

(19) 日本国特許庁 (JP)

(12) 特 許 公 報 (B2)

(11) 特許番号

特許第4723253号
(P4723253)

(45) 発行日 平成23年7月13日 (2011. 7. 13)

(24) 登録日 平成23年4月15日 (2011. 4. 15)

(51) Int. Cl.

F 1

C O 7 D 471/04 (2006. 01)

C O 7 D 471/04 1 1 4 A

A O 1 N 43/90 (2006. 01)

C O 7 D 471/04 C S P

A O 1 P 3/00 (2006. 01)

A O 1 N 43/90 1 O 3

A O 1 P 3/00

請求項の数 5 (全 74 頁)

(21) 出願番号 特願2004-561602 (P2004-561602)
 (86) (22) 出願日 平成15年12月3日 (2003. 12. 3)
 (65) 公表番号 特表2006-514029 (P2006-514029A)
 (43) 公表日 平成18年4月27日 (2006. 4. 27)
 (86) 国際出願番号 PCT/GB2003/005248
 (87) 国際公開番号 W02004/056824
 (87) 国際公開日 平成16年7月8日 (2004. 7. 8)
 審査請求日 平成18年12月1日 (2006. 12. 1)
 (31) 優先権主張番号 0230018. 4
 (32) 優先日 平成14年12月23日 (2002. 12. 23)
 (33) 優先権主張国 英国 (GB)

(73) 特許権者 500371307
 シンジェンタ リミテッド
 イギリス国 サリー ジーユー2 7ワイ
 エイチ, ギルドフォード, サリー リサー
 チ パーク, プリーストリー ロード, ユ
 アロピーアン リージョナル センター
 (73) 特許権者 500584309
 シンジェンタ パーティシペーションズ
 アクチェンゲゼルシャフト
 スイス国, ツェーハー 4 0 5 8 バーゼ
 ル, シュバルツバルトアレー 2 1 5
 (74) 代理人 100099759
 弁理士 青木 篤
 (74) 代理人 100077517
 弁理士 石田 敬

最終頁に続く

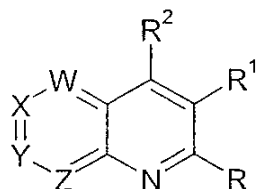
(54) 【発明の名称】 殺真菌剤

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項 1】

一般式 (1) :

【化 1】



(1)

10

(ここで、W、X及びYは全てCHであり、且つZはNであり；Rはハロであり；
 R^1 は1～5個のハロゲン原子で置換されたフェニルであり； R^2 は NR^3R^4 であり、
 R^3 及び R^4 は独立してH又は C_{1-8} アルキルであり、但し、 R^3 及び R^4 が両方Hであるこ
 とはなく、あるいは、

それらが結合する窒素原子と一緒に、 R^3 と R^4 は、モルホリンを形成し；

前述のアルキルが任意に、ハロゲン、シアノ、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} アルキルカルボニ

20

ル、 C_{1-6} アルコキシカルボニル、 C_{1-6} ハロアルコキシ、 C_{1-6} アルキルチオ、トリ (C_{1-4}) アルキルシリル、 C_{1-6} アルキルアミノ又は C_{1-6} ジアルキルアミノで置換され、前述のモルホリンが、任意に C_{1-4} アルキルで置換される)の化合物。

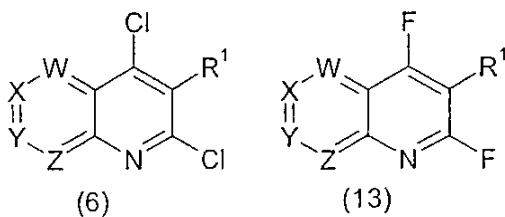
【請求項 2】

R^1 が 2, 6-ジフルオロフェニル、2-フルオロ-6-クロロフェニル、2, 5, 6-トリフルオロフェニル、2, 4, 6-トリフルオロフェニル、又はペンタフルオロフェニルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

R がクロロ又はフルオロであり、且つ R^2 が NR^3R^4 であり、且つ W , X , Y , Z , R^1 , R^3 及び R^4 は請求項 1 で定義した通りである、請求項 1 に記載の一般式 (1) の化合物を調製する方法であって、一般式 NR^3R^4 のアミンを一般式 (6) 又は (13) の化合物【化 2】

10



20

(ここで、 W , X , Y , Z 及び R^1 は請求項 1 で定義した通りである)と反応させることを含んで成る方法。

【請求項 4】

殺真菌的に有効量の請求項 1 又は 2 に記載の化合物及び適当な担体又はそれらの希釈物を含んで成る植物殺真菌組成物。

【請求項 5】

植物病原性真菌を駆除又は防除する方法であって、殺真菌的に有効量の請求項 1 又は 2 に記載の化合物又は請求項 4 に記載の組成物を、植物、植物の種子、前記植物又は種子の現場、あるいは土壌又は任意の植物生育培地に対し散布することを含んで成る方法。

30

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、ナフチリジンの新規誘導体、それらの調製方法、それらの製造に使用される幾つかの中間体化合物、それらを含む組成物、及び真菌、特に植物の真菌感染を駆除 (combat) するためのそれらの使用方法、に関する。

【背景技術】

【0002】

窒素含有 5, 6 環系 s-1, 2, 4-トリアゾロ [1, 5-a] ピリミジン誘導体は、特許文献により病原性真菌を防除するために有用であることが知られている。近年の特許文献の例には、EP-A-1249452, WO 02/051845, WO 02/083676, WO 02/083677, WO 02/088125, WO 02/088126, WO 02/088127 が含まれる。幾つかのナフチリジン誘導体の植物殺真菌活性が、EP-A-0410762 及び US 4801592 に記載されている。他のナフチリジン誘導体は、例えば、除草剤として WO 92/07468 及び US 5258356 に、そして医薬用途について WO 93/13097 and WO 92/22533 に記載されている。ナフチリジン誘導体はまた、一般的な化学文献、例えば、Synthetic Communications (2003), 33 (1), 73; Indian Journal of Chemistry, Section B (2002), 41B (10), 2194; Farmaco (2002), 57 (8), 631; Farmaco (2001), 56 (4), 311; Farmaco (2000), 55 (9-10), 603; Arch. Pharm. (1957), 290, 136; Fa

40

50

rmaco, Edizione Scientifica (1979), 34 (2), 165 ; Journal of the Chemical Society, Chemical Communications (1974), (4), 134 ; Journal of the Chemical Society, Perkin Transactions 1 (1996), (12), 1359; Journal of Organic Chemistry (1972), 37 (20), 3101 ; Journal of Medicinal Chemistry (1973), 16 (7), 849 ; Journal of the Chemical Society, Chemical Communications (1974), (4), 134;及びthe European Journal of Medicinal Chemistry (200), 35 (11), 1021-1035により知られている。

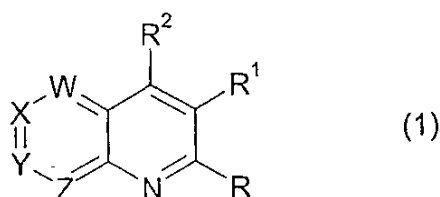
【0003】

本発明は、植物及び収穫された食用作物上の植物病原性疾患を駆除するための代替の新規ナフチリジンの規定に関する。

【0004】

従って、本発明により、一般式(1)：

【化1】



(ここで、W、X、Y及びZのうち1つがNであり、その他がCR⁸であり；
R⁸はH、ハロ、C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ又はハロ(C₁₋₄)アルキルであり、但し、XがCHである場合、ZはNであり、
RはNHNH₂であり、R¹はフェニルであり、且つR²はC1であり、W及びYは両方CH₃であることはなく；

R及びR²のうち一方がNR³R⁴であり、且つ他方がハロ、C₁₋₈アルキル、C₁₋₈アルコキシ、C₁₋₈アルキルチオ、C₂₋₈アルケニル、C₂₋₈アルキニル又はシアノであり；

R¹はアリール、ヘテロアリール、モルホリノ、ピペリジノ又はピロリジノであり；

R³及びR⁴は独立してH、C₁₋₈アルキル、C₂₋₈アルケニル、C₂₋₈アルキニル、アリール、アリール(C₁₋₈)アルキル、C₃₋₈シクロアルキル、C₃₋₈シクロアルキル(C₁₋₆)アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリール(C₁₋₈)アルキル、NR⁵R⁶、であり、但し、R³及びR⁴が両方H又はNR⁵R⁶であることはなく、あるいは

R³とR⁴は一緒に、C₃₋₇アルキレン又はC₃₋₇アルケニレン鎖を形成し、これは任意に1又は複数のC₁₋₄アルキル又はC₁₋₄アルコキシ基で置換され、あるいは、それらが結合する窒素原子と一緒に、R³とR⁴は、モルホリン、チオモルホリン、チオモルホリンS-オキシド又はチオモルホリンS-ジオキシド環あるいはピペラジン又はピペラジンN-(C₁₋₄)アルキル(特にN-メチル)環を形成し；且つ

R⁵及びR⁶は独立してH、C₁₋₈アルキル、C₂₋₈アルケニル、C₂₋₈アルキニル、アリール、アリール(C₁₋₈)アルキル、C₃₋₈シクロアルキル、C₃₋₈シクロアルキル(C₁₋₆)アルキル、ヘテロアリール又はヘテロアリール(C₁₋₈)アルキルを形成し；

前述のアルキル、アルケニル、アルキニル又はシクロアルキル基又は部分(R⁸についてのものを除く)のいずれかが任意に、ハロゲン、シアノ、C₁₋₆アルコキシ、C₁₋₆アルキルカルボニル、C₁₋₆アルコキシカルボニル、C₁₋₆ハロアルコキシ、C₁₋₆アルキルチオ、トリ(C₁₋₄)アルキルシリル、C₁₋₆アルキルアミノ又はC₁₋₆ジアルキルアミノで置換され、

前述のモルホリン、チオモルホリン、ピペリジン、ピペラジン及びピロリジン環のいずれかが、任意にC₁₋₄アルキル(特にメチル)で置換され、且つ

前述のアリール又はヘテロアリール基又は部分のいずれかが、任意に、ハロ、ヒドロキシ

、メルカプト、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{2-6} アルケニルオキシ、 C_{2-6} アルキニルオキシ、ハロ (C_{1-6}) アルキル、ハロ (C_{1-6}) アルコキシ、 C_{1-6} アルキルチオ、ハロ (C_{1-6}) アルキルチオ、ヒドロキシ (C_{1-6}) アルキル、 C_{1-4} アルコキシ (C_{1-6}) アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{3-6} シクロアルキル (C_{1-4}) アルキル、フェノキシ、ベンジルオキシ、ベンゾイルオキシ、シアノ、イソシアノ、チオシアネート、イソチオシアネート、ニトロ、 $-NR''''R''''$ 、 $-NHCONR''''R''''$ 、 $-CONR''''R''''$ 、 $-SO_2R''''$ 、 $-OSO_2R''''$ 、 $-COR''''$ 、 $-CR''''=NR''''$ 又は $-N=CR''''R''''$ から選択される1又は複数の置換基で置換され、ここで、 R'''' 及び R'''' は独立して水素、 C_{1-4} アルキル、ハロ (C_{1-4}) アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、ハロ (C_{1-4}) アルコキシ、 C_{1-4} アルキルチオ、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{3-6} シクロアルキル (C_{1-4}) アルキル、フェニル又はベンジルであり、フェニル及びベンジル基は、任意にハロゲン、 C_{1-4} アルキル又は C_{1-4} アルコキシで置換される) の化合物が提供される。

10

【0005】

本発明には、直近の定義のような一般式 (1) の化合物が含まれるが、但し、 C_{1-8} アルコキシ及び C_{1-8} アルキルチオは R 及び R^2 の値としては除外され； C_7 アルキレン及び C_{3-7} アルケニレンは R^3 及び R^4 により形成される鎖としては除外され； R^3 及び R^4 が形成しうる C_{3-6} 鎖のみ、任意に1又は複数のメチル基で置換されることがあり；チオモルホリン、チオモルホリンS-オキシド、チオモルホリンS-ジオキシド及びピペラジンは、 R^3 及び R^4 が形成しうる環として除外され；トリ (C_{1-4}) アルキルシリルは、あらゆるアルキル、アルケニル、アルキニル又はシクロアルキル基又は部分の置換基として除外され、そしてあらゆるモルホリン、ピペリジン又はピロリジン環が置換されない。

20

【0006】

本発明の化合物は1又は複数の不斉炭素原子を含むことがあり、且つ鏡像異性体として(又はのジアステレオ異性体の対として)あるいはそれらの混合物として存在することもある。それらはまた、結合の束縛回転に基づいてジアステレオ異性体として存在することもある。しかしながら、鏡像異性体又はジアステレオ異性体の混合物が個々の異性体又は異性体対に分離されることもあり、そして本発明はそのような異性体及びそれらのあらゆる比率の混合物を包含する。任意の所定の化合物につき、ある異性体が、別のものと比べてより殺真菌的に活性であることもあると予想されるべきである。

30

【0007】

特に定めのない限り、アルキル基及び、アルコキシ、アルキルチオ等のアルキル部分は、1～8個、適切には1～6個、そして典型的には1～4個の炭素原子を直鎖又は分枝鎖の形態で含む。例えば、メチル、エチル、*n*-及びイソプロピル、*n*-、*sec*-、イソ-及び*tert*-ブチル、*n*-ペンチル及び*n*-ヘキシルである。シクロアルキル基は3～8個、典型的には3～6個の炭素原子を含み、且つビスシクロアルキル基、例えばビスシクロ[2.2.1]ヘプチル基を含む。ハロアルキル基又は部分は、典型的にはトリクロロメチル又はトリフルオロメチルであり、あるいはトリクロロメチル又はトリフルオロメチルの末端基を含む。

40

【0008】

特に定めのない限り、アルケニル及びアルキニル部分も、2～8個、適切には2～6個、そして典型的には2～4個の炭素原子を直鎖又は分子鎖の形態で含む。例えば、アリル、2-メチルアリル及びプロパルギルである。任意の置換基に、ハロ、典型的にはフルオロが含まれる。ハロ置換アルケニルの例は、3, 4, 4-トリフルオロ-*n*-ブテニルである。

【0009】

ハロには、フルオロ、クロロ、ブロモ及びヨードが含まれる。最も一般的には、それはフルオロ、クロロ又はブロモであり、そして通常フルオロ又はクロロである。

【0010】

50

アリールは通常フェニルであるが、ナフチル、アントリル及びフェナントリルも含まれる。

【0011】

ヘテロアリールは典型的には、1又は複数のO、N又はSのヘテロ原子を含む5又は6員の芳香環であり、これは1又は複数の他の芳香又は複素芳香環、例えばベンゼン環と融合していることもある。例えば、チエニル、フリル、ピロリル、イソキサゾリル、オキサゾリル、オキサジアゾリル、ピラゾリル、イミダゾリル、トリアゾリル、イソチアゾリル、テトラゾリル、チアジアゾリル、ピリジリル、ピリミジニル、ピラジニル、ピリダジニル、トリアジニル、ベンゾフリル、ベンゾチエニル、ジベンゾフリル、ベンゾチアゾリル、ベンゾオキサゾリル、ベンゾイミダゾリル、インドリル、キノリニル及びキノキサリニル基であり、妥当な場合、それらのN-オキシドである。

10

【0012】

一般式(1)に包含される6, 6-環系には、1, 8-ナフチリジン(ここで、W、X及びYは全て CR^8 であり、且つZはNである)、1, 7-ナフチリジン(ここで、W、X及びZは全て CR^8 であり、且つYはNである)、1, 6-ナフチリジン(ここで、W、Y及びZは全て CR^8 であり、且つXはNである)、及び1, 5-ナフチリジン(ここで、X、Y及びZは全て CR^8 であり、且つWはNである)がある。特に注目すべきは1, 8-ナフチリジンである。

【0013】

R^8 は、W、X、Y及びZのうち3つの CR^8 の値につき同一であっても又は異なっているてもよく、そしてH、ハロ(例えばブロモ)、 C_{1-4} アルキル(例えばメチル)、 C_{1-4} アルコキシ(例えばメトキシ)又はハロ(C_{1-4})アルキル(例えばトリフルオロメチル)である。通常、 R^8 はHであろう。しかしながら、特に注目すべきは3-ブロモ-1, 8-ナフチリジン環を含む化合物(すなわち、W及びXはCHであり、XはCBrであり、且つZはNであるもの)である。

20

【0014】

R及び R^2 のうちの一方、好ましくは R^2 は、 NR^3R^4 である。他方のものは、典型的にはハロ、特にクロロ又はフルオロである。1, 8-ナフチリジン環系の場合、より活性な化合物は、 R^2 が NR^3R^4 であるものである。 R^3 は、典型的には C_{1-8} アルキル(例えばエチル、n-プロピル、n-ブチル、sec-ブチル(S-又はR-異性体又はラセミ体)及びtert-ブチル)、ハロ(C_{1-8})アルキル(例えば2, 2, 2-トリフルオロエチル、2, 2, 2-トリフルオロ-1-メチルエチル(S-又はR-異性体又はラセミ体)、3, 3, 3-トリフルオロプロピル及び4, 4, 4-トリフルオロブチル)、ヒドロキシ(C_{1-8})アルキル(例えばヒドロキシエチル)、 C_{1-4} アルコキシ(C_{1-8})アルキル(例えばメトキシメチル及びメトキシイソブチル)、 C_{1-4} アルコキシハロ(C_{1-8})アルキル(例えば2-メトキシ-2-トリフルオロメチルエチル)、トリ(C_{1-4})アルキルシリル(C_{1-6})アルキル(例えばトリメチルシリルメチル)、 C_{1-4} アルキルカルボニル(C_{1-8})アルキル(例えば1-アセチルエチル及び1-tert-ブチルカルボニルエチル)、 C_{1-4} アルキルカルボニルハロ(C_{1-8})アルキル(例えば1-アセチル-2, 2, 2-トリフルオロエチル)、フェニル(C_{1-4})アルキル(例えばベンジル)、 C_{2-8} アルケニル(例えばアリル及びメチルアリル)、ハロ(C_{2-8})アルケニル(例えば3-メチル-4, 4-ジフルオロブタ-3-エニル)、 C_{2-8} アルキニル(例えばプロパルギル)、 C_{3-8} シクロアルキル(例えばシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル及びシクロヘキシル)であって、任意にクロロ、フルオロ又はメチルで置換されているもの、 C_{3-8} シクロアルキル(C_{1-4})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及びシクロヘキシルメチル)、フェニルアミノ、ピペリジノ又はモルホリノ、であり、フェニルアルキル又はフェニルアミノのフェニル環は、任意に、ハロ(典型的にはフルオロ、クロロ又はブロモ)、 C_{1-4} アルキル(典型的にはメチル)、ハロ(C_{1-4})アルキル(典型的にはトリフルオロメチル)、 C_{1-4} アルコキシ(典型的にはメトキシ)及びハロ(C_{1-4})アルコキシ(典型的にはトリフルオロメトキ

30

40

50

シ) から選択される 1, 2 又は 3 個の置換基で置換される。R⁴は、典型的には H、(C₁₋₄) アルキル (例えばエチル及び n-プロピル)、ハロ (C₁₋₄) アルキル (例えば 2, 2-トリフルオロエチル) 又はアミノである。あるいは、R³と R⁴は一緒に、任意にメチルで置換された C₄₋₆ アルキレン鎖、例えば 3-メチルペンチレンを形成し、又はそれらが結合する窒素原子と一緒に、R³と R⁴は、モルホリン、チオモルホリン、チオモルホリン S-オキシド又はチオモルホリン S-ジオキシド環又はピペラジン若しくはピペラジン N-(C₁₋₄) アルキル (特に N-メチル) 環を形成し、ここで、モルホリン又はピペラジン環はメチルで任意に置換される。

【0015】

典型的に、R¹はフェニルであり、これは 1~5 個のハロゲン原子、特にフッ素及び塩素原子、特別にはフッ素原子で、又はハロ (例えばフルオロ及びクロロ)、C₁₋₄ アルキル (例えばメチル)、ハロ C₁₋₄ アルキル (例えばトリフルオロメチル)、C₁₋₄ アルコキシ (例えばメトキシ) 又はハロ (C₁₋₄) アルコキシ (例えばトリフルオロメトキシ) から選択される 1 又は 3 個の置換基で置換される。例は、2, 6-ジフルオロフェニル、2-フルオロ-6-クロロフェニル、2, 5, 6-トリフルオロフェニル、2, 4, 6-トリフルオロフェニル、2, 6-ジフルオロ-4-メトキシフェニル、ペンタフルオロフェニル、2-フルオロフェニル、2, 3, 5, 6-テトラフルオロフェニル、2-クロロ-4, 6-ジフルオロフェニル、2-クロロフェニル、2, 6-ジクロロフェニル、2, 4-ジクロロフェニル、2, 4, 6-トリクロロフェニル、2, 3, 6-トリクロロフェニル、ペンタクロロフェニル、2-フルオロ-4, 6-ジクロロフェニル、4-フルオロ-2, 6-ジクロロフェニル、2-ブロモフェニル、2-フルオロ-6-ブロモフェニル、2-ブロモ-4, 6-ジフルオロフェニル、2-フルオロ-6-メチルフェニル、2-クロロ-6-メチルフェニル、2-メトキシフェニル、2, 6-ジメトキシフェニル、2-フルオロ-6-メトキシフェニル、2-トリフルオロメチルフェニル、2-フルオロ-6-トリフルオロメチルフェニル、2, 6-ジー (トリフルオロメチル) フェニル、2-クロロ-6-トリフルオロメチルフェニル、2, 4-ジフルオロ-6-トリフルオロメチルフェニル、2, 4-ジフルオロ-6-メトキシフェニル及び 2, 4-ジフルオロ-6-メチルフェニルである。

【0016】

また、特に注目すべきものは、R¹がピリジルであり、これが 1 又は 4 個のハロゲン原子で、あるいはハロ (例えばフルオロ及びクロロ)、C₁₋₄ アルキル (例えばメチル)、ハロ C₁₋₄ アルキル (例えばトリフルオロメチル)、C₁₋₄ アルコキシ (例えばメトキシ) 又はハロ (C₁₋₄) アルコキシ (例えばトリフルオロメトキシ) から選択される 1 又は 3 個の置換基で任意に置換されている化合物である。例えば、2, 4-ジフルオロピリジ-3-イル、3, 5-ジフルオロピリジ-4-イル、テトラフルオロピリジ-4-イル、3-フルオロピリジ-2-イル、4-フルオロピリジ-3-イル、3-フルオロピリジ-4-イル、2-フルオロピリジ-3-イル、2, 4, 6-トリフルオロピリジ-3-イル、3, 5-ジフルオロピリジ-2-イル、2, 6-ジフルオロピリジ-3-イル、2, 4-ジフルオロ-6-メトキシピリジ-3-イル、2-フルオロ-4-クロロピリジ-3-イル、3-フルオロ-5-クロロピリジ-4-イル、2-クロロ-4-フルオロピリジ-3-イル、2, 4-ジクロロピリジ-3-イル、3-クロロピリジ-2-イル I、4-クロロピリジ-3-イル、3-クロロピリジ-4-イル、2-クロロピリジ-3-イル、3-トリフルオロメチルピリジ-2-イル、4-トリフルオロメチルピリジ-3-イル、3, 5-ジクロロピリジ-2-イル、4, 6-ジクロロピリジ-3-イル、3-トリフルオロメチルピリジ-4-イル、2-トリフルオロメチルピリジ-3-イル、2-フルオロ-4-トリフルオロメチルピリジ-3-イル、3-フルオロ-5-トリフルオロメチルピリジ-4-イル、4-フルオロ-2-トリフルオロメチルピリジ-3-イル、2, 6-ジクロロピリジ-3-イル、3, 5-ジクロロピリジ-4-イル、3-クロロ-6-トリフルオロメチルピリジ-2-イル、3-フルオロ-6-トリフルオロメチルピリジ-2-イル、ピリジ-2-イル、ピリジ-3-イル及びピリジ-4-イル、である。

【0017】

また、特に注目すべきものは、 R^1 が2-又は3-チエニルであり、これが1~3このハロゲン原子、あるいはハロ（例えばフルオロ及びクロロ）、 C_{1-4} アルキル（例えばメチル）、ハロ C_{1-4} アルキル（例えばトリフルオロメチル）、 C_{1-4} アルコキシ（例えばメトキシ）又はハロ（ C_{1-4} ）アルコキシ（例えばトリフルオロメトキシ）から選択される1又は3個の置換基で置換される化合物である。例えば、3-フルオロチエン-2-イル、3-クロロチエン-2-イル、2,4-ジフルオロチエン-3-イル、2,4-ジクロロチエン-3-イル及び2,4,5-トリクロロチエン-3-イルである。

【0018】

特に注目すべき R^1 の他の値の例は、置換されていないピペリジノ及びモルホリノ、2-メチルピペリジノ、2,6-ジメチルピペリジノ及び2,6-ジメチルモルホリノである。

【0019】

1つの側面において、本発明は、W、X、Y及びZのうちの1つがNであり、そしてその他のは CR^8 であり；

R^8 はH、ハロ、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ又はハロ（ C_{1-4} ）アルキルであり、但し、XがCHである場合、ZはNであり、

Rは NH_2 であり、 R^1 はフェニルであり、且つ R^2 はC1であり、W及びYは両方 CH_3 であることはなく；

R及び R^2 のうち一方（好ましくは R^2 ）が NR^3R^4 であり、且つ他方がハロであり；

R^1 はアリール、ヘテロアリール、モルホリノ、ピペリジノ又はピロリジノであり；

R^3 及び R^4 は独立してH、 C_{1-8} アルキル、 C_{2-8} アルケニル、 C_{2-8} アルキニル、アリール、アリール（ C_{1-8} ）アルキル、 C_{3-8} シクロアルキル、 C_{3-8} シクロアルキル（ C_{1-6} ）アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリール（ C_{1-8} ）アルキル、 NR^5R^6 、であり、但し、 R^3 及び R^4 が両方H又は NR^5R^6 であることはなく、あるいは

R^3 と R^4 は一緒に、 C_{3-7} アルキレン又は C_{3-7} アルケニレン鎖を形成し、これは任意に1又は複数の C_{1-4} アルキル又は C_{1-4} アルコキシ基で置換され、あるいは、

それらが結合する窒素原子と一緒に、 R^3 と R^4 は、モルホリン、チオモルホリン、チオモルホリンS-オキシド又はチオモルホリンS-ジオキシド環あるいはピペラジン又はピペラジンN-（ C_{1-4} ）アルキル（特にN-メチル）環を形成し；且つ

R^5 及び R^6 は独立してH、 C_{1-8} アルキル、 C_{2-8} アルケニル、 C_{2-8} アルキニル、アリール、アリール（ C_{1-8} ）アルキル、 C_{3-8} シクロアルキル、 C_{3-8} シクロアルキル（ C_{1-6} ）アルキル、ヘテロアリール又はヘテロアリール（ C_{1-8} ）アルキルを形成し；

前述のアルキル、アルケニル、アルキニル又はシクロアルキル基又は部分（ R^8 についてのもので除く）のいずれかが任意に、ハロゲン、シアノ、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} アルキルカルボニル、 C_{1-6} アルコキシカルボニル、 C_{1-6} ハロアルコキシ、 C_{1-6} アルキルチオ、トリ（ C_{1-4} ）アルキルシリル、 C_{1-6} アルキルアミノ又は C_{1-6} ジアルキルアミノで置換され、

前述のモルホリン、チオモルホリン、ピペリジン、ピペラジン及びピロリドン環のいずれかが、任意に C_{1-4} アルキル（特にメチル）で置換され、且つ

前述のアリール又はヘテロアリール、アリールオキシ又はヘテロアリール基のいずれかが、任意に、ハロ、ヒドロキシ、メルカプト、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{2-6} アルケニルオキシ、 C_{2-6} アルキニルオキシ、ハロ（ C_{1-6} ）アルキル、ハロ（ C_{1-6} ）アルコキシ、 C_{1-6} アルキルチオ、ハロ（ C_{1-6} ）アルキルチオ、ヒドロキシ（ C_{1-6} ）アルキル、 C_{1-4} アルコキシ（ C_{1-6} ）アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{3-6} シクロアルキル（ C_{1-4} ）アルキル、フェノキシ、ベンジルオキシ、ベンゾイルオキシ、シアノ、イソシアノ、チオシアネート、イソチオシアネート、ニトロ、 $-NR''''R''''$ 、 $-NHCOR''''$ 、 $-NHCONR''''R''''$ 、 $-CONR''''R''''$ 、 $-SO_2R''''$ 、 $-OSO_2R''''$ 、 $-COR''''$ 、 $-CR''''=NR''''$ 又は $-N=CR''''R''''$ から選択される1又は複数の置

10

20

30

40

50

換基で置換され、ここで、 R''' 及び R'''' は独立して水素、 C_{1-4} アルキル、ハロ (C_{1-4}) アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、ハロ (C_{1-4}) アルコキシ、 C_{1-4} アルキルチオ、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{3-6} シクロアルキル (C_{1-4}) アルキル、フェニル又はベンジルであり、フェニル及びベンジル基は、任意にハロゲン、 C_{1-4} アルキル又は C_{1-4} アルコキシで置換されている、一般式 (1) の化合物を提供する。特に注目すべきは、W, X 及び Y が CH であり、且つ Z が N である化合物である。

【0020】

本発明は、直近の定義の一般式 (1) の化合物を含むが、但し、 C_7 アルキレン及び C_{3-7} アルケニレンは R^3 及び R^4 により形成される鎖としては除外され； R^3 及び R^4 が形成しうる C_{3-6} 鎖のみ、任意にメチルで置換されることがあり；チオモルホリン、チオモルホリン S-オキシド、チオモルホリン S-ジオキシド及びピペラジンは、 R^3 及び R^4 が形成しうる環として除外され；トリ (C_{1-4}) アルキルシリルは、あらゆるアルキル、アルケニル、アルキニル又はシクロアルキル基又は部分の置換基として除外され、そしてあらゆるモルホリン、ピペリジン又はピロリジン環は置換されない。

【0021】

別の側面において、本発明は、W, X, Y 及び Z のうちの 1 つが N であり、そしてその他は CR^8 であり；

R^8 は H、ハロ、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ又はハロ (C_{1-4}) アルキルであり、但し、X が CH である場合、Z は N であり、

R は $NH-NH_2$ であり、 R^1 はフェニルであり、且つ R^2 は C1 であり、W 及び Y は両方 CH_3 であることはなく；

R 及び R^2 のうち一方 (好ましくは R^2) が NR^3R^4 であり、且つ他方がハロであり；

R^1 はアリール、ヘテロアリール、モルホリノ、ピペリジノ又はピロリジノであり；

R^3 は C_{1-4} アルキル、ハロ (C_{1-4}) アルキル、 C_{2-4} アルケニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{3-6} シクロアルキル (C_{1-4}) アルキル又はフェニルアミノであり、ここで、フェニル環は、任意に、ハロ、 C_{1-4} アルキル、ハロ (C_{1-4}) アルキル、 C_{1-4} アルコキシ及びハロ (C_{1-4}) アルコキシから選択される 1, 2 又は 3 個の置換基で置換され；且つ

R^4 は H、 C_{1-4} アルキル又はアミノであり、あるいは

R^3 と R^4 は一緒に C_{4-6} アルキレン鎖を形成し、これは、 C_{1-4} アルキル又は、 C_{1-4} アルコキシで置換され、あるいは

それらが結合する窒素原子と一緒に、 R^3 と R^4 は、モルホリン、チオモルホリン、チオモルホリン S-オキシド又はチオモルホリン S-ジオキシド環又はピペラジン若しくはピペラジン N- (C_{1-4}) アルキル (特に N-メチル) 環を形成し；

前述のアルキル、アルケニル、アルキニル又はシクロアルキル基又は部分 (R^8 についてのものを除く) のいずれかが任意に、ハロゲン、シアノ、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} アルキルカルボニル、 C_{1-6} アルコキシカルボニル、 C_{1-6} ハロアルコキシ、 C_{1-6} アルキルチオ、トリ (C_{1-4}) アルキルシリル、 C_{1-6} アルキルアミノ又は C_{1-6} ジアルキルアミノで置換され、

前述のモルホリン、チオモルホリン、ピペリジン、ピペラジン及びピロリジン環のいずれかが、任意に C_{1-4} アルキル (特にメチル) で置換され、且つ

前述のアリール又はヘテロアリール基又は部分のいずれかが、任意に、ハロ、ヒドロキシ、メルカプト、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{2-6} アルケニルオキシ、 C_{2-6} アルキニルオキシ、ハロ (C_{1-6}) アルキル、ハロ (C_{1-6}) アルコキシ、 C_{1-6} アルキルチオ、ハロ (C_{1-6}) アルキルチオ、ヒドロキシ (C_{1-6}) アルキル、 C_{1-4} アルコキシ (C_{1-6}) アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{3-6} シクロアルキル (C_{1-4}) アルキル、フェノキシ、ベンジルオキシ、ベンゾイルオキシ、シアノ、イソシアノ、チオシアネート、イソチオシアネート、ニトロ、 $-NR''''R''''$ 、 $-NHCOR''''$ 、 $-NHCONR''''R''''$ 、 $-CONR''''R''''$ 、 $-SO_2R''''$ 、 $-OSO_2R''''$ 、 $-COR''''$ 、 $-CR''''=NR''''$ 又は $-N=CR''''R''''$ から選択される 1 又は複数の置換基で置換され、ここで、R

10

20

30

40

50

、及び R'''' は独立して水素、 C_{1-4} アルキル、ハロ(C_{1-4})アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、ハロ(C_{1-4})アルコキシ、 C_{1-4} アルキルチオ、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{3-6} シクロアルキル(C_{1-4})アルキル、フェニル又はベンジルであり、フェニル及びベンジル基は、任意にハロゲン、 C_{1-4} アルキル又は C_{1-4} アルコキシで置換されている、一般式(1)の化合物を提供する。特に注目すべきは、W、X及びYがCHであり、且つZがNである化合物である。

【0022】

本発明は、直近の定義の一般式(1)の化合物を含むが、但し、 R^3 及び R^4 が形成しうる C_{4-6} 鎖のみ、任意に1又は複数のメチル基で置換されることがあり；チオモルホリン、チオモルホリンS-オキシド、チオモルホリンS-ジオキシド及びピペラジンは、 R^3 及び R^4 が形成しうる環として除外され；トリ(C_{1-4})アルキルシリルは、あらゆるアルキル、アルケニル、アルキニル又はシクロアルキル基又は部分の置換基として除外され、そしてあらゆるモルホリン、ピペリジン又はピロリジン環は置換されない。

【0023】

更に別の側面において、本発明は、W、X、Y及びZのうち1つがNであり、その他が CR^8 であり；

R^8 はH、ハロ、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ又はハロ(C_{1-4})アルキルであり、但し、XがCHである場合、ZはNであり、

Rは $NH-NH_2$ であり、 R^1 はフェニルであり、且つ R^2 はC1であり、W及びYは両方 CH_3 であることはなく；

R及び R^2 のうち一方が NR^3R^4 であり、且つ他方がハロ、 C_{1-8} アルキル、 C_{1-8} アルコキシ、 C_{1-8} アルキルチオ、 C_{2-8} アルケニル、 C_{2-8} アルキニル又はシアノであり；

R^1 は任意に置換されたフェニルであり；

R^3 及び R^4 は独立してH、 C_{1-8} アルキル、 C_{2-8} アルケニル、 C_{2-8} アルキニル、アリール、アリール(C_{1-8})アルキル、 C_{3-8} シクロアルキル、 C_{3-8} シクロアルキル(C_{1-6})アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリール(C_{1-8})アルキル、 NR^5R^6 であり、但し、 R^3 及び R^4 が両方H又は NR^5R^6 であることはなく、あるいは

