

(19)日本国特許庁(JP)

(12)公表特許公報(A)

(11)公表番号

特表2023-525349

(P2023-525349A)

(43)公表日 令和5年6月15日(2023.6.15)

(51)国際特許分類	F I	テーマコード(参考)
C 0 7 D 239/30 (2006.01)	C 0 7 D 239/30	4 C 0 6 3
C 0 7 D 253/07 (2006.01)	C 0 7 D 253/07	C S P 4 H 0 1 1
C 0 7 D 239/34 (2006.01)	C 0 7 D 239/34	
C 0 7 D 403/12 (2006.01)	C 0 7 D 403/12	
C 0 7 D 405/12 (2006.01)	C 0 7 D 405/12	
審査請求 未請求 予備審査請求 未請求 (全236頁) 最終頁に続く		

(21)出願番号	特願2022-568980(P2022-568980)	(71)出願人	516245885
(86)(22)出願日	令和3年5月10日(2021.5.10)		バイエル、アクチエンゲゼルシャフト
(85)翻訳文提出日	令和5年1月11日(2023.1.11)		BAYER AKTIENGESELL
(86)国際出願番号	PCT/EP2021/062253		SCHAFT
(87)国際公開番号	WO2021/228734		ドイツ連邦共和国レーパークーゼン、カ
(87)国際公開日	令和3年11月18日(2021.11.18)		イザー - ビルヘルム - アレー、1
(31)優先権主張番号	20174102.2	(74)代理人	100120031
(32)優先日	令和2年5月12日(2020.5.12)		弁理士 宮嶋 学
(33)優先権主張国・地域又は機関	欧州特許庁(EP)	(74)代理人	100126099
			弁理士 反町 洋
(81)指定国・地域	AP(BW,GH,GM,KE,LR,LS,MW,MZ,NA, RW,SD,SL,ST,SZ,TZ,UG,ZM,ZW),EA(AM,AZ,BY,KG,KZ,RU,TJ,TM),EP(AL,A T,BE,BG,CH,CY,CZ,DE,DK,EE,ES,FI,FR ,GB,GR,HR,HU,IE,IS,IT,LT,LU,LV,MC, 最終頁に続く	(72)発明者	ジュリー、ガイスト
			フランス国リヨン、リュ、ブルジェ、2
		(72)発明者	3アー
			シリル、モンターニュ
			フランス国リヨン、リュ、ブルジェ、2
			最終頁に続く

(54)【発明の名称】 殺真菌性化合物としてのトリアジンおよびピリミジン(チオ)アミド化合物

(57)【要約】

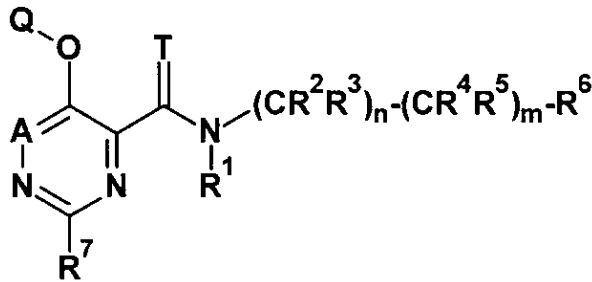
本発明は、トリアジン化合物およびピリミジン(チオ)アミド化合物、それらの調製のためのプロセスおよび中間体、並びに植物病原性真菌などの植物病原性微生物を防除するためのその使用に関する。

## 【特許請求の範囲】

## 【請求項 1】

式 (I) :

## 【化 1】



10

(式中、

A は、窒素 (N) または C - R<sup>8</sup> であって、R<sup>8</sup> は、水素、ハロゲン、シアノ、または C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルであり、

T は、酸素 (O) または硫黄 (S) であり、

n は、0 または 1、

m は、0 または 1、

20

R<sup>1</sup> は、水素、ヒドロキシル、シアノ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシ - C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、- C(=O)R<sup>10</sup>、- C(=O)(OR<sup>11</sup>)、- S(=O)R<sup>12</sup>、- S(=O)<sub>2</sub>R<sup>12</sup>、- C(=O)N(R<sup>13</sup>)<sub>2</sub>、または - S(=O)<sub>2</sub>N(R<sup>14</sup>)<sub>2</sub> であって、

R<sup>10</sup>、R<sup>11</sup>、および R<sup>12</sup> は独立して C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキル、または C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - アルケニルであり、

R<sup>13</sup> および R<sup>14</sup> は独立して水素、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキル、または C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - アルケニルであり、

R<sup>2</sup> および R<sup>3</sup> は独立して水素、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、カルボキシル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシカルボニル、若しくは C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキルであるか、

30

または

R<sup>2</sup> および R<sup>3</sup> は、それらが結合している炭素原子と一緒にあって、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキル環若しくは 3 員 ~ 7 員ヘテロシクリル環を形成し、

R<sup>4</sup> および R<sup>5</sup> は独立して水素、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、カルボキシル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシカルボニル、若しくは C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキルであるか、

または

R<sup>4</sup> および R<sup>5</sup> は、それらが結合している炭素原子と一緒にあって、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキル環若しくは 3 員 ~ 7 員ヘテロシクリル環を形成し、

40

または

R<sup>2</sup> および R<sup>4</sup> は、それらが結合している炭素原子と一緒にあって、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキル環若しくは 3 員 ~ 7 員ヘテロシクリル環を形成し、

並びに

R<sup>3</sup> および R<sup>5</sup> は独立して水素またはハロゲンであり、

または

R<sup>2</sup> および R<sup>4</sup> は一緒に式 \* \* - C(R<sup>3</sup>) = C(R<sup>5</sup>) - # #

(式中、

\* \* は N(R<sup>1</sup>) への結合点であり、

50

## は  $R^6$  への結合点である)の基を形成し、

並びに

$R^3$  および  $R^5$  は独立して水素、ハロゲン、または  $C_1 - C_6$  - アルキルであり、

$R^6$  は、 $C_3 - C_{12}$  - 炭素環、 $C_6 - C_{14}$  - アリール、3員~14員ヘテロシクリル、5員~14員ヘテロアリール、 $C_3 - C_{12}$  - カルボシクリルオキシ、 $C_6 - C_{14}$  - アリールオキシ、5員~14員ヘテロアリールオキシ、3員~14員ヘテロシクリルオキシ、 $C_1 - C_3$  - アルコキシ、または  $C_1 - C_3$  - ハロアルコキシであって、

$C_1 - C_3$  - アルコキシおよび  $C_1 - C_3$  - ハロアルコキシは、 $C_3 - C_{12}$  - 炭素環、 $C_6 - C_{14}$  - アリール、3員~14員ヘテロシクリル、および5員~14員ヘテロアリールからなる群から選択される1個の置換基で独立して置換され、

10

前記  $C_3 - C_{12}$  - 炭素環、 $C_6 - C_{14}$  - アリール、3員~14員ヘテロシクリル、および5員~14員ヘテロアリールは順番に1~4個の  $R^6$  置換基で所望により置換され、

$C_3 - C_{12}$  - 炭素環、 $C_6 - C_{14}$  - アリール、3員~14員ヘテロシクリル、5員~14員ヘテロアリール、 $C_3 - C_{12}$  - カルボシクリルオキシ、 $C_6 - C_{14}$  - アリールオキシ、5員~14員ヘテロアリールオキシ、および3員~14員ヘテロシクリルオキシは1~4個の  $R^6$  置換基で所望により置換され、

$R^6$  は独立してハロゲン、シアノ、イソシアノ、ニトロ、ヒドロキシル、メルカプト、ペンタフルオロスルファニル、オキソ、メチリデン、ハロメチリデン、 $C_1 - C_6$  - アルキル、 $C_1 - C_6$  - ハロアルキル、 $C_1 - C_6$  - アルコキシ、 $C_1 - C_6$  - ハロアルコキシ、 $C_2 - C_6$  - アルケニル、 $C_2 - C_6$  - ハロアルケニル、 $C_2 - C_6$  - アルキニル、 $C_2 - C_6$  - ハロアルキニル、 $C_2 - C_6$  - アルケニルオキシ、 $C_2 - C_6$  - ハロアルケニルオキシ、 $C_1 - C_6$  - アルキルスルファニル、 $C_1 - C_6$  - ハロアルキルスルファニル、 $C_3 - C_8$  - シクロアルキルスルファニル、 $C_1 - C_6$  - アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$  - ハロアルキルスルフィニル、 $C_3 - C_8$  - シクロアルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$  - アルキルスルホニル、 $C_1 - C_6$  - ハロアルキルスルホニル、 $C_3 - C_8$  - シクロアルキルスルホニル、 $C_3 - C_8$  - シクロアルキル、 $C_3 - C_8$  - シクロアルコキシ、 $C_3 - C_8$  - シクロアルケニル、 $C_6 - C_{14}$  - アリール、5員または6員ヘテロアリール、3員~7員ヘテロシクリル、 $-N(R^{15})_2$ 、 $-C(=O)R^{16}$ 、 $-C(=O)(OR^{17})$ 、 $-C(=O)N(R^{18})_2$ 、 $-S(=O)_2N(R^{19})_2$ 、 $-OSi(C_1 - C_6 - アルキル)_3$ 、または  $-Si(C_1 - C_6 - アルキル)_3$  であり、

20

30

前記  $C_1 - C_6$  - アルキル、 $C_1 - C_6$  - ハロアルキル、 $C_1 - C_6$  - アルコキシ、 $C_1 - C_6$  - ハロアルコキシ、 $C_2 - C_6$  - アルケニル、 $C_2 - C_6$  - ハロアルケニル、 $C_2 - C_6$  - アルキニル、 $C_2 - C_6$  - ハロアルキニル、 $C_2 - C_6$  - アルケニルオキシ、 $C_2 - C_6$  - ハロアルケニルオキシ、 $C_1 - C_6$  - アルキルスルファニル、 $C_1 - C_6$  - ハロアルキルスルファニル、 $C_1 - C_6$  - アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$  - ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$  - アルキルスルホニル、 $C_1 - C_6$  - ハロアルキルスルホニル、 $-OSi(C_1 - C_6 - アルキル)_3$ 、および  $-Si(C_1 - C_6 - アルキル)_3$  は、シアノ、ヒドロキシル、 $C_1 - C_6$  - アルコキシ、 $C_1 - C_6$  - ハロアルコキシ、 $-OSi(C_1 - C_6 - アルキル)_3$ 、 $-Si(C_1 - C_6 - アルキル)_3$ 、 $C_3 - C_8$  - シクロアルキル、 $C_3 - C_8$  - ハロシクロアルキル、および3員~7員ヘテロシクリルからなる群から独立して選択される1~3個の置換基でさらに所望により置換され、

40

並びに

前記  $C_3 - C_8$  - シクロアルキルスルファニル、 $C_3 - C_8$  - シクロアルキルスルフィニル、 $C_3 - C_8$  - シクロアルキルスルホニル、 $C_3 - C_8$  - シクロアルキル、 $C_3 - C_8$  - シクロアルコキシ、 $C_3 - C_8$  - シクロアルケニル、 $C_6 - C_{14}$  - アリール、5員または6員ヘテロアリール、および3員~7員ヘテロシクリルは、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、ホルミル、カルボキシル、オキソ、メチリデン、ハロメチリデン、 $C_1 - C_6$  - アルキル、 $C_1 - C_6$  - ハロアルキル、 $C_1 - C_6$  - アルコキシ、 $C_1$

50

- C<sub>6</sub> - ハロアルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシカルボニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルコキシカルボニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - アルケニル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキル、および C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - ハロシクロアルキルからなる群から独立して選択される 1 ~ 4 個の置換基でさらに所望により置換されるか、

または

同一の炭素原子に結合された 2 個の C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル置換基は、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキル環を形成し、

または

2 個の R<sup>65</sup> 置換基は所望によりそれらが結合している炭素原子と一緒にあって C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキル環を形成し、

並びに

R<sup>15</sup> は、水素、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、または C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキルであって、

前記 C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルは、シアノ、ヒドロキシル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルコキシ、-O-Si(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル)<sub>3</sub>、-Si(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル)<sub>3</sub>、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - ハロシクロアルキル、および 3 員 ~ 7 員ヘテロシクリルからなる群から独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基でさらに所望により置換され、

および

前記 C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキルは、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、ホルミル、カルボキシル、オキソ、メチリデン、ハロメチリデン、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシカルボニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルコキシカルボニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - アルケニル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキル、および C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - ハロシクロアルキルからなる群から独立して選択される 1 ~ 4 個の置換基でさらに所望により置換され、

R<sup>16</sup>、R<sup>17</sup>、R<sup>18</sup>、および R<sup>19</sup> は独立して水素、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、または C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキルであって、

前記 C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルまたは C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキルは、シアノ、ヒドロキシル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルコキシ、-O-Si(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル)<sub>3</sub>、-Si(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル)<sub>3</sub>、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - ハロシクロアルキル、および 3 員 ~ 7 員ヘテロシクリルからなる群から独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基でさらに所望により置換され、

R<sup>7</sup> は、水素、ハロゲン、シアノ、イソシアノ、ヒドロキシル、メルカプト、ニトロ、アミノ、ホルミル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ヒドロキシアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルカルボニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキルカルボニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルコキシ、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - アルケニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルケニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - アルキニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - アルケニルオキシ、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルケニルオキシ、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - アルキニルオキシ、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキニルオキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルスルファニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキルスルファニル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキルスルファニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキルスルフィニル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキルスルフィニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルスルホニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキルスルホニル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキルスルホニル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - シクロアルケニル、C<sub>6</sub> - C<sub>14</sub> - アリール、5 員または 6 員ヘテロアリール、3 員 ~ 7 員ヘテロシクリル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルコキシ、C<sub>6</sub> - C<sub>14</sub> - アリールオキシ、5 員または 6 員ヘテロアリールオキシ、3 員 ~ 7 員ヘテロシクリルオキシ、-O-Si(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル)<sub>3</sub>、-Si(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル)<sub>3</sub>、-N(R<sup>20</sup>)<sub>2</sub>、-C(=NR<sup>21</sup>)R<sup>22</sup>、-NR<sup>23</sup>C(=O)R<sup>24</sup>、-C(=O)(OR<sup>25</sup>)、-C(=O)N(R<sup>26</sup>)<sub>2</sub>、-S(=O)<sub>2</sub>N(R<sup>27</sup>)<sub>2</sub>、または -S(=O)(=NR<sup>28</sup>)R<sup>29</sup>であって、

10

20

30

40

50

C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ヒドロキシアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルカルボニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキルカルボニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルコキシ、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - アルケニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルケニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - アルキニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - アルケニルオキシ、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルケニルオキシ、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - アルキニルオキシ、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキニルオキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルスルファニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキルスルファニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキルスルフィニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルスルホニル、およびC<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキルスルホニルは所望により1~3個のR<sup>7S<sup>a</sup></sup>置換基で置換され、

C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキルスルファニル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキルスルフィニル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキルスルホニル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - シクロアルケニル、C<sub>6</sub> - C<sub>14</sub> - アリール、5員または6員ヘテロアリール、3員~7員ヘテロシクリル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルコキシ、C<sub>6</sub> - C<sub>14</sub> - アリールオキシ、5員または6員ヘテロアリールオキシ、および3員~7員ヘテロシクリルオキシは所望により1~3個のR<sup>7S<sup>c</sup></sup>置換基で置換され、

並びに

R<sup>20</sup>は、水素、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシ、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - アルケニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルケニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - アルキニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキニル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - ハロシクロアルキル、C<sub>6</sub> - C<sub>14</sub> - アリール、5員または6員ヘテロアリール、または3員~7員ヘテロシクリルであって、

C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシ、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - アルケニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルケニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - アルキニル、およびC<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキニルは所望により1~3個のR<sup>7S<sup>a</sup></sup>置換基で置換され、

および

C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - ハロシクロアルキル、C<sub>6</sub> - C<sub>14</sub> - アリール、5員または6員ヘテロアリール、および3員~7員ヘテロシクリルは所望により1~3個の置換基R<sup>7S<sup>c</sup></sup>で置換され、

R<sup>21</sup>およびR<sup>22</sup>は独立してヒドロキシル、アミノ、シアノ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシ、モノ - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル)アミノ、またはジ - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル)アミノであって、

C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシ、モノ - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル)アミノ、またはジ - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル)アミノは所望により1~3個のR<sup>7S<sup>a</sup></sup>置換基で置換され、

R<sup>23</sup>、R<sup>24</sup>、R<sup>25</sup>、R<sup>26</sup>、R<sup>27</sup>、R<sup>28</sup>、およびR<sup>29</sup>は独立して水素、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキル、およびC<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキルであって、

C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルおよびC<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキルは所望により1~3個の置換基R<sup>7S<sup>a</sup></sup>で置換され、

および

C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキルは所望により1~3個の置換基R<sup>7S<sup>c</sup></sup>で置換され、

R<sup>7S<sup>a</sup></sup>は独立してシアノ、ヒドロキシル、カルボキシル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルコキシ、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - ハロシクロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシカルボニル、-O-Si(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル)<sub>3</sub>、-Si(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル)<sub>3</sub>、C<sub>6</sub> - C<sub>14</sub> - アリール、または3員~7員ヘテロシクリルであり、

R<sup>7S<sup>c</sup></sup>は独立してハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、ホルミル、オキソ、メチリデン、ハロメチリデン、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルコキシ、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - アルケニル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - ハロシクロアルキル、-O-Si(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキ

10

20

30

40

50

ル) 3、若しくは3員～7員ヘテロシクリルであるか、

または

同一の炭素原子に結合されたC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキルの2個の置換基R<sup>75c</sup>は、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-シクロアルキルを形成し、

Qは、C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>-アリール、C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>-炭素環、3員～14員ヘテロシクリル、または5員～14員ヘテロアリールであって、

C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>-アリール、C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>-炭素環、3員～14員ヘテロシクリル、および5員～14員ヘテロアリールは、ハロゲン、シアノ、イソシアノ、ニトロ、ヒドロキシル、メルカプト、ホルミル、カルボキシル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキルカルボニル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルキルカルボニル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルコキシ-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルコキシカルボニル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルコキシカルボニル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-アルケニル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルケニル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-アルキニル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルキニル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-アルケニルオキシ、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルケニルオキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキルスルファニル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルキルスルファニル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキルスルホニル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルキルスルホニル、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-シクロアルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-シクロアルコキシ、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-シクロアルケニル、3員～7員ヘテロシクリル、5員～14員ヘテロアリール、-O-Si(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル)<sub>3</sub>、-Si(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル)<sub>3</sub>、-O-C(=O)R<sup>33</sup>、-NR<sup>34</sup>C(=O)R<sup>35</sup>、-C(=O)N(R<sup>36</sup>)<sub>2</sub>、C(=S)R<sup>37</sup>、-C(=S)N(R<sup>38</sup>)<sub>2</sub>、-C(=NR<sup>39</sup>)R<sup>40</sup>、-C(=NOR<sup>41</sup>)R<sup>42</sup>、および-N(R<sup>43</sup>)<sub>2</sub>からなる群から独立して選択される1～5個のQ<sup>S</sup>置換基で所望により置換され、

前記C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキルカルボニル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルキルカルボニル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルコキシ-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルコキシカルボニル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルコキシカルボニル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-アルケニル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルケニル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-アルキニル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルキニル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-アルケニルオキシ、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルケニルオキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキルスルファニル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルキルスルファニル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキルスルホニル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルキルスルホニル、-O-Si(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル)<sub>3</sub>、および-Si(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル)<sub>3</sub>は、シアノ、アミノ、ニトロ、ヒドロキシル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルコキシカルボニル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルコキシカルボニル、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-シクロアルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-ハロシクロアルキル、-Si(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル)<sub>3</sub>、および3員～7員ヘテロシクリルからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で所望により置換され、

前記C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-シクロアルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-シクロアルコキシ、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-シクロアルケニル、3員～7員ヘテロシクリル、および5員～14員ヘテロアリールは、ハロゲン、シアノ、アミノ、ニトロ、ヒドロキシル、ホルミル、カルボキシル、オキソ、メチリデン、ハロメチリデン、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルコキシカルボニル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルコキシカルボニル、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-シクロアルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-ハロシクロアルキル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-アルケニル、および3員～7員ヘテロシクリルからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で所望により置換され、

前記C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-シクロアルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-ハロシクロアルキル、および3員～7員ヘテロシクリルは順番にそれらが結合している炭素原子と一緒になってC<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-シクロアルキルを形成する2個の置換基で所望により置換される)の化合物であって、

R<sup>34</sup>、R<sup>35</sup>、R<sup>36</sup>、R<sup>37</sup>、R<sup>38</sup>、R<sup>39</sup>、R<sup>40</sup>、R<sup>41</sup>、およびR<sup>42</sup>は

10

20

30

40

50

独立して水素、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキル、または $C_1 - C_6$ -アルコキシであって、

前記 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキル、および $C_1 - C_6$ -アルコキシは、シアノ、アミノ、ニトロ、ヒドロキシル、 $C_1 - C_6$ -アルコキシ、 $C_1 - C_6$ -ハロアルコキシ、 $C_1 - C_6$ -アルコキシカルボニル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルコキシカルボニル、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル、 $C_3 - C_8$ -ハロシクロアルキル、 $-Si(C_1 - C_6 - \text{アルキル})_3$ 、および3員~7員ヘテロシクリルからなる群から独立して選択される1~3個の置換基で所望により置換され、

並びに

$R^{43}$ は独立して水素、ヒドロキシル、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_6$ -アルコキシ、 $C_2 - C_6$ -アルケニル、 $C_2 - C_6$ -ハロアルケニル、または $C_3 - C_8$ -シクロアルキルであって、

前記 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_6$ -アルコキシ、 $C_2 - C_6$ -アルケニル、および $C_2 - C_6$ -ハロアルケニルは、シアノ、アミノ、ニトロ、ヒドロキシル、 $C_1 - C_6$ -アルコキシ、 $C_1 - C_6$ -ハロアルコキシ、 $C_1 - C_6$ -アルコキシカルボニル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルコキシカルボニル、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル、 $C_3 - C_8$ -ハロシクロアルキル、 $-Si(C_1 - C_6 - \text{アルキル})_3$ 、および3員~7員ヘテロシクリルからなる群から独立して選択される1~3個の置換基で所望により置換され、

前記 $C_3 - C_8$ -シクロアルキルは、ハロゲン、シアノ、アミノ、ニトロ、ヒドロキシル、ホルミル、カルボキシル、オキソ、メチリデン、ハロメチリデン、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_6$ -アルコキシ、 $C_1 - C_6$ -ハロアルコキシ、 $C_1 - C_6$ -アルコキシカルボニル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルコキシカルボニル、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル、 $C_3 - C_8$ -ハロシクロアルキル、 $C_2 - C_6$ -アルケニル、および3員~7員ヘテロシクリルからなる群から独立して選択される1~3個の置換基で所望により置換され、

前記 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル、 $C_3 - C_8$ -ハロシクロアルキル、および3員~7員ヘテロシクリルは順番にそれらが結合している炭素原子と一緒になって $C_3 - C_8$ -シクロアルキルを形成する2個の置換基で所望により置換される)の化合物、

並びにそれらの塩、N-オキシド、並びに前記塩およびN-オキシドの溶媒和物。

#### 【請求項2】

Aは、窒素(N)または $C - R^8$ であって、

$R^8$ は、水素であり、

Tは、酸素(O)であり、

nは、0または1、

mは、0または1、

$R^1$ は、水素、ヒドロキシル、シアノ、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -アルコキシ、 $C_1 - C_6$ -アルコキシ- $C_1 - C_6$ -アルキル、 $-C(=O)R^{10}$ 、または $-C(=O)(OR^{11})$ であって、

$R^{10}$ および $R^{11}$ は独立して $C_1 - C_6$ -アルキルまたは $C_2 - C_6$ -アルケニルであり、

$R^2$ および $R^3$ は独立して水素、ハロゲン、シアノ、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシカルボニル、若しくは $C_3 - C_6$ -シクロアルキルであるか、

または

$R^2$ および $R^3$ は、それらが結合している炭素原子と一緒になって、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキル環を形成し、

$R^4$ および $R^5$ は独立して水素、ハロゲン、ヒドロキシル、 $C_1 - C_6$ -アルキル、若しくは $C_1 - C_6$ -ハロアルキルであるか、

または

10

20

30

40

50

R<sup>4</sup> および R<sup>5</sup> は、それらが結合している炭素原子と一緒にあって、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - シクロアルキル環、オキセタニル環、アゼチジニル環、テトラヒドロフラニル環、ピロリジニル環、若しくはテトラヒドロピラニル環を形成し、

または

R<sup>2</sup> および R<sup>4</sup> は一緒に式  $^{**} - C(R^3) = C(R^5) - \#\#$

(式中、

\*\* は N(R<sup>1</sup>) への結合点であり、

## は R<sup>6</sup> への結合点である) の基を形成し、

および

R<sup>3</sup> および R<sup>5</sup> は独立して水素、ハロゲン、または C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルであり、

R<sup>6</sup> は、インダニル、テトラヒドロナフタレニル、スピロ[シクロプロパン - 1, 2' - インダン]イル、フェニル、ナフチル、ジヒドロベンゾフラニル、クロマニル、イソクロマニル、チオクロマニル、イソチオクロマニル、1, 3 - ベンゾジオキソリル、ジヒドロ - 1, 4 - ベンゾジオキシニル、テトラヒドロベンゾチオフェニル、テトラヒドロベンゾチアゾリル、フラニル、ピラゾリル、チエニル、ピリジニル、ピリミジニル、インドリル、ベンゾオキサゾリル、イミダゾピリジニル、キノリニル、イソキノリニル、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> - アルコキシ、または C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> - ハロアルコキシであって、

C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> - アルコキシおよび C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> - ハロアルコキシは、フェニル、ナフチル、フラニル、ピラゾリル、チエニル、ピリジニル、ピリミジニル、インドリル、ベンゾオキサゾリル、イミダゾピリジニル、キノリニルおよびイソキノリニルからなる群から選択される 1 個の置換基で独立して置換され、

前記フェニル、ナフチル、フラニル、ピラゾリル、チエニル、ピリジニル、ピリミジニル、インドリル、ベンゾオキサゾリル、イミダゾピリジニル、キノリニル、およびイソキノリニルは、1 または 2 個の R<sup>6S</sup> 置換基で順番に所望により置換され、

インダニル、テトラヒドロナフタレニル、スピロ[シクロプロパン - 1, 2' - インダン]イル、フェニル、ナフチル、ジヒドロベンゾフラニル、クロマニル、イソクロマニル、チオクロマニル、イソチオクロマニル、1, 3 - ベンゾジオキソリル、ジヒドロ - 1, 4 - ベンゾジオキシニル、テトラヒドロベンゾチオフェニル、テトラヒドロベンゾチアゾリル、フラニル、ピラゾリル、チエニル、ピリジニル、ピリミジニル、インドリル、ベンゾオキサゾリル、イミダゾピリジニル、キノリニル、およびイソキノリニルは所望により 1 ~ 4 個の R<sup>6S</sup> 置換基で置換され、

R<sup>6S</sup> は独立してハロゲン、シアノ、オキソ、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルコキシ、C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub> - アルケニル、C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルケニル、C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub> - アルキニル、C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルキニル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - シクロアルキル、フェニル、ピラゾリル、イミダゾリル、ピリジニル、オキセタニル、アゼチジニル、テトラヒドロフラニル、ピロリジニル、テトラヒドロピラニル、- C(=O)R<sup>16</sup>、または - C(=O)(OR<sup>17</sup>) であって、

前記 C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルコキシ、C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub> - アルケニル、C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルケニル、C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub> - アルキニル、および C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルキニルは、シアノ、ヒドロキシル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルコキシ、- O - Si(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル)<sub>3</sub>、- Si(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル)<sub>3</sub>、および C<sub>3</sub> - C<sub>4</sub> - シクロアルキルからなる群から独立して選択される 1 または 2 個の置換基でさらに所望により置換され、

および

前記 C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - シクロアルキル、フェニル、ピラゾリル、イミダゾリル、ピリジニル、オキセタニル、アゼチジニル、テトラヒドロフラニル、ピロリジニル、およびテトラヒドロピラニルは、ハロゲン、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルキル、および C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルコキシカルボニルからなる群から独立して選択される 1 または 2 個の置換基でさらに所望により置換され、

10

20

30

40

50



並びに

$R^{16}$  は、 $C_1 - C_4$  - アルキルであり、

$R^{17}$  は、水素または  $C_1 - C_4$  - アルキルであり、

$R^7$  は、ハロゲン、シアノ、メルカプト、 $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_1 - C_4$  - ハロアルキル、 $C_1 - C_4$  - アルキルカルボニル、 $C_1 - C_4$  - ハロアルキルカルボニル、 $C_3 - C_6$  - シクロアルキル、または  $-N(R^{20})_2$  であり、

並びに

$R^{20}$  は、水素または  $C_1 - C_4$  - アルキルであり、

Q は、フェニル、ナフチル、ピシクロ[4.2.0]オクタ-1(6)2,4-トリエニル、インダニル、テトラヒドロナフタレニル、インデニル、ジヒドロナフタレニル、ジヒドロベンゾフラニル、ジヒドロイソベンゾフラニル、インドリニル、1,3-ベンゾジオキサソリル、クロマニル、ジヒドロ-1,4-ベンゾジオキシニル、[1,3]ジオキサソロ[4,5-b]ピリジニル、テトラヒドロキノリニル、ジヒドロ-5H-シクロペンタ[b]ピリジニル、ジヒドロベンゾフラニル、ピロリル、フラニル、チエニル、イミダゾリル、トリアゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、ピリジニル、ピリダジニル、ピリミジニル、インドリル、ベンズイミダゾリル、インダゾリル、ベンゾフラニル、ベンゾチオフェニル、ベンゾチアゾリル、ベンゾオキサゾリル、イソキノリニル、キノリニル、フロピリジニル、チエノチオフェニル、またはチエノチアゾリルであって、

10

フェニル、ナフチル、ピシクロ[4.2.0]オクタ-1(6)2,4-トリエニル、インダニル、テトラヒドロナフタレニル、インデニル、ジヒドロナフタレニル、ジヒドロベンゾフラニル、ジヒドロイソベンゾフラニル、インドリニル、1,3-ベンゾジオキサソリル、クロマニル、ジヒドロ-1,4-ベンゾジオキシニル、[1,3]ジオキサソロ[4,5-b]ピリジニル、テトラヒドロキノリニル、ジヒドロ-5H-シクロペンタ[b]ピリジニル、ジヒドロベンゾフラニル、ピロリル、フラニル、チエニル、イミダゾリル、トリアゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、ピリジニル、ピリダジニル、ピリミジニル、インドリル、ベンズイミダゾリル、インダゾリル、ベンゾフラニル、ベンゾチオフェニル、ベンゾチアゾリル、ベンゾオキサゾリル、イソキノリニル、キノリニル、フロピリジニル、チエノチオフェニル、およびチエノチアゾリルは、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_1 - C_4$  - ハロアルキル、 $C_1 - C_4$  - アルキルカルボニル、 $C_1 - C_4$  - ハロアルキルカルボニル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ、 $C_1 - C_4$  - ハロアルコキシ、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ- $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_2 - C_4$  - アルケニル、 $C_2 - C_4$  - ハロアルケニル、 $C_2 - C_4$  - アルキニル、 $C_2 - C_4$  - ハロアルキニル、 $C_1 - C_4$  - アルキルスルファニル、 $C_1 - C_4$  - ハロアルキルスルファニル、 $C_3 - C_6$  - シクロアルキル、フェニル、ピラゾリル、イミダゾリル、ピリジニル、オキセタニル、アゼチジニル、テトラヒドロフラニル、ピロリジニル、テトラヒドロピラニル、および  $-N(R^4)^3$  からなる群から独立して選択される 1 ~ 3 個の  $Q^S$  置換基で所望により置換され、

20

30

前記  $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_1 - C_4$  - ハロアルキル、 $C_1 - C_4$  - アルキルカルボニル、 $C_1 - C_4$  - ハロアルキルカルボニル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ、 $C_1 - C_4$  - ハロアルコキシ、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ- $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_2 - C_4$  - アルケニル、 $C_2 - C_4$  - ハロアルケニル、 $C_2 - C_4$  - アルキニル、 $C_2 - C_4$  - ハロアルキニル、 $C_1 - C_4$  - アルキルスルファニル、および  $C_1 - C_4$  - ハロアルキルスルファニルは、ヒドロキシル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ、および  $C_1 - C_4$  - ハロアルコキシからなる群から独立して選択される 1 または 2 個の置換基で所望により置換され、

40

前記  $C_3 - C_6$  - シクロアルキル、フェニル、ピラゾリル、イミダゾリル、ピリジニル、オキセタニル、アゼチジニル、テトラヒドロフラニル、ピロリジニル、およびテトラヒドロピラニルは、ハロゲン、 $C_1 - C_4$  - アルキル、および  $C_1 - C_4$  - ハロアルキルからなる群から独立して選択される 1 または 2 個の置換基で所望により置換され、

並びに

$R^{43}$  は独立して水素または  $C_1 - C_4$  - アルキルである、請求項 1 に記載の式 (I) の化合物、

50

並びにそれらの塩、N - オキシド、並びに前記塩およびN - オキシドの溶媒和物。

【請求項3】

Aは、窒素(N)またはC - R<sup>8</sup>であって、

R<sup>8</sup>は、水素であり、

Tは、酸素(O)であり、

nは、0または1、

mは、0または1、

R<sup>1</sup>は、水素、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルコキシ、または - C(=O)R<sup>10</sup>であり、

R<sup>10</sup>は、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルであり、

R<sup>2</sup>およびR<sup>3</sup>は、水素であり、

R<sup>4</sup>およびR<sup>5</sup>は独立して水素、ハロゲン、またはC<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルであり、

または

R<sup>4</sup>およびR<sup>5</sup>は、それらが結合している炭素原子と一緒にシクロプロピル環、シクロブチル環、またはオキセタニル環を形成し、

または

R<sup>2</sup>およびR<sup>4</sup>は一緒に式 \* \* - C(R<sup>3</sup>) = C(R<sup>5</sup>) - # #

(式中、

\* \* はN(R<sup>1</sup>)への結合点であり、

# # はR<sup>6</sup>への結合点である)の基を形成し、

および

R<sup>3</sup>およびR<sup>5</sup>は独立して水素、フルオロ、クロロ、またはメチルであり、

R<sup>6</sup>は、インダニル、テトラヒドロナフタレニル、スピロ[シクロプロパン - 1, 2' - インダン]イル、フェニル、ナフチル、ジヒドロベンゾフラニル、クロマニル、イソクロマニル、チオクロマニル、イソチオクロマニル、テトラヒドロベンゾチアゾリル、フラニル、ピラゾリル、チエニル、ピリジニル、ピリミジニル、インドリル、キノリニル、イソキノリニル、またはC<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> - アルコキシであって、

C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> - アルコキシは、フェニル、フラニル、およびチエニルからなる群から選択される1個の置換基で置換され、

前記フェニル、フラニル、およびチエニルは1または2個のR<sup>6S</sup>置換基で順番に所望により置換され、

インダニル、テトラヒドロナフタレニル、スピロ[シクロプロパン - 1, 2' - インダン]イル、フェニル、ナフチル、ジヒドロベンゾフラニル、クロマニル、イソクロマニル、チオクロマニル、イソチオクロマニル、テトラヒドロベンゾチアゾリル、フラニル、ピラゾリル、チエニル、ピリジニル、ピリミジニル、インドリル、キノリニル、およびイソキノリニルは所望により1 ~ 4個のR<sup>6S</sup>置換基で置換され、

R<sup>6S</sup>は独立してハロゲン、オキソ、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルコキシ、またはC<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - シクロアルキルであり、

R<sup>7</sup>は、ハロゲン、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、またはC<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - シクロアルキルであり、

Qは、フェニル、ナフチル、インダニル、ジヒドロベンゾフラニル、テトラヒドロキノリニル、ジヒドロ - 5H - シクロペンタ[b]ピリジニル、ジヒドロベンゾフラニル、ピリジニル、ベンゾフラニル、ベンゾチオフェニル、イソキノリニル、またはキノリニルであり、

フェニル、ナフチル、インダニル、ジヒドロベンゾフラニル、テトラヒドロキノリニル、ジヒドロ - 5H - シクロペンタ[b]ピリジニル、ジヒドロベンゾフラニル、ピリジニル、ベンゾフラニル、ベンゾチオフェニル、イソキノリニル、およびキノリニルは、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルカルボニル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルキルカルボニル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルコキシ - C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、C<sub>2</sub>

10

20

30

40

50

- C<sub>4</sub> - アルケニル、C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルケニル、C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub> - アルキニル、C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルキニル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルスルファニル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルキルスルファニル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - シクロアルキル、フェニル、ピラゾリル、ピリジニル、オキセタニル、アゼチジニル、テトラヒドロフラニル、ピロリジニル、および - N(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub> からなる群から独立して選択される 1 または 2 個の Q<sup>S</sup> 置換基で所望により置換され、

前記 C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルコキシ、および C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルコキシは、ヒドロキシル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルコキシ、および C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルコキシからなる群から独立して選択される 1 または 2 個の置換基で所望により置換され、

前記 C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - シクロアルキル、フェニル、ピラゾリル、ピリジニル、オキセタニル、アゼチジニル、テトラヒドロフラニル、およびピロリジニルは、ハロゲン、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、および C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルキルからなる群から独立して選択される 1 または 2 個の置換基で所望により置換され、

並びに

R<sup>4</sup> は独立して C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルである、請求項 1 または 2 のいずれか一項に記載の式 (I) の化合物、

並びにそれらの塩、N - オキシド、並びに前記塩および N - オキシドの溶媒和物。

【請求項 4】

R<sup>1</sup> は、水素であり、

R<sup>2</sup> および R<sup>3</sup> は、水素であり、

R<sup>4</sup> および R<sup>5</sup> は独立して水素またはハロゲンであり、

または

R<sup>4</sup> および R<sup>5</sup> は、それらが結合している炭素原子と一緒にシクロプロピル環、シクロブチル環、またはオキセタニル環を形成する、請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の式 (I) の化合物。

【請求項 5】

R<sup>6</sup> は、インダニル、テトラヒドロナフタレニル、スピロ [シクロプロパン - 1, 2' - インダン] イル、フェニル、ナフチル、ジヒドロベンゾフラニル、クロマニル、イソクロマニル、チオクロマニル、イソチオクロマニル、テトラヒドロベンゾチアゾリル、フラニル、ピラゾリル、チエニル、ピリミジニル、インドリル、キノリニル、イソキノリニル、または C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> - アルコキシであって、

C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> - アルコキシは、フェニル、フラニル、およびチエニルからなる群から選択される 1 個の置換基で置換され、

前記フェニル、フラニル、およびチエニルは 1 または 2 個の R<sup>6</sup> S 置換基で順番に所望により置換され、

インダニル、テトラヒドロナフタレニル、スピロ [シクロプロパン - 1, 2' - インダン] イル、フェニル、ナフチル、ジヒドロベンゾフラニル、クロマニル、イソクロマニル、チオクロマニル、イソチオクロマニル、テトラヒドロベンゾチアゾリル、フラニル、ピラゾリル、チエニル、ピリミジニル、インドリル、キノリニル、およびイソキノリニルは所望により 1 ~ 4 個の R<sup>6</sup> S 置換基で置換され、

R<sup>6</sup> S は独立してハロゲン、オキソ、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルコキシ、または C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - シクロアルキルである、請求項 1 ~ 4 のいずれか一項に記載の式 (I) の化合物。

【請求項 6】

R<sup>7</sup> は、クロロ、ヨード、メチル、またはシクロプロピルである、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の式 (I) の化合物。

【請求項 7】

Q は、フェニル、ナフチル、インダニル、ジヒドロベンゾフラニル、テトラヒドロキノリニル、ジヒドロ - 5 H - シクロペンタ [b] ピリジニル、ジヒドロベンゾフラニル、ピリジニル、ベンゾフラニル、ベンゾチオフェニル、イソキノリニル、またはキノリニルであり、

10

20

30

40

50

フェニル、ナフチル、インダニル、ジヒドロベンゾフラニル、テトラヒドロキノリニル、ジヒドロ-5H-シクロペンタ[b]ピリジニル、ジヒドロベンゾフラニル、ピリジニル、ベンゾフラニル、ベンゾチオフェニル、イソキノリニル、またはキノリニルは、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-ハロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキルカルボニル、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-ハロアルキルカルボニル、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-ハロアルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルコキシ-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキル、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-アルケニル、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-ハロアルケニル、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-アルキニル、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-ハロアルキニル、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキルスルファニル、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-ハロアルキルスルファニル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-シクロアルキル、フェニル、ピラゾリル、ピリジニル、オキセタニル、アゼチジニル、テトラヒドロフラニル、ピロリジニル、および-N(R<sup>43</sup>)<sub>2</sub>からなる群から独立して選択される1または2個のQ<sup>S</sup>置換基で所望により置換され、

10

前記C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルコキシ、およびC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-ハロアルコキシは、ヒドロキシル、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルコキシ、およびC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-ハロアルコキシからなる群から独立して選択される1または2個の置換基で所望により置換され、

前記C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-シクロアルキル、フェニル、ピラゾリル、ピリジニル、オキセタニル、アゼチジニル、テトラヒドロフラニル、およびピロリジニルは、ハロゲン、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキル、およびC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-ハロアルキルからなる群から独立して選択される1または2個の置換基で所望により置換され、

並びに

R<sup>43</sup>は、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキルである、請求項1~6のいずれか一項に記載の式(I)の化合物。

20

【請求項8】

請求項1~7のいずれか一項に記載の少なくとも1つの式(I)の化合物と、少なくとも1つの担体および/または界面活性剤を含む、植物病原性有害真菌を防除するための組成物。

【請求項9】

作物保護および材料の保護における有害微生物の防除方法であって、請求項1~7のいずれか一項に記載の少なくとも1つの式(I)の化合物および/または請求項8に記載の組成物を、前記有害微生物および/またはそれらの生息地に施用することを特徴とする、方法。

30

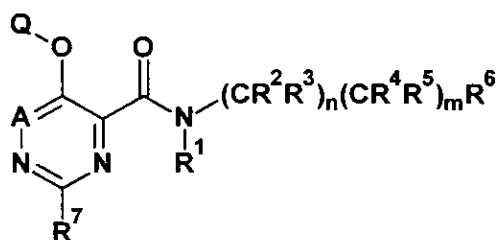
【請求項10】

作物保護および材料の保護における有害微生物を防除するための、請求項1~7のいずれか一項に記載の式(I)の1または複数の化合物および/または請求項8に記載の組成物の使用。

【請求項11】

式(I-a)：

【化2】



40

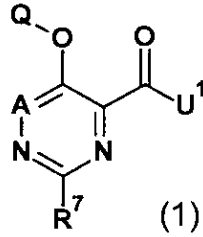
(I-a)

(式中、m、n、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、R<sup>7</sup>、A、およびQは、請求項1~7のいずれかで定義され、並びに

50

Tは、酸素（O）である）の化合物を調製するためのプロセスであって、  
式（1）：

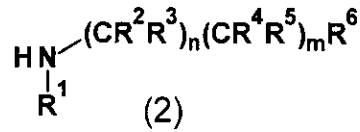
【化3】



10

（式中、R<sup>7</sup>、A、およびQは、請求項1～7のいずれかで定義され、  
U<sup>1</sup>は、ヒドロキシル、ハロゲン、またはC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルコキシである）の化合物を  
式（2）：

【化4】



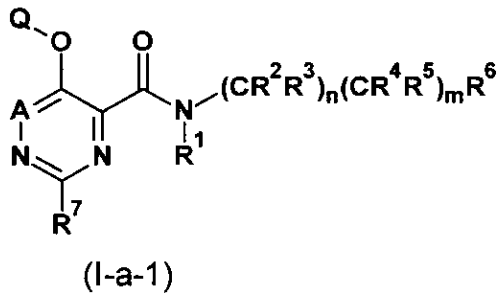
20

（式中、m、n、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、およびR<sup>6</sup>は、請求項1～7のいずれかで定義される）のアミンまたはその塩と反応させる工程を含む、プロセス。

【請求項12】

式（I-a-1）：

【化5】



30

（式中、m、n、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、A、およびQは、請求項1～7のいずれかで定義され、並びに

Tは、酸素（O）であり、

R<sup>1</sup>は、水素、ヒドロキシル、シアノ、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル、またはC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルコキシであり、

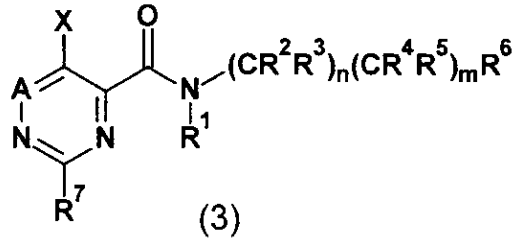
R<sup>7</sup>は、水素、ハロゲン、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルコキシ、またはC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルコキシである）の化合物を調製するためのプロセスであって、

式（3）：

40

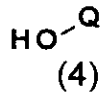
50

【化 6】



(式中、 $m$ 、 $n$ 、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、および  $A$  は、請求項 1 ~ 7 のいずれかで定義され、並びに  $X$  は、ハロゲンである) の化合物を  
式 (4)

【化 7】

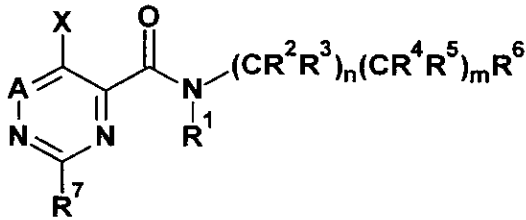


(式中、 $Q$  は、請求項 1 ~ 7 のいずれか一項で定義される) の化合物と、有機塩基または無機塩基の存在下で反応させる工程を含む、プロセス。

【請求項 13】

式 (3) :

【化 8】



の化合物であって、

$A$  は、窒素 ( $N$ ) または  $C - R^8$  であって、

$R^8$  は、水素またはハロゲンであり、

$n$  は 1、

$m$  は 1、

$R^1$  は、水素であり、

$R^2$  および  $R^3$  は、水素であり、

$R^4$  および  $R^5$  は独立して水素またはフッ素であるが、

$R^4$  および  $R^5$  の少なくとも 1 つが水素ではなく、

$R^6$  は、フェニル、2,3-ジヒドロベンゾフラニル、1,3-ベンゾジオキサソリル、2,3-ジヒドロ-1,4-ベンゾジオキシニル、フラニル、ピラゾリル、チエニル、ピリジニル、インドリル、フェニルオキシ、またはベンジルオキシであって、

フェニル、2,3-ジヒドロベンゾフラニル、1,3-ベンゾジオキサソリル、2,3-ジヒドロ-1,4-ベンゾジオキシニル、フラニル、ピラゾリル、チエニル、ピリジニル、インドリル、フェニルオキシ、またはベンジルオキシは、1~3個の  $R^{6S}$  置換基で所望により置換され、

$R^{6S}$  はハロゲン、シアノ、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、 $C_1 - C_4$ -ハロアルコキシ、 $C_2 - C_6$ -アルケニル、 $C_2$

30

40

50

- C<sub>6</sub> - アルキニル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - シクロアルキル、フェニル、ピラゾリル、イミダゾリル、ピリジニル、- C(=O)R<sup>16</sup>、または - C(=O)(OR<sup>17</sup>)であって、

前記C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - シクロアルキル、フェニル、ピラゾリル、イミダゾリル、およびピリジニルは、フルオロ、プロモ、クロロ、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、およびC<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルキルからなる群から独立して選択される1または2個の置換基で所望によりさらに置換され、

並びに

R<sup>16</sup>は、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルであり、

R<sup>17</sup>は、水素またはC<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルであり、

R<sup>7</sup>は、ハロゲン、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ヒドロキシアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルカルボニル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルスルファニル、C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub> - アルケニル、C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub> - アルキニル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - シクロアルキル、ピリジニル、イミダゾリル、ピラゾリル、オキセタニル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロピラニル、ピロリジニル、ピペリジニル、- N(R<sup>20</sup>)<sub>2</sub>、- C(=NR<sup>21</sup>)R<sup>22</sup>、または - C(=O)(OR<sup>25</sup>)であって、

C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ヒドロキシアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルカルボニル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルスルファニル、C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub> - アルケニル、およびC<sub>2</sub> - C<sub>4</sub> - アルキニルは所望により1または2個のR<sup>7S<sup>a</sup></sup>置換基で置換され、

C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - シクロアルキル、ピリジニル、イミダゾリル、ピラゾリル、オキセタニル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロピラニル、ピロリジニル、およびピペリジニルは所望により1または2個のR<sup>7S<sup>c</sup></sup>置換基で置換され、

R<sup>20</sup>は、水素、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、またはC<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - シクロアルキルであり、

R<sup>21</sup>は、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルまたはC<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルコキシであり、

R<sup>22</sup>は、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルであり、

R<sup>25</sup>は、水素またはC<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルであり、

並びに

R<sup>7S<sup>a</sup></sup>は独立してC<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルコキシまたはフェニルであり、

R<sup>7S<sup>c</sup></sup>は独立してハロゲンまたはC<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルであり、

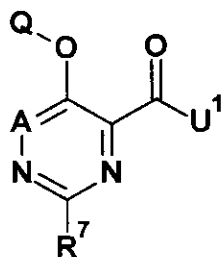
Xは、ハロゲンであるが、

5 - クロロ - N - [ 2 , 2 - ジフルオロ - 2 - ( 3 - フルオロフェニル ) エチル ] - 2 - エチルピリミジン - 4 - カルボキサミド ( CAS 2404152 - 87 - 8 ) ではない、前記式 ( 3 ) の化合物。

【請求項14】

式 ( 1 ) :

【化9】



の化合物であって、

Aは、窒素 ( N ) またはC - R<sup>8</sup>であって、

R<sup>8</sup>は、水素であり、

Qは、フェニル、2 , 3 - ジヒドロベンゾフラニル、インドリニル、1 , 3 - ベンゾジ

オキシソリル、クロマニル、2, 3 - ジヒドロ - 1, 4 - ベンゾジオキシニル、5, 6, 7, 8 - テトラヒドロキノリニル、2, 3 - ジヒドロベンゾフラニル、チエニル、ピリジニルまたはインドリルであって、

フェニル、2, 3 - ジヒドロベンゾフラニル、インドリニル、1, 3 - ベンゾジオキシソリル、クロマニル、2, 3 - ジヒドロ - 1, 4 - ベンゾジオキシニル、5, 6, 7, 8 - テトラヒドロキノリニル、2, 3 - ジヒドロベンゾフラニル、チエニル、ピリジニルおよびインドリルは、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ホルミル、 $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_1 - C_4$  - ハロアルキル、 $C_1 - C_4$  - アルキルカルボニル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ、 $C_1 - C_4$  - ハロアルコキシ、 $C_2 - C_4$  - アルキニル、 $C_3 - C_6$  - シクロアルキル、オキセタニル、および  $-N(R^{43})_2$  からなる群から独立して選択される 1 ~ 3 個の  $Q^S$  置換基で置換され、

10

前記  $C_3 - C_6$  - シクロアルキルおよびオキセタニルは、ハロゲンおよび  $C_1 - C_4$  - アルキルからなる群から独立して選択される 1 または 2 個の置換基で順番に所望により置換され、

$R^{43}$  は、水素および  $C_1 - C_4$  - アルキルであり、

$R^7$  は、ハロゲン、 $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_1 - C_4$  - ハロアルキル、 $C_1 - C_4$  - ヒドロキシアルキル、 $C_1 - C_4$  - アルキルカルボニル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ、 $C_2 - C_4$  - アルケニル、 $C_2 - C_4$  - アルキニル、 $C_3 - C_6$  - シクロアルキル、ピリジニル、イミダゾリル、ピラゾリル、オキセタニル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロピラニル、ピロリジニル、ピペリジニル、 $-N(R^{20})_2$ 、 $-C(=NR^{21})R^{22}$ 、または  $-C(=O)(OR^{25})$  であって、

20

$C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_1 - C_4$  - ハロアルキル、 $C_1 - C_4$  - ヒドロキシアルキル、 $C_1 - C_4$  - アルキルカルボニル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ、 $C_2 - C_4$  - アルケニル、および  $C_2 - C_4$  - アルキニルは所望により 1 または 2 個の  $R^{7S^a}$  置換基で置換され、

$C_3 - C_6$  - シクロアルキル、ピリジニル、イミダゾリル、ピラゾリル、オキセタニル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロピラニル、ピロリジニル、およびピペリジニルは所望により 1 または 2 個の  $R^{7S^c}$  置換基で置換され、

$R^{20}$  は、水素、 $C_1 - C_4$  - アルキル、または  $C_3 - C_6$  - シクロアルキルであり、

$R^{21}$  は、 $C_1 - C_4$  - アルキルまたは  $C_1 - C_4$  - アルコキシであり、

30

$R^{22}$  は、 $C_1 - C_4$  - アルキルであり、

$R^{25}$  は、水素または  $C_1 - C_4$  - アルキルであり、

並びに

$R^{7S^a}$  は独立して  $C_1 - C_4$  - アルコキシまたはフェニルであり、

$R^{7S^c}$  は独立してハロゲンまたは  $C_1 - C_4$  - アルキルであり、

$U^1$  は、ヒドロキシル、ハロゲン、または  $C_1 - C_6$  - アルコキシであるが、

式 (1) において、A が  $C - R^8$  および  $R^8 = H$  である場合、

$U^1$  がヒドロキシルであれば、 $R^7$  はイソプロピルではない、前記式 (1) の化合物。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

40

【0001】

本発明は、トリアジン化合物およびピリミジン(チオ)アミド化合物、および植物病原性真菌などの植物病原性微生物を防除するためのその使用に関する。また、これらの化合物を調製するためのプロセスおよび中間体にも関する。

【背景技術】

【0002】

これまで、微生物の蔓延に対抗または防止するための数多くの作物保護剤が開発されてきた。しかしながら、真菌などの広範囲の植物病原性微生物に対して有効であり、毒性が低く、選択性が高く、または低施用率で使用できると同時に効果的な害虫駆除を可能にする化合物を提供するために、新規化合物自体の開発の必要性が依然としてある。耐性の出

50



現を防ぐために、新しい化合物を有することも望まれ得る。

【発明の概要】

【0003】

本発明は、真菌などの植物病原性微生物を防除するための新規化合物を提供し、これらの態様の少なくともいくつかにおいて、公知の化合物および組成物よりも優れた利点を有する。

【0004】

除草剤としての置換ベンジルカルボキサミドは、国際公開第2005/070889号に記載されている。国際公開第2010/049302号は、糖尿病治療のためのGPBAR1アゴニストとしてのフェノキシピリジルカルボキサミドについて記載している。国際公開第2019/014352号では、ナトリウムチャンネルモジュレーターとしてのフェニルカルボキサミドが記載されている。国際公開第2018/055135号は、殺菌活性を有する5-トリフルオロメチルオキサジアゾール誘導体を開示している。国際公開第2004/016088号には、植物病原性疾患の治療のための2-ピリジルエチルベンズアミド誘導体が記載されている。

10

【発明を実施するための形態】

【0005】

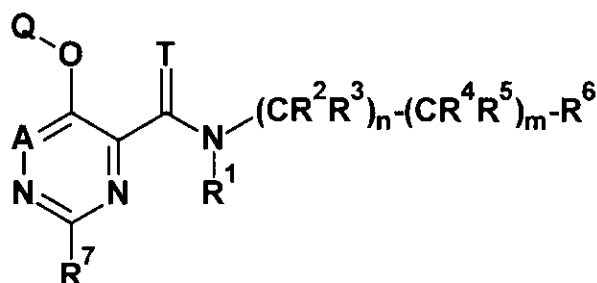
式(I)の化合物

本発明は、式(I)：

【0006】

20

【化1】



30

【0007】

(式中、

Aは、窒素(N)またはC-R<sup>8</sup>であって、

R<sup>8</sup>は、水素、ハロゲン、シアノ、またはC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキルであり、

Tは、酸素(O)または硫黄(S)であり、

nは、0または1、

mは、0または1、

R<sup>1</sup>は、水素、ヒドロキシル、シアノ、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルコキシ-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル、-C(=O)R<sup>10</sup>、-C(=O)(OR<sup>11</sup>)、-S(=O)R<sup>12</sup>、-S(=O)<sub>2</sub>R<sup>12</sup>、-C(=O)N(R<sup>13</sup>)<sub>2</sub>、または-S(=O)<sub>2</sub>N(R<sup>14</sup>)<sub>2</sub>であって、

40

R<sup>10</sup>、R<sup>11</sup>、およびR<sup>12</sup>は独立してC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-シクロアルキル、またはC<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-アルケニルであり、

R<sup>13</sup>およびR<sup>14</sup>は独立して水素、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-シクロアルキル、またはC<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-アルケニルであり、

R<sup>2</sup>およびR<sup>3</sup>は独立して水素、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、カルボキシル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルコキシカルボニル、若しくはC<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-シクロアルキルであるか、

50

または

$R^2$  および  $R^3$  は、それらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C_3 - C_8$  - シクロアルキル環若しくは 3 員 ~ 7 員ヘテロシクリル環を形成し、

$R^4$  および  $R^5$  は独立して水素、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、カルボキシル、 $C_1 - C_6$  - アルキル、 $C_1 - C_6$  - ハロアルキル、 $C_1 - C_6$  - アルコキシ、 $C_1 - C_6$  - アルコキシカルボニル、若しくは  $C_3 - C_8$  - シクロアルキルであるか、

または

$R^4$  および  $R^5$  は、それらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C_3 - C_8$  - シクロアルキル環若しくは 3 員 ~ 7 員ヘテロシクリル環を形成し、

または

$R^2$  および  $R^4$  は、それらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C_3 - C_8$  - シクロアルキル環若しくは 3 員 ~ 7 員ヘテロシクリル環を形成し、

並びに

$R^3$  および  $R^5$  は独立して水素またはハロゲンであり、

または

$R^2$  および  $R^4$  は一緒に式  $** - C(R^3) = C(R^5) - \#\#$

(式中、

$**$  は  $N(R^1)$  への結合点であり、

$\#\#$  は  $R^6$  への結合点である) の基を形成し、

並びに

$R^3$  および  $R^5$  は独立して水素、ハロゲン、または  $C_1 - C_6$  - アルキルであり、

$R^6$  は、 $C_3 - C_{12}$  - 炭素環、 $C_6 - C_{14}$  - アリール、3 員 ~ 14 員ヘテロシクリル、5 員 ~ 14 員ヘテロアリール、 $C_3 - C_{12}$  - カルボシクリルオキシ、 $C_6 - C_{14}$  - アリールオキシ、5 員 ~ 14 員ヘテロアリールオキシ、3 員 ~ 14 員ヘテロシクリルオキシ、 $C_1 - C_3$  - アルコキシ、または  $C_1 - C_3$  - ハロアルコキシであって、

$C_1 - C_3$  - アルコキシおよび  $C_1 - C_3$  - ハロアルコキシは、 $C_3 - C_{12}$  - 炭素環、 $C_6 - C_{14}$  - アリール、3 員 ~ 14 員ヘテロシクリル、および 5 員 ~ 14 員ヘテロアリールからなる群から選択される 1 個の置換基で独立して置換され、

前記  $C_3 - C_{12}$  - 炭素環、 $C_6 - C_{14}$  - アリール、3 員 ~ 14 員ヘテロシクリル、および 5 員 ~ 14 員ヘテロアリールは順番に 1 ~ 4 個の  $R^{6S}$  置換基で所望により置換され、

$C_3 - C_{12}$  - 炭素環、 $C_6 - C_{14}$  - アリール、3 員 ~ 14 員ヘテロシクリル、5 員 ~ 14 員ヘテロアリール、 $C_3 - C_{12}$  - カルボシクリルオキシ、 $C_6 - C_{14}$  - アリールオキシ、5 員 ~ 14 員ヘテロアリールオキシ、および 3 員 ~ 14 員ヘテロシクリルオキシは 1 ~ 4 個の  $R^{6S}$  置換基で所望により置換され、

$R^{6S}$  は独立してハロゲン、シアノ、イソシアノ、ニトロ、ヒドロキシル、メルカプト、ペンタフルオロスルファニル、オキソ、メチリデン、ハロメチリデン、 $C_1 - C_6$  - アルキル、 $C_1 - C_6$  - ハロアルキル、 $C_1 - C_6$  - アルコキシ、 $C_1 - C_6$  - ハロアルコキシ、 $C_2 - C_6$  - アルケニル、 $C_2 - C_6$  - ハロアルケニル、 $C_2 - C_6$  - アルケニル、 $C_2 - C_6$  - ハロアルケニル、 $C_2 - C_6$  - アルケニルオキシ、 $C_2 - C_6$  - ハロアルケニルオキシ、 $C_1 - C_6$  - アルキルスルファニル、 $C_1 - C_6$  - ハロアルキルスルファニル、 $C_3 - C_8$  - シクロアルキルスルファニル、 $C_1 - C_6$  - アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$  - ハロアルキルスルフィニル、 $C_3 - C_8$  - シクロアルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$  - アルキルスルホニル、 $C_1 - C_6$  - ハロアルキルスルホニル、 $C_3 - C_8$  - シクロアルキルスルホニル、 $C_3 - C_8$  - シクロアルキル、 $C_3 - C_8$  - シクロアルコキシ、 $C_3 - C_8$  - シクロアルケニル、 $C_6 - C_{14}$  - アリール、5 員または 6 員ヘテロアリール、3 員 ~ 7 員ヘテロシクリル、 $-N(R^{15})_2$ 、 $-C(=O)R^{16}$ 、 $-C(=O)(OR^{17})$ 、 $-C(=O)N(R^{18})_2$ 、 $-S(=O)_2N(R^{19})_2$ 、 $-OSi(C_1 - C_6 - \text{アルキル})_3$ 、または  $-Si(C_1 - C_6 - \text{アルキル})_3$  であり、

前記  $C_1 - C_6$  - アルキル、 $C_1 - C_6$  - ハロアルキル、 $C_1 - C_6$  - アルコキ

10

20

30

40

50

シ、 $C_1 - C_6$  - ハロアルコキシ、 $C_2 - C_6$  - アルケニル、 $C_2 - C_6$  - ハロアルケニル、 $C_2 - C_6$  - アルキニル、 $C_2 - C_6$  - ハロアルキニル、 $C_2 - C_6$  - アルケニルオキシ、 $C_2 - C_6$  - ハロアルケニルオキシ、 $C_1 - C_6$  - アルキルスルファニル、 $C_1 - C_6$  - ハロアルキルスルファニル、 $C_1 - C_6$  - アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$  - ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$  - アルキルスルホニル、 $C_1 - C_6$  - ハロアルキルスルホニル、 $-O-Si(C_1 - C_6 - アルキル)_3$ 、および $-Si(C_1 - C_6 - アルキル)_3$ は、シアノ、ヒドロキシル、 $C_1 - C_6$  - アルコキシ、 $C_1 - C_6$  - ハロアルコキシ、 $-O-Si(C_1 - C_6 - アルキル)_3$ 、 $-Si(C_1 - C_6 - アルキル)_3$ 、 $C_3 - C_8$  - シクロアルキル、 $C_3 - C_8$  - ハロシクロアルキル、および3員～7員ヘテロシクリルからなる群から独立して選択される1～3個の置換基でさらに所望により置換され、

並びに

前記 $C_3 - C_8$  - シクロアルキルスルファニル、 $C_3 - C_8$  - シクロアルキルスルフィニル、 $C_3 - C_8$  - シクロアルキルスルホニル、 $C_3 - C_8$  - シクロアルキル、 $C_3 - C_8$  - シクロアルコキシ、 $C_3 - C_8$  - シクロアルケニル、 $C_6 - C_{14}$  - アリール、5員または6員ヘテロアリール、および3員～7員ヘテロシクリルは、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、ホルミル、カルボキシル、オキソ、メチリデン、ハロメチリデン、 $C_1 - C_6$  - アルキル、 $C_1 - C_6$  - ハロアルキル、 $C_1 - C_6$  - アルコキシ、 $C_1 - C_6$  - ハロアルコキシ、 $C_1 - C_6$  - アルコキシカルボニル、 $C_1 - C_6$  - ハロアルコキシカルボニル、 $C_2 - C_6$  - アルケニル、 $C_3 - C_8$  - シクロアルキル、および $C_3 - C_8$  - ハロシクロアルキルからなる群から独立して選択される1～4個の置換基でさらに所望により置換されるか、

または

同一の炭素原子に結合された2個の $C_1 - C_6$  - アルキル置換基は、 $C_3 - C_8$  - シクロアルキル環を形成し、

または

2個の $R^{6S}$ 置換基は所望によりそれらが結合している炭素原子と一緒になって $C_3 - C_8$  - シクロアルキル環を形成し、

並びに

$R^{15}$ は、水素、 $C_1 - C_6$  - アルキル、または $C_3 - C_8$  - シクロアルキルであって、

前記 $C_1 - C_6$  - アルキルは、シアノ、ヒドロキシル、 $C_1 - C_6$  - アルコキシ、 $C_1 - C_6$  - ハロアルコキシ、 $-O-Si(C_1 - C_6 - アルキル)_3$ 、 $-Si(C_1 - C_6 - アルキル)_3$ 、 $C_3 - C_8$  - シクロアルキル、 $C_3 - C_8$  - ハロシクロアルキル、および3員～7員ヘテロシクリルからなる群から独立して選択される1～3個の置換基でさらに所望により置換され、

および

前記 $C_3 - C_8$  - シクロアルキルは、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、ホルミル、カルボキシル、オキソ、メチリデン、ハロメチリデン、 $C_1 - C_6$  - アルキル、 $C_1 - C_6$  - ハロアルキル、 $C_1 - C_6$  - アルコキシ、 $C_1 - C_6$  - ハロアルコキシ、 $C_1 - C_6$  - アルコキシカルボニル、 $C_1 - C_6$  - ハロアルコキシカルボニル、 $C_2 - C_6$  - アルケニル、 $C_3 - C_8$  - シクロアルキル、および $C_3 - C_8$  - ハロシクロアルキルからなる群から独立して選択される1～4個の置換基でさらに所望により置換され、

$R^{16}$ 、 $R^{17}$ 、 $R^{18}$ 、および $R^{19}$ は独立して水素、 $C_1 - C_6$  - アルキル、または $C_1 - C_6$  - ハロアルキルであって、

前記 $C_1 - C_6$  - アルキルまたは $C_1 - C_6$  - ハロアルキルは、シアノ、ヒドロキシル、 $C_1 - C_6$  - アルコキシ、 $C_1 - C_6$  - ハロアルコキシ、 $-O-Si(C_1 - C_6 - アルキル)_3$ 、 $-Si(C_1 - C_6 - アルキル)_3$ 、 $C_3 - C_8$  - シクロアルキル、 $C_3 - C_8$  - ハロシクロアルキル、および3員～7員ヘテロシクリルからなる群から独立して選択される1～3個の置換基でさらに所望により置換され、

R<sup>7</sup>は、水素、ハロゲン、シアノ、イソシアノ、ヒドロキシル、メルカプト、ニトロ、アミノ、ホルミル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ヒドロキシアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキルカルボニル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルキルカルボニル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルコキシ、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-アルケニル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルケニル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-アルキニル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルキニル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-アルケニルオキシ、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルケニルオキシ、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-アルキニルオキシ、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルキニルオキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキルスルファニル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルキルスルファニル、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-シクロアルキルスルファニル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルキルスルフィニル、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-シクロアルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキルスルホニル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルキルスルホニル、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-シクロアルキルスルホニル、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-シクロアルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-シクロアルケニル、C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>-アリーール、5員または6員ヘテロアリーール、3員~7員ヘテロシクリル、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-シクロアルコキシ、C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>-アリーールオキシ、5員または6員ヘテロアリーールオキシ、3員~7員ヘテロシクリルオキシ、-O-Si(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル)<sub>3</sub>、-Si(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル)<sub>3</sub>、-N(R<sup>20</sup>)<sub>2</sub>、-C(=NR<sup>21</sup>)R<sup>22</sup>、-NR<sup>23</sup>C(=O)R<sup>24</sup>、-C(=O)(OR<sup>25</sup>)、-C(=O)N(R<sup>26</sup>)<sub>2</sub>、-S(=O)<sub>2</sub>N(R<sup>27</sup>)<sub>2</sub>、または-S(=O)(=NR<sup>28</sup>)R<sup>29</sup>であって、

10

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ヒドロキシアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキルカルボニル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルキルカルボニル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルコキシ、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-アルケニル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルケニル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-アルキニル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルキニル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-アルケニルオキシ、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルケニルオキシ、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-アルキニルオキシ、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルキニルオキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキルスルファニル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルキルスルファニル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキルスルホニル、およびC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルキルスルホニルは所望により1~3個のR<sup>7S a</sup>置換基で置換され、

20

C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-シクロアルキルスルファニル、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-シクロアルキルスルフィニル、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-シクロアルキルスルホニル、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-シクロアルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-シクロアルケニル、C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>-アリーール、5員または6員ヘテロアリーール、3員~7員ヘテロシクリル、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-シクロアルコキシ、C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>-アリーールオキシ、5員または6員ヘテロアリーールオキシ、および3員~7員ヘテロシクリルオキシは所望により1~3個のR<sup>7S c</sup>置換基で置換され、

30

並びに

R<sup>20</sup>は、水素、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルコキシ、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-アルケニル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルケニル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-アルキニル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルキニル、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-シクロアルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-ハロシクロアルキル、C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>-アリーール、5員または6員ヘテロアリーール、または3員~7員ヘテロシクリルであって、

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルコキシ、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-アルケニル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルケニル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-アルキニル、およびC<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルキニルは所望により1~3個のR<sup>7S a</sup>置換基で置換され、

40

および

C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-シクロアルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-ハロシクロアルキル、C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>-アリーール、5員または6員ヘテロアリーール、および3員~7員ヘテロシクリルは所望により1~3個の置換基R<sup>7S c</sup>で置換され、

R<sup>21</sup>およびR<sup>22</sup>は独立してヒドロキシル、アミノ、シアノ、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルコキシ、モノ-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル)アミノ、またはジ-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル)アミノであって、

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルコキシ、モ

50

ノ - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル) アミノ、またはジ - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル) アミノは所望により 1 ~ 3 個の R<sup>7 S a</sup> 置換基で置換され、

R<sup>2 3</sup>、R<sup>2 4</sup>、R<sup>2 5</sup>、R<sup>2 6</sup>、R<sup>2 7</sup>、R<sup>2 8</sup>、および R<sup>2 9</sup> は独立して水素、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキル、および C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキルであって、

C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルおよび C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキルは所望により 1 ~ 3 個の置換基 R<sup>7 S a</sup> で置換され、

および

C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキルは所望により 1 ~ 3 個の置換基 R<sup>7 S c</sup> で置換され、

R<sup>7 S a</sup> は独立してシアノ、ヒドロキシル、カルボキシル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルコキシ、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - ハロシクロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシカルボニル、- O - Si (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル)<sub>3</sub>、- Si (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル)<sub>3</sub>、C<sub>6</sub> - C<sub>1 4</sub> - アリール、または 3 員 ~ 7 員ヘテロシクリルであり、

R<sup>7 S c</sup> は独立してハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、ホルミル、オキソ、メチリデン、ハロメチリデン、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルコキシ、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - アルケニル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - ハロシクロアルキル、- O - Si (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル)<sub>3</sub>、若しくは 3 員 ~ 7 員ヘテロシクリルであるか、

または

同一の炭素原子に結合された C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルの 2 個の置換基 R<sup>7 S c</sup> は、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキルを形成し、

Q は、C<sub>6</sub> - C<sub>1 4</sub> - アリール、C<sub>3</sub> - C<sub>1 2</sub> - 炭素環、3 員 ~ 1 4 員ヘテロシクリル、または 5 員 ~ 1 4 員ヘテロアリールであって、

C<sub>6</sub> - C<sub>1 4</sub> - アリール、C<sub>3</sub> - C<sub>1 2</sub> - 炭素環、3 員 ~ 1 4 員ヘテロシクリル、および 5 員 ~ 1 4 員ヘテロアリールは、ハロゲン、シアノ、イソシアノ、ニトロ、ヒドロキシル、メルカプト、ホルミル、カルボキシル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルカルボニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキルカルボニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシ - C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシカルボニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルコキシカルボニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - アルケニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルケニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - アルキニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - アルケニルオキシ、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルケニルオキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルスルファニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキルスルファニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキルスルフィニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルスルホニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキルスルホニル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルコキシ、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - シクロアルケニル、3 員 ~ 7 員ヘテロシクリル、5 員 ~ 1 4 員ヘテロアリール、- O - Si (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル)<sub>3</sub>、- Si (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル)<sub>3</sub>、- O - C (= O) R<sup>3 3</sup>、- NR<sup>3 4</sup> C (= O) R<sup>3 5</sup>、- C (= O) N (R<sup>3 6</sup>)<sub>2</sub>、C (= S) R<sup>3 7</sup>、- C (= S) N (R<sup>3 8</sup>)<sub>2</sub>、- C (= NR<sup>3 9</sup>) R<sup>4 0</sup>、- C (= NOR<sup>4 1</sup>) R<sup>4 2</sup>、および - N (R<sup>4 3</sup>)<sub>2</sub> からなる群から独立して選択される 1 ~ 5 個の Q<sup>S</sup> 置換基で所望により置換され、

前記 C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルカルボニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキルカルボニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシ - C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシカルボニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルコキシカルボニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - アルケニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルケニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - アルキニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - アルケニルオキシ、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルケニルオキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルスルファニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキルスルファニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキルスルフィニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルスルホニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキルスルホニル、- O - Si (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル)<sub>3</sub>、および - S

10

20

30

40

50

i (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル)<sub>3</sub> は、シアノ、アミノ、ニトロ、ヒドロキシル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシカルボニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルコキシカルボニル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - ハロシクロアルキル、- Si (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル)<sub>3</sub>、および3員~7員ヘテロシクリルからなる群から独立して選択される1~3個の置換基で所望により置換され、

前記C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルコキシ、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - シクロアルケニル、3員~7員ヘテロシクリル、および5員~14員ヘテロアリールは、ハロゲン、シアノ、アミノ、ニトロ、ヒドロキシル、ホルミル、カルボキシル、オキソ、メチリデン、ハロメチリデン、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシカルボニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルコキシカルボニル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - ハロシクロアルキル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - アルケニル、および3員~7員ヘテロシクリルからなる群から独立して選択される1~3個の置換基で所望により置換され、

前記C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - ハロシクロアルキル、および3員~7員ヘテロシクリルは順番にそれらが結合している炭素原子と一緒にあってC<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキルを形成する2個の置換基で所望により置換される)の化合物であって、

R<sup>34</sup>、R<sup>35</sup>、R<sup>36</sup>、R<sup>37</sup>、R<sup>38</sup>、R<sup>39</sup>、R<sup>40</sup>、R<sup>41</sup>、およびR<sup>42</sup>は独立して水素、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキル、またはC<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシであって、

前記C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキル、およびC<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシは、シアノ、アミノ、ニトロ、ヒドロキシル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシカルボニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルコキシカルボニル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - ハロシクロアルキル、- Si (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル)<sub>3</sub>、および3員~7員ヘテロシクリルからなる群から独立して選択される1~3個の置換基で所望により置換され、

並びに

R<sup>43</sup>は独立して水素、ヒドロキシル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシ、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - アルケニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルケニル、またはC<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキルであって、

前記C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシ、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - アルケニル、およびC<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルケニルは、シアノ、アミノ、ニトロ、ヒドロキシル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシカルボニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルコキシカルボニル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - ハロシクロアルキル、- Si (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル)<sub>3</sub>、および3員~7員ヘテロシクリルからなる群から独立して選択される1~3個の置換基で所望により置換され、

前記C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキルは、ハロゲン、シアノ、アミノ、ニトロ、ヒドロキシル、ホルミル、カルボキシル、オキソ、メチリデン、ハロメチリデン、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシカルボニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルコキシカルボニル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - ハロシクロアルキル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - アルケニル、および3員~7員ヘテロシクリルからなる群から独立して選択される1~3個の置換基で所望により置換され、

前記C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - ハロシクロアルキル、および3員~7員ヘテロシクリルは順番にそれらが結合している炭素原子と一緒にあってC<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキルを形成する2個の置換基で所望により置換される)の化合物、

並びにそれらの塩、N - オキシド、並びに前記塩およびN - オキシドの溶媒和物に関する。

【0008】

本発明は、少なくとも1つの本明細書で定義される式(I)の化合物および少なくとも

10

20

30

40

50

1つの農業的に適切な助剤を含む組成物に関する。

【0009】

本発明はまた、植物病原性真菌を防除するための、本明細書で定義される式(I)の化合物または本明細書で定義される組成物の使用に関する。

【0010】

本発明は、植物、植物部分、種子、果実、または植物が生育する土壤に、本明細書で定義される少なくとも1つの式(I)の化合物または本明細書で定義される組成物を施用する工程を含む、植物病原性真菌を防除する方法に関する。

【0011】

本発明は、式(I)の化合物を調製するためのプロセスおよび中間体にも関する。

10

【0012】

特に明記しない限り、以下の定義は、本明細書および特許請求の範囲全体で使用される置換基および残基に適用される。

本明細書で使用される「ハロゲン」という用語は、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、またはヨウ素原子を指す。

【0013】

本明細書で使用される「メチリデン」という用語は、二重結合を介して炭素原子に結合した $\text{CH}_2$ 基を指す。

【0014】

本明細書で使用される「ハロメチリデン」という用語は、二重結合を介して炭素原子に結合した $\text{CX}_2$ 基を指し、Xはハロゲンである。

20

【0015】

本明細書で使用される「オキソ」という用語は、二重結合を介して炭素原子または硫黄原子に結合している酸素原子を指す。

【0016】

本明細書で使用される用語「 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ -アルキル」は、1、2、3、4、5、または6個の炭素原子を有する飽和、分枝状、または直鎖状炭化水素鎖を指す。 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ -アルキルの例には、メチル、エチル、プロピル(n-プロピル)、1-メチルエチル(iso-プロピル)、ブチル(n-ブチル)、1-メチルプロピル(sec-ブチル)、2-メチルプロピル(iso-ブチル)、1,1-ジメチルエチル(tert-ブチル)、ペンチル、1-メチルブチル、2-メチルブチル、3-メチルブチル、2,2-ジメチルプロピル、1-エチルプロピル、1,1-ジメチルプロピル、1,2-ジメチルプロピル、ヘキシル、1-メチルペンチル、2-メチルペンチル、3-メチルペンチル、4-メチルペンチル、1,1-ジメチルブチル、1,2-ジメチルブチル、1,3-ジメチルブチル、2,2-ジメチルブチル、2,3-ジメチルブチル、3,3-ジメチルブチル、1-エチルブチル、2-エチルブチル、1,1,2-トリメチルプロピル、1,2,2-トリメチルプロピル、1-エチル-1-メチルプロピル、および1-エチル-2-メチルプロピルが挙げられるが、これらに限定されない。特に、前記炭化水素鎖は、1、2、3、または4個の炭素原子(「 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ -アルキル」)、例えば、メチル、エチル、プロピル、イソ-プロピル、ブチル、sec-ブチル、iso-ブチル、またはtert-ブチルを有する。

30

40

【0017】

本明細書で使用される「 $\text{C}_3 - \text{C}_8$ -シクロアルキル」および「 $\text{C}_3 - \text{C}_8$ -シクロアルキル環」という用語は、3、4、5、6、7、または8個の炭素原子を含む飽和単環状炭化水素環を指す。 $\text{C}_3 - \text{C}_8$ -シクロアルキルの例には、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、およびシクロオクチルが挙げられるが、これらに限定されない。特に、前記シクロアルキルは、3~6個の炭素原子を有する。

【0018】

本明細書で使用される「 $\text{C}_2 - \text{C}_6$ -アルケニル」という用語は、2、3、4、5、ま

50

たは6個の炭素原子を有し、少なくとも1つの二重結合を含む不飽和の分岐状または直鎖状炭化水素鎖を指す。C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-アルケニルの例には、エテニル(または「ビニル」)基、プロパ-2-エン-1-イル(または「アリル」)基、プロパ-1-エン-1-イル基、プト-3-エニル基、プト-2-エニル基、プト-1-エニル基、ペント-4-エニル基、ペント-3-エニル基、ペント-2-エニル基、ペント-1-エニル基、ヘキサ-5-エニル基、ヘキサ-4-エニル基、ヘキサ-3-エニル基、ヘキサ-2-エニル基、ヘキサ-1-エニル基、プロパ-1-エン-2-イル(または「イソプロベニル」)基、2-メチルプロパ-2-エニル基、1-メチルプロパ-2-エニル基、2-メチルプロパ-1-エニル基、1-メチルプロパ-1-エニル基、3-メチルプト-3-エニル基、2-メチルプト-3-エニル基、1-メチルプト-3-エニル基、3-メチルプト-2-エニル基、2-メチルプト-2-エニル基、1-メチルプト-2-エニル基、3-メチルプト-1-エニル基、2-メチルプト-1-エニル基、1-メチルプト-1-エニル基、1,1-ジメチルプロパ-2-エニル基、1-エチルプロパ-1-エニル基、1-プロピルビニル基、1-イソプロピルビニル基、4-メチルペント-4-エニル基、3-メチルペント-4-エニル基、2-メチルペント-4-エニル基、1-メチルペント-4-エニル基、4-メチルペント-3-エニル基、3-メチルペント-3-エニル基、2-メチルペント-3-エニル基、1-メチルペント-3-エニル基、4-メチルペント-2-エニル基、3-メチルペント-2-エニル基、2-メチルペント-2-エニル基、1-メチルペント-2-エニル基、4-メチルペント-1-エニル基、3-メチルペント-1-エニル基、2-メチルペント-1-エニル基、1-メチルペント-1-エニル基、3-エチルプト-3-エニル基、2-エチルプト-3-エニル基、1-エチルプト-3-エニル基、3-エチルプト-2-エニル基、2-エチルプト-2-エニル基、1-エチルプト-2-エニル基、3-エチルプト-1-エニル基、2-エチルプト-1-エニル基、1-エチルプト-1-エニル基、2-プロピルプロパ-2-エニル基、1-プロピルプロパ-2-エニル基、2-イソプロピルプロパ-2-エニル基、1-イソプロピルプロパ-2-エニル基、2-プロピルプロパ-1-エニル基、1-プロピルプロパ-1-エニル基、2-イソプロピルプロパ-1-エニル基、1-イソプロピルプロパ-1-エニル基、3,3-ジメチルプロパ-1-エニル基、1-(1,1-ジメチルエチル)エテニル基、ブタ-1,3-ジエニル基、ペント-1,4-ジエニル基、ヘキサ-1,5-ジエニル基、またはメチルヘキサジエニル基が挙げられるが、これらに限定されない。

10

20

30

#### 【0019】

本明細書で使用される「C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-アルキニル」という用語は、2、3、4、5、または6個の炭素原子を有し、少なくとも1つの三重結合を含む分岐状または直鎖状炭化水素鎖を指す。C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-アルキニルの例には、エチニル基、プロパ-1-イニル基、プロパ-2-イニル炭化水素鎖(または「プロパルギル」)基、プト-1-イニル基、プト-2-イニル基、プト-3-イニル基、ペント-1-イニル基、ペント-2-イニル基、ペント-3-イニル基、ペント-4-イニル基、ヘキサ-1-イニル基、ヘキサ-2-イニル基、ヘキサ-3-イニル基、ヘキサ-4-イニル基、ヘキサ-5-イニル基、1-メチルプロパ-2-イニル基、2-メチルプト-3-イニル基、1-メチルプト-3-イニル基、1-メチルプト-2-イニル基、3-メチルプト-1-イニル基、1-エチルプロパ-2-イニル基、3-メチルペント-4-イニル基、2-メチルペント-4-イニル基、1-メチルペント-4-イニル基、2-メチルペント-3-イニル基、1-メチルペント-3-イニル基、4-メチルペント-2-イニル基、1-メチルペント-2-イニル基、4-メチルペント-1-イニル基、3-メチルペント-1-イニル基、2-エチルプト-3-イニル基、1-エチルプト-3-イニル基、1-エチルプト-2-イニル基、1-プロピルプロパ-2-イニル基、1-イソプロピルプロパ-2-イニル基、2,2-ジメチルプト-3-イニル基、1,1-ジメチルプト-3-イニル基、1,1-ジメチルプト-2-イニル基、または3,3-ジメチルプト-1-イニル基が挙げられるが、これらに限定されない。

40

#### 【0020】

50



本明細書で使用される「 $C_1 - C_6$  - ハロアルキル」という用語は、上記で定義したように、1または複数の水素原子が、同一または異なっている1または複数のハロゲン原子で置換されている $C_1 - C_6$  - アルキル基を指す。 $C_1 - C_6$  - ハロアルコキシの例には、クロロメチル、プロモメチル、ジクロロメチル、トリクロロメチル、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロフルオロメチル、ジクロロフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、1 - クロロエチル、1 - プロモエチル、1 - フルオロエチル、2 - フルオロエチル、2, 2 - ジフルオロ - エチル、2, 2, 2 - トリフルオロエチル、2 - クロロ - 2 - フルオロエチル、2 - クロロ - 2, 2 - ジフルオロエチル、2, 2 - ジクロロ - 2 - フルオロエチル、2, 2, 2 - トリクロロエチル、ペンタフルオロエチル、および1, 1, 1 - トリフルオロプロパ - 2 - イルが挙げられるが、これらに限定されない。フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、フルオロエチル、2 - フルオロエチル、2, 2 - ジフルオロ - エチル、2, 2, 2 - トリフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、および1, 1, 1 - トリフルオロプロパ - 2 - イルが好ましい。

#### 【0021】

本明細書で使用される「 $C_1 - C_6$  - フルオロアルキル」という用語は、上記で定義したように、1または複数の水素原子が、同一または異なっている1または複数のフッ素原子で置換されている $C_1 - C_6$  - アルキル基を指す。 $C_1 - C_6$  - フルオロアルキルの例には、モノフルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、1 - フルオロエチル、1, 1 - ジフルオロエチル、2, 2 - ジフルオロエチル、および2, 2, 2 - トリフルオロエチルが挙げられるが、これらに限定されない。

#### 【0022】

本明細書で使用される「 $C_2 - C_6$  - ハロアルケニル」という用語は、上記で定義したように、1または複数の水素原子が、同一または異なっている1または複数のハロゲン原子で置換されている $C_2 - C_6$  - アルケニル基を指す。

#### 【0023】

本明細書で使用される「 $C_2 - C_6$  - ハロアルキニル」という用語は、上記で定義したように、1または複数の水素原子が、同一でもよい1または複数のハロゲン原子で置換されている $C_2 - C_6$  - アルキニル基を指す。

本明細書で使用される「 $C_1 - C_6$  - アルコキシ」という用語は、「 $C_1 - C_6$  - アルキル」という用語が本明細書で定義されている、式( $C_1 - C_6$  - アルキル) - O - の基を指す。 $C_1 - C_6$  - アルコキシの例には、メトキシ、エトキシ、n - プロポキシ、1 - メチルエトキシ、n - ブトキシ、1 - メチルプロポキシ、2 - メチルプロポキシ、1, 1 - ジメチルエトキシ、n - ペントキシ、1 - メチルブトキシ、2 - メチルブトキシ、3 - メチルブトキシ、2, 2 - ジメチルプロポキシ、1 - エチルプロポキシ、1, 1 - ジメチルプロポキシ、1, 2 - ジメチルプロポキシ、n - ヘキシルオキシ、1 - メチルペントオキシ、2 - メチルペントオキシ、3 - メチルペントオキシ、4 - メチルペントオキシ、1, 1 - ジメチルブトキシ、1, 2 - ジメチルブトキシ、1, 3 - ジメチルブトキシ、2, 2 - ジメチルブトキシ、2, 3 - ジメチルブトキシ、3, 3 - ジメチルブトキシ、1 - エチルブトキシ、2 - エチルブトキシ、1, 1, 2 - トリメチルプロポキシ、1, 2, 2 - トリメチルプロポキシ、1 - エチル - 1 - メチルプロポキシ、および1 - エチル - 2 - メチルプロポキシが挙げられるが、これらに限定されない。これは、他で定義されていない限り、複合置換基の一部としてのアルコキシ、例えば、アルコシアルキル、アルコシアルコキシにも適用される。

#### 【0024】

本明細書で使用される「 $C_1 - C_6$  - ハロアルコキシ」という用語は、上記で定義したように、1または複数の水素原子が、同一または異なっている1または複数のハロゲン原子で置換されている $C_1 - C_6$  - アルコキシ基を指す。 $C_1 - C_6$  - ハロアルコキシの例には、クロロメトキシ、プロモメトキシ、ジクロロメトキシ、トリクロロメトキシ、フルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、クロロフルオロメト

キシ、ジクロロフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、1 - クロロエトキシ、1 - プロモエトキシ、1 - フルオロエトキシ、2 - フルオロエトキシ、2, 2 - ジフルオロエトキシ、2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ、2 - クロロ - 2 - フルオロエトキシ、2 - クロロ - 2, 2 - ジフルオロエトキシ、2, 2 - ジクロロ - 2 - フルオロエトキシ、2, 2, 2 - トリクロロエトキシ、ペンタフルオロエトキシ、および1, 1, 1 - トリフルオロプロパ - 2 - オキシが挙げられるが、これらに限定されない。

【0025】

本明細書で使用される「C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ヒドロキシアルキル」という用語は、上記で定義したように、少なくとも1つの水素原子がヒドロキシル基で置換されているC<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル基を指す。C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ヒドロキシアルキルの例には、ヒドロキシメチル、1 - ヒドロキシエチル、2 - ヒドロキシエチル、1, 2 - ジヒドロキシエチル、3 - ヒドロキシプロピル、2 - ヒドロキシプロピル、1 - ヒドロキシプロピル、1 - ヒドロキシプロパン - 2 - イル、2 - ヒドロキシプロパン - 2 - イル、2, 3 - ジヒドロキシプロピル、および1, 3 - ジヒドロキシプロパン - 2 - イルが挙げられるが、これらに限定されない。

【0026】

本明細書で使用される「C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルコキシ」という用語は、3 ~ 8個および好ましくは3 ~ 6個の炭素環員を有する単環式の飽和シクロアルコキシラジカル、例えば(限定されないが)、シクロプロピルオキシ、シクロブチルオキシ、シクロペンチルオキシ、およびシクロヘキシルオキシを指す。これは、他で定義されていない限り、複合置換基の一部としてのシクロアルコキシ、例えば、シクロアルコキシアルキルにも適用される。

【0027】

本明細書で使用される「C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - ハロシクロアルコキシ」という用語は、上記で定義したように、1または複数の水素原子が、同一または異なってもよい1または複数のハロゲン原子で置換されているC<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルコキシ基を指す。

