0); 0, 724 (4、4); 0, 711 (4、1); 0, 70
 6 (3、6); 0, 694 (1、4); 0, 587 (1、5); 0, 576 (4、6);
 0, 570 (4、4); 0, 561 (3、8); 0, 548 (1、1); 0, 000 (4
 8、0)

10

実施例 I - T3 - 137: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):
 $\delta = 8, 543$ (6、9); $8, 537$ (7、0); $8, 455$ (8、0); $8, 36$
 4 (2、9); $8, 356$ (3、0); $8, 268$ (8、1); $8, 118$ (4、5);
 $8, 113$ (4、5); $8, 083$ (13、0); $4, 467$ (0、5); $4, 453$
 (1、5); $4, 439$ (0、6); $4, 112$ (0、4); $4, 099$ (0、4); $3,$
 904 (16、0); $3, 483$ (0、3); $3, 469$ (0、4); $3, 433$ (0、
 5); $3, 407$ (0、8); $3, 395$ (4、1); $3, 388$ (3、4); $3, 38$
 1 (4、6); $3, 338$ (731、2); $3, 174$ (1、7); $3, 161$ (1、
 6); $2, 955$ (0、8); $2, 852$ (0、8); $2, 844$ (1、2); $2, 83$
 5 (1、8); $2, 826$ (2、0); $2, 818$ (2、0); $2, 809$ (2、0);
 $2, 800$ (2、0); $2, 791$ (1、8); $2, 782$ (1、2); $2, 772$ (0、
 8); $2, 676$ (1、4); $2, 672$ (1、9); $2, 667$ (1、5); $2, 50$
 7 (235、5); $2, 502$ (302、0); $2, 498$ (229、6); $2, 33$
 3 (1、4); $2, 329$ (1、8); $2, 325$ (1、4); $1, 237$ (0、4);
 0, 873 (0、4); 0, 854 (0、3); 0, 765 (1、1); 0, 753 (3、
 5); 0, 748 (4、4); 0, 736 (5、1); 0, 731 (4、0); 0, 71
 8 (5、1); 0, 706 (3、9); 0, 700 (3、5); 0, 689 (1、4);
 0, 582 (1、4); 0, 571 (4、3); 0, 565 (4、0); 0, 556 (3、
 5); 0, 544 (1、0); 0, 466 (1、3); 0, 455 (4、0); 0, 45
 0 (4、1); 0, 445 (4、0); 0, 440 (3、9); 0, 428 (1、1);
 0, 000 (39、5)

20

30

実施例 I - T3 - 138: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):
 $\delta = 8, 524$ (1、8); $8, 515$ (1、9); $8, 487$ (3、8); $8, 48$
 2 (3、9); $8, 443$ (6、4); $8, 432$ (1、1); $8, 419$ (1、9);
 $8, 405$ (1、0); $8, 274$ (0、4); $8, 262$ (6、3); $8, 120$ (4、
 0); $8, 114$ (3、6); $8, 081$ (10、3); $4, 453$ (0、7); $3, 9$
 04 (16、0); $3, 606$ (1、0); $3, 592$ (3、0); $3, 579$ (3、
 7); $3, 566$ (1、8); $3, 523$ (3、7); $3, 511$ (4、9); $3, 49$
 8 (1、9); $3, 473$ (0、5); $3, 449$ (0、3); $3, 395$ (2、5);

40

3, 387 (2、3); 3, 381 (2、9); 3, 338 (556、7); 3, 299 (28、1); 3, 286 (1、6); 3, 262 (0、8); 3, 256 (0、7); 3, 174 (0、9); 3, 161 (0、9); 2, 840 (0、6); 2, 831 (0、9); 2, 822 (1、3); 2, 812 (1、4); 2, 804 (0、9); 2, 795 (0、6); 2, 676 (1、4); 2, 672 (2、0); 2, 667 (1、4); 2, 507 (219、1); 2, 503 (282、2); 2, 498 (210、9); 2, 334 (1、2); 2, 329 (1、7); 2, 325 (1、3); 1, 235 (0、5); 0, 747 (0、8); 0, 734 (2、3); 0, 729 (3、2); 0, 717 (2、9); 0, 711 (2、6); 0, 700 (1、0); 0, 589 (1、1); 0, 579 (3、3); 0, 573 (3、0); 0, 569 (3、0); 0, 563 (2、7); 0, 551 (0、9); 0, 008 (1、7); 0, 000 (45、2); -0, 008 (1、8)

10

実施例 I-T3-139: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):
 δ =9, 474 (2、4); 8, 837 (1、9); 8, 831 (2、1); 8, 602 (3、2); 8, 355 (3、4); 7, 970 (2、0); 7, 965 (2、2); 7, 596 (4、3); 4, 467 (0、4); 4, 453 (1、0); 4, 440 (0、4); 3, 904 (6、3); 3, 423 (0、3); 3, 395 (2、3); 3, 387 (2、3); 3, 381 (2、8); 3, 340 (340、7); 3, 174 (0、4); 3, 161 (0、4); 3, 063 (0、6); 2, 880 (0、6); 2, 672 (0、9); 2, 668 (0、7); 2, 507 (107、5); 2, 503 (142、8); 2, 498 (119、4); 2, 329 (1、2); 2, 325 (1、2); 2, 312 (0、8); 2, 299 (0、6); 2, 292 (0、5); 2, 110 (16、0); 1, 615 (0、8); 1, 601 (2、0); 1, 594 (2、3); 1, 581 (1、0); 1, 324 (0、9); 1, 310 (2、1); 1, 304 (2、3); 1, 289 (0、8); 1, 257 (0、4); 1, 243 (0、4); 1, 168 (0、4); 0, 993 (2、1); 0, 982 (3、3); 0, 962 (1、9); 0, 000 (10、4)

20

30

実施例 I-T3-140: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):
 δ =8, 785 (2、0); 8, 780 (1、9); 8, 595 (1、3); 8, 584 (4、5); 8, 345 (3、4); 7, 890 (2、0); 7, 885 (1、9); 7, 594 (4、2); 4, 455 (0、3); 3, 904 (3、2); 3, 408 (0、5); 3, 394 (1、3); 3, 382 (1、7); 3, 342 (322、7); 3, 174 (0、4); 3, 162 (0、4); 2, 892 (0、5); 2, 883 (0、7); 2, 873 (0、7); 2, 865 (0、5); 2, 855 (0、4); 2, 672 (0、7); 2, 503 (110、1); 2, 352 (0、4); 2, 345 (0、5); 2, 334 (1、3); 2, 314 (0、5); 2, 111 (16、0); 0, 9

40

7 3 (1、9); 0, 9 6 1 (1、8); 0, 9 5 1 (1、9); 0, 9 3 1 (1、6);
0, 7 4 0 (0、4); 0, 7 2 3 (1、7); 0, 7 1 0 (1、7); 0, 7 0 5 (1、
4); 0, 6 9 4 (0、6); 0, 5 8 2 (0、6); 0, 5 7 1 (1、8); 0, 5 6
4 (1、8); 0, 5 5 5 (1、5); 0, 5 4 3 (0、4); 0, 0 0 0 (8、3)

実施例 I-T3-141: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):
 δ =9, 0 9 3 (2、2); 8, 6 6 8 (2、1); 8, 6 6 2 (2、2); 8, 5 7
7 (3、2); 8, 3 2 7 (3、3); 8, 3 1 4 (2、3); 8, 3 0 8 (2、2);
7, 5 9 3 (3、8); 3, 9 6 9 (10、4); 3, 9 0 4 (3、5); 3, 4 0 9
(0、5); 3, 3 4 3 (332、3); 3, 2 8 5 (0、3); 2, 6 7 6 (0、5);
2, 6 7 2 (0、7); 2, 6 6 8 (0、6); 2, 5 2 5 (2、4); 2, 5 1 2 (4
5、6); 2, 5 0 7 (89、1); 2, 5 0 3 (116、0); 2, 4 9 8 (87、
1); 2, 3 3 4 (0、5); 2, 3 3 0 (0、7); 2, 3 2 5 (0、5); 2, 1 2
1 (16、0); 1, 6 0 2 (0、8); 1, 5 8 7 (2、0); 1, 5 8 1 (2、2);
1, 5 6 7 (0、9); 1, 3 0 5 (1、0); 1, 2 9 2 (2、1); 1, 2 8 5 (2、
2); 1, 2 7 1 (0、8); 0, 0 0 8 (0、4); 0, 0 0 0 (11、6); -0,
0 0 8 (0、5)

実施例 I-T3-142: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):
 δ =8, 7 6 7 (2、0); 8, 5 8 2 (3、2); 8, 3 4 3 (3、2); 7, 9 4
8 (2、0); 7, 8 5 1 (0、3); 7, 5 9 1 (5、1); 4, 4 5 4 (0、8);
3, 9 0 4 (4、5); 3, 3 8 1 (3、9); 3, 3 4 1 (346、8); 3, 2 1
8 (0、4); 3, 1 7 5 (0、5); 3, 1 6 2 (0、4); 3, 0 4 3 (7、9);
2, 7 9 1 (1、0); 2, 7 8 1 (0、9); 2, 7 6 6 (1、5); 2, 6 7 2 (1、
0); 2, 5 0 3 (159、1); 2, 3 3 0 (1、0); 2, 1 2 2 (16、0); 1,
9 2 6 (0、6); 1, 9 1 5 (0、9); 1, 9 0 1 (0、7); 1, 8 8 2 (0、
4); 0, 9 9 2 (1、5); 0, 9 6 1 (2、3); 0, 9 4 3 (2、0); 0, 8 2
4 (0、4); 0, 8 0 9 (0、4); 0, 7 6 4 (0、5); 0, 5 4 0 (2、1);
0, 4 8 2 (1、7); 0, 4 6 7 (1、6); 0, 0 0 0 (14、1)

実施例 I-T3-143: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):
 δ =8, 6 0 8 (2、1); 8, 6 0 2 (2、1); 8, 5 5 6 (3、2); 8, 3 0
8 (3、3); 8, 2 6 6 (1、0); 8, 2 5 6 (1、0); 8, 2 2 7 (2、2);
8, 2 2 1 (2、1); 7, 5 9 0 (3、9); 3, 9 4 8 (10、3); 3, 9 0 4
(3、5); 3, 3 9 5 (0、9); 3, 3 4 3 (295、8); 3, 1 7 5 (0、3);
2, 8 7 3 (0、3); 2, 8 6 3 (0、5); 2, 8 5 5 (0、7); 2, 8 4 5 (0、
7); 2, 8 3 7 (0、5); 2, 8 2 7 (0、3); 2, 6 7 6 (0、5); 2, 6 7
2 (0、7); 2, 6 6 8 (0、5); 2, 5 0 7 (88、5); 2, 5 0 3 (112、
5); 2, 4 9 8 (84、8); 2, 3 3 4 (0、5); 2, 3 2 9 (0、7); 2, 3

25 (0、5); 2, 120 (16、0); 0, 740 (0、4); 0, 727 (1、3); 0, 722 (1、8); 0, 709 (1、6); 0, 704 (1、4); 0, 692 (0、6); 0, 580 (0、6); 0, 570 (1、8); 0, 564 (1、7); 0, 554 (1、4); 0, 542 (0、4); 0, 008 (0、7); 0, 000 (14、6)

实施例 I-T3-144: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):
 δ =8, 563 (2、0); 8, 558 (2、0); 8, 526 (3、6); 8, 302 (3、3); 8, 005 (1、9); 7, 999 (2、0); 7, 590 (4、6); 4, 468 (0、3); 4, 454 (0、8); 4, 440 (0、3); 3, 915 (9、8); 3, 904 (7、4); 3, 425 (0、4); 3, 395 (2、6); 3, 388 (2、3); 3, 381 (3、0); 3, 341 (345、9); 3, 282 (0、4); 2, 981 (8、7); 2, 748 (0、5); 2, 738 (0、8); 2, 724 (0、6); 2, 711 (0、3); 2, 700 (0、9); 2, 676 (0、7); 2, 672 (0、9); 2, 668 (0、8); 2, 507 (111、1); 2, 503 (144、6); 2, 499 (113、9); 2, 334 (0、6); 2, 329 (0、8); 2, 127 (16、0); 0, 466 (3、1); 0, 449 (1、7); 0, 000 (11、6)

实施例 I-T3-145: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):
 δ =8, 848 (0、6); 8, 841 (0、8); 8, 835 (4、1); 8, 829 (4、2); 8, 781 (6、9); 8, 537 (7、1); 8, 316 (0、4); 8, 283 (13、4); 8, 274 (4、6); 8, 257 (0、6); 8, 251 (0、5); 3, 424 (0、3); 3, 409 (0、3); 3, 398 (0、4); 3, 387 (0、3); 3, 371 (0、4); 3, 324 (185、3); 2, 776 (0、4); 2, 764 (0、8); 2, 759 (0、9); 2, 750 (1、6); 2, 739 (1、0); 2, 733 (0、9); 2, 722 (0、5); 2, 675 (1、1); 2, 671 (1、5); 2, 667 (1、1); 2, 524 (4、5); 2, 506 (173、0); 2, 502 (225、3); 2, 497 (167、2); 2, 333 (1、1); 2, 329 (1、5); 2, 324 (1、1); 1, 398 (16、0); 1, 238 (4、1); 1, 220 (8、5); 1, 202 (3、9); 1, 120 (0、5); 1, 102 (1、0); 1, 085 (0、5); 0, 951 (0、4); 0, 935 (0、5); 0, 577 (2、8); 0, 549 (2、5); 0, 532 (2、1); 0, 146 (0、9); 0, 008 (7、2); 0, 000 (188、0); -0, 008 (8、4); -0, 150 (0、9)

实施例 I-T3-146: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):
 δ =10, 752 (3、5); 8, 900 (3、6); 8, 894 (3、7); 8, 806 (5、3); 8, 571 (5、2); 8, 570 (5、2); 8, 393 (3、7);

10

20

30

40

8, 387 (3、6); 8, 284 (8、3); 8, 283 (8、3); 8, 028 (4、8); 7, 502 (4、8); 7, 501 (5、0); 5, 756 (5、9); 4, 056 (0、5); 4, 038 (1、6); 4, 020 (1、6); 4, 002 (0、5); 3, 837 (16、0); 3, 324 (33、1); 2, 671 (0、4); 2, 524 (1、0); 2, 520 (1、4); 2, 511 (20、1); 2, 507 (41、3); 2, 502 (54、9); 2, 497 (40、1); 2, 493 (19、7); 2, 329 (0、4); 1, 989 (6、9); 1, 193 (1、9); 1, 175 (3、8); 1, 157 (1、9); 0, 008 (1、9); 0, 000 (58、8); -0, 009 (2、2)

10

実施例 I-T3-147: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):
 δ =8, 999 (3、5); 8, 993 (3、6); 8, 778 (6、5); 8, 499 (6、5); 8, 384 (3、5); 8, 378 (3、5); 8, 279 (10、7); 5, 757 (1、1); 4, 384 (1、6); 4, 366 (5、0); 4, 348 (5、1); 4, 331 (1、7); 3, 894 (0、5); 3, 324 (128、6); 2, 714 (16、0); 2, 675 (0、9); 2, 671 (1、3); 2, 666 (1、0); 2, 524 (3、3); 2, 511 (69、0); 2, 506 (138、7); 2, 502 (184、5); 2, 498 (139、2); 2, 333 (0、8); 2, 329 (1、1); 2, 325 (0、9); 1, 989 (0、7); 1, 377 (5、4); 1, 360 (11、3); 1, 342 (5、4); 1, 234 (0、5); 1, 175 (0、4); 0, 146 (0、9); 0, 008 (6、9); 0, 000 (189、8); -0, 150 (0、9)

20

実施例 I-T3-148: ^1H -NMR (400, 0MHz、 CD_3CN):
 δ =8, 344 (1、0); 8, 180 (2、1); 8, 179 (2、0); 8, 138 (1、8); 8, 094 (1、0); 7, 688 (1、2); 7, 683 (1、6); 7, 655 (0、9); 7, 650 (0、6); 7, 634 (1、0); 7, 629 (0、8); 7, 474 (1、5); 7, 454 (1、2); 6, 895 (0、4); 6, 892 (0、4); 2, 860 (0、4); 2, 851 (0、6); 2, 842 (0、6); 2, 833 (0、4); 2, 132 (17、4); 2, 107 (0、3); 1, 964 (1、5); 1, 958 (3、8); 1, 952 (20、1); 1, 946 (36、2); 1, 940 (48、4); 1, 933 (33、3); 1, 927 (17、3); 1, 437 (16、0); 0, 781 (1、0); 0, 776 (1、2); 0, 763 (1、3); 0, 758 (0、9); 0, 746 (0、4); 0, 611 (0、4); 0, 601 (1、1); 0, 594 (1、2); 0, 590 (1、0); 0, 584 (1、0); 0, 000 (2、5)

30

40

実施例 I-T3-149: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):
 δ =18, 228 (0、3); 18, 070 (0、4); 11, 873 (0、3); 9,

4 6 4 (0、4); 9, 4 3 5 (1 3、6); 9, 4 0 7 (0、4); 9, 2 6 5 (9、2); 9, 1 6 8 (1 6、0); 8, 8 6 9 (9、9); 8, 5 4 4 (1 5、8); 8, 5 1 4 (0、4); 8, 3 1 6 (1、1); 8, 1 4 8 (0、4); 8, 0 1 2 (0、4); 7, 9 4 5 (1 2、0); 7, 9 3 1 (6、4); 7, 9 1 0 (6、2); 7, 9 0 5 (5、4); 7, 8 5 0 (0、4); 7, 8 4 3 (0、4); 7, 8 3 9 (0、4); 7, 7 0 2 (0、4); 7, 6 3 9 (0、4); 7, 5 8 2 (9、8); 7, 5 6 1 (9、0); 7, 5 4 3 (0、4); 3, 6 3 7 (0、4); 3, 5 9 1 (0、4); 3, 5 7 2 (0、4); 3, 5 4 7 (0、4); 3, 5 3 5 (0、6); 3, 5 1 2 (0、5); 3, 4 6 9 (0、6); 3, 4 3 4 (0、9); 3, 3 9 2 (2、8); 3, 3 4 4 (1 3 1 6、4); 3, 3 3 9 (7 6 5、9); 3, 3 3 1 (9 9 2、7); 3, 2 1 8 (1、0); 3, 2 1 1 (0、9); 3, 1 7 8 (0、5); 3, 1 2 1 (0、3); 3, 0 5 8 (0、3); 2, 7 3 1 (0、4); 2, 6 7 1 (5、7); 2, 6 3 8 (0、4); 2, 5 8 4 (0、4); 2, 5 0 6 (6 8 9、3); 2, 5 0 2 (8 4 7、8); 2, 4 1 7 (1、1); 2, 3 8 1 (0、8); 2, 3 3 3 (4、7); 2, 3 2 8 (5、7); 2, 2 8 8 (0、4); 2, 2 8 3 (0、4); 1, 6 5 8 (0、3); 1, 6 2 0 (4、0); 1, 6 0 6 (1 1、5); 1, 5 9 9 (1 2、3); 1, 5 8 6 (5、4); 1, 5 4 6 (0、6); 1, 4 8 9 (0、4); 1, 3 7 0 (0、3); 1, 3 5 0 (0、7); 1, 3 1 0 (5、0); 1, 2 9 6 (1 1、9); 1, 2 9 0 (1 2、3); 1, 2 7 5 (4、4); 1, 2 3 7 (0、5); 0, 1 4 6 (2、0); 0, 0 0 0 (4 0 4、8); -0, 1 5 0 (2、2); -3, 1 4 6 (0、3)

10

20

実施例 I - T 3 - 1 5 0 : ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):
 δ =9, 2 6 5 (5、5); 9, 1 7 9 (0、4); 9, 1 4 4 (1 2、1); 9, 0 8 6 (0、6); 8, 8 6 8 (5、9); 8, 8 6 3 (6、0); 8, 5 5 4 (0、6); 8, 5 3 6 (1 6、0); 8, 5 2 5 (4、5); 8, 5 0 4 (0、7); 8, 3 1 6 (0、8); 8, 2 9 2 (0、4); 7, 8 7 2 (1 4、1); 7, 8 6 6 (7、0); 7, 8 5 5 (6、0); 7, 8 5 0 (3、3); 7, 5 6 9 (0、3); 7, 5 3 4 (7、4); 7, 5 2 7 (1、7); 7, 5 1 8 (1、6); 7, 5 1 1 (6、7); 3, 5 6 8 (0、6); 3, 4 6 8 (0、4); 3, 4 5 5 (0、4); 3, 4 4 4 (0、5); 3, 3 4 1 (5 7 6、1); 3, 3 3 9 (5 9 0、5); 3, 3 3 1 (5 5 2、2); 2, 8 7 5 (0、5); 2, 8 6 4 (1、2); 2, 8 5 5 (1、6); 2, 8 4 6 (2、6); 2, 8 3 6 (2、6); 2, 8 2 8 (1、7); 2, 8 1 8 (1、3); 2, 8 0 7 (0、5); 2, 6 7 6 (2、6); 2, 6 7 2 (3、7); 2, 6 6 7 (2、8); 2, 6 6 2 (1、4); 2, 5 8 0 (0、4); 2, 5 2 5 (9、0); 2, 5 2 0 (1 3、1); 2, 5 1 1 (1 9 7、7); 2, 5 0 7 (4 1 1、4); 2, 5 0 2 (5 5 9、2); 2, 4 9 8 (4 2 3、2); 2, 4 9 3 (2 1 2、6); 2, 4 5 8 (0、5); 2, 3 3 4 (2、7); 2, 3 2 9 (3、7); 2, 3 2 5 (2、7); 0, 7 3

30

40

6 (1、7); 0, 724 (4、5); 0, 718 (6、6); 0, 706 (6、1);
 0, 700 (5、1); 0, 689 (2、3); 0, 650 (0、3); 0, 608 (0、
 4); 0, 578 (2、2); 0, 568 (6、4); 0, 562 (5、7); 0, 55
 8 (5、5); 0, 552 (5、2); 0, 540 (1、7); 0, 146 (1、7);
 0, 030 (0、4); 0, 024 (0、4); 0, 017 (0、6); 0, 008 (1
 2、6); 0, 000 (401、4); -0, 009 (15、0); -0, 150 (1、
 7)

10

実施例 I-T3-151: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):
 δ =9, 444 (12、0); 9, 048 (16、0); 8, 890 (7、0); 8,
 886 (7、3); 8, 610 (8、1); 8, 605 (7、8); 8, 506 (15、
 9); 8, 495 (0、3); 8, 317 (4、4); 7, 899 (6、5); 7, 89
 4 (13、4); 7, 885 (2、6); 7, 870 (6、7); 7, 865 (4、8);
 7, 579 (9、1); 7, 559 (8、2); 3, 410 (0、4); 3, 383 (0、
 7); 3, 364 (1、2); 3, 327 (1576, 2); 3, 293 (1、2); 2,
 694 (0、5); 2, 676 (8、0); 2, 671 (11、2); 2, 667 (8、
 3); 2, 643 (0、4); 2, 630 (0、4); 2, 623 (0、5); 2, 59
 9 (0、7); 2, 524 (28、8); 2, 520 (43、4); 2, 511 (59
 4、8); 2, 507 (1217, 9); 2, 502 (1623, 1); 2, 498 (1
 195, 4); 2, 493 (589、7); 2, 419 (0、6); 2, 338 (3、
 7); 2, 333 (7、9); 2, 329 (11、1); 2, 324 (8、1); 2, 3
 20 (4、0); 1, 620 (3、9); 1, 606 (9、5); 1, 599 (10、
 3); 1, 586 (4、4); 1, 546 (0、4); 1, 342 (0、4); 1, 30
 3 (4、6); 1, 289 (9、5); 1, 282 (10、2); 1, 268 (3、8);
 1, 234 (0、6); 1, 148 (0、9); 0, 146 (8、7); 0, 049 (0、
 4); 0, 039 (0、7); 0, 008 (63、6); 0, 000 (1893, 8);
 -0, 009 (67、7); -0, 035 (1、3); -0, 045 (0、8); -0,
 088 (0、3); -0, 150 (8、7)

20

30

実施例 I-T3-152: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):
 δ =9, 046 (0、6); 9, 022 (16、0); 8, 893 (8、5); 8, 6
 08 (9、0); 8, 604 (8、5); 8, 543 (6、0); 8, 532 (6、0);
 8, 515 (0、9); 8, 496 (15、9); 8, 453 (0、3); 8, 317
 (2、0); 7, 901 (0、4); 7, 896 (0、4); 7, 828 (8、6); 7,
 823 (11、4); 7, 818 (11、0); 7, 812 (8、2); 7, 682 (0、
 3); 7, 532 (8、5); 7, 521 (2、4); 7, 510 (7、5); 3, 50
 8 (0、4); 3, 327 (1034, 9); 3, 230 (0、5); 3, 210 (0、
 4); 2, 874 (0、7); 2, 864 (1、6); 2, 854 (2、4); 2, 84

40

6 (3、5); 2, 836 (3、5); 2, 827 (2、5); 2, 817 (1、7);
 2, 807 (0、8); 2, 671 (8、3); 2, 622 (0、7); 2, 608 (0、
 8); 2, 506 (980、0); 2, 502 (1179、0); 2, 329 (8、1);
 2, 297 (0、4); 2, 281 (0、3); 1, 236 (0、7); 1, 149 (0、
 6); 0, 735 (2、2); 0, 717 (8、7); 0, 705 (8、5); 0, 69
 9 (7、0); 0, 688 (2、9); 0, 666 (0、5); 0, 648 (0、4);
 0, 615 (0、3); 0, 603 (0、4); 0, 574 (3、0); 0, 563 (9、
 1); 0, 556 (9、0); 0, 548 (7、5); 0, 535 (2、1); 0, 52
 5 (0、5); 0, 488 (0、3); 0, 146 (5、2); 0, 000 (1050、
 7); -0, 150 (5、5)

10

実施例 I - T3-153: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):
 δ =9, 441 (7、1); 9, 380 (9、1); 8, 960 (4、8); 8, 95
 4 (5、0); 8, 641 (9、2); 8, 581 (3、9); 8, 577 (3、9);
 8, 317 (0、9); 8, 166 (1、1); 8, 002 (5、1); 7, 997 (6、
 5); 7, 969 (3、3); 7, 963 (2、5); 7, 948 (3、5); 7, 94
 2 (3、0); 7, 589 (6、2); 7, 568 (5、7); 3, 430 (0、6);
 3, 411 (1、9); 3, 393 (2、3); 3, 378 (2、6); 3, 359 (2、
 8); 3, 328 (240、7); 2, 950 (0、6); 2, 932 (2、1); 2,
 913 (2、4); 2, 898 (2、1); 2, 880 (1、9); 2, 862 (0、
 5); 2, 676 (1、9); 2, 671 (2、7); 2, 667 (2、0); 2, 54
 2 (1、0); 2, 525 (6、6); 2, 520 (10、2); 2, 511 (145、
 4); 2, 507 (298、6); 2, 502 (396、9); 2, 498 (292、
 6); 2, 493 (144、6); 2, 334 (1、9); 2, 329 (2、6); 2,
 325 (1、9); 2, 320 (1、0); 2, 075 (0、6); 1, 908 (0、
 5); 1, 627 (2、3); 1, 613 (5、6); 1, 606 (6、0); 1, 59
 3 (2、7); 1, 314 (2、6); 1, 301 (5、6); 1, 294 (5、9);
 1, 279 (2、3); 1, 106 (7、4); 1, 088 (16、0); 1, 069
 (7、2); 0, 146 (2、3); 0, 008 (17、1); 0, 000 (509、
 3); -0, 009 (19、8); -0, 031 (0、4); -0, 034 (0、4);
 -0, 150 (2、3)

20

30

実施例 I - T3-154: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):
 δ =9, 448 (6、4); 9, 231 (4、3); 9, 226 (4、3); 9, 18
 6 (8、2); 8, 634 (4、2); 8, 629 (4、2); 8, 596 (8、2);
 8, 317 (3、6); 7, 954 (4、3); 7, 949 (6、0); 7, 934 (3、
 1); 7, 929 (2、0); 7, 913 (3、2); 7, 908 (2、5); 7, 59
 5 (5、2); 7, 574 (4、7); 4, 152 (1、7); 4, 133 (5、6);

40

4, 115 (5, 6); 4, 096 (1, 8); 3, 459 (0, 4); 3, 445 (0, 3); 3, 436 (0, 3); 3, 328 (1346, 5); 2, 694 (0, 4); 2, 676 (6, 7); 2, 671 (9, 0); 2, 667 (6, 9); 2, 629 (0, 5); 2, 620 (0, 5); 2, 524 (24, 4); 2, 506 (1009, 7); 2, 502 (1305, 6); 2, 498 (988, 2); 2, 405 (0, 6); 2, 389 (0, 6); 2, 333 (6, 4); 2, 329 (8, 7); 2, 325 (6, 5); 1, 623 (2, 1); 1, 608 (5, 2); 1, 602 (5, 6); 1, 589 (2, 4); 1, 575 (0, 5); 1, 326 (6, 4); 1, 308 (16, 0); 1, 289 (11, 7); 1, 274 (2, 1); 1, 258 (0, 6); 1, 247 (0, 5); 1, 236 (0, 7); 1, 158 (0, 5); 1, 147 (0, 4); 1, 068 (0, 8); 0, 146 (6, 9); 0, 008 (62, 7); 0, 000 (1428, 7); -0, 059 (0, 5); -0, 080 (0, 4); -0, 101 (0, 4); -0, 150 (7, 0)

10

実施例 I-T3-155: ^1H -NMR (400, 0MHz、CD₃CN):

δ =8, 345 (0, 9); 8, 192 (1, 8); 8, 153 (1, 5); 8, 094 (0, 9); 7, 738 (1, 0); 7, 732 (1, 3); 7, 706 (0, 6); 7, 700 (0, 5); 7, 685 (0, 7); 7, 680 (0, 6); 7, 563 (0, 4); 7, 507 (1, 1); 7, 486 (0, 9); 2, 144 (6, 2); 2, 114 (0, 5); 2, 108 (0, 4); 1, 972 (1, 1); 1, 964 (1, 1); 1, 958 (2, 8); 1, 952 (14, 4); 1, 946 (26, 2); 1, 940 (35, 3); 1, 934 (25, 1); 1, 928 (13, 6); 1, 596 (0, 5); 1, 582 (1, 3); 1, 575 (1, 3); 1, 561 (0, 7); 1, 437 (16, 0); 1, 362 (0, 6); 1, 349 (1, 3); 1, 342 (1, 4); 1, 327 (0, 5); 1, 204 (0, 5); 0, 146 (0, 8); 0, 008 (7, 0); 0, 000 (147, 1); -0, 008 (10, 2); -0, 150 (0, 7)

20

30

実施例 I-T3-156: ^1H -NMR (400, 0MHz、d₆-DMSO):

δ =9, 077 (8, 4); 9, 076 (8, 4); 8, 593 (4, 1); 8, 589 (4, 2); 8, 540 (3, 1); 8, 529 (3, 2); 8, 471 (8, 5); 8, 469 (8, 4); 8, 317 (0, 7); 8, 019 (4, 1); 8, 015 (4, 0); 7, 848 (1, 5); 7, 843 (5, 5); 7, 839 (7, 4); 7, 834 (5, 9); 7, 826 (4, 6); 7, 820 (2, 2); 7, 526 (5, 7); 7, 517 (1, 0); 7, 513 (0, 9); 7, 504 (5, 1); 3, 328 (238, 4); 3, 109 (1, 9); 3, 091 (6, 4); 3, 072 (6, 5); 3, 054 (2, 0); 2, 874 (0, 4); 2, 864 (0, 9); 2, 854 (1, 2); 2, 846 (1, 9); 2, 836 (2, 0); 2, 827 (1, 2); 2, 818 (1, 0); 2, 808 (0, 4); 2, 676 (1, 5); 2, 671 (2, 2);