R^3 と R^4 は一緒に、 C_{3-7} アルキレン又は C_{3-7} アルケニレン鎖を形成し、これは任意に1又は複数の C_{1-4} アルキル又は C_{1-4} アルコキシ基で置換され、あるいは、

それらが結合する窒素原子と一緒に、 R^3 と R^4 は、モルホリン、チオモルホリン、チオモルホリンS-オキシド又はチオモルホリンS-ジオキシド環あるいはピペラジン又はピペラジンN-(C_{1-4})アルキル(特にN-メチル)環を形成し；且つ

R^5 及び R^6 は独立してH、 C_{1-8} アルキル、 C_{2-8} アルケニル、 C_{2-8} アルキニル、アリール、アリール(C_{1-8})アルキル、 C_{3-8} シクロアルキル、 C_{3-8} シクロアルキル(C_{1-6})アルキル、ヘテロアリール又はヘテロアリール(C_{1-8})アルキルを形成し；

前述のアルキル、アルケニル、アルキニル又はシクロアルキル基又は部分(R^8 についてものを除く)のいずれかが任意に、ハロゲン、シアノ、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} アルキルカルボニル、 C_{1-6} アルコキシカルボニル、 C_{1-6} ハロアルコキシ、 C_{1-6} アルキルチオ、トリ(C_{1-4})アルキルシリル、 C_{1-6} アルキルアミノ又は C_{1-6} ジアルキルアミノで置換され、

前述のモルホリン、チオモルホリン、ピペリジン、ピペラジン及びピロリジン環のいずれかが、任意に C_{1-4} アルキル(特にメチル)で置換され、且つ

前述のアリール又はヘテロアリール基又は部分のいずれか、例えば R^1 のフェニル基が、任意に、ハロ、ヒドロキシ、メルカプト、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{2-6} アルケニルオキシ、 C_{2-6} アルキニルオキシ、ハロ(C_{1-6})アルキル、ハロ(C_{1-6})アルコキシ、 C_{1-6} アルキルチオ、ハロ(C_{1-6})アルキルチオ、ヒドロキシ(C_{1-6})アルキル、 C_{1-4} アルコキシ(C_{1-6})アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{3-6} シクロアルキル(C_{1-4})アルキル、フェノキシ、ベンジルオキシ、ベンゾイルオキシ、シアノ、イソシアノ、チオシアネート、イソチオシアネート、ニトロ、 $-NR''''R''''$ 、 $-NHCOR''''$ 、 $-NHCONR''''R''''$ 、 $-CO$

10

20

30

40

50

$\text{NR}''''\text{R}''''', -\text{SO}_2\text{R}''''', -\text{OSO}_2\text{R}''''', -\text{COR}''''', -\text{CR}''''', -\text{NR}''''',$ 又は $-\text{N}=\text{CR}'''''\text{R}'''''$ から選択される 1 又は複数の置換基で置換され、ここで、 R''''' 及び R''''' は独立して水素、 C_{1-4} アルキル、ハロ (C_{1-4}) アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、ハロ (C_{1-4}) アルコキシ、 C_{1-4} アルキルチオ、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{3-6} シクロアルキル (C_{1-4}) アルキル、フェニル又はベンジルであり、フェニル及びベンジル基は、任意にハロゲン、 C_{1-4} アルキル又は C_{1-4} アルコキシで置換されている、一般式 (1) の化合物を提供する。特に注目すべきは、W, X 及び Y が CH であり、且つ Z が N である化合物である。

【0024】

本発明は、直近の定義の一般式 (1) の化合物を含むが、但し、 C_{1-8} アルコキシ及び C_{1-8} アルキルチオは R 及び R^2 の値としては除外され； C_7 アルキレン及び C_{3-7} アルケニレンは R^3 及び R^4 により形成される鎖としては除外され； R^3 及び R^4 が形成しうる C_{3-6} 鎖のみ、任意に 1 又は複数のメチル基で置換されることがあり；チオモルホリン、チオモルホリン S-オキシド、チオモルホリン S-ジオキシド及びピペラジンは、 R^3 及び R^4 が形成しうる環として除外され；トリ (C_{1-4}) アルキルシリルは、あらゆるアルキル、アルケニル、アルキニル又はシクロアルキル基又は部分の置換基として除外され、そして R^3 及び R^4 が形成しうるモルホリン環が置換されない。

【0025】

また更に別の側面において、本発明は、W, X, Y 及び Z のうちの 1 つが N であり、そしてその他は CR^8 であり；

R^8 は H、ハロ (例えば、フルオロ、クロロ又はブロモ)、 C_{1-4} アルキル (例えばメチル)、 C_{1-4} アルコキシ (例えばメトキシ) 又はハロ (C_{1-4}) アルキル (例えばトリフルオロメチル) であり、但し、X が CH である場合、Z は N であり、R は NHNH_2 であり、 R^1 はフェニルであり、且つ R^2 は C1 であり、W 及び Y は両方 CCH_3 であることはなく；

R はハロ (例えば、フルオロ、クロロ又はブロモ)、 C_{1-4} アルキル (例えばメチル)、 C_{1-4} アルコキシ (例えばメトキシ) 又はシアノであり；

R^1 は、任意に 1~5 個のハロゲン原子又はハロ、 C_{1-4} アルキル、ハロ (C_{1-4}) アルキル、 C_{1-4} アルコキシ若しくはハロ (C_{1-4}) アルコキシから選択される 1~3 個の置換基で置換されたフェニル、任意に 1~4 個のハロゲン原子又はハロ、 C_{1-4} アルキル、ハロ (C_{1-4}) アルキル、 C_{1-4} アルコキシ若しくはハロ (C_{1-4}) アルコキシから選択される 1~3 個の置換基で置換されたピリジル、任意に 1~3 個のハロゲン原子又はハロ、 C_{1-4} アルキル、ハロ (C_{1-4}) アルキル、 C_{1-4} アルコキシ若しくはハロ (C_{1-4}) アルコキシから選択される 1~3 個の置換基で置換された 2-又は 3-チエニル、あるいは共に 1 又は 2 個のメチル基で任意に置換されたピペリジノ又はモルホリノ、であり；

R^2 は NR^3R^4 であり；

R^3 は C_{1-8} アルキル、ハロ (C_{1-8}) アルキル、ヒドロキシ (C_{1-8}) アルキル、 C_{1-4} アルコキシハロ (C_{1-8}) アルキル、トリ (C_{1-4}) アルキルシリル (C_{1-6}) アルキル、 C_{1-4} アルキルカルボニル (C_{1-8}) アルキル、 C_{1-4} アルキルカルボニルハロ (C_{1-8}) アルキル、フェニル (C_{1-4}) アルキル、 C_{2-8} アルケニル、ハロ (C_{2-8}) アルケニル、 C_{2-8} アルキニル、 C_{3-8} シクロアルキルであって、任意にクロロ、フルオロ又はメチルで置換されているもの、 C_{3-8} シクロアルキル (C_{1-4}) アルキル、フェニルアミノ、ピペリジノ又はモルホリノであり、当該フェニルアルキル又はフェニルアミノのフェニル環は、任意に、ハロ、 C_{1-4} アルキル、ハロ (C_{1-4}) アルキル、 C_{1-4} アルコキシ及びハロ (C_{1-4}) アルコキシから選択される 1, 2 又は 3 個の置換基で置換され；且つ

R^4 は H、 C_{1-4} アルキル、ハロ (C_{1-4}) アルキル又はアミノであり、あるいは

R^3 と R^4 は一緒に C_{3-7} アルキレン又は C_{3-7} アルケニレン鎖を形成し、これは任意にメチルで置換され、あるいは、

それらが結合する窒素原子と一緒に、 R^3 と R^4 は、モルホリン、チオモルホリン、チオモルホリン S-オキシド又はチオモルホリン S-ジオキシド環あるいはピペラジンは又はピペ

10

20

30

40

50

ラジンN- (C_{1-4}) アルキル (特にN-メチル) 環を形成し、ここで、当該モルホリン又はピペラジン環は任意にメチルで置換されている、一般式 (1) の化合物を提供する。特に注目すべきは、W, X 及び Y が CH であり、且つ Z が N である化合物である。

【0026】

また更に別の側面において、本発明は、W, X, Y 及び Z のうちの 1 つが N であり、そしてその他は CR^8 であり；

R^8 は H、ハロ、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ又はハロ (C_{1-4}) アルキルであり；

R はハロであり；

R^1 は、任意に 1 ~ 5 個のハロゲン原子又はハロ、 C_{1-4} アルキル、ハロ (C_{1-4}) アルキル、 C_{1-4} アルコキシ若しくはハロ (C_{1-4}) アルコキシから選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されたフェニルであり；

R^2 が NR^3R^4 であり；

R^3 が C_{1-4} アルキル、ハロ (C_{1-4}) アルキル、 C_{2-4} アルケニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{3-6} シクロアルキル (C_{1-4}) アルキル又はフェニルアミノであり、ここで、フェニル環が任意に、ハロ、 C_{1-4} アルキル、ハロ (C_{1-4}) アルキル、 C_{1-4} アルコキシ及びハロ (C_{1-4}) アルコキシから選択される 1, 2 又は 3 個の置換基で置換されており；且つ

R^4 は H、 C_{1-4} アルキル又はアミノであり、あるいは R^3 と R^4 は一緒に、任意にメチルで置換される C_{4-6} アルキレン鎖を形成し、あるいは、それらが結合する窒素原子と一緒に、 R^3 と R^4 は、モルホリン環を形成している、一般式 (1) の化合物を提供する。特に注目すべきは、W, X 及び Y が CH であり、且つ Z が N である化合物である。

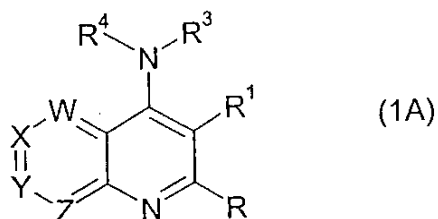
【0027】

本発明の一部を形成する化合物を以下の表 1 ~ 126 に例示する。特徴的なデータは下文の実施例及び表 132 に示す。

【0028】

表 1 において、化合物は、一般式 (1A) を有し、ここで、W, X 及び Y が CH であり、Z が N であり、R が Cl であり、 R^1 が 2, 4, 6-トリフルオロフェニルであり、且つ R^3 及び R^4 は表に示す通りである。

【化 2】



【0029】

【化 3】

表 1

化合物 番号	R ³	R ⁴
1	C ₂ H ₅	H
2	<i>n</i> -C ₃ H ₇	H
3	<i>i</i> -C ₃ H ₇	H
4	<i>n</i> -C ₄ H ₉	H
5	<i>i</i> -C ₄ H ₉	H
6	CH ₂ =CHCH ₂	H
7	CH ₂ =C(CH ₃)CH ₂	H
8	CF ₃ CH ₂	H
9	CF ₃ CH ₂ CH ₂	H
10	CF ₃ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H
11	CF ₃ (CH ₃)CH	H
12	(S)-CF ₃ (CH ₃)CH	H
13	(R)-CF ₃ (CH ₃)CH	H
14	シクロ-C ₃ H ₅	H
15	シクロ-C ₄ H ₇	H
16	シクロ-C ₅ H ₉	H
17	シクロ-C ₆ H ₁₁	H
18	シクロ-C ₃ H ₅ CH ₂	H
19	シクロ-C ₄ H ₇ CH ₂	H
20	-(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂ -	
21	シクロ-C ₆ H ₁₁ CH ₂	H
22	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -	
23	CH ₃ CH ₂ (CH ₃)CH	H
24	(S)-CH ₃ CH ₂ (CH ₃)CH	H
25	(R)-CH ₃ CH ₂ (CH ₃)CH	H
26	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
27	<i>n</i> -C ₃ H ₇	<i>n</i> -C ₃ H ₇
28	CH ₂ =C(CH ₃)CH ₂	C ₂ H ₅
29	CF ₃ CH ₂	C ₂ H ₅
30	C ₂ H ₅	NH ₂
31	<i>n</i> -C ₃ H ₇	NH ₂
32	<i>i</i> -C ₃ H ₇	NH ₂
33	<i>n</i> -C ₄ H ₉	NH ₂
34	CH ₂ =CHCH ₂	NH ₂
35	CH ₂ =C(CH ₃)CH ₂	NH ₂
36	CF ₂ =CFCH ₂ CH ₂	NH ₂

化合物 番号	R ³	R ⁴
37	CF ₃ CH ₂	NH ₂
38	CF ₃ CH ₂ CH ₂	NH ₂
39	CF ₃ CH ₂ CH ₂ CH ₂	NH ₂
40	4- <i>t</i> -C ₄ H ₉ -C ₆ H ₄ NH	H
41	4-F-C ₆ H ₄ NH	H
42	C ₆ H ₅ NH	H
43	4-CH ₃ -C ₆ H ₄ NH	H
44	4-Br-C ₆ H ₄ NH	H
45	2-F-C ₆ H ₄ NH	H
46	3,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃ NH	H
47	3-CF ₃ -C ₆ H ₄ NH	H
48	3,5-Cl ₂ -C ₆ H ₃ NH	H
49	4-CF ₃ O-C ₆ H ₃ NH	H
50	2-CF ₃ -C ₆ H ₄ NH	H
51	4-CF ₃ -C ₆ H ₄ NH	H
52	2-Br-C ₆ H ₄ NH	H
53	2-Cl-C ₆ H ₄ NH	H
54	2-CH ₃ -4-Cl-C ₆ H ₃ NH	H
55	2-CH ₃ -5-F-C ₆ H ₃ NH	H
56	3-Cl-C ₆ H ₄ NH	H
57	CH ₃	H
58	(CH ₃) ₂ CHCH ₂	H
59	(CH ₃) ₃ CCH ₂	H
60	(CH ₃) ₃ C(CH ₃)CH	H
61	CH ₃ CH ₂ (CH ₃) ₂ C	H
62	CH ₃ CH ₂ (CF ₃)CH	H
63	(S)-CH ₃ CH ₂ (CF ₃)CH	H
64	(R)-CH ₃ CH ₂ (CF ₃)CH	H
65	CH ₃ CH ₂ (CH ₃ CH ₂)CH	H
66	(CH ₃) ₂ CH(CH ₃ CH ₂)CH	H
67	(CH ₃) ₂ CH(CH ₃)CH	H
68	(CH ₃) ₂ CH(CF ₃)CH	H
69	(S)-(CH ₃) ₂ CH(CF ₃)CH	H
70	(R)-(CH ₃) ₂ CH(CF ₃)CH	H
71	HC=C(CH ₃)CH ₂	H
72	CH ₂ =CH(CH ₃ CH ₂)CH	H

10

20

30

40

【化 4】

化合物 番号	R ³	R ⁴
73	CH ₃ CH ₂ CH ₂ (CH ₃)CH	H
74	CH ₃ CH ₂ CH ₂ (CF ₃)CH	H
75	(S)-CH ₃ CH ₂ CH ₂ (CF ₃)CH	H
76	(R)-CH ₃ CH ₂ CH ₂ (CF ₃)CH	H
77	CH ₃ CH ₂ CH ₂ (CH ₃) ₂ C	H
78	CH ₃ CH ₂ (CH ₃)CHCH ₂	H
79	(CH ₃) ₂ CHCH ₂ CH ₂	H
80	(CH ₃) ₃ CCH ₂ CH ₂	H
81	CH ₃ CH ₂ (CH ₃)CH(CH ₃)- CH	H
82	CH ₃ CH ₂ (CH ₃)CH(CF ₃)- CH	H
83	(S)-CH ₃ CH ₂ (CH ₃)CH- (CF ₃)CH	H
84	(R)-CH ₃ CH ₂ (CH ₃)CH- (CF ₃)CH	H
85	CH ₃ (CH ₃)CHCH ₂ (CH ₃)- CH	H
86	CH ₃ (CH ₃)CHCH ₂ (CF ₃)- CH	H
87	(S)-CH ₃ (CH ₃)CHCH ₂ - (CF ₃)CH	H
88	(R)-CH ₃ (CH ₃)CHCH ₂ - (CF ₃)CH	H
89	(CH ₃) ₂ CH(CH ₃)CH- (CH ₃)CH ₂	H
90	(CH ₃) ₃ CCH ₂ (CH ₃)CH	H
91	<i>E</i> -CH ₃ CH=CH(CH ₃)CH	H
92	<i>E</i> -CH ₃ CH=CH(CH ₃ CH ₂)- CH	H
93	CH ₃ CH ₂ CH ₂ (CH ₃ CH ₂)- CH	H
94	CH ₃ CH ₂ (CH ₃ CH ₂)- CHCH ₂	H
95	CF ₂ =CFCH ₂ CH ₂	H
96	CF ₃ CH ₂ (CH ₃)CHCH ₂	H
97	CF ₃ CF ₂ CH ₂ CH ₂	H
98	CF ₃ CF ₂ CF ₂ CH ₂	H
99	CF ₂ =C(CH ₃)CH ₂ CH ₂	H
100	CH ₃ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H
101	CH ₃ CH ₂ CH ₂ CH ₂ - (CH ₃)CH	H
102	CH ₃ CH ₂ CH ₂ (CH ₃)- CHCH ₂	H
103	CH ₃ CH ₂ (CH ₃)CHCH ₂ - CH ₂	H
104	CH ₃ CH ₂ CH ₂ (CH ₃)CH- (CH ₃)CH	H

化合物 番号	R ³	R ⁴
105	CH ₃ CH ₂ (CH ₃)CHCH ₂ (CH ₃)CH	H
106	HOCH ₂ CH ₂	H
107	CH ₃ OCH ₂ CH ₂	H
108	CH ₃ OCH ₂ (CH ₃)CH	H
109	CH ₃ OCH ₂ (CF ₃)CH	H
110	CH ₃ OCH ₂ (CH ₃) ₂ C	H
111	CH ₃ O(CH ₃)CHCH ₂	H
112	CH ₃ O(CH ₃)CH(CH ₃)CH	H
113	HC≡CCH ₂	H
114	CH ₃ C≡CCH ₂	H
115	HC≡CCH ₂ CH ₂	H
116	HOCH ₂ CH ₂ CH ₂	H
117	CH ₃ OCH ₂ CH ₂ CH ₂	H
118	(CH ₃) ₃ SiCH ₂	H
119	C ₆ H ₅ CH ₂	H
120	C ₆ H ₅ (CH ₃)CH	H
121	4-F-C ₆ H ₄ CH ₂	H
122	4-Cl-C ₆ H ₄ CH ₂	H
123	4-F-C ₆ H ₃ (CH ₃)CH	H
124	4-Cl-C ₆ H ₃ (CH ₃)CH	H
125	C ₆ H ₅ CH ₂ CH ₂	H
126	4-F-C ₆ H ₄ CH ₂ CH ₂	H
127	1-ヒ ⁺ アリジノ	H
128	1-ヒ ⁺ ロリジノ	H
129	シクロ-C ₅ H ₉ CH ₂	H
130	ヒ ⁺ シクロ[2. 2. 1]ヘプター-2-イル	H
131	1-CH ₃ -シクロア ⁺ ロヒ ⁺ ル	H
132	cis-2-CH ₃ -シクロア ⁺ ロヒ ⁺ ル	H
133	trans-2-CH ₃ -シクロア ⁺ ロヒ ⁺ ル	H
134	2,2-(CH ₃) ₂ -シクロア ⁺ ロヒ ⁺ ル	H
135	1-CH ₃ -シクロア ⁺ チル	H
136	cis-2-CH ₃ -シクロア ⁺ チル	H
137	trans-2-CH ₃ -シクロア ⁺ チル	H
138	cis-3-CH ₃ -シクロア ⁺ チル	H
139	trans-3-CH ₃ -シクロア ⁺ チル	H
140	2,2-(CH ₃) ₂ -シクロア ⁺ チル	H

10

20

30

40

【化5】

化合物 番号	R ³	R ⁴
141	3,3-(CH ₃) ₂ -シクロブチル	H
142	1-CH ₃ -シクロペンチル	H
143	cis-2-CH ₃ -シクロペンチル	H
144	trans-2-CH ₃ -シクロペンチル	H
145	cis-3-CH ₃ -シクロペンチル	H
146	trans-3-CH ₃ -シクロペンチル	H
147	2,2-(CH ₃) ₂ -シクロヘキシル	H
148	3,3-(CH ₃) ₂ -シクロヘキシル	H
149	1-CH ₃ -シクロヘキシル	H
150	cis-2-CH ₃ -シクロヘキシル	H
151	trans-2-CH ₃ -シクロヘキシル	H
152	cis-3-CH ₃ -シクロヘキシル	H
153	trans-3-CH ₃ -シクロヘキシル	H
154	2,2-(CH ₃) ₂ -シクロヘキシル	H
155	3,3-(CH ₃) ₂ -シクロヘキシル	H
156	cis-4-CH ₃ -シクロヘキシル	H
157	trans-4-CH ₃ -シクロヘキシル	H
158	4,4-(CH ₃) ₂ -シクロヘキシル	H
159	4-(CH ₃) ₃ C-シクロヘキシル	H
160	-(CH ₂) ₃ -	
161	-(CH ₂) ₄ -	
162	-(CH ₂) ₅ -	
163	-(CH ₂) ₆ -	
164	-(CH ₂) ₂ (CH ₃) ₂ C(CH ₂) ₂ -	
165	-(CH ₃)CH(CH ₂) ₂ -	
166	-(CH ₃)CH(CH ₂) ₃ -	
167	-(CH ₃)CH(CH ₂) ₄ -	
168	-(CH ₃)CH(CH ₂) ₅ -	
169	-CH ₂ CH=CH(CH ₂) ₂ -	
170	-(CH ₂) ₂ NH(CH ₂) ₂ -	
171	-(CH ₂) ₂ NCH ₃ (CH ₂) ₂ -	
172	-(CH ₂) ₂ S(CH ₂) ₂ -	
173	-(CH ₂) ₂ SO(CH ₂) ₂ -	
174	-(CH ₂) ₂ SO ₂ (CH ₂) ₂ -	
175	-CH ₂ (CH ₃)CHO(CH ₃)CHCH ₂ -	
176	C ₂ H ₅	CH ₃
177	n-C ₃ H ₇	CH ₃

化合物 番号	R ³	R ⁴
178	i-C ₃ H ₇	CH ₃
179	n-C ₄ H ₉	CH ₃
180	i-C ₄ H ₉	CH ₃
181	CH ₂ =CHCH ₂	CH ₃
182	CH ₂ =C(CH ₃)CH ₂	CH ₃
183	CF ₃ CH ₂	CH ₃
184	CF ₃ CH ₂ CH ₂	CH ₃
185	CF ₃ CH ₂ CH ₂ CH ₂	CH ₃
186	CF ₃ (CH ₃)CH	CH ₃
187	(S)-CF ₃ (CH ₃)CH	CH ₃
188	(R)-CF ₃ (CH ₃)CH	CH ₃
189	シクロ-C ₃ H ₅	CH ₃
190	シクロ-C ₄ H ₇	CH ₃
191	シクロ-C ₅ H ₉	CH ₃
192	シクロ-C ₆ H ₁₁	CH ₃
193	シクロ-C ₃ H ₅ CH ₂	CH ₃
194	シクロ-C ₄ H ₇ CH ₂	CH ₃
195	シクロ-C ₆ H ₁₁ CH ₂	CH ₃
196	CH ₃ CH ₂ (CH ₃)CH	CH ₃
197	(S)-CH ₃ CH ₂ (CH ₃)CH	CH ₃
198	(R)-CH ₃ CH ₂ (CH ₃)CH	CH ₃
199	シクロ-C ₇ H ₁₃	CH ₃
200	CH ₂ =C(CH ₃)CH ₂	CH ₃
201	CF ₃ CH ₂	CH ₃
202	4-i-C ₄ H ₉ -C ₆ H ₄ NH	CH ₃
203	4-F-C ₆ H ₄ NH	CH ₃
204	C ₆ H ₅ NH	CH ₃
205	4-CH ₃ -C ₆ H ₄ NH	CH ₃
206	4-Br-C ₆ H ₄ NH	CH ₃
207	2-F-C ₆ H ₄ NH	CH ₃
208	3,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃ NH	CH ₃
209	3-CF ₃ -C ₆ H ₄ NH	CH ₃
210	3,5-Cl ₂ -C ₆ H ₃ NH	CH ₃
211	4-CF ₃ O-C ₆ H ₃ NH	CH ₃
212	2-CF ₃ -C ₆ H ₄ NH	CH ₃
213	4-CF ₃ -C ₆ H ₄ NH	CH ₃
214	2-Br-C ₆ H ₄ NH	CH ₃

10

20

30

40

【化 6】

化合物 番号	R ³	R ⁴
215	2-Cl-C ₆ H ₄ NH	CH ₃
216	2-CH ₃ -4-Cl-C ₆ H ₃ NH	CH ₃
217	2-CH ₃ -5-F-C ₆ H ₃ NH	CH ₃
218	3-Cl-C ₆ H ₄ NH	CH ₃
219	CH ₃	CH ₃
220	(CH ₃) ₂ CHCH ₂	CH ₃
221	(CH ₃) ₃ CCH ₂	CH ₃
222	(CH ₃) ₃ C(CH ₃)CH	CH ₃
223	CH ₃ CH ₂ (CH ₃) ₂ C	CH ₃
224	CH ₃ CH ₂ (CF ₃)CH	CH ₃
225	(S)-CH ₃ CH ₂ (CF ₃)CH	CH ₃
226	(R)-CH ₃ CH ₂ (CF ₃)CH	CH ₃
227	CH ₃ CH ₂ (CH ₃ CH ₂)CH	CH ₃
228	(CH ₃) ₂ CH(CH ₃ CH ₂)CH	CH ₃
229	(CH ₃) ₂ CH(CH ₃)CH	CH ₃
230	(CH ₃) ₂ CH(CF ₃)CH	CH ₃
231	(S)-(CH ₃) ₂ CH(CF ₃)CH	CH ₃
232	(R)-(CH ₃) ₂ CH(CF ₃)CH	CH ₃
233	HC=C(CH ₃)CH ₂	CH ₃
234	CH ₂ =CH(CH ₃ CH ₂)CH	CH ₃
235	CH ₃ CH ₂ CH ₂ (CH ₃)CH	CH ₃
236	CH ₃ CH ₂ CH ₂ (CF ₃)CH	CH ₃
237	(S)-CH ₃ CH ₂ CH ₂ (CF ₃)CH	CH ₃
238	(R)-CH ₃ CH ₂ CH ₂ (CF ₃)CH	CH ₃
239	CH ₃ CH ₂ CH ₂ (CH ₃) ₂ C	CH ₃
240	CH ₃ CH ₂ (CH ₃)CHCH ₂	CH ₃
241	(CH ₃) ₂ CHCH ₂ CH ₂	CH ₃
242	(CH ₃) ₃ CCH ₂ CH ₂	CH ₃
243	CH ₃ CH ₂ (CH ₃)CH(CH ₃)- CH	CH ₃
244	CH ₃ CH ₂ (CH ₃)CH(CF ₃)- CH	CH ₃
245	(S)-CH ₃ CH ₂ (CH ₃)CH- (CF ₃)CH	CH ₃
246	(R)-CH ₃ CH ₂ (CH ₃)CH- (CF ₃)CH	CH ₃
247	CH ₃ (CH ₃)CHCH ₂ - (CH ₃)CH	CH ₃
248	CH ₃ (CH ₃)CHCH ₂ - (CF ₃)CH	CH ₃

化合物 番号	R ³	R ⁴
249	(S)-CH ₃ (CH ₃)CHCH ₂ - (CF ₃)CH	CH ₃
250	(R)-CH ₃ (CH ₃)CHCH ₂ - (CF ₃)CH	CH ₃
251	(CH ₃) ₂ CH(CH ₃)CH(CH ₃)- CH ₂	CH ₃
252	(CH ₃) ₃ CCH ₂ (CH ₃)CH	CH ₃
253	<i>E</i> -CH ₃ CH=CH(CH ₃)CH	CH ₃
254	<i>E</i> -CH ₃ CH=CH(CH ₃ CH ₂)- CH	CH ₃
255	CH ₃ CH ₂ CH ₂ (CH ₃ CH ₂)- CH	CH ₃
256	CH ₃ CH ₂ (CH ₃ CH ₂)- CHCH ₂	CH ₃
257	CF ₂ =CFCH ₂ CH ₂	CH ₃
258	CF ₃ CH ₂ (CH ₃)CHCH ₂	CH ₃
259	CF ₃ CF ₂ CH ₂ CH ₂	CH ₃
260	CF ₃ CF ₂ CF ₂ CH ₂	CH ₃
261	CF ₂ =C(CH ₃)CH ₂ CH ₂	CH ₃
262	CH ₃ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	CH ₃
263	CH ₃ CH ₂ CH ₂ CH ₂ (CH ₃)- CH	CH ₃
264	CH ₃ CH ₂ CH ₂ (CH ₃)- CHCH ₂	CH ₃
265	CH ₃ CH ₂ (CH ₃)CHCH ₂ - CH ₂	CH ₃
266	CH ₃ CH ₂ CH ₂ (CH ₃)CH- (CH ₃)CH	CH ₃
267	CH ₃ CH ₂ (CH ₃)CHCH ₂ - (CH ₃)CH	CH ₃
268	HOCH ₂ CH ₂	CH ₃
269	CH ₃ OCH ₂ CH ₂	CH ₃
270	CH ₃ OCH ₂ (CH ₃)CH	CH ₃
271	CH ₃ OCH ₂ (CF ₃)CH	CH ₃
272	CH ₃ OCH ₂ (CH ₃) ₂ C	CH ₃
273	CH ₃ O(CH ₃)CHCH ₂	CH ₃
274	CH ₃ O(CH ₃)CH(CH ₃)CH	CH ₃
275	HC≡CCH ₂	CH ₃
276	CH ₃ C≡CCH ₂	CH ₃
277	HC≡CCH ₂ CH ₂	CH ₃
278	HOCH ₂ CH ₂ CH ₂	CH ₃
279	CH ₃ OCH ₂ CH ₂ CH ₂	CH ₃
280	(CH ₃) ₃ SiCH ₂	CH ₃
281	C ₆ H ₅ CH ₂	CH ₃

10

20

30

40

【化 7】

化合物 番号	R ³	R ⁴
282	C ₆ H ₅ (CH ₃)CH	CH ₃
283	4-F-C ₆ H ₄ CH ₂	H
284	4-Cl-C ₆ H ₄ CH ₂	CH ₃
285	4-F-C ₆ H ₅ (CH ₃)CH	CH ₃
286	4-Cl-C ₆ H ₅ (CH ₃)CH	CH ₃
287	C ₆ H ₅ CH ₂ CH ₂	CH ₃
288	4-F-C ₆ H ₅ CH ₂ CH ₂	CH ₃
289	1- $\text{t}^{\circ}\text{A}^{\circ}\text{リジノ}$	CH ₃
290	1- $\text{t}^{\circ}\text{シリジノ}$	CH ₃
291	シクロ-C ₃ H ₉ CH ₂	CH ₃
292	$\text{t}^{\circ}\text{シクロ}[2.2.1]\text{ヘプタ-2-イル}$	CH ₃
293	1-CH ₃ -シクロ 7° ピ t° ル	CH ₃
294	cis-2-CH ₃ -シクロ 7° ピ t° ル	CH ₃
295	trans-2-CH ₃ -シクロ 7° ピ t° ル	CH ₃
296	2,2-(CH ₃) ₂ -シクロ 7° ピ t° ル	CH ₃
297	1-CH ₃ -シクロ 7° チル	CH ₃
298	cis-2-CH ₃ -シクロ 7° チル	CH ₃
299	trans-2-CH ₃ -シクロ 7° チル	CH ₃
300	cis-3-CH ₃ -シクロ 7° チル	CH ₃
301	trans-3-CH ₃ -シクロ 7° チル	CH ₃
302	2,2-(CH ₃) ₂ -シクロ 7° チル	CH ₃
303	3,3-(CH ₃) ₂ -シクロ 7° チル	CH ₃
304	1-CH ₃ -シクロ 8° チル	CH ₃
305	cis-2-CH ₃ -シクロ 8° チル	CH ₃
306	trans-2-CH ₃ -シクロ 8° チル	CH ₃
307	cis-3-CH ₃ -シクロ 8° チル	CH ₃
308	trans-3-CH ₃ -シクロ 8° チル	CH ₃
309	2,2-(CH ₃) ₂ -シクロ 8° チル	CH ₃
310	3,3-(CH ₃) ₂ -シクロ 8° チル	CH ₃
311	1-CH ₃ -シクロヘキシル	CH ₃
312	cis-2-CH ₃ -シクロヘキシル	CH ₃
313	trans-2-CH ₃ -シクロヘキシル	CH ₃
314	cis-3-CH ₃ -シクロヘキシル	CH ₃
315	trans-3-CH ₃ -シクロヘキシル	CH ₃
316	2,2-(CH ₃) ₂ -シクロヘキシル	CH ₃
317	3,3-(CH ₃) ₂ -シクロヘキシル	CH ₃
318	cis-4-CH ₃ -シクロヘキシル	CH ₃

化合物 番号	R ⁵	R ⁴
319	trans-4-CH ₃ -シクロヘキシル	CH ₃
320	4,4-(CH ₃) ₂ -シクロヘキシル	CH ₃
321	4-(CH ₃) ₃ C-シクロヘキシル	CH ₃
322	n-C ₃ H ₇	C ₂ H ₅
323	i-C ₃ H ₇	C ₂ H ₅
324	n-C ₄ H ₉	C ₂ H ₅
325	t-C ₄ H ₉	C ₂ H ₅
326	CH ₂ =CHCH ₂	C ₂ H ₅
327	CF ₃ CH ₂ CH ₂	C ₂ H ₅
328	CF ₃ CH ₂ CH ₂ CH ₂	C ₂ H ₅
329	CF ₃ (CH ₃)CH	C ₂ H ₅
330	(S)-CF ₃ (CH ₃)CH	C ₂ H ₅
331	(R)-CF ₃ (CH ₃)CH	C ₂ H ₅
332	シクロ-C ₃ H ₅	C ₂ H ₅
333	シクロ-C ₄ H ₇	C ₂ H ₅
334	シクロ-C ₅ H ₉	C ₂ H ₅
335	シクロ-C ₆ H ₁₁	C ₂ H ₅
336	シクロ-C ₃ H ₅ CH ₂	C ₂ H ₅
337	シクロ-C ₄ H ₇ CH ₂	C ₂ H ₅
338	シクロ-C ₆ H ₁₁ CH ₂	C ₂ H ₅
339	CH ₃ CH ₂ (CH ₃)CH	C ₂ H ₅
340	(S)-CH ₃ CH ₂ (CH ₃)CH	C ₂ H ₅
341	(R)-CH ₃ CH ₂ (CH ₃)CH	C ₂ H ₅
342	シクロ-C ₇ H ₁₃	C ₂ H ₅
343	4-t-C ₄ H ₉ -C ₆ H ₄ NH	C ₂ H ₅
344	4-F-C ₆ H ₄ NH	C ₂ H ₅
345	C ₆ H ₅ NH	C ₂ H ₅
346	4-CH ₃ -C ₆ H ₄ NH	C ₂ H ₅
347	4-Br-C ₆ H ₄ NH	C ₂ H ₅
348	2-F-C ₆ H ₄ NH	C ₂ H ₅
349	3,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃ NH	C ₂ H ₅
350	3-CF ₃ -C ₆ H ₄ NH	C ₂ H ₅
351	3,5-Cl ₂ -C ₆ H ₃ NH	C ₂ H ₅
352	4-CF ₃ O-C ₆ H ₅ NH	C ₂ H ₅
353	2-CF ₃ -C ₆ H ₄ NH	C ₂ H ₅
354	4-CF ₃ -C ₆ H ₄ NH	C ₂ H ₅
355	2-Br-C ₆ H ₄ NH	C ₂ H ₅