【0028】

本明細書で使用される「C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - アルケニルオキシ」という用語は、「C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルケニル」という用語が本明細書で定義されている、式(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - アルケニル) - O - の基を指す。C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - アルケニルの例には基、エテニルオキシ(または「ビニルオキシ」)基、プロパ - 2 - エン - 1 - イルオキシ(または「アリル」)基、プロパ - 1 - エン - 1 - イルオキシ基、ブト - 3 - エニルオキシ基、ブト - 2 - エニルオキシ基、ブト - 1 - エニルオキシ基、ペント - 4 - エニルオキシ基、ペント - 3 - エニルオキシ基、ペント - 2 - エニルオキシ基、ペント - 1 - エニルオキシ基、ヘキサ - 5 - エニルオキシ基、ヘキサ - 4 - エニルオキシ基、ヘキサ - 3 - エニルオキシ基、ヘキサ - 2 - エニルオキシ基、ヘキサ - 1 - エニルオキシ基、プロパ - 1 - エン - 2 - イルオキシ(または「イソプロペニルオキシ」)基、2 - メチルプロパ - 2 - エニルオキシ基、1 - メチルプロパ - 2 - エニルオキシ基、2 - メチルプロパ - 1 - エニルオキシ基、1 - メチルプロパ - 1 - エニルオキシ基、3 - メチルブト - 3 - エニルオキシ基、2 - メチルブト - 3 - エニルオキシ基、1 - メチルブト - 3 - エニルオキシ基、3 - メチルブト - 2 - エニルオキシ基、2 - メチルブト - 2 - エニルオキシ基、1 - メチルブト - 2 - エニルオキシ基、3 - メチルブト - 1 - エニルオキシ基、2 - メチルブト - 1 - エニルオキシ基、1 - メチルブト - 1 - エニルオキシ基、1, 1 - ジメチルプロパ - 2 - エニルオキシ基、1 - エチルプロパ - 1 - エニルオキシ基、1 - プロピルビニルオキシ基、1 - イソプロピルビニルオキシ基、4 - メチルペント - 4 - エニルオキシ基、3 - メチルペント - 4 - エニルオキシ基、2 - メチルペント - 4 - エニルオキシ基、1 - メチルペント - 4 - エニルオキシ基、4 - メチルペント - 3 - エニルオキシ基、3 - メチルペント - 3 - エニルオキシ基、2 - メチルペント - 3 - エニルオキシ基、1 - メチルペント - 3 - エニルオキシ基、4 - メチルペント - 2 - エニルオキシ基、3 - メチルペント - 2 - エニルオキシ基、2 - メチルペント - 2 - エニルオキシ基、1 - メチルペント - 2 - エニルオキシ基、4 - メチルペント - 1 - エニルオキシ基、3 - メチルペント - 1 - エニルオキシ基、2 - メチルペント - 1 -

エニルオキシ基、1 - メチルプロピル - 1 - エニルオキシ基、3 - エチルプロピル - 3 - エニルオキシ基、2 - エチルプロピル - 3 - エニルオキシ基、1 - エチルプロピル - 3 - エニルオキシ基、3 - エチルプロピル - 2 - エニルオキシ基、2 - エチルプロピル - 2 - エニルオキシ基、1 - エチルプロピル - 2 - エニルオキシ基、3 - エチルプロピル - 1 - エニルオキシ基、2 - エチルプロピル - 1 - エニルオキシ基、1 - エチルプロピル - 1 - エニルオキシ基、2 - プロピルプロパ - 2 - エニルオキシ基、1 - プロピルプロパ - 2 - エニルオキシ基、2 - イソプロピルプロパ - 2 - エニルオキシ基、1 - イソプロピルプロパ - 2 - エニルオキシ基、2 - プロピルプロパ - 1 - エニルオキシ基、1 - プロピルプロパ - 1 - エニルオキシ基、2 - イソプロピルプロパ - 1 - エニルオキシ基、1 - イソプロピルプロパ - 1 - エニルオキシ基、3, 3 - ジメチルプロパ - 1 - エニルオキシ基、1 - (1, 1 - ジメチルエチル) エテニルオキシ基、ブタ - 1, 3 - ジエニルオキシ基、ペンタ - 1, 4 - ジエニルオキシ基、ヘキサ - 1, 5 - ジエニルオキシ基、またはメチルヘキサジエニルオキシ基が挙げられるが、これらに限定されない。

10

## 【0029】

本明細書で使用される「C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルケニルオキシ」という用語は、上記で定義したように、1または複数の水素原子が、同一または異なってもよい1または複数のハロゲン原子で置換されている(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - アルケニル) - O - 基を指す。

## 【0030】

本明細書で使用される「C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルスルファニル」という用語は、「C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル」という用語が本明細書で定義されている、式(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル) - S - の飽和直鎖状または分岐状の基を指す。C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルスルファニルの例には、メチルスルファニル基、エチルスルファニル基、プロピルスルファニル基、イソプロピルスルファニル基、ブチルスルファニル基、sec - ブチルスルファニル基、イソブチルスルファニル基、tert - ブチルスルファニル基、ペンチルスルファニル基、イソペンチルスルファニル基、ヘキシルスルファニル基が挙げられるが、これらに限定されない。

20

## 【0031】

本明細書で使用される「C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキルスルファニル」という用語は、上記で定義したように、1または複数の水素原子が、同一または異なってもよい1または複数のハロゲン原子で置換されているC<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルスルファニルを指す。

30

## 【0032】

本明細書で使用される「C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキルスルファニル」という用語は、3、4、5、6、7、または8個の炭素原子を含み、硫黄原子を介して骨格に結合している飽和1価単環式炭化水素環を指す。単環式C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキルスルファニルの例には、シクロプロピルスルファニル、シクロブチルスルファニル、シクロペンチルスルファニル、シクロヘキシルスルファニル、シクロヘプチルスルファニル、またはシクロオクチルスルファニルが挙げられるが、これらに限定されない。

## 【0033】

本明細書で使用される「C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルスルフィニル」という用語は、「C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル」という用語が本明細書で定義されている、式(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル) - S(=O) - の飽和直鎖状または分岐状の基を指す。C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルスルフィニルの例には、1~8個、好ましくは1~6個、より好ましくは1~4個の炭素原子を有する飽和直鎖状または分岐状アルキルスルフィニルラジカル、例えば(限定されないが)、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、プロピルスルフィニル、1 - メチルエチルスルフィニル、ブチルスルフィニル、1 - メチルプロピルスルフィニル、2 - メチルプロピルスルフィニル、1, 1 - ジメチルエチルスルフィニル、ペンチルスルフィニル、1 - メチルブチルスルフィニル、2 - メチルブチルスルフィニル、3 - メチルブチルスルフィニル、2, 2 - ジメチルプロピルスルフィニル、1 - エチルプロピルスルフィニル、1, 1 - ジメチルプロピルスルフィニル、1, 2 - ジメチルプロピルスルフィニル、ヘキシルスルフィニル、1 - メチルペンチルスルフィニル、2 - メチルペンチルスルフィニル、3 -

40

50

メチルペンチルスルフィニル、4 - メチルペンチルスルフィニル、1, 1 - ジメチルブチルスルフィニル、1, 2 - ジメチルブチルスルフィニル、1, 3 - ジメチルブチルスルフィニル、2, 2 - ジメチルブチルスルフィニル、2, 3 - ジメチルブチルスルフィニル、3, 3 - ジメチルブチルスルフィニル、1 - エチルブチルスルフィニル、2 - エチルブチルスルフィニル、1, 1, 2 - トリメチルプロピルスルフィニル、1, 2, 2 - トリメチルプロピルスルフィニル、1 - エチル - 1 - メチルプロピルスルフィニル、および 1 - エチル - 2 - メチルプロピルスルフィニルなどの C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルスルフィニルが挙げられるが、これらに限定されない。

【0034】

本明細書で使用される「C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキルスルフィニル」という用語は、上記で定義したように、1または複数の水素原子が、同一または異なっている1または複数のハロゲン原子で置換されているC<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルスルフィニルを指す。

10

【0035】

本明細書で使用される「C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキルスルフィニル」という用語は、3、4、5、6、7、または8個の炭素原子を含み、-S(=O)-基を介して骨格に結合している飽和1価単環式炭化水素環を指す。単環式C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキルスルフィニルの例には、シクロプロピルスルフィニル、シクロブチルスルフィニル、シクロペンチルスルフィニル、シクロヘキシルスルフィニル、シクロヘプチルスルフィニル、またはシクロオクチルスルフィニルが挙げられるが、これらに限定されない。

【0036】

本明細書で使用される「C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルスルホニル」という用語は、「C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル」という用語が本明細書で定義されている、式(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル) - S(=O)<sub>2</sub> - の飽和直鎖状または分岐状の基を指す。C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルスルホニルの例には、メチルスルホニル、エチルスルホニル、プロピルスルホニル、1 - メチルエチルスルホニル、ブチルスルホニル、1 - メチルプロピルスルホニル、2 - メチルプロピルスルホニル、1, 1 - ジメチルエチルスルホニル、ペンチルスルホニル、1 - メチルブチルスルホニル、2 - メチルブチルスルホニル、3 - メチルブチルスルホニル、2, 2 - ジメチルプロピルスルホニル、1 - エチルプロピルスルホニル、1, 1 - ジメチルプロピルスルホニル、1, 2 - ジメチルプロピルスルホニル、ヘキシルスルホニル、1 - メチルペンチルスルホニル、2 - メチルペンチルスルホニル、3 - メチルペンチルスルホニル、4 - メチルペンチルスルホニル、1, 1 - ジメチルブチルスルホニル、1, 2 - ジメチルブチルスルホニル、1, 3 - ジメチルブチルスルホニル、2, 2 - ジメチルブチルスルホニル、2, 3 - ジメチルブチルスルホニル、3, 3 - ジメチルブチルスルホニル、1 - エチルブチルスルホニル、2 - エチルブチルスルホニル、1, 1, 2 - トリメチルプロピルスルホニル、1, 2, 2 - トリメチルプロピルスルホニル、1 - エチル - 1 - メチルプロピルスルホニル、および 1 - エチル - 2 - メチルプロピルスルホニルが挙げられるが、これらに限定されない。

20

【0037】

本明細書で使用される「C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキルスルホニル」という用語は、上記で定義したように、1または複数の水素原子が、同一または異なっている1または複数のハロゲン原子で置換されているC<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルスルホニル基を指す。

40

【0038】

本明細書で使用される「C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキルスルホニル」という用語は、3、4、5、6、7、または8個の炭素原子を含み、-S(=O)<sub>2</sub>-基を介して骨格に結合している飽和1価単環式炭化水素環を指す。単環式C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキルスルホニルの例には、シクロプロピルスルホニル、シクロブチルスルホニル、シクロペンチルスルホニル、シクロヘキシルスルホニル、シクロヘプチルスルホニル、またはシクロオクチルスルホニルが挙げられるが、これらに限定されない。

【0039】

本明細書で使用される「C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルカルボニル」という用語は、「C<sub>1</sub> - C

50

「 $C_6$  - アルキル」という用語が本明細書で定義されている、式 ( $C_1 - C_6$  - アルキル) -  $C(=O)$  - の飽和直鎖状または分岐状の基を指す。

【0040】

本明細書で使用される「 $C_1 - C_6$  - ハロアルキルカルボニル」という用語は、上記で定義したように、1または複数の水素原子が、同一または異なってもよい1または複数のハロゲン原子で置換されている  $C_1 - C_6$  - アルキルカルボニルを指す。

【0041】

本明細書で使用される「 $C_1 - C_6$  - アルコキシカルボニル」という用語は、「 $C_1 - C_6$  - アルコキシ」という用語が本明細書で定義されている、式 ( $C_1 - C_6$  - アルコキシ) -  $C(=O)$  - の飽和直鎖状または分岐状の基を指す。

10

【0042】

本明細書で使用される「 $C_1 - C_6$  - ハロアルコキシカルボニル」という用語は、上記で定義したように、1または複数の水素原子が、同一または異なってもよい1または複数のハロゲン原子で置換されている  $C_1 - C_6$  - アルコキシカルボニルを指す。

【0043】

本明細書で使用される「モノ - ( $C_1 - C_6$  - アルキル) アミノ」という用語は、本明細書で定義されるように、1つの  $C_1 - C_6$  - アルキル基を有するアミノラジカルを指す。モノ - ( $C_1 - C_6$  - アルキル) アミノの例には、Nメチルアミノ、N - エチルアミノ、N - イソプロピルアミノ、N - n - プロピルアミノ、N - イソプロピルアミノ、および N - tert - ブチルアミノが挙げられるが、これらに限定されない。

20

【0044】

本明細書で使用される「ジ - ( $C_1 - C_6$ ) - アルキルアミノ」という用語は、本明細書で定義されるように、独立して選択された2つの  $C_1 - C_6$  - アルキル基を有するアミノラジカルを指す。 $C_1 - C_6$  - ジアルキルアミノの例には、N, N - ジメチルアミノ、N, N - ジエチルアミノ、N, N - ジイソプロピルアミノ、N - エチル - N - メチルアミノ、N - メチル - N - n - プロピルアミノ、N - イソプロピル - N - n - プロピルアミノ、および N - tert - ブチル - N - メチルアミノが挙げられるが、これらに限定されない。

【0045】

本明細書で使用される「 $C_3 - C_{12}$  - 炭素環」という用語は、3 ~ 12で変動する全ての環員が炭素原子である飽和または部分不飽和炭化水素環系を指す。この環系は、単環式または多環式（縮合、スピロ、または架橋）であってもよい。 $C_3 - C_{12}$  - 炭素環には、 $C_3 - C_{12}$  - シクロアルキル（単環式または二環式）、 $C_3 - C_{12}$  - シクロアルケニル（単環式または二環式）、単環式  $C_3 - C_8$  - シクロアルキル（例えば、テトラヒドロナフタレニル、インダニル）に縮合したアリール（例えば、フェニル）を含む二環式系、単環式  $C_3 - C_8$  - シクロアルケニル（例えば、インデニル、ジヒドロナフタレニル）に縮合したアリール（例えば、フェニル）を含む二環式系、および1つの炭素原子を介して  $C_3 - C_8$  - シクロアルキルまたは  $C_3 - C_8$  - シクロアルケニルに縮合したアリール（例えば、フェニル）を含む二環式系に結合したシクロプロピルを含む三環式系が含まれるが、これらに限定されない。この  $C_3 - C_{12}$  - 炭素環は、任意の炭素原子を介して親分子部分に結合され得る。

30

40

【0046】

本明細書で使用される「 $C_3 - C_{12}$  - シクロアルケニル」という用語は、3、4、5、6、7、8、9、10、11、または12個の炭素原子および1つまたは2つの二重結合を含む不飽和1価単環式または二環式炭化水素環を指す。単環式  $C_3 - C_8$  - シクロアルケニル基の例には、シクロブテニル、シクロペンテニル、シクロヘキセニル、シクロヘプテニル、およびシクロオクテニル基が含まれるが、これらに限定されない。二環式  $C_6 - C_{12}$  - シクロアルケニル基の例には、ビスクロ[2.2.1]hept-2-エニルまたはビスクロ[2.2.2]oct-2-エニルが含まれるが、これらに限定されない。

50

## 【 0 0 4 7 】

本明細書で使用される「 $C_6 - C_{14}$ -アリール」という用語は、6 ~ 14、好ましくは6 ~ 10で変動する全ての環員が炭素原子である芳香族炭化水素環系を指す。この環系は、単環式または縮合多環式（例えば、二環式または三環式）であってもよい。アリールの例には、フェニル、アズレニル、およびナフチルが挙げられるが、これらに限定されない。

## 【 0 0 4 8 】

本明細書で使用される「3員 ~ 14員ヘテロシクリル」という用語は、酸素、窒素、および硫黄からなる群から独立して選択された1 ~ 4個のヘテロ原子を含む、飽和または部分的に不飽和の3員、4員、5員、6員、7員、8員、9員、10員、11員、12員、13員、または14員環系を指す。この環系が、2個以上の酸素原子を含む場合、それらは直接隣接していない。複素環には、3員 ~ 7員単環式複素環および8員 ~ 14員多環式（例えば、二環式または三環式）複素環が含まれるが、これらに限定されない。この3員 ~ 14員複素環は、複素環内に含まれる任意の炭素原子または窒素原子を介して親分子部分に結合することができる。飽和複素環の例には、オキシラニルおよびアジリジニルなどの3員環、アゼチジニル、オキセタニル、およびチエタニルなどの4員環、テトラヒドロフラニル、1,3-ジオキサニル、テトラヒドロチエニル、ピロリジニル、ピラゾリジニル、イミダゾリジニル、トリアゾリジニル、イソキサゾリジニル、オキサゾリジニル、オキサジアゾリジニル、チアゾリジニル、イソチアゾリジニル、およびチアジアゾリジニルなどの5員環、ペペリジニル、ヘキサヒドロピリダジニル、ヘキサヒドロピリミジニル、ピペラジニル、トリアジナニル (triazinanyl)、ヘキサヒドロトリアジニル、テトラヒドロピラニル、ジオキサニル、テトラヒドロチオピラニル、ジチアニル、モルホリニル、1,2-オキサジナニル (oxazinanyl)、オキサチアニル (oxathiananyl)、およびチオモルホリニルなどの6員環、またはオキセパニル、アゼパニル、1,4-ジアゼパニル、および1,4-オキサゼパニル (oxazepanyl) などの7員環が挙げられるが、これらに限定されない。不飽和複素環の例には、ジヒドロフラニル、1,3-ジオキサニル、ジヒドロチエニル、ピロリニル、ジヒドロイミダゾリル、ジヒドロピラゾリル、イソキサゾリニル、ジヒドロオキサゾリル、およびジヒドロチアゾリルなどの5員環またはピラニル、チオピラニル、チアジニル、およびチアジアジニル (thiadiazinyl) などの6員環が挙げられるが、これらに限定されない。本明細書で定義されるように、二環式複素環は、単環式 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル、単環式 $C_3 - C_8$ -シクロアルケニル、若しくは単環式複素環に縮合した単環式ヘテロアリールからなってもよく、またはアリール（例えば、フェニル）、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル、 $C_3 - C_8$ -シクロアルケニル、若しくは単環式複素環のいずれかに縮合した単環式複素環からなってもよい。2つの単環式複素環または1つの単環式複素環並びに窒素原子を含む1つの単環式ヘテロアリールが縮合する場合、窒素原子は橋頭位にあってもよい（例えば、4,5,6,7-テトラヒドロピラゾロ[1,5-a]ピリジニル、5,6,7,8-テトラヒドロ-[1,2,4]トリアゾロ[1,5-a]ピリジニル、5,6,7,8-テトラヒドロイミダゾ[1,2-a]ピリジニル）。3環式複素環は、二環式複素環に1つの一般的な原子を介して結合された単環式シクロアルキルからなってもよい。

## 【 0 0 4 9 】

本明細書で使用される「3員 ~ 7員ヘテロシクリル」および「3員 ~ 7員ヘテロシクリル環」という用語は、酸素、窒素、および硫黄からなる群から独立して選択された1個または2個のヘテロ原子を含む飽和3員、4員、5員、6員、または7員環系を指す。例として、オキシラニル、アジリジニル、アゼチジニル、オキセタニル、チエタニル、テトラヒドロフラニル、1,3-ジオキサニル、テトラヒドロチエニル、ピロリジニル、ピラゾリジニル、イミダゾリジニル、トリアゾリジニル、イソキサゾリジニル、オキサゾリジニル、オキサジアゾリジニル、チアゾリジニル、イソチアゾリジニル、チアジアゾリジニル、ペペリジニル、ヘキサヒドロピリダジニル、ヘキサヒドロピリミジニル、ピペラジニ

ル、トリアジナニル ( triazinanyl )、ヘキサヒドロトリアジニル、テトラヒドロピラニル、ジオキサニル、テトラヒドロチオピラニル、ジチアニル、モルホリニル、1, 2 - オキサジナニル ( oxazinanyl )、オキサチアニル ( oxathianyl )、チオモルホリニル、オキセパニル、アゼパニル、1, 4 - ジアゼパニル、および 1, 4 - オキサゼパニル ( oxazepanyl ) が挙げられるが、これらに限定されない。好ましい 3 員 ~ 7 員ヘテロシクリルは、オキシラニル、アジリジニル、アゼチジニル、オキセタニル、テトラヒドロフラニル、1, 3 - ジオキソラニル、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペラジニル、テトラヒドロピラニル、ジオキサニル、モルホリニル、およびチオモルホリニルである。

#### 【 0 0 5 0 】

本明細書で使用される「5 員 ~ 1 4 員ヘテロアリアル」という用語は、酸素、窒素、および硫黄からなる群から独立して選択された 1 ~ 4 個のヘテロ原子を含む芳香族環系を指す。この環系が、2 個以上の酸素原子を含む場合、それらは直接隣接していない。芳香族複素環には、5 員または 6 員単環式ヘテロアリアルおよび 7 員 ~ 1 4 員多環式 ( 例えば、二環式または三環式 ) ヘテロアリアルが含まれる。この 5 員 ~ 1 4 員ヘテロアリアルは、複素環内に含まれる任意の炭素原子または窒素原子を介して親分子部分に結合することができる。

10

#### 【 0 0 5 1 】

本明細書で使用される「5 員または 6 員ヘテロアリアル」という用語は、酸素、窒素、および硫黄からなる群から独立して選択された 1、2、3、または 4 個のヘテロ原子を含む 5 員または 6 員芳香族単環式環系を指す。5 員単環式ヘテロアリアルの例には、フリル ( フラニル )、チエニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、トリアゾリル、テトラゾイル、イソキサゾイル、オキサゾリル、オキサジアゾリル、オキサトリアゾリル、イソチアゾリル、チアゾリル、チアジアゾリル、およびチアトリアゾリルが挙げられるが、これらに限定されない。6 員単環式ヘテロアリアルの例には、ピリジニル、ピリダジニル、ピリミジニル、ピラジニル、トリアジニル、およびテトラジニルが挙げられるが、これらに限定されない。

20

#### 【 0 0 5 2 】

本明細書で使用される「7 員 ~ 1 4 員ヘテロアリアル」という用語は、酸素、窒素、および硫黄からなる群から独立して選択された 1 個、2 個、または 3 個のヘテロ原子を含む 7 員、8 員、9 員、1 0 員、1 1 員、1 2 員、1 3 員、または 1 4 員芳香族多環式 ( 例えば、二環式または三環式 ) 環系を指す。本明細書で定義されるように、二環式ヘテロアリアルは、アリアル ( 例えば、フェニル ) または単環式ヘテロアリアルに縮合した単環式ヘテロアリアルからなってもよい。二環式ヘテロアリアルの例には、インドリル、インドリジニル、イソインドリル、ベンズイミダゾリル、イミダゾピリジニル、インダゾリル、ベンゾトリアゾリル、プリニル、ベンゾフラニル、ベンゾチオフェニル、ベンゾチアゾリル、ベンゾオキサゾリル、およびベンズイソキサゾリルなどの 9 員環またはキノリニル、イソキノリニル、シンノリニル、キナゾリニル、キノキサリニル、フトラジニル、ナフチリジニル、プテリディナル ( pteridinal )、およびベンゾジオキシニルなどの 1 0 員環が挙げられるが、これらに限定されない。2 個の縮合 5 員または 6 員単環式ヘテロアリアルを含む 9 員または 1 0 員二環式ヘテロアリアルにおいて、窒素原子は、橋頭位 ( 例えば、イミダゾ [ 1, 2 - a ] ピリジニル、[ 1, 2, 4 ] トリアゾロ [ 4, 3 - a ] ピリジニル、イミダゾ [ 1, 2 - a ] ピリジニル、イミダゾ [ 2, 1 - b ] オキサゾリル、フロ [ 2, 3 - d ] イソキサゾリル ) にあってもよい。三環式芳香族複素環の例には、カルバゾイル、アクリジニル、およびフェナジニルが挙げられるが、これらに限定されない。

30

40

#### 【 0 0 5 3 】

本明細書で使用される「C<sub>3</sub> - C<sub>12</sub> - カルボシクリルオキシ」、「C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルコキシ」、「C<sub>6</sub> - C<sub>14</sub> - アリアルオキシ」、「5 員 ~ 1 4 員ヘテロアリアルオキシ」、および「3 員 ~ 1 4 員ヘテロシクリルオキシ」という用語は、本明細書で定義さ

50

れるように、RはそれぞれC<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>-カルボシクリル、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-シクロアルキル、C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>-アリール、5員~14員ヘテロアリール、または3員~14員ヘテロシクリル基である式-O-Rの基を指定する。

【0054】

本明細書で使用される「脱離基」という用語は、置換または脱離反応において化合物から置換される基、例えば、ハロゲン原子、トリフルオロメタンスルホネート（「トリフレート」）基、アルコキシ、メタンスルホネート、p-トルエンスルホネートなどを意味すると理解されたい。

【0055】

「本明細書に記載されているように」という語句は、変数Q、T、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、R<sup>7</sup>、R<sup>8</sup>、n、およびmに言及する場合、変数の広い定義、並びにもしあれば、好ましい、より好ましい、さらにより好ましい、および特に好ましいものを参照により組み込む。

10

【0056】

自然の法則に反し、したがって当業者がその専門知識に基づいて除外する組み合わせから生じる化合物は、本明細書に包含されない。例えば、3つ以上の隣接する酸素原子を有する環構造は除外される。

【0057】

式(I)の化合物は、適切には、それらの遊離形態、塩形態、N-オキシド形態、または溶媒和物形態（例えば水和物）であり得る。

20

【0058】

置換基の性質に応じて、式(I)の化合物は、異なる立体異性体の形態で存在し得る。これらの立体異性体は、例えば、エナンチオマー、ジアステレオマー、アトロプ異性体、または幾何異性体である。したがって、本発明は、純粋な立体異性体およびこれらの異性体の任意の混合物の両方を包含する。化合物が平衡状態で2つ以上の互変異性体の形で存在できる場合、1つの互変異性体の説明による化合物への言及は、全ての互変異性体の形態を含むと見なされる。

【0059】

本発明の化合物のいずれも、化合物中の二重結合の数に応じて、1または複数の幾何異性体形態で存在してもよい。二重結合または環に関する置換基の性質による幾何異性体は、シス(=Z-)またはトランス(=E-)の形態で存在する場合がある。したがって、本発明は、全ての幾何異性体およびあらゆる比率の全ての可能な混合物に等しく関する。

30

【0060】

置換基の性質に応じて、式(I)の化合物は、遊離化合物および/または農薬活性塩などのその塩の形態で存在し得る。

【0061】

農薬活性塩には、無機酸および有機酸の酸付加塩並びに慣用の塩基の塩が含まれる。無機酸の例には、フッ化水素、塩化水素、臭化水素、およびヨウ化水素などのハロゲン化水素酸、硫酸、リン酸、硝酸、並びに重硫酸ナトリウムおよび重硫酸カリウムなどの酸性塩が挙げられる。有用な有機酸には、例えば、ギ酸、アルカン酸（炭酸、酢酸、トリフルオロ酢酸、トリクロロ酢酸、およびプロピオン酸など）、またグリコール酸、チオシアン酸、乳酸、コハク酸、クエン酸、安息香酸、桂皮酸、シュウ酸、6~20個の炭素原子を有する飽和または一価若しくは二価不飽和脂肪酸、アルキル硫酸モノエステル、アルキルスルホン酸（1~20個の炭素原子を有する直鎖状または分枝状アルキル基を有するスルホン酸）、アリールスルホン酸またはアリールジスルホン酸（1つまたは2つのスルホン酸基を有するフェニルおよびナフチルなどの芳香族ラジカル）、アルキルホスホン酸（1~20個の炭素原子を有する直鎖状または分枝状アルキルラジカルを有するホスホン酸）、並びにアリールホスホン酸またはアリールジホスホン酸（1つまたは2つのホスホン酸ラジカルを有するフェニルおよびナフチルなどの芳香族ラジカル）（アルキル基およびアリール基は、さらなる置換基、例えば、p-トルエンスルホン酸、サリチル酸、p-アミノ

40

50



サリチル酸、2 - フェノキシ安息香酸、2 - アセトキシ安息香酸、などを有していてもよい)が挙げられる。

【0062】

本発明の化合物またはその塩の溶媒和物は、化合物と溶媒との化学量論的組成物である。

【0063】

本発明の化合物は、多結晶および/または非晶質形態で存在し得る。結晶形には、非溶媒和結晶形、溶媒和物、および水和物が含まれる。

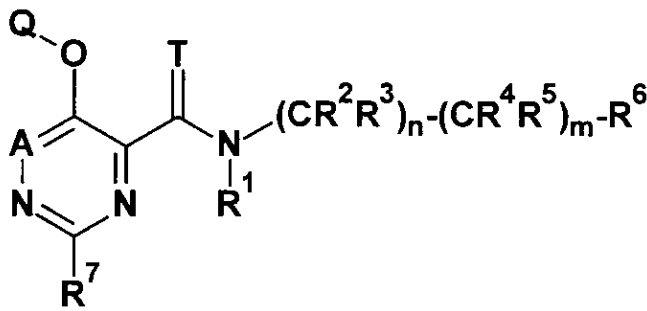
【0064】

一実施形態では、本発明は、式(I)：

10

【0065】

【化2】



20

【0066】

(式中、

Aは、窒素(N)またはC-R<sup>8</sup>であって、

Tは、酸素(O)または硫黄(S)であり、

nは、0または1、

mは、0または1、

R<sup>1</sup>は、水素、ヒドロキシル、シアノ、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルコキシ-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル、-C(=O)R<sup>10</sup>、-C(=O)(OR<sup>11</sup>)、-S(=O)R<sup>12</sup>、-S(=O)<sub>2</sub>R<sup>12</sup>、-C(=O)N(R<sup>13</sup>)<sub>2</sub>、またはS(=O)<sub>2</sub>N(R<sup>14</sup>)<sub>2</sub>であって、

30

R<sup>10</sup>、R<sup>11</sup>、およびR<sup>12</sup>は独立してC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-シクロアルキル、またはC<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-アルケニルであり、

R<sup>13</sup>およびR<sup>14</sup>は独立して水素、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-シクロアルキル、またはC<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-アルケニルであり、

R<sup>2</sup>およびR<sup>3</sup>は独立して水素、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、カルボキシル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルコキシカルボニル、若しくはC<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-シクロアルキルであるか、

40

または

R<sup>2</sup>およびR<sup>3</sup>は、それらが結合している炭素原子と一緒に、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-シクロアルキル環若しくは3員~7員ヘテロシクリル環を形成し、

R<sup>4</sup>およびR<sup>5</sup>は独立して水素、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、カルボキシル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルコキシカルボニル、若しくはC<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-シクロアルキルであるか、

または

R<sup>4</sup>およびR<sup>5</sup>は、それらが結合している炭素原子と一緒に、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-シクロアルキル環若しくは3員~7員ヘテロシクリル環を形成し、

または

50

R<sup>2</sup> および R<sup>4</sup> は、それらが結合している炭素原子と一緒にあって、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキル環若しくは 3 員 ~ 7 員ヘテロシクリル環を形成し、

および

R<sup>3</sup> および R<sup>5</sup> は独立して水素またはハロゲンであり、

または

R<sup>2</sup> および R<sup>4</sup> は一緒に式  $^{**} - C(R^3) = C(R^5) - \#\#$

(式中、

$^{**}$  は N(R<sup>1</sup>) への結合点であり、

$\#\#$  は R<sup>6</sup> への結合点である) の基を形成し、

並びに

R<sup>3</sup> および R<sup>5</sup> は独立して水素または C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルであり、

R<sup>6</sup> は、C<sub>3</sub> - C<sub>12</sub> - 炭素環、C<sub>6</sub> - C<sub>14</sub> - アリール、3 員 ~ 14 員ヘテロシクリル、5 員 ~ 14 員ヘテロアリール、C<sub>3</sub> - C<sub>12</sub> - カルボシクリルオキシ、C<sub>6</sub> - C<sub>14</sub> - アリールオキシ、5 員 ~ 14 員ヘテロアリールオキシ、3 員 ~ 14 員ヘテロシクリルオキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> - アルコキシ、または C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> - ハロアルコキシであって、

C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> - アルコキシおよび C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> - ハロアルコキシは、C<sub>3</sub> - C<sub>12</sub> - 炭素環、C<sub>6</sub> - C<sub>14</sub> - アリール、3 員 ~ 14 員ヘテロシクリル、および 5 員 ~ 14 員ヘテロアリールからなる群から選択される 1 個の置換基で独立して置換され、

前記 C<sub>3</sub> - C<sub>12</sub> - 炭素環、C<sub>6</sub> - C<sub>14</sub> - アリール、3 員 ~ 14 員ヘテロシクリル、および 5 員 ~ 14 員ヘテロアリールは順番に 1 ~ 4 個の R<sup>6S</sup> 置換基で所望により置換され、

C<sub>3</sub> - C<sub>12</sub> - 炭素環、C<sub>6</sub> - C<sub>14</sub> - アリール、3 員 ~ 14 員ヘテロシクリル、5 員 ~ 14 員ヘテロアリール、C<sub>3</sub> - C<sub>12</sub> - カルボシクリルオキシ、C<sub>6</sub> - C<sub>14</sub> - アリールオキシ、5 員 ~ 14 員ヘテロアリールオキシ、および 3 員 ~ 14 員ヘテロシクリルオキシは 1 ~ 4 個の R<sup>6S</sup> 置換基で所望により置換され、

R<sup>6S</sup> は、ハロゲン、シアノ、イソシアノ、ニトロ、ヒドロキシル、メルカプト、ペンタフルオロスルファニル、オキソ、メチリデン、ハロメチリデン、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルコキシ、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - アルケニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルケニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - アルキニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - アルケニルオキシ、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルケニルオキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルスルファニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキルスルファニル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキルスルファニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキルスルフィニル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキルスルフィニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルスルホニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキルスルホニル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキルスルホニル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルコキシ、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルケニル、C<sub>6</sub> - C<sub>14</sub> - アリール、5 員または 6 員ヘテロアリール、3 員 ~ 7 員ヘテロシクリル、- N(R<sup>15</sup>)<sub>2</sub>、- C(=O)R<sup>16</sup>、- C(=O)(OR<sup>17</sup>)、- C(=O)N(R<sup>18</sup>)<sub>2</sub>、- S(=O)<sub>2</sub>N(R<sup>19</sup>)<sub>2</sub>、- O-Si(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル)<sub>3</sub>、または - Si(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル)<sub>3</sub> であり、

前記 C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルコキシ、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - アルケニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルケニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - アルキニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - アルケニルオキシ、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルケニルオキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルスルファニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキルスルファニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキルスルフィニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルスルホニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキルスルホニル、- O-Si(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル)<sub>3</sub>、および - Si(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル)<sub>3</sub> は、シアノ、ヒドロキシル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルコキシ、- O-Si(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル)<sub>3</sub>、- Si(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル)<sub>3</sub>、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - ハロシクロアルキル、および 3 員 ~ 7 員ヘテロシクリルからなる群から独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基でさらに所望により置換され

10

20

30

40

50

並びに

前記  $C_3 - C_8$  - シクロアルキルスルファニル、 $C_3 - C_8$  - シクロアルキルスルフィニル、 $C_3 - C_8$  - シクロアルキルスルホニル、 $C_3 - C_8$  - シクロアルキル、 $C_3 - C_8$  - シクロアルコキシ、 $C_3 - C_8$  - シクロアルケニル、 $C_6 - C_{14}$  - アリール、5員または6員ヘテロアリール、および3員~7員ヘテロシクリルは、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、ホルミル、カルボキシル、オキソ、メチリデン、ハロメチリデン、 $C_1 - C_6$  - アルキル、 $C_1 - C_6$  - ハロアルキル、 $C_1 - C_6$  - アルコキシ、 $C_1 - C_6$  - ハロアルコキシ、 $C_1 - C_6$  - アルコキシカルボニル、 $C_1 - C_6$  - ハロアルコキシカルボニル、 $C_2 - C_6$  - アルケニル、 $C_3 - C_8$  - シクロアルキル、および  $C_3 - C_8$  - ハロシクロアルキルからなる群から独立して選択される1~4個の置換基でさらに所望により置換されるか、

10

または

同一の炭素原子に結合された2個の  $C_1 - C_6$  - アルキル置換基は、 $C_3 - C_8$  - シクロアルキル環を形成し、

または

2個の  $R^{6S}$  置換基は所望によりそれらが結合している炭素原子と一緒になって  $C_3 - C_8$  - シクロアルキル環を形成し、

並びに

$R^{15}$  は、水素、 $C_1 - C_6$  - アルキル、または  $C_3 - C_8$  - シクロアルキルであつて、

20

前記  $C_1 - C_6$  - アルキルは、シアノ、ヒドロキシル、 $C_1 - C_6$  - アルコキシ、 $C_1 - C_6$  - ハロアルコキシ、 $-O-Si(C_1 - C_6 - アルキル)_3$ 、 $-Si(C_1 - C_6 - アルキル)_3$ 、 $C_3 - C_8$  - シクロアルキル、 $C_3 - C_8$  - ハロシクロアルキル、および3員~7員ヘテロシクリルからなる群から独立して選択される1~3個の置換基でさらに所望により置換され、

並びに

前記  $C_3 - C_8$  - シクロアルキルは、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、ホルミル、カルボキシル、オキソ、メチリデン、ハロメチリデン、 $C_1 - C_6$  - アルキル、 $C_1 - C_6$  - ハロアルキル、 $C_1 - C_6$  - アルコキシ、 $C_1 - C_6$  - ハロアルコキシ、 $C_1 - C_6$  - アルコキシカルボニル、 $C_1 - C_6$  - ハロアルコキシカルボニル、 $C_2 - C_6$  - アルケニル、 $C_3 - C_8$  - シクロアルキル、および  $C_3 - C_8$  - ハロシクロアルキルからなる群から独立して選択される1~4個の置換基でさらに所望により置換され、

30

$R^{16}$ 、 $R^{17}$ 、 $R^{18}$ 、および  $R^{19}$  は独立して水素、 $C_1 - C_6$  - アルキル、または  $C_1 - C_6$  - ハロアルキルであつて、

前記  $C_1 - C_6$  - アルキルまたは  $C_1 - C_6$  - ハロアルキルは、シアノ、ヒドロキシル、 $C_1 - C_6$  - アルコキシ、 $C_1 - C_6$  - ハロアルコキシ、 $-O-Si(C_1 - C_6 - アルキル)_3$ 、 $-Si(C_1 - C_6 - アルキル)_3$ 、 $C_3 - C_8$  - シクロアルキル、 $C_3 - C_8$  - ハロシクロアルキル、および3員~7員ヘテロシクリルからなる群から独立して選択される1~3個の置換基でさらに所望により置換され、

40

$R^7$  は、水素、ハロゲン、シアノ、イソシアノ、ヒドロキシル、メルカプト、ニトロ、アミノ、ホルミル、 $C_1 - C_6$  - アルキル、 $C_1 - C_6$  - ハロアルキル、 $C_1 - C_6$  - ヒドロキシアルキル、 $C_1 - C_6$  - アルキルカルボニル、 $C_1 - C_6$  - ハロアルキルカルボニル、 $C_1 - C_6$  - アルコキシ、 $C_1 - C_6$  - ハロアルコキシ、 $C_2 - C_6$  - アルケニル、 $C_2 - C_6$  - ハロアルケニル、 $C_2 - C_6$  - アルキニル、 $C_2 - C_6$  - ハロアルキニル、 $C_2 - C_6$  - アルケニルオキシ、 $C_2 - C_6$  - ハロアルケニルオキシ、 $C_2 - C_6$  - アルキニルオキシ、 $C_2 - C_6$  - ハロアルキニルオキシ、 $C_1 - C_6$  - アルキルスルファニル、 $C_1 - C_6$  - ハロアルキルスルファニル、 $C_3 - C_8$  - シクロアルキルスルファニル、 $C_1 - C_6$  - アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$  - ハロアルキルスルフィニル、 $C_3 - C_8$  - シクロアルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$  - アルキルスルホニル、 $C_1 - C_6$  - ハ

50

ロアルキルスルホニル、 $C_3 - C_8$  - シクロアルキルスルホニル、 $C_3 - C_8$  - シクロアルキル、 $C_3 - C_6$  - シクロアルケニル、 $C_6 - C_{14}$  - アリール、5員または6員ヘテロアリール、3員~7員ヘテロシクリル、 $C_3 - C_8$  - シクロアルコキシ、 $C_6 - C_{14}$  - アリールオキシ、5員または6員ヘテロアリールオキシ、3員~7員ヘテロシクリルオキシ、 $-O-Si(C_1 - C_6 - アルキル)_3$ 、 $-Si(C_1 - C_6 - アルキル)_3$ 、 $-N(R^{20})_2$ 、 $-C(=NR^{21})R^{22}$ 、 $-NR^{23}C(=O)R^{24}$ 、 $-C(=O)(OR^{25})$ 、 $-C(=O)N(R^{26})_2$ 、 $-S(=O)_2N(R^{27})_2$ 、または $-S(=O)(=NR^{28})R^{29}$ であって、

$C_1 - C_6$  - アルキル、 $C_1 - C_6$  - ハロアルキル、 $C_1 - C_6$  - ヒドロキシアルキル、 $C_1 - C_6$  - アルキルカルボニル、 $C_1 - C_6$  - ハロアルキルカルボニル、 $C_1 - C_6$  - アルコキシ、 $C_1 - C_6$  - ハロアルコキシ、 $C_2 - C_6$  - アルケニル、 $C_2 - C_6$  - ハロアルケニル、 $C_2 - C_6$  - アルキニル、 $C_2 - C_6$  - ハロアルキニル、 $C_2 - C_6$  - アルケニルオキシ、 $C_2 - C_6$  - ハロアルケニルオキシ、 $C_2 - C_6$  - アルキニルオキシ、 $C_2 - C_6$  - ハロアルキニルオキシ、 $C_1 - C_6$  - アルキルスルファニル、 $C_1 - C_6$  - ハロアルキルスルファニル、 $C_1 - C_6$  - アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$  - ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$  - アルキルスルホニル、および $C_1 - C_6$  - ハロアルキルスルホニルは所望により1~3個の $R^{7S^a}$ 置換基で置換され、

$C_3 - C_8$  - シクロアルキルスルファニル、 $C_3 - C_8$  - シクロアルキルスルフィニル、 $C_3 - C_8$  - シクロアルキルスルホニル、 $C_3 - C_8$  - シクロアルキル、 $C_3 - C_6$  - シクロアルケニル、 $C_6 - C_{14}$  - アリール、5員または6員ヘテロアリール、3員~7員ヘテロシクリル、 $C_3 - C_8$  - シクロアルコキシ、 $C_6 - C_{14}$  - アリールオキシ、5員または6員ヘテロアリールオキシ、および3員~7員ヘテロシクリルオキシは所望により1~3個の $R^{7S^c}$ 置換基で置換され、

並びに

$R^{20}$ は、水素、 $C_1 - C_6$  - アルキル、 $C_1 - C_6$  - ハロアルキル、 $C_1 - C_6$  - アルコキシ、 $C_2 - C_6$  - アルケニル、 $C_2 - C_6$  - ハロアルケニル、 $C_2 - C_6$  - アルキニル、 $C_2 - C_6$  - ハロアルキニル、 $C_3 - C_8$  - シクロアルキル、 $C_3 - C_8$  - ハロシクロアルキル、 $C_6 - C_{14}$  - アリール、5員または6員ヘテロアリール、または3員~7員ヘテロシクリルであって、

$C_1 - C_6$  - アルキル、 $C_1 - C_6$  - ハロアルキル、 $C_1 - C_6$  - アルコキシ、 $C_2 - C_6$  - アルケニル、 $C_2 - C_6$  - ハロアルケニル、 $C_2 - C_6$  - アルキニル、および $C_2 - C_6$  - ハロアルキニルは所望により1~3個の $R^{7S^a}$ 置換基で置換され、

および

$C_3 - C_8$  - シクロアルキル、 $C_3 - C_8$  - ハロシクロアルキル、 $C_6 - C_{14}$  - アリール、5員または6員ヘテロアリール、および3員~7員ヘテロシクリルは所望により1~3個の置換基 $R^{7S^c}$ で置換され、

$R^{21}$ および $R^{22}$ は独立してヒドロキシル、アミノ、シアノ、 $C_1 - C_6$  - アルキル、 $C_1 - C_6$  - ハロアルキル、 $C_1 - C_6$  - アルコキシ、モノ- ( $C_1 - C_6$  - アルキル)アミノ、またはジ- ( $C_1 - C_6$  - アルキル)アミノであって、

$C_1 - C_6$  - アルキル、 $C_1 - C_6$  - ハロアルキル、 $C_1 - C_6$  - アルコキシ、モノ- ( $C_1 - C_6$  - アルキル)アミノ、またはジ- ( $C_1 - C_6$  - アルキル)アミノは所望により1~3個の $R^{7S^a}$ 置換基で置換され、

$R^{23}$ 、 $R^{24}$ 、 $R^{25}$ 、 $R^{26}$ 、 $R^{27}$ 、 $R^{28}$ 、および $R^{29}$ は独立して水素、 $C_1 - C_6$  - アルキル、 $C_1 - C_6$  - ハロアルキル、および $C_3 - C_8$  - シクロアルキルであって、

$C_1 - C_6$  - アルキルおよび $C_1 - C_6$  - ハロアルキルは所望により1~3個の置換基 $R^{7S^a}$ で置換され、

および

$C_3 - C_8$  - シクロアルキルは所望により1~3個の置換基 $R^{7S^c}$ で置換され、 $R^{7S^a}$ は独立してシアノ、ヒドロキシル、カルボキシル、 $C_1 - C_6$  - アルコキシ

、 $C_1 - C_6$  - ハロアルコキシ、 $C_3 - C_8$  - シクロアルキル、 $C_3 - C_8$  - ハロシクロアルキル、 $C_1 - C_6$  - アルコキシカルボニル、 $-O-Si(C_1 - C_6 - アルキル)_3$ 、 $-Si(C_1 - C_6 - アルキル)_3$ 、 $C_6 - C_{14}$  - アリール、または3員~7員ヘテロシクリルであり、

$R^{7S}$  は独立してハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、ホルミル、オキソ、メチリデン、ハロメチリデン、 $C_1 - C_6$  - アルキル、 $C_1 - C_6$  - ハロアルキル、 $C_1 - C_6$  - アルコキシ、 $C_1 - C_6$  - ハロアルコキシ、 $C_2 - C_6$  - アルケニル、 $C_3 - C_8$  - シクロアルキル、 $C_3 - C_8$  - ハロシクロアルキル、 $-O-Si(C_1 - C_6 - アルキル)_3$ 、若しくは3員~7員ヘテロシクリルであるか、

または

同一の炭素原子に結合された $C_1 - C_6$  - アルキルの2個の置換基 $R^{7S}$ は、 $C_3 - C_8$  - シクロアルキルを形成し、

$R^8$  は、水素またはハロゲンであり、

Qは、 $C_6 - C_{14}$  - アリール、 $C_3 - C_{12}$  - 炭素環、3員~14員ヘテロシクリル、または5員~14員ヘテロアリールであって、

$C_6 - C_{14}$  - アリール、 $C_3 - C_{12}$  - 炭素環、3員~14員ヘテロシクリル、および5員~14員ヘテロアリールは、ハロゲン、シアノ、イソシアノ、ニトロ、ヒドロキシル、メルカプト、ホルミル、カルボキシル、 $C_1 - C_6$  - アルキル、 $C_1 - C_6$  - ハロアルキル、 $C_1 - C_6$  - アルキルカルボニル、 $C_1 - C_6$  - ハロアルキルカルボニル、 $C_1 - C_6$  - アルコキシ、 $C_1 - C_6$  - ハロアルコキシ、 $C_1 - C_6$  - アルコキシ -  $C_1 - C_6$  - アルキル、 $C_1 - C_6$  - アルコキシカルボニル、 $C_1 - C_6$  - ハロアルコキシカルボニル、 $C_2 - C_6$  - アルケニル、 $C_2 - C_6$  - ハロアルケニル、 $C_2 - C_6$  - アルキニル、 $C_2 - C_6$  - ハロアルキニル、 $C_2 - C_6$  - アルケニルオキシ、 $C_2 - C_6$  - ハロアルケニルオキシ、 $C_1 - C_6$  - アルキルスルファニル、 $C_1 - C_6$  - ハロアルキルスルファニル、 $C_1 - C_6$  - アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$  - ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$  - アルキルスルホニル、 $C_1 - C_6$  - ハロアルキルスルホニル、 $C_3 - C_8$  - シクロアルキル、 $C_3 - C_8$  - シクロアルコキシ、 $C_3 - C_6$  - シクロアルケニル、3員~7員ヘテロシクリル、5員~14員ヘテロアリール、 $-O-Si(C_1 - C_6 - アルキル)_3$ 、 $-Si(C_1 - C_6 - アルキル)_3$ 、 $-O-C(=O)R^{33}$ 、 $-NR^{34}C(=O)R^{35}$ 、 $-C(=O)N(R^{36})_2$ 、 $C(=S)R^{37}$ 、 $-C(=S)N(R^{38})_2$ 、 $-C(=NR^{39})R^{40}$ 、 $-C(=NOR^{41})R^{42}$ 、および $-N(R^{43})_2$ からなる群から独立して選択される1~5個の $Q^S$ 置換基で置換され、

前記 $C_1 - C_6$  - アルキル、 $C_1 - C_6$  - ハロアルキル、 $C_1 - C_6$  - アルキルカルボニル、 $C_1 - C_6$  - ハロアルキルカルボニル、 $C_1 - C_6$  - アルコキシ、 $C_1 - C_6$  - ハロアルコキシ、 $C_1 - C_6$  - アルコキシ -  $C_1 - C_6$  - アルキル、 $C_1 - C_6$  - アルコキシカルボニル、 $C_1 - C_6$  - ハロアルコキシカルボニル、 $C_2 - C_6$  - アルケニル、 $C_2 - C_6$  - ハロアルケニル、 $C_2 - C_6$  - アルキニル、 $C_2 - C_6$  - ハロアルキニル、 $C_2 - C_6$  - アルケニルオキシ、 $C_2 - C_6$  - ハロアルケニルオキシ、 $C_1 - C_6$  - アルキルスルファニル、 $C_1 - C_6$  - ハロアルキルスルファニル、 $C_1 - C_6$  - アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$  - ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$  - アルキルスルホニル、 $C_1 - C_6$  - ハロアルキルスルホニル、 $-O-Si(C_1 - C_6 - アルキル)_3$ 、および $-Si(C_1 - C_6 - アルキル)_3$ は、シアノ、アミノ、ニトロ、ヒドロキシル、 $C_1 - C_6$  - アルコキシ、 $C_1 - C_6$  - ハロアルコキシ、 $C_1 - C_6$  - アルコキシカルボニル、 $C_1 - C_6$  - ハロアルコキシカルボニル、 $C_3 - C_8$  - シクロアルキル、 $C_3 - C_8$  - ハロシクロアルキル、 $-Si(C_1 - C_6 - アルキル)_3$ 、および3員~7員ヘテロシクリルからなる群から独立して選択される1~3個の置換基で所望により置換され、

前記 $C_3 - C_8$  - シクロアルキル、 $C_3 - C_8$  - シクロアルコキシ、 $C_3 - C_6$  - シクロアルケニル、3員~7員ヘテロシクリル、および5員~14員ヘテロアリールは、ハロゲン、シアノ、アミノ、ニトロ、ヒドロキシル、ホルミル、カルボキシル、オキソ、メチリデン、ハロメチリデン、 $C_1 - C_6$  - アルキル、 $C_1 - C_6$  - ハロアルキル、 $C_1$

10

20

30

40

50

- C<sub>6</sub> - アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシカルボニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルコキシカルボニル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - ハロシクロアルキル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - アルケニル、および3員～7員ヘテロシクリルからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で所望により置換され、

前記C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - ハロシクロアルキル、および3員～7員ヘテロシクリルは順番にそれらが結合している炭素原子と一緒になってC<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキルを形成する2個の置換基で所望により置換される)の化合物、

R<sup>34</sup>、R<sup>35</sup>、R<sup>36</sup>、R<sup>37</sup>、R<sup>38</sup>、R<sup>39</sup>、R<sup>40</sup>、R<sup>41</sup>、およびR<sup>42</sup>は独立して水素、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキル、またはC<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシであって、

前記C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキル、およびC<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシは、シアノ、アミノ、ニトロ、ヒドロキシル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシカルボニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルコキシカルボニル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - ハロシクロアルキル、- Si (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル)<sub>3</sub>、および3員～7員ヘテロシクリルからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で所望により置換され、

並びに

R<sup>43</sup>は水素、ヒドロキシル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシ、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - アルケニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルケニル、またはC<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキルであって、

前記C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシ、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - アルケニル、およびC<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルケニルは、シアノ、アミノ、ニトロ、ヒドロキシル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシカルボニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルコキシカルボニル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - ハロシクロアルキル、- Si (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル)<sub>3</sub>、および3員～7員ヘテロシクリルからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で所望により置換され、

前記C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキルは、ハロゲン、シアノ、アミノ、ニトロ、ヒドロキシル、ホルミル、カルボキシル、オキソ、メチリデン、ハロメチリデン、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシカルボニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルコキシカルボニル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - ハロシクロアルキル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - アルケニル、および3員～7員ヘテロシクリルからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で所望により置換され、

前記C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - ハロシクロアルキル、および3員～7員ヘテロシクリルは順番にそれらが結合している炭素原子と一緒になってC<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキルを形成する2個の置換基で所望により置換される)の化合物、

並びにそれらの塩、N - オキシド、および溶媒和物に関する。

#### 【0067】

好ましい実施形態では、本発明は、一般式(I)の化合物であって、

Aは、窒素(N)またはC - R<sup>8</sup>であって、

R<sup>8</sup>は、水素であり、

Tは、酸素(O)であり、

nは、0または1、

mは、0または1、

R<sup>1</sup>は、水素、ヒドロキシル、シアノ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、- C(=O)R<sup>10</sup>、またはC(=O)(OR<sup>11</sup>)であって、

R<sup>10</sup>およびR<sup>11</sup>は独立してC<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルまたはC<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - アルケニルであり、

10

20

30

40

50

R<sup>2</sup> および R<sup>3</sup> は独立して水素、ハロゲン、シアノ、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルコキシカルボニル、若しくは C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - シクロアルキルであるか、

または

R<sup>2</sup> および R<sup>3</sup> は、それらが結合している炭素原子と一緒にあって、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - シクロアルキル環を形成し、

R<sup>4</sup> および R<sup>5</sup> は独立して水素、ハロゲン、ヒドロキシル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、若しくは C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキルであるか、

または

R<sup>4</sup> および R<sup>5</sup> は、それらが結合している炭素原子と一緒にあって、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - シクロアルキル環、オキセタニル環、アゼチジニル環、テトラヒドロフラニル環、ピロリジニル環、若しくはテトラヒドロピラニル環を形成し、

または

R<sup>2</sup> および R<sup>4</sup> は一緒に式 \* \* - C ( R<sup>3</sup> ) = C ( R<sup>5</sup> ) - # #

( 式中

\* \* は N ( R<sup>1</sup> ) への結合点であり、

# # は R<sup>6</sup> への結合点である ) の基を形成し、

並びに

R<sup>3</sup> および R<sup>5</sup> は独立して水素、ハロゲン、または C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルであり、

R<sup>6</sup> は、インダニル、テトラヒドロナフタレニル、スピロ [ シクロプロパン - 1 , 2 ' - インダン ] イル、フェニル、ナフチル、ジヒドロベンゾフラニル、クロマニル、イソクロマニル、チオクロマニル、イソチオクロマニル、1 , 3 - ベンゾジオキサソリル、ジヒドロ - 1 , 4 - ベンゾジオキシニル、テトラヒドロベンゾチオフェニル、テトラヒドロベンゾチアゾリルフラニル、ピラゾリル、チエニル、ピリジニル、ピリミジニル、インドリル、ベンゾオキサゾリル、イミダゾピリジニル、キノリニル、イソキノリニル、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> - アルコキシ、または C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> - ハロアルコキシであって、

C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> - アルコキシおよび C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> - ハロアルコキシは、フェニル、ナフチル、フラニル、ピラゾリル、チエニル、ピリジニル、ピリミジニル、インドリル、ベンゾオキサゾリル、イミダゾピリジニル、キノリニルおよびイソキノリニルからなる群から選択される 1 個の置換基で独立して置換され、

前記フェニル、ナフチル、フラニル、ピラゾリル、チエニル、ピリジニル、ピリミジニル、インドリル、ベンゾオキサゾリル、イミダゾピリジニル、キノリニル、およびイソキノリニルは、1 または 2 個の R<sup>6 S</sup> 置換基で順番に所望により置換され、

インダニル、テトラヒドロナフタレニル、スピロ [ シクロプロパン - 1 , 2 ' - インダン ] イル、フェニル、ナフチル、ジヒドロベンゾフラニル、クロマニル、イソクロマニル、チオクロマニル、イソチオクロマニル、1 , 3 - ベンゾジオキサソリル、ジヒドロ - 1 , 4 - ベンゾジオキシニル、テトラヒドロベンゾチオフェニル、テトラヒドロベンゾチアゾリル、フラニル、ピラゾリル、チエニル、ピリジニル、ピリミジニル、インドリル、ベンゾオキサゾリル、イミダゾピリジニル、キノリニル、およびイソキノリニルは所望により 1 ~ 4 個の R<sup>6 S</sup> 置換基で置換され、

R<sup>6 S</sup> は独立してハロゲン、シアノ、オキソ、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルコキシ、C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub> - アルケニル、C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルケニル、C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub> - アルキニル、C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルキニル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - シクロアルキル、フェニル、ピラゾリル、イミダゾリル、ピリジニル、オキセタニル、アゼチジニル、テトラヒドロフラニル、ピロリジニル、テトラヒドロピラニル、- C ( = O ) R<sup>1 6</sup>、または - C ( = O ) ( O R<sup>1 7</sup> ) であって、

前記 C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルコキシ、C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub> - アルケニル、C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルケニル、C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub> - アルキニル、および C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルキニルは、シアノ、ヒドロキシル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルコキシ、- O - Si ( C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>

10

20

30

40

50

- アルキル)<sub>3</sub>、- Si (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル)<sub>3</sub>、および C<sub>3</sub> - C<sub>4</sub> - シクロアルキルからなる群から独立して選択される 1 または 2 個の置換基でさらに所望により置換され、

および

前記 C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - シクロアルキル、フェニル、ピラゾリル、イミダゾリル、ピリジニル、オキセタニル、アゼチジニル、テトラヒドロフラニル、ピロリジニル、およびテトラヒドロピラニルは、ハロゲン、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルキル、および C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルコキシカルボニルからなる群から独立して選択される 1 または 2 個の置換基でさらに所望により置換され、

並びに

R<sup>16</sup> は、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルであり、

R<sup>17</sup> は、水素または C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルであり、

R<sup>7</sup> は、ハロゲン、シアノ、メルカプト、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルカルボニル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルキルカルボニル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - シクロアルキル、または N (R<sup>20</sup>)<sub>2</sub> であり、

並びに

R<sup>20</sup> は、水素または C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルであり、

Q は、フェニル、ナフチル、ビシクロ [ 4 . 2 . 0 ] オクタ - 1 ( 6 ) 2 , 4 - トリエニル、インダニル、テトラヒドロナフタレニル、インデニル、ジヒドロナフタレニル、ジヒドロベンゾフラニル、ジヒドロイソベンゾフラニル、インドリニル、1 , 3 - ベンゾジオキサソリル、クロマニル、ジヒドロ - 1 , 4 - ベンゾジオキシニル、[ 1 , 3 ] ジオキサソロ [ 4 , 5 - b ] ピリジニル、テトラヒドロキノリニル、ジヒドロ - 5 H - シクロペンタ [ b ] ピリジニル、ジヒドロベンゾフラニル、ピロリル、フラニル、チエニル、イミダゾリル、トリアゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、ピリジニル、ピリダジニル、ピリミジニル、インドリル、ベンズイミダゾリル、インダゾリル、ベンゾフラニル、ベンゾチオフェニル、ベンゾチアゾリル、ベンゾオキサゾリル、イソキノリニル、キノリニル、フロピリジニル、チエノチオフェニル、またはチエノチアゾリルであって、

フェニル、ナフチル、ビシクロ [ 4 . 2 . 0 ] オクタ - 1 ( 6 ) 2 , 4 - トリエニル、インダニル、テトラヒドロナフタレニル、インデニル、ジヒドロナフタレニル、ジヒドロベンゾフラニル、ジヒドロイソベンゾフラニル、インドリニル、1 , 3 - ベンゾジオキサソリル、クロマニル、ジヒドロ - 1 , 4 - ベンゾジオキシニル、[ 1 , 3 ] ジオキサソロ [ 4 , 5 - b ] ピリジニル、テトラヒドロキノリニル、ジヒドロ - 5 H - シクロペンタ [ b ] ピリジニル、ジヒドロベンゾフラニル、ピロリル、フラニル、チエニル、イミダゾリル、トリアゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、ピリジニル、ピリダジニル、ピリミジニル、インドリル、ベンズイミダゾリル、インダゾリル、ベンゾフラニル、ベンゾチオフェニル、ベンゾチアゾリル、ベンゾオキサゾリル、イソキノリニル、キノリニル、フロピリジニル、チエノチオフェニル、およびチエノチアゾリルは、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルカルボニル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルキルカルボニル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルコキシ - C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub> - アルケニル、C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルケニル、C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub> - アルキニル、C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルキニル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルスルファニル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルキルスルファニル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - シクロアルキル、フェニル、ピラゾリル、イミダゾリル、ピリジニル、オキセタニル、アゼチジニル、テトラヒドロフラニル、ピロリジニル、テトラヒドロピラニル、および - N (R<sup>43</sup>)<sub>2</sub> からなる群から独立して選択される 1 ~ 3 個の Q<sup>S</sup> 置換基で所望により置換され、

前記 C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルカルボニル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルキルカルボニル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルコキシ - C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub> - アルケニル、C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルケニル、C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub> - アルキニル、C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルキニル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルスルファニル、および C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルキルスルファニ

10

20

30

40

50



ルは、ヒドロキシル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、および $C_1 - C_4$ -ハロアルコキシからなる群から独立して選択される1または2個の置換基で所望により置換され、

前記 $C_3 - C_6$ -シクロアルキル、フェニル、ピラゾリル、イミダゾリル、ピリジニル、オキサニル、アゼチジニル、テトラヒドロフラニル、ピロリジニル、およびテトラヒドロピラニルは、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ -アルキル、および $C_1 - C_4$ -ハロアルキルからなる群から独立して選択される1または2個の置換基で所望により置換され、

並びに

$R^{43}$ は独立して水素または $C_1 - C_4$ -アルキルである化合物、

並びにそれらの塩、N-オキシド、並びに前記塩およびN-オキシドの溶媒和物に関する。

10

#### 【0068】

同じように好ましい実施形態では、本発明は、一般式(I)の化合物であって、

Aは、窒素(N)または $C - R^8$ であって、

Tは、酸素(O)または硫黄(S)であり、

nは、1、

mは、0または1、

$R^1$ は、水素、ヒドロキシル、シアノ、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -アルコキシ、 $C_1 - C_6$ -アルコキシ- $C_1 - C_6$ -アルキル、 $-C(=O)R^{10}$ 、または $C(=O)(OR^{11})$ であって、

$R^{10}$ および $R^{11}$ は独立して $C_1 - C_6$ -アルキルまたは $C_2 - C_6$ -アルケニルであり、

20

$R^2$ および $R^3$ は独立して水素、ハロゲン、シアノ、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_6$ -アルコキシカルボニル、若しくは $C_3 - C_8$ -シクロアルキル環であるか、

または

$R^2$ および $R^3$ は、それらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキル環を形成し、

$R^4$ および $R^5$ は独立して水素、ハロゲン、ヒドロキシル、 $C_1 - C_6$ -アルキル、若しくは $C_1 - C_6$ -ハロアルキルであるか、

または

$R^4$ および $R^5$ は、それらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキル環を形成し、

30

または

$R^2$ および $R^4$ は、それらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキル環を形成し、

並びに

$R^3$ および $R^5$ は独立して水素またはハロゲンであり、

$R^6$ は、インダニル、テトラヒドロナフタレニル、スピロ[シクロプロパン-1,2'-インダン]イル、フェニル、ナフチル、ジヒドロベンゾフラニル、クロマニル、イソクロマニル、1,3-ベンゾジオキサソリル、ジヒドロ-1,4-ベンゾジオキシニル、テトラヒドロベンゾチオフェニル、フラニル、ピラゾリル、チエニル、ピリジニル、ピリミジニル、インドリル、ベンゾオキサゾリル、イミダゾピリジニル、キノリニル、イソキノリニル、フェニルオキシ、またはベンジルオキシであって、

40

インダニル、テトラヒドロナフタレニル、スピロ[シクロプロパン-1,2'-インダン]イル、フェニル、ナフチル、ジヒドロベンゾフラニル、クロマニル、イソクロマニル、1,3-ベンゾジオキサソリル、ジヒドロ-1,4-ベンゾジオキシニル、テトラヒドロベンゾチオフェニル、フラニル、ピラゾリル、チエニル、ピリジニル、ピリミジニル、インドリル、ベンゾオキサゾリル、イミダゾピリジニル、キノリニル、イソキノリニル、フェニルオキシ、およびベンジルオキシは所望により1~3個の $R^{6S}$ 置換基で置換され、

50

$R^{6S}$  は、ハロゲン、シアノ、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_6$ -アルコキシ、 $C_1 - C_6$ -ハロアルコキシ、 $C_2 - C_6$ -アルケニル、 $C_2 - C_6$ -ハロアルケニル、 $C_2 - C_6$ -アルキニル、 $C_2 - C_6$ -ハロアルキニル、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキル、フェニル、ピラゾリル、イミダゾリル、ピリジニル、オキセタニル、アゼチジニル、テトラヒドロフラニル、ピロリジニル、テトラヒドロピラニル、 $-C(=O)R^{16}$  または、 $-C(=O)(OR^{17})$  であって、

前記  $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_6$ -アルコキシ、 $C_1 - C_6$ -ハロアルコキシ、 $C_2 - C_6$ -アルケニル、 $C_2 - C_6$ -ハロアルケニル、 $C_2 - C_6$ -アルキニル、および  $C_2 - C_6$ -ハロアルキニルは、シアノ、ヒドロキシル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、 $C_1 - C_4$ -ハロアルコキシ、 $-O-Si(C_1 - C_6 - \text{アルキル})_3$ 、 $-Si(C_1 - C_6 - \text{アルキル})_3$ 、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキル、 $C_3 - C_6$ -ハロシクロアルキル、および 3 員 ~ 7 員ヘテロシクリルからなる群から独立して選択される 1 または 2 個の置換基でさらに所望により置換され、

並びに

前記  $C_3 - C_6$ -シクロアルキル、フェニル、ピラゾリル、イミダゾリル、ピリジニル、オキセタニル、アゼチジニル、テトラヒドロフラニル、ピロリジニル、およびテトラヒドロピラニルは、ハロゲン、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキル、および  $C_1 - C_6$ -アルコキシカルボニルからなる群から独立して選択される 1 または 2 個の置換基でさらに所望により置換され、

並びに

$R^{16}$  は、 $C_1 - C_6$ -アルキルであり、

$R^{17}$  は、水素または  $C_1 - C_6$ -アルキルであり、

$R^7$  は、水素、ハロゲン、シアノ、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_6$ -ヒドロキシアルキル、 $C_1 - C_6$ -アルキルカルボニル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキルカルボニル、 $C_1 - C_6$ -アルコキシ、 $C_1 - C_6$ -ハロアルコキシ、 $C_2 - C_6$ -アルケニル、 $C_2 - C_6$ -ハロアルケニル、 $C_2 - C_6$ -アルキニル、 $C_2 - C_6$ -ハロアルキニル、 $C_1 - C_6$ -アルキルスルファニル、 $C_1 - C_6$ -アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$ -アルキルスルホニル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキルスルホニル、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル、フェニル、ナフチル、5 員または 6 員ヘテロアリール、3 員 ~ 7 員ヘテロシクリル、 $-N(R^{20})_2$ 、 $-C(=NR^{21})R^{22}$ 、 $-C(=O)(OR^{25})$ 、または  $C(=O)N(R^{26})_2$  であって、

$C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_6$ -ヒドロキシアルキル、 $C_1 - C_6$ -アルキルカルボニル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキルカルボニル、 $C_1 - C_6$ -アルコキシ、 $C_1 - C_6$ -ハロアルコキシ、 $C_2 - C_6$ -アルケニル、 $C_2 - C_6$ -ハロアルケニル、 $C_2 - C_6$ -アルキニル、 $C_2 - C_6$ -ハロアルキニル、 $C_1 - C_6$ -アルキルスルファニル、 $C_1 - C_6$ -アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$ -アルキルスルホニル、および  $C_1 - C_6$ -ハロアルキルスルホニルは、所望により 1 ~ 3 個の  $R^{7Sa}$  置換基で置換され、

$R^{7Sa}$  は独立してシアノ、ヒドロキシル、 $C_1 - C_6$ -アルコキシ、 $C_1 - C_6$ -ハロアルコキシ、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシカルボニル、およびフェニルであり、

$C_3 - C_8$ -シクロアルキル、フェニル、ナフチル、5 員または 6 員ヘテロアリール、および 3 員 ~ 7 員ヘテロシクリルは、所望により 1 ~ 3 個の  $R^{7Sc}$  置換基で置換され、

$R^{7Sc}$  は独立してハロゲン、ヒドロキシル、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、または  $C_1 - C_4$ -ハロアルコキシであり、

$R^{20}$  は、水素、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキル、または  $C_3 - C_6$ -シクロアルキルであって、

$C_3 - C_8$ -シクロアルキルは、ハロゲンおよび  $C_1 - C_6$ -アルキルからなる群から独立して選択される 1 または 2 個の置換基で所望により置換され、

10

20

30

40

50

$R^{21}$  は、ヒドロキシル、 $C_1 - C_6$ -アルキル、または $C_1 - C_6$ -アルコキシであり、

$R^{22}$  は、水素、 $C_1 - C_6$ -アルキル、または $C_1 - C_6$ -ハロアルキルであり、

$R^{25}$  および  $R^{26}$  は独立して水素または $C_1 - C_6$ -アルキルであり、

$R^8$  は、水素またはハロゲンであり、

Q は、フェニル、ナフチル、ピシクロ [ 4 . 2 . 0 ] オクタ - 1 ( 6 ) 2 , 4 - トリエニル、インダニル、テトラヒドロナフタレニル、インデニル、ジヒドロナフタレニル、ジヒドロベンゾフラニル、ジヒドロイソベンゾフラニル、インドリニル、1, 3 - ベンゾジオキサソリル、クロマニル、ジヒドロ - 1 , 4 - ベンゾジオキシニル、[ 1 , 3 ] ジオキサソロ [ 4 , 5 - b ] ピリジニル、テトラヒドロキノリニル、ジヒドロ - 5 H - シクロペンタ [ b ] ピリジニル、ジヒドロベンゾフラニル、ピロリル、フラニル、チエニル、イミダゾリル、トリアゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、ピリジニル、ピリダジニル、ピリミジニル、インドリル、ベンズイミダゾリル、インダゾリル、ベンゾフラニル、ベンゾチオフェニル、ベンゾチアゾリル、ベンゾオキサゾリル、キノリニル、フロピリジニル、チエノチオフェニル、またはチエノチアゾリルであって、

10

フェニル、ナフチル、ピシクロ [ 4 . 2 . 0 ] オクタ - 1 ( 6 ) 2 , 4 - トリエニル、インダニル、テトラヒドロナフタレニル、インデニル、ジヒドロナフタレニル、ジヒドロベンゾフラニル、ジヒドロイソベンゾフラニル、インドリニル、1, 3 - ベンゾジオキサソリル、クロマニル、ジヒドロ - 1 , 4 - ベンゾジオキシニル、[ 1 , 3 ] ジオキサソロ [ 4 , 5 - b ] ピリジニル、テトラヒドロキノリニル、ジヒドロ - 5 H - シクロペンタ [ b ] ピリジニル、ジヒドロベンゾフラニル、ピロリル、フラニル、チエニル、イミダゾリル、トリアゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、ピリジニル、ピリダジニル、ピリミジニル、インドリル、ベンズイミダゾリル、インダゾリル、ベンゾフラニル、ベンゾチオフェニル、ベンゾチアゾリル、ベンゾオキサゾリル、キノリニル、フロピリジニル、チエノチオフェニル、およびチエノチアゾリルは、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、ホルミル、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_6$ -アルキルカルボニル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキルカルボニル、 $C_1 - C_6$ -アルコキシ、 $C_1 - C_6$ -ハロアルコキシ、 $C_1 - C_6$ -アルコキシ -  $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_2 - C_6$ -アルケニル、 $C_2 - C_6$ -ハロアルケニル、 $C_2 - C_6$ -アルキニル、 $C_2 - C_6$ -ハロアルキニル、 $C_1 - C_6$ -アルキルスルファニル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキルスルファニル、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキル、オキセタニル、および - N (  $R^{43}$  )<sub>2</sub> からなる群から独立して選択される 1 ~ 4 個の Q<sup>5</sup> 置換基で置換され、

20

30

前記  $C_3 - C_6$ -シクロアルキルおよびオキセタニルは、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ -アルキル、および  $C_1 - C_4$ -ハロアルキルからなる群から独立して選択される 1 または 2 個の置換基で所望により置換され、

$R^{43}$  は、水素および  $C_1 - C_6$ -アルキルである化合物、

並びにそれらの塩、N-オキシド、および溶媒和物に関する。

#### 【 0 0 6 9 】

より好ましい実施形態では、本発明は、一般式 ( I ) の化合物であって、

A は、窒素 ( N ) または C -  $R^8$  であり、

40

$R^8$  は、水素であり、

T は、酸素 ( O ) であり、

n は、0 または 1、

m は、0 または 1、

$R^1$  は、水素、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、または - C ( = O )  $R^{10}$  であり、

$R^{10}$  は、 $C_1 - C_4$ -アルキルであり、

$R^2$  および  $R^3$  は、水素であり、

$R^4$  および  $R^5$  は独立して水素、ハロゲン、または  $C_1 - C_4$ -アルキルであり、

または

50

R<sup>4</sup> および R<sup>5</sup> は、それらが結合している炭素原子と一緒にシクロプロピル環、シクロブチル環、またはオキセタニル環を形成し、

または

R<sup>2</sup> および R<sup>4</sup> は一緒に式 \* \* - C ( R<sup>3</sup> ) = C ( R<sup>5</sup> ) - # #

( 式中

\* \* は N ( R<sup>1</sup> ) への結合点であり、

# # は R<sup>6</sup> への結合点である ) の基を形成し、

並びに

R<sup>3</sup> および R<sup>5</sup> は独立して水素、フルオロ、クロロ、またはメチルであり、

R<sup>6</sup> は、インダニル、テトラヒドロナフタレニル、スピロ [ シクロプロパン - 1 , 2 ' - インダン ] イル、フェニル、ナフチル、ジヒドロベンゾフラニル、クロマニル、イソクロマニル、チオクロマニル、イソチオクロマニル、テトラヒドロベンゾチアゾリル、フラニル、ピラゾリル、チエニル、ピリジニル、ピリミジニル、インドリル、キノリニル、イソキノリニル、または C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> - アルコキシであって、

C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> - アルコキシは、フェニル、フラニル、およびチエニルからなる群から選択される 1 個の置換基で置換され、

前記フェニル、フラニル、およびチエニルは 1 または 2 個の R<sup>6 S</sup> 置換基で順番に所望により置換され、

インダニル、テトラヒドロナフタレニル、スピロ [ シクロプロパン - 1 , 2 ' - インダン ] イル、フェニル、ナフチル、ジヒドロベンゾフラニル、クロマニル、イソクロマニル、チオクロマニル、イソチオクロマニル、テトラヒドロベンゾチアゾリル、フラニル、ピラゾリル、チエニル、ピリジニル、ピリミジニル、インドリル、キノリニル、およびイソキノリニルは所望により 1 ~ 4 個の R<sup>6 S</sup> 置換基で置換され、

R<sup>6 S</sup> は独立してハロゲン、オキソ、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルコキシ、または C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - シクロアルキルであり、

R<sup>7</sup> は、ハロゲン、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、または C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - シクロアルキルであり、

Q は、フェニル、ナフチル、インダニル、ジヒドロベンゾフラニル、テトラヒドロキノリニル、ジヒドロ - 5 H - シクロペンタ [ b ] ピリジニル、ジヒドロベンゾフラニル、ピリジニル、ベンゾフラニル、ベンゾチオフエニル、イソキノリニル、またはキノリニルであり、

フェニル、ナフチル、インダニル、ジヒドロベンゾフラニル、テトラヒドロキノリニル、ジヒドロ - 5 H - シクロペンタ [ b ] ピリジニル、ジヒドロベンゾフラニル、ピリジニル、ベンゾフラニル、ベンゾチオフエニル、イソキノリニル、およびキノリニルは、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルカルボニル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルキルカルボニル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルコキシ - C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub> - アルケニル、C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルケニル、C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub> - アルキニル、C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルキニル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルスルファニル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルキルスルファニル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - シクロアルキル、フェニル、ピラゾリル、ピリジニル、オキセタニル、アゼチジニル、テトラヒドロフラニル、ピロリジニル、および - N ( R<sup>4 3</sup> )<sub>2</sub> からなる群から独立して選択される 1 または 2 個の Q<sup>S</sup> 置換基で所望により置換され、

前記 C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルコキシ、および C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルコキシは、ヒドロキシル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルコキシ、および C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルコキシからなる群から独立して選択される 1 または 2 個の置換基で所望により置換され、

前記 C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - シクロアルキル、フェニル、ピラゾリル、ピリジニル、オキセタニル、アゼチジニル、テトラヒドロフラニル、およびピロリジニルは、ハロゲン、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、および C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルキルからなる群から独立して選択される 1 または 2 個の置換基で所望により置換され、

並びに

10

20

30

40

50

$R^4$   $R^3$  は独立して  $C_1 - C_4$  - アルキルである化合物、  
並びにそれらの塩、 $N$  - オキシド、並びに前記塩および  $N$  - オキシドの溶媒和物に関する。

【0070】

同じようにより好ましい実施形態では、本発明は、一般式 (I) の化合物であって、

$A$  は、窒素 ( $N$ ) または  $C - R^8$  であり、

$T$  は、酸素 ( $O$ ) であり、

$n$  は、1、

$m$  は、0 または 1、

$R^1$  は、水素、 $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ、または  $-C(=O)$  10  
 $R^{10}$  であり、

$R^{10}$  は、 $C_1 - C_4$  - アルキルであり、

$R^2$  および  $R^3$  は独立して水素または  $C_1 - C_4$  - アルキルであり、

または

$R^2$  および  $R^3$  は、それらが結合している炭素原子と一緒になって  $C_3 - C_5$  - シクロ  
アルキルを形成し、

$R^4$  および  $R^5$  は独立して水素またはハロゲンであり、

または

$R^4$  および  $R^5$  は、それらが結合している炭素原子と一緒になって  $C_3 - C_5$  - シクロ  
アルキルを形成し、 20

$R^6$  は、フェニル、2,3-ジヒドロベンゾフラニル、1,3-ベンゾジオキサソリル、  
2,3-ジヒドロ-1,4-ベンゾジオキシニル、フラニル、ピラゾリル、チエニル、ピ  
リジニル、ピリミジニル、インドリル、フェニルオキシ、またはベンジルオキシであって

、  
フェニル、2,3-ジヒドロベンゾフラニル、1,3-ベンゾジオキサソリル、2,3-  
ジヒドロ-1,4-ベンゾジオキシニル、フラニル、ピラゾリル、チエニル、ピリジ  
ニル、ピリミジニル、インドリル、フェニルオキシ、またはベンジルオキシは、1~3個の  
 $R^{65}$  置換基で所望により置換され、

$R^{65}$  はハロゲン、シアノ、 $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_1 - C_4$  - ハロアルキル、  
 $C_1 - C_4$  - アルコキシ、 $C_1 - C_4$  - ハロアルコキシ、 $C_2 - C_6$  - アルケニル、 $C_2$  30  
 $- C_6$  - アルキニル、 $C_3 - C_6$  - シクロアルキル、フェニル、ピラゾリル、イミダゾリ  
ル、ピリジニル、 $-C(=O)R^{16}$ 、または  $-C(=O)(OR^{17})$  であって、

前記  $C_3 - C_6$  - シクロアルキル、フェニル、ピラゾリル、イミダゾリル、およ  
びピリジニルは、フルオロ、プロモ、クロロ、 $C_1 - C_4$  - アルキル、および  $C_1 - C_4$   
- ハロアルキルからなる群から独立して選択される 1 または 2 個の置換基でさらに所望に  
より置換され、

並びに

$R^{16}$  は、 $C_1 - C_4$  - アルキルであり、

$R^{17}$  は、水素または  $C_1 - C_4$  - アルキルであり、

$R^7$  は、ハロゲン、 $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_1 - C_4$  - ハロアルキル、 $C_1 - C_4$  - 40  
ヒドロキシアルキル、 $C_1 - C_4$  - アルキルカルボニル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ、 $C_1$   
 $- C_4$  - アルキルスルファニル、 $C_2 - C_4$  - アルケニル、 $C_2 - C_4$  - アルキニル、 $C$   
 $3 - C_6$  - シクロアルキル、ピリジニル、イミダゾリル、ピラゾリル、オキセタニル、テ  
トラヒドロフラニル、テトラヒドロピラニル、ピロリジニル、ピペリジニル、 $-N(R^{20})_2$ 、  
 $-C(=NR^{21})R^{22}$ 、または  $C(=O)(OR^{25})$  であって、

$C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_1 - C_4$  - ハロアルキル、 $C_1 - C_4$  - ヒドロキシアルキ  
ル、 $C_1 - C_4$  - アルキルカルボニル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ、 $C_1 - C_4$  - アルキル  
スルファニル、 $C_2 - C_4$  - アルケニル、および  $C_2 - C_4$  - アルキニルは所望により 1  
または 2 個の  $R^{75}$  置換基で置換され、

$C_3 - C_6$  - シクロアルキル、ピリジニル、イミダゾリル、ピラゾリル、オキセタニ 50

ル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロピラニル、ピロリジニル、およびピペリジニルは所望により1または2個の $R^{7S_c}$ 置換基で置換され、

$R^{20}$ は、水素、 $C_1 - C_4$ -アルキル、または $C_3 - C_6$ -シクロアルキルであり、

$R^{21}$ は、 $C_1 - C_4$ -アルキルまたは $C_1 - C_4$ -アルコキシであり、

$R^{22}$ は、 $C_1 - C_4$ -アルキルであり、

$R^{25}$ は、水素または $C_1 - C_4$ -アルキルであり、

並びに

$R^{7S_a}$ は独立して $C_1 - C_4$ -アルコキシまたはフェニルであり、

$R^{7S_c}$ は独立してハロゲンまたは $C_1 - C_4$ -アルキルであり、

$R^8$ は、水素またはハロゲンであり、

10

Qは、フェニル、2,3-ジヒドロベンゾフラニル、インドリニル、1,3-ベンゾジオキサソリル、クロマニル、2,3-ジヒドロ-1,4-ベンゾジオキシニル、5,6,7,8-テトラヒドロキノリニル、2,3-ジヒドロベンゾフラニル、チエニル、ピリジニルまたはインドリルであって、

フェニル、2,3-ジヒドロベンゾフラニル、インドリニル、1,3-ベンゾジオキサソリル、クロマニル、2,3-ジヒドロ-1,4-ベンゾジオキシニル、5,6,7,8-テトラヒドロキノリニル、2,3-ジヒドロベンゾフラニル、チエニル、ピリジニルおよびインドリルは、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ホルミル、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ -アルキルカルボニル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、 $C_1 - C_4$ -ハロアルコキシ、 $C_2 - C_4$ -アルキニル、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキル、オキセタニル、および $-N(R^{43})_2$ からなる群から独立して選択される1~3個の $Q^S$ 置換基で置換され、

20

前記 $C_3 - C_6$ -シクロアルキルおよびオキセタニルは、ハロゲンおよび $C_1 - C_4$ -アルキルからなる群から独立して選択される1または2個の置換基で所望により置換され、

$R^{43}$ は、水素および $C_1 - C_4$ -アルキルである化合物、

並びにそれらの塩、N-オキシド、並びに前記塩およびN-オキシドの溶媒和物に関する。

#### 【0071】

さらにより好ましい実施形態では、本発明は、一般式(I)の化合物であって、

30

Aは、窒素(N)またはC- $R^8$ であり、

$R^8$ は、水素であり、

Tは、酸素(O)であり、

nは、1、

mは、1、

$R^1$ は、水素、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、または $-C(=O)$   
 $R^{10}$ であり、

$R^{10}$ は、 $C_1 - C_4$ -アルキルであり、

$R^2$ および $R^3$ は、水素であり、

$R^4$ および $R^5$ は独立して水素、フルオロ、または $C_1 - C_4$ -アルキルであり、

40

$R^6$ は、フェニルであって、

フェニルは1または2個の $R^{6S}$ 置換基で置換され、

$R^{6S}$ は独立してハロゲン、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、 $C_1 - C_4$ -ハロアルコキシ、または $C_3 - C_6$ -シクロアルキルであり、

$R^7$ は、メチルまたはシクロプロピルであり、

Qは、フェニル、ナフチル、インダニル、ジヒドロベンゾフラニル、テトラヒドロキノリニル、ジヒドロ-5H-シクロペンタ[b]ピリジニル、ジヒドロベンゾフラニル、ピリジニル、ベンゾフラニル、ベンゾチオフェニル、イソキノリニル、またはキノリニルであり、

50

フェニル、ナフチル、インダニル、ジヒドロベンゾフラニル、テトラヒドロキノリニル、ジヒドロ-5H-シクロペンタ[b]ピリジニル、ジヒドロベンゾフラニル、ピリジニル、ベンゾフラニル、ベンゾチオフェニル、イソキノリニル、およびキノリニルは、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-ハロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキルカルボニル、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-ハロアルキルカルボニル、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-ハロアルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルコキシ-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキル、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-アルケニル、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-ハロアルケニル、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-アルキニル、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-ハロアルキニル、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキルスルファニル、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-ハロアルキルスルファニル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-シクロアルキル、フェニル、ピラゾリル、ピリジニル、オキセタニル、アゼチジニル、テトラヒドロフラニル、ピロリジニル、および-N(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>からなる群から独立して選択される1または2個のQ<sup>S</sup>置換基で所望により置換され、

10

前記C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルコキシ、およびC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-ハロアルコキシは、ヒドロキシル、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルコキシ、およびC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-ハロアルコキシからなる群から独立して選択される1または2個の置換基で所望により置換され、

前記C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-シクロアルキル、フェニル、ピラゾリル、ピリジニル、オキセタニル、アゼチジニル、テトラヒドロフラニル、およびピロリジニルは、ハロゲン、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキル、およびC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-ハロアルキルからなる群から独立して選択される1または2個の置換基で所望により置換され、

並びに

R<sup>4</sup>は独立してC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキルである化合物、

20

並びにそれらの塩、N-オキシド、並びに前記塩およびN-オキシドの溶媒和物に関する。

#### 【0072】

同じようにさらにより好ましい実施形態では、本発明は、一般式(I)の化合物であって、

Aは、窒素(N)またはC-R<sup>8</sup>であり、

R<sup>8</sup>は、水素であり、

Tは、酸素(O)であり、

nは、0または1、

mは、0または1、

30

R<sup>1</sup>は、水素、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルコキシ、または-C(=O)R<sup>10</sup>であり、

R<sup>10</sup>は、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキルであり、

R<sup>2</sup>およびR<sup>3</sup>は、水素であり、

R<sup>4</sup>およびR<sup>5</sup>は独立して水素、ハロゲン、またはC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキルであり、

または

R<sup>4</sup>およびR<sup>5</sup>は、それらが結合している炭素原子と一緒にシクロプロピル環、シクロブチル環、またはオキセタニル環を形成し、

または

R<sup>2</sup>およびR<sup>4</sup>は一緒に式\*\* - C(R<sup>3</sup>) = C(R<sup>5</sup>) - ##

40

(式中

\*\*はN(R<sup>1</sup>)への結合点であり、

##はR<sup>6</sup>への結合点である)の基を形成し、

並びに

R<sup>3</sup>およびR<sup>5</sup>は独立して水素、フルオロ、クロロ、またはメチルであり、

R<sup>6</sup>は、インダニル、テトラヒドロナフタレニル、スピロ[シクロプロパン-1,2'-インダン]イル、フェニル、ナフチル、ジヒドロベンゾフラニル、クロマニル、イソクロマニル、チオクロマニル、イソチオクロマニル、テトラヒドロベンゾチアゾリル、フラニル、ピラゾリル、チエニル、ピリジニル、ピリミジニル、インドリル、キノリニル、イソキノリニル、またはC<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-アルコキシであって、

50

C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> - アルコキシは、フェニル、フラニル、およびチエニルからなる群から選択される 1 個の置換基で置換され、

前記フェニル、フラニル、およびチエニルは 1 または 2 個の R<sup>6S</sup> 置換基で順番に所望により置換され、

インダニル、テトラヒドロナフタレニル、スピロ [シクロプロパン - 1, 2' - インダン] イル、フェニル、ナフチル、ジヒドロベンゾフラニル、クロマニル、イソクロマニル、チオクロマニル、イソチオクロマニル、テトラヒドロベンゾチアゾリル、フラニル、ピラゾリル、チエニル、ピリジニル、ピリミジニル、インドリル、キノリニル、およびイソキノリニルは所望により 1 ~ 4 個の R<sup>6S</sup> 置換基で置換され、

R<sup>6S</sup> は独立してハロゲン、オキソ、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルコキシ、または C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - シクロアルキルであり、

R<sup>7</sup> は、ハロゲン、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、または C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - シクロアルキルであり、Q は、フェニルであり、

フェニルは、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルカルボニル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルコキシ - C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub> - アルケニル、C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルケニル、C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub> - アルキニル、C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルキニル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルスルファニル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルキルスルファニル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - シクロアルキル、および - N (R<sup>43</sup>)<sub>2</sub> からなる群から独立して選択される 1 または 2 個の Q<sup>S</sup> 置換基で置換され、

前記 C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルおよび C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルコキシは、ヒドロキシル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルコキシ、および C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルコキシからなる群から独立して選択される 1 または 2 個の置換基で所望により置換され、

前記 C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - シクロアルキルは、ハロゲンからなる群から独立して選択される 1 または 2 個の置換基で所望により置換され、

並びに

R<sup>43</sup> は独立して C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルである化合物、

並びにそれらの塩、N - オキシド、並びに前記塩および N - オキシドの溶媒和物に関する。

### 【0073】

同じようにさらにより好ましい実施形態では、本発明は、一般式 (I) の化合物であって、

A は、窒素 (N) または C - R<sup>8</sup> であり、

T は、酸素 (O) であり、

n は、1、

m は、1、

R<sup>1</sup> は、水素であり、

R<sup>2</sup> および R<sup>3</sup> は独立して水素であり、

R<sup>4</sup> および R<sup>5</sup> は独立して水素またはフルオロであり、

R<sup>6</sup> は、フェニル、2, 3 - ジヒドロベンゾフラニル、1, 3 - ベンゾジオキサリル、2, 3 - ジヒドロ - 1, 4 - ベンゾジオキシニル、フラニル、ピラゾリル、チエニル、ピリジニル、ピリミジニル、インドリル、またはベンジルオキシであって、

フェニル、2, 3 - ジヒドロベンゾフラニル、1, 3 - ベンゾジオキサリル、2, 3 - ジヒドロ - 1, 4 - ベンゾジオキシニル、フラニル、ピラゾリル、チエニル、ピリジニル、ピリミジニル、インドリル、およびフェニルオキシは、1 ~ 3 個の R<sup>6S</sup> 置換基で所望により置換され、

R<sup>6S</sup> はハロゲン、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルコキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、エテニル、プロペニル、エチニル、プロピニル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - シクロアルキル、ピラゾリル、または



- C (= O) (OR<sup>17</sup>) であって、

C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - シクロアルキルおよびピラゾリルは、フルオロ、クロロ、および C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルからなる群から独立して選択される 1 または 2 個の置換基で所望によりさらに置換され、