40

2, 667 (1、6); 2, 662 (0、8); 2, 525 (5、6); 2, 520 (8、4); 2, 511 (110、7); 2, 507 (227、2); 2, 502 (302、7); 2, 498 (222、3); 2, 493 (109、6); 2, 338 (0、6); 2, 334 (1、4); 2, 329 (1、9); 2, 324 (1、4); 2, 320 (0、7); 1, 398 (1、0); 1, 235 (8、0); 1, 217 (16、0); 1, 198 (7、0); 0, 736 (1、2); 0, 723 (3、4); 0, 718 (4、9); 0, 706 (4、5); 0, 700 (3、8); 0, 688 (1、6); 0, 577 (1、6); 0, 566 (4、8); 0, 560 (4、3); 0, 556 (4、1); 0, 550 (3、9); 0, 538 (1、2); 0, 146 (0、6); 0, 008 (4、5); 0, 000 (140、4); -0, 009 (5、1); -0, 150 (0、6)

10

実施例 I-T3-157: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):
 δ =9, 389 (0、4); 9, 355 (9、8); 8, 964 (5、4); 8, 959 (5、4); 8, 642 (0、5); 8, 627 (9、7); 8, 577 (4、7); 8, 540 (3、8); 8, 529 (3、8); 8, 317 (1、2); 7, 913 (12、3); 7, 893 (4、1); 7, 887 (2、8); 7, 541 (4、9); 7, 520 (4、4); 4, 038 (0、9); 4, 020 (0、8); 4, 002 (0、4); 3, 454 (0、4); 3, 425 (0、9); 3, 406 (2、4); 3, 387 (2、9); 3, 372 (3、7); 3, 353 (5、7); 3, 329 (694、0); 2, 952 (0、7); 2, 934 (2、2); 2, 915 (2、5); 2, 900 (2、2); 2, 882 (2、0); 2, 864 (1、6); 2, 855 (1、6); 2, 846 (2、3); 2, 836 (2、3); 2, 827 (1、6); 2, 818 (1、1); 2, 807 (0、5); 2, 676 (3、2); 2, 671 (4、1); 2, 667 (3、2); 2, 507 (462、3); 2, 502 (589、8); 2, 498 (442、8); 2, 333 (2、8); 2, 329 (3、8); 2, 325 (2、8); 1, 989 (3、4); 1, 398 (1、9); 1, 234 (0、7); 1, 193 (1、0); 1, 175 (1、8); 1, 157 (0、9); 1, 099 (7、6); 1, 081 (16、0); 1, 063 (7、3); 0, 741 (1、3); 0, 728 (4、0); 0, 723 (5、4); 0, 711 (5、1); 0, 705 (4、3); 0, 694 (1、7); 0, 583 (1、8); 0, 573 (5、5); 0, 566 (5、3); 0, 557 (4、5); 0, 545 (1、3); 0, 146 (0、3); 0, 008 (3、2); 0, 000 (63、6)

20

30

40

実施例 I-T3-158: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):
 δ =9, 234 (1、6); 9, 229 (1、6); 9, 165 (3、1); 8, 632 (1、6); 8, 627 (1、6); 8, 584 (3、2); 8, 547 (1、2); 8, 536 (1、2); 7, 875 (4、5); 7, 871 (1、9); 7, 857 (1、5); 7, 852 (0、9); 7, 548 (1、5); 7, 543 (0、7); 7, 52

9 (0、6); 7, 525 (1、4); 4, 151 (0、7); 4, 132 (2、2);
 4, 114 (2、2); 4, 095 (0、7); 3, 329 (71、4); 2, 867
 (0、3); 2, 857 (0、4); 2, 849 (0、7); 2, 839 (0、7); 2,
 830 (0、5); 2, 821 (0、3); 2, 676 (0、4); 2, 672 (0、
 6); 2, 667 (0、4); 2, 525 (1、6); 2, 511 (33、5); 2, 5
 07 (66、9); 2, 502 (87、7); 2, 498 (64、8); 2, 494 (3
 2、5); 2, 334 (0、4); 2, 329 (0、6); 2, 325 (0、4); 1,
 398 (16、0); 1, 324 (2、6); 1, 306 (5、7); 1, 287 (2、
 6); 1, 236 (0、3); 0, 738 (0、4); 0, 725 (1、3); 0, 72
 0 (1、8); 0, 708 (1、6); 0, 702 (1、4); 0, 691 (0、6);
 0, 580 (0、6); 0, 569 (1、8); 0, 563 (1、6); 0, 554 (1、
 4); 0, 541 (0、4); 0, 008 (0、4); 0, 000 (10、6); -0,
 008 (0、4)

10

実施例 I-T3-159: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):

δ =9, 812 (2、8); 9, 173 (7、1); 8, 904 (2、9); 8, 88
 0 (0、5); 8, 874 (0、4); 8, 852 (1、7); 8, 845 (2、6);
 8, 822 (6、9); 8, 816 (7、2); 8, 765 (9、2); 8, 566 (0、
 7); 8, 554 (1、9); 8, 512 (5、8); 8, 484 (11、2); 8, 4
 55 (6、7); 8, 449 (6、6); 8, 318 (0、7); 8, 263 (1、1);
 8, 257 (1、1); 8, 237 (0、4); 8, 093 (5、7); 3, 903 (1
 6、0); 3, 680 (2、8); 3, 593 (0、6); 3, 582 (0、9); 3,
 570 (0、7); 3, 388 (0、9); 3, 333 (306、9); 3, 276 (1、
 0); 3, 267 (1、3); 3, 168 (13、0); 3, 044 (0、4); 2, 9
 80 (0、9); 2, 891 (2、0); 2, 732 (1、7); 2, 676 (1、9);
 2, 672 (2、6); 2, 667 (1、9); 2, 542 (0、9); 2, 525 (6、
 2); 2, 511 (158、8); 2, 507 (322、0); 2, 503 (423、
 2); 2, 498 (311、3); 2, 494 (156、1); 2, 334 (2、0);
 2, 329 (2、7); 2, 325 (2、1); 2, 083 (0、4); 2, 065 (0、
 3); 1, 877 (2、4); 1, 867 (5、7); 1, 857 (6、2); 1, 84
 8 (2、6); 1, 718 (0、4); 1, 709 (0、4); 1, 435 (0、4);
 1, 355 (0、6); 1, 298 (0、6); 1, 284 (0、5); 1, 276 (0、
 6); 1, 259 (3、3); 1, 249 (6、9); 1, 239 (9、7); 1, 23
 6 (9、6); 1, 001 (0、6); 0, 991 (0、5); 0, 986 (0、5);
 0, 871 (0、5); 0, 862 (0、6); 0, 854 (1、3); 0, 843 (0、
 5); 0, 837 (0、7); 0, 827 (0、3); 0, 008 (0、7); 0, 00
 0 (25、7); -0, 008 (1、0)

20

30

40

実施例 I-T3-160: ^1H -NMR (400, 0MHz、 CD_3CN):

$\delta = 8, 728$ (0、3); $8, 722$ (0、5); $8, 704$ (9、5); $8, 698$ (9、6); $8, 524$ (0、3); $8, 353$ (7、7); $8, 234$ (15、1); $8, 219$ (12、8); $8, 100$ (7、8); $8, 052$ (10、3); $8, 046$ (10、1); $7, 603$ (0、4); $7, 592$ (0、6); $7, 560$ (0、5); $7, 537$ (0、5); $7, 495$ (0、5); $7, 490$ (0、5); $7, 342$ (0、5); $7, 067$ (2、6); $5, 449$ (0、7); $4, 054$ (1、4); $3, 893$ (0、3); $3, 441$ (0、7); $3, 375$ (0、6); $3, 241$ (1、1); $3, 154$ (3、0); $3, 070$ (0、6); $2, 886$ (0、9); $2, 876$ (1、9); $2, 867$ (2、7); $2, 858$ (3、9); $2, 849$ (3、9); $2, 840$ (2、7); $2, 831$ (1、9); $2, 821$ (0、7); $2, 600$ (0、3); $2, 590$ (0、4); $2, 531$ (0、4); $2, 470$ (3、6); $2, 465$ (5、0); $2, 460$ (3、7); $2, 432$ (0、3); $2, 425$ (0、4); $2, 394$ (0、4); $2, 368$ (0、5); $2, 359$ (0、5); $2, 329$ (0、6); $2, 316$ (0、6); $2, 289$ (0、8); $2, 261$ (1、3); $2, 257$ (1、3); $2, 255$ (1、3); $2, 243$ (1、9); $2, 178$ (1072, 5); $2, 127$ (0、9); $2, 121$ (1、9); $2, 114$ (3、1); $2, 108$ (4、0); $2, 102$ (2、8); $2, 096$ (1、6); $2, 087$ (0、7); $2, 057$ (0、4); $2, 036$ (0、7); $2, 017$ (1、1); $1, 998$ (1、2); $1, 965$ (20、6); $1, 959$ (52、5); $1, 953$ (270、7); $1, 947$ (487、5); $1, 941$ (651、6); $1, 935$ (450、7); $1, 929$ (234、0); $1, 782$ (1、4); $1, 775$ (2、7); $1, 769$ (3、6); $1, 763$ (2、5); $1, 757$ (1、3); $1, 711$ (2、4); $1, 384$ (0、4); $1, 380$ (0、8); $1, 269$ (16、0); $0, 897$ (0、7); $0, 881$ (1、8); $0, 864$ (0、9); $0, 808$ (2、2); $0, 795$ (6、8); $0, 790$ (8、9); $0, 778$ (9、1); $0, 772$ (6、9); $0, 760$ (3、0); $0, 738$ (0、4); $0, 721$ (0、4); $0, 661$ (0、4); $0, 651$ (0、4); $0, 621$ (3、0); $0, 609$ (8、1); $0, 603$ (8、3); $0, 599$ (7、4); $0, 594$ (7、1); $0, 581$ (2、1); $0, 543$ (0、5); $0, 390$ (0、4); $0, 385$ (0、5); $0, 146$ (8、5); $0, 085$ (0、4); $0, 078$ (0、5); $0, 065$ (0、5); $0, 008$ (68、5); $0, 000$ (1708, 3); $-0, 009$ (75、1); $-0, 049$ (0、5); $-0, 058$ (0、4); $-0, 150$ (8、4)

実施例 I-T3-161: ^1H -NMR (400, 0MHz、 CD_3CN):

$\delta = 8, 626$ (2、2); $8, 153$ (1、1); $8, 140$ (16、0); $8, 100$ (13、1); $7, 994$ (7、6); $7, 949$ (7、7); $7, 629$ (9、

3); 7, 624 (11、5); 7, 596 (6、2); 7, 591 (4、8); 7, 585 (2、3); 7, 575 (7、4); 7, 570 (6、0); 7, 488 (0、5); 7, 467 (0、4); 7, 436 (11、0); 7, 415 (8、4); 4, 085 (1、8); 4, 068 (5、5); 4, 050 (5、6); 4, 032 (1、9); 3, 435 (0、7); 3, 425 (1、5); 3, 416 (1、9); 3, 407 (3、0); 3, 394 (2、9); 3, 383 (1、8); 3, 376 (1、3); 3, 365 (0、6); 3, 033 (0、5); 2, 905 (0、4); 2, 683 (0、6); 2, 665 (0、6); 2, 467 (0、8); 2, 143 (2313, 8); 2, 117 (49、9); 2, 108 (11、0); 2, 101 (6、8); 2, 095 (3、7); 1, 972 (32、2); 1, 964 (49、2); 1, 958 (118、9); 1, 953 (611、9); 1, 946 (1099, 9); 1, 940 (1474, 5); 1, 934 (1019, 6); 1, 928 (525、2); 1, 781 (2、8); 1, 775 (5、7); 1, 769 (7、9); 1, 762 (5、4); 1, 756 (2、4); 1, 437 (7、6); 1, 270 (1、1); 1, 222 (6、5); 1, 204 (13、0); 1, 186 (6、4); 0, 951 (2、0); 0, 939 (6、4); 0, 934 (8、6); 0, 921 (8、9); 0, 915 (6、5); 0, 902 (2、8); 0, 881 (0、8); 0, 863 (0、6); 0, 821 (0、5); 0, 811 (0、4); 0, 782 (2、8); 0, 770 (7、8); 0, 764 (8、1); 0, 760 (6、9); 0, 754 (6、8); 0, 741 (1、9); 0, 192 (0、4); 0, 146 (19、2); 0, 087 (1、0); 0, 063 (1、5); 0, 008 (155、4); 0, 000 (3971, 4); -0, 009 (173、7); -0, 068 (0、4); -0, 150 (18、8)

10

20

实施例 I-T3-162: ^1H -NMR (400, 0MHz、CD₃CN):

δ =8, 194 (6、9); 8, 179 (6、7); 7, 972 (3、4); 7, 759 (3、0); 7, 688 (3、5); 7, 682 (4、6); 7, 655 (2、4); 7, 650 (1、8); 7, 635 (2、7); 7, 629 (2、4); 7, 477 (4、3); 7, 456 (3、4); 6, 951 (1、1); 2, 872 (0、7); 2, 862 (1、1); 2, 854 (1、6); 2, 844 (1、6); 2, 835 (1、1); 2, 826 (0、8); 2, 471 (0、3); 2, 466 (0、5); 2, 461 (0、3); 2, 180 (199、2); 2, 134 (0、5); 2, 115 (0、5); 2, 109 (0、6); 2, 102 (0、4); 1, 965 (2、7); 1, 959 (6、7); 1, 953 (37、6); 1, 947 (69、0); 1, 941 (93、6); 1, 935 (65、6); 1, 929 (34、4); 1, 776 (0、4); 1, 770 (0、5); 1, 763 (0、4); 1, 437 (16、0); 1, 269 (0、4); 0, 795 (0、9); 0, 782 (2、6); 0, 777 (3、6); 0, 765 (3、7); 0, 759 (2、8); 0, 747 (1、2); 0, 612 (1、2); 0, 601 (3、

30

40

3); 0, 595 (3、4); 0, 591 (3、1); 0, 586 (3、0); 0, 573 (0、9); 0, 146 (1、5); 0, 008 (10、7); 0, 000 (294、5); -0, 150 (1、5)

実施例 I-T3-163: ^1H -NMR (400, 0MHz、 CD_3CN):

$\delta=8, 205$ (4、0); $8, 190$ (4、1); $7, 973$ (2、2); $7, 760$ (2、0); $7, 736$ (2、0); $7, 731$ (2、6); $7, 704$ (1、2); $7, 700$ (1、0); $7, 684$ (1、4); $7, 679$ (1、2); $7, 600$ (0、8); $7, 509$ (2、3); $7, 488$ (1、9); $2, 161$ (116、4); $2, 121$ (0、5); $2, 114$ (0、5); $2, 108$ (0、6); $2, 102$ (0、4); $1, 963$ (2、5); $1, 952$ (29、4); $1, 946$ (52、9); $1, 941$ (70、8); $1, 934$ (50、0); $1, 928$ (26、6); $1, 769$ (0、4); $1, 598$ (1、0); $1, 583$ (2、9); $1, 576$ (2、8); $1, 563$ (1、3); $1, 436$ (16、0); $1, 362$ (1、3); $1, 348$ (2、9); $1, 341$ (3、0); $1, 327$ (1、0); $1, 269$ (0、5); $0, 145$ (1、2); $0, 000$ (226、5); -0, 150 (1、2)

実施例 I-T3-164: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):

$\delta=9, 460$ (5、0); $8, 854$ (7、4); $8, 671$ (4、0); $8, 651$ (4、0); $8, 535$ (7、4); $7, 846$ (1、3); $7, 840$ (3、0); $7, 833$ (4、3); $7, 827$ (5、4); $7, 824$ (4、4); $7, 818$ (1、5); $7, 594$ (4、1); $7, 584$ (0、8); $7, 582$ (0、8); $7, 572$ (3、6); $4, 056$ (1、2); $4, 038$ (3、7); $4, 020$ (3、7); $4, 002$ (1、3); $3, 934$ (1、6); $3, 329$ (39、1); $2, 671$ (0、4); $2, 525$ (1、1); $2, 507$ (42、6); $2, 502$ (56、3); $2, 498$ (42、6); $2, 329$ (0、4); $1, 989$ (16、0); $1, 619$ (1、7); $1, 605$ (4、3); $1, 598$ (4、6); $1, 585$ (1、9); $1, 397$ (5、6); $1, 295$ (2、0); $1, 281$ (4、2); $1, 275$ (4、5); $1, 260$ (1、6); $1, 193$ (4、2); $1, 175$ (8、4); $1, 157$ (4、1); $1, 069$ (10、8); $0, 008$ (1、8); $0, 000$ (48、4); -0, 008 (2、3)

実施例 I-T3-165: ^1H -NMR (400, 0MHz、 CD_3CN):

$\delta=8, 748$ (1、7); $8, 742$ (1、8); $8, 353$ (1、5); $8, 243$ (2、8); $8, 228$ (2、4); $8, 116$ (1、9); $8, 110$ (2、1); $8, 101$ (1、5); $7, 706$ (0、5); $3, 236$ (0、9); $3, 070$ (0、4); $2, 883$ (0、4); $2, 284$ (0、3); $2, 154$ (118、3); $2, 120$ (0、8); $2, 114$ (0、9); $2, 108$ (0、9); $2, 102$ (0、7); $2, 095$ (0、4); $1, 972$ (0、7); $1, 965$ (3、4); $1, 95$

8 (8、8); 1, 953 (47、0); 1, 946 (85、3); 1, 940 (11
4、8); 1, 934 (80、1); 1, 928 (41、8); 1, 775 (0、5);
1, 769 (0、7); 1, 763 (0、5); 1, 612 (0、8); 1, 597 (2、
0); 1, 591 (2、0); 1, 577 (1、0); 1, 437 (16、0); 1, 3
70 (1、0); 1, 356 (2、0); 1, 349 (2、1); 1, 334 (0、8);
1, 269 (0、9); 0, 146 (1、9); 0, 008 (15、7); 0, 000
(390、9); -0, 009 (19、9); -0, 150 (2、0)

10

実施例 I-T3-166: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):
 δ =9, 440 (11、8); 9, 127 (15、9); 8, 569 (7、7); 8,
491 (16、0); 8, 318 (2、5); 7, 965 (7、6); 7, 961 (7、
7); 7, 926 (7、5); 7, 921 (12、0); 7, 912 (6、7); 7, 9
06 (3、4); 7, 891 (6、2); 7, 885 (4、8); 7, 573 (10、
1); 7, 553 (9、2); 3, 459 (0、4); 3, 399 (0、7); 3, 36
5 (1、8); 3, 331 (1516, 7); 3, 298 (1、6); 2, 701 (0、
4); 2, 694 (0、3); 2, 676 (6、5); 2, 671 (9、1); 2, 66
7 (6、9); 2, 638 (0、4); 2, 576 (1、1); 2, 529 (53、9);
2, 520 (35、9); 2, 511 (509、9); 2, 507 (1041, 8);
2, 502 (1375, 8); 2, 498 (1016, 8); 2, 417 (0、5);
2, 351 (0、6); 2, 334 (6、6); 2, 329 (9、1); 2, 325 (6、
8); 2, 302 (0、3); 1, 621 (3、9); 1, 607 (9、8); 1, 60
0 (10、6); 1, 587 (4、4); 1, 547 (0、4); 1, 348 (0、4);
1, 307 (4、5); 1, 294 (9、7); 1, 287 (10、6); 1, 273
(3、7); 1, 237 (0、4); 0, 146 (3、4); 0, 024 (0、3); 0,
008 (24、7); 0, 000 (766、8); -0, 008 (29、5); -0,
032 (0、8); -0, 150 (3、5)

20

30

実施例 I-T3-167: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):
 δ =9, 440 (6、2); 9, 103 (8、3); 9, 094 (0、8); 8, 58
7 (4、2); 8, 479 (8、5); 8, 317 (1、1); 8, 021 (4、5);
7, 917 (3、9); 7, 911 (6、2); 7, 903 (3、6); 7, 898 (1、
8); 7, 882 (3、2); 7, 877 (2、5); 7, 597 (0、4); 7, 57
4 (5、4); 7, 554 (4、7); 3, 329 (494、7); 3, 110 (1、
9); 3, 092 (6、3); 3, 074 (6、4); 3, 056 (2、0); 2, 87
1 (0、3); 2, 676 (3、0); 2, 671 (4、2); 2, 667 (3、1);
2, 524 (9、6); 2, 507 (478、6); 2, 502 (637、0); 2,
498 (477、3); 2, 408 (0、8); 2, 333 (2、9); 2, 329 (4、
1); 2, 325 (3、1); 1, 621 (2、0); 1, 607 (5、2); 1, 60

40

0 (5、6); 1, 587 (2、3); 1, 306 (2、4); 1, 293 (5、3);
1, 286 (5、7); 1, 272 (2、1); 1, 261 (0、6); 1, 235 (7、
6); 1, 217 (16、0); 1, 199 (7、1); 0, 146 (1、6); 0, 0
08 (11、5); 0, 000 (362、6); -0, 008 (14、5); -0, 0
26 (0、6); -0, 150 (1、6)

実施例 I-T3-168: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):
 δ =8, 917 (4、0); 8, 676 (2、2); 8, 612 (2、2); 8, 55
4 (1、4); 8, 543 (1、4); 8, 439 (4、1); 7, 783 (0、8);
7, 777 (1、6); 7, 770 (2、3); 7, 764 (3、0); 7, 539 (2、
1); 7, 527 (0、4); 7, 517 (1、8); 4, 038 (0、4); 4, 02
0 (0、4); 3, 936 (2、3); 3, 333 (40、9); 2, 864 (0、4);
2, 854 (0、6); 2, 846 (0、8); 2, 836 (0、8); 2, 827 (0、
6); 2, 818 (0、4); 2, 507 (26、6); 2, 503 (34、6); 2,
498 (26、4); 1, 989 (1、7); 1, 296 (0、7); 1, 193 (0、
5); 1, 175 (0、9); 1, 157 (0、5); 1, 069 (16、0); 0, 7
33 (0、5); 0, 720 (1、6); 0, 716 (2、1); 0, 703 (2、0);
0, 698 (1、8); 0, 686 (0、7); 0, 566 (0、7); 0, 555 (2、
1); 0, 549 (2、0); 0, 540 (1、8); 0, 527 (0、6); 0, 00
0 (11、0)

実施例 I-T3-169: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):
 δ =9, 461 (11、1); 9, 416 (0、4); 8, 936 (15、7); 8,
681 (8、8); 8, 616 (8、7); 8, 450 (16、0); 7, 833 (1
1、0); 7, 827 (9、7); 7, 820 (7、2); 7, 652 (0、3); 7,
589 (8、1); 7, 578 (1、9); 7, 567 (7、0); 7, 556 (0、
5); 4, 038 (0、8); 4, 020 (0、8); 3, 937 (0、6); 3, 33
3 (133、2); 2, 672 (0、7); 2, 503 (110、4); 2, 330 (0、
7); 1, 989 (3、2); 1, 622 (3、6); 1, 607 (9、7); 1, 60
1 (10、5); 1, 587 (4、3); 1, 563 (0、4); 1, 556 (0、4);
1, 547 (0、5); 1, 334 (0、4); 1, 314 (0、5); 1, 300 (4、
8); 1, 294 (5、2); 1, 281 (9、9); 1, 274 (10、4); 1, 2
59 (3、7); 1, 235 (0、6); 1, 193 (0、9); 1, 175 (1、7);
1, 157 (0、9); 1, 069 (3、7); 0, 000 (35、7)

実施例 I-T3-170: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):
 δ =9, 441 (1、5); 9, 436 (2、4); 8, 694 (1、7); 8, 61
9 (3、2); 8, 443 (1、7); 8, 398 (3、2); 8, 274 (2、8);
7, 960 (1、6); 7, 956 (1、6); 7, 810 (0、9); 7, 804 (2、

10

20

30

40

1); 7, 797 (2、3); 7, 792 (2、9); 7, 787 (3、1); 7, 782 (0、9); 7, 742 (1、6); 7, 739 (1、6); 7, 569 (1、0); 7, 557 (2、1); 7, 546 (1、3); 7, 535 (1、8); 4, 056 (1、2); 4, 038 (3、6); 4, 020 (3、7); 4, 002 (1、2); 3, 332 (35、6); 3, 116 (0、7); 3, 097 (2、3); 3, 079 (2、4); 3, 061 (0、7); 2, 525 (0、5); 2, 512 (10、5); 2, 507 (21、4); 2, 503 (28、1); 2, 498 (20、5); 2, 494 (9、9); 1, 990 (16、0); 1, 615 (1、1); 1, 601 (2、8); 1, 594 (2、9); 1, 581 (1、3); 1, 289 (1、3); 1, 276 (2、8); 1, 269 (3、0); 1, 255 (1、1); 1, 208 (2、7); 1, 193 (5、6); 1, 190 (6、2); 1, 175 (9、2); 1, 157 (4、2); 0, 000 (3、5)

10

実施例 I-T3-171: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):
 $\delta=9, 443$ (12、6); 9, 162 (16、0); 8, 676 (8、2); 8, 530 (16、0); 8, 412 (7、8); 8, 317 (4、0); 7, 937 (8、0); 7, 932 (12、0); 7, 921 (6、8); 7, 915 (3、8); 7, 900 (6、4); 7, 895 (5、0); 7, 716 (0、4); 7, 584 (10、3); 7, 563 (9、1); 4, 358 (2、5); 4, 332 (7、5); 4, 306 (7、8); 4, 280 (2、7); 4, 104 (0、5); 4, 079 (0、4); 3, 496 (0、5); 3, 480 (0、4); 3, 466 (0、5); 3, 452 (0、4); 3, 396 (0、8); 3, 329 (1554, 1); 3, 287 (1、0); 2, 676 (8、0); 2, 671 (11、1); 2, 667 (8、6); 2, 645 (0、6); 2, 525 (28、7); 2, 511 (614、7); 2, 507 (1266, 3); 2, 502 (1687, 1); 2, 498 (1264, 4); 2, 389 (0、6); 2, 380 (0、6); 2, 333 (7、8); 2, 329 (11、0); 2, 325 (8、3); 2, 256 (0、4); 2, 075 (1、4); 1, 623 (4、0); 1, 608 (10、0); 1, 601 (10、8); 1, 588 (4、6); 1, 548 (0、5); 1, 347 (0、4); 1, 306 (4、7); 1, 293 (10、0); 1, 286 (10、8); 1, 272 (3、9); 1, 234 (0、7); 0, 146 (0、5); 0, 017 (0、4); 0, 008 (3、6); 0, 000 (115、1); -0, 008 (5、1); -0, 150 (0、6)

20

30

実施例 I-T3-172: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):
 $\delta=8, 613$ (0、3); 8, 596 (8、4); 8, 529 (2、9); 8, 518 (3、0); 8, 492 (0、7); 8, 381 (8、5); 8, 333 (0、6); 7, 956 (4、4); 7, 953 (4、4); 7, 749 (2、3); 7, 743 (4、8); 7, 739 (5、0); 7, 725 (13、2); 7, 507 (4、3); 7, 4

40

88 (2、3); 7, 485 (3、1); 4, 055 (1、2); 4, 038 (3、6);
 4, 020 (3、7); 4, 002 (1、2); 3, 329 (51、5); 3, 112
 (1、9); 3, 094 (6、1); 3, 076 (6、1); 3, 057 (2、0); 3,
 048 (0、4); 3, 029 (0、9); 3, 011 (0、9); 2, 856 (0、
 8); 2, 847 (1、1); 2, 838 (1、8); 2, 828 (1、8); 2, 81
 9 (1、1); 2, 809 (0、9); 2, 676 (0、4); 2, 671 (0、5);
 2, 667 (0、4); 2, 524 (1、3); 2, 511 (30、4); 2, 507
 (60、9); 2, 502 (79、7); 2, 498 (58、7); 2, 494 (29、
 4); 2, 333 (0、4); 2, 329 (0、5); 2, 324 (0、4); 1, 98
 9 (16、0); 1, 235 (0、4); 1, 207 (6、8); 1, 192 (7、1);
 1, 189 (14、7); 1, 175 (10、4); 1, 170 (7、2); 1, 15
 7 (4、7); 1, 068 (0、4); 0, 727 (1、1); 0, 714 (3、3);
 0, 709 (4、6); 0, 697 (4、3); 0, 691 (3、7); 0, 680 (1、
 5); 0, 563 (1、5); 0, 552 (4、6); 0, 546 (4、3); 0, 53
 6 (3、8); 0, 524 (1、1); 0, 008 (2、2); 0, 000 (61、3);
 -0, 008 (2、4)

10

20

実施例 I-T3-173: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):
 δ =8, 653 (6、0); 8, 567 (3、1); 8, 561 (3、2); 8, 40
 1 (5、7); 8, 091 (10、1); 8, 013 (3、1); 8, 007 (3、2);
 7, 957 (0、4); 6, 579 (0、7); 5, 409 (0、3); 3, 923 (1
 6、0); 3, 592 (0、3); 3, 367 (923、7); 2, 985 (14、3);
 2, 767 (0、4); 2, 740 (1、3); 2, 725 (0、9); 2, 704 (1、
 4); 2, 674 (0、9); 2, 509 (96、0); 2, 505 (123、6); 2,
 501 (91、6); 2, 332 (0、8); 2, 074 (1、6); 1, 271 (0、
 8); 1, 169 (5、1); 0, 467 (4、6); 0, 450 (2、4); 0, 00
 8 (1、4); 0, 000 (28、9)

30

実施例 I-T3-174: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):
 δ =8, 835 (7、5); 8, 672 (3、0); 8, 669 (4、0); 8, 65
 0 (3、9); 8, 649 (3、9); 8, 645 (2、9); 8, 556 (2、5);
 8, 545 (2、5); 8, 525 (7、6); 7, 787 (1、7); 7, 781 (2、
 9); 7, 766 (4、0); 7, 763 (11、3); 7, 546 (3、2); 7, 5
 42 (1、7); 7, 527 (1、5); 7, 524 (2、8); 4, 056 (1、2);
 4, 038 (3、6); 4, 020 (3、7); 4, 002 (1、2); 3, 329 (5
 9、6); 2, 865 (0、7); 2, 856 (0、9); 2, 847 (1、4); 2,
 836 (1、5); 2, 828 (0、9); 2, 818 (0、7); 2, 671 (0、
 4); 2, 525 (1、0); 2, 520 (1、6); 2, 511 (21、0); 2, 5

40

07 (42、8); 2, 502 (56、7); 2, 498 (41、2); 2, 493 (19、8); 2, 329 (0、4); 1, 989 (16、0); 1, 193 (4、3); 1, 175 (8、7); 1, 157 (4、2); 0, 733 (1、0); 0, 720 (2、7); 0, 715 (3、8); 0, 703 (3、5); 0, 697 (2、9); 0, 686 (1、3); 0, 566 (1、3); 0, 555 (3、7); 0, 549 (3、3); 0, 545 (3、1); 0, 540 (3、0); 0, 527 (0、9); 0, 008 (1、4); 0, 000 (40、4); -0, 009 (1、3)

10

実施例 I-T3-175: $^1\text{H-NMR}$ (400, 0MHz、 CD_3CN):