10

20

30

40

【化 8】

化合物 番号	R ³	R ⁴
356	2-Cl-C ₆ H ₄ NH	C ₂ H ₅
357	2-CH ₃ -4-Cl-C ₆ H ₃ NH	C ₂ H ₅
358	2-CH ₃ -5-F-C ₆ H ₃ NH	C ₂ H ₅
359	3-Cl-C ₆ H ₄ NH	C ₂ H ₅
360	(CH ₃) ₂ CHCH ₂	C ₂ H ₅
361	(CH ₃) ₃ CCH ₂	C ₂ H ₅
362	(CH ₃) ₃ C(CH ₃)CH	C ₂ H ₅
363	CH ₃ CH ₂ (CH ₃) ₂ C	C ₂ H ₅
364	CH ₃ CH ₂ (CF ₃)CH	C ₂ H ₅
365	(S)-CH ₃ CH ₂ (CF ₃)CH	C ₂ H ₅
366	(R)-CH ₃ CH ₂ (CF ₃)CH	C ₂ H ₅
367	CH ₃ CH ₂ (CH ₃ CH ₂)CH	C ₂ H ₅
368	(CH ₃) ₂ CH(CH ₃ CH ₂)CH	C ₂ H ₅
369	(CH ₃) ₂ CH(CH ₃)CH	C ₂ H ₅
370	(CH ₃) ₂ CH(CF ₃)CH	C ₂ H ₅
371	(S)-(CH ₃) ₂ CH(CF ₃)CH	C ₂ H ₅
372	(R)-(CH ₃) ₂ CH(CF ₃)CH	C ₂ H ₅
373	HC=C(CH ₃)CH ₂	C ₂ H ₅
374	CH ₂ =CH(CH ₃ CH ₂)CH	C ₂ H ₅
375	CH ₃ CH ₂ CH ₂ (CH ₃)CH	C ₂ H ₅
376	CH ₃ CH ₂ CH ₂ (CF ₃)CH	C ₂ H ₅
377	(S)-CH ₃ CH ₂ CH ₂ (CF ₃)CH	C ₂ H ₅
378	(R)-CH ₃ CH ₂ CH ₂ (CF ₃)CH	C ₂ H ₅
379	CH ₃ CH ₂ CH ₂ (CH ₃) ₂ C	C ₂ H ₅
380	CH ₃ CH ₂ (CH ₃)CHCH ₂	C ₂ H ₅
381	(CH ₃) ₂ CHCH ₂ CH ₂	C ₂ H ₅
382	(CH ₃) ₃ CCH ₂ CH ₂	C ₂ H ₅
383	CH ₃ CH ₂ (CH ₃)CH(CH ₃)- CH	C ₂ H ₅
384	CH ₃ CH ₂ (CH ₃)CH(CF ₃)- CH	C ₂ H ₅
385	(S)-CH ₃ CH ₂ (CH ₃)CH- (CF ₃)CH	C ₂ H ₅
386	(R)-CH ₃ CH ₂ (CH ₃)CH- (CF ₃)CH	C ₂ H ₅
387	CH ₃ (CH ₃)CHCH ₂ (CH ₃)- CH	C ₂ H ₅
388	CH ₃ (CH ₃)CHCH ₂ (CF ₃)- CH	C ₂ H ₅
389	(S)-CH ₃ (CH ₃)CHCH ₂ - (CF ₃)CH	C ₂ H ₅

化合物 番号	R ³	R ⁴
390	(R)-CH ₃ (CH ₃)CHCH ₂ - (CF ₃)CH	C ₂ H ₅
391	(CH ₃) ₂ CH(CH ₃)CH- (CH ₃)CH ₂	C ₂ H ₅
392	(CH ₃) ₃ CCH ₂ (CH ₃)CH	C ₂ H ₅
393	<i>E</i> -CH ₃ CH=CH(CH ₃)CH	C ₂ H ₅
394	<i>E</i> -C H ₃ CH=CH- (CH ₃ CH ₂)CH	C ₂ H ₅
395	CH ₃ CH ₂ CH ₂ (CH ₃ CH ₂)- CH	C ₂ H ₅
396	CH ₃ CH ₂ (CH ₃ CH ₂)CH- CH ₂	C ₂ H ₅
397	CF ₂ =CFCH ₂ CH ₂	C ₂ H ₅
398	CF ₃ CH ₂ (CH ₃)CHCH ₂	C ₂ H ₅
399	CF ₃ CF ₂ CH ₂ CH ₂	C ₂ H ₅
400	CF ₃ CF ₂ CF ₂ CH ₂	C ₂ H ₅
401	CF ₂ =C(CH ₃)CH ₂ CH ₂	C ₂ H ₅
402	CH ₃ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	C ₂ H ₅
403	CH ₃ CH ₂ CH ₂ CH ₂ (CH ₃)- CH	C ₂ H ₅
404	CH ₃ CH ₂ CH ₂ (CH ₃)CH- CH ₂	C ₂ H ₅
405	CH ₃ CH ₂ (CH ₃)CHCH ₂ - CH ₂	C ₂ H ₅
406	CH ₃ CH ₂ CH ₂ (CH ₃)CH- (CH ₃)CH	C ₂ H ₅
407	CH ₃ CH ₂ (CH ₃)CHCH ₂ - (CH ₃)CH	C ₂ H ₅
408	HOCH ₂ CH ₂	C ₂ H ₅
409	CH ₃ OCH ₂ CH ₂	C ₂ H ₅
410	CH ₃ OCH ₂ (CH ₃)CH	C ₂ H ₅
411	CH ₃ OCH ₂ (CF ₃)CH	C ₂ H ₅
412	CH ₃ OCH ₂ (CH ₃) ₂ C	C ₂ H ₅
413	CH ₃ O(CH ₃)CHCH ₂	C ₂ H ₅
414	CH ₃ O(CH ₃)CH(CH ₃)CH	C ₂ H ₅
415	HC≡CCH ₂	C ₂ H ₅
416	CH ₃ C≡CCH ₂	C ₂ H ₅
417	HC≡CCH ₂ CH ₂	C ₂ H ₅
418	HOCH ₂ CH ₂ CH ₂	C ₂ H ₅
419	CH ₃ OCH ₂ CH ₂ CH ₂	C ₂ H ₅
420	(CH ₃) ₃ SiCH ₂	C ₂ H ₅
421	C ₆ H ₅ CH ₂	C ₂ H ₅
422	C ₆ H ₅ (CH ₃)CH	C ₂ H ₅

10

20

30

40

【化 9】

化合物 番号	R ³	R ⁴
423	4-F-C ₆ H ₄ CH ₂	C ₂ H ₅
424	4-Cl-C ₆ H ₄ CH ₂	C ₂ H ₅
425	4-F-C ₆ H ₃ (CH ₃)CH	C ₂ H ₅
426	4-Cl-C ₆ H ₃ (CH ₃)CH	C ₂ H ₅
427	C ₆ H ₅ CH ₂ CH ₂	C ₂ H ₅
428	4-F-C ₆ H ₅ CH ₂ CH ₂	C ₂ H ₅
429	1-ヒ [°] ヘ [°] リジ [°] ノ	C ₂ H ₅
430	1-ヒ [°] ロ [°] リジ [°] ノ	C ₂ H ₅
431	シロ [°] -C ₅ H ₉ CH ₂	C ₂ H ₅
432	ヒ [°] シロ [°] [2. 2. 1]ヘ [°] タ [°] -2-イル	C ₂ H ₅
433	1-CH ₃ -シロ [°] ア [°] ロ [°] ヒ [°] ル	C ₂ H ₅
434	cis-2-CH ₃ -シロ [°] ア [°] ロ [°] ヒ [°] ル	C ₂ H ₅
435	trans-2-CH ₃ -シロ [°] ア [°] ロ [°] ヒ [°] ル	C ₂ H ₅
436	2,2-(CH ₃) ₂ -シロ [°] ア [°] ロ [°] ヒ [°] ル	C ₂ H ₅
437	1-CH ₃ -シロ [°] ア [°] チ [°] ル	C ₂ H ₅
438	cis-2-CH ₃ -シロ [°] ア [°] チ [°] ル	C ₂ H ₅
439	trans-2-CH ₃ -シロ [°] ア [°] チ [°] ル	C ₂ H ₅
440	cis-3-CH ₃ -シロ [°] ア [°] チ [°] ル	C ₂ H ₅
441	trans-3-CH ₃ -シロ [°] ア [°] チ [°] ル	C ₂ H ₅
442	2,2-(CH ₃) ₂ -シロ [°] ア [°] チ [°] ル	C ₂ H ₅
443	3,3-(CH ₃) ₂ -シロ [°] ア [°] チ [°] ル	C ₂ H ₅
444	1-CH ₃ -シロ [°] ヘ [°] ンチ [°] ル	C ₂ H ₅
445	cis-2-CH ₃ -シロ [°] ヘ [°] ンチ [°] ル	C ₂ H ₅
446	trans-2-CH ₃ -シロ [°] ヘ [°] ンチ [°] ル	C ₂ H ₅
447	cis-3-CH ₃ -シロ [°] ヘ [°] ンチ [°] ル	C ₂ H ₅
448	trans-3-CH ₃ -シロ [°] ヘ [°] ンチ [°] ル	C ₂ H ₅
449	2,2-(CH ₃) ₂ -シロ [°] ヘ [°] ンチ [°] ル	C ₂ H ₅
450	3,3-(CH ₃) ₂ -シロ [°] ヘ [°] ンチ [°] ル	C ₂ H ₅
451	1-CH ₃ -シロ [°] ヘ [°] キシ [°] ル	C ₂ H ₅
452	cis-2-CH ₃ -シロ [°] ヘ [°] キシ [°] ル	C ₂ H ₅
453	trans-2-CH ₃ -シロ [°] ヘ [°] キシ [°] ル	C ₂ H ₅
454	cis-3-CH ₃ -シロ [°] ヘ [°] キシ [°] ル	C ₂ H ₅
355	trans-3-CH ₃ -シロ [°] ヘ [°] キシ [°] ル	C ₂ H ₅
456	2,2-(CH ₃) ₂ -シロ [°] ヘ [°] キシ [°] ル	C ₂ H ₅
457	3,3-(CH ₃) ₂ -シロ [°] ヘ [°] キシ [°] ル	C ₂ H ₅
458	cis-4-CH ₃ -シロ [°] ヘ [°] キシ [°] ル	C ₂ H ₅
459	trans-4-CH ₃ -シロ [°] ヘ [°] キシ [°] ル	C ₂ H ₅

化合物 番号	R ³	R ⁴
460	4,4-(CH ₃) ₂ -シロ [°] ヘ [°] キシ [°] ル	C ₂ H ₅
461	4-(CH ₃) ₃ C-シロ [°] ヘ [°] キシ [°] ル	C ₂ H ₅
462	n-C ₃ H ₇	CF ₃ CH ₂
463	i-C ₃ H ₇	CF ₃ CH ₂
464	n-C ₄ H ₉	CF ₃ CH ₂
465	t-C ₄ H ₉	CF ₃ CH ₂
466	CH ₂ =CHCH ₂	CF ₃ CH ₂
467	CH ₂ =C(CH ₃)CH ₂	CF ₃ CH ₂
468	CF ₃ CH ₂	CF ₃ CH ₂
469	CF ₃ CH ₂ CH ₂	CF ₃ CH ₂
470	CF ₃ CH ₂ CH ₂ CH ₂	CF ₃ CH ₂
471	CF ₃ (CH ₃)CH	CF ₃ CH ₂
472	(S)-CF ₃ (CH ₃)CH	CF ₃ CH ₂
473	(R)-CF ₃ (CH ₃)CH	CF ₃ CH ₂
474	シロ [°] -C ₃ H ₅	CF ₃ CH ₂
475	シロ [°] -C ₄ H ₇	CF ₃ CH ₂
476	シロ [°] -C ₅ H ₉	CF ₃ CH ₂
477	シロ [°] -C ₆ H ₁₁	CF ₃ CH ₂
478	シロ [°] -C ₃ H ₅ CH ₂	CF ₃ CH ₂
479	シロ [°] -C ₄ H ₇ CH ₂	CF ₃ CH ₂
480	シロ [°] -C ₆ H ₁₁ CH ₂	CF ₃ CH ₂
481	CH ₃ CH ₂ (CH ₃)CH	CF ₃ CH ₂
482	(S)-CH ₃ CH ₂ (CH ₃)CH	CF ₃ CH ₂
483	(R)-CH ₃ CH ₂ (CH ₃)CH	CF ₃ CH ₂
484	シロ [°] -C ₇ H ₁₃	CF ₃ CH ₂
485	CH ₂ =C(CH ₃)CH ₂	CF ₃ CH ₂
486	CF ₃ CH ₂	CF ₃ CH ₂
487	4-t-C ₄ H ₉ -C ₆ H ₄ NH	CF ₃ CH ₂
488	4-F-C ₆ H ₄ NH	CF ₃ CH ₂
489	C ₆ H ₅ NH	CF ₃ CH ₂
490	4-CH ₃ -C ₆ H ₄ NH	CF ₃ CH ₂
491	4-Br-C ₆ H ₄ NH	CF ₃ CH ₂
492	2-F-C ₆ H ₄ NH	CF ₃ CH ₂
493	3,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃ NH	CF ₃ CH ₂
494	3-CF ₃ -C ₆ H ₄ NH	CF ₃ CH ₂
495	3,5-Cl ₂ -C ₆ H ₃ NH	CF ₃ CH ₂
496	4-CF ₃ O-C ₆ H ₅ NH	CF ₃ CH ₂

10

20

30

40

【化 10】

化合物 番号	R ³	R ⁴
497	2-CF ₃ -C ₆ H ₄ NH	CF ₃ CH ₂
498	4-CF ₃ -C ₆ H ₄ NH	CF ₃ CH ₂
499	2-Br-C ₆ H ₄ NH	CF ₃ CH ₂
500	2-Cl-C ₆ H ₄ NH	CF ₃ CH ₂
501	2-CH ₃ -4-Cl-C ₆ H ₃ NH	CF ₃ CH ₂
502	2-CH ₃ -5-F-C ₆ H ₃ NH	CF ₃ CH ₂
503	3-Cl-C ₆ H ₄ NH	CF ₃ CH ₂
504	(CH ₃) ₂ CHCH ₂	CF ₃ CH ₂
505	(CH ₃) ₃ CCH ₂	CF ₃ CH ₂
506	(CH ₃) ₃ C(CH ₃)CH	CF ₃ CH ₂
507	CH ₃ CH ₂ (CH ₃) ₂ C	CF ₃ CH ₂
508	CH ₃ CH ₂ (CF ₃)CH	CF ₃ CH ₂
509	(S)-CH ₃ CH ₂ (CF ₃)CH	CF ₃ CH ₂
510	(R)-CH ₃ CH ₂ (CF ₃)CH	CF ₃ CH ₂
511	CH ₃ CH ₂ (CH ₃ CH ₂)CH	CF ₃ CH ₂
512	(CH ₃) ₂ CH(CH ₃ CH ₂)CH	CF ₃ CH ₂
513	(CH ₃) ₂ CH(CH ₃)CH	CF ₃ CH ₂
514	(CH ₃) ₂ CH(CF ₃)CH	CF ₃ CH ₂
515	(S)-(CH ₃) ₂ CH(CF ₃)CH	CF ₃ CH ₂
516	(R)-(CH ₃) ₂ CH(CF ₃)CH	CF ₃ CH ₂
517	HC=C(CH ₃)CH ₂	CF ₃ CH ₂
518	CH ₂ =CH(CH ₃ CH ₂)CH	CF ₃ CH ₂
520	CH ₃ CH ₂ CH ₂ (CH ₃)CH	CF ₃ CH ₂
521	CH ₃ CH ₂ CH ₂ (CF ₃)CH	CF ₃ CH ₂
522	(S)-CH ₃ CH ₂ CH ₂ (CF ₃)CH	CF ₃ CH ₂
523	(R)-CH ₃ CH ₂ CH ₂ (CF ₃)CH	CF ₃ CH ₂
524	CH ₃ CH ₂ CH ₂ (CH ₃) ₂ C	CF ₃ CH ₂
525	CH ₃ CH ₂ (CH ₃)CHCH ₂	CF ₃ CH ₂
526	(CH ₃) ₂ CHCH ₂ CH ₂	CF ₃ CH ₂
527	(CH ₃) ₃ CCH ₂ CH ₂	CF ₃ CH ₂
528	CH ₃ CH ₂ (CH ₃)CH(CH ₃)- CH	CF ₃ CH ₂
529	CH ₃ CH ₂ (CH ₃)CH(CF ₃)- CH	CF ₃ CH ₂
530	(S)-CH ₃ CH ₂ (CH ₃)CH- (CF ₃)CH	CF ₃ CH ₂
531	(R)-CH ₃ CH ₂ (CH ₃)CH- (CF ₃)CH	CF ₃ CH ₂
532	CH ₃ (CH ₃)CHCH ₂ (CH ₃)- CH	CF ₃ CH ₂

化合物 番号	R ³	R ⁴
533	CH ₃ (CH ₃)CHCH ₂ (CF ₃)- CH	CF ₃ CH ₂
534	(S)-CH ₃ (CH ₃)CHCH ₂ - (CF ₃)CH	CF ₃ CH ₂
535	(R)-CH ₃ (CH ₃)CHCH ₂ - (CF ₃)CH	CF ₃ CH ₂
536	(CH ₃) ₂ CH(CH ₃)CH- (CH ₃)CH ₂	CF ₃ CH ₂
537	(CH ₃) ₃ CCH ₂ (CH ₃)CH	CF ₃ CH ₂
538	<i>E</i> -CH ₃ CH=CH(CH ₃)CH	CF ₃ CH ₂
539	<i>E</i> -CH ₃ CH=CH(CH ₃ CH ₂)- CH	CF ₃ CH ₂
540	CH ₃ CH ₂ CH ₂ (CH ₃ CH ₂)- CH	CF ₃ CH ₂
541	CH ₃ CH ₂ (CH ₃ CH ₂)CH- CH ₂	CF ₃ CH ₂
542	CF ₂ =CFCH ₂ CH ₂	CF ₃ CH ₂
543	CF ₃ CH ₂ (CH ₃)CHCH ₂	CF ₃ CH ₂
544	CF ₃ CF ₂ CH ₂ CH ₂	CF ₃ CH ₂
545	CF ₃ CF ₂ CF ₂ CH ₂	CF ₃ CH ₂
546	CF ₂ =C(CH ₃)CH ₂ CH ₂	CF ₃ CH ₂
547	CH ₃ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	CF ₃ CH ₂
548	CH ₃ CH ₂ CH ₂ CH ₂ (CH ₃)- CH	CF ₃ CH ₂
549	CH ₃ CH ₂ CH ₂ (CH ₃)CH- CH ₂	CF ₃ CH ₂
550	CH ₃ CH ₂ (CH ₃)CHCH ₂ - CH ₂	CF ₃ CH ₂
551	CH ₃ CH ₂ CH ₂ (CH ₃)CH- (CH ₃)CH	CF ₃ CH ₂
552	CH ₃ CH ₂ (CH ₃)CHCH ₂ - (CH ₃)CH	CF ₃ CH ₂
553	HOCH ₂ CH ₂	CF ₃ CH ₂
554	CH ₃ OCH ₂ CH ₂	CF ₃ CH ₂
555	CH ₃ OCH ₂ (CH ₃)CH	CF ₃ CH ₂
556	CH ₃ OCH ₂ (CF ₃)CH	CF ₃ CH ₂
557	CH ₃ OCH ₂ (CH ₃) ₂ C	CF ₃ CH ₂
558	CH ₃ O(CH ₃)CHCH ₂	CF ₃ CH ₂
559	CH ₃ O(CH ₃)CH(CH ₃)CH	CF ₃ CH ₂
560	HC≡CCH ₂	CF ₃ CH ₂
561	CH ₃ C≡CCH ₂	CF ₃ CH ₂
562	HC≡CCH ₂ CH ₂	CF ₃ CH ₂
563	HOCH ₂ CH ₂ CH ₂	CF ₃ CH ₂
564	CH ₃ OCH ₂ CH ₂ CH ₂	CF ₃ CH ₂
565	(CH ₃) ₃ SiCH ₂	CF ₃ CH ₂

10

20

30

40

【化 1 1】

化合物 番号	R ³	R ⁴
566	C ₆ H ₅ CH ₂	CF ₃ CH ₂
567	C ₆ H ₅ (CH ₃)CH	CF ₃ CH ₂
568	4-F-C ₆ H ₄ CH ₂	CF ₃ CH ₂
569	4-Cl-C ₆ H ₄ CH ₂	CF ₃ CH ₂
570	4-F-C ₆ H ₃ (CH ₃)CH	CF ₃ CH ₂
571	4-Cl-C ₆ H ₃ (CH ₃)CH	CF ₃ CH ₂
572	C ₆ H ₅ CH ₂ CH ₂	CF ₃ CH ₂
573	4-F-C ₆ H ₅ CH ₂ CH ₂	CF ₃ CH ₂
574	1-ヒンクリン	CF ₃ CH ₂
575	1-ヒンクリン	CF ₃ CH ₂
576	シクロ-C ₃ H ₅ CH ₂	CF ₃ CH ₂
577	ヒンクリン [2, 2, 1]ヘプタ-2-イル	CF ₃ CH ₂
578	1-CH ₃ -シクロプロピル	CF ₃ CH ₂
579	cis-2-CH ₃ -シクロプロピル	CF ₃ CH ₂
580	trans-2-CH ₃ -シクロプロピル	CF ₃ CH ₂
581	2,2-(CH ₃) ₂ -シクロプロピル	CF ₃ CH ₂
582	1-CH ₃ -シクロブチル	CF ₃ CH ₂
583	cis-2-CH ₃ -シクロブチル	CF ₃ CH ₂
584	trans-2-CH ₃ -シクロブチル	CF ₃ CH ₂
585	cis-3-CH ₃ -シクロブチル	CF ₃ CH ₂
586	trans-3-CH ₃ -シクロブチル	CF ₃ CH ₂
587	2,2-(CH ₃) ₂ -シクロブチル	CF ₃ CH ₂
588	3,3-(CH ₃) ₂ -シクロブチル	CF ₃ CH ₂
589	1-CH ₃ -シクロペンチル	CF ₃ CH ₂
590	cis-2-CH ₃ -シクロペンチル	CF ₃ CH ₂
591	trans-2-CH ₃ -シクロペンチル	CF ₃ CH ₂
592	cis-3-CH ₃ -シクロペンチル	CF ₃ CH ₂
593	trans-3-CH ₃ -シクロペンチル	CF ₃ CH ₂
594	2,2-(CH ₃) ₂ -シクロペンチル	CF ₃ CH ₂
595	3,3-(CH ₃) ₂ -シクロペンチル	CF ₃ CH ₂
596	1-CH ₃ -シクロヘキシル	CF ₃ CH ₂
597	cis-2-CH ₃ -シクロヘキシル	CF ₃ CH ₂
598	trans-2-CH ₃ -シクロヘキシル	CF ₃ CH ₂
599	cis-3-CH ₃ -シクロヘキシル	CF ₃ CH ₂
600	trans-3-CH ₃ -シクロヘキシル	CF ₃ CH ₂
601	2,2-(CH ₃) ₂ -シクロヘキシル	CF ₃ CH ₂
602	3,3-(CH ₃) ₂ -シクロヘキシル	CF ₃ CH ₂

化合物 番号	R ³	R ⁴
603	cis-4-CH ₃ -シクロヘキシル	CF ₃ CH ₂
604	trans-4-CH ₃ -シクロヘキシル	CF ₃ CH ₂
605	4,4-(CH ₃) ₂ -シクロヘキシル	CF ₃ CH ₂
606	4-(CH ₃) ₃ C-シクロヘキシル	CF ₃ CH ₂
607	cis-1-CH ₃ -2-フルオロ- シクロプロピル	H
608	trans-1-CH ₃ -2-フルオロ- シクロプロピル	H
609	1-CH ₃ -2,2-ジフルオロ- シクロプロピル	H
610	cis-1-CH ₃ -2-クロロ-2- フルオロシクロプロピル	H
611	trans-1-CH ₃ -2-クロロ-2- フルオロシクロプロピル	H
612	CH ₃ CO(CH ₃)CH	H
613	CH ₃ CH ₂ CO(CH ₃)CH	H
614	(CH ₃) ₂ CHCO(CH ₃)CH	H
615	(CH ₃) ₃ CCO(CH ₃)CH	H
616	CH ₃ CH ₂ CH ₂ CO(CH ₃)CH	H
617	CH ₃ CO(CF ₃)CH	H
618	CH ₃ CH ₂ CO(CF ₃)CH	H
619	CH ₃ CO(CH ₃) ₂ C	H
620	CH ₃ CH ₂ CO(CH ₃) ₂ C	H
621	cis-1-CH ₃ -2-フルオロ- シクロプロピル	CH ₃
622	trans-1-CH ₃ -2-フルオロ- シクロプロピル	CH ₃
623	1-CH ₃ -2,2-ジフルオロ- シクロプロピル	CH ₃
624	cis-1-CH ₃ -2-クロロ-2- フルオロシクロプロピル	CH ₃
625	trans-1-CH ₃ -2-クロロ-2- フルオロシクロプロピル	CH ₃
626	CH ₃ CO(CH ₃)CH	CH ₃
627	CH ₃ CH ₂ CO(CH ₃)CH	CH ₃
628	(CH ₃) ₂ CHCO(CH ₃)CH	CH ₃
629	(CH ₃) ₃ CCO(CH ₃)CH	CH ₃
630	CH ₃ CH ₂ CH ₂ CO(CH ₃)CH	CH ₃
631	CH ₃ CO(CF ₃)CH	CH ₃
632	CH ₃ CH ₂ CO(CF ₃)CH	CH ₃
633	CH ₃ CO(CH ₃) ₂ C	CH ₃
634	CH ₃ CH ₂ CO(CH ₃) ₂ C	CH ₃
635	cis-1-CH ₃ -2-フルオロ- シクロプロピル	C ₂ H ₅

10

20

30

40

【化 1 2】

化合物 番号	R ³	R ⁴
636	<i>trans</i> -1-CH ₃ -2-フルオロ- シクロプロピル	C ₂ H ₅
637	1-CH ₃ -2,2-ジフルオロ- シクロプロピル	C ₂ H ₅
638	<i>cis</i> -1-CH ₃ -2-クロロ-2- フルオロシクロプロピル	C ₂ H ₅
639	<i>trans</i> -1-CH ₃ -2-クロロ-2- フルオロシクロプロピル	C ₂ H ₅
640	CH ₃ CO(CH ₃)CH	C ₂ H ₅
641	CH ₃ CH ₂ CO(CH ₃)CH	C ₂ H ₅
642	(CH ₃) ₂ CHCO(CH ₃)CH	C ₂ H ₅
643	(CH ₃) ₃ CCO(CH ₃)CH	C ₂ H ₅
644	CH ₃ CH ₂ CH ₂ CO(CH ₃)CH	C ₂ H ₅
645	CH ₃ CO(CF ₃)CH	C ₂ H ₅
646	CH ₃ CH ₂ CO(CF ₃)CH	C ₂ H ₅
647	CH ₃ CO(CH ₃) ₂ C	C ₂ H ₅
648	CH ₃ CH ₂ CO(CH ₃) ₂ C	C ₂ H ₅
649	<i>cis</i> -1-CH ₃ -2-フルオロ- シクロプロピル	CF ₃ CH ₂

化合物 番号	R ³	R ⁴
650	<i>trans</i> -1-CH ₃ -2-フルオロ- シクロプロピル	CF ₃ CH ₂
651	1-CH ₃ -2,2-ジフルオロ- シクロプロピル	CF ₃ CH ₂
652	<i>cis</i> -1-CH ₃ -2-クロロ-2- フルオロシクロプロピル	CF ₃ CH ₂
653	<i>trans</i> -1-CH ₃ -2-クロロ-2- フルオロシクロプロピル	CF ₃ CH ₂
654	CH ₃ CO(CH ₃)CH	CF ₃ CH ₂
655	CH ₃ CH ₂ CO(CH ₃)CH	CF ₃ CH ₂
656	(CH ₃) ₂ CHCO(CH ₃)CH	CF ₃ CH ₂
657	(CH ₃) ₃ CCO(CH ₃)CH	CF ₃ CH ₂
658	CH ₃ CH ₂ CH ₂ CO(CH ₃)CH	CF ₃ CH ₂
659	CH ₃ CO(CF ₃)CH	CF ₃ CH ₂
660	CH ₃ CH ₂ CO(CF ₃)CH	CF ₃ CH ₂
661	CH ₃ CO(CH ₃) ₂ C	CF ₃ CH ₂
662	CH ₃ CH ₂ CO(CH ₃) ₂ C	CF ₃ CH ₂

【0030】

表 2

表 2 は、W、X 及び Y が CH であり、Z が N であり、R が Cl であり、R¹ が 2, 5, 6-トリフルオロフェニルであり、且つ R³ 及び R⁴ の値は表 1 に列記した通りである、一般式 (1A) の 662 個の化合物から成る。従って、表 2 の化合物 1 は、表 2 の化合物 1 において、R¹ が 2, 5, 6-トリフルオロフェニルであることを除いて、表 1 の化合物 1 と同一である。同様に、表 2 の化合物 2~662 は、表 2 の化合物において、R¹ が 2, 5, 6-トリフルオロフェニルであることを除いて、表 1 の化合物 2~662 と同一である。

【0031】

表 3

表 3 は、W、X 及び Y が CH であり、Z が N であり、R が Cl であり、R¹ が 2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニルであり、且つ R³ 及び R⁴ の値は表 1 に列記した通りである、一般式 (1A) の 662 個の化合物から成る。従って、表 3 の化合物 1 は、表 3 の化合物 1 において、R¹ が 2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニルであることを除いて、表 1 の化合物 1 と同一である。同様に、表 3 の化合物 2~662 は、表 3 の化合物において、R¹ が 2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニルであることを除いて、表 1 の化合物 2~662 と同一である。

【0032】

表 4

表 4 は、W、X 及び Y が CH であり、Z が N であり、R が Cl であり、R¹ が 2, 6-ジフルオロ-4-メトキシフェニルであり、且つ R³ 及び R⁴ の値は表 1 に列記した通りである、一般式 (1A) の 662 個の化合物から成る。従って、表 4 の化合物 1 は、表 4 の化合物 1 において、R¹ が 2, 6-ジフルオロ-4-メトキシフェニルであることを除いて、

て、表 1 の化合物 1 と同一である。同様に、表 4 の化合物 2 ～ 6 6 2 は、表 4 の化合物において、 R^1 が 2, 6-ジフルオロ-4-メトキシフェニルであることを除いて、表 1 の化合物 2 ～ 6 6 2 と同一である。

【0033】

表 5

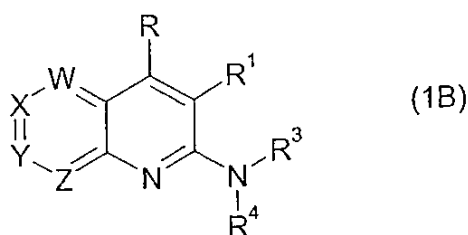
表 5 は、W、X 及び Y が CH であり、Z が N であり、R が Cl であり、 R^1 が 2-フルオロ-6-クロロフェニルであり、且つ R^3 及び R^4 の値は表 1 に列記した通りである、一般式 (1A) の 6 6 2 個の化合物から成る。従って、表 5 の化合物 1 は、表 5 の化合物 1 において、 R^1 が 2-フルオロ-6-クロロフェニルであることを除いて、表 1 の化合物 1 と同一である。同様に、表 5 の化合物 2 ～ 6 6 2 は、表 5 の化合物において、 R^1 が 2-フルオロ-6-クロロフェニルであることを除いて、表 1 の化合物 2 ～ 6 6 2 と同一である。

10

【0034】

表 6

【化 13】



20

表 6 は、W、X 及び Y が CH であり、Z が N であり、R が Cl であり、 R^1 が 2, 4, 6-トリフルオロフェニルであり、且つ R^3 及び R^4 の値は表 1 に列記した通りである、一般式 (1B) の 6 6 2 個の化合物から成る。従って、表 6 の化合物 1 は、表 6 の化合物 1 において、化合物が一般式 (1B) を有することを除いて、表 1 の化合物 1 と同一である。同様に、表 6 の化合物 2 ～ 6 6 2 は、表 6 の化合物において、化合物が一般式 (1B) を有することを除いて、表 1 の化合物 2 ～ 6 6 2 と同一である。

30

【0035】

表 7

表 7 は、W、X 及び Y が CH であり、Z が N であり、R が Cl であり、 R^1 が 2, 5, 6-トリフルオロフェニルであり、且つ R^3 及び R^4 の値は表 1 に列記した通りである、一般式 (1B) の 6 6 2 個の化合物から成る。従って、表 7 の化合物 1 は、表 7 の化合物 1 において、化合物が一般式 (1B) を有することを除いて、表 1 の化合物 1 と同一である。同様に、表 7 の化合物 2 ～ 6 6 2 は、表 7 の化合物において、化合物が一般式 (1B) を有することを除いて、表 1 の化合物 2 ～ 6 6 2 と同一である。

40

【0036】

表 8

表 8 は、W、X 及び Y が CH であり、Z が N であり、R が Cl であり、 R^1 が 2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニルであり、且つ R^3 及び R^4 の値は表 3 に列記した通りである、一般式 (1B) の 6 6 2 個の化合物から成る。従って、表 8 の化合物 1 は、表 8 の化合物 1 において、化合物が一般式 (1B) を有することを除いて、表 3 の化合物 1 と同一である。同様に、表 8 の化合物 2 ～ 6 6 2 は、表 8 の化合物において、化合物が一般式 (1B) を有することを除いて、表 3 の化合物 2 ～ 6 6 2 と同一である。

【0037】

表 9

50

表 9 は、W、X 及び Y が CH であり、Z が N であり、R が Cl であり、R¹ が 2, 6-ジフルオロ-4-メトキシフェニルであり、且つ R³ 及び R⁴ の値は表 1 に列記した通りである、一般式 (1 B) の 662 個の化合物から成る。従って、表 9 の化合物 1 は、表 9 の化合物 1 において、化合物が一般式 (1 B) を有することを除いて、表 4 の化合物 1 と同一である。同様に、表 9 の化合物 2 ~ 662 は、表 9 の化合物において、化合物が一般式 (1 B) を有することを除いて、表 4 の化合物 2 ~ 662 と同一である。

【0038】

表 10

表 10 は、W、X 及び Y が CH であり、Z が N であり、R が Cl であり、R¹ が 2-フルオロ-6-クロロフェニルであり、且つ R³ 及び R⁴ の値は表 1 に列記した通りである、一般式 (1 B) の 662 個の化合物から成る。従って、表 10 の化合物 1 は、表 10 の化合物 1 において、化合物が一般式 (1 B) を有することを除いて、表 5 の化合物 1 と同一である。同様に、表 10 の化合物 2 ~ 662 は、表 10 の化合物において、化合物が一般式 (1 B) を有することを除いて、表 5 の化合物 2 ~ 662 と同一である。

10

【0039】

表 11

表 11 は、W が N であり且つ、X、Y 及び Z が CH であり、R が Cl であり、R¹ が 2, 4, 6-トリフルオロフェニルであり、且つ R³ 及び R⁴ の値は表 1 に列記した通りである、一般式 (1 A) の 662 個の化合物から成る。従って、表 11 の化合物 1 は、表 11 の化合物 1 において、W が N であり且つ、X、Y 及び Z が CH であることを除いて、表 1 の化合物 1 と同一である。同様に、表 11 の化合物 2 ~ 662 は、表 11 の化合物において、W が N であり且つ、X、Y 及び Z が CH であることを除いて、表 1 の化合物 2 ~ 662 と同一である。