R<sup>17</sup> は、水素または C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルであり、

R<sup>7</sup> は、クロロ、ブromo、ヨード、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ヒドロキシアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルカルボニル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルスルファニル、C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub> - アルケニル、C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub> - アルキニル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - シクロアルキル、- N (R<sup>20</sup>)<sub>2</sub>、または - C (= NR<sup>21</sup>) R<sup>22</sup> であり、

10

C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ヒドロキシアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルカルボニル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルスルファニル、C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub> - アルケニル、および C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub> - アルキニルは所望により 1 または 2 個の R<sup>7S<sup>a</sup></sup> 置換基で置換され、

C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - シクロアルキルは所望により 1 または 2 個の置換基 R<sup>7S<sup>c</sup></sup> で置換され、

R<sup>20</sup> は水素、シクロプロピル、またはシクロブチルであり、

R<sup>21</sup> は、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルまたは C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルコキシであり、

R<sup>22</sup> は、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルであり、

並びに

R<sup>7S<sup>a</sup></sup> は独立して C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルコキシであり、

20

R<sup>7S<sup>c</sup></sup> は独立してハロゲンであり、

R<sup>8</sup> は、水素であり、

Q は、フェニルであり、

フェニルは、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ホルミル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルカルボニル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルコキシ、C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub> - アルキニル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - シクロアルキル、およびオキセタニルからなる群から独立して選択される 1 ~ 3 個の Q<sup>S</sup> 置換基であり、

前記 C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - シクロアルキルおよびオキセタニルは、ハロゲンからなる群から独立して選択される 1 または 2 個の置換基で所望により置換される化合物、

並びにそれらの塩、N - オキシド、および溶媒和物に関する。

30

【0074】

好ましくは、A は、窒素 (N) または CH である。

【0075】

より好ましくは、A は、CH である。

【0076】

好ましくは、R<sup>1</sup> は水素、ヒドロキシル、シアノ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシ - C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、- C (= O) R<sup>10</sup>、または C (= O) (OR<sup>11</sup>) であって、R<sup>10</sup> および R<sup>11</sup> は独立して C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルまたは C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - アルケニルである。

【0077】

より好ましくは、R<sup>1</sup> は、水素、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルコキシ、または - C (= O) R<sup>10</sup> であって、R<sup>10</sup> は独立して C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルである。

40

【0078】

同様に、より好ましくは、R<sup>1</sup> は、水素、ヒドロキシル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシ、または - C (= O) R<sup>10</sup> であって、R<sup>10</sup> は独立して C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルである。

【0079】

さらにより好ましくは、R<sup>1</sup> は水素である。

【0080】

適切な R<sup>1</sup> の非限定的な例には、表 1 の列「R<sup>1</sup>」に開示されている R<sup>1</sup> 基のいずれか

50

が含まれる。

【0081】

好ましくは、 $R^2$  および  $R^3$  は独立して水素、ハロゲン、シアノ、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_6$ -アルコキシカルボニル、若しくは  $C_3 - C_8$ -シクロアルキルであるか、または  $R^2$  および  $R^3$  はそれらが結合している炭素原子と一緒にあって  $C_3 - C_6$ -シクロアルキル環を形成する。

【0082】

より好ましくは、 $R^2$  および  $R^3$  は独立して水素若しくは  $C_1 - C_4$ -アルキルであるか、または  $R^2$  および  $R^3$  はそれらが結合している炭素原子と一緒にあってシクロプロピル環を形成する。

【0083】

さらにより好ましくは、 $R^2$  および  $R^3$  は水素である。

【0084】

好ましくは、 $R^4$  および  $R^5$  は独立して水素、ハロゲン、ヒドロキシル、 $C_1 - C_6$ -アルキル、若しくは  $C_1 - C_6$ -ハロアルキルであるか、または  $R^4$  および  $R^5$  はそれらが結合している炭素原子と一緒にあって  $C_3 - C_6$ -シクロアルキル環を形成する。

【0085】

より好ましくは、 $R^4$  および  $R^5$  は独立して水素若しくはハロゲンであるか、または  $R^4$  および  $R^5$  はそれらが結合している炭素原子と一緒にあってシクロプロピル環を形成する。

【0086】

同様に、より好ましくは、 $R^4$  および  $R^5$  は独立して水素若しくはハロゲンであるか、または  $R^4$  および  $R^5$  はそれらが結合している炭素原子と一緒にあってシクロブチル環またはオキセタニル環を形成する。

【0087】

好ましくは、 $R^2$  および  $R^4$  はシクロプロピル環を形成し、並びに  $R^3$  および  $R^5$  は独立して水素またはハロゲンである。

【0088】

好ましくは、 $R^2$  および  $R^4$  は一緒に式  $* * - C ( R^3 ) = C ( R^5 ) - \# \#$

(式中、

\* \* は  $N ( R^1 )$  への結合点であり、

# # は  $R^6$  への結合点である)の基を形成し、

並びに

$R^3$  および  $R^5$  は独立して水素、ハロゲン、または  $C_1 - C_4$ -アルキルである。

【0089】

より好ましくは、 $R^1$  は水素であり、 $R^2$  および  $R^3$  は独立して水素若しくは  $C_1 - C_4$ -アルキルであり、または  $R^2$  および  $R^3$  はそれらが結合している炭素原子と一緒にあってシクロプロピル環を形成し、 $R^4$  および  $R^5$  は独立して水素若しくはハロゲンであるか、または  $R^4$  および  $R^5$  はそれらが結合している炭素原子と一緒にあってシクロプロピル環を形成する。

【0090】

さらにより好ましくは、 $R^1$  は水素であり、 $R^2$  および  $R^3$  は水素であり、 $R^4$  および  $R^5$  は独立して水素若しくはハロゲンであるか、または  $R^4$  および  $R^5$  はそれらが結合している炭素原子と一緒にあってシクロプロピル環、シクロブチル環、またはオキセタニル環を形成する。

【0091】

好ましくは、 $R^6$  は、1個の  $C_6 - C_{14}$ -アリールで置換された、所望により1~3個の本明細書で定義される置換基  $R^6$  で置換された、 $C_7 - C_{12}$ -炭素環、 $C_6 - C_{14}$ -アリール、3員~14員ヘテロシクリル、5員~14員ヘテロアリール、 $C_6 - C_{14}$ -アリールオキシ、および  $C_1 - C_3$ -アルコキシである。より好ましくは、本明細

10

20

30

40

50

書で開示される R<sup>6</sup> 基は、本明細書で上記または以下に開示される 1 または 2 個 R<sup>6S</sup> 置換基で置換される。

【0092】

好ましくは、R<sup>6S</sup> は独立してハロゲン、シアノ、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルコキシ、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-アルケニル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-アルキニル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-シクロアルキル、フェニル、ピラゾリル、イミダゾリル、ピリジニル、オキセタニル、アゼチジニル、テトラヒドロフラニル、ピロリジニル、テトラヒドロピラニル、-C(=O)R<sup>16</sup>、または -C(=O)(OR<sup>17</sup>) であって、前記 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルコキシ、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-アルケニル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルケニル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-アルキニル、および C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルキニルは、シアノ、ヒドロキシル、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-ハロアルコキシ、-O-Si(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル)<sub>3</sub>、-Si(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル)<sub>3</sub>、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-シクロアルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-ハロシクロアルキル、および 3 員~7 員ヘテロシクリルからなる群から独立して選択される 1 または 2 個の置換基でさらに所望により置換され、並びに前記 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-シクロアルキル、フェニル、ピラゾリル、イミダゾリル、ピリジニル、オキセタニル、アゼチジニル、テトラヒドロフラニル、ピロリジニル、およびテトラヒドロピラニルは、ハロゲン、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルキル、および C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルコキシカルボニルからなる群から独立して選択される 1 または 2 個の置換基でさらに所望により置換され、並びに R<sup>16</sup> は C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキルであり、R<sup>17</sup> は水素または C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキルである。

10

20

【0093】

より好ましくは、R<sup>6S</sup> はハロゲン、シアノ、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-ハロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-ハロアルコキシ、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-アルケニル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-アルキニル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-シクロアルキル、フェニル、ピラゾリル、イミダゾリル、ピリジニル、-C(=O)R<sup>16</sup>、または -C(=O)(OR<sup>17</sup>) であって、前記 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-シクロアルキル、フェニル、ピラゾリル、イミダゾリル、およびピリジニルは、フルオロ、プロモ、クロロ、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキル、および C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-ハロアルキルからなる群から独立して選択される 1 または 2 個の置換基で所望によりさらに置換され、並びに R<sup>16</sup> は C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキルであり並びに R<sup>17</sup> は水素または C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキルである。

30

【0094】

より好ましくは、R<sup>6</sup> は、フェニル、ナフチル、インダニル、テトラヒドロナフタレニル、ビシクロ[4.2.0]オクタ-1(6), 2, 4-トリエニル、スピロ[シクロプロパン-2, 1'-インダン]-1-イル、スピロ[シクロプロパン-1, 2'-テトラリン]-1-イル、ジヒドロベンゾフラニル、ジヒドロベンゾチオフエニル、インドリニル、1, 3-ベンゾジオキサソリル、テトラヒドロキノリニル、クロマニル、イソクロマニル、チオクロマニル、ジヒドロ-1, 4-ベンゾジオキシニル、テトラヒドロベンゾチオフエニル、ジヒドロ-5H-シクロペンタ[b]ピリジニル、テトラヒドロベンゾフラニル、テトラヒドロベンゾオキサゾリル、テトラヒドロベンゾチアゾリル、テトラヒドロ-1H-ベンズイミダゾリル、テトラヒドロインダゾリル、テトラヒドロ-2H-イソインドリル、テトラヒドロ-2-ベンゾチオフエニル、ジヒドロ-4H-シクロペンタ[b]チオフェニル、ジヒドロ-4H-シクロペンタ[d]チアゾリル、テトラヒドロピラゾロ[1, 5-a]ピリジニル、テトラヒドロ-[1, 2, 4]トリアゾロ[1, 5-a]ピリジニル、テトラヒドロイミダゾ[1, 2-a]ピリジニル、ジヒドロ-5H-チエノ[3, 2-b]ピラニル、スピロ[クロマン-3, 1'-シクロプロパン]-イル、スピロ[7, 8-ジヒドロ-5H-キノリン-6, 1'-シクロプロパン]-イル、フラニル、チエニル、ピラゾリル、イミダゾリル、トリアゾリル、オキサゾリル、オキサジアゾリル、チアゾリル、チアジアゾリル、ピリジニル、ピリダジニル、ピリミジニル、インドリル、ベンズイミダゾリル、インダゾリル、ベンゾフラニル、ベンゾチオフエニル、ベンゾチア

40

50

ゾリル、ベンゾオキサゾリル、キノリニル、イソキノリニル、キノキサリニル、ピロロ [ 3 , 2 - c ] ピリジニル、イミダゾ [ 1 , 2 - a ] ピリジニル、 [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 4 , 3 - a ] ピリジニル、イミダゾ [ 1 , 2 - a ] ピリジニル、チエノ [ 3 , 2 - b ] ピロリル、チエノ [ 3 , 2 - b ] チオフェニル、イミダゾ [ 2 , 1 - b ] オキサゾリル、フロ [ 2 , 3 - d ] イソキサゾリル、またはチエノ [ 2 , 3 - d ] イソチアゾリルであり、所望により 1 または 2 個の本明細書で定義される置換基  $R^{6S}$  で置換される。

【 0 0 9 5 】

さらにより好ましくは、 $R^6$  は、インダニル、テトラヒドロナフタレニル、スピロ [ シクロプロパン - 1 , 2 ' - インダン ] イル、フェニル、ナフチル、ジヒドロベンゾフラニル、クロマニル、イソクロマニル、チオクロマニル、イソチオクロマニル、テトラヒドロベンゾチアゾリル、フラニル、ピラゾリル、チエニル、ピリミジニル、インドリル、キノリニル、イソキノリニル、または  $C_1 - C_3$  - アルコキシであって、

10

$C_1 - C_3$  - アルコキシは、フェニル、フラニル、およびチエニルからなる群から選択される 1 個の置換基で置換され、

前記フェニル、フラニル、およびチエニルは 1 または 2 個の  $R^{6S}$  置換基で順番に所望により置換され、

インダニル、テトラヒドロナフタレニル、スピロ [ シクロプロパン - 1 , 2 ' - インダン ] イル、フェニル、ナフチル、ジヒドロベンゾフラニル、クロマニル、イソクロマニル、チオクロマニル、イソチオクロマニル、テトラヒドロベンゾチアゾリル、フラニル、ピラゾリル、チエニル、ピリミジニル、インドリル、キノリニル、およびイソキノリニルは所望により 1 ~ 4 個の  $R^{6S}$  置換基で置換され、

20

$R^{6S}$  は独立してハロゲン、オキソ、 $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_1 - C_4$  - ハロアルキル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ、 $-C_1 - C_4$  - ハロアルコキシ、または  $C_3 - C_6$  - シクロアルキルである。

【 0 0 9 6 】

同様に、さらにより好ましくは、 $R^6$  は、フェニル、1 , 3 - ベンゾジオキサール - 5 - イル、2 , 3 - ジヒドロ - 1 , 4 - ベンゾジオキシン - 6 - イル、4 , 5 , 6 , 7 - テトラヒドロベンゾチオフェン - 7 - イル、フラン - 2 - イル、チエン - 2 - イル、チエン - 3 - イル、ピラゾール - 1 - イル、ピリジン - 2 - イル、ピリジン - 3 - イル、ピリミジン - 2 - イル、ピリミジン - 5 - イル、インドール - 3 - イル、インドール - 4 - イル、インドール - 5 - イル、フェノキシ、またはベンジルオキシであって、フェニル、1 , 3 - ベンゾジオキサール - 5 - イル、2 , 3 - ジヒドロ - 1 , 4 - ベンゾジオキシン - 6 - イル、4 , 5 , 6 , 7 - テトラヒドロベンゾチオフェン - 7 - イル、フラン - 2 - イル、チエン - 2 - イル、チエン - 3 - イル、ピラゾール - 1 - イル、ピリジン - 2 - イル、ピリジン - 3 - イル、ピリミジン - 2 - イル、ピリミジン - 5 - イル、インドール - 3 - イル、インドール - 4 - イル、インドール - 5 - イル、フェノキシ、およびベンジルオキシは所望により 1 または 2 個の置換基  $R^{6S}$  で置換され、 $R^{6S}$  はハロゲン、シアノ、 $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_1 - C_4$  - ハロアルキル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ、 $C_1 - C_4$  - ハロアルコキシ、 $C_2 - C_6$  - アルケニル、 $C_2 - C_6$  - アルキニル、 $C_3 - C_6$  - シクロアルキル、フェニル、ピラゾリル、イミダゾリル、ピリジニル、 $-C(=O)R^{16}$ 、または  $-C(=O)(OR^{17})$  であって、前記  $C_3 - C_6$  - シクロアルキル、フェニル、ピラゾリル、イミダゾリル、およびピリジニルは、フルオロ、プロモ、クロロ、 $C_1 - C_4$  - アルキル、および  $C_1 - C_4$  - ハロアルキルからなる群から独立して選択される 1 または 2 個の置換基でさらに所望により置換され、並びに  $R^{16}$  は  $C_1 - C_4$  - アルキルであり、 $R^{17}$  は水素または  $C_1 - C_4$  - アルキルである。

30

40

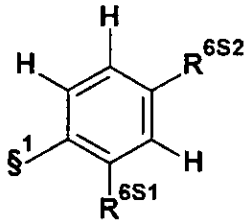
【 0 0 9 7 】

さらにより好ましい実施形態では、 $R^6$  は、

【 0 0 9 8 】

50

## 【化 3】



10

## 【0099】

式中、

$S^1$  は  $C(R^4 R^5)_m$  への結合点であり、

$R^{6S1}$  および  $R^{6S2}$  は独立して水素または  $R^6 S$  であって、

$R^6 S$  はハロゲン、シアノ、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、 $C_1 - C_6$ -ハロアルコキシ、 $C_1 - C_6$ -アルコキシカルボニル、 $C_1 - C_6$ -アルキルカルボニル、 $C_2 - C_6$ -アルケニル、 $C_2 - C_6$ -アルキニル、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキル、およびピラゾリルであって、

前記  $C_3 - C_6$ -シクロアルキルおよびピラゾリルは、ハロゲンおよび  $C_1 - C_4$ -アルキルからなる群から独立して選択される 1 または 2 個の置換基で所望により置換されるが、

20

$R^{6S1}$  および  $R^{6S2}$  の少なくとも 1 つが水素とは異なる。

## 【0100】

好ましくは、少なくとも 1 つの  $R^{6S2}$  は、水素とは異なり、すなわち、好ましくは、 $R^{6S2}$  は  $R^6 S$  である。

## 【0101】

より好ましくは、 $n$  は 1、 $m$  は 1、並びに  $R^6$  は、ナフチル、インダニル、テトラヒドロナフタレニル、ビスクロ[4.2.0]オクタ-1(6), 2, 4-トリエニル、スピロ[シクロプロパン-2, 1'-インダン]-1-イル、スピロ[シクロプロパン-1, 2'-テトラリン]-1-イル、ジヒドロベンゾフラニル、ジヒドロベンゾチオフェニル、インドリニル、1, 3-ベンゾジオキサニル、テトラヒドロキノリニル、クロマニル、イソクロマニル、チオクロマニル、ジヒドロ-1, 4-ベンゾジオキシニル、テトラヒドロベンゾチオフェニル、ジヒドロ-5H-シクロペンタ[b]ピリジニル、テトラヒドロベンゾフラニル、テトラヒドロベンゾオキサゾリル、テトラヒドロベンゾチアゾリル、テトラヒドロ-1H-ベンズイミダゾリル、テトラヒドロインダゾリル、テトラヒドロ-2H-イソインドリル、テトラヒドロ-2-ベンゾチオフェニル、ジヒドロ-4H-シクロペンタ[b]チオフェニル、ジヒドロ-4H-シクロペンタ[d]チアゾリル、テトラヒドロピラゾロ[1, 5-a]ピリジニル、テトラヒドロ-[1, 2, 4]トリアゾロ[1, 5-a]ピリジニル、テトラヒドロイミダゾ[1, 2-a]ピリジニル、ジヒドロ-5H-チエノ[3, 2-b]ピラニル、スピロ[クロマン-3, 1'-シクロプロパン]-イル、スピロ[7, 8-ジヒドロ-5H-キノリン-6, 1'-シクロプロパン]-イル、ベンズイミダゾリル、インダゾリル、ベンゾフラニル、ベンゾチオフェニル、ベンゾチアゾリル、ベンゾオキサゾリル、キノリニル、イソキノリニル、キノキサリニル、ピロロ[3, 2-c]ピリジニル、イミダゾ[1, 2-a]ピリジニル、[1, 2, 4]トリアゾロ[4, 3-a]ピリジニル、イミダゾ[1, 2-a]ピリジニル、チエノ[3, 2-b]ピロリル、チエノ[3, 2-b]チオフェニル、イミダゾ[2, 1-b]オキサゾリル、フロ[2, 3-d]イソキサゾリル、またはチエノ[2, 3-d]イソチアゾリルであり、

30

40

ナフチル、インダニル、テトラヒドロナフタレニル、ビスクロ[4.2.0]オクタ-1(6), 2, 4-トリエニル、スピロ[シクロプロパン-2, 1'-インダン]-1

50

-イル、スピロ[シクロプロパン-1, 2'-テトラリン]-1-イル、ジヒドロベンゾフラニル、ジヒドロベンゾチオフェニル、インドリニル、1, 3-ベンゾジオキサニル、テトラヒドロキノリニル、クロマニル、イソクロマニル、チオクロマニル、ジヒドロ-1, 4-ベンゾジオキサニル、テトラヒドロベンゾチオフェニル、ジヒドロ-5H-シクロペンタ[b]ピリジニル、テトラヒドロベンゾフラニル、テトラヒドロベンゾオキサゾリル、テトラヒドロベンゾチアゾリル、テトラヒドロ-1H-ベンズイミダゾリル、テトラヒドロインダゾリル、テトラヒドロ-2H-イソインドリル、テトラヒドロ-2-ベンゾチオフェニル、ジヒドロ-4H-シクロペンタ[b]チオフェニル、ジヒドロ-4H-シクロペンタ[d]チアゾリル、テトラヒドロピラゾロ[1, 5-a]ピリジニル、テトラヒドロ-[1, 2, 4]トリアゾロ[1, 5-a]ピリジニル、テトラヒドロイミダゾ[1, 2-a]ピリジニル、ジヒドロ-5H-チエノ[3, 2-b]ピラニル、スピロ[クロマン-3, 1'-シクロプロパン]-イル、スピロ[7, 8-ジヒドロ-5H-キノリン-6, 1'-シクロプロパン]-イル、ベンズイミダゾリル、インダゾリル、ベンゾフラニル、ベンゾチオフェニル、ベンゾチアゾリル、ベンゾオキサゾリル、キノリニル、イソキノリニル、キノキサリニル、ピロロ[3, 2-c]ピリジニル、イミダゾ[1, 2-a]ピリジニル、[1, 2, 4]トリアゾロ[4, 3-a]ピリジニル、イミダゾ[1, 2-a]ピリジニル、チエノ[3, 2-b]ピロリル、チエノ[3, 2-b]チオフェニル、イミダゾ[2, 1-b]オキサゾリル、フロ[2, 3-d]イソキサゾリル、およびチエノ[2, 3-d]イソチアゾリルは、1~4個の置換基 $R^{6S}$ によって所望により置換され、

10

20

$R^{6S}$ は、ハロゲン、シアノ、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_6$ -アルコキシ、 $C_1 - C_6$ -ハロアルコキシ、 $C_2 - C_6$ -アルケニル、 $C_2 - C_6$ -アルキニル、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキル、フェニル、ピラゾリル、イミダゾリル、ピリジニル、オキセタニル、アゼチジニル、テトラヒドロフラニル、ピロリジニル、テトラヒドロピラニル、 $-C(=O)R^{16}$ 、または $-C(=O)(OR^{17})$ からなる群から独立して選択され、

前記 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_6$ -アルコキシ、 $C_1 - C_6$ -ハロアルコキシ、 $C_2 - C_6$ -アルケニル、 $C_2 - C_6$ -ハロアルケニル、 $C_2 - C_6$ -アルキニル、および $C_2 - C_6$ -ハロアルキニルは、シアノ、ヒドロキシル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、 $C_1 - C_4$ -ハロアルコキシ、 $-O-Si(C_1 - C_6 - \text{アルキル})_3$ 、 $-Si(C_1 - C_6 - \text{アルキル})_3$ 、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキル、 $C_3 - C_6$ -ハロシクロアルキル、および3員~7員ヘテロシクリルからなる群から独立して選択される1または2個の置換基でさらに所望により置換され、

30

並びに

前記 $C_3 - C_6$ -シクロアルキル、フェニル、ピラゾリル、イミダゾリル、ピリジニル、オキセタニル、アゼチジニル、テトラヒドロフラニル、ピロリジニル、およびテトラヒドロピラニルは、ハロゲン、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキル、および $C_1 - C_6$ -アルコキシカルボニルからなる群から独立して選択される1または2個の置換基でさらに所望により置換され、並びに $R^{16}$ は $C_1 - C_6$ -アルキルであり、 $R^{17}$ は水素または $C_1 - C_6$ -アルキルである。

40

【0102】

より好ましくは、 $n$ は1、 $m$ は1、 $R^6$ は、テトラヒドロナフタレニル、スピロ[シクロプロパン-1, 2'-インダン]イル、ナフチル、ジヒドロベンゾフラニル、クロマニル、イソクロマニル、チオクロマニル、イソチオクロマニル、テトラヒドロベンゾチアゾリル、インドリル、キノリニル、またはイソキノリニルであって、

テトラヒドロナフタレニル、スピロ[シクロプロパン-1, 2'-インダン]イル、ナフチル、ジヒドロベンゾフラニル、クロマニル、イソクロマニル、チオクロマニル、イソチオクロマニル、テトラヒドロベンゾチアゾリル、インドリル、キノリニル、およびイソキノリニルは所望により1~4個の $R^{6S}$ 置換基で置換され、

$R^{6S}$ は独立してハロゲン、オキソ、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -ハロア

50

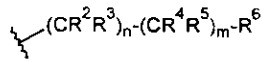
ルキル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、 $-C_1 - C_4$ -ハロアルコキシ、または $C_3 - C_6$ -シクロアルキルである。

【0103】

適切な下記鎖の非限定的な例には、

【0104】

【化4】



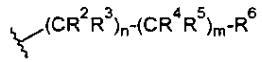
10

【0105】

下記鎖のいずれかが含まれ

【0106】

【化5】



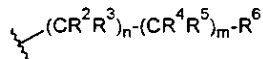
20

【0107】

表1の「

【0108】

【化6】



【0109】

」列に開示される。

【0110】

好ましくは、 $R^7$ は水素、ハロゲン、シアノ、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_6$ -ヒドロキシアルキル、 $C_1 - C_6$ -アルキルカルボニル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキルカルボニル、 $C_1 - C_6$ -アルコキシ、 $C_1 - C_6$ -ハロアルコキシ、 $C_2 - C_6$ -アルケニル、 $C_2 - C_6$ -ハロアルケニル、 $C_2 - C_6$ -アルキニル、 $C_2 - C_6$ -ハロアルキニル、 $C_1 - C_6$ -アルキルスルファニル、 $C_1 - C_6$ -アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$ -アルキルスルホニル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキルスルホニル、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル、フェニル、ナフチル、5員または6員ヘテロアリアル、3員~7員ヘテロシクリル、 $-N(R^{20})_2$ 、 $-C(=NR^{21})R^{22}$ 、 $-C(=O)(OR^{25})$ 、または $-C(=O)N(R^{26})_2$ であって、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_6$ -ヒドロキシアルキル、 $C_1 - C_6$ -アルキルカルボニル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキルカルボニル、 $C_1 - C_6$ -アルコキシ、 $C_1 - C_6$ -ハロアルコキシ、 $C_2 - C_6$ -アルケニル、 $C_2 - C_6$ -ハロアルケニル、 $C_2 - C_6$ -アルキニル、 $C_2 - C_6$ -ハロアルキニル、 $C_1 - C_6$ -アルキルスルファニル、 $C_1 - C_6$ -アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$ -アルキルスルホニル、および $C_1 - C_6$ -ハロアルキルスルホニルは、1~3個の $R^{7S^a}$ 置換基で所望により置換され、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル、フェニル、ナフチル、5員または6員ヘテロアリアル、および3員~7員ヘテロシクリルは、1~3個の $R^{7S^c}$ 置換基で所望により置換され、

30

40

$R^{20}$ は、水素、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキル、または $C_3 - C$

50

6 - シクロアルキルであって、

$C_3 - C_8$  - シクロアルキルは、ハロゲンおよび  $C_1 - C_6$  - アルキルからなる群から独立して選択される 1 または 2 個の置換基で所望により置換され、

$R^{21}$  は、ヒドロキシル、 $C_1 - C_6$  - アルキル、または  $C_1 - C_6$  - アルコキシであり、

$R^{22}$  は、水素、 $C_1 - C_6$  - アルキル、または  $C_1 - C_6$  - ハロアルキルであり、

$R^{25}$  および  $R^{26}$  は独立して水素または  $C_1 - C_6$  - アルキルであり、

並びに

$R^{7S^a}$  は独立してシアノ、ヒドロキシル、 $C_1 - C_6$  - アルコキシ、 $C_1 - C_6$  - ハロアルコキシ、 $C_3 - C_6$  - シクロアルキル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシカルボニル、およびフェニルであり、

10

$R^{7S^c}$  は独立してハロゲン、ヒドロキシル、 $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_1 - C_4$  - ハロアルキル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ、または  $C_1 - C_4$  - ハロアルコキシである。

【0111】

より好ましくは、 $R^7$  は、ハロゲン、 $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_1 - C_4$  - ハロアルキル、 $C_1 - C_4$  - ヒドロキシアルキル、 $C_1 - C_4$  - アルキルカルボニル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ、 $C_1 - C_4$  - アルキルスルファニル、 $C_2 - C_4$  - アルケニル、 $C_2 - C_4$  - アルキニル、 $C_3 - C_6$  - シクロアルキル、ピリジニル、イミダゾリル、ピラゾリル、オキサニル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロピラニル、ピロリジニル、ピペリジニル、 $-N(R^{20})_2$ 、 $-C(=NR^{21})R^{22}$ 、または  $-C(=O)(OR^{25})$  であって、 $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_1 - C_4$  - ハロアルキル、 $C_1 - C_4$  - ヒドロキシアルキル、 $C_1 - C_4$  - アルキルカルボニル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ、 $C_1 - C_4$  - アルキルスルファニル、 $C_2 - C_4$  - アルケニル、および  $C_2 - C_4$  - アルキニルは、1 または 2 個の  $R^{7S^a}$  置換基で所望により置換され、 $C_3 - C_6$  - シクロアルキル、ピリジニル、イミダゾリル、ピラゾリル、オキサニル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロピラニル、ピロリジニル、ピペリジニルは、 $R^{7S^c}$  置換基で所望により置換され、

20

$R^{20}$  は、水素、 $C_1 - C_4$  - アルキル、または  $C_3 - C_6$  - シクロアルキルであり、

$R^{21}$  は、 $C_1 - C_4$  - アルキルまたは  $C_1 - C_4$  - アルコキシであり、

$R^{22}$  は、 $C_1 - C_4$  - アルキルであり、

$R^{25}$  は、水素または  $C_1 - C_4$  - アルキルであり、

30

並びに

$R^{7S^a}$  は独立して  $C_1 - C_4$  - アルコキシまたはフェニルであり、

$R^{7S^c}$  は独立してハロゲンまたは  $C_1 - C_4$  - アルキルである。

【0112】

さらにより好ましくは、 $R^7$  は、クロロ、ヨード、 $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_1 - C_4$  - ハロアルキル、 $C_1 - C_4$  - ヒドロキシアルキル、 $C_1 - C_4$  - アルキルカルボニル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ、 $C_1 - C_4$  - アルキルスルファニル、 $C_2 - C_4$  - アルケニル、 $C_2 - C_4$  - アルキニル、 $C_3 - C_6$  - シクロアルキル、 $-N(R^{20})_2$ 、または  $-C(=NR^{21})R^{22}$  であり、

$C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_1 - C_4$  - ハロアルキル、 $C_1 - C_4$  - ヒドロキシアルキル、 $C_1 - C_4$  - アルキルカルボニル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ、 $C_1 - C_4$  - アルキルスルファニル、 $C_2 - C_4$  - アルケニル、および  $C_2 - C_4$  - アルキニルは所望により 1 または 2 個の  $R^{7S^a}$  置換基で置換され、

40

$C_3 - C_6$  - シクロアルキルは所望により 1 または 2 個の置換基  $R^{7S^c}$  で置換され、

$R^{20}$  は水素、シクロプロピル、またはシクロブチルであり、

$R^{21}$  は、 $C_1 - C_4$  - アルキルまたは  $C_1 - C_4$  - アルコキシであり、

$R^{22}$  は、 $C_1 - C_4$  - アルキルであり、

並びに

$R^{7S^a}$  は独立して  $C_1 - C_4$  - アルコキシであり、

$R^{7S^c}$  は独立してハロゲンである。

50



## 【 0 1 1 3 】

さらにより好ましいのは、 $R^7$ が、クロロ、ヨード、メチル、またはシクロプロピルである式 ( I ) の化合物である。

## 【 0 1 1 4 】

適切な  $R^7$  の非限定的な例には、表 1 の列「 $R^7$ 」に列挙された  $R^7$  基のいずれかが含まれる。

## 【 0 1 1 5 】

特に好ましいのは、

$R^7$ が、メチル、エチル、メトキシ、メチルスルファニル、またはシクロプロピル、特にメチル、メトキシ、メチルスルファニル、またはシクロプロピルである式 ( I ) の化合物である。

10

## 【 0 1 1 6 】

$R^8$ は、水素またはハロゲンであり、特に好ましくは、 $R^8$ は水素である。

## 【 0 1 1 7 】

適切な  $R^8$  の非限定的な例には、 $A = C - R^8$ である場合に、 $A$ の一部として表 1 の列「 $R^8$ 」に列挙された  $R^8$  基のいずれかが含まれる。

## 【 0 1 1 8 】

特に好ましいのは、 $R^7$ が、クロロ、ヨード、メチル、またはシクロプロピルであり、および  $R^8$ が水素である式 ( I ) の化合物である。

## 【 0 1 1 9 】

20

好ましくは、 $Q$ は、フェニル、ナフチル、ビスクロ [ 4 . 2 . 0 ] オクタ - 1 ( 6 ) , 2 , 4 - トリエニル、インダニル、テトラヒドロナフタレニル、インデニル、ジヒドロナフタレニル、ビスクロ [ 4 . 2 . 0 ] オクタ - 1 ( 6 ) , 2 , 4 - トリエニル、ジヒドロベンゾフラニル、ジヒドロイソベンゾフラニル、インドリニル、1 , 3 - ベンゾジオキサソリル、クロマニル、ジヒドロ - 1 , 4 - ベンゾジオキシニル、[ 1 , 3 ] ジオキサソ [ 4 , 5 - b ] ピリジニル、テトラヒドロキノリニル、6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - シクロペンタ [ b ] ピリジニル、ピロリル、フラニル、チエニル、イミダゾリル、トリアゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、ピリジニル、ピリダジニル、ピリミジニル、インドリル、ベンズイミダゾリル、インダゾリル、ベンゾフラニル、ベンゾチオフェニル、ベンゾチアゾリル、ベンゾオキサゾリル、キノリニル、フロ [ 3 , 2 - b ] ピリジニル、チエノ [ 3 , 2 - b ] チオフェニル、およびチエノ [ 2 , 3 - d ] チアゾリルであり、いずれの場合も、1 ~ 4 個の置換基  $Q^S$  で所望により置換される。好ましくは、 $Q$  基は、1 ~ 3 個の置換基  $Q^S$  で置換される。より好ましくは、 $Q$  基は、1 または 2 個の置換基  $Q^S$  で置換される。

30

## 【 0 1 2 0 】

好ましい実施形態では、 $Q$ は、フェニル、ナフチル、ビスクロ [ 4 . 2 . 0 ] オクタ - 1 ( 6 ) 2 , 4 - トリエニル、インダニル、テトラヒドロナフタレニル、インデニル、ジヒドロナフタレニル、ジヒドロベンゾフラニル、ジヒドロイソベンゾフラニル、インドリニル、1 , 3 - ベンゾジオキサソリル、クロマニル、ジヒドロ - 1 , 4 - ベンゾジオキシニル、[ 1 , 3 ] ジオキサソ [ 4 , 5 - b ] ピリジニル、テトラヒドロキノリニル、ジヒドロ - 5 H - シクロペンタ [ b ] ピリジニル、ジヒドロベンゾフラニル、ピロリル、フラニル、チエニル、イミダゾリル、トリアゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、ピリジニル、ピリダジニル、ピリミジニル、インドリル、ベンズイミダゾリル、インダゾリル、ベンゾフラニル、ベンゾチオフェニル、ベンゾチアゾリル、ベンゾオキサゾリル、イソキノリニル、キノリニル、フロピリジニル、チエノチオフェニル、またはチエノチアゾリルであって、フェニル、ナフチル、ビスクロ [ 4 . 2 . 0 ] オクタ - 1 ( 6 ) 2 , 4 - トリエニル、インダニル、テトラヒドロナフタレニル、インデニル、ジヒドロナフタレニル、ジヒドロベンゾフラニル、ジヒドロイソベンゾフラニル、インドリニル、1 , 3 - ベンゾジオキサソリル、クロマニル、ジヒドロ - 1 , 4 - ベンゾジオキシニル、[ 1 , 3 ] ジオキサソ [ 4 , 5 - b ] ピリジニル、テトラヒドロキノリニル、ジヒドロ - 5 H - シクロペンタ [ b ] ピリジニル、ジヒドロベンゾフラニル、ピロリル、フラニル、チエニル、イミダゾリ

40

50

ル、トリアゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、ピリジニル、ピリダジニル、ピリミジニル、インドリル、ベンズイミダゾリル、インダゾリル、ベンゾフラニル、ベンゾチオフェニル、ベンゾチアゾリル、ベンゾオキサゾリル、イソキノリニル、キノリニル、フロピリジニル、チエノチオフェニル、およびチエノチアゾリルは、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ -アルキルカルボニル、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキルカルボニル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、 $C_1 - C_4$ -ハロアルコキシ、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ- $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_2 - C_4$ -アルケニル、 $C_2 - C_4$ -ハロアルケニル、 $C_2 - C_4$ -アルキニル、 $C_2 - C_4$ -ハロアルキニル、 $C_1 - C_4$ -アルキルスルファニル、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキルスルファニル、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキル、フェニル、ピラゾリル、イミダゾリル、ピリジニル、オキセタニル、アゼチジニル、テトラヒドロフラニル、ピロリジニル、テトラヒドロピラニル、および  $N(R^{4,3})_2$  からなる群から独立して選択される 1 ~ 3 個の  $Q^S$  置換基で所望により置換され、

10

前記  $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ -アルキルカルボニル、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキルカルボニル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、 $C_1 - C_4$ -ハロアルコキシ、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ- $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_2 - C_4$ -アルケニル、 $C_2 - C_4$ -ハロアルケニル、 $C_2 - C_4$ -アルキニル、 $C_2 - C_4$ -ハロアルキニル、 $C_1 - C_4$ -アルキルスルファニル、および  $C_1 - C_4$ -ハロアルキルスルファニルは、ヒドロキシル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、および  $C_1 - C_4$ -ハロアルコキシからなる群から独立して選択される 1 または 2 個の置換基で所望により置換され、

20

前記  $C_3 - C_6$ -シクロアルキル、フェニル、ピラゾリル、イミダゾリル、ピリジニル、オキセタニル、アゼチジニル、テトラヒドロフラニル、ピロリジニル、およびテトラヒドロピラニルは、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ -アルキル、および  $C_1 - C_4$ -ハロアルキルからなる群から独立して選択される 1 または 2 個の置換基で所望により置換され、

並びに

$R^{4,3}$  は独立して水素または  $C_1 - C_4$ -アルキルである。

【0121】

より好ましくは、 $Q$  は、フェニル、ナフチル、ビシクロ[4.2.0]オクタ-1(6), 2, 4-トリエニル、ベンゾジオキサソリル、2, 3-ジヒドロベンゾフラニル、ピリジニル、チエニル、またはインドリルであって、

30

フェニル、ナフチル、ビシクロ[4.2.0]オクタ-1(6), 2, 4-トリエニル、ベンゾジオキサソリル、2, 3-ジヒドロベンゾフラニル、ピリジニル、チエニル、およびインドリルは、1 ~ 3 個の置換基  $Q^S$  で所望により置換され、

$Q^S$  は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ホルミル、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ -アルキルカルボニル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、 $C_1 - C_4$ -ハロアルコキシ、 $C_2 - C_4$ -アルキニル、または  $C_3 - C_6$ -シクロアルキルであり、

前記  $C_3 - C_6$ -シクロアルキルは、フルオロまたはメチルからなる群から独立して選択される 1 または 2 個の置換基で同様に所望により置換される。

【0122】

40

同様に、より好ましくは、 $Q$  は、フェニル、ナフチル、ビシクロ[4.2.0]オクタ-1(6), 2, 4-トリエニル、ベンゾジオキサソリル、2, 3-ジヒドロベンゾフラニル、ピリジニル、チエニル、またはインドリルであって、

フェニル、ナフチル、ビシクロ[4.2.0]オクタ-1(6), 2, 4-トリエニル、ベンゾジオキサソリル、2, 3-ジヒドロベンゾフラニル、ピリジニル、チエニル、およびインドリルは、1 ~ 3 個の置換基  $Q^S$  で置換され、

$Q^S$  は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ホルミル、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ -アルキルカルボニル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、 $C_1 - C_4$ -ハロアルコキシ、 $C_2 - C_4$ -アルキニル、または  $C_3 - C_6$ -シクロアルキルであり、

50

前記 C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - シクロアルキルは、フルオロまたはメチルからなる群から独立して選択される 1 または 2 個の置換基で同様に所望により置換される。

【 0 1 2 3 】

より好ましい実施形態では、Q は、フェニル、ナフチル、インダニル、ジヒドロベンゾフラニル、テトラヒドロキノリニル、ジヒドロ - 5 H - シクロペンタ [ b ] ピリジニル、ジヒドロベンゾフラニル、ピリジニル、ベンゾフラニル、ベンゾチオフェニル、イソキノリニル、またはキノリニルであり、フェニル、ナフチル、インダニル、ジヒドロベンゾフラニル、テトラヒドロキノリニル、ジヒドロ - 5 H - シクロペンタ [ b ] ピリジニル、ジヒドロベンゾフラニル、ピリジニル、ベンゾフラニル、ベンゾチオフェニル、イソキノリニル、またはキノリニルは、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルカルボニル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルキルカルボニル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルコキシ - C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub> - アルケニル、C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルケニル、C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub> - アルキニル、C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルキニル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルスルファニル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルキルスルファニル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - シクロアルキル、フェニル、ピラゾリル、ピリジニル、オキセタニル、アゼチジニル、テトラヒドロフラニル、ピロリジニル、および - N ( R<sup>4 3</sup> )<sub>2</sub> からなる群から独立して選択される 1 または 2 個の Q<sup>S</sup> 置換基で所望により置換され、

10

前記 C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルコキシ、および C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルコキシは、ヒドロキシル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルコキシ、および C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルコキシからなる群から独立して選択される 1 または 2 個の置換基で所望により置換され、

20

前記 C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - シクロアルキル、フェニル、ピラゾリル、ピリジニル、オキセタニル、アゼチジニル、テトラヒドロフラニル、およびピロリジニルは、ハロゲン、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、および C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルキルからなる群から独立して選択される 1 または 2 個の置換基で所望により置換され、

並びに

R<sup>4 3</sup> は独立して C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルである化合物。

【 0 1 2 4 】

より好ましくは、Q はフェニルまたはピリジニルであり、それぞれの場合、1 ~ 3 個の置換基 Q<sup>S</sup> で所望により置換され、好ましくは 1 または 2 個の置換基 Q<sup>S</sup> で置換される。

30

【 0 1 2 5 】

好ましくは、Q<sup>S</sup> はハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、ホルミル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルカルボニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキルカルボニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシ - C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - アルケニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルケニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - アルキニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルスルファニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキルスルファニル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - シクロアルキル、オキセタニル、および - N ( R<sup>4 3</sup> )<sub>2</sub> であって、前記 C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - シクロアルキルおよびオキセタニルは、ハロゲン、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、および C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルキルからなる群から独立して選択される 1 または 2 個の置換基で所望により置換され、並びに R<sup>4 3</sup> は、水素または C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルである。

40

【 0 1 2 6 】

より好ましくは、Q<sup>S</sup> は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ホルミル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルカルボニル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルコキシ、C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub> - アルキニル、および C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - シクロアルキルからなる群から独立して選択され、前記 C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - シクロアルキルおよびオキセタニルは、フルオロまたはメチルからなる群から独立して選択される 1 または 2 個の置換基で順番に所望により置換される。

【 0 1 2 7 】

同様に、さらにより好ましくは、Q はフェニルであって、フェニルは、ハロゲン、シア

50

ノ、ニトロ、ホルミル、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ -アルキルカルボニル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、 $C_1 - C_4$ -ハロアルコキシ、 $C_2 - C_4$ -アルキニル、シクロプロピル、およびシクロブチルからなる群から独立して選択される1または2個の置換基 $Q^S$ で置換され、前記シクロプロピルおよびシクロブチルは順番にフルオロまたはメチルからなる群から独立して選択される1または2個の置換基 $Q^S$ で所望により置換される。

## 【0128】

適切なQの非限定的な例には、表1の列「Q」に列挙されたQ基のいずれかが含まれる。

## 【0129】

特に好ましくは、Qは、1~3個の置換基 $Q^S$ で置換されたフェニルまたはピリジニルであり、前記置換基は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ホルミル、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキル、および $C_1 - C_4$ -ハロアルキルからなる群から独立して選択され、好ましくは、前記 $Q^S$ 置換基の少なくとも1つが、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキルである。

10

## 【0130】

特に好ましくは、Qは、フェニル環の3位に1個の $Q^S$ 置換基で置換されたフェニルであり、好ましくは、3-シクロプロピル、3-クロロメチル、または3-トリフルオロメチルである。特に好ましい実施形態では、Qは3-(トリフルオロメチル)フェニルである。

20

## 【0131】

m、n、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^8$ 、A、およびQの上記の特定の定義(広い定義並びに好ましい、より好ましい、さらにより好ましい、特に好ましい定義)は、様々な方法で組み合わせることができる。よって、定義のこれらの組み合わせは、本発明による化合物のサブクラスを提供する。

## 【0132】

特に好ましい式(I)の化合物は、

Aは、窒素(N)または $C - R^8$ であり、

Tは、酸素(O)であり、

nは、1、

mは、1、

$R^1$ は、水素であり、

$R^2$ および $R^3$ は、水素であり、

$R^4$ は、水素またはフッ素であり、

$R^5$ は、水素またはフッ素であり、

$R^6$ は、フェニル、ピリジン-2-イル、またはピリジン-3-イルであり、 $R^6$ は1~3個の $R^6^S$ 置換基で置換され、前記置換基 $R^6^S$ はハロゲン、シアノ、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、 $C_1 - C_6$ -ハロアルコキシ、 $C_1 - C_6$ -アルコキシカルボニル、 $C_1 - C_6$ -アルキルカルボニル、 $C_2 - C_6$ -アルケニル、 $C_2 - C_6$ -アルキニル、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキル、およびピラゾリルからなる群から独立して選択され、前記 $C_3 - C_6$ -シクロアルキルおよびピラゾリルは、ハロゲンおよび $C_1 - C_4$ -アルキルからなる群から独立して選択される1または2個の置換基で所望により置換されるが、

30

40

$R^7$ は、クロロ、ヨード、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ -ヒドロキシアルキル、 $C_1 - C_4$ -アルキルカルボニル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、 $C_1 - C_4$ -アルキルスルファニル、 $C_2 - C_4$ -アルケニル、 $C_2 - C_4$ -アルキニル、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキルであり、

$C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ -ヒドロキシアルキル、 $C_1 - C_4$ -アルキルカルボニル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、 $C_1 - C_4$ -アルキルスルファニル、 $C_2 - C_4$ -アルケニル、および $C_2 - C_4$ -アルキニルは所望により1

50

または 2 個の  $R^{7S^a}$  置換基で置換され、

$C_3 - C_6$  - シクロアルキルは所望により 1 または 2 個の置換基  $R^{7S^c}$  で置換され、

$R^{7S^a}$  は独立して  $C_1 - C_4$  - アルコキシであり、

$R^{7S^c}$  は独立してハロゲンであり、

$R^8$  は、水素であり、

Q は、1 ~ 3 個の置換基  $Q^S$  で置換されたフェニルまたはピリジニルであり、前記置換基  $Q^S$  は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ホルミル、 $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ、 $C_3 - C_6$  - シクロアルキル、および  $C_1 - C_4$  - ハロアルキルからなる群から独立して選択される化合物、

並びにそれらの塩、N - オキシド、および溶媒和物に関する。

10

【0133】

さらに特に好ましい式 (I) の化合物は、

A は、窒素 (N) または  $C - R^8$  であり、

T は、酸素 (O) であり、

n は、1、

m は、1、

$R^1$  は、水素であり、

$R^2$  および  $R^3$  は、水素であり、

$R^4$  は、水素またはフッ素であり、

$R^5$  は、水素またはフッ素であり、

20

$R^6$  は、フェニルであって、 $R^6$  は 1、2、または 3 個の  $R^{6S}$  置換基で置換され、前記置換基  $R^{6S}$  は、ハロゲン (好ましくは、Cl または Br) および  $C_1 - C_4$  - アルキル (好ましくは、メチル) からなる群から独立して選択され、

$R^7$  は、 $C_1 - C_4$  - アルキル (好ましくは、メチルまたはエチル)、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ (好ましくは、メトキシ)、 $C_1 - C_4$  - アルキルスルファニル (好ましくは、SMe)、または  $C_3 - C_6$  - シクロアルキル (好ましくは、シクロプロピル) であり、  
 $R^8$  は、水素であり、

Q は、1 または 2 個の置換基  $Q^S$  で置換されたフェニルであり、前記置換基  $Q^S$  は、ハロゲン (好ましくは、Cl または Br)、 $C_1 - C_4$  - アルキル (好ましくは、メチル)、 $C_1 - C_4$  - ハロアルキル (好ましくは、トリフルオロメチル)、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ (好ましくは、メトキシ)、および  $C_3 - C_6$  - シクロアルキル (好ましくは、シクロプロピル) からなる群から独立して選択され、好ましくは  $Q^S$  は、3 - シクロプロピル、3 - クロロメチル、または 3 - トリフルオロメチルからなる群から選択される化合物、並びにそれらの塩、N - オキシド、および溶媒和物に関する。

30

【0134】

特に好ましい式 (I) の化合物は、

$R^7$  は、メチル、エチル、メトキシ、メチルスルファニル、またはシクロプロピルであり、

および / または

Q は、1 ~ 3 個の置換基  $Q^S$  で置換されたフェニルであり、前記置換基は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ホルミル、 $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ、 $C_3 - C_6$  - シクロアルキル、および  $C_1 - C_4$  - ハロアルキルからなる群から独立して選択され、好ましくは、前記  $Q^S$  置換基の少なくとも 1 つが、 $C_1 - C_4$  - ハロアルキルである上記で定義される化合物である。

40

【0135】

特に好ましいのは、

$R^7$  は、メチル、メトキシ、メチルスルファニル、またはシクロプロピルであり、

および / または

Q は、フェニル環の 3 位に 1 個の  $Q^S$  置換基で置換されたフェニルであり、好ましくは、 $Q^S$  は、3 - シクロプロピル、3 - クロロメチル、または 3 - トリフルオロメチルから

50

なる群から選択される、式 ( I ) の化合物である

【 0 1 3 6 】

本発明は、表 1 に開示される式 ( I ) の任意の化合物にも関する。

【 0 1 3 7 】

式 ( I ) の化合物は、( 植物病原性真菌を防除するための ) 殺真菌剤として、特に式 ( I ) の 1 または複数の化合物を植物に施用する工程を含む植物病原性真菌を防除する方法において使用することができる。

【 0 1 3 8 】

式 ( I ) の化合物および中間体を調製するためのプロセス

本発明は、式 ( I ) の化合物およびそれらの中間体を調製するためのプロセスに関する。他に示されない限り、ラジカルである Q、T、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、R<sup>7</sup>、R<sup>8</sup>、並びに m および n は、式 ( I ) の化合物について上で与えられた意味を有する。これらの定義は、式 ( I ) の最終生成物だけでなく、全ての中間体にも適用される。

10

【 0 1 3 9 】

式 ( I - a ) および式 ( I - b ) の化合物は、式 ( I ) のサブセットである。式 ( I - a - 1 ) および式 ( I - a - 2 ) の化合物は、式 ( I - a ) のサブセットである。式 ( I - a ) および式 ( I - b ) 並びに式 ( I - a - 1 ) および式 ( I - a - 2 ) の全ての置換基は、特に明記しない限り、式 ( I ) について上記で定義したとおりである。

【 0 1 4 0 】

一般式 ( I ) の化合物は、公知のプロセス ( 例えば、その中の参考文献を参照 ) と同様に、異なる経路によって調製することができる。適切なプロセスの非限定的な例が本明細書に記載されている。

20

【 0 1 4 1 】

式 ( I ) の化合物は、プロセス A または B を実施することによって直接得てもよく、または本明細書に記載のプロセスに従って調製された式 ( I ) の別の化合物の変換または誘導体化によって得てもよい。例えば、式 ( I ) の化合物は、式 ( I ) の出発化合物の 1 または複数の置換基を他の置換基で置換することにより、式 ( I ) の別の化合物に変換することができる。そのような変換または誘導体化の非限定的な例を以下に記載する。

【 0 1 4 2 】

本明細書に記載のプロセスは、考慮される反応に慣例である 1 または複数の不活性有機溶媒を使用して適切に実施することができる。適切な不活性有機溶媒は、以下から選択され得る：脂肪族、脂環式、または芳香族炭化水素 ( 例えば、石油エーテル、ペンタン、ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン、メチルシクロヘキサン、リグロイン、ベンゼン、トルエン、キシレン、またはデカリン )、ハロゲン化脂肪族、脂環式、または芳香族炭化水素 ( 例えば、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1, 2 - ジクロロエタン、またはトリクロロエタン )、エーテル ( 例えば、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、メチル - t - ブチルエーテル、メチル - t - アミルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、2 - メチルテトラヒドロフラン、1, 2 - ジメトキシエタン、1, 2 - ジエトキシエタン、またはアニソール )、ケトン ( 例

え

ば、アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソプロピルケトン、およびメチルイソブチルケトン )、エステル ( 例

え

ば、メチルアセテート、エチルアセテート、またはブチルアセテート )、アルコール ( 例

え

ば、メタノール、エタノール、プロパノール、イソプロパノール、ブタノール、tert - ブタノール )、ニトリル ( 例

え

ば、アセトニトリル、プロピオニトリル、n - 若しくは i - ブチロニトリル、またはベンゾニトリル )、アミド ( 例

え

ば、N, N - ジメチルホルムアミド、N, N - ジメチルアセトアミド、N - メチルホルムアニリド、N - メチルピロリドン、またはヘキサメチルリン酸トリアミド )、スルホキシド ( 例

え

ば、ジメチルスルホキシド ) またはスルホン ( 例

え

ば、スルホラン )、ウレア ( 例

え

ば、1, 3 - ジメチル - 3, 4, 5, 6 - テトラヒドロ - 2 ( 1 H ) - ピリミジンオン )、またはそれらの混合物のいずれか。

30

40

【 0 1 4 3 】

50

本明細書に記載のいくつかのプロセスは、そのような反応に慣例である 1 または複数の無機または有機塩基を必要とするか、または必要に応じて使用することができる。適切な無機塩基および有機塩基の例としては、アルカリ土類金属またはアルカリ金属炭酸塩（例えば、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、重炭酸カリウム、重炭酸ナトリウム、または炭酸セシウム）、アルカリ金属水素化物（例えば、水素化ナトリウム）、アルカリ土類金属またはアルカリ金属水酸化物（例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カルシウム、水酸化カリウム、または他の水酸化アンモニウム誘導体）、アルカリ土類金属、アルカリ金属またはフッ化アンモニウム（例えば、フッ化カリウム、フッ化セシウム、またはフッ化テトラブチルアンモニウム）、アルカリ金属またはアルカリ土類金属の酢酸塩（例えば、酢酸ナトリウム、酢酸リチウム、酢酸カリウム、または酢酸カルシウム）、アルカリ金属アルコラート（例えば、カリウム *tert*-ブトキシドまたはナトリウム *tert*-ブトキシド）、アルカリ金属リン酸塩（例えば、リン酸三カリウム）、第三級アミン（例えば、トリメチルアミン、トリエチルアミン、トリブチルアミン、*N,N*-ジメチルアニリン、*N,N*-ジシクロヘキシルメチルアミン、*N,N*-ジイソプロピルエチルアミン、*N*-メチルピペリジン、*N,N*-ジメチルアミノピリジン、ジアザピシクロオクタン（*DABCO*）、ジアザピシクロノネン（*DBN*）、ジアザピシクロウンデセン（*DBU*）、キヌクリジン、3-アセトキシキヌクリジン、グアニジン、または芳香族塩基（例えば、ピリジン、ピコリン、ルチジン、またはコリジン）が挙げられるが、これらに限定されない。

10

## 【0144】

本明細書に記載のプロセスのいくつかは、必要に応じて、金属（例えば、銅またはパラジウム）塩または錯体などの遷移金属触媒の存在下で、適切であればリガンドの存在下で行うことができる。

20

## 【0145】

適切な銅塩または錯体およびそれらの水和物には、金属銅、ヨウ化銅（*I*）、塩化銅（*I*）、臭化銅（*I*）、塩化銅（*II*）、臭化銅（*II*）、酸化銅（*II*）、酸化銅（*I*）、酢酸銅（*II*）、酢酸銅（*I*）、チオフェン-2-カルボン酸銅（*I*）、シアン化銅（*I*）、硫酸銅（*II*）、ビス（2,2,6,6-テトラメチル-3,5-ヘプタンジオネート）銅（*II*）、トリフルオロメタンスルホン酸銅（*II*）、テトラキス（アセトニトリル）銅（*I*）ヘキサフルオロホスフェート、テトラキス（アセトニトリル）-銅（*I*）テトラフルオロボレートが含まれるが、これらに限定されない。

30

## 【0146】

以下に挙げるような銅塩とリガンドまたは塩との反応に別々に添加することにより、反応混合物中に適切な銅錯体をイン・サイチュ（*in situ*）で生成することも可能である：エチレンジアミン、*N,N*-ジメチルエチレンジアミン、*N,N'*-ジメチルエチレンジアミン、*rac*-トランス-1,2-ジアミノシクロヘキサン、*rac*-トランス-*N,N'*-ジメチルシクロヘキサン-1,2-ジアミン、1,1'-ピナフチル-2,2'-ジアミン、*N,N,N',N'*-テトラメチルエチレンジアミン、プロリン、*N,N*-ジメチルグリシン、キノリン-8-オール、ピリジン、2-アミノピリジン、4-(ジメチルアミノ)ピリジン、2,2'-ビピリジル、2,6-ジ(2-ピリジル)ピリジン、2-ピコリン酸、2-(ジメチルアミノメチル)-3-ヒドロキシピリジン、1,10-フェナントロリン、3,4,7,8-テトラメチル-1,10-フェナントロリン、2,9-ジメチル-1,10-フェナントロリン、4,7-ジメトキシ-1,10-フェナントロリン、*N,N'*-ビス[(*E*)-ピリジン-2-イルメチリデン]シクロヘキサン-1,2-ジアミン、*N*-[(*E*)-フェニルメチリデン]、*N*-[(*E*)-フェニルメチリデン]-シクロヘキサンアミン、1,1,1-トリス(ヒドロキシメチル)エタン、エチレングリコール、2,2,6,6-テトラメチルヘプタン-3,5-ジオン、2-(2,2-ジメチルプロパノイル)シクロヘキサノン、アセチルアセトン、ジベンゾイルメタン、2-(2-メチルプロパノイル)シクロヘキサノン、ピフェニル-2-イル(ジ-*tert*-ブチル)ホスファン、エチレンビス-(ジフェニルホスフィン)、*N,N*-ジエチルサリチルアミド、2-ヒドロキシベンズアルデヒドオキシム、オキソ[(2,4,6

40

50

- トリメチルフェニル) アミノ] 酢酸、または 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸。

【 0 1 4 7 】

適切なパラジウム塩または錯体には、塩化パラジウム、酢酸パラジウム、テトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(0)、ビス(ジベンジリデンアセトン)パラジウム(0)、トリス(ジベンジリデンアセトン)ジパラジウム(0)、ビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(II)ジクロリド、[1, 1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセン]ジクロロパラジウム(II)、ビス(シンナミル)ジクロロジパラジウム(II)、ビス(アリル)-ジクロロジパラジウム(II)、または[1, 1'-Bis(ジ-tert-ブチルホスフィノ)フェロセン]ジクロロパラジウム(II)が挙げられるが、これらに限定されない。

10

【 0 1 4 8 】

以下に挙げるようなパラジウム塩とリガンドまたは塩との反応に別々に添加することにより、反応混合物中にパラジウム錯体を生成することも可能である：トリエチルホスフィン、トリ-tert-ブチルホスフィン、トリ-tert-ブチルホスホニウムテトラフルオロボレート、トリシクロヘキシルホスフィン、2-(ジシクロヘキシルホスフィノ)ピフェニル、2-(ジ-tert-ブチルホスフィノ)ピフェニル、2-(ジシクロヘキシルホスフィノ)-2'-(N,N-ジメチルアミノ)ピフェニル、2-(tert-ブチルホスフィノ)-2'-(N,N-ジメチルアミノ)ピフェニル、2-ジ-tert-ブチルホスフィノ-2', 4', 6'-トリスプロピルピフェニル、2-ジシクロヘキシルホスフィノ-2', 4', 6'-トリスプロピルピフェニル、2-ジシクロヘキシルホスフィノ-2, 6'-ジメトキシピフェニル、2-ジシクロヘキシルホスフィノ-2', 6'-ジイソプロポキシピフェニル、トリフェニル-ホスフィン、トリス-(o-トリル)ホスフィン、3-(ジフェニルホスフィノ)ベンゼンスルホン酸ナトリウム、トリス-(2-メトキシ-フェニル)ホスフィン、2, 2'-ビス(ジフェニルホスフィノ)-1, 1'-ビナフチル、1, 4-ビス(ジフェニルホスフィノ)ブタン、1, 2-ビス(ジフェニルホスフィノ)エタン、1, 4-ビス(ジシクロヘキシルホスフィノ)ブタン、1, 2-ビス(ジシクロヘキシルホスフィノ)-エタン、2-(ジシクロヘキシルホスフィノ)-2'-(N,N-ジメチルアミノ)-ピフェニル、1, 1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)-フェロセン、(R)-( )-1-[ (S)-2-ジフェニルホスフィノ)フェロセニル]エチルジシクロヘキシルホスフィン、トリス-(2, 4-tert-ブチル-フェニル)亜リン酸塩、ジ(1-アダマンチル)-2-モルフォリノフェニルホスフィン、または1, 3-ビス(2, 4, 6-トリメチルフェニル)イミダゾリウムクロリド。

20

30

【 0 1 4 9 】

適切な触媒および/またはリガンドは、Strem Chemicals社による「Metal Catalysts for Organic Synthesis」などの商業カタログまたはレビュー(Chemical Society Reviews (2014), 43, 3525, Coordination Chemistry Reviews (2004), 248, 2337および記載されている参考文献)から選択され得る。

【 0 1 5 0 】

本明細書に記載のプロセスのいくつかは、文献に報告されている方法に従って、金属光レドックス触媒作用によって実施され得る(Nature chemistry review, (2017) 005 2および記載されている参考文献; Science (2016) 352, 6291, 1304; Org. Lett. 2016, 18, 4012, J. Org. Chem 2016, 81, 6898; J. Am. Chem. Soc. 2016, 138, 12715, J. Am. Chem. Soc. 2016, 138, 13862; J. Am. Chem. Soc. 2016, 138, 8034; J. Org. Chem. 2016, 81, 12525, J. Org. Chem. 2015, 80, 7642)。次いで、このプロセスは、Ir 策体およびRu 錯体または有機染料などの光増感剤、およびNi 錯体などの金属触媒の存在下で実施される。前記反応は、リガンドの存在下、適切な場合には塩基の存在下、青色光または白色光の照射下で行うことができる。

40

【 0 1 5 1 】

適切な光増感剤には、[Ir(dFCF<sub>3</sub>ppy)<sub>2</sub>(bpy)]PF<sub>6</sub>(dFCF<sub>3</sub>ppy = 2-(2, 4-ジフルオロフェニル)-5-トリフルオロメチルピリジン、b p

50



y = 2, 2' - ビピリジン)、[Ir(dFCF<sub>3</sub>ppy)<sub>2</sub>(dtbbpy)]PF<sub>6</sub> (dtbbpy = 4, 4' - ジ - tert - ブチル - 2, 2' - ビピリジン)、Ir(ppy)<sub>2</sub>(dtbbpy)PF<sub>6</sub> (ppy = 2 - フェニルピリジン)、Ir(ppy)<sub>2</sub>(bpy)PF<sub>6</sub>、Ir(dFppy)<sub>3</sub>PF<sub>6</sub> (dFppy = 2 - (2, 4 - ジフルオロフェニル)ピリジン)、fac - Ir(ppy)<sub>3</sub>、(Ir[diF(5 - Me)ppy]<sub>2</sub>(テトラMePhen)PF<sub>6</sub> (ジF(5 - Me)ppy = 2 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) - 5 - メチルピリジン、テトラMePhen = 3, 4, 7, 8 - テトラメチル - 1, 10 - フェナントロリン)などのイリジウム(Ir)(III)光触媒、Ru(bpy)<sub>3</sub>Cl<sub>2</sub>若しくはRu(bpy)<sub>3</sub>(PF<sub>6</sub>)<sub>2</sub>などのルビジウム(Ru)(II)光触媒、または9 - メシチル - 10 - アクリジニウムなどの有機染料、過塩素酸塩若しくは四フッ化ホウ酸塩などの塩、または2, 4, 5, 6 - テトラ - 9H - カルバゾール - 9 - イル - 1, 3 - ベンゼンジカルボニトリル、9 - フルオレノン、および9, 10 - フェナントレンキノンが挙げられるが、これらに限定されない。

#### 【0152】

適切なニッケル触媒には、ビス(1, 5 - シクロオクタジエン)ニッケル(0)、塩化ニッケル(II)、臭化ニッケル(II)、ヨウ化ニッケル(II)(無水物若しくは水和物の形態でまたはジメトキシエタン錯体として)、ニッケル(II)アセチルアセトナート、硝酸ニッケル(II)六水和物が挙げられるが、これらに限定されない。これらのニッケル触媒は、2, 2' - ビピリジン、4, 4' - ジ - tert - ブチル - 2, 2' - ビピリジン、4, 4' - ジメトキシ - 2, 2' - ビピリジン、4, 4' - ジメチル - 2, 2' - ビピリジンなどのビピリジンリガンド、または1, 10 - フェナントロリン、4, 7 - ジメチル - 1, 10 - フェナントロリン、4, 7 - ジメトキシ - 1, 10 - フェナントロリンなどのフェナントロリン、またはN, N, N', N' - テトラメチルエチレンジアミンなどのジアミン、またはテトラメチルヘプタンジオンなどのジオンと組み合わせて使用され得る。

#### 【0153】

本明細書に記載のプロセスは、- 105 ~ 250、好ましくは- 78 ~ 185の範囲内の温度で実施することができる。

#### 【0154】

反応時間は、反応の規模および反応温度の関数として変動するが、概して数分間 ~ 48時間である。

#### 【0155】

本明細書に記載のプロセスは、概して標準圧力下で実施される。しかしながら、加圧下または減圧下で作業することも可能である。

#### 【0156】

本明細書に記載のプロセスでは、出発物質は概してほぼ等モル量で使用される。しかしながら、出発物質の1つを比較的大過剰で使用することも可能である。

#### 【0157】

式(I)の化合物を調製するためのプロセス

プロセスA

式(I - a)の化合物(式中、m、n、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、R<sup>7</sup>、R<sup>8</sup>、A、およびQが上記のように定義され、並びに

Tは酸素(O)である)は、

式(1)(式中、R<sup>7</sup>、R<sup>8</sup>、A、およびQが上記のように定義され、

U<sup>1</sup>は、ヒドロキシル、ハロゲン、またはC<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシである)の化合物を

式(2)(m、n、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、およびR<sup>6</sup>は、上記のように定義される)のアミンまたはその塩と、スキーム1に示されるように反応させる工程を含むプロセスによって調製され得る。

#### 【0158】

10

-20

30

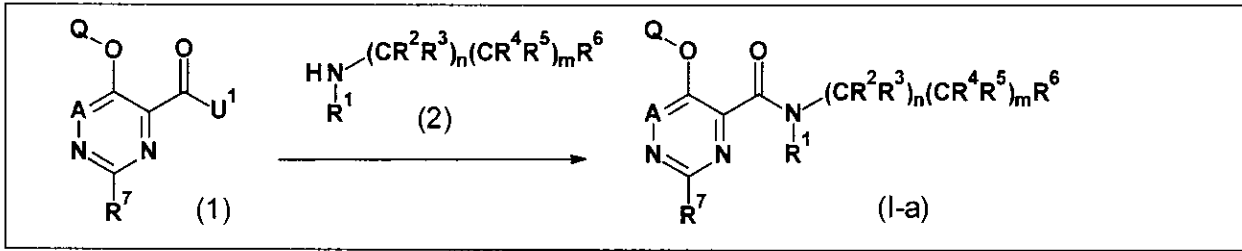
40

50

スキーム 1 : プロセス A - 式 ( I - a ) のアミドの合成

【 0 1 5 9 】

【 化 7 】



10

【 0 1 6 0 】

U<sup>1</sup> が水酸基である式 ( 1 ) の化合物は、文献 ( 例えば、Tetrahedron 2005, 61, 10827-10852) に記載された方法により、縮合試薬の存在下で式 ( 2 ) のアミンと反応させることができる。適切な縮合試薬の例には、ハロゲン化剤 ( 例えば、ホスゲン、三臭化リン、三塩化リン、五塩化リン、三塩化リン酸化物、塩化オキサリル、または塩化チオニル)、脱水試薬 ( 例えば、クロロギ酸エチル、クロロギ酸メチル、クロロギ酸イソプロピル、クロロギ酸イソブチル、または塩化メタンスルホニル)、カルボジイミド ( 例：N, N' - ジシクロヘキシルカルボジイミド ( D C C ) )、またはその他の慣例の縮合 ( またはペプチド結合) 試薬 ( 例えば、五酸化リン、ポリリン酸、ビス ( 2 - オキソ - 3 - オキサゾリジニル) ホスフィン酸クロリド、1 - [ビス (ジメチルアミノ) メチレン] - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾロ [ 4, 5 - b ] ピリジニウム 3 - オキシドヘキサフルオロホスフェート ( H A T U )、N, N' - カルボニルジイミダゾール、2 - エトキシ - N - エトキシカルボニル - 1, 2 - ジヒドロキノリン ( E E D Q )、トリフェニルホスフィン / テトラクロロ - メタン、4 - ( 4, 6 - ジメトキシ [ 1 . 3 . 5 ] - トリアジン - 2 - イル) - 4 - 塩化メチルモルホリニウム水和物、プロモトリピロリジノホスホニウムヘキサフルオロホスフェート、若しくはプロパンホスホン酸無水物 ( T 3 P ) . が含まれるが、これらに限定されない。

20

【 0 1 6 1 】

U<sup>1</sup> がハロゲン原子である式 ( 1 ) の化合物は、周知の方法により酸スカベンジャーの存在下で式 ( 2 ) のアミンと反応させることができる。適切な酸スカベンジャーには、本明細書に記載されているように、そのような反応に慣例の任意の無機塩基および有機塩基が含まれる。アルカリ金属炭酸塩、アルカリ土類金属酢酸塩、第三級アミン、または芳香族塩基が好ましい。

30

【 0 1 6 2 】

U<sup>1</sup> が C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシ基である式 ( 1 ) の化合物は、所望によりトリメチルアルミニウムなどのルイス酸の存在下で過剰の式 ( 2 ) のアミンと反応させることができる。

【 0 1 6 3 】

式 ( 1 ) の化合物は、本明細書に記載のプロセスの 1 または複数によって調製することができる ( 例えば、プロセス D を参照 ) 。

40

【 0 1 6 4 】

式 ( 2 ) のアミンは市販されているか、または文献 ( 例えば、国際公開第 2 0 0 7 / 1 4 1 0 0 9 号、国際公開第 2 0 1 3 / 0 6 4 4 6 0 号、国際公開第 2 0 1 5 / 0 7 8 8 0 0 号、国際公開第 2 0 1 6 / 0 6 6 5 7 4 号、米国特許出願公開第 2 0 0 6 / 0 1 1 6 3 7 0 号、国際公開第 2 0 0 7 / 1 3 4 7 9 9 号、国際公開第 2 0 1 4 / 1 7 7 4 8 7 号、国際公開第 2 0 1 1 / 1 4 4 3 3 8 号、欧州特許第 0 8 0 7 6 2 9 号) に記載されるプロセスに従って調製することができる。

【 0 1 6 5 】

プロセス B

50

式 (I - a - 1) (式中、 $m$ 、 $n$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $A$ 、および  $Q$  は上記のように定義され、並びに

$T$  は、酸素 (O) であり、

$R^1$  は、水素、ヒドロキシル、シアノ、 $C_1 - C_6$ -アルキル、または  $C_1 - C_6$ -アルコキシであり、

$R^7$  は、水素、ハロゲン、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_6$ -アルコキシ、または  $C_1 - C_6$ -ハロアルコキシである) の化合物は、

式 (3) (式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、および  $A$  が上記のように定義され、

$X$  は、ハロゲンである) の化合物を、

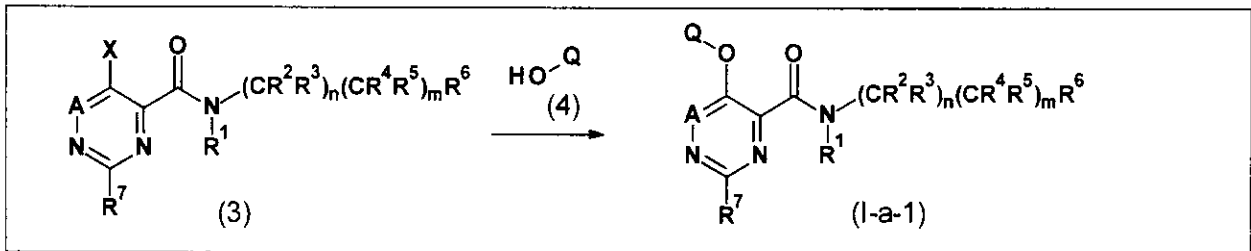
式 (4) (式中、 $Q$  は上記のように定義される) の化合物と、スキーム 2 に示すように、有機塩基または無機塩基の存在下で反応させる工程を含むプロセスによって調製することができる。

【0166】

スキーム 2 : プロセス B - 式 (I - a - 1) のアミドの合成

【0167】

【化 8】



【0168】

プロセス B は、銅塩または錯体などの遷移金属触媒の存在下で、適切であればリガンドの存在下で行うことができる。

【0169】

式 (3) の化合物は、例えば、本明細書に記載のプロセス E によって調製することができる。

【0170】

式 (4) の化合物は市販されているか、または周知の方法に従って式 (4) の別の化合物を変換または誘導体化することによって得てもよい。

【0171】

プロセス C

式 (I - b) (式中、 $m$ 、 $n$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $A$ 、および  $Q$  は上記のように定義され、並びに

$T$  は、硫黄 (S) であり、

$R^1$  は水素である) の化合物は、

式 (I - a - 2) (式中、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $A$ 、および  $Q$  が上記のように定義され、並びに

$T$  は、酸素 (O) であり、

$R^1$  は水素である) の化合物を、

スキーム 3 に示すように、チオ化剤と反応させる工程を含むプロセスによって調製することができる。

【0172】

スキーム 3 : プロセス C - 式 (I - b) のチオアミドの合成

【0173】

10

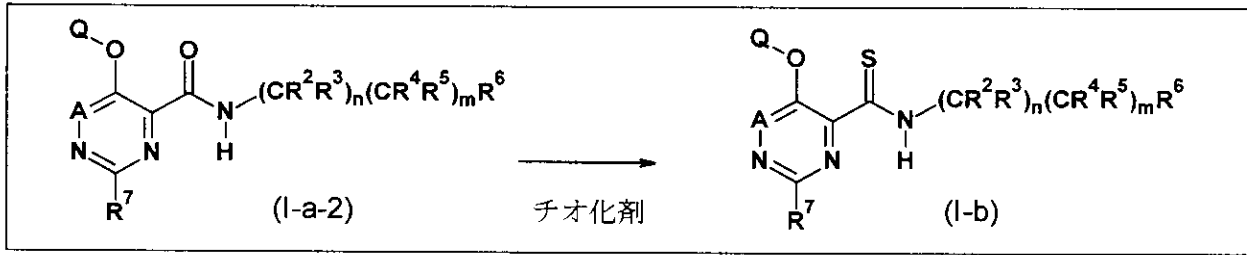
20

30

40

50

## 【化 9】



10

## 【0174】

プロセスCを実施するための適切なチオ化剤には、硫黄(S)、硫酸(H<sub>2</sub>S)、硫化ナトリウム(Na<sub>2</sub>S)、水硫化ナトリウム(NaHS)、三硫化ホウ素(B<sub>2</sub>S<sub>3</sub>)、ビス(ジエチルアルミニウム)スルフィド((AlEt<sub>2</sub>)<sub>2</sub>S)、硫化アンモニウム((NH<sub>4</sub>)<sub>2</sub>S)、五硫化リン(P<sub>2</sub>S<sub>5</sub>)、ローソン試薬(2,4-ビス(4-メトキシフェニル)-1,2,3,4-ジチアジホスフェタン2,4-ジスルフィド)、または Journal of the Chemical Society, Perkin 1(2001), 358に記載されるようなポリマー担持チオ化試薬が挙げられるが、これらに限定されない。

## 【0175】

このプロセスは、所望により、触媒的または化学量論的または過剰量の塩基(無機塩基および有機塩基)の存在下で行われる。好ましくは、アルカリ金属炭酸塩(例えば、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、重炭酸ナトリウム、重炭酸ナトリウム)、複素環式芳香族塩基(例えば、ピリジン、ピコリン、ルチジン、コリジン)、また第三級アミン(例えば、トリメチルアミン、トリエチルアミン、トリブチルアミン、N,N-ジメチルアニリン、N,N-ジメチルピリジン-4-アミン、またはN-メチル-ピペリジン)である。

20

## 【0176】

式(I-a-2)の化合物は、式(I-a-1)の化合物のサブグループを形成し、本明細書に記載のプロセスの1または複数によって調製することができる。

## 【0177】

## プロセスD

式(1)の化合物は、下記プロセスDを実施することによって直接得てもよく、または本明細書に記載のプロセスに従って調製された式(1)の別の化合物の変換または誘導体化によって得てもよい。式(1-a)、式(1-a')、および式(1-a'')の化合物は、式(1)の様々なサブセットである。

30

## 【0178】

式(1-a)(式中、R<sup>7</sup>、A、およびQは上記のように定義され、並びに

U<sup>1</sup>はC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルコキシである)の化合物は、

式(5)

(式中、R<sup>7</sup>およびAは上記のように定義され、並びに

U<sup>1</sup>はC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルコキシであり、

Xは、ハロゲンである)の化合物を、

40

式(4)(式中、Qは上記のように定義される)の化合物と、スキーム4に示すように、銅塩または錯体などの遷移金属触媒の存在下で、所望により塩基の存在下で反応させる工程を含むプロセスによって調製することができる。

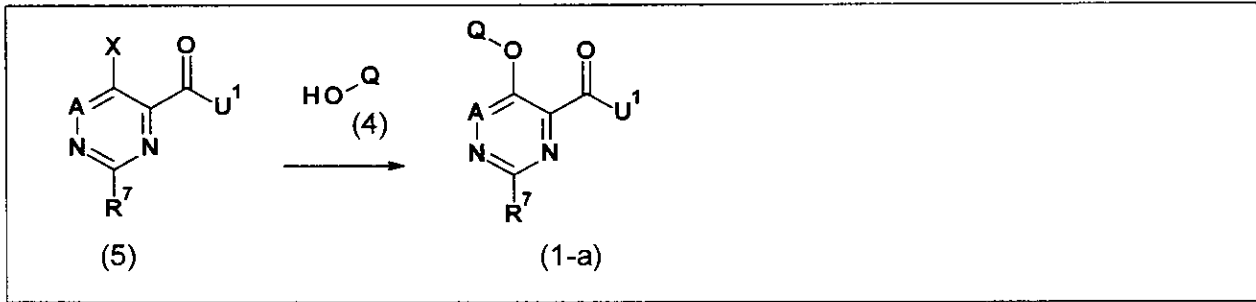
## 【0179】

スキーム4：プロセスD - 式(1-a)の化合物の合成

## 【0180】

50

## 【化10】



10

## 【0181】

式(5)の化合物は市販されているか、または文献(ACD Chemical Neuroscience 2017, 8, 2374-2380、国際公開第2016/74052号、国際公開第2018/019555号、国際公開第2009/006389号、Synlett 2015, 26, 1365-1370、国際公開第2008/116742号、J. Org. Chem. 1985, 50, 2293-2298、国際公開第2015/022284号)に記載されるプロセスに従って調製することができる。

## 【0182】

式(4)の化合物は市販されているか、または周知の方法に従って式(4)の別の化合物を変換または誘導体化することによって得てもよい。

20

## 【0183】

式(1-a) (式中、 $U^1$ は $C_1 - C_6$ -アルコキシである)の化合物を、周知の官能基相互変換法によって、例えば、水酸化リチウム(LiOH)含有テトラヒドロフラン(THF)/水によるエステル基の加水分解によって、式(1) (式中、 $U^1$ はヒドロキシル基である)の化合物へ変換することができる。

## 【0184】

式(1-a') (式中、 $U^1$ はヒドロキシルである)の化合物を、ハロゲン化剤の存在下で周知の方法によって、式(1-a'') (式中、 $U^1$ はハロゲンである)の化合物へ変換することができる。適切なハロゲン化試薬には、三臭化リン、三塩化リン、五塩化リン、三塩化リン酸化物、塩化オキサリル、または塩化チオニルが含まれるが、これらに限定されない。

30

## 【0185】

## プロセスE

式(3) (式中、 $m$ 、 $n$ 、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、およびAは上記のように定義され、並びに

Xは、ハロゲンである)の化合物は、

式(5) (式中、 $R^7$ およびAが上記のように定義され、

Xは、ハロゲンであり、並びに

$U^1$ は、ヒドロキシル、ハロゲン、または $C_1 - C_6$ -アルコキシである)の化合物を

40

、スキーム5に示すように、式(2)のアミンまたはその塩の1つで反応させる工程を含むプロセスによって調製することができる。

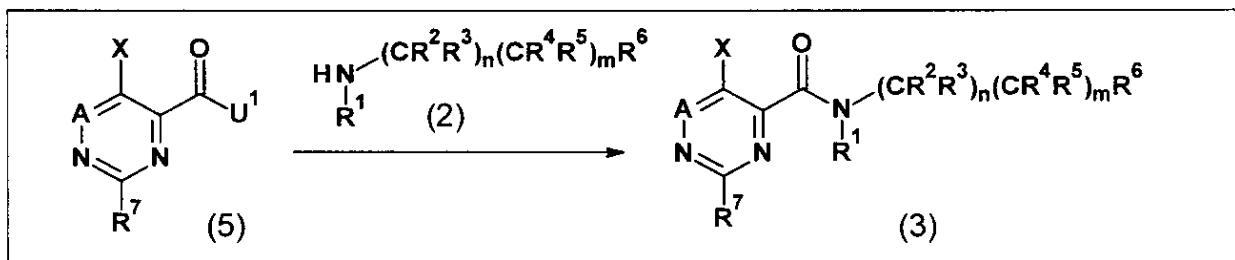
## 【0186】

スキーム5：プロセスE - 式(3)の化合物の合成

## 【0187】

50

## 【化 1 1】



10

## 【 0 1 8 8 】

プロセス E は、プロセス A について記載されるものと同じ条件を使用して行うことができる。

## 【 0 1 8 9 】

式 (5) の化合物は市販されているか、または文献 (ACD Chemical Neuroscience 2017, 8, 2374-2380、国際公開第 2016/74052 号、国際公開第 2018/019555 号、国際公開第 2009/006389 号、Synlett 2015, 26, 1365-1370、国際公開第 2008/116742 号、J. Org. Chem. 1985, 50, 2293-2298、国際公開第 2015/022284 号) に記載されるプロセスに従って調製することができる。

20

## 【 0 1 9 0 】

式 (I) の化合物を調製するための中間体

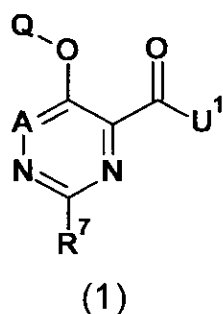
本発明は、式 (I) の化合物を調製するための特定の中間体にも関する。本明細書で定義される式 (1) および式 (3) の中間体の一部は、先行技術から公知である。例えば、中国特許出願公開第 106317027 (A) 号および米国特許出願公開第 5420129 (A) 号を参照。

## 【 0 1 9 1 】

よって、本発明は、式 (1) :

## 【 0 1 9 2 】

## 【化 1 2】



30

40

## 【 0 1 9 3 】

(式中、

Q は、C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>-アリール、C<sub>7</sub>-C<sub>12</sub>-炭素環、6員~14員ヘテロシクリル、または5員~14員ヘテロアリールであって、

C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>-アリール、C<sub>7</sub>-C<sub>12</sub>-炭素環、6員~14員ヘテロシクリル、および5員~14員ヘテロアリールは、ハロゲン、シアノ、イソシアノ、ニトロ、ヒドロキシル、メルカプト、ホルミル、カルボキシル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキルカルボニル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルキルカルボニル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルコキシ-C<sub>1</sub>-C

50

6 - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシカルボニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルコキシカルボニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - アルケニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルケニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - アルキニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - アルケニルオキシ、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルケニルオキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルスルファニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキルスルファニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキルスルフィニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルスルホニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキルスルホニル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルコキシ、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - シクロアルケニル、3員~7員ヘテロシクリル、5員~14員ヘテロアリール、-O-Si(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル)<sub>3</sub>、-Si(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル)<sub>3</sub>、-O-C(=O)R<sup>33</sup>、-NR<sup>34</sup>C(=O)R<sup>35</sup>、-C(=O)N(R<sup>36</sup>)<sub>2</sub>、-C(=S)R<sup>37</sup>、-C(=S)N(R<sup>38</sup>)<sub>2</sub>、-C(=NR<sup>39</sup>)R<sup>40</sup>およびC(=NOR<sup>41</sup>)R<sup>42</sup>、並びに-N(R<sup>43</sup>)<sub>2</sub>からなる群から独立して選択される1~5個のQ<sup>S</sup>置換基で所望により置換され、

10

前記C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルカルボニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキルカルボニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシ-C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシカルボニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルコキシカルボニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - アルケニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルケニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - アルキニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - アルケニルオキシ、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルケニルオキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルスルファニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキルスルファニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキルスルフィニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルスルホニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキルスルホニル、-O-Si(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル)<sub>3</sub>、および-Si(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル)<sub>3</sub>は、シアノ、アミノ、ニトロ、ヒドロキシル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシカルボニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルコキシカルボニル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - ハロシクロアルキル、-Si(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル)<sub>3</sub>、および3員~7員ヘテロシクリルからなる群から独立して選択される1~3個の置換基で順番に所望により置換され、

20

前記C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルコキシ、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - シクロアルケニル、3員~7員ヘテロシクリル、および5員~14員ヘテロアリールは、ハロゲン、シアノ、アミノ、ニトロ、ヒドロキシル、ホルミル、カルボキシル、オキソ、メチリデン、ハロメチリデン、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシカルボニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルコキシカルボニル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - ハロシクロアルキル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - アルケニル、および3員~7員ヘテロシクリルからなる群から独立して選択される1~3個の置換基で順番に所望により置換され、

30

前記C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - ハロシクロアルキル、および非芳香族3員~7員ヘテロシクリルはそれらが結合している炭素原子と一緒にあってC<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキルを形成する2個の置換基でさらに所望により置換され、

R<sup>34</sup>、R<sup>35</sup>、R<sup>36</sup>、R<sup>37</sup>、R<sup>38</sup>、R<sup>39</sup>、R<sup>40</sup>、R<sup>41</sup>、およびR<sup>42</sup>は独立して水素、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキル、またはC<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシであって、

40

前記C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキル、またはC<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシは、シアノ、アミノ、ニトロ、ヒドロキシル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシカルボニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルコキシカルボニル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - ハロシクロアルキル、-Si(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル)<sub>3</sub>、および3員~7員ヘテロシクリルからなる群から独立して選択される1~3個の置換基で順番に所望により置換され、

R<sup>43</sup>は独立して水素、ヒドロキシル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシ、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - アルケニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルケニル、またはC<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキルであって、

前記C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキ

50

シ、 $C_2 - C_6$ -アルケニル、および $C_2 - C_6$ -ハロアルケニルは、シアノ、アミノ、ニトロ、ヒドロキシル、 $C_1 - C_6$ -アルコキシ、 $C_1 - C_6$ -ハロアルコキシ、 $C_1 - C_6$ -アルコキシカルボニル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルコキシカルボニル、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル、 $C_3 - C_8$ -ハロシクロアルキル、 $-Si(C_1 - C_6 - アルキル)_3$ 、および3員~7員ヘテロシクリルからなる群から独立して選択される1~3個の置換基で順番に所望により置換され、

前記 $C_3 - C_8$ -シクロアルキルは、ハロゲン、シアノ、アミノ、ニトロ、ヒドロキシル、ホルミル、カルボキシル、オキソ、メチリデン、ハロメチリデン、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_6$ -アルコキシ、 $C_1 - C_6$ -ハロアルコキシ、 $C_1 - C_6$ -アルコキシカルボニル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルコキシカルボニル、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル、 $C_3 - C_8$ -ハロシクロアルキル、 $C_2 - C_6$ -アルケニル、および3員~7員ヘテロシクリルからなる群から独立して選択される1~3個のR<sup>Q</sup>置換基でさらに所望により置換され、

10

前記 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル、 $C_3 - C_8$ -ハロシクロアルキル、および3員~7員ヘテロシクリルはそれらが結合している炭素原子と一緒になって $C_3 - C_8$ -シクロアルキルを形成する2個の置換基でさらに所望により置換され、

R<sup>7</sup>は、水素、ハロゲン、シアノ、イソシアノ、ヒドロキシル、メルカプト、ニトロ、アミノ、ホルミル、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_6$ -ヒドロキシアルキル、 $C_1 - C_6$ -アルキルカルボニル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキルカルボニル、 $C_1 - C_6$ -アルコキシ、 $C_1 - C_6$ -ハロアルコキシ、 $C_2 - C_6$ -アルケニル、 $C_2 - C_6$ -ハロアルケニル、 $C_2 - C_6$ -アルキニル、 $C_2 - C_6$ -ハロアルキニル、 $C_2 - C_6$ -アルケニルオキシ、 $C_2 - C_6$ -ハロアルケニルオキシ、 $C_2 - C_6$ -アルキニルオキシ、 $C_2 - C_6$ -ハロアルキニルオキシ、 $C_1 - C_6$ -アルキルスルファニル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキルスルファニル、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキルスルファニル、 $C_1 - C_6$ -アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキルスルフィニル、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$ -アルキルスルホニル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキルスルホニル、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキルスルホニル、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル、 $C_3 - C_6$ -シクロアルケニル、 $C_6 - C_{14}$ -アリーール、5員または6員ヘテロアリーール、3員~7員ヘテロシクリル、 $C_3 - C_8$ -シクロアルコキシ、 $C_6 - C_{14}$ -アリーールオキシ、5員または6員ヘテロアリーールオキシ、3員~7員ヘテロシクリルオキシ、 $-O-Si(C_1 - C_6 - アルキル)_3$ 、 $-O-Si(C_1 - C_6 - アルキル)_3$ 、 $-Si(C_1 - C_6 - アルキル)_3$ 、 $-N(R^{20})_2$ 、 $-C(=NR^{21})R^{22}$ 、 $-NR^{23}C(=O)R^{24}$ 、 $-C(=O)(OR^{25})$ 、 $-C(=O)N(R^{26})_2$ 、 $-S(=O)_2N(R^{27})_2$ 、または $-S(=O)(=NR^{28})R^{29}$ であって、

20

$C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_6$ -ヒドロキシアルキル、 $C_1 - C_6$ -アルキルカルボニル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキルカルボニル、 $C_1 - C_6$ -アルコキシ、 $C_1 - C_6$ -ハロアルコキシ、 $C_2 - C_6$ -アルケニル、 $C_2 - C_6$ -ハロアルケニル、 $C_2 - C_6$ -アルキニル、 $C_2 - C_6$ -ハロアルキニル、 $C_2 - C_6$ -アルケニルオキシ、 $C_2 - C_6$ -ハロアルケニルオキシ、 $C_2 - C_6$ -アルキニルオキシ、 $C_2 - C_6$ -ハロアルキニルオキシ、 $C_1 - C_6$ -アルキルスルファニル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキルスルファニル、 $C_1 - C_6$ -アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$ -アルキルスルホニル、および $C_1 - C_6$ -ハロアルキルスルホニルは所望により1~3個のR<sup>7S</sup>置換基で置換され、