$\delta=8, 146$ (3、1); 8, 082 (4、8); 7, 714 (1、6); 7, 697 (2、0); 7, 692 (2、5); 7, 663 (1、3); 7, 658 (1、0); 7, 642 (1、5); 7, 637 (1、3); 7, 472 (2、3); 7, 451 (1、8); 6, 931 (0、6); 2, 873 (0、4); 2, 864 (0、6); 2, 855 (0、9); 2, 845 (0、9); 2, 837 (0、6); 2, 827 (0、4); 2, 165 (79、0); 2, 115 (0、4); 2, 108 (0、5); 2, 102 (0、3); 1, 965 (1、5); 1, 959 (4、0); 1, 953 (28、1); 1, 947 (52、6); 1, 941 (72、5); 1, 935 (50、5); 1, 929 (26、2); 1, 769 (0、4); 1, 437 (16、0); 0, 796 (0、5); 0, 783 (1、5); 0, 778 (2、0); 0, 765 (2、0); 0, 760 (1、5); 0, 748 (0、7); 0, 613 (0、6); 0, 601 (1、7); 0, 595 (1、8); 0, 591 (1、6); 0, 586 (1、6); 0, 574 (0、5); 0, 000 (0、6)

20

実施例 I-T3-176: $^1\text{H-NMR}$ (400, 0MHz、 CD_3CN):

$\delta=19, 983$ (0、4); 8, 920 (0、7); 8, 270 (0、3); 8, 158 (11、0); 8, 124 (0、4); 8, 095 (11、8); 8, 083 (6、1); 8, 035 (0、7); 7, 746 (6、2); 7, 741 (7、8); 7, 713 (9、2); 7, 692 (4、8); 7, 686 (4、4); 7, 669 (3、3); 7, 590 (0、6); 7, 505 (6、9); 7, 484 (5、7); 3, 901 (3、1); 2, 470 (2、5); 2, 466 (3、4); 2, 461 (2、6); 2, 417 (1、0); 2, 179 (1701、9); 2, 153 (39、9); 2, 121 (2、8); 2, 115 (3、6); 2, 109 (4、3); 2, 103 (3、2); 2, 096 (1、9); 2, 034 (0、5); 1, 965 (12、0); 1, 954 (216、5); 1, 947 (401、4); 1, 941 (546、5); 1, 935 (384、1); 1, 929 (201、2); 1, 782 (1、6); 1, 776 (2、6); 1, 770 (3、4); 1, 764 (2、5); 1, 599 (3、1); 1, 584 (8、5); 1, 577 (8、4); 1, 564 (4、1); 1, 524 (0、7); 1, 437 (16、0); 1, 401 (0、7); 1, 362 (3、9); 1, 349 (8、6);

30

40

1, 342 (8、8); 1, 327 (3、1); 1, 268 (2、7); 0, 882 (0、4); 0, 000 (4、2)

実施例 I-T3-177: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):
 $\delta=9, 462$ (7、5); $8, 855$ (1、9); $8, 790$ (8、8); $8, 673$ (1、1); $8, 653$ (1、1); $8, 536$ (1、9); $8, 483$ (8、9);
 $8, 391$ (4、5); $8, 388$ (4、6); $8, 105$ (4、5); $8, 102$ (4、5); $7, 846$ (0、5); $7, 840$ (1、0); $7, 833$ (2、8); $7, 827$ (5、2); $7, 820$ (5、9); $7, 814$ (7、0); $7, 810$ (5、4);
 $7, 804$ (1、9); $7, 595$ (1、3); $7, 586$ (5、5); $7, 573$ (1、8); $7, 564$ (4、6); $4, 055$ (0、5); $4, 038$ (1、4); $4, 020$ (1、4); $4, 002$ (0、5); $3, 331$ (91、4); $3, 168$ (2、0);
 $3, 150$ (6、5); $3, 131$ (6、6); $3, 113$ (2、0); $2, 676$ (0、5); $2, 672$ (0、7); $2, 667$ (0、5); $2, 525$ (1、8); $2, 511$ (39、2); $2, 507$ (78、6); $2, 502$ (103、0); $2, 498$ (76、1); $2, 494$ (38、1); $2, 334$ (0、5); $2, 329$ (0、7); $2, 325$ (0、5); $1, 989$ (6、1); $1, 619$ (2、5); $1, 604$ (6、3); $1, 598$ (6、8); $1, 585$ (2、8); $1, 397$ (5、9); $1, 293$ (2、9); $1, 279$ (6、3); $1, 273$ (6、7); $1, 258$ (2、4);
 $1, 203$ (7、5); $1, 193$ (2、5); $1, 184$ (16、0); $1, 175$ (4、1); $1, 166$ (7、2); $1, 157$ (2、0); $1, 069$ (0、5); $0, 008$ (2、2); $0, 000$ (62、2); $-0, 008$ (2、5)

実施例 I-T3-178: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):
 $\delta=8, 730$ (5、4); $8, 726$ (5、4); $8, 701$ (10、4); $8, 556$ (3、7); $8, 545$ (3、7); $8, 483$ (0、5); $8, 463$ (10、3); $8, 318$ (0、6); $8, 268$ (5、5); $8, 264$ (5、4); $7, 760$ (2、4); $7, 754$ (3、8); $7, 736$ (14、8); $7, 524$ (4、5);
 $7, 505$ (2、3); $7, 502$ (3、8); $4, 055$ (1、2); $4, 037$ (3、6); $4, 020$ (3、7); $4, 002$ (1、2); $3, 460$ (1、7); $3, 442$ (5、0); $3, 424$ (5、0); $3, 405$ (1、7); $3, 329$ (124、3); $2, 868$ (0、4); $2, 858$ (1、0); $2, 848$ (1、4); $2, 840$ (2、2); $2, 830$ (2、2); $2, 821$ (1、4); $2, 811$ (1、0);
 $2, 802$ (0、4); $2, 675$ (1、1); $2, 671$ (1、5); $2, 667$ (1、2); $2, 541$ (6、3); $2, 506$ (175、4); $2, 502$ (223、8); $2, 498$ (167、1); $2, 333$ (1、1); $2, 329$ (1、4); $2, 324$ (1、1); $1, 989$ (15、7); $1, 235$ (0、4); $1, 193$ (4、2); $1, 175$ (8、3); $1, 157$ (5、1); $1, 150$ (7、5); $1, 132$ (1

10

20

30

40

6、0); 1, 113 (7、2); 0, 728 (1、4); 0, 715 (4、2); 0, 710 (5、5); 0, 698 (5、2); 0, 692 (4、4); 0, 681 (1、7); 0, 561 (1、8); 0, 551 (5、6); 0, 545 (5、4); 0, 535 (4、6); 0, 523 (1、3); 0, 146 (0、4); 0, 000 (94、7); -0, 008 (4、3); -0, 150 (0、4)

実施例 I-T3-179: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):

$\delta=8, 862$ (9、5); $8, 701$ (0、4); $8, 548$ (3、2); $8, 537$ (3、2); $8, 504$ (0、4); $8, 487$ (10、0); $8, 482$ (5、1); $8, 477$ (4、7); $8, 463$ (0、4); $8, 317$ (1、4); $8, 095$ (4、8); $8, 091$ (4、8); $7, 769$ (2、1); $7, 764$ (3、9); $7, 753$ (5、3); $7, 748$ (11、5); $7, 736$ (0、7); $7, 540$ (5、3); $7, 533$ (1、3); $7, 524$ (1、3); $7, 517$ (4、5); $4, 055$ (1、0); $4, 037$ (3、2); $4, 020$ (3、2); $4, 002$ (1、1); $3, 507$ (0、3); $3, 443$ (0、4); $3, 424$ (0、4); $3, 396$ (0、5); $3, 373$ (0、8); $3, 332$ (779、0); $3, 293$ (0、7); $3, 061$ (0、5); $3, 042$ (1、8); $3, 024$ (2、1); $3, 008$ (2、2); $2, 995$ (0、5); $2, 990$ (2、0); $2, 971$ (0、6); $2, 870$ (0、4); $2, 860$ (0、9); $2, 850$ (1、3); $2, 842$ (2、0); $2, 831$ (2、1); $2, 822$ (1、3); $2, 813$ (1、0); $2, 803$ (0、4); $2, 680$ (1、3); $2, 676$ (2、7); $2, 671$ (3、7); $2, 667$ (2、8); $2, 584$ (1、0); $2, 565$ (2、6); $2, 547$ (3、3); $2, 542$ (5、6); $2, 525$ (10、0); $2, 520$ (15、4); $2, 511$ (205、0); $2, 507$ (417、5); $2, 502$ (550、6); $2, 498$ (403、5); $2, 493$ (198、2); $2, 333$ (2、6); $2, 329$ (3、6); $2, 325$ (2、7); $1, 989$ (13、8); $1, 298$ (0、3); $1, 259$ (0、5); $1, 235$ (0、9); $1, 193$ (3、9); $1, 175$ (7、6); $1, 157$ (3、8); $1, 132$ (0、6); $1, 047$ (7、2); $1, 029$ (16、0); $1, 010$ (6、9); $0, 733$ (1、3); $0, 720$ (3、5); $0, 715$ (5、2); $0, 703$ (4、7); $0, 697$ (4、1); $0, 685$ (1、7); $0, 563$ (1、7); $0, 552$ (5、0); $0, 546$ (4、7); $0, 542$ (4、4); $0, 536$ (4、2); $0, 524$ (1、3); $0, 146$ (1、1); $0, 008$ (8、8); $0, 000$ (281、7); $-0, 009$ (10、6); $-0, 150$ (1、1)

実施例 I-T3-180: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):

$\delta=9, 105$ (5、5); $9, 100$ (4、5); $8, 889$ (0、7); $8, 871$ (9、2); $8, 581$ (4、6); $8, 570$ (6、0); $8, 564$ (6、8);

10

20

30

40

8, 559 (5、5); 8, 545 (9、1); 8, 317 (0、9); 7, 817 (0、3); 7, 812 (0、3); 7, 774 (3、3); 7, 768 (4、2); 7, 755 (7、5); 7, 751 (13、2); 7, 553 (4、7); 7, 548 (2、1); 7, 535 (2、4); 7, 530 (3、5); 4, 055 (0、8); 4, 037 (2、1); 4, 020 (2、1); 4, 002 (0、7); 3, 559 (2、3); 3, 541 (6、5); 3, 523 (6、4); 3, 504 (2、1); 3, 334 (39、2); 3, 328 (131、0); 2, 866 (1、3); 2, 856 (1、8); 2, 847 (2、5); 2, 837 (2、3); 2, 829 (1、5); 2, 819 (1、0); 2, 809 (0、4); 2, 676 (2、3); 2, 671 (2、5); 2, 667 (1、8); 2, 621 (0、4); 2, 507 (343、0); 2, 502 (380、1); 2, 498 (256、9); 2, 333 (2、1); 2, 329 (2、4); 2, 324 (1、6); 1, 995 (2、3); 1, 989 (8、7); 1, 298 (0、4); 1, 258 (0、6); 1, 249 (0、7); 1, 236 (1、2); 1, 193 (3、8); 1, 181 (8、8); 1, 175 (7、3); 1, 163 (16、0); 1, 157 (4、7); 1, 144 (6、8); 1, 114 (0、6); 0, 731 (1、9); 0, 719 (5、2); 0, 714 (5、7); 0, 702 (5、8); 0, 696 (4、2); 0, 684 (1、6); 0, 593 (0、3); 0, 563 (2、7); 0, 553 (6、7); 0, 547 (6、1); 0, 538 (4、5); 0, 525 (1、3); 0, 006 (15、8); 0, 000 (61、8); -0, 008 (2、7)

実施例 I-T3-181: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):
 δ =9, 108 (0、4); 9, 087 (10、3); 8, 892 (5、1); 8, 888 (5、2); 8, 613 (0、4); 8, 591 (10、7); 8, 579 (3、8); 8, 568 (3、7); 8, 407 (5、3); 8, 403 (5、3); 7, 787 (2、0); 7, 781 (4、5); 7, 775 (6、6); 7, 769 (7、7); 7, 765 (6、0); 7, 759 (2、3); 7, 575 (6、0); 7, 564 (1、5); 7, 552 (5、0); 4, 056 (1、1); 4, 038 (3、4); 4, 020 (3、4); 4, 002 (1、2); 3, 330 (39、4); 3, 101 (0、5); 3, 083 (1、8); 3, 065 (2、2); 3, 049 (2、3); 3, 031 (2、1); 3, 012 (0、6); 2, 879 (0、4); 2, 869 (1、0); 2, 860 (1、4); 2, 851 (2、1); 2, 841 (2、1); 2, 833 (1、4); 2, 823 (1、0); 2, 813 (0、4); 2, 676 (0、5); 2, 672 (0、6); 2, 667 (0、5); 2, 601 (0、7); 2, 583 (2、1); 2, 564 (2、5); 2, 549 (2、3); 2, 530 (2、5); 2, 525 (2、1); 2, 507 (69、4); 2, 503 (90、4); 2, 498 (68、1); 2, 334 (0、4); 2, 329 (0、6); 2, 325 (0、4); 1, 989 (14、7); 1, 193 (3、9); 1, 175 (7、7); 1, 158 (3、8); 1, 08

1 (0、4); 1, 067 (7、5); 1, 048 (16、0); 1, 030 (7、2);
0, 738 (1、3); 0, 725 (4、0); 0, 720 (5、5); 0, 708 (5、
1); 0, 702 (4、4); 0, 691 (1、8); 0, 566 (1、8); 0, 55
5 (5、4); 0, 549 (5、2); 0, 539 (4、6); 0, 527 (1、3);
0, 008 (0、6); 0, 000 (16、1)

実施例 I-T3-182: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):
 δ =9, 454 (7、2); 8, 884 (10、2); 8, 500 (10、2); 8,
482 (4、9); 8, 478 (5、0); 8, 317 (0、4); 8, 098 (5、
0); 8, 093 (5、0); 7, 829 (1、5); 7, 823 (5、9); 7, 82
1 (7、8); 7, 815 (6、3); 7, 807 (4、8); 7, 801 (2、4);
7, 588 (5、9); 7, 579 (1、0); 7, 574 (1、0); 7, 566 (5、
1); 4, 056 (1、2); 4, 038 (3、6); 4, 020 (3、6); 4, 00
2 (1、2); 3, 329 (62、1); 3, 069 (0、5); 3, 051 (1、8);
3, 032 (2、1); 3, 017 (2、3); 2, 998 (2、1); 2, 980 (0、
6); 2, 676 (0、6); 2, 672 (0、8); 2, 667 (0、6); 2, 59
4 (0、6); 2, 575 (2、1); 2, 557 (2、5); 2, 541 (2、4);
2, 523 (3、8); 2, 520 (3、9); 2, 511 (46、1); 2, 507
(93、1); 2, 503 (122、1); 2, 498 (89、1); 2, 494 (4
4、0); 2, 334 (0、6); 2, 329 (0、8); 2, 325 (0、6); 1,
989 (15、8); 1, 622 (2、4); 1, 607 (5、9); 1, 601 (6、
4); 1, 588 (2、7); 1, 290 (2、8); 1, 276 (5、9); 1, 27
0 (6、4); 1, 255 (2、4); 1, 235 (0、5); 1, 193 (4、2);
1, 175 (8、3); 1, 157 (4、1); 1, 134 (0、3); 1, 051 (7、
3); 1, 033 (16、0); 1, 014 (7、1); 0, 008 (0、8); 0, 0
00 (23、6); -0, 008 (0、9)

実施例 I-T3-183: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):
 δ =9, 464 (4、6); 8, 733 (3、3); 8, 729 (3、6); 8, 72
3 (6、9); 8, 477 (6、6); 8, 270 (3、3); 8, 266 (3、3);
7, 820 (1、3); 7, 814 (3、0); 7, 808 (4、3); 7, 803 (4、
8); 7, 798 (3、7); 7, 792 (1、4); 7, 573 (4、0); 7, 56
2 (0、9); 7, 551 (3、4); 4, 055 (1、2); 4, 038 (3、6);
4, 020 (3、7); 4, 002 (1、2); 3, 465 (0、9); 3, 447 (2、
9); 3, 429 (3、0); 3, 410 (1、0); 3, 329 (48、5); 2, 6
76 (0、4); 2, 671 (0、6); 2, 667 (0、5); 2, 525 (1、6);
2, 511 (35、4); 2, 507 (71、4); 2, 502 (93、1); 2, 4
98 (68、1); 2, 494 (33、4); 2, 333 (0、4); 2, 329 (0、

10

20

30

40

6); 2, 325 (0、4); 1, 989 (16、0); 1, 614 (1、6); 1, 600 (3、9); 1, 593 (4、1); 1, 580 (1、7); 1, 290 (1、9); 1, 277 (4、0); 1, 270 (4、3); 1, 256 (1、6); 1, 235 (0、5); 1, 193 (4、4); 1, 175 (8、8); 1, 157 (4、9); 1, 152 (5、1); 1, 134 (10、7); 1, 115 (4、8); 0, 008 (0、6); 0, 000 (19、6); -0, 009 (0、7)

実施例 I-T3-184: ^1H -NMR (400, 0MHz、CD₃CN):

δ =8, 222 (1、1); 8, 212 (14、6); 8, 193 (0、9); 8, 163 (0、7); 8, 151 (14、2); 8, 150 (13、6); 7, 984 (5、6); 7, 968 (5、6); 7, 937 (0、6); 7, 860 (0、5); 7, 837 (0、5); 7, 699 (8、7); 7, 694 (11、4); 7, 666 (5、9); 7, 660 (4、9); 7, 645 (6、7); 7, 639 (6、1); 7, 588 (0、8); 7, 523 (0、3); 7, 480 (10、7); 7, 459 (8、5); 6, 928 (2、6); 5, 448 (5、4); 2, 881 (0、7); 2, 871 (1、9); 2, 862 (2、7); 2, 853 (4、3); 2, 844 (4、3); 2, 835 (2、8); 2, 825 (2、1); 2, 816 (0、7); 2, 474 (0、9); 2, 469 (1、8); 2, 464 (2、4); 2, 460 (1、9); 2, 455 (1、0); 2, 293 (0、4); 2, 270 (0、7); 2, 266 (0、7); 2, 246 (1、0); 2, 227 (1、0); 2, 160 (875、2); 2, 121 (3、1); 2, 114 (4、2); 2, 108 (5、3); 2, 102 (3、8); 2, 096 (2、1); 2, 036 (0、6); 2, 018 (0、8); 1, 998 (0、9); 1, 965 (19、7); 1, 959 (49、7); 1, 953 (311、9); 1, 947 (575、9); 1, 941 (786、4); 1, 935 (548、9); 1, 929 (287、9); 1, 883 (0、6); 1, 782 (1、8); 1, 775 (3、4); 1, 769 (4、7); 1, 763 (3、2); 1, 757 (1、8); 1, 525 (0、4); 1, 385 (0、3); 1, 372 (0、5); 1, 359 (0、4); 1, 340 (1、4); 1, 335 (0、8); 1, 285 (2、9); 1, 270 (16、0); 1, 204 (0、3); 0, 918 (0、4); 0, 899 (0、9); 0, 882 (2、1); 0, 864 (1、1); 0, 832 (0、4); 0, 795 (2、4); 0, 783 (7、1); 0, 777 (9、7); 0, 765 (9、8); 0, 760 (7、5); 0, 747 (3、3); 0, 726 (0、5); 0, 708 (0、5); 0, 652 (0、5); 0, 643 (0、5); 0, 627 (0、4); 0, 613 (3、3); 0, 601 (8、2); 0, 595 (8、8); 0, 591 (7、8); 0, 586 (7、8); 0, 573 (2、3); 0, 536 (0、3); 0, 520 (0、4); 0, 478 (0、3); 0, 392 (0、4); 0, 387 (0、4); 0, 008 (0、7); 0, 000 (20、9); -0, 009 (1、0)

10

20

30

40

実施例 I-T3-185: ^1H -NMR (400, 0MHz, CD_3CN):

$\delta = 17, 517$ (0、4); $15, 219$ (0、3); $14, 973$ (0、3); $13, 920$ (0、3); $8, 404$ (0、4); $8, 394$ (0、4); $8, 224$ (16、0); $8, 208$ (0、8); $8, 165$ (12、9); $7, 986$ (5、2); $7, 970$ (5、1); $7, 938$ (1、2); $7, 864$ (0、5); $7, 840$ (0、4); $7, 747$ (7、8); $7, 741$ (10、5); $7, 715$ (5、2); $7, 710$ (4、3); $7, 694$ (6、0); $7, 689$ (5、7); $7, 654$ (3、5); $7, 624$ (1、2); $7, 601$ (2、1); $7, 594$ (1、3); $7, 590$ (2、0); $7, 564$ (1、9); $7, 541$ (1、1); $7, 513$ (9、5); $7, 492$ (7、5); $7, 292$ (0、7); $7, 282$ (0、4); $7, 270$ (0、7); $7, 201$ (0、4); $7, 176$ (1、6); $7, 168$ (0、4); $7, 151$ (0、4); $7, 064$ (0、5); $7, 045$ (0、4); $6, 914$ (0、4); $6, 892$ (0、4); $6, 881$ (0、8); $6, 859$ (0、6); $6, 178$ (0、3); $6, 160$ (0、4); $6, 111$ (0、4); $6, 099$ (0、4); $6, 067$ (0、4); $6, 042$ (0、4); $6, 038$ (0、4); $6, 017$ (0、4); $5, 640$ (0、4); $5, 594$ (0、3); $5, 540$ (0、3); $5, 516$ (0、4); $5, 485$ (0、4); $5, 427$ (0、3); $5, 373$ (0、3); $4, 507$ (0、6); $4, 491$ (0、6); $4, 068$ (1、3); $4, 050$ (1、1); $4, 032$ (0、5); $3, 789$ (0、5); $3, 776$ (1、0); $3, 758$ (2、9); $3, 656$ (0、4); $3, 149$ (0、4); $3, 128$ (0、4); $2, 720$ (13、7); $2, 656$ (0、5); $2, 492$ (0、9); $2, 475$ (2、8); $2, 470$ (6、1); $2, 465$ (9、0); $2, 461$ (6、7); $2, 456$ (3、4); $2, 285$ (0、4); $2, 264$ (0、7); $2, 247$ (1、5); $2, 237$ (1、1); $2, 171$ (2483、4); $2, 121$ (7、1); $2, 114$ (9、5); $2, 108$ (11、9); $2, 102$ (8、8); $2, 096$ (5、2); $2, 075$ (1、8); $2, 032$ (0、9); $2, 020$ (0、7); $2, 011$ (0、6); $1, 972$ (8、4); $1, 965$ (39、5); $1, 959$ (102、1); $1, 953$ (642、3); $1, 947$ (1199、8); $1, 941$ (1645、9); $1, 935$ (1167、9); $1, 929$ (619、1); $1, 818$ (1、3); $1, 782$ (4、2); $1, 775$ (7、5); $1, 769$ (10、3); $1, 763$ (7、4); $1, 757$ (4、5); $1, 722$ (0、9); $1, 708$ (0、9); $1, 696$ (0、9); $1, 688$ (0、9); $1, 674$ (0、7); $1, 638$ (0、8); $1, 597$ (4、8); $1, 583$ (11、6); $1, 576$ (12、0); $1, 562$ (6、3); $1, 543$ (0、8); $1, 522$ (1、2); $1, 501$ (0、6); $1, 472$ (0、6); $1, 437$ (9、0); $1, 402$ (1、2); $1, 361$ (6、2); $1, 348$ (11、9); $1, 341$ (12、8); $1, 327$ (7、6); $1,$

10

20

30

40

3 1 1 (3、5); 1, 2 6 9 (8、7); 1, 2 2 2 (1、9); 1, 2 0 4 (3、2); 1, 1 8 6 (1、7); 1, 1 6 4 (0、6); 1, 1 5 4 (0、6); 1, 1 4 5 (0、5); 1, 1 3 1 (0、6); 1, 1 0 9 (0、6); 1, 0 9 5 (0、6); 1, 0 9 1 (0、6); 1, 0 4 7 (0、5); 1, 0 4 0 (0、4); 1, 0 3 1 (0、4); 1, 0 0 9 (0、4); 0, 9 8 7 (0、4); 0, 9 7 6 (0、4); 0, 9 5 2 (0、4); 0, 9 4 5 (0、5); 0, 8 9 7 (0、8); 0, 8 8 1 (1、6); 0, 8 5 5 (1、3); 0, 8 3 8 (0、9); 0, 8 2 4 (0、5); 0, 8 0 6 (0、5); 0, 7 9 7 (0、4); 0, 7 7 6 (0、4); 0, 7 6 6 (0、5); 0, 7 3 9 (0、4); 0, 6 3 6 (0、3); 0, 5 2 6 (0、3); 0, 1 4 7 (0、4); 0, 0 0 8 (2、5); 0, 0 0 0 (80、2); -0, 0 2 0 (0、5); -0, 1 2 1 (0、3); -0, 1 4 9 (0、4); -0, 2 1 3 (0、4); -2, 4 7 8 (0、3); -3, 0 1 7 (0、3)

10

実施例 I - T 3 - 1 8 6 : ^1H -NMR (400, 0MHz、 CD_3CN):
 δ = 8, 2 0 2 (8、0); 8, 1 9 0 (8、4); 7, 9 2 7 (0、7); 7, 8 5 8 (4、8); 7, 7 3 1 (2、7); 7, 7 0 8 (2、9); 7, 6 9 0 (4、8); 7, 6 8 5 (6、1); 7, 6 5 7 (2、8); 7, 6 5 2 (2、5); 7, 6 3 7 (3、4); 7, 6 3 2 (3、2); 7, 5 9 0 (0、8); 7, 4 7 7 (5、0); 7, 4 5 6 (4、0); 6, 9 8 4 (0、3); 6, 9 5 1 (1、9); 6, 0 4 1 (0、3); 5, 5 2 1 (0、4); 5, 4 9 1 (0、4); 5, 4 6 6 (0、3); 3, 8 7 4 (0、9); 3, 0 5 6 (0、3); 2, 8 9 0 (4、6); 2, 8 7 2 (1、0); 2, 8 6 3 (1、5); 2, 8 5 3 (2、1); 2, 8 4 4 (2、2); 2, 8 3 5 (1、7); 2, 8 2 5 (1、1); 2, 7 9 9 (0、4); 2, 7 7 2 (4、2); 2, 7 1 1 (0、4); 2, 6 8 4 (0、4); 2, 6 7 1 (0、4); 2, 6 6 2 (0、4); 2, 6 1 9 (0、4); 2, 6 0 1 (1、1); 2, 5 8 3 (0、4); 2, 5 4 3 (0、5); 2, 5 2 2 (0、5); 2, 5 0 5 (0、6); 2, 4 6 6 (6、3); 2, 3 5 1 (0、9); 2, 3 1 0 (1、3); 2, 2 9 8 (1、3); 2, 1 7 9 (2377, 2); 2, 1 2 1 (5、6); 2, 1 1 5 (6、3); 2, 1 0 8 (7、1); 2, 1 0 2 (5、6); 2, 0 4 3 (0、8); 2, 0 1 8 (1、0); 1, 9 5 3 (344、9); 1, 9 4 7 (623、4); 1, 9 4 1 (840、7); 1, 9 3 5 (641、3); 1, 9 2 9 (374、2); 1, 8 2 7 (0、6); 1, 7 8 1 (2、1); 1, 7 7 6 (3、6); 1, 7 7 0 (4、8); 1, 7 6 3 (3、6); 1, 7 5 8 (2、2); 1, 4 3 7 (16、0); 1, 3 1 1 (0、4); 1, 2 8 3 (0、5); 1, 2 6 8 (0、9); 0, 7 9 4 (1、2); 0, 7 7 7 (5、1); 0, 7 6 4 (5、1); 0, 7 4 7 (1、8); 0, 7 3 8 (0、4); 0, 6 1 2 (1、5); 0, 6 0 0 (4、9); 0, 5 9 4 (5、3); 0, 5 8 6 (4、9); 0, 5 7 3 (1、5); 0, 0 0 0 (28、5)

20

30

40

実施例 I - T 3 - 1 8 7 : ^1H -NMR (400, 0MHz、 CD_3CN):

$\delta = 19, 987 (0, 6); 8, 214 (12, 6); 8, 200 (13, 9); 7, 859 (6, 8); 7, 738 (9, 0); 7, 733 (14, 7); 7, 707 (9, 2); 7, 701 (5, 6); 7, 686 (6, 6); 7, 680 (5, 9); 7, 610 (3, 2); 7, 587 (1, 7); 7, 510 (9, 9); 7, 489 (8, 2); 7, 448 (0, 5); 2, 469 (1, 8); 2, 464 (2, 6); 2, 459 (2, 0); 2, 157 (1156, 2); 2, 120 (5, 2); 2, 114 (6, 3); 2, 108 (7, 5); 2, 102 (5, 6); 2, 096 (3, 3); 1, 965 (26, 5); 1, 959 (71, 5); 1, 953 (401, 8); 1, 947 (750, 3); 1, 941 (1019, 6); 1, 935 (723, 9); 1, 928 (383, 2); 1, 781 (2, 7); 1, 775 (4, 6); 1, 769 (6, 2); 1, 763 (4, 5); 1, 757 (2, 6); 1, 634 (0, 6); 1, 597 (4, 4); 1, 583 (11, 2); 1, 576 (11, 2); 1, 563 (6, 0); 1, 523 (1, 0); 1, 437 (16, 0); 1, 401 (1, 1); 1, 361 (6, 0); 1, 347 (11, 3); 1, 341 (12, 0); 1, 326 (4, 9); 1, 270 (8, 5); 0, 882 (2, 0); 0, 857 (2, 2); 0, 000 (34, 6)$

10

20

实施例 I-T3-188: $^1\text{H-NMR}$ (400, 0MHz, CD_3CN):

$\delta = 8, 340 (9, 9); 8, 272 (16, 0); 8, 192 (0, 3); 7, 761 (9, 7); 7, 755 (12, 3); 7, 742 (0, 4); 7, 737 (0, 3); 7, 727 (6, 7); 7, 721 (5, 0); 7, 706 (7, 8); 7, 700 (6, 5); 7, 569 (4, 5); 7, 524 (11, 5); 7, 503 (9, 3); 5, 447 (0, 8); 2, 576 (0, 8); 2, 572 (0, 8); 2, 250 (0, 4); 2, 139 (89, 4); 2, 120 (0, 7); 2, 114 (0, 7); 2, 108 (0, 9); 2, 102 (0, 6); 2, 095 (0, 3); 1, 965 (3, 2); 1, 959 (8, 4); 1, 953 (52, 4); 1, 947 (96, 8); 1, 940 (132, 2); 1, 934 (91, 5); 1, 928 (47, 5); 1, 781 (0, 3); 1, 775 (0, 6); 1, 769 (0, 8); 1, 763 (0, 6); 1, 604 (5, 0); 1, 590 (12, 7); 1, 583 (12, 8); 1, 569 (6, 7); 1, 529 (0, 9); 1, 406 (0, 8); 1, 366 (6, 8); 1, 352 (12, 5); 1, 346 (13, 2); 1, 331 (5, 3); 1, 309 (0, 5); 1, 293 (0, 9); 1, 285 (1, 5); 1, 269 (7, 2); 0, 898 (0, 3); 0, 881 (0, 9); 0, 864 (0, 4); 0, 000 (3, 9)$

30

40

实施例 I-T3-189: $^1\text{H-NMR}$ (400, 0MHz, CD_3CN):

$\delta = 8, 726 (0, 3); 8, 720 (0, 4); 8, 701 (10, 1); 8, 694 (10, 3); 8, 265 (0, 8); 8, 253 (16, 0); 8, 246 (15, 9); 8, 062 (0, 6); 8, 051 (11, 3); 8, 045 (11, 1); 7, 978 (7, 4); 7, 766 (6, 5); 7, 051 (2, 2); 5, 449 (0,$