20

【0040】

表 12

表 12 は、W が N であり且つ、X、Y 及び Z が CH であり、R が Cl であり、R¹ が 2, 5, 6-トリフルオロフェニルであり、且つ R³ 及び R⁴ の値は表 1 に列記した通りである、一般式 (1 A) の 662 個の化合物から成る。従って、表 12 の化合物 1 は、表 12 の化合物 1 において、W が N であり且つ、X、Y 及び Z が CH であることを除いて、表 2 の化合物 1 と同一である。同様に、表 12 の化合物 2 ~ 662 は、表 12 の化合物において、W が N であり且つ、X、Y 及び Z が CH であることを除いて、表 2 の化合物 2 ~ 662 と同一である。

30

【0041】

表 13

表 13 は、W が N であり且つ、X、Y 及び Z が CH であり、R が Cl であり、R¹ が 2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニルであり、且つ R³ 及び R⁴ の値は表 1 に列記した通りである、一般式 (1 A) の 662 個の化合物から成る。従って、表 13 の化合物 1 は、表 13 の化合物 1 において、W が N であり且つ、X、Y 及び Z が CH であることを除いて、表 3 の化合物 1 と同一である。同様に、表 13 の化合物 2 ~ 662 は、表 13 の化合物において、W が N であり且つ、X、Y 及び Z が CH であることを除いて、表 3 の化合物 2 ~ 662 と同一である。

40

【0042】

表 14

表 14 は、W が N であり且つ、X、Y 及び Z が CH であり、R が Cl であり、R¹ が 2, 6-ジフルオロ-4-メトキシフェニルであり、且つ R³ 及び R⁴ の値は表 1 に列記した通りである、一般式 (1 A) の 662 個の化合物から成る。従って、表 14 の化合物 1 は、表 14 の化合物 1 において、W が N であり且つ、X、Y 及び Z が CH であることを除いて、表 4 の化合物 1 と同一である。同様に、表 14 の化合物 2 ~ 662 は、表 14 の化合物において、W が N であり且つ、X、Y 及び Z が CH であることを除いて、表 4 の化合物 2 ~ 662 と同一である。

50

【0043】

表15

表15は、WがNであり且つ、X、Y及びZがCHであり、RがClであり、R¹が2-フルオロ-6-クロロフェニルであり、且つR³及びR⁴の値は表1に列記した通りである、一般式(1A)の662個の化合物から成る。従って、表15の化合物1は、表15の化合物1において、WがNであり且つ、X、Y及びZがCHであることを除いて、表5の化合物1と同一である。同様に、表15の化合物2～662は、表15の化合物において、WがNであり且つ、X、Y及びZがCHであることを除いて、表5の化合物2～662と同一である。

【0044】

表16

表16は、WがNであり且つ、X、Y及びZがCHであり、RがClであり、R¹が2, 4, 6-トリフルオロフェニルであり、且つR³及びR⁴の値は表1に列記した通りである、一般式(1B)の662個の化合物から成る。従って、表16の化合物1は、表16の化合物1において、WがNであり且つ、X、Y及びZがCHであることを除いて、表11の化合物1と同一である。同様に、表6の化合物2～662は、表16の化合物において、化合物が一般式(1B)を有することを除いて、表11の化合物2～662と同一である。

【0045】

表17

表17は、WがNであり且つ、X、Y及びZがCHであり、RがClであり、R¹が2, 5, 6-トリフルオロフェニルであり、且つR³及びR⁴の値は表1に列記した通りである、一般式(1B)の662個の化合物から成る。従って、表17の化合物1は、表17の化合物1において、化合物が一般式(1B)を有することを除いて、表12の化合物1と同一である。同様に、表17の化合物2～662は、表17の化合物において、化合物が一般式(1B)を有することを除いて、表12の化合物2～662と同一である。

【0046】

表18

表18は、WがNであり且つ、X、Y及びZがCHであり、RがClであり、R¹が2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニルであり、且つR³及びR⁴の値は表3に列記した通りである、一般式(1B)の662個の化合物から成る。従って、表18の化合物1は、表18の化合物1において、化合物が一般式(1B)を有することを除いて、表13の化合物1と同一である。同様に、表18の化合物2～662は、表18の化合物において、化合物が一般式(1B)を有することを除いて、表13の化合物2～662と同一である。

【0047】

表19

表9は、WがNであり且つ、X、Y及びZがCHであり、RがClであり、R¹が2, 6-ジフルオロ-4-メトキシフェニルであり、且つR³及びR⁴の値は表1に列記した通りである、一般式(1B)の662個の化合物から成る。従って、表19の化合物1は、表19の化合物1において、化合物が一般式(1B)を有することを除いて、表14の化合物1と同一である。同様に、表19の化合物2～662は、表19の化合物において、化合物が一般式(1B)を有することを除いて、表14の化合物2～662と同一である。

【0048】

表20

表20は、WがNであり且つ、X、Y及びZがCHであり、RがClであり、R¹が2-フルオロ-6-クロロフェニルであり、且つR³及びR⁴の値は表1に列記した通りである、一般式(1B)の662個の化合物から成る。従って、表20の化合物1は、表20の化合物1において、化合物が一般式(1B)を有することを除いて、表15の化合物と

10

20

30

40

50

同一である。同様に、表 20 の化合物 2 ～ 662 は、表 20 の化合物において、化合物が一般式 (1B) を有することを除いて、表 15 の化合物 2 ～ 662 と同一である。

【0049】

表 21

表 21 は、W、X 及び Z が CH であり、且つ Y が N であり、R が Cl であり、 R^1 が 2, 4, 6-トリフルオロフェニルであり、且つ R^3 及び R^4 の値は表 1 に列記した通りである、一般式 (1A) の 662 個の化合物から成る。従って、表 21 の化合物 1 は、表 21 の化合物 1 において、化合物が一般式 (1A) を有することを除いて、表 1 の化合物 1 と同一である。同様に、表 21 の化合物 2 ～ 662 は、表 21 の化合物において、化合物が一般式 (1A) を有することを除いて、表 1 の化合物 2 ～ 662 と同一である。

10

【0050】

表 22

表 22 は、W、X 及び Z が CH であり、且つ Y が N であり、R が Cl であり、 R^1 が 2, 5, 6-トリフルオロフェニルであり、且つ R^3 及び R^4 の値は表 1 に列記した通りである、一般式 (1A) の 662 個の化合物から成る。従って、表 22 の化合物 1 は、表 22 の化合物 1 において、化合物が W、X 及び Z が CH であり、且つ Y が N である一般式 (1A) を有することを除いて、表 2 の化合物 1 と同一である。同様に、表 22 の化合物 2 ～ 662 は、表 22 の化合物において、W、X 及び Z が CH であり、且つ Y が N であることを除いて、表 2 の化合物 2 ～ 662 と同一である。

20

【0051】

表 23

表 23 は、W、X 及び Z が CH であり、且つ Y が N であり、R が Cl であり、 R^1 が 2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニルであり、且つ R^3 及び R^4 の値は表 1 に列記した通りである、一般式 (1A) の 662 個の化合物から成る。従って、表 23 の化合物 1 は、表 23 の化合物 1 において、化合物が、W、X 及び Z が CH であり、且つ Y が N である一般式 (1A) を有することを除いて、表 23 の化合物 1 と同一である。同様に、表 23 の化合物 2 ～ 662 は、表 23 の化合物において、化合物が、W、X 及び Z が CH であり、且つ Y が N である一般式 (1A) を有することを除いて、表 3 の化合物 2 ～ 662 と同一である。

30

【0052】

表 24

表 24 は、W、X 及び Z が CH であり、且つ Y が N であり、R が Cl であり、 R^1 が 2, 6-ジフルオロ-4-メトキシフェニルであり、且つ R^3 及び R^4 の値は表 1 に列記した通りである、一般式 (1A) の 662 個の化合物から成る。従って、表 24 の化合物 1 は、表 24 の化合物 1 において、化合物が、W、X 及び Z が CH であり、且つ Y が N である一般式 (1A) を有することを除いて、表 4 の化合物 1 と同一である。同様に、表 24 の化合物 2 ～ 662 は、表 24 の化合物において、化合物が、W、X 及び Z が CH であり、且つ Y が N である一般式 (1A) を有することを除いて、表 4 の化合物 2 ～ 662 と同一である。

40

【0053】

表 25

表 25 は、W、X 及び Z が CH であり、且つ Y が N であり、R が Cl であり、 R^1 が 2-フルオロ-6-クロロフェニルであり、且つ R^3 及び R^4 の値は表 1 に列記した通りである、一般式 (1A) の 662 個の化合物から成る。従って、表 25 の化合物 1 は、表 25 の化合物 1 において、化合物が、W、X 及び Z が CH であり、且つ Y が N である一般式 (1A) を有することを除いて、表 5 の化合物と同一である。同様に、表 25 の化合物 2 ～ 662 は、表 25 の化合物 1 において、化合物が、W、X 及び Z が CH であり、且つ Y が N である一般式 (1A) を有することを除いて、表 5 の化合物 2 ～ 662 と同一である。

【0054】

表 26

50

表 2 6 は、W、Y 及び Z が C H であり、且つ X が N であり、R が C l であり、 R^1 が 2, 4, 6-トリフルオロフェニルであり、且つ R^3 及び R^4 の値は表 1 に列記した通りである、一般式 (1 B) の 6 6 2 個の化合物から成る。従って、表 2 6 の化合物 1 は、表 1 の化合物 1 において、W、Y 及び Z が C H であり、且つ X が N であることを除いて、表 1 の化合物 1 と同一である。同様に、表 2 6 の化合物 2 ~ 6 6 2 は、表 2 6 の化合物 1 において、W、Y 及び Z が C H であり、且つ X が N であることを除いて、表 1 の化合物 2 ~ 6 6 2 と同一である。

【0055】

表 2 7

表 2 7 は、W、Y 及び Z が C H であり、且つ X が N であり、R が C l であり、 R^1 が 2, 5, 6-トリフルオロフェニルであり、且つ R^3 及び R^4 の値は表 1 に列記した通りである、一般式 (1 B) の 6 6 2 個の化合物から成る。従って、表 2 7 の化合物 1 は、表 2 7 の化合物 1 において、化合物が、W、Y 及び Z が C H であり、且つ X が N である一般式 (1 A) を有することを除いて、表 2 の化合物 1 と同一である。同様に、表 2 7 の化合物 2 ~ 6 6 2 は、表 2 7 の化合物において、化合物が、W、Y 及び Z が C H であり、且つ X が N である一般式 (1 A) を有することを除いて、表 2 の化合物 2 ~ 6 6 2 と同一である。

【0056】

表 2 8

表 2 8 は、W、Y 及び Z が C H であり、且つ X が N であり、R が C l であり、 R^1 が 2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニルであり、且つ R^3 及び R^4 の値は表 3 に列記した通りである、一般式 (1 B) の 6 6 2 個の化合物から成る。従って、表 2 8 の化合物 1 は、表 2 8 の化合物 1 において、化合物が、W、Y 及び Z が C H であり、且つ X が N である一般式 (1 A) を有することを除いて、表 3 の化合物 1 と同一である。同様に、表 2 8 の化合物 2 ~ 6 6 2 は、表 2 8 の化合物において、化合物が、W、Y 及び Z が C H であり、且つ X が N である一般式 (1 A) を有することを除いて、表 3 の化合物 2 ~ 6 6 2 と同一である。

【0057】

表 2 9

表 2 9 は、W、Y 及び Z が C H であり、且つ X が N であり、R が C l であり、 R^1 が 2, 6-ジフルオロ-4-メトキシフェニルであり、且つ R^3 及び R^4 の値は表 1 に列記した通りである、一般式 (1 B) の 6 6 2 個の化合物から成る。従って、表 2 9 の化合物 1 は、表 2 9 の化合物 1 において、化合物が、W、Y 及び Z が C H であり、且つ X が N である一般式 (1 A) を有することを除いて、表 4 の化合物 1 と同一である。同様に、表 2 9 の化合物 2 ~ 6 6 2 は、表 2 9 の化合物において、化合物が、W、Y 及び Z が C H であり、且つ X が N である一般式 (1 A) を有することを除いて、表 4 の化合物 2 ~ 6 6 2 と同一である。

【0058】

表 3 0

表 3 0 は、W、Y 及び Z が C H であり、且つ X が N であり、R が C l であり、 R^1 が 2-フルオロ-6-クロロフェニルであり、且つ R^3 及び R^4 の値は表 1 に列記した通りである、一般式 (1 B) の 6 6 2 個の化合物から成る。従って、表 3 0 の化合物 1 は、表 3 0 の化合物 1 において、化合物が、W、Y 及び Z が C H であり、且つ X が N である一般式 (1 A) を有することを除いて、表 5 の化合物 1 と同一である。同様に、表 3 0 の化合物 2 ~ 6 6 2 は、表 3 0 の化合物において、化合物が、W、Y 及び Z が C H であり、且つ X が N である一般式 (1 A) を有することを除いて、表 5 の化合物 2 ~ 6 6 2 と同一である。

【0059】

表 3 1

表 3 1 は 3 9 7 2 個の化合物から成る。化合物 1 ~ 6 6 2 はそれぞれ表 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 6 6 3 ~ 1 3 2 4 はそれぞれ表 1 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 3 2 5 ~ 1 9 8 6 はそれぞれ表 1 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全

10

20

30

40

50

く同一であり、化合物 1 9 8 7 ~ 2 6 4 8 はそれぞれ表 2 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 2 6 4 9 ~ 3 3 1 0 はそれぞれ表 2 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 3 3 1 1 ~ 3 9 7 2 はそれぞれ表 3 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、但し、表 3 1 の化合物の全てにおいて、 R^1 は、2-フルオロ-6-クロロフェニルの代わりに 2, 6-ジフルオロフェニルである。

【0060】

表 3 2

表 3 2 は 3 9 7 2 個の化合物から成る。化合物 1 ~ 6 6 2 はそれぞれ表 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 6 6 3 ~ 1 3 2 4 はそれぞれ表 1 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 3 2 5 ~ 1 9 8 6 はそれぞれ表 1 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 9 8 7 ~ 2 6 4 8 はそれぞれ表 2 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 2 6 4 9 ~ 3 3 1 0 はそれぞれ表 2 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 3 3 1 1 ~ 3 9 7 2 はそれぞれ表 3 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、但し、表 3 2 の化合物の全てにおいて、 R^1 は、2-フルオロ-6-クロロフェニルの代わりに 2-フルオロフェニルである。

10

【0061】

表 3 3

表 3 3 は 3 9 7 2 個の化合物から成る。化合物 1 ~ 6 6 2 はそれぞれ表 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 6 6 3 ~ 1 3 2 4 はそれぞれ表 1 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 3 2 5 ~ 1 9 8 6 はそれぞれ表 1 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 9 8 7 ~ 2 6 4 8 はそれぞれ表 2 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 2 6 4 9 ~ 3 3 1 0 はそれぞれ表 2 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 3 3 1 1 ~ 3 9 7 2 はそれぞれ表 3 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、但し、表 3 3 の化合物の全てにおいて、 R^1 は、2-フルオロ-6-クロロフェニルの代わりに 2, 3, 5, 6-テトラフルオロフェニルである。

20

【0062】

表 3 4

表 3 4 は 3 9 7 2 個の化合物から成る。化合物 1 ~ 6 6 2 はそれぞれ表 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 6 6 3 ~ 1 3 2 4 はそれぞれ表 1 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 3 2 5 ~ 1 9 8 6 はそれぞれ表 1 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 9 8 7 ~ 2 6 4 8 はそれぞれ表 2 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 2 6 4 9 ~ 3 3 1 0 はそれぞれ表 2 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 3 3 1 1 ~ 3 9 7 2 はそれぞれ表 3 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、但し、表 3 4 の化合物の全てにおいて、 R^1 は、2-フルオロ-6-クロロフェニルの代わりに 2-クロロ-4, 6-ジフルオロフェニルである。

30

【0063】

表 3 5

表 3 5 は 3 9 7 2 個の化合物から成る。化合物 1 ~ 6 6 2 はそれぞれ表 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 6 6 3 ~ 1 3 2 4 はそれぞれ表 1 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 3 2 5 ~ 1 9 8 6 はそれぞれ表 1 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 9 8 7 ~ 2 6 4 8 はそれぞれ表 2 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 2 6 4 9 ~ 3 3 1 0 はそれぞれ表 2 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 3 3 1 1 ~ 3 9 7 2 はそれぞれ表 3 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、但し、表 3 5 の化合物の全てにおいて、 R^1 は、2-フルオロ-6-クロロフェニルの代わりに 2-クロロフェニルである。

40

【0064】

表 3 6

表 3 6 は 3 9 7 2 個の化合物から成る。化合物 1 ~ 6 6 2 はそれぞれ表 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 6 6 3 ~ 1 3 2 4 はそれぞれ表 1 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 3 2 5 ~ 1 9 8 6 はそれぞれ表 1 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全

50

く同一であり、化合物 1 9 8 7 ~ 2 6 4 8 はそれぞれ表 2 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 2 6 4 9 ~ 3 3 1 0 はそれぞれ表 2 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 3 3 1 1 ~ 3 9 7 2 はそれぞれ表 3 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、但し、表 3 6 の化合物の全てにおいて、 R^1 は、2-フルオロ-6-クロロフェニルの代わりに2, 6-ジクロロフェニルである。

【0065】

表 3 7

表 3 7 は 3 9 7 2 個の化合物から成る。化合物 1 ~ 6 6 2 はそれぞれ表 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 6 6 3 ~ 1 3 2 4 はそれぞれ表 1 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 3 2 5 ~ 1 9 8 6 はそれぞれ表 1 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 9 8 7 ~ 2 6 4 8 はそれぞれ表 2 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 2 6 4 9 ~ 3 3 1 0 はそれぞれ表 2 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 3 3 1 1 ~ 3 9 7 2 はそれぞれ表 3 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、但し、表 3 7 の化合物の全てにおいて、 R^1 は、2-フルオロ-6-クロロフェニルの代わりに2, 4-ジクロロフェニルである。

10

【0066】

表 3 8

表 3 8 は 3 9 7 2 個の化合物から成る。化合物 1 ~ 6 6 2 はそれぞれ表 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 6 6 3 ~ 1 3 2 4 はそれぞれ表 1 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 3 2 5 ~ 1 9 8 6 はそれぞれ表 1 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 9 8 7 ~ 2 6 4 8 はそれぞれ表 2 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 2 6 4 9 ~ 3 3 1 0 はそれぞれ表 2 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 3 3 1 1 ~ 3 9 7 2 はそれぞれ表 3 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、但し、表 3 8 の化合物の全てにおいて、 R^1 は、2-フルオロ-6-クロロフェニルの代わりに2, 4, 6-トリクロロフェニルである。

20

【0067】

表 3 9

表 3 9 は 3 9 7 2 個の化合物から成る。化合物 1 ~ 6 6 2 はそれぞれ表 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 6 6 3 ~ 1 3 2 4 はそれぞれ表 1 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 3 2 5 ~ 1 9 8 6 はそれぞれ表 1 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 9 8 7 ~ 2 6 4 8 はそれぞれ表 2 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 2 6 4 9 ~ 3 3 1 0 はそれぞれ表 2 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 3 3 1 1 ~ 3 9 7 2 はそれぞれ表 3 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、但し、表 3 9 の化合物の全てにおいて、 R^1 は、2-フルオロ-6-クロロフェニルの代わりに2, 3, 6-トリクロロフェニルである。

30

【0068】

表 4 0

表 4 0 は 3 9 7 2 個の化合物から成る。化合物 1 ~ 6 6 2 はそれぞれ表 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 6 6 3 ~ 1 3 2 4 はそれぞれ表 1 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 3 2 5 ~ 1 9 8 6 はそれぞれ表 1 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 9 8 7 ~ 2 6 4 8 はそれぞれ表 2 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 2 6 4 9 ~ 3 3 1 0 はそれぞれ表 2 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 3 3 1 1 ~ 3 9 7 2 はそれぞれ表 3 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、但し、表 4 0 の化合物の全てにおいて、 R^1 は、2-フルオロ-6-クロロフェニルの代わりにペンタクロロフェニルである。

40

【0069】

表 4 1

表 4 1 は 3 9 7 2 個の化合物から成る。化合物 1 ~ 6 6 2 はそれぞれ表 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 6 6 3 ~ 1 3 2 4 はそれぞれ表 1 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 3 2 5 ~ 1 9 8 6 はそれぞれ表 1 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全

50

く同一であり、化合物 1 9 8 7 ~ 2 6 4 8 はそれぞれ表 2 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 2 6 4 9 ~ 3 3 1 0 はそれぞれ表 2 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 3 3 1 1 ~ 3 9 7 2 はそれぞれ表 3 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、但し、表 4 1 の化合物の全てにおいて、R¹は、2-フルオロ-6-クロロフェニルの代わりに2-フルオロ-4, 6-ジクロロフェニルである。

【0070】

表 4 2

表 4 2 は 3 9 7 2 個の化合物から成る。化合物 1 ~ 6 6 2 はそれぞれ表 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 6 6 3 ~ 1 3 2 4 はそれぞれ表 1 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 3 2 5 ~ 1 9 8 6 はそれぞれ表 1 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 9 8 7 ~ 2 6 4 8 はそれぞれ表 2 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 2 6 4 9 ~ 3 3 1 0 はそれぞれ表 2 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 3 3 1 1 ~ 3 9 7 2 はそれぞれ表 3 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、但し、表 4 2 の化合物の全てにおいて、R¹は、2-フルオロ-6-クロロフェニルの代わりに4-フルオロ-2, 6-ジクロロフェニルである。

10

【0071】

表 4 3

表 4 3 は 3 9 7 2 個の化合物から成る。化合物 1 ~ 6 6 2 はそれぞれ表 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 6 6 3 ~ 1 3 2 4 はそれぞれ表 1 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 3 2 5 ~ 1 9 8 6 はそれぞれ表 1 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 9 8 7 ~ 2 6 4 8 はそれぞれ表 2 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 2 6 4 9 ~ 3 3 1 0 はそれぞれ表 2 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 3 3 1 1 ~ 3 9 7 2 はそれぞれ表 3 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、但し、表 4 3 の化合物の全てにおいて、R¹は、2-フルオロ-6-クロロフェニルの代わりに2-ブロモフェニルである。

20

【0072】

表 4 4

表 4 4 は 3 9 7 2 個の化合物から成る。化合物 1 ~ 6 6 2 はそれぞれ表 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 6 6 3 ~ 1 3 2 4 はそれぞれ表 1 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 3 2 5 ~ 1 9 8 6 はそれぞれ表 1 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 9 8 7 ~ 2 6 4 8 はそれぞれ表 2 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 2 6 4 9 ~ 3 3 1 0 はそれぞれ表 2 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 3 3 1 1 ~ 3 9 7 2 はそれぞれ表 3 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、但し、表 4 4 の化合物の全てにおいて、R¹は、2-フルオロ-6-クロロフェニルの代わりに2-フルオロ-6-ブロモフェニルである。

30

【0073】

表 4 5

表 4 5 は 3 9 7 2 個の化合物から成る。化合物 1 ~ 6 6 2 はそれぞれ表 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 6 6 3 ~ 1 3 2 4 はそれぞれ表 1 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 3 2 5 ~ 1 9 8 6 はそれぞれ表 1 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 9 8 7 ~ 2 6 4 8 はそれぞれ表 2 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 2 6 4 9 ~ 3 3 1 0 はそれぞれ表 2 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 3 3 1 1 ~ 3 9 7 2 はそれぞれ表 3 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、但し、表 4 5 の化合物の全てにおいて、R¹は、2-フルオロ-6-クロロフェニルの代わりに2-ブロモ-4, 6-ジフルオロフェニルである。

40

【0074】

表 4 6

表 4 6 は 3 9 7 2 個の化合物から成る。化合物 1 ~ 6 6 2 はそれぞれ表 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 6 6 3 ~ 1 3 2 4 はそれぞれ表 1 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 3 2 5 ~ 1 9 8 6 はそれぞれ表 1 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全

50

く同一であり、化合物 1 9 8 7 ~ 2 6 4 8 はそれぞれ表 2 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 2 6 4 9 ~ 3 3 1 0 はそれぞれ表 2 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 3 3 1 1 ~ 3 9 7 2 はそれぞれ表 3 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、但し、表 4 6 の化合物の全てにおいて、 R^1 は、2-フルオロ-6-クロロフェニルの代わりに 2-フルオロ-6-メチルフェニルである。

【0075】

表 4 7

表 4 7 は 3 9 7 2 個の化合物から成る。化合物 1 ~ 6 6 2 はそれぞれ表 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 6 6 3 ~ 1 3 2 4 はそれぞれ表 1 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 3 2 5 ~ 1 9 8 6 はそれぞれ表 1 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 9 8 7 ~ 2 6 4 8 はそれぞれ表 2 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 2 6 4 9 ~ 3 3 1 0 はそれぞれ表 2 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 3 3 1 1 ~ 3 9 7 2 はそれぞれ表 3 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、但し、表 4 7 の化合物の全てにおいて、 R^1 は、2-フルオロ-6-クロロフェニルの代わりに 2-クロロ-6-メチルフェニルである。

10

【0076】

表 4 8

表 4 8 は 3 9 7 2 個の化合物から成る。化合物 1 ~ 6 6 2 はそれぞれ表 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 6 6 3 ~ 1 3 2 4 はそれぞれ表 1 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 3 2 5 ~ 1 9 8 6 はそれぞれ表 1 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 9 8 7 ~ 2 6 4 8 はそれぞれ表 2 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 2 6 4 9 ~ 3 3 1 0 はそれぞれ表 2 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 3 3 1 1 ~ 3 9 7 2 はそれぞれ表 3 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、但し、表 4 8 の化合物の全てにおいて、 R^1 は、2-フルオロ-6-クロロフェニルの代わりに 2-メトキシフェニルである。

20

【0077】

表 4 9

表 4 9 は 3 9 7 2 個の化合物から成る。化合物 1 ~ 6 6 2 はそれぞれ表 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 6 6 3 ~ 1 3 2 4 はそれぞれ表 1 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 3 2 5 ~ 1 9 8 6 はそれぞれ表 1 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 9 8 7 ~ 2 6 4 8 はそれぞれ表 2 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 2 6 4 9 ~ 3 3 1 0 はそれぞれ表 2 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 3 3 1 1 ~ 3 9 7 2 はそれぞれ表 3 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、但し、表 4 9 の化合物の全てにおいて、 R^1 は、2-フルオロ-6-クロロフェニルの代わりに 2, 6-ジメトキシフェニルである。

30

【0078】

表 5 0

表 5 0 は 3 9 7 2 個の化合物から成る。化合物 1 ~ 6 6 2 はそれぞれ表 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 6 6 3 ~ 1 3 2 4 はそれぞれ表 1 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 3 2 5 ~ 1 9 8 6 はそれぞれ表 1 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 9 8 7 ~ 2 6 4 8 はそれぞれ表 2 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 2 6 4 9 ~ 3 3 1 0 はそれぞれ表 2 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 3 3 1 1 ~ 3 9 7 2 はそれぞれ表 3 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、但し、表 5 0 の化合物の全てにおいて、 R^1 は、2-フルオロ-6-クロロフェニルの代わりに 2-フルオロ-6-メトキシフェニルである。

40

【0079】

表 5 1

表 5 1 は 3 9 7 2 個の化合物から成る。化合物 1 ~ 6 6 2 はそれぞれ表 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 6 6 3 ~ 1 3 2 4 はそれぞれ表 1 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 3 2 5 ~ 1 9 8 6 はそれぞれ表 1 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全

50

く同一であり、化合物 1 9 8 7 ~ 2 6 4 8 はそれぞれ表 2 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 2 6 4 9 ~ 3 3 1 0 はそれぞれ表 2 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 3 3 1 1 ~ 3 9 7 2 はそれぞれ表 3 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、但し、表 5 1 の化合物の全てにおいて、 R^1 は、2-フルオロ-6-クロロフェニルの代わりに 2-トリフルオロメチルフェニルである。

【0080】

表 5 2

表 5 2 は 3 9 7 2 個の化合物から成る。化合物 1 ~ 6 6 2 はそれぞれ表 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 6 6 3 ~ 1 3 2 4 はそれぞれ表 1 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 3 2 5 ~ 1 9 8 6 はそれぞれ表 1 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 9 8 7 ~ 2 6 4 8 はそれぞれ表 2 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 2 6 4 9 ~ 3 3 1 0 はそれぞれ表 2 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 3 3 1 1 ~ 3 9 7 2 はそれぞれ表 3 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、但し、表 5 2 の化合物の全てにおいて、 R^1 は、2-フルオロ-6-クロロフェニルの代わりに 2-フルオロ-6-トリフルオロメチルフェニルである。

10

【0081】

表 5 3

表 5 3 は 3 9 7 2 個の化合物から成る。化合物 1 ~ 6 6 2 はそれぞれ表 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 6 6 3 ~ 1 3 2 4 はそれぞれ表 1 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 3 2 5 ~ 1 9 8 6 はそれぞれ表 1 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 9 8 7 ~ 2 6 4 8 はそれぞれ表 2 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 2 6 4 9 ~ 3 3 1 0 はそれぞれ表 2 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 3 3 1 1 ~ 3 9 7 2 はそれぞれ表 3 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、但し、表 5 3 の化合物の全てにおいて、 R^1 は、2-フルオロ-6-クロロフェニルの代わりに 2, 6-ジ- (トリフルオロメチル) フェニルである。

20

【0082】

表 5 4

表 5 4 は 3 9 7 2 個の化合物から成る。化合物 1 ~ 6 6 2 はそれぞれ表 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 6 6 3 ~ 1 3 2 4 はそれぞれ表 1 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 3 2 5 ~ 1 9 8 6 はそれぞれ表 1 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 9 8 7 ~ 2 6 4 8 はそれぞれ表 2 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 2 6 4 9 ~ 3 3 1 0 はそれぞれ表 2 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 3 3 1 1 ~ 3 9 7 2 はそれぞれ表 3 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、但し、表 5 4 の化合物の全てにおいて、 R^1 は、2-フルオロ-6-クロロフェニルの代わりに 2-クロロ-6-トリフルオロメチルフェニルである。

30

【0083】

表 5 5

表 5 5 は 3 9 7 2 個の化合物から成る。化合物 1 ~ 6 6 2 はそれぞれ表 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 6 6 3 ~ 1 3 2 4 はそれぞれ表 1 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 3 2 5 ~ 1 9 8 6 はそれぞれ表 1 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 9 8 7 ~ 2 6 4 8 はそれぞれ表 2 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 2 6 4 9 ~ 3 3 1 0 はそれぞれ表 2 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 3 3 1 1 ~ 3 9 7 2 はそれぞれ表 3 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、但し、表 5 5 の化合物の全てにおいて、 R^1 は、2-フルオロ-6-クロロフェニルの代わりに 2, 4-ジフルオロ-6-トリフルオロメチルフェニルである。

40

【0084】

表 5 6

表 5 6 は 3 9 7 2 個の化合物から成る。化合物 1 ~ 6 6 2 はそれぞれ表 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 6 6 3 ~ 1 3 2 4 はそれぞれ表 1 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 3 2 5 ~ 1 9 8 6 はそれぞれ表 1 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全

50

く同一であり、化合物 1 9 8 7 ~ 2 6 4 8 はそれぞれ表 2 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 2 6 4 9 ~ 3 3 1 0 はそれぞれ表 2 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 3 3 1 1 ~ 3 9 7 2 はそれぞれ表 3 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、但し、表 5 6 の化合物の全てにおいて、 R^1 は、2-フルオロ-6-クロロフェニルの代わりに2, 4-ジフルオロ-6-メトキシフェニルである。

【0085】

表 5 7

表 5 7 は 3 9 7 2 個の化合物から成る。化合物 1 ~ 6 6 2 はそれぞれ表 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 6 6 3 ~ 1 3 2 4 はそれぞれ表 1 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 3 2 5 ~ 1 9 8 6 はそれぞれ表 1 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 9 8 7 ~ 2 6 4 8 はそれぞれ表 2 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 2 6 4 9 ~ 3 3 1 0 はそれぞれ表 2 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 3 3 1 1 ~ 3 9 7 2 はそれぞれ表 3 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、但し、表 5 7 の化合物の全てにおいて、 R^1 は、2-フルオロ-6-クロロフェニルの代わりに2, 4-ジフルオロ-6-メチルフェニルである。

10

【0086】

表 5 8

表 5 8 は 3 9 7 2 個の化合物から成る。化合物 1 ~ 6 6 2 はそれぞれ表 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 6 6 3 ~ 1 3 2 4 はそれぞれ表 1 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 3 2 5 ~ 1 9 8 6 はそれぞれ表 1 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 9 8 7 ~ 2 6 4 8 はそれぞれ表 2 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 2 6 4 9 ~ 3 3 1 0 はそれぞれ表 2 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 3 3 1 1 ~ 3 9 7 2 はそれぞれ表 3 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、但し、表 5 8 の化合物の全てにおいて、 R^1 は、2-フルオロ-6-クロロフェニルの代わりに2, 4-ジフルオロピリジ-3-イルである。

20

【0087】

表 5 9

表 5 9 は 3 9 7 2 個の化合物から成る。化合物 1 ~ 6 6 2 はそれぞれ表 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 6 6 3 ~ 1 3 2 4 はそれぞれ表 1 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 3 2 5 ~ 1 9 8 6 はそれぞれ表 1 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 9 8 7 ~ 2 6 4 8 はそれぞれ表 2 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 2 6 4 9 ~ 3 3 1 0 はそれぞれ表 2 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 3 3 1 1 ~ 3 9 7 2 はそれぞれ表 3 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、但し、表 5 9 の化合物の全てにおいて、 R^1 は、2-フルオロ-6-クロロフェニルの代わりに3, 5-ジフルオロピリジ-4-イルである。

30

【0088】

表 6 0

表 6 0 は 3 9 7 2 個の化合物から成る。化合物 1 ~ 6 6 2 はそれぞれ表 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 6 6 3 ~ 1 3 2 4 はそれぞれ表 1 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 3 2 5 ~ 1 9 8 6 はそれぞれ表 1 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 9 8 7 ~ 2 6 4 8 はそれぞれ表 2 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 2 6 4 9 ~ 3 3 1 0 はそれぞれ表 2 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 3 3 1 1 ~ 3 9 7 2 はそれぞれ表 3 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、但し、表 6 0 の化合物の全てにおいて、 R^1 は、2-フルオロ-6-クロロフェニルの代わりにテトラフルオロピリジ-4-イルである。

40

【0089】

表 6 1

表 6 1 は 3 9 7 2 個の化合物から成る。化合物 1 ~ 6 6 2 はそれぞれ表 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 6 6 3 ~ 1 3 2 4 はそれぞれ表 1 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 3 2 5 ~ 1 9 8 6 はそれぞれ表 1 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全

50

く同一であり、化合物 1 9 8 7 ~ 2 6 4 8 はそれぞれ表 2 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 2 6 4 9 ~ 3 3 1 0 はそれぞれ表 2 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 3 3 1 1 ~ 3 9 7 2 はそれぞれ表 3 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、但し、表 6 1 の化合物の全てにおいて、R¹は、2-フルオロ-6-クロロフェニルの代わりに3-フルオロピリジ-2-イルである。

【0090】

表 6 2

表 6 2 は 3 9 7 2 個の化合物から成る。化合物 1 ~ 6 6 2 はそれぞれ表 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 6 6 3 ~ 1 3 2 4 はそれぞれ表 1 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 3 2 5 ~ 1 9 8 6 はそれぞれ表 1 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 9 8 7 ~ 2 6 4 8 はそれぞれ表 2 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 2 6 4 9 ~ 3 3 1 0 はそれぞれ表 2 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 3 3 1 1 ~ 3 9 7 2 はそれぞれ表 3 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、但し、表 6 2 の化合物の全てにおいて、R¹は、2-フルオロ-6-クロロフェニルの代わりに4-フルオロピリジ-3-イルである。