40

$C_3 - C_8$ -シクロアルキルスルファニル、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキルスルフィニル、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキルスルホニル、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル、 $C_3 - C_6$ -シクロアルケニル、 $C_6 - C_{14}$ -アリーール、5員または6員ヘテロアリーール、3員~7員ヘテロシクリル、 $C_3 - C_8$ -シクロアルコキシ、 $C_6 - C_{14}$ -アリーールオキシ、5員または6員ヘテロアリーールオキシ、および3員~7員ヘテロシクリルオキシは所望により1~3個のR<sup>7S</sup>置換基で置換され、

R<sup>20</sup>は独立して、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_6$ -

50



アルコキシ、 $C_2 - C_6$  - アルケニル、 $C_2 - C_6$  - ハロアルケニル、 $C_2 - C_6$  - アルキニル、 $C_2 - C_6$  - ハロアルキニル、 $C_3 - C_8$  - シクロアルキル、 $C_3 - C_8$  - ハロシクロアルキル、 $C_6 - C_{14}$  - アリール、5員または6員ヘテロアリール、または3員~7員ヘテロシクリルであって、

$C_1 - C_6$  - アルキル、 $C_1 - C_6$  - ハロアルキル、 $C_1 - C_6$  - アルコキシ、 $C_2 - C_6$  - アルケニル、 $C_2 - C_6$  - ハロアルケニル、 $C_2 - C_6$  - アルキニル、および  $C_2 - C_6$  - ハロアルキニルは所望により1~3個の  $R^{7S^a}$  置換基で置換され、

並びに

$C_3 - C_8$  - シクロアルキル、 $C_3 - C_8$  - ハロシクロアルキル、 $C_6 - C_{14}$  - アリール、5員または6員ヘテロアリール、および3員~7員ヘテロシクリルは所望により1~3個の置換基  $R^{7S^c}$  で置換され、

$R^{21}$  および  $R^{22}$  は独立してヒドロキシル、アミノ、シアノ、 $C_1 - C_6$  - アルキル、 $C_1 - C_6$  - ハロアルキル、 $C_1 - C_6$  - アルコキシ、モノ - ( $C_1 - C_6$  - アルキル) アミノ、またはジ - ( $C_1 - C_6$  - アルキル) アミノであって、

$C_1 - C_6$  - アルキル、 $C_1 - C_6$  - ハロアルキル、 $C_1 - C_6$  - アルコキシ、モノ - ( $C_1 - C_6$  - アルキル) アミノ、またはジ - ( $C_1 - C_6$  - アルキル) アミノは所望により1~3個の  $R^{7S^a}$  置換基で置換され、

$R^{23}$ 、 $R^{24}$ 、 $R^{25}$ 、 $R^{26}$ 、 $R^{27}$ 、 $R^{28}$ 、および  $R^{29}$  は独立して水素、 $C_1 - C_6$  - アルキル、 $C_1 - C_6$  - ハロアルキル、および  $C_3 - C_8$  - シクロアルキルであって、

$C_1 - C_6$  - アルキルおよび  $C_1 - C_6$  - ハロアルキルは所望により1~3個の置換基  $R^{7S^a}$  で置換され、

並びに

$C_3 - C_8$  - シクロアルキルは所望により1~3個の置換基  $R^{7S^c}$  で置換され、  
 $R^{7S^a}$  は独立してシアノ、ヒドロキシル、カルボキシル、 $C_1 - C_6$  - アルコキシ、 $C_1 - C_6$  - ハロアルコキシ、 $C_3 - C_8$  - シクロアルキル、 $C_3 - C_8$  - ハロシクロアルキル、 $C_1 - C_6$  - アルコキシカルボニル、 $-O-Si(C_1 - C_6 - アルキル)_3$ 、 $-Si(C_1 - C_6 - アルキル)_3$ 、 $C_6 - C_{14}$  - アリール、または3員~7員ヘテロシクリルであり、

$R^{7S^c}$  は独立してハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、ホルミル、オキソ、メチリデン、ハロメチリデン、 $C_1 - C_6$  - アルキル、 $C_1 - C_6$  - ハロアルキル、 $C_1 - C_6$  - アルコキシ、 $C_1 - C_6$  - ハロアルコキシ、 $C_2 - C_6$  - アルケニル、 $C_3 - C_8$  - シクロアルキル、 $C_3 - C_8$  - ハロシクロアルキル、 $-O-Si(C_1 - C_6 - アルキル)_3$ 、若しくは3員~7員ヘテロシクリルであるか、

または

同一の炭素原子に結合された  $C_1 - C_6$  - アルキルの2個の置換基  $R^{7S^c}$  は、 $C_3 - C_8$  - シクロアルキルを形成し、

A は上記のように定義され、

$U^1$  は、ヒドロキシル、ハロゲン、または  $C_1 - C_6$  - アルコキシであるが、

式(1)において、Aが  $C - R^8$  および  $R^8 = H$  である場合、

$R^7$  が水素であれば、Qは2,5-ジクロロフェノキシではない)の化合物であって、

並びに  
 エチル2,6-ジクロロ-5-フェノキシピリミジン-4-カルボキシレート(CAS 157415-41-3)ではない、前記式(1)の化合物に関する。

【0194】

よって、本発明はまた、式(1)：

【0195】

10

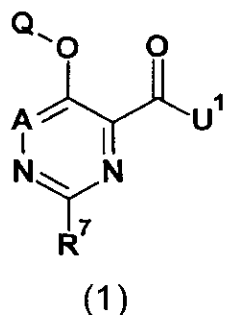
20

30

40

50

## 【化 1 3】



10

## 【0 1 9 6】

(式中、

Qは、C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>-アリール、C<sub>7</sub>-C<sub>12</sub>-炭素環、6員~14員ヘテロシクリル、または5員~14員ヘテロアリールであって、

C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>-アリール、C<sub>7</sub>-C<sub>12</sub>-炭素環、6員~14員ヘテロシクリル、および5員~14員ヘテロアリールは、ハロゲン、シアノ、イソシアノ、ニトロ、ヒドロキシル、メルカプト、ホルミル、カルボキシル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキルカルボニル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルキルカルボニル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルコキシ-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルコキシカルボニル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルコキシカルボニル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-アルケニル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルケニル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-アルキニル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルキニル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-アルケニルオキシ、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルケニルオキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキルスルファニル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルキルスルファニル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキルスルホニル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルキルスルホニル、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-シクロアルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-シクロアルコキシ、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-シクロアルケニル、3員~7員ヘテロシクリル、5員~14員ヘテロアリール、-O-Si(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル)<sub>3</sub>、-Si(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル)<sub>3</sub>、-O-C(=O)R<sup>33</sup>、-NR<sup>34</sup>C(=O)R<sup>35</sup>、-C(=O)N(R<sup>36</sup>)<sub>2</sub>、-C(=S)R<sup>37</sup>、-C(=S)N(R<sup>38</sup>)<sub>2</sub>、-C(=NR<sup>39</sup>)R<sup>40</sup>、および-C(=NOR<sup>41</sup>)R<sup>42</sup>、並びに-N(R<sup>43</sup>)<sub>2</sub>からなる群から独立して選択される1~5個のQS置換基で置換され、

20

30

前記C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキルカルボニル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルキルカルボニル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルコキシ-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルコキシカルボニル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルコキシカルボニル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-アルケニル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルケニル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-アルキニル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルキニル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-アルケニルオキシ、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルケニルオキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキルスルファニル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルキルスルファニル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキルスルホニル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルキルスルホニル、-O-Si(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル)<sub>3</sub>、および-Si(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル)<sub>3</sub>は、シアノ、アミノ、ニトロ、ヒドロキシル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルコキシカルボニル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルコキシカルボニル、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-シクロアルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-ハロシクロアルキル、-Si(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル)<sub>3</sub>、および3員~7員ヘテロシクリルからなる群から独立して選択される1~3個の置換基で順番に所望により置換され、

40

前記C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-シクロアルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-シクロアルコキシ、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-シクロアルケニル、3員~7員ヘテロシクリル、および5員~14員ヘテロアリールは、ハロゲン、シアノ、アミノ、ニトロ、ヒドロキシル、ホルミル、カルボキシル、オキソ、メチリデン、ハロメチリデン、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルキル、C<sub>1</sub>

50

- C<sub>6</sub> - アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシカルボニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルコキシカルボニル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - ハロシクロアルキル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - アルケニル、および3員～7員ヘテロシクリルからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で順番に所望により置換され、

前記C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - ハロシクロアルキル、および非芳香族3員～7員ヘテロシクリルはそれらが結合している炭素原子と一緒にあってC<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキルを形成する2個の置換基でさらに所望により置換され、

R<sup>34</sup>、R<sup>35</sup>、R<sup>36</sup>、R<sup>37</sup>、R<sup>38</sup>、R<sup>39</sup>、R<sup>40</sup>、R<sup>41</sup>、およびR<sup>42</sup>は独立して水素、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキル、またはC<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシであって、

10

前記C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキル、またはC<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシは、シアノ、アミノ、ニトロ、ヒドロキシル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシカルボニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルコキシカルボニル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - ハロシクロアルキル、-Si(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル)<sub>3</sub>、および3員～7員ヘテロシクリルからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で順番に所望により置換され、

R<sup>43</sup>は独立して水素、ヒドロキシル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシ、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - アルケニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルケニル、またはC<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキルであって、

前記C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシ、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - アルケニル、およびC<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルケニルは、シアノ、アミノ、ニトロ、ヒドロキシル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシカルボニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルコキシカルボニル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - ハロシクロアルキル、-Si(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル)<sub>3</sub>、および3員～7員ヘテロシクリルからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で順番に所望により置換され、

20

前記C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキルは、ハロゲン、シアノ、アミノ、ニトロ、ヒドロキシル、ホルミル、カルボキシル、オキソ、メチリデン、ハロメチリデン、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシカルボニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルコキシカルボニル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - ハロシクロアルキル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - アルケニル、および3員～7員ヘテロシクリルからなる群から独立して選択される1～3個のR<sup>Q</sup>置換基でさらに所望により置換され、

30

前記C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - ハロシクロアルキル、および3員～7員ヘテロシクリルはそれらが結合している炭素原子と一緒にあってC<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキルを形成する2個の置換基でさらに所望により置換され、

R<sup>7</sup>は、水素、ハロゲン、シアノ、イソシアノ、ヒドロキシル、メルカプト、ニトロ、アミノ、ホルミル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ヒドロキシアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルカルボニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキルカルボニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルコキシ、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - アルケニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルケニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - アルキニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - アルケニルオキシ、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルケニルオキシ、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - アルキニルオキシ、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキニルオキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルスルファニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキルスルファニル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキルスルファニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキルスルフィニル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキルスルフィニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルスルホニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキルスルホニル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキルスルホニル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - シクロアルケニル、C<sub>6</sub> - C<sub>14</sub> - アリール、5員または6員ヘテロアリール、3員～7員ヘテロシクリル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルコキシ、C<sub>6</sub> - C<sub>14</sub> - アリールオキシ、5員または6員ヘテロアリールオキシ、3員～7員ヘテロシクリルオ

40

50

キシ、 $-O-Si(C_1-C_6-アルキル)_3$ 、 $-O-Si(C_1-C_6-アルキル)_3$ 、 $-Si(C_1-C_6-アルキル)_3$ 、 $-N(R^{20})_2$ 、 $-C(=NR^{21})R^{22}$ 、 $-NR^{23}C(=O)R^{24}$ 、 $-C(=O)(OR^{25})$ 、 $-C(=O)N(R^{26})_2$ 、 $-S(=O)_2N(R^{27})_2$ 、または $-S(=O)(=NR^{28})R^{29}$ であって、

$C_1-C_6-アルキル$ 、 $C_1-C_6-ハロアルキル$ 、 $C_1-C_6-ヒドロキシアルキル$ 、 $C_1-C_6-アルキルカルボニル$ 、 $C_1-C_6-ハロアルキルカルボニル$ 、 $C_1-C_6-アルコキシ$ 、 $C_1-C_6-ハロアルコキシ$ 、 $C_2-C_6-アルケニル$ 、 $C_2-C_6-ハロアルケニル$ 、 $C_2-C_6-アルキニル$ 、 $C_2-C_6-ハロアルキニル$ 、 $C_2-C_6-アルケニルオキシ$ 、 $C_2-C_6-ハロアルケニルオキシ$ 、 $C_2-C_6-アルキニルオキシ$ 、 $C_2-C_6-ハロアルキニルオキシ$ 、 $C_1-C_6-アルキルスルファニル$ 、 $C_1-C_6-ハロアルキルスルファニル$ 、 $C_1-C_6-アルキルスルフィニル$ 、 $C_1-C_6-ハロアルキルスルフィニル$ 、 $C_1-C_6-アルキルスルホニル$ 、および $C_1-C_6-ハロアルキルスルホニル$ は所望により1~3個の $R^{7S^a}$ 置換基で置換され、

$C_3-C_8-シクロアルキルスルファニル$ 、 $C_3-C_8-シクロアルキルスルフィニル$ 、 $C_3-C_8-シクロアルキルスルホニル$ 、 $C_3-C_8-シクロアルキル$ 、 $C_3-C_6-シクロアルケニル$ 、 $C_6-C_{14}-アリール$ 、5員または6員ヘテロアリール、3員~7員ヘテロシクリル、 $C_3-C_8-シクロアルコキシ$ 、 $C_6-C_{14}-アリールオキシ$ 、5員または6員ヘテロアリールオキシ、および3員~7員ヘテロシクリルオキシは所望により1~3個の $R^{7S^c}$ 置換基で置換され、

$R^{20}$ は、 $C_1-C_6-アルキル$ 、 $C_1-C_6-ハロアルキル$ 、 $C_1-C_6-アルコキシ$ 、 $C_2-C_6-アルケニル$ 、 $C_2-C_6-ハロアルケニル$ 、 $C_2-C_6-アルキニル$ 、 $C_2-C_6-ハロアルキニル$ 、 $C_3-C_8-シクロアルキル$ 、 $C_3-C_8-ハロシクロアルキル$ 、 $C_6-C_{14}-アリール$ 、5員または6員ヘテロアリール、または3員~7員ヘテロシクリルであって、

$C_1-C_6-アルキル$ 、 $C_1-C_6-ハロアルキル$ 、 $C_1-C_6-アルコキシ$ 、 $C_2-C_6-アルケニル$ 、 $C_2-C_6-ハロアルケニル$ 、 $C_2-C_6-アルキニル$ 、および $C_2-C_6-ハロアルキニル$ は所望により1~3個の $R^{7S^a}$ 置換基で置換され、

並びに

$C_3-C_8-シクロアルキル$ 、 $C_3-C_8-ハロシクロアルキル$ 、 $C_6-C_{14}-アリール$ 、5員または6員ヘテロアリール、および3員~7員ヘテロシクリルは所望により1~3個の置換基 $R^{7S^c}$ で置換され、

$R^{21}$ および $R^{22}$ は独立してヒドロキシル、アミノ、シアノ、 $C_1-C_6-アルキル$ 、 $C_1-C_6-ハロアルキル$ 、 $C_1-C_6-アルコキシ$ 、モノ- $(C_1-C_6-アルキル)$ アミノ、またはジ- $(C_1-C_6-アルキル)$ アミノであって、

$C_1-C_6-アルキル$ 、 $C_1-C_6-ハロアルキル$ 、 $C_1-C_6-アルコキシ$ 、モノ- $(C_1-C_6-アルキル)$ アミノ、またはジ- $(C_1-C_6-アルキル)$ アミノは所望により1~3個の $R^{7S^a}$ 置換基で置換され、

$R^{23}$ 、 $R^{24}$ 、 $R^{25}$ 、 $R^{26}$ 、 $R^{27}$ 、 $R^{28}$ 、および $R^{29}$ は独立して水素、 $C_1-C_6-アルキル$ 、 $C_1-C_6-ハロアルキル$ 、および $C_3-C_8-シクロアルキル$ であって、

$C_1-C_6-アルキル$ および $C_1-C_6-ハロアルキル$ は所望により1~3個の置換基 $R^{7S^a}$ で置換され、

並びに

$C_3-C_8-シクロアルキル$ は所望により1~3個の置換基 $R^{7S^c}$ で置換され、 $R^{7S^a}$ は独立してシアノ、ヒドロキシル、カルボキシル、 $C_1-C_6-アルコキシ$ 、 $C_1-C_6-ハロアルコキシ$ 、 $C_3-C_8-シクロアルキル$ 、 $C_3-C_8-ハロシクロアルキル$ 、 $C_1-C_6-アルコキシカルボニル$ 、 $-O-Si(C_1-C_6-アルキル)_3$ 、 $-Si(C_1-C_6-アルキル)_3$ 、 $C_6-C_{14}-アリール$ 、または3員~7員ヘテロシクリルであり、

$R^{7S^c}$ は独立してハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、ホルミル、オキソ、

10

20

30

40

50

メチリデン、ハロメチリデン、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_6$ -アルコキシ、 $C_1 - C_6$ -ハロアルコキシ、 $C_2 - C_6$ -アルケニル、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル、 $C_3 - C_8$ -ハロシクロアルキル、 $-O-Si(C_1 - C_6-アルキル)_3$ 、若しくは3員～7員ヘテロシクリルであるか、

または

同一の炭素原子に結合された $C_1 - C_6$ -アルキルの2個の置換基 $R^7$ は、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキルを形成し、

Aは上記のように定義され、

$U^1$ は、ヒドロキシル、ハロゲン、または $C_1 - C_6$ -アルコキシであるが、

式(1)において、Aが $C - R^8$ および $R^8 = H$ である場合、

$R^7$ が水素であれば、Qは2,5-ジクロロフェノキシではない)の化合物であって、並びに

エチル2,6-ジクロロ-5-フェノキシピリミジン-4-カルボキシレート(CAS 157415-41-3)ではない、前記式(1)の化合物に関する。

【0197】

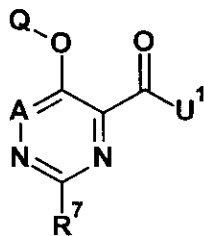
有利な式(1)の化合物において、 $R^7$ は水素ではない。

【0198】

本発明は、好ましくは、式(1)：

【0199】

【化14】



(1)

【0200】

(式中、

Aは、窒素(N)または $C - R^8$ であって、

$R^8$ は、水素であり、

Qは、フェニル、2,3-ジヒドロベンゾフラニル、インドリニル、1,3-ベンゾジオキサソリル、クロマニル、2,3-ジヒドロ-1,4-ベンゾジオキシニル、5,6,7,8-テトラヒドロキノリニル、2,3-ジヒドロベンゾフラニル、チエニル、ピリジニルまたはインドリルであって、

フェニル、2,3-ジヒドロベンゾフラニル、インドリニル、1,3-ベンゾジオキサソリル、クロマニル、2,3-ジヒドロ-1,4-ベンゾジオキシニル、5,6,7,8-テトラヒドロキノリニル、2,3-ジヒドロベンゾフラニル、チエニル、ピリジニルおよびインドリルは、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ホルミル、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ -アルキルカルボニル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、 $C_1 - C_4$ -ハロアルコキシ、 $C_2 - C_4$ -アルケニル、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキル、オキセタニル、および $-N(R^{4,3})_2$ からなる群から独立して選択される1～3個の $Q^5$ 置換基で置換され、

前記 $C_3 - C_6$ -シクロアルキルおよびオキセタニルは、ハロゲンおよび $C_1 - C_4$ -アルキルからなる群から独立して選択される1または2個の置換基で順番に所望により置換され、

$R^{4,3}$ は独立して水素および $C_1 - C_4$ -アルキルであり、

10

20

30

40

50

$R^7$  は、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ -ヒドロキシアルキル、 $C_1 - C_4$ -アルキルカルボニル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、 $C_2 - C_4$ -アルケニル、 $C_2 - C_4$ -アルキニル、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキル、ピリジニル、イミダゾリル、ピラゾリル、オキセタニル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロピラニル、ピロリジニル、ピペリジニル、 $-N(R^{20})_2$ 、 $-C(=NR^{21})R^{22}$ 、または $C(=O)(OR^{25})$ であって、

$C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ -ヒドロキシアルキル、 $C_1 - C_4$ -アルキルカルボニル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、 $C_2 - C_4$ -アルケニル、および $C_2 - C_4$ -アルキニルは所望により1または2個の $R^{7S^a}$ 置換基で置換され、

10

$C_3 - C_6$ -シクロアルキル、ピリジニル、イミダゾリル、ピラゾリル、オキセタニル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロピラニル、ピロリジニル、およびピペリジニルは所望により1または2個の $R^{7S^c}$ 置換基で置換され、

$R^{20}$  は、水素、 $C_1 - C_4$ -アルキル、または $C_3 - C_6$ -シクロアルキルであり、

$R^{21}$  は、 $C_1 - C_4$ -アルキルまたは $C_1 - C_4$ -アルコキシであり、

$R^{22}$  は、 $C_1 - C_4$ -アルキルであり、

$R^{25}$  は、水素または $C_1 - C_4$ -アルキルであり、

並びに

$R^{7S^a}$  は独立して $C_1 - C_4$ -アルコキシまたはフェニルであり、

$R^{7S^c}$  は独立してハロゲンまたは $C_1 - C_4$ -アルキルであり、

20

$U^1$  は、ヒドロキシル、ハロゲン、または $C_1 - C_6$ -アルコキシである)の化合物であって、

好ましくは、式(1)において、Aが $C - R^8$ および $R^8 = H$ である場合、

$U^1$  がヒドロキシルであれば、 $R^7$  はイソプロピルではない、前記式(1)の化合物に関する。

#### 【0201】

より好ましい式(1)の化合物は、

$R^7$  は、メチル、エチル、メトキシ、メチルスルファニル、またはシクロプロピルであり、

および/または

30

Qは、1~3個の置換基 $Q^S$ で置換されたフェニルであり、前記置換基は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ホルミル、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキル、および $C_1 - C_4$ -ハロアルキルからなる群から独立して選択され、好ましくは、前記 $Q^S$ 置換基の少なくとも1つが、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキルである上記で定義される化合物である。

#### 【0202】

特に好ましい式(1)の化合物は、

$R^7$  は、メチル、メトキシ、メチルスルファニル、またはシクロプロピルであり、

および/または

Qは、フェニル環の3位に1個の $Q^S$ 置換基で置換されたフェニルであり、好ましくは、3-シクロプロピル、3-クロロメチル、または3-トリフルオロメチルである化合物である。

40

#### 【0203】

特に好ましい実施形態では、Qは3-(トリフルオロメチル)フェニルである。

#### 【0204】

特に好ましい式(1)の化合物は、以下の表3の化合物に対応する。

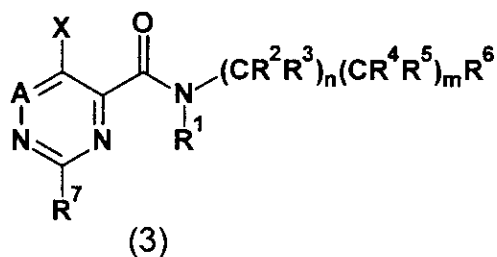
#### 【0205】

本発明はまた、式(3)：

#### 【0206】

50

## 【化 15】



10

## 【0207】

(式中、

Aは、窒素(N)またはC-R<sup>8</sup>であって、R<sup>8</sup>は、水素またはハロゲンであり、

nは、1、

mは、1、

R<sup>1</sup>は、水素であり、R<sup>2</sup>およびR<sup>3</sup>は、水素であり、R<sup>4</sup>およびR<sup>5</sup>は独立して水素またはフッ素であるが、R<sup>4</sup>およびR<sup>5</sup>の少なくとも1つが水素ではなく、

20

R<sup>6</sup>は、C<sub>7</sub>-C<sub>12</sub>-炭素環、C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>-アリール、5員~14員ヘテロアリール、および6員~14員ヘテロシクリルであって、C<sub>7</sub>-C<sub>12</sub>-炭素環、C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>-アリール、6員~14員ヘテロシクリル、および5員~14員ヘテロアリールは1~4個のR<sup>6S</sup>置換基で所望により置換され、

R<sup>6S</sup>は、ハロゲン、シアノ、イソシアノ、ニトロ、ヒドロキシル、メルカプト、ペンタフルオロスルファニル、オキソ、メチリデン、ハロメチリデン、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルコキシ、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-アルケニル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルケニル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-アルキニル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルキニル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-アルケニルオキシ、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルケニルオキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキルスルファニル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルキルスルファニル、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-シクロアルキルスルファニル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルキルスルフィニル、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-シクロアルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキルスルホニル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルキルスルホニル、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-シクロアルキルスルホニル、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-シクロアルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-シクロアルコキシ、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-シクロアルケニル、C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>-アリール、5員または6員ヘテロアリール、3員~7員ヘテロシクリル、-N(R<sup>15</sup>)<sub>2</sub>、-C(=O)R<sup>16</sup>、-C(=O)(OR<sup>17</sup>)、-C(=O)N(R<sup>18</sup>)<sub>2</sub>、-S(=O)<sub>2</sub>N(R<sup>19</sup>)<sub>2</sub>、-O-Si(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル)<sub>3</sub>、または-Si(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル)<sub>3</sub>であり、

30

前記C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルコキシ、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-アルケニル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルケニル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-アルキニル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルキニル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-アルケニルオキシ、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルケニルオキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキルスルファニル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルキルスルファニル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキルスルホニル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルキルスルホニル、-O-Si(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル)<sub>3</sub>、および-Si(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル)<sub>3</sub>は、シアノ、ヒドロキシル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルコキシ、-O-Si(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル)<sub>3</sub>、-Si(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル)<sub>3</sub>、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-シクロアルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-ハロシクロアルキル、および3員~7員ヘテロシクリルからなる群から独立して選択される1~3個の置換基でさらに所望により置換され、

40

50

並びに

前記 C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキルスルファニル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキルスルフィニル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキルスルホニル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルコキシ、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルケニル、C<sub>6</sub> - C<sub>14</sub> - アリール、5員または6員ヘテロアリール、および3員~7員ヘテロシクリルは、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、ホルミル、カルボキシル、オキソ、メチリデン、ハロメチリデン、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシカルボニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルコキシカルボニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - アルケニル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキル、およびC<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - ハロシクロアルキルからなる群から独立して選択される1~4個の置換基でさらに所望により置換されるか、または

同一の炭素原子に結合された2個のC<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル置換基は、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキルを形成し、

または

2個のR<sup>6S</sup>置換基は所望によりそれらが結合している炭素原子と一緒になってC<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキルを形成し、

R<sup>15</sup>は、水素、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、またはC<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキルであつて、

前記C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルは、シアノ、ヒドロキシル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルコキシ、-O-Si(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル)<sub>3</sub>、-Si(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル)<sub>3</sub>、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - ハロシクロアルキル、および3員~7員ヘテロシクリルからなる群から独立して選択される1~3個の置換基でさらに所望により置換され、

並びに

前記C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキルは、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、ホルミル、カルボキシル、オキソ、メチリデン、ハロメチリデン、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシカルボニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルコキシカルボニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - アルケニル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキル、およびC<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - ハロシクロアルキルからなる群から独立して選択される1~4個の置換基で所望によりさらに置換され、

R<sup>16</sup>、R<sup>17</sup>、R<sup>18</sup>、およびR<sup>19</sup>は独立して水素、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、またはC<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキルであつて、

前記C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルまたはC<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキル置換基は、シアノ、ヒドロキシル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルコキシ、-O-Si(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル)<sub>3</sub>、-Si(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル)<sub>3</sub>、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - ハロシクロアルキル、および非芳香族3員~7員ヘテロシクリルからなる群から独立して選択される1~3個の置換基でさらに所望により置換され、

R<sup>7</sup>は、水素、ハロゲン、シアノ、イソシアノ、ヒドロキシル、メルカプト、ニトロ、アミノ、ホルミル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ヒドロキシアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルカルボニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキルカルボニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルコキシ、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - アルケニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルケニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - アルキニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - アルケニルオキシ、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルケニルオキシ、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - アルキニルオキシ、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキニルオキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルスルファニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキルスルファニル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキルスルファニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキルスルフィニル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキルスルフィニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルスルホニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキルスルホニル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルケニル、C<sub>6</sub> - C<sub>14</sub> - アリール、5員または6員ヘテロアリール、3員~7員ヘテロシクリル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルコキシ、C<sub>6</sub> - C<sub>14</sub>



- アリールオキシ、5員または6員ヘテロアリールオキシ、3員~7員ヘテロシクリルオキシ、 $-O-Si(C_1-C_6-アルキル)_3$ 、 $-Si(C_1-C_6-アルキル)_3$ 、 $-N(R^{20})_2$ 、 $-C(=NR^{21})R^{22}$ 、 $-NR^{23}C(=O)R^{24}$ 、 $-C(=O)(OR^{25})$ 、 $-C(=O)N(R^{26})_2$ 、 $-S(=O)_2N(R^{27})_2$ 、または $-S(=O)(=NR^{28})R^{29}$ であって、

$C_1-C_6$ -アルキル、 $C_1-C_6$ -ハロアルキル、 $C_1-C_6$ -ヒドロキシアルキル、 $C_1-C_6$ -アルキルカルボニル、 $C_1-C_6$ -ハロアルキルカルボニル、 $C_1-C_6$ -アルコキシ、 $C_1-C_6$ -ハロアルコキシ、 $C_2-C_6$ -アルケニル、 $C_2-C_6$ -ハロアルケニル、 $C_2-C_6$ -アルキニル、 $C_2-C_6$ -ハロアルキニル、 $C_2-C_6$ -アルケニルオキシ、 $C_2-C_6$ -ハロアルケニルオキシ、 $C_2-C_6$ -アルキニルオキシ、 $C_2-C_6$ -ハロアルキニルオキシ、 $C_1-C_6$ -アルキルスルファニル、 $C_1-C_6$ -ハロアルキルスルファニル、 $C_1-C_6$ -アルキルスルフィニル、 $C_1-C_6$ -ハロアルキルスルフィニル、 $C_1-C_6$ -アルキルスルホニル、および $C_1-C_6$ -ハロアルキルスルホニルは所望により1~3個の $R^{7S^a}$ 置換基で置換され、

$C_3-C_8$ -シクロアルキルスルファニル、 $C_3-C_8$ -シクロアルキルスルフィニル、 $C_3-C_8$ -シクロアルキルスルホニル、 $C_3-C_8$ -シクロアルキル、 $C_3-C_6$ -シクロアルケニル、 $C_6-C_{14}$ -アリール、5員または6員ヘテロアリール、3員~7員ヘテロシクリル、 $C_3-C_8$ -シクロアルコキシ、 $C_6-C_{14}$ -アリールオキシ、5員または6員ヘテロアリールオキシ、および3員~7員ヘテロシクリルオキシは所望により1~3個の $R^{7S^c}$ 置換基で置換され、

$R^{20}$ は、 $C_1-C_6$ -アルキル、 $C_1-C_6$ -ハロアルキル、 $C_1-C_6$ -アルコキシ、 $C_2-C_6$ -アルケニル、 $C_2-C_6$ -ハロアルケニル、 $C_2-C_6$ -アルキニル、 $C_2-C_6$ -ハロアルキニル、 $C_3-C_8$ -シクロアルキル、 $C_3-C_8$ -ハロシクロアルキル、 $C_6-C_{14}$ -アリール、5員または6員ヘテロアリール、または3員~7員ヘテロシクリルであって、

$C_1-C_6$ -アルキル、 $C_1-C_6$ -ハロアルキル、 $C_1-C_6$ -アルコキシ、 $C_2-C_6$ -アルケニル、 $C_2-C_6$ -ハロアルケニル、 $C_2-C_6$ -アルキニル、および $C_2-C_6$ -ハロアルキニルは所望により1~3個の $R^{7S^a}$ 置換基で置換され、

並びに

$C_3-C_8$ -シクロアルキル、 $C_3-C_8$ -ハロシクロアルキル、 $C_6-C_{14}$ -アリール、5員または6員ヘテロアリール、および3員~7員ヘテロシクリルは所望により1~3個の置換基 $R^{7S^c}$ で置換され、

$R^{21}$ および $R^{22}$ は独立してヒドロキシル、アミノ、シアノ、 $C_1-C_6$ -アルキル、 $C_1-C_6$ -ハロアルキル、 $C_1-C_6$ -アルコキシ、モノ-( $C_1-C_6$ -アルキル)アミノ、またはジ-( $C_1-C_6$ -アルキル)アミノであって、

$C_1-C_6$ -アルキル、 $C_1-C_6$ -ハロアルキル、 $C_1-C_6$ -アルコキシ、モノ-( $C_1-C_6$ -アルキル)アミノ、またはジ-( $C_1-C_6$ -アルキル)アミノは所望により1~3個の $R^{7S^a}$ 置換基で置換され、

$R^{23}$ 、 $R^{24}$ 、 $R^{25}$ 、 $R^{26}$ 、 $R^{27}$ 、 $R^{28}$ 、および $R^{29}$ は独立して水素、 $C_1-C_6$ -アルキル、 $C_1-C_6$ -ハロアルキル、および $C_3-C_8$ -シクロアルキルであって、

$C_1-C_6$ -アルキルおよび $C_1-C_6$ -ハロアルキルは所望により1~3個の置換基 $R^{7S^a}$ で置換され、

並びに

$C_3-C_8$ -シクロアルキルは所望により1~3個の置換基 $R^{7S^c}$ で置換され、 $R^{7S^a}$ は独立してシアノ、ヒドロキシル、カルボキシル、 $C_1-C_6$ -アルコキシ、 $C_1-C_6$ -ハロアルコキシ、 $C_3-C_8$ -シクロアルキル、 $C_3-C_8$ -ハロシクロアルキル、 $C_1-C_6$ -アルコキシカルボニル、 $-O-Si(C_1-C_6-アルキル)_3$ 、 $-Si(C_1-C_6-アルキル)_3$ 、 $C_6-C_{14}$ -アリール、または3員~7員ヘテロシクリルであり、

10

20

30

40

50

$R^{7S}$ は独立してハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、ホルミル、オキソ、メチリデン、ハロメチリデン、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_6$ -アルコキシ、 $C_1 - C_6$ -ハロアルコキシ、 $C_2 - C_6$ -アルケニル、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル、 $C_3 - C_8$ -ハロシクロアルキル、 $-O-Si(C_1 - C_6-アルキル)_3$ 、若しくは3員~7員ヘテロシクリルであるか、

または

同一の炭素原子に結合された $C_1 - C_6$ -アルキルの2個の置換基 $R^{7S}$ は、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキルを形成し、

Xは、ハロゲンである)の化合物であって、

好ましくは、

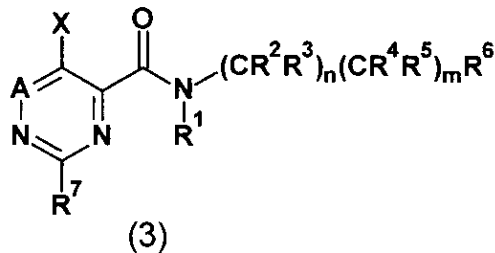
5-クロロ-N-[2,2-ジフルオロ-2-(3-フルオロフェニル)エチル]-2-エチルピリミジン-4-カルボキサミド(CAS 2404152-87-8)ではない、前記式(3)の化合物に関する。

【0208】

本発明は、好ましくは、式(3)：

【0209】

【化16】



【0210】

(式中、

Aは、窒素(N)または $C - R^8$ であり、

$R^8$ は、水素またはハロゲンであり、

nは、1、

mは、1、

$R^1$ は、水素であり、

$R^2$ および $R^3$ は、水素であり、

$R^4$ および $R^5$ は独立して水素またはフッ素であるが、

$R^4$ および $R^5$ の少なくとも1つが水素ではなく、

$R^6$ は、フェニル、2,3-ジヒドロベンゾフラニル、1,3-ベンゾジオキサリル、2,3-ジヒドロ-1,4-ベンゾジオキシニル、フラニル、ピラゾリル、チエニル、ピリジニル、インドリル、フェニルオキシ、またはベンジルオキシであって

フェニル、2,3-ジヒドロベンゾフラニル、1,3-ベンゾジオキサリル、2,3-ジヒドロ-1,4-ベンゾジオキシニル、フラニル、ピラゾリル、チエニル、ピリジニル、インドリル、フェニルオキシ、またはベンジルオキシは、1~3個の $R^{6S}$ 置換基で所望により置換され、

$R^{6S}$ はハロゲン、シアノ、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、 $C_1 - C_4$ -ハロアルコキシ、 $C_2 - C_6$ -アルケニル、 $C_2 - C_6$ -アルキニル、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキル、フェニル、ピラゾリル、イミダゾリル、ピリジニル、 $-C(=O)R^{16}$ 、または $-C(=O)(OR^{17})$ であって、

前記 $C_3 - C_6$ -シクロアルキル、フェニル、ピラゾリル、イミダゾリル、およ

びピリジニルは、フルオロ、プロモ、クロロ、 $C_1 - C_4$ -アルキル、および $C_1 - C_4$ -ハロアルキルからなる群から独立して選択される1または2個の置換基で所望によりさらに置換され、

並びに

$R^{16}$ は、 $C_1 - C_4$ -アルキルであり、

$R^{17}$ は、水素または $C_1 - C_4$ -アルキルであり、

$R^7$ は、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ -ヒドロキシアルキル、 $C_1 - C_4$ -アルキルカルボニル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、 $C_1 - C_4$ -アルキルスルファニル、 $C_2 - C_4$ -アルケニル、 $C_2 - C_4$ -アルキニル、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキル、ピリジニル、イミダゾリル、ピラゾリル、オキセタニル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロピラニル、ピロリジニル、ピペリジニル、 $-N(R^{20})_2$ 、 $-C(=NR^{21})R^{22}$ 、または $C(=O)(OR^{25})$ であって、

10

$C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ -ヒドロキシアルキル、 $C_1 - C_4$ -アルキルカルボニル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、 $C_1 - C_4$ -アルキルスルファニル、 $C_2 - C_4$ -アルケニル、および $C_2 - C_4$ -アルキニルは所望により1または2個の $R^{7S^a}$ 置換基で置換され、

$C_3 - C_6$ -シクロアルキル、ピリジニル、イミダゾリル、ピラゾリル、オキセタニル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロピラニル、ピロリジニル、およびピペリジニルは所望により1または2個の $R^{7S^c}$ 置換基で置換され、

$R^{20}$ は、水素、 $C_1 - C_4$ -アルキル、または $C_3 - C_6$ -シクロアルキルであり、

20

$R^{21}$ は、 $C_1 - C_4$ -アルキルまたは $C_1 - C_4$ -アルコキシであり、

$R^{22}$ は、 $C_1 - C_4$ -アルキルであり、

$R^{25}$ は、水素または $C_1 - C_4$ -アルキルであり、

並びに

$R^{7S^a}$ は独立して $C_1 - C_4$ -アルコキシまたはフェニルであり、

$R^{7S^c}$ は独立してハロゲンまたは $C_1 - C_4$ -アルキルであり、

Xは、ハロゲンである)の化合物であって、

好ましくは、

5-クロロ-N-[2,2-ジフルオロ-2-(3-フルオロフェニル)エチル]-2-エチルピリミジン-4-カルボキサミド(CAS 2404152-87-8)ではない、前記式(3)の化合物に関する。

30

【0211】

より好ましい式(3)の化合物は、

Aは、窒素(N)または $C - R^8$ であり、

$R^8$ は、水素であり、

nは、1、

mは、1、

$R^1$ は、水素であり、

$R^2$ および $R^3$ は、水素であり、

$R^4$ は、水素またはフッ素であり、

40

$R^5$ は、水素またはフッ素であり、

$R^7$ は、メチル、メトキシ、メチルスルファニル、またはシクロプロピルであり、

Xは、ハロゲン、好ましくは、ClまたはBrであり、

並びに、式(3)の $R^6$ は、上記の式(I)の文脈において、より好ましい、さらにより好ましい、または特に好ましい $R^6$ として言及されたものに対応する化合物であって、好ましくは、

5-クロロ-N-[2,2-ジフルオロ-2-(3-フルオロフェニル)エチル]-2-エチルピリミジン-4-カルボキサミド(CAS 2404152-87-8)ではない、式(3)の化合物である。

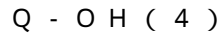
【0212】

50

特に好ましい式(3)の化合物は、表5の化合物に対応する。

【0213】

本発明はまた、式(4)：



(式中、

Qは、式(I)の化合物(を得るプロセス)の文脈において、すなわち、すなわち、Qの広い定義、好ましい定義、より好ましい定義、さらにより好ましいQの定義の文脈において、上記で定義された基であるが、

式(4)の化合物は、

【0214】

【表1】

3-シクロプロピル-2-フルオ ローフェノール	2290421-25-7	
2-フルオロ-3-(1-フルオロ シクロプロピル)フェノール	2385918-06-7	
3-(2, 2-ジフルオロシクロ プロピル)-2-フルオロフェ ノール	2435608-24-3	20
2-フルオロ-3-ビニルフェ ノール	2290411-18-4	
2-フルオロ-3-[(E)-プロ ポ-1-エニル]フェノール	2435608-23-2	
2-フルオロ-3-イソプロペ ニル フェノール	1375066-38-8	
3-エチル-2-フルオロフェ ノール	1243456-02-1	30
2-フルオロ-3-プロピルフェ ノール	2284409-52-3	
3-ブチル-2-フルオロフェ ノール	2284271-78-7	

ではない。

【0215】

組成物および製剤

本発明はさらに、組成物、特に望ましくない微生物を防除するための組成物に関する。前記組成物は、微生物および/またはそれらの生息地に施用することができる。

【0216】

この組成物は、少なくとも1つの式(I)の化合物と、少なくとも1つの農業に適した助剤、例えば、担体および/または界面活性剤を含む。

【0217】

担体は、概して不活性な、固体または液体、天然または合成、有機または無機物質である。担体は概して、例えば植物、植物の部分、または種子への化合物の施用を改善する。

10

20

30

40

50

適切な固体担体の例には、アンモニウム塩、特に、硫酸アンモニウム、リン酸アンモニウム、および硝酸アンモニウム、カオリン、粘土、タルク、チョーク、石英、アタパルジャイト、モンモリロナイト、および珪藻土などの天然岩粉、微粉シリカ、アルミナ、ケイ酸塩などのシリカゲルおよび合成岩粉が含まれるが、これらに限定されない。顆粒を調製するための典型的に有用な固体担体の例には、方解石、大理石、軽石、セピオライト、ドロマイトなどの粉碎および分別された天然岩、無機および有機小麦粉の合成顆粒、並びに紙、おがくず、ココナッツの殻、トウモロコシの穂軸、およびタバコの茎などの有機材料の顆粒が含まれるが、これらに限定されない。適切な液体担体の例には、水、有機溶媒、およびそれらの組み合わせが含まれるが、これらに限定されない。適切な溶媒の例には、例えば、芳香族および非芳香族炭化水素のクラスからの極性および非極性の有機化学液体（シクロヘキサン、パラフィン、アルキルベンゼン、キシレン、トルエン、テトラヒドロナフタレン、アルキルナフタレン、塩素化芳香族またはクロロベンゼンなどの塩素化脂肪族炭化水素、クロロエチレン、または塩化メチレンなど）、アルコールおよびポリオール（エタノール、プロパノール、ブタノール、ベンジルアルコール、シクロヘキサノール、またはグリコールなど、置換、エーテル化、および/またはエステル化されていてもよい）、ケトン（アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン、またはシクロヘキサノンなど）、エステル（油脂を含む）および（ポリ）エーテル、非置換および置換アミン、アミド（ジメチルホルムアミドまたは脂肪酸アミドなど）、およびそれらのエステル、ラクタム（N-アルキルピロリドン、特にN-メチルピロリドンなど）およびラクトン、スルホンおよびスルホキシド（ジメチルスルホキシドなど）、植物または動物由来の油が含まれる。担体はまた、液化ガス増量剤、すなわち、標準温度および標準圧力下で気体の液体、例えば、ハロゲン化炭化水素、ブタン、プロパン、窒素、二酸化炭素などのエアゾール噴射剤であってもよい、

【0218】

好ましい固体担体は、クレー、タルク、およびシリカから選択される。

【0219】

好ましい液体担体は、水、脂肪酸アミド、およびそのエステル、芳香族および非芳香族炭化水素、ラクタム、並びに炭酸エステルから選択される。

【0220】

担体の量は、典型的には、組成物の1~99.99重量%、好ましくは5~99.9重量%、より好ましくは10~99.5重量%、最も好ましくは20~99重量%の範囲内である。

【0221】

液体担体は、典型的には組成物の20~90重量%、例えば30~80重量%の範囲内で存在する。

【0222】

固体担体は、典型的には組成物の0~50重量%、好ましくは5~45重量%、例えば10~30重量%の範囲内で存在する。

【0223】

組成物が2つ以上の担体を含む場合、概説された範囲は担体の総量を指す。

【0224】

界面活性剤は、イオン性（カチオン性またはアニオン性）、両性または非イオン性界面活性剤、例えば、イオン性または非イオン性乳化剤、起泡剤、分散剤、湿潤剤、浸透促進剤、およびそれらの任意の混合物であり得る。適切な界面活性剤の例には、ポリアクリル酸の塩、リグノスルホン酸の塩（リグノスルホン酸ナトリウムなど）、フェノールスルホン酸またはナフタレンスルホン酸の塩、エチレンオキシドおよび/またはプロピレンオキシドと脂肪アルコールとの重縮合物、脂肪酸または脂肪アミン（例えば、ヒマシ油エトキシレートなどのポリオキシエチレン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレン脂肪アルコールエーテル、例えばアルキルアリアルポリグリコールエーテル）、置換フェノール（好ましくはアルキルフェノールまたはアリアルフェノール）およびそのエトキシレート（トリス

チリルフェノールエトキシレートなど)、スルホコハク酸エステル塩、タウリン誘導体(好ましくはアルキルタウレート)、ポリエトキシ化アルコールまたはフェノールのリン酸エステル、ポリオールの脂肪エステル(グリセロール、ソルビトール、またはスクロースの脂肪酸エステルなど)、硫酸塩(アルキル硫酸塩およびアルキルエーテル硫酸塩など)、スルホン酸塩(例えば、アルキルスルホン酸塩、アリールスルホン酸塩、およびアルキルベンゼンスルホン酸塩)、リン酸エステル、タンパク質加水分解物、リグノサルファイト廃液、並びにメチルセルロースが含まれるが、これらに限定されない。本段落における塩への言及は、好ましくは、それぞれのアルカリ塩、アルカリ土類塩、およびアンモニウム塩を指す

【0225】

10

好ましい界面活性剤は、ポリオキシエチレン脂肪アルコールエーテル、ポリオキシエチレン脂肪酸エステル、ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウムなどのアルキルベンゼンスルホン酸塩、ヒマシ油エトキシレート、リグノスルホン酸ナトリウム、およびトリスチリルフェノールエトキシレートなどのアリールフェノールエトキシレートから選択される。

【0226】

界面活性剤の量は、典型的には組成物の5~40重量%、例えば10~20重量%の範囲内である。

【0227】

適切な助剤のさらなる例には、撥水剤、乾燥剤、バインダー(接着剤、粘着付与剤、カルボキシメチルセルロースなどの固定剤、アラビアゴム、ポリビニルアルコール、およびポリ酢酸ビニルなどの粉末、顆粒、またはラテックスの形態の天然ポリマーおよび合成ポリマー、セファリンおよびレシチンなどの天然リン脂質および合成リン脂質、ポリビニルピロリドン、並びにチロース)、増粘剤および二次増粘剤(セルロースエーテル、アクリル酸誘導体、キサンタンガム、変性粘土、例えば、BENTONE(登録商標)の名称で入手可能な製品、および微粉シリカなど)、安定剤(例えば、低温安定剤、防腐剤(例えば、ジクロロフェンおよびベンジルアルコールヘミホルマール)、酸化防止剤、光安定剤、特にUV安定剤、または化学的および/若しくは物理的安定性を改善するその他の薬剤)、染料または顔料(例えば、酸化鉄、酸化チタン、プルシアンブルーなどの無機顔料、例えば、アリザリン、アゾ、金属フタロシアニン染料などの有機染料など)、消泡剤(例えば、シリコン消泡剤およびステアリン酸マグネシウム)、不凍剤、ステッカー、ジベレリン、加工助剤、鉱物油、植物油、香料、ワックス、栄養素(鉄、マンガン、ホウ素、銅、コバルト、モリブデン、および亜鉛の塩などの微量栄養素を含む)、保護コロイド、チキソトロピック物質、浸透剤、金属イオン封鎖剤、並びに複合形成剤が含まれる。

20

30

【0228】

助剤の選択は、式(I)の化合物の意図する施用様式および/または化合物の物理的性質によって決まる。さらに、助剤は、特定の特性(技術的、物理的、および/または生物学的特性)を組成物またはそれから調製される使用形態に付与するために選択され得る。助剤の選択により、組成物を特定のニーズに合わせてカスタマイズしてもよい。

【0229】

本発明の組成物は、即時使用可能な製剤としてエンドユーザーに提供され得る。すなわち、前記組成物は、噴霧または散布装置などの適切な装置によって植物または種子に直接施用され得る。あるいは、前記組成物は、使用前に好ましくは水で希釈する必要がある濃縮物の形態でエンドユーザーに提供されてもよい。

40

【0230】

本発明の組成物は、従来の方法で、例えば式(I)の化合物を上記で開示したような1または複数の適切な助剤と混合することにより調製することができる。

【0231】

前記組成物は、殺菌有効量の式(I)の化合物を含む。「有効量」という用語は、栽培植物において有害な菌類を防除するか、または材料を保護するのに充分であり、処理された植物に実質的な損傷をもたらさない量を意味する。そのような量は広い範囲で変更する

50

ことができ、防除される真菌種、処理される栽培植物または材料、気候条件、および使用される式 (I) の特定の化合物などの様々な要因によって決まる。通常、本発明による組成物は、0.01 ~ 99 重量%、好ましくは0.05 ~ 98 重量%、より好ましくは0.1 ~ 95 重量%、さらにより好ましくは0.5 ~ 90 重量%、最も好ましくは1 ~ 80 重量%の式 (I) の化合物を含有する。組成物が本発明の2つ以上の化合物を含むことが可能である。そのような場合、概説した範囲は、本発明の化合物の総量を指す。

#### 【0232】

本発明の組成物は、溶液 (例えば、水溶液)、エマルジョン、水性および油性懸濁液、粉末 (例えば、水和剤、可溶性粉末)、細粉、ペースト、顆粒 (例えば、可溶性顆粒、散布用顆粒)、サスポエマルジョン (suspension) 濃縮物、式 (I) の化合物を含浸させた天然または合成製品、肥料、並びにポリマー物質のマイクロカプセル化合物など、任意の慣用の組成物タイプであってよい。式 (I) の化合物は、懸濁、乳化、または溶解形態で存在し得る。特定の適切な組成物タイプの例には、溶液、水溶性濃縮物 (例えば、SL、LS)、分散性濃縮物 (DC)、懸濁液および懸濁液濃縮物 (例えば、SC、OD、OF、FS)、乳剤 (例えば、EC)、エマルジョン (例えば、EW、EO、ES、ME、SE)、カプセル剤 (例えば、CS、ZC)、ペースト、トローチ、水和剤または細粉 (例えば、WP、SP、WS、DP、DS)、プレス (例えば、BR、TB、DT)、顆粒 (例えば、WG、SG、GR、FG、GG、MG)、殺虫剤 (例えば、LN)、並びに種子 (例えば、GW、GF) などの植物繁殖材料を処理するためのゲル製剤が挙げられる。これらおよびさらなる組成タイプは、国際連合食糧農業機関 (FAO) によって定義されている。「Catalogue of pesticide formulation types and international coding system」(Technical Monograph No. 2, 6th Ed. May 2008, Croplife International) に概要が記載されている。

#### 【0233】

好ましくは、本発明の組成物は、以下のタイプの1つの形態である：EC、SC、FS、SE、OD、およびWG、より好ましくはEC、SC、OD、およびWG。

#### 【0234】

組成物タイプの例およびそれらの調製についてのさらなる詳細を以下に示す。2つ以上の本発明の化合物が存在する場合、本発明の化合物の概略量は、本発明の化合物の総量を指す。これは、例えば、湿潤剤やバインダーなどのそのような構成要素の代表が2つ以上ある場合、組成物の任意のさらなる構成要素に準用される。

#### 【0235】

##### i) 水溶性濃縮物 (SL、LS)

10 ~ 60 重量%の少なくとも1つの式 (I) の化合物および5 ~ 15 重量%の界面活性剤 (例えば、ポリオキシエチレン脂肪アルコールエーテル) を、そのような量の水および/または水溶性溶媒 (例えば、プロピレングリコールまたはプロピレンカーボネートなどのカーボネート) を添加して、総量が100重量%になるようにする。施用前に、この濃縮物を水で希釈する。

#### 【0236】

##### ii) 分散性濃縮物 (DC)

5 ~ 25 重量%の少なくとも1つの式 (I) の化合物および1 ~ 10 重量%の界面活性剤および/またはバインダー (例えば、ポリビニルピロリドン) を、そのような量の有機溶媒 (例えば、シクロヘキサノン) に溶解して、総量が100重量%になるようにする。水で希釈すると分散液が得られる。

#### 【0237】

##### iii) 乳剤 (EC)

15 ~ 70 重量%の少なくとも1つの式 (I) の化合物および5 ~ 10 重量%の界面活性剤 (例えば、ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウムとヒマシ油エトキシレートとの混合物) を、そのような量の水不溶性有機溶媒 (例えば、芳香族炭化水素または脂肪酸アミド)、並びに必要に応じて追加の水溶性溶媒を添加して、総量が100重量%になるよう

10

20

30

40

50

にする。水で希釈するとエマルジョンが得られる。

【0238】

i v) エマルジョン (EW、EO、ES)

5 ~ 40 重量%の少なくとも1つの式 (I) の化合物および 1 ~ 10 重量%の界面活性剤 (例えば、ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウムとヒマシ油エトキシレートとの混合物) を、20 ~ 40 重量%の水不溶性有機溶媒に溶解する (例えば、芳香族炭化水素)。この混合物を、乳化機によってその量の水に添加して、総量が 100 重量%になるようにする。得られる組成物は均質なエマルジョンである。施用前に、このエマルジョンを水でさらに希釈してもよい。

【0239】

v) 懸濁液および懸濁液濃縮物

v - 1) 水性 (SC、FS)

例えば、攪拌ボールミルなどの適切な研削装置で、20 ~ 60 重量%の少なくとも1つの式 (I) の化合物を、2 ~ 10 重量%の界面活性剤 (例えば、リグニンスルホン酸ナトリウムおよびポリオキシエチレン脂肪アルコールエーテル) を添加して粉碎し、0.1 ~ 2 重量%の増粘剤 (例えば、キサンタンガム) および水を添加して、活性物質の微細な懸濁液を得る。水は、総量が 100 重量%になるような量で添加する。水で希釈すると、活性物質の安定した懸濁液が得られる。FS タイプの組成物では、最大 40 重量%のバインダー (例えば、ポリビニルアルコール) を添加する。

【0240】

v - 2) 油性 (OD、OF)

例えば、攪拌ボールミルなどの適切な研削装置で、20 ~ 60 重量%の少なくとも1つの式 (I) の化合物を、2 ~ 10 重量%の界面活性剤 (例えば、リグニンスルホン酸ナトリウムおよびポリオキシエチレン脂肪アルコールエーテル) を添加して粉碎し、0.1 ~ 2 重量%の増粘剤 (例えば、変性粘土、特に BENTONE (登録商標) またはシリカ) および有機担体を添加して、活性物質の微細な油性懸濁液を得る。この有機担体は、総量が 100 重量%になるような量で添加する。水で希釈すると、活性物質の安定した分散液が得られる。

【0241】

vi) 水分散性顆粒および水溶性顆粒 (WG、SG)

50 ~ 80 重量%の少なくとも1つの式 (I) の化合物を、界面活性剤 (例えば、リグニンスルホン酸ナトリウムおよびポリオキシエチレン脂肪アルコールエーテル) を添加して微粉碎し、技術的装置 (例えば、押出機、噴霧塔、流動床) によって水分散性または水溶性顆粒に変換する。界面活性剤は、総量が 100 重量%になるような量で使用する。水で希釈すると、活性物質の安定した分散液または溶液が得られる。

【0242】

vii) 水分散性粉末および水溶性粉末 (WP、SP、WS)

50 ~ 80 重量%の少なくとも1つの式 (I) の化合物に、1 ~ 8 重量%の界面活性剤 (例えば、リグニスルホン酸ナトリウム、ポリオキシエチレン脂肪アルコールエーテル) およびそのような量の固体担体、例えば、シリカゲルを添加して、ローターステーターミルで粉碎して、総量が 100 重量%になるようにする。水で希釈すると、活性物質の安定した分散液または溶液が得られる。

【0243】

viii) ゲル (GW、GF)

攪拌式ボールミルで、5 ~ 25 重量%の少なくとも1つの式 (I) の化合物に、3 ~ 10 重量%の界面活性剤 (例えば、リグニンスルホン酸ナトリウム) を添加して粉碎し、1 ~ 5 重量%のバインダー (例えば、カルボキシメチルセルロース) およびそのような量の水を添加して、総量が 100 重量%になるようにする。これにより、活性物質の微細な懸濁液が得られる。水で希釈すると、活性物質の安定した懸濁液が得られる。

【0244】

10

20

30

40

50



## i x ) マイクロエマルジョン ( M E )

5 ~ 20 重量%の少なくとも1つの式 ( I ) の化合物を、5 ~ 30 重量%の有機溶剤ブレンド (例えば、脂肪酸ジメチルアミドおよびシクロヘキサノン)、10 ~ 25 重量%の界面活性剤ブレンド (例えば、ポリオキシエチレン脂肪アルコールエーテルおよびアリールフェノールエトキシレート)、およびそのような量の水に添加して、総量が100重量%になるようにする。この混合物を1時間攪拌して、熱力学的に安定なマイクロエマルジョンを自発的に生成させる。

## 【 0 2 4 5 】

## x ) マイクロカプセル ( C S )

少なくとも1つの式 ( I ) の化合物を5 ~ 50 重量%含む油相、0 ~ 40 重量%の水不溶性有機溶剤 (例えば、芳香族炭化水素)、および2 ~ 15 重量%のアクリルモノマー (例えば、メチルメタクリレート、メタクリル酸、ジ-またはトリ-アクリレート)を、保護コロイド (例えば、ポリビニルアルコール)の水溶液に分散させる。ラジカル開始剤によって開始されるラジカル重合により、ポリ (メタ) アクリレートマイクロカプセルが形成される。あるいは、少なくとも1つの式 ( I ) の化合物を5 ~ 50 重量%含む油相、0 ~ 40 重量%の水不溶性有機溶剤 (例えば、芳香族炭化水素)、およびイソシアネートモノマー (例えば、ジフェニルメテン - 4 , 4 ' - ジイソシアネート)を、保護コロイド (例えば、ポリビニルアルコール)の水溶液に分散させる。ポリアミン (例えば、ヘキサメチレンジアミン)を添加すると、ポリ尿素マイクロカプセルが形成される。このモノマーは、CS組成物全体の1 ~ 10 重量%に達する。

10

20

## 【 0 2 4 6 】

## x i ) 粉末製剤 ( D P 、 D S )

1 ~ 10 重量%の少なくとも1つの式 ( I ) の化合物を細かく粉砕し、そのような量の固体担体、例えば、細かく分割したカオリンと緊密に混合して、総量が100重量%になるようにする。

## 【 0 2 4 7 】

## x i i ) 顆粒 ( G R 、 F G )

0 . 5 ~ 30 重量%の少なくとも1つの式 ( I ) の化合物を細かく粉砕し、そのような量の固体担体 (例えばケイ酸塩)と組み合わせて、総量が100重量%になるようにする。造粒は、押出、噴霧乾燥、または流動床によって達成される。

30

## 【 0 2 4 8 】

## x i i i ) 超微量液体 ( U L )

1 ~ 50 重量%の少なくとも1つの式 ( I ) の化合物を、そのような量の有機溶媒、例えば、芳香族炭化水素に溶解して、総量が100重量%になるようにする。

## 【 0 2 4 9 】

i ) ~ x i i i ) のタイプの組成物は、0 . 1 ~ 1 重量%の防腐剤などの助剤、0 . 1 ~ 1 重量%の消泡剤、0 . 1 ~ 1 重量%の染料および/または顔料、および5 ~ 10 重量%の不凍液を所望により含んでもよい。

## 【 0 2 5 0 】

## 混合物 / 組み合わせ

式 ( I ) の化合物および本発明の組成物は、殺真菌剤、殺菌剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺虫剤、生物学的防除剤、または除草剤などの他の有効成分と混合することができる。肥料、成長調節剤、セーフナー (薬害軽減剤)、硝化阻害剤、情報化学物質 ( s e m i o c h e m i c a l ) 、 および / または他の農業に有益な薬剤との混合物も可能である。これにより、活性スペクトルを広げたり、耐性の発生を防ぐことができる。公知の殺真菌剤、殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、および殺菌剤の例は、「Pesticide Manual」 (第17版)に開示されている。

40

## 【 0 2 5 1 】

式 ( I ) の化合物および本発明の組成物と混合することができる殺真菌剤の例は以下である。

50

1) エルゴステロール生合成阻害剤、例えば、(1.001) シプロコナゾール、(1.002) ジフェノコナゾール、(1.003) エポキシコナゾール、(1.004) フェンヘキサミド、(1.005) フェンプロピジン、(1.006) フェンプロピモルフ、(1.007) フェンピラザミン、(1.008) フルキンコナゾール、(1.009) フルトリアホール、(1.010) イマザリル、(1.011) 硫酸イマザリル、(1.012) イブコナゾール、(1.013) メトコナゾール、(1.014) ミクロブタニル、(1.015) パクロブトラゾール、(1.016) プロクロラズ、(1.017) プロピコナゾール、(1.018) プロチオコナゾール、(1.019) ピリソキサゾール、(1.020) スピロキサミン、(1.021) テブコナゾール、(1.022) テトラコナゾール、(1.023) トリアジメノール、(1.024) トリデモルフ、(1.025) トリチコナゾール、(1.026) (1R, 2S, 5S) - 5 - (4 - クロロベンジル) - 2 - (クロロメチル) - 2 - メチル - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イルメチル) シクロペンタノール、(1.027) (1S, 2R, 5R) - 5 - (4 - クロロベンジル) - 2 - (クロロメチル) - 2 - メチル - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イルメチル) シクロペンタノール、(1.028) (2R) - 2 - (1 - クロロシクロプロピル) - 4 - [(1R) - 2, 2 - ジクロロシクロプロピル] - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) ブタン - 2 - オール、(1.029) (2R) - 2 - (1 - クロロシクロプロピル) - 4 - [(1S) - 2, 2 - ジクロロシクロプロピル] - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) ブタン - 2 - オール、(1.030) (2R) - 2 - [4 - (4 - クロロフェノキシ) - 2 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) プロパン - 2 - オール、(1.031) (2S) - 2 - (1 - クロロシクロプロピル) - 4 - [(1R) - 2, 2 - ジクロロシクロプロピル] - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) ブタン - 2 - オール、(1.032) (2S) - 2 - (1 - クロロシクロプロピル) - 4 - [(1S) - 2, 2 - ジクロロシクロプロピル] - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) ブタン - 2 - オール、(1.033) (2S) - 2 - [4 - (4 - クロロフェノキシ) - 2 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) プロパン - 2 - オール、(1.034) (R) - [3 - (4 - クロロ - 2 - フルオロフェニル) - 5 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) - 1, 2 - オキサゾール - 4 - イル] (ピリジン - 3 - イル) メタノール、(1.035) (S) - [3 - (4 - クロロ - 2 - フルオロフェニル) - 5 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) - 1, 2 - オキサゾール - 4 - イル] (ピリジン - 3 - イル) メタノール、(1.036) [3 - (4 - クロロ - 2 - フルオロフェニル) - 5 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) - 1, 2 - オキサゾール - 4 - イル] (ピリジン - 3 - イル) メタノール、(1.037) 1 - ( { (2R, 4S) - 2 - [2 - クロロ - 4 - (4 - クロロフェノキシ) フェニル] - 4 - メチル - 1, 3 - ジオキソラン - 2 - イル } メチル ) - 1H - 1, 2, 4 - トリアゾール、(1.038) 1 - ( { (2S, 4S) - 2 - [2 - クロロ - 4 - (4 - クロロフェノキシ) フェニル] - 4 - メチル - 1, 3 - ジオキソラン - 2 - イル } メチル ) - 1H - 1, 2, 4 - トリアゾール、(1.039) 1 - { [3 - (2 - クロロフェニル) - 2 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) オキシラン - 2 - イル] メチル } - 1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 5 - イル チオシアナート、(1.040) 1 - { [rel(2R, 3R) - 3 - (2 - クロロフェニル) - 2 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) オキシラン - 2 - イル] メチル } - 1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 5 - イル チオシアナート、(1.041) 1 - { [rel(2R, 3S) - 3 - (2 - クロロフェニル) - 2 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) オキシラン - 2 - イル] メチル } - 1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 5 - イル チオシアナート、(1.042) 2 - [(2R, 4R, 5R) - 1 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2, 6, 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2, 4 - ジヒドロ - 3H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1.043) 2 - [(2R, 4R, 5S) - 1 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2, 6, 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2, 4 - ジヒドロ - 3H - 1,

2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1.044) 2 - [(2R, 4S, 5R) - 1 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2, 6, 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2, 4 - ジヒドロ - 3H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1.045) 2 - [(2R, 4S, 5S) - 1 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2, 6, 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2, 4 - ジヒドロ - 3H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1.046) 2 - [(2S, 4R, 5R) - 1 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2, 6, 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2, 4 - ジヒドロ - 3H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1.047) 2 - [(2S, 4R, 5S) - 1 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2, 6, 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2, 4 - ジヒドロ - 3H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1.048) 2 - [(2S, 4S, 5R) - 1 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2, 6, 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2, 4 - ジヒドロ - 3H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1.049) 2 - [(2S, 4S, 5S) - 1 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2, 6, 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2, 4 - ジヒドロ - 3H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1.050) 2 - [1 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2, 6, 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2, 4 - ジヒドロ - 3H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1.051) 2 - [2 - クロロ - 4 - (2, 4 - ジクロロフェノキシ)フェニル] - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル)プロパン - 2 - オール、(1.052) 2 - [2 - クロロ - 4 - (4 - クロロフェノキシ)フェニル] - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル)ブタン - 2 - オール、(1.053) 2 - [4 - (4 - クロロフェノキシ) - 2 - (トリフルオロメチル)フェニル] - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル)ブタン - 2 - オール、(1.054) 2 - [4 - (4 - クロロフェノキシ) - 2 - (トリフルオロメチル)フェニル] - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル)ペンタン - 2 - オール、(1.055)メフェントリフルコナゾール、(1.056) 2 - {[3 - (2 - クロロフェニル) - 2 - (2, 4 - ジフルオロフェニル)オキシラン - 2 - イル]メチル} - 2, 4 - ジヒドロ - 3H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1.057) 2 - {[rel(2R, 3R) - 3 - (2 - クロロフェニル) - 2 - (2, 4 - ジフルオロフェニル)オキシラン - 2 - イル]メチル} - 2, 4 - ジヒドロ - 3H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1.058) 2 - {[rel(2R, 3S) - 3 - (2 - クロロフェニル) - 2 - (2, 4 - ジフルオロフェニル)オキシラン - 2 - イル]メチル} - 2, 4 - ジヒドロ - 3H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1.059) 5 - (4 - クロロベンジル) - 2 - (クロロメチル) - 2 - メチル - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イルメチル)シクロペンタノール、(1.060) 5 - (アリルスルファニル) - 1 - {[3 - (2 - クロロフェニル) - 2 - (2, 4 - ジフルオロフェニル)オキシラン - 2 - イル]メチル} - 1H - 1, 2, 4 - トリアゾール、(1.061) 5 - (アリルスルファニル) - 1 - {[rel(2R, 3R) - 3 - (2 - クロロフェニル) - 2 - (2, 4 - ジフルオロフェニル)オキシラン - 2 - イル]メチル} - 1H - 1, 2, 4 - トリアゾール、(1.062) 5 - (アリルスルファニル) - 1 - {[rel(2R, 3S) - 3 - (2 - クロロフェニル) - 2 - (2, 4 - ジフルオロフェニル)オキシラン - 2 - イル]メチル} - 1H - 1, 2, 4 - トリアゾール、(1.063) N' - (2, 5 - ジメチル - 4 - {[3 - (1, 1, 2, 2 - テトラフルオロエトキシ)フェニル]スルファニル}フェニル) - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、(1.064) N' - (2, 5 - ジメチル - 4 - {[3 - (2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ)フェニル]スルファニル}フェニル) - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、(1.065) N' - (2, 5 - ジメチル - 4 - {[3 - (2, 2, 3, 3 - テトラフルオロプロポキシ)フェニル]スルファニル}フェニル) - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、(1.066) N' - (2, 5 - ジメチル - 4 - {[3 - (ペンタフルオロエトキシ)フェニル]スルファニル}フェニル) - N - エチル - N - メチルイミドホルム

10

20

30

40

50

アミド、(1.067) N' - (2, 5 - ジメチル - 4 - { 3 - [ (1, 1, 2, 2 - テ  
 トラフルオロエチル) スルファニル ] フェノキシ } フェニル) - N - エチル - N - メチル  
 イミドホルムアミド、(1.068) N' - (2, 5 - ジメチル - 4 - { 3 - [ (2, 2  
 , 2 - トリフルオロエチル) スルファニル ] フェノキシ } フェニル) - N - エチル - N -  
 メチルイミドホルムアミド、(1.069) N' - (2, 5 - ジメチル - 4 - { 3 - [ (2  
 , 2, 3, 3 - テトラフルオロプロピル) スルファニル ] フェノキシ } フェニル) - N  
 - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、(1.070) N' - (2, 5 - ジメチル -  
 4 - { 3 - [ (ペンタフルオロエチル) スルファニル ] フェノキシ } フェニル) - N - エ  
 チル - N - メチルイミドホルムアミド、(1.071) N' - (2, 5 - ジメチル - 4 -  
 フェノキシフェニル) - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、(1.072) N  
 ' - (4 - { [ 3 - (ジフルオロメトキシ) フェニル ] スルファニル } - 2, 5 - ジメチ  
 ルフェニル) - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、(1.073) N' - (4  
 - { 3 - [ (ジフルオロメチル) スルファニル ] フェノキシ } - 2, 5 - ジメチルフェニ  
 ル) - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、(1.074) N' - [ 5 - プロモ  
 - 6 - (2, 3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 2 - イルオキシ) - 2 - メチルピリジン -  
 3 - イル ] - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、(1.075) N' - { 4 -  
 [ (4, 5 - ジクロロ - 1, 3 - チアゾール - 2 - イル) オキシ ] - 2, 5 - ジメチルフェ  
 ニル } - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、(1.076) N' - { 5 - ブ  
 ロモ - 6 - [ (1R) - 1 - (3, 5 - ジフルオロフェニル) エトキシ ] - 2 - メチルピ  
 リジン - 3 - イル } - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、(1.077) N'  
 - { 5 - プロモ - 6 - [ (1S) - 1 - (3, 5 - ジフルオロフェニル) エトキシ ] - 2  
 - メチルピリジン - 3 - イル } - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、(1.0  
 78) N' - { 5 - プロモ - 6 - [ (シス - 4 - イソプロピルシクロヘキシル) オキシ ]  
 - 2 - メチルピリジン - 3 - イル } - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、(1  
 .079) N' - { 5 - プロモ - 6 - [ (トランス - 4 - イソプロピルシクロヘキシル)  
 オキシ ] - 2 - メチルピリジン - 3 - イル } - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミ  
 ド、(1.080) N' - { 5 - プロモ - 6 - [ 1 - (3, 5 - ジフルオロフェニル) エ  
 トキシ ] - 2 - メチルピリジン - 3 - イル } - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミ  
 ド  
 、(1.081) イフェントリフルコナゾール (ipfentrifluconazole)、(1.082) 2 - [ 4 - (4 - クロロフェノキシ) - 2 - (トリフルオロメチル  
 ) フェニル ] - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) プロパン - 2 - オール、  
 (1.083) 2 - [ 6 - (4 - プロモフェノキシ) - 2 - (トリフルオロメチル)  
 - 3 - ピリジル ] - 1 - (1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) プロパン - 2 - オール  
 、(1.084) 2 - [ 6 - (4 - クロロフェノキシ) - 2 - (トリフルオロメチル) -  
 3 - ピリジル ] - 1 - (1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) プロパン - 2 - オール、  
 (1.085) 3 - [ 2 - (1 - クロロシクロプロピル) - 3 - (3 - クロロ - 2 - フル  
 オロ - フェニル) - 2 - ヒドロキシ - プロピル ] イミダゾール - 4 - カルボニトリル、  
 (1.086) 4 - [ [ 6 - [ rac - (2R) - 2 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) -  
 1, 1 - ジフルオロ - 2 - ヒドロキシ - 3 - (5 - チオキソ - 4H - 1, 2, 4 - トリア  
 ザール - 1 - イル) プロピル ] - 3 - ピリジル ] オキシ ] ベンゾニトリル、(1.087  
 ) N - イソプロピル - N' - [ 5 - メトキシ - 2 - メチル - 4 - (2, 2, 2 - トリフル  
 オロ - 1 - ヒドロキシ - 1 - フェニルエチル) フェニル ] - N - メチルイミドホルムアミ  
 ド、(1.088) N' - { 5 - プロモ - 2 - メチル - 6 - [ (1 - プロポキシプロパン  
 - 2 - イル) オキシ ] ピリジン - 3 - イル } - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミ  
 ド、(1.089) ヘキサコナゾール、(1.090) ペンコナゾール、(1.091)  
 フェンブコナゾール、(1.092) メチル - 2 - [ 2 - クロロ - 4 - (4 - クロロフェ  
 ノキシ) フェニル ] - 2 - ヒドロキシ - 3 - (1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) プ  
 ロパノエート。

【0252】

2) 複合体 I または I I の呼吸鎖の阻害剤、例えば、(2.001) ベンゾピンジフル  
 ピル、(2.002) ピキサフェン、(2.003) ポスカリド、(2.004) カルボ  
 キシン、(2.005) フルオピラム、(2.006) フルトラニル、(2.007) フ  
 ルキサピロキサド、(2.008) フラメトピル、(2.009) イソフェタミド、(2  
 .010) イソピラザム (anti 体エピマー-エナンチオマー-1R, 4S, 9S)、(2  
 .011) イソピラザム (anti 体エピマー-エナンチオマー-1S, 4R, 9R)、(2  
 .012) イソピラザム (anti 体エピマー-ラセミ体 1RS, 4SR, 9SR)、(2  
 .013) イソピラザム (syn 体エピマー-ラセミ体 1RS, 4SR, 9RS および a  
 nti 体エピマー-ラセミ体 1RS, 4SR, 9SR の混合物)、(2.014) イソピラ  
 ザム (syn 体エピマー-エナンチオマー-1R, 4S, 9R)、(2.015) イソピラザ  
 ム (syn 体エピマー-エナンチオマー-1S, 4R, 9S)、(2.016) イソピラザム  
 (syn 体エピマー-ラセミ体 1RS, 4SR, 9RS)、(2.017) ペンフルフェ  
 ン、(2.018) ペンチオピラド、(2.019) ピジフルメトフェン、(2.020  
 ) ピラジフルミド、(2.021) セダキサソ、(2.022) 1, 3-ジメチル-N-  
 (1, 1, 3-トリメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル)-1H-ピ  
 ラゾール-4-カルボキサミド、(2.023) 1, 3-ジメチル-N-[(3R)-1  
 , 1, 3-トリメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル]-1H-ピラゾ  
 ール-4-カルボキサミド、(2.024) 1, 3-ジメチル-N-[(3S)-1, 1  
 , 3-トリメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル]-1H-ピラゾ  
 ール-4-カルボキサミド、(2.025) 1-メチル-3-(トリフルオロメチル)-N-  
 [2'- (トリフルオロメチル) ピフェニル-2-イル]-1H-ピラゾール-4-カル  
 ボキサミド、(2.026) 2-フルオロ-6-(トリフルオロメチル)-N-(1, 1  
 , 3-トリメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル) ベンズアミド、(2  
 .027) 3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-N-(1, 1, 3-トリメチル-2  
 , 3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル)-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド  
 、(2.028) インピルフルキサム、(2.029) 3-(ジフルオロメチル)-1-  
 メチル-N-[(3S)-1, 1, 3-トリメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン  
 -4-イル]-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.030) フルインダピル  
 、(2.031) 3-(ジフルオロメチル)-N-[(3R)-7-フルオロ-1, 1,  
 3-トリメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル]-1-メチル-1H-  
 ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.032) 3-(ジフルオロメチル)-N-[(  
 3S)-7-フルオロ-1, 1, 3-トリメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-  
 4-イル]-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.033) 5,  
 8-ジフルオロ-N-[2-(2-フルオロ-4-{[4-(トリフルオロメチル) ピリ  
 ジン-2-イル] オキシ} フェニル) エチル] キナゾリン-4-アミン、(2.034)  
 N-(2-シクロペンチル-5-フルオロベンジル)-N-シクロプロピル-3-(ジフ  
 ルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、  
 (2.035) N-(2-tert-ブチル-5-メチルベンジル)-N-シクロプロピ  
 ル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カ  
 ルボキサミド、(2.036) N-(2-tert-ブチルベンジル)-N-シクロプロ  
 ピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-  
 カルボキサミド、(2.037) N-(5-クロロ-2-エチルベンジル)-N-シクロ  
 プロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-  
 4-カルボキサミド、(2.038) イソフルシプラム、(2.039) N-[(1R,  
 4S)-9-(ジクロロメチレン)-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1, 4-メタノナ  
 フタレン-5-イル]-3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4  
 -カルボキサミド、(2.040) N-[(1S, 4R)-9-(ジクロロメチレン)-  
 1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1, 4-メタノナフタレン-5-イル]-3-(ジフル  
 オロメチル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.041) N  
 -[1-(2, 4-ジクロロフェニル)-1-メトキシプロパン-2-イル]-3-(ジ

10

20

30

40

50

フルオロメチル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、( 2 . 0 4 2 ) N - [ 2 - クロロ - 6 - (トリフルオロメチル)ベンジル ] - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、( 2 . 0 4 3 ) N - [ 3 - クロロ - 2 - フルオロ - 6 - (トリフルオロメチル)ベンジル ] - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、( 2 . 0 4 4 ) N - [ 5 - クロロ - 2 - (トリフルオロメチル)ベンジル ] - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、( 2 . 0 4 5 ) N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - N - [ 5 - メチル - 2 - (トリフルオロメチル)ベンジル ] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、( 2 . 0 4 6 ) N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - N - ( 2 - フルオロ - 6 - イソプロピルベンジル ) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、( 2 . 0 4 7 ) N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - N - ( 2 - イソプロピル - 5 - メチルベンジル ) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、( 2 . 0 4 8 ) N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - N - ( 2 - イソプロピルベンジル ) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボチオアミド、( 2 . 0 4 9 ) N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - N - ( 2 - イソプロピルベンジル ) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、( 2 . 0 5 0 ) N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - N - ( 5 - フルオロ - 2 - イソプロピルベンジル ) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、( 2 . 0 5 1 ) N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - N - ( 2 - エチル - 4 , 5 - ジメチルベンジル ) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、( 2 . 0 5 2 ) N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - N - ( 2 - エチル - 5 - フルオロベンジル ) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、( 2 . 0 5 3 ) N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - N - ( 2 - エチル - 5 - メチルベンジル ) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、( 2 . 0 5 4 ) N - シクロプロピル - N - ( 2 - シクロプロピル - 5 - フルオロベンジル ) - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、( 2 . 0 5 5 ) N - シクロプロピル - N - ( 2 - シクロプロピル - 5 - メチルベンジル ) - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、( 2 . 0 5 6 ) N - シクロプロピル - N - ( 2 - シクロプロピルベンジル ) - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、( 2 . 0 5 7 ) ピラプロポイン、( 2 . 0 5 8 ) N - [ r a c - ( 1 S , 2 S ) - 2 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル)シクロブチル ] - 2 - (トリフルオロメチル)ニコチンアミド、( 2 . 0 5 9 ) N - [ ( 1 S , 2 S ) - 2 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル)シクロブチル ] - 2 - (トリフルオロメチル)ニコチンアミド、( 2 . 0 6 0 ) フルベネテラム。

【 0 2 5 3 】

3) 複合体 I I I の呼吸鎖の阻害剤、例えば、( 3 . 0 0 1 ) アメトクトラジン、( 3 . 0 0 2 ) アミスルプロム、( 3 . 0 0 3 ) アゾキシストロピン、( 3 . 0 0 4 ) クメトキシストロピン、( 3 . 0 0 5 ) コモキシストロピン ( c o u m o x y s t r o b i n )、( 3 . 0 0 6 ) シアゾファアミド、( 3 . 0 0 7 ) ジモキシストロピン、( 3 . 0 0 8 ) エノキサストロピン、( 3 . 0 0 9 ) ファモキサドン、( 3 . 0 1 0 ) フェナミドン、( 3 . 0 1 1 ) フルフェノキシストロピン、( 3 . 0 1 2 ) フルオキサストロピン、( 3 . 0 1 3 ) クレソキシムメチル、( 3 . 0 1 4 ) メトミノストロピン、( 3 . 0 1 5 ) オリサストロピン、( 3 . 0 1 6 ) ピコキシストロピン、( 3 . 0 1 7 ) ピラクロストロピン、( 3 . 0 1 8 ) ピラメトストロピン、( 3 . 0 1 9 ) ピラオキシストロピン ( p y r a o x y s t r o b i n )、( 3 . 0 2 0 ) トリフロキシストロピン、( 3 . 0 2 1 ) ( 2 E ) - 2 - { 2 - [ ( { [ ( 1 E ) - 1 - ( 3 - { [ ( E ) - 1 - フルオロ - 2 - フェニルビニル ] オキシ } フェニル ) エチリデン ] アミノ } オキシ ) メチル ] フェニル } - 2 -

(メトキシイミノ) - N - メチルアセトアミド、(3.022)(2E, 3Z) - 5 - { [1 - (4 - クロロフェニル) - 1H - ピラゾール - 3 - イル] オキシ } - 2 - (メトキシイミノ) - N, 3 - ジメチルペント - 3 - エナミド、(3.023)(2R) - 2 - { 2 - [(2, 5 - ジメチルフェノキシ)メチル]フェニル } - 2 - メトキシ - N - メチルアセトアミド、(3.024)(2S) - 2 - { 2 - [(2, 5 - ジメチルフェノキシ)メチル]フェニル } - 2 - メトキシ - N - メチルアセトアミド、(3.025)フェンピコキサミド、(3.026)マンデストロピン、(3.027)N - (3 - エチル - 3, 5, 5 - トリメチルシクロヘキシル) - 3 - ホルムアミド - 2 - ヒドロキシベンズアミド、(3.028)(2E, 3Z) - 5 - { [1 - (4 - クロロ - 2 - フルオロフェニル) - 1H - ピラゾール - 3 - イル] オキシ } - 2 - (メトキシイミノ) - N, 3 - ジメチルペント - 3 - エナミド、(3.029)メチル { 5 - [3 - (2, 4 - ジメチルフェニル) - 1H - ピラゾール - 1 - イル] - 2 - メチルベンジル } カルバメート、(3.030)メチルテトラプロール、(3.031)フロリルピコキサミド、(3.032)(2S, 3S) - 3 - (o - トリル)ブタン - 2 - イル N - { [4 - メトキシ - 3 - (プロパノイルオキシ) - 2 - ピリジル]カルボニル } - L - アラニナート。

10

## 【0254】

4) 有糸分裂と細胞分裂の阻害剤、例えば、(4.001)カルベンダジム、(4.002)ジエトフェンカルブ、(4.003)エタボキサム、(4.004)フルオピコリド、(4.005)ペンシクロン、(4.006)チアベンダゾール、(4.007)チオファネート - メチル、(4.008)ゾキサミド、(4.009)ピリダクロメチル、(4.010)3 - クロロ - 5 - (4 - クロロフェニル) - 4 - (2, 6 - ジフルオロフェニル) - 6 - メチルピリダジン、(4.011)3 - クロロ - 5 - (6 - クロロピリジン - 3 - イル) - 6 - メチル - 4 - (2, 4, 6 - トリフルオロフェニル)ピリダジン、(4.012)4 - (2 - プロモ - 4 - フルオロフェニル) - N - (2, 6 - ジフルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1H - ピラゾール - 5 - アミン、(4.013)4 - (2 - プロモ - 4 - フルオロフェニル) - N - (2 - プロモ - 6 - フルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1H - ピラゾール - 5 - アミン、(4.014)4 - (2 - プロモ - 4 - フルオロフェニル) - N - (2 - プロモフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1H - ピラゾール - 5 - アミン、(4.015)4 - (2 - プロモ - 4 - フルオロフェニル) - N - (2 - クロロ - 6 - フルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1H - ピラゾール - 5 - アミン、(4.016)4 - (2 - プロモ - 4 - フルオロフェニル) - N - (2 - クロロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1H - ピラゾール - 5 - アミン、(4.017)4 - (2 - プロモ - 4 - フルオロフェニル) - N - (2 - フルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1H - ピラゾール - 5 - アミン、(4.018)4 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - N - (2, 6 - ジフルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1H - ピラゾール - 5 - アミン、(4.019)4 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - N - (2 - クロロ - 6 - フルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1H - ピラゾール - 5 - アミン、(4.020)4 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - N - (2 - クロロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1H - ピラゾール - 5 - アミン、(4.021)4 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - N - (2 - フルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1H - ピラゾール - 5 - アミン、(4.022)4 - (4 - クロロフェニル) - 5 - (2, 6 - ジフルオロフェニル) - 3, 6 - ジメチルピリダジン、(4.023)N - (2 - プロモ - 6 - フルオロフェニル) - 4 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1H - ピラゾール - 5 - アミン、(4.024)N - (2 - プロモフェニル) - 4 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1H - ピラゾール - 5 - アミン、(4.025)N - (4 - クロロ - 2, 6 - ジフルオロフェニル) - 4 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1H - ピラゾール - 5 - アミン、(4.026)フルオピモミド。

20

30

40

## 【0255】

5) マルチサイト作用が可能な化合物、例えば、(5.001)ボルドー混合物、(5

50

． 0 0 2 ) カブタホール、 ( 5 . 0 0 3 ) キャプタン、 ( 5 . 0 0 4 ) クロロタロニル、 ( 5 . 0 0 5 ) 水酸化銅、 ( 5 . 0 0 6 ) ナフテン酸銅、 ( 5 . 0 0 7 ) 酸化銅、 ( 5 . 0 0 8 ) オキシ塩化銅、 ( 5 . 0 0 9 ) 硫酸銅 ( I I )、 ( 5 . 0 1 0 ) ジチアノン、 ( 5 . 0 1 1 ) ドジン、 ( 5 . 0 1 2 ) ホルベット、 ( 5 . 0 1 3 ) マンコゼブ、 ( 5 . 0 1 4 ) マネブ、 ( 5 . 0 1 5 ) メチラム、 ( 5 . 0 1 6 ) メチラム亜鉛、 ( 5 . 0 1 7 ) オキシ - 銅、 ( 5 . 0 1 8 ) プロピネブ、 ( 5 . 0 1 9 ) 硫黄および多硫化カルシウムを含む硫黄調製物、 ( 5 . 0 2 0 ) チラム、 ( 5 . 0 2 1 ) ジネブ、 ( 5 . 0 2 2 ) ジラム、 ( 5 . 0 2 3 ) 6 - エチル - 5 , 7 - ジオキソ - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロロ [ 3 ' , 4 ' : 5 , 6 ] [ 1 , 4 ] ジチイノ [ 2 , 3 - c ] [ 1 , 2 ] チアゾール - 3 - カルボニトリル。

10

## 【 0 2 5 6 】

6 ) 宿主防御を誘発することができる化合物、例えば、 ( 6 . 0 0 1 ) アシベンゾラル - S - メチル、 ( 6 . 0 0 2 ) イソチアニル、 ( 6 . 0 0 3 ) プロベナゾール、 ( 6 . 0 0 4 ) チアジニル。

## 【 0 2 5 7 】

7 ) アミノ酸および / またはタンパク質生合成の阻害剤、例えば、 ( 7 . 0 0 1 ) シプロジニル、 ( 7 . 0 0 2 ) カスガマイシン、 ( 7 . 0 0 3 ) カスガマイシン塩酸塩水和物、 ( 7 . 0 0 4 ) オキシテトラサイクリン、 ( 7 . 0 0 5 ) ピリメタニル、 ( 7 . 0 0 6 ) 3 - ( 5 - フルオロ - 3 , 3 , 4 , 4 - テトラメチル - 3 , 4 - ジヒドロイソキノリン - 1 - イル ) キノリン。

20

## 【 0 2 5 8 】

8 ) A T P 産生の阻害剤、例えば、 ( 8 . 0 0 1 ) シルチオファミン。

## 【 0 2 5 9 】

9 ) 細胞壁合成の阻害剤、例えば、 ( 9 . 0 0 1 ) ベンチアバリカルブ、 ( 9 . 0 0 2 ) ジメトモルフ、 ( 9 . 0 0 3 ) フルモルフ、 ( 9 . 0 0 4 ) イプロバリカルブ、 ( 9 . 0 0 5 ) マンジプロパミド、 ( 9 . 0 0 6 ) ピリモルフ、 ( 9 . 0 0 7 ) バリフェナレート、 ( 9 . 0 0 8 ) ( 2 E ) - 3 - ( 4 - t e r t - ブチルフェニル ) - 3 - ( 2 - クロロピリジン - 4 - イル ) - 1 - ( モルホリン - 4 - イル ) プロパ - 2 - エン - 1 - オン、 ( 9 . 0 0 9 ) ( 2 Z ) - 3 - ( 4 - t e r t - ブチルフェニル ) - 3 - ( 2 - クロロピリジン - 4 - イル ) - 1 - ( モルホリン - 4 - イル ) プロパ - 2 - エン - 1 - オン。

30

## 【 0 2 6 0 】

1 0 ) 脂質および膜合成の阻害剤、例えば、 ( 1 0 . 0 0 1 ) プロパモカルブ、 ( 1 0 . 0 0 2 ) プロパモカルブ塩酸塩、 ( 1 0 . 0 0 3 ) トルククロホスメチル。

## 【 0 2 6 1 】

1 1 ) メラニン生合成の阻害剤、例えば、 ( 1 1 . 0 0 1 ) トリシクラゾール、 ( 1 1 . 0 0 2 ) トルプロカルブ。

## 【 0 2 6 2 】

1 2 ) 核酸合成の阻害剤、例えば、 ( 1 2 . 0 0 1 ) ベナラキシル、 ( 1 2 . 0 0 2 ) ベナラキシル - M ( キララキシル )、 ( 1 2 . 0 0 3 ) メタラキシル、 ( 1 2 . 0 0 4 ) メタラキシル - M ( メフェノキサム )。

40

## 【 0 2 6 3 】

1 3 ) シグナル伝達の阻害剤、例えば、 ( 1 3 . 0 0 1 ) フルジオキソニル、 ( 1 3 . 0 0 2 ) イプロジオン、 ( 1 3 . 0 0 3 ) プロシミドン、 ( 1 3 . 0 0 4 ) プロキナジド、 ( 1 3 . 0 0 5 ) キノキシフェン、 ( 1 3 . 0 0 6 ) ピンクロゾリン。