6); 4, 068 (0、4); 4, 050 (0、4); 3, 024 (0、4); 2, 888 (0、6); 2, 878 (1、7); 2, 869 (2、5); 2, 860 (3、8); 2, 851 (3、8); 2, 842 (2、5); 2, 833 (1、8); 2, 823 (0、6); 2, 729 (0、6); 2, 473 (0、5); 2, 468 (0、9); 2, 464 (1、2); 2, 459 (0、9); 2, 454 (0、5); 2, 166 (234、9); 2, 121 (0、8); 2, 114 (1、2); 2, 108 (1、5); 2, 102 (1、1); 2, 096 (0、6); 2, 087 (0、5); 2, 035 (0、4); 2, 017 (0、7); 1, 998 (0、6); 1, 972 (2、6); 1, 965 (5、7); 1, 959 (13、8); 1, 953 (85、4); 1, 947 (157、6); 1, 941 (215、5); 1, 935 (150、1); 1, 928 (78、1); 1, 782 (0、5); 1, 775 (0、9); 1, 769 (1、3); 1, 763 (0、9); 1, 757 (0、5); 1, 437 (3、4); 1, 308 (0、3); 1, 268 (8、7); 1, 222 (0、6); 1, 204 (1、0); 1, 186 (0、5); 0, 898 (0、4); 0, 881 (1、1); 0, 864 (0、5); 0, 810 (2、1); 0, 797 (6、2); 0, 792 (8、4); 0, 779 (8、6); 0, 774 (6、4); 0, 762 (2、8); 0, 740 (0、4); 0, 722 (0、4); 0, 662 (0、3); 0, 652 (0、4); 0, 622 (2、8); 0, 610 (7、3); 0, 604 (7、7); 0, 600 (6、9); 0, 595 (6、8); 0, 582 (2、1); 0, 543 (0、4); 0, 391 (0、3); 0, 386 (0、3); 0, 008 (1、2); 0, 000 (38、3); -0, 009 (1、6)

10

20

実施例 I-T3-190: $^1\text{H-NMR}$ (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):
 $\delta=9, 487$ (7、1); 9, 105 (5、1); 9, 102 (5、1); 8, 887 (9、5); 8, 557 (11、6); 8, 317 (0、4); 7, 826 (4、4); 7, 820 (6、3); 7, 815 (6、9); 7, 810 (5、3); 7, 602 (5、1); 7, 591 (1、5); 7, 580 (4、2); 4, 055 (1、3); 4, 038 (3、8); 4, 020 (3、8); 4, 002 (1、3); 3, 560 (1、9); 3, 542 (6、2); 3, 523 (6、3); 3, 505 (2、1); 3, 328 (157、1); 2, 671 (1、6); 2, 506 (190、5); 2, 502 (243、8); 2, 329 (1、7); 1, 989 (16、0); 1, 617 (2、3); 1, 602 (6、1); 1, 596 (6、6); 1, 583 (2、7); 1, 296 (2、7); 1, 282 (6、2); 1, 276 (6、6); 1, 261 (2、3); 1, 193 (4、5); 1, 181 (7、3); 1, 175 (10、1); 1, 163 (14、9); 1, 158 (7、2); 1, 145 (6、8); 0, 000 (25、1)

30

40

実施例 I-T3-191: $^1\text{H-NMR}$ (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):
 $\delta=9, 426$ (3、3); 8, 594 (4、6); 8, 359 (4、8); 8, 317 (0、5); 7, 785 (4、0); 7, 779 (2、8); 7, 770 (2、1);

7, 765 (1、1); 7, 545 (2、7); 7, 537 (0、6); 7, 530 (0、5); 7, 522 (2、3); 7, 351 (6、5); 3, 331 (366、6); 3, 015 (2、0); 2, 997 (6、6); 2, 979 (6、7); 2, 960 (2、1); 2, 676 (1、1); 2, 671 (1、6); 2, 667 (1、2); 2, 524 (4、4); 2, 511 (86、9); 2, 507 (177、3); 2, 502 (236、3); 2, 498 (176、3); 2, 493 (90、0); 2, 333 (1、1); 2, 329 (1、5); 2, 324 (1、2); 1, 611 (1、1); 1, 597 (2、7); 1, 590 (2、9); 1, 577 (1、2); 1, 398 (15、1); 1, 285 (1、3); 1, 271 (2、7); 1, 264 (2、9); 1, 250 (1、1); 1, 195 (7、5); 1, 177 (16、0); 1, 158 (7、3); 0, 146 (1、7); 0, 008 (13、5); 0, 000 (371、8); -0, 008 (16、5); -0, 150 (1、7)

10

実施例 I-T3-192: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):
 $\delta=9, 435$ (6、5); $8, 687$ (9、2); $8, 408$ (9、3); $8, 317$ (1、5); $7, 796$ (4、7); $7, 787$ (4、3); $7, 780$ (6、0); $7, 775$ (6、7); $7, 770$ (5、2); $7, 764$ (2、0); $7, 559$ (5、8); $7, 548$ (5、4); $7, 537$ (5、3); $3, 330$ (735、7); $3, 123$ (0、7); $3, 082$ (1、9); $3, 063$ (6、4); $3, 045$ (6、6); $3, 027$ (2、0); $2, 838$ (0、6); $2, 676$ (2、8); $2, 671$ (4、1); $2, 667$ (3、1); $2, 525$ (10、0); $2, 520$ (15、7); $2, 511$ (220、9); $2, 507$ (459、4); $2, 502$ (612、6); $2, 498$ (450、6); $2, 493$ (223、7); $2, 333$ (2、9); $2, 329$ (4、0); $2, 324$ (3、0); $1, 614$ (2、1); $1, 600$ (5、3); $1, 593$ (5、7); $1, 580$ (2、4); $1, 284$ (2、5); $1, 271$ (5、3); $1, 264$ (5、7); $1, 250$ (2、1); $1, 205$ (7、5); $1, 187$ (16、0); $1, 168$ (7、5); $0, 146$ (1、8); $0, 008$ (13、1); $0, 000$ (404、0); -0, 009 (15、5); -0, 150 (1、8)

20

30

実施例 I-T3-193: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):
 $\delta=9, 458$ (0、3); $8, 777$ (8、3); $8, 542$ (3、2); $8, 531$ (3、0); $8, 504$ (0、3); $8, 462$ (8、6); $8, 337$ (3、7); $8, 317$ (1、8); $7, 962$ (3、6); $7, 750$ (2、0); $7, 745$ (3、2); $7, 738$ (1、0); $7, 726$ (12、9); $7, 717$ (1、1); $7, 710$ (1、7); $7, 692$ (1、1); $7, 659$ (1、1); $7, 653$ (0、9); $7, 569$ (1、2); $7, 548$ (1、0); $7, 529$ (3、7); $7, 526$ (2、4); $7, 510$ (2、0); $7, 507$ (3、2); $7, 484$ (1、3); $7, 46$

40

5 (0、8); 7, 420 (0、5); 7, 402 (0、6); 7, 058 (1、6);
 6, 924 (3、7); 6, 789 (1、9); 4, 055 (1、2); 4, 037 (3、
 6); 4, 020 (3、6); 4, 002 (1、2); 3, 328 (98、6); 3, 3
 05 (0、8); 2, 858 (0、9); 2, 849 (1、2); 2, 840 (1、9);
 2, 830 (1、9); 2, 821 (1、3); 2, 812 (0、9); 2, 801 (0、
 4); 2, 676 (1、1); 2, 671 (1、6); 2, 667 (1、2); 2, 66
 2 (0、6); 2, 524 (3、6); 2, 511 (83、9); 2, 507 (175、
 0); 2, 502 (233、7); 2, 498 (171、2); 2, 493 (84、1);
 2, 338 (0、5); 2, 333 (1、1); 2, 329 (1、5); 2, 324 (1、
 1); 1, 989 (16、0); 1, 234 (0、8); 1, 193 (4、2); 1, 1
 75 (8、4); 1, 157 (4、2); 0, 729 (1、2); 0, 716 (3、5);
 0, 711 (4、9); 0, 699 (4、5); 0, 693 (4、0); 0, 682 (1、
 6); 0, 568 (0、4); 0, 559 (1、8); 0, 549 (5、1); 0, 54
 3 (4、5); 0, 534 (3、7); 0, 522 (1、2); 0, 146 (0、4);
 0, 008 (2、5); 0, 000 (83、8); -0, 009 (3、2); -0, 1
 50 (0、4)

10

20

実施例 I-T3-194: ^1H -NMR (400, 0MHz, CD_3CN):

δ =8, 349 (9、1); 8, 304 (0、4); 8, 286 (14、8); 8, 2
 41 (0、3); 7, 801 (9、7); 7, 795 (11、3); 7, 718 (6、
 0); 7, 712 (5、6); 7, 697 (7、3); 7, 692 (6、9); 7, 66
 5 (0、5); 7, 647 (0、7); 7, 643 (0、7); 7, 635 (0、5);
 7, 617 (0、6); 7, 614 (0、7); 7, 584 (1、1); 7, 541 (0、
 6); 7, 522 (11、4); 7, 501 (9、2); 7, 484 (0、5); 7, 4
 53 (4、1); 7, 422 (0、4); 7, 236 (0、4); 7, 215 (0、3);
 6, 837 (0、5); 6, 673 (0、4); 6, 617 (1、3); 6, 575 (0、
 4); 5, 973 (0、3); 5, 954 (0、3); 5, 896 (1、4); 5, 44
 7 (5、8); 3, 817 (0、8); 3, 769 (0、4); 3, 550 (1、0);
 3, 545 (0、9); 2, 579 (0、4); 2, 575 (0、5); 2, 269 (0、
 4); 2, 253 (0、5); 2, 140 (512、8); 2, 120 (7、2); 2,
 114 (6、9); 2, 108 (7、9); 2, 102 (5、5); 2, 095 (3、
 1); 1, 965 (25、3); 1, 959 (63、5); 1, 953 (411、4);
 1, 947 (768、8); 1, 940 (1065、1); 1, 934 (761、0);
 1, 928 (406、5); 1, 849 (1、2); 1, 799 (0、7); 1, 78
 1 (2、8); 1, 775 (4、8); 1, 769 (6、7); 1, 763 (4、7);
 1, 756 (2、7); 1, 728 (0、5); 1, 714 (0、5); 1, 699 (0、
 5); 1, 677 (0、4); 1, 666 (0、5); 1, 649 (0、4); 1, 62

30

40

8 (0、4); 1, 580 (0、4); 1, 570 (0、4); 1, 556 (0、4);
 1, 515 (0、6); 1, 477 (5、4); 1, 466 (14、4); 1, 457
 (16、0); 1, 447 (6、5); 1, 407 (0、7); 1, 398 (0、5);
 1, 386 (0、8); 1, 366 (0、5); 1, 340 (6、0); 1, 305 (1、
 0); 1, 285 (8、1); 1, 270 (5、0); 1, 247 (0、7); 1, 23
 0 (0、5); 1, 217 (0、6); 1, 199 (0、5); 1, 190 (0、6);
 1, 185 (0、7); 1, 145 (6、1); 1, 135 (15、7); 1, 126
 (14、8); 1, 115 (5、4); 1, 076 (0、6); 1, 063 (0、4);
 0, 994 (0、4); 0, 976 (0、8); 0, 958 (0、5); 0, 951 (0、
 4); 0, 930 (0、4); 0, 923 (0、4); 0, 882 (1、1); 0, 85
 6 (0、9); 0, 842 (0、7); 0, 783 (0、4); 0, 771 (0、4);
 0, 764 (0、5); 0, 735 (0、4); 0, 597 (0、3); 0, 564 (0、
 4); 0, 008 (1、0); 0, 000 (32、8)

10

実施例 I-T3-195: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):
 δ =9, 457 (8、1); 8, 920 (11、3); 8, 511 (11、3); 8,
 325 (5、6); 8, 319 (6、1); 8, 030 (5、3); 7, 802 (8、
 5); 7, 797 (7、4); 7, 789 (5、4); 7, 784 (3、0); 7, 59
 1 (6、0); 7, 582 (1、3); 7, 569 (5、0); 4, 037 (0、6);
 4, 019 (0、6); 3, 329 (278、3); 3, 090 (0、5); 3, 07
 1 (1、9); 3, 053 (2、4); 3, 037 (2、5); 3, 019 (2、1);
 3, 000 (0、7); 2, 675 (3、1); 2, 671 (4、3); 2, 667 (3、
 5); 2, 597 (0、4); 2, 506 (494、1); 2, 502 (653、4);
 2, 498 (511、0); 2, 470 (6、8); 2, 452 (3、7); 2, 43
 4 (2、4); 2, 416 (1、0); 2, 333 (3、0); 2, 329 (4、1);
 2, 325 (3、3); 1, 989 (2、4); 1, 621 (2、6); 1, 607 (6、
 7); 1, 600 (7、6); 1, 587 (3、1); 1, 397 (1、3); 1, 33
 5 (0、4); 1, 327 (0、3); 1, 297 (0、8); 1, 286 (3、2);
 1, 273 (7、0); 1, 266 (7、6); 1, 252 (3、2); 1, 235 (5、
 1); 1, 193 (0、7); 1, 175 (1、3); 1, 157 (0、7); 1, 10
 7 (0、4); 0, 982 (7、4); 0, 964 (16、0); 0, 945 (7、3);
 0, 854 (0、5); 0, 835 (0、3); 0, 000 (20、8)

20

30

実施例 I-T3-196: ^1H -NMR (601, 6MHz、 CD_3CN):
 δ =8, 223 (0、5); 8, 218 (0、5); 8, 045 (0、3); 8, 04
 1 (0、3); 2, 621 (0、7); 2, 150 (4、8); 1, 948 (1、3);
 1, 944 (2、2); 1, 940 (3、2); 1, 936 (2、2); 1, 932 (1、
 1); 1, 135 (16、0); 0, 000 (0、9)

40

実施例 I-T3-197: ^1H -NMR (601, 6MHz、 CD_3CN):
 $\delta=8,765$ (7、5); $8,761$ (7、5); $8,2493$ (9、5); $8,2486$ (9、9); $8,230$ (8、0); $8,115$ (8、0); $8,111$ (8、0); $8,038$ (4、4); $7,992$ (4、5); $7,394$ (1、5); $3,844$ (16、0); $3,552$ (11、2); $3,542$ (11、1); $3,312$ (0、7); $3,303$ (0、7); $2,172$ (78、0); $2,155$ (28、3); $2,088$ (0、6); $2,084$ (0、8); $2,080$ (0、6); $1,998$ (2、0); $1,989$ (5、4); $1,985$ (7、5); $1,982$ (52、9); $1,977$ (98、7); $1,973$ (145、4); $1,969$ (98、4); $1,965$ (48、4); $1,956$ (0、7); $1,863$ (0、5); $1,859$ (0、8); $1,854$ (0、6); $1,312$ (2、7); $1,303$ (8、1); $1,299$ (8、0); $1,291$ (3、5); $1,266$ (0、4); $1,192$ (0、4); $1,166$ (3、5); $1,158$ (7、9); $1,154$ (7、9); $1,146$ (2、6)

10

実施例 I-T3-198: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):
 $\delta=9,484$ (3、8); $9,467$ (0、6); $8,776$ (0、9); $8,753$ (5、3); $8,574$ (0、6); $8,561$ (8、6); $8,509$ (5、3); $8,491$ (0、8); $8,317$ (1、8); $8,178$ (0、4); $7,782$ (7、1); $7,778$ (3、2); $7,765$ (2、2); $7,759$ (1、3); $7,579$ (2、8); $7,557$ (2、4); $4,049$ (0、4); $3,497$ (0、3); $3,479$ (0、7); $3,461$ (0、7); $3,413$ (1、0); $3,395$ (1、5); $3,377$ (1、6); $3,329$ (582、9); $3,287$ (1、0); $2,676$ (4、0); $2,671$ (5、5); $2,667$ (4、1); $2,524$ (14、3); $2,507$ (629、0); $2,502$ (826、7); $2,498$ (606、0); $2,333$ (3、8); $2,329$ (5、2); $2,324$ (3、9); $1,614$ (1、3); $1,600$ (3、4); $1,593$ (3、7); $1,580$ (1、5); $1,289$ (1、5); $1,276$ (3、3); $1,269$ (3、6); $1,255$ (1、3); $1,237$ (0、4); $1,150$ (0、4); $1,126$ (0、7); $1,108$ (8、3); $1,089$ (16、0); $1,071$ (7、0); $0,008$ (0、5); $0,000$ (18、9); $-0,008$ (0、7)

20

30

実施例 I-T3-199: ^1H -NMR (400, 1MHz、 d_6 -DMSO):
 $\delta=8,86$ (0,0328); $8,85$ (0,0664); $8,56$ (0,0471); $8,51$ (0,0250); $8,18$ (0,0290); $8,17$ (0,0298); $8,09$ (0,0245); $3,47$ (0,0401); $3,45$ (0,0407); $3,31$ (0,7767); $2,54$ (0,3233); $2,50$ (0,3250); $2,50$ (0,4400); $2,50$ (0,3578); $1,25$ (0,0306); $1,25$ (0,0369); $1,15$ (0,0210); $1,14$ (0,0347);

40

1, 13 (0, 0321); 0, 00 (1, 0000)	
实施例 I-T3-200: ^1H-NMR (400, 0MHz、CD₃CN): δ=8, 745 (8、9); 8, 739 (8、9); 8, 566 (1、6); 8, 560 (1、6); 8, 264 (13、9); 8, 256 (14、3); 8, 244 (0、7); 8, 115 (9、6); 8, 109 (9、4); 8, 056 (1、8); 8, 050 (1、7); 7, 998 (0、4); 7, 983 (7、2); 7, 980 (7、2); 7, 767 (6、3); 7, 690 (2、3); 7, 666 (0、6); 7, 587 (0、3); 5, 448 (3、1); 3, 724 (0、8); 3, 071 (0、5); 2, 882 (0、5); 2, 626 (0、7); 2, 603 (0、5); 2, 468 (0、4); 2, 463 (0、5); 2, 458 (0、4); 2, 152 (189、2); 2, 120 (1、4); 2, 114 (1、8); 2, 108 (2、1); 2, 102 (1、5); 2, 096 (0、8); 1, 965 (8、9); 1, 959 (23、8); 1, 953 (126、4); 1, 947 (227、5); 1, 941 (305、0); 1, 935 (212、6); 1, 928 (110、8); 1, 868 (0、3); 1, 781 (0、8); 1, 775 (1、4); 1, 769 (1、9); 1, 763 (1、3); 1, 757 (0、7); 1, 615 (3、9); 1, 600 (10、0); 1, 593 (10、8); 1, 580 (6、7); 1, 571 (2、5); 1, 557 (1、3); 1, 540 (0、7); 1, 410 (0、6); 1, 386 (0、4); 1, 370 (5、3); 1, 356 (10、0); 1, 350 (10、4); 1, 335 (5、3); 1, 325 (2、3); 1, 310 (1、1); 1, 297 (0、5); 1, 285 (0、7); 1, 270 (2、4); 1, 202 (0、6); 1, 134 (16、0); 0, 882 (0、4); 0, 008 (0、5); 0, 000 (15、0); -0, 008 (0、8)	10
实施例 I-T3-201: ^1H-NMR (400, 0MHz、d₆-DMSO): δ=9, 467 (2、2); 8, 775 (3、1); 8, 578 (1、5); 8, 573 (1、5); 8, 490 (3、1); 8, 177 (1、4); 7, 800 (0、6); 7, 795 (1、2); 7, 787 (1、8); 7, 782 (2、4); 7, 778 (1、9); 7, 578 (1、7); 7, 555 (1、5); 3, 498 (0、6); 3, 479 (1、9); 3, 461 (1、9); 3, 443 (0、6); 3, 330 (198、5); 2, 676 (0、7); 2, 671 (1、0); 2, 667 (0、7); 2, 524 (2、5); 2, 507 (107、2); 2, 502 (141、8); 2, 498 (106、1); 2, 333 (0、7); 2, 329 (0、9); 2, 325 (0、7); 1, 989 (0、4); 1, 614 (0、7); 1, 600 (1、8); 1, 593 (1、9); 1, 580 (0、8); 1, 398 (16、0); 1, 287 (0、8); 1, 274 (1、8); 1, 267 (2、0); 1, 253 (0、7); 1, 235 (0、3); 1, 126 (2、1); 1, 108 (4、7); 1, 089 (2、1); 0, 146 (0、9); 0, 008 (7、4); 0, 000 (188、9); -0, 008 (8、7); -	30
	40

0, 150 (0、9)	
実施例 I-T3-202: $^1\text{H-NMR}$ (400, 0MHz、$\text{d}_6\text{-DMSO}$): $\delta=9, 428$ (4、8); $8, 626$ (0、4); $8, 603$ (6、6); $8, 357$ (6、9); $8, 316$ (0、6); $7, 790$ (1、3); $7, 785$ (2、8); $7, 777$ (4、1); $7, 772$ (5、1); $7, 768$ (4、0); $7, 562$ (3、3); $7, 548$ (3、9); $7, 537$ (0、8); $7, 525$ (3、2); $7, 428$ (3、2); $3, 343$ (390、5); $2, 991$ (1、5); $2, 973$ (4、8); $2, 955$ (5、1); $2, 937$ (1、8); $2, 676$ (1、0); $2, 672$ (1、3); $2, 668$ (1、0); $2, 507$ (163、2); $2, 503$ (208、0); $2, 499$ (152、2); $2, 334$ (1、0); $2, 330$ (1、3); $2, 325$ (0、9); $2, 188$ (1、0); $2, 100$ (16、0); $2, 075$ (0、5); $1, 613$ (1、6); $1, 598$ (4、1); $1, 592$ (4、5); $1, 579$ (2、0); $1, 284$ (2、0); $1, 270$ (4、3); $1, 263$ (4、5); $1, 249$ (1、6); $1, 232$ (0、4); $1, 214$ (0、7); $1, 192$ (5、5); $1, 173$ (11、4); $1, 155$ (5、2); $0, 146$ (0、5); $0, 008$ (4、9); $0, 000$ (117、1); $-0, 008$ (4、9); $-0, 150$ (0、5)	10
実施例 I-T3-203: $^1\text{H-NMR}$ (400, 0MHz、$\text{d}_6\text{-DMSO}$): $\delta=8, 601$ (0、6); $8, 581$ (6、8); $8, 520$ (2、4); $8, 509$ (2、4); $8, 343$ (7、1); $8, 137$ (0、8); $7, 732$ (1、5); $7, 726$ (2、4); $7, 707$ (9、8); $7, 561$ (3、2); $7, 499$ (2、9); $7, 477$ (2、5); $7, 427$ (3、2); $3, 329$ (31、4); $2, 989$ (1、5); $2, 971$ (5、0); $2, 952$ (5、1); $2, 940$ (0、7); $2, 934$ (1、6); $2, 922$ (0、4); $2, 854$ (0、6); $2, 844$ (0、9); $2, 836$ (1、4); $2, 826$ (1、4); $2, 818$ (1、0); $2, 808$ (0、7); $2, 676$ (0、5); $2, 671$ (0、7); $2, 667$ (0、5); $2, 524$ (1、7); $2, 511$ (39、4); $2, 507$ (80、4); $2, 502$ (106、1); $2, 498$ (78、2); $2, 333$ (0、5); $2, 329$ (0、7); $2, 324$ (0、5); $2, 187$ (1、2); $2, 116$ (0、8); $2, 101$ (16、0); $2, 075$ (1、0); $1, 909$ (0、5); $1, 230$ (0、4); $1, 212$ (0、9); $1, 190$ (5、7); $1, 172$ (11、9); $1, 154$ (5、4); $0, 726$ (0、9); $0, 713$ (2、6); $0, 708$ (3、6); $0, 696$ (3、5); $0, 690$ (3、0); $0, 679$ (1、3); $0, 560$ (1、2); $0, 550$ (3、7); $0, 544$ (3、5); $0, 534$ (3、0); $0, 522$ (0、9); $0, 008$ (2、2); $0, 000$ (67、6); $-0, 008$ (2、8)	30 40

実施例 I-T3-204: ^1H -NMR (400, 0MHz, d_6 -DMSO):

$\delta=8,968$ (6、3); $8,871$ (0、8); $8,864$ (4、0); $8,858$ (3、7); $8,617$ (5、8); $8,558$ (2、8); $8,554$ (2、9); $8,469$ (3、0); $8,464$ (2、8); $8,379$ (3、8); $8,373$ (3、6); $8,318$ (1、3); $8,261$ (0、5); $8,255$ (0、6); $4,155$ (1、4); $3,332$ (210、2); $3,309$ (0、8); $3,036$ (16、0); $3,014$ (1、0); $2,886$ (0、9); $2,809$ (0、3); $2,798$ (0、7); $2,791$ (0、8); $2,782$ (1、3); $2,772$ (1、0); $2,762$ (3、0); $2,727$ (0、4); $2,676$ (0、8); $2,672$ (1、1); $2,667$ (0、9); $2,541$ (0、4); $2,525$ (2、7); $2,511$ (61、5); $2,507$ (127、7); $2,503$ (170、1); $2,498$ (126、6); $2,494$ (64、4); $2,334$ (0、8); $2,329$ (1、1); $2,325$ (0、9); $2,075$ (2、2); $1,169$ (0、5); $0,836$ (0、3); $0,817$ (0、4); $0,775$ (0、4); $0,608$ (0、4); $0,587$ (2、1); $0,579$ (2、6); $0,570$ (1、1); $0,562$ (0、6); $0,544$ (1、0); $0,532$ (2、1); $0,515$ (2、1); $0,496$ (0、5); $0,146$ (0、4); $0,008$ (2、9); $0,000$ (95、4); $-0,008$ (4、6); $-0,150$ (0、4)

実施例 I-T3-205: ^1H -NMR (400, 0MHz, d_6 -DMSO):

$\delta=8,991$ (0、5); $8,972$ (14、8); $8,876$ (0、4); $8,861$ (9、9); $8,855$ (10、1); $8,716$ (4、8); $8,706$ (5、3); $8,672$ (0、4); $8,661$ (0、4); $8,642$ (0、8); $8,631$ (14、8); $8,562$ (7、0); $8,557$ (7、2); $8,471$ (7、3); $8,467$ (6、8); $8,318$ (8、7); $8,264$ (0、7); $8,258$ (0、8); $8,247$ (9、6); $8,240$ (9、4); $7,948$ (0、4); $7,942$ (0、4); $7,795$ (0、4); $4,156$ (4、3); $3,329$ (163、2); $3,306$ (4、7); $2,887$ (0、6); $2,877$ (1、4); $2,867$ (2、0); $2,859$ (3、0); $2,849$ (3、2); $2,840$ (2、2); $2,830$ (1、7); $2,821$ (0、8); $2,676$ (1、6); $2,671$ (2、1); $2,667$ (1、6); $2,525$ (5、4); $2,507$ (239、7); $2,502$ (316、6); $2,498$ (235、7); $2,333$ (1、4); $2,329$ (2、0); $2,325$ (1、5); $2,076$ (16、0); $0,760$ (1、9); $0,747$ (5、6); $0,743$ (7、6); $0,730$ (7、4); $0,725$ (6、3); $0,713$ (2、8); $0,570$ (2、3); $0,559$ (7、1); $0,553$ (7、0); $0,550$ (6、7); $0,544$ (6、4); $0,532$ (2、3); $0,495$ (0、4); $0,146$ (0、8); $0,008$ (5、8); $0,000$ (1

40

7, 978 (2、3); 7, 946 (0、5); 7, 940 (0、5); 7, 766 (2、1); 3, 068 (16、0); 2, 800 (2、7); 2, 783 (0、6); 2, 776 (0、6); 2, 767 (1、1); 2, 756 (0、7); 2, 748 (0、6); 2, 465 (0、4); 2, 170 (94、3); 2, 115 (0、5); 2, 109 (0、6); 2, 102 (0、4); 1, 965 (2、7); 1, 959 (7、1); 1, 954 (39、1); 1, 947 (71、0); 1, 941 (94、9); 1, 935 (64、8); 1, 929 (33、1); 1, 776 (0、4); 1, 770 (0、5); 1, 763 (0、4); 0, 855 (0、3); 0, 789 (0、4); 0, 579 (1、4); 0, 535 (1、7); 0, 525 (1、1); 0, 518 (1、6); 0, 000 (0、5)

10

実施例 I-T3-209: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):
 δ =9, 461 (4、8); 8, 713 (6、6); 8, 448 (6、8); 8, 317 (1、4); 8, 281 (3、0); 8, 094 (3、1); 7, 800 (1、3); 7, 794 (2、8); 7, 787 (4、1); 7, 782 (5、1); 7, 778 (4、1); 7, 569 (3、8); 7, 557 (0、8); 7, 546 (3、2); 3, 393 (0、4); 3, 331 (347、0); 2, 676 (2、0); 2, 672 (2、7); 2, 667 (2、1); 2, 524 (7、4); 2, 507 (323、5); 2, 503 (427、2); 2, 498 (324、8); 2, 426 (0、4); 2, 334 (1、9); 2, 329 (2、7); 2, 325 (2、1); 2, 197 (0、8); 2, 160 (16、0); 1, 614 (1、5); 1, 600 (4、0); 1, 593 (4、4); 1, 580 (1、8); 1, 284 (1、8); 1, 270 (4、0); 1, 264 (4、4); 1, 249 (1、5); 1, 147 (0、6); 1, 079 (4、6); 1, 061 (10、1); 1, 042 (4、5); 0, 146 (0、9); 0, 008 (6、6); 0, 000 (197、0); -0, 150 (1、0)

20

30

実施例 I-T3-210: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):
 δ =8, 835 (0、4); 8, 692 (6、8); 8, 552 (2、5); 8, 540 (2、5); 8, 513 (0、5); 8, 435 (7、0); 8, 318 (0、5); 8, 278 (3、0); 8, 094 (3、0); 7, 873 (0、4); 7, 742 (1、5); 7, 736 (2、5); 7, 718 (10、2); 7, 520 (3、0); 7, 502 (1、5); 7, 498 (2、5); 3, 357 (1、0); 3, 329 (76、1); 3, 304 (1、0); 2, 857 (0、6); 2, 847 (0、9); 2, 839 (1、4); 2, 829 (1、4); 2, 820 (0、9); 2, 811 (0、7); 2, 676 (0、8); 2, 671 (1、1); 2, 667 (0、9); 2, 524 (3、0); 2, 511 (66、6); 2, 507 (135、2); 2, 502 (178、3); 2, 498 (130、4); 2, 493 (64、6); 2, 333 (0、9); 2, 329 (1、2); 2, 324 (0、9); 2, 193 (1、1); 2, 159 (16、

40

0); 2, 075 (0、6); 1, 153 (0、3); 1, 135 (0、7); 1, 078 (4、8); 1, 060 (10、5); 1, 041 (4、6); 0, 727 (0、9); 0, 714 (2、6); 0, 709 (3、6); 0, 697 (3、5); 0, 691 (3、0); 0, 680 (1、3); 0, 559 (1、2); 0, 548 (3、6); 0, 542 (3、3); 0, 539 (3、1); 0, 533 (3、0); 0, 521 (0、9); 0, 146 (0、4); 0, 008 (3、0); 0, 000 (92、3); -0, 008 (3、7); -0, 150 (0、4)