10

【0091】

表 6 3

表 6 3 は 3 9 7 2 個の化合物から成る。化合物 1 ~ 6 6 2 はそれぞれ表 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 6 6 3 ~ 1 3 2 4 はそれぞれ表 1 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 3 2 5 ~ 1 9 8 6 はそれぞれ表 1 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 9 8 7 ~ 2 6 4 8 はそれぞれ表 2 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 2 6 4 9 ~ 3 3 1 0 はそれぞれ表 2 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 3 3 1 1 ~ 3 9 7 2 はそれぞれ表 3 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、但し、表 6 3 の化合物の全てにおいて、R¹は、2-フルオロ-6-クロロフェニルの代わりに3-フルオロピリジ-4-イルである。

20

【0092】

表 6 4

表 6 4 は 3 9 7 2 個の化合物から成る。化合物 1 ~ 6 6 2 はそれぞれ表 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 6 6 3 ~ 1 3 2 4 はそれぞれ表 1 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 3 2 5 ~ 1 9 8 6 はそれぞれ表 1 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 9 8 7 ~ 2 6 4 8 はそれぞれ表 2 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 2 6 4 9 ~ 3 3 1 0 はそれぞれ表 2 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 3 3 1 1 ~ 3 9 7 2 はそれぞれ表 3 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、但し、表 6 4 の化合物の全てにおいて、R¹は、2-フルオロ-6-クロロフェニルの代わりに2-フルオロピリジ-3-イルである。

30

【0093】

表 6 5

表 6 5 は 3 9 7 2 個の化合物から成る。化合物 1 ~ 6 6 2 はそれぞれ表 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 6 6 3 ~ 1 3 2 4 はそれぞれ表 1 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 3 2 5 ~ 1 9 8 6 はそれぞれ表 1 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 9 8 7 ~ 2 6 4 8 はそれぞれ表 2 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 2 6 4 9 ~ 3 3 1 0 はそれぞれ表 2 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 3 3 1 1 ~ 3 9 7 2 はそれぞれ表 3 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、但し、表 6 5 の化合物の全てにおいて、R¹は、2-フルオロ-6-クロロフェニルの代わりに2, 4, 6-トリフルオロピリジ-3-イルである。

40

【0094】

表 6 6

表 6 6 は 3 9 7 2 個の化合物から成る。化合物 1 ~ 6 6 2 はそれぞれ表 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 6 6 3 ~ 1 3 2 4 はそれぞれ表 1 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 3 2 5 ~ 1 9 8 6 はそれぞれ表 1 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全

50

く同一であり、化合物 1 9 8 7 ~ 2 6 4 8 はそれぞれ表 2 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 2 6 4 9 ~ 3 3 1 0 はそれぞれ表 2 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 3 3 1 1 ~ 3 9 7 2 はそれぞれ表 3 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、但し、表 6 6 の化合物の全てにおいて、R¹は、2-フルオロ-6-クロロフェニルの代わりに 3, 5-ジフルオロピリジ-2-イルである。

【0095】

表 6 7

表 6 7 は 3 9 7 2 個の化合物から成る。化合物 1 ~ 6 6 2 はそれぞれ表 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 6 6 3 ~ 1 3 2 4 はそれぞれ表 1 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 3 2 5 ~ 1 9 8 6 はそれぞれ表 1 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 9 8 7 ~ 2 6 4 8 はそれぞれ表 2 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 2 6 4 9 ~ 3 3 1 0 はそれぞれ表 2 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 3 3 1 1 ~ 3 9 7 2 はそれぞれ表 3 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、但し、表 6 7 の化合物の全てにおいて、R¹は、2-フルオロ-6-クロロフェニルの代わりに 2, 6-ジフルオロピリジ-3-イルである。

10

【0096】

表 6 8

表 6 8 は 3 9 7 2 個の化合物から成る。化合物 1 ~ 6 6 2 はそれぞれ表 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 6 6 3 ~ 1 3 2 4 はそれぞれ表 1 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 3 2 5 ~ 1 9 8 6 はそれぞれ表 1 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 9 8 7 ~ 2 6 4 8 はそれぞれ表 2 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 2 6 4 9 ~ 3 3 1 0 はそれぞれ表 2 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 3 3 1 1 ~ 3 9 7 2 はそれぞれ表 3 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、但し、表 6 8 の化合物の全てにおいて、R¹は、2-フルオロ-6-クロロフェニルの代わりに 2, 4-ジフルオロ-6-メトキシピリジ-3-イルである。

20

【0097】

表 6 9

表 6 9 は 3 9 7 2 個の化合物から成る。化合物 1 ~ 6 6 2 はそれぞれ表 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 6 6 3 ~ 1 3 2 4 はそれぞれ表 1 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 3 2 5 ~ 1 9 8 6 はそれぞれ表 1 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 9 8 7 ~ 2 6 4 8 はそれぞれ表 2 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 2 6 4 9 ~ 3 3 1 0 はそれぞれ表 2 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 3 3 1 1 ~ 3 9 7 2 はそれぞれ表 3 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、但し、表 6 9 の化合物の全てにおいて、R¹は、2-フルオロ-6-クロロフェニルの代わりに 2-フルオロ-4-クロロピリジ-3-イルである。

30

【0098】

表 7 0

表 7 0 は 3 9 7 2 個の化合物から成る。化合物 1 ~ 6 6 2 はそれぞれ表 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 6 6 3 ~ 1 3 2 4 はそれぞれ表 1 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 3 2 5 ~ 1 9 8 6 はそれぞれ表 1 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 9 8 7 ~ 2 6 4 8 はそれぞれ表 2 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 2 6 4 9 ~ 3 3 1 0 はそれぞれ表 2 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 3 3 1 1 ~ 3 9 7 2 はそれぞれ表 3 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、但し、表 7 0 の化合物の全てにおいて、R¹は、2-フルオロ-6-クロロフェニルの代わりに 3-フルオロ-5-クロロピリジ-4-イルである。

40

【0099】

表 7 1

表 7 1 は 3 9 7 2 個の化合物から成る。化合物 1 ~ 6 6 2 はそれぞれ表 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 6 6 3 ~ 1 3 2 4 はそれぞれ表 1 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 3 2 5 ~ 1 9 8 6 はそれぞれ表 1 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全

50

く同一であり、化合物 1 9 8 7 ~ 2 6 4 8 はそれぞれ表 2 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 2 6 4 9 ~ 3 3 1 0 はそれぞれ表 2 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 3 3 1 1 ~ 3 9 7 2 はそれぞれ表 3 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、但し、表 7 1 の化合物の全てにおいて、R¹は、2-フルオロ-6-クロロフェニルの代わりに2-クロロ-4-フルオロピリジ-3-イルである。

【0100】

表 7 2

表 7 2 は 3 9 7 2 個の化合物から成る。化合物 1 ~ 6 6 2 はそれぞれ表 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 6 6 3 ~ 1 3 2 4 はそれぞれ表 1 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 3 2 5 ~ 1 9 8 6 はそれぞれ表 1 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 9 8 7 ~ 2 6 4 8 はそれぞれ表 2 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 2 6 4 9 ~ 3 3 1 0 はそれぞれ表 2 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 3 3 1 1 ~ 3 9 7 2 はそれぞれ表 3 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、但し、表 7 2 の化合物の全てにおいて、R¹は、2-フルオロ-6-クロロフェニルの代わりに2, 4-ジクロロピリジ-3-イルである。

10

【0101】

表 7 3

表 7 3 は 3 9 7 2 個の化合物から成る。化合物 1 ~ 6 6 2 はそれぞれ表 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 6 6 3 ~ 1 3 2 4 はそれぞれ表 1 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 3 2 5 ~ 1 9 8 6 はそれぞれ表 1 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 9 8 7 ~ 2 6 4 8 はそれぞれ表 2 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 2 6 4 9 ~ 3 3 1 0 はそれぞれ表 2 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 3 3 1 1 ~ 3 9 7 2 はそれぞれ表 3 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、但し、表 7 3 の化合物の全てにおいて、R¹は、2-フルオロ-6-クロロフェニルの代わりに3-クロロピリジ-2-イルである。

20

【0102】

表 7 4

表 7 4 は 3 9 7 2 個の化合物から成る。化合物 1 ~ 6 6 2 はそれぞれ表 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 6 6 3 ~ 1 3 2 4 はそれぞれ表 1 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 3 2 5 ~ 1 9 8 6 はそれぞれ表 1 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 9 8 7 ~ 2 6 4 8 はそれぞれ表 2 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 2 6 4 9 ~ 3 3 1 0 はそれぞれ表 2 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 3 3 1 1 ~ 3 9 7 2 はそれぞれ表 3 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、但し、表 7 4 の化合物の全てにおいて、R¹は、2-フルオロ-6-クロロフェニルの代わりに4-クロロピリジ-3-イルである。

30

【0103】

表 7 5

表 7 5 は 3 9 7 2 個の化合物から成る。化合物 1 ~ 6 6 2 はそれぞれ表 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 6 6 3 ~ 1 3 2 4 はそれぞれ表 1 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 3 2 5 ~ 1 9 8 6 はそれぞれ表 1 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 9 8 7 ~ 2 6 4 8 はそれぞれ表 2 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 2 6 4 9 ~ 3 3 1 0 はそれぞれ表 2 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 3 3 1 1 ~ 3 9 7 2 はそれぞれ表 3 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、但し、表 7 5 の化合物の全てにおいて、R¹は、2-フルオロ-6-クロロフェニルの代わりに3-クロロピリジ-4-イルである。

40

【0104】

表 7 6

表 7 6 は 3 9 7 2 個の化合物から成る。化合物 1 ~ 6 6 2 はそれぞれ表 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 6 6 3 ~ 1 3 2 4 はそれぞれ表 1 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 3 2 5 ~ 1 9 8 6 はそれぞれ表 1 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全

50

く同一であり、化合物 1 9 8 7 ~ 2 6 4 8 はそれぞれ表 2 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 2 6 4 9 ~ 3 3 1 0 はそれぞれ表 2 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 3 3 1 1 ~ 3 9 7 2 はそれぞれ表 3 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、但し、表 7 6 の化合物の全てにおいて、R¹は、2-フルオロ-6-クロロフェニルの代わりに2-クロロピリジ-3-イルである。

【0105】

表 7 7

表 7 7 は 3 9 7 2 個の化合物から成る。化合物 1 ~ 6 6 2 はそれぞれ表 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 6 6 3 ~ 1 3 2 4 はそれぞれ表 1 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 3 2 5 ~ 1 9 8 6 はそれぞれ表 1 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 9 8 7 ~ 2 6 4 8 はそれぞれ表 2 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 2 6 4 9 ~ 3 3 1 0 はそれぞれ表 2 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 3 3 1 1 ~ 3 9 7 2 はそれぞれ表 3 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、但し、表 7 7 の化合物の全てにおいて、R¹は、2-フルオロ-6-クロロフェニルの代わりに3-トリフルオロメチルピリジ-2-イルである。

10

【0106】

表 7 8

表 7 8 は 3 9 7 2 個の化合物から成る。化合物 1 ~ 6 6 2 はそれぞれ表 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 6 6 3 ~ 1 3 2 4 はそれぞれ表 1 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 3 2 5 ~ 1 9 8 6 はそれぞれ表 1 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 9 8 7 ~ 2 6 4 8 はそれぞれ表 2 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 2 6 4 9 ~ 3 3 1 0 はそれぞれ表 2 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 3 3 1 1 ~ 3 9 7 2 はそれぞれ表 3 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、但し、表 7 8 の化合物の全てにおいて、R¹は、2-フルオロ-6-クロロフェニルの代わりに4-トリフルオロメチルピリジ-3-イルである。

20

【0107】

表 7 9

表 7 9 は 3 9 7 2 個の化合物から成る。化合物 1 ~ 6 6 2 はそれぞれ表 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 6 6 3 ~ 1 3 2 4 はそれぞれ表 1 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 3 2 5 ~ 1 9 8 6 はそれぞれ表 1 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 9 8 7 ~ 2 6 4 8 はそれぞれ表 2 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 2 6 4 9 ~ 3 3 1 0 はそれぞれ表 2 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 3 3 1 1 ~ 3 9 7 2 はそれぞれ表 3 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、但し、表 7 9 の化合物の全てにおいて、R¹は、2-フルオロ-6-クロロフェニルの代わりに3, 5-ジクロロピリジ-2-イルである。

30

【0108】

表 8 0

表 8 0 は 3 9 7 2 個の化合物から成る。化合物 1 ~ 6 6 2 はそれぞれ表 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 6 6 3 ~ 1 3 2 4 はそれぞれ表 1 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 3 2 5 ~ 1 9 8 6 はそれぞれ表 1 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 9 8 7 ~ 2 6 4 8 はそれぞれ表 2 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 2 6 4 9 ~ 3 3 1 0 はそれぞれ表 2 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 3 3 1 1 ~ 3 9 7 2 はそれぞれ表 3 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、但し、表 8 0 の化合物の全てにおいて、R¹は、2-フルオロ-6-クロロフェニルの代わりに4, 6-ジクロロピリジ-3-イルである。

40

【0109】

表 8 1

表 8 1 は 3 9 7 2 個の化合物から成る。化合物 1 ~ 6 6 2 はそれぞれ表 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 6 6 3 ~ 1 3 2 4 はそれぞれ表 1 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 3 2 5 ~ 1 9 8 6 はそれぞれ表 1 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全

50

く同一であり、化合物 1 9 8 7 ~ 2 6 4 8 はそれぞれ表 2 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 2 6 4 9 ~ 3 3 1 0 はそれぞれ表 2 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 3 3 1 1 ~ 3 9 7 2 はそれぞれ表 3 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、但し、表 8 1 の化合物の全てにおいて、R¹は、2-フルオロ-6-クロロフェニルの代わりに3-トリフルオロメチルピリジ-4-イルである。

【0110】

表 8 2

表 8 2 は 3 9 7 2 個の化合物から成る。化合物 1 ~ 6 6 2 はそれぞれ表 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 6 6 3 ~ 1 3 2 4 はそれぞれ表 1 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 3 2 5 ~ 1 9 8 6 はそれぞれ表 1 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 9 8 7 ~ 2 6 4 8 はそれぞれ表 2 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 2 6 4 9 ~ 3 3 1 0 はそれぞれ表 2 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 3 3 1 1 ~ 3 9 7 2 はそれぞれ表 3 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、但し、表 8 2 の化合物の全てにおいて、R¹は、2-フルオロ-6-クロロフェニルの代わりに2-トリフルオロメチルピリジ-3-イルである。

10

【0111】

表 8 3

表 8 3 は 3 9 7 2 個の化合物から成る。化合物 1 ~ 6 6 2 はそれぞれ表 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 6 6 3 ~ 1 3 2 4 はそれぞれ表 1 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 3 2 5 ~ 1 9 8 6 はそれぞれ表 1 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 9 8 7 ~ 2 6 4 8 はそれぞれ表 2 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 2 6 4 9 ~ 3 3 1 0 はそれぞれ表 2 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 3 3 1 1 ~ 3 9 7 2 はそれぞれ表 3 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、但し、表 8 3 の化合物の全てにおいて、R¹は、2-フルオロ-6-クロロフェニルの代わりに2-フルオロ-4-トリフルオロメチルピリジ-3-イルである。

20

【0112】

表 8 4

表 8 4 は 3 9 7 2 個の化合物から成る。化合物 1 ~ 6 6 2 はそれぞれ表 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 6 6 3 ~ 1 3 2 4 はそれぞれ表 1 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 3 2 5 ~ 1 9 8 6 はそれぞれ表 1 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 9 8 7 ~ 2 6 4 8 はそれぞれ表 2 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 2 6 4 9 ~ 3 3 1 0 はそれぞれ表 2 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 3 3 1 1 ~ 3 9 7 2 はそれぞれ表 3 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、但し、表 8 4 の化合物の全てにおいて、R¹は、2-フルオロ-6-クロロフェニルの代わりに3-フルオロ-5-トリフルオロメチルピリジ-4-イルである。

30

【0113】

表 8 5

表 8 5 は 3 9 7 2 個の化合物から成る。化合物 1 ~ 6 6 2 はそれぞれ表 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 6 6 3 ~ 1 3 2 4 はそれぞれ表 1 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 3 2 5 ~ 1 9 8 6 はそれぞれ表 1 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 9 8 7 ~ 2 6 4 8 はそれぞれ表 2 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 2 6 4 9 ~ 3 3 1 0 はそれぞれ表 2 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 3 3 1 1 ~ 3 9 7 2 はそれぞれ表 3 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、但し、表 8 4 の化合物の全てにおいて、R¹は、2-フルオロ-6-クロロフェニルの代わりに4-フルオロ-2-トリフルオロメチルピリジ-3-イルである。

40

【0114】

表 8 6

表 8 6 は 3 9 7 2 個の化合物から成る。化合物 1 ~ 6 6 2 はそれぞれ表 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 6 6 3 ~ 1 3 2 4 はそれぞれ表 1 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 3 2 5 ~ 1 9 8 6 はそれぞれ表 1 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全

50

く同一であり、化合物 1 9 8 7 ~ 2 6 4 8 はそれぞれ表 2 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 2 6 4 9 ~ 3 3 1 0 はそれぞれ表 2 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 3 3 1 1 ~ 3 9 7 2 はそれぞれ表 3 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、但し、表 8 6 の化合物の全てにおいて、R¹は、2-フルオロ-6-クロロフェニルの代わりに2, 6-ジクロロピリジ-3-イルである。

【0115】

表 8 7

表 8 7 は 3 9 7 2 個の化合物から成る。化合物 1 ~ 6 6 2 はそれぞれ表 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 6 6 3 ~ 1 3 2 4 はそれぞれ表 1 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 3 2 5 ~ 1 9 8 6 はそれぞれ表 1 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 9 8 7 ~ 2 6 4 8 はそれぞれ表 2 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 2 6 4 9 ~ 3 3 1 0 はそれぞれ表 2 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 3 3 1 1 ~ 3 9 7 2 はそれぞれ表 3 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、但し、表 8 7 の化合物の全てにおいて、R¹は、2-フルオロ-6-クロロフェニルの代わりに3, 5-ジクロロピリジ-4-イルである。

10

【0116】

表 8 8

表 8 8 は 3 9 7 2 個の化合物から成る。化合物 1 ~ 6 6 2 はそれぞれ表 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 6 6 3 ~ 1 3 2 4 はそれぞれ表 1 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 3 2 5 ~ 1 9 8 6 はそれぞれ表 1 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 9 8 7 ~ 2 6 4 8 はそれぞれ表 2 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 2 6 4 9 ~ 3 3 1 0 はそれぞれ表 2 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 3 3 1 1 ~ 3 9 7 2 はそれぞれ表 3 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、但し、表 8 8 の化合物の全てにおいて、R¹は、2-フルオロ-6-クロロフェニルの代わりに3-クロロ-6-トリフルオロメチルピリジ-2-イルである。

20

【0117】

表 8 9

表 8 9 は 3 9 7 2 個の化合物から成る。化合物 1 ~ 6 6 2 はそれぞれ表 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 6 6 3 ~ 1 3 2 4 はそれぞれ表 1 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 3 2 5 ~ 1 9 8 6 はそれぞれ表 1 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 9 8 7 ~ 2 6 4 8 はそれぞれ表 2 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 2 6 4 9 ~ 3 3 1 0 はそれぞれ表 2 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 3 3 1 1 ~ 3 9 7 2 はそれぞれ表 3 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、但し、表 8 9 の化合物の全てにおいて、R¹は、2-フルオロ-6-クロロフェニルの代わりに3-フルオロ-6-トリフルオロメチルピリジ-2-イルである。

30

【0118】

表 9 0

表 9 0 は 3 9 7 2 個の化合物から成る。化合物 1 ~ 6 6 2 はそれぞれ表 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 6 6 3 ~ 1 3 2 4 はそれぞれ表 1 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 3 2 5 ~ 1 9 8 6 はそれぞれ表 1 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 9 8 7 ~ 2 6 4 8 はそれぞれ表 2 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 2 6 4 9 ~ 3 3 1 0 はそれぞれ表 2 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 3 3 1 1 ~ 3 9 7 2 はそれぞれ表 3 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、但し、表 9 0 の化合物の全てにおいて、R¹は、2-フルオロ-6-クロロフェニルの代わりにピリジ-2-イルである。

40

【0119】

表 9 1

表 9 1 は 3 9 7 2 個の化合物から成る。化合物 1 ~ 6 6 2 はそれぞれ表 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 6 6 3 ~ 1 3 2 4 はそれぞれ表 1 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 3 2 5 ~ 1 9 8 6 はそれぞれ表 1 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全

50

く同一であり、化合物 1 9 8 7 ~ 2 6 4 8 はそれぞれ表 2 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 2 6 4 9 ~ 3 3 1 0 はそれぞれ表 2 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 3 3 1 1 ~ 3 9 7 2 はそれぞれ表 3 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、但し、表 9 1 の化合物の全てにおいて、R¹は、2-フルオロ-6-クロロフェニルの代わりにピリジ-3-イルである。

【0120】

表 9 2

表 9 2 は 3 9 7 2 個の化合物から成る。化合物 1 ~ 6 6 2 はそれぞれ表 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 6 6 3 ~ 1 3 2 4 はそれぞれ表 1 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 3 2 5 ~ 1 9 8 6 はそれぞれ表 1 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 9 8 7 ~ 2 6 4 8 はそれぞれ表 2 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 2 6 4 9 ~ 3 3 1 0 はそれぞれ表 2 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 3 3 1 1 ~ 3 9 7 2 はそれぞれ表 3 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、但し、表 9 2 の化合物の全てにおいて、R¹は、2-フルオロ-6-クロロフェニルの代わりにピリジ-4-イルである。

10

【0121】

表 9 3

表 9 3 は 3 9 7 2 個の化合物から成る。化合物 1 ~ 6 6 2 はそれぞれ表 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 6 6 3 ~ 1 3 2 4 はそれぞれ表 1 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 3 2 5 ~ 1 9 8 6 はそれぞれ表 1 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 9 8 7 ~ 2 6 4 8 はそれぞれ表 2 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 2 6 4 9 ~ 3 3 1 0 はそれぞれ表 2 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 3 3 1 1 ~ 3 9 7 2 はそれぞれ表 3 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、但し、表 9 3 の化合物の全てにおいて、R¹は、2-フルオロ-6-クロロフェニルの代わりに3-フルオロチエン-2-イルである。

20

【0122】

表 9 4

表 9 4 は 3 9 7 2 個の化合物から成る。化合物 1 ~ 6 6 2 はそれぞれ表 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 6 6 3 ~ 1 3 2 4 はそれぞれ表 1 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 3 2 5 ~ 1 9 8 6 はそれぞれ表 1 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 9 8 7 ~ 2 6 4 8 はそれぞれ表 2 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 2 6 4 9 ~ 3 3 1 0 はそれぞれ表 2 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 3 3 1 1 ~ 3 9 7 2 はそれぞれ表 3 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、但し、表 9 4 の化合物の全てにおいて、R¹は、2-フルオロ-6-クロロフェニルの代わりに3-クロロチエン-2-イルである。

30

【0123】

表 9 5

表 9 5 は 3 9 7 2 個の化合物から成る。化合物 1 ~ 6 6 2 はそれぞれ表 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 6 6 3 ~ 1 3 2 4 はそれぞれ表 1 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 3 2 5 ~ 1 9 8 6 はそれぞれ表 1 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 9 8 7 ~ 2 6 4 8 はそれぞれ表 2 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 2 6 4 9 ~ 3 3 1 0 はそれぞれ表 2 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 3 3 1 1 ~ 3 9 7 2 はそれぞれ表 3 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、但し、表 9 5 の化合物の全てにおいて、R¹は、2-フルオロ-6-クロロフェニルの代わりに2, 4-ジフルオロチエン-3-イルである。

40

【0124】

表 9 6

表 9 6 は 3 9 7 2 個の化合物から成る。化合物 1 ~ 6 6 2 はそれぞれ表 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 6 6 3 ~ 1 3 2 4 はそれぞれ表 1 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 3 2 5 ~ 1 9 8 6 はそれぞれ表 1 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全

50

く同一であり、化合物 1 9 8 7 ~ 2 6 4 8 はそれぞれ表 2 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 2 6 4 9 ~ 3 3 1 0 はそれぞれ表 2 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 3 3 1 1 ~ 3 9 7 2 はそれぞれ表 3 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、但し、表 9 6 の化合物の全てにおいて、R¹は、2-フルオロ-6-クロロフェニルの代わりに 2, 4-ジクロロチエン-3-イルである。

【0125】

表 9 7

表 9 7 は 3 9 7 2 個の化合物から成る。化合物 1 ~ 6 6 2 はそれぞれ表 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 6 6 3 ~ 1 3 2 4 はそれぞれ表 1 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 3 2 5 ~ 1 9 8 6 はそれぞれ表 1 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 9 8 7 ~ 2 6 4 8 はそれぞれ表 2 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 2 6 4 9 ~ 3 3 1 0 はそれぞれ表 2 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 3 3 1 1 ~ 3 9 7 2 はそれぞれ表 3 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、但し、表 9 7 の化合物の全てにおいて、R¹は、2-フルオロ-6-クロロフェニルの代わりに 2, 4, 5-トリクロロチエン-3-イルである。

10

【0126】

表 9 8

表 9 8 は 3 9 7 2 個の化合物から成る。化合物 1 ~ 6 6 2 はそれぞれ表 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 6 6 3 ~ 1 3 2 4 はそれぞれ表 1 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 3 2 5 ~ 1 9 8 6 はそれぞれ表 1 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 9 8 7 ~ 2 6 4 8 はそれぞれ表 2 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 2 6 4 9 ~ 3 3 1 0 はそれぞれ表 2 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 3 3 1 1 ~ 3 9 7 2 はそれぞれ表 3 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、但し、表 9 8 の化合物の全てにおいて、R¹は、2-フルオロ-6-クロロフェニルの代わりにピペリジノである。

20

【0127】

表 9 9

表 9 9 は 3 9 7 2 個の化合物から成る。化合物 1 ~ 6 6 2 はそれぞれ表 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 6 6 3 ~ 1 3 2 4 はそれぞれ表 1 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 3 2 5 ~ 1 9 8 6 はそれぞれ表 1 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 9 8 7 ~ 2 6 4 8 はそれぞれ表 2 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 2 6 4 9 ~ 3 3 1 0 はそれぞれ表 2 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 3 3 1 1 ~ 3 9 7 2 はそれぞれ表 3 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、但し、表 9 9 の化合物の全てにおいて、R¹は、2-フルオロ-6-クロロフェニルの代わりに 2-メチルピペリジノである。

30

【0128】

表 1 0 0

表 1 0 0 は 3 9 7 2 個の化合物から成る。化合物 1 ~ 6 6 2 はそれぞれ表 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 6 6 3 ~ 1 3 2 4 はそれぞれ表 1 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 3 2 5 ~ 1 9 8 6 はそれぞれ表 1 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 9 8 7 ~ 2 6 4 8 はそれぞれ表 2 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 2 6 4 9 ~ 3 3 1 0 はそれぞれ表 2 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 3 3 1 1 ~ 3 9 7 2 はそれぞれ表 3 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、但し、表 1 0 0 の化合物の全てにおいて、R¹は、2-フルオロ-6-クロロフェニルの代わりに 2, 6-ジメチルピペリジノである。

40

【0129】

表 1 0 1

表 1 0 1 は 3 9 7 2 個の化合物から成る。化合物 1 ~ 6 6 2 はそれぞれ表 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 6 6 3 ~ 1 3 2 4 はそれぞれ表 1 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 3 2 5 ~ 1 9 8 6 はそれぞれ表 1 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と

50

全く同一であり、化合物 1 9 8 7 ~ 2 6 4 8 はそれぞれ表 2 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 2 6 4 9 ~ 3 3 1 0 はそれぞれ表 2 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 3 3 1 1 ~ 3 9 7 2 はそれぞれ表 3 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、但し、表 1 0 1 の化合物の全てにおいて、R¹は、2-フルオロ-6-クロロフェニルの代わりにモルホリノである。

【0130】

表 1 0 2

表 1 0 2 は 3 9 7 2 個の化合物から成る。化合物 1 ~ 6 6 2 はそれぞれ表 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 6 6 3 ~ 1 3 2 4 はそれぞれ表 1 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 3 2 5 ~ 1 9 8 6 はそれぞれ表 1 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 1 9 8 7 ~ 2 6 4 8 はそれぞれ表 2 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 2 6 4 9 ~ 3 3 1 0 はそれぞれ表 2 5 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、化合物 3 3 1 1 ~ 3 9 7 2 はそれぞれ表 3 0 の化合物 1 ~ 6 6 2 と全く同一であり、但し、表 1 0 2 の化合物の全てにおいて、R¹は、2-フルオロ-6-クロロフェニルの代わりに 2, 6-ジメチルモルホリノである。

10

【0131】

表 1 0 3

表 1 0 3 は 3 0 5, 8 4 4 個の化合物から成る。これらの化合物はそれぞれ表 1 ~ 1 0 2 中の対応する化合物と全く同一であり（したがって、例えば、表 1 0 3 の化合物は表 1 の化合物 1 と同一であり、表 1 0 3 の化合物 6 6 3 は表 2 の化合物 1 と同一であり、表 1 0 3 の化合物 1 9, 8 6 1 は表 3 1 の化合物 1 と同一であり、表 1 0 3 の化合物 3 0 5, 8 4 4 は表 1 0 2 の化合物 3, 9 7 2 と同一である）、但し、表 1 0 3 の化合物の全てにおいて、R は、C l の代わりに F である。

20

【0132】

表 1 0 4

表 1 0 4 は 3 0 5, 8 4 4 個の化合物から成る。これらの化合物はそれぞれ表 1 ~ 1 0 2 中の対応する化合物と全く同一であり（したがって、例えば、表 1 0 4 の化合物は表 1 の化合物 1 と同一であり、表 1 0 4 の化合物 6 6 3 は表 2 の化合物 1 と同一であり、表 1 0 4 の化合物 1 9, 8 6 1 は表 3 1 の化合物 1 と同一であり、表 1 0 4 の化合物 3 0 5, 8 4 4 は表 1 0 2 の化合物 3, 9 7 2 と同一である）、但し、表 1 0 4 の化合物の全てにおいて、R は、C l の代わりに B r である。

30

【0133】

表 1 0 5

表 1 0 5 は 3 0 5, 8 4 4 個の化合物から成る。これらの化合物はそれぞれ表 1 ~ 1 0 2 中の対応する化合物と全く同一であり（したがって、例えば、表 1 0 5 の化合物は表 1 の化合物 1 と同一であり、表 1 0 5 の化合物 6 6 3 は表 2 の化合物 1 と同一であり、表 1 0 5 の化合物 1 9, 8 6 1 は表 3 1 の化合物 1 と同一であり、表 1 0 5 の化合物 3 0 5, 8 4 4 は表 1 0 2 の化合物 3, 9 7 2 と同一である）、但し、表 1 0 5 の化合物の全てにおいて、R は、C l の代わりにメチルである。

40

【0134】

表 1 0 6

表 1 0 6 は 3 0 5, 8 4 4 個の化合物から成る。これらの化合物はそれぞれ表 1 ~ 1 0 2 中の対応する化合物と全く同一であり（したがって、例えば、表 1 0 6 の化合物は表 1 の化合物 1 と同一であり、表 1 0 6 の化合物 6 6 3 は表 2 の化合物 1 と同一であり、表 1 0 6 の化合物 1 9, 8 6 1 は表 3 1 の化合物 1 と同一であり、表 1 0 6 の化合物 3 0 5, 8 4 4 は表 1 0 2 の化合物 3, 9 7 2 と同一である）、但し、表 1 0 6 の化合物の全てにおいて、R は、C l の代わりにエチルである。

【0135】

表 1 0 7

表 1 0 7 は 3 0 5, 8 4 4 個の化合物から成る。これらの化合物はそれぞれ表 1 ~ 1 0

50

2 中の対応する化合物と全く同一であり（したがって、例えば、表 1 0 7 の化合物は表 1 の化合物 1 と同一であり、表 1 0 7 の化合物 6 6 3 は表 2 の化合物 1 と同一であり、表 1 0 7 の化合物 1 9, 8 6 1 は表 3 1 の化合物 1 と同一であり、表 1 0 7 の化合物 3 0 5, 8 4 4 は表 1 0 2 の化合物 3, 9 7 2 と同一である）、但し、表 1 0 7 の化合物の全てにおいて、R は、C l の代わりにシアノである。

【0 1 3 6】

表 1 0 8

表 1 0 8 は 3 0 5, 8 4 4 個の化合物から成る。これらの化合物はそれぞれ表 1 ~ 1 0 2 中の対応する化合物と全く同一であり（したがって、例えば、表 1 0 8 の化合物は表 1 の化合物 1 と同一であり、表 1 0 8 の化合物 6 6 3 は表 2 の化合物 1 と同一であり、表 1 0 8 の化合物 1 9, 8 6 1 は表 3 1 の化合物 1 と同一であり、表 1 0 8 の化合物 3 0 5, 8 4 4 は表 1 0 2 の化合物 3, 9 7 2 と同一である）、但し、表 1 0 8 の化合物の全てにおいて、R は、C l の代わりにメトキシである。

10

【0 1 3 7】

表 1 0 9

表 1 0 9 は 6 6 2 0 個の化合物から成る。これらの化合物はそれぞれ表 1 ~ 1 0 中の対応する化合物と全く同一であり（したがって、例えば、表 1 0 9 の化合物は表 1 の化合物 1 と同一であり、表 1 0 9 の化合物 6 6 3 は表 2 の化合物 1 と同一である、等）、但し、表 1 0 9 の化合物の全てにおいて、X は、C H の代わりに C F である。

【0 1 3 8】

20

表 1 1 0

表 1 1 0 は 6 6 2 0 個の化合物から成る。これらの化合物はそれぞれ表 1 ~ 1 0 中の対応する化合物と全く同一であり（したがって、例えば、表 1 1 0 の化合物は表 1 の化合物 1 と同一であり、表 1 1 0 の化合物 6 6 3 は表 2 の化合物 1 と同一である、等）、但し、表 1 1 0 の化合物の全てにおいて、X は、C H の代わりに C C l である。

【0 1 3 9】

表 1 1 1

表 1 1 1 は 6 6 2 0 個の化合物から成る。これらの化合物はそれぞれ表 1 ~ 1 0 中の対応する化合物と全く同一であり（したがって、例えば、表 1 1 1 の化合物は表 1 の化合物 1 と同一であり、表 1 1 1 の化合物 6 6 3 は表 2 の化合物 1 と同一である、等）、但し、表 1 1 1 の化合物の全てにおいて、X は、C H の代わりに C B r である。

30

【0 1 4 0】

表 1 1 2

表 1 1 2 は 6 6 2 0 個の化合物から成る。これらの化合物はそれぞれ表 1 ~ 1 0 中の対応する化合物と全く同一であり（したがって、例えば、表 1 1 2 の化合物は表 1 の化合物 1 と同一であり、表 1 1 2 の化合物 6 6 3 は表 2 の化合物 1 と同一である、等）、但し、表 1 1 2 の化合物の全てにおいて、X は、C H の代わりに C C H₃ である。

【0 1 4 1】

表 1 1 3

表 1 1 3 は 6 6 2 0 個の化合物から成る。これらの化合物はそれぞれ表 1 ~ 1 0 中の対応する化合物と全く同一であり（したがって、例えば、表 1 1 3 の化合物は表 1 の化合物 1 と同一であり、表 1 1 3 の化合物 6 6 3 は表 2 の化合物 1 と同一である、等）、但し、表 1 1 3 の化合物の全てにおいて、Y は、C H の代わりに C F である。

40

【0 1 4 2】

表 1 1 4

表 1 1 4 は 6 6 2 0 個の化合物から成る。これらの化合物はそれぞれ表 1 ~ 1 0 中の対応する化合物と全く同一であり（したがって、例えば、表 1 1 4 の化合物は表 1 の化合物 1 と同一であり、表 1 1 4 の化合物 6 6 3 は表 2 の化合物 1 と同一である、等）、但し、表 1 1 4 の化合物の全てにおいて、Y は、C H の代わりに C C l である。