## 【 0 2 6 4 】

1 4 ) アンカプラー ( 脱共役剤 ) として作用できる化合物、例えば、 ( 1 4 . 0 0 1 ) フルアジナム、 ( 1 4 . 0 0 2 ) メプチルジノカプ ( m e p t y l d i n o c a p )。

## 【 0 2 6 5 】

1 5 ) ( 1 5 . 0 0 1 ) アブシジン酸、 ( 1 5 . 0 0 2 ) ベンチアゾール、 ( 1 5 . 0 0 3 ) ベトキサジン、 ( 1 5 . 0 0 4 ) カプシマイシン、 ( 1 5 . 0 0 5 ) カルボン、 (

50



15.006)キノメチオネート、(15.007)クフラネブ、(15.008)シフルフェナミド(15.009)シモキサニル、(15.010)シプロスルファミド、(15.011)フルチアニル、(15.012)ホセチルアルミニウム、(15.013)ホセチルカルシウム、(15.014)ホセチルナトリウム、(15.015)メチルイソチオシアナート、(15.016)メトラフェノン、(15.017)ミルジオマイシン(milidiomycin)、(15.018)ナタマイシン(natamycin)、(15.019)ジメチルジチオカルバミン酸ニッケル、(15.020)ニトロタールイソプロピル、(15.021)オキサモカルブ(oxamocarb)、(15.022)オキサチアピプロリン、(15.023)オキシフェンチン(oxyfenthin)、(15.024)ペンタクロロフェノールおよび塩、(15.025)亜リン酸およびその塩、(15.026)プロパモカルブホセチレート(propamocarb-fosetylalte)、(15.027)ピリオフェノン(クラザフェノン)、(15.028)テブフロキン、(15.029)テクロフタラム、(15.030)トルニファニド、(15.031)1-(4-{4-[(5R)-5-(2,6-ジフルオロフェニル)-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル]-1,3-チアゾール-2-イル}ピペリジン-1-イル)-2-[5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]エタノン、(15.032)1-(4-{4-[(5S)-5-(2,6-ジフルオロフェニル)-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル]-1,3-チアゾール-2-イル}ピペリジン-1-イル)-2-[5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]エタノン、(15.033)2-(6-ベンジルピリジン-2-イル)キナゾリン、(15.034)ジピメチトロン、(15.035)2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[2-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル]-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン、(15.036)2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[2-クロロ-6-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル]-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン、(15.037)2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[2-フルオロ-6-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル]-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン、(15.038)2-[6-(3-フルオロ-4-メトキシフェニル)-5-メチルピリジン-2-イル]キナゾリン、(15.039)2-{(5R)-3-[2-(1-{[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]アセチル}ピペリジン-4-イル)-1,3-チアゾール-4-イル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-5-イル}-3-クロロフェニルメタンスルホナート、(15.040)2-{(5S)-3-[2-(1-{[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]アセチル}ピペリジン-4-イル)-1,3-チアゾール-4-イル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-5-イル}-3-クロロフェニルメタンスルホナート、(15.041)イブフルフェノキン、(15.042)2-{2-フルオロ-6-[(8-フルオロ-2-メチルキノリン-3-イル)オキシ]フェニル}プロパン-2-オール、(15.043)フルオキサピプロリン、(15.044)2-{3-[2-(1-{[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]アセチル}ピペリジン-4-イル)-1,3-チアゾール-4-イル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-5-イル}フェニルメタンスルホナート、(15.045)2-フェニルフェノールおよび塩、(15.046)3-(4,4,5-トリフルオロ-3,3-ジメチル-3,4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン、(15.047)キノフメリン、(15.048)4-アミノ-5-フルオロピリミジン-2-オール(互変異性体:4-アミノ-5-フルオロピリミジン-2(1H)-オン)、(15.049)4-オキソ-4

- [(2-フェニルエチル)アミノ]ブタン酸、(15.050)5-アミノ-1,3,4-チアジアゾール-2-チオ1、(15.051)5-クロロ-N'-フェニル-N'-(プロバ-2-イン-1-イル)チオフェン-2-スルホノヒドラジド、(15.052)5-フルオロ-2-[(4-フルオロベンジル)オキシ]ピリミジン-4-アミン、(15.053)5-フルオロ-2-[(4-メチルベンジル)オキシ]ピリミジン-4-アミン、(15.054)9-フルオロ-2,2-ジメチル-5-(キノリン-3-イル)-2,3-ジヒドロ-1,4-ベンゾオキサゼピン、(15.055)プト-3-イン-1-イル {6-[(Z)-(1-メチル-1H-テトラゾール-5-イル)(フェニル)メチレン]アミノ}オキシ)メチル]ピリジン-2-イル}カルバメート、(15.056)エチル(2Z)-3-アミノ-2-シアノ-3-フェニルアクリレート、(15.057)フェナジン-1-カルボン酸、(15.058)プロピル 3,4,5-トリヒドロキシベンゾエート、(15.059)キノリン-8-オール、(15.060)キノリン-8-オールサルフェート(2:1)、(15.061)tert-ブチル {6-[(Z)-[(1-メチル-1H-テトラゾール-5-イル)(フェニル)メチレン]アミノ}オキシ)メチル]ピリジン-2-イル}カルバメート、(15.062)5-フルオロ-4-イミノ-3-メチル-1-[(4-メチルフェニル)スルホニル]-3,4-ジヒドロピリミジン-2(1H)-オン、(15.063)アミノピリフェン、(15.064)(N'-[2-クロロ-4-(2-フルオロフェノキシ)-5-メチルフェニル]-N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド)、(15.065)(N'-(2-クロロ-5-メチル-4-フェノキシフェニル)-N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド)、(15.066)(2-{2-[(7,8-ジフルオロ-2-メチルキノリン-3-イル)オキシ]-6-フルオロフェニル}プロパン-2-オール)、(15.067)(5-プロモ-1-(5,6-ジメチルピリジン-3-イル)-3,3-ジメチル-3,4-ジヒドロイソキノリン)、(15.068)(3-(4,4-ジフルオロ-5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロチエノ[2,3-c]ピリジン-7-イル)キノリン)、(15.069)(1-(4,5-ジメチル-1H-ベンズイミダゾール-1-イル)-4,4-ジフルオロ-3,3-ジメチル-3,4-ジヒドロイソキノリン)、(15.070)8-フルオロ-3-(5-フルオロ-3,3-ジメチル-3,4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノロン、(15.071)8-フルオロ-3-(5-フルオロ-3,3,4,4-テトラメチル-3,4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノロン、(15.072)3-(4,4-ジフルオロ-3,3-ジメチル-3,4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)-8-フルオロキノリン、(15.073)(N-メチル-N-フェニル-4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]ベンズアミド)、(15.074)メチル {4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル}カルバメート、(15.075)(N-{4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]ベンジル}シクロプロパンカルボキサミド)、(15.076)N-メチル-4-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)ベンズアミド、(15.077)N-[(E)-メトキシイミノメチル]-4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]ベンズアミド、(15.078)N-[(Z)-メトキシイミノメチル]-4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]ベンズアミド、(15.079)N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]シクロプロパンカルボキサミド、(15.080)N-(2-フルオロフェニル)-4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]ベンズアミド、(15.081)2,2-ジフルオロ-N-メチル-2-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトアミド、(15.082)N-アリル-N-[[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]メチル]アセトアミド、(15.083)N-[(E)-N-メトキシ-C-メチル-カルボンイミドイル]-4-(5-(トリフルオロメチル)

10

20

30

40

50

- 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] ベンズアミド、(15.084) N - [(Z) - N - メトキシ - C - メチル - カルボンイミドイル] - 4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] ベンズアミド、(15.085) N - アリル - N - [[4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] メチル] プロパンアミド、(15.086) 4, 4 - ジメチル - 1 - [[4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] メチル] ピロリジン - 2 - オン、(15.087) N - メチル - 4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] ベンゼンカルボチオアミド、(15.088) 5 - メチル - 1 - [[4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] メチル] ピロリジン - 2 - オン、(15.089) N - ((2, 3 - ジフルオロ - 4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] メチル] - 3, 3, 3 - トリフルオロ - プロパンアミド、(15.090) 1 - メトキシ - 1 - メチル - 3 - [[4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] メチル] ウレア、(15.091) 1, 1 - ジエチル - 3 - [[4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] メチル] ウレア、(15.092) N - [[4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] メチル] プロパンアミド、(15.093) N - メトキシ - N - [[4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] メチル] シクロプロパンカルボキサミド、(15.094) 1 - メトキシ - 3 - メチル - 1 - [[4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] メチル] ウレア、(15.095) N - メトキシ - N - [[4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] メチル] シクロプロパンカルボキサミド、(15.096) N, 2 - ジメトキシ - N - [[4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] メチル] プロパンアミド、(15.097) N - エチル - 2 - メチル - N - [[4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] メチル] プロパンアミド、(15.098) 1 - メトキシ - 3 - メチル - 1 - [[4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] メチル] ウレア、(15.099) 1, 3 - ジメトキシ - 1 - [[4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] メチル] ウレア、(15.100) 3 - エチル - 1 - メトキシ - 1 - [[4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] メチル] ウレア、(15.101) 1 - [[4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] メチル] ピペリジン - 2 - オン、(15.102) 4, 4 - ジメチル - 2 - [[4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] メチル] イソキサゾリジン - 3 - オン、(15.103) 5, 5 - ジメチル - 2 - [[4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] メチル] イソキサゾリジン - 3 - オン、(15.104) 3, 3 - ジメチル - 1 - [[4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] メチル] ピペリジン - 2 - オン、(15.105) 1 - [[3 - フルオロ - 4 - (5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] メチル] アゼパン - 2 - オン、(15.106) 4, 4 - ジメチル - 2 - [[4 - (5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] メチル] イソキサゾリジン - 3 - オン、(15.107) 5, 5 - ジメチル - 2 - [[4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] メチル] イソキサゾリジン - 3 - オン、(15.108) エチル 1 - {4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] ベンジル} - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキシレート、(15.109) N, N - ジメチル - 1 - {4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] ベンジル} 10  
20  
30  
40  
50

- 1 H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - アミン、( 15 . 110 ) N - { 2, 3 - ジフルオロ - 4 - [ 5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル ] ベンジル } ブタンアミド、( 15 . 111 ) N - ( 1 - メチルシクロプロピル ) - 4 - [ 5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル ] ベンズアミド、( 15 . 112 ) N - ( 2, 4 - ジフルオロフェニル ) - 4 - [ 5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル ] ベンズアミド、( 15 . 113 ) 1 - ( 5, 6 - ジメチルピリジン - 3 - イル ) - 4, 4 - ジフルオロ - 3, 3 - ジメチル - 3, 4 - ジヒドロイソキノリン、( 15 . 114 ) 1 - ( 6 - (ジフルオロメチル) - 5 - メチル - ピリジン - 3 - イル ) - 4, 4 - ジフルオロ - 3, 3 - ジメチル - 3, 4 - ジヒドロイソキノリン、( 15 . 115 ) 1 - ( 5 - (フルオロメチル) - 6 - メチル - ピリジン - 3 - イル ) - 4, 4 - ジフルオロ - 3, 3 - ジメチル - 3, 4 - ジヒドロイソキノリン、( 15 . 116 ) 1 - ( 6 - (ジフルオロメチル) - 5 - メトキシ - ピリジン - 3 - イル ) - 4, 4 - ジフルオロ - 3, 3 - ジメチル - 3, 4 - ジヒドロイソキノリン、( 15 . 117 ) 4 - [ 5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル ] フェニルジメチルカルバメート、( 15 . 118 ) N - { 4 - [ 5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル ] フェニル } プロパンアミド、( 15 . 119 ) 3 - [ 2 - ( 1 - { [ 5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル ] アセチル } ピペリジン - 4 - イル ) - 1, 3 - チアゾール - 4 - イル ] - 1, 5 - ジヒドロ - 2, 4 - ベンゾジオキセピン - 6 - イル メタンスルホナート、( 15 . 120 ) 9 - フルオロ - 3 - [ 2 - ( 1 - { [ 5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル ] アセチル } ピペリジン - 4 - イル ) - 1, 3 - チアゾール - 4 - イル ] - 1, 5 - ジヒドロ - 2, 4 - ベンゾジオキセピン - 6 - イル メタンスルホナート、( 15 . 121 ) 3 - [ 2 - ( 1 - { [ 3, 5 - ビス(ジフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル ] アセチル } ピペリジン - 4 - イル ) - 1, 3 - チアゾール - 4 - イル ] - 1, 5 - ジヒドロ - 2, 4 - ベンゾジオキセピン - 6 - イル メタンスルホナート、( 15 . 122 ) 3 - [ 2 - ( 1 - { [ 3, 5 - ビス(ジフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル ] アセチル } ピペリジン - 4 - イル ) - 1, 3 - チアゾール - 4 - イル ] - 9 - フルオロ - 1, 5 - ジヒドロ - 2, 4 - ベンゾジオキセピン - 6 - イル メタンスルホナート、( 15 . 123 ) 1 - ( 6, 7 - ジメチルピラゾロ [ 1, 5 - a ] ピリジン - 3 - イル ) - 4, 4 - ジフルオロ - 3, 3 - ジメチル - 3, 4 - ジヒドロイソキノリン、( 15 . 124 ) 8 - フルオロ - N - ( 4, 4, 4 - トリフルオロ - 2 - メチル - 1 - フェニルブタン - 2 - イル ) キノリン - 3 - カルボキサミド、( 15 . 125 ) 8 - フルオロ - N - [ ( 2 S ) - 4, 4, 4 - トリフルオロ - 2 - メチル - 1 - フェニルブタン - 2 - イル ] キノリン - 3 - カルボキサミド、( 15 . 126 ) N - ( 2, 4 - ジメチル - 1 - フェニルペンタン - 2 - イル ) - 8 - フルオロキノリン - 3 - カルボキサミド、( 15 . 127 ) N - [ ( 2 S ) - 2, 4 - ジメチル - 1 - フェニルペンタン - 2 - イル ] - 8 - フルオロキノリン - 3 - カルボキサミド、および ( 15 . 128 ) D - タガトースからなる群から選択されるさらなる殺真菌剤。

【 0 2 6 6 】

上記のクラス ( 1 ) ~ ( 15 ) の全ての命名された混合パートナーは、遊離化合物の形態で、またはそれらの官能基がこれを可能にする場合、その農薬活性塩の形態で存在し得る。

【 0 2 6 7 】

式 ( I ) の化合物および本発明の組成物はまた、1または複数の生物学的防除剤と組み合わせてもよい。

【 0 2 6 8 】

本明細書で使用される場合、「生物学的防除」という用語は、生物防除剤の使用または採用による、植物病原性真菌および/または昆虫および/またはダニおよび/または線虫などの有害生物の防除として定義される。

【 0 2 6 9 】

10

20

30

40

50

本明細書で使用される「生物学的防除剤」という用語は、有害な生物以外の生物および/または生物学的防除のためにそのような生物によって産生されるタンパク質若しくは二次代謝産物として定義される。2番目の生物の変異体は、生物学的防除剤の定義に含まれるものとする。「変異体」という用語は、親株のバリエーション、並びに殺虫活性が親株によって発現されるものよりも大きい変異体またはバリエーションを得るための方法を指す。「親株」は、本明細書において、突然変異誘発前の元の株として定義される。そのような変異体を得るために、親株は、N-メチル-N'-ニトロ-N-ニトロソグアニジン、エチルメタンスルホンなどの化学物質で、または 線、X線、若しくはUV照射を使用する照射によって、または当業者に周知の他の手段によって十分に処理され得る。生物学的防除剤の公知のメカニズムは、根の表面の空間を求めて真菌を打ち負かすことによって根腐れ病を防除する腸内細菌を含む。抗生物質などの細菌毒素は、病原体を防除するために使用されてきた。毒素を単離して植物に直接適用するか、細菌種を投与してイン・サイチュで毒素を生成することができる。

10

## 【0270】

「バリエーション」とは、本明細書に示されているNRRLまたはATCC受託番号の全ての識別特性を有する株であり、NRRLまたはATCC受託番号のゲノムに高ストリンジェンシー条件下でハイブリダイズするゲノムを有すると識別できる。

## 【0271】

「ハイブリダイゼーション」は、1または複数のポリヌクレオチドが反応して、ヌクレオチド残基の塩基間の水素結合を介して安定化される複合体を形成する反応を指す。水素結合は、ワトソン-クリック(Watson-Crick)塩基対合、フーグスティン(Hoogsteen)結合、またはその他の配列特異的な方法で発生し得る。前記複合体は、二重鎖構造を形成する2つの鎖、多鎖複合体を形成する3つ以上の鎖、単一の自己ハイブリダイズ鎖、またはこれらの任意の組み合わせを含み得る。ハイブリダイゼーション反応は、様々な「ストリンジェンシー」の条件下で実施され得る。概して、低ストリンジェンシーハイブリダイゼーション反応は、 $10 \times SSC$ または同等のイオン強度/温度の溶液中約40 で実施される。適度なストリンジェンシーのハイブリダイゼーション反応は、典型的には、 $6 \times SSC$ で約50 で実施され、高ストリンジェントなハイブリダイゼーション反応は、概ね $1 \times SSC$ で約60 で実施される。

20

## 【0272】

示されたNRRLまたはATCC受託番号のバリエーションは、示されたNRRLまたはATCC受託番号のゲノムに対して85%を超える、より好ましくは90%を超える、またはより好ましくは95%を超える配列同一性を有するゲノム配列を有する株としても定義され得る。ポリヌクレオチド若しくはポリヌクレオチド領域(またはポリペプチド若しくはポリペプチド領域)が、別の配列に対して特定の割合(例えば、80%、85%、90%、または95%)の「配列同一性」を有するとは、整列(アラインメント)させた場合、その塩基(またはアミノ酸)の割合(%)が、2つの配列を比較すると、同一であることを意味する。このアラインメントおよびパーセント相同性若しくは配列同一性は、当技術分野で公知のソフトウェアプログラム、例えば、「Current Protocols in Molecular Biology」(F. M. Ausubel et al., eds., 1987)に記載のものを使用して決定することができる。

30

40

## 【0273】

「NRRL」は、「Agricultural Research Service Culture Collection」の略称で、特許手続きのための微生物の寄託の国際承認に関するブダペスト条約に基づく微生物株の寄託を目的とした国際寄託機関であり、所在地は、米国イリノイ州ペロイラ(ジップコード61604)、ノースユニバーシティストリート1815、米国農務省農業利用研究所(National Center for Agricultural Utilization Research)、農業研究サービス(Agricultural Research service)部門である。

50

## 【0274】

「ATCC」は、「American Type Culture Collection」の略称で、特許手続きのための微生物の寄託の国際承認に関するブダペスト条約に基づく微生物株の寄託を目的とした国際寄託機関であり、所在地は、米国バージニア州マナッサス（ジップコード10110）、ユニバーシティブルーバード10801、ATCC特許寄託機関（ATCC Patent Depository）である。

## 【0275】

式（I）の化合物および本発明の組成物と組み合わせることができる生物学的防除剤の例は以下のものである：

（A）下記群から選択される抗菌剤：

（A1）例えば以下の細菌：（A1.1）枯草菌（*Bacillus subtilis*）、特に、QST713/AQ713株（バイエル クロップサイエンス（Bayer Crop Science）社（米国）からSERENADE OPTIまたはSERENADE ASOとして入手可能、NRRL受託番号B21661、米国特許第6,060,051号）；（A1.2）パチルス属（*Bacillus*）種、特に、D747株（DOUBLE NICKEL（登録商標）として入手可能）、受託番号FERM BP-8234、米国特許第7,094,592号；（A1.3）パチルス・プミルス（*Bacillus pumilus*）、特に、BUF-33株、NRRL受託番号50185（BASFのCARTISSA（登録商標）製品の一部として入手可能、EPA登録番号71840-19）；（A1.4）パチルス・アミロリクエファシエンス（変種）（*Bacillus subtilis* var. *amyloliquefaciens*）FZB24株、受託番号DSM 10271（Novozymes社からTAEGRO（登録商標）またはTAEGRO（登録商標）ECOとして入手可能（EPA登録番号70127-5））；（A1.5）パエニパチルス属（*Paenibacillus*）種株、受託番号NRRL B-50972または受託番号NRRL B-67129、国際公開第2016/154297号；（A1.6）枯草菌（*Bacillus subtilis*）BU1814株（BASF SE社からVELONDIS（登録商標）PLUS、VELONDIS（登録商標）FLEX、およびVELONDIS（登録商標）EXTRAとして入手可能）；（A1.7）パチルス・モジャベンシス（*Bacillus mojavensis*）R3B株（受託番号NCAIM（P）B001389）（国際公開第2013/034938号）、三井物産子会社のCertis USA社；（A1.8）枯草菌（*Bacillus subtilis*）CX-9060、三井物産子会社のCertis USA社；（A1.9）パエニパチルス・ポリミクサ（*Paenibacillus polymyxa*）、特に、AC-1株（例えば、Green Biotech Company社のTOPSEED（登録商標））；（A1.10）シュードモナス・プロラジキス（*Pseudomonas proradix*）（例えば、Sourcon Padena社のPRORADIX（登録商標））；（A1.11）パントエア・アグロメランズ（*Pantoea agglomerans*）、特にE325株（受託番号NRRL B-21856）（Northwest Agri ProductsからBLOOMTIME BIOLOGICAL（商標）FD BIOPESTICIDEとして入手可能）；並びに

（A2）例えば以下の真菌：（A2.1）アウレオバシジウム プルランス（*Aureobasidium pullulans*）、特に、DSM14940株の出芽胞子、DSM 14941株の出芽胞子、またはDSM14940株およびDSM14941株の出芽胞子の混合物（例えば、スイスのbio-ferm社のBOTECTOR（登録商標）およびBLOSSOM PROTECT（登録商標））；（A2.2）シュードザイマ・アフィディス（*Pseudozyma aphidis*）（エルサレムのヘブライ大学（Hebrew University）のイッスム研究開発会社（Yissum Research Development Company）により国際公開第2011/151819号に開示）；（A2.3）サッカロマイセス・セレビシエ（*Sacchar*

10

20

30

40

50

omyces cerevisiae) の特定の種であるフランスの Lesaffre et Compagnie 社の CNCM 番号 I - 3936、CNCM 番号 I - 3937、CNCM 番号 I - 3938、または CNCM 番号 I - 3939 (国際公開第 2010/086790 号) ;

(B) 下記群から選択される生物殺真菌剤 :

(B1) 例えば以下の細菌 : (B1.1) 枯草菌 (*Bacillus subtilis*)、特に、QST713/AQ713 株 (バイエル クロップサイエンス (Bayer Crop Science) 社 (米国) から SERENADE OPTI または SERENADE ASO として入手可能、NRRL 受託番号 B21661、および米国特許第 6,060,051 号に記載) ; (B1.2) パチルス・プミルス (*Bacillus pumilus*)、特に、QST2808 株 (米国の Bayer Crop Science 社から SONATA (登録商標) として入手可能、受託番号 NRRL B - 30087、および米国特許第 6,245,551 号に記載) ; (B1.3) パチルス・プミルス (*Bacillus pumilus*)、特に、GB34 株 (ドイツの Bayer 社から Yield Shield (登録商標) として入手可能) ; (B1.4) パチルス・プミルス (*Bacillus pumilus*)、特に、BUF - 33 株、NRRL 受託番号 50185 (BASF 社から CARTISSA 製品として入手可能、EPA 登録番号 71840-19) ; (B1.5) パチルス・アミロリクエファシエンス (*Bacillus amyloliquefaciens*)、特に、D747 株 (クマイ化学工業社から Double Nickel (商標) として入手可能、受託番号 FERM BP - 8234、米国特許第 7,094,592 号) ; (B1.6) 枯草菌 (*Bacillus subtilis*) Y1336 (台湾の Bion-Tech 社から BIOBAC (登録商標) WP として入手可能、台湾で登録番号 4764、5454、5096、および 5277 の生物殺真菌剤として登録) ; (B1.7) 枯草菌 (*Bacillus subtilis*) MBI 600 株 (BASF SE 社から SUBTILEX として入手可能)、受託番号 NRRL B - 50595、米国特許第 5,061,495 号 ; (B1.8) 枯草菌 (*Bacillus subtilis*) GB03 株 (ドイツの Bayer 社から Kodiak (登録商標) として入手可能) ; (B1.9) パチルス・アミロリクエファシエンス (変種) (*Bacillus subtilis* var. *amyloliquefaciens*) FZB24 株、受託番号 DSM 10271 (Novozymes 社から TAE GRO (登録商標) または TAE GRO (登録商標) ECO として入手可能 (EPA 登録番号 70127-5)) ; (B1.10) パチルス・マイコイデス (*Bacillus mycoides*) J 単離株、受託番号 B - 30890 (三井物産子会社の Certis USA 社から BMJ TGA I (登録商標) または WG および Life Guard (商標) として入手可能) ; (B1.11) パチルス・リケニフォルミス (*Bacillus licheniformis*)、特に SB3086 株、受託番号 ATCC 55406、国際公開第 2003/000051 号 (Novozymes 社から ECOGUARD (登録商標) Biofungicide および GREEN RELEAF (商標) として入手可能) ; (B1.12) パエニパチルス属 (*Paenibacillus*) 種株、受託番号 NRRL B - 50972 または受託番号 NRRL B - 67129、国際公開第 2016/154297 号 ; (B1.13) 枯草菌 (*Bacillus subtilis*) BU1814 株 (BASF SE 社から VELONDIS (登録商標) PLUS、VELONDIS (登録商標) FLEX、および VELONDIS (登録商標) EXTRA として入手可能) ; (B1.14) 枯草菌 (*Bacillus subtilis*) CX - 9060、三井物産子会社の Certis USA 社 ; (B1.15) パチルス・アミロリクエファシエンス (*Bacillus amyloliquefaciens*) F727 株 (MBI 110 株としても公知) (NRRL 受託番号 B - 50768、国際公開第 2014/028521 号) (Marrone Bio Innovations 社の STAR GUS (登録商標)) ; (B1.16) パチルス・アミロリクエファシエンス (*Bacillus amyloliquefaciens*) FZB42 社、受託番号 DSM 23

117 (ドイツの ABITEP 社から RHIZOVITAL (登録商標) として入手可能); (B1.17) パチルス・リケニフォルミス (*Bacillus licheniformis*) FMCH001 および 枯草菌 (*Bacillus subtilis*) FMCH002 (FMC Corporation の QUARTZO (登録商標) (WG) および PRESENCE (登録商標)); (B1.18) パチルス・モジャベンシス (*Bacillus mojavensis*) R3B 株 (受託番号 NCAIM (P) B001389) (国際公開第 2013/034938 号)、三井物産子会社の Certis USA 社; (B1.19) パエニパチルス・ポリミクサ (亜種) プラントルム (*Paenibacillus polymyxa* ssp. *plantarum*) (国際公開第 2016/020371 号)、BASF SE 社; (B1.20) パエニパチルス・エピフィ  
10 テイクス (*Paenibacillus epiphyticus*) (国際公開第 2016/020371 号)、BASF SE 社; (B.1.21) シュードモナス・クロロラフィス (*Pseudomonas chlororaphis*) AFS009 株、受託番号 NRRL B-50897、国際公開第 2017/019448 号、(例えば、米国の AgBiome Innovations 社の HOWLER (商標) および ZIO (登録商標)); (B1.22) シュードモナス・クロロラフィス (*Pseudomonas chlororaphis*)、特に、MA342 株 (例えば、Bioagri および Kopper  
20 t による CEDOMON (登録商標)、CERALL (登録商標)、および CEDRESS (登録商標)); (B1.23) ストレプトマイセス・ライディカス (*Streptomyces lydicus*) WYEC108 株 (ストレプトマイセス・ライ  
20 ディカス (*Streptomyces lydicus* WYCD108 US 株としても公知) (Novozymes 社の ACTINO-IRON (登録商標) および ACTINOVATE (登録商標)); (B1.24) アグロバクテリウム・ラディオバクター (*Agrobacterium radiobacter*) K84 株 (例えば、カナダの AgBioChem 社の GALLTROL-A (登録商標)); (B1.25) アグロバクテリ  
ウム・ラディオバクター (*Agrobacterium radiobacter*) K1026 株 (例えば、BASF SE 社の NOGALL (商標)); (B1.26) 枯草菌 (*Bacillus subtilis*) KTSB 株 (Donaghys 社の FOLIA  
30 CTIVE (登録商標)); (B1.27) 枯草菌 (*Bacillus subtilis*) IAB/BS03 (STK Bio-Ag Technologies 社の AVIV (商標)); (B1.28) 枯草菌 (*Bacillus subtilis*) Y1336 株 (台湾の Bion-Tech 社から BIOBAC (登録商標) WP として入手可能、台湾で登録番号 4764、5454、5096、および 5277 の生物殺真菌剤として登録  
); (B1.29) パチルス・アミロリクエファシエンス (*Bacillus amyloliquefaciens*) B246 単離株 (例えば、プレトリア大学 (University of Pretoria) の AVOGREEN (商標)); (B1.30) パ  
チルス・メチロトロフィカス (*Bacillus methylotrophicus*) BAC-9912 株 (中国科学院大学応用生態研究所 (Chinese Academy of Sciences' Institute of Applied Ecology  
40 )); (B1.31) シュードモナス・プロラジキス (*Pseudomonas pro-radix*) (例えば、Sourcon Padena 社の PRORADIX (登録商標)); (B1.32) ストレプトマイセス・グリセオビリディス (*Streptomyces griseoviridis*) K61 株 (ストレプトマイセス・ガルブス (*Streptomyces galbus*) K61 株としても公知) (受託番号 DSM 7206) (Verdera 社の MYCOSTOP (登録商標)、BioWorks 社の PREFENCE (登録商標)、Crop Protection 2006, 25, 468-475 を参照); (B1.33) シュードモナス・フルオレッセンス (*Pseudomonas fluorescens*) A506 株 (例えば、NuFarm 社による BLIGHTBAN (登録商標)); 並びに

(B2) 真菌、例えば以下のもの: (B2.1) コニオチリウム・ミニタンス (*Con* 50



*iothyrium minitans*, )、特に、CON/M/91-8株(受託番号 DSM-9660、例えば、Bayer CropScience Biologics GmbHのContans(登録商標)); (B2.2)メツシュニコウイア・フルクチャコラ(*Metschnikowia fructicola*)、特に、NRRL Y-30752株; (B2.3)ミクロスフェロプシス・オクラセア(*Microsphaeraopsis ochracea*); (B2.5)トリコデルマ・アトロビリデ(*Trichoderma atroviride*)、特に、SC1株(受託番号CBS 122089、国際公開第2009/116106号および米国特許第8,431,120(Bi-PA社))、77B株(Andermatt Biocontrol社のT77)またはLU132株(例えば、Sentinel from Agrimm Technologies社); (B2.6)トリコデルマ・ハルチアナム(*Trichoderma harzianum*)T-22株(例えば、Andermatt Biocontrol社またはKoppert社のTrianium-P)またはCepa Simb-T5株(Simbiose Agro社); (B2.14)グリオクラジウムロセウム(*Gliocladium roseum*)(クロノスタキス・ロゼア f.ロゼア(*Clonostachys rosea* f. *rosea*)としても公知)、特に、Adjuvants Plus社の321U株、Xue(Efficacy of Clonostachys rosea strain ACM941 and fungicide seed treatments for controlling the root rot complex of field pea, Can Jour Plant Sci 83(3): 519-524)に開示されているACM941株、またはIK726株(Jensen DF, et al. Development of a biocontrol agent for plant disease control with special emphasis on the near commercial fungal antagonist Clonostachys rosea strain 'IK726'; Australas Plant Pathol. 2007; 36:95-101); (B2.35)タラロマイセス・フラバス(*Talaromyces flavus*)V117b株; (B2.36)トリコデルマ・ビリデ(*Trichoderma viride*)、特に、B35株(Pietr et al., 1993, Zesz. Nauk. A R w Szczecinie 161: 125-137); (B2.37)トリコデルマ・アスペレルム(*Trichoderma asperellum*)、特に、SKT-1株、受託番号FERM P-16510(例えば、クミアイ化学工業社のECO-HOPE(登録商標))、T34株(例えば、スペインのBiocontrol Technologies社のT34 Biocontrol)、またはIsagro社のICC 012株; (B2.38)トリコデルマ・アトロビリデ(*Trichoderma atroviride*)CNCM I-1237株(例えば、フランスのAgrauxine社のEsquive(登録商標)WP); (B2.39)トリコデルマ・アトロビリデ(*Trichoderma atroviride*)株番号V08/002387; (B2.40)トリコデルマ・アトロビリデ(*Trichoderma atroviride*)NMI株V08/002388; (B2.41)トリコデルマ・アトロビリデ(*Trichoderma atroviride*)NMI株V08/002389; (B2.42)トリコデルマ・アトロビリデ(*Trichoderma atroviride*)NMI株V08/002390; (B2.43)トリコデルマ・アトロビリデ(*Trichoderma atroviride*)LC52株(例えば、Agrimm Technologies社のTenet); (B2.44)トリコデルマ・アトロビリデ(*Trichoderma atroviride*)ATCC株20476(IMI 206040); (B2.45)トリコデルマ・アトロビリデ(*Trichoderma atroviride*)T11株(IMI352941/CECT20498); (B2.46)トリコデルマ・ハマトム(*Trichoderma hamatum*); (B2.47)トリコデルマ・ハルジアナム(*Trich*

oderma harzianum); (B2.48) トリコデルマ・ハルジアナム (Trichoderma harzianum rifai T39) (例えば、米国のMakhteshimのTrichodex (登録商標)); (B2.49) トリコデルマ・アスペレルム (Trichoderma asperellum)、特に、kd株 (例えば、Andermatt Biocontrol社のT-Gro); (B2.50) トリコデルマ・ハルジアナム (Trichoderma harzianum ITEM908株 (例えば、Koppert社のTrianium-P); (B2.51) トリコデルマ・ハルジアナム (Trichoderma harzianum) TH35株 (例えば、Mycontrol社のRoot-Pro); (B2.52) トリコデルマ・ビレンス (Trichoderma virens) (グリオクラジウム・ビレンス (Gliocladium virens) としても公知)、特に、GL-21社 (例えば、米国のCerti社のSoilGard); (B2.53) トリコデルマ・ピリデ (Trichoderma viride) TV1株 (例えば、Koppert社のTrianium-P); (B2.54) アンペロマイセス・クイスクアリス (Ampelomyces quisqualis)、特に、AQ 10株 (例えば、イタリアのIntrachemBioのAQ 10 (登録商標)); (B2.56) アウレオバシジウム・プルランス (Aureobasidium pullulans)、特に、DSM14940株の出芽胞子; (B2.57) アウレオバシジウム・プルランス (Aureobasidium pullulans)、特に、DSM 14941株の出芽胞子; (B2.58) アウレオバシジウム・プルランス (Aureobasidium pullulans)、特にDSM 14940株およびDSM 14941株の出芽胞子の混合物 (例えば、スイスのbio-ferm社のBotector (登録商標)); (B2.64) クラドスポリウム・クラドスポリオイデス (Cladosporium cladosporioides) H39株、受託番号CBS122244、米国特許出願公開第2010/0291039号 (Stichting Dienst Landbouwkundig Onderzoekによる); (B2.69) グリオクラジウム・カテヌラタム (Gliocladium catenulatum) (同義語: クロノスタキス・ロゼア f. カテヌラータ (Clonostachys rosea f. catenulate) J1446株 (例えば、LallemandによるPrestop (登録商標)); (B2.70) レカニシリウム・レカニ (Lecanicillium lecanii) (旧称: パーティシリウム・レカニ (Verticillium lecanii) として公知) コニディア (conidia) のKV01株 (例えば、Koppert社/Arysta社によるVertalec (登録商標)); (B2.71) ペニシリウム・バーミキュラタム (Penicillium vermiculatum); (B2.72) ピキア・アノマラ (Pichia anomala,) WRL-076株 (NRRL Y-30842)、米国特許第7,579,183号; (B2.75) トリコデルマ・アトロピリデ (Trichoderma atroviride) SKT-1株 (FERM P-16510)、日本公開特許公報特開11-253151(A)号; (B2.76) トリコデルマ・アトロピリデ (Trichoderma atroviride) SKT-2株 (FERM P-16511)、日本公開特許公報特開11-253151(A)号; (B2.77) トリコデルマ・アトロピリデ (Trichoderma atroviride) SKT-3株 (FERM P-17021)、日本公開特許公報特開11-253151(A)号; (B2.78) トリコデルマ・ガムシ (Trichoderma gamsii) (旧称: トリコデルマ・ピリデ (T. viride))、ICC080株 (IMICC 392151 CABI、例えば、AGROBIOSOL DE MEXICO社によるBioDerma); (B2.79) トリコデルマ・ハルジアナム (Trichoderma harzianum) DB 103株 (Dagut at Biolab社によりT-GRO (登録商標) 7456として入手可能); (B2.80) トリコデルマ・ポリスポラム (Trichoderma polysporum) IMI 206039株 (例えば、スウェーデンのBINAB Bio-Innovation ABによるB

inab TF WP); (B2.81)トリコデルマ・ストロマティウム (*Trichoderma stromaticum*)、受託番号Ts3550 (例えば、ブラジルのCEPLAC社によるTricovab); (B2.83)ウロクラディウム・オウデマンシ (*Ulocladium oudemansii*) U3株、受託番号NM 99/06216 (例えば、ニュージーランドのBotry-ZenによるBOTRY-ZEN (登録商標) およびBioWorks社のBOTRYSTOP (登録商標)); (B2.84)パーティシリウム・アルボ・アトムル (*Verticillium albo-atrum*) (旧称: パーティシリウム・ダリエ (*V. dahliae*))、WCS850株、受託番号WCS850、オランダ菌類培養中央局 (Central Bureau for Fungi Cultures) に寄託 (例えば、Tree Care Innovations社によるDUTCH TRIG (登録商標)); (B2.86)パーティシリウム・クラミドスポリウム (*Verticillium chlamydosporium*); (B2.87)トリコデルマ・アスペレルム (*Trichoderma asperellum*) ICC 012株 (トリコデルマ・ハルジアナム (*Trichoderma harzianum*) ICC012としても公知)、受託番号CABI CCIMI 392716、およびトリコデルマ・ガムシ (*Trichoderma gamsii*) (旧称: トリコデルマ・ガムシ (*T. viride*)) ICC 080種、受託番号IMI 392151 (例えば、Isagro USA社のBIO-TAM (商標) およびAgrobiosol de Mexico社のBIODERMA (登録商標) )の混合物; (B2.88)トリコデルマ・アスペレロイデス (*Trichoderma asperelloides*) JM41R (受託番号NRRL B-50759) (BASF SE社のTRICHO PLUS (登録商標)); (B2.89)アスペルギルス・フラバス (*Aspergillus flavus*) NRRL 21882株 (Syngenta社/ChemChina社のAFLA-GUARD (登録商標) としても公知の製品); (B2.90)ケトミウム・クプレウム (*Chaetomium cupreum*) (受託番号CABI 353812) (例えば、AgriLife社によるBIOKUPRUM (商標)); (B2.91) サッカロマイセス・セレビスエ (*Saccharomyces cerevisiae*)、特に、LASO2株 (Agro-Levures et Derive's社)、LAS117株の細胞壁 (Lesaffre社のCEREVISANE (登録商標)、BASF SE社のROMEO (登録商標)、フランスのLesaffre et Compagnie社のCNCM番号I-3936株、CNCM番号I-3937株、CNCM番号I-3938株、CNCM番号I-3939株 (国際公開第2010/086790号)); (B2.92)トリコデルマ・ビレンス (*Trichoderma viren*) G-41株、旧称: グリオクラジウム・ビレンス (*Gliocladium virens*) として公知 (受託番号ATCC 20906) (例えば、米国のBioWorksのROOTSHIELD (登録商標) PLUS WPおよびTURFSHIELD (登録商標) PLUS WP); (B2.93)トリコデルマ・ハマタム (*Trichoderma hamatum*)、受託番号ATCC 28012; (B2.94)アンペロマイセス・クイスクアリス (*Ampeomyces quisqualis*) AQ10株、受託番号CNCM I-807 (例えば、イタリアのIntrachemBio社のAQ 10 (登録商標)); (B2.95)フレビオプシス・ギガンテア (*Phlebiopsis gigantea*) VRA 1992株 (Danstar Ferment社のROTSSTOP (登録商標)); (B2.96)ペニシリウム・ステッキ (*Penicillium steckii*) (DSM 27859、国際公開第2015/067800号)、BASF SE社; (B2.97)ケトミウム・グロボスム (*Chaetomium globosum*) (Rivale社によるRIVADIOM (登録商標) として公知); (B2.98)クリプトコッカス・フラベッセンス (*Cryptococcus flavescens*) 3C株 (NRRL Y-50378); (B2.99)ダクティラリア・カンジダ (*Dactylaria candida*); (B2.100)ジロホスホラ・アロペクリ (*Dil*

ophosphora alopecuri) (TWIST FUNGUS (登録商標)として入手可能); (B2.101)フザリウム・オキシスポラム (Fusarium oxysporum) Fo47株 (Natural Plant ProtectionによりFUSACLEAN (登録商標)として入手可能); (B2.102)シュードザイマ・フロキュロサ (Pseudozyma flocculosa) PF-A22 UL株 (カナダのPlant Products社よりSPORODEX (登録商標)として入手可能); (B2.103)トリコデルマ・ガムシ (Trichoderma gamsii) (旧称:トリコデルマ・ビリデ (T. viride)), ICC 080株 (IMI CC 392151 CABI) (AGROBIOSOL DE MEXICO社よりBIODERMA (登録商標)として入手可能); (B2.104)トリコデルマ・フェータイル (Trichoderma fertile) (例えば、BASF社のTrichoPlus製品); (B2.105)ムスコドル・ロセウス (Muscodorr roseus)、特に、A3-5株 (受託番号NRRL 30548); (B2.106)シンプリシリウム・ラノソニベウム (Simplificillium lanosoniveum);

以下を含む本発明に係る化合物の組み合わせで組み合わせることができる植物の成長および/または植物の健康を改善する効果を有する生物学的防除剤:

(C1)パチルス・プミルス (Bacillus pumilus) からなる群から選択される細菌、特に、QST2808株 (受託番号:NRRL番号B-30087); 枯草菌 (Bacillus subtilis)、特に、QST713/AQ713株 (NRRL受託番号B-21661を有し米国特許第6,060,051号に記載されている、米国のBayer CropScience社からSERENADE (登録商標)OPTIまたはSERENADE (登録商標)として入手可能; 枯草菌 (Bacillus subtilis)、特に、AQ30002株 (受託番号NRRL B-50421を有し米国特許出願公開第13/330,576号に記載されている); 枯草菌 (Bacillus subtilis)、特に、AQ30004株 (およびNRRL B-50455、米国特許出願公開第13/330,576号に記載されている); シノリゾビウム・メリロティ (Sinorhizobium meliloti) NRG-185-1株 (Bayer CropScience社のNITRAGIN (登録商標)); 枯草菌 (Bacillus subtilis) BU1814株 (BASF SE社のTEQUALIS (登録商標)); 枯草菌 (Bacillus subtilis) rm303 (Biofilm Crop Protection社のRHIZOMAX (登録商標)); パチルス・アミロリケファシエンス (Bacillus amyloliquefaciens) pm414 (Biofilm Crop Protection社のLOLI-PEPTA (登録商標)); パチルス・ミコイデス (Bacillus mycooides) BT155 (NRRL番号B-50921)、パチルス・ミコイデス (Bacillus mycooides) EE118 (NRRL番号B-50918)、パチルス・ミコイデス (Bacillus mycooides) EE141 (NRRL番号B-50916)、パチルス・ミコイデス (Bacillus mycooides) BT46-3 (NRRL番号B-50922)、パチルス・セレウス (Bacillus cereus) ファミリーメンバーEE128 (NRRL番号B-50917)、パチルス・チューリングエンシス (Bacillus thuringiensis) BT013A (NRRL番号B-50924) (パチルス・チューリングエンシス (Bacillus thuringiensis) 4Q7としても公知)、パチルス・セレウス (Bacillus cereus) ファミリーメンバーEE349 (NRRL番号B-50928)、パチルス・アミロリケファシエンス (Bacillus amyloliquefaciens) SB3281 (ATCC番号PTA-7542、国際公開第2017/205258号)、パチルス・アミロリケファシエンス (Bacillus amyloliquefaciens) TJ1000 (Novozymes社からQUIKROOTS (登録商標)として入手可能); パチルス・ファーマス (Bacillus firmus)、特に、C

NMC I - 1582株(例えば、BASF SE社のVOTIVO(登録商標)); パチルス・プミルス(*Bacillus pumilus*)、特に、GB34株(例えば、ドイツのBayer Crop Science社のYIELD SHIELD(登録商標)); パチルス・アミロリケファシエンス(*Bacillus amyloliquefaciens*)、特に、IN937a株; パチルス・アミロリケファシエンス(*Bacillus amyloliquefaciens*)、特に、FZB42株(例えば、ドイツのABITEP社のRHI ZOVITAL(登録商標)); パチルス・アミロリケファシエンス(*Bacillus amyloliquefaciens*)BS27(受託番号NRRLB-5015); パチルス・リケニフォルミス(*Bacillus licheniformis*)FMCH001および枯草菌(*Bacillus subtilis*)FMCH002(FMC CorporationからQUARTZO(登録商標)(WG)およびPRESENCE(登録商標)として入手可能)の混合物; パチルス・セレウス(*Bacillus cereus*)、特に、BP01株(ATCC 55675、例えば、米国のArysta Lifescience社からのMEPICHLOR(登録商標)); 枯草菌(*Bacillus subtilis*)、特に、MBI600株(例えば、BASF SE社のSUBTILEX(登録商標)); ブラディリゾビウム・ジャポニカム(*Bradyrhizobium japonicum*) (例えば、Novozymes社のOPTIMIZE(登録商標)); メソリゾビウム・シセリ(*Mesorhizobium cicer*(例えば、BASF SE社のNODULATOR); リゾビウム・レグミノサラム(生物型)ビシアエ(*Rhizobium leguminosarium biovar viciae*) (例えば、BASF SE社のNODULATOR); デルフチア・アシドボランス(*Delftia acidovorans*)、特に、RAY209株(例えば、Brett Young Seeds社のBIOBOOST(登録商標)); ラクトパチルス属(*Lactobacillus*)種(例えば、LactopAFI社のLACTOPLANT(登録商標)); パエニパチルス・ポリミクサ(*Paenibacillus polymyxa*)、特に、AC-1株(例えば、Green Biotech Company社のTOPSEED(登録商標)); シュードモナス・プロラディックス(*Pseudomonas proradix*) (例えば、Sourcon Padena社のPRORADIX(登録商標)); アゾスピリルム・ブラジリエンス(*Azospirillum brasilense*) (例えば、KALO社のVIGOR(登録商標)); *Azospirillum lipoferum* (例えば、TerraMax社のVERTEX-IF(商標)); アゾトバクター・ヴィネランディ(*Azotobacter vinelandii*)およびクロストリジウム・パストゥリアヌム(*Clostridium pasteurianum*) (Agrinos社のINVIGORATE(登録商標)として入手可能)の混合物; 緑膿菌(*Pseudomonas aeruginosa*)、特に、PN1株; リゾビウム・レグミノサルム(*Rhizobium leguminosarum*)、特に、(生物型)ビシアエ(*bv. viciae*)Z25株(受託番号CECT 4585); アゾリゾビウム・カウリノダンス(*Azorhizobium caulinodans*)、特に、ZB-SK-5株; アゾトバクター・クロコッカム(*Azotobacter chroococcum*)、特に、H23株; アゾトバクター・ヴィネランディ(*Azotobacter vinelandii*)、特に、ATCC 12837株; パチルス・シアメンシス(*Bacillus siamensis*)、特に、KCTC 13613T株; パチルス・テキレンシス(*Bacillus tequilensis*)、特に、NII-0943株; セラチア・マルセッセンス(*Serratia marcescens*)、特に、SRM株(受託番号MTCC 8708); チオパチルス属(*Thiobacillus*)種(例えば、英国のCropaid社のCROPAID(登録商標)); 並びに

(C2) プルプレオシルリウム・リラシナム(*Purpureocillium lilacinum*) (旧称: パエシロミセス・リラシナス(*Paecilomyces l* 50

*ilacinus*)として公知)251株(AGAL 89/030550、例えば、Bayer CropScience Biologics GmbHのBioAct)、ペニシリウム・ビライ(*Penicillium bilaii*)ATCC 22348株(例えば、Acceleron BioAg社のJumpStart(登録商標))、およびタロマイセス・フラバス(*Talaromyces flavus*)V117b株からなる群から選択される真菌；トリコデルマ・アトロビリデ(*Trichoderma atroviride*)株CNCM I-1237(例えば、フランスのAgrauxine社のEsquive(登録商標)WP)；トリコデルマ・ビリデ(*Trichoderma viride*)、例えば、B35株(Pietret al., 1993, Zesz. Nauk. ARW Szczecinie 161: 125-137)；トリコデルマ・アトロビリデ(*Trichoderma atroviride*)LC52株(トリコデルマ・アトロビリデ(*Trichoderma atroviride*)LU132株としても公知、例えば、Agrimm Technologies社のSentinel)；トリコデルマ・アトロビリデ(*Trichoderma atroviride*)SC1株、国際出願第PCT/IT2008/000196号に記載；トリコデルマ・アスペレルム(*Trichoderma asperellum*)kd株(例えば、Andermatt Biocontrol社のT-Gro)；トリコデルマ・アスペレルム(*Trichoderma asperellum*)Eco-T株(南アフリカのPlant Health Products社)；トリコデルマ・ハルジアナム(*Trichoderma harzianum*)T-22株(例えば、Andermatt Biocontrol社またはKoppert社のTrianium-P)；ミロテシウム・ベルカリア(*Myrothecium verrucaria*)AARC-0255株(例えば、Valent BiosciencesのDiTera(商標))；ペニシリウム・ビライ(*Penicillium bilaii*)ATCC ATCC20851株；ピシウム・オリガンDRAM(*Pythium oligandrum*)M1株(ATCC 38472、例えば、チェコ共和国のBiopreparaty社のPolyversum)；トリコデルマ・ビレンス(*Trichoderma virens*)GL-21株(例えば、米国のCertis社のSoilGuard(登録商標))；バーティシリウム・アルボ・アトムル(*Verticillium albo-atrum*)(旧称：*V. dahliae*(*V. dahliae*))WCS850株(CBS 276.92、例えば、Tree Care Innovations社のDutch Trig)；トリコデルマ・アトロビリデ(*Trichoderma atroviride*)、特に、V08/002387株、NMI番号V08/002388株、NMI番号V08/002389株、NMI番号V08/002390株；トリコデルマ・ハルジアナム(*Trichoderma harzianum*)ITEM 908株；トリコデルマ・ハルジアナム(*Trichoderma harzianum*)TSTh20株；トリコデルマ・ハルジアナム(*Trichoderma harzianum*)1295-22株；ピシウム・オリガンDRAM(*Pythium oligandrum*)DV74株；リゾポゴン・アミロポゴン(*Rhizopogon amylopogon*)(例えば、Helena Chemical Company社のMycosolに含まれる)；リゾポゴン・フルビグレバ(*Rhizopogon fulvigleba*)(例えば、Helena Chemical Company社のMycosolに含まれる)；並びにトリコデルマ・ビレンス(*Trichoderma virens*)GI-3株；

下記から選択される殺虫活性生物防除剤：

(D1)以下からなる群から選択される細菌：バチルス・チューリングエンシス(亜種)アイザワイ(*Bacillus thuringiensis* subsp. aizawai)、特に、ABTS-1857株(SD-1372、例えば、Valent Biosciences社のXENTARI(登録商標))；バチルス・ミコイデス(*Bacillus mycoides*)、J単離株(例えば、三井物産子会社のCertis

USA社のBmJ) ; パチルス・スフェリカス (*Bacillus sphaericus*)、特に、セロタイプH5a5b、2362株 (ABTS-1743株) (例えば、米国のValent BioSciences社のVECTOLEX (登録商標)) ; パチルス・チューリングエンシス (亜種) クルスターキ (*Bacillus thuringiensis subsp. kurstaki*) BMP 123株、イスラエルのBecker Microbial Products社 ; パチルス・チューリングエンシス (亜種) アイザワイ (*Bacillus thuringiensis subsp. aizawai*)、特に、セロタイプH-7 (例えば、米国のValent BioSciences社のFLORBAC (登録商標)) ; パチルス・チューリングエンシス (亜種) クルスターキ (*Bacillus thuringiensis subsp. kurstaki*) HD-1株 (例えば、米国のValent BioSciences社のDIPEL (登録商標)) ; パチルス・チューリングエンシス (亜種) クルスターキ (*Bacillus thuringiensis subsp. kurstaki*) BMP 123株、イスラエルのBecker Microbial Products社 ; パチルス・チューリングエンシス (亜種) イスラエレンシス (*Bacillus thuringiensis israelensis*) BMP 144株 (例えば、イスラエルのBecker Microbial Products社によるAQUABAC (登録商標)) ; バークホルデリア属 (*Burkholderia*) 種、特に、バークホルデリア・リノジェンシス (*Burkholderia rinojensis*) A396株 (バークホルデリア・リノジェンシス (*Burkholderia rinojensis*) MBI株としても公知) (受託番号NRRL B-50319、国際公開第2011/106491号および国際公開第2013/032693号、例えば、Marrone Bio Innovations社のMBI-206 TGA IおよびZELTO (登録商標)) ; クロモバクテリウム・サブツガエ (*Chromobacterium subtsugae*)、特に、PRAA4-1T株 (MBI-203、例えば、Marrone Bio Innovations社のGRANDEVO (登録商標)) ; パエニバチルス・ポピリアエ (*Paenibacillus popilliae*) (旧称 : パチルス・ポピリアエ (*Bacillus popilliae*))、例えば、St. Gabriel Laboratories社のMILKY SPORE POWDER (商標) およびMILKY SPORE GRANULAR (商標)) ; パチルス・チューリングエンシス (亜種) イスラエレンシス (*Bacillus thuringiensis subsp. israelensis*) (セロタイプH-14) AM65-52株 (受託番号ATCC 1276) (例えば、米国のValent BioScience社のVECTOBAC (登録商標)) ; パチルス・チューリングエンシス (変種) クルスターキ (*Bacillus thuringiensis var. kurstaki*) EVB-113-19株 (例えば、AEF Global社のBIOPROTEC (登録商標)) ; パチルス・チューリングエンシス (亜種) テネブリオニス (*Bacillus thuringiensis subsp. tenebrionis*) NB 176株 (SD-5428、例えば、ドイツのBioFa社のNOVODOR (登録商標)) ; パチルス・チューリングエンシス (変種) ヤポネンシス (*Bacillus thuringiensis var. japonensis*) Buibui株 ; パチルス・チューリングエンシス (亜種) クルスターキ *Bacillus thuringiensis subsp. kurstaki*) ABTS 351株 ; パチルス・チューリングエンシス (亜種) クルスターキ (*Bacillus thuringiensis subsp. kurstaki*) PB 54株 ; パチルス・チューリングエンシス (亜種) クルスターキ (*Bacillus thuringiensis subsp. kurstaki*) SA 11株 ; パチルス・チューリングエンシス (亜種) クルスターキ (*Bacillus thuringiensis subsp. kurstaki*) SA 12株 ; パチルス・チューリングエンシス (亜種) クルスターキ (*Bacillus thuringiensis subsp. kurstaki*) EG 2348株 ; パチ

ルス・チューリングエンシス(変種)コルメリ(*Bacillus thuringiensis* var. *Colmeri*) (例えば、Changzhou Jianghai Chemical Factory社によるTIANBAOBTC); パチルス・チューリングエンシス(亜種)アイザワイ(*Bacillus thuringiensis* subsp. *aizawai*) GC-91株; セラチア・エントモフィラ(*Serratia entomophila*) (例えば、Wrightson Seeds社によるINVADE(登録商標)); セラチア・マルセッセンス(*Serratia marcescens*)、特に、SRM株(受託番号MTCC 8708); およびボルバキア・ピピエンティス(*Wolbachia pipientis*) ZAP株(例えば、MosquitoMate社のZAP MALES(登録商標)); 並びに

(D2) 以下からなる群から選択される真菌: イサリア・フモソロセア(*Isaria fumosorosea*) (旧称: ペシロマイセス・フモソロセウス(*Paecilomyces fumosoroseus*)として公知) apopka 97株; ボーベリア・バッシアーナ(*Beauveria bassiana*) ATCC 74040株(例えば、イタリアのIntrachem Bio社のNATURALIS(登録商標)); ボーベリア・バッシアーナ(*Beauveria bassiana*) GHA株(受託番号ATCC74250、例えば、Laverlam International CorporationのBOTANIGUARD(登録商標)ESおよびMYCONTROL-O(登録商標)); ズーフトラ・ラディカンス(*Zoopthora radicans*); メタリジウム・ロベルツイ(*Metarhizium robertsii*) 15013-1(NRRL受託番号67073で寄託)、メタリジウム・ロベルツイ(*Metarhizium robertsii*) 23013-3(NRRL受託番号67075で寄託)、およびメタリジウム・アニソプリエ(*Metarhizium anisopliae*) 3213-1(NRRL受託番号67074で寄託)(国際公開第2017/066094、Pioneer Hi-Bred International社); ボーベリア・バッシアーナ(*Beauveria bassiana*) ATP02株(受託番号DSM 24665); ボーベリア・バッシアーナ(*Beauveria bassiana*) ATP02株(受託番号DSM 24665)。これらの中で、イサリア・フモソロセア(*Isaria fumosorosea*) (旧称: ペシロマイセス・フモソロセウス(*Paecilomyces fumosoroseus*)として公知) apopka 97株が特に好ましい。

(E) 以下からなる群から選択されるウイルス: アドクソフィエス・オラナ(*Adoxophyes orana*) (サマーフルーツトルトリックス) 顆粒病ウイルス(GV)、シディア・ポモネラ(*Cydia pomonella*) (コドリングア) 顆粒病ウイルス(GV)、ヘリコベルパ・アルミゲラ(*Helicoverpa armigera*) (アメリカタバコガの幼虫) 核多角体病ウイルス(NPV)、スポドプテラ・エクシグア(*Spodoptera exigua*) (シロイチモンジヨトウ)mNPV、スポドプテラ・フルギベルダ(*Spodoptera frugiperda*) (アワヨトウの幼虫の幼虫)mNPV、およびスポドプテラ・リトラリス(*Spodoptera litoralis*) (アフリカ綿葉虫) NPV;

(F) 植物または植物の部分または植物の器官に「接種材料」として加えることができ、それらの特定の特性により、植物の成長および植物の健康を促進する細菌および真菌。以下に例を挙げる: アグロバクテリウム属(*Agrobacterium*)種、アゾリゾビウム・カウリノダンス(*Azorhizobium caulinodans*)、アゾリゾビウム属(*Azospirillum*)種、アゾトバクター属(*Azotobacter*)種、ブラディリゾビウム属(*Bradyrhizobium*)種、バークホルデリア属(*Burkholderia*)種、特に、バークホルデリア・セパシア(*Burkholderia cepacia*) (旧称: シュードモナス・セパシア(*Pseudomonas cepacia*)として公知)、ギガスポラ属(*Gigaspora*)種またはギガスポラ・モノスポラム(*Gigaspora monosporum*)、グロムス

10

20

30

40

50



属 (*Glomus*) 種、ラッカリア属 (*Laccaria*) 種、ラクトバチルス・ブフネリ (*Lactobacillus buchneri*)、パラグロムス属 (*Paraglomus*) 種、ピソリサス・ティンクトリアス (*Pisolithus tinctorius*)、シュードモナス属 (*Pseudomonas*) 種、リゾビウム属 (*Rhizobium*) 種、特に、リゾビウム・トリフォリイ (*Rhizobium trifolii*)、シヨウロ属 (*Rhizopogon*) 種、スクレロデルマ属 (*Scleroderma*) 種、ヌメリイグチ属 (*Suillus*) 種、およびストレプトマイセス属 (*Streptomyces*) 種；並びに

(G) 生物学的防除剤として使用できる、タンパク質および二次代謝産物を含む微生物によって形成される植物抽出物および生成物、例えば、アリウム・サティバム (*Allium sativum*)、アルテミシア・アブシンチウム (*Artemisia absinthium*)、アザジラクチン、Biokeeper WP、カシア・ニグリカン (*Cassia nigricans*)、セラストラス・アングラタス (*Celastrus angulatus*)、ケノポディウム・アンテルミンティウム (*Chenopodium anthelminticum*)、キチン (chitin)、ARMOUR-Zen (登録商標)、ドリオプテリス・フィリックスマス (*Dryopteris filix-mas*)、スギナ (*Equisetum arvense*)、Fortune Aza、Fungastop、Heads Up (アカザキノア (*Chenopodium quinoa*) サポニン抽出物)、除虫菊 (ピレトラム/ピレスリン)、カシア・アマラ (*Quassia amara*)、コナラ属 (*Quercus*)、キラヤ (*Quillaja*)、レガリア (*Regalia*)、「Requiem (商標) 殺虫剤」、ロテノン、リアニア/リアノジン、シンファイタム・オフィシナーレ (*Symphytum officinale*)、タナセタム・ブルガレ (*Tanacetum vulgare*)、チモール、TRIACT (登録商標) 70、TriCon、トロペオラム・マジュス (*Tropaeolum majus*)、ウルティカ・ディオイカ (*Urtica dioica*)、Veratrin、ビスカム・アルバム (*Viscum album*)、アブラナ科 (*Brassicaceae*) 抽出物、特に、ナタネパウダーまたはマスタードパウダー、並びに オリーブオイルから得られる生物殺虫・殺ダニ活性物質、特に、有効成分として炭素鎖長  $C_{16} - C_{20}$  を有する不飽和脂肪酸/カルボン酸、例えば、商品名 FLIPPER (登録商標) の製品に含まれているものなど。

#### 【0276】

式 (I) の化合物および本発明の組成物は、殺虫剤、殺ダニ剤、および殺線虫剤から選択される 1 または複数の有効成分と組み合わせることができる。

#### 【0277】

「殺虫剤」および「殺虫性」という用語は、物質が昆虫の死亡率を高めたり、または成長率を阻害したりする能力を指す。本明細書で使用される「昆虫」という用語は、「昆虫」綱の全ての生物を含む。

#### 【0278】

「殺線虫剤」および「殺線虫性」は、物質が線虫の死亡率を増加させたり、または成長速度を阻害する能力を指す。概して、「線虫」という用語は、前記生物の卵、幼虫、幼体、および成熟形態を含む。

#### 【0279】

「殺ダニ剤」および「殺ダニ性」とは、クモ綱、ダニ亜綱に属する外部寄生生物の死亡率を増加させたり、または成長率を阻害する物質の能力を指す。

#### 【0280】

式 (I) の化合物および本発明の組成物と混合することができる殺虫剤、殺ダニ剤、および殺線虫剤の例はそれぞれ以下である：

(1) アセチルコリンエステラーゼ (ACHE) 阻害剤、例えば、カーバメート系、例えばアラニカルブ、アルジカルブ、ベンジオカルブ、ペンフラカルブ、プトカルボキシム、プトキシカルボキシム、カルパリル、カルボフラン、カルボスルファン、エチオフェン

カルブ、フェノブカルブ、ホルメタネート、フラチオカルブ、イソプロカルブ、メチオカルブ、メソミル、メトルカルブ、オキサミル、ピリミカーブ、プロポキスル、チオジカルブ、チオファノクス、トリアザメート、トリメタカルブ、XMC、およびキシリルカルブなど；または有機リン酸塩、例えば、アセフェート、アザメチホス、アジンホスエチル、アジンホスメチル、カズサホス、クロレトキシホス、クロルフェンピンホス、クロルメホス、クロルピリホスメチル、クマホス、シアノホス、ジメトン-S-メチル、ダイアジノン、ジクロルボス/DDVP、ジクロトホス、ジメトエート、ジメチルピンホス、ジスルホトン、EPN、エチオン、エトプロホス、ファンフル、フェナミホス、フェニトロチオン、フェンチオン、ホスチアゼート、ヘプテノホス、イミシアホス、イソフェンホス、イソプロピル-O-(メトキシアミノチオホスホリル)サリチラート、イソキサチオン、マラチオン、メカルバム、メタミドホス、メチダチオン、メピンホス、モノクロトホス、ナレド、オメトエート、オキシジメトンメチル、パラチオンメチル、フェントエート、ホレート、ホサロン、ホスメット、ホスファミドン、ホキシム、ピリミホスメチル、プロフェノホス、プロピタムホス、プロチオホス、ピラクロホス、ピリダフェンチオン、キナルホス、スルホテップ、テブピリムホス、テメホス、テルブホス、テトラクロルピンホス、チオメトン、トリアゾホス、トリクロルホン、およびバミドチオンなど。

10

## 【0281】

(2) GABA 開閉型塩化物チャネルブロッカー、例えば、クロルデンおよびエンドスルファンなどの環状ジエン有機塩素系化合物、またはエチプロールおよびフィプロニルなどのフェニルピラゾール系(フィプロール系)。

20

## 【0282】

(3) ナトリウムチャネルモジュレーター、例えば、ピレスロイド系、例えば、アクリナトリン、アレスリン、d-シス-トランスアレスリン、d-トランスアレスリン、ピフェントリン、ピオアレスリン、ピオアレスリンs-シクロペンテニル異性体、ピオレスメトリン、シクロプロトリン、シフルトリン、シフルトリン、シハロトリン、シハロトリン、シハロトリン、シベルメトリン、シベルメトリン、シベルメトリン、シフェノトリン[(1R)-トランス-異性体]、デルタメトリン、エンペントリン[(EZ)-(1R)-異性体]、エスフェンバレレート、エトフェンプロックス、フェンプロパトリン、フェンバレレート、フルシトリネート、フルメトリン、フルバリネート、ハルフェンプロックス、イミプロトリン、カデスリン、モンフルオロトリン、ベルメトリン、フェノトリン[(1R)-トランス-異性体]、プラレトリン、ピレトリン(除虫菊)、レスメトリン、シラフルオフエン、テフルトリン、テトラメスリン、テトラメスリン[(1R)-異性体]、トラロメトリン、およびトランスフルトリン、またはDDT、またはメトキシクロルなど。

30

## 【0283】

(4) ニコチン性アセチルコリン受容体(nAChR)競合的モジュレーター、例えば、ネオニコチノイド系、例えば、アセタミプリド、クロチアニジン、ジノテフラン、イミダクロプリド、ニテンピラム、チアクロプリド、およびチアメトキサム、またはニコチン、またはスルホキサフロール、またはフルピラジフロン。

## 【0284】

(5) ニコチン性アセチルコリン受容体(nAChR)アロステリックモジュレーター、例えば、スピノシン系、例えばスピネトラムおよびスピノサド。

40

## 【0285】

(6) グルタミン酸開閉型塩化物チャネル(GluCl)アロステリックモジュレーター、例えばアベルメクチン系/ミルベマイシン系、例えばアバメクチン、エマメクチン安息香酸塩、レピメクチン、およびミルベメクチンなど。

## 【0286】

(7) 幼若ホルモン類似剤、例えば、幼若ホルモン類縁体、例えば、ヒドロプレン、キノプレン、およびメトプレン、またはフェノキシカルブ、またはピリプロキシフェン。

## 【0287】

50

(8) その他の非特異的(マルチサイト)阻害剤、例えばハロゲン化アルキル類、例えば、臭化メチルおよびその他のハロゲン化アルキル類、またはクロロピクリン、またはフッ化スルフルル、またはホウ砂、または吐酒石、またはイソシアン酸メチル発生剤、例えば、ジアゾメットおよびメタム。

【0288】

(9) 例えば、ピメトロジンまたはフロニカミドなどの弦音器官のモジュレーター。

【0289】

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

【0290】

(11) Microbial disruptors of the insect gut membrane, such as, for example *Bacillus thuringiensis* subspecies *israelensis*, *Bacillus sphaericus*, *Bacillus thuringiensis* subspecies *aizawai*, *Bacillus thuringiensis* subspecies *kurstaki*, *Bacillus thuringiensis* subspecies *tenebrionis*, and *B. t.* plant proteins: Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1Fa, Cry1A.105, Cry2Ab, Vip3A, mCry3A, Cry3Ab, Cry3Bb, Cry34Ab1/35Ab1.

【0291】

(12) ミトコンドリアATP合成酵素阻害剤、例えば、ジアフェンチウロンなどのATP破壊剤、または有機スズ化合物、例えば、アゾシクロチン、シヘキサチン、および酸化フェンブタスズ、またはプロパルギット、またはテトラジホン。

【0292】

(13) プロトン勾配の破壊による酸化的リン酸化脱共役剤、例えば、クロルフェナピル、DNOC、およびスルフルラミドなど。

【0293】

(14) ニコチン性アセチルコリン受容体チャネルブロッカー、例えば、ベンスルタップ、カルタップ塩酸塩、チオシクラム、およびチオスルタップナトリウム塩など。

【0294】

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

【0295】

(16) キチン生合成阻害剤、タイプ1、例えばプロロフェジン。

【0296】

(17) 脱皮攪乱剤(特に双翅目、すなわち双翅類)、例えば、シロマジン。

【0297】

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

【0298】

(19) オクトパミン受容体アゴニスト、例えば、アミトラズ。

【0299】

(20) ミトコンドリア電子伝達系複合体III阻害剤、例えば、ヒドラメチルノン、アセキノシル、またはフルアクリピリムなど。

【0300】

(21) ミトコンドリア電子伝達系複合体I阻害剤、例えば、METI殺ダニ剤の群からのもの、例えば、フェナザキン、フェンピロキシメート、ピリミジフェン、ピリダベン

10

20

30

40

50

、テブフェンピラド、およびトルフェンピラド、またはロテノン（デリス）。

【0301】

（22）電位依存性ナトリウムチャンネルブロッカー、例えば、インドキサカルブまたはメタフルミゾンなど。

【0302】

（23）アセチルCoAカルボキシラーゼ阻害剤、例えば、テトロン酸およびテトラミン酸誘導体、例えば、スピロジクロフェン、スピロメシフェン、スピロテトラマト。

【0303】

（24）ミトコンドリア電子伝達系複合体IV阻害剤、例えば、ホスフィン系、例えば、リン化アルミニウム、リン化カルシウム、ホスフィン、およびリン化亜鉛、またはシアン化物、例えば、シアン化カルシウム、シアン化カリウム、およびシアン化ナトリウム。

10

【0304】

（25）ミトコンドリア電子伝達系複合体II阻害剤、例えば、 $\alpha$ -ケトニトリル誘導体、シエノピラフェンおよびシフルメトフェンなど、およびカルボキサニリド、例えばピフルブミドなど。

【0305】

（28）リアノジン受容体モジュレーター、例えば、ジアミド系、例えば、クロラントラニリプロール、シアントラニリプロール、およびフルベンジアミド、

さらなる活性化化合物、例えば、アフィドピロベン（Afidopyropen）、アフォキサネル（Afoxolaner）、アザディラクチン（Azadirachtin）、ベンクロチアズ（Benclothiaz）、ベンゾキシメート（Benzoximate）、ピフェナゼート（Bifenazate）、プロフラニリド（Broflanilide）、ブromoプロピレート（Bromopropylate）、キノメチオネート（Chinomethionat）、クロロプラレスリン（Chloroprallethrin）、氷晶石（Cryolite）、シクラニリプロール（Cyclaniliprole）、シクロキサプリド（Cycloxyaprid）、シハロジアミド（Cyhalodiamide）、ジクロロメゾチアズ（Dichloromezotiaz）、ジコホール（Dicofol）、 $\alpha$ -メトフルトリン（ $\alpha$ -Metofluthrin）、 $\epsilon$ -モンフルトリン（ $\epsilon$ -Momfluthrin）、フロメトキン（Flometoquin）、フルアザインドリジン（Fluazaindolizine）、（Fluensulfone）、フルフェネリム（Flufenerim）、フルフェノキシストロビン（Flufenoxystrobin）、フルフィプロール（Flufiprole）、フルヘキサフォン（Fluhexafon）、フルオピラム（Fluopyram）、フルララネル（Fluralaner）、フルキサメタミド（Fluxametamide）、フフェノジド（Fufenozide）、グアジピル（Guadipyr）、ヘプタフルトリン（Heptafluthrin）、イミダクロチズ（Imidaclothiz）、イプロジオン（Iprodione）、 $\beta$ -ピフェントリン（ $\beta$ -Bifenthrin）、 $\gamma$ -テフルトリン（ $\gamma$ -Tefluthrin）、ロチラネル（Lotilaner）、メベルフルトリン（Meperfluthrin）、パイチョンディン（Paichongding）、ピリダリル（Pyridalyl）、ピリフルキナゾン（Pyrifluquinazon）、ピリミノストロビン（Pyriminostrobilin）、スピロジクロフェン（Spirobudiclofen）、テトラメチルフルトリン（Tetramethylfluthrin）、テトラニリプロール（Tetraniliprole）、テトラクロラントラニリプロール（Tetrachlorantraniliprole）、チゴラネル（Tigolaner）、チオキサザフェン（Thioxazafen）、チオフルオキシメート（Thiofluoximate）、トリフルメゾピリム（Triflumezopyrim）、およびヨードメタン、バチルス・フィルムス（*Bacillus firmus*）（I-1582, BioNem, Votivo）に基づくさらなる製剤など、並びに以下の化合物：1 - {2 - フルオロ - 4 - メチル - 5 - [(2, 2, 2 - トリフルオロエチル)スルフィニル]フェニ

20

30

40

50

ル} - 3 - (トリフルオロメチル) - 1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 5 - アミン (国際公開第 2006/043635 号から公知) (CAS 番号 885026-50-6)、  
 { 1' - [ (2E) - 3 - (4 - クロロフェニル) プロパ - 2 - エン - 1 - イル ] - 5 -  
 フルオロスピロ [ インドール - 3, 4' - ピペリジン ] - 1 (2H) - イル } (2 - クロ  
 ロピリジン - 4 - イル) メタノン (国際公開第 2003/106457 号から公知) (C  
 AS 番号 637360-23-7)、2 - クロロ - N - [ 2 - { 1 - [ (2E) - 3 - (4 - クロロフェニル) プロパ - 2 - エン - 1 - イル ] ピペリジン - 4 - イル } - 4 - (ト  
 リフルオロメチル) フェニル ] イソニコチンアミド (国際公開第 2006/003494  
 号から公知) (CAS 番号 872999-66-1)、3 - (4 - クロロ - 2, 6 - ジメ  
 チルフェニル) - 4 - ヒドロキシ - 8 - メトキシ - 1, 8 - ジアザスピロ [ 4.5 ] デカ 10  
 - 3 - エン - 2 - オン (国際公開第 2010052161 号から公知) (CAS 番号 12  
 25292-17-0)、3 - (4 - クロロ - 2, 6 - ジメチルフェニル) - 8 - メトキ  
 シ - 2 - オキソ - 1, 8 - ジアザスピロ [ 4.5 ] デカ - 3 - エン - 4 - イルエチルカー  
 ボネート (EP 2647626 号から公知) (CAS 番号 1440516-42-6)、  
 4 - (ブト - 2 - イン - 1 - イルオキシ) - 6 - (3, 5 - ジメチルピペリジン - 1 - イ  
 ル) - 5 - フルオロピリミジン (国際公開第 2004/099160 号から公知) (CA  
 S 番号 792914-58-0)、PF 1364 (日本公開特許公報特開 2010/01  
 8586 号から公知) (CAS 番号 1204776-60-2)、N - [ (2E) - 1 -  
 [ (6 - クロロピリジン - 3 - イル) メチル ] ピリジン - 2 (1H) - イリデン ] - 2,  
 2, 2 - トリフルオロアセトアミド (国際公開第 2012/029672 号から公知) ( 20  
 CAS 番号 1363400-41-2)、(3E) - 3 - [ 1 - [ (6 - クロロ - 3 - ピ  
 リジル) メチル ] - 2 - ピリジリデン ] - 1, 1, 1 - トリフルオロ - プロパン - 2 - オン  
 (国際公開第 2013/144213 号から公知) (CAS 番号 1461743-15  
 - 6)、N - [ 3 - (ベンジルカルバモイル) - 4 - クロロフェニル ] - 1 - メチル - 3  
 - (ペンタフルオロエチル) - 4 - (トリフルオロメチル) - 1H - ピラゾール - 5 - カ  
 ルボキサミド (国際公開第 2010/051926 号から公知) (CAS 番号 12268  
 89-14-0)、5 - プロモ - 4 - クロロ - N - [ 4 - クロロ - 2 - メチル - 6 - (メ  
 チルカルバモイル) フェニル ] - 2 - (3 - クロロ - 2 - ピリジル) ピラゾール - 3 - カ  
 ルボキサミド (中国特許出願公開第 103232431 号から公知) (CAS 番号 144  
 9220-44-3)、4 - [ 5 - (3, 5 - ジクロロフェニル) - 4, 5, - ジヒドロ 30  
 - 5 - (トリフルオロメチル) - 3 - イソキサゾリル ] - 2 - メチル - N - (シス - 1 -  
 オキシド - 3 - チェタニル) - ベンズアミド、4 - [ 5 - (3, 5 - ジクロロフェニル)  
 - 4, 5 - ジヒドロ - 5 - (トリフルオロメチル) - 3 - イソキサゾリル ] - 2 - メチル  
 - N - (トランス - 1 - オキシド - 3 - チェタニル) - ベンズアミドおよび 4 - [ (5S  
 ) - 5 - (3, 5 - ジクロロフェニル) - 4, 5 - ジヒドロ - 5 - (トリフルオロメチル)  
 ) - 3 - イソキサゾリル ] - 2 - メチル - N - (シス - 1 - オキシド - 3 - チェタニル)  
 ベンズアミド (国際公開第 2013/050317 (A1) 号から公知) (CAS 番号 1  
 332628-83-7)、N - [ 3 - クロロ - 1 - (3 - ピリジニル) - 1H - ピラゾ  
 ール - 4 - イル ] - N - エチル - 3 - [ (3, 3, 3 - トリフルオロプロピル) スルフィ  
 ニル ] - プロパンアミド、(+) - N - [ 3 - クロロ - 1 - (3 - ピリジニル) - 1H - 40  
 ピラゾール - 4 - イル ] - N - エチル - 3 - [ (3, 3, 3 - トリフルオロプロピル) ス  
 ルフィニル ] - プロパンアミド、および (-) - N - [ 3 - クロロ - 1 - (3 - ピリジニ  
 ル) - 1H - ピラゾール - 4 - イル ] - N - エチル - 3 - [ (3, 3, 3 - トリフルオロ  
 プロピル) スルフィニル ] - プロパンアミド (国際公開第 2013/162715 (A2  
 ) 号、国際公開第 2013/162716 (A2) 号、米国特許出願公開第 2014/0  
 213448 (A1) 号から公知) (CAS 番号 1477923-37-7)、5 - [ [ (2E) - 3 - クロロ - 2 - プロペン - 1 - イル ] アミノ ] - 1 - [ 2, 6 - ジクロロ -  
 4 - (トリフルオロメチル) フェニル ] - 4 - [ (トリフルオロメチル) スルフィニル ]  
 - 1H - ピラゾール - 3 - カルボニトリル (中国特許出願公開第 101337937 (A  
 ) から公知) (CAS 番号 1105672-77-2)、3 - プロモ - N - [ 4 - クロロ 50

- 2 - メチル - 6 - [ (メチルアミノ)チオキソメチル]フェニル] - 1 - (3 - クロロ  
 - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド、(Liudaibenji  
 iaxuanan、中国特許出願公開第103109816(A)号から公知)(CAS  
 番号1232543-85-9); N - [4 - クロロ - 2 - [[ (1, 1 - ジメチルエチ  
 ル)アミノ]カルボニル] - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル  
 ) - 3 - (フルオロメトキシ) - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド(国際公開第2  
 012/034403(A1)号から公知)(CAS番号1268277-22-0)、  
 N - [2 - (5 - アミノ - 1, 3, 4 - チアジアゾール - 2 - イル) - 4 - クロロ - 6 -  
 メチルフェニル] - 3 - プロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾー  
 ル - 5 - カルボキサミド(国際公開第2011/085575(A1)号から公知)(C 10  
 AS番号1233882-22-8)、4 - [3 - [2, 6 - ジクロロ - 4 - [(3, 3  
 - ジクロロ - 2 - プロペン - 1 - イル)オキシ]フェノキシ]プロポキシ] - 2 - メトキ  
 シ - 6 - (トリフルオロメチル) - ピリミジン(中国特許出願公開第101337940  
 (A)号から公知)(CAS番号1108184-52-6); (2E) - および2(Z  
 ) - 2 - [2 - (4 - シアノフェニル) - 1 - [3 - (トリフルオロメチル)フェニル]  
 エチリデン] - N - [4 - (ジフルオロメトキシ)フェニル] - ヒドラジンカルボキサミ  
 ド(中国特許出願公開第101715774(A)号から公知)(CAS番号12325  
 43-85-9); 3 - (2, 2 - ジクロロエテニル) - 2, 2 - ジメチル - 4 - (1H  
 - ベンズイミダゾール - 2 - イル)フェニル - シクロプロパンカルボン酸エステル(中国  
 特許出願公開第103524422(A)号から公知)(CAS番号1542271-4 20  
 6-4); (4aS) - 7 - クロロ - 2, 5 - ジヒドロ - 2 - [[ (メトキシカルボニル  
 ) [4 - [(トリフルオロメチル)チオ]フェニル]アミノ]カルボニル] - インデン[  
 1, 2 - e] [1, 3, 4]オキサジアジン - 4a(3H) - カルボン酸メチルエステル  
 (国特許出願公開第102391261(A)号から公知)(CAS番号1370358  
 - 69-2); 6 - デオキシ - 3 - O - エチル - 2, 4 - ジ - O - メチル - , 1 - [N -  
 [4 - [1 - [4 - (1, 1, 2, 2, 2 - ペンタフルオロエトキシ)フェニル] - 1H  
 - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - イル]フェニル]カルバメート] - L - マンノピ  
 ラノース(米国特許出願公開第2014/0275503(A1)号から公知)(CAS  
 番号1181213-14-8); 8 - (2 - シクロプロピルメトキシ - 4 - トリフルオ  
 ロメチル - フェノキシ) - 3 - (6 - トリフルオロメチル - ピリダジン - 3 - イル) - 3 30  
 - アザ - ビシクロ[3.2.1]オクタン(CAS番号1253850-56-4)、(8 - anti)  
 - 8 - (2 - シクロプロピルメトキシ - 4 - トリフルオロメチル - フェノ  
 キシ) - 3 - (6 - トリフルオロメチル - ピリダジン - 3 - イル) - 3 - アザ - ビシクロ  
 [3.2.1]オクタン(CAS番号933798-27-7)、(8 - syn) - 8 -  
 (2 - シクロプロピルメトキシ - 4 - トリフルオロメチル - フェノキシ) - 3 - (6 - ト  
 リフルオロメチル - ピリダジン - 3 - イル) - 3 - アザ - ビシクロ[3.2.1]オクタ  
 ン(国際公開第2007/040280(A1)号、国際公開第2007040282(A  
 1)号から公知)(CAS番号934001-66-8)、N - [3 - クロロ - 1 - (3  
 - ピリジニル) - 1H - ピラゾール - 4 - イル] - N - エチル - 3 - [(3, 3, 3 -  
 トリフルオロプロピル)チオ] - プロパンアミド(国際公開第2015/058021(A  
 1)号、国際公開第2015/058028(A1)号から公知)(CAS番号147  
 7919-27-9)およびN - [4 - (アミノチオキソメチル) - 2 - メチル - 6 - [ 40  
 (メチルアミノ)カルボニル]フェニル] - 3 - プロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジ  
 ニル) - 1H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド(中国特許出願公開第10326552  
 7(A)から公知)(CAS番号1452877-50-7)、5 - (1, 3 - ジオキサ  
 ン - 2 - イル) - 4 - [[4 - (トリフルオロメチル)フェニル]メトキシ] - ピリミジ  
 ン  
 (国際公開第2013/115391(A1)号から公知)(CAS番号1449021  
 - 97-9)、3 - (4 - クロロ - 2, 6 - ジメチルフェニル) - 4 - ヒドロキシ - 8 -  
 メトキシ - 1 - メチル - 1, 8 - ジアザスピロ[4.5]デカ - 3 - エン - 2 - オン(国 50

際公開第2010/066780(A1)号、国際公開第2011/151146(A1)号から公知)(CAS番号1229023-34-0)、3-(4-クロロ-2,6-ジメチルフェニル)-8-メトキシ-1-メチル-1,8-ジアザスピロ[4.5]デカン-2,4-ジオン(国際公開第2014/187846(A1)号から公知)(CAS番号1638765-58-8)、3-(4-クロロ-2,6-ジメチルフェニル)-8-メトキシ-1-メチル-2-オキソ-1,8-ジアザスピロ[4.5]デカ-3-エン-4-イル-カルボン酸エチルエステル(国際公開第2010/066780(A1)号、国際公開第2011151146(A1)号から公知)(CAS番号1229023-00-0)、N-[1-[(6-クロロ-3-ピリジニル)メチル]-2(1H)-ピリジニリデン]-2,2,2-トリフルオロ-アセトアミド(独国特許出願公開第3639877(A1)号、国際公開第2012029672(A1)号から公知)(CAS番号1363400-41-2)、[N(E)]-N-[1-[(6-クロロ-3-ピリジニル)メチル]-2(1H)-ピリジニリデン]-2,2,2-トリフルオロ-アセトアミド(国際公開第2016005276(A1)号から公知)(CAS番号1689566-03-7)、[N(Z)]-N-[1-[(6-クロロ-3-ピリジニル)メチル]-2(1H)-ピリジニリデン]-2,2,2-トリフルオロ-アセトアミド、(CAS番号1702305-40-5)、3-endo-3-[2-プロポキシ-4-(トリフルオロメチル)フェノキシ]-9-[5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジニル]オキシ]-9-アザビシクロ[3.3.1]ノナン(国際公開第2011/105506(A1)号、国際公開第2016/133011(A1)号から公知)(CAS番号1332838-17-1)。

【0306】

式(I)の化合物および本発明の組成物と混合することができる除草剤の例は以下である。

アセトクロル、アシフルオルフェン、アシフルオルフェンナトリウム、アクロニフェン、アラクロル、アリドクロル、アロキシジム、アロキシジムナトリウム、アメトリン、アミカルバゾン、アミドクロル、アミドスルフロ、4-アミノ-3-クロロ-5-フルオロ-6-(7-フルオロ-1H-インドール-6-イル)ピリジン-2-カルボン酸、アミノシクロピラクロール、アミノシクロピラクロール-カリウム、アミノシクロピラクロール-メチル、アミノピラリド、アミトロール、アンモニウムスルファメート、アニロホス、アスラム、アトラジン、アザフェニジン、アジムスルフロ、ベフルブタミド、ベナゾリン、ベナゾリン-エチル、ベンフルラリン、ベンフレセート、ベンスルフロ、ベンスルフロ-メチル、ベンズリド、ベントゾン、ベンゾビシクロン、ベンゾフェナップ、ビシクロピロン、ピフェノックス、ピラナフォス、ピラナフォス-ナトリウム、ビスピリバック、ビスピリバック-ナトリウム、ピクスロゾン、プロマシル、プロモブチド、プロモフェノキシム、プロモキシニル、プロモキシニル-ブチレート、-カリウム、-ヘプタノエート、および-オクタノエート、ブソキシノン、ブタクロル、ブタフェナシル、ブタミホス、ブテナクロル、ブトラリン、ブトロキシジム、ブチレート、カフェンストロール、カルベタミド、カルフェントラゾン、カルフェントラゾン-エチル、クロラムベン、クロルプロムロン、1-{2-クロロ-3-[(3-シクロプロピル-5-ヒドロキシ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル)カルボニル]-6-(トリフルオロメチル)フェニル}ピペリジン-2-オン、4-{2-クロロ-3-[(3,5-ジメチル-1H-ピラゾール-1-イル)メチル]-4-(メチルスルホニル)ベンゾイル}-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-イル-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-4-カルボキシレート、クロルフェナク、クロルフェナクナトリウム、クロルフェンプロップ、クロルフルレノール、クロルフルレノールメチル、クロリダゾン、クロリムロン、クロリムロンエチル、2-[2-クロロ-4-(メチルスルホニル)-3-(モルホリン-4-イルメチル)ベンゾイル]-3-ヒドロキシシクロヘキサ-2-エン-1-オン、4-{2-クロロ-4-(メチルスルホニル)-3-[(2,2,2-トリフルオロエトキシ)メチル]ベンゾイル}-1-エチル-1H-ピラゾール-5-イル-1,3-ジメチル-1H-

ピラゾール - 4 - カルボキシレート、クロロフタリム、クロロトルロン、クロルタール - ジメチル、3 - [ 5 - クロロ - 4 - (トリフルオロメチル)ピリジン - 2 - イル ] - 4 - ヒドロキシ - 1 - メチルイミダゾリジン - 2 - オン、クロルスルフロン、シニドン、シニドン - エチル、シンメチリン、シノスルフロン、クラシホス、クレトジウム、クロジナホップ、クロジナホップ - プロパルギル、クロマゾン、クロメプロップ、クロピラリド、クロランスラム、クロランスラム - メチル、クミルロン、シアナミド、シアナジン、シクロエート、シクロピラニル、シクロピリモレート、シクロスルファミロン、シクロキシジウム、シハロホップ、シハロホップ - ブチル、シブラジン、2, 4 - D、2, 4 - D - ブチル、- ブチル、- ジメチルアンモニウム、- ジオールアミン、- エチル、2 - エチルヘキシル、- イソブチル、- イソオクチル、- イソプロピルアンモニウム、- カリウム、- トリイソプロパノールアンモニウムおよび - トロラミン、2, 4 - DB、2, 4 - DB - ブチル、- ジメチルアンモニウム、イソオクチル、- カリウムおよび - ナトリウム、ダイムロン (daimuron / dymron)、ダラポン、ダゾメット、n - デカノール、デスメジファミン、DETシル - ピラゾレート (DTP)、ジカンバ、ジクロベニル、ジクロルプロップ、ジクロルプロップ - P、ジクロホップ、ジクロホップ - メチル、ジクロホップ - P - メチル、ジクロスラム、ジフェンゾコート、ジフルフェニカン、ジフルフェンゾピル、ジフルフェンゾピル - ナトリウム、ジメフロン、ジメピベレート、ジメタクロール、ジメタメトリン、ジメテナミド、ジメテナミド - P、3 - (2, 6 - ジメチルフェニル) - 6 - [ (2 - ヒドロキシ - 6 - オキソシクロヘキサ - 1 - エン - 1 - イル)カルボニル] - 1 - メチルキナゾリン - 2, 4 (1H, 3H) - ジオン、1, 3 - ジメチル - 4 - [ 2 - (メチルスルホニル) - 4 - (トリフルオロメチル)ベンゾイル] - 1H - ピラゾール - 5 - イル - 1, 3 - ジメチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキシレート、ジメトラスルフロン、ジニトラミン、ジノテルブ、ジフェナミド、ジクワット、ジクワット - ジプロミド、ジチオピル、ジウロン、DMPA、DNOC、エンドタール、EPTC、エスプロカルブ、エタルフルラリン、エタメトスルフロン、エタメトスルフロン - メチル、エチオジン、エトフメセート、エトキシフェン、エトキシフェン - エチル、エトキシスルフロン、エトベンザニド、エチル - [ (3 - { 2 - クロロ - 4 - フルオロ - 5 - [ 3 - メチル - 2, 6 - ジオキソ - 4 - (トリフルオロメチル) - 3, 6 - ジヒドロピリミジン - 1 (2H) - イル ] フェノキシ } ピリジン - 2 - イル) オキシ ] アセテート、F - 9600、F - 5231、すなわち、N - { 2 - クロロ - 4 - フルオロ - 5 - [ 4 - (3 - フルオロプロピル) - 5 - オキソ - 4, 5 - ジヒドロ - 1H - テトラゾール - 1イル ] - フェニル } エタンスルホンアミド、F - 7967、すなわち、3 - [ 7 - クロロ - 5 - フルオロ - 2 - (トリフルオロメチル) - 1H - ベンゾイミダゾール - 4 - イル ] - 1 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル)ピリミジン - 2, 4 (1H, 3H) - ジオン、フェノキサプロップ、フェノキサプロップ - P、フェノキサプロップ - エチル、フェノキサプロップ - P - エチル、フェノキサスルホン、フェンキノトリオン、フェントラザミド、フラムプロップ、フラムプロップ - M - イソプロピル、フラムプロップ - M - メチル、フラザスルフロン、フロラスラム、フルアジホップ、フルアジホップ - P、フルアジホップ - ブチル、フルアジホップ - P - ブチル、フルカルバゾン、フルカルバゾン - ナトリウム、フルセトスルフロン、フルクロラリン、フルフェナセット、フルフェンピル、フルフェンピル - エチル、フルメツラム、フルミクロラック、フルミクロラック - ベンチル、フルミオキサジン、フルオメツロン、フルレノール、フルレノール - ブチル、- ジメチルアンモニウム、および - メチル、フルオログリコフェン、フルオログリコフェン - エチル、フルプロパネート、フルピルスルフロン、フルピルスルフロン - メチル - ナトリウム、フルリドン、フルロクロリドン、フルロキシピル、フルロキシピル - メブチル、フルルタモン、フルチアセット、フルチアセット - メチル、ホメサフェン、ホメサフェン - ナトリウム、ホラムスルフロン、ホサミン、グルホシネート、グルホシネート - アンモニウム、グルホシネート - P - ナトリウム、グルホシネート - P - アンモニウム、グルホシネート - P - ナトリウム、グリホセート、グリホセート - アンモニウム、- イソプロピルアンモニウム、- ジアンモニウム、- ジメチルアンモニウム、- カリウム、- ナトリウム、および - トリメシウム、