10

実施例 I-T3-211: $^1\text{H-NMR}$ (400, 0MHz、 $\text{d}_6\text{-DMSO}$):
 $\delta=8, 641$ (0、5); $8, 541$ (0、8); $8, 530$ (3、2); $8, 524$ (3、1); $8, 504$ (5、0); $8, 495$ (0、7); $8, 385$ (0、5); $8, 318$ (1、5); $8, 288$ (5、2); $8, 280$ (0、8); $7, 971$ (3、1); $7, 965$ (3、0); $7, 943$ (0、5); $7, 803$ (0、8); $7, 532$ (2、9); $7, 375$ (2、7); $7, 322$ (0、3); $7, 209$ (0、3); $4, 421$ (0、8); $4, 404$ (2、1); $4, 386$ (2、3); $4, 369$ (1、0); $4, 240$ (1、1); $4, 224$ (3、6); $4, 206$ (3、6); $4, 189$ (1、2); $4, 179$ (0、5); $4, 162$ (0、4); $3, 741$ (0、4); $3, 727$ (0、4); $3, 328$ (176、8); $3, 027$ (0、8); $2, 985$ (16、0); $2, 886$ (0、8); $2, 775$ (0、5); $2, 762$ (1、0); $2, 748$ (1、4); $2, 734$ (1、2); $2, 717$ (2、0); $2, 676$ (2、7); $2, 671$ (3、8); $2, 667$ (2、8); $2, 524$ (10、0); $2, 510$ (212、4); $2, 507$ (426、0); $2, 502$ (559、5); $2, 498$ (412、6); $2, 456$ (0、7); $2, 333$ (2、6); $2, 329$ (3、5); $2, 324$ (2、7); $2, 075$ (1、5); $1, 361$ (0、8); $1, 344$ (1、7); $1, 329$ (5、1); $1, 312$ (10、0); $1, 294$ (5、0); $1, 282$ (0、6); $1, 229$ (0、6); $1, 213$ (4、5); $1, 196$ (8、4); $1, 178$ (4、2); $1, 160$ (0、4); $1, 147$ (0、4); $0, 788$ (0、3); $0, 779$ (0、4); $0, 704$ (0、4); $0, 469$ (4、1); $0, 454$ (2、9); $0, 146$ (1、0); $0, 008$ (7、5); $0, 000$ (219、5); -0, 008 (9、3); -0, 150 (1、0)

20

30

実施例 I-T3-212: $^1\text{H-NMR}$ (400, 0MHz、 $\text{d}_6\text{-DMSO}$):
 $\delta=9, 450$ (2、0); $8, 714$ (2、7); $8, 433$ (2、7); $8, 220$ (1、3); $8, 083$ (1、3); $7, 802$ (0、5); $7, 796$ (1、2); $7, 790$ (1、7); $7, 785$ (1、8); $7, 780$ (1、4); $7, 774$ (0、6); $7, 567$ (1、5); $7, 556$ (0、4); $7, 545$ (1、3); $3, 329$ (62、0); $2, 675$ (0、5); $2, 671$ (0、7); $2, 667$ (0、5); $2, 506$ (78、1); $2, 502$ (103、1); $2, 498$ (77、2); $2,$

40

3 2 9 (0、7); 1, 6 1 5 (0、6); 1, 6 0 1 (1、6); 1, 5 9 4 (1、7); 1, 5 8 1 (0、7); 1, 3 9 8 (16、0); 1, 2 8 7 (0、7); 1, 2 7 4 (1、6); 1, 2 6 7 (1、7); 1, 2 5 3 (0、6); 0, 0 0 8 (1、3); 0, 0 0 0 (41、2); -0, 0 0 8 (1、8)

実施例 I-T3-213: ^1H -NMR (400, 0MHz、 d_6 -DMSO):

δ =8, 6 9 2 (2、3); 8, 5 4 2 (0、8); 8, 5 3 1 (0、8); 8, 4 1 7 (2、3); 8, 2 2 0 (1、0); 8, 2 1 6 (1、1); 8, 0 7 9 (1、1); 8, 0 7 5 (1、0); 7, 7 4 2 (0、5); 7, 7 3 7 (0、8); 7, 7 1 7 (3、3); 7, 5 1 7 (1、0); 7, 4 9 6 (0、9); 3, 3 4 8 (0、4); 3, 3 3 0 (73、9); 2, 8 3 9 (0、5); 2, 8 2 9 (0、5); 2, 6 7 6 (0、3); 2, 6 7 1 (0、5); 2, 6 6 7 (0、4); 2, 5 2 5 (1、2); 2, 5 2 0 (1、9); 2, 5 1 1 (26、1); 2, 5 0 7 (54、6); 2, 5 0 2 (72、8); 2, 4 9 8 (52、8); 2, 4 9 3 (25、6); 2, 3 3 3 (0、3); 2, 3 2 9 (0、5); 2, 3 2 4 (0、3); 1, 3 9 8 (16、0); 0, 7 1 6 (0、8); 0, 7 1 0 (1、2); 0, 6 9 8 (1、1); 0, 6 9 2 (0、9); 0, 6 8 1 (0、4); 0, 5 6 2 (0、4); 0, 5 5 2 (1、2); 0, 5 4 5 (1、1); 0, 5 3 6 (0、9); 0, 0 0 8 (1、1); 0, 0 0 0 (33、4); -0, 0 0 9 (1、1)

実施例 I-T3-214: ^1H -NMR (400, 0MHz、CD₃CN):

δ =20, 0 2 0 (0、4); 8, 2 0 3 (15、1); 8, 1 8 7 (0、8); 8, 1 7 3 (15、3); 7, 8 6 5 (8、4); 7, 7 1 6 (8、3); 7, 7 1 1 (10、7); 7, 6 8 3 (5、4); 7, 6 7 7 (4、2); 7, 6 6 2 (6、4); 7, 6 5 6 (5、5); 7, 6 0 8 (8、3); 7, 5 2 8 (0、3); 7, 5 0 4 (10、0); 7, 4 8 4 (7、9); 7, 0 1 6 (4、8); 6, 9 3 1 (3、0); 6, 8 3 5 (9、8); 6, 6 5 3 (5、0); 2, 9 1 0 (0、6); 2, 9 0 1 (1、7); 2, 8 9 1 (2、6); 2, 8 8 3 (3、9); 2, 8 7 3 (4、0); 2, 8 6 5 (2、6); 2, 8 5 5 (1、8); 2, 8 4 6 (0、6); 2, 1 7 4 (590、6); 2, 1 5 0 (3、3); 2, 1 4 4 (3、9); 2, 1 3 8 (4、9); 2, 1 3 2 (3、3); 2, 1 2 5 (2、0); 1, 9 9 5 (20、3); 1, 9 8 8 (51、7); 1, 9 8 3 (284、0); 1, 9 7 7 (520、7); 1, 9 7 0 (703、8); 1, 9 6 4 (488、9); 1, 9 5 8 (254、0); 1, 8 1 1 (1、6); 1, 8 0 5 (2、8); 1, 7 9 9 (4、0); 1, 7 9 3 (2、8); 1, 7 8 6 (1、4); 1, 4 6 7 (16、0); 1, 2 9 9 (0、7); 0, 8 2 4 (2、1); 0, 8 1 1 (6、5); 0, 8 0 7 (8、8); 0, 7 9 4 (8、9); 0, 7 8 9 (6、8); 0, 7 7 7 (2、9); 0, 7 5 5 (0、4); 0, 7 3 7 (0、4); 0, 6 7 0 (0、4); 0, 6 4 1 (2、8); 0, 6 2 9 (8、1); 0, 6 2 3 (8、3); 0, 6 1 4 (7、3); 0, 6 0 2 (2、1); 0, 0 3 0 (2、9)

实施例 I-T3-215: ^1H -NMR (400, 0MHz, CD_3CN):

$\delta=8, 215 (15, 4); 8, 189 (16, 0); 7, 866 (9, 4); 7, 763 (8, 8); 7, 758 (11, 3); 7, 732 (5, 7); 7, 726 (4, 7); 7, 711 (6, 6); 7, 705 (5, 9); 7, 672 (4, 3); 7, 609 (9, 4); 7, 536 (9, 6); 7, 515 (7, 8); 7, 022 (4, 7); 6, 840 (9, 6); 6, 659 (4, 7); 4, 096 (0, 8); 4, 079 (0, 8); 2, 495 (1, 5); 2, 491 (1, 3); 2, 206 (651, 9); 2, 150 (2, 6); 2, 144 (2, 8); 2, 138 (3, 0); 2, 131 (2, 4); 2, 001 (6, 5); 1, 994 (14, 1); 1, 983 (141, 8); 1, 976 (255, 1); 1, 970 (340, 8); 1, 964 (252, 4); 1, 958 (142, 1); 1, 811 (1, 0); 1, 805 (1, 6); 1, 799 (2, 1); 1, 793 (1, 6); 1, 787 (1, 0); 1, 664 (0, 3); 1, 626 (4, 3); 1, 611 (12, 2); 1, 605 (12, 9); 1, 591 (6, 2); 1, 551 (0, 7); 1, 466 (4, 4); 1, 431 (0, 8); 1, 390 (5, 7); 1, 376 (12, 2); 1, 370 (13, 2); 1, 355 (4, 7); 1, 318 (0, 5); 1, 297 (1, 2); 1, 251 (1, 0); 1, 233 (1, 9); 1, 215 (1, 0); 0, 029 (1, 1)$

实施例 I-T3-216: ^1H -NMR (400, 0MHz, CD_3CN):

$\delta=8, 197 (4, 6); 8, 169 (4, 8); 7, 865 (3, 0); 7, 669 (1, 3); 7, 664 (1, 9); 7, 644 (6, 9); 7, 609 (3, 0); 7, 584 (0, 6); 7, 579 (0, 6); 7, 516 (2, 2); 7, 495 (1, 7); 7, 023 (1, 3); 7, 016 (0, 4); 6, 841 (2, 7); 6, 835 (0, 7); 6, 660 (1, 3); 3, 086 (16, 0); 2, 794 (3, 5); 2, 778 (0, 8); 2, 769 (1, 2); 2, 759 (0, 9); 2, 751 (0, 7); 2, 741 (0, 3); 2, 184 (18, 2); 2, 175 (42, 1); 2, 144 (0, 3); 2, 138 (0, 4); 2, 002 (1, 1); 1, 994 (1, 5); 1, 988 (3, 9); 1, 983 (19, 8); 1, 976 (36, 2); 1, 970 (48, 7); 1, 964 (34, 4); 1, 958 (18, 2); 1, 466 (8, 2); 1, 233 (0, 5); 0, 869 (0, 5); 0, 852 (0, 5); 0, 806 (0, 6); 0, 795 (0, 5); 0, 598 (1, 8); 0, 512 (1, 7); 0, 504 (1, 6); 0, 495 (1, 8)$

实施例 I-T3-217: ^1H -NMR (400, 0MHz, CD_3CN):

$\delta=8, 724 (2, 9); 8, 717 (3, 2); 8, 247 (7, 4); 8, 240 (1, 1); 8, 028 (3, 1); 8, 022 (3, 1); 7, 971 (0, 5); 7, 965 (0, 5); 7, 869 (2, 3); 7, 615 (2, 4); 7, 034 (1, 5); 6, 852 (2, 9); 6, 846 (0, 6); 6, 671 (1, 5); 3, 09$

7 (16、0); 2, 828 (2、6); 2, 812 (0、6); 2, 805 (0、6);
 2, 797 (1、1); 2, 786 (0、7); 2, 778 (0、6); 2, 179 (5
 6、3); 2, 150 (0、4); 2, 144 (0、5); 2, 138 (0、6); 2,
 131 (0、4); 1, 994 (4、3); 1, 988 (6、2); 1, 982 (37、
 6); 1, 976 (69、1); 1, 970 (93、5); 1, 964 (64、7); 1,
 958 (33、4); 1, 805 (0、4); 1, 799 (0、6); 1, 792 (0、
 4); 0, 817 (0、4); 0, 608 (1、4); 0, 573 (1、0); 0, 56
 5 (1、7); 0, 556 (1、1); 0, 548 (1、5)

10

実施例 I-T3-218: $^1\text{H-NMR}$ (400, 0MHz、CD₃CN):

δ =20, 011 (0、4); 8, 773 (8、6); 8, 766 (9、0); 8, 7
 41 (1、2); 8, 735 (1、2); 8, 265 (14、9); 8, 261 (16、
 0); 8, 253 (3、2); 8, 250 (2、9); 8, 143 (9、4); 8, 13
 7 (9、5); 8, 009 (1、3); 8, 002 (1、3); 7, 870 (7、3);
 7, 689 (3、7); 7, 614 (8、2); 7, 029 (4、5); 6, 847 (9、
 1); 6, 666 (4、5); 5, 477 (0、5); 3, 753 (3、4); 3, 65
 3 (0、4); 3, 636 (0、6); 3, 628 (0、6); 3, 611 (0、4);
 3, 327 (0、4); 3, 315 (0、8); 3, 304 (0、7); 3, 098 (0、
 7); 3, 087 (0、6); 2, 911 (0、4); 2, 168 (284、6); 2,
 150 (2、8); 2, 144 (3、6); 2, 138 (4、5); 2, 131 (3、
 1); 2, 125 (1、7); 1, 994 (21、0); 1, 988 (48、8); 1,
 982 (280、0); 1, 976 (513、9); 1, 970 (694、8); 1,
 964 (480、4); 1, 958 (247、2); 1, 811 (1、5); 1, 80
 5 (2、9); 1, 799 (4、1); 1, 792 (2、9); 1, 786 (1、4);
 1, 644 (3、6); 1, 629 (9、1); 1, 623 (9、3); 1, 609 (4、
 8); 1, 568 (0、6); 1, 440 (0、5); 1, 399 (4、9); 1, 38
 6 (9、0); 1, 379 (9、4); 1, 364 (3、7); 1, 327 (0、4);
 1, 299 (0、5); 1, 164 (0、7); 0, 029 (2、4)

20

30

実施例 I-T3-219: $^1\text{H-NMR}$ (400, 0MHz、CD₃CN):

δ =8, 186 (4、3); 8, 170 (4、3); 7, 971 (2、5); 7, 75
 8 (2、2); 7, 641 (1、2); 7, 636 (1、8); 7, 616 (6、7);
 7, 558 (0、6); 7, 552 (0、5); 7, 490 (2、0); 7, 488 (1、
 7); 7, 483 (0、7); 7, 470 (1、3); 7, 468 (1、5); 7, 46
 2 (0、6); 3, 057 (16、0); 2, 765 (3、5); 2, 755 (0、7);
 2, 747 (0、7); 2, 738 (1、1); 2, 728 (0、7); 2, 720 (0、
 6); 2, 139 (32、4); 2, 114 (0、4); 2, 108 (0、5); 2, 1
 02 (0、4); 1, 965 (2、1); 1, 959 (5、3); 1, 953 (31、

40

9); 1, 947 (58、9); 1, 941 (79、9); 1, 934 (55、2); 1, 928 (28、6); 1, 775 (0、3); 1, 769 (0、5); 1, 437 (6、1); 0, 840 (0、4); 0, 822 (0、4); 0, 777 (0、5); 0, 766 (0、4); 0, 568 (1、4); 0, 482 (1、4); 0, 474 (1、3); 0, 464 (1、5)

実施例 I-T3-220: ^1H -NMR (400, 0MHz、CD₃CN):

δ =8, 695 (3、0); 8, 689 (3、2); 8, 219 (7、0); 8, 000 (3、0); 7, 994 (3、0); 7, 937 (8、6); 7, 897 (0、6); 5, 449 (12、1); 3, 067 (16、0); 2, 891 (0、7); 2, 869 (0、3); 2, 798 (2、8); 2, 785 (0、6); 2, 778 (0、7); 2, 769 (1、2); 2, 758 (0、8); 2, 750 (0、7); 2, 741 (0、4); 2, 474 (0、3); 2, 469 (0、5); 2, 464 (0、4); 2, 189 (56、5); 2, 121 (0、4); 2, 115 (0、4); 2, 109 (0、5); 2, 103 (0、4); 2, 087 (3、4); 1, 965 (1、9); 1, 959 (4、3); 1, 954 (23、2); 1, 947 (42、6); 1, 941 (57、3); 1, 935 (40、0); 1, 929 (20、9); 1, 770 (0、3); 1, 316 (1、1); 1, 300 (0、9); 1, 285 (0、3); 1, 269 (1、0); 0, 853 (0、4); 0, 834 (0、4); 0, 787 (0、4); 0, 776 (0、4); 0, 578 (1、6); 0, 535 (1、9); 0, 525 (1、3); 0, 518 (1、7); 0, 146 (0、6); 0, 008 (4、9); 0, 000 (131、9); -0, 008 (6、9); -0, 150 (0、6)

実施例 I-T3-221: ^1H -NMR (400, 0MHz、CD₃CN):

δ =8, 693 (6、2); 8, 687 (6、2); 8, 234 (0、7); 8, 225 (9、9); 8, 212 (10、1); 8, 053 (0、4); 8, 042 (6、8); 8, 036 (6、6); 7, 932 (16、0); 7, 011 (1、9); 5, 447 (15、9); 2, 886 (0、5); 2, 876 (1、3); 2, 867 (1、8); 2, 858 (2、8); 2, 848 (2、8); 2, 840 (1、8); 2, 830 (1、3); 2, 821 (0、4); 2, 149 (16、6); 2, 121 (1、4); 2, 114 (1、2); 2, 108 (1、2); 2, 102 (0、9); 2, 096 (0、6); 1, 965 (6、2); 1, 959 (9、3); 1, 953 (46、1); 1, 947 (83、1); 1, 941 (110、8); 1, 934 (76、5); 1, 928 (39、4); 1, 775 (0、5); 1, 769 (0、7); 1, 763 (0、4); 1, 269 (1、0); 1, 259 (0、5); 0, 809 (1、5); 0, 796 (4、5); 0, 791 (5、9); 0, 778 (6、1); 0, 773 (4、5); 0, 761 (2、0); 0, 620 (2、0); 0, 608 (5、1); 0, 603 (5、5); 0, 599 (4、9); 0, 593 (4、7); 0, 581 (1、4); 0, 146 (1、

10

20

30

40

3); 0, 008 (11、5); 0, 000 (286、0); -0, 009 (12、3);
-0, 150 (1、3)

実施例 I-T3-222: $^1\text{H-NMR}$ (400, 0MHz、 CD_3CN):

δ =8, 742 (7、6); 8, 736 (7、9); 8, 237 (11、7); 8, 230 (10、9); 8, 112 (8、3); 8, 106 (8、3); 7, 935 (16、0); 7, 717 (1、6); 6, 777 (0、5); 5, 448 (3、1); 2, 170 (68、6); 2, 121 (0、4); 2, 115 (0、6); 2, 108 (0、7);
2, 102 (0、5); 1, 965 (4、0); 1, 959 (7、7); 1, 953 (42、0); 1, 947 (76、9); 1, 941 (104、1); 1, 935 (72、7); 1, 929 (37、9); 1, 776 (0、5); 1, 769 (0、6); 1, 763 (0、5); 1, 697 (0、5); 1, 612 (3、1); 1, 598 (7、6); 1, 591 (7、8); 1, 577 (4、2); 1, 537 (0、5); 1, 523 (1、3); 1, 505 (1、2); 1, 408 (0、5); 1, 368 (4、3); 1, 355 (7、7); 1, 348 (8、0); 1, 333 (3、2); 1, 277 (0、4);
1, 269 (0、9); 1, 259 (1、1); 1, 193 (0、9); 1, 187 (0、6); 1, 183 (0、4); 1, 177 (1、0); 1, 171 (0、6); 1, 166 (0、4); 0, 146 (1、1); 0, 008 (9、5); 0, 000 (259、4); -0, 009 (11、5); -0, 150 (1、1)

実施例 I-T3-223: $^1\text{H-NMR}$ (600, 1MHz、 CD_3CN):

δ =8, 772 (0、8); 8, 732 (3、1); 8, 728 (3、0); 8, 222 (7、7); 8, 215 (5、8); 8, 200 (0、8); 8, 021 (3、2); 8, 017 (3、1); 7, 943 (13、2); 6, 642 (0、5); 4, 077 (1、3); 4, 065 (3、9); 4, 053 (3、9); 4, 042 (1、3); 3, 752 (0、8); 3, 165 (3、1); 3, 069 (0、4); 2, 934 (16、0); 2, 880 (0、4); 2, 245 (0、5); 2, 240 (0、6); 2, 222 (0、8); 2, 146 (25、4); 2, 078 (1、0); 2, 059 (0、8); 2, 055 (1、1); 2, 050 (1、3); 2, 046 (1、0); 2, 042 (0、7); 1, 972 (17、2); 1, 964 (2、0); 1, 956 (5、4); 1, 952 (7、4); 1, 948 (55、6); 1, 944 (100、9); 1, 940 (146、1); 1, 936 (99、1); 1, 931 (49、9); 1, 833 (0、4); 1, 829 (0、7); 1, 825 (0、9); 1, 821 (0、7); 1, 816 (0、4); 1, 664 (3、8); 1, 661 (4、0); 1, 505 (0、4); 1, 473 (3、0); 1, 443 (0、6); 1, 425 (0、6); 1, 422 (0、6); 1, 409 (0、8); 1, 406 (0、8); 1, 390 (2、1); 1, 388 (1、6); 1, 372 (1、4); 1, 363 (0、5); 1, 358 (0、7); 1, 341 (1、7); 1, 316 (0、9); 1, 303 (0、9); 1, 285 (3、5);

1, 277 (3、9); 1, 271 (6、9); 1, 221 (1、2); 1, 216 (6、4); 1, 214 (5、7); 1, 204 (9、5); 1, 201 (2、5); 1, 192 (4、8); 1, 180 (0、6); 1, 175 (0、3); 0, 948 (0、4); 0, 893 (0、9); 0, 882 (1、8); 0, 870 (1、5); 0, 863 (0、9); 0, 860 (0、9); 0, 856 (0、9); 0, 846 (0、9); 0, 000 (7、9)

実施例 I - T3 - 224: ^1H -NMR (400, 0MHz、 CD_3CN):

δ = 8, 271 (7、9); 8, 267 (7、8); 8, 184 (15、8); 8, 183 (15、9); 8, 152 (0、7); 8, 141 (16、0); 7, 791 (6、9); 7, 693 (9、4); 7, 688 (12、0); 7, 678 (0、8); 7, 662 (6、6); 7, 656 (4、7); 7, 641 (7、7); 7, 635 (6、2); 7, 591 (0、7); 7, 479 (11、5); 7, 458 (9、1); 6, 959 (2、7); 4, 086 (0、9); 4, 068 (2、7); 4, 050 (2、8); 4, 032 (0、9); 2, 986 (0、4); 2, 883 (0、8); 2, 873 (2、2); 2, 864 (3、0); 2, 855 (4、6); 2, 846 (4、6); 2, 837 (2、9); 2, 828 (2、2); 2, 818 (0、9); 2, 567 (0、7); 2, 536 (0、3); 2, 503 (0、4); 2, 477 (1、2); 2, 472 (1、9); 2, 467 (2、6); 2, 462 (1、9); 2, 458 (1、1); 2, 411 (0、5); 2, 398 (0、5); 2, 373 (0、6); 2, 310 (0、9); 2, 281 (1、2); 2, 187 (1104、6); 2, 121 (0、9); 2, 115 (2、0); 2, 109 (2、7); 2, 103 (1、9); 2, 096 (0、9); 1, 993 (0、6); 1, 973 (14、2); 1, 966 (15、1); 1, 960 (36、7); 1, 954 (209、3); 1, 948 (380、7); 1, 941 (511、0); 1, 935 (347、0); 1, 929 (175、8); 1, 916 (1、4); 1, 782 (1、0); 1, 776 (1、9); 1, 770 (2、8); 1, 764 (1、8); 1, 757 (0、8); 1, 437 (14、7); 1, 340 (0、4); 1, 285 (0、8); 1, 270 (2、8); 1, 222 (3、4); 1, 204 (6、6); 1, 186 (3、2); 0, 882 (0、5); 0, 857 (0、5); 0, 841 (0、4); 0, 796 (2、4); 0, 784 (7、0); 0, 779 (9、4); 0, 766 (9、7); 0, 761 (6、9); 0, 749 (3、1); 0, 727 (0、5); 0, 709 (0、4); 0, 654 (0、4); 0, 644 (0、4); 0, 614 (3、2); 0, 602 (7、9); 0, 597 (8、2); 0, 593 (7、3); 0, 587 (7、3); 0, 575 (2、2); 0, 526 (0、3); 0, 146 (7、1); 0, 138 (0、4); 0, 079 (0、4); 0, 069 (0、4); 0, 066 (0、3); 0, 058 (0、5); 0, 054 (0、5); 0, 049 (0、5); 0, 045 (0、6); 0, 037 (0、8); 0, 023 (2、0); 0, 00

10

20

30

40

8 (59、7); 0, 000 (1582, 5); -0, 009 (57、5); -0, 033 (0、5); -0, 036 (0、5); -0, 150 (7、0)

实施例 I-T3-225: ^1H -NMR (400, 0MHz、CD₃CN):

δ =8, 269 (2、4); 8, 266 (2、4); 8, 170 (4、4); 8, 126 (4、2); 7, 787 (2、2); 7, 644 (1、2); 7, 639 (1、7); 7, 624 (1、0); 7, 618 (5、4); 7, 613 (1、7); 7, 561 (0、6); 7, 556 (0、5); 7, 490 (2、1); 7, 489 (2、0); 7, 482 (0、7); 7, 470 (1、6); 7, 468 (1、6); 7, 462 (0、6); 3, 058 (14、9); 3, 006 (0、4); 2, 778 (0、6); 2, 771 (3、2); 2, 761 (0、6); 2, 753 (0、7); 2, 744 (1、1); 2, 734 (0、7); 2, 726 (0、8); 2, 127 (33、1); 2, 113 (0、8); 2, 106 (0、7); 2, 100 (0、5); 1, 971 (0、8); 1, 963 (2、6); 1, 957 (6、7); 1, 951 (37、7); 1, 945 (68、8); 1, 939 (92、9); 1, 933 (64、3); 1, 927 (33、3); 1, 774 (0、4); 1, 767 (0、5); 1, 761 (0、4); 1, 437 (16、0); 1, 270 (0、8); 1, 204 (0、4); 0, 841 (0、5); 0, 823 (0、4); 0, 780 (0、5); 0, 769 (0、4); 0, 581 (1、4); 0, 575 (1、4); 0, 487 (1、5); 0, 479 (1、3); 0, 470 (1、5); 0, 146 (1、1); 0, 008 (9、5); 0, 000 (262、4); -0, 009 (11、4); -0, 150 (1、2)

实施例 I-T3-226: ^1H -NMR (400, 0MHz、CD₃CN):

δ =8, 269 (7、2); 8, 266 (7、5); 8, 191 (16、0); 8, 147 (15、3); 8, 056 (0、9); 7, 789 (6、5); 7, 741 (8、2); 7, 735 (10、5); 7, 708 (5、2); 7, 703 (4、0); 7, 687 (6、0); 7, 682 (5、1); 7, 582 (0、8); 7, 554 (4、5); 7, 509 (10、0); 7, 488 (8、2); 4, 084 (0、6); 4, 067 (1、9); 4, 049 (1、9); 4, 032 (0、6); 3, 063 (0、7); 3, 040 (5、6); 2, 902 (4、9); 2, 854 (0、6); 2, 568 (0、4); 2, 126 (170、0); 2, 112 (2、8); 2, 106 (2、7); 2, 100 (1、9); 2, 093 (1、0); 2, 035 (0、4); 1, 970 (10、0); 1, 962 (11、5); 1, 956 (26、7); 1, 951 (152、2); 1, 944 (278、1); 1, 938 (376、5); 1, 932 (259、9); 1, 926 (134、2); 1, 913 (1、4); 1, 779 (0、8); 1, 773 (1、5); 1, 767 (2、1); 1, 761 (1、4); 1, 754 (0、7); 1, 597 (4、0); 1, 583 (10、7); 1, 576 (10、4); 1, 563 (5、3); 1, 523 (0、7); 1, 436 (8、2); 1, 404 (0、7);

1, 364 (5, 4); 1, 350 (10, 4); 1, 344 (11, 2); 1, 329 (4, 1); 1, 318 (0, 3); 1, 292 (0, 5); 1, 269 (2, 7); 1, 221 (2, 2); 1, 203 (4, 2); 1, 185 (2, 1); 0, 881 (0, 4); 0, 858 (0, 3); 0, 145 (5, 2); 0, 031 (0, 9); 0, 0071 (35, 1); 0, 0066 (35, 1); -0, 001 (985, 7); -0, 009 (44, 0); -0, 026 (0, 9); -0, 040 (0, 4); -0, 151 (5, 1)

10

実施例 I-T3-227: ^1H -NMR (400, 0MHz, CD_3CN):

δ =8, 511 (7, 8); 8, 508 (7, 8); 8, 174 (16, 0); 8, 118 (13, 4); 8, 099 (7, 8); 7, 694 (9, 8); 7, 688 (12, 4); 7, 662 (6, 6); 7, 656 (5, 0); 7, 641 (7, 7); 7, 635 (6, 4); 7, 499 (0, 3); 7, 476 (11, 6); 7, 455 (9, 2); 6, 938 (2, 9); 3, 062 (0, 6); 2, 880 (0, 7); 2, 870 (2, 1); 2, 861 (3, 0); 2, 852 (4, 7); 2, 843 (4, 7); 2, 834 (3, 0); 2, 825 (2, 2); 2, 815 (0, 7); 2, 543 (0, 4); 2, 468 (0, 4); 2, 463 (0, 6); 2, 459 (0, 4); 2, 163 (162, 8); 2, 120 (1, 0); 2, 114 (1, 0); 2, 108 (1, 1); 2, 102 (0, 9); 2, 087 (20, 5); 1, 972 (1, 6); 1, 965 (5, 0); 1, 959 (13, 4); 1, 953 (69, 2); 1, 947 (125, 1); 1, 941 (166, 4); 1, 935 (115, 7); 1, 928 (59, 8); 1, 781 (0, 4); 1, 775 (0, 7); 1, 769 (1, 0); 1, 763 (0, 6); 1, 757 (0, 3); 1, 285 (0, 4); 1, 269 (1, 7); 1, 204 (0, 6); 1, 186 (0, 3); 1, 179 (0, 8); 0, 794 (2, 5); 0, 781 (7, 3); 0, 776 (9, 8); 0, 763 (10, 2); 0, 758 (7, 4); 0, 746 (3, 4); 0, 724 (0, 4); 0, 707 (0, 4); 0, 652 (0, 4); 0, 642 (0, 4); 0, 612 (3, 3); 0, 601 (8, 5); 0, 595 (8, 9); 0, 591 (8, 1); 0, 586 (7, 9); 0, 573 (2, 5); 0, 536 (0, 4); 0, 528 (0, 3); 0, 146 (2, 7); 0, 029 (0, 4); 0, 008 (25, 1); 0, 000 (580, 3); -0, 009 (29, 4); -0, 028 (0, 7); -0, 150 (2, 7)

20

30

実施例 I-T3-228: ^1H -NMR (400, 0MHz, CD_3CN):

δ =8, 508 (2, 3); 8, 184 (4, 7); 8, 130 (3, 9); 8, 099 (2, 3); 7, 741 (2, 6); 7, 735 (3, 4); 7, 711 (1, 8); 7, 705 (1, 3); 7, 690 (2, 1); 7, 684 (1, 7); 7, 644 (1, 3); 7, 509 (3, 2); 7, 488 (2, 6); 2, 545 (0, 6); 2, 468 (0, 5); 2, 463 (0, 7); 2, 459 (0, 5); 2, 159 (239, 4)

40

3); 2, 119 (0、6); 2, 113 (0、8); 2, 107 (0、9); 2, 101 (0、7); 2, 095 (0、4); 1, 971 (1、0); 1, 964 (3、7); 1, 958 (9、3); 1, 952 (53、0); 1, 946 (96、2); 1, 940 (130、0); 1, 933 (90、1); 1, 927 (46、8); 1, 780 (0、3); 1, 774 (0、6); 1, 768 (0、8); 1, 762 (0、6); 1, 595 (1、3); 1, 581 (3、4); 1, 574 (3、5); 1, 560 (1、8); 1, 437 (16、0); 1, 363 (1、8); 1, 349 (3、4); 1, 343 (3、5); 1, 328 (1、4); 1, 270 (0、7); 1, 204 (0、4); 0, 146 (1、3); 0, 008 (10、5); 0, 000 (282、8); -0, 009 (11、9); -0, 150 (1、3)