【0 1 4 3】

50

表 1 1 5

表 1 1 5 は 6 6 2 0 個の化合物から成る。これらの化合物はそれぞれ表 1 ～ 1 0 中の対応する化合物と全く同一であり（したがって、例えば、表 1 1 5 の化合物は表 1 の化合物 1 と同一であり、表 1 1 5 の化合物 6 6 3 は表 2 の化合物 1 と同一である、等）、但し、表 1 1 5 の化合物の全てにおいて、Y は、CH の代わりに C B r である。

【0 1 4 4】

表 1 1 6

表 1 1 6 は 6 6 2 0 個の化合物から成る。これらの化合物はそれぞれ表 1 ～ 1 0 中の対応する化合物と全く同一であり（したがって、例えば、表 1 1 6 の化合物は表 1 の化合物 1 と同一であり、表 1 1 6 の化合物 6 6 3 は表 2 の化合物 1 と同一である、等）、但し、表 1 1 6 の化合物の全てにおいて、Y は、CH の代わりに C C H₃ である。

【0 1 4 5】

表 1 1 7

表 1 1 7 は、W、X 及び Z が CH であり、Y が N であり、R が Cl であり、R¹ が 2, 4, 6-トリフルオロフェニルであり、且つ R³ 及び R⁴ の値が表 1 に列記した通りである、一般式 (1 B) の 6 6 2 個の化合物から成る。従って、表 1 1 7 の化合物 1 は、表 1 1 7 の化合物 1 において、当該化合物が一般式 (1 B) を有することを除き、表 2 1 の化合物 1 と同一である。同様に、表 1 1 7 の化合物 2 ～ 6 6 2 は、表 1 1 7 の化合物において、当該化合物が一般式 (1 B) を有することを除き、表 2 1 の化合物 2 ～ 6 6 2 と同一である。

【0 1 4 6】

表 1 1 8

表 1 1 8 は、W、X 及び Z が CH であり、Y が N であり、R が Cl であり、R¹ が 2, 5, 6-トリフルオロフェニルであり、且つ R³ 及び R⁴ の値が表 1 に列記した通りである、一般式 (1 B) の 6 6 2 個の化合物から成る。従って、表 1 1 8 の化合物 1 は、表 1 1 8 の化合物 1 において、当該化合物が一般式 (1 B) を有することを除き、表 2 2 の化合物 1 と同一である。同様に、表 1 1 8 の化合物 2 ～ 6 6 2 は、表 1 1 8 の化合物において、当該化合物が一般式 (1 B) を有することを除き、表 2 2 の化合物 2 ～ 6 6 2 と同一である。

【0 1 4 7】

表 1 1 9

表 1 1 9 は、W、X 及び Z が CH であり、Y が N であり、R が Cl であり、R¹ が 2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニルであり、且つ R³ 及び R⁴ の値が表 1 に列記した通りである、一般式 (1 B) の 6 6 2 個の化合物から成る。従って、表 1 1 9 の化合物 1 は、表 1 1 9 の化合物 1 において、当該化合物が一般式 (1 B) を有することを除き、表 2 3 の化合物 1 と同一である。同様に、表 1 1 9 の化合物 2 ～ 6 6 2 は、表 1 1 9 の化合物において、当該化合物が一般式 (1 B) を有することを除き、表 2 3 の化合物 2 ～ 6 6 2 と同一である。

【0 1 4 8】

表 1 2 0

表 1 2 0 は、W、X 及び Z が CH であり、Y が N であり、R が Cl であり、R¹ が 2, 6-ジフルオロ-4-メトキシフェニルであり、且つ R³ 及び R⁴ の値が表 1 に列記した通りである、一般式 (1 B) の 6 6 2 個の化合物から成る。従って、表 1 2 0 の化合物 1 は、表 1 2 0 の化合物 1 において、当該化合物が一般式 (1 B) を有することを除き、表 2 4 の化合物 1 と同一である。同様に、表 1 2 0 の化合物 2 ～ 6 6 2 は、表 1 2 0 の化合物において、当該化合物が一般式 (1 B) を有することを除き、表 2 4 の化合物 2 ～ 6 6 2 と同一である。

【0 1 4 9】

表 1 2 1

表 1 2 1 は、W、X 及び Z が CH であり、Y が N であり、R が Cl であり、R¹ が 2 -

10

20

30

40

50

フルオロー 6-クロロフェニルであり、且つ R^3 及び R^4 の値が表 1 に列記した通りである、一般式 (1 B) の 6 6 2 個の化合物から成る。従って、表 1 2 1 の化合物 1 は、表 1 2 1 の化合物 1 において、当該化合物が一般式 (1 B) を有することを除き、表 2 5 の化合物 1 と同一である。同様に、表 1 2 1 の化合物 2 ~ 6 6 2 は、表 1 2 1 の化合物において、当該化合物が一般式 (1 B) を有することを除き、表 2 5 の化合物 2 ~ 6 6 2 と同一である。

【0 1 5 0】

表 1 2 2

表 1 2 2 は、W、Y 及び Z が CH であり、X が N であり、R が Cl であり、 R^1 が 2, 4, 6-トリフルオロフェニルであり、且つ R^3 及び R^4 の値が表 1 に列記した通りである、一般式 (1 B) の 6 6 2 個の化合物から成る。従って、表 1 2 2 の化合物 1 は、表 1 2 2 の化合物 1 において、当該化合物が一般式 (1 B) を有することを除き、表 2 6 の化合物 1 と同一である。同様に、表 1 2 2 の化合物 2 ~ 6 6 2 は、表 1 2 2 の化合物において、当該化合物が一般式 (1 B) を有することを除き、表 2 6 の化合物 2 ~ 6 6 2 と同一である。

10

【0 1 5 1】

表 1 2 3

表 1 2 3 は、W、Y 及び Z が CH であり、X が N であり、R が Cl であり、 R^1 が 2, 4, 5-トリフルオロフェニルであり、且つ R^3 及び R^4 の値が表 1 に列記した通りである、一般式 (1 B) の 6 6 2 個の化合物から成る。従って、表 1 2 3 の化合物 1 は、表 1 2 3 の化合物 1 において、当該化合物が一般式 (1 B) を有することを除き、表 2 7 の化合物 1 と同一である。同様に、表 1 2 3 の化合物 2 ~ 6 6 2 は、表 1 2 3 の化合物において、当該化合物が一般式 (1 B) を有することを除き、表 2 7 の化合物 2 ~ 6 6 2 と同一である。

20

【0 1 5 2】

表 1 2 4

表 1 2 4 は、W、Y 及び Z が CH であり、X が N であり、R が Cl であり、 R^1 が 2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニルであり、且つ R^3 及び R^4 の値が表 1 に列記した通りである、一般式 (1 B) の 6 6 2 個の化合物から成る。従って、表 1 2 4 の化合物 1 は、表 1 2 4 の化合物 1 において、当該化合物が一般式 (1 B) を有することを除き、表 2 8 の化合物 1 と同一である。同様に、表 1 2 4 の化合物 2 ~ 6 6 2 は、表 1 2 4 の化合物において、当該化合物が一般式 (1 B) を有することを除き、表 2 8 の化合物 2 ~ 6 6 2 と同一である。

30

【0 1 5 3】

表 1 2 5

表 1 2 5 は、W、Y 及び Z が CH であり、X が N であり、R が Cl であり、 R^1 が 2, 6-ジフルオロー 4-メトキシフェニルであり、且つ R^3 及び R^4 の値が表 1 に列記した通りである、一般式 (1 B) の 6 6 2 個の化合物から成る。従って、表 1 2 5 の化合物 1 は、表 1 2 5 の化合物 1 において、当該化合物が一般式 (1 B) を有することを除き、表 2 9 の化合物 1 と同一である。同様に、表 1 2 5 の化合物 2 ~ 6 6 2 は、表 1 2 5 の化合物において、当該化合物が一般式 (1 B) を有することを除き、表 2 9 の化合物 2 ~ 6 6 2 と同一である。

40

【0 1 5 4】

表 1 2 6

表 1 2 6 は、W、Y 及び Z が CH であり、X が N であり、R が Cl であり、 R^1 が 2-フルオロー 6-クロロフェニルであり、且つ R^3 及び R^4 の値が表 1 に列記した通りである、一般式 (1 B) の 6 6 2 個の化合物から成る。従って、表 1 2 6 の化合物 1 は、表 1 2 6 の化合物 1 において、当該化合物が一般式 (1 B) を有することを除き、表 3 0 の化合物 1 と同一である。同様に、表 1 2 6 の化合物 2 ~ 6 6 2 は、表 1 2 6 の化合物において、当該化合物が一般式 (1 B) を有することを除き、表 3 0 の化合物 2 ~ 6 6 2 と同一である。

50

ある。

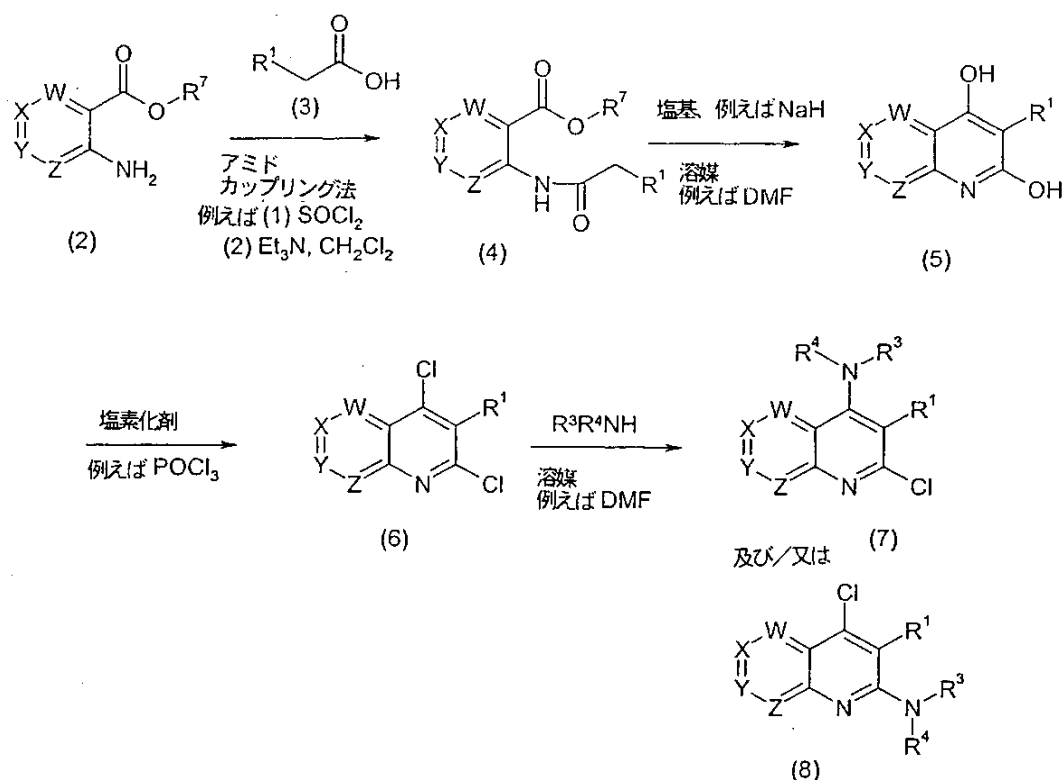
【0155】

R 及び R^2 のうち的一方が NR^3R^4 である一般式 (1) の化合物の例である、式 (7) 又は (8) の化合物は、スキーム 1 に示すように生成することができ、ここで、W, X, Y, Z, R^1 , R^3 及び R^4 は上文で示した意味を有し、且つ R^7 は C_{1-4} アルキルである。

【0156】

【化14】

スキーム 1



【0157】

一般式 (4) の化合物は、市販されているか、あるいは文献公知の方法で生成される一般式 (2) の化合物から、一般式 (3) の酸との反応であって、標準的なカップリング法を用いての反応、例えば塩素化剤、例えば塩化チオニルを用いての酸塩化物への変換、続く、生じた酸塩化物の任意に塩基、例えばトリエチルアミンの存在下での反応であって、適当な溶媒、例えばジクロロメタン又はトルエンの存在下での反応、により調製されうる。一般式 (5) の化合物は、一般式 (4) の化合物を、塩基、例えば水素化ナトリウムで、任意にルイス酸、例えば酸化マグネシウムの存在下で、適当な溶媒、例えば N, N-ジメチルホルムアミド (DMF) 又はトルエン中で、室温から $150^\circ C$ で、しかし好ましくは $60 \sim 90^\circ C$ で処理することにより調製されうる。一般式 (6) の化合物は、一般式 (5) の化合物と、塩素化試薬、例えばオキシ塩化リンとの、ニートでの、又は適当な溶媒、例えばトルエン中での、 $50 \sim 150^\circ C$ での、しかし好ましくは $80 \sim 110^\circ C$ での、あるいはマイクロ波反応装置内での $150 \sim 300^\circ C$ での、しかし好ましくは $200 \sim 250^\circ C$ での、反応により調製されうる。式 (7) 及び (8) の化合物は、一般式 (6) とアミン R^3R^4NH との、ニートでの、又は適当な溶媒、例えば DMF 中での、室温から

150℃での、しかし好ましくは50～80℃での反応により調製されうる。化合物(7)及び(8)が混合物として産生される場合、それらは適当な手段、例えば結晶化又は順相又は逆相条件下でのクロマトグラフィーにより分離されうる。

【0158】

一般式(5)、(6)、(7)及び(8)の化合物は、クロロ又はヒドロキシ置換基を介して、一般式(1)の他の化合物を形成するためのルーチンな化学的技術を用いて誘導体化されうる。あるいは、一般式(1)の他の化合物は、化合物(5)～(8)を調製するために記載したものと類似の方法論を用いて、且つ化学文献において知られている調製用の技術を利用して調製されうる。

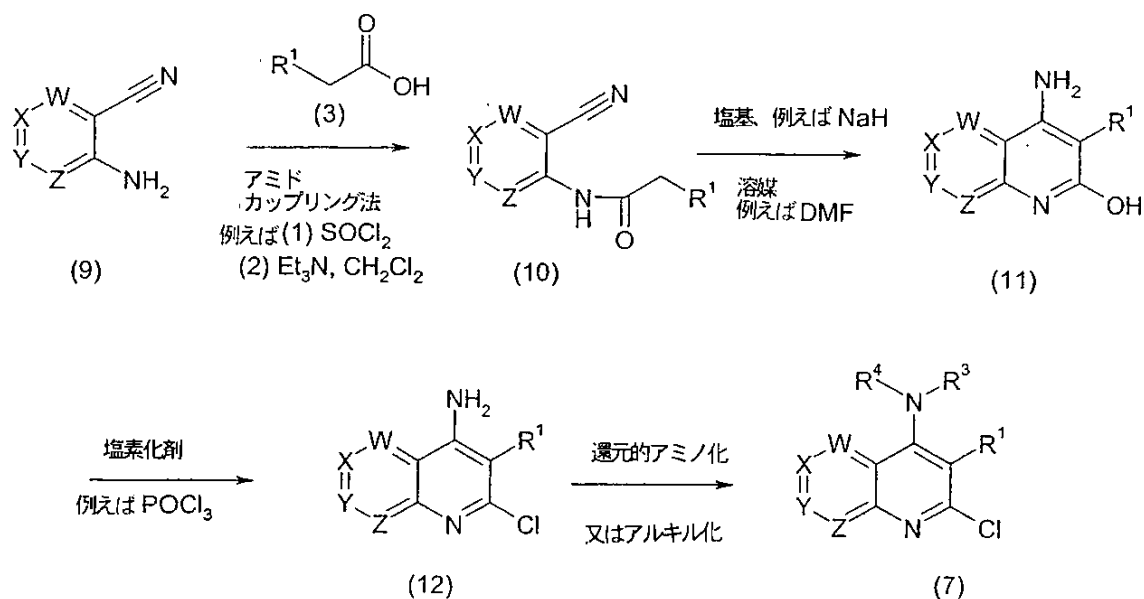
【0159】

式(7)の化合物もスキーム2に示すように生成されうる。

【0160】

【化15】

スキーム2



【0161】

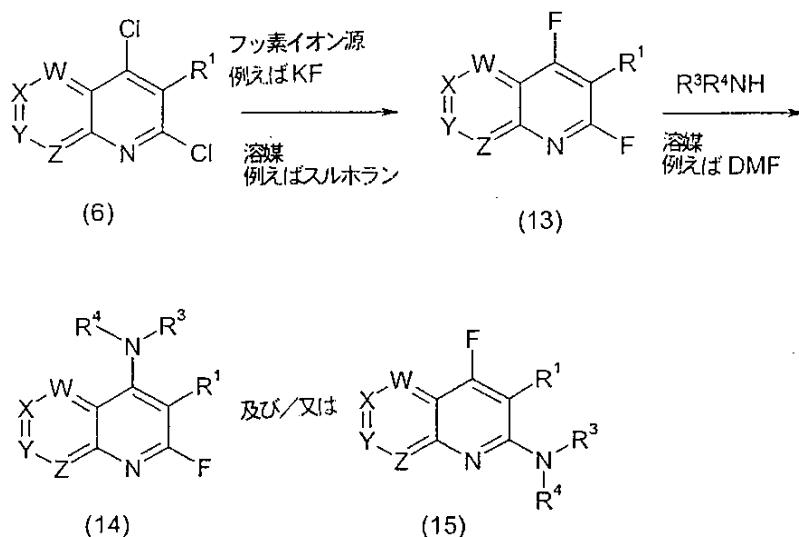
一般式(10)の化合物は、市販されているか、あるいは文献公知の方法で生成される一般式(9)の化合物から、一般式(3)の酸との反応であって、標準的なカップリング法を用いての反応、例えば塩素化剤、例えば塩化チオニルを用いての酸塩化物への変換、続く、生じた酸塩化物の任意に塩基、例えばトリエチルアミンの存在下での反応であって、適当な溶媒、例えばジクロロメタン又はトルエンの存在下での反応、により調製されうる。一般式(11)の化合物は、一般式(10)の化合物を、塩基、例えば水素化ナトリウムで、任意にルイス酸、例えば酸化マグネシウムの存在下で、適当な溶媒、例えばN,N-ジメチルホルムアミド(DMF)又はトルエン中で、室温から150℃で、しかし好ましくは60～90℃で処理することにより調製されうる。一般式(12)の化合物は、一般式(11)の化合物と、塩素化試薬、例えばオキシ塩化リンとの、ニートでの、又は適当な溶媒、例えばトルエン中での、50～150℃での、しかし好ましくは80～110℃での、あるいはマイクロ波反応装置内での150～300℃での、しかし好ましくは200～250℃での、反応により調製されうる。式(7)の化合物は、式(12)の化

化合物から、例えば還元的アミノ化、例えばケトン又はアルデヒドとの、適当な溶媒、例えばエタノール又はトルエン中での、室温から還流温度での、任意に酸触媒、例えばパラトルエンスルホン酸又は乾燥剤、例えばモレキュラーシーブの存在下での反応、続く、適当な還元剤、例えば水素化ホウ素ナトリウムによる、 $-20^{\circ}\text{C}\sim 40^{\circ}\text{C}$ での、しかし好ましくは室温での処理、により調製されうる。前記アルデヒド又はケトンは、所望の基 R^3 及び R^4 がアミン (12) との反応産物の還元後に形成されるように選択される。例えば、式 (12) の化合物が 1 等量のプロピオンアルデヒドと、そして次に水素化ホウ素ナトリウムと反応する場合、 R^3 が n -プロピルであり、且つ R^4 が水素である式 (7) の化合物が形成される。必要に応じ、当該反応は異なるアルデヒド又はケトンを用いて繰り返されうる。例えば、アセトンが第二の反応に使用される場合、 R^3 が n -プロピルであり、且つ R^4 がイソプロピルである式 (7) の化合物が形成される。あるいは、式 (7) の化合物は、式 (12) の化合物から、基 R^3LG (ここで、 LG は脱離基である) によるアルキル化、適当な塩基、例えば水素化ナトリウムとの、溶媒、例えば DMF 中での、又は炭酸カリウムのような塩基との、溶媒、例えばアセトン又は DMF 中での、 $-78^{\circ}\text{C}\sim 100^{\circ}\text{C}$ での、しかし好ましくは室温から 60°C での処理、続く、必要に応じての同一条件下での第二段階の R^4LG での処理、により形成されうる。

【0162】

【化16】

スキーム 3



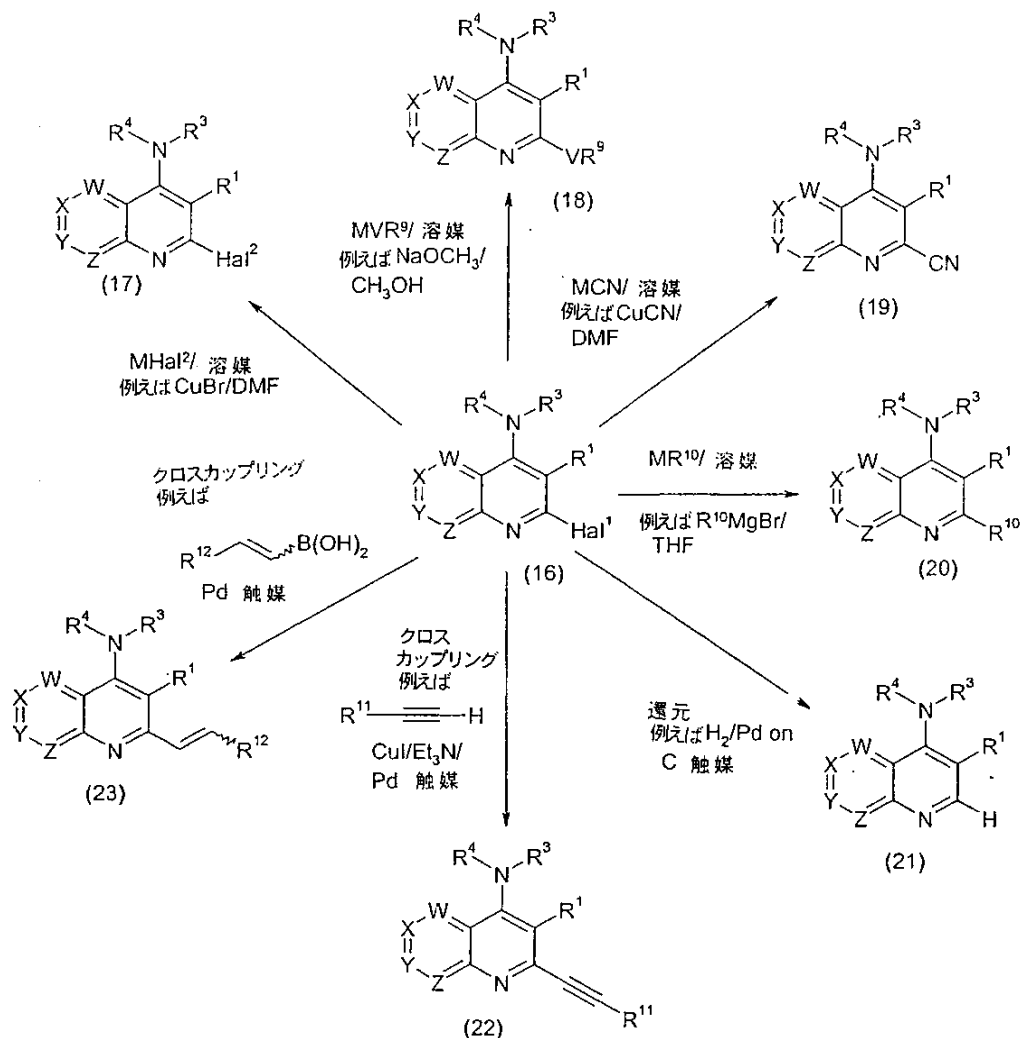
【0163】

式 (13) の化合物は、スキーム 3 に示すように、式 (6) の化合物から、フッ素イオン源、例えばフッ化カリウムとの、適当な溶媒、例えばスルホラン中での、 $50^{\circ}\text{C}\sim 200^{\circ}\text{C}$ 、しかし好ましくは $80\sim 150^{\circ}\text{C}$ の温度での反応により調製されうる。式 (14) の化合物及び／又は式 (15) の化合物は、式 (13) のジフルオロ化合物から、式 $\text{R}^3\text{R}^4\text{NH}$ のアミンとの、適当な溶媒、例えば DMF 又は CH_2Cl_2 中での、 $0^{\circ}\text{C}\sim 100^{\circ}\text{C}$ 、しかし好ましくは室温の温度での反応により調製されうる。

【0164】

【化 1 7】

スキーム 4



【0165】

Hal^1 が塩素又はフッ素である一般式(16)の化合物は、スキーム4に示すように、式(17)、(18)、(19)、(20)、(21)、(22)又は(23)の化合物に変換されう。 Hal^2 が臭素又はヨウ素である一般式(17)の化合物は、一般式(16)の化合物と、ハロゲン化金属、例えば臭化第一銅とを、適当な溶媒、例えばDMF、室温から155℃で、しかし好ましくは70℃から155℃で反応させることにより形成されう。 V が酸素又は硫黄であり、且つ R^9 が C_{1-8} アルキルである一般式(18)の化合物は、一般式(16)の化合物と、シアン化金属とを適当な溶媒中で、例えばシアン化第一銅とをDMF中で、室温から155℃で、好ましくは50℃から155℃で反応させることにより形成されう。 R^{10} が C_{1-8} アルキルである一般式(20)の化合物は、一般式(16)の化合物とアルキル金属誘導体とを適当な溶媒中で、例えば臭化メチルマグネシウムとをTHF中で、任意に、触媒、例えば臭化第一銅又は $Pd(Ph)_4$ の存在下で、-40℃~50℃で反応させることにより形成されう。一般式(21)の化合物は、 Hal^1 が塩素である一般式(16)の化合物の還元により、例えば水素ガス及び

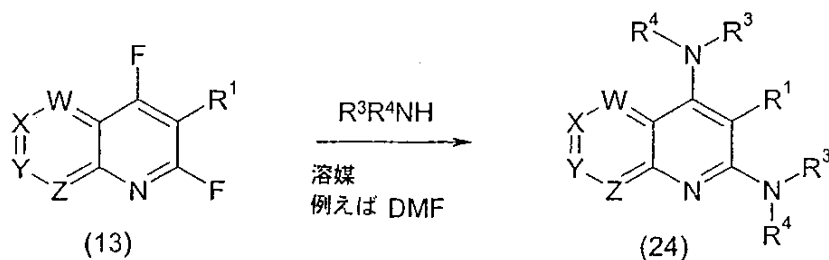
金属触媒、例えばPd/Cにより、適当な溶媒、例えばエタノール中での、室温での水素添加分解により形成されうる。R¹¹が水素又はC₁₋₆アルキルである一般式(22)の化合物は、一般式(16)の化合物と、アセチレンアルキルとの、菌頭条件下での、例えば1-プロピレン/トリエチルアミンによる、第一銅塩、例えば、ヨウ化第一銅及びパラジウム触媒、例えばPd(Ph)₄の存在下での、室温から70℃での反応により形成されうる。R¹²が水素又はC₁₋₆アルキルである一般式(23)の化合物は、一般式(16)の化合物と、アルケニル金属誘導体との、適当な溶媒中での反応、例えばエチニルボロン酸とのTHF中での反応であって、パラジウム触媒、例えばPd(Ph)₄及び塩基、例えば炭酸セシウムの存在下での室温から60℃での反応により形成されうる。

【0166】

【化18】

10

スキーム5



20

【0167】

スキーム5において、2つのR³R⁴N基が同一である一般式(24)の化合物は、一般式(13)の化合物から、大過剰のアミンR³R⁴NHとの反応であって、適当な溶媒、例えばDMF中での、0℃から150℃、しかし好ましくは室温から100℃の温度での反応により生成されうる。

30

【0168】

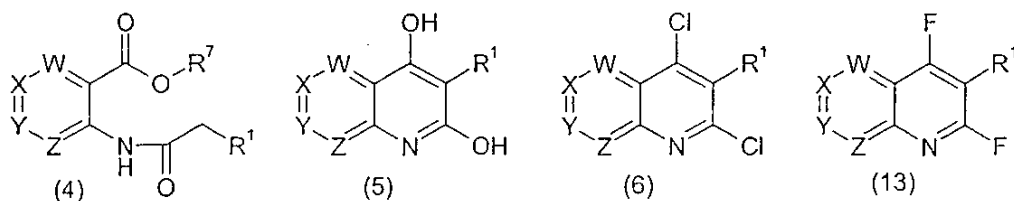
式(1)の化合物の調製の更なる補助は、以下の刊行物: Emilio, Toja, et. al., J. Heterocyclic Chem., 23,1955 (1986), H. Schafer, et. al., J f prakt. Chemie, 321 (4), 695-(1970) and-H. Brederick et. al., Chem. Ber. 96,1868-1872 (1993)から導くことができる。

【0169】

一般式(4)、(5)、(6)及び(13)：

【化19】

40



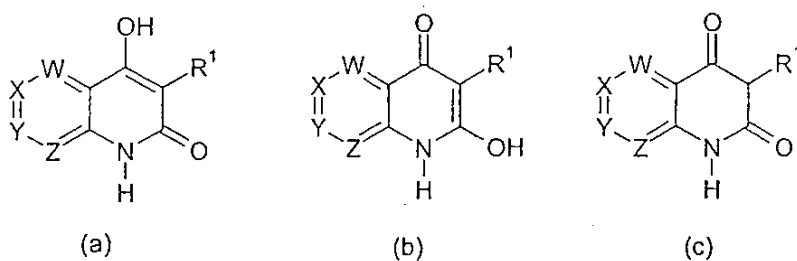
50

(ここで、W, X, Y, Z, R¹及びR⁷は上文で定義した通りである)
を有する中間体化学物質は新規化合物であり、且つ本発明の追加の部分形成すると考えられる。

【0170】

注意すべきは、一般域(5)の中間体が、式(5)に示す形態と同様に、互変異性型で存在しうることである：

【化20】



10

【0171】

本発明は、一般式(5)により定義される通り、全てのそのような互変異性体を包含する。

【0172】

特に注目すべきものは、以下の表127～134に列記する中間体である。表127において、化合物は、R⁷がメチルであり、且つW, X, Y, Z及びR¹が表中に示す値を有する一般式(4)を有する。

20

【化 2 1】

表127

化合物 番号	R ¹	W	X	Y	Z
1	2,4,6-トリフルオロフェニル	CH	CH	CH	N
2	2,5,6-トリフルオロフェニル	CH	CH	CH	N
3	2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェニル	CH	CH	CH	N
4	2,3,5,6-テトラフルオロフェニル	CH	CH	CH	N
5	2,6-ジフルオロ-4-メトキシフェニル	CH	CH	CH	N
6	2-フルオロ-6-クロロフェニル	CH	CH	CH	N
7	2,6-ジフルオロフェニル	CH	CH	CH	N
8	2,3,5,6-テトラフルオロフェニル	CH	CH	CH	N
9	2-フルオロフェニル	CH	CH	CH	N
10	2-クロロフェニル	CH	CH	CH	N
11	2-ブロモフェニル	CH	CH	CH	N
12	2,4-ジクロロフェニル	CH	CH	CH	N

10

20

【化 2 2】

13	2,4,6-トリフルオロフェニル	N	CH	CH	CH
14	2,5,6-トリフルオロフェニル	N	CH	CH	CH
15	2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェニル	N	CH	CH	CH
16	2,3,5,6-テトラフルオロフェニル	N	CH	CH	CH
17	2,6-ジフルオロ-4-メトキシフェニル	N	CH	CH	CH
18	2-フルオロ-6-クロロフェニル	N	CH	CH	CH
19	2,6-ジフルオロフェニル	N	CH	CH	CH
20	2,3,5,6-テトラフルオロフェニル	N	CH	CH	CH
21	2-フルオロフェニル	N	CH	CH	CH
22	2-クロロフェニル	N	CH	CH	CH
23	2-ブロモフェニル	N	CH	CH	CH
24	2,4-ジクロロフェニル	N	CH	CH	CH
25	2,4,6-トリフルオロフェニル	CH	CH	N	CH
26	2,5,6-トリフルオロフェニル	CH	CH	N	CH
27	2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェニル	CH	CH	N	CH
28	2,3,5,6-テトラフルオロフェニル	CH	CH	N	CH
29	2,6-ジフルオロ-4-メトキシフェニル	CH	CH	N	CH
30	2-フルオロ-6-クロロフェニル	CH	CH	N	CH
31	2,6-ジフルオロフェニル	CH	CH	N	CH
32	2,3,5,6-テトラフルオロフェニル	CH	CH	N	CH
33	2-フルオロフェニル	CH	CH	N	CH
34	2-クロロフェニル	CH	CH	N	CH
35	2-ブロモフェニル	CH	CH	N	CH
36	2,4-ジクロロフェニル	CH	CH	N	CH
37	2,4,6-トリフルオロフェニル	CH	N	CH	CH
38	2,5,6-トリフルオロフェニル	CH	N	CH	CH
39	2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェニル	CH	N	CH	CH
40	2,3,5,6-テトラフルオロフェニル	CH	N	CH	CH
41	2,6-ジフルオロ-4-メトキシフェニル	CH	N	CH	CH
42	2-フルオロ-6-クロロフェニル	CH	N	CH	CH
43	2,6-ジフルオロフェニル	CH	N	CH	CH
44	2,3,5,6-テトラフルオロフェニル	CH	N	CH	CH

10

20

30

40

【化 2 3】

45	2-フルオロフェニル	CH	N	CH	CH
46	2-クロロフェニル	CH	N	CH	CH
47	2-ブロモフェニル	CH	N	CH	CH
48	2,4-ジクロロフェニル	CH	N	CH	CH

10

【0 1 7 3】

表 1 2 8

表 1 2 8 は、W, X, Y, Z 及び R^1 が表 1 2 7 に示す値を有する一般式 (5) の 4 8 個の化合物から成る。従って、表 1 2 8 の化合物 1 は、例えば、表 1 2 7 の化合物 1 と同一の W, X, Y, Z 及び R^1 の値を有する。

【0 1 7 4】

表 1 2 9

表 1 2 9 は、W, X, Y, Z 及び R^1 が表 1 2 7 に示す値を有する一般式 (6) の 4 8 個の化合物から成る。従って、表 1 2 9 の化合物 1 は、例えば、表 1 2 7 の化合物 1 と同一の W, X, Y, Z 及び R^1 の値を有する。

20

【0 1 7 5】

表 1 3 0

表 1 3 0 は、W, X, Y, Z 及び R^1 が表 1 2 7 に示す値を有する一般式 (13) の 4 8 個の化合物から成る。従って、表 1 2 9 の化合物 1 は、例えば、表 1 3 0 の化合物 1 と同一の W, X, Y, Z 及び R^1 の値を有する。

【0 1 7 6】

表 1 3 1

表 1 3 1 は、W, X, Y, Z 及び R^1 が表 1 3 1 に示す値を有し、且つ R^7 がエチルである一般式 (5) の 4 8 個の化合物から成る。従って、表 1 3 1 の化合物 1 は、表 1 3 1 の化合物において R^7 がメチルの代わりにエチルであることを除き表 1 2 7 の化合物と同一である。同様に、表 1 3 1 の化合物 2 ~ 4 8 は、表 1 3 1 の化合物において、 R^7 がエチルであることを除き、表 1 2 7 の化合物 2 ~ 4 8 と同一である。