10

20

30

40

50



H - 9 2 0 1、すなわち、O - ( 2 , 4 - ジメチル - 6 - ニトロフェニル ) O - エチル  
 イソプロピルホスホルアミドチオエート、ハラウキシフェン、ハラウキシフェン - メチル  
 、ハロサフェン、ハロスルフロソ、ハロスルフロソ - メチル、ハロキシホップ、ハロキシ  
 ホップ - P、ハロキシホップ - エトキシエチル、ハロキシホップ - P - エトキシエチル、  
 ハロキシホップ - メチル、ハロキシホップ - P - メチル、ヘキサジノン、HW - 0 2、す  
 なわち、1 - ( ジメトキシホスホリル ) エチル - ( 2 , 4 - ジクロロフェノキシ ) アセテ  
 ート、4 - ヒドロキシ - 1 - メトキシ - 5 - メチル - 3 - [ 4 - ( トリフルオロメチル )  
 ピリジン - 2 - イル ] イミダゾリジン - 2 - オン、4 - ヒドロキシ - 1 - メチル - 3 - [  
 4 - ( トリフルオロメチル ) ピリジン - 2 - イル ] イミダゾリジン - 2 - オン、( 5 - ヒ  
 ドロキシ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル ) ( 3 , 3 , 4 - トリメチル - 1 ,  
 1 - ジオキシド - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 - ベンゾチオフェン - 5 - イル ) メタノン、6 -  
 [ ( 2 - ヒドロキシ - 6 - オキソシクロヘキサ - 1 - エン - 1 - イル ) カルボニル ] - 1  
 , 5 - ジメチル - 3 - ( 2 - メチルフェニル ) キナゾリン - 2 , 4 ( 1 H , 3 H ) - ジオ  
 ン、イマザメタベンズ、イマザメタベンズ - メチル、イマザモックス、イマザモックス -  
 アンモニウム、イマザピック、イマザピック - アンモニウム、イマザピル、イマザピル -  
 イソプロピルアンモニウム、イマザキン、イマザキン - アンモニウム、イマゼタピル、イ  
 マゼタピル - インモニウム、イマゾスルフロソ、インダノファン、インダジフラム、ヨ  
 ードスルフロソ、ヨードスルフロソ - メチル - ナトリウム、アイオキシニル、アイオキシニ  
 ル - オクタノエート、 - カリウム、および - ナトリウム、イプフェンカルバゾン、イソ  
 プロツロン、イソウロン、イソキサベン、イソキサフルトール、カルブチレート、K U H -  
 0 4 3、すなわち、3 - ( { [ 5 - ( ジフルオロメチル ) - 1 - メチル - 3 - ( トリフル  
 オロメチル ) - 1 H - ピラゾール - 4 - イル ] メチル } スルホニル ) - 5 , 5 - ジメチル  
 - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール、ケトスピラドックス ( k e t o s p i r a  
 d o x )、ラクトフェン、レナシル、リニユロン、M C P A、M C P A - ブトチル、 - ジ  
 メチルアンモニウム、 - 2 - エチルヘキシル、 - イソプロピルアンモニウム、 - カリウム  
 、および - ナトリウム、M C P B、M C P B - メチル、 - エチル、および - ナトリウム、  
 メコプロップ、メコプロップ - ナトリウムおよび - ブトチル、メコプロップ - P、メコ  
 プロップ - P - ブトチル、 - ジメチルアンモニウム、 - 2 - エチルヘキシルおよび - カリウ  
 ム、メフェナセット、メフルイジド、メソスルフロソ、メソスルフロソ - メチル、メソ  
 トリオン、メタベンズチアズロン、メタム、メタミホップ、メタミトロン、メタザク  
 ロール、メタゾスルフロソ、メタベンズチアズロン、メチオピルスルフロソ ( m e t h i o p y  
 r s u l f u r o n )、メチオゾリン、2 - ( { 2 - [ ( 2 - メトキシエトキシ ) メチル  
 ] - 6 - ( トリフルオロメチル ) ピリジン - 3 - イル } カルボニル ) シクロヘキサン - 1  
 , 3 - ジオン、イソチオシアン酸メチル、1 - メチル - 4 - [ ( 3 , 3 , 4 - トリメチル  
 - 1 , 1 - ジオキシド - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 - ベンゾチオフェン - 5 - イル ) カルボ  
 ニル ] - 1 H - ピラゾール - 5 - イルプロパン - 1 - スルホネート、メトプロムロン、メ  
 トラクロール、S - メトラクロール、メトスラム、メトクスロン、メトリブジン、メ  
 トスルフロソ、メトスルフロソ - メチル、モリネート ( m o l i n a t )、モノリニユ  
 ロソ、モノスルフロソ - エステル、M T - 5 9 5 0、すなわち、N - [ 3 - クロ  
 ロ - 4 - イソプロピルフェニル ] - 2 - メチルペンタンアミド、N G G C - 0 1 1、ナ  
 プ  
 ロパミド、N C - 3 1 0、すなわち、[ 5 - ( ベンジルオキシ ) - 1 - メチル - 1 H - ピ  
 ラゾール - 4 - イル ] ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) メタノン、ネブロン、ニコスルフロ  
 ソ、ノナン酸 ( ペラルゴン酸 )、ノルフルラゾン、オレイン酸 ( 脂肪酸 )、オルベンカル  
 ブ、オルソスルファミロン、オリザリン、オキサジアルギル、オキサジアゾン、オキサ  
 スルフロソ、オキサジクロメフォン、オキシフルオルフェン、パラコート、パラ  
 コートジク  
 ロリド、ペプレート、ベンジメタリン、ベノキススラム、ベクタクロロフェノール、  
 ペ  
 トキサゾン、ペトキサミド、石油、フェンメジファミン、ピクロラム、ピコリナフェン、  
 ピ  
 ノキサデン、ピペロホス、プレチラクロール、プリミスルフロソ、プリミスルフロ  
 ソ - メ  
 チル、プロジアミン、プロホキシジム、プロメトン、プロメトリン、プロパク  
 ロール、  
 プロパニル、プロパキサホップ、プロパジン、プロファミン、プロピソク  
 ロール、プロ  
 ポキシ

10

20

30

40

50

カルバゾン、プロボキシカルバゾン - ナトリウム、プロピリスルフロソ、プロピザミド、  
 プロスルホカルブ、プロスルフロソ、ピラクロニル、ピラフルフェン、ピラフルフェン -  
 エ

チル、ピラスルホトール、ピラゾリネート (ピラゾレート)、ピラゾスルフロソ、ピラゾ  
 スルフロソ - エチル、ピラゾキシフェン、ピリバムベンズ ( p y r i b a m b e n z )、  
 ピリバムベンズ - イソプロピル、ピリバムベンズ - プロピル、ピリベンゾキシム、ピリブ  
 チカルブ、ピリダフォル、ピリデート、ピリフタリド、ピリミノバック、ピリミノバック  
 - メチル、ピリミスルファン、ピリチオバック、ピリチオバック - ナトリウム、ピロキサ  
 スルホン、ピロキシスラム、キンクロラック、キンメラック、キノクラミン、キザロホッ  
 プ、キザロホップ - エチル、キザロホップ - P、キザロホップ - P - エチル、キザロホッ  
 プ - P - テフリル、Q Y M - 2 0 1、Q Y R - 3 0 1、リムスルフロソ、サフルフェナシ  
 ル、セトキシジム、シデュロン、シマジソ、シメトリン、S L - 2 6 1、スルコトリオン  
 、スルフェントラゾン、スルホメツロン、スルホメツロン - メチル、スルホスルフロソ、  
 S Y N - 5 2 3、S Y P - 2 4 9、すなわち、1 - エトキシ - 3 - メチル - 1 - オキソブ  
 タ - 3 - エン - 2 - イル 5 - [ 2 - クロロ - 4 - (トリフルオロメチル)フェノキシ]  
 - 2 - ニトロベンゾエート、S Y P - 3 0 0、すなわち、1 - [ 7 - フルオロ - 3 - オキ  
 ソ - 4 - (プロバ - 2 - イン - 1 - イル) - 3, 4 - ジヒドロ - 2 H - 1, 4 - ベンゾ  
 オキシジン - 6 - イル] - 3 - プロピル - 2 - チオキソイミダゾリジン - 4, 5 - ジオン、  
 2, 3, 6 - T B A、T C A (トリクロロ酢酸)、T C A - ナトリウム、テブチウロン、  
 テフリルトリオン、テンボトリオン、テブラロキシジム、ターバシル、テルブカルブ、テ  
 ルブメトン、テルブチラジン、テルブトリソ、テトフルピロリメット、テニルクロール、  
 チアゾピル、チエンカルバゾン、チエンカルバゾン - メチル、チフェンスルフロソ、チフ  
 ェンスルフロソ - メチル、チオベンカルブ、チアフェナシル、トルピラレート、トブラメ  
 ゾソ、トラルコキシジム、トリアファモン、トリアレート、トリアスルフロソ、トリアジ  
 フラム、トリベヌロン、トリベヌロン - メチル、トリクロピル、トリエタジン、トリフロ  
 キシスルフロソ、トリフロキシスルフロソ - ナトリウム、トリフルジモキサジン、トリフ  
 ルラリン、トリフルスルフロソ、トリフルスルフロソ - メチル、トリトスルフロソ、尿素  
 硫酸塩、ベルノレート、Z J - 0 8 6 2、すなわち、3, 4 - ジクロロ - N - { 2 - [ ( 4,  
 6 - ジメトキシピリミジン - 2 - イル) オキシ] ベンジル } アニリン。

10

20

30

#### 【 0 3 0 7 】

植物成長調節剤の例は以下のものである：

アシベンゾラル、アシベンゾラル - S - メチル、5 - アミノレブリン酸、アンシミドール  
 ル、6 - ベンジルアミノプリン、ブラシノリド、カテキソ、クロルメコート - クロリド、  
 クロプロップ、シクラニリド、3 - (シクロプロバ - 1 - エニル) プロピオン酸、ダミノ  
 ジド、ダゾメット、n - デカノール、ジケグラック、ジケグラック - ナトリウム、エンド  
 タール、エンドタール - ニカリウム、- ニナトリウム、および - モノ ( N, N - ジメチル  
 アルキルアンモニウム )、エテホン、フルメトラリン、フルレノール、フルレノール - ブ  
 チル、フルルプリミドール、ホルクロルフェニユロン、ジベレリン酸、イナベンフィド、  
 インドール - 3 - 酢酸 ( I A A )、4 - インドール - 3 - イル酪酸、イソプロチオラン、  
 プロベナゾール、ジャスモン酸、マレイン酸ヒドラジド、メピコートクロリド、1 - メチ  
 ルシクロプロペン、ジャスモン酸メチル、2 - ( 1 - ナフチル ) アセトアミド、1 - ナフ  
 チル酢酸、2 - ナフチルオキシ酢酸、ニトロフェノラート混合物、パクロブトラゾール、  
 N - ( 2 - フェニルエチル ) - アラニン、N - フェニルフタルアミド酸、プロヘキサ  
 ジオン、プロヘキサジソン - カルシウム、プロヒドロジャスモン、サリチル酸、ストリゴ  
 ラクトソ、テクナゼソ、チジアズロン、トリアコンタノール、トリネキサパック、トリネ  
 キサパック - エチル、チトデフ ( t s i t o d e f )、ウニコナゾール、ウニコナゾール  
 - P。

40

#### 【 0 3 0 8 】

式 ( I ) の化合物および本発明の組成物と混合することができる薬害軽減剤の例には、  
 ベノキサコール、クロキントセット ( - メチル )、シオメトリニル、シプロスルファミド

50

、ジクロロミド、フェンクロラゾール(-エチル)、フェンクロリム、フルラゾール、フルキソフェニム、フリラゾール、イソキサジフェン(-エチル)、メフェンピル(-ジエチル)、ナフタル酸無水物、オキサベトリニル、2-メトキシ-N-( { 4 - [ (メチルカルバモイル)アミノ]フェニル } スルホニル)ベンズアミド(CAS番号129531-12-0)、4-(ジクロロアセチル)-1-オキサ-4-アザスピロ[4.5]デカン(CAS番号71526-07-3)、2,2,5-トリメチル-3-(ジクロロアセチル)-1,3-オキサゾリジン(CAS番号52836-31-4)が挙げられる。

【0309】

式(I)の化合物および本発明の組成物と混合することができる硝化阻害剤の例は、以下からなる群から選択される：2-(3,4-ジメチル-1H-ピラゾール-1-イル)コハク酸、2-(4,5-ジメチル-1H-ピラゾール-1-イル)コハク酸、3,4-ジメチルピラゾリウムグリコレート、3,4-ジメチルピラゾリウムシトレート、3,4-ジメチルピラゾリウムラクテート、3,4-ジメチルピラゾリウムマンデレート、1,2,4-トリアゾール、4-クロロ-3-メチルピラゾール、N-( (3(5)-メチル-1H-ピラゾール-1-イル)メチル)アセトアミド、N-( (3(5)-メチル-1H-ピラゾール-1-イル)メチル)ホルムアミド、N-( (3(5),4-ジメチルピラゾール-1-イル)メチル)ホルムアミド、N-( (4-クロロ-3(5)-メチルピラゾール-1-イル)メチル)ホルムアミド；ジシアンジアミドの反応付加物、ウレアおよびホルムアルデヒド、トリアゾニル-ホルムアルデヒド-ジシアンジアミド付加物、2-シアノ-1-( (4-オキソ-1,3,5-トリアジナン-1-イル)メチル)グアニジン、1-( (2-シアノグアニジノ)メチル)ウレア、2-シアノ-1-( (2-シアノグアニジノ)メチル)グアニジン、2-クロロ-6-(トリクロロメチル)-ピリジン(ニトラピリンまたはN-サブ)、ジシアンジアミド、3,4-ジメチルピラゾールリン酸塩、4,5-ジメチルピラゾールリン酸塩、3,4-ジメチルピラゾール、4,5-ジメチルピラゾール、チオ硫酸アンモニウム、ニーム(neem)、ニームの成分をベースとする製品、リノール酸、-リノール酸、メチルp-クマル酸、フェルラ酸メチル、メチル3-(4-ヒドロキシフェニル)プロピオナート、カラジン、ブラキアラクトン、p-ベンゾキノソルゴレオン(sorgoleone)、4-アミノ-1,2,4-トリアゾール塩酸塩、1-アミド-2-チオウレア、2-アミノ-4-クロロ-6-メチルピリミジン、2-メルカプト-ベンゾチアゾール、5-エトキシ-3-トリクロロメチル-1,2,4-チオジアゾール(テラゾール、エトリジアゾール)、2-スルファニルアミドチアゾール、3-メチルピラゾール、1,2,4-トリアゾールチオウレア、シアンアミド、メラミン、ゼオライト粉末、カテコール、ベンゾキノ、四ホウ酸ナトリウム、アрилチオウレア、塩素酸塩、および硫酸亜鉛。

【0310】

式(I)の化合物および本発明の組成物は、1または複数の農業上有益な薬剤と組み合わせることができる。

【0311】

農業上有益な薬剤の例には、バイオスティミュラント(生体刺激剤)、植物成長調節剤、植物シグナル分子、成長促進剤、微生物刺激分子、生体分子、土壌改良剤、栄養素、植物栄養強化剤など、例えば、リポキトオリゴ糖(LCO)、キトオリゴ糖(CO)、キチン化合物、フラボノイド、ジャスモン酸またはその誘導体(例えば、ジャスモン酸)、サイトカイニン、オーキシン、ジベレリン、アブシシン酸、エチレン、ブラシノステロイド、サリチル酸塩、多量および微量栄養素、リノール酸またはその誘導体、カリキン、有益微生物(例えば、リゾビウム属(Rhizobium)種、ブラジリゾビウム属(Bradyrhizobium)種、シノリゾビウム属(Sinorhizobium)種、アゾリゾビウム属(Azorhizobium)種、グロムス属(Glomus)種、ギガスポラ属(Gigaspora)種、ニセビョウタケ属(Hymenoscyphous)種、オイディオデンドロン属(Oidiiodendron)種、キツネタケ属(Laccaria)種、ピソリサス属(Pisolithus)種、ショウ口属(Rhizop

ogon)種、スクレロデルマ属(*Scleroderma*)種、リゾクトニア属(*Rhizoctonia*)種、アシネトバクター属(*Acinetobacter*)種、アルスロバクター属(*Arthrobacter*)種、アルツロボトリス属(*Arthrobotrys*)種、アスペルギルス属(*Aspergillus*)種、アゾスピリルム属(*Azospirillum*)種、(*Bacillus*)種、パークホルデリア属(*Burkholderia*)種、カンジダ属(*Candida*)種、クリセオモナス属(*Chryseomonas*)種、エンテロバクター属(*Enterobacter*)種、エウペニシリウム属(*Eupenicillium*)種、エキシグオバクテリア属(*Exiguobacterium*)種、クレブシエラ属(*Klebsiella*)種、クスイペラ属(*Kluyvera*)種、マイクロバクテリウム属(*Microbacterium*)種、ムコール属(*Mucor*)種、ペシロマイセス属(*Paecilomyces*)種、パエニバシラス属(*Paenibacillus*)種、ペニシリウム属(*Penicillium*)種、シュードモナス属(*Pseudomonas*)種、セラチア属(*Serratia*)種、ステノトロホモナス属(*Stenotrophomonas*)種、ストレプトマイセス属(*Streptomyces*)種、ストレプトスポランジウム属(*Streptosporangium*)種、スワミナタニア属(*Swaminathania*)種、チオバシラス属(*Thiobacillus*)種、トルロスポラ属(*Torulospora*)種、ビブリオ属(*Vibrio*)種、キサントバクテリア属(*Xanthobacter*)種、キサントモナス属(*Xanthomonas*)種など)およびそれらの組み合わせが含まれる。

#### 【0312】

##### 方法および用途

式(I)の化合物および本発明の組成物は、強力な殺菌活性および/または植物防御調節を有する。それらは、植物の不要な真菌類および細菌類などの不要な微生物を防除するために使用できる。それらは、本明細書の以下でより詳細に説明するように、作物保護(植物病害を引き起こす微生物を防除する)または材料(例えば、工業材料、材木、貯蔵品)を保護するために特に有用であり得る。より具体的には、式(I)の化合物および本発明の組成物は、種子、発芽種子、出芽実生、植物、植物部分、果実、収穫物、および/または植物が生育する土壌を望ましくない微生物から保護するために使用することができる。

#### 【0313】

本明細書で使用される防除または防除することは、望ましくない微生物の保護、治療、および根絶処理を包含する。望ましくない微生物は、病原性細菌、病原性ウイルス、病原性卵菌または病原性真菌、より具体的には植物病原性細菌、植物病原性ウイルス、植物病原性卵菌または植物病原性真菌であり得る。以下に詳述するように、これらの植物病原性微生物は、広範囲の植物病害の原因物質である。

#### 【0314】

より具体的には、式(I)の化合物および本発明の組成物は殺真菌剤として使用することができる。本明細書の目的のために、「殺真菌剤」という用語は、ネコブカビ類(*Plasmodiophoromycetes*)、ツボカビ類(*Chytridiomycetes*)、接合菌類(*Zygomycetes*)、子囊菌類(*Ascomycetes*)、担子菌類(*Basidiomycetes*)、および不完全菌類(*Deuteromycetes*)などの望ましくない真菌を防除するために、並びに/または卵菌の防御のために、作物保護に使用できる化合物または組成物を指す。

#### 【0315】

式(I)の化合物および本発明の組成物は、抗菌剤としても使用され得る。特に、例えば、シュードモナス科(*Pseudomonadaceae*)、リゾビウム科(*Rhizobiaceae*)、キサントモナス科(*Xanthomonadaceae*)、腸内細菌科(*Enterobacteriaceae*)、コリネバクテリウム科(*Corynebacteriaceae*)、およびストレプトマイセス科(*Streptomycet*

a c e a e ) などの不要な細菌の防除など、作物保護に使用することができる。

【0316】

式(I)の化合物および本発明の組成物は、作物保護における抗ウイルス剤としても使用され得る。例えば、式(I)の化合物および本発明の組成物は、タバコモザイクウイルス(TMV)、タバコガラガラウイルス、タバコ矮化ウイルス(TStuV)、タバコの葉のカールウイルス(VLCV)、タバコネルビリア(nervilia)モザイクウイルス(TVBMV)、タバコえそ萎縮ウイルス(TNDV)、タバコ条斑ウイルス(TSV)、ジャガイモウイルスX(PVX)、ジャガイモウイルスY、S、M、およびA、ジャガイモオキュバ(acuba)モザイクウイルス(PAMV)、ジャガイモモップトップウイルス(PMTV)、ジャガイモリーフロールウイルス(PLRV)、アルファルファモザイクウイルス(AMV)、キュウリモザイクウイルス(CMV)、キュウリ緑斑モザイクウイルス(CGMMV)、キュウリ黄化ウイルス(CuYV)、スイカモザイクウイルス(WMV)、トマト黄化えそウイルス(TSWV)、トマト輪点ウイルス(TomRSV)、サトウキビモザイクウイルス(SCMV)、イネ萎縮病ウイルス、イネ縞葉枯ウイルス、イネ黒縞萎縮ウイルス、イチゴ斑紋ウイルス(SMoV)、イチゴベインバンディングウイルス(SVBV)、イチゴマイルドイエローエッジウイルス(SMYEV)、イチゴクリンクルウイルス(SCrV)、ソラマメウルトウイルス(BBWV)、およびメロンえそ斑点ウイルス(MNSV)などの植物ウイルスによる病害に対して効果を有し得る。

10

【0317】

本発明はまた、少なくとも1つの式(I)の化合物または少なくとも1つの本発明の組成物を微生物および/またはそれらの生息地(植物、植物の部分、種子、果実、または植物が生育する土壌)に施用する工程を含む、植物上の望ましくない菌類、卵菌、および細菌などの望ましくない微生物を防除する方法にも関する。

20

【0318】

典型的には、式(I)の化合物および本発明の組成物が、植物病原性真菌および/または植物病原性卵菌を防除するための治療的または保護的方法で使用される場合、その有効かつ植物適合量を、植物、植物部分、果実、種子、または植物が生育する土壌若しくは基材に施用する。植物を栽培するために使用できる適切な基材には、ミネラルウール、特にストーンウール、パーライト、砂または砂利などの無機物ベースの基材、泥炭、松の樹皮、おがくずなどの有機基材、ポリマーフォームまたはプラスチックビーズなどの石油ベースの基材が含まれる。植物適合有効量とは、農耕地に存在するまたは出現する可能性のある菌類を防除または破壊するのに十分な量であり、前記作物に対する植物毒性の顕著な症状を伴わない量を意味する。そのような量は、防除される真菌、作物の種類、作物の生育段階、気候条件、および使用される本発明のそれぞれの化合物または組成物に応じて広い範囲内で変化し得る。この量は、当業者の能力の範囲内である体系的な実地試験によって決定することができる。

30

【0319】

植物および植物の部分

式(I)の化合物および本発明の組成物は、任意の植物または植物部分に施用することができる。

40

【0320】

植物とは、望ましいおよび望ましくない野生植物または作物植物(天然に存在する作物植物を含む)など、全ての植物および植物集団を意味する。作物は、従来 of 育種および最適化方法によって、またはバイオテクノロジーおよび遺伝子工学的な方法、若しくはこれらの方法の組み合わせによって取得できる植物であり、遺伝子組み換え植物(GMOまたはトランスジェニック植物)、並びに植物育種者の権利によって保護可能および保護不可能な植物品種を含む。

【0321】

植物品種は、新しい特性(「形質」)を有し、従来 of 育種、突然変異誘発または組換え

50

DNA技術によって得られた植物を意味すると理解される。それらは、品種、変種、生物型、または遺伝子型であり得る。

【0322】

植物の部分とは、シュート、葉、針葉樹、柄(stalk)、茎(stem)、花、子実体、果実、種子、根、塊茎、および根茎など、地上および地下にある植物の全ての部分および器官を意味すると理解される。植物の部分には、収穫された材料、植物材料および生殖繁殖材料、例えば挿し木(cutting)、塊茎、根茎、挿し木(slip)、および種子も含まれる。

【0323】

本発明の方法に従って処理することができる植物には、以下が含まれ得る：ワタ、亜麻、ブドウ、果物、野菜、例えば、バラ科(Rosaceae)種(例えば、リンゴやナシなどのナシ状果だけでなく、アプリコット、チェリー、アーモンド、桃などの核果、イチゴなどの柔らかい果実も含まれる)、リベシオイダエ科(Ribesioideae)種、クルミ科(Juglandaceae)種、カバノキ科(Betulaceae)種、ウルシ科(Anacardiaceae)種、ブナ科(Fagaceae)種、クワ科(Moraceae)種、モクセイ科(Oleaceae)種、マタタビ科(Actinidiaceae)種、クスノキ科(Lauraceae)種、バショウ科(Musaceae)種(例えばバナナの木および植栽)、アカネ科(Rubiaceae)種(例えばコーヒー)、ツバキ科(Theaceae)種、アオギリ科(Sterculiaceae)種、ミカン科(Rutaceae)種(例えばレモン、オレンジ、およびグレープフルーツ)；ナス科(Solanaceae)種(例えばトマト)、ユリ科(Liliaceae)種、キク科(Asteraceae)種(例えばレタス)、セリ科(Umbelliferae)種、アブラナ科(Cruciferae)種、アカザ科(Chenopodiaceae)種、ウリ科(Cucurbitaceae)種(例えばキュウリ)、ネギ科(Alliaceae)種(例えばニラネギおよびタマネギ)、マメ科(Papilionaceae)種(例えばエンドウ豆)；主要作物、例えば、イネ科(Gramineae)種(例えばトウモロコシ、芝生、小麦、ライ麦、米、大麦、オート麦、キビ、ライ小麦などの穀物)、キク科(Asteraceae)種(例えばヒマワリ)、アブラナ科(Brassicaceae)種(例えば白キャベツ、赤キャベツ、ブロッコリー、カリフラワー、芽キャベツ、青梗菜、コールラビ、ラディッシュ、ナタネ、マスタード、ホースラディッシュ、クレソン)、マメ科(Fabaceae)種(例えば豆、ピーナッツ)、マメ科(Papilionaceae)種(例えば大豆)、ナス科(Solanaceae)種(例えばジャガイモ)、アカザ科(Chenopodiaceae)種(例えば、テンサイ、飼料ビート、フダンソウ(スイスチャード)、ビーツ)；庭や樹木が茂った地域のための有用な植物や観葉植物；並びにこれらの植物のそれぞれの遺伝子組換え品種。

【0324】

上記で開示された方法によって処理され得る植物および植物品種には、1または複数の生物的ストレスに対して耐性がある植物および植物品種が含まれる。すなわち、前記植物は、線虫、昆虫、ダニ、植物病原菌、細菌、ウイルスおよび/またはウイロイドなどの動物および微生物害虫に対してより優れた防御を示す。

【0325】

上記に開示された方法によって処理され得る植物および植物品種には、1または複数の非生物的ストレスに耐性がある植物が含まれる。非生物的ストレス条件には、例えば、干ばつ、低温への暴露、熱への暴露、浸透圧ストレス、洪水、土壌塩分濃度の上昇、ミネラルへの暴露の増加、オゾンへの暴露、強い光への暴露、窒素栄養素の利用の制限、リン栄養素の利用の制限、日陰回避が含まれ得る。

【0326】

上記に開示された方法によって処理され得る植物および植物品種には、収量特性が向上したことを特徴とする植物が含まれる。前記植物における収量の増加は、例えば、水利用効率、保水効率、窒素利用の改善、炭素同化の向上、光合成の向上、発芽効率の向上、お

10

20

30

40

50

よび成熟の促進など、植物の生理機能、成長、および発育の向上の結果であり得る。さらに収量は、改良された植物構造（ストレス下および非ストレス下）によって影響を受ける可能性があり、早期開花、ハイブリッド種子生産のための開花制御、実生の活力、植物の大きさ、節間数および節間距離、根の成長、種子のサイズ、果実のサイズ、鞘のサイズ、鞘または穂の数、莢または穂あたりの種子数、種子質量、種子充填の強化、種子分散の減少、鞘の裂開および倒伏抵抗の減少が挙げられるが、これらに限定されない。さらなる収量特性には、炭水化物含有量およびワタまたはデンプンなどの組成、タンパク質含有量、油含有量および組成、栄養価、抗栄養化合物の減少、改善された加工性、並びにより良好な貯蔵安定性などの種子組成が含まれる。

#### 【0327】

上記で開示された方法によって処理され得る植物および植物品種には、概してより高い収量、活力、健康、並びに生物学的および非生物学的ストレスに対する耐性をもたらす雑種強勢または雑種活力の特徴をすでに発現している雑種植物である植物および植物品種が含まれる。

#### 【0328】

トランスジェニック植物、種子処理、および統合イベント

式(I)の化合物は、有利なおよび/または有用な特性(形質)をこれらの植物、植物品種、または植物部分に付与する遺伝物質を受け取ったトランスジェニック植物、植物品種、または植物部分を処理するために有利に使用することができる。したがって、本発明は、1または複数の組換え形質、トランスジェニックイベント、またはそれらの組み合わせと組み合わせることができると考えられる。この出願の目的のために、トランスジェニックイベントは、植物ゲノムの染色体内の特定の位置(遺伝子座)への特定の組換えDNA分子の挿入によって作出される。挿入により、「イベント」と称される新規のDNA配列が作成され、挿入された組換えDNA分子と、挿入されたDNAの両端のすぐ近くの隣接するゲノムDNAのある程度の量とによって特徴付けられる。そのような形質またはトランスジェニックイベントには、病害虫抵抗性、水利用効率、収量実績、干ばつ耐性、種子の品質、栄養品質の改善、ハイブリッド種子生産、および除草剤耐性が含まれるが、これらに限定されない。形質は、そのような形質またはトランスジェニックイベントを欠く植物に関して測定される。そのような有利・有用な特性(特性)の具体例は、より良い植物の成長、活力、ストレス耐性、安定性、耐倒伏性、栄養素の取り込み、植物の栄養、および/または収量、特に、成長の改善、高温または低温に対する耐性の向上、干ばつまたは水若しくは土壌の塩分レベルに対する耐性の向上、開花性能の向上、収穫の容易化、熟成の促進、収量の増加、収穫物の高品質および/または栄養価の向上、収穫物の貯蔵寿命および/または加工性の向上、並びに昆虫、クモ類、線虫、ダニ、ナメクジ、カタツムリなどの動物および微生物害虫に対する耐性の向上である。

#### 【0329】

そのような動物および微生物害虫、特に昆虫に対する耐性の特性を付与するタンパク質をコードするDNA配列の中で、特に、文献に広く記載され、当業者に周知のBtタンパク質をコードするバチルス・チューリングエンシス(*Bacillus thuringiensis*)由来の遺伝物質について言及する。フォトラブダス属(*Photobdus*) (国際公開第97/17432号および第98/08932号)などの細菌から抽出されたタンパク質も言及される。特に、Bt Cryタンパク質またはVIPタンパク質について言及する。それらには、Cry1A、Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1IA、Cry1IIA、Cry1IIB2、Cry9c、Cry2Ab、Cry3Bb、およびCryIFタンパク質またはそれらの毒性断片、さらにそれらのハイブリッドまたは組み合わせ、特に、Cry1Fタンパク質またはCry1Fタンパク質由来のハイブリッド(例えば、ハイブリッドCry1A-Cry1Fタンパク質またはそれらの毒性断片)、Cry1Aタイプタンパク質またはそれらの毒性断片、好ましくは、Cry1Acタンパク質またはCry1Acタンパク質由来ハイブリッド(例えば、ハイブリッドCry1Ab-Cry1Acタンパク質)またはCry1Ab若しくはBt2タンパク質ま

10

20

30

40

50

たはその毒性断片、Cry2Ae、Cry2Af、またはCry2Agタンパク質またはその毒性断片、Cry1A.105タンパク質またはその毒性断片、VIP3Aa19タンパク質、VIP3Aa20タンパク質、COT202またはCOT203ワタイベントで産生されたVIP3Aタンパク質、Estruch et al. (1996), Proc Natl Acad Sci USA, 28;93(11):5389-94に記載されるVIP3Aタンパク質またはその毒性断片、国際公開第2001/47952号に記載されるCryタンパク質、ゼノラブダス属(Xenorhabdus)由来の殺虫タンパク質(国際公開第98/50427号に記載)、セラチア属(Serratia)(特にセラチア・エントモフィラ(S. entomophila)由来)またはフォトラブダス属(Photorhabdus)種菌株、例えば、国際公開第98/08932号に記載されるフォトラブダス属由来のTcタンパク質が含まれる。また、これらのタンパク質のいずれか1つのバリエーションまたは変異体で、上記の配列のいずれか、特に、それらの毒性断片の配列と一部のアミノ酸(1~10個、好ましくは1~5個)が異なるもの、またはプラスチド輸送ペプチドまたは別のタンパク質若しくはペプチドなどの輸送ペプチドに融合されたものが、本明細書に含まれる。

10

#### 【0330】

そのような特性の別の特に強調された例は、1または複数の除草剤、例えばイミダゾリノン、スルホニル尿素、グリホサート、またはホスフィノスリシンに対する耐性の付与である。形質転換された植物細胞および植物に特定の除草剤に対する耐性の特性を付与するタンパク質をコードするDNA配列の中で、特に、国際公開第2009/152359号に記載される、グルホシネート除草剤に対する耐性を付与する、bar若しくはPAT遺伝子またはストレプトマイセス・コエリカラー(Streptomyces coelicolor)遺伝子、EPSPSを標的とする除草剤、特にグリホサートやその塩などの除草剤に対する耐性を付与する適切なEPSPS(5-エノールピルビルシキマツト-3-ホスファット-シンターゼ)(5-Enolpyruvylshikimate-3-phosphat-synthase)をコードする遺伝子、グリホサート-n-アセチルトランスフェラーゼをコードする遺伝子、またはグリホサート酸化還元酵素をコードする遺伝子について言及する。さらに適切な除草剤耐性形質には、少なくとも1つのALS(アセト乳酸合成酵素)阻害剤(例えば、国際公開第2007/024782号)、変異型シロイヌナズナ(Arabidopsis)ALS/AHAS遺伝子(例えば、米国特許第6,855,533号)、2,4-D(2,4-ジクロロフェノキシ酢酸)に対する耐性を付与する2,4-D-モノオキシゲナーゼをコードする遺伝子、ジカンバ(3,6-ジクロロ-2-メトキシ安息香酸)に対する耐性を付与するジカンバモノオキシゲナーゼをコードする遺伝子が含まれる。

20

30

#### 【0331】

そのような特性のさらに別の例は、1または複数の植物病原性真菌、例えばアジアのダイズさび病(Asian Soybean Rust)に対する抵抗性である。そのような病害に対する耐性の特性を付与するタンパク質をコードするDNA配列の中で、特に、グリシン・トメンテラ(glycine tomentella)からの遺伝物質、例えば、国際公開第2019/103918号に記載されるように、公的に入手可能な受託系統(PI441001、PI483224、PI583970、PI446958、PI499939、PI505220、PI499933、PI441008、PI505256、またはPI446961)のいずれかからの遺伝物質について言及する。

40

#### 【0332】

このような特性のさらに特に強調された例は、例えば、全身獲得耐性(SAR)、システミン、フィトアレキシン、エリシター、および耐性遺伝子、並びに対応して発現したタンパク質および毒素による、細菌および/またはウイルスに対する耐性の増加である。

#### 【0333】

本発明に従って優先的に処理することができるトランスジェニック植物または植物品種における特に有用なトランスジェニックイベントには、イベント531/PV-GHBK

50



04 (ワタ、昆虫防除、国際公開第2002/040677号に記載)、イベント1143-14A (ワタ、昆虫防除、受託なし、国際公開第2006/128569号に記載) ; イベント1143-51B (ワタ、昆虫防除、受託なし、国際公開第2006/128570号に記載) ; イベント1445 (ワタ、除草剤耐性、受託なし、米国特許出願公開第2002-120964号または国際公開第2002/034946号に記載) ; イベント17053 (イネ、除草剤耐性、受託番号PTA-9843、国際公開第2010/117737号に記載) ; イベント17314 (イネ、除草剤耐性、受託番号PTA-9844、国際公開第2010/117735号に記載) ; イベント281-24-236 (ワタ、昆虫防除-除草剤耐性、受託番号PTA-6233、国際公開第2005/103266号または米国特許出願公開第2005-216969号に記載) ; イベント3006-210-23 (ワタ、昆虫防除-除草剤耐性、受託番号PTA-6233、米国特許出願公開第2007-143876号または国際公開第2005/103266号に記載) ; イベント3272 (トウモロコシ、品質特性、受託番号PTA-9972、国際公開第2006/098952号または米国特許出願公開第2006-230473号に記載) ; イベント33391 (小麦、除草剤耐性、受託番号PTA-2347、国際公開第2002/027004号に記載)、イベント40416 (トウモロコシ、昆虫防除-除草剤耐性、受託番号ATCC PTA-11508、国際公開第11/075593号に記載) ; イベント43A47 (トウモロコシ、昆虫防除-除草剤耐性、受託番号ATCC PTA-11509、国際公開第2011/075595号に記載) ; イベント5307 (トウモロコシ、昆虫防除、受託番号ATCC PTA-9561、国際公開第2010/077816号に記載) ; イベントASR-368 (ベントグラス、除草剤耐性、受託番号ATCC PTA-4816、米国特許出願公開第2006-162007号または国際公開第2004/053062号に記載) ; イベントB16 (トウモロコシ、除草剤耐性、受託なし、米国特許出願公開第2003-126634号に記載) ; イベントBPS-CV127-9 (大豆、除草剤耐性、受託番号NCIMB 41603、国際公開第2010/080829号に記載) ; イベントBLR1 (ナタネ、男性不妊の回復、受託番号NCIMB 41193、国際公開第2005/074671号に記載)、イベントCE43-67B (ワタ、昆虫防除、受託番号DSM ACC2724、米国特許出願公開第2009-217423号または国際公開第2006/128573号に記載) ; イベントCE44-69D (ワタ、昆虫防除、受託なし、米国特許出願公開第2010-0024077号に記載) ; イベントCE44-69D (ワタ、昆虫防除、受託なし国際公開第2006/128571号に記載) ; イベントCE46-02A (ワタ、昆虫防除、受託なし国際公開第2006/128572号に記載) ; イベントCOT102 (ワタ、昆虫防除、受託なし米国特許出願公開第2006-130175号または国際公開第2004/039986号に記載) ; イベントCOT202 (ワタ、昆虫防除、受託なし米国特許出願公開第2007-067868号または国際公開第2005/054479号に記載) ; イベントCOT203 (ワタ、昆虫防除、受託なし国際公開第2005/054480号に記載) ; イベントDAS21606-3/1606 (大豆、除草剤耐性、受託番号PTA-11028、国際公開第2012/033794号に記載)、イベントDAS40278 (トウモロコシ、除草剤耐性、受託番号ATCC PTA-10244、国際公開第2011/022469号に記載) ; イベントDAS-44406-6/pDAB8264.44.06.1 (大豆、除草剤耐性、受託番号PTA-11336、国際公開第2012/075426号に記載)、イベントDAS-14536-7/pDAB8291.45.36.2 (大豆、除草剤耐性、受託番号PTA-11335、国際公開第2012/075429号に記載)、イベントDAS-59122-7 (トウモロコシ、昆虫防除-除草剤耐性、受託番号ATCC PTA 11384、米国特許出願公開第2006-070139号に記載) ; イベントDAS-59132 (トウモロコシ、昆虫防除-除草剤耐性、受託なし国際公開第2009/100188号に記載) ; イベントDAS68416 (大豆、除草剤耐性、受託番号ATCC PTA-10442、国際公開第2011/066384または国際公開第2011/066360号に記載) ; イベント

10

20

30

40

50

トDP - 098140 - 6 (トウモロコシ、除草剤耐性、受託番号ATCC PTA - 8296、米国特許出願公開第2009 - 137395号または国際公開第08 / 112019号に記載) ; イベントDP - 305423 - 1 (大豆、品質特性、受託なし、米国特許出願公開第2008 - 312082号または国際公開第2008 / 054747号に記載) ; イベントDP - 32138 - 1 (トウモロコシ、ハイブリダイゼーションシステム、受託番号ATCC PTA - 9158、米国特許出願公開第2009 - 0210970号または国際公開第2009 / 103049号に記載) ; イベントDP - 356043 - 5 (大豆、除草剤耐性、受託番号ATCC PTA - 8287、米国特許出願公開第2010 - 0184079号または国際公開第2008 / 002872号に記載) ; イベントEE - I (ナス、昆虫防除、受託なし国際公開第07 / 091277号に記載) ; イベントFil 17 (トウモロコシ、除草剤耐性、受託番号ATCC 209031、米国特許出願公開第2006 - 059581号または国際公開第98 / 044140号に記載) ; イベントFG72 (大豆、除草剤耐性、受託番号PTA - 11041、国際公開第2011 / 063413号に記載) ; イベントGA21 (トウモロコシ、除草剤耐性、受託番号ATCC 209033、米国特許出願公開第2005 - 086719号または国際公開第98 / 044140号に記載) ; イベントGG25 (トウモロコシ、除草剤耐性、受託番号ATCC 209032、米国特許出願公開第2005 - 188434号または国際公開第98 / 044140号に記載) ; イベントGHB119 (ワタ、昆虫防除 - 除草剤耐性、受託番号ATCC PTA - 8398、国際公開第2008 / 151780号に記載) ; イベントGHB614 (ワタ、除草剤耐性、受託番号ATCC PTA - 6878、米国特許出願公開第2010 - 050282号または国際公開第2007 / 017186号に記載) ; イベントGJ11 (トウモロコシ、除草剤耐性、受託番号ATCC 209030、米国特許出願公開第2005 - 188434号または国際公開第98 / 044140号に記載) ; イベントGM RZ13 (テンサイ、ウイルス耐性、受託番号NCIMB - 41601、国際公開第2010 / 076212号に記載) ; イベントH7 - 1 (テンサイ、除草剤耐性、受託番号NCIMB 41158またはNCIMB 41159、米国特許出願公開第2004 - 172669号または国際公開第2004 / 074492号に記載) ; イベントJOPLIN1 (小麦、病害耐性、受託なし米国特許出願公開第2008 - 064032号に記載) ; イベントLL27 (大豆、除草剤耐性、受託番号NCIMB 41658、国際公開第2006 / 108674号または米国特許出願公開第2008 - 320616号に記載) ; イベントLL55 (大豆、除草剤耐性、受託番号NCIMB 41660、国際公開第2006 / 108675号または米国特許出願公開第2008 - 196127号に記載) ; イベントLLcotton25 (ワタ、除草剤耐性、受託番号ATCC PTA - 3343、国際公開第2003 / 013224号または米国特許出願公開第2003 - 097687号に記載) ; イベントLLRICE06 (イネ、除草剤耐性、受託番号ATCC 203353、米国特許第6,468,747号または国際公開第2000 / 026345号に記載) ; イベントLLRice62 (イネ、除草剤耐性、受託番号ATCC 203352、国際公開第2000 / 026345号に記載) ; イベントLLRICE601 (イネ、除草剤耐性、受託番号ATCC PTA - 2600、米国特許出願公開第2008 - 2289060号または国際公開第2000 / 026356号に記載) ; イベントLY038 (トウモロコシ、品質特性、受託番号ATCC PTA - 5623、米国特許出願公開第2007 - 028322号または国際公開第2005 / 061720号に記載) ; イベントMIR162 (トウモロコシ、昆虫防除、受託番号PTA - 8166、米国特許出願公開第2009 - 300784号または国際公開第2007 / 142840号に記載) ; イベントMIR604 (トウモロコシ、昆虫防除、受託なし米国特許出願公開第2008 - 167456号または国際公開第2005 / 103301号に記載) ; イベントMON15985 (ワタ、昆虫防除、受託番号ATCC PTA - 2516、米国特許出願公開第2004 - 250317号または国際公開第2002 / 100163号に記載) ; イベントMON810 (トウモロコシ、昆虫防除、受託なし米国特許出願公開第2002 - 102582号に記載) ; イベントMON86

3 (トウモロコシ、昆虫防除、受託番号 ATCC PTA - 2605、国際公開第 2004 / 011601 号または米国特許出願公開第 2006 - 095986 号に記載) ; ベント MON 87427 (トウモロコシ、受粉制御、受託番号 ATCC PTA - 7899、国際公開第 2011 / 062904 号に記載) ; イベント MON 87460 (トウモロコシ、ストレス耐性、受託番号 ATCC PTA - 8910、国際公開第 2009 / 111263 号または米国特許出願公開第 2011 - 0138504 号に記載) ; イベント MON 87701 (大豆、昆虫防除、受託番号 ATCC PTA - 8194、米国特許出願公開第 2009 - 130071 号または国際公開第 2009 / 064652 号に記載) ; イベント MON 87705 (大豆、品質特性 - 除草剤耐性、受託番号 ATCC PTA - 9241、米国特許出願公開第 2010 - 0080887 号または国際公開第 2010 / 037016 号に記載) ; イベント MON 87708 (大豆、除草剤耐性、受託番号 ATCC PTA - 9670、国際公開第 2011 / 034704 号に記載) ; イベント MON 87712 (大豆、収率、受託番号 PTA - 10296、国際公開第 2012 / 051199 号に記載) ; イベント MON 87754 (大豆、品質特性、受託番号 ATCC PTA - 9385、国際公開第 2010 / 024976 号に記載) ; イベント MON 87769 (大豆、品質特性、受託番号 ATCC PTA - 8911、米国特許出願公開第 2011 - 0067141 号または国際公開第 2009 / 102873 号に記載) ; イベント MON 88017 (トウモロコシ、昆虫防除 - 除草剤耐性、受託番号 ATCC PTA - 5582、米国特許出願公開第 2008 - 028482 号または国際公開第 2005 / 059103 号に記載) ; イベント MON 88913 (ワタ、除草剤耐性、受託番号 ATCC PTA - 4854、国際公開第 2004 / 072235 号または米国特許出願公開第 2006 - 059590 号に記載) ; イベント MON 88302 (ナタネ、除草剤耐性、受託番号 PTA - 10955、国際公開第 2011 / 153186 号に記載) ; イベント MON 88701 (ワタ、除草剤耐性、受託番号 PTA - 11754、国際公開第 2012 / 134808 号に記載) ; イベント MON 89034 (トウモロコシ、昆虫防除、受託番号 ATCC PTA - 7455、国際公開第 07 / 140256 号または米国特許出願公開第 2008 - 260932 号に記載) ; イベント MON 89788 (大豆、除草剤耐性、受託番号 ATCC PTA - 6708、米国特許出願公開第 2006 - 282915 号または国際公開第 2006 / 130436 号に記載) ; イベント MS11 (ナタネ、受粉制御 - 除草剤耐性、受託番号 ATCC PTA - 850 または PTA - 2485、国際公開第 2001 / 031042 号に記載) ; イベント MS8 (ナタネ、受粉制御 - 除草剤耐性、受託番号 ATCC PTA - 730、国際公開第 2001 / 041558 号または米国特許出願公開第 2003 - 188347 号に記載) ; イベント NK603 (トウモロコシ、除草剤耐性、受託番号 ATCC PTA - 2478、米国特許出願公開第 2007 - 292854 号に記載) ; イベント PE-7 (イネ、昆虫防除、受託なし、国際公開第 2008 / 114282 号に記載) ; イベント RF3 (ナタネ、受粉制御 - 除草剤耐性、受託番号 ATCC PTA - 730、国際公開第 2001 / 041558 号または米国特許出願公開第 2003 - 188347 号に記載) ; イベント RT73 (ナタネ、除草剤耐性、受託なし、国際公開第 2002 / 036831 号または米国特許出願公開第 2008 - 070260 号に記載) ; イベント SYHT0H2 / SYN - 000H2 - 5 (大豆、除草剤耐性、受託番号 PTA - 11226、国際公開第 2012 / 082548 号に記載) ; イベント T227 - 1 (テンサイ、除草剤耐性、受託なし、国際公開第 2002 / 44407 号または米国特許出願公開第 2009 - 265817 号に記載) ; イベント T25 (トウモロコシ、除草剤耐性、受託なし、米国特許出願公開第 2001 - 029014 号または国際公開第 2001 / 051654 号に記載) ; イベント T304 - 40 (ワタ、昆虫防除 - 除草剤耐性、受託番号 ATCC PTA - 8171、米国特許出願公開第 2010 - 077501 号または国際公開第 2008 / 122406 号に記載) ; イベント T342 - 142 (ワタ、昆虫防除、受託なし、国際公開第 2006 / 128568 号に記載) ; イベント TC1507 (トウモロコシ、昆虫防除 - 除草剤耐性、受託なし、米国特許出願公開第 2005 - 039226 号または国際公開第 2004 / 099447 号

10

20

30

40

50

に記載) ; イベントVIP1034 (トウモロコシ、昆虫防除 - 除草剤耐性、受託番号 ATCC PTA - 3925、国際公開第2003/052073号に記載)、イベント32316 (トウモロコシ、昆虫防除 - 除草剤耐性、受託番号PTA - 11507、国際公開第2011/084632号に記載)、イベント4114 (トウモロコシ、昆虫防除 - 除草剤耐性、受託番号PTA - 11506、国際公開第2011/084621号に記載)、イベントEE - GM3 / FG72 (大豆、除草剤耐性、ATCC受託番号PTA - 11041) は所望によりイベントEE - GM1 / LL27またはイベントEE - GM2 / LL55 (国際公開第2011/063413A2号) においてスタックド品種、イベントDAS - 68416 - 4 (大豆、除草剤耐性、ATCC受託番号PTA - 10442、国際公開第2011/066360 (A1)号)、イベントDAS - 68416 - 4 (大豆、除草剤耐性、ATCC受託番号PTA - 10442、国際公開第2011/066384 (A1)号)、イベントDP - 040416 - 8 (トウモロコシ、昆虫防除、ATCC受託番号PTA - 11508、国際公開第2011/075593 (A1)号)、イベントDP - 043A47 - 3 (トウモロコシ、昆虫防除、ATCC受託番号PTA - 11509、国際公開第2011/075595 (A1)号)、イベントDP - 004114 - 3 (トウモロコシ、昆虫防除、ATCC受託番号PTA - 11506、国際公開第2011/084621 (A1)号)、イベントDP - 032316 - 8 (トウモロコシ、昆虫防除、ATCC受託番号PTA - 11507、国際公開第2011/084632 (A1)号)、イベントMON - 88302 - 9 (ナタネ、除草剤耐性、ATCC受託番号PTA - 10955、国際公開第2011/153186 (A1)号)、イベントDAS - 21606 - 3 (大豆、除草剤耐性、ATCC受託番号PTA - 11028、国際公開第2012/033794 (A2)号)、イベントMON - 87712 - 4 (大豆、品質特性、ATCC受託番号PTA - 10296、国際公開第2012/051199 (A2)号)、イベントDAS - 44406 - 6 (大豆、スタックド品種、除草剤耐性、ATCC受託番号PTA - 11336、国際公開第2012/075426 (A1)号)、イベントDAS - 14536 - 7 (大豆、スタックド品種、除草剤耐性、ATCC受託番号PTA - 11335、国際公開第2012/075429 (A1)号)、イベントSYN - 000H2 - 5 (大豆、除草剤耐性、ATCC受託番号PTA - 11226、国際公開第2012/082548 (A2)号)、イベントDP - 061061 - 7 (ナタネ、除草剤耐性、受託番号なし、国際公開第2012071039 (A1)号)、イベントDP - 073496 - 4 (ナタネ、除草剤耐性、受託番号なし、米国特許出願公開第2012131692号)、イベント8264.44.06.1 (大豆、スタックド品種、除草剤耐性、受託番号PTA - 11336、国際公開第2012075426 (A2)号)、イベント8291.45.36.2 (大豆、スタックド品種、除草剤耐性、受託番号PTA - 11335、国際公開第2012075429 (A2)号)、イベントSYHT0H2 (大豆、ATCC受託番号PTA - 11226、国際公開第2012/082548 (A2)号)、イベントMON88701 (ワタ、ATCC受託番号PTA - 11754、国際公開第2012/134808 (A1)号)、イベントKK179 - 2 (アルファルファ、ATCC受託番号PTA - 11833、国際公開第2013/003558 (A1)号)、イベントpDAB8264.42.32.1 (大豆、スタックド品種、除草剤耐性、ATCC受託番号PTA - 11993、国際公開第2013/010094 (A1)号)、イベントMZDT09Y (トウモロコシ、ATCC受託番号PTA - 13025、国際公開第2013/012775 (A1)号)。

【0334】

さらに、そのようなトランスジェニックイベントのリストは、米国農務省 (USDA) の動植物衛生検査サービス (APHIS) によって提供されており、ワールドワイドウェブ上のWebサイト (aphis.usda.gov) で見ることができる。この出願については、この出願の出願日におけるそのようなリストの状態がそのまま/そのままであったように関連する。

【0335】

10

20

30

40

50

問題の所望の形質を付与する遺伝子ノイベントは、トランスジェニック植物において互いに組み合わせて存在する場合もある。言及される可能性のあるトランスジェニック植物の例は、重要な作物植物であり、穀類（小麦、米、ライ小麦、大麦、ライ麦、オート麦）、とうもろこし、大豆、じゃがいも、テンサイ、サトウキビ、トマト、えんどう豆、その他の野菜、ワタ、タバコ、ナタネ、並びに果樹（リンゴ、ナシ、柑橘類、ぶどうを含む）を含み、トウモロコシ、大豆、小麦、米、じゃがいも、ワタ、サトウキビ、タバコ、およびナタネに特に重点が置かれる。特に強調される特性は、昆虫、クモ形類動物、線虫、ナメクジ、およびカタツムリに対する植物の耐性の増加、並びに1または複数の除草剤に対する植物の耐性の増加である。

#### 【0336】

本発明に従って優先的に処理され得るそのような植物、植物部分または植物種子の商業的に入手可能な例には、商品名（GENUITY（登録商標）、DROUGHTGARD（登録商標）、SMARTSTAX（登録商標）、RIB COMPLETE（登録商標）、ROUNDUP READY（登録商標）、VT DOUBLE PRO（登録商標）、VT TRIPLE PRO（登録商標）、BOLLGARD II（登録商標）、ROUNDUP READY 2 YIELD（登録商標）、YIELDGARD（登録商標）、ROUNDUP READY（登録商標）2 XTEND（商標）、INTACTARR2 PRO（登録商標）、VISTIVE GOLD（登録商標）、および/またはXTENDFLEX（商標））で販売または流通される植物種子などの商品が含まれる。

#### 【0337】

##### 病原体

本発明に従って治療することができる真菌性病害の病原体の非限定的な例には、以下が含まれる：

うどん粉病病原体、例えば、ブルメリア属（*Blumeria*）種、例えばブルメリア・グラミニス（*Blumeria graminis*）、ポドスファエラ属（*Podosphaera*）種、例えばポドスファエラ・ロイコトリカ（*Podosphaera leucotricha*）、スファエロテカ属（*Sphaerotheca*）種、例えばスファエロテカ・フリギネア（*Sphaerotheca fuliginea*）、ウンシヌラ属（*Uncinula*）種、例えばウンシヌラ・ネカトル（*Uncinula necator*）によって引き起こされる病害；

さび病病原体、例えば、ギムノスポランギウム属（*Gymnosporangium*）種（例えば、ギムノスポランギウム・サピナエ（*Gymnosporangium sabiniae*））、ヘミレイア属（*Hemileia*）種（例えば、ヘミレイア・バスタトリックス（*Hemileia vastatrix*））、ファコソブラ属（*Phakopsora*）種（例えば、ファコソブラ・パキジリ（*Phakopsora pachyrhizi*）またはファコソブラ・メイボミアエ（*Phakopsora meibomiae*））、プッキニア属（*Puccinia*）種（例えば、プッキニア・レコンディタ（*Puccinia recondita*））、プッキニア・グラミニス（*Puccinia graminis*）、またはプッキニア・ストリホルミス（*Puccinia striiformis*））、ウロミケス属（*Uromyces*）種（例えば、ウロミケス・アペンディクラツス（*Uromyces appendiculatus*））による病害；

例えば、アルブゴ属（*Albugo*）種（例えば、アルブゴ・カンディダ（*Albugo candida*））、ブレミア属（*Bremia*）種（例えば、ブレミア・ラクツケ（*Bremia lactucae*））、ペロノスポラ属（*Peronospora*）種（例えば、ペロノスポラ・ピシ（*Peronospora pisi*）またはペロノスポラ・ブラシカエ（*P. brassicae*））、フィトフトラ属（*Phytophthora*）種（例えば、フィトフトラ・インフェスタンス（*Phytophthora infestans*））、プラズモパラ属（*Plasmopara*）種（例えば、プラズモパラ・ビチコラ（*Plasmopara viticola*））、シュドペロノスポラ属（

10

20

30

40

50

*Pseudoperonospora*)種(例えば、シュドペロノスポラ・フムリ(*Pseudoperonospora humuli*)またはシュドペロノスポラ・クベンス(*Pseudoperonospora cubensis*))、ピシウム属(*Pythium*)種(例えば、ピシウム・ウルティムム(*Pythium ultimum*))である卵菌類群の病原体によって引き起こされる病害；

例えば、アルテルナリア属(*Alternaria*)種、例えばアルテルナリア・ソラニ(*Alternaria solani*)、セルコスボラ属(*Cercospora*)種(例えば、セルコスボラ・ベティコラ(*Cercospora beticola*))、クラドスポリウム属(*Cladosporium*)種(例えば、クラドスポリウム・ククメリナム(*Cladosporium cucumerinum*))、コクリオボルス属(*Cochliobolus*)種(例えば、コクリオボルス・サチブス(*Cochliobolus sativus*))(分生子形態：ドレクスレア(*Drechslera*))、シノニム：ヘルミントスポリウム(*Helminthosporium*)またはコクリオボルス・ミヤベアヌス(*Cochliobolus miyabeanus*)、コレトトリカム属(*Colletotrichum*)種(例えばコレトトリカム・リンデムチアヌム(*Colletotrichum lindemuthanium*))、コリネスボラ属(*Corynespora*)種(例えば、コリネスボラ・カッシイコラ(*Corynespora cassiicola*))、シクロコニウム属(*Cycloconium*)種(例えば、シクロコニウム・オレアギヌム(*Cycloconium oleaginum*))、ジアポルテ属(*Diaporthe*)種(例えば、ジアポルテ・シトリ(*Diaporthe citri*))、エルシノエ属(*Elsinoe*)種(例えば、エルシノエ・ファウセッチイ(*Elsinoe fawcettii*))、グロエオスポリウム属(*Gloeosporium*)種(例えば、グロエオスポリウム・ラエチコロール(*Gloeosporium laeticolor*))、グロメラ属(*Glomerella*)種(例えば、グロメラ・シングラタ(*Glomerella cingulata*))、ギグナルデア属(*Guignardia*)種(例えば、ギグナルデア・ビドウェルリイ(*Guignardia bidwellii*))、レプトスファエリ属(*Leptosphaeria*)種(例えば、レプトスファエリア・マクランズ(*Leptosphaeria maculans*))、マグナポルテ属(*Magnaporthe*)種(例えば、マグナポルテ・グリセア(*Magnaporthe grisea*))、ミクロドキウム属(*Microdochium*)種(例えば、ミクロドキウム・ニバレ(*Microdochium nivale*))、ミコスファエレラ属(*Mycosphaerella*)種(例えば、ミコスファエレラ・グラミニコラ(*Mycosphaerella graminicola*))、ミコスファエレラ・アラキディコラ(*Mycosphaerella arachidicola*)、またはミコスファエレラ・フィジエンシス(*Mycosphaerella fijjensis*))、フェオスファエリア属(*Phaeosphaeria*)種(例えば、フェオスファエリア・ノドルム(*Phaeosphaeria nodorum*))、ピレノホラ属(*Pyrenophora*)種(例えば、ピレノホラ・テレス(*Pyrenophora teres*)またはピレノホラ・トリティキレペンティス(*Pyrenophora tritici repentis*))、ラムラリア属(*Ramularia*)種、例えば、ラムラリア・コロシグニ(*Ramularia collo-cygni*)またはラムラリア・アレオラ(*Ramularia areola*))、リンコスボリウム属(*Rhynchosporium*)種(例えば、リンコスボリウム・セカリス(*Rhynchosporium secalis*))、セプトリア属(*Septoria*)種(例えば、セプトリア・アピイ(*Septoria api*)またはセプトリア・リコベルシキ(*Septoria lycopersici*))、スタゴノスポラ属(*Stagonospora*)種(例えば、スタゴノスポラ・ノドルム(*Stagonospora nodorum*))、ティフラ属(*Typhula*)種(例えば、チフラ・インカルナタ(*Typhula incarnata*))、ベンツリア属(*Venturia*)種(例えば、ベンツリア・

10

20

30

40

50

イナエクアリス (*Venturia inaequalis*) ) によって引き起こされる褐斑病および立枯病；

例えば、コルチキウム属 (*Corticium*) 種 (例えば、コルチキウム・グラミナルム (*Corticium graminearum*) )、フザリウム属 (*Fusarium*) 種 (例えば、フザリウム・オキシスポルム (*Fusarium oxysporum*) )、ゲウマノミセス属 (*Gaeumannomyces*) 種 (例えば、ゲウマノミセス・グラミニス (*Gaeumannomyces graminis*) )、プラスモディオホラ属 (*Plasmodiophora*) 種 (例えば、プラスモディオホラ・ブラシカエ (*Plasmodiophora brassicae*) )、リゾクトニア属 (*Rhizoctonia*) 種 (例えば、リゾクトニア・ソラニ (*Rhizoctonia solani*) )、サロクラジウム属 (*Sarocladium*) 種 (例えば、サロクラジウム・オリザエ (*Sarocladium oryzae*) )、スクレロチウム属 (*Sclerotium*) 種 (例えば、スクレロチウム・オリザエ (*Sclerotium oryzae*) )、タペシア属 (*Tapesia*) 種 (例えば、タペシア・アクホルミス (*Tapesia aciformis*) )、チエラウィオプシス属 (*Thielaviopsis*) 種 (例えば、チエラウィオプシス・バシコラ (*Thielaviopsis basicola*) ; ) によって引き起こされる根と茎の病害；

例えば、アルテルナリア属 (*Alternaria*) 種 (例えば、アルテルナリア属の種 (*Alternaria* spp.) )、アスペルギルス属 (*Aspergillus*) 種 (例えば、アスペルギルス・フラウス (*Aspergillus flavus*) )、クラドスポリウム属 (*Cladosporium*) 種 (例えば、クラドスポリウム・クラドスポリオエデス (*Cladosporium cladosporioides*) )、クラビセプス属 (*Claviceps*) 種 (例えば、クラビセプス・プルプレア (*Claviceps purpurea*) )、フザリウム属 (*Fusarium*) 種 (例えば、フザリウム・クルモルム (*Fusarium culmorum*) )、ギベレラ属 (*Gibberella*) 種 (例えば、ギベレラ・ゼアエ (*Gibberella zeae*) )、モノグラフェラ属 (*Monographella*) 種 (例えば、モノグラフェラ・ニバリス (*Monographella nivalis*) )、スタグノスポラ属 (*Stagnospora*) 種 (例えば、スタグノスポラ・ノドルム (*Stagnospora nodorum*) ) によって引き起こされる穂や円錐花序の病害 (トウモロコシの穂軸を含む) ；

スマット菌、例えば、スファケロテカ属 (*Sphacelotheca*) 種 (例えば、スファケロテカ・レイリアナ (*Sphacelotheca reiliana*) )、チレチア属 (*Tilletia*) 種 (例えば、チレチア・カリエス (*Tilletia caries*) またはチレチア・コントロベルサ (*Tilletia controversa*) )、ウロチステイス属 (*Urocystis*) 種 (例えば、ウロチステイス・オックルタ (*Urocystis occulta*) )、ウスチラゴ属 (*Ustilago*) 種 (例えば、ウスチラゴ・ヌダ (*Ustilago nuda*) ) によって引き起こされる病害；

例えば、アスペルギルス属 (*Aspergillus*) 種 (例えば、アスペルギルス・フラウス (*Aspergillus flavus*) )、ボトリチス属 (*Botrytis*) 種 (例えば、ボトリチス・シネレア (*Botrytis cinerea*) )、モニリニア属 (*Monilinia*) 種 (例えば、モニリニア・ラクサ) )、ペニシリウム属 (*Penicillium*) 種 (例えば、ペニシリウム・イクパンザム (*Penicillium expansum*) またはペニシリウム・プルプロゲナム (*Penicillium purpurogenum*) )、リゾープス属 (*Rhizopus*) 種 (例えば、リゾープス・ストロニフェル (*Rhizopus stolonifer*) )、スクレロチニア属 (*Sclerotinia*) 種 (例えば、スクレロチニア・スクレロチオルム (*Sclerotinia sclerotiorum*) )、ベルチキリウム属 (*Verticillium*) 種 (例えば、ベルチキリウム・アルポアトルム (*Verticilli*

10

20

30

40

50

um albo atrum)) によって引き起こされる果実腐敗；

例えば、アルテルナリア属 (*Alternaria*) 種 (例えば、アルテルナリア・ブラシキコラ (*Alternaria brassicicola*))、アフアノミケス属 (*Aphanomyces*) 種 (例えば、アフアノミケス・エウテイケス (*Aphanomyces euteiches*))、アスコシタ属 (*Ascochyta*) 種 (例えば、アスコシタ・レンチス (*Ascochyta lentis*))、アスペルギルス属 (*Aspergillus*) 種 (例えば、アスペルギルス・フラウス (*Aspergillus flavus*))、クラドスポリウム属 (*Cladosporium*) 種 (例えば、クラドスポリウム・ヘルバルム (*Cladosporium herbarum*))、コクリオボルス属 (*Cochliobolus*) 種 (例えば、コクリオボルス・サチブス (*Cochliobolus sativus*)) (分生子形態：ドレクスレラ属 (*Drechslera*))、ビポラリス属 (*Bipolaris*) (シノニム)：ヘルミントスポリウム属 (*Helminthosporium*)、コレトトリクム属 (*Colletotrichum*) 種 (例えば、コレトトリクム・コッコデス (*Colletotrichum coccodes*))、フザリウム属 (*Fusarium*) 種 (例えば、フザリウム・クルモルム (*Fusarium culmorum*))、ギベレラ属 (*Gibberella*) 種 (例えば、ギベレラ・ゼアエ (*Gibberella zeae*))、マクロホミナ属 (*Macrophomina*) 種 (例えば、マクロホミナ・ファゼオリナ (*Macrophomina phaseolina*))、ミクロドキウム属 (*Microdochium*) 種 (例えば、ミクロドキウム・ニバレ (*Microdochium nivale*))、モノグラフェラ属 (*Monographella*) 種 (例えば、モノグラフェラ・ニバリス (*Monographella nivalis*))、ペニシリウム属 (*Penicillium*) 種 (例えば、ペニシリウム・エクспанスム (*Penicillium expansum*))、ホーマ属 (*Phoma*) 種 (例えば、ホーマ・リンガム (*Phoma lingam*))、ポモプシス属 (*Phomopsis*) 種 (例えば、ポモプシス・ソジャエ (*Phomopsis sojae*))、フィトフトラ属 (*Phytophthora*) 種 (例えば、フィトフトラ・カクトルム (*Phytophthora cactorum*))、ピレノホラ属 (*Pyrenophora*) 種 (例えば、ピレノホラ・グラミネア (*Pyrenophora graminea*))、ピリクラリア属 (*Pyricularia*) 種 (例えば、ピリクラリア・オリザエ (*Pyricularia oryzae*))、ピシウム属 (*Pythium*) 種 (例えば、ピシウム・ウルティムム (*Pythium ultimum*))、リゾクトニア属 (*Rhizoctonia*) 種 (例えば、リゾクトニア・ソラニ (*Rhizoctonia solani*))、リゾープス属 (*Rhizopus*) 種 (例えば、リゾープス・オリザエ (*Rhizopus oryzae*))、スクレロチウム属 (*Sclerotium*) 種 (例えば、スクレロチウム・ロルフシイ (*Sclerotium rolfsii*))、セプトリア属 (*Septoria*) 種 (例えば、セプトリア・ノドルム (*Septoria nodorum*))、ティフラ属 (*Typhula*) 種 (例えば、ティフラ・インカルナタ (*Typhula incarnata*))、ウェルチキリウム属 (*Verticillium*) 種 (例えば、ウェルチキリウム・ダリアエ (*Verticillium dahliae*)) によって引き起こされる種子および土壌由来の腐敗および立枯病、また苗の病害；

例えば、ネクトリア属 (*Nectria*) 種 (例えば、ネクトリア・ガリゲナ (*Nectria galligena*)) によって引き起こされる癌腫 (cancer)、こぶ (gall)、およびてんぐ巣病 (witches' broom)；

例えば、ベルチキリウム属 (*Verticillium*) 種 (例えば、ベルチキリウム・ロンギスボルム (*Verticillium longisporum*))、フザリウム属 (*Fusarium*) 種 (例えば、フザリウム・オキシスポルム (*Fusarium oxysporum*)) によって引き起こされる立枯病；

例えば、エキソバシジウム属 (*Exobasidium*) 種 (例えば、エキソバシジウム・ベキサンズ (*Exobasidium vexans*))、タフリナ属 (*Taphr*



ina) 種 (例えば、タフリナ・デホルマンズ (*Taphrina deformans*)) によって引き起こされる葉、花、果実の変形；

例えば、エスカ属 (*Esca*) 種 (例えば、ファエオモニエラ・クラミドスポラ (*Phaeomonieella chlamydospora*)、ファエオアクレモニウム・アエオフィラム (*Phaeoacremonium aleophilum*)、またはホミチポリア・メジテラネア (*Fomitiporia mediterranea*)、ガノデルマ属 (*Ganoderma*) 種 (例えば、ガノデルマ・ボニンセンセ (*Ganoderma boninense*)) によって引き起こされる木本植物の変性病害；

例えば、リゾクトニア属 (*Rhizoctonia*) 種 (例えば、リゾクトニア・ソラニ (*Rhizoctonia solani*))、ヘルミントス属 (*Helminthosporium*) 種 (例えば、ヘルミントスポリウム・ソラニ (*Helminthosporium solani*)) によって引き起こされる植物塊茎の病害；

細菌性病原体、例えば、キサントモナス属 (*Xanthomonas*, ) 種 (例えば、キサントモナス・カンペストリス・pv. オリザエ (*Xanthomonas campestris* pv. *oryzae*))、シュードモナス属 (*Pseudomonas*) 種 (例えば、シュードモナス・シリングエ・pv. ラクリマンズ (*Pseudomonas syringae* pv. *lachrymans*))、エルウィニア属 (*Erwinia*) 種 (例えば、エルウィニア・アミロボラ (*Erwinia amylovora*))、リベリバクター属 (*Liberibacter*) 種 (例えば、リベリバクター・アシアティクス (*Liberibacter asiaticus*))、キシレラ属 (*Xylella*) 種 (例えば、キシレラ・ファスティディオサ (*Xylella fastidiosa*))、ラルストニア属 (*Ralstonia*) 種 (例えば、ラルストニア・ソラナケアルム (*Ralstonia solanacearum*))、ディケヤ属 (*Dickeya*) 種 (例えば、ディケヤ・ソラニ (*Dickeya solani*))、クラビバクター属 (*Clavibacter*) 種 (例えば、クラビバクター・ミシガネンシス (*Clavibacter michiganensis*))、ストレプトマイセス属 (*Streptomyces*) 種 (例えば、ストレプトマイセス・スキャビーズ (*Streptomyces scabies*)) によって引き起こされる病害。

#### 【0338】

ダイズの病害：

例えば、黒斑病 (アルテルナリア属の種アトランス・テラヌイスシマ (*Alternaria spec. atrans tenuissima*))、炭疽病 (コレトトリクム・グロエオスポイデス・デマチウム (変種) トルンカツム (*Colletotrichum gloeosporoides dematium* var. *truncatum*))、褐斑病 (セプトリア・グリシネス (*Septoria glycines*))、テンサイ褐斑病および胴枯れ病 (セルコスボラ・キクチイ (*Cercospora kikuchii*))、コアネフォラ立枯病 (コアネフォラ・インフンジブリフェラ・トリスポラ (シノニム))、ダクチュリホラ斑点病 (ダクチュリホラ・グリシネス (*Dactuliophora glycines*))、べと病 (ペロノスポラ・マンシュリカ (*Perothospora manshurica*))、ドレクスレア胴枯れ病 (ドレクスレア・グリシニ (*Drechslera glycinii*))、赤星病斑点病 (セルコスボラ・ソジナ (*Cercospora sojae*))、レプトスファエルリナ斑点病 (レプトスファエルリナ・トリホリイ (*Leptosphaerulina trifolioli*))、フィロスティクタ斑点病 (フィロスティクタ・ソジャエコラ (*Phyllosticta sojaecola*))、鞘および茎の胴枯れ病 (ポモプシス・ソジャエ (*Phomopsis sojae*))、うどん粉病 (マイクロスファエラ・ジフサ (*Microsphaera diffusa*))、ピレノカエタ斑点病 (ピレノカエタ・グリシネス (*Pyrenochaeta glycines*))、ダイズ葉腐病、群葉、およびクモの巣病 (リゾクトニア・ソラニ (*Rhizoctonia solani*))、さび病 (ファコソブラ・パキジリ (*Phakopsora pachyrhizi*))、ファコソ

10

20

30

40

50

ブラ・メイボミア (*Phakopsora meibomiae*)、腐敗病 (スファケロマ・グリシネス (*Sphaceloma glycines*))、ステムフィリウム立枯病 (ステムフィリウム・ボトリオスム (*Stemphylium botryosum*))、突然枯死症候群 (フザリウム・ビルグリフォルム (*Fusarium virguliforme*))、輪紋病 (コリネスポラ・カッシイコラ (*Corynespora cassiicola*)) によって引き起こされる葉、茎、鞘、種子の真菌性病害。

【0339】

根および茎基部の真菌性病害は、例えば、黒色根腐れ病 (カロネクトリア・クロタラリアエ (*Calonectria crotalariae*))、炭腐病 (マクロホミナ・ファゼオリナ (*Macrophomina phaseolina*))、赤かび病または立枯病、根腐れ病、並びに鞘腐れおよび頸領腐れ病 (フザリウム・オキシスポルム (*Fusarium oxysporum*))、フザリウム・オルトセラス (*Fusarium orthoceras*)、フザリウム・セミテクトム (*Fusarium semitectum*)、フザリウム・エクイセチ (*Fusarium equiseti*)、ミコレプトディスカス根腐れ病 (ミコレプトディスカス・テレストリス (*Mycoleptodiscus terrestris*))、ネオコスモスポラ (*neocosmospora*) (ネオコスモスポラ・バシンフェクタ (*Neocosmospora vasinfecta*))、鞘枯および茎枯病 (ディアポルテ・ファセオロラム (*Diaporthe phaseolorum*))、枝枯病 (ディアポルテ・ファセオロラム (変種) カウリボラ (*Diaporthe phaseolorum var. caulivora*))、フィトフトラ腐敗病 (フィトフトラ・メガスペルマ (*Phytophthora megasperma*))、落葉病 (フィアロホラ・グレガータ (*Phialophora gregata*))、クサレカビ腐敗病 (フィチウム・アフアニデルマツム (*Pythium aphanidermatum*))、フィチウム・イレグラレ (*Pythium irregulare*)、フィチウム・デバリアヌム (*Pythium debaryanum*)、フィチウム・ミリオチルム (*Pythium myriotylum*)、フィチウム・ウルチナム (*Pythium ultimum*))、リゾクトニア腐れ病、幹腐食および立枯病 (リゾクトニア・ソラニ (*Rhizoctonia solani*))、スクレオチニア幹腐食 (スクレロチニア・スクレロチウム (*Sclerotinia sclerotiorum*))、白絹病 (スクレロチニア・ロルフシ (*Sclerotinia rolfii*))、チエラビオプシス根腐れ病 (チエラビオプシス・パシコラ (*Thielaviopsis basicola*)) によって引き起こされる。

【0340】

マイコトキシン

さらに、式 (I) の化合物および本発明の組成物は、収穫された材料およびそれから調製された食物および飼料中のマイコトキシン含有量を減少させることができる。マイコトキシンには、特に以下のものが含まれるが、これらに限定されない：デオキシニバレノール (DON)、ニバレノール、15-Ac-DON、3-Ac-DON、T2-毒素およびHT2-毒素、フモニシン、ゼアラレノン、モニリホルミン、フサリン、ジアセトキシルペノール (DAS)、ビューベリシン、エニアチン、フサロプロリフェリン、フサレノール、オクラトキシン、パツリン、麦角アルカロイド、並びにアフラトキシン、これらは、例えば以下の真菌によって産生され得る：フザリウム種 (*Fusarium*)、例えば、フザリウム・アクミナツム (*F. acuminatum*)、フザリウム・アジアティカム (*F. asiaticum*)、フザリウム・アベナシウム (*F. avenaceum*)、フザリウム・クルークウエレンセ (*F. crookwellense*)、フザリウム・クルモルム (*F. culmorum*)、フザリウム・グラミネアルム (*F. graminearum*) (ギベレラ・ゼアエ (*Gibberella zeae*))、フザリウム・エクイセチ (*F. equiseti*)、フザリウム・フジコロイ (*F. fujikoroii*)、フザリウム・ムサルム (*F. musarum*)、フザリウム・オキシスポルム (*F. oxysporum*)、フザリウム・プロリフェラツム (*F. proliferans*)、



合物および本発明の組成物は、塩水または汽水と接触する物体、特に船体、スクリーン、ネット、建物、係留システム、および信号システムを汚れから保護するために使用することができる。

【0347】

式(I)の化合物および本発明の組成物はまた、貯蔵品を保護するために使用され得る。貯蔵品とは、植物または動物由来の天然物質または天然由来であり、長期保護が望まれるその加工製品を意味すると理解される。植物由来の貯蔵品、例えば茎、葉、塊茎、種子、果実、穀物などの植物または植物の部分は、収穫したての状態、または(前)乾燥、湿潤、粉碎、研削、圧搾、または焙煎による加工後に保護される場合がある。貯蔵品には、建設用材木、電柱、バリアなどの未加工の木材、または家具などの完成品の形の材木も含まれる。動物由来の貯蔵品は、例えば、皮(hide)、革(leather)、毛皮、および毛である。式(I)の化合物および本発明の組成物は、腐敗、崩壊、変色、脱色、またはカビの形成などの悪影響を防ぐことができる。

10

【0348】

工業材料を分解または変質できる微生物には、例えば、細菌、真菌、酵母、藻類、および粘液生物が含まれる。式(I)の化合物および本発明の組成物は、好ましくは菌類、特にカビ、木材変色菌、および木材破壊菌(子囊菌類(Ascomycetes)、担子菌類Basidiomycetes)、不完全菌類(Deuteromycetes)、および接合菌類(Zygomycetes))に対して、並びに粘液生物および藻類に対して作用する。菌類の例には以下の属の微生物が含まれる:アルテルナリア属(Alternaria, ) (アルタルナリア テヌイス(Alternaria tenuis)など)、アスペルギルス属(Aspergillus) (アスペルギルス・ニガー(Aspergillus niger)など)、ケトミウム属(Chaetomium) (ケトミウム・グロボーサム(Chaetomium globosum)など)、コニオフォラ属(Coniophora) (コニオフォラ・プテアナ(Coniophora puteana)など)、レンティヌス属(Lentinus) (レンティヌス・チグリヌス(Lentinus tigrinus)など)、ペニシリウム属(Penicillium) (ペニシリウム・グラウカム(Penicillium glaucum)など)、ポリポルス属(Polyporus) (ポリポルス・バージカラー(Polyporus versicolor)など)、アウレオバシジウム属(Aureobasidium) (アウレオバシジウム・プルランス(Aureobasidium pullulans)など)、スクレロフォーマ属(Sclerophoma) (スクレロフォーマ・ピティオフィラ(Sclerophoma pityophila)など)、トリコデルマ属(Trichoderma) (トリコデルマ・ヴィリデ(Trichoderma viride)など)、オフィオストマ属(Ophiostoma, )種、ケラトシステス属(Ceratocystis)種、フミコラ属(Humicola, )種、ペトリエラ属(Petriella, )種、トリクルス属(Trichurus)種、コリオルス属(Coriolus)種、グロエフィラム属(Gloeophyllum)種、プレウロタス属(Pleurotus)種、ポリア属(Poria)種、セルブラ属(Serpula)種およびチロマイセス属(Tyromyces)種、クラドスポリウム属(Cladosporium)種、ペシロマイセス属(Paecilomyces)種、ムーコル属(Mucor)種、エシェリキア属(Escherichia) (大腸菌(Escherichia coli)など)、シュードモナス属(Pseudomonas) (緑膿菌(Pseudomonas aeruginosa; )など)、ブドウ球菌属(Staphylococcus) (黄色ブドウ球菌(Staphylococcus aureus)など)、カンジダ属(Candida)種、並びにサッカロマイセス属(Saccharomyces) (サッカロマイセス・セレビスエ(Saccharomyces cerevisiae)など)。

20

30

40

【0349】

種子処理

50

式 ( I ) の化合物および本発明の組成物はまた、望ましくない微生物、例えば植物病原性微生物、例えば植物病原性真菌または植物病原性卵菌から種子を保護するために使用され得る。本明細書で使用される種子という用語には、休眠種子、プライミング種子、発芽前種子、並びに出芽した根および葉を有する種子が含まれる。

【 0 3 5 0 】

したがって、本発明はまた、式 ( I ) の化合物または本発明の組成物で種子を処理する工程を含む、望ましくない微生物から種子を保護する方法に関する。

【 0 3 5 1 】

式 ( I ) の化合物または本発明の組成物による種子の処理は、植物病原性微生物から種子を保護するが、発芽種子、出芽実生、および処理された種子から出芽した後の植物も保護する。したがって、本発明はまた、種子を保護し、種子を発芽させ、出芽した実生を保護する方法にも関する。

【 0 3 5 2 】

種子処理は、播種前、播種時、または播種直後に行うことができる。

【 0 3 5 3 】

種子処理が播種前に行われる場合 (例えば、いわゆる種子上施用)、種子の処理は、以下のように行うことができる: 種子を、所望の量の式 ( I ) の化合物または本発明の組成物と共にミキサーに入れることができ、種子および式 ( I ) の化合物または本発明の組成物を、種子への均一な分布が達成されるまで混合する。必要に応じて、種子を乾燥させる。

【 0 3 5 4 】

本発明は、式 ( I ) の化合物または本発明の組成物でコーティングされた種子にも関する。

【 0 3 5 5 】

好ましくは、種子は、処理の過程で損傷が生じないように十分に安定な状態で処理される。概して、種子は収穫から播種直後まで任意の時点で処理され得る。植物から分離され、果実の穂軸、殻、茎、外皮、毛、または果肉を取り除いた種子を使用することが通例である。例えば、収穫され、洗浄され、含水量が 15 重量%未満になるまで乾燥された種子を使用することが可能である。あるいは、乾燥後、例えば、水で処理してから再度乾燥させた種子、プライミング直後の種子、プライミングされた状態で保存された種子、発芽前の種子、または苗床用トレイ、テープ、若しくは紙に播種された種子を使用することも可能である。

【 0 3 5 6 】

種子に適用される式 ( I ) の化合物または本発明の組成物の量は、典型的には、種子の発芽が損なわれないか、または得られる植物が損傷を受けないような量である。これは、特に式 ( I ) の化合物が特定の施用率で植物毒性効果を示す場合に確保されなければならない。最小量の化合物を使用して最適な種子および発芽植物の保護を達成するために、種子に適用される式 ( I ) の化合物の量を決定する際に、トランスジェニック植物の固有の表現型も考慮に入れるべきである。

【 0 3 5 7 】

式 ( I ) の化合物はそのまま種子に直接、すなわち他の成分を使用せず、希釈せずに施用することができる。また、本発明の組成物は種子に施用することができる。

【 0 3 5 8 】

式 ( I ) の化合物および本発明の組成物は、あらゆる植物品種の種子を保護するのに適している。好ましい種子は、穀類 (コムギ、オオムギ、ライムギ、キビ、ライコムギ、およびエンバクなど)、ナタネ、トウモロコシ、綿、大豆、イネ、ジャガイモ、ヒマワリ、豆、コーヒー、エンドウ豆、テンサイ (例えば、テンサイおよび飼料ビート)、ピーナッツ、野菜 (トマト、キュウリ、タマネギ、およびレタスなど)、芝生、および観葉植物の種子である。より好ましいのは、コムギ、ダイズ、アブラナ、トウモロコシ、およびイネの種子である。

10

20

30

40

50

## 【0359】

式(I)の化合物および本発明の組成物は、トランスジェニック種子、特に、害虫、除草剤による損傷、または非生物的ストレスに対して作用するポリペプチド若しくはタンパク質を発現することができる植物の種子を処理するために使用することができ、それによって保護効果を増大させる。害虫、除草剤による損傷、または非生物的ストレスに対して作用するポリペプチド若しくはタンパク質を発現できる植物の種子は、前記ポリペプチド若しくはタンパク質の発現を可能にする少なくとも1つの異種遺伝子を含み得る。トランスジェニック種子中のこれらの異種遺伝子は、例えば、バチルス(Bacillus)、リゾビウム(Rhizobium)、シュードモナス(Pseudomonas)、セラチア(Serratia)、トリコデルマ(Trichoderma)、クラビバクター(Clavibacter)、グロムス(Glomus)、またはグリオクラジウム(Gliocladium)の種の微生物に由来し得る。これらの異種遺伝子は、好ましくはバチルス属種に由来し、その場合、遺伝子産物はヨーロッパアワノメイガおよび/またはウエスタンコーンルートワームに対して有効である。特に好ましくは、異種遺伝子はバチルス・スリングエンシス(Bacillus thuringiensis)に由来する。

10

## 【0360】

## 施用

式(I)の化合物は、そのまま、または例えば、即時使用可能溶液、エマルジョン、水性若しくは油性懸濁液、粉末、水和剤、ペースト、可溶性粉末、粉剤、可溶性顆粒、散布用顆粒、サスポエマルジョン濃縮物、式(I)の化合物を含浸させた天然物、式(I)の化合物を含浸させた合成物質、肥料、またはポリマー物質中のマイクロカプセル化物などの形態で施用することができる。

20

## 【0361】

施用は、通常の方法で、例えば、散水、噴霧(スプレー)、霧化、吹き付け、散粉、泡立て、または塗布によって達成される。式(I)の化合物を、ドリップ灌漑システムまたはドレンチ施用を介して超低容量法により展開し、畝内に施用するか、または土壌の幹部若しくは胴部に注入することも可能である。式(I)の化合物を、創傷封止材、塗料、または他の創傷包帯によって施用することがさらに可能である。

## 【0362】

植物、植物部分、果実、種子または土壌に適用される式(I)の化合物の有効かつ植物に適合した量は、使用する化合物/組成物、処理の対象(植物、植物の一部、果実、種子、または土壌)、処理の種類(散布、散播、播種)、処理の目的(治療的および保護的)、微生物の種類、微生物の発育段階、微生物の感受性、作物の成長段階、および環境条件など様々な要因によって決まる。

30

## 【0363】

式(I)の化合物が殺真菌剤として使用される場合、施用率は、施用の種類に応じて、比較的広い範囲内で変動し得る。葉などの植物部分の処理では、施用量は、0.1~10,000g/ha、好ましくは10~1000g/ha、より好ましくは50~300g/haの範囲内であり得る(散水または滴下による施用の場合、特にロックウールやパーライトなどの不活性基材が使用されている際は、塗布率を下げることも可能である)。種子の処理では、施用量は、種子100kg当たり0.1~200g、好ましくは種子100kg当たり1~150g、より好ましくは種子100kg当たり2.5~25g、さらにより好ましくは種子100kg当たり2.5~12.5gの範囲内であり得る。土壌処理の場合、施用量は0.1~10,000g/ha、好ましくは1~5000g/haの範囲内である。

40

## 【0364】

これらの施用率は単なる例であり、本発明の範囲を限定することを意図するものではない。

## 【0365】

式(I)の化合物および本発明の組成物は、例えば、場所特有の作物管理、サテライト

50

ファーミング、精密ファーミング、または精密農業のためのコンピュータプログラムに組み込まれているモデルと組み合わせて使用することができる。このようなモデルは、収益性、持続可能性、および環境保護を最適化することを目的として、土壌、天候、作物（例えば、種類、成長段階、植物の健康状態）、雑草（例えば、種類、成長段階）、病害、害虫、栄養素、水、水分、バイオマス、衛星データ、収量などの様々なソースからのデータを使用して、農業用地の場所特有の管理をサポートする。特に、このようなモデルは、農学的決定を最適化し、農薬散布の精度を制御し、実行された作業を記録するのに役立つ。

【0366】

一例として、モデルが、真菌性病害の発症をモデル化し、式(I)の化合物を作物に施用することが推奨される閾値に達したことを計算すると、式(I)の化合物を、適切な投与計画に従って作物に施用することができる。 10

【0367】

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

【0368】

式(I)の化合物は、高性能噴霧装置、例えば、トラクター、ロボット、ヘリコプター、飛行機、ドローンなどの無人航空機(UAV)などの農業用車両に取り付けられたまたはその中に収容されたスポットスプレーまたは精密スプレー装置などと組み合わせて使用することもできる。このような機器には、通常、入力センサー（例えば、カメラなど）と、入力データを分析するように構成され、特定かつ正確な方法で本発明の化合物を作物植物（それぞれ雑草）に適用するための入力データの分析に基づく決定を提供するように構成された処理ユニットとが含まれる。このようなスマートな噴霧装置を使用するには、通常、記録されたデータをローカライズし、農業用車両を誘導または制御するための測位システム（例えば、GPS受信機）、わかりやすい地図上に情報を表示する地理情報システム(GIS)、および噴霧などの必要な農場作業を実行するための適切な農場用車両も必要である。 20

【0369】

一例では、カメラによって取得された画像から真菌性病害を検出することができる。一例において、真菌性病害は、その画像に基づいて識別および/または分類することができる。そのような識別および/または分類は、画像処理アルゴリズムを利用することができる。このような画像処理アルゴリズムは、訓練されたニューラルネットワーク、決定木などの機械学習アルゴリズムを利用し、人工知能アルゴリズムを利用することができる。このように、本明細書に記載の化合物は、必要な場合にのみ適用することができる。 30

【0370】

本教示の態様は、以下の実施例に照らしてさらに理解することができ、決して本教示の範囲を限定するものと解釈されるべきではない。

【実施例】

【0371】

A. 実施例

A-1. 技術的一般性

A-1.1. Log P値の測定

本明細書で提供されるLog P値の測定は、欧州経済共同体(EEC)指令(EEC directive 79/831 Annex V, A8)に従って、逆相カラムでのHPLC(高速液体クロマトグラフィー)により、以下の方法で実施した:

[a] Log P値は、0.1%ギ酸含有水および溶離液としてアセトニトリル(10%アセトニトリル~95%アセトニトリルまでの直線勾配)を用いて、酸性範囲内でLC-UVを測定することによって決定される。

[b] Log P値は、0.001モルの酢酸アンモニウム含有水および溶離剤としてア 50

セトニトリル（１０％アセトニトリル～９５％アセトニトリルまでの直線勾配）を用いて、中性範囲内でＬＣ－ＵＶを測定することによって決定される。

【 0 3 7 2 】  
 「 c 」 L o g P 値は、 0 . 1 % リン酸および溶離剤としてアセトニトリル（ 1 0 % アセトニトリル～ 9 5 % アセトニトリルまでの直線勾配）を用いて、酸性範囲内でＬＣ－ＵＶを測定することによって決定される。

【 0 3 7 2 】

同じ方法内で複数の L o g P 値が使用可能な場合、全ての値が付与され、「 + 」で区切られる。

【 0 3 7 3 】

キャリブレーションは、既知の L o g P 値（連続するアルカノン間の線形補間による保持時間を使用した L o g P 値の測定）を有する直鎖アルカン - 2 - オン（ 3 ~ 1 6 個の炭素原子を有する）で行った。ラムダ最大値は、 2 0 0 n m ~ 4 0 0 n m の U V スペクトルおよびクロマトグラフィーシグナルのピーク値を使用して決定した。

10

【 0 3 7 4 】

A - 1 . 2 . <sup>1</sup>H - N M R データ

本明細書で提供される選択された実施例の <sup>1</sup>H - N M R データは、<sup>1</sup>H - N M R - ピークリストの形式で記載されている。各シグナルピークには、値が p p m で示され、シグナル強度が丸括弧で示されている。値 - シグナル強度のペアの間には、区切り文字としてのセミコロンが存在する。

【 0 3 7 5 】

したがって、一例のピークリストは以下の形式となる。

$\delta_1$  (強度<sub>1</sub>)、 $\delta_2$  (強度<sub>2</sub>)、 $\dots$ 、 $\delta_i$  (強度<sub>i</sub>)、 $\dots$ 、 $\delta_n$  (強度<sub>n</sub>)

シャープなシグナル強度は、NMR スペクトルの印刷例のシグナル高さ ( c m ) と相関し、シグナル強度の実際の関係を示している。幅広いシグナルから、いくつかのピークまたはシグナルの中央と、スペクトル内の最も強いシグナルと比較したそれらの相対的な強度を示すことができる。

20

【 0 3 7 6 】

<sup>1</sup>H スペクトルの化学シフトをキャリブレーションするために、特に D M S O で測定されるスペクトルの場合、テトラメチルシランおよび / または使用される溶媒の化学シフトを使用する。したがって、NMR ピークリストでは、テトラメチルシランのピークが発生する可能性があるが必ずしもそうとは限らない。

30

【 0 3 7 7 】

<sup>1</sup>H - N M R ピークリストは、従来の <sup>1</sup>H - N M R プリントに類似しているため、通常、従来の N M R 解釈でリストされている全てのピークが含まれている。

【 0 3 7 8 】

さらに、それらは、溶媒の従来の <sup>1</sup>H - N M R プリントシグナル、本発明の対象でもある標的化合物の立体異性体、および / または不純物のピークのように示すことができる。

【 0 3 7 9 】

溶媒および / または水の範囲で化合物シグナルを表示するために、溶媒の通常のピーク、例えば D M S O - D <sub>6</sub> 中の D M S O のピークおよび水のピークが、本発明者らの <sup>1</sup>H - N M R ピークリストに示され、概ね平均して高強度である。

40

【 0 3 8 0 】

前記標的化合物の立体異性体のピークおよび / または不純物のピークは、概ね平均して標的化合物（例えば純度 > 9 0 % ）のピークよりも低い強度を有する。

【 0 3 8 1 】

そのような立体異性体および / または不純物は、特定の調製プロセスにとって典型的であり得る。したがって、それらのピークは、「副産物フィンガープリント」を介して、本発明者らの調製プロセスの再現を認識するのに役立ち得る。

【 0 3 8 2 】

公知の方法（経験的に評価された期待値も有する、M e s t r e C、A C D シミュレー

50



ション)を使用して標的化合物のピークを計算する専門家は、所望により追加の強度フィルターを使用して、必要に応じて標的化合物のピークを分離できる。この分離は、従来の<sup>1</sup>H-NMR解釈での関連するピークのピッキングに類似する場合もある。

【0383】

ピークリストを含むNMRデータの説明の詳細については、Research Disclosure Database(564025号)の刊行物「Citation of NMR Peaklist Data within Patent Applications」に記載されている。

【0384】

以下の実施例は、本発明による式(I)の化合物の調製および生物学的活性を非限定的に説明するものである。

【0385】

A-2. 式(I)の化合物および中間体の合成

調製例1: N-[2-(4-ブロモ-2-クロロフェニル)-2,2-ジフルオロエチル]-3-メチル-6-[3-(トリフルオロメチル)フェノキシ]-1,2,4-トリアジン-5-カルボキサミド(化合物I-005)の調製

工程1: エチル6-クロロ-3-メチル-1,2,4-トリアジン-5-カルボキシレートの調製

塩化ホスホリル(POCl<sub>3</sub>)(1 mL、10.9 mmol)の溶液を、エチル3-メチル-6-オキソ-1,6-ジヒドロ-1,2,4-トリアジン-5-カルボキシレート(1 g、5.46 mmol)含有アセトニトリル(14 mL)へ添加して、反応物を70

で2時間撹拌した。室温まで冷却した後、反応物を飽和炭酸水素ナトリウム溶液で希釈し、有機相を酢酸エチル(2×100 mL)で抽出した。合わせた有機相をブラインで洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮した。シリカゲルのカラムクロマトグラフィー(勾配:ヘプタン/酢酸エチル(EtOAc))による残留物の精製により、溶媒の蒸発後、352 mg(純度100%、収率32%)のエチル6-クロロ-3-メチル-1,2,4-トリアジン-5-カルボキシレートを得た。

【0386】

工程2: エチル3-メチル-6-[3-(トリフルオロメチル)フェノキシ]-1,2,4-トリアジン-5-カルボキシレート(化合物1-02)の調製

エチル6-クロロ-3-メチル-1,2,4-トリアジン-5-カルボキシレート(264 mg、1.33 mmol)含有アセトニトリル(9 mL)の溶液に、3-(トリフルオロメチル)フェノール(271 mg、1.67 mmol)および炭酸カリウム(253 mg、1.83 mmol)を添加した。反応混合物を室温で18時間撹拌し、次いで水で希釈し、酢酸エチル(2×100 mL)で抽出した。有機抽出物を水およびブライン(鹹水)で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮した。シリカゲルのカラムクロマトグラフィー(勾配:ヘプタン/酢酸エチル(EtOAc))による残留物の精製により、溶媒の蒸発後、289 mg(純度100%、収率66%)のエチル3-メチル-6-[3-(トリフルオロメチル)フェノキシ]-1,2,4-トリアジン-5-カルボキシレートを得た。

【0387】

工程3: N-[2-(4-ブロモ-2-クロロフェニル)-2,2-ジフルオロエチル]-3-メチル-6-[3-(トリフルオロメチル)フェノキシ]-1,2,4-トリアジン-5-カルボキサミドの調製

トリメチルアルミニウム(0.18 mL、0.36 mmol、トルエン中2 M)の溶液を、エチル3-メチル-6-[3-(トリフルオロメチル)フェノキシ]-1,2,4-トリアジン-5-カルボキシレート(100 mg、0.3 mmol)含有テトラヒドロフラン(0.5 mL)に室温で添加した。5分間撹拌した後、2-(4-ブロモ-2-クロロフェニル)-2,2-ジフルオロエタンアミン(99 mg、0.36 mmol)含有ジクロロメタン(0.5 mL)の溶液を混合物へ添加した。18時間撹拌した後、tert-ブタノール(0.2 mL)および1 M塩酸(HCl)水溶液(10 mL)を加え

10

20

30

40

50

て反応を停止させた。有機層を酢酸エチル（2 × 50 mL）で抽出した。有機抽出物を水およびブライン（鹹水）で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮した。分取HPLCによる残留物の精製により、溶媒の蒸発後、69 mg（純度96%、収率39%）のN-[2-(4-プロモ-2-クロロフェニル)-2,2-ジフルオロエチル]-3-メチル-6-[3-(トリフルオロメチル)フェノキシ]-1,2,4-トリアジン-5-カルボキサミドを黄色油状物として得た。

【0388】

調製例2：N-[2-(4-クロロフェニル)-2,2-ジフルオロエチル]-2-メチル-5-[3-(トリフルオロメチル)フェノキシ]ピリミジン-4-カルボキサミド（化合物I-002）の調製

10

工程1：2-メチル-5-[3-(トリフルオロメチル)フェノキシ]ピリミジン-4-カルボン酸（化合物1-01）の調製

マイクロ波バイアル内で、ヨウ化銅（110 mg、0.56 mmol）を、5-クロロ-2-メチル-ピリミジン-4-カルボン酸（1 g、5.79 mmol）、3-(トリフルオロメチル)フェノール（1 g、6.37 mmol）、炭酸セシウム（3.8 g、11.6 mmol）、および1-(2-ピリジル)プロパン-2-オン（157 mg、1.15 mmol）の混合物を含むジメチルスルホキシド（1 mL）に添加した。反応混合物をマイクロ波で3 × 30分、140 で加熱し、次いで水で希釈し、ジクロロメタン（2 × 100 mL）で抽出した。有機抽出物を水およびブライン（鹹水）で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮した。分取HPLCによる残留物の精製により、溶媒の蒸発後、370 mg（純度96%、収率20%）の2-メチル-5-[3-(トリフルオロメチル)フェノキシ]ピリミジン-4-カルボン酸を固体として得た。

20

【0389】

工程2：N-[2-(4-クロロフェニル)-2,2-ジフルオロエチル]-2-メチル-5-[3-(トリフルオロメチル)フェノキシ]ピリミジン-4-カルボキサミドの調製

2-メチル-5-[3-(トリフルオロメチル)フェノキシ]ピリミジン-4-カルボン酸（40 mg、0.12 mmol）含有ジクロロメタン（0.5 mL）の懸濁液に、塩化オキサリル（21 mg、0.17 mmol）、次いでDMFを2滴添加した。反応混合物を室温で3時間攪拌した。予め形成された塩化アシルに、2-(4-クロロフェニル)-2,2-ジフルオロエタンアミン塩酸塩（38 mg、0.17 mmol）およびトリエチルアミン（50 μL、0.38 mmol）含有ジクロロメタン（1 mL）の溶液を0 で添加した。反応混合物を室温で18時間攪拌し、次いで水で希釈し、ジクロロメタン（2 × 100 mL）で抽出した。有機抽出物を水およびブライン（鹹水）で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮した。シリカゲルのカラムクロマトグラフィ（勾配：ヘプタン/酢酸エチル（EtOAc））による残留物の精製により、溶媒の蒸発後、55 mg（純度91%、収率91%）のN-[2-(4-クロロフェニル)-2,2-ジフルオロエチル]-2-メチル-5-[3-(トリフルオロメチル)フェノキシ]ピリミジン-4-カルボキサミドを無色油状物として得た。

30

【0390】

調製例3：5-(3-シクロプロピルフェノキシ)-N-[2-(2,4-ジメチルフェニル)-2,2-ジフルオロエチル]-2-メチルピリミジン-4-カルボキサミド（化合物I-015）の調製

40

工程1：5-プロモ-N-[2-(2,4-ジメチルフェニル)-2,2-ジフルオロエチル]-2-メチルピリミジン-4-カルボキサミドの調製

5-プロモ-2-メチルピリミジン-4-カルボン酸（100 mg、0.46 mmol）含有ジクロロメタン（1 mL）の懸濁液に、塩化オキサリル（0.05 mL、0.6 mmol）、次いでDMFを2滴添加した。反応混合物を室温で1時間攪拌した。予め形成された塩化アシルに、2-(2,4-ジメチルフェニル)-2,2-ジフルオロエタンアミン塩酸塩（112 mg、0.5 mmol）およびトリエチルアミン（0.2 mL、1.