10

実施例 I-T3-229: ^1H -NMR (400, 0MHz、CD₃CN):

δ =8, 507 (1、6); 8, 161 (3、4); 8, 104 (3、1); 7, 644 (0、8); 7, 639 (1、1); 7, 619 (3、9); 7, 562 (0、4); 7, 557 (0、4); 7, 488 (1、4); 7, 481 (0、5); 7, 466 (1、1); 7, 460 (0、4); 3, 056 (10、5); 2, 855 (0、4); 2, 771 (2、3); 2, 763 (0、5); 2, 755 (0、5); 2, 745 (0、8); 2, 736 (0、5); 2, 728 (0、4); 2, 544 (0、4); 2, 131 (16、7); 1, 971 (0、5); 1, 963 (1、1); 1, 957 (2、7); 1, 951 (15、4); 1, 945 (28、4); 1, 939 (38、5); 1, 933 (26、5); 1, 927 (13、7); 1, 437 (16、0); 0, 779 (0、4); 0, 576 (1、0); 0, 488 (1、0); 0, 480 (0、9); 0, 471 (1、0); 0, 146 (0、4); 0, 008 (3、0); 0, 000 (85、2); -0, 009 (3、4); -0, 150 (0、4)

20

30

実施例 I-T4-1: ^1H -NMR (400, 0MHz、CD₃CN):

δ =8, 170 (4、8); 7, 860 (5、7); 7, 840 (2、0); 7, 833 (1、3); 7, 687 (4、2); 7, 561 (1、9); 7, 539 (1、6); 7, 436 (5、5); 6, 972 (0、9); 2, 871 (0、5); 2, 862 (0、8); 2, 853 (1、1); 2, 843 (1、1); 2, 835 (0、8); 2, 825 (0、5); 2, 251 (24、5); 2, 140 (6、0); 1, 971 (0、5); 1, 964 (0、6); 1, 958 (1、4); 1, 952 (6、2); 1, 946 (11、2); 1, 940 (15、0); 1, 934 (10、9); 1, 928 (5、9); 1, 436 (16、0); 0, 796 (0、6); 0, 784 (1、9); 0, 779 (2、5); 0, 766 (2、6); 0, 761 (2、0); 0, 749 (0、9); 0, 619 (0、8); 0, 608 (2、3); 0, 601 (2、5); 0, 592 (2、1); 0, 580 (0、6); 0, 000 (15、7)

40

実施例 I-T4-2: ^1H -NMR (400, 0MHz、CD₃CN):

$\delta = 8, 184 (6, 7); 8, 183 (6, 5); 7, 920 (2, 5); 7, 915 (8, 6); 7, 894 (3, 0); 7, 887 (1, 9); 7, 699 (6, 2); 7, 680 (1, 6); 7, 602 (3, 0); 7, 600 (2, 8); 7, 582 (2, 4); 7, 580 (2, 6); 7, 438 (7, 8); 2, 463 (0, 3); 2, 253 (39, 2); 2, 151 (134, 8); 2, 120 (0, 5); 2, 114 (0, 7); 2, 108 (0, 9); 2, 102 (0, 6); 2, 095 (0, 4); 1, 972 (1, 2); 1, 965 (4, 2); 1, 959 (10, 5); 1, 953 (54, 2); 1, 947 (98, 7); 1, 940 (132, 9); 1, 934 (93, 2); 1, 928 (48, 4); 1, 775 (0, 6); 1, 769 (0, 8); 1, 763 (0, 6); 1, 599 (1, 8); 1, 585 (4, 6); 1, 578 (4, 7); 1, 564 (2, 4); 1, 437 (16, 0); 1, 415 (0, 4); 1, 375 (2, 4); 1, 361 (4, 7); 1, 354 (4, 9); 1, 340 (1, 8); 1, 269 (1, 5); 1, 204 (0, 4); 0, 146 (0, 7); 0, 008 (5, 3); 0, 000 (150, 3); -0, 008 (7, 3); -0, 149 (0, 7)$

10

实施例 I-T4-3: $^1\text{H-NMR}$ (400, 0MHz, CD_3CN):

20

$\delta = 8, 929 (2, 4); 8, 922 (2, 4); 8, 231 (2, 7); 8, 224 (2, 6); 8, 205 (4, 3); 7, 754 (3, 8); 7, 444 (5, 0); 7, 072 (0, 7); 2, 881 (0, 4); 2, 872 (0, 7); 2, 863 (1, 0); 2, 853 (1, 0); 2, 845 (0, 7); 2, 835 (0, 4); 2, 252 (22, 9); 2, 140 (16, 7); 1, 964 (1, 1); 1, 952 (13, 4); 1, 946 (23, 9); 1, 940 (31, 3); 1, 934 (21, 8); 1, 928 (11, 3); 1, 436 (16, 0); 0, 814 (0, 5); 0, 800 (1, 8); 0, 796 (2, 2); 0, 783 (2, 3); 0, 778 (1, 7); 0, 766 (0, 7); 0, 633 (0, 7); 0, 622 (2, 1); 0, 616 (2, 2); 0, 612 (2, 0); 0, 607 (1, 8); 0, 594 (0, 5); 0, 146 (0, 6); 0, 000 (113, 1); -0, 150 (0, 6)$

30

实施例 I-T4-4: $^1\text{H-NMR}$ (400, 0MHz, CD_3CN):

$\delta = 8, 974 (3, 9); 8, 967 (3, 9); 8, 300 (4, 1); 8, 294 (4, 0); 8, 216 (6, 7); 7, 764 (6, 3); 7, 753 (0, 6); 7, 735 (1, 8); 7, 446 (7, 8); 4, 067 (0, 9); 4, 050 (0, 9); 3, 076 (1, 0); 2, 898 (1, 0); 2, 254 (38, 8); 2, 144 (39, 1); 2, 114 (0, 6); 2, 107 (0, 6); 2, 101 (0, 4); 2, 095 (0, 4); 2, 086 (0, 4); 2, 063 (0, 4); 1, 972 (4, 1); 1, 964 (2, 3); 1, 958 (6, 0); 1, 952 (30, 2); 1, 946 (53, 9); 1, 940 (71, 6); 1, 934 (48, 9); 1, 928 (25, 1); 1, 768 (0, 4); 1, 617 (1, 7); 1, 602 (4,$

40

5); 1, 595 (4、4); 1, 581 (2、2); 1, 437 (16、0); 1, 388 (2、3); 1, 375 (4、5); 1, 368 (4、5); 1, 353 (1、7); 1, 269 (0、9); 1, 221 (1、0); 1, 204 (2、0); 1, 186 (1、0); 0, 146 (1、1); 0, 008 (8、7); 0, 000 (211、3); -0, 009 (8、7); -0, 150 (1、1)

実施例 I-T22-1: ^1H -NMR (400, 0MHz、CD₃CN):

δ =7, 934 (2、4); 7, 928 (3、4); 7, 908 (1、9); 7, 902 (1、3); 7, 887 (2、0); 7, 882 (1、6); 7, 615 (3、0); 7, 594 (2、6); 7, 486 (5、3); 7, 037 (0、7); 6, 864 (0、4); 6, 858 (6、5); 2, 877 (0、5); 2, 867 (0、8); 2, 858 (1、2); 2, 849 (1、2); 2, 840 (0、8); 2, 831 (0、6); 2, 258 (25、0); 2, 168 (12、6); 1, 965 (0、4); 1, 959 (1、0); 1, 953 (5、8); 1, 947 (10、6); 1, 941 (14、3); 1, 935 (10、0); 1, 928 (5、3); 1, 436 (16、0); 0, 800 (0、6); 0, 788 (1、8); 0, 783 (2、5); 0, 770 (2、6); 0, 765 (1、9); 0, 753 (0、9); 0, 624 (0、9); 0, 613 (2、2); 0, 606 (2、3); 0, 602 (2、0); 0, 597 (2、0); 0, 585 (0、7); 0, 008 (0、7); 0, 000 (20、3); -0, 009 (0、9)

実施例 I-T22-2: ^1H -NMR (400, 0MHz、CD₃CN):

δ =7, 992 (6、1); 7, 986 (8、0); 7, 960 (4、3); 7, 954 (3、3); 7, 939 (4、6); 7, 933 (4、0); 7, 709 (2、2); 7, 654 (7、3); 7, 633 (6、4); 7, 487 (13、6); 6, 877 (16、0); 5, 448 (2、4); 2, 418 (0、4); 2, 260 (66、3); 2, 153 (49、7); 2, 120 (0、4); 2, 114 (0、4); 2, 108 (0、5); 2, 098 (0、5); 2, 086 (1、9); 1, 972 (0、6); 1, 964 (1、9); 1, 958 (4、9); 1, 953 (28、0); 1, 946 (51、5); 1, 940 (70、2); 1, 934 (49、9); 1, 928 (27、0); 1, 775 (0、3); 1, 769 (0、4); 1, 603 (3、1); 1, 588 (8、0); 1, 581 (8、3); 1, 568 (4、3); 1, 528 (0、5); 1, 436 (0、9); 1, 419 (0、5); 1, 379 (4、2); 1, 365 (8、0); 1, 359 (8、7); 1, 344 (3、3); 1, 268 (0、4); 0, 146 (0、5); 0, 008 (3、8); 0, 000 (117、9); -0, 008 (7、0); -0, 150 (0、6)

実施例 I-T22-3: ^1H -NMR (400, 0MHz、CD₃CN):

δ =7, 982 (3、5); 7, 977 (5、3); 7, 966 (3、0); 7, 96

0 (1、9); 7, 945 (2、9); 7, 939 (2、5); 7, 669 (4、3);
 7, 648 (3、7); 7, 487 (9、9); 6, 883 (8、4); 4, 152 (1、
 0); 4, 136 (1、1); 4, 129 (3、0); 4, 112 (3、1); 4, 10
 5 (3、3); 4, 089 (3、1); 4, 082 (1、4); 4, 065 (1、1);
 2, 262 (40、4); 2, 156 (20、4); 2, 101 (0、4); 1, 97
 2 (0、5); 1, 964 (1、0); 1, 958 (2、4); 1, 953 (12、4);
 1, 946 (23、1); 1, 940 (31、5); 1, 934 (23、1); 1, 9
 28 (12、8); 1, 436 (16、0); 0, 008 (2、0); 0, 000 (5
 3、5)

10

実施例 I-T22-4: ^1H -NMR (400, 0MHz、CD₃CN):

δ =8, 983 (1、2); 8, 977 (1、3); 8, 360 (1、3); 8, 35
 5 (1、3); 7, 953 (1、3); 7, 944 (1、4); 7, 036 (2、1);
 2, 306 (6、0); 2, 160 (8、1); 1, 953 (4、2); 1, 947 (7、
 8); 1, 941 (10、6); 1, 935 (7、9); 1, 929 (4、3); 1, 6
 19 (0、6); 1, 604 (1、6); 1, 597 (1、6); 1, 584 (0、8);
 1, 437 (16、0); 1, 390 (0、8); 1, 376 (1、6); 1, 369
 (1、7); 1, 354 (0、6)

20

実施例 I-T22-5: ^1H -NMR (400, 0MHz、CD₃CN):

δ =7, 942 (4、2); 7, 936 (5、2); 7, 918 (1、6); 7, 91
 2 (1、1); 7, 897 (1、6); 7, 892 (1、3); 7, 619 (2、4);
 7, 598 (2、1); 7, 045 (0、8); 6, 922 (4、2); 2, 874 (0、
 4); 2, 865 (0、7); 2, 856 (1、0); 2, 847 (1、0); 2, 83
 8 (0、7); 2, 828 (0、4); 2, 305 (10、8); 2, 183 (27、
 7); 1, 960 (0、8); 1, 954 (3、8); 1, 948 (6、9); 1, 94
 2 (9、3); 1, 936 (6、5); 1, 930 (3、4); 1, 436 (16、0);
 0, 799 (0、5); 0, 786 (1、7); 0, 781 (2、2); 0, 769 (2、
 2); 0, 764 (1、7); 0, 751 (0、7); 0, 624 (0、7); 0, 61
 3 (2、1); 0, 607 (2、1); 0, 603 (2、0); 0, 597 (1、8);
 0, 585 (0、5); 0, 000 (23、8)

30

実施例 I-T22-6: ^1H -NMR (400, 0MHz、CD₃CN):

δ =8, 939 (1、4); 8, 933 (1、4); 8, 292 (1、5); 8, 28
 6 (1、4); 7, 952 (1、1); 7, 942 (1、1); 7, 150 (0、3);
 7, 022 (2、3); 2, 874 (0、4); 2, 865 (0、5); 2, 855 (0、
 5); 2, 847 (0、4); 2, 305 (5、7); 2, 187 (7、7); 1, 97
 3 (0、7); 1, 960 (0、4); 1, 954 (2、8); 1, 948 (5、1);
 1, 942 (7、0); 1, 936 (4、8); 1, 930 (2、5); 1, 436 (1

40

6、0); 1, 204 (0、3); 0, 803 (0、9); 0, 798 (1、1); 0, 785 (1、2); 0, 780 (0、9); 0, 767 (0、4); 0, 636 (0、4); 0, 624 (1、0); 0, 619 (1、1); 0, 615 (0、9); 0, 609 (0、9); 0, 000 (5、3)

実施例 I-T22-7: $^1\text{H-NMR}$ (400, 0MHz、CD₃CN):
 δ = 7, 999 (1、6); 7, 994 (2、1); 7, 970 (1、1); 7, 965 (0、8); 7, 949 (2、6); 7, 944 (2、6); 7, 937 (1、8); 7, 659 (2、2); 7, 638 (1、6); 6, 939 (3、3); 2, 306 (8、4); 2, 155 (9、0); 1, 972 (0、6); 1, 965 (0、3); 1, 953 (5、6); 1, 947 (10、3); 1, 941 (14、0); 1, 935 (9、7); 1, 929 (5、0); 1, 602 (0、8); 1, 587 (2、1); 1, 581 (2、1); 1, 567 (1、1); 1, 436 (16、0); 1, 380 (1、1); 1, 366 (2、1); 1, 360 (2、2); 1, 345 (0、8)

実施例 I-T23-1: $^1\text{H-NMR}$ (400, 0MHz、CD₃CN):
 δ = 7, 961 (5、3); 7, 958 (2、0); 7, 942 (1、7); 7, 937 (1、0); 7, 864 (5、1); 7, 609 (1、6); 7, 606 (1、0); 7, 590 (1、0); 7, 587 (1、4); 7, 148 (5、1); 6, 968 (0、5); 2, 876 (0、4); 2, 867 (0、6); 2, 858 (0、9); 2, 849 (0、9); 2, 840 (0、6); 2, 831 (0、4); 2, 134 (6、5); 1, 964 (1、6); 1, 958 (2、5); 1, 952 (11、3); 1, 946 (20、0); 1, 940 (26、1); 1, 934 (17、8); 1, 928 (9、0); 1, 437 (16、0); 0, 800 (0、5); 0, 787 (1、5); 0, 782 (1、9); 0, 770 (2、0); 0, 764 (1、4); 0, 752 (0、7); 0, 624 (0、7); 0, 614 (1、6); 0, 606 (1、7); 0, 602 (1、5); 0, 597 (1、5); 0, 584 (0、5); 0, 000 (0、7)

実施例 I-T23-2: $^1\text{H-NMR}$ (400, 0MHz、CD₃CN):
 δ = 8, 014 (3、3); 8, 010 (1、3); 7, 997 (1、1); 7, 991 (0、6); 7, 866 (3、6); 7, 648 (1、5); 7, 642 (0、8); 7, 630 (0、6); 7, 625 (1、2); 7, 162 (3、0); 5, 447 (16、0); 2, 140 (12、0); 1, 972 (0、4); 1, 964 (2、4); 1, 958 (4、0); 1, 952 (17、2); 1, 946 (30、2); 1, 940 (39、3); 1, 934 (26、8); 1, 928 (13、7); 1, 600 (0、6); 1, 586 (1、7); 1, 579 (1、7); 1, 565 (0、9); 1, 437 (0、9); 1, 380 (0、9); 1, 367 (1、6); 1, 360 (1、7); 1, 345 (0、7); 0, 000 (0、9)

実施例 I-T46-1: $^1\text{H-NMR}$ (400, 0MHz、CD₃CN):

$\delta = 7, 669 (6, 3); 7, 664 (9, 6); 7, 654 (5, 5); 7, 648 (2, 9); 7, 633 (5, 5); 7, 627 (4, 3); 7, 582 (3, 1); 7, 509 (16, 0); 7, 426 (8, 2); 7, 405 (6, 8); 7, 166 (4, 7); 7, 161 (8, 3); 7, 156 (5, 0); 6, 767 (3, 7); 6, 760 (7, 3); 6, 754 (5, 5); 6, 735 (5, 6); 6, 730 (6, 3); 6, 723 (3, 8); 2, 468 (0, 7); 2, 463 (1, 0); 2, 459 (0, 7); 2, 298 (0, 5); 2, 161 (388, 0); 2, 139 (78, 8); 2, 121 (1, 2); 2, 114 (1, 5); 2, 108 (1, 7); 2, 102 (1, 2); 2, 096 (0, 7); 1, 993 (0, 7); 1, 977 (0, 9); 1, 965 (8, 8); 1, 959 (16, 3); 1, 953 (98, 1); 1, 947 (179, 6); 1, 941 (243, 9); 1, 935 (167, 4); 1, 928 (86, 0); 1, 856 (0, 9); 1, 842 (0, 6); 1, 782 (0, 6); 1, 775 (1, 1); 1, 769 (1, 5); 1, 763 (1, 0); 1, 757 (0, 5); 1, 585 (3, 5); 1, 570 (9, 4); 1, 563 (9, 3); 1, 550 (4, 6); 1, 510 (0, 5); 1, 394 (0, 5); 1, 354 (4, 7); 1, 340 (9, 4); 1, 333 (9, 8); 1, 319 (3, 5); 0, 146 (0, 4); 0, 008 (2, 9); 0, 000 (87, 8); -0, 008 (3, 4); -0, 150 (0, 4)$

実施例 I-T46-2: $^1\text{H-NMR}$ (400, 0MHz、 CD_3CN):

$\delta = 7, 682 (3, 3); 7, 677 (6, 3); 7, 676 (6, 2); 7, 673 (6, 2); 7, 668 (4, 7); 7, 665 (5, 9); 7, 653 (5, 1); 7, 647 (7, 8); 7, 628 (1, 3); 7, 623 (1, 7); 7, 606 (1, 1); 7, 600 (0, 7); 7, 585 (1, 1); 7, 579 (1, 0); 7, 518 (4, 3); 7, 517 (4, 5); 7, 507 (3, 5); 7, 496 (6, 1); 7, 478 (6, 1); 7, 475 (3, 5); 7, 459 (3, 7); 7, 422 (2, 5); 7, 419 (1, 8); 7, 409 (1, 0); 7, 403 (2, 8); 7, 394 (1, 8); 7, 385 (1, 0); 7, 373 (1, 2); 7, 153 (0, 9); 7, 148 (1, 6); 7, 143 (1, 1); 6, 961 (0, 8); 6, 900 (0, 5); 6, 760 (0, 8); 6, 753 (1, 5); 6, 747 (1, 1); 6, 724 (1, 1); 6, 720 (1, 3); 6, 717 (1, 2); 6, 713 (0, 9); 3, 855 (0, 7); 3, 051 (1, 3); 2, 881 (0, 4); 2, 871 (1, 1); 2, 862 (1, 6); 2, 853 (2, 4); 2, 843 (3, 0); 2, 834 (1, 8); 2, 826 (1, 3); 2, 816 (0, 6); 2, 476 (0, 8); 2, 472 (1, 3); 2, 467 (1, 8); 2, 462 (1, 4); 2, 427 (0, 5); 2, 391 (0, 4); 2, 383 (0, 3); 2, 359 (0, 4); 2, 327 (0, 5); 2, 182 (852, 2); 2, 138 (15, 6); 2, 121 (1,$

5); 2, 115 (2、2); 2, 109 (2、8); 2, 102 (2、4); 2, 096 (1、2); 1, 992 (0、9); 1, 966 (9、9); 1, 959 (26、3); 1, 954 (166、7); 1, 947 (309、9); 1, 941 (423、2); 1, 935 (291、5); 1, 929 (148、5); 1, 782 (0、9); 1, 776 (1、7); 1, 770 (2、4); 1, 764 (1、7); 1, 757 (0、9); 1, 437 (16、0); 1, 270 (1、6); 0, 790 (1、1); 0, 778 (3、3); 0, 773 (4、8); 0, 766 (2、0); 0, 760 (4、8); 0, 755 (4、0); 0, 743 (1、7); 0, 736 (0、5); 0, 614 (1、5); 0, 602 (4、2); 0, 593 (4、9); 0, 587 (4、7); 0, 575 (1、8); 0, 000 (1、7)

10

実施例 I-T46-3: $^1\text{H-NMR}$ (400, 0MHz、CD₃CN):

δ =8, 649 (2、9); 8, 643 (3、2); 7, 935 (2、9); 7, 929 (2、9); 7, 873 (7、9); 7, 322 (1、5); 7, 318 (2、7); 7, 313 (1、9); 6, 923 (1、5); 6, 917 (2、0); 6, 916 (2、3); 6, 910 (1、9); 6, 802 (1、7); 6, 798 (2、2); 6, 795 (2、0); 6, 790 (1、9); 3, 058 (16、0); 2, 790 (2、7); 2, 783 (0、4); 2, 772 (0、6); 2, 765 (0、6); 2, 757 (1、2); 2, 745 (0、7); 2, 738 (0、6); 2, 170 (18、1); 1, 966 (1、0); 1, 960 (2、0); 1, 954 (11、8); 1, 948 (21、8); 1, 941 (29、7); 1, 935 (20、7); 1, 929 (10、7); 1, 269 (0、6); 0, 844 (0、3); 0, 826 (0、4); 0, 783 (0、4); 0, 573 (1、4); 0, 528 (1、7); 0, 518 (1、1); 0, 511 (1、6); 0, 000 (7、0); -0, 008 (0、3)

20

30

実施例 I-T46-4: $^1\text{H-NMR}$ (400, 0MHz、CD₃CN):

δ =8, 649 (6、8); 8, 643 (7、0); 7, 990 (0、3); 7, 976 (7、4); 7, 970 (7、3); 7, 871 (16、0); 7, 320 (4、1); 7, 315 (6、6); 7, 310 (4、1); 6, 976 (1、8); 6, 920 (3、8); 6, 914 (4、9); 6, 912 (5、2); 6, 907 (4、0); 6, 805 (4、5); 6, 801 (4、8); 6, 798 (4、5); 6, 794 (3、8); 5, 448 (0、6); 2, 876 (0、4); 2, 867 (1、2); 2, 857 (1、7); 2, 849 (2、7); 2, 839 (2、8); 2, 831 (1、8); 2, 821 (1、3); 2, 811 (0、4); 2, 143 (54、7); 2, 114 (0、4); 2, 108 (0、4); 1, 965 (2、0); 1, 959 (5、3); 1, 953 (26、5); 1, 947 (48、2); 1, 941 (64、2); 1, 934 (44、7); 1, 928 (23、1); 1, 769 (0、4); 1, 269 (0、9); 1, 200 (0、4); 0, 799 (1、4); 0, 786 (4、5); 0, 781 (5、9); 0,

40

7 6 9 (6、1); 0, 7 6 3 (4、5); 0, 7 5 1 (1、9); 0, 6 1 4 (1、9); 0, 6 0 2 (5、1); 0, 5 9 7 (5、6); 0, 5 9 3 (5、0); 0, 5 8 7 (4、8); 0, 5 7 5 (1、4); 0, 0 0 8 (0、5); 0, 0 0 0 (15、3)

実施例 I-T 4 6-5: ^1H -NMR (400, 0MHz、CD₃CN):

δ =8, 6 9 3 (7、0); 8, 6 8 7 (7、3); 8, 0 3 4 (7、5); 8, 0 2 8 (7、5); 7, 8 7 3 (16、0); 7, 6 9 3 (1、3); 7, 3 3 5 (3、9); 7, 3 3 0 (6、8); 7, 3 2 5 (4、4); 6, 9 2 7 (3、7); 6, 9 2 2 (4、7); 6, 9 2 0 (5、0); 6, 9 1 4 (4、3); 6, 8 1 6 (4、3); 6, 8 1 2 (4、8); 6, 8 0 8 (4、4); 6, 8 0 4 (3、9); 5, 4 4 9 (14、1); 2, 1 7 3 (58、5); 2, 1 1 5 (0、4); 2, 1 0 9 (0、5); 2, 1 0 3 (0、4); 1, 9 6 6 (2、9); 1, 9 6 0 (5、1); 1, 9 5 4 (29、3); 1, 9 4 8 (53、8); 1, 9 4 1 (72、9); 1, 9 3 5 (50、8); 1, 9 2 9 (26、4); 1, 7 7 6 (0、3); 1, 7 7 0 (0、4); 1, 7 6 4 (0、3); 1, 6 0 2 (2、9); 1, 5 8 8 (7、3); 1, 5 8 1 (7、4); 1, 5 6 7 (3、9); 1, 5 5 1 (0、4); 1, 5 2 3 (0、7); 1, 5 0 5 (0、6); 1, 4 0 5 (0、5); 1, 3 6 5 (4、1); 1, 3 5 1 (7、2); 1, 3 4 5 (7、6); 1, 3 3 0 (3、0); 1, 2 6 9 (0、9); 1, 2 5 9 (0、5); 1, 2 0 0 (0、6); 1, 1 9 3 (0、4); 1, 1 8 7 (0、4); 1, 1 7 7 (0、5); 1, 1 7 1 (0、4); 0, 0 0 8 (0、4); 0, 0 0 0 (13、0)

実施例 I-T 4 6-6: ^1H -NMR (400, 0MHz、CD₃CN):

δ =8, 7 2 9 (1、0); 8, 6 9 2 (3、0); 8, 6 8 7 (3、0); 8, 1 4 5 (1、0); 7, 9 5 4 (3、0); 7, 9 4 9 (3、0); 7, 8 7 1 (14、1); 7, 3 2 5 (3、5); 7, 0 7 1 (0、6); 6, 9 2 6 (2、7); 6, 9 2 0 (3、2); 6, 9 1 4 (2、1); 6, 8 0 8 (2、6); 6, 8 0 3 (2、8); 6, 6 4 3 (1、1); 6, 4 9 6 (1、1); 3, 7 5 1 (1、8); 3, 6 5 9 (0、8); 3, 6 4 9 (0、9); 3, 6 4 3 (2、1); 3, 6 2 4 (1、8); 3, 1 5 9 (4、2); 3, 0 7 6 (1、9); 3, 0 6 2 (0、3); 2, 9 2 7 (16、0); 2, 9 0 5 (0、3); 2, 8 8 7 (0、3); 2, 8 7 4 (0、3); 2, 2 4 0 (1、1); 2, 1 7 6 (137、5); 2, 1 2 1 (0、6); 2, 1 1 5 (0、7); 2, 1 0 9 (0、7); 2, 1 0 3 (0、6); 2, 0 9 7 (0、4); 1, 9 6 6 (2、5); 1, 9 6 0 (6、5); 1, 9 5 4 (35、6); 1, 9 4 8 (65、4); 1, 9 4 2 (88、3); 1, 9 3 5 (62、6); 1, 9 2 9 (33、5); 1, 8 1 9 (1、0); 1, 8 1 1 (1、1); 1, 8 0 3 (2、6); 1, 7 9 4 (1、2); 1, 7 8 6 (1、1); 1, 7 7 6 (0、6); 1, 7 7 0 (0、8); 1, 7 6 4 (0、6); 1, 7 5 8 (0、4); 1, 6 9 8 (0、4); 1, 6 5 3 (4、1); 1, 5 9 9 (0、4); 1, 5 8 6 (0、3); 1, 5 4 8 (0、4); 1, 5 4 1 (0、4); 1, 5 2

3 (0、9); 1, 505 (1、0); 1, 468 (3、4); 1, 453 (1、6);
 1, 415 (1、4); 1, 405 (1、4); 1, 389 (9、5); 1, 358 (1、
 0); 1, 340 (1、1); 1, 315 (1、4); 1, 303 (3、2); 1, 28
 5 (4、6); 1, 270 (11、8); 1, 221 (12、0); 1, 214 (12、
 0); 1, 200 (3、3); 1, 193 (1、3); 1, 190 (1、5); 1, 17
 7 (1、0); 1, 172 (1、1); 1, 161 (0、7); 1, 121 (0、6);
 1, 107 (0、6); 1, 093 (0、9); 1, 057 (0、7); 0, 974 (0、
 4); 0, 957 (0、5); 0, 947 (0、6); 0, 934 (0、5); 0, 92
 3 (0、7); 0, 898 (1、3); 0, 882 (3、1); 0, 876 (2、5);
 0, 858 (2、8); 0, 840 (1、7); 0, 815 (0、6); 0, 000 (3、
 4)

10

¹) 規定質量は、最も高い強度の $[M+H]^+$ イオンの同位体パターンのピークである；
 $[M-H]^-$ イオンが検出された場合、規定質量は²で特定される。² 規定質量は、最も
 高い強度の $[M-H]^-$ イオンの同位体パターンのピークである。

^a) $\log P$ 値の決定および質量検出に関する注意： $\log P$ 値を、EEC Directive 79/831 Annex V. A8に従って、逆相カラム (C18) Agilent 1100 LCシステム；50×4.6 Zorbax Eclipse Plus C18 1.8ミクロン；溶離剤A：アセトニトリル (0.1%ギ酸)；溶離剤B：水 (0.09%ギ酸)；4.25分で10%アセトニトリル～95%アセトニトリル、次いでさらに1.25分にわたる95%アセトニトリルの直線グラジエント；オープン温度55℃；流速：2.0ml/分でのHPLC (高性能液体クロマトグラフィー) によって、決定した。Agilent MSDシステムによって、質量検出を達成する。

20

【0663】

生物学の実施例

リピセファルス・サングイネウスー成体ブラウニヌダニによるin vitroでの接触試験

30

試験管のコーティングのために、9mgの活性成分を1mlのアセトンp. a. 中に最初に溶解し、次いで、アセトンp. a. で所望の濃度に希釈した。250μlの溶液を、オービタルシェーカー上で旋回および揺動することによって (30rpmで2時間にわたる揺動回転)、25ml試験管の内壁および底に均一に分散させた。900ppmの活性成分溶液および内面積44.7cm²で、所定の均一分散により、5μg/cm²の面積当たりの容量が達成された。

【0664】

溶媒を留去した後、チューブに5～10の成体のイヌダニ (リピセファルス・サングイネウス) を入れ、穴の開いたプラスチック蓋で密封し、室温および周囲湿度の暗室で、水平位置でインキュベートした。48時間後、有効性を決定した。このために、マダニをチューブの底面に叩き落とし、ホットプレート上で、45～50℃で5分以下にわたってインキュベートした。上に向かってよじ登ることによって熱を意図的に避けることができない、底面上で静止したままの、またはまとまりのない状態で動くマダニは、死んでいるか、または瀕死状態であると判断した。

40

【0665】

この試験において、5μg/cm²の適用量で少なくとも80%の有効性が達成された場合、その物質は、リピセファルス・サングイネウスに対して良好な有効性を示す。100%の有効性とは、すべてのマダニが死んでいるか、または瀕死状態であったことを意味する。0%の有効性とは、マダニがまったく損傷を受けなかったことを意味する。