30

【0 1 7 7】

式 (1) の化合物はまた活性な殺真菌剤であり、且つ 1 又は複数の以下の病原を防除するのに使用されうる：イネ及びコムギのイモチ病菌 (*Pyricularia oryzae*) (*Magnaporthe grisea*) 並びにその他の宿主のイモチ病原菌 (*Pyricularia* spp)；コムギの赤さび病原菌 (*Puccinia triticina* (又は *recondita*)、黄さび病原菌 (*Puccinia striiformis*) 及びその他のさび病原菌、オオムギの小さび病原菌 (*Puccinia hordei*)、黄さび病原菌 (*Puccinia striiformis*) 及びその他のさび病原菌、その他の宿主 (例えば、芝生、ライムギ、コーヒー、洋ナシ、リンゴ、ラッカセイ、サトウダイコン、野菜類及び観賞植物) のさび病原菌；ウリ科植物 (例えば、メロン) のうどんこ病原菌 (*Erysiphe cichoracearum*)；オオムギ、コムギ、ライムギ及び芝生のうどんこ病原菌 (*Erysiphe graminis*) 並びに種々の宿主のその他のうどんこ病原菌、例えばホップのうどんこ病原菌 (*Sphaerotheca macularis*)、ウリ科植物 (例えば、キュウリ) のうどんこ病原菌 [*Sphaerotheca fusca* (*Sphaerotheca fuliginea*)]、トマト、ナス及びアマトウガラシのうどんこ病原菌 (*Leveillula taurica*)、リンゴのうどんこ病原菌 (*Podosphaera leucotricha*) 及びブドウのうどんこ病原菌 (*Uncinula necator*)；穀草類 (例えば、コムギ、オオムギ、ライムギ)、芝生及びその他の宿主のコクリオボルス (*Cochliobolus*) 種、ヘルミントスポリウム (*Helminthosporium*) 種、ドレクスレラ (*D*

40

50

rechslera)種〔ピレノホーラ(Pyrenophora)種〕、リンコスポリウム(Rhynchosporium)種、マイコスファエレラ・グラミニコラ(Mycosphaerella graminicola) (葉枯病原菌(Septoria tritici)) 及びファエオスファエリア・ノドラム(Phaeosphaeria nodorum) (スタゴノスポラ・ノドラム(Stagonospora nodorum) 又はふ枯病原菌(Septoria nodorum))、眼紋病原菌(Pseudocercospora herpotrichoides) 及び立枯病原菌(Gaeumannomyces graminis)；落花生の褐斑病原菌(Cercospora arachidicola)及び黒斑病原菌(Cercosporidium personatum)並びにその他の宿主、例えば、サトウダイコン、バナナ、ダイズ及び稲のその他のセルコスポラ(Cercospora)種；トマト、イチゴ、野菜類、ブドウ及びその他の宿主の灰色カビ病原菌(Botrytis cinerea)並びにその他の宿主のその他のボトリチス(Botrytis)種；野菜類(例えば、ニンジン)、セイヨウアブラナ、リンゴ、トマト、ジャガイモ、穀草類(例えば、コムギ)及びその他の宿主のアルタナリア(Alternaria)種；リンゴ、ナシ、核果、木の実及びその他の宿主の黒星病原菌(Venturia)種 (例えば、リンゴ黒星病原菌(Venturia inaequalis))；一連の宿主 例えば穀草類(例えば、コムギ)及びトマトのクラドスポリウム(Cladosporium)種；核果、木の実及びその他の宿主のモニリニア(Monilinia)種；トマト、芝生、コムギ、ウリ科植物及びその他の宿主のジダイメラ(Didymella)種；セイヨウアブラナ、芝生、稲、ジャガイモ、コムギ及びその他の宿主のホーマ(Phoma)種；コムギ、木材及びその他の宿主のアスペルギルス(Aspergillus)種及びアウレオバシジウム(Aureobasidium)種；エンドウ、コムギ、オオムギ及びその他の宿主の輪紋病原菌 (Ascochyta)種；リンゴ、ナシ、タマネギ及びその他の宿主の斑点病原菌(Stemphylium)種(斑点病菌(Pleospora)種)；リンゴ及びナシの夏季の病気(summer diseases)〔例えば、炭疽病原菌(Glomerella cingulata)、黒腐病原菌(Botryosphaeria obtusa)、黒点病原菌 (Mycosphaerella pomi)、赤星病原菌(Gymnosporangium juniperi-virginianae)、すす斑病原菌(Gloeodes pomigena)、すす点病原菌(Schizothyrium pomi) 及び胴腐病原菌(Botryosphaeria dothidea)〕；ブドウのべと病(Plasmopara viticola)；その他のべと病、例えばレタスのべと病原菌(Bremia lactucae)、ダイズ、タバコ、タマネギ及びその他の宿主のべと病原菌(Peronospora)種、ホップのべと病原菌(Pseudoperonospora humuli)並びにウリ科植物のべと病原菌(Pseudoperonospora cubensis)；芝生及びその他の宿主のフハイカビ(Pythium)病原菌 (例えば、苗腐敗病原菌(Pythium ultimum))；ジャガイモ及びトマトの疫病原菌(Phytophthora infestans) 並びに野菜類、イチゴ、アボカド、コショウ、観賞植物、タバコ、カカオ及びその他の宿主のその他の疫病原菌(Phytophthora)種；稲及び芝生の葉腐病原菌(Thanatephorus cucumeris)並びに種々の宿主、例えば、コムギ、オオムギ、落花生、野菜類、ワタ及び芝生のリゾクトニア菌(Rhizoctonia)種；芝生、落花生、ジャガイモ、セイヨウアブラナ及びその他の宿主の菌核病菌(Sclerotinia)種；芝生、落花生及びその他の宿主のスクレロチウム菌(Sclerotium)種；イネの馬鹿苗病(Gibberella fujikuroi)；一連の宿主、例えば、芝生、コーヒー及び野菜類のコレトリチウム(Colletotrichum)種；芝生のラエチサリア・フキホルミス(Laetisaria fuciformis)；バナナ、落花生、柑橘類、ペカン、パパイヤ及びその他の宿主の(Mycosphaerella)菌種；柑橘類、ダイズ、メロン、ナシ、ルピナス及びその他の宿主のジアポルテ(Diaporthe)菌種；柑橘類、ブドウ、オリーブ、ペカン、バラ及びその他の宿主のエリシノエ(Elsinoe)菌種；一連の宿主、例えば、ホップ、ジャガイモ及びトマトのバーティシリウム病菌(Verticillium)種；セイヨウアブラナ及びその他の宿主のピレノペジザ(Pyrenopeziza)種；立枯れ病(vascular streak dieback)を引き起こすココアのオンコバシジウム・テオブロマエ(Oncobasidium theobromae)；種々の宿主、特にコムギ、オオムギ、芝生及びトウモロコシのフザリウム(Fusarium)種、Typhula種、紅色雪腐病菌(Microdochium nivale)、クロボ菌(Ustilago)種、Urocystis種、チレチア菌(Tilletia)種及び麦角病菌(Claviceps purpurea)；サトウダイコン、オオムギ及びその他の宿主のラムラリア(Ramularia)種；特に果物の収穫後の病気〔例えば、柑橘類の緑かび病原菌(Penicillium digitatum)、青かび病原菌(Penicillium italicum) 及び立枯れ病原菌(Trichoderma viride)、バナナの輪腐病原菌(Colletotrichum musae) 及び炭疽病原菌(Gloeosporium musarum)並びにブドウの灰色カビ病原菌(Botrytis cinerea)〕；ブドウのその他の病原菌、特にEutypa lata、黒腐病原菌(Guig

nardia bidwellii)、卒中病原菌(Phellinus igniarius)、つる割病原菌(Phomopsis viticola)、シュードペジザ・トレケイフィラ(Pseudopeziza tracheiphila)及びステレウム・ヒルスタム(Stereum hirsutum)；樹木すなわち木材のその他の病原菌(例えば、ロフォデルミウム・セジチオサム(Lophodermium seditiosum))、特にセファロアスクス・フラグランス(Cephaloascus fragrans)、ケラトシスチス(Ceratocystis)種、オフィオストーマ・ピケアエ(Ophiostoma piceae)、ペニシリウム(Penicillium)種、トリコデルマ・プソイドコンギー(Trichoderma pseudokoningii)、トリコデルマ・ビリデ(Trichoderma viride)、トリコデルマ・ハルチアナム(Trichoderma harzianum)、アルペルギルス・ニガー(Aspergillus niger)、レプトグラフィウム・リンドベルギ(Leptographium lindbergi)及びオーレオバシジウム・プルランス(Aureobasidium pullulans)；並びにウイルス病の菌ベクター(例えば、オオムギ黄色モザイクウイルス(BYMV)のベクターとしての穀草類のポリミキサ・グラミニス(Polymyxa graminis)及びリゾマニア(rhizomania)のベクターとしてのサトウダイコンのポリミキシ・ベタエ(Polymyxa betae))。

10

【0178】

式(1)の化合物は、1又は複数の真菌類に対して活性であるべき植物組織において求項的に、求基的に又は局所的に移動し得る。また、式(1)の化合物は、植物上の1又は複数の真菌類に対して蒸気相中で活性であるのに十分なほど揮発性であってもよい。

【0179】

従って、本発明は、病原性真菌を駆除又は防除する方法であって、殺真菌的に有効量の一般式(1)の化合物を、植物、植物の種子、植物の現場あるいは土壌又は任意の植物生育培地、例えば栄養溶液に対し散布することを含んで成る方法、を提供する。

20

【0180】

用語「植物」は、本明細書で使用する場合、苗、低木及び高木を包含する。また、本発明の殺真菌法は、保護処理、治療処理、全身処理、撲滅処理及び孢子形成阻害処理を含む。

【0181】

式(1)の化合物は、好ましくは、農業用途、園芸用途及び芝草用途に組成物の形態で使用される。

【0182】

式(1)の化合物を植物、植物の種子、前記植物又は種子の現場あるいは土壌又は任意の植物生育培地に散布するために、式(1)の化合物は、式(1)の化合物に加え、適当な不活性希釈剤又は担体と、任意に、表面活性剤(SFA)とを含有する組成物に製剤化される。SFA類は、界面張力を下げることによって界面(例えば、液体／固体、液体／空気又は液体／液体の界面)の性質を変えることができ、それによってその他の性質(例えば、分散、乳化、湿潤)に変化をもたらすことができる化学物質である。全ての組成物(固形製剤及び液状製剤の両方)は式(1)の化合物を重量で0.0001～95%、さらに好ましくは1～85%、例えば5～60%を含有することが好ましい。組成物は、一般に式(1)の化合物を1ヘクタール当たり0.1g～10kg、好ましくは1ヘクタール当たり1g～6kg、さらに好ましくは1ヘクタール当たり1g～1kgの量で散布されるように真菌類の防除に使用される。

30

40

【0183】

種子のドレッシングに使用する場合には、式(1)の化合物は、種子1kg当たり0.0001g～10g(例えば、0.001g又は0.05g)、好ましくは0.005g～10g、さらに好ましくは0.005g～4gの量で散布される。

【0184】

別の側面において、本発明は、殺真菌性の組成物であって、殺真菌的に有効量の式(1)の化合物及び適当な担体又はそれらの希釈剤を含んで成る組成物を提供する。

【0185】

更に他の側面において、本発明は、ある現場の真菌を駆除し且つ防除する方法であって、当該真菌、又は当該真菌の現場を、式(1)の化合物を含んで成る殺真菌的に有効量の

50

組成物で処理することを含んで成る方法、を提供する。

【0186】

前記組成物は、多数の製剤の型、例えば粉剤(DP)、水溶剤(SP)、水溶性顆粒剤(SG)、水和性顆粒剤(WG)、水和剤(WP)、粒剤(GR)(徐放性又は速放性)、可溶性濃縮物(SL)、油混和性液剤(OL)、微量液剤(UL)、乳剤(EC)、分散性濃縮物(DC)、エマルジョン(水中油型(EW)及び油中水型(EO)の両方)、マイクロエマルジョン(ME)、フロアブル剤(SC)、エアロゾル、燻蒸／燻煙剤、カプセル懸濁剤(CS)及び種子処理製剤の中から選択することができる。いずれの場合においても選択される製剤の型は、想定した特定の目的及び前記の式(1)の化合物の物理的、化学的及び生物学的性質に左右されるであろう。

【0187】

粉剤(DP)は、式(1)の化合物を1又は複数の固形希釈剤(例えば、天然粘土、カオリン、ピロフィライト、ベントナイト、アルミナ、モンモリロナイト、ケイソウ土(kieselguhr)、チョーク、ケイソウ土(diatomaceous earth)、リン酸カルシウム、炭酸カルシウム、炭酸マグネシウム、硫黄、石灰、小麦粉、タルク及びその他の有機及び無機固体担体)と混合し、次いで得られる混合物を微細粉末に機械粉砕することにより製造し得る。

【0188】

水溶剤(SP)は、式(1)の化合物を、1又は複数の水溶性無機塩(例えば、重炭酸ナトリウム、炭酸ナトリウム又は硫酸マグネシウム)又は1又は複数の水溶性有機固体(例えば多糖)と、場合によっては水分散性／溶解性を向上させるための1又は複数の湿潤剤、1又は複数の分散剤あるいはこれらの混合物と混合することにより製造し得る。次いで、得られた混合物を微細粉末に粉砕する。また、同様の組成物を粉砕して水溶性顆粒(SG)を形成することもできる。

【0189】

水和剤(WP)は、式(1)の化合物を、1又は複数の固体希釈剤又は担体と、1又は複数の湿潤剤と、好ましくは1又は複数の分散剤と、場合によっては液体中への分散を促進する1又は複数の懸濁剤とを混合することにより製造し得る。次いで得られた混合物を微細な粉末に粉砕する。また、同様な組成物を造粒して水和性顆粒剤(WG)を形成してもよい。

【0190】

粒剤(GR)は、式(1)の化合物と1又は複数の粉末状固体希釈剤又は担体との混合物を造粒化することにより形成してもよいし、あるいは予備形成したブランク顆粒から、式(1)の化合物(又はその適当な薬剤に溶解した溶液)を多孔質の粒状材料(例えば、軽石、アタパルジャイトクレー、フロー土、ケイソウ土(kieselguhr)、ケイソウ土(diatomaceous earth)又は粉砕したトウモロコシ穂軸)に吸収させるか又は式(1)の化合物(又はその適当な薬剤に溶解した溶液)を硬質芯材(例えば、砂、ケイ酸塩、鉱物質炭酸塩、硫酸塩又はリン酸塩)に吸着させ、必要ならば乾燥させることによって形成してもよい。吸収又は吸着を促進するのに常用される薬剤としては、溶媒(例えば、脂肪族及び芳香族石油溶媒、アルコール、エーテル、ケトン及びエステル)及び粘着剤(例えば、ポリ酢酸ビニル、ポリビニルアルコール、デキストリン、糖及び植物油)が挙げられる。また、別の1又は複数の添加剤を顆粒に含有させてもよい(例えば、乳化剤、湿潤剤又は分散剤)。

【0191】

分散性濃縮物(DC)は、式(1)の化合物を水又は有機溶媒、例えばケトン、アルコール又はグリコールエーテルに溶解することにより製造し得る。これらの溶液は、界面活性剤(例えば、水希釈を向上させるか又は噴霧タンク中での晶出を防止するため)を含有し得る。

【0192】

乳剤(EC)又は水中油エマルジョン(EW)は、式(1)の化合物を、有機溶媒(場合によっては1又は複数の湿潤剤、1又は複数の乳化剤あるいはこれらの混合物を含有する)に溶解することにより製造し得る。ECに使用するのに適した有機溶媒としては、芳香族炭化水素(例えば、SOLVesso 100、SOLVesso 150及びSOLVesso 200(SOLVessoは登録商標である))によって代表されるアルキルベンゼン又はアルキルナフタレン)、ケトン類(例えば、

10

20

30

40

50

シクロヘキサノン又はメチルシクロヘキサノン) 及びアルコール類 (例えば、ベンジルアルコール、フルフリルアルコール又はブタノール)、N-アルキルピロリドン類 (例えば、N-メチルピロリドン又はN-オクチルピロリドン)、脂肪酸のジメチルアミド類 (例えば、 $C_8 \sim C_{10}$ 脂肪酸ジメチルアミド) 及び塩素化炭化水素が挙げられる。EC製品は、水に添加すると自然に乳化して、適当な装置による噴霧散布を可能にするのに十分な安定性を有するエマルジョンを生成し得る。EWの調製には、式(1)の化合物を液体として(室温で液体でない場合には、合理的な温度、典型的には70℃以下で溶融してもよい)あるいは溶解した状態(前記化合物を適当な溶媒に溶解することにより)で得て、次いで得られる液体又は溶液を高剪断下で1又は複数のSFAを含有する水に乳化させてエマルジョンを生成させることを伴う。EWに使用するのに適した溶媒としては、植物油、塩素化炭化水素(例えば、クロロベンゼン)、芳香族溶媒(例えば、アルキルベンゼン又はアルキルナフタレン)及び低い水溶性を有する他の適当な有機溶媒が挙げられる。

10

【0193】

マイクロエマルジョン(ME)は、1又は複数の溶媒と1又は複数のSFAとの配合物を、水と混合して、熱力学的に安定な等張液配合物を製造することにより調製し得る。式(1)の化合物は、最初に水に又は溶媒/SFA配合物に存在させる。MEに使用するのに適した溶媒としては、EC又はEWにおける使用について前記した溶媒が挙げられる。MEは水中油系又は油中水系のいずれであってもよく(どちらの系が存在するかは電導率測定により決定し得る)、しかも水溶性及び油溶性の殺虫剤を同じ配合物に混合するのに適当であり得る。MEはマイクロエマルジョンとして残留させるか又は慣用の水中油型エマルジョンを形成して水に希釈するのに適している。

20

【0194】

フロアブル剤(SC)は、式(1)の化合物の微細不溶性固体粒子の水性又は非水性懸濁物を含有し得る。SCは、式(1)の化合物の固体を適当な媒体中で、場合によっては1又は複数の分散剤と共にボールミル又はビーズミル粉碎して該化合物の微粒子懸濁物を生成させることにより製造し得る。1又は複数の湿潤剤を該組成物に含有させてもよいし、また懸濁剤を含有させて粒子が沈降する速度を低下させてもよい。別法として、式(1)の化合物を乾燥粉碎してもよいし、前記の薬剤を含有する水に添加して所望の最終製品を製造してもよい。

【0195】

エアロゾル製剤は、式(1)の化合物と適当な噴射剤(例えばn-ブタン)とを含有する。また、式(1)の化合物は、適当な媒体(例えば、水又は水混和性液体、例えばn-プロパノール)に溶解又は分散させて非加圧式手動噴霧ポンプに用いる組成物を提供し得る。

30

【0196】

式(1)の化合物は、乾燥状態で火工混合物と混合して、密閉空間中で当該化合物を含有する煙を発生させるのに適した組成物を形成し得る。

【0197】

カプセル懸濁剤(CS)は、EW製剤の製造と同様にして調製し得るが、油滴の水性分散物が得られるように追加の重合工程を用いる。該水性分散物中で各々の油滴はポリマー製シェル(shell)によってカプセル化されており、且つ式(1)の化合物と、任意に担体又はそれらの希釈剤とを含有する。ポリマー製シェルは、界面重縮合反応によるか又はコアセルベーション法により製造し得る。当該組成物は式(1)の化合物の制御された放出を提供することができ、これは種子の処理に使用され得る。式(1)の化合物はまた、生分解性のポリマー製マトリックスに配合して当該化合物の緩やかな制御された放出を提供し得る。

40

【0198】

組成物は、(例えば、表面の湿潤性、保持力又は分布; 処理した表面の耐雨性; 又は式(1)の化合物の吸収又は移動性を向上させることにより) 当該組成物の生物学的性能を向上させるために1又は複数の添加剤を含有し得る。かかる添加剤としては、界面活性剤

50

、油基剤の噴霧添加剤、例えば、ある種の鉱物油又は天然植物油(例えば、ダイズ油及びナタネ油)、及びこれらと別の生体機能強化補助剤(式(1)の化合物の作用を促進するか改質し得る成分)との混合物がある。

【0199】

式(1)の化合物はまた、種子処理剤として、例えば粉末組成物、例えば乾燥種子処理用粉末(DS)、水溶性粉末(SS)又はスラリー処理用の水分散性粉末(WS)として製剤化してもよいし、あるいは液体組成物、例えば流動性濃縮物(FS)、液剤(LS)又はカプセル懸濁物(CS)として使用するために製剤してもよい。DS、SS、WS、FS及びLS組成物の製造は、それぞれ前記したDP、SP、WP、SC及びDC組成物の製造と極めて似ている。種子処理用の組成物は、種子に対する該組成物の付着を促進する薬剤(例えば、鉱物油又は皮膜形成性遮断剤)を含有し得る。

10

【0200】

湿潤剤、分散剤及び乳化剤は、陽イオン性、陰イオン性、両親媒性又は非イオン性の界面活性剤(SFA)であり得る。

【0201】

陽イオン性の適当なSFAとしては、第四級アンモニウム化合物(例えばセチルトリメチルアンモニウムブロミド)、イミダゾリン類及びアミン塩が挙げられる。

【0202】

適当な陰イオン性SFAとしては、脂肪酸のアルカリ金属塩、硫酸の脂肪族モノエステルの塩(例えば、ラウリル硫酸ナトリウム)、スルホン化芳香族化合物の塩(例えば、ドデシルベンゼンスルホン酸ナトリウム、ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム、ブチルナフタレンスルホン酸塩、及びジイソプロピルナフタレンスルホン酸塩とトリイソプロピルナフタレンスルホン酸塩との混合物)、エーテル硫酸、アルコールエーテルサルフェート(例えばラウレス-3-硫酸ナトリウム)、エーテルカルボキシレート(例えばラウレス-3-カルボン酸ナトリウム)、リン酸エステル(1又は複数の脂肪アルコールと、リン酸との反応による生成物(主としてモノエステル)又は五酸化リンとの反応による生成物(主としてジエステル)、例えばラウリルアルコールとテトラリン酸との反応による生成物;更にこれらの生成物はエトキシ化してもよい)、スルホコハク酸エステル、パラフィン又はオレフィンスルホネート、タウレート及びリグノスルホネートが挙げられる。

20

【0203】

両親媒性の適当なSFAとしては、ベタイン、プロピオネート及びグリシネートが挙げられる。

30

【0204】

非イオン性の適当なSFAとしては、アルキレンオキシド、例えばエチレンオキシド、プロピレンオキシド、ブチレンオキシド又はこれらの混合物と脂肪アルコール(例えば、オレイルアルコール又はセチルアルコール)との縮合生成物又はアルキルフェノール(例えば、オクチルフェノール、ノニルフェノール又はオクチルクレゾール)との縮合生成物;長鎖脂肪酸又はヘキシトール無水物から誘導した部分エステル;前記部分エステルとエチレンオキシドとの縮合生成物;ブロックポリマー(エチレンオキシド及びプロピレンオキシドを含有する);アルカノールアミド;単純エステル(例えば、脂肪酸ポリエチレングリコールエステル);アミンオキシド(例えば、ラウリルジメチルアミンオキシド);及びレシチンが挙げられる。

40

【0205】

適当な懸濁剤としては、親水性コロイド(例えば、多糖、ポリビニルピロリドン又はカルボキシメチルセルロースナトリウム)及び膨潤性粘土(例えば、ベントナイト又はアタパルジャイト)が挙げられる。

【0206】

式(1)の化合物は、殺虫性(pesticidal)又は殺カビ性化合物を散布するする既知の手段で散布され得る。例えば、式(1)の化合物は、製剤化するか又は製剤化せずに、植物のあらゆる部分、例えば葉、茎、枝又は根に、播種する前の種子に又は植物が生育してい

50

るか又は植物を植えようとするその他の媒体（例えば、根を取り巻く土壌、一般的には土壌、水田又は水耕栽培系）に直接散布してもよいし、あるいは土壌又は水性環境に噴霧してもよいし、散粉してもよいし、浸漬により散布してもよいし、クリーム又はペースト製剤として散布してもよいし、蒸気として散布してもよいし、又は組成物（例えば、粒剤組成物又は水溶性包装製剤に充填した組成物）の分布又は配合によって散布してもよい。

【0207】

式（1）の化合物は、植物中に注入してもよいし又は電動噴霧法もしくは他の少量法を用いて植物部分に噴霧してもよいし、あるいは土壌又は空中散水装置(land or irrigation system)により散布してもよい。

【0208】

水性調製物（水溶液又は分散液）として用いる組成物は、一般に有効成分を高い割合で含有する濃縮物の形で供給され、当該濃縮物は使用前に水に添加される。これらの濃縮物としてはDC、SC、EC、EW、ME、SG、SP、WP、WG及びCSを挙げることができ、これらの濃縮物は長期間の貯蔵に耐えることが必要である場合が多く、しかもかかる貯蔵後に水に添加してこれらを慣用の噴霧装置で施用できるのに十分な時間均質である水性調製物を形成することが必要である場合が多い。かかる水性調製物は、使用されるべき目的に応じて式（1）の化合物を種々の量（例えば、0.0001～10重量%）で含有し得る。

【0209】

式（1）の化合物は、肥料（例えば、窒、カリ又はリン含有肥料）と混合して使用してもよい。適当な製剤の型には、肥料の粒剤が含まれる。当該混合物は、適当には、式（1）の化合物を最大で25重量%含有する。

【0210】

従って、本発明はまた、肥料と式（1）の化合物とを含んで成る肥料組成物を提供する。

【0211】

本発明の組成物は、生物学的活性を有する別の化合物、例えば微量栄養剤を含有してもよいし、あるいは同様の活性もしくは補完的殺真菌活性を有する化合物かあるいは植物生育制御活性、除草活性、殺虫活性、殺線虫活性又は殺ダニ活性を有する化合物を含有してもよい。

【0212】

別の殺菌剤を含有することにより、得られる組成物は、式（1）の化合物単独の場合よりも広い範囲の活性又は大きな個有の活性を有し得る。また、別の殺菌剤は式（1）の化合物の殺菌活性に対して相乗効果を有し得る。

【0213】

式（1）の化合物は、前記組成物の唯一の有効成分であってもよいし又は適当な場合には1又は複数の追加の有効成分、例えば、殺虫剤、殺菌剤、共力剤、除草剤又は植物生育制御剤と混合されていてもよい。追加の有効成分は、散布される場所でさらに広い活性スペクトルを有するか又は高められた持続性を有する組成物を提供することがあり；前記の式（1）の化合物の活性に相乗作用を与えるか又は該活性を（例えば、効果の速度を高めるか又は忌避性を克服することによって）補足することがあり；あるいは個々の成分の抵抗性の発生を克服するか又は防止することを促進することがある。具体的な追加の有効成分は、組成物の所定の用途に依存するであろう。

【0214】

本発明の組成物に含まれうる殺真菌性の化合物の例は、AC382042（N-(1-シアノ-1,2-ジメチルプロピル)-2-(2,4-ジクロロフェノキシ)プロピオンアミド）、アシベンゾラルーS-メチル、アラニカルブ、アルジモルフ、アニラジン、アザコナゾール、アザフェニジン、アゾキシストロビン、ベナラキシル、ベノミル、ベンチアバリカルブ、ビロキサゾール、ピテルタノール、ブラストサイジンS、ボスカリド（ニコビフェン(nicobifen)の新しい名前）、ブロムコナゾール、ブプリメート、カプタホール、キャプタン、カルベンダジム、カルベンダジム塩酸塩、カルボキシシン、カルプロパミド、カルボン、CGA41396、CGA4

10

20

30

40

50

1397、キノメチオネート、クロルベンゾチアゾン(chlorbenzthiazone)、クロロタロニル、クロゾリネート、クロジラコン、銅含有化合物、例えばオキシ塩化銅、オキシキノリン銅、硫酸銅、銅タレート(copper tallate)、及びボルドー液、シアミダゾスルファミド(cyamidazosulfamid)、シアゾファミド(IKF-916)、シフルフェナミド、シモキサニル、シプロコナゾール、シプロジニル、デバカルブ、ジ-2-ピリジル-ジスルフィド-1,1'-ジオキシド、ジクロフルアニド、ジクロシメット、ジクロメジン、ジクロラン、ジエトフェンカルブ、ジフェンコナゾール、ジフェンゾコート、ジフルメトリン、0,0-ジイソプロピル-S-ベンジル-チオホスフェート、ジメフルアゾール、ジメトコナゾール、ジメチリモール、ジメトモルフ、ジモキシストロビン、ジニコナゾール、ジノカップ、ジチアノン、ドデシルジメチルアンモニウムクロリド、ドデモルフ、ドジン、ドグアジン、エジフェンホス、エポキシコナゾール、エタボキサム、エチリモール、エチル(Z)-N-ベンジル-N([メチル(メチルチオエチリデンアミノオキシカルボニル)アミノ]チオ)-β-アラニナート、エトリジアゾール、ファモキサドン、フェナミドン、フェナリモール、フェンブコナゾール、フェンフラム、フェンヘキサミド、フェノキサニル(AC382042)、フェンピクロニル、フェンプロピジン、フェンプロピモルフ、酢酸フェンチン、水酸化フェンチン、ファーバム、フェリムゾン、フルアジナム、フルジオキソニル、フルメトオーバー(flumetover)、フルモルフ(flumorph)、フルオロイミド、フルオキサストロビン、フルキンコナゾール、フルシラゾール、フルトラニル、フルスルファミド、フルトリアホール、フォルペット、フォセチルーアルミニウム、フベリダゾール、フララキシル、フラメトピル、グアザチン、ヘキサコナゾール、ヒドロキシイソキサゾール、ヒメキサゾール、イマザリル、イミベンコナゾール、イミノクタジン、イミノクタジン三酢酸塩、イブコナゾール、イプロベンホス、イプロジオン、イプロバリカルブ、イソプロパニルブチルカルバメート、イソプロチオラン、カスガマイシン、クレソキシムメチル、LY186054、LY211795、LY248908、マンコゼブ、マネブ、メフェノキサム、メパニピリム、メプロニル、メタラキシル、メタラキシルM、メトコナゾール、メチラム、メチラム-亜鉛、メトミノストロビン、メトラフェノン、MON65500(N-アリル-4,5-ジメチル-2-トリメチルシリルチオフェン-3-カルボキサミド)、マイクロブタニル、NTN0301、ネオアソジン、ジチルジチオカルバミン酸ニッケル、ニトロタル・イソプロピル、ヌアリモール、オフレース、有機水銀化合物、オリザストロビン、オキサジキシル、オキサスルフロ(登録商標)、オキシリン酸、オキソポコナゾール、オキシカルボキシン、ペフラゾエート、ペンコナゾール、ペンシクロン、フェナジンオキシド、亜リン酸、フサライド、ピコシキストロビン、ポリオキシシンD、ポリラム、プロベナゾール、プロクロラズ、プロシミドン、プロパモカルブ、プロパモカルブ塩酸塩、プロピコナゾール、プロピネブ、プロピオン酸、プロキナジド、プロチオコナゾール、ピラクロストロビン、ピラゾホス、ピリフェノックス、ピリメタニル、ピロキロン、ピロキシフル、ピロールニトリン、四級アンモニウム化合物、キノメチオネート、キノキシフェン、キントゼン、シルチオフアム(MON65500)、S-イマザリル、シメコナゾール、シブコナゾール、ペンタクロロフェノールナトリウム、スピロキサミン、ストレプトマイシン、硫黄、テブコナゾール、テクロフタラム、テクナゼン、テトラコナゾール、チアベンダゾール、チフルザミド、2-(チオシアノメチルチオ)ベンゾチアゾール、チオフアネート-メチル、チラム、チアジニル、チミベンコナゾール、トルクロホス-メチル、トリルフルアニド、トリアジメホン、トリアジメノール、トリアズブチル、トリアゾキシド、トリシクラゾール、トリデモルフ、トリフロキシストロビン、トリフルミゾール、トリホリン、トリチコナゾール、バリダマイシンA、バパム、ピンクロゾリン、XRD-563、ジネブ、ゾキサミド及び式

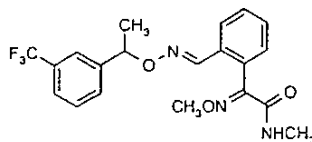
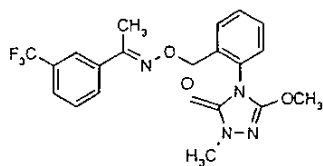
10

20

30

40

【化 2 4】



10

の化合物である。

【0 2 1 5】

式(1)の化合物は、種子媒介性の病気、土壌媒介性の病気又は葉の真菌病から植物を保護するために土壌、泥炭又はその他の発根媒体と混合してもよい。

【0 2 1 6】

幾つかの混合物は、同一の慣用の製剤の型に容易に適さないような著しく異なる物理学的性質、化学的性質又は生物学的性質をもつ有効成分を含有し得る。これらの状況において、別の製剤の型を調製し得る。例えば、一方の有効成分が水不溶性固体であり且つ他方の水不溶性液体である場合には、それにもかかわらず、前記固体成分を（SCの製造法と同様の製造法を使用して）懸濁物として分散させることによって、しかし液体成分を（EWの製造法と同様の製造法を使用して）エマルジョンとして分散させることによって、それぞれの有効成分を同一の連続水性相に分散させることが可能であり得る。得られる組成物はサスポエマルジョン(SE)製剤である。

20

【0 2 1 7】

本発明は以下の実施例により例示され、ここで、以下の略語が使用される：

m l = ミリリットル

D C M = ジクロロメタン

g = グラム

D M F = N, N-ジメチルホルムアミド

p p m = 1 0 0 万分の 1

D M S O = ジメチルスルホキシド

s = シングレット

D M A P = 4-ジメチルアミノピリジン

30

d = ダブルレット

t = トリプレット

E D C = 1-エチル-3-N, N-ジメチ
ミノプロピルカルボジイミド塩酸塩

ルア q = カルテット

m = マルチプレット

N M R = 核磁気共鳴

b = ブロード

H P L C = 高性能液体クロマトグラフィー

f = ファイン

【実施例】

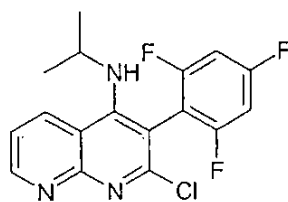
【0 2 1 8】

実施例 1

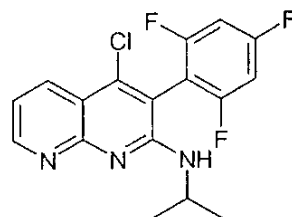
本実施例は、[2-クロロ-3-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)-[1, 8]ナフチリジン-4-イル]-イソプロピルアミン(化合物番号 3、表 1)及び[4-クロロ-3-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)-[1, 8]ナフチリジン-2-イル]-イソプロピルアミン(化合物番号 3、表 6)の調製を例示する。

40

【化 2 5】



化合物番号 3、表 1



化合物番号 3、表 6

10

【0 2 1 9】

段階 1

2-アミノニコチン酸エチルエステル (2.4 g) を乾燥トルエン (50 ml) 中で懸濁した。攪拌した懸濁物に対し、2, 4, 6-トリフルオロフェニルアセチルクロリド (3.0 g) / 乾燥トルエン (20 ml) を添加した。生じた懸濁物を加熱して 8 時間還流した。反応混合物を周囲温度に冷却し、ジエチルエーテル (100 ml) で希釈し、水及び塩水で洗浄し、そして有機層を硫酸マグネシウム上で脱水した。溶媒を蒸発させ、2-[2-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)-アセチルアミノ]-ニコチン酸エチルエステルを黄色い固体として生成せしめた (4.5 g, 93%)。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 1.33 (t, 3H), 4.00 (s, 2H), 4.31 (q, 2H), 6.63 (m, 2H); 7.00 (dd, 1H), 8.25 (dd, 1H), 8.50 (dd, 1H), 10.86 (s, 1H).