50

38 mmol) 含有ジクロロメタン (1 mL) の溶液を 0 で添加した。反応混合物を室温で 1 時間攪拌し、次いで水で希釈し、ジクロロメタン (2 × 50 mL) で抽出した。有機抽出物を水およびブライン (鹼水) で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮した。シリカゲルのカラムクロマトグラフィー (勾配: ヘプタン / 酢酸エチル (EtOAc)) による残留物の精製により、溶媒の蒸発後、55 mg (純度 100%、収率 31%) の 5 - プロモ - N - [2 - (2, 4 - ジメチルフェニル) - 2, 2 - ジフルオロエチル] - 2 - メチルピリミジン - 4 - カルボキサミドを黄色固体として得た。

【0391】

工程 2: 5 - (3 - シクロプロピルフェノキシ) - N - [2 - (2, 4 - ジメチルフェニル) - 2, 2 - ジフルオロエチル] - 2 - メチルピリミジン - 4 - カルボキサミドの調製

10

マイクロ波バイアル内で、5 - プロモ - N - [2 - (2, 4 - ジメチルフェニル) - 2, 2 - ジフルオロエチル] - 2 - メチルピリミジン - 4 - カルボキサミド (55 mg、0.14 mmol)、3 - (シクロプロピル) フェノール (29 mg、0.21 mmol)、N - (n - ブチル) イミダゾール (9 mg、0.07 mmol)、炭酸セシウム (93 mg、0.29 mmol)、およびヨウ化銅 (I) (2.7 mg、0.01 mmol) の混合物を、ジオキサン (2.5 mL) に溶解した。バイアル管を密封し、反応混合物をマイクロ波照射下、130 で 30 分間加熱した。反応物をジクロロメタンで希釈し、Celite (登録商標) でろ過した。有機層を減圧下で濃縮した。分取 HPLC による残留物の精製により、溶媒の蒸発後、12 mg (純度 100%、収率 20%) の 5 - (3 - シクロプロピルフェノキシ) - N - [2 - (2, 4 - ジメチルフェニル) - 2, 2 - ジフルオロエチル] - 2 - メチルピリミジン - 4 - カルボキサミドを油状物として得た。

20

【0392】

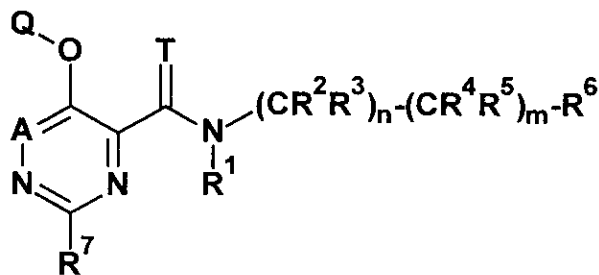
以下の表 1 に示される化合物を、上記の実施例と同様に調製した。これらの化合物の <sup>1</sup>H - NMR を表 2 に示す。

【0393】

表 1 式 (I) に係る化合物

【0394】

【化 17】



(I)

30

【0395】

40

50

【表 2】

実施例番号	A	R <sup>7</sup>	Q	T	R <sup>1</sup>	$(CR^2R^3)_n-(CR^4R^5)_m-R^6$	Log P
I-001	N	メチル	3-(トリフルオロメチル)フェニル	O	H	2-(2,4-ジメチルフェニル)エチル	3.79 [a]
I-002	CH	メチル	3-(トリフルオロメチル)フェニル	O	H	2-(4-クロロフェニル)-2,2-ジフルオロエチル	4.04 [a]
I-003	CH	メチル	3-(トリフルオロメチル)フェニル	O	H	2-(2,4-ジメチルフェニル)-2,2-ジフルオロエチル	4.32 [a]
I-004	CH	メチル	3-(トリフルオロメチル)フェニル	O	H	2-(4-ブロモ-2-クロロフェニル)-2,2-ジフルオロエチル	4.49 [a]
I-005	N	メチル	3-(トリフルオロメチル)フェニル	O	H	2-(4-ブロモ-2-クロロフェニル)-2,2-ジフルオロエチル	4.26 [a]
I-006	N	メチル	3-(トリフルオロメチル)フェニル	O	H	2-(4-クロロフェニル)-2,2-ジフルオロエチル	3.85 [a]
I-007	N	メチル	3-(トリフルオロメチル)フェニル	O	H	2-(2,4-ジクロロフェニル)-2,2-ジフルオロエチル	4.20 [a]
I-008	CH	メチル	3-(トリフルオロメチル)フェニル	O	H	2-(2-クロロ-4-メチルフェニル)-2,2-ジフルオロエチル	4.37 [a]
I-009	CH	メトキシ	3-(トリフルオロメチル)フェニル	O	H	2-(2,4-ジメチルフェニル)-2,2-ジフルオロエチル	4.46 [a]
I-010	CH	シクロプロピル	3-(トリフルオロメチル)フェニル	O	H	2-(2,4-ジメチルフェニル)-2,2-ジフルオロエチル	5.04 [a]
I-011	CH	エチル	3-(トリフルオロメチル)フェニル	O	H	2-(2,4-ジメチルフェニル)-2,2-ジフルオロエチル	4.89 [a]

10

20

30

40

50

実施例番号	A	R <sup>7</sup>	Q	T	R <sup>1</sup>	$(CR^2R^3)_n-(CR^4R^5)_m-R^6$	Log P
I-012	CH	メチルスルファニル	3-(トリフルオロメチル)フェニル	O	H	2-(2,4-ジメチルフェニル)-2,2-ジフルオロエチル	4.97 [a]
I-013	CH	メチル	3-クロロフェニル	O	H	2-(2,4-ジメチルフェニル)-2,2-ジフルオロエチル	4.30 [a]
I-014	CH	シクロプロピル	3-クロロフェニル	O	H	2-(2,4-ジメチルフェニル)-2,2-ジフルオロエチル	5.00 [a]
I-015	CH	メチル	3-シクロプロピルフェニル	O	H	2-(2,4-ジメチルフェニル)-2,2-ジフルオロエチル	4.38 [a]
I-016	CH	メチル	3-シクロプロピル-2-フルオロフェニル	O	H	2-(5-クロロピリミジン-2-イル)エチル	2.72 [a]
I-017	CH	メチル	3-シクロプロピル-2-フルオロフェニル	O	H	(4S)-6-フルオロクロマン-4-イル	3.62 [a]
I-018	CH	メチル	3-シクロプロピル-2-フルオロフェニル	O	H	2-[5-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-イル]エチル	3.31 [a]
I-019	CH	メチル	3-メトキシフェニル	O	H	2-(2,4-ジメチルフェニル)-2,2-ジフルオロエチル	3.76 [a]
I-020	N	メチル	3-(トリフルオロメチル)フェニル	O	H	2-クロロ-2-(2,4-ジクロロフェニル)エチル	4.34 [a]
I-021	N	メチル	3-シクロプロピルフェニル	O	H	2-(2-クロロ-4-メチルフェニル)-2,2-ジフルオロエチル	4.19 [a]
I-022	CH	メチル	3-アセチルフェニル	O	H	2-(2,4-ジメチルフェニル)-2,2-ジフルオロエチル	3.40 [a]

10

20

30

40

50

実施 例番 号	A	R <sup>7</sup>	Q	T	R <sup>1</sup>	$(CR^2R^3)_n-(CR^4R^5)_m-R^6$	L o g P
I- 02 3	CH	メチル	1-ベンゾチ オフエン-6 -イル	O	H	2-(2,4-ジメチル フェニル)-2,2-ジ フルオロエチル	4. 15 [a]
I- 02 4	N	シクロ プロピ ル	3-(トリフ ルオロメチ ル)フェニル	O	H	2-(3,4-ジメチル フェニル)-2,2-ジ フルオロエチル	4. 66 [a]
I- 02 5	N	シクロ プロピ ル	3-ブromo- 2-フルオロ フェニル	O	H	2-(2,4-ジメチル フェニル)-2,2-ジ フルオロエチル	4. 66 [a]
I- 02 6	CH	メチル	2,4,5- トリフルオロ フェニル	O	H	2-(2,4-ジメチル フェニル)-2,2-ジ フルオロエチル	4. 02 [a]
I- 02 7	N	シクロ プロピ ル	3-ブromo- 2-フルオロ フェニル	O	H	(E)-2-(2,4- ジメチルフェニル)-2 -フルオロエテン-1- イル	5. 36 [a]
I- 02 8	N	メチル	3-シクロプ ロピルフェニ ル	O	H	2-(4-クロロフェニ ル)-2,2-ジフルオ ロエチル	4. 01 [a]
I- 02 9	CH	メチル	3-シクロプ ロピル-2- フルオロフェ ニル	O	H	2-(1H-インドール -5-イル)エチル	3. 21 [a]
I- 03 0	CH	メチル	3-シクロプ ロピル-2- フルオロフェ ニル	O	H	6-フルオロクロマン- 4-イル	3. 62 [a]
I- 03 1	N	メチル	3-シクロプ ロピルフェニ ル	O	H	2-(3,4-ジメチル フェニル)-2,2-ジ フルオロエチル	4. 19 [a]
I- 03 2	CH	メチル	3-シクロプ ロピル-2- フルオロフェ ニル	O	H	2-[2-(トリフルオ ロメチル)ピリミジン- 5-イル]エチル	3. 09 [a]
I- 03 3	CH	メチル	3-メチルフ エニル	O	H	2-(2,4-ジメチル フェニル)-2,2-ジ フルオロエチル	4. 06 [a]

10

20

30

40

50

実施 例番 号	A	R <sup>7</sup>	Q	T	R <sup>1</sup>	$(CR^2R^3)_n-(CR^4R^5)_m-R^6$	L o g P
I- 03 4	CH	メチル	3-シクロプロピル-2-フルオロフェニル	O	メトキシ	2-(2, 4-ジクロロフェニル) エチル	4. 91 [a]
I- 03 5	CH	メチル	3-(ジメチルアミノ)フェニル	O	H	2-(2, 4-ジメチルフェニル)-2, 2-ジフルオロエチル	3. 88 [a]
I- 03 6 <sup>1)</sup>	CH	メチル	3-[2-フルオロシクロプロピル]フェニル	O	H	2-(2, 4-ジメチルフェニル)-2, 2-ジフルオロエチル	3. 97 + 4. 13 [a]
I- 03 7	N	シクロプロピル	3-シクロプロピル-2-フルオロフェニル	O	H	2-(2, 4-ジメチルフェニル)-2, 2-ジフルオロエチル	4. 81 [a]
I- 03 8	N	シクロプロピル	3-エチルフェニル	O	H	(Z)-2-(2, 4-ジメチルフェニル)-2-フルオロエテン-1-イル	4. 59 [a]
I- 03 9	CH	メチル	3-クロロ-2-フルオロフェニル	O	H	2-(2, 4-ジメチルフェニル)-2, 2-ジフルオロエチル	4. 22 [a]
I- 04 0	N	シクロプロピル	3-シクロプロピル-2-フルオロフェニル	O	H	(E)-2-(2, 4-ジメチルフェニル)-2-フルオロエテン-1-イル	5. 49 [a]
I- 04 1	CH	メチル	3-シクロプロピル-2-フルオロフェニル	O	H	2-(5-メチル-2-フリル) エチル	3. 52 [a]
I- 04 2	CH	メチル	3-シクロプロピル-2-フルオロフェニル	O	H	2-(1H-インドール-4-イル) エチル	3. 23 [a]

10

20

30

40

50

実施 例番 号	A	R <sup>7</sup>	Q	T	R <sup>1</sup>	$(CR^2R^3)_n(CR^4R^5)_mR^6$	L o g P
I- 04 3	CH	メチル	3-シクロプロピル-2-フルオロフェニル	O	H	2-(3,4-ジメチルフェニル)-2-フルオロエチル	4. 22 [a]
I- 04 4	CH	メチル	3-(ジフルオロメトキシ)フェニル	O	H	2-(2,4-ジメチルフェニル)-2,2-ジフルオロエチル	3. 98 [a]
I- 04 5	CH	メチル	3-シクロプロピル-2-フルオロフェニル	O	H	7-ブromo-1,2,3,4-テトラヒドロナフタレン-1-イル	4. 55 [a]
I- 04 6	CH	メチル	3-シクロプロピル-2-フルオロフェニル	O	H	(4S)-クロマン-4-イル	3. 54 [a]
I- 04 7	CH	メチル	3-エトキシフェニル	O	H	2-(2,4-ジメチルフェニル)-2,2-ジフルオロエチル	4. 13 [a]
I- 04 8	N	シクロプロピル	3-ブromo-2-フルオロフェニル	O	H	(Z)-2-(2,4-ジメチルフェニル)-2-フルオロエテン-1-イル	5. 04 [a]
I- 04 9	CH	メチル	4-(トリフルオロメチル)フェニル	O	H	2-(2,4-ジメチルフェニル)-2,2-ジフルオロエチル	4. 39 [a]
I- 05 0	N	シクロプロピル	2-フルオロ-3-メチルフェニル	O	H	2-(2,4-ジメチルフェニル)-2,2-ジフルオロエチル	4. 47 [a]
I- 05 1	N	シクロプロピル	2-フルオロ-3-メチルフェニル	O	H	(E)-2-(2,4-ジメチルフェニル)-2-フルオロエテン-1-イル	5. 16 [a]
I- 05 2	CH	メチル	3-シクロプロピル-2-フルオロフェニル	O	H	2-(4-メチル-1H-ピラゾール-1-イル)エチル	2. 59 [a]

10

20

30

40

50



実施 例番 号	A	R <sup>7</sup>	Q	T	R <sup>1</sup>	$(CR^2R^3)_n-(CR^4R^5)_m-R^6$	L o g P
I- 05 3	CH	メチル	3-シクロブ ロピル-2- フルオロフェ ニル	O	H	6-メチル-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナ フタレン-1-イル	4. 49 [a]
I- 05 4	CH	メチル	3-シクロブ ロピル-2- フルオロフェ ニル	O	H	2-(4-クロロフェノ キシ) エチル	3. 93 [a]
I- 05 5	CH	メチル	3-シクロブ ロピル-2- フルオロフェ ニル	O	H	2, 2, 6-トリメチル クロマン-4-イル	4. 42 [a]
I- 05 6	CH	メチル	3-(オキセ タン-3-イル) フェニル	O	H	2-(2, 4-ジメチル フェニル)-2, 2-ジ フルオロエチル	3. 32 [a]
I- 05 7	CH	メチル	3-シクロブ ロピル-2- フルオロフェ ニル	O	H	1, 1-ジオキソ-3, 4-ジヒドロ-2H-チ オクロメン-4-イル	2. 78 [a]
I- 05 8	CH	メチル	フェニル	O	H	2-(2, 4-ジメチル フェニル)-2, 2-ジ フルオロエチル	3. 71 [a]
I- 05 9	CH	メチル	3-(2-メ トキシエトキ シ) フェニル	O	H	2-(2, 4-ジメチル フェニル)-2, 2-ジ フルオロエチル	3. 66 [a]
I- 06 0	CH	メチル	3-シクロブ ロピル-2- フルオロフェ ニル	O	H	2, 7-ジメトキシ- 1, 2, 3, 4-テトラ ヒドロナフタレン-1- イル	3. 72 [a]
I- 06 1	N	シクロ プロピ ル	3-メトキシ フェニル	O	H	(Z)-2-(2, 4- ジメチルフェニル)-2 -フルオロエテン-1- イル	4. 44 [a]
I- 06 2	N	シクロ プロピ ル	3-ブロモフ ェニル	O	H	2-(2, 4-ジメチル フェニル)-2, 2-ジ フルオロエチル	4. 59 [a]

10

20

30

40

50

実施 例番 号	A	R <sup>7</sup>	Q	T	R <sup>1</sup>	$(CR^2R^3)_n(CR^4R^5)_mR^6$	L o g P
I- 06 3	N	シクロ プロピ ル	3-プロモフ ェニル	O	H	(E)-2-(2,4- ジメチルフェニル)-2 -フルオロエテン-1- イル	5. 28 [a]
I- 06 4	CH	メチル	3-シクロブ ロピル-2- フルオロフェ ニル	O	H	2-チオフェン-2-イ ルエチル	3. 43 [a]
I- 06 5 <sup>2)</sup>	CH	メチル	3-シクロブ ロピル-2- フルオロフェ ニル	O	H	4-メチル-1,2, 3,4-テトラヒドロナ フタレン-1-イル	4. 40 [a]
I- 06 6	CH	メチル	3-シクロブ ロピル-2- フルオロフェ ニル	O	プロピ オニル	2-フェニルエチル	4. 52 [a]
I- 06 7	CH	メチル	3-シクロブ ロピル-2- フルオロフェ ニル	O	アセチ ル	2-(4-メトキシフェ ニル)エチル	4. 01 [a]
I- 06 8	CH	メチル	5-(トリフ ルオロメチ ル)ピリジ ン-3-イル	O	H	2-(2,4-ジメチル フェニル)-2,2-ジ フルオロエチル	3. 73 [a]
I- 06 9	CH	メチル	3-シクロブ ロピル-2- フルオロフェ ニル	O	H	6-ブromo-1,2, 3,4-テトラヒドロナ フタレン-1-イル	4. 71 [a]
I- 07 0	CH	メチル	3-シクロブ ロピル-2- フルオロフェ ニル	O	H	2-(2,5-ジクロロ -3-チエニル)-2, 2-ジフルオロエチル	4. 69 [a]
I- 07 1	CH	メチル	3-エチルフ ェニル	O	H	2-(2,4-ジメチル フェニル)-2,2-ジ フルオロエチル	4. 42 [a]

10

20

30

40

50

実施 例番 号	A	R <sup>7</sup>	Q	T	R <sup>1</sup>	$(CR^2R^3)_n-(CR^4R^5)_m-R^6$	L o g P
I- 07 2	CH	メチル	3-(メトキシメチル)フェニル	O	H	2-(2,4-ジメチルフェニル)-2,2-ジフルオロエチル	3. 67 [a]
I- 07 3	N	シクロプロピル	3-エチルフェニル	O	H	2-(2,4-ジメチルフェニル)-2,2-ジフルオロエチル	4. 26 [a]
I- 07 4	N	シクロプロピル	3-エチルフェニル	O	H	(E)-2-(2,4-ジメチルフェニル)-2-フルオロエチン-1-イル	4. 89 [a]
I- 07 5	CH	メチル	3-シクロプロピル-2-フルオロフェニル	O	H	2-(3,5-ジメチル-1H-ピラゾール-1-イル)エチル	2. 60 [a]
I- 07 6	CH	メチル	3-シクロプロピル-2-フルオロフェニル	O	H	1-(5-クロロ-2-チエニル)エチル	4. 09 [a]
I- 07 7	CH	メチル	3-シクロプロピル-2-フルオロフェニル	O	H	2-(2,3-ジヒドロ-1,4-ベンゾジオキシン-6-イル)エチル	3. 30 [a]
I- 07 8	CH	メチル	3-シクロプロピル-2-フルオロフェニル	O	H	2-シクロプロピル-4,5,6,7-テトラヒドロ-1,3-ベンゾチアゾール-4-イル	3. 81 [a]
I- 07 9	CH	メチル	3-エトキシフェニル	O	H	2-(2,4-ジメチルフェニル)-2,2-ジフルオロエチル	3. 53 [a]
I- 08 0	CH	メチル	3-シクロプロピル-2-フルオロフェニル	O	H	7-クロロ-6-フルオロ-2,2-ジメチルクロマン-4-イル	4. 87 [a]
I- 08 1	CH	メチル	3-シクロプロピル-2-フルオロフェニル	O	H	2-[2-クロロ-4-(トリフルオロメチル)フェノキシ]エチル	4. 52 [a]

10

20

30

40

50

実施例番号	A	R <sup>7</sup>	Q	T	R <sup>1</sup>	$\text{-(CR}^2\text{R}^3\text{)}_n\text{-(CR}^4\text{R}^5\text{)}_m\text{-R}^6$	Log P
I-082	N	シクロプロピル	3-メトキシフェニル	O	H	2-(2,4-ジメチルフェニル)-2,2-ジフルオロエチル	4.19 [a]
I-083	CH	メチル	2-フルオロ-3-メチルフェニル	O	H	2-(2,4-ジメチルフェニル)-2,2-ジフルオロエチル	4.07 [a]
I-084	CH	メチル	2-フルオロ-3-メトキシフェニル	O	H	2-(2,4-ジメチルフェニル)-2,2-ジフルオロエチル	3.71 [a]
I-085	CH	メチル	3-ブロモフェニル	O	H	2-(2,4-ジメチルフェニル)-2,2-ジフルオロエチル	4.28 [a]
I-086	CH	メチル	3-シクロプロピル-2-フルオロフェニル	O	H	2-(4-クロロ-1H-ピラゾール-1-イル)エチル	2.88 [a]
I-087	CH	メチル	3-シクロプロピル-2-フルオロフェニル	O	H	2-(2,3-ジヒドロ-1-ベンゾフラン-5-イル)エチル	3.43 [a]
I-088	CH	メチル	3-シクロプロピル-2-フルオロフェニル	O	2-メチルプロポキシ	ベンジル	4.72 [a]
I-089	CH	メチル	3-シクロプロピル-2-フルオロフェニル	O	H	2-(4-クロロ-3-メトキシフェニル)-2-フルオロエチル	3.93 [a]
I-090	CH	メチル	3-ニトロフェニル	O	H	2-(2,4-ジメチルフェニル)-2,2-ジフルオロエチル	3.75 [a]
I-091 <sup>3)</sup>	CH	メチル	3-シクロプロピル-2-フルオロフェニル	O	H	5'-ブロモスピロ [シクロプロパン-2,1'-インダン]-1-イル	4.73 [a]

10

20

30

40

50

実施 例番 号	A	R <sup>7</sup>	Q	T	R <sup>1</sup>	$(CR^2R^3)_n(CR^4R^5)_m-R^6$	L o g P
I- 09 2	CH	メチル	インダン-4 -イル	O	H	2-(2,4-ジメチル フェニル)-2,2-ジ フルオロエチル	4. 49 [a]
I- 09 3	CH	メチル	3-クロロ- 4-メチルフ ェニル	O	H	2-(2,4-ジメチル フェニル)-2,2-ジ フルオロエチル	4. 54 [a]
I- 09 4	CH	メチル	3-(トリフ ルオロメトキシ)フェニル	O	H	2-(2,4-ジメチル フェニル)-2,2-ジ フルオロエチル	4. 50 [a]
I- 09 5	CH	アミノ	3-(トリフ ルオロメチ ル)フェニル	O	H	2-(4-ブロモフェニ ル)エチル	4. 05 [a]
I- 09 6	CH	フルオ ロ	3-(トリフ ルオロメチ ル)フェニル	O	H	1-[3-(トリフルオ ロメチル)フェニル]エ チル	2. 88 [a]
I- 09 7	CH	メチル	3-シクロ ロピル-2- フルオロフェ ニル	O	H	(4-シアノフェニル) メトキシ	2. 87 [a]
I- 09 8	CH	メチル	3-シクロ ロピル-2- フルオロフェ ニル	O	H	6-メチル-3,4-ジ ヒドロ-1H-イソクロ メン-4-イル	3. 69 [a]
I- 09 9	CH	メチル	3-シクロ ロピル-2- フルオロフェ ニル	O	H	2-(6-イソプロピル オキシピリジン-3-イ ル)エチル	3. 44 [a]
I- 10 0	CH	メチル	3-シクロ ロピル-2- フルオロフェ ニル	O	H	[4-(トリフルオロメ トキシ)フェニル]メト キシ	3. 89 [a]
I- 10 1	CH	フルオ ロ	3-(トリフ ルオロメチ ル)フェニル	O	H	2-(2,4-ジメチル フェニル)エチル	
I- 10 2	CH	メチル	3-エチニル フェニル	O	H	2-(2,4-ジメチル フェニル)-2,2-ジ フルオロエチル	4. 01 [a]

10

20

30

40

50

実施例番号	A	R <sup>7</sup>	Q	T	R <sup>1</sup>	$\text{-(CR}^2\text{R}^3)_n\text{-(CR}^4\text{R}^5)_m\text{-R}^6$	Log P
I-103	CH	メチル	3-シクロプロピル-2-フルオロフェニル	O	H	2-(2,4-ジメチルフェニル)-2,2-ジフルオロエチル	4.44 [a]
I-104	CH	メチル	インダン-5-イル	O	H	2-(2,4-ジメチルフェニル)-2,2-ジフルオロエチル	4.56 [a]
I-105	N	シクロプロピル	3-クロロ-2-フルオロフェニル	O	H	(Z)-2-(2,4-ジメチルフェニル)-2-フルオロエテン-1-イル	5.36 [a]
I-106	CH	メチル	ナフタレン-2-イル	O	H	2-(2,4-ジメチルフェニル)-2,2-ジフルオロエチル	4.35 [a]
I-107	N	シクロプロピル	2-フルオロ-3-メチルフェニル	O	H	(Z)-2-(2,4-ジメチルフェニル)-2-フルオロエテン-1-イル	4.85 [a]
I-108	CH	メチル	4-クロロ-3-(トリフルオロメチル)フェニル	O	H	2-(2,4-ジメチルフェニル)-2,2-ジフルオロエチル	4.72 [a]
I-109	N	シクロプロピル	3-クロロ-2-フルオロフェニル	O	H	(E)-2-(2,4-ジメチルフェニル)-2-フルオロエテン-1-イル	5.00 [a]
I-110	N	メチル	3-(トリフルオロメチル)フェニル	O	H	[3-(4-クロロフェニル)オキセタン-3-イル]メチル	3.35 [a]
I-111	CH	メチル	3-シクロプロピル-2-フルオロフェニル	O	エチル	2-フェニルエチル	4.04 [a]
I-112	N	シクロプロピル	3-シクロプロピル-2-フルオロフェニル	O	H	(Z)-2-(2,4-ジメチルフェニル)-2-フルオロエテン-1-イル	5.20 [a]

10

20

30

40

50

実施 例番 号	A	R <sup>7</sup>	Q	T	R <sup>1</sup>	$(CR^2R^3)_n(CR^4R^5)_mR^6$	L o g P
I- 11 3	CH	メチル	3-シクロプロピル-2-フルオロフェニル	O	H	8-メチルクロマン-4-イル	4. 02 [a]
I- 11 4	CH	メチル	3-シクロプロピル-2-フルオロフェニル	O	H	7-クロロ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン-1-イル	4. 46 [a]
I- 11 5	CH	メチル	3-ビニルフェニル	O	H	2-(2, 4-ジメチルフェニル)-2, 2-ジフルオロエチル	4. 17 [a]
I- 11 6	CH	メチル	3-シクロプロピル-2-フルオロフェニル	O	H	2, 7-ジメトキシ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン-1-イル	3. 99 [a]
I- 11 7	N	メチル	3-シクロプロピルフェニル	O	H	2-(2, 4-ジメチルフェニル)-2, 2-ジフルオロエチル	4. 33 [a]
I- 11 8	CH	メチル	6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[b]ピリジン-3-イル	O	H	2-(2, 4-ジメチルフェニル)-2, 2-ジフルオロエチル	2. 78 [a]
I- 11 9	N	メチル	3-(トリフルオロメチル)フェニル	O	H	1-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル	3. 77 [a]
I- 12 0	CH	メチル	キノリン-3-イル	O	H	2-(2, 4-ジメチルフェニル)-2, 2-ジフルオロエチル	3. 40 [a]
I- 12 1	N	シクロプロピル	3-(トリフルオロメチル)フェニル	O	H	2-(2, 4-ジメチルフェニル)-2, 2-ジフルオロエチル	4. 74 [a]

10

20

30

40

50

実施例番号	A	R <sup>7</sup>	Q	T	R <sup>1</sup>	$(CR^2R^3)_n-(CR^4R^5)_m-R^6$	Log P
I-122	CH	メチル	3-[3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]フェニル	O	H	2-(2,4-ジメチルフェニル)-2,2-ジフルオロエチル	4.54 [a]
I-123	CH	メチル	3-シクロプロピル-2-フルオロフェニル	O	エトキシ	ベンジル	3.97 [a]
I-124	CH	メチル	3-シクロプロピル-2-フルオロフェニル	O	H	2-(1,3-ベンゾジオキソール-5-イル)エチル	3.34 [a]
I-125	CH	メチル	3-シクロプロピル-2-フルオロフェニル	O	H	6-フルオロチオクロマン-4-イル	3.98 [a]
I-126	CH	メチル	3-メチルスルファニルフェニル	O	H	2-(2,4-ジメチルフェニル)-2,2-ジフルオロエチル	4.11 [a]
I-127	CH	メチル	3-シクロプロピル-2-フルオロフェニル	O	H	2-(3,4-ジクロロフェニル)-2-フルオロエチル	4.38 [a]
I-128	CH	メチル	2,3-ジヒドロ-1-ベンゾフラン-5-イル	O	H	2-(2,4-ジメチルフェニル)-2,2-ジフルオロエチル	3.59 [a]
I-129	CH	メチル	3-クロロ-4-フルオロフェニル	O	H	2-(2,4-ジメチルフェニル)-2,2-ジフルオロエチル	4.20 [a]
I-130	N	シクロプロピル	3-(トリフルオロメチル)フェニル	O	H	2-(2-クロロ-4-メチルフェニル)-2,2-ジフルオロエチル	4.66 [a]

10

20

30

40

50



実施例番号	A	R <sup>7</sup>	Q	T	R <sup>1</sup>	$(CR^2R^3)_n-(CR^4R^5)_m-R^6$	Log P
I-131	N	シクロプロピル	3-クロロ-2-フルオロフェニル	O	H	2-(2,4-ジメチルフェニル)-2,2-ジフルオロエチル	4.62 [a]
I-132	N	シクロプロピル	3-ブロモフェニル	O	H	(Z)-2-(2,4-ジメチルフェニル)-2-フルオロエテン-1-イル	4.97 [a]
I-133	CH	フルオロ	3-(トリフルオロメチル)フェニル	O	H	1-[4-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル	
I-134	CH	メチル	3-シクロプロピル-2-フルオロフェニル	O	H	2-(4,5-ジメチル-3-チエニル)エチル	4.10 [a]

10

20

- 1) 立体異性体の混合物  
 2) 立体異性体の混合物  
 3) 立体異性体の混合物

【0396】

30

40

50

## 【表 3】

表 2 式 (I) の化合物の<sup>1</sup>H-NMRデータ

<p>I-001: -<sup>1</sup>H-NMR (300.2-MHz, -CDC13): -</p> <p>δ = 7.7726 - (0.7); -7.6089 - (1.3); -7.5878 - (3.9); -7.5668 - (0.4); -7.5285 - (1.8); -7.4777 - (0.8); -7.4686 - (1.3); -7.4613 - (0.9); -7.4469 - (0.8); -7.4397 - (0.5); -7.3000 - (4.6); -7.1227 - (1.5); -7.0972 - (2.2); -7.0463 - (2.1); -6.9964 - (1.4); -6.9711 - (0.9); -5.3378 - (0.5); -3.7811 - (1.0); -3.7585 - (2.1); -3.7368 - (2.0); -3.7339 - (2.0); -3.7124 - (1.1); -3.0164 - (1.7); -2.9920 - (2.8); -2.9681 - (1.6); -2.8994 - (16.0); -2.3903 - (11.0); -2.3268 - (10.5); -2.0847 - (0.3); -1.6346 - (0.5); -1.3226 - (0.4); -1.2985 - (0.7); -1.2720 - (0.3); -1.2673 - (0.4); -1.2482 - (0.5); -0.9674 - (0.4); -0.9431 - (0.4); -0.9216 - (0.4); -0.1110 - (1.9); -0.0397 - (3.5)</p>	10
<p>I-002: -<sup>1</sup>H-NMR (300.2-MHz, -CDC13): -</p> <p>δ = 8.5909 - (5.3); -8.2509 - (0.4); -8.2315 - (0.7); -7.5177 - (2.2); -7.4889 - (4.5); -7.4696 - (1.4); -7.4416 - (5.1); -7.4130 - (2.5); -7.3036 - (19.0); -7.1992 - (1.7); -7.1290 - (1.0); -7.1003 - (0.8); -5.3430 - (0.4); -4.1765 - (0.3); -4.1528 - (0.3); -4.1317 - (1.1); -4.1100 - (1.0); -4.0834 - (2.2); -4.0618 - (2.1); -4.0352 - (1.1); -4.0135 - (1.0); -2.8569 - (16.0); -2.1778 - (0.8); -2.0888 - (1.5); -2.0511 - (0.4); -1.6037 - (5.2); -1.4831 - (0.6); -1.4651 - (1.2); -1.4190 - (0.3); -1.3756 - (1.5); -1.3265 - (2.9); -1.2975 - (13.5); -1.2789 - (2.7); -1.1937 - (0.6); -1.1447 - (0.7); -1.0644 - (0.3); -0.9225 - (1.6); -0.8974 - (1.6); -0.8748 - (1.1); -0.7560 - (0.4); -0.0529 - (0.5); -0.0420 - (17.8); -0.0311 - (0.7)</p>	20
<p>I-003: -<sup>1</sup>H-NMR (300.2-MHz, -CDC13): -</p> <p>δ = 8.5753 - (5.0); -8.2823 - (0.4); -8.2631 - (0.7); -8.2431 - (0.4); -7.5282 - (0.5); -7.5022 - (1.5); -7.4754 - (1.2); -7.4374 - (1.6); -7.4033 - (1.8); -7.3768 - (1.9); -7.3037 - (9.5); -7.2284 - (1.7); -7.1734 - (1.0); -7.1465 - (0.8); -7.0795 - (2.2); -7.0421 - (1.0); -5.3427 - (3.5); -4.1618 - (1.0); -4.1408 - (0.9); -4.1116 - (2.0); -4.0905 - (1.9); -4.0613 - (1.0); -4.0402 - (1.0); -2.8535 - (16.0); -2.5055 - (3.1); -2.4985 - (5.7); -2.4910 - (3.2); -2.3603 - (8.0); -1.6096 - (9.0); -0.0425 - (8.7)</p>	30
<p>I-004: -<sup>1</sup>H-NMR (300.2-MHz, -CDC13): -</p> <p>δ = 8.5739 - (5.0); -8.2485 - (0.4); -8.2280 - (0.7); -8.2057 - (0.4); -7.6648 - (2.4); -7.5202 - (1.0); -7.5022 - (1.6); -7.4904 - (6.1); -7.4757 - (1.4); -7.4426 - (1.5); -7.4168 - (0.7); -7.3036 - (22.7); -7.2104 - (1.6); -7.1504 - (0.9); -7.1242 - (0.8); -5.3432 - (0.5); -4.3342 - (0.9); -4.3126 - (1.0); -4.2850 - (2.0); -4.2632 - (1.9); -4.2357 - (1.0); -4.2138 - (1.0); -3.4097 - (0.4); -2.8528 - (16.0); -1.5997 - (17.2); -1.2970 - (0.4); -0.0525 - (0.7); -0.0418 - (20.2); -0.0308 - (0.6)</p>	40

I-005:  $^1\text{H-NMR}$  (300.2-MHz,  $-\text{CDCl}_3$ ): -

$\delta = 8.0872 - (0.4); -8.0693 - (0.8); -8.0464 - (0.4); -7.7042 - (2.3); -7.6076 - (1.4); -7.5862 - (3.8); -7.5643 - (0.9); -7.5355 - (5.9); -7.4975 - (0.5); -7.4773 - (0.8); -7.4688 - (1.3); -7.4616 - (0.8); -7.4464 - (0.8); -7.2993 - (19.1); -4.4426 - (0.9); -4.4208 - (0.9); -4.3935 - (2.0); -4.3717 - (2.0); -4.3444 - (1.0); -4.3225 - (1.0); -2.9442 - (16.0); -2.0844 - (0.9); -1.5977 - (1.6); -1.3218 - (0.6); -1.2922 - (4.0); -1.2744 - (0.9); -0.9185 - (0.4); -0.8933 - (0.5); -0.8689 - (0.3); -0.0488 - (0.7); -0.0381 - (20.4); -0.0272 - (1.1)$

10

I-006:  $^1\text{H-NMR}$  (300.2-MHz,  $-\text{CDCl}_3$ ): -

$\delta = 8.0836 - (0.3); -8.0629 - (0.6); -8.0430 - (0.3); -7.6087 - (1.1); -7.5873 - (3.4); -7.5653 - (1.9); -7.5361 - (4.8); -7.4892 - (3.4); -7.4814 - (1.4); -7.4705 - (1.4); -7.4615 - (1.9); -7.4598 - (1.9); -7.4498 - (0.8); -7.4416 - (0.4); -7.2984 - (8.5); -5.3370 - (1.0); -4.2306 - (0.9); -4.2090 - (0.9); -4.1938 - (0.5); -4.1822 - (1.9); -4.1700 - (1.5); -4.1607 - (1.9); -4.1462 - (1.4); -4.1338 - (1.0); -4.1225 - (0.6); -4.1123 - (1.0); -2.9420 - (16.0); -2.1248 - (0.5); -2.0824 - (6.4); -2.0444 - (0.4); -1.3199 - (1.8); -1.2961 - (4.4); -1.2723 - (1.9); -0.0365 - (9.0); -0.0256 - (0.3)$

20

I-007:  $^1\text{H-NMR}$  (300.2-MHz,  $-\text{CDCl}_3$ ): -

$\delta = 8.0924 - (0.4); -8.0712 - (0.7); -8.0512 - (0.4); -7.6312 - (2.1); -7.6032 - (3.1); -7.5848 - (3.8); -7.5635 - (0.5); -7.5517 - (1.8); -7.5456 - (2.0); -7.5295 - (1.8); -7.4764 - (0.7); -7.4676 - (1.2); -7.4603 - (0.8); -7.4455 - (0.7); -7.4383 - (0.4); -7.3829 - (1.2); -7.3764 - (1.1); -7.3546 - (1.0); -7.3480 - (1.0); -7.2987 - (10.2); -5.3378 - (0.7); -4.4444 - (0.9); -4.4227 - (0.9); -4.3952 - (2.0); -4.3734 - (1.9); -4.3460 - (1.0); -4.3243 - (1.0); -4.1707 - (0.4); -4.1469 - (0.4); -2.9430 - (16.0); -2.0833 - (1.9); -1.6000 - (1.5); -1.3207 - (0.5); -1.2968 - (1.1); -1.2731 - (0.5); -0.0477 - (0.4); -0.0369 - (10.5); -0.0260 - (0.4)$

30

I-008:  $^1\text{H-NMR}$  (300.2-MHz,  $-\text{CDCl}_3$ ): -

$\delta = 8.5686 - (4.9); -8.2586 - (0.4); -8.2366 - (0.7); -8.2167 - (0.4); -7.5238 - (2.2); -7.4968 - (3.3); -7.4678 - (1.2); -7.4281 - (1.5); -7.4022 - (0.8); -7.2988 - (10.4); -7.2034 - (1.7); -7.1657 - (1.0); -7.1544 - (1.4); -7.1279 - (1.2); -4.3308 - (1.0); -4.3093 - (0.9); -4.2806 - (2.0); -4.2591 - (2.0); -4.2303 - (1.1); -4.2089 - (1.0); -2.9964 - (1.0); -2.9239 - (0.9); -2.8468 - (16.0); -2.3827 - (8.3); -2.1317 - (0.6); -2.0839 - (0.8); -1.6075 - (0.4); -1.3210 - (0.3); -1.2972 - (0.7); -0.1074 - (4.4); -0.0477 - (0.5); -0.0370 - (12.5); -0.0261 - (0.4)$

40

50

I-009:  $^1\text{H-NMR}$  (500.1 MHz,  $-\text{CDCl}_3$ ):  $-\$

$\delta = 8.4892 - (5.4); -7.9812 - (0.6); -7.9697 - (0.9); -7.9583 - (0.6); -7.4448 - (0.8); -7.4289 - (1.8); -7.4129 - (1.2); -7.3503 - (1.7); -7.3312 - (2.6); -7.3148 - (2.2); -7.2591 - (4.6); -7.1368 - (2.2); -7.0789 - (1.2); -7.0749 - (1.1); -7.0624 - (1.1); -7.0584 - (1.0); -7.0248 - (2.5); -7.0045 - (1.4); -6.9884 - (1.2); -4.0921 - (16.0); -4.0663 - (1.0); -4.0533 - (1.2); -4.0366 - (2.1); -4.0239 - (2.0); -4.0068 - (1.1); -3.9942 - (1.0); -2.4288 - (6.9); -2.3098 - (9.7); -1.5524 - (2.6); -0.0705 - (2.2); -0.0002 - (5.3)$

I-010:  $^1\text{H-NMR}$  (500.1 MHz,  $-\text{CDCl}_3$ ):  $-\$

$\delta = 8.4632 - (9.7); -8.1248 - (0.8); -8.1132 - (1.5); -8.1016 - (0.9); -7.4476 - (1.2); -7.4317 - (2.9); -7.4156 - (2.0); -7.3628 - (2.9); -7.3506 - (4.4); -7.3351 - (3.7); -7.3228 - (0.6); -7.3072 - (0.6); -7.2575 - (3.6); -7.1650 - (3.5); -7.0904 - (1.9); -7.0864 - (1.8); -7.0740 - (1.8); -7.0700 - (1.6); -7.0349 - (4.3); -7.0238 - (2.7); -7.0072 - (2.0); -4.0823 - (1.6); -4.0697 - (1.6); -4.0527 - (3.5); -4.0401 - (3.4); -4.0230 - (1.8); -4.0104 - (1.7); -3.9586 - (0.6); -3.9455 - (0.6); -2.4462 - (12.8); -2.3752 - (0.5); -2.3646 - (1.0); -2.3597 - (1.1); -2.3563 - (0.9); -2.3494 - (2.1); -2.3437 - (1.0); -2.3391 - (1.2); -2.3337 - (1.3); -2.3239 - (3.7); -2.3166 - (16.0); -1.5856 - (0.8); -1.1879 - (0.4); -1.1753 - (2.1); -1.1701 - (5.0); -1.1665 - (2.8); -1.1539 - (9.8); -1.1474 - (4.9); -1.1443 - (5.5); -1.1391 - (2.1); -1.1253 - (0.3); -0.0731 - (0.6); -0.0002 - (3.7)$

I-011:  $^1\text{H-NMR}$  (500.1 MHz,  $-\text{CDCl}_3$ ):  $-\$

$\delta = 8.5515 - (9.7); -8.2308 - (0.7); -8.2188 - (1.2); -8.2070 - (0.7); -7.4677 - (1.1); -7.4518 - (2.6); -7.4357 - (1.8); -7.3867 - (2.4); -7.3711 - (1.6); -7.3585 - (3.1); -7.3426 - (3.4); -7.2585 - (5.3); -7.1948 - (2.9); -7.1206 - (1.6); -7.1160 - (1.5); -7.1043 - (1.4); -7.0996 - (1.3); -7.0363 - (3.4); -7.0187 - (1.8); -7.0025 - (1.6); -4.1003 - (1.5); -4.0877 - (1.5); -4.0706 - (3.4); -4.0579 - (3.3); -4.0407 - (1.7); -4.0281 - (1.6); -3.0924 - (2.3); -3.0772 - (7.1); -3.0620 - (7.2); -3.0469 - (2.4); -2.4546 - (9.6); -2.4504 - (5.5); -2.3155 - (13.7); -1.4311 - (7.9); -1.4160 - (16.0); -1.4073 - (0.5); -1.4008 - (7.7); -0.0719 - (2.0); -0.0002 - (5.7)$

I-012:  $^1\text{H-NMR}$  (500.1 MHz,  $-\text{CDCl}_3$ ):  $-\$

$\delta = 8.4674 - (5.6); -7.9911 - (0.4); -7.9792 - (0.7); -7.9675 - (0.4); -7.4610 - (0.6); -7.4451 - (1.4); -7.4289 - (1.0); -7.3751 - (1.3); -7.3595 - (0.9); -7.3415 - (1.7); -7.3256 - (1.9); -7.2588 - (10.8); -7.1726 - (1.6); -7.1077 - (0.9); -7.1031 - (0.8); -7.0913 - (0.8); -7.0866 - (0.7); -7.0340 - (1.9); -7.0198 - (1.1); -7.0035 - (0.9); -5.2977 - (4.5); -4.0786 - (0.8); -4.0661 - (0.8); -4.0490 - (1.8); -4.0364 - (1.8); -4.0194 - (0.9); -4.0068 - (0.9); -2.6051 - (16.0); -2.4401 - (5.5); -2.3163 - (7.8); -2.0434 - (0.3); -1.5370 - (4.4); -1.2585 - (0.4); -0.0695 - (1.1); -0.0062 - (0.6); -0.0002 - (15.2); -0.0068 - (0.6)$

10

20

30

40

50

I-013:  $^1\text{H-NMR}$  (500.1-MHz,  $-\text{CDCl}_3$ ):  $-\$

$\delta = 8.5114 - (5.0); -8.1892 - (2.1); -7.3542 - (2.9); -7.3387 - (3.0); -7.2744 - (1.9); -7.2591 - (6.3); -7.2434 - (2.1); -7.1142 - (2.8); -7.0989 - (2.4); -7.0382 - (4.9); -7.0191 - (3.2); -7.0039 - (2.6); -6.9278 - (4.0); -6.8567 - (2.7); -6.8411 - (2.4); -4.1046 - (1.7); -4.0924 - (1.9); -4.0749 - (3.3); -4.0630 - (3.1); -4.0453 - (1.9); -4.0334 - (1.6); -2.7920 - (16.0); -2.4634 - (12.4); -2.3179 - (15.1); -1.6376 - (1.0); -1.2561 - (0.8); -0.0708 - (1.2); -0.0002 - (4.4)$

10

I-014:  $^1\text{H-NMR}$  (500.1-MHz,  $-\text{CDCl}_3$ ):  $-\$

$\delta = 8.4481 - (7.8); -8.1105 - (0.8); -8.0988 - (1.4); -8.0874 - (0.8); -7.3533 - (3.1); -7.3375 - (3.4); -7.2591 - (16.6); -7.2409 - (4.1); -7.2246 - (2.4); -7.0894 - (2.3); -7.0878 - (2.2); -7.0733 - (1.9); -7.0718 - (1.9); -7.0386 - (4.1); -7.0265 - (2.2); -7.0102 - (1.9); -6.9019 - (2.2); -6.8979 - (3.8); -6.8939 - (2.3); -6.8345 - (2.0); -6.8299 - (1.8); -6.8179 - (1.9); -6.8133 - (1.7); -5.6926 - (0.4); -5.2978 - (5.8); -4.1287 - (0.8); -4.1144 - (0.8); -4.0997 - (0.4); -4.0928 - (1.5); -4.0803 - (1.5); -4.0632 - (3.2); -4.0507 - (3.1); -4.0336 - (1.6); -4.0211 - (1.5); -2.4559 - (10.5); -2.3638 - (0.4); -2.3535 - (0.9); -2.3480 - (1.0); -2.3379 - (1.9); -2.3208 - (16.0); -2.3031 - (0.4); -2.0435 - (3.2); -2.0041 - (0.7); -1.5443 - (8.2); -1.2729 - (1.1); -1.2585 - (2.2); -1.2444 - (1.0); -1.1762 - (0.4); -1.1588 - (4.3); -1.1416 - (7.9); -1.1312 - (4.9); -1.1128 - (0.4); -0.0694 - (5.4); -0.0002 - (20.5)$

20

I-015:  $^1\text{H-NMR}$  (500.1-MHz,  $-\text{CDCl}_3$ ):  $-\$

$\delta = 8.4203 - (5.2); -8.1933 - (0.5); -8.1816 - (0.8); -8.1698 - (0.5); -7.3636 - (2.0); -7.3477 - (2.2); -7.2590 - (3.1); -7.2319 - (1.1); -7.2157 - (1.6); -7.2078 - (0.5); -7.1988 - (1.3); -7.0392 - (2.3); -7.0125 - (1.2); -6.9964 - (1.1); -6.8823 - (1.6); -6.8668 - (1.4); -6.7347 - (3.1); -6.7307 - (2.5); -6.7264 - (1.8); -6.7237 - (1.7); -4.1375 - (0.9); -4.1250 - (0.9); -4.1075 - (2.0); -4.0949 - (2.0); -4.0774 - (1.0); -4.0648 - (1.0); -2.7586 - (16.0); -2.4784 - (6.4); -2.3145 - (9.2); -1.8803 - (0.6); -1.8735 - (0.6); -1.8635 - (1.2); -1.8535 - (0.7); -1.8468 - (0.6); -1.8366 - (0.3); -1.2557 - (0.5); -0.9809 - (0.7); -0.9716 - (2.1); -0.9677 - (2.1); -0.9586 - (1.1); -0.9548 - (2.1); -0.9510 - (2.0); -0.9420 - (0.8); -0.6908 - (0.8); -0.6814 - (2.6); -0.6781 - (2.3); -0.6717 - (2.1); -0.6681 - (2.7); -0.6585 - (0.7); -0.0713 - (1.4); -0.0002 - (3.4)$

30

40

50

I-016:  $^1\text{H-NMR}$  (400.2-MHz,  $-\text{d}_6\text{-DMSO}$ ): -

$\delta = 8.8502 - (0.6)$ ;  $-8.8361 - (1.2)$ ;  $-8.8214 - (0.6)$ ;  $-8.7969 - (13.5)$ ;  $-8.5340 - (5.7)$ ;  $-7.9541 - (0.3)$ ;  $-7.0248 - (0.7)$ ;  $-7.0220 - (0.7)$ ;  $-7.0046 - (1.5)$ ;  $-7.0020 - (1.6)$ ;  $-6.9845 - (0.9)$ ;  $-6.9820 - (1.0)$ ;  $-6.7732 - (1.0)$ ;  $-6.7664 - (1.2)$ ;  $-6.7566 - (1.5)$ ;  $-6.7465 - (1.9)$ ;  $-6.7428 - (1.4)$ ;  $-6.7369 - (0.8)$ ;  $-6.7266 - (0.8)$ ;  $-6.7231 - (0.6)$ ;  $-3.6738 - (0.9)$ ;  $-3.6562 - (2.2)$ ;  $-3.6409 - (2.3)$ ;  $-3.6234 - (1.0)$ ;  $-3.3423 - (12.7)$ ;  $-3.3396 - (14.8)$ ;  $-3.0734 - (1.9)$ ;  $-3.0556 - (3.7)$ ;  $-3.0377 - (1.7)$ ;  $-2.8924 - (2.4)$ ;  $-2.7331 - (2.0)$ ;  $-2.6526 - (16.0)$ ;  $-2.5272 - (0.5)$ ;  $-2.5225 - (0.7)$ ;  $-2.5137 - (8.8)$ ;  $-2.5093 - (17.7)$ ;  $-2.5048 - (23.1)$ ;  $-2.5002 - (16.8)$ ;  $-2.4958 - (8.2)$ ;  $-2.0953 - (0.5)$ ;  $-2.0869 - (0.6)$ ;  $-2.0742 - (1.0)$ ;  $-2.0615 - (0.6)$ ;  $-2.0533 - (0.6)$ ;  $-1.0323 - (0.7)$ ;  $-1.0214 - (2.1)$ ;  $-1.0159 - (2.2)$ ;  $-1.0113 - (1.0)$ ;  $-1.0056 - (1.1)$ ;  $-1.0002 - (2.1)$ ;  $-0.9948 - (2.1)$ ;  $-0.9846 - (0.8)$ ;  $-0.7741 - (0.9)$ ;  $-0.7638 - (2.3)$ ;  $-0.7587 - (2.4)$ ;  $-0.7510 - (2.2)$ ;  $-0.7459 - (2.4)$ ;  $-0.7347 - (0.7)$ ;  $-0.0002 - (1.7)$

10

I-017:  $^1\text{H-NMR}$  (400.2-MHz,  $-\text{d}_6\text{-DMSO}$ ): -

$\delta = 9.2597 - (1.3)$ ;  $-9.2387 - (1.3)$ ;  $-8.6070 - (6.1)$ ;  $-7.0427 - (0.6)$ ;  $-7.0401 - (0.7)$ ;  $-7.0204 - (2.1)$ ;  $-7.0129 - (0.7)$ ;  $-6.9995 - (2.0)$ ;  $-6.9913 - (1.2)$ ;  $-6.9778 - (0.7)$ ;  $-6.9700 - (0.8)$ ;  $-6.8970 - (1.1)$ ;  $-6.8894 - (1.0)$ ;  $-6.8739 - (1.2)$ ;  $-6.8663 - (1.0)$ ;  $-6.8248 - (0.7)$ ;  $-6.8213 - (1.0)$ ;  $-6.8113 - (1.8)$ ;  $-6.8044 - (1.5)$ ;  $-6.7996 - (2.7)$ ;  $-6.7945 - (1.1)$ ;  $-6.7890 - (1.9)$ ;  $-6.7849 - (1.0)$ ;  $-6.7766 - (2.4)$ ;  $-6.7580 - (0.7)$ ;  $-5.1790 - (0.4)$ ;  $-5.1608 - (0.8)$ ;  $-5.1446 - (0.8)$ ;  $-5.1263 - (0.4)$ ;  $-4.1916 - (1.6)$ ;  $-4.1778 - (2.8)$ ;  $-4.1650 - (1.6)$ ;  $-3.3385 - (21.8)$ ;  $-2.8905 - (0.4)$ ;  $-2.6651 - (16.0)$ ;  $-2.5248 - (0.5)$ ;  $-2.5201 - (0.8)$ ;  $-2.5114 - (8.7)$ ;  $-2.5070 - (17.5)$ ;  $-2.5024 - (23.0)$ ;  $-2.4979 - (16.7)$ ;  $-2.4934 - (8.1)$ ;  $-2.1075 - (0.5)$ ;  $-2.0992 - (0.6)$ ;  $-2.0868 - (1.2)$ ;  $-2.0749 - (1.0)$ ;  $-2.0641 - (0.9)$ ;  $-2.0533 - (0.6)$ ;  $-2.0403 - (0.7)$ ;  $-2.0281 - (0.6)$ ;  $-1.9079 - (0.4)$ ;  $-1.9046 - (0.5)$ ;  $-1.8899 - (0.6)$ ;  $-1.8726 - (0.6)$ ;  $-1.8539 - (0.4)$ ;  $-1.0395 - (0.7)$ ;  $-1.0290 - (2.0)$ ;  $-1.0234 - (2.0)$ ;  $-1.0185 - (1.0)$ ;  $-1.0136 - (1.0)$ ;  $-1.0079 - (2.0)$ ;  $-1.0023 - (2.0)$ ;  $-0.9926 - (0.8)$ ;  $-0.7800 - (0.9)$ ;  $-0.7702 - (2.0)$ ;  $-0.7653 - (2.1)$ ;  $-0.7573 - (2.0)$ ;  $-0.7521 - (1.9)$ ;  $-0.7415 - (0.7)$ ;  $-0.0002 - (1.7)$

20

30

40

50

I-018:  $^1\text{H-NMR}$  (400.2-MHz,  $-\text{d}_6\text{-DMSO}$ ): -

$\delta = 8.8738 - (0.6)$ ;  $-8.8593 - (1.4)$ ;  $-8.8454 - (2.5)$ ;  $-8.5256 - (6.1)$ ;  $-8.0269 - (1.1)$ ;  $-8.0211 - (1.1)$ ;  $-8.0061 - (1.2)$ ;  $-8.0006 - (1.2)$ ;  $-7.4909 - (1.9)$ ;  $-7.4704 - (1.8)$ ;  $-7.0322 - (0.7)$ ;  $-7.0301 - (0.7)$ ;  $-7.0122 - (1.6)$ ;  $-6.9900 - (1.0)$ ;  $-6.7830 - (2.6)$ ;  $-6.7633 - (3.6)$ ;  $-6.7446 - (1.5)$ ;  $-3.6366 - (0.9)$ ;  $-3.6193 - (2.2)$ ;  $-3.6040 - (2.3)$ ;  $-3.5868 - (1.0)$ ;  $-3.3373 - (14.2)$ ;  $-3.0495 - (1.5)$ ;  $-3.0319 - (3.0)$ ;  $-3.0144 - (1.4)$ ;  $-2.8927 - (0.9)$ ;  $-2.7335 - (0.8)$ ;  $-2.6517 - (16.0)$ ;  $-2.5272 - (0.5)$ ;  $-2.5137 - (10.0)$ ;  $-2.5094 - (19.4)$ ;  $-2.5049 - (25.1)$ ;  $-2.5004 - (18.1)$ ;  $-2.4961 - (8.7)$ ;  $-2.0946 - (0.5)$ ;  $-2.0862 - (0.6)$ ;  $-2.0735 - (1.0)$ ;  $-2.0608 - (0.6)$ ;  $-2.0526 - (0.6)$ ;  $-1.0325 - (0.7)$ ;  $-1.0216 - (2.1)$ ;  $-1.0161 - (2.2)$ ;  $-1.0117 - (1.0)$ ;  $-1.0058 - (1.1)$ ;  $-1.0005 - (2.1)$ ;  $-0.9951 - (2.1)$ ;  $-0.9849 - (0.8)$ ;  $-0.7695 - (0.9)$ ;  $-0.7592 - (2.4)$ ;  $-0.7542 - (2.4)$ ;  $-0.7465 - (2.2)$ ;  $-0.7414 - (2.4)$ ;  $-0.7301 - (0.7)$ ;  $-0.0002 - (1.9)$

10

I-019:  $^1\text{H-NMR}$  (400.1-MHz,  $-\text{CDCl}_3$ ): -

$\delta = 8.4728 - (4.6)$ ;  $-8.1926 - (1.5)$ ;  $-7.3642 - (2.5)$ ;  $-7.3445 - (2.4)$ ;  $-7.2613 - (7.9)$ ;  $-7.2351 - (2.8)$ ;  $-7.2146 - (1.5)$ ;  $-7.0417 - (3.8)$ ;  $-7.0200 - (2.2)$ ;  $-7.0008 - (1.8)$ ;  $-6.7130 - (2.1)$ ;  $-6.6925 - (1.8)$ ;  $-6.5762 - (3.1)$ ;  $-6.5709 - (3.4)$ ;  $-6.5653 - (1.6)$ ;  $-6.5318 - (2.2)$ ;  $-6.5129 - (1.9)$ ;  $-4.1373 - (1.4)$ ;  $-4.1214 - (1.4)$ ;  $-4.0997 - (2.8)$ ;  $-4.0839 - (2.4)$ ;  $-4.0622 - (1.5)$ ;  $-4.0466 - (1.2)$ ;  $-3.7822 - (16.0)$ ;  $-2.9558 - (1.2)$ ;  $-2.8839 - (1.1)$ ;  $-2.7671 - (15.0)$ ;  $-2.7277 - (0.3)$ ;  $-2.6726 - (0.7)$ ;  $-2.4747 - (9.3)$ ;  $-2.3176 - (11.9)$ ;  $-2.1707 - (0.4)$ ;  $-2.0052 - (10.7)$ ;  $-1.5827 - (13.4)$ ;  $-0.0002 - (4.1)$

20

I-020:  $^1\text{H-NMR}$  (499.9-MHz,  $-\text{CDCl}_3$ ): -

$\delta = 8.0635 - (2.5)$ ;  $-7.9953 - (0.6)$ ;  $-7.6163 - (2.6)$ ;  $-7.6098 - (2.4)$ ;  $-7.5994 - (3.8)$ ;  $-7.5547 - (7.4)$ ;  $-7.5005 - (5.8)$ ;  $-7.4206 - (8.0)$ ;  $-7.3336 - (3.5)$ ;  $-7.3210 - (3.5)$ ;  $-7.3171 - (3.6)$ ;  $-7.2610 - (20.6)$ ;  $-7.2332 - (5.4)$ ;  $-5.6334 - (2.4)$ ;  $-5.6259 - (2.8)$ ;  $-5.6171 - (2.8)$ ;  $-5.3004 - (1.6)$ ;  $-4.1878 - (1.5)$ ;  $-4.1848 - (1.5)$ ;  $-4.1738 - (2.0)$ ;  $-4.1599 - (2.3)$ ;  $-4.1502 - (2.1)$ ;  $-4.1291 - (1.8)$ ;  $-4.1147 - (1.9)$ ;  $-4.1015 - (1.4)$ ;  $-3.8542 - (1.8)$ ;  $-3.8433 - (2.2)$ ;  $-3.8330 - (2.0)$ ;  $-3.8260 - (2.0)$ ;  $-3.8155 - (1.8)$ ;  $-2.9460 - (0.3)$ ;  $-2.9034 - (16.0)$ ;  $-2.0458 - (3.7)$ ;  $-1.5486 - (11.5)$ ;  $-1.2596 - (2.8)$ ;  $-1.2458 - (2.6)$ ;  $-1.1632 - (0.5)$ ;  $-1.1355 - (0.3)$ ;  $-0.0002 - (20.6)$ ;  $-0.0276 - (5.4)$

30

40

50

I-021:  $^1\text{H-NMR}$  (400.1-MHz,  $-\text{CDCl}_3$ ): -

$\delta = 8.0089 - (0.5); -7.9944 - (0.9); -7.9802 - (0.6); -7.5146 - (2.2); -7.4945 - (2.4); -7.3069 - (1.2); -7.2872 - (5.1); -7.2673 - (2.0); -7.2602 - (8.6); -7.1158 - (1.5); -7.0952 - (1.4); -6.9977 - (1.6); -6.9742 - (1.7); -6.9667 - (1.6); -6.9522 - (1.2); -6.9464 - (1.4); -6.8896 - (1.8); -6.8849 - (2.5); -6.8803 - (1.7); -4.3952 - (1.0); -4.3793 - (1.0); -4.3582 - (2.2); -4.3424 - (2.2); -4.3211 - (1.2); -4.3053 - (1.2); -4.1480 - (1.0); -4.1302 - (2.8); -4.1124 - (3.0); -4.0946 - (1.1); -2.8751 - (16.0); -2.8384 - (0.3); -2.3472 - (9.6); -2.0434 - (12.0); -1.9355 - (0.4); -1.9228 - (0.7); -1.9143 - (0.7); -1.9017 - (1.3); -1.8891 - (0.8); -1.8807 - (0.8); -1.8683 - (0.5); -1.5582 - (1.5); -1.2763 - (3.2); -1.2584 - (6.5); -1.2406 - (3.4); -0.9890 - (0.7); -0.9774 - (2.0); -0.9724 - (2.2); -0.9611 - (1.3); -0.9563 - (2.3); -0.9514 - (2.3); -0.9404 - (1.1); -0.9247 - (0.3); -0.7173 - (0.8); -0.7057 - (2.5); -0.7017 - (2.4); -0.6938 - (2.3); -0.6892 - (2.9); -0.6771 - (1.0); -0.0698 - (0.9); -0.0076 - (0.4); --0.0002 - (10.2)$

10

I-022:  $^1\text{H-NMR}$  (400.2-MHz,  $-\text{d}_6\text{-DMSO}$ ): -

$\delta = 9.1668 - (0.5); -9.1510 - (1.0); -9.1353 - (0.5); -8.6186 - (5.7); -7.9578 - (0.6); -7.7739 - (0.9); -7.7713 - (1.2); -7.7679 - (0.9); -7.7546 - (1.1); -7.7511 - (1.4); -7.7487 - (1.0); -7.5577 - (1.3); -7.5377 - (2.3); -7.5179 - (1.3); -7.4761 - (1.4); -7.4700 - (1.7); -7.4660 - (1.4); -7.2907 - (1.0); -7.2885 - (1.2); -7.2813 - (2.0); -7.2702 - (1.0); -7.2681 - (1.0); -7.2608 - (2.2); -7.0772 - (1.8); -6.9879 - (1.0); -6.9677 - (0.8); -3.9909 - (0.5); -3.9748 - (0.5); -3.9526 - (1.2); -3.9365 - (1.1); -3.9138 - (0.6); -3.8980 - (0.5); -3.3407 - (23.2); -2.8957 - (4.3); -2.7359 - (3.5); -2.6957 - (13.6); -2.6767 - (0.4); -2.5703 - (16.0); -2.5302 - (1.1); -2.5255 - (1.7); -2.5168 - (18.8); -2.5123 - (37.2); -2.5077 - (48.4); -2.5031 - (35.1); -2.4986 - (16.8); -2.3889 - (4.8); -2.2513 - (6.9); -2.1887 - (0.4); -1.3606 - (3.2)$

20

I-023:  $^1\text{H-NMR}$  (400.2-MHz,  $-\text{d}_6\text{-DMSO}$ ): -

$\delta = 9.1387 - (0.7); -9.1229 - (1.5); -9.1072 - (0.8); -8.5727 - (6.6); -7.9579 - (1.4); -7.8938 - (2.8); -7.8721 - (3.0); -7.7068 - (3.4); -7.6932 - (3.8); -7.6313 - (2.8); -7.6258 - (2.9); -7.4520 - (2.8); -7.4384 - (2.6); -7.2738 - (2.2); -7.2538 - (2.4); -7.1394 - (1.9); -7.1336 - (1.9); -7.1177 - (1.8); -7.1119 - (1.8); -7.0660 - (2.8); -6.9453 - (1.5); -6.9254 - (1.3); -4.0020 - (0.7); -3.9861 - (0.7); -3.9637 - (1.7); -3.9477 - (1.6); -3.9252 - (0.8); -3.9093 - (0.8); -3.3428 - (24.6); -2.8947 - (8.5); -2.7360 - (7.7); -2.6811 - (16.0); -2.5120 - (26.4); -2.5077 - (34.1); -2.5033 - (26.3); -2.3925 - (7.2); -2.2273 - (9.9); -1.3613 - (1.6)$

30

40



I-024:  $^1\text{H-NMR}$  (400.1-MHz,  $-\text{CDCl}_3$ ):  $-\$

$\delta = 7.8604 - (0.6); -7.8458 - (1.1); -7.8316 - (0.7); -7.5700 - (0.6); -7.5506 - (2.0); -7.5307 - (4.9); -7.5266 - (2.7); -7.5108 - (0.8); -7.4834 - (3.0); -7.4635 - (0.3); -7.4499 - (0.4); -7.4316 - (1.3); -7.4266 - (2.1); -7.4212 - (1.2); -7.4132 - (0.9); -7.4086 - (1.4); -7.4036 - (0.9); -7.3149 - (3.1); -7.2888 - (1.4); -7.2684 - (2.4); -7.2594 - (19.2); -7.2187 - (2.9); -7.1990 - (1.7); -5.2979 - (6.6); -4.1537 - (1.5); -4.1481 - (0.6); -4.1381 - (1.5); -4.1301 - (1.1); -4.1175 - (3.3); -4.1123 - (1.5); -4.1019 - (3.2); -4.0945 - (0.7); -4.0813 - (1.7); -4.0656 - (1.7); -2.5317 - (0.4); -2.5193 - (0.9); -2.5115 - (1.0); -2.5078 - (0.8); -2.4993 - (1.7); -2.4948 - (1.0); -2.4868 - (1.0); -2.4790 - (1.1); -2.4667 - (0.6); -2.3008 - (16.0); -2.2916 - (12.7); -2.2519 - (0.6); -2.2380 - (0.9); -2.2062 - (0.5); -2.0433 - (4.0); -2.0040 - (8.3); -1.5479 - (1.6); -1.2763 - (1.2); -1.2585 - (2.9); -1.2483 - (2.1); -1.2414 - (3.9); -1.2339 - (2.6); -1.2279 - (2.1); -1.2211 - (3.1); -1.2147 - (2.3); -1.2050 - (2.4); -1.1972 - (3.0); -1.1910 - (3.9); -1.1856 - (3.2); -1.1787 - (2.4); -1.1645 - (0.8); -0.0501 - (0.4); -0.0080 - (1.0); -0.0002 - (29.2); -0.0084 - (1.4); -0.0496 - (0.4)$

10

I-025:  $^1\text{H-NMR}$  (400.1-MHz,  $-\text{CDCl}_3$ ):  $-\$

$\delta = 7.9029 - (0.8); -7.8876 - (1.5); -7.8732 - (0.9); -7.4860 - (1.6); -7.4822 - (1.7); -7.4710 - (1.7); -7.4660 - (2.7); -7.4618 - (2.1); -7.4506 - (1.9); -7.4468 - (2.0); -7.3883 - (3.6); -7.3685 - (4.1); -7.3096 - (0.6); -7.2880 - (1.7); -7.2841 - (1.8); -7.2710 - (2.0); -7.2673 - (3.8); -7.2594 - (30.1); -7.2506 - (3.1); -7.2467 - (2.7); -7.2096 - (0.6); -7.1075 - (2.3); -7.1035 - (2.4); -7.0870 - (3.8); -7.0830 - (4.0); -7.0667 - (5.6); -7.0628 - (3.9); -7.0561 - (3.0); -7.0338 - (2.3); -7.0121 - (0.8); -6.9955 - (0.4); -6.9727 - (0.4); -4.2006 - (1.8); -4.1848 - (1.8); -4.1640 - (4.1); -4.1481 - (4.0); -4.1272 - (2.2); -4.1114 - (2.1); -3.7072 - (0.5); -3.6908 - (0.5); -2.9632 - (0.4); -2.9455 - (0.7); -2.9275 - (0.3); -2.5283 - (0.7); -2.5043 - (12.6); -2.4986 - (7.7); -2.4893 - (2.2); -2.4830 - (2.2); -2.4759 - (2.0); -2.4635 - (1.4); -2.4312 - (0.4); -2.3776 - (0.4); -2.3475 - (2.6); -2.3270 - (16.0); -2.2942 - (2.6); -2.2773 - (0.6); -2.0042 - (5.0); -1.5448 - (13.9); -1.4952 - (0.4); -1.2624 - (0.7); -1.2551 - (0.6); -1.2474 - (2.4); -1.2406 - (4.3); -1.2347 - (3.0); -1.2269 - (2.6); -1.2196 - (6.7); -1.2149 - (5.7); -1.2056 - (5.5); -1.2009 - (6.2); -1.1939 - (3.3); -1.1811 - (1.1); -1.1778 - (1.1); -1.1523 - (0.6); -1.1439 - (0.8); -1.1330 - (0.7); -1.1260 - (0.6); -0.0500 - (0.5); -0.0080 - (1.1); -0.0002 - (38.7); -0.0084 - (2.4); -0.0150 - (0.9); -0.0500 - (0.6)$

20

30

40

50

I-026:  $^1\text{H-NMR}$  (400.1-MHz, -CDCl<sub>3</sub>): -

$\delta = 8.4474 - (5.0); -8.1929 - (1.6); -7.3677 - (2.4); -7.3480 - (2.7); -7.2598 - (11.0); -7.1073 - (0.7); -7.0845 - (1.6); -7.0640 - (1.8); -7.0464 - (4.6); -7.0133 - (2.0); -6.8961 - (0.7); -6.8759 - (1.5); -6.8526 - (1.5); -6.8322 - (0.6); -5.2982 - (1.3); -4.1254 - (1.3); -4.1100 - (1.3); -4.0883 - (2.6); -4.0728 - (2.5); -4.0508 - (1.4); -4.0354 - (1.3); -2.7799 - (16.0); -2.4738 - (10.8); -2.3239 - (13.8); -1.5538 - (3.3); -1.2560 - (0.6); -0.0002 - (14.2)$

10

I-027:  $^1\text{H-NMR}$  (400.1-MHz, -CDCl<sub>3</sub>): -

$\delta = 9.5441 - (1.0); -9.5175 - (1.1); -7.7085 - (0.6); -7.6872 - (0.7); -7.6101 - (2.5); -7.5982 - (0.4); -7.5039 - (0.4); -7.4983 - (1.4); -7.4944 - (1.4); -7.4891 - (0.7); -7.4834 - (1.8); -7.4786 - (2.4); -7.4740 - (1.8); -7.4688 - (0.8); -7.4629 - (1.7); -7.4590 - (1.6); -7.4013 - (0.4); -7.3977 - (0.4); -7.3865 - (0.4); -7.3817 - (0.6); -7.3774 - (0.5); -7.3624 - (0.8); -7.3588 - (0.5); -7.3496 - (0.5); -7.3454 - (0.7); -7.3418 - (0.8); -7.3382 - (0.6); -7.3205 - (4.1); -7.3029 - (5.8); -7.2864 - (2.0); -7.2826 - (1.8); -7.2693 - (0.5); -7.2587 - (8.6); -7.2093 - (0.3); -7.1792 - (1.0); -7.1590 - (1.4); -7.1441 - (1.3); -7.1345 - (1.9); -7.1279 - (1.0); -7.1233 - (2.0); -7.1194 - (2.0); -7.1114 - (1.1); -7.1071 - (1.2); -7.1028 - (3.0); -7.0989 - (3.0); -7.0911 - (0.8); -7.0867 - (0.9); -7.0823 - (1.7); -7.0784 - (1.8); -7.0647 - (5.0); -7.0356 - (2.9); -7.0181 - (1.1); -7.0146 - (1.1); -6.9920 - (2.6); -6.9649 - (2.3); -6.9482 - (0.3); -6.9329 - (1.1); -6.9253 - (2.6); -6.8981 - (2.2); -6.7759 - (0.5); -6.7557 - (0.5); -5.8528 - (0.8); -5.8412 - (0.8); -5.2952 - (12.1); -2.5715 - (0.6); -2.5571 - (1.2); -2.5537 - (1.2); -2.5397 - (6.1); -2.5322 - (1.4); -2.5255 - (1.6); -2.5219 - (1.6); -2.5065 - (0.9); -2.4810 - (0.4); -2.4733 - (0.4); -2.4506 - (0.5); -2.4298 - (10.6); -2.4228 - (10.9); -2.4023 - (5.2); -2.3802 - (4.9); -2.3580 - (6.2); -2.3497 - (16.0); -2.3302 - (3.6); -2.3007 - (0.9); -2.2705 - (4.0); -2.2226 - (0.3); -2.0008 - (0.4); -1.4314 - (0.5); -1.3293 - (0.4); -1.3162 - (0.4); -1.3044 - (0.8); -1.2977 - (1.0); -1.2785 - (15.1); -1.2660 - (6.3); -1.2584 - (6.8); -1.2330 - (0.9); -1.2295 - (0.9); -1.2207 - (1.0); -1.2116 - (1.3); -1.2052 - (1.0); -1.2007 - (1.0); -1.1914 - (1.1); -1.1845 - (0.9); -1.1726 - (0.5); -1.0611 - (0.4); -1.0446 - (0.4); -0.9266 - (0.5); -0.9143 - (0.3); -0.9063 - (0.4); -0.5007 - (0.8); -0.4843 - (0.6); -0.0149 - (0.3); -0.0078 - (0.6); -0.0002 - (11.3); -0.0083 - (0.8)$

20

30

40

50

I-028:  $^1\text{H-NMR}$  (400.1-MHz,  $-\text{CDCl}_3$ ): -

$\delta = 8.0063 - (1.5); -7.5156 - (3.6); -7.4946 - (5.4); -7.4338 - (5.3); -7.4130 - (3.3); -7.3147 - (1.4); -7.2950 - (3.0); -7.2748 - (2.6); -7.2607 - (14.3); -7.0034 - (2.4); -6.9840 - (2.2); -6.9684 - (2.2); -6.9483 - (1.8); -6.8873 - (3.4); -4.1856 - (1.3); -4.1702 - (1.4); -4.1496 - (2.8); -4.1338 - (2.9); -4.1134 - (2.0); -4.0974 - (1.4); -3.7325 - (0.4); -2.8820 - (16.0); -2.0454 - (2.6); -1.9170 - (1.1); -1.9050 - (1.6); -1.8926 - (1.1); -1.8850 - (1.0); -1.5538 - (7.7); -1.2773 - (0.9); -1.2593 - (2.0); -1.2419 - (0.9); -0.9766 - (3.4); -0.9600 - (3.2); -0.7073 - (3.9); -0.6960 - (3.8); -0.6923 - (3.7); -0.0693 - (1.1); -0.0002 - (17.5)$

10

I-029:  $^1\text{H-NMR}$  (400.2-MHz,  $-\text{d}_6\text{-DMSO}$ ): -

$\delta = 10.9694 - (1.2); -8.8161 - (0.6); -8.8019 - (1.3); -8.7875 - (0.6); -8.5570 - (5.6); -7.9523 - (1.8); -7.3593 - (2.8); -7.2950 - (2.1); -7.2904 - (2.0); -7.2833 - (2.7); -7.2760 - (3.2); -7.0417 - (0.7); -7.0392 - (0.7); -7.0193 - (1.6); -7.0014 - (1.0); -6.9990 - (1.0); -6.9527 - (1.6); -6.9490 - (1.6); -6.9319 - (1.4); -6.9282 - (1.5); -6.8042 - (1.0); -6.7846 - (2.2); -6.7686 - (1.7); -6.7531 - (0.8); -6.3194 - (1.4); -6.3143 - (2.1); -6.3092 - (1.4); -3.4306 - (0.8); -3.4151 - (1.6); -3.3930 - (1.6); -3.3780 - (1.0); -3.3413 - (25.0); -2.8890 - (12.2); -2.8002 - (1.6); -2.7800 - (2.1); -2.7622 - (1.4); -2.7304 - (10.7); -2.6610 - (16.0); -2.5246 - (0.6); -2.5112 - (11.8); -2.5068 - (23.3); -2.5023 - (30.4); -2.4977 - (22.4); -2.4933 - (10.9); -2.1058 - (0.5); -2.0977 - (0.6); -2.0849 - (1.0); -2.0721 - (0.6); -2.0638 - (0.6); -1.0314 - (0.7); -1.0204 - (2.1); -1.0149 - (2.2); -1.0105 - (1.1); -1.0048 - (1.1); -0.9993 - (2.1); -0.9938 - (2.2); -0.9837 - (0.8); -0.7737 - (0.9); -0.7633 - (2.3); -0.7583 - (2.5); -0.7506 - (2.3); -0.7454 - (2.4); -0.7343 - (0.7); -0.0002 - (2.0)$

20

30

40

50

I-030:  $^1\text{H-NMR}$  (400.2-MHz,  $-\text{d}_6\text{-DMSO}$ ): -

$\delta = 9.2590 - (1.3); -9.2380 - (1.3); -8.6071 - (5.7); -7.0427 - (0.6); -7.0398 - (0.7); -7.0202 - (2.0); -7.0129 - (0.7); -6.9994 - (2.0); -6.9913 - (1.2); -6.9779 - (0.7); -6.9700 - (0.7); -6.8968 - (1.1); -6.8892 - (1.0); -6.8736 - (1.1); -6.8660 - (0.9); -6.8245 - (0.7); -6.8209 - (1.0); -6.8111 - (1.8); -6.8042 - (1.5); -6.7995 - (2.7); -6.7944 - (1.1); -6.7889 - (1.9); -6.7845 - (1.0); -6.7765 - (2.4); -6.7579 - (0.7); -6.7546 - (0.6); -5.1789 - (0.4); -5.1608 - (0.8); -5.1447 - (0.7); -5.1260 - (0.4); -4.1915 - (1.6); -4.1777 - (2.7); -4.1649 - (1.6); -3.3349 - (11.9); -2.8905 - (1.1); -2.7315 - (0.9); -2.7308 - (0.9); -2.6650 - (16.0); -2.5249 - (0.6); -2.5201 - (0.9); -2.5114 - (10.2); -2.5069 - (20.4); -2.5023 - (26.7); -2.4977 - (19.3); -2.4932 - (9.2); -2.1075 - (0.5); -2.0993 - (0.6); -2.0867 - (1.1); -2.0749 - (1.0); -2.0639 - (0.8); -2.0531 - (0.6); -2.0401 - (0.7); -2.0278 - (0.6); -1.9078 - (0.4); -1.9043 - (0.5); -1.8896 - (0.6); -1.8721 - (0.6); -1.8537 - (0.4); -1.0394 - (0.7); -1.0290 - (2.0); -1.0234 - (2.1); -1.0183 - (1.0); -1.0135 - (1.1); -1.0078 - (2.0); -1.0022 - (2.0); -0.9925 - (0.8); -0.7800 - (0.9); -0.7702 - (2.0); -0.7652 - (2.1); -0.7573 - (2.0); -0.7520 - (1.9); -0.7415 - (0.7); -0.0002 - (2.5)$