【0666】

50

この試験では、例えば、製造例により得られた以下の化合物が、 $5 \mu\text{g}/\text{cm}^2$ の適用量で100%の有効性を示した：I-T3-1、I-T3-3、I-T3-20、I-T3-21、I-T3-23、I-T3-24、I-T3-42、I-T3-44、I-T3-46、I-T3-47、I-T3-52、I-T3-53、I-T3-54、I-T3-55、I-T3-56、I-T3-61、I-T3-63、I-T3-71、I-T3-72、I-T3-81、I-T3-90、I-T3-91、I-T3-96、I-T3-97、I-T3-98、I-T3-104、I-T3-106、I-T3-109、I-T3-110、I-T3-112、I-T3-117、I-T3-119、I-T3-148、I-T3-155、I-T3-160、I-T3-161、I-T3-162、I-T3-163、I-T3-165、I-T3-175、I-T3-176、I-T3-189、I-T3-196、I-T4-1、I-T4-2、I-T4-3、I-T4-4、I-T22-2、I-T22-1、I-T22-4、I-T22-5、I-T22-6、I-T22-7。

10

【0667】

この試験では、例えば、製造例により得られた以下の化合物が、 $5 \mu\text{g}/\text{cm}^2$ の適用量で80%の有効性を示した：I-T3-38、I-T3-43、I-T3-80、I-T3-88、I-T3-92、I-T3-143。

【0668】

この試験では、例えば、製造例により得られた化合物が、 $1 \mu\text{g}/\text{cm}^2$ の適用量で100%の有効性を示した：I-T3-108、I-T3-114、I-T3-141。

20

【0669】

この試験では、例えば、製造例により得られた以下の化合物が、 $1 \mu\text{g}/\text{cm}^2$ の適用量で80%の有効性を示した：I-T3-94、I-T3-123。

【0670】

この試験では、例えば、製造例により得られた以下の化合物が、 $0.2 \mu\text{g}/\text{cm}^2$ の適用量で100%の有効性を示した：I-T3-105。

【0671】

この試験では、例えば、製造例により得られた以下の化合物が、 $0.2 \mu\text{g}/\text{cm}^2$ の適用量で80%の有効性を示した：I-T3-64。

【0672】

30

クテノセファリデス・フェリスー成体ネコノミによるin vitro接触試験

試験管のコートイングのために、9mgの活性成分を1mlのアセトンp. a.中に最初に溶解し、次いで、アセトンp. a.で所望の濃度に希釈した。250 μl の溶液を、オービタルシェーカー上で旋回および揺動することによって（30rpmで2時間にわたる揺動回転）、25ml試験管の内壁および底に均一に分散させた。900ppmの活性成分溶液および内面積44.7 cm^2 で、所定の均一分散により、 $5 \mu\text{g}/\text{cm}^2$ の面積当たりの容量が達成された。

【0673】

溶媒を留去した後、チューブに5～10の成体のネコノミ（クテノセファリデス・フェリス）を入れ、穴の開いたプラスチック蓋で密封し、室温および周囲湿度で、水平位置でインキュベートした。48時間後、有効性を決定した。このために、試験管を真っ直ぐ立てて、ノミを管の底に叩き落とした。底で静止したままの、またはまとまりのない状態で動くノミは、死んでいるか、または瀕死状態であると判断した。

40

【0674】

この試験において、 $5 \mu\text{g}/\text{cm}^2$ の適用量で少なくとも80%の有効性が達成された場合、その物質は、クテノセファリデス・フェリスに対して良好な有効性を示す。100%の有効性とは、すべてのノミが死んでいるか、または瀕死状態であったことを意味する。0%の有効性とは、ノミが損傷を受けなかったことを意味する。

【0675】

この試験では、例えば、製造例により得られた以下の化合物が、 $5 \mu\text{g}/\text{cm}^2$ （= 5

50

00 g/h a) の適用量で100%の有効性を示した：I-T3-1、I-T3-3、I-T3-7、I-T3-9、I-T3-17、I-T3-20、I-T3-21、I-T3-23、I-T3-24、I-T3-25、I-T3-27、I-T3-28、I-T3-29、I-T3-30、I-T3-31、I-T3-42、I-T3-43、I-T3-44、I-T3-46、I-T3-54、I-T3-55、I-T3-56、I-T3-57、I-T3-61、I-T3-63、I-T3-64、I-T3-71、I-T3-72、I-T3-80、I-T3-81、I-T3-84、I-T3-85、I-T3-86、I-T3-87、I-T3-88、I-T3-91、I-T3-92、I-T3-93、I-T3-94、I-T3-95、I-T3-96、I-T3-97、I-T3-98、I-T3-99、I-T3-100、I-T3-101、I-T3-102、I-T3-103、I-T3-106、I-T3-107、I-T3-108、I-T3-109、I-T3-110、I-T3-111、I-T3-112、I-T3-113、I-T3-114、I-T3-115、I-T3-116、I-T3-117、I-T3-118、I-T3-119、I-T3-120、I-T3-123、I-T3-124、I-T3-125、I-T3-127、I-T3-128、I-T3-129、I-T3-130、I-T3-131、I-T3-132、I-T3-133、I-T3-136、I-T3-137、I-T3-138、I-T3-143、I-T3-145、I-T3-147、I-T3-148、I-T3-155、I-T3-160、I-T3-162、I-T3-163、I-T3-165、I-T3-175、I-T3-176、I-T3-189、I-T3-196、I-T3-199、I-T4-2、I-T4-3、I-T4-4、I-T22-1、I-T22-2、I-T22-3、I-T22-5、I-T22-7、I-T23-1、I-T23-2、I-T46-2。

10

20

【0676】

アンブリオンマ・ヘバラエウム (Amblyomma hebaraeum) 試験

溶媒：ジメチルスルホキシド

【0677】

適切な活性成分製剤を製造するために、10mgの活性成分を0.5mlのジメチルスルホキシドと混合し、濃縮物を水で所望の濃度に希釈した。

【0678】

マダニ幼虫（アンブリオンマ・ヘバラエウム）を、穴の開いたプラスチックビーカーに入れ、所望の濃度に1分間浸漬した。マダニをペトリ皿の中の濾紙に移し、環境制御された棚で保管した。

30

【0679】

42日後、死滅を%で決定した。100%とはすべてのマダニが死滅したことを意味し、0%とはマダニがまったく死滅しなかったことを意味する。

【0680】

この試験では、例えば、製造例により得られた以下の化合物が、100ppmの適用量で100%の有効性を示した：I-T3-1、I-T3-3、I-T3-20、I-T3-21、I-T3-24、I-T3-28、I-T3-42、I-T3-43、I-T3-44、I-T3-54、I-T3-55、I-T3-56、I-T3-57、I-T3-63、I-T3-64、I-T3-71、I-T3-72、I-T3-81、I-T3-86、I-T3-91、I-T3-92、I-T3-95、I-T3-96、I-T3-97、I-T3-98、I-T3-100、I-T3-104、I-T3-106、I-T3-107、I-T3-108、I-T3-109、I-T3-110、I-T3-112、I-T3-114、I-T3-116、I-T3-117、I-T3-119、I-T3-124、I-T3-125、I-T3-131、I-T3-148、I-T3-155、I-T3-162、I-T3-163、I-T22-1、I-T22-2、I-T23-1、I-T4-3、I-T4-4。

40

【0681】

この試験では、例えば、製造例により得られた以下の化合物が、100ppmの適用量

50

で 95% の有効性を示した： I-T3-101。

【0682】

この試験では、例えば、製造例により得られた以下の化合物が、100ppm の適用量で 90% の有効性を示した： I-T3-102、I-T3-103。

【0683】

この試験では、例えば、製造例により得られた以下の化合物が、100ppm の適用量で 85% の有効性を示した： I-T3-105。

【0684】

この試験では、例えば、製造例により得られた以下の化合物が、100ppm の適用量で 80% の有効性を示した： I-T3-53、I-T3-61、I-T3-111、I-T3-123。

【0685】

ポオフィルス・ミクロプルス (*Boophilus microplus*) - 注入試験

溶媒：ジメチルスルホキシド

【0686】

適切な活性成分製剤を製造するために、10mg の活性成分を 0.5ml の溶媒と混合し、濃縮物を溶媒で所望の濃度に希釈した。

【0687】

1μl の活性成分溶液を、5匹の充血した成体の雌のオウシマダニ（ポオフィルス・ミクロプルス）の腹部に注入した。これらをディッシュに移し、環境制御された部屋で保持した。

【0688】

7日後、有精卵の産卵によって有効性を評価した。視覚的に受精していない卵を約 42 日後の幼虫孵化まで環境制御された棚に保管した。100% の有効性とはマダニがまったく有精卵を産卵しなかったことを意味し、0% とはすべての卵が受精していることを意味する。

【0689】

この試験では、例えば、製造例により得られた以下の化合物が、20μg/動物の適用量で 100% の有効性を示した： I-T2-1、I-T2-2、I-T3-1、I-T3-2、I-T3-3、I-T3-4、I-T3-5、I-T3-6、I-T3-7、I-T3-8、I-T3-9、I-T3-10、I-T3-11、I-T3-12、I-T3-13、I-T3-15、I-T3-17、I-T3-18、I-T3-19、I-T3-20、I-T3-21、I-T3-23、I-T3-24、I-T3-25、I-T3-26、I-T3-27、I-T3-28、I-T3-29、I-T3-30、I-T3-31、I-T3-32、I-T3-33、I-T3-34、I-T3-35、I-T3-36、I-T3-37、I-T3-38、I-T3-39、I-T3-40、I-T3-41、I-T3-42、I-T3-43、I-T3-44、I-T3-45、I-T3-46、I-T3-47、I-T3-48、I-T3-49、I-T3-50、I-T3-51、I-T3-52、I-T3-53、I-T3-54、I-T3-55、I-T3-56、I-T3-57、I-T3-58、I-T3-59、I-T3-60、I-T3-61、I-T3-62、I-T3-63、I-T3-64、I-T3-65、I-T3-66、I-T3-67、I-T3-68、I-T3-69、I-T3-70、I-T3-71、I-T3-72、I-T3-73、I-T3-74、I-T3-76、I-T3-77、I-T3-78、I-T3-79、I-T3-80、I-T3-81、I-T3-82、I-T3-83、I-T3-84、I-T3-85、I-T3-86、I-T3-87、I-T3-88、I-T3-89、I-T3-90、I-T3-91、I-T3-92、I-T3-93、I-T3-94、I-T3-95、I-T3-96、I-T3-97、I-T3-98、I-T3-99、I-T3-100、I-T3-101、I-T3-102、I-T3-103、I-T3-104、I-T3-105、I-T3-106、I-T3-107、I-T3-108、I-T3-109、I-T3-110、I

10

20

30

40

50

-T 3-1 1 1、I-T 3-1 1 2、I-T 3-1 1 3、I-T 3-1 1 4、I-T 3-1 1 5、I-T 3-1 1 6、I-T 3-1 1 7、I-T 3-1 1 8、I-T 3-1 1 9、
 I-T 3-1 2 0、I-T 3-1 2 3、I-T 3-1 2 4、I-T 3-1 2 5、I-T 3-1 2 6、I-T 3-1 2 7、I-T 3-1 2 8、I-T 3-1 2 9、I-T 3-1 3 0
 、I-T 3-1 3 1、I-T 3-1 3 2、I-T 3-1 3 3、I-T 3-1 3 6、I-T 3-1 3 7、I-T 3-1 4 5、I-T 3-1 3 9、I-T 3-1 4 0、I-T 3-1 4
 1、I-T 3-1 4 2、I-T 3-1 4 3、I-T 3-1 4 4、I-T 3-1 4 6、I-T 3-1 4 8、I-T 3-1 4 9、I-T 3-1 5 0、I-T 3-1 5 1、I-T 3-1
 5 5、I-T 3-1 6 0、I-T 3-1 6 1、I-T 3-1 6 2、I-T 3-1 6 3、I-T 3-1 6 5、I-T 3-1 6 8、I-T 3-1 7 5、I-T 3-1 7 6、I-T 3-1 7 8、I-T 3-1 7 9、I-T 4-1、I-T 4-2、I-T 4-3、I-T 4-4、I-T 2 2-1、I-T 2 2-2、I-T 2 2-3、I-T 2 2-4、I-T 2 2-5、I-T 2 2-6、I-T 2 2-7、I-T 2 3-1、I-T 2 3-2、I-T 4 6-2。

10

【0690】

この試験では、例えば、製造例により得られた以下の化合物が、 $20 \mu\text{g}$ ／動物の適用量で90%の有効性を示した：I-T 3-7 5。

【0691】

この試験では、例えば、製造例により得られた以下の化合物が、 $20 \mu\text{g}$ ／動物の適用量で80%の有効性を示した：I-T 3-1 2 1。

20

【0692】

ボオフィルス・ミクロプルスー浸漬試験

試験動物：オウシマダニ（ボオフィルス・ミクロプルス）パークスト（Parkhurst）株、SP-耐性

【0693】

溶媒：ジメチルスルホキシド

【0694】

10 mg の活性成分を 0.5 ml のジメチルスルホキシド中に溶解した。好適な製剤を製造するために、活性成分溶液を水でそれぞれの場合に所望の濃度に希釈した。

【0695】

この活性成分製剤をピペットでチューブに入れた。8～10匹の成体の充血した雌のオウシマダニ（ボオフィルス・ミクロプルス）を穴の開いた別のチューブに移した。このチューブを活性成分製剤中に浸漬し、すべてのマダニを完全に湿らせた。液体がなくなった後、マダニをプラスチック皿中のフィルタディスクに移し、環境制御された部屋で保管した。

30

【0696】

7日後、有精卵の産卵によって有効性を評価した。視覚的に受精していない卵を約42日後の幼虫孵化まで環境制御された棚に保管した。100%の有効性とはマダニがまったく有精卵を産卵しなかったことを意味し、0%とはすべての卵が受精していることを意味する。

【0697】

この試験では、例えば、製造例により得られた以下の化合物が、 100 ppm の適用量で100%の有効性を示した：I-T 3-1、I-T 3-3、I-T 3-2 0、I-T 3-2 1、I-T 3-2 4、I-T 3-2 8、I-T 3-3 9、I-T 3-4 2、I-T 3-4 3、I-T 3-4 4、I-T 3-4 8、I-T 3-5 3、I-T 3-5 4、I-T 3-5 5、I-T 3-5 6、I-T 3-5 7、I-T 3-6 1、I-T 3-6 3、I-T 3-6 4、I-T 3-7 1、I-T 3-7 2、I-T 3-8 1、I-T 3-8 6、I-T 3-9 1、I-T 3-9 2、I-T 3-9 5、I-T 3-9 6、I-T 3-9 7、I-T 3-9 8、I-T 3-1 0 0、I-T 3-1 0 1、I-T 3-1 0 2、I-T 3-1 0 3、I-T 3-1 0 4、I-T 3-1 0 6、I-T 3-1 0 7、I-T 3-1 0 8、I-T 3-1 0 9、I-T 3-1 1 0、I-T 3-1 1 2、I-T 3-1 1 3、I-T 3-1 1 4

40

50

、I-T3-115、I-T3-116、I-T3-117、I-T3-118、I-T3-119、I-T3-120、I-T3-123、I-T3-124、I-T3-125、I-T3-130、I-T3-131、I-T3-133、I-T3-148、I-T3-155、I-T3-160、I-T3-162、I-T3-163、I-T3-165、I-T3-175、I-T3-176、I-T4-3、I-T4-4、I-T22-1、I-T22-2、I-T22-4、I-T22-5、I-T22-6、I-T22-7、I-T23-1。

【0698】

この試験では、例えば、製造例により得られた以下の化合物が、100ppmの適用量で98%の有効性を示した：I-T3-111。

10

【0699】

この試験では、例えば、製造例により得られた以下の化合物が、100ppmの適用量で90%の有効性を示した：I-T3-99。

【0700】

この試験では、例えば、製造例により得られた以下の化合物が、100ppmの適用量で80%の有効性を示した：I-T3-27、I-T3-80。

【0701】

クテノセファリデス・フェリスー経口試験

溶媒：ジメチルスルホキシド

【0702】

適切な活性成分製剤を製造するために、10mgの活性成分を0.5mlのジメチルスルホキシドと混合した。クエン酸ウシ血で希釈して所望の濃度とした。

20

【0703】

約20の餌を与えていない成体ネコノミ（クテノセファリデス・フェリス）を、頂部および底部をガーゼで閉じたチャンバ内に入れた。底部端をパラフィルムで閉じた金属シリンダをチャンバの上に置いた。シリンダは血液／活性成分製剤を含有し、それはパラフィルム膜を通してノミによって摂取され得る。

【0704】

2日後、死滅を%で決定した。100%とはすべてのノミが死滅したことを意味し、0%とはノミがまったく死滅しなかったことを意味する。

30

この試験では、例えば、製造例により得られた以下の化合物が、100ppmの適用量で100%の有効性を示した：I-T3-1、I-T3-2、I-T3-3、I-T3-4、I-T3-5、I-T3-7、I-T3-8、I-T3-9、I-T3-10、I-T3-12、I-T3-18、I-T3-20、I-T3-21、I-T3-23、I-T3-24、I-T3-25、I-T3-26、I-T3-27、I-T3-28、I-T3-29、I-T3-30、I-T3-31、I-T3-32、I-T3-33、I-T3-34、I-T3-35、I-T3-38、I-T3-39、I-T3-40、I-T3-42、I-T3-43、I-T3-44、I-T3-46、I-T3-47、I-T3-48、I-T3-49、I-T3-50、I-T3-51、I-T3-52、I-T3-53、I-T3-54、I-T3-55、I-T3-56、I-T3-57、I-T3-58、I-T3-59、I-T3-61、I-T3-62、I-T3-63、I-T3-64、I-T3-65、I-T3-66、I-T3-67、I-T3-68、I-T3-69、I-T3-71、I-T3-72、I-T3-73、I-T3-76、I-T3-77、I-T3-78、I-T3-80、I-T3-81、I-T3-84、I-T3-85、I-T3-86、I-T3-87、I-T3-88、I-T3-89、I-T3-90、I-T3-91、I-T3-92、I-T3-93、I-T3-94、I-T3-95、I-T3-96、I-T3-97、I-T3-98、I-T3-99、I-T3-100、I-T3-101、I-T3-102、I-T3-103、I-T3-104、I-T3-105、I-T3-106、I-T3-107、I-T3-108、I-T3-109、I-T3-110、I-T3-111、I-T3-112、I-T3-1

40

50

13、I-T3-114、I-T3-115、I-T3-116、I-T3-117、I-T3-118、I-T3-119、I-T3-120、I-T3-123、I-T3-124、I-T3-125、I-T3-127、I-T3-128、I-T3-129、I-T3-130、I-T3-131、I-T3-132、I-T3-133、I-T3-135、I-T3-136、I-T3-137、I-T3-139、I-T3-140、I-T3-141、I-T3-143、I-T3-145、I-T3-146、I-T3-148、I-T3-149、I-T3-150、I-T3-151、I-T3-155、I-T3-160、I-T3-161、I-T3-162、I-T3-163、I-T3-165、I-T3-168、I-T3-175、I-T3-176、I-T3-189、I-T4-1、I-T4-2、I-T4-3、I-T4-4、I-T22-1、I-T22-2、I-T22-3、I-T22-4、I-T22-5、I-T22-7、I-T23-1、I-T23-2、I-T46-2。

この試験では、例えば、製造例により得られた以下の化合物が、100ppmの適用量で95%の有効性を示した：I-T3-11、I-T3-17、I-T3-19、I-T3-41、I-T3-45、I-T3-70、I-T3-79、I-T3-82、I-T3-83、I-T22-6。

この試験では、例えば、製造例により得られた以下の化合物が、100ppmの適用量で90%の有効性を示した：I-T3-15、I-T3-37、I-T3-60、I-T3-126、I-T3-144。

この試験では、例えば、製造例により得られた以下の化合物が、100ppmの適用量で80%の有効性を示した：I-T3-13、I-T3-16、I-T3-36。

【0705】

ルキリア・クプリナ試験

溶媒：ジメチルスルホキシド

【0706】

適切な活性成分製剤を製造するために、10mgの活性成分を0.5mlのジメチルスルホキシドと混合し、濃縮物を水で所望の濃度に希釈した。

【0707】

約20匹のオーストラリアヒツジクロバエ（ルキリア・クプリナ）のL1幼虫を、ミンチ馬肉および所望の濃度の活性成分製剤を含有する試験容器に移した。

【0708】

2日後、死滅を%で決定した。100%とはすべての幼虫が死滅したことを意味し、0%とは幼虫がまったく死滅しなかったことを意味する。

【0709】

この試験では、例えば、製造例により得られた以下の化合物が、100ppmの適用量で100%の有効性を示した：I-T3-1、I-T3-2、I-T3-3、I-T3-4、I-T3-5、I-T3-6、I-T3-7、I-T3-8、I-T3-9、I-T3-10、I-T3-15、I-T3-17、I-T3-18、I-T3-20、I-T3-21、I-T3-23、I-T3-24、I-T3-25、I-T3-26、I-T3-27、I-T3-28、I-T3-29、I-T3-30、I-T3-31、I-T3-32、I-T3-33、I-T3-34、I-T3-35、I-T3-36、I-T3-37、I-T3-38、I-T3-39、I-T3-40、I-T3-42、I-T3-43、I-T3-44、I-T3-45、I-T3-46、I-T3-47、I-T3-48、I-T3-49、I-T3-50、I-T3-51、I-T3-52、I-T3-53、I-T3-54、I-T3-55、I-T3-56、I-T3-57、I-T3-58、I-T3-59、I-T3-61、I-T3-62、I-T3-63、I-T3-64、I-T3-65、I-T3-66、I-T3-67、I-T3-68、I-T3-70、I-T3-71、I-T3-72、I-T3-73、I-T3-77、I-T3-78、I-T3-80、I-T3-81、I-T3-82、I-T3-83、I-T3-84、I-T3-85、I-T3-86、I-T3-87、I-T3-88、I-T

3-89、I-T3-90、I-T3-91、I-T3-92、I-T3-93、I-T3-94、I-T3-96、I-T3-97、I-T3-98、I-T3-99、I-T3-100、I-T3-101、I-T3-102、I-T3-103、I-T3-104、I-T3-105、I-T3-106、I-T3-107、I-T3-108、I-T3-109、I-T3-110、I-T3-111、I-T3-112、I-T3-113、I-T3-114、I-T3-115、I-T3-116、I-T3-117、I-T3-118、I-T3-119、I-T3-120、I-T3-123、I-T3-124、I-T3-125、I-T3-130、I-T3-131、I-T3-133、I-T3-136、I-T3-139、I-T3-140、I-T3-141、I-T3-143、I-T3-144、I-T3-145、I-T3-148、I-T3-149、I-T3-150、I-T3-151、I-T3-155、I-T3-160、I-T3-161、I-T3-162、I-T3-163、I-T3-165、I-T3-168、I-T3-175、I-T3-176、I-T3-189、I-T4-1、I-T4-2、I-T4-3、I-T4-4、I-T22-1、I-T22-2、I-T22-3、I-T22-5、I-T22-6、I-T22-7、I-T23-1、I-T23-2、I-T46-2。

【0710】

この試験では、例えば、製造例により得られた以下の化合物が、100ppmの適用量で95%の有効性を示した：I-T3-69。

【0711】

この試験では、例えば、製造例により得られた以下の化合物が、100ppmの適用量で90%の有効性を示した：I-T3-41、I-T3-60、I-T3-74、I-T3-76、I-T3-127、I-T3-146。

【0712】

この試験では、例えば、製造例により得られた以下の化合物が、100ppmの適用量で80%の有効性を示した：I-T3-12、I-T3-75、I-T3-79、I-T3-121、I-T3-137。

【0713】

ムスカ・ドメスチカ試験

溶媒：ジメチルスルホキシド

【0714】

適切な活性成分製剤を製造するために、10mgの活性成分を0.5mlのジメチルスルホキシドと混合し、濃縮物を水で所望の濃度に希釈。

【0715】

糖溶液と所望の濃度の活性成分製剤で処理されたスポンジを含む容器に、10匹の成体のイエバエ（ムスカ・ドメスチカ）を入れた。

【0716】

2日後、死滅を%で決定した。100%とはすべてのハエが死滅したことを意味し、0%とはハエがまったく死滅しなかったことを意味する。

【0717】

この試験では、例えば、製造例により得られた以下の化合物が、100ppmの適用量で100%の有効性を示した：I-T3-1、I-T3-2、I-T3-3、I-T3-4、I-T3-5、I-T3-8、I-T3-20、I-T3-21、I-T3-23、I-T3-24、I-T3-25、I-T3-26、I-T3-27、I-T3-29、I-T3-31、I-T3-34、I-T3-38、I-T3-42、I-T3-43、I-T3-46、I-T3-48、I-T3-52、I-T3-53、I-T3-54、I-T3-55、I-T3-56、I-T3-57、I-T3-58、I-T3-61、I-T3-62、I-T3-63、I-T3-64、I-T3-65、I-T3-71、I-T3-72、I-T3-73、I-T3-77、I-T3-80、I-T3-84、I-T3-85、I-T3-86、I-T3-87、I-T3-89、I-T3-91、

I-T3-92、I-T3-93、I-T3-94、I-T3-96、I-T3-97、
I-T3-100、I-T3-101、I-T3-102、I-T3-103、I-T3-
104、I-T3-106、I-T3-107、I-T3-108、I-T3-109
、I-T3-110、I-T3-111、I-T3-112、I-T3-113、I-T
3-114、I-T3-115、I-T3-116、I-T3-117、I-T3-11
8、I-T3-119、I-T3-120、I-T3-123、I-T3-124、I-
T3-125、I-T3-130、I-T3-131、I-T3-133、I-T3-1
36、I-T3-137、I-T3-141、I-T3-143、I-T3-144、I-
T3-148、I-T3-149、I-T3-150、I-T3-151、I-T3-
155、I-T3-160、I-T3-161、I-T3-162、I-T3-163、
I-T3-165、I-T3-175、I-T3-176、I-T3-189、I-T4
-2、I-T22-1、I-T22-2、I-T22-3、I-T22-5、I-T22
-7、I-T23-1、I-T23-2。

10

【0718】

この試験では、例えば、製造例により得られた以下の化合物が、100ppmの適用量で95%の有効性を示した：I-T3-51。

【0719】

この試験では、例えば、製造例により得られた以下の化合物が、100ppmの適用量で90%の有効性を示した：I-T3-30、I-T3-67、I-T3-76、I-T
3-81、I-T3-90、I-T3-98、I-T3-99、I-T3-139、I-
T3-145、I-T22-6。

20

【0720】

この試験では、例えば、製造例により得られた以下の化合物が、100ppmの適用量で80%の有効性を示した：I-T3-7、I-T3-66、I-T3-68、I-T3
-79、I-T3-88、I-T3-105、I-T3-121、I-T3-129。

【0721】

この試験では、例えば、製造例により得られた以下の化合物が、20ppmの適用量で80%の有効性を示した：I-T3-28。

【0722】

この試験では、例えば、製造例により得られた以下の化合物が、4ppmの適用量で80%の有効性を示した：I-T3-35。

30

【0723】

メロイドギネ・インコグニタ試験

溶媒：125.0重量部のアセトン

【0724】

適切な活性成分製剤を製造するために、1重量部の活性成分を規定量の溶媒と混合し、その濃縮物を水で所望の濃度に希釈した。

【0725】

容器を砂、活性成分溶液、サツマイモネコブセンチュウ（メロイドギネ・インコグニタ）の卵／幼虫の懸濁液、およびレタス種子で満たした。レタス種子を発芽させ、植物を発育させた。根の上に瘤を発達させた。

40

【0726】

14日後、瘤の形成によって、殺線虫の有効性を%で決定した。100%とは瘤が発見されなかったことを意味し、0%とは処理された植物上の瘤の数が処理されていない対照と一致することを意味する。

【0727】

この試験では、例えば、製造例により得られた以下の化合物が、20ppmの適用量で90%の有効性を示した：I-T3-27、I-T3-28、I-T3-184、I-T
3-185。

【0728】

50

ミズス・ペルシカエー噴霧試験

溶媒：７８重量部のアセトンおよび１．５重量部のジメチルホルムアミド

【０７２９】

乳化剤：アルキルアリールポリグリコールエーテル

【０７３０】

適切な活性成分製剤を製造するために、１重量部の活性成分を所定の重量部の溶媒を使用して溶解し、所望の濃度に達するまで１０００ppmの乳化剤濃縮物を含有する水を添加した。さらなる試験濃縮物を製造するために、製剤を乳化剤を含有する水で希釈した。

【０７３１】

すべてのステージのモモアカアブラムシ（ミズス・ペルシカエ）が寄生した白菜（ブラシカ・ペキネンシス（*Brassica pekinensis*））の葉のディスクに、所望の濃度の活性成分製剤を噴霧した。

10

【０７３２】

６日後、有効性を％で決定した。１００％とはすべてのアブラムシが死滅したことを意味し、０％とはアブラムシがまったく死滅しなかったことを意味する。

【０７３３】

この試験では、例えば、製造例により得られた以下の化合物が、５００g／haの適用量で１００％の有効性を示した：I-T3-7、I-T3-20、I-T3-43、I-T3-44、I-T3-46、I-T3-92、I-T3-100、I-T3-106、I-T3-107、I-T3-108、I-T3-110、I-T3-122、I-T3-185、I-T3-187。

20

【０７３４】

この試験では、例えば、製造例により得られた以下の化合物が、５００g／haの適用量で９０％の有効性を示した：I-T3-8、I-T3-21、I-T3-29、I-T3-30、I-T3-42、I-T3-91、I-T3-97、I-T3-103、I-T3-105、I-T3-109、I-T3-114、I-T3-117、I-T3-119、I-T3-120、I-T3-186。

【０７３５】

この試験では、例えば、製造例により得られた以下の化合物が、１００g／haの適用量で１００％の有効性を示した：I-T3-1、I-T3-3、I-T3-27、I-T3-54、I-T3-55、I-T3-77、I-T3-88、I-T3-99、I-T3-101、I-T3-112、I-T3-113、I-T3-115、I-T3-116、I-T3-118、I-T3-120、I-T3-123、I-T3-124、I-T3-125、I-T3-127、I-T3-128、I-T3-129、I-T3-130、I-T3-162、I-T3-165、I-T3-170、I-T3-174、I-T3-175、I-T3-176、I-T3-179、I-T3-184、I-T3-189、I-T22-1、I-T22-2、I-T22-5、I-T22-7。

30

【０７３６】

この試験では、例えば、製造例により得られた以下の化合物が、１００g／haの適用量で９０％の有効性を示した：I-T3-28、I-T3-38、I-T3-39、I-T3-53、I-T3-64、I-T3-72、I-T3-76、I-T3-80、I-T3-81、I-T3-85、I-T3-87、I-T3-95、I-T3-96、I-T3-98、I-T3-131、I-T3-132、I-T3-145、I-T3-160、I-T3-164、I-T3-163、I-T4-3。

40

【０７３７】

この試験では、例えば、製造例により得られた以下の化合物が、２０g／haの適用量で９０％の有効性を示した：I-T3-182、I-T4-2。

【０７３８】

ファエドン・コクレアリエー噴霧試験

溶媒：７８．０重量部のアセトンおよび１．５重量部のジメチルホルムアミド

50

【0739】

乳化剤：アルキルアリールポリグリコールエーテル

【0740】

適切な活性成分製剤を製造するために、1重量部の活性成分を所定の重量部の溶媒を使用して溶解し、所望の濃度に達するまで1000ppmの乳化剤濃縮物を含有する水を添加した。さらなる試験濃縮物を製造するために、製剤を乳化剤を含有する水で希釈した。