【0 2 2 0】

段階 2

段階 1 の産物 (3.0 g) をトルエン (100 ml) に溶解し、そして水素化ナトリウム (1.0 g の 60% 懸濁物 / 鉱油) を少量ずつ添加した。中間反応が起こり、そして混合物を室温で 2 時間、そして 70 °C で 5 時間攪拌した。反応混合物を冷却し、そして蒸発させて白色の固体 (3 g) を生成せしめ、これを次に希塩酸で酸性化した。生じた白色の懸濁物を濾過し、そして回収し、エーテルで洗浄し、そして乾燥させて 3-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)-1H-[1, 8]ナフチリジン-2, 4-ジオン (1.6 g, 62%) を生成せしめた。

^1H NMR (d^6 -DMSO) δ ppm: 7.26 (m, 3H), 8.35 (dd, 1H), 8.59 (dd, 1H), 11.21 (s, 1H), 11.97 (s, 1H).

【0 2 2 1】

段階 3

段階 2 由来の産物 (1.0 g) を少量ずつオキシ塩化リン (18 ml) に攪拌しながら添加した。反応は発熱であった。混合物はよく懸濁することで黄色くなり、そして続いて 3 時間還流された。過剰なオキシ塩化リンを蒸発させ、混合物をジエチルエーテルで希釈し、そして次に、氷水及び塩水で洗浄し、そして有機層を硫酸マグネシウム上で脱水した。溶媒を蒸発させ、2, 4-ジクロロ-3-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)-[1, 8]ナフチリジンを黄色い固体 (1.0 g, 88%) として生成せしめた。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 6.81 (m, 2H), 7.61 (dd, 1H), 8.60 (dd, 1H), 9.17 (dd, 1H).

【0 2 2 2】

段階 4

段階 3 由来の産物 (0.12 g)、イソプロピルアミン (0.3 ml) 及び N-エチル-ジイソプロピルアミン (0.10 g) を密封管中の DMF (8 ml) において 50 °C で

20

30

40

50

17時間還流した。暗色の反応混合物を蒸発させ、油を生成せしめ、これをシリカゲル上でのフラッシュカラムクロマトグラフィー（40-60、酢酸エチル／ヘキサン、1／3）により精製し、[2-クロロ-3-(2,4,6-トリフルオロフェニル)-[1,8]ナフチリジン-4-イル]-イソプロピルアミンを融点193℃の白色の結晶として（0.059g、46%）（¹H NMR (CDCl₃) δ ppm: 1.06 (d, 6H), 3.68 (m, 1H), 4.04 (m, 1H), 6.80 (m, 2H), 7.36 (dd, 1H), 8.28 (dd, 1H), 9.00 (dd, 1H))、そして[4-クロロ-3-(2,4,6-トリフルオロフェニル)-[1,8]ナフチリジン-2-イル]-イソプロピルアミンを融点202℃の黄色の結晶として（0.039g、30%）（¹H NMR (CDCl₃) δ ppm: 1.24 (d, 6H), 4.35 (m, 1H), 4.70 (m, 1H), 6.93 (m, 2H), 7.70 (dd, 1H), 8.38 (dd, 1H), 8.67 (dd, 1H)) 生成せしめた。

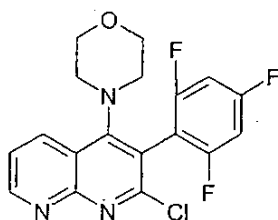
10

【0223】

実施例2

本実施例は、2-クロロ-4-モルホリン-4-イル-3-(2,4,6-トリフルオロフェニル)-[1,8]ナフチリジン（化合物番号20、表1）の調製を例示する。

【化26】



20

【0224】

2,4-ジクロロ-3-(2,4,6-トリフルオロフェニル)-[1,8]ナフチリジン（0.12g、実施例1の段階3由来の産物）及びモルホリン（0.01ml）を密封管中のDMF（8ml）中で、50℃で17時間還流した。暗色の反応混合物を蒸発させて油を生成せしめ、これをシリカゲル上でのフラッシュカラムクロマトグラフィーにより精製し（40-60、酢酸エチル／ヘキサン 1／3）、黄色い蜜として表題の化合物を生成させた（0.087g、63%）。

30

¹H NMR (CDCl₃) δ ppm: 3.34 (m, 2H), 3.62 (m, 2H), 6.90 (m, 2H), 7.43 (dd, 1H), 8.51 (dd, 1H), 9.05 (dd, 1H).

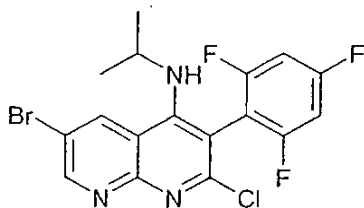
【0225】

実施例3

本実施例は、[6-ブロモ-2-クロロ-3-(2,4,6-トリフルオロフェニル)-[1,8]ナフチリジン-4-イル]-イソプロピルアミン（化合物番号3、表1）の調製を例示する。

40

【化 2 7】



10

【0 2 2 6】

実施例 1 の段階 1 ～ 4 に記載のものと類似の工程を用いて、2-アミノ-5-ブロモニコチン酸エチルエステルから出発して、黄色の結晶としての、融点 202℃の表題の化合物を合成した（41％）。

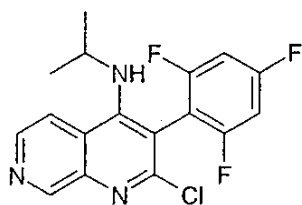
^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 1.36 (d, 6H), 3.94 (m, 1H), 4.25 (m, 1H), 7.06 (m, 2H), 8.64 (d, 1H), 9.25 (d, 1H).

【0 2 2 7】

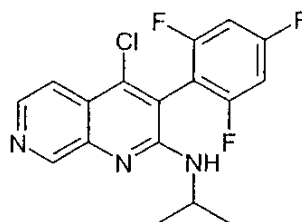
実施例 4

本実施例は、[2-クロロ-3-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)-[1, 7]ナフチリジン-4-イル]-イソプロピルアミン（化合物番号 3、表 2 1）、及び[4-クロロ-3-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)-[1, 7]ナフチリジン-2-イル]-イソプロピルアミン（化合物番号 3、表 1 1 7）の調製を例示する。

【化 2 8】



化合物番号 3、表21



化合物番号 3、表117

【0 2 2 8】

段階 1

3-アミノ-4-ピリジンカルボン酸（5.52 g）をエタノール（300 ml）中で、室温で攪拌しながら懸濁した。1 等量の DMA P（10.0 g）を最初に添加し、そして混合物を 1 時間室温で攪拌して懸濁液を製造した。2 等量の DMA P を添加し、そして懸濁が消失した。EDC（8.0 g）を続いて添加し、そして反応液を室温で 17 時間攪拌した。溶媒を除去して、水溶性の黄色の油を生成せしめた。水性の画分を酢酸エチルで抽出し、塩水で洗浄し、そして硫酸マグネシウム上で脱水した。溶媒の蒸発後、スラッジ（16.2 g）が得られ、これをシリカゲル（40-60）のプラグを通過させ、これを酢酸エチルで抽出し、黄色の油を生成せしめ（4.5 g）、これは NMR により所望の産物とエチル 3-アミノ-4-ピリジンカルボキシラートの 2：1 の比率のものであり、D

50

M A Pを有しており、そしてこれを更に精製することなく次の反応に使用した。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 1.4 (t, 3H), 4.4 (q, 2H), 5.8 (bs, 2H), 7.6 (d, 1H), 7.95 (d, 1H), 8.2 (s, 1H).

【0229】

段階2

段階1由来の粗製のエステル(4.5 g)を乾燥DCM(30 ml)中に溶解し、そして次にピリジン(5.0 ml)を添加して暗褐色の溶液を生成せしめた。攪拌された溶液を氷浴内で冷却し、そして2, 4, 6-トリフルオロフェニルアセチルクロリド(3.1 g)／乾燥DCM(20 ml)を1滴ずつ添加した。反応混合物を6時間攪拌し、そして一晩放置した。溶媒を除去して橙色のスラッジを生成せしめ、水を添加し、そして固体を酢酸エチルに溶解させた。有機性の画分を重炭酸ナトリウム溶液、続いて少量の1 M塩酸溶液、その後水で洗浄し、そして硫酸マグネシウムで脱水した。酢酸エチルを蒸発させて固体(6.5 g)を生成せしめ、これをシリカゲル(40-60)上でのフラッシュカラムクロマトグラフィーにより、酢酸エチルで溶出して精製し、エチルー[2-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)-アセチルアミノ]-ピリジン-4-カルボキシラートを黄色の固体として生成させた(3.2 g)。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 1.45 (t, 3H), 3.8 (fd, 2H), 4.45 (q, 2H) 6.75 (t, 2H), 7.8 (d, 2H), 8.45 (d, 2H), 10.0 (s, 1H), 11.0 (s, 1H).

【0230】

段階3

段階2由来の産物(3.0 g)及び炭酸カリウム(1.6 g)を乾燥DMF(100 ml)中で、100℃で3時間攪拌した。反応液を冷却し、そして過剰なDMFを蒸発させて黒色の油を生成せしめた。水(100 ml)を添加し、そして次に酢酸エチルで洗浄した。水性画分を濾過し、そして2 Mの水性の塩酸で中性のpHにまで酸性化し、そして水を蒸発させて固体を生成せしめ、これをメタノールで抽出した。メタノール抽出物を蒸発させ、粗製の2-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)-1H-[1, 7]ナフチリジン-2, 4-ジオンを暗褐色の結晶固体(2.0 g)として生成せしめ、これを更に精製することなく次の反応に使用した。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 6.8 (t, 2H), 7.95 (m, 2H), 8.2 (d, 1H).

【0231】

段階4

段階3の産物(0.4 g)をオキシ塩化リン(5.0 ml)に添加し、そして反応混合物を攪拌しながら85℃に至らせ、そしてその後5時間攪拌した。過剰なオキシ塩化リンを蒸発させ、褐色の油を生成せしめ、これをジエチルエーテル(100 ml)に溶解させ、そして冷水で洗浄した。エーテル層を分離し、硫酸マグネシウム上で脱水し、そして蒸発させてスラッジ(0.150 g)を生成せしめ、これをシリカゲル(40-60)上でのフラッシュカラムクロマトグラフィーにより、ジエチルエーテルで溶出して精製し、油としての2, 4-ジクロロ-3-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)-[1, 7]ナフチリジン(0.10 g)を生成せしめ、これを放置して凝固させた。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 6.9 (t, 2H), 8.05 (d, 1H), 8.8 (d, 1H), 9.5 (s, 1H), M^+ 329

【0232】

段階5

段階4の産物(0.09 g)をDCM(3.0 ml)に溶解し、そしてイソプロピルアミン(1.0 ml)、N-エチル-ジイソプロピルアミン(0.07 g)及びジメチルアセトアミド(1.0 ml)を含有する密封管に移した。容器を密封し、そして穏やかに10時間60℃に加温した。反応液を冷却し、そして蒸発させて油を生成せしめ、これをシリカゲル(40-60)上でのフラッシュカラムクロマトグラフィーにより、ジエチルエーテルで溶出して精製した。2つの異性体が得られた：油としての[2-クロロ-3-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)-[1, 7]ナフチリジン-4-イル]-イソブ

ロピルアミン。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 1.1 (d, 6H), 3.75 (m, 1H), 4.3 (bd, 1H), 6.9 (t, 2H), 7.75 (d, 1H), 8.6 (d, 1H), 9.35 (s, 1H).

【0233】

第二の異性体である [4-クロロ-3-(2,4,6-トリフルオロフェニル)-[1,7]ナフチリジン-2-イル]-イソプロピルアミンは、出発時のジクロロ化合物を含む混合物として得られ、そして再び反応させ、そして上述のようにフラッシュカラムクロマトグラフィーで精製して油としての当該化合物を生成せしめた。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 1.1 (d, 6H), 4.25 (bd, 1H), 4.5 (m, 1H), 6.9 (t, 2H), 7.75 (d, 1H), 8.4 (d, 1H), 9.15 (s, 1H).

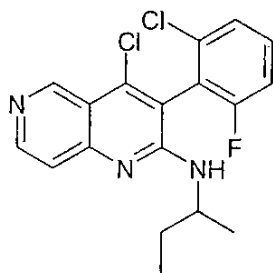
10

【0234】

実施例 5

本実施例は、N-sec-ブチル-4-クロロ-3-(2-クロロ-6-フルオロフェニル)-1,6-ナフチリジン-2-アミン (化合物番号 23、表 126) の調製を例示する。

【化 29】



20

【0235】

段階 1

30

エチル 4-アミノピリジン-3-カルボキシレート (1.5 g) を乾燥トルエン (50 ml) に溶解して浅黄色の溶液を生成せしめ、そして 2-クロロ-6-フルオロフェニルアセチルクロリド (1.87 g) / 乾燥 DCM (13 ml) を添加した。鮮黄色の反応混合物を 95 で 4 時間加熱した。茶色がかった溶液を周囲温度に冷却して、酢酸エチルを添加し、そして混合物を水、塩水、そしてつぎに希塩酸で洗浄し、そして有機層を硫酸マグネシウム上で脱水した。溶媒を蒸発させ褐色の固体を生成せしめ、これをシリカゲル (40-60) 上でのフラッシュカラムクロマトグラフィーにより、1:1 のヘキサン:酢酸エチルで溶出して精製し、純粋なエチル 4-(2-(2-クロロ-6-フルオロフェニル)アセトアミド)-ピリジン-3-カルボキシレートを、融点 114~116 °C の黄色い固体 (1.4 g) として生成させた。

40

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 1.32 (t, 3H), 3.91 (s, 2H), 4.28 (q, 2H), 7.02 (m, 1H), 7.21 (m, 2H), 8.51 (m, 2H), 9.07 (s, 1H), 11.2 (s, 1H).

【0236】

段階 2

段階 1 由来の産物 (1.0 g) を DMF (15 ml) 中に溶解し、そして固体の炭酸カリウム (0.8 g) を添加した。生じた浅黄色の溶液を 100 °C で 4 時間加熱した。反応混合物を冷却し、そして蒸発させて黄色の固体 (3 g) を生成せしめ、これをその後希塩酸で酸性化した。生じた白色の懸濁液を濾過し、そして回収し、エーテルで洗浄し、そして乾燥させて融点 249 °C の 3-(2-クロロ-6-トリフルオロフェニル)-1H-[1,6]ナフチリジン-2,4-ジオン (0.8 g) を生成させた。

50

^1H NMR ($\text{d}^6\text{-DMSO}$) δ ppm: 6.80 (d, 1H), 7.00 (m, 1H), 7.13 (m, 2H), 8.10 (d, 1H), 8.62 (d, 1H), 12.11 (s, 1H).

【0237】

段階3

段階2由来の産物(0.70g)を1,2-ジクロロエタン(15ml)に溶解した。DMF(2ml)及びオキシ塩化リン(2ml)を攪拌しながら添加した。浅黄色の懸濁液を続いて4時間還流した。反応混合物を周囲温度に冷却し、ジエチルエーテルで希釈し、そして次に水で洗浄して鮮黄色の固体として2,4-ジクロロ-3-(2-クロロ-6-フルオロフェニル)-1,6-ナフチリジン(0.38g)を生成させた。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 7.12 (td, 1H), 7.32 (d, 1H), 7.41 (dd, 1H), 7.87 (bs, 1H), 8.88 (bs, 1H) 9.40 (bs, 1H).

【0238】

段階4

段階3由来の産物(0.10g)をDMF(2ml)に溶解させた。sec-ブチルアミン(0.2ml)を添加し、そして混合物を密封管中で70℃で14時間還流した。暗色の反応混合物を蒸発させて油を生成せしめ、これをシリカゲル(40-60)上でのフラッシュカラムクロマトグラフィーにより、1:1の酢酸エチル:ヘキサンで溶出して精製し、鮮黄色のガムとしてのN-sec-ブチル-4-クロロ-3-(2-クロロ-6-フルオロフェニル)-1,6-ナフチリジン-2-アミン(0.08g)を生成させた。

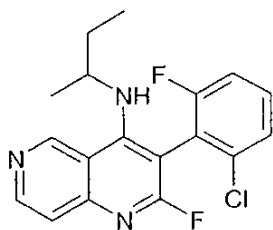
^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 0.08 (m, 3H), 1.10 (t, 3H), 1.48 (m, 2H), 4.18 (m, 1H), 4.28 (m, 1H), 7.10 (m, 1H), 7.36 (t, 1H), 7.40 (m, 1H), 8.52 (d, 1H), 9.20 (s, 1H), 9.30 (s, 1H).

【0239】

実施例6

本実施例は、N-sec-ブチル-3-(2-クロロ-6-フルオロフェニル)-2-フルオロ-1,6-ナフチリジン-4-アミン(化合物番号19221、表103)の調製を例示する。

【化30】



【0240】

段階1

2,4-ジクロロ-3-(2-クロロ-6-フルオロフェニル)-1,6-ナフチリジン(0.20g)をスルホラン(2ml)中に溶解させた。フッ化カリウム(0.11g)を添加し、そして混合物を密封管中で120℃で14時間加熱した。蜜の色をした反応混合物を周囲温度に冷却し、ジエチルエーテルで希釈し、そして次に大規模に水で洗浄した。溶媒の蒸発後、生じた浅黄色の油は、シリカゲル(40-60)上でのフラッシュカラムクロマトグラフィーにより、1:4の酢酸エチル:ヘキサンで溶出して精製し、浅黄色の3-(2-クロロ-6-フルオロフェニル)-2,4-ジフルオロ-1,6-ナフチリジン(0.10g)を生成せしめた。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 7.06 (m, 1H), 7.20 (m, 1H), 7.31 (m, 1H), 8.53 (d, 1H), 9.

20 (d, 1H).

【0241】

段階6

段階1由来の産物(0.10g)をDMF(2ml)に溶解した。sec-ブチルアミン(0.1ml)及びDMA P(0.001g)を添加し、そして混合物を密封管中で周囲温度で18時間攪拌した。褐色の反応混合物をジエチルエーテルで希釈し、塩水で洗浄し、そして硫酸ナトリウム上で脱水した。溶媒の蒸発後、生じた黄色のガムを、シリカゲル(40-60)上でのフラッシュカラムクロマトグラフィーにより、1:3の酢酸エチル:ヘキサンで溶出して精製し、暗黄色の固体としてのN-sec-ブチル-3-(2-クロロ-6-フルオロフェニル)-2-フルオロ-1,6-ナフチリジン-4-アミン(0.06g)を生成させた。

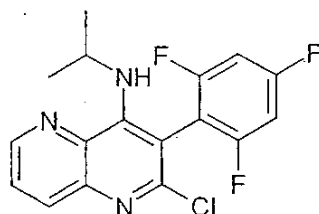
¹H NMR (CDCl₃) δ ppm: 0.082 (m, 3H), 1.20 (m, 3H), 1.34 (m, 2H), 3.02 (m, 1H), 5.08 (m, 1H), 7.10 (d, 1H), 7.28 (m, 1H), 7.38 (m, 1H), 8.58 (d, 1H), 9.20 (s, 1H), 9.30 (s, 1H).

【0242】

実施例7

本実施例は、[2-クロロ-3-(2,4,6-トリフルオロフェニル)-[1,5]ナフチリジン-4-イル]-イソプロピルアミン(化合物番号3、表11)の調製を例示する。

【化31】



【0243】

段階1

3-アミノ-2-ピコリン酸(4.14g)をエタノール(100ml)中、室温で攪拌しながら懸濁した。DMA P(3.7g)を添加し、そして反応液を1時間室温で攪拌した。更に等量のDMA P(3.7g)を添加し、そして懸濁を消失させ、そして次にEDC(5.80g)を添加し、そして反応液を室温で17時間攪拌した。エタノールを蒸発させて暗色の油を生成せしめ、水を添加し、そして混合物を酢酸エチルで抽出し、塩水で洗浄し、そして硫酸マグネシウム上で脱水した。溶媒の蒸発は、エチル3-アミノ-2-ピコリナートを固体として生成せしめ(6.5g)、これはDMA Pと2:1の比率で混合されていた。

¹H NMR (CDCl₃) δ ppm: 1.4 (t, 3H), 4.45 (q, 2H), 5.8 (bs, 2H), 7.05 (d, 1H), 7.2 (dd, 1H), 8.05 (fd, 1H).

【0244】

段階2

段階1由来の粗製産物(6.5g)を乾燥DCM(150ml)に溶解し、そしてトリエチルアミン(5.0ml)を添加して暗褐色の溶液を生成させた。反応液を水槽において攪拌し、そして2,4,6-トリフルオロフェニルアセチルクロリド(8.0g)/乾燥DCM(20ml)を1滴ずつ添加した。混合物を6時間攪拌し、そして18時間放置した。溶媒を蒸発させ橙色のスラッジを生成させ、水を添加し、そして固体を酢酸エチル

に溶解させ、これを重炭酸ナトリウム溶液及び水で洗浄し、そして次に硫酸マグネシウム上で脱水した。酢酸エチルを蒸発させて固体（8.5 g）を生成せしめ、これをシリカゲル（40－60）上でのフラッシュカラムクロマトグラフィーにより酢酸エチルで溶出して固体を生成せしめ、これをジエチルエーテルで粉碎してエチル 3－〔2－（2，4，6－トリフルオロフェニル）－アセチルアミノ〕－ピリジン－2－カルボン酸エチルエステルを白色の固体として生成せしめた（3.0 g）。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm : 1.45 (t, 3H), 3.85 (d, 2H), 4.5 (q, 2H) 6.75 (t, 2H), 7.5 (m, 1H), 8.45 (d, 2H), 9.0 (d, 1H), 11.2 (s, 1H).

【0245】

段階 3

10

段階 2 由来の産物（0.80 g）及び炭酸カリウム（0.40 g）を乾燥 DMF（10 ml）中で、100℃で6時間攪拌した。反応混合物を冷却し、18時間放置し、そして DMF を蒸発させて固体を生成させた。これを水（1 ml）で希釈し、中性に酸性化し、そして水を蒸発させて、これを次にメタノールで抽出した。メタノールを蒸発させ、3－（2，4，6－トリフルオロフェニル）－1H－〔1，5〕ナフチリジン－2，4－ジオンを桃色の固体として生成させ（0.15 g）、これを更に精製することなく使用した。

^1H NMR (CD_3OD) δ ppm: 6.88 (m, 2H), 7.45 (m, 1H), 7.72 (m, 1H), 8.10 (d, 1H).

【0246】

段階 4

20

段階 3 由来の産物（0.20 g）をオキシ塩化リン（5.0 ml）に添加し、そして懸濁液を攪拌し、そして85℃で5時間維持した。オキシ塩化リンを蒸発させ褐色の油を生成させ、これを DCM（100 ml）に溶解し、そして冷水で洗浄した。DCM 層を分離し、硫酸マグネシウム上で脱水し、そして溶媒を蒸発させて2，4－ジクロロ－3－（2，4，6－トリフルオロフェニル）－〔1，5〕ナフチリジンを固体として生成させた（0.070 g）。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 6.9 (t, 2H), 7.9 (m, 1H), 8.5 (d, 1H), 9.2 (bs, 1H).

【0247】

段階 5

30

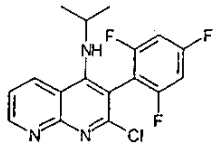
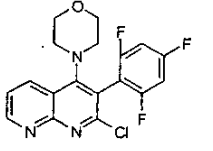
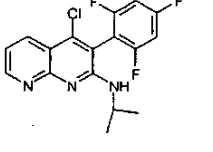
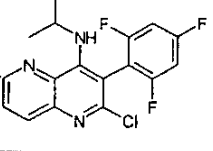
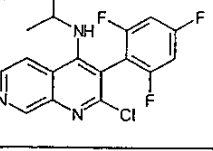
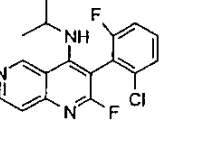
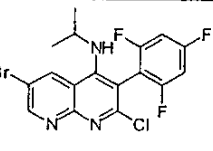
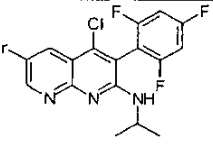
段階 4 由来の産物（0.070 g）をイソプロピルアミン（1.0 ml）に溶解し、密封管中で60℃に2時間加温した。イソプロピルアミンを蒸発させ、そして残渣をシリカゲル（40－60）上でのフラッシュカラムクロマトグラフィーによりジエチルエーテルで溶出して黄色のガムとしての、〔2－クロロ－3－（2，4，6－トリフルオロフェニル）－〔1，5〕ナフチリジン－4－イル〕－イソプロピルアミンを生成させた（0.009 g）。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm : 1.1 (d, 6H), 3.25 (m, 1H), 6.8 (t, 2H), 7.6 (dd, 1H), 8.35 (d, 1H), 8.7 (d, 1H).

【0248】

【化 3 2】

表132

化合物 番号	表番号	化合物構造	NMRデータ（特に断らない限りppm、 CDCl ₃ 中）又はMpt.
3	1		1.06 (d,6H), 3.68 (m,1H), 4.04 (m,1H), 6.80 (m,2H), 7.36 (dd,1H), 8.28 (dd,1H), 9.00 (dd,1H)
20	1		3.34 (m,2H), 3.62 (m,2H), 6.90 (m,2H), 7.43 (dd,1H), 8.51 (dd,1H), 9.05 (dd,1H)
3	6		1.24 (d,6H), 4.35 (m,1H), 4.70 (m,1H), 6.93 (m,2H), 7.70 (dd,1H), 8.38 (dd,1H), 8.67 (dd,1H).
3	11		1.1 (d,6H), 3.25 (m,1H), 6.8 (t,2H), 7.6 (dd,1H), 8.35 (d,1H), 8.7 (d,1H).
3	21		1.1 (d, 6H), 3.75 (m,1H), 4.3 (bd,1H), 6.9 (t,2H), 7.75(d,1H), 8.6 (d,1H), 9.35 (s,1H).
19221	103		0.082(m,3H), 1.20(m,3H), 1.34(m,2H), 3.02(m,1H), 5.08(m,1H), 7.10(d,1H), 7.28(m,1H), 7.38(m,1H), 8.58(d,1H), 9.20(s,1H), 9.30(s,1H).
3	111		1.36 (d,6H), 3.94 (m,1H), 4.25 (m,1H), 7.06 (m,2H), 8.64 (d,1H), 9.25(d, 1H).
3313	111		165-166°C

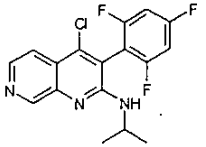
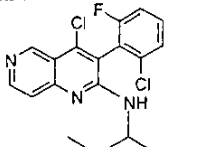
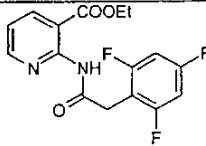
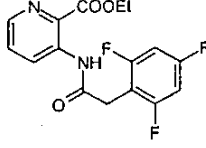
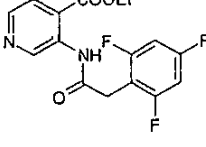
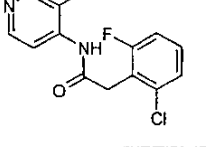
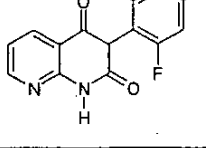
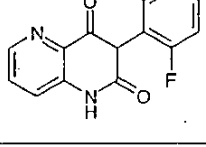
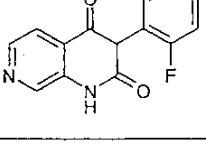
10

20

30

40

【化 3 3】

3	117		1.1 (d,6H), 4.25 (bd,1H), 4.5 (m,1H), 6.9 (t,2H), 7.75 (d,1H), 8.4 (d,1H), 9.15 (s,1H).
23	126		0.08(m,3H), 1.10(t,3H), 1.48(m,2H), 4.18(m,1H), 4.28(m,1H), 7.10(m,1H), 7.36(t,1H), 7.40(m,1H), 8.52(d,1H), 9.20(s,1H), 9.30(s,1H).
1	131		1.33 (t,3H), 4.00 (s,2H), 4.31 (q,2H), 6.63 (m,2H); 7.00 (dd,1H), 8.25 (dd,1H), 8.50 (dd,1H), 10.86 (s,1H).
13	131		1.45 (t,3H), 3.85 (d,2H), 4.5 (q,2H) 6.75 (t,2H), 7.5 (m,1H), 8.45 (d,2H), 9.0 (d,1H), 11.2 (s,1H).
25	131		1.45 (t,3H), 3.8 (fd,2H), 4.45 (q,2H) 6.75 (t,2H), 7.8 (d,2H), 8.45 (d,2H), 10.0 (s,1H), 11.0 (s,1H).
42	131		114-116°C
1	128		7.26 (m,3H), 8.35 (dd,1H), 8.59 (dd,1H), 11.21 (s,1H), 11.97 (s,1H).
13	128		6.88 (m,2H), 7.45 (m,1H), 7.72 (m,1H), 8.10 (d,1H).
25	128		6.8 (t, 2H), 7.95 (m,2H), 8.2 (d,1H).

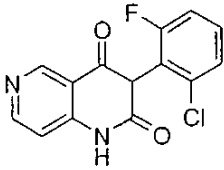
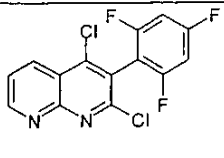
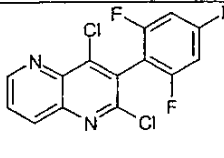
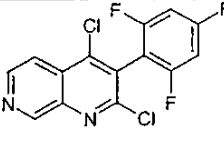
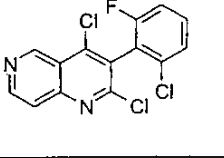
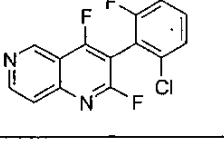
10

20

30

40

【化 3 4】

42	128		249°C
1	129		151-153°C
13	129		6.9 (t,2H), 7.9 (m,1H), 8.5 (d,1H), 9.2 (bs,1H).
25	129		6.9 (t,2H), 8.05 (d,1H), 8.8 (d,1H), 9.5 (s,1H)
42	129		7.12 (td,1H), 7.32 (d,1H), 7.41 (dd,1H), 7.87 (bs,1H), 8.88 (bs,1H) 9.40 (bs,1H).
42	130		7.06 (m,1H), 7.20 (m,1H), 7.31 (m,1H), 8.53 (d,1H), 9.20 (d,1H)

【0249】

実施例 8

本実施例は、一般式（1）の化合物の殺真菌特性を例示する。

【0250】

化合物は、後述する方法によるリーフディスクアッセイにおいて試験した。試験化合物をDMSOに溶解し、そして水で200 ppmに希釈した。

【0251】

エリシフェ・グラミニス (*Erysiphe graminis*) ・ フォルマ・スペシャリス (f. sp.) ・ ホルデイ (hordei) (オオムギうどんこ病) : オオムギ葉断片を24ウェルプレート内の寒天上に置き、試験化合物の溶液でスプレーした。12~24時間、完全に乾燥させた後に、このリーフディスクに菌の孢子懸濁液を接種した。適当なインキュベーション後に、化合物の活性を予防殺菌活性として接種後4日間評価した。

【0252】

エリシフェ・グラミニス (*Erysiphe graminis*) ・ フォルマ・スペシャリス (f. sp.) ・ トリチシ (tritici) (コムギうどんこ病) : コムギ葉断片を24ウェルプレート内の寒天上に置き、試験化合物の溶液でスプレーした。12~24時間、完全に乾燥させた後に、このリーフディスクに菌の孢子懸濁液を接種した。適当なインキュベーション後に、化合物の活性を予防殺菌活性として接種後4日間評価した。

【0253】

プクシニア・レコンディダ (*Puccinia recondita*) ・ フォルマ・スペシャリス (f. sp.) ・ トリチシ (*tritici*) (コムギ褐色さび病 (brown rust)) : コムギ葉断片を24ウェルプレート内の寒天上に置き、試験化合物の溶液でスプレーした。12～24時間、完全に乾燥させた後に、このリーフディスクに菌の孢子懸濁液を接種した。適当なインキュベーション後に、化合物の活性を予防殺菌活性として接種後9日間評価した。

【0254】

ピリキュラリア・オリザエ (*Pyricularia oryzae*) (イネいもち病菌) : イネ葉断片を24ウェルプレート内の寒天上に置き、試験化合物の溶液でスプレーした。12～24時間、完全に乾燥させた後に、このリーフディスクに菌の孢子懸濁液を接種した。適当なインキュベーション後に、化合物の活性を予防殺菌活性として接種後4日間評価した。

10

【0255】

ボトリチス・シネレア (*Botrytis cinerea*) (灰色カビ (grey mould)) : マメリーフディスクを24ウェルプレート内の寒天上に置き、試験化合物の溶液でスプレーした。12～24時間、完全に乾燥させた後に、このリーフディスクに菌の孢子懸濁液を接種した。適当なインキュベーション後に、化合物の活性を予防殺菌活性として接種後4日間評価した。

【0256】

フィトフトラ・インフェスタンス (*Phytophthora infestans*) (ジャガイモまたはトマトの疫病) : トマトリーフディスクを24ウェルプレート内の寒天上に置き、試験化合物の溶液でスプレーした。12～24時間、完全に乾燥させた後に、このリーフディスクに菌の孢子懸濁液を接種した。適当なインキュベーション後に、化合物の活性を予防殺菌活性として接種後4日間評価した。

20

【0257】

プラスモパラ・ビチコーラ (*Plasmopara viticola*) (ブドウのべと病 (downy mildew)) : ブドウリーフディスクを24ウェルプレート内の寒天上に置き、試験化合物の溶液でスプレーした。12～24時間、完全に乾燥させた後に、このリーフディスクに菌の孢子懸濁液を接種した。適当なインキュベーション後に、化合物の活性を予防殺菌活性として接種後7日間評価した。

【0258】

30

以下の化合物は、60%超の疾患の防除を示した。

プラスモパラ・ビチコーラ (*Plasmopara viticola*)、化合物3 (111) ;

フィトフトラ・インフェスタンス (*Phytophthora infestans*)、化合物20 (1) ;

エリシフェ・グラミニス (*Erysiphe graminis* f. sp.) ・ ホルデイ (*hordei*)、化合物3 (1)、20 (1)、3 (111) ;

エリシフェ・グラミニス (*Erysiphe graminis* f. sp.) ・ トリチシ (*tritici*)、化合物3 (1)、3 (11)、3 (21) ;

プクシニア・レコンディダ (*Puccinia recondita* f. sp.) ・ トリチシ (*tritici*)、化合物3 (1)、3 (117) ;

ピリキュラリア・オリザエ (*Pyricularia oryzae*)、化合物3 (1)、20 (1)、3 (21) ;

40

ボトリチス・シネレア (*Botrytis cinerea*)、化合物3 (1)。

フロントページの続き

(74)代理人 100087871

弁理士 福本 積

(74)代理人 100087413

弁理士 古賀 哲次

(74)代理人 100117019

弁理士 渡辺 陽一

(74)代理人 100082898

弁理士 西山 雅也

(72)発明者 クロウリー, パトリック ジェルフ

イギリス国, パークシャー アールジー42 6イーワイ, ブラックネル, ジェロッツ ヒル インターナショナル リサーチ センター, シンジェンタ リミテッド

(72)発明者 ダブラー, マルクス

アメリカ合衆国, マサチューセッツ 02139, ケンブリッジ, マサチューセッツ アベニュー 250, ノバルティス インスティテューツ フォー バイオメディカル リサーチ インコーポレイティド

(72)発明者 ムエラー, ウルス

スイス国, ツェーハー4058 バーゼル, シュバルツバルトアレー 215, シンジェンタ クロップ プロテクション アクチェンゲゼルシャフト

(72)発明者 ウィリアムス, ジョン

イギリス国, パークシャー アールジー42 6イーワイ, ブラックネル, ジェロッツ ヒル インターナショナル リサーチ センター, シンジェンタ リミテッド

審査官 岡山 太一郎

(56)参考文献 特開昭63-174986 (JP, A)

特開平03-086881 (JP, A)

特開平08-507539 (JP, A)

国際公開第02/083676 (WO, A1)

(58)調査した分野(Int.Cl., DB名)

C07D 471/00

A01N 43/00

Caplus/REGISTRY/MEDLINE/EMBASE/BIOSIS(STN)