【0741】

白菜（ブラシカ・ペキネンシス）の葉のディスクに所望の濃度の活性成分製剤を噴霧し、乾燥後、マスタービートル（ファエドン・コクレアリエ）の幼虫を入れた。

【0742】

7日後、有効性を%で決定した。100%とはマスタービートルの幼虫が死滅したことを意味し、0%とはマスタービートルの幼虫が死滅しなかったことを意味する。

【0743】

この試験では、例えば、製造例により得られた以下の化合物が、500g/haの適用量で100%の有効性を示した：I-T3-7、I-T3-8、I-T3-9、I-T3-10、I-T3-12、I-T3-15、I-T3-17、I-T3-18、I-T3-19、I-T3-20、I-T3-21、I-T3-22、I-T3-23、I-T3-24、I-T3-25、I-T3-26、I-T3-29、I-T3-30、I-T3-31、I-T3-34、I-T3-35、I-T3-36、I-T3-37、I-T3-42、I-T3-43、I-T3-44、I-T3-45、I-T3-46、I-T3-47、I-T3-65、I-T3-66、I-T3-67、I-T3-68、I-T3-69、I-T3-70、I-T3-73、I-T3-74、I-T3-75、I-T3-76、I-T3-77、I-T3-78、I-T3-79、I-T3-89、I-T3-90、I-T3-91、I-T3-92、I-T3-96、I-T3-97、I-T3-98、I-T3-100、I-T3-101、I-T3-102、I-T3-103、I-T3-104、I-T3-105、I-T3-106、I-T3-107、I-T3-108、I-T3-109、I-T3-110、I-T3-111、I-T3-112、I-T3-113、I-T3-114、I-T3-115、I-T3-116、I-T3-117、I-T3-118、I-T3-119、I-T3-120、I-T3-126、I-T3-184、I-T3-185、I-T3-186、I-T3-187、I-T3-188、I-T23-1、I-T23-2。

【0744】

この試験では、例えば、製造例により得られた以下の化合物が、100g/haの適用量で100%の有効性を示した：I-T2-1、I-T2-2、I-T3-1、I-T3-2、I-T3-3、I-T3-4、I-T3-5、I-T3-6、I-T3-27、I-T3-28、I-T3-38、I-T3-39、I-T3-40、I-T3-41、I-T3-48、I-T3-49、I-T3-50、I-T3-51、I-T3-52、I-T3-53、I-T3-54、I-T3-55、I-T3-56、I-T3-57、I-T3-58、I-T3-59、I-T3-61、I-T3-62、I-T3-63、I-T3-64、I-T3-71、I-T3-72、I-T3-80、I-T3-81、I-T3-82、I-T3-83、I-T3-84、I-T3-85、I-T3-86、I-T3-87、I-T3-88、I-T3-93、I-T3-94、I-T3-95、I-T3-99、I-T3-123、I-T3-124、I-T3-125、I-T3-127、I-T3-128、I-T3-129、I-T3-130、I-T3-131、I-T3-132、I-T3-133、I-T3-136、I-T3-137、I-T3-139、I-T3-140、I-T3-141、I-T3-143、I-T3-144、I-T3-145、I-T3-148、I-T3-149、I-T3-151、I-T3-152、I-T3-153、I-T3-155、I-T3-160、I-T3-161、I-T3-162、I-T3-163、I-T3-164、I-T3-165、I-T3-168、I-T3-169、I-T3-170、I-T3-171、I-T3-17

10

20

30

40

50

2、I-T3-174、I-T3-175、I-T3-176、I-T3-177、I-T3-178、I-T3-179、I-T3-180、I-T3-181、I-T3-182、I-T3-183、I-T3-189、I-T3-190、I-T3-191、I-T3-192、I-T3-195、I-T3-197、I-T3-198、I-T3-220、I-T3-221、I-T3-222、I-T3-223、I-T4-1、I-T4-2、I-T4-3、I-T4-4、I-T22-1、I-T22-2、I-T22-3、I-T22-4、I-T22-5、I-T22-6、I-T22-7、I-T46-2、I-T46-3、I-T46-4、I-T46-5、I-T46-6。

【0745】

この試験では、例えば、製造例により得られた以下の化合物が、100g/haの適用量で83%の有効性を示した：I-T3-138。

10

【0746】

スポドプテラ・フルギペルダー噴霧試験

溶媒：78.0重量部のアセトンおよび1.5重量部のジメチルホルムアミド

【0747】

乳化剤：アルキルアリールポリグリコールエーテル

【0748】

適切な活性成分製剤を製造するために、1重量部の活性成分を所定の重量部の溶媒を使用して溶解し、所望の濃度に達するまで1000ppmの乳化剤濃縮物を含有する水を添加した。さらなる試験濃縮物を製造するために、製剤を乳化剤を含有する水で希釈した。

20

【0749】

トウモロコシ（ゼア・メイズ）の葉ディスクに所望の濃度の活性成分製剤を噴霧し、乾燥後、ヨトウムシ（スポドプテラ・フルギペルダ）の毛虫を入れた。

【0750】

7日後、有効性を%で決定した。100%とはすべての毛虫が死滅したことを意味し、0%とは毛虫が死滅しなかったことを意味する。

【0751】

この試験では、例えば、製造例により得られた以下の化合物が、500g/haの適用量で100%の有効性を示した：I-T3-7、I-T3-8、I-T3-9、I-T3-10、I-T3-12、I-T3-17、I-T3-18、I-T3-19、I-T3-20、I-T3-21、I-T3-22、I-T3-23、I-T3-24、I-T3-25、I-T3-26、I-T3-29、I-T3-30、I-T3-31、I-T3-34、I-T3-42、I-T3-43、I-T3-44、I-T3-45、I-T3-46、I-T3-47、I-T3-65、I-T3-66、I-T3-67、I-T3-68、I-T3-69、I-T3-70、I-T3-73、I-T3-74、I-T3-75、I-T3-76、I-T3-77、I-T3-78、I-T3-79、I-T3-89、I-T3-90、I-T3-91、I-T3-92、I-T3-96、I-T3-97、I-T3-98、I-T3-100、I-T3-102、I-T3-103、I-T3-104、I-T3-105、I-T3-106、I-T3-107、I-T3-108、I-T3-109、I-T3-110、I-T3-111、I-T3-112、I-T3-113、I-T3-114、I-T3-115、I-T3-116、I-T3-117、I-T3-118、I-T3-119、I-T3-120、I-T3-126、I-T3-184、I-T3-185、I-T3-186、I-T3-187、I-T23-1、I-T23-2。

30

40

【0752】

この試験では、例えば、製造例により得られた以下の化合物が、500g/haの適用量で83%の有効性を示した：I-T3-101。

【0753】

この試験では、例えば、製造例により得られた以下の化合物が、100g/haの適用量で100%の有効性を示した：I-T2-2、I-T3-1、I-T3-2、I-T3

50

- 3、I-T 3-4、I-T 3-27、I-T 3-28、I-T 3-38、I-T 3-39、I-T 3-40、I-T 3-41、I-T 3-48、I-T 3-52、I-T 3-53、I-T 3-54、I-T 3-55、I-T 3-56、I-T 3-57、I-T 3-58、I-T 3-61、I-T 3-62、I-T 3-63、I-T 3-64、I-T 3-71、I-T 3-72、I-T 3-80、I-T 3-81、I-T 3-82、I-T 3-83、I-T 3-84、I-T 3-85、I-T 3-86、I-T 3-87、I-T 3-88、I-T 3-93、I-T 3-94、I-T 3-95、I-T 3-99、I-T 3-123、I-T 3-124、I-T 3-125、I-T 3-130、I-T 3-131、I-T 3-133、I-T 3-136、I-T 3-137、I-T 3-138、I-T 3-139、I-T 3-140、I-T 3-141、I-T 3-143、I-T 3-145、I-T 3-148、I-T 3-151、I-T 3-152、I-T 3-155、I-T 3-160、I-T 3-161、I-T 3-162、I-T 3-163、I-T 3-164、I-T 3-165、I-T 3-170、I-T 3-174、I-T 3-175、I-T 3-176、I-T 3-189、I-T 3-191、I-T 3-192、I-T 3-197、I-T 3-198、I-T 4-1、I-T 4-2、I-T 4-3、I-T 4-4、I-T 22-1、I-T 22-2、I-T 22-3、I-T 22-5、I-T 22-7、I-T 46-2、I-T 46-3、I-T 46-4、I-T 46-5、I-T 46-6。

10

【0754】

この試験では、例えば、製造例により得られた以下の化合物が、100 g/haの適用量で83%の有効性を示した：I-T 3-35、I-T 3-50、I-T 3-169、I-T 3-177。

20

【0755】

テトラニクス・ウルティカエー噴霧試験、OP耐性

溶媒：78.0重量部のアセトンおよび1.5重量部のジメチルホルムアミド

【0756】

乳化剤：アルキルアリアルポリグリコールエーテル

【0757】

適切な活性成分製剤を製造するために、1重量部の活性成分を所定の重量部の溶媒を使用して溶解し、所望の濃度に達するまで1000 ppmの乳化剤濃縮物を含有する水を添加した。さらなる試験濃縮物を製造するために、製剤を乳化剤を含有する水で希釈した。

30

【0758】

すべてのステージの温室アカハダニ（テトラニクス・ウルティカエ）が寄生したマメ（ファセオルス・ブルガリス）の葉のディスクに所望の濃度の活性成分製剤を噴霧した。

【0759】

6日後、有効性を%で決定した。100%とはすべてのハダニが死滅したことを意味し、0%とはハダニがまったく死滅しなかったことを意味する。

【0760】

この試験では、例えば、製造例により得られた以下の化合物が、500 g/haの適用量で100%の有効性を示した：I-T 3-7、I-T 3-8、I-T 3-9、I-T 3-10、I-T 3-20、I-T 3-21、I-T 3-22、I-T 3-23、I-T 3-24、I-T 3-26、I-T 3-29、I-T 3-30、I-T 3-31、I-T 3-34、I-T 3-42、I-T 3-43、I-T 3-44、I-T 3-45、I-T 3-46、I-T 3-47、I-T 3-69、I-T 3-75、I-T 3-76、I-T 3-77、I-T 3-78、I-T 3-91、I-T 3-92、I-T 3-96、I-T 3-97、I-T 3-98、I-T 3-100、I-T 3-101、I-T 3-103、I-T 3-106、I-T 3-107、I-T 3-108、I-T 3-109、I-T 3-110、I-T 3-112、I-T 3-113、I-T 3-114、I-T 3-115、I-T 3-119、I-T 3-120、I-T 3-184、I-T 3-185、I-T 3-186、I-T 3-187、I-T 23-1、I-T 23-2。

40

【0761】

50

この試験では、例えば、製造例により得られた以下の化合物が、500 g / ha の適用量で90%の有効性を示した：I-T3-25、I-T3-65、I-T3-70、I-T3-89、I-T3-90、I-T3-102、I-T3-104、I-T3-105、I-T3-116、I-T3-117、I-T3-118。

【0762】

この試験では、例えば、製造例により得られた以下の化合物が、100 g / ha の適用量で100%の有効性を示した：I-T3-1、I-T3-2、I-T3-3、I-T3-4、I-T3-27、I-T3-28、I-T3-38、I-T3-39、I-T3-41、I-T3-51、I-T3-53、I-T3-54、I-T3-55、I-T3-56、I-T3-57、I-T3-58、I-T3-61、I-T3-62、I-T3-63、I-T3-64、I-T3-72、I-T3-73、I-T3-80、I-T3-81、I-T3-82、I-T3-83、I-T3-84、I-T3-85、I-T3-86、I-T3-87、I-T3-88、I-T3-93、I-T3-94、I-T3-95、I-T3-99、I-T3-124、I-T3-125、I-T3-127、I-T3-129、I-T3-130、I-T3-131、I-T3-132、I-T3-133、I-T3-139、I-T3-145、I-T3-146、I-T3-155、I-T3-160、I-T3-161、I-T3-162、I-T3-163、I-T3-164、I-T3-165、I-T3-168、I-T3-169、I-T3-170、I-T3-174、I-T3-175、I-T3-176、I-T3-177、I-T3-178、I-T3-179、I-T3-180、I-T3-181、I-T3-182、I-T3-183、I-T3-189、I-T3-190、I-T3-192、I-T3-197、I-T3-221、I-T3-222、I-T3-223、I-T4-1、I-T4-2、I-T4-3、I-T4-4、I-T22-4、I-T22-5、I-T22-7、I-T46-4、I-T46-5、I-T46-6。

10

20

【0763】

この試験では、例えば、製造例により得られた以下の化合物が、100 g / ha の適用量で90%の有効性を示した：I-T3-50、I-T3-52、I-T3-71、I-T3-74、I-T3-111、I-T3-123、I-T3-137、I-T3-138、I-T3-147、I-T3-148、I-T3-151、I-T3-172、I-T3-195、I-T22-1、I-T22-2、I-T22-3。

30

【0764】

この試験では、例えば、製造例により得られた以下の化合物が、20 g / ha の適用量で100%の有効性を示した：I-T3-49。

【0765】

アノフェレス試験（ANPHGB表面処理）

溶媒：アセトン+2000 ppmナタネ油メチルエステル（RME）

【0766】

適切な活性成分製剤を製造するために、活性成分を溶媒（2 mg / ml）中に溶解した。活性成分製剤を施釉タイル上にピペットで移し、乾燥させた後、アノフェレス・ガンビエ種の株RSPH（ホモ接合体kdr）の成体のカを処理されたタイルの上に置いた。露出時間は30分間とした。

40

【0767】

処理表面との接触の24時間後、死亡率を%で決定した。100%とはすべてのカが死滅したことを意味し、0%とはカがまったく死滅しなかったことを意味する。

【0768】

この試験では、例えば、製造例により得られた以下の化合物が、100 mg / m² の適用量で90~100%の有効性を示した：I-T3-20、I-T3-24、I-T3-27、I-T3-28、I-T3-43、I-T3-52、I-T3-53、I-T3-54、I-T3-56、I-T3-57、I-T3-61、I-T3-100、I-T3-102、I-T3-112、I-T3-123、I-T3-130、I-T3-133

50

、I-T3-134、I-T3-136、I-T3-145、I-T3-148、I-T3-155、I-T3-160、I-T3-162、I-T3-173、I-T3-189、I-T22-1。

【0769】

この試験では、例えば、製造例により得られた以下の化合物が、 20 mg/m^2 の適用量で90～100%の有効性を示した：I-T3-23、I-T3-24、I-T3-26、I-T3-27、I-T3-28、I-T3-43、I-T3-52、I-T3-53、I-T3-54、I-T3-57、I-T3-58、I-T3-61、I-T3-87、I-T3-91、I-T3-92、I-T3-100、I-T3-102、I-T3-106、I-T3-112、I-T3-116、I-T3-130；I-T3-133、I-T3-134、I-T3-136、I-T3-137、I-T3-145、I-T3-148、I-T3-155、I-T3-159、I-T3-160、I-T3-162、I-T3-189、I-T22-2。

10

【0770】

アノフェレス試験（ANPHFU表面処理）

溶媒：アセトン+2000ppmナタネ油メチルエステル（RME）

【0771】

適切な活性成分製剤を製造するために、活性成分を溶媒（ 2 mg/ml ）中に溶解した。活性成分製剤を施釉タイル上にピペットで移し、それを乾燥させた後、アノフェレス・フネストス（*Anopheles funestus*）種の株FUMOZ-R（Hunt et al., Med Vet Entomol. 2005 Sep; 19（3）：271-5）の成体のカを処理されたタイル上に置いた。露出時間は30分間とした。

20

【0772】

処理表面との接触の24時間後、死亡率を%で決定した。100%とはすべてのカが死滅したことを意味し、0%とはカがまったく死滅しなかったことを意味する。

【0773】

この試験では、例えば、製造例により得られた以下の化合物が、 100 mg/m^2 の適用量で90～100%の有効性を示した：I-T3-24、I-T3-25、I-T3-38、I-T3-43、I-T3-46、I-T3-54、I-T3-56、I-T3-58、I-T3-63、I-T3-86、I-T3-92、I-T3-99、I-T3-100、I-T3-102、I-T3-107、I-T3-112、I-T3-113、I-T3-115、I-T3-123、I-T3-133、I-T3-134、I-T3-136、I-T3-145、I-T3-148、I-T3-155、I-T3-159、I-T3-160、I-T3-162、I-T3-189、I-T22-1、I-T22-2。

30

【0774】

この試験では、例えば、製造例により得られた以下の化合物が、 20 mg/m^2 の適用量で90～100%の有効性を示した：I-T3-3、I-T3-24、I-T3-25、I-T3-26、I-T3-38、I-T3-42、I-T3-43、I-T3-46、I-T3-52、I-T3-53、I-T3-54、I-T3-55、I-T3-57、I-T3-61、I-T3-63、I-T3-92、I-T3-93、I-T3-99、I-T3-100、I-T3-102、I-T3-107、I-T3-112、I-T3-113、I-T3-116、I-T3-123、I-T3-134、I-T3-136、I-T3-145、I-T3-148、I-T3-155、I-T3-159、I-T3-160、I-T3-162、I-T3-189、I-T22-1、I-T22-2、I-T23-1、I-T23-2。

40

【0775】

アエデス試験（AEDSAE表面処理）

溶媒：アセトン+2000ppmナタネ油メチルエステル（RME）

【0776】

50

適切な活性成分製剤を製造するために、活性成分を溶媒（2 mg / ml）中に溶解した。活性成分製剤を施釉タイル上にピペットで移し、それを乾燥させた後、アエデス・アエジプチ種の株MONHEIMの成体のカを処理されたタイルの上に置いた。露出時間は30分間とした。

【0777】

処理表面との接触の24時間後、死亡率を%で決定した。100%とはすべてのカが死滅したことを意味し、0%とはカがまったく死滅しなかったことを意味する。

【0778】

この試験では、例えば、製造例により得られた以下の化合物が、100 mg / m²の適用量で90～100%の有効性を示した：I-T3-1、I-T3-3、I-T3-8、I-T3-20、I-T3-21、I-T3-23、I-T3-24、I-T3-25、I-T3-27、I-T3-28、I-T3-38、I-T3-42、I-T3-43、I-T3-46、I-T3-52、I-T3-53、I-T3-54、I-T3-55、I-T3-56、I-T3-57、I-T3-58、I-T3-61、I-T3-63、I-T3-64、I-T3-86、I-T3-87、I-T3-91、I-T3-92、I-T3-93、I-T3-96、I-T3-98、I-T3-99、I-T3-100、I-T3-101、I-T3-102、I-T3-103、I-T3-106、I-T3-107、I-T3-108、I-T3-112、I-T3-113、I-T3-115、I-T3-117、I-T3-118、I-T3-120、I-T3-123、I-T3-130、I-T3-133、I-T3-134、I-T3-136、I-T3-145、I-T3-148、I-T3-155、I-T3-160、I-T3-162、I-T3-163、I-T3-173、I-T3-189、I-T22-1、I-T22-2、I-T23-1、I-T23-2。

10

20

【0779】

この試験では、例えば、製造例により得られた以下の化合物が、20 mg / m²の適用量で90～100%の有効性を示した：I-T3-1、I-T3-3、I-T3-8、I-T3-20、I-T3-21、I-T3-23、I-T3-24、I-T3-25、I-T3-27、I-T3-28、I-T3-38、I-T3-42、I-T3-43、I-T3-46、I-T3-52、I-T3-53、I-T3-54、I-T3-55、I-T3-56、I-T3-57、I-T3-58、I-T3-61、I-T3-63、I-T3-64、I-T3-86、I-T3-87、I-T3-91、I-T3-92、I-T3-93、I-T3-95、I-T3-96、I-T3-98、I-T3-99、I-T3-100、I-T3-101、I-T3-102、I-T3-103、I-T3-106、I-T3-107、I-T3-108、I-T3-112、I-T3-113、I-T3-115、I-T3-116、I-T3-117、I-T3-118、I-T3-123、I-T3-130、I-T3-133、I-T3-134、I-T3-136、I-T3-145、I-T3-148、I-T3-155、I-T3-159、I-T3-160、I-T3-162、I-T3-163、I-T3-173、I-T3-189、I-T22-1、I-T22-2、I-T23-1、I-T23-2。

30

【国際調査報告】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/EP2014/073795

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

INV. C07D231/12 A01N43/56 A01N43/72 C07D261/08 A01P7/00
C07D401/04 C07D403/04 C07D207/337 A01N43/80

ADD.

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

C07D A01N A01P

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)

EPO-Internal, WPI Data, CHEM ABS Data, BEILSTEIN Data

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	GABRIEL G GAMBER ET AL: "3,5-Diarylazoles as novel and selective inhibitors of protein kinase D", BIOORGANIC & MEDICINAL CHEMISTRY LETTERS, PERGAMON, GB, vol. 21, no. 5, 6 January 2011 (2011-01-06), pages 1447-1451, XP028144502, ISSN: 0960-894X, DOI: 10.1016/J.BMCL.2011.01.014 [retrieved on 2011-01-11] page 1448; compound 16 Scheme 5; page 1449; compounds 22a-d, 24a-c page 1450; table 2; compounds ----- -/--	1,14

☒ Further documents are listed in the continuation of Box C.

☒ See patent family annex.

* Special categories of cited documents:

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier application or patent but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

"Z" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

25 November 2014

Date of mailing of the international search report

17/12/2014

Name and mailing address of the ISA/

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel: (+31-70) 340-2040,
Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Stix-Malaun, Elke

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No

PCT/EP2014/073795

C(Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO 2011/009484 A1 (NOVARTIS AG [CH]; CAPPARELLI MICHAEL PAUL [US]; GAMBER GABRIEL G [US];) 27 January 2011 (2011-01-27) page 91 - page 92; examples page 98 - page 102; examples page 105 - page 111; examples page 117 - page 119; examples page 135 - page 140; examples page 121; examples page 142 - page 156; examples page 158 - page 159; examples claims -----	1,14
X	WO 03/087061 A1 (PFIZER PHARMA [JP]; HIRANO MISATO [JP]; NAKAO KAZUNARI [JP]; NUKUI SEI) 23 October 2003 (2003-10-23) page 112 - page 117; examples 59-62 claims steps; compounds -----	1,14
X	LOUNKINE EUGEN ET AL: "Chemotography for multi-target SAR analysis in the context of biological pathways", BIOORGANIC & MEDICINAL CHEMISTRY, vol. 20, no. 18, 20 February 2012 (2012-02-20), pages 5416-5427, XP028938241, ISSN: 0968-0896, DOI: 10.1016/J.BMC.2012.02.034 page 5425; compound 6m -----	1,14
X	DATABASE CA [Online] CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; BALLELL, LLUIS ET AL: "Fueling Open-Source Drug Discovery: 177 Small-Molecule Leads against Tuberculosis", XP002732971, retrieved from STN Database accession no. 2013:56758 abstract -----	1,14
A	WO 2013/041602 A1 (BAYER IP GMBH [DE]) 28 March 2013 (2013-03-28) examples claims -----	1-14
A	WO 2012/175474 A1 (SYNGENTA PARTICIPATIONS AG [CH]; JUNG PIERRE JOSEPH MARCEL [CH]; HUETE) 27 December 2012 (2012-12-27) cited in the application examples claims -----	1-14

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No

PCT/EP2014/073795

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 2011009484	A1	27-01-2011	NONE
WO 03087061	A1	23-10-2003	AU 2003216581 A1 27-10-2003 BR 0309188 A 09-02-2005 CA 2482382 A1 23-10-2003 EP 1495005 A1 12-01-2005 JP 2005532291 A 27-10-2005 MX PA04009960 A 13-12-2004 US 2004019045 A1 29-01-2004 WO 03087061 A1 23-10-2003
WO 2013041602	A1	28-03-2013	AR 087971 A1 30-04-2014 CN 103929964 A 16-07-2014 EP 2757886 A1 30-07-2014 US 2014329684 A1 06-11-2014 WO 2013041602 A1 28-03-2013
WO 2012175474	A1	27-12-2012	NONE

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2014/073795

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES		
INV. C07D231/12	A01N43/56	A01N43/72
C07D401/04	C07D403/04	C07D207/337
		A01N43/80
ADD.		
Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPC) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPC		
B. RECHERCHIERTE GEBIETE		
Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)		
C07D A01N A01P		
Recherchierte, aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen		
Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)		
EPO-Internal, WPI Data, CHEM ABS Data, BEILSTEIN Data		
C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	GABRIEL G GAMBER ET AL: "3,5-Diarylazoles as novel and selective inhibitors of protein kinase D", BIOORGANIC & MEDICINAL CHEMISTRY LETTERS, PERGAMON, GB, Bd. 21, Nr. 5, 6. Januar 2011 (2011-01-06), Seiten 1447-1451, XP028144502, ISSN: 0960-894X, DOI: 10.1016/J.BMCL.2011.01.014 [gefunden am 2011-01-11] Seite 1448; Verbindung 16 Scheme 5; Seite 1449; Verbindungen 22a-d, 24a-c Seite 1450; Tabelle 2; Verbindungen ----- -/--	1,14
☒ Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen ☒ Siehe Anhang Patentfamilie		
* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen : "A" Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist "E" frühere Anmeldung oder Patent, die bzw. das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist "L" Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt) "O" Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht "P" Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist "T" Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist "X" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden "Y" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist "Z" Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist		
Datum des Abschlusses der internationalen Recherche		Absenddatum des internationalen Recherchenberichts
25. November 2014		17/12/2014
Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Fax: (+31-70) 340-3016		Bevollmächtigter Bediensteter Stix-Malaun, Elke

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2014/073795

C. (Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	WO 2011/009484 A1 (NOVARTIS AG [CH]; CAPPARELLI MICHAEL PAUL [US]; GAMBER GABRIEL G [US];) 27. Januar 2011 (2011-01-27) Seite 91 - Seite 92; Beispiele Seite 98 - Seite 102; Beispiele Seite 105 - Seite 111; Beispiele Seite 117 - Seite 119; Beispiele Seite 135 - Seite 140; Beispiele Seite 121; Beispiele Seite 142 - Seite 156; Beispiele Seite 158 - Seite 159; Beispiele Ansprüche -----	1,14
X	WO 03/087061 A1 (PFIZER PHARMA [JP]; HIRANO MISATO [JP]; NAKAO KAZUNARI [JP]; NUKUI SEI) 23. Oktober 2003 (2003-10-23) Seite 112 - Seite 117; Beispiele 59-62 Ansprüche steps; Verbindungen -----	1,14
X	LOUNKINE EUGEN ET AL: "Chemotography for multi-target SAR analysis in the context of biological pathways", BIOORGANIC & MEDICINAL CHEMISTRY, Bd. 20, Nr. 18, 20. Februar 2012 (2012-02-20), Seiten 5416-5427, XP028938241, ISSN: 0968-0896, DOI: 10.1016/J.BMC.2012.02.034 Seite 5425; Verbindung 6m -----	1,14
X	DATABASE CA [Online] CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; BALLELL, LLUIS ET AL: "Fueling Open-Source Drug Discovery: 177 Small-Molecule Leads against Tuberculosis", XP002732971, gefunden im STN Database accession no. 2013:56758 Zusammenfassung -----	1,14
A	WO 2013/041602 A1 (BAYER IP GMBH [DE]) 28. März 2013 (2013-03-28) Beispiele Ansprüche -----	1-14
A	WO 2012/175474 A1 (SYNGENTA PARTICIPATIONS AG [CH]; JUNG PIERRE JOSEPH MARCEL [CH]; HUETE) 27. Dezember 2012 (2012-12-27) in der Anmeldung erwähnt Beispiele Ansprüche -----	1-14

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2014/073795

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument		Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO 2011009484	A1	27-01-2011	KEINE	

WO 03087061	A1	23-10-2003	AU 2003216581 A1	27-10-2003
			BR 0309188 A	09-02-2005
			CA 2482382 A1	23-10-2003
			EP 1495005 A1	12-01-2005
			JP 2005532291 A	27-10-2005
			MX PA04009960 A	13-12-2004
			US 2004019045 A1	29-01-2004
			WO 03087061 A1	23-10-2003

WO 2013041602	A1	28-03-2013	AR 087971 A1	30-04-2014
			CN 103929964 A	16-07-2014
			EP 2757886 A1	30-07-2014
			US 2014329684 A1	06-11-2014
			WO 2013041602 A1	28-03-2013

WO 2012175474	A1	27-12-2012	KEINE	

フロントページの続き

(51)Int.Cl.	F I	テーマコード (参考)
A 0 1 N 43/80 (2006.01)	A 0 1 N 43/80	1 0 1
A 6 1 P 33/14 (2006.01)	A 6 1 P 33/14	
A 6 1 P 33/02 (2006.01)	A 6 1 P 33/02	
C 0 7 D 401/04 (2006.01)	C 0 7 D 231/12	D
C 0 7 D 261/08 (2006.01)	C 0 7 D 401/04	
C 0 7 D 231/38 (2006.01)	C 0 7 D 261/08	
C 0 7 D 413/04 (2006.01)	C 0 7 D 231/12	E
C 0 7 D 403/04 (2006.01)	C 0 7 D 231/38	B
C 0 7 D 207/337 (2006.01)	C 0 7 D 413/04	
A 6 1 K 31/415 (2006.01)	C 0 7 D 403/04	
A 6 1 K 31/506 (2006.01)	C 0 7 D 207/337	
A 6 1 K 31/4439 (2006.01)	A 6 1 K 31/415	
A 6 1 K 31/42 (2006.01)	A 6 1 K 31/506	
A 6 1 K 31/40 (2006.01)	A 6 1 K 31/4439	
	A 6 1 K 31/42	
	A 6 1 K 31/40	

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

(74)代理人 100126099

弁理士 反町 洋

(72)発明者 ベルナー、ハレンバッハ

ドイツ連邦共和国モンハイム、リヒテンベルガー、シュトラッセ、6 8

(72)発明者 ハンスーゲオルク、シュワルツ

ドイツ連邦共和国ドルステン、アウフ、デム、ベーアーエンカンフ、8 2 ベー

(72)発明者 ケルスティン、イルク

ドイツ連邦共和国ケルン、ノイッサー、バル、3 2

(72)発明者 ウルリッヒ、ジェルゲン

ドイツ連邦共和国ラーティンゲン、フェスター、シュトラッセ、3 7

(72)発明者 ヨハネス、ケベルリンク

ドイツ連邦共和国ノイス、アツァリエンシュトラッセ、3 0

(72)発明者 アンドレアス、トゥルベルク

ドイツ連邦共和国ハーン、ジンターシュトラッセ、8 6

(72)発明者 ニールス、ベーンケ

ドイツ連邦共和国ベルリン、ゼジッシェ、シュトラッセ、4 1

(72)発明者 ミヒャエル、マウエ

ドイツ連邦共和国ランゲンフェルト、ブルネンシュトラッセ、1 8 アー

(72)発明者 ローベルト、フェルテン

ドイツ連邦共和国ランゲンフェルト、ヘーアシュトラッセ、1 7

(72)発明者 トビアス、ハルシュネック

ドイツ連邦共和国デュッセルドルフ、アム、ボターニッシェン、ガルテン、1 1

(72)発明者 ユリア、ヨハンナ、ハーン

ドイツ連邦共和国デュッセルドルフ、アインシュタインシュトラッセ、3 8

(72)発明者 セバスティアン、ホーストマン

ドイツ連邦共和国レーパークーゼン、オーバー、デム、ホーフ、1 1

F ターム(参考) 4C056 AA01 AB01 AC01 AD01 AE03 FA16 FB01 FC01
4C063 AA01 BB01 BB02 CC22 CC29 CC51 DD12 DD22 EE01 EE03
4C069 AC02 BB08 BB52
4C086 AA01 AA02 AA03 BC05 BC36 BC42 BC67 GA07 GA08 GA09
MA01 MA04 NA14 ZB37 ZB38 ZB39
4H011 AC01 AC04 BA01 BA05 BB09 BB10 BC04 BC05 BC06 DA15
DA16 DC05 DD03 DE15