10

20

I-031:  $^1\text{H-NMR}$  (400.1-MHz,  $-\text{CDCl}_3$ ): -

$\delta = 7.9911 - (0.8); -7.9774 - (0.5); -7.3107 - (2.5); -7.2897 - (3.2); -7.2697 - (2.8); -7.2595 - (12.9); -7.1978 - (2.0); -7.1782 - (1.4); -6.9994 - (1.4); -6.9793 - (2.3); -6.9734 - (1.6); -6.9590 - (1.1); -6.9531 - (1.3); -6.8976 - (1.6); -6.8928 - (2.3); -6.8880 - (1.5); -4.1720 - (0.9); -4.1566 - (1.0); -4.1481 - (0.9); -4.1353 - (2.2); -4.1303 - (2.6); -4.1198 - (2.2); -4.1124 - (2.5); -4.0985 - (1.3); -4.0947 - (1.2); -4.0832 - (1.2); -2.8777 - (16.0); -2.2848 - (14.2); -2.0435 - (9.2); -1.9244 - (0.6); -1.9157 - (0.7); -1.9034 - (1.2); -1.8908 - (0.8); -1.8822 - (0.7); -1.8699 - (0.4); -1.5498 - (3.4); -1.2764 - (2.5); -1.2585 - (5.2); -1.2407 - (2.6); -0.9904 - (0.7); -0.9788 - (1.9); -0.9739 - (2.1); -0.9626 - (1.2); -0.9576 - (2.1); -0.9528 - (2.0); -0.9417 - (1.0); -0.7191 - (0.8); -0.7075 - (2.4); -0.7034 - (2.2); -0.6953 - (2.1); -0.6910 - (2.7); -0.6789 - (0.9); -0.0695 - (1.3); -0.0078 - (0.5); -0.0002 - (15.1)$

30

40

50

I-032:  $^1\text{H-NMR}$  (400.2-MHz,  $-\text{d}_6\text{-DMSO}$ ): -

$\delta = 8.9209 - (8.9); -8.8915 - (0.6); -8.8770 - (1.1); -8.8624 - (0.6); -8.4971 - (5.2); -7.9545 - (0.6); -7.0332 - (0.6); -7.0303 - (0.7); -7.0112 - (1.4); -6.9930 - (0.9); -6.9902 - (0.9); -6.7948 - (1.5); -6.7922 - (1.3); -6.7749 - (3.2); -6.7552 - (2.2); -3.5935 - (0.8); -3.5775 - (2.1); -3.5619 - (2.1); -3.5458 - (0.8); -3.3396 - (13.8); -2.9528 - (1.4); -2.9364 - (2.6); -2.9199 - (1.2); -2.8925 - (4.4); -2.7334 - (3.6); -2.6661 - (0.3); -2.6458 - (16.0); -2.5271 - (0.5); -2.5224 - (0.8); -2.5137 - (9.0); -2.5093 - (18.0); -2.5047 - (23.6); -2.5000 - (17.0); -2.4955 - (8.0); -2.0879 - (0.5); -2.0795 - (0.5); -2.0668 - (1.0); -2.0540 - (0.6); -2.0458 - (0.5); -1.0290 - (0.8); -1.0181 - (2.1); -1.0126 - (2.1); -1.0080 - (1.0); -1.0023 - (1.1); -0.9969 - (2.1); -0.9914 - (2.1); -0.9813 - (0.8); -0.7719 - (0.9); -0.7617 - (2.2); -0.7564 - (2.3); -0.7489 - (2.1); -0.7436 - (2.3); -0.7324 - (0.7); -0.0002 - (2.0)$

10

I-033:  $^1\text{H-NMR}$  (400.1-MHz,  $-\text{CDCl}_3$ ): -

$\delta = 8.4403 - (5.0); -8.1746 - (1.3); -7.3629 - (2.4); -7.3429 - (2.6); -7.2601 - (7.9); -7.2478 - (1.5); -7.2282 - (2.7); -7.2086 - (1.6); -7.0383 - (3.5); -7.0135 - (2.0); -6.9930 - (1.9); -6.9756 - (2.2); -6.9570 - (1.9); -6.8078 - (3.2); -6.7890 - (2.0); -6.7686 - (1.7); -4.1424 - (1.2); -4.1269 - (1.2); -4.1047 - (2.5); -4.0891 - (2.4); -4.0673 - (1.4); -4.0516 - (1.2); -2.9543 - (0.5); -2.8828 - (0.4); -2.7634 - (16.0); -2.4740 - (9.3); -2.4312 - (0.4); -2.3282 - (15.8); -2.3152 - (13.5); -2.1689 - (0.4); -2.0027 - (11.5); -1.5735 - (17.1); -0.0002 - (4.4)$

20

I-034:  $^1\text{H-NMR}$  (400.2-MHz,  $-\text{d}_6\text{-DMSO}$ ): -

$\delta = 8.5367 - (0.8); -8.4533 - (5.6); -7.9546 - (0.4); -7.5183 - (3.7); -7.5129 - (3.5); -7.3548 - (2.8); -7.3342 - (3.0); -7.3058 - (0.5); -7.1501 - (1.9); -7.1448 - (1.8); -7.1296 - (1.6); -7.1242 - (1.5); -7.0966 - (0.8); -7.0770 - (1.8); -7.0582 - (1.2); -6.8802 - (1.0); -6.8604 - (1.7); -6.8542 - (1.1); -6.8345 - (1.7); -6.8174 - (1.0); -4.0025 - (1.6); -3.9850 - (3.0); -3.9672 - (1.7); -3.6889 - (0.3); -3.6703 - (0.5); -3.6465 - (2.3); -3.5976 - (16.0); -3.4493 - (0.6); -3.3445 - (27.2); -3.3406 - (27.5); -2.9964 - (0.5); -2.9680 - (1.7); -2.9504 - (3.1); -2.9329 - (1.5); -2.9078 - (0.5); -2.8922 - (2.5); -2.7329 - (2.2); -2.6462 - (15.5); -2.5988 - (2.1); -2.5272 - (0.7); -2.5136 - (14.3); -2.5093 - (27.8); -2.5049 - (36.0); -2.5003 - (26.2); -2.4960 - (12.8); -2.0984 - (0.6); -2.0900 - (0.6); -2.0773 - (1.2); -2.0645 - (0.8); -2.0565 - (0.7); -2.0434 - (0.4); -1.0285 - (0.8); -1.0174 - (2.3); -1.0119 - (2.6); -1.0018 - (1.5); -0.9963 - (2.4); -0.9909 - (2.6); -0.9810 - (1.1); -0.7743 - (0.9); -0.7638 - (2.6); -0.7590 - (2.7); -0.7510 - (2.7); -0.7463 - (3.0); -0.7348 - (1.2); -0.0002 - (2.4)$

30

40

50

I-035:  $^1\text{H-NMR}$  (400.2-MHz,  $-\text{d}_6\text{-DMSO}$ ): -

$\delta = 9.0928 - (0.6); -8.4237 - (3.4); -7.9582 - (0.4); -7.3099 - (1.0); -7.2900 - (1.1); -7.1838 - (0.8); -7.1633 - (1.5); -7.1428 - (0.9); -7.0929 - (1.2); -7.0053 - (0.6); -6.9852 - (0.5); -6.5437 - (0.6); -6.5377 - (0.6); -6.5227 - (0.6); -6.5176 - (0.6); -6.3762 - (0.8); -6.3704 - (1.5); -6.3645 - (0.8); -6.2356 - (0.7); -6.2301 - (0.6); -6.2157 - (0.6); -6.2111 - (0.6); -3.9818 - (0.7); -3.9659 - (0.7); -3.9433 - (0.4); -3.9273 - (0.3); -3.3502 - (6.1); -3.3433 - (7.4); -2.8953 - (3.5); -2.8866 - (16.0); -2.7370 - (2.4); -2.7361 - (2.6); -2.6481 - (8.2); -2.5305 - (0.4); -2.5257 - (0.5); -2.5170 - (6.2); -2.5126 - (12.2); -2.5080 - (16.0); -2.5034 - (11.8); -2.4989 - (5.8); -2.4191 - (3.0); -2.3761 - (0.3); -2.2933 - (0.5); -2.2642 - (4.2); -1.3614 - (1.1)$

10

I-036:  $^1\text{H-NMR}$  (400.2-MHz,  $-\text{d}_6\text{-DMSO}$ ): -

$\delta = 9.1283 - (0.4); -9.1126 - (1.2); -9.0960 - (1.4); -9.0797 - (0.5); -8.6031 - (0.7); -8.5644 - (0.4); -8.5075 - (5.9); -8.4844 - (3.4); -8.3244 - (0.9); -7.9580 - (0.8); -7.3199 - (0.7); -7.2997 - (2.0); -7.2959 - (2.3); -7.2889 - (3.1); -7.2759 - (2.7); -7.2692 - (4.5); -7.2496 - (1.3); -7.1033 - (1.4); -7.0885 - (3.9); -7.0669 - (1.3); -7.0466 - (0.7); -6.9957 - (1.8); -6.9754 - (1.6); -6.9259 - (1.1); -6.8775 - (1.5); -6.8613 - (1.2); -6.8483 - (0.9); -6.8436 - (0.7); -6.8295 - (0.6); -6.8235 - (0.6); -6.8144 - (0.9); -6.8102 - (1.2); -6.7872 - (2.1); -6.7815 - (2.0); -6.4535 - (0.3); -6.4371 - (0.7); -6.4217 - (0.3); -4.9965 - (0.4); -4.9895 - (0.4); -4.9607 - (0.4); -4.9537 - (0.5); -4.9481 - (0.4); -4.9454 - (0.4); -4.9399 - (0.5); -4.9326 - (0.3); -4.8297 - (0.4); -4.8223 - (0.4); -4.8007 - (0.3); -4.7937 - (0.5); -4.7880 - (0.4); -4.7854 - (0.4); -4.7800 - (0.5); -4.7726 - (0.4); -3.9957 - (0.8); -3.9803 - (0.8); -3.9573 - (1.7); -3.9470 - (1.2); -3.9414 - (1.6); -3.9188 - (0.8); -3.9028 - (0.8); -3.8034 - (0.3); -3.7876 - (0.3); -3.7643 - (0.8); -3.7486 - (0.7); -3.7251 - (0.4); -3.7101 - (0.4); -3.3440 - (77.5); -2.8957 - (6.0); -2.7369 - (4.9); -2.7358 - (5.1); -2.6800 - (4.0); -2.6709 - (16.0); -2.6666 - (10.0); -2.5303 - (2.9); -2.5255 - (4.5); -2.5168 - (52.3); -2.5124 - (102.6); -2.5078 - (132.8); -2.5032 - (96.6); -2.4987 - (46.7); -2.4654 - (0.7); -2.4479 - (0.4); -2.4427 - (0.4); -2.4373 - (0.4); -2.4324 - (0.4); -2.4058 - (7.9); -2.3752 - (3.3); -2.3435 - (0.3); -2.3392 - (0.6); -2.3347 - (0.9); -2.3302 - (0.6); -2.2937 - (4.8); -2.2635 - (9.0); -2.1887 - (1.0); -2.1539 - (0.4); -2.1481 - (0.4); -2.1287 - (0.4); -1.5686 - (0.4); -1.5584 - (0.4); -1.5509 - (0.5); -1.5476 - (0.4); -1.5403 - (0.4); -1.5300 - (0.4); -1.5225 - (0.4); -1.5181 - (0.4); -1.5105 - (0.4); -1.5004 - (0.4); -1.4930 - (0.4); -1.4897 - (0.4); -1.4822 - (0.4); -1.4719 - (0.3); -1.3828 - (0.4); -1.3762 - (0.6); -1.3699 - (0.6); -1.3605 - (6.7); -1.3258 - (0.4); -1.3181 - (0.3); -1.2479 - (0.4); -1.2416 - (0.4); -1.2373 - (0.4); -1.2294 - (0.4); -1.2037 - (0.4); -1.1859 - (0.6); -1.1687 - (0.8); -1.1588 - (0.4); -1.1527 - (0.8); -1.1413 - (0.8); -1.1350 - (0.4); -1.1253 - (0.8)$

20

30

40

50

I-037:  $^1\text{H-NMR}$  (400.1-MHz,  $-\text{CDCl}_3$ ):  $-\text{}$

$\delta = 7.9044 - (0.8); -7.8899 - (1.5); -7.8751 - (0.9); -7.3904 - (3.5); -7.3705 - (4.0); -7.3103 - (0.4); -7.2593 - (20.5); -7.2099 - (0.4); -7.0997 - (0.6); -7.0943 - (0.9); -7.0793 - (2.8); -7.0741 - (2.8); -7.0675 - (9.2); -7.0589 - (5.5); -7.0516 - (5.4); -7.0449 - (2.9); -7.0307 - (2.0); -7.0240 - (2.4); -7.0020 - (0.6); -6.8096 - (1.3); -6.8044 - (1.5); -6.7924 - (2.0); -6.7855 - (2.1); -6.7785 - (1.4); -6.7694 - (1.2); -4.2098 - (1.8); -4.1941 - (1.8); -4.1731 - (4.0); -4.1574 - (3.9); -4.1364 - (2.1); -4.1207 - (2.0); -2.9464 - (0.4); -2.5200 - (0.7); -2.5044 - (12.5); -2.4877 - (3.2); -2.4805 - (1.6); -2.4729 - (1.7); -2.4694 - (1.6); -2.4551 - (1.2); -2.4403 - (0.4); -2.3723 - (0.4); -2.3462 - (1.5); -2.3212 - (16.0); -2.2828 - (1.5); -2.2720 - (0.6); -2.0970 - (0.5); -2.0840 - (1.0); -2.0757 - (1.1); -2.0627 - (2.1); -2.0499 - (1.3); -2.0416 - (1.2); -2.0285 - (0.6); -2.0034 - (6.4); -1.5507 - (4.9); -1.2469 - (0.4); -1.2229 - (1.7); -1.2164 - (5.7); -1.2073 - (6.2); -1.1956 - (15.6); -1.1671 - (0.7); -1.1590 - (0.8); -1.1511 - (0.6); -1.1446 - (0.7); -1.1392 - (0.6); -1.1319 - (0.4); -1.0089 - (1.5); -0.9973 - (3.8); -0.9925 - (4.1); -0.9879 - (2.3); -0.9814 - (2.3); -0.9760 - (4.2); -0.9712 - (4.1); -0.9602 - (2.1); -0.9441 - (0.5); -0.9231 - (0.4); -0.7598 - (1.7); -0.7485 - (4.4); -0.7441 - (4.4); -0.7357 - (4.2); -0.7314 - (5.0); -0.7194 - (1.7); -0.6963 - (0.3); -0.0509 - (0.4); -0.0080 - (0.8); -0.0002 - (27.0); -0.0084 - (1.4); -0.0498 - (0.4)$

10

20

I-038:  $^1\text{H-NMR}$  (400.1-MHz,  $-\text{CDCl}_3$ ):  $-\text{}$

$\delta = 8.9008 - (0.6); -8.8741 - (0.7); -7.3974 - (0.8); -7.3938 - (0.6); -7.3813 - (1.9); -7.3784 - (3.0); -7.3738 - (3.9); -7.3544 - (2.9); -7.3352 - (1.2); -7.3206 - (1.8); -7.2980 - (1.9); -7.2927 - (2.0); -7.2879 - (1.8); -7.2854 - (1.7); -7.2699 - (3.2); -7.2656 - (2.1); -7.2607 - (3.4); -7.2366 - (2.5); -7.2329 - (2.1); -7.1417 - (4.0); -7.1280 - (1.3); -7.1234 - (1.6); -7.1180 - (1.0); -7.0586 - (1.6); -7.0393 - (1.4); -5.2955 - (6.3); -3.0968 - (6.3); -2.4656 - (0.3); -2.4535 - (0.8); -2.4448 - (0.8); -2.4330 - (1.5); -2.4211 - (1.0); -2.4125 - (0.9); -2.4009 - (0.8); -2.3543 - (16.0); -2.3035 - (0.5); -1.5958 - (0.3); -1.1600 - (0.7); -1.1488 - (2.1); -1.1417 - (2.6); -1.1283 - (2.3); -1.1215 - (2.4); -1.1117 - (1.0); -0.9634 - (0.9); -0.9532 - (2.7); -0.9467 - (2.5); -0.9417 - (2.6); -0.9351 - (2.8); -0.9239 - (0.8); -0.0002 - (3.7)$

30

I-039:  $^1\text{H-NMR}$  (400.1-MHz,  $-\text{CDCl}_3$ ):  $-\text{}$

$\delta = 8.4335 - (4.7); -8.1766 - (1.3); -7.3697 - (2.2); -7.3500 - (2.5); -7.2606 - (11.0); -7.2276 - (1.1); -7.2082 - (1.9); -7.1920 - (1.3); -7.0446 - (4.0); -7.0302 - (4.2); -7.0095 - (2.9); -6.8918 - (1.2); -6.8716 - (1.9); -6.8537 - (1.0); -5.2991 - (3.7); -4.1315 - (1.4); -4.1155 - (1.3); -4.0942 - (2.5); -4.0784 - (2.4); -4.0566 - (1.4); -4.0407 - (1.3); -2.7762 - (16.0); -2.4738 - (9.2); -2.3209 - (11.9); -2.0445 - (0.8); -1.5613 - (16.9); -1.2771 - (0.6); -1.2588 - (1.3); -1.2427 - (0.5); -0.0697 - (3.7); -0.0002 - (13.8)$

40

I-040:  $^1\text{H-NMR}$  (400.1-MHz,  $-\text{CDCl}_3$ ): -

$\delta = 9.5552 - (1.1); -9.5288 - (1.1); -7.3227 - (2.8); -7.3033 - (3.4); -7.2591 - (28.3); -7.2089 - (0.4); -7.1398 - (1.0); -7.1353 - (1.1); -7.1194 - (2.6); -7.1152 - (2.2); -7.1032 - (2.5); -7.0981 - (2.2); -7.0907 - (2.9); -7.0695 - (5.2); -7.0648 - (4.8); -7.0529 - (3.0); -7.0365 - (2.2); -7.0102 - (3.0); -6.9951 - (0.5); -6.9831 - (2.7); -6.9431 - (2.9); -6.9161 - (2.5); -6.8227 - (1.3); -6.8185 - (1.4); -6.8007 - (2.0); -6.7877 - (1.3); -6.7826 - (1.2); -2.5651 - (0.6); -2.5522 - (1.1); -2.5455 - (1.3); -2.5396 - (1.0); -2.5327 - (2.5); -2.5242 - (1.1); -2.5197 - (1.2); -2.5131 - (1.4); -2.5000 - (0.8); -2.4809 - (0.3); -2.4739 - (0.4); -2.4516 - (0.4); -2.4303 - (11.1); -2.4231 - (11.6); -2.3995 - (0.8); -2.3788 - (0.5); -2.3501 - (16.0); -2.3010 - (0.6); -2.2708 - (0.4); -2.1106 - (0.5); -2.0974 - (0.9); -2.0891 - (1.0); -2.0763 - (1.9); -2.0633 - (1.1); -2.0550 - (1.1); -2.0422 - (0.6); -2.0040 - (1.6); -1.5471 - (9.6); -1.4972 - (0.4); -1.4319 - (1.9); -1.2970 - (0.5); -1.2803 - (2.1); -1.2735 - (5.4); -1.2690 - (4.7); -1.2614 - (7.4); -1.2575 - (8.0); -1.2513 - (3.3); -1.2428 - (3.2); -1.2377 - (4.6); -1.2307 - (2.8); -1.2151 - (1.1); -1.0148 - (1.4); -1.0033 - (3.6); -0.9984 - (4.0); -0.9937 - (2.1); -0.9873 - (2.2); -0.9820 - (4.0); -0.9771 - (3.8); -0.9661 - (2.0); -0.9501 - (0.4); -0.9290 - (0.4); -0.7682 - (1.8); -0.7569 - (4.2); -0.7524 - (4.2); -0.7441 - (4.0); -0.7398 - (4.7); -0.7277 - (1.6); -0.0496 - (0.5); -0.0080 - (1.0); -0.0002 - (36.4); -0.0084 - (1.8); -0.0191 - (0.4); -0.0503 - (0.5)$

10

20

I-041:  $^1\text{H-NMR}$  (400.2-MHz,  $-\text{d}_6\text{-DMSO}$ ): -

$\delta = 8.8658 - (0.6); -8.8515 - (1.1); -8.8368 - (0.6); -8.5779 - (5.6); -7.0293 - (0.7); -7.0265 - (0.7); -7.0076 - (1.5); -6.9889 - (1.0); -6.9863 - (0.9); -6.7794 - (1.4); -6.7759 - (1.3); -6.7592 - (3.2); -6.7394 - (2.1); -6.4794 - (0.5); -5.9924 - (1.9); -5.9849 - (2.2); -5.9079 - (1.7); -5.9054 - (1.8); -5.9006 - (1.6); -5.8981 - (1.4); -3.4233 - (1.0); -3.4055 - (1.9); -3.3900 - (1.9); -3.3715 - (1.0); -3.3357 - (15.6); -2.8909 - (0.4); -2.7316 - (0.4); -2.7147 - (1.6); -2.6961 - (2.7); -2.6773 - (1.7); -2.6654 - (16.0); -2.5254 - (0.6); -2.5206 - (0.8); -2.5120 - (10.5); -2.5075 - (20.9); -2.5029 - (27.3); -2.4983 - (19.8); -2.4939 - (9.6); -2.1944 - (11.0); -2.0987 - (0.5); -2.0906 - (0.6); -2.0779 - (1.0); -2.0652 - (0.6); -2.0569 - (0.6); -1.0315 - (0.7); -1.0206 - (2.1); -1.0151 - (2.2); -1.0105 - (1.1); -1.0048 - (1.1); -0.9995 - (2.1); -0.9940 - (2.2); -0.9839 - (0.9); -0.7697 - (0.9); -0.7594 - (2.4); -0.7542 - (2.4); -0.7466 - (2.3); -0.7415 - (2.4); -0.7303 - (0.7); -0.0002 - (2.4)$

30

40

50



I-042:  $^1\text{H-NMR}$  (400.2-MHz,  $-\text{d}_6\text{-DMSO}$ ): -

$\delta = 11.0728 - (0.9); -8.8937 - (0.5); -8.8793 - (1.1); -8.8648 - (0.5); -8.5863 - (5.5); -7.9527 - (1.4); -7.3236 - (1.4); -7.3166 - (2.1); -7.3098 - (1.4); -7.2516 - (1.6); -7.2313 - (1.9); -7.0454 - (0.6); -7.0426 - (0.6); -7.0253 - (1.3); -7.0226 - (1.3); -7.0052 - (0.8); -7.0025 - (0.9); -6.9827 - (1.3); -6.9648 - (1.8); -6.9447 - (1.5); -6.8148 - (1.9); -6.8098 - (0.8); -6.8058 - (1.0); -6.7972 - (1.6); -6.7893 - (1.2); -6.7858 - (1.6); -6.7655 - (1.5); -6.7458 - (0.6); -6.5371 - (1.2); -6.5345 - (1.3); -6.5318 - (1.7); -6.5294 - (1.2); -6.5267 - (1.1); -3.4996 - (0.7); -3.4846 - (1.3); -3.4750 - (0.8); -3.4653 - (1.0); -3.4604 - (1.3); -3.4460 - (0.8); -3.3310 - (31.1); -2.9793 - (1.4); -2.9643 - (1.2); -2.9589 - (1.5); -2.9403 - (1.2); -2.8897 - (10.8); -2.7312 - (8.9); -2.7299 - (9.2); -2.6710 - (16.0); -2.5243 - (1.5); -2.5196 - (2.3); -2.5108 - (27.8); -2.5063 - (55.7); -2.5017 - (72.9); -2.4971 - (52.5); -2.4925 - (24.8); -2.3285 - (0.4); -2.1031 - (0.4); -2.0951 - (0.5); -2.0823 - (0.9); -2.0695 - (0.5); -2.0613 - (0.5); -1.0225 - (0.7); -1.0116 - (1.9); -1.0061 - (1.9); -1.0014 - (0.9); -0.9958 - (1.0); -0.9904 - (1.9); -0.9849 - (1.9); -0.9748 - (0.8); -0.7652 - (0.8); -0.7550 - (2.0); -0.7521 - (1.6); -0.7497 - (2.1); -0.7422 - (2.0); -0.7369 - (2.1); -0.7259 - (0.7); -0.0080 - (0.4); -0.0002 - (12.3); -0.0085 - (0.3)$

10

20

I-043:  $^1\text{H-NMR}$  (400.2-MHz,  $-\text{d}_6\text{-DMSO}$ ): -

$\delta = 9.0729 - (0.6); -9.0583 - (1.2); -9.0437 - (0.6); -8.5615 - (5.6); -7.9530 - (0.4); -7.1670 - (2.2); -7.1532 - (1.0); -7.1337 - (2.4); -7.1092 - (1.6); -7.0897 - (0.7); -7.0441 - (0.6); -7.0413 - (0.7); -7.0237 - (1.4); -7.0214 - (1.5); -7.0039 - (0.9); -7.0012 - (0.9); -6.8165 - (0.7); -6.8129 - (0.9); -6.7962 - (1.3); -6.7925 - (1.9); -6.7724 - (1.8); -6.7542 - (0.7); -6.7509 - (0.5); -5.5634 - (0.4); -5.5539 - (0.5); -5.5430 - (0.4); -5.5336 - (0.4); -5.4421 - (0.4); -5.4331 - (0.5); -5.4212 - (0.5); -5.4125 - (0.4); -3.6701 - (0.5); -3.6552 - (0.4); -3.6496 - (0.7); -3.6345 - (0.4); -3.6287 - (0.9); -3.6180 - (0.5); -3.6136 - (0.8); -3.6081 - (0.5); -3.6038 - (0.5); -3.5928 - (0.5); -3.5530 - (0.4); -3.5440 - (0.3); -3.5384 - (0.4); -3.5292 - (0.4); -3.3357 - (12.0); -2.8904 - (3.3); -2.7319 - (2.7); -2.7309 - (2.8); -2.6892 - (0.3); -2.6766 - (16.0); -2.5253 - (0.6); -2.5206 - (0.9); -2.5119 - (10.1); -2.5074 - (20.4); -2.5028 - (26.9); -2.4982 - (19.6); -2.4937 - (9.4); -2.2179 - (10.9); -2.2063 - (7.3); -2.1019 - (0.5); -2.0935 - (0.5); -2.0809 - (1.0); -2.0681 - (0.6); -2.0598 - (0.6); -1.0333 - (0.7); -1.0225 - (2.0); -1.0170 - (2.1); -1.0123 - (1.0); -1.0069 - (1.0); -1.0014 - (2.0); -0.9958 - (2.0); -0.9858 - (0.8); -0.7734 - (0.9); -0.7632 - (2.1); -0.7580 - (2.2); -0.7505 - (2.1); -0.7451 - (2.2); -0.7342 - (0.7); -0.0002 - (2.5)$

30

40

50

I-044:  $^1\text{H-NMR}$  (400.2-MHz,  $-\text{d}_6\text{-DMSO}$ ): -

$\delta = 9.1297 - (0.6); -9.1142 - (1.3); -9.0982 - (0.6); -8.6302 - (6.5); -7.4501 - (1.5); -7.4311 - (1.3); -7.4196 - (0.4); -7.4096 - (2.1); -7.4021 - (0.4); -7.3881 - (1.5); -7.2898 - (2.0); -7.2694 - (2.7); -7.2656 - (3.5); -7.0884 - (2.6); -7.0812 - (2.1); -7.0095 - (1.3); -6.9896 - (1.2); -6.9692 - (1.2); -6.9647 - (1.3); -6.9487 - (1.1); -6.9446 - (1.2); -6.8529 - (1.0); -6.8490 - (2.0); -6.8469 - (2.3); -6.8448 - (2.1); -6.8389 - (3.0); -6.8329 - (3.3); -6.8270 - (0.8); -3.9936 - (0.7); -3.9777 - (0.7); -3.9551 - (1.5); -3.9391 - (1.5); -3.9165 - (0.8); -3.9005 - (0.7); -3.3415 - (15.7); -2.8957 - (1.4); -2.7370 - (1.2); -2.6916 - (16.0); -2.5302 - (0.8); -2.5167 - (12.7); -2.5124 - (24.5); -2.5079 - (31.5); -2.5033 - (23.3); -2.4990 - (11.6); -2.3988 - (6.3); -2.3762 - (0.6); -2.2936 - (0.9); -2.2661 - (8.9); -1.3615 - (0.8)$

10

I-045:  $^1\text{H-NMR}$  (400.2-MHz,  $-\text{d}_6\text{-DMSO}$ ): -

$\delta = 9.1580 - (1.3); -9.1361 - (1.3); -8.5438 - (5.7); -7.9527 - (1.1); -7.3378 - (3.6); -7.3164 - (1.7); -7.3112 - (1.2); -7.0803 - (2.1); -7.0607 - (2.3); -7.0437 - (1.5); -7.0416 - (1.6); -7.0237 - (0.9); -7.0213 - (1.0); -6.8821 - (0.8); -6.8786 - (0.9); -6.8620 - (1.4); -6.8587 - (1.4); -6.8421 - (0.7); -6.8385 - (0.6); -6.8092 - (0.8); -6.8060 - (0.7); -6.7896 - (1.3); -6.7730 - (0.7); -6.7699 - (0.6); -5.1035 - (0.7); -5.0899 - (0.6); -3.3355 - (16.4); -2.8907 - (8.3); -2.7316 - (7.2); -2.6850 - (1.8); -2.6709 - (1.4); -2.6608 - (16.0); -2.5249 - (0.6); -2.5201 - (0.9); -2.5115 - (10.8); -2.5070 - (21.6); -2.5024 - (28.1); -2.4978 - (20.2); -2.4933 - (9.6); -2.1114 - (0.5); -2.1031 - (0.6); -2.0904 - (1.0); -2.0775 - (0.6); -2.0695 - (0.5); -1.9232 - (0.5); -1.9118 - (0.5); -1.9055 - (0.5); -1.8946 - (0.8); -1.8836 - (1.0); -1.8703 - (0.6); -1.8573 - (0.6); -1.8525 - (0.6); -1.8397 - (0.5); -1.7485 - (0.3); -1.7279 - (0.6); -1.7110 - (0.8); -1.7004 - (0.7); -1.6902 - (0.8); -1.6657 - (0.5); -1.6622 - (0.5); -1.0356 - (0.7); -1.0253 - (2.0); -1.0196 - (2.0); -1.0146 - (1.0); -1.0098 - (1.0); -1.0041 - (2.0); -0.9985 - (2.0); -0.9888 - (0.8); -0.7763 - (0.9); -0.7664 - (2.0); -0.7617 - (2.1); -0.7536 - (2.0); -0.7484 - (1.9); -0.7379 - (0.7); -0.0002 - (2.5)$

20

30

40

50

I-046:  $^1\text{H-NMR}$  (400.2-MHz,  $-\text{d}_6\text{-DMSO}$ ): -

$\delta = 9.1907 - (1.3); -9.1697 - (1.3); -8.6146 - (6.1); -7.9520 - (1.2); -7.1627 - (0.6); -7.1590 - (0.7); -7.1413 - (1.4); -7.1243 - (0.8); -7.1204 - (0.9); -7.0914 - (1.3); -7.0730 - (1.5); -7.0368 - (0.7); -7.0184 - (1.6); -6.9987 - (0.9); -6.9965 - (1.0); -6.8279 - (1.0); -6.8253 - (1.1); -6.8068 - (1.8); -6.7926 - (2.8); -6.7746 - (5.3); -6.7548 - (3.8); -5.1574 - (0.4); -5.1414 - (0.8); -5.1220 - (0.8); -5.1063 - (0.4); -4.1843 - (1.6); -4.1714 - (2.6); -4.1575 - (1.6); -3.3381 - (26.5); -2.8901 - (8.5); -2.7307 - (7.3); -2.6578 - (16.0); -2.5243 - (0.5); -2.5193 - (0.8); -2.5107 - (9.9); -2.5064 - (19.8); -2.5019 - (26.0); -2.4973 - (19.2); -2.4930 - (9.4); -2.1229 - (0.5); -2.1145 - (0.6); -2.1020 - (1.0); -2.0892 - (0.6); -2.0807 - (0.7); -2.0665 - (0.8); -2.0525 - (0.6); -2.0454 - (0.4); -2.0298 - (0.6); -2.0166 - (0.6); -1.8845 - (0.4); -1.8793 - (0.5); -1.8678 - (0.6); -1.8622 - (0.5); -1.8479 - (0.5); -1.8311 - (0.5); -1.0510 - (0.7); -1.0403 - (2.0); -1.0348 - (2.2); -1.0302 - (1.0); -1.0247 - (1.0); -1.0191 - (2.0); -1.0137 - (2.1); -1.0037 - (0.8); -0.7868 - (0.9); -0.7766 - (2.2); -0.7715 - (2.4); -0.7638 - (2.2); -0.7587 - (2.3); -0.7477 - (0.7); -0.0002 - (1.8)$

10

20

I-047:  $^1\text{H-NMR}$  (400.2-MHz,  $-\text{d}_6\text{-DMSO}$ ): -

$\delta = 9.1133 - (0.7); -9.0975 - (1.4); -9.0815 - (0.7); -8.5253 - (6.7); -7.2935 - (2.1); -7.2832 - (1.5); -7.2735 - (2.5); -7.2630 - (2.7); -7.2426 - (1.3); -7.0892 - (2.5); -7.0002 - (1.3); -6.9801 - (1.2); -6.7367 - (1.3); -6.7335 - (1.3); -6.7168 - (1.2); -6.7120 - (1.3); -6.5609 - (1.3); -6.5554 - (3.1); -6.5505 - (3.9); -6.5309 - (1.5); -6.5254 - (1.0); -4.0206 - (1.2); -4.0032 - (4.3); -3.9857 - (4.2); -3.9679 - (2.6); -3.9513 - (1.5); -3.9286 - (0.8); -3.9127 - (0.7); -3.3403 - (20.7); -2.8952 - (1.9); -2.7363 - (1.6); -2.6678 - (16.0); -2.5298 - (0.7); -2.5164 - (13.2); -2.5121 - (24.8); -2.5076 - (31.3); -2.5031 - (22.6); -2.4987 - (11.0); -2.4081 - (6.4); -2.3763 - (0.4); -2.2930 - (0.5); -2.2650 - (9.1); -1.3612 - (1.0); -1.3234 - (4.1); -1.3060 - (8.7); -1.2886 - (4.0)$

30

40

50

I-048:  $^1\text{H-NMR}$  (400.1-MHz,  $-\text{CDCl}_3$ ): -

$\delta = 8.8901 - (0.7); -8.8626 - (0.7); -7.4931 - (0.9); -7.4893 - (1.0); -7.4781 - (1.0); -7.4734 - (1.6); -7.4690 - (1.2); -7.4578 - (1.1); -7.4539 - (1.1); -7.3199 - (1.8); -7.2974 - (3.3); -7.2920 - (2.3); -7.2807 - (2.0); -7.2778 - (2.1); -7.2696 - (2.1); -7.2600 - (6.8); -7.2421 - (1.1); -7.2383 - (1.1); -7.2250 - (1.2); -7.2215 - (2.0); -7.2179 - (1.4); -7.2048 - (1.4); -7.2009 - (1.3); -7.1532 - (2.9); -7.1069 - (1.4); -7.1030 - (1.4); -7.0864 - (3.5); -7.0827 - (3.3); -7.0660 - (2.3); -7.0625 - (1.9); -5.2974 - (7.3); -2.4628 - (0.4); -2.4509 - (0.8); -2.4422 - (0.9); -2.4304 - (1.6); -2.4184 - (1.1); -2.4098 - (1.2); -2.3978 - (0.7); -2.3615 - (16.0); -2.3564 - (15.5); -2.3121 - (0.7); -1.5703 - (0.6); -1.2552 - (0.7); -1.1653 - (0.8); -1.1542 - (2.3); -1.1473 - (2.7); -1.1337 - (2.5); -1.1269 - (2.5); -1.1169 - (1.1); -0.9457 - (1.0); -0.9356 - (2.8); -0.9290 - (2.8); -0.9240 - (2.8); -0.9173 - (3.0); -0.9063 - (0.9); -0.0078 - (0.4); -0.0002 - (8.5); -0.0081 - (0.7)$

10

I-049:  $^1\text{H-NMR}$  (400.2-MHz,  $-\text{d}_6\text{-DMSO}$ ): -

$\delta = 9.1573 - (0.6); -9.1416 - (1.2); -9.1255 - (0.6); -8.7596 - (6.8); -7.7260 - (3.0); -7.7043 - (3.1); -7.2758 - (2.0); -7.2558 - (2.3); -7.1320 - (3.0); -7.1106 - (2.9); -7.0797 - (2.3); -7.0037 - (1.2); -6.9836 - (1.1); -3.9735 - (0.6); -3.9575 - (0.6); -3.9350 - (1.5); -3.9188 - (1.4); -3.8962 - (0.7); -3.8802 - (0.7); -3.3422 - (16.4); -2.8952 - (1.2); -2.7363 - (1.1); -2.7185 - (16.0); -2.5300 - (0.8); -2.5252 - (1.2); -2.5167 - (12.4); -2.5122 - (24.0); -2.5076 - (30.9); -2.5030 - (22.4); -2.4986 - (10.7); -2.3791 - (6.0); -2.2611 - (8.5); -1.3608 - (1.1)$

20

I-050:  $^1\text{H-NMR}$  (400.1-MHz,  $-\text{CDCl}_3$ ): -

$\delta = 7.9058 - (0.8); -7.8916 - (1.5); -7.8783 - (0.9); -7.3890 - (3.4); -7.3692 - (3.8); -7.2592 - (14.9); -7.1366 - (0.8); -7.1312 - (1.0); -7.1181 - (1.7); -7.1124 - (2.8); -7.1041 - (1.7); -7.0936 - (3.3); -7.0747 - (7.3); -7.0628 - (4.8); -7.0572 - (4.9); -7.0440 - (2.7); -7.0243 - (2.3); -7.0017 - (0.6); -4.2065 - (1.7); -4.1908 - (1.7); -4.1698 - (3.7); -4.1542 - (3.6); -4.1331 - (1.9); -4.1175 - (1.8); -3.7101 - (0.4); -3.6945 - (0.4); -2.9444 - (0.5); -2.5030 - (12.2); -2.4980 - (8.2); -2.4830 - (2.7); -2.4759 - (1.5); -2.4683 - (1.6); -2.4642 - (1.5); -2.4505 - (1.0); -2.3448 - (2.0); -2.3220 - (16.0); -2.2941 - (13.7); -2.2892 - (14.7); -2.2448 - (0.4); -2.0031 - (6.2); -1.5531 - (3.6); -1.2551 - (0.6); -1.2427 - (0.3); -1.2390 - (0.3); -1.2206 - (1.8); -1.2144 - (5.5); -1.2043 - (6.1); -1.1931 - (12.9); -1.1643 - (0.6); -1.1572 - (0.7); -1.1527 - (0.6); -1.1456 - (0.6); -1.1401 - (0.6); -1.1351 - (0.5); -0.0074 - (0.8); -0.0002 - (19.4); -0.0498 - (0.3)$

30

40

I-051:  $^1\text{H-NMR}$  (400.1-MHz,  $-\text{CDCl}_3$ ): —

$\delta = 9.5546 - (1.0); -9.5276 - (1.1); -7.3215 - (2.8); -7.3089 - (0.7); -7.3022 - (3.4); -7.2590 - (28.7); -7.2089 - (0.4); -7.1774 - (0.9); -7.1730 - (1.0); -7.1596 - (1.8); -7.1536 - (2.1); -7.1442 - (1.4); -7.1364 - (1.5); -7.1227 - (1.0); -7.1066 - (2.3); -7.0928 - (7.6); -7.0871 - (1.9); -7.0746 - (3.4); -7.0640 - (4.6); -7.0566 - (3.8); -7.0359 - (2.2); -7.0069 - (2.9); -6.9951 - (0.5); -6.9798 - (2.6); -6.9399 - (2.8); -6.9128 - (2.5); -2.5606 - (0.6); -2.5477 - (1.0); -2.5411 - (1.4); -2.5352 - (0.9); -2.5282 - (2.5); -2.5198 - (1.0); -2.5158 - (1.1); -2.5088 - (1.4); -2.4956 - (0.7); -2.4728 - (0.3); -2.4290 - (10.9); -2.4219 - (11.3); -2.4010 - (0.8); -2.3779 - (0.5); -2.3696 - (0.6); -2.3499 - (16.0); -2.3058 - (12.4); -2.3005 - (13.4); -2.2552 - (0.6); -2.0040 - (1.3); -1.5465 - (10.4); -1.4973 - (0.3); -1.2941 - (0.5); -1.2772 - (2.2); -1.2705 - (5.5); -1.2662 - (4.7); -1.2577 - (8.1); -1.2558 - (8.5); -1.2492 - (3.2); -1.2406 - (3.3); -1.2357 - (4.9); -1.2286 - (2.8); -1.2128 - (1.0); -0.0498 - (0.4); -0.0080 - (1.1); -0.0002 - (36.8); -0.0085 - (1.8); -0.0504 - (0.4)$

10

I-052:  $^1\text{H-NMR}$  (400.2-MHz,  $-\text{d}_6\text{-DMSO}$ ): —

$\delta = 8.9010 - (0.6); -8.8870 - (1.1); -8.8726 - (0.6); -8.5488 - (5.7); -7.4020 - (3.6); -7.2192 - (4.0); -7.0507 - (0.6); -7.0479 - (0.7); -7.0280 - (1.5); -7.0104 - (0.9); -7.0077 - (0.9); -6.8208 - (0.7); -6.8172 - (0.9); -6.8004 - (1.4); -6.7968 - (2.2); -6.7767 - (2.0); -6.7596 - (0.7); -4.1439 - (1.7); -4.1278 - (3.9); -4.1118 - (1.8); -3.5661 - (0.9); -3.5505 - (2.6); -3.5354 - (2.5); -3.5195 - (0.8); -3.3371 - (16.4); -2.8907 - (1.6); -2.7311 - (1.3); -2.6605 - (16.0); -2.5252 - (0.5); -2.5205 - (0.8); -2.5119 - (9.8); -2.5074 - (19.3); -2.5029 - (25.0); -2.4983 - (18.2); -2.4938 - (8.7); -2.1012 - (0.5); -2.0929 - (0.5); -2.0803 - (1.0); -2.0676 - (0.6); -2.0593 - (0.5); -1.9259 - (12.3); -1.0331 - (0.7); -1.0222 - (2.0); -1.0167 - (2.1); -1.0122 - (1.0); -1.0065 - (1.1); -1.0011 - (2.0); -0.9956 - (2.0); -0.9855 - (0.8); -0.7731 - (0.9); -0.7628 - (2.2); -0.7576 - (2.3); -0.7501 - (2.2); -0.7448 - (2.3); -0.7337 - (0.7); -0.0002 - (1.7)$

20

30

40

50

I-053:  $^1\text{H-NMR}$  (400.2-MHz,  $-\text{d}_6\text{-DMSO}$ ): -

$\delta = 8.9648 - (1.3); -8.9428 - (1.3); -8.5890 - (6.2); -7.9516 - (1.0); -7.0323 - (0.7); -7.0140 - (3.1); -6.9945 - (3.0); -6.8904 - (2.4); -6.8769 - (1.5); -6.8570 - (1.1); -6.7885 - (2.4); -6.7694 - (3.7); -6.7502 - (2.1); -5.0448 - (0.6); -5.0301 - (0.6); -3.3364 - (28.0); -2.8898 - (7.4); -2.7304 - (6.5); -2.6759 - (1.1); -2.6605 - (1.5); -2.6516 - (16.0); -2.5240 - (0.6); -2.5192 - (0.9); -2.5105 - (10.7); -2.5061 - (21.4); -2.5016 - (28.2); -2.4970 - (20.7); -2.4926 - (10.2); -2.2199 - (10.2); -2.1298 - (0.5); -2.1215 - (0.6); -2.1089 - (1.0); -2.0961 - (0.6); -2.0879 - (0.6); -1.8776 - (0.7); -1.8671 - (0.9); -1.8488 - (1.0); -1.8377 - (1.0); -1.8251 - (0.4); -1.6964 - (0.4); -1.6845 - (1.0); -1.6699 - (1.0); -1.6621 - (0.9); -1.6457 - (0.6); -1.0539 - (0.6); -1.0439 - (1.9); -1.0383 - (2.0); -1.0329 - (0.9); -1.0289 - (1.0); -1.0228 - (1.9); -1.0171 - (1.9); -1.0078 - (0.7); -0.7879 - (0.9); -0.7783 - (1.8); -0.7744 - (2.1); -0.7654 - (1.9); -0.7502 - (0.7); -0.0002 - (2.1)$

10

I-054:  $^1\text{H-NMR}$  (400.2-MHz,  $-\text{d}_6\text{-DMSO}$ ): -

$\delta = 8.9685 - (0.6); -8.9542 - (1.2); -8.9398 - (0.6); -8.5780 - (5.8); -7.9538 - (0.4); -7.3239 - (0.4); -7.3150 - (4.8); -7.3095 - (1.4); -7.2981 - (1.5); -7.2925 - (5.4); -7.2836 - (0.5); -7.0076 - (0.6); -7.0048 - (0.7); -6.9873 - (1.5); -6.9848 - (1.5); -6.9674 - (0.9); -6.9646 - (1.0); -6.9455 - (0.5); -6.9366 - (5.0); -6.9310 - (1.4); -6.9197 - (1.4); -6.9141 - (4.5); -6.9052 - (0.4); -6.7946 - (0.7); -6.7909 - (0.9); -6.7743 - (1.4); -6.7709 - (1.5); -6.7542 - (1.4); -6.7507 - (1.4); -6.7343 - (1.3); -6.7178 - (0.7); -6.7145 - (0.6); -4.0174 - (1.6); -4.0030 - (3.6); -3.9889 - (1.8); -3.5807 - (0.9); -3.5665 - (2.6); -3.5521 - (2.4); -3.5377 - (0.8); -3.3379 - (11.6); -2.8910 - (2.9); -2.7324 - (2.4); -2.7317 - (2.4); -2.6660 - (16.0); -2.5262 - (0.4); -2.5214 - (0.7); -2.5127 - (8.8); -2.5083 - (17.6); -2.5037 - (22.9); -2.4991 - (16.5); -2.4945 - (7.9); -2.0693 - (0.5); -2.0609 - (0.5); -2.0483 - (1.0); -2.0355 - (0.6); -2.0272 - (0.5); -1.0208 - (0.7); -1.0099 - (2.1); -1.0044 - (2.1); -0.9998 - (1.0); -0.9942 - (1.1); -0.9888 - (2.1); -0.9833 - (2.1); -0.9731 - (0.8); -0.7545 - (0.9); -0.7442 - (2.2); -0.7390 - (2.3); -0.7314 - (2.2); -0.7262 - (2.3); -0.7150 - (0.7); -0.0002 - (2.0)$

20

30

40

50

I-055:  $^1\text{H-NMR}$  (400.2-MHz,  $-\text{d}_6\text{-DMSO}$ ): -

$\delta = 9.1089 - (1.3)$ ;  $-9.0870 - (1.3)$ ;  $-8.5719 - (6.1)$ ;  $-7.9526 - (1.6)$ ;  $-7.0772 - (0.6)$ ;  $-7.0747 - (0.7)$ ;  $-7.0547 - (1.5)$ ;  $-7.0369 - (0.9)$ ;  $-7.0346 - (1.0)$ ;  $-6.9501 - (2.1)$ ;  $-6.9213 - (1.1)$ ;  $-6.9162 - (0.9)$ ;  $-6.9007 - (1.2)$ ;  $-6.8955 - (1.1)$ ;  $-6.8894 - (0.8)$ ;  $-6.8857 - (0.9)$ ;  $-6.8691 - (1.3)$ ;  $-6.8658 - (1.4)$ ;  $-6.8491 - (0.7)$ ;  $-6.8456 - (0.6)$ ;  $-6.8219 - (0.7)$ ;  $-6.8186 - (0.7)$ ;  $-6.8022 - (1.3)$ ;  $-6.7857 - (0.7)$ ;  $-6.7824 - (0.6)$ ;  $-6.6245 - (3.0)$ ;  $-6.6040 - (2.6)$ ;  $-5.2281 - (0.3)$ ;  $-5.2062 - (0.4)$ ;  $-5.1998 - (0.5)$ ;  $-5.1899 - (0.5)$ ;  $-5.1837 - (0.4)$ ;  $-3.3355 - (21.4)$ ;  $-2.8904 - (11.4)$ ;  $-2.7314 - (9.3)$ ;  $-2.7307 - (9.5)$ ;  $-2.6666 - (16.0)$ ;  $-2.5246 - (0.7)$ ;  $-2.5199 - (1.0)$ ;  $-2.5112 - (12.1)$ ;  $-2.5067 - (24.1)$ ;  $-2.5021 - (31.4)$ ;  $-2.4975 - (22.7)$ ;  $-2.4930 - (10.8)$ ;  $-2.1161 - (0.5)$ ;  $-2.1078 - (0.5)$ ;  $-2.0951 - (1.0)$ ;  $-2.0823 - (0.6)$ ;  $-2.0742 - (0.5)$ ;  $-2.0290 - (1.1)$ ;  $-2.0184 - (10.6)$ ;  $-1.9965 - (1.2)$ ;  $-1.9809 - (1.0)$ ;  $-1.8159 - (0.8)$ ;  $-1.7856 - (1.1)$ ;  $-1.7541 - (0.6)$ ;  $-1.3623 - (9.6)$ ;  $-1.2393 - (9.3)$ ;  $-1.0448 - (0.7)$ ;  $-1.0339 - (2.0)$ ;  $-1.0284 - (2.1)$ ;  $-1.0238 - (1.0)$ ;  $-1.0183 - (1.1)$ ;  $-1.0128 - (2.0)$ ;  $-1.0073 - (2.0)$ ;  $-0.9973 - (0.8)$ ;  $-0.7818 - (0.9)$ ;  $-0.7715 - (2.2)$ ;  $-0.7664 - (2.2)$ ;  $-0.7588 - (2.1)$ ;  $-0.7535 - (2.2)$ ;  $-0.7426 - (0.7)$ ;  $-0.0002 - (2.2)$

10

20

I-056:  $^1\text{H-NMR}$  (400.2-MHz,  $-\text{d}_6\text{-DMSO}$ ): -

$\delta = 9.1353 - (0.5)$ ;  $-9.1194 - (1.1)$ ;  $-9.1039 - (0.5)$ ;  $-8.5455 - (5.7)$ ;  $-8.3245 - (2.3)$ ;  $-7.4001 - (1.1)$ ;  $-7.3804 - (2.2)$ ;  $-7.3606 - (1.5)$ ;  $-7.2891 - (1.7)$ ;  $-7.2691 - (2.0)$ ;  $-7.2198 - (1.4)$ ;  $-7.2006 - (1.2)$ ;  $-7.0864 - (2.1)$ ;  $-7.0472 - (1.5)$ ;  $-7.0423 - (2.0)$ ;  $-7.0377 - (1.4)$ ;  $-6.9915 - (1.1)$ ;  $-6.9721 - (1.0)$ ;  $-6.9067 - (1.0)$ ;  $-6.9026 - (1.0)$ ;  $-6.8880 - (1.0)$ ;  $-6.8818 - (1.0)$ ;  $-4.9289 - (2.6)$ ;  $-4.9140 - (3.0)$ ;  $-4.9080 - (2.9)$ ;  $-4.8932 - (3.0)$ ;  $-4.6018 - (2.8)$ ;  $-4.5853 - (3.8)$ ;  $-4.5701 - (2.7)$ ;  $-4.2587 - (0.7)$ ;  $-4.2414 - (1.0)$ ;  $-4.2221 - (0.6)$ ;  $-3.9934 - (0.6)$ ;  $-3.9775 - (0.6)$ ;  $-3.9553 - (1.3)$ ;  $-3.9391 - (1.2)$ ;  $-3.9167 - (0.7)$ ;  $-3.9003 - (0.6)$ ;  $-3.3387 - (231.2)$ ;  $-3.0436 - (1.2)$ ;  $-2.8959 - (1.4)$ ;  $-2.7365 - (1.2)$ ;  $-2.6751 - (16.0)$ ;  $-2.6320 - (0.3)$ ;  $-2.5703 - (0.4)$ ;  $-2.5298 - (10.3)$ ;  $-2.5164 - (175.8)$ ;  $-2.5120 - (333.5)$ ;  $-2.5074 - (423.7)$ ;  $-2.5029 - (308.4)$ ;  $-2.4985 - (149.8)$ ;  $-2.4000 - (5.5)$ ;  $-2.3433 - (1.0)$ ;  $-2.3388 - (1.9)$ ;  $-2.3343 - (2.6)$ ;  $-2.3297 - (1.8)$ ;  $-2.2577 - (7.6)$ ;  $-2.1884 - (0.8)$ ;  $-1.3600 - (5.9)$ ;  $-1.2409 - (0.4)$ ;  $-1.1993 - (0.4)$ ;  $-1.1859 - (0.4)$

30

40

50

I-057:  $^1\text{H-NMR}$  (400.2-MHz,  $-\text{d}_6\text{-DMSO}$ ): -

$\delta = 9.5362 - (1.4); -9.5140 - (1.5); -8.6512 - (6.2); -7.9523 - (2.2); -7.8196 - (1.4); -7.8118 - (1.0); -7.8083 - (1.1); -7.8026 - (0.8); -7.7964 - (1.6); -7.5757 - (0.3); -7.5636 - (2.8); -7.5575 - (1.5); -7.5531 - (1.9); -7.5468 - (1.7); -7.5404 - (2.8); -7.5283 - (0.4); -7.3086 - (1.2); -7.3013 - (0.6); -7.2973 - (1.1); -7.2937 - (1.0); -7.2858 - (1.0); -7.0535 - (0.7); -7.0512 - (0.7); -7.0333 - (1.6); -7.0129 - (1.0); -6.8015 - (2.2); -6.7815 - (3.1); -6.7646 - (1.0); -6.7617 - (1.1); -5.4530 - (0.4); -5.4328 - (0.8); -5.4193 - (0.7); -5.4125 - (0.5); -5.3981 - (0.4); -3.6957 - (0.8); -3.6868 - (0.7); -3.6636 - (1.1); -3.6475 - (0.8); -3.6386 - (0.8); -3.3409 - (12.5); -3.3390 - (12.8); -3.3358 - (14.3); -2.8902 - (14.6); -2.7310 - (13.1); -2.6706 - (16.0); -2.5241 - (0.6); -2.5105 - (11.5); -2.5062 - (22.3); -2.5018 - (28.6); -2.4972 - (20.8); -2.4931 - (10.1); -2.4472 - (0.5); -2.4339 - (0.6); -2.4249 - (0.9); -2.4174 - (0.9); -2.4040 - (0.8); -2.3932 - (0.7); -2.3801 - (0.4); -2.3719 - (0.4); -2.1248 - (0.5); -2.1166 - (0.6); -2.1040 - (1.0); -2.0911 - (0.6); -2.0830 - (0.6); -1.0537 - (0.5); -1.0426 - (2.0); -1.0372 - (2.2); -1.0299 - (0.9); -1.0264 - (0.8); -1.0215 - (2.0); -1.0161 - (2.2); -1.0060 - (0.6); -0.7905 - (0.8); -0.7808 - (2.0); -0.7764 - (2.2); -0.7679 - (2.1); -0.7631 - (1.9); -0.7524 - (0.7); -0.0002 - (2.1)$

I-058:  $^1\text{H-NMR}$  (400.2-MHz,  $-\text{d}_6\text{-DMSO}$ ): -

$\delta = 9.1278 - (0.6); -9.1124 - (1.2); -9.0967 - (0.6); -8.5239 - (6.2); -7.4081 - (1.9); -7.4029 - (0.7); -7.3895 - (3.0); -7.3867 - (2.9); -7.3810 - (0.5); -7.3728 - (1.0); -7.3680 - (2.5); -7.3619 - (0.3); -7.2966 - (2.0); -7.2767 - (2.2); -7.1807 - (1.2); -7.1622 - (2.0); -7.1438 - (0.9); -7.0874 - (2.2); -7.0157 - (2.9); -7.0131 - (3.7); -7.0077 - (2.0); -6.9964 - (2.0); -6.9938 - (3.3); -6.9917 - (3.0); -6.9852 - (1.4); -3.9973 - (0.6); -3.9813 - (0.6); -3.9587 - (1.5); -3.9427 - (1.4); -3.9201 - (0.8); -3.9042 - (0.7); -3.3414 - (14.1); -2.8952 - (1.7); -2.7361 - (1.5); -2.6713 - (16.0); -2.5300 - (0.6); -2.5166 - (11.2); -2.5122 - (21.4); -2.5076 - (27.4); -2.5031 - (20.1); -2.4987 - (9.8); -2.4056 - (6.0); -2.2628 - (8.4); -1.3613 - (1.5)$

10

20

30

40

50



I-059:  $^1\text{H-NMR}$  (400.2-MHz,  $-\text{d}_6\text{-DMSO}$ ): -

$\delta = 9.1142 - (0.6)$ ;  $-9.0986 - (1.4)$ ;  $-9.0829 - (0.6)$ ;  $-8.5338 - (6.9)$ ;  $-7.2911 - (2.6)$ ;  $-7.2700 - (3.7)$ ;  $-7.2492 - (1.5)$ ;  $-7.0889 - (2.4)$ ;  $-7.0019 - (1.3)$ ;  $-6.9821 - (1.1)$ ;  $-6.7573 - (1.3)$ ;  $-6.7531 - (1.3)$ ;  $-6.7373 - (1.2)$ ;  $-6.7321 - (1.2)$ ;  $-6.5846 - (1.4)$ ;  $-6.5790 - (3.0)$ ;  $-6.5730 - (2.5)$ ;  $-6.5497 - (1.4)$ ;  $-6.5448 - (1.1)$ ;  $-4.0755 - (2.2)$ ;  $-4.0677 - (2.1)$ ;  $-4.0644 - (2.6)$ ;  $-4.0602 - (2.0)$ ;  $-4.0529 - (2.4)$ ;  $-4.0042 - (0.7)$ ;  $-3.9882 - (0.7)$ ;  $-3.9657 - (1.5)$ ;  $-3.9497 - (1.4)$ ;  $-3.9272 - (0.8)$ ;  $-3.9112 - (0.7)$ ;  $-3.6446 - (2.6)$ ;  $-3.6374 - (2.2)$ ;  $-3.6333 - (2.7)$ ;  $-3.6299 - (2.1)$ ;  $-3.6221 - (2.2)$ ;  $-3.3408 - (22.4)$ ;  $-3.2903 - (21.8)$ ;  $-2.8955 - (1.5)$ ;  $-2.7366 - (1.3)$ ;  $-2.6698 - (16.0)$ ;  $-2.5300 - (0.8)$ ;  $-2.5166 - (15.2)$ ;  $-2.5122 - (28.8)$ ;  $-2.5077 - (36.6)$ ;  $-2.5031 - (26.5)$ ;  $-2.4988 - (12.8)$ ;  $-2.4075 - (6.3)$ ;  $-2.2651 - (9.0)$ ;  $-1.3611 - (2.1)$

10

I-060:  $^1\text{H-NMR}$  (500.1-MHz,  $-\text{d}_6\text{-DMSO}$ ): -

$\delta = 9.0563 - (1.1)$ ;  $-9.0389 - (1.1)$ ;  $-8.5449 - (4.4)$ ;  $-7.0491 - (0.5)$ ;  $-7.0473 - (0.6)$ ;  $-7.0321 - (2.6)$ ;  $-7.0153 - (2.4)$ ;  $-6.8310 - (0.5)$ ;  $-6.8283 - (0.7)$ ;  $-6.8149 - (1.0)$ ;  $-6.8123 - (1.2)$ ;  $-6.8052 - (0.7)$ ;  $-6.8025 - (0.7)$ ;  $-6.7991 - (0.7)$ ;  $-6.7961 - (0.8)$ ;  $-6.7895 - (1.1)$ ;  $-6.7842 - (1.2)$ ;  $-6.7783 - (1.5)$ ;  $-6.7673 - (0.9)$ ;  $-6.7619 - (1.1)$ ;  $-6.7299 - (1.9)$ ;  $-6.7247 - (1.5)$ ;  $-4.9910 - (0.6)$ ;  $-4.9800 - (0.7)$ ;  $-4.9739 - (0.7)$ ;  $-4.9628 - (0.6)$ ;  $-3.6110 - (15.5)$ ;  $-3.4405 - (0.4)$ ;  $-3.4353 - (0.5)$ ;  $-3.4294 - (0.6)$ ;  $-3.4252 - (0.9)$ ;  $-3.4208 - (0.6)$ ;  $-3.4149 - (0.5)$ ;  $-3.4096 - (0.4)$ ;  $-3.3153 - (9.6)$ ;  $-3.3026 - (0.3)$ ;  $-3.2927 - (16.0)$ ;  $-2.8964 - (2.4)$ ;  $-2.7377 - (2.1)$ ;  $-2.7370 - (2.1)$ ;  $-2.7158 - (0.4)$ ;  $-2.7046 - (0.4)$ ;  $-2.6995 - (0.5)$ ;  $-2.6885 - (0.4)$ ;  $-2.6541 - (13.1)$ ;  $-2.6465 - (0.7)$ ;  $-2.6334 - (0.7)$ ;  $-2.6209 - (0.4)$ ;  $-2.6000 - (0.4)$ ;  $-2.5138 - (1.7)$ ;  $-2.5102 - (3.5)$ ;  $-2.5065 - (4.8)$ ;  $-2.5029 - (3.5)$ ;  $-2.4993 - (1.6)$ ;  $-2.1130 - (0.4)$ ;  $-2.1064 - (0.4)$ ;  $-2.0962 - (0.8)$ ;  $-2.0859 - (0.5)$ ;  $-2.0791 - (0.5)$ ;  $-2.0098 - (0.4)$ ;  $-1.9990 - (0.4)$ ;  $-1.9936 - (0.4)$ ;  $-1.9884 - (0.3)$ ;  $-1.9830 - (0.4)$ ;  $-1.7981 - (0.4)$ ;  $-1.7854 - (0.5)$ ;  $-1.7718 - (0.5)$ ;  $-1.0459 - (0.6)$ ;  $-1.0373 - (1.7)$ ;  $-1.0329 - (1.7)$ ;  $-1.0291 - (0.9)$ ;  $-1.0246 - (0.9)$ ;  $-1.0204 - (1.7)$ ;  $-1.0160 - (1.7)$ ;  $-1.0078 - (0.7)$ ;  $-0.7855 - (0.7)$ ;  $-0.7772 - (1.8)$ ;  $-0.7750 - (1.5)$ ;  $-0.7731 - (1.9)$ ;  $-0.7670 - (1.8)$ ;  $-0.7628 - (1.9)$ ;  $-0.7540 - (0.6)$

20

30

40

50

I-061:  $^1\text{H-NMR}$  (400.1-MHz,  $-\text{CDCl}_3$ ):  $-\$

$\delta = 8.9244 - (0.5); -8.8974 - (0.6); -7.3280 - (1.3); -7.3117 - (1.4); -7.3052 - (1.5); -7.3004 - (1.5); -7.2914 - (2.7); -7.2781 - (2.0); -7.2709 - (1.7); -7.2601 - (4.5); -7.1242 - (2.4); -7.0340 - (1.3); -7.0147 - (1.2); -6.8192 - (1.2); -6.8133 - (1.3); -6.7982 - (1.1); -6.7924 - (1.2); -6.6977 - (1.1); -6.6923 - (1.5); -6.6776 - (0.8); -6.6723 - (1.6); -6.6656 - (1.9); -6.6599 - (2.6); -6.6545 - (1.2); -5.2959 - (3.3); -3.7848 - (16.0); -2.4502 - (0.6); -2.4412 - (0.7); -2.4297 - (1.2); -2.4181 - (0.8); -2.4093 - (0.7); -2.3971 - (0.6); -2.3504 - (6.7); -2.3423 - (11.3); -1.5837 - (0.6); -1.1482 - (0.6); -1.1372 - (1.7); -1.1300 - (2.1); -1.1168 - (1.8); -1.1098 - (1.9); -1.1000 - (0.8); -0.9674 - (0.8); -0.9571 - (2.2); -0.9508 - (2.0); -0.9458 - (2.1); -0.9391 - (2.2); -0.9278 - (0.6);  $-0.0002 - (4.0)$$

10

I-062:  $^1\text{H-NMR}$  (400.1-MHz,  $-\text{CDCl}_3$ ):  $-\$

$\delta = 7.8819 - (0.8); -7.8678 - (1.4); -7.8524 - (0.9); -7.4069 - (1.5); -7.4026 - (2.4); -7.4001 - (2.3); -7.3830 - (9.1); -7.3812 - (8.0); -7.3767 - (5.4); -7.3722 - (3.1); -7.3649 - (4.7); -7.3350 - (0.4); -7.3058 - (2.5); -7.2854 - (4.9); -7.2652 - (3.1); -7.2594 - (18.9); -7.2365 - (0.4); -7.2096 - (0.4); -7.1780 - (2.5); -7.1756 - (2.6); -7.1723 - (2.6); -7.1699 - (2.5); -7.1576 - (1.9); -7.1548 - (2.0); -7.1522 - (2.0); -7.1494 - (1.8); -7.1423 - (0.5); -7.0694 - (4.4); -7.0535 - (2.6); -7.0345 - (2.1); -7.0154 - (0.8); -6.9733 - (0.4); -4.1909 - (1.8); -4.1752 - (1.8); -4.1542 - (3.9); -4.1384 - (3.8); -4.1173 - (2.1); -4.1016 - (2.0); -3.6978 - (0.6); -3.6821 - (0.6); -2.9531 - (0.4); -2.9354 - (0.8); -2.9177 - (0.4); -2.5275 - (0.6); -2.5145 - (1.4); -2.5001 - (11.7); -2.4950 - (9.0); -2.4823 - (1.8); -2.4752 - (1.7); -2.4626 - (1.1); -2.4531 - (0.7); -2.4454 - (0.6); -2.4331 - (0.3); -2.3824 - (0.4); -2.3418 - (3.5); -2.3317 - (16.0); -2.3006 - (3.0); -2.2831 - (0.6); -2.0034 - (8.4); -1.5517 - (8.4); -1.2582 - (0.8); -1.2430 - (2.2); -1.2363 - (4.2); -1.2304 - (2.7); -1.2225 - (2.4); -1.2153 - (6.8); -1.2106 - (5.8); -1.2016 - (5.2); -1.1970 - (5.8); -1.1901 - (3.0); -1.1784 - (1.1); -1.1736 - (0.9); -1.1581 - (0.5); -1.1489 - (0.6); -1.1408 - (0.8); -1.1362 - (0.7); -1.1292 - (0.7); -1.1225 - (0.6); -0.0078 - (0.7);  $-0.0002 - (24.7); -0.0084 - (1.3); -0.0140 - (0.4); -0.0499 - (0.4)$$

20

30

40

50

I-063:  $^1\text{H-NMR}$  (400.1-MHz,  $-\text{CDCl}_3$ ): —

$\delta = 9.5232 - (1.0); -9.4980 - (1.1); -7.4312 - (2.0); -7.4265 - (4.4); -7.4213 - (5.6); -7.4013 - (2.6); -7.3986 - (3.0); -7.3245 - (2.8); -7.3178 - (3.1); -7.3041 - (5.1); -7.2985 - (3.9); -7.2845 - (2.8); -7.2591 - (20.8); -7.2177 - (2.3); -7.2150 - (2.5); -7.2124 - (2.5); -7.2097 - (2.6); -7.1972 - (1.7); -7.1951 - (1.7); -7.1917 - (1.7); -7.1335 - (0.3); -7.0655 - (4.3); -7.0362 - (2.0); -6.9831 - (2.5); -6.9560 - (2.3); -6.9162 - (2.4); -6.8891 - (2.2); -2.5725 - (0.6); -2.5579 - (1.1); -2.5546 - (1.2); -2.5468 - (0.9); -2.5400 - (2.4); -2.5339 - (1.2); -2.5225 - (1.4); -2.5075 - (0.8); -2.4697 - (0.4); -2.4276 - (10.8); -2.4205 - (11.2); -2.3997 - (0.8); -2.3817 - (0.9); -2.3505 - (15.9); -2.3013 - (0.6); -2.0041 - (1.0); -1.5458 - (10.4); -1.4954 - (0.3); -1.3264 - (0.4); -1.3044 - (0.4); -1.2770 - (16.0); -1.2645 - (6.3); -1.2571 - (6.6); -1.2312 - (0.6); -1.2270 - (0.7); -1.2125 - (0.5); -1.1921 - (0.4); -0.0496 - (0.6); -0.0078 - (1.0); -0.0002 - (26.2); -0.0077 - (1.6); -0.0500 - (0.6)$

10

I-064:  $^1\text{H-NMR}$  (400.2-MHz,  $-\text{d}_6\text{-DMSO}$ ): —

$\delta = 8.9207 - (0.6); -8.9064 - (1.1); -8.8921 - (0.6); -8.5780 - (5.5); -7.3270 - (2.0); -7.3239 - (2.0); -7.3144 - (2.2); -7.3113 - (2.1); -7.0387 - (0.7); -7.0357 - (0.7); -7.0162 - (1.5); -6.9984 - (0.9); -6.9956 - (0.9); -6.9304 - (1.5); -6.9219 - (2.4); -6.9178 - (1.4); -6.9092 - (2.4); -6.8940 - (2.0); -6.8917 - (2.1); -6.8859 - (1.2); -6.8832 - (1.1); -6.7889 - (1.1); -6.7817 - (1.1); -6.7689 - (2.1); -6.7650 - (1.5); -6.7482 - (1.2); -3.4511 - (0.9); -3.4334 - (1.8); -3.4182 - (1.8); -3.3994 - (1.0); -3.3388 - (15.5); -2.9651 - (1.8); -2.9467 - (2.8); -2.9282 - (1.5); -2.8905 - (0.5); -2.7318 - (0.4); -2.6689 - (16.0); -2.5253 - (0.5); -2.5205 - (0.8); -2.5119 - (9.2); -2.5075 - (18.1); -2.5029 - (23.3); -2.4983 - (16.7); -2.4938 - (7.9); -2.1015 - (0.5); -2.0932 - (0.5); -2.0805 - (1.0); -2.0677 - (0.6); -2.0595 - (0.5); -1.0320 - (0.8); -1.0211 - (2.1); -1.0156 - (2.2); -1.0110 - (1.0); -1.0054 - (1.1); -1.0000 - (2.1); -0.9945 - (2.1); -0.9843 - (0.8); -0.7709 - (0.9); -0.7606 - (2.3); -0.7555 - (2.3); -0.7479 - (2.2); -0.7427 - (2.3); -0.7315 - (0.7); -0.0002 - (1.6)$

20

30

40

50

I-065:  $^1\text{H-NMR}$  (400.2-MHz,  $-\text{d}_6\text{-DMSO}$ ): -

$\delta = 9.0564 - (1.4); -9.0345 - (1.4); -9.0230 - (0.4); -9.0006 - (0.3); -8.6045 - (6.2); -8.5913 - (1.5); -7.9521 - (1.5); -7.2309 - (0.5); -7.2194 - (0.7); -7.1991 - (2.8); -7.1813 - (1.5); -7.1778 - (1.5); -7.1623 - (0.5); -7.1585 - (0.5); -7.1205 - (1.0); -7.1025 - (2.4); -7.0818 - (1.2); -7.0775 - (1.4); -7.0616 - (1.4); -7.0418 - (1.2); -7.0197 - (1.8); -6.9991 - (1.1); -6.7999 - (1.3); -6.7943 - (1.6); -6.7791 - (3.0); -6.7592 - (2.0); -5.0680 - (0.5); -5.0498 - (0.9); -5.0302 - (0.8); -5.0122 - (0.3); -3.3367 - (15.2); -3.3336 - (17.0); -2.8900 - (9.8); -2.8747 - (0.5); -2.8628 - (0.8); -2.8466 - (0.8); -2.8314 - (0.4); -2.7311 - (8.7); -2.6622 - (16.0); -2.6516 - (4.1); -2.5236 - (0.8); -2.5059 - (28.9); -2.5015 - (37.2); -2.4970 - (27.4); -2.1281 - (0.7); -2.1197 - (0.8); -2.1073 - (1.3); -2.0945 - (0.8); -2.0862 - (0.7); -2.0732 - (0.4); -1.8860 - (0.3); -1.8673 - (0.6); -1.8540 - (0.6); -1.8407 - (0.6); -1.8168 - (1.2); -1.8088 - (1.0); -1.7986 - (1.5); -1.7876 - (1.4); -1.7702 - (0.8); -1.6374 - (0.4); -1.6253 - (0.6); -1.6100 - (0.6); -1.5994 - (0.5); -1.5927 - (0.5); -1.5861 - (0.4); -1.2700 - (6.4); -1.2524 - (6.4); -1.2387 - (1.6); -1.2213 - (1.4); -1.0514 - (0.8); -1.0406 - (2.5); -1.0353 - (2.7); -1.0250 - (1.3); -1.0195 - (2.5); -1.0142 - (2.6); -1.0042 - (0.9); -0.7880 - (1.1); -0.7778 - (2.9); -0.7730 - (3.0); -0.7650 - (2.9); -0.7601 - (3.0); -0.7490 - (0.9); -0.0002 - (2.8)$

10

20

I-066:  $^1\text{H-NMR}$  (400.2-MHz,  $-\text{d}_6\text{-DMSO}$ ): -

$\delta = 8.4669 - (5.6); -7.2833 - (0.7); -7.2793 - (0.4); -7.2664 - (1.8); -7.2613 - (1.8); -7.2486 - (4.1); -7.2356 - (5.8); -7.2227 - (1.5); -7.2191 - (2.0); -7.2134 - (2.0); -7.2030 - (0.4); -7.1968 - (0.4); -7.0959 - (0.6); -7.0930 - (0.7); -7.0732 - (1.5); -7.0557 - (0.9); -7.0530 - (1.0); -6.8931 - (0.7); -6.8896 - (0.9); -6.8730 - (1.3); -6.8698 - (1.4); -6.8531 - (0.7); -6.8495 - (0.7); -6.8428 - (0.8); -6.8396 - (0.8); -6.8230 - (1.3); -6.8065 - (0.7); -6.8032 - (0.6); -3.9383 - (1.3); -3.9198 - (1.9); -3.9004 - (1.4); -3.3334 - (37.5); -2.8905 - (0.8); -2.8533 - (1.4); -2.8342 - (1.9); -2.8155 - (1.3); -2.7315 - (0.7); -2.6760 - (0.3); -2.6715 - (0.4); -2.6670 - (0.3); -2.6607 - (0.4); -2.6183 - (16.0); -2.5249 - (1.6); -2.5116 - (25.0); -2.5071 - (49.8); -2.5025 - (66.4); -2.4980 - (47.7); -2.4934 - (22.8); -2.4834 - (3.5); -2.4655 - (1.0); -2.3294 - (0.4); -2.0880 - (0.5); -2.0797 - (0.6); -2.0671 - (1.0); -2.0542 - (0.6); -2.0459 - (0.5); -1.0187 - (0.8); -1.0077 - (2.1); -1.0022 - (2.2); -0.9977 - (1.1); -0.9919 - (1.1); -0.9866 - (2.1); -0.9811 - (2.1); -0.9709 - (0.8); -0.8493 - (3.1); -0.8316 - (6.9); -0.8138 - (3.0); -0.7616 - (0.9); -0.7513 - (2.3); -0.7461 - (2.3); -0.7385 - (2.2); -0.7333 - (2.3); -0.7222 - (0.7); -0.0002 - (5.9)$

30

40

50

I-067:  $^1\text{H-NMR}$  (400.2-MHz,  $-\text{d}_6\text{-DMSO}$ ): -

$\delta = 8.4538 - (4.0); -7.1464 - (2.6); -7.1414 - (0.8); -7.1297 - (1.0); -7.1248 - (2.9); -7.1003 - (0.5); -7.0977 - (0.5); -7.0802 - (1.0); -7.0776 - (1.1); -7.0601 - (0.6); -7.0575 - (0.7); -6.8978 - (0.5); -6.8939 - (0.6); -6.8775 - (0.9); -6.8742 - (1.0); -6.8577 - (0.5); -6.8538 - (0.6); -6.8506 - (0.6); -6.8471 - (0.5); -6.8305 - (0.9); -6.8105 - (0.7); -6.8032 - (3.3); -6.7981 - (1.0); -6.7866 - (0.9); -6.7816 - (2.9); -3.9012 - (0.9); -3.8830 - (1.4); -3.8640 - (1.0); -3.6929 - (16.0); -3.3294 - (100.6); -2.8903 - (1.6); -2.7980 - (0.9); -2.7792 - (1.4); -2.7608 - (0.9); -2.7312 - (1.3); -2.7300 - (1.3); -2.6800 - (0.4); -2.6754 - (0.9); -2.6708 - (1.2); -2.6662 - (0.9); -2.6622 - (0.6); -2.6585 - (0.4); -2.6129 - (12.0); -2.5243 - (4.2); -2.5196 - (6.2); -2.5109 - (69.9); -2.5064 - (139.8); -2.5018 - (182.8); -2.4972 - (131.6); -2.4926 - (61.9); -2.3379 - (0.4); -2.3332 - (0.8); -2.3286 - (1.1); -2.3241 - (0.8); -2.3194 - (0.3); -2.1146 - (12.3); -2.0953 - (0.4); -2.0869 - (0.4); -2.0743 - (0.7); -2.0616 - (0.4); -2.0532 - (0.4); -1.2360 - (0.8); -1.0238 - (0.6); -1.0129 - (1.5); -1.0073 - (1.5); -1.0028 - (0.8); -0.9971 - (0.8); -0.9918 - (1.5); -0.9862 - (1.5); -0.9760 - (0.6); -0.8539 - (0.4); -0.7674 - (0.7); -0.7572 - (1.6); -0.7519 - (1.6); -0.7444 - (1.6); -0.7391 - (1.7); -0.7280 - (0.5); -0.0080 - (0.7); --0.0002 - (23.9); --0.0085 - (0.7)$

10

20

I-068:  $^1\text{H-NMR}$  (400.1-MHz,  $-\text{CDCl}_3$ ): -

$\delta = 8.6363 - (6.4); -8.5292 - (0.6); -8.4832 - (2.4); -8.4772 - (2.4); -8.2450 - (1.1); -8.0172 - (1.0); -7.3806 - (2.6); -7.3443 - (2.1); -7.3247 - (2.4); -7.2622 - (8.8); -7.0747 - (0.4); -7.0342 - (3.4); -7.0068 - (1.5); -4.1028 - (0.3); -4.0869 - (0.4); -4.0686 - (1.2); -4.0527 - (1.2); -4.0312 - (2.2); -4.0153 - (2.2); -3.9935 - (1.2); -3.9778 - (1.2); -2.9572 - (6.4); -2.8847 - (6.0); -2.8481 - (16.0); -2.6735 - (2.2); -2.5006 - (1.1); -2.4390 - (7.9); -2.3412 - (1.6); -2.3211 - (10.9); -1.6036 - (4.5); -1.2551 - (0.4); -0.0701 - (3.2); --0.0002 - (10.2)$

30

40

50

I-069:  $^1\text{H-NMR}$  (400.2-MHz,  $-\text{d}_6\text{-DMSO}$ ): -

$\delta = 9.0788 - (1.3); -9.0568 - (1.3); -8.6115 - (6.0); -7.9523 - (1.2); -7.3209 - (2.1); -7.3159 - (2.3); -7.2362 - (1.2); -7.2309 - (1.0); -7.2155 - (1.4); -7.2101 - (1.3); -7.0473 - (2.1); -7.0383 - (0.7); -7.0352 - (0.7); -7.0262 - (1.8); -7.0181 - (1.5); -7.0152 - (1.5); -6.9979 - (0.9); -6.9951 - (0.9); -6.7884 - (1.3); -6.7861 - (1.4); -6.7720 - (1.5); -6.7662 - (2.2); -6.7555 - (0.6); -6.7521 - (0.8); -6.7461 - (0.9); -6.7427 - (0.5); -5.0418 - (0.6); -5.0265 - (0.6); -3.3354 - (14.8); -2.8904 - (8.6); -2.7317 - (8.0); -2.7305 - (8.1); -2.7151 - (1.2); -2.6709 - (0.6); -2.6592 - (16.0); -2.5247 - (0.6); -2.5200 - (0.9); -2.5113 - (10.3); -2.5068 - (20.7); -2.5022 - (27.2); -2.4976 - (19.7); -2.4930 - (9.4); -2.1271 - (0.5); -2.1187 - (0.5); -2.1061 - (1.0); -2.0933 - (0.6); -2.0851 - (0.5); -1.8890 - (0.5); -1.8779 - (0.7); -1.8651 - (0.8); -1.8503 - (0.8); -1.8378 - (0.7); -1.7172 - (0.4); -1.7030 - (0.9); -1.6875 - (1.0); -1.6791 - (0.8); -1.6608 - (0.6); -1.0546 - (0.7); -1.0448 - (1.7); -1.0393 - (1.8); -1.0334 - (1.0); -1.0299 - (1.0); -1.0237 - (1.7); -1.0181 - (1.8); -1.0088 - (0.8); -0.7881 - (0.9); -0.7786 - (1.6); -0.7748 - (1.9); -0.7655 - (1.8); -0.7596 - (1.4); -0.7511 - (0.6); -0.0002 - (2.5)$

10

I-070:  $^1\text{H-NMR}$  (400.2-MHz,  $-\text{d}_6\text{-DMSO}$ ): -

$\delta = 9.2187 - (0.7); -9.2028 - (1.5); -9.1867 - (0.7); -8.5077 - (5.5); -7.9536 - (0.3); -7.1720 - (7.5); -7.0596 - (0.8); -7.0574 - (0.8); -7.0390 - (1.7); -7.0194 - (1.1); -6.8345 - (1.0); -6.8145 - (1.9); -6.7937 - (1.9); -6.7736 - (0.8); -4.0918 - (0.8); -4.0761 - (0.8); -4.0564 - (1.7); -4.0403 - (1.6); -4.0208 - (0.9); -4.0048 - (0.8); -3.3392 - (30.4); -2.8915 - (2.0); -2.7324 - (1.8); -2.6635 - (16.0); -2.5256 - (1.1); -2.5120 - (15.6); -2.5080 - (28.8); -2.5035 - (36.5); -2.4990 - (27.0); -2.0968 - (0.6); -2.0885 - (0.7); -2.0758 - (1.1); -2.0632 - (0.7); -2.0548 - (0.6); -1.0352 - (0.8); -1.0243 - (2.3); -1.0189 - (2.4); -1.0144 - (1.3); -1.0085 - (1.3); -1.0032 - (2.3); -0.9978 - (2.3); -0.9876 - (0.9); -0.7778 - (1.0); -0.7674 - (2.6); -0.7626 - (2.6); -0.7548 - (2.5); -0.7499 - (2.5); -0.7385 - (0.8); -0.0002 - (2.4)$

20

I-071:  $^1\text{H-NMR}$  (400.2-MHz,  $-\text{d}_6\text{-DMSO}$ ): -

$\delta = 9.1217 - (0.6); -9.1059 - (1.2); -9.0901 - (0.6); -8.5018 - (6.4); -7.3038 - (1.6); -7.2993 - (2.1); -7.2842 - (2.8); -7.2794 - (2.5); -7.2647 - (1.7); -7.0890 - (2.3); -7.0242 - (1.5); -7.0040 - (2.2); -6.9811 - (1.1); -6.8783 - (1.5); -6.8734 - (2.1); -6.8079 - (1.2); -6.8027 - (1.0); -6.7886 - (1.1); -6.7825 - (1.0); -3.9987 - (0.6); -3.9825 - (0.6); -3.9602 - (1.5); -3.9442 - (1.4); -3.9216 - (0.7); -3.9055 - (0.7); -3.3418 - (13.6); -2.8953 - (0.8); -2.7361 - (0.7); -2.6673 - (16.0); -2.6576 - (0.9); -2.6214 - (1.0); -2.6025 - (3.0); -2.5835 - (3.1); -2.5646 - (1.1); -2.5302 - (0.7); -2.5254 - (1.0); -2.5168 - (11.1); -2.5123 - (21.8); -2.5078 - (28.3); -2.5032 - (20.8); -2.4988 - (10.1); -2.4079 - (6.0); -2.2617 - (8.5); -1.3613 - (0.6); -1.1819 - (4.8); -1.1630 - (10.2); -1.1440 - (4.6)$

30

40

50

I-072:  $^1\text{H-NMR}$  (400.2-MHz,  $-\text{d}_6\text{-DMSO}$ ): -

$\delta = 9.1335 - (0.6)$ ;  $-9.1176 - (1.3)$ ;  $-9.1017 - (0.6)$ ;  $-8.5295 - (6.0)$ ;  $-7.3796 - (0.9)$ ;  $-7.3771 - (0.8)$ ;  $-7.3607 - (1.7)$ ;  $-7.3582 - (1.7)$ ;  $-7.3423 - (0.8)$ ;  $-7.3394 - (1.1)$ ;  $-7.2946 - (2.0)$ ;  $-7.2746 - (2.3)$ ;  $-7.1140 - (1.7)$ ;  $-7.0901 - (2.5)$ ;  $-7.0044 - (1.3)$ ;  $-6.9844 - (1.1)$ ;  $-6.9345 - (4.7)$ ;  $-6.9164 - (1.4)$ ;  $-6.9109 - (0.8)$ ;  $-4.3954 - (8.6)$ ;  $-3.9938 - (0.7)$ ;  $-3.9778 - (0.7)$ ;  $-3.9554 - (1.5)$ ;  $-3.9393 - (1.5)$ ;  $-3.9167 - (0.8)$ ;  $-3.9007 - (0.7)$ ;  $-3.3503 - (13.3)$ ;  $-3.3438 - (16.6)$ ;  $-3.2826 - (20.6)$ ;  $-2.8952 - (0.7)$ ;  $-2.7361 - (0.6)$ ;  $-2.6742 - (16.0)$ ;  $-2.5302 - (0.6)$ ;  $-2.5253 - (1.0)$ ;  $-2.5167 - (12.2)$ ;  $-2.5123 - (24.2)$ ;  $-2.5078 - (31.3)$ ;  $-2.5032 - (22.8)$ ;  $-2.4987 - (11.0)$ ;  $-2.4034 - (6.2)$ ;  $-2.2623 - (8.8)$ ;  $-1.3612 - (0.5)$

10

I-073:  $^1\text{H-NMR}$  (400.1-MHz,  $-\text{CDCl}_3$ ): -

$\delta = 7.8864 - (0.8)$ ;  $-7.8715 - (1.5)$ ;  $-7.8569 - (0.9)$ ;  $-7.3848 - (4.0)$ ;  $-7.3790 - (7.5)$ ;  $-7.3768 - (8.2)$ ;  $-7.3730 - (4.7)$ ;  $-7.3695 - (4.8)$ ;  $-7.3623 - (6.1)$ ;  $-7.3418 - (1.4)$ ;  $-7.3218 - (3.7)$ ;  $-7.3180 - (3.8)$ ;  $-7.2594 - (21.7)$ ;  $-7.2376 - (0.5)$ ;  $-7.2238 - (2.0)$ ;  $-7.2176 - (3.0)$ ;  $-7.2102 - (2.1)$ ;  $-7.2070 - (2.1)$ ;  $-7.2011 - (2.5)$ ;  $-7.1947 - (1.6)$ ;  $-7.1895 - (0.7)$ ;  $-7.1830 - (0.6)$ ;  $-7.0681 - (4.3)$ ;  $-7.0515 - (3.1)$ ;  $-7.0315 - (2.1)$ ;  $-7.0099 - (0.9)$ ;  $-6.9956 - (0.4)$ ;  $-6.9676 - (0.5)$ ;  $-6.9462 - (0.4)$ ;  $-4.1957 - (1.8)$ ;  $-4.1799 - (1.7)$ ;  $-4.1589 - (3.8)$ ;  $-4.1432 - (3.7)$ ;  $-4.1221 - (2.0)$ ;  $-4.1064 - (1.9)$ ;  $-3.7016 - (0.7)$ ;  $-3.6861 - (0.8)$ ;  $-3.6689 - (0.4)$ ;  $-3.0848 - (11.2)$ ;  $-2.9543 - (0.6)$ ;  $-2.9369 - (1.0)$ ;  $-2.9193 - (0.5)$ ;  $-2.5226 - (0.6)$ ;  $-2.5006 - (12.0)$ ;  $-2.4830 - (1.8)$ ;  $-2.4768 - (1.8)$ ;  $-2.4703 - (1.7)$ ;  $-2.4574 - (1.3)$ ;  $-2.4415 - (0.6)$ ;  $-2.4286 - (0.4)$ ;  $-2.3810 - (0.4)$ ;  $-2.3413 - (3.8)$ ;  $-2.3295 - (16.0)$ ;  $-2.2969 - (3.6)$ ;  $-2.2815 - (0.7)$ ;  $-2.0923 - (0.4)$ ;  $-2.0036 - (4.9)$ ;  $-1.5508 - (5.6)$ ;  $-1.4150 - (0.3)$ ;  $-1.2503 - (0.6)$ ;  $-1.2344 - (2.2)$ ;  $-1.2276 - (4.6)$ ;  $-1.2226 - (2.8)$ ;  $-1.2065 - (8.6)$ ;  $-1.1974 - (5.3)$ ;  $-1.1933 - (6.1)$ ;  $-1.1868 - (2.8)$ ;  $-1.1703 - (1.3)$ ;  $-1.1634 - (1.0)$ ;  $-1.1491 - (0.7)$ ;  $-1.1412 - (0.9)$ ;  $-1.1360 - (1.0)$ ;  $-1.1297 - (0.8)$ ;  $-1.1231 - (0.7)$ ;  $-1.1091 - (0.3)$ ;  $-0.0527 - (0.3)$ ;  $-0.0079 - (0.8)$ ;  $-0.0002 - (27.6)$ ;  $-0.0084 - (1.5)$ ;  $-0.0478 - (0.4)$

20

30

40

50

I-074:  $^1\text{H-NMR}$  (400.1-MHz,  $-\text{CDCl}_3$ ):  $-\$

$\delta = 9.5346 - (1.0); -9.5085 - (1.1); -7.3943 - (6.6); -7.3852 - (3.7); -7.3798 - (4.9); -7.3723 - (3.5); -7.3678 - (3.9); -7.3182 - (3.1); -7.3089 - (1.2); -7.2992 - (3.9); -7.2773 - (0.6); -7.2660 - (2.1); -7.2592 - (17.8); -7.2514 - (2.9); -7.2438 - (1.9); -7.2368 - (1.6); -7.2091 - (0.7); -7.1706 - (0.5); -7.1508 - (0.6); -7.0643 - (4.5); -7.0354 - (2.3); -6.9901 - (2.3); -6.9630 - (2.2); -6.9231 - (2.3); -6.8960 - (2.1); -3.0915 - (9.2); -3.0622 - (0.6); -2.5672 - (0.5); -2.5537 - (1.0); -2.5486 - (1.1); -2.5423 - (0.8); -2.5349 - (2.5); -2.5270 - (0.9); -2.5210 - (1.1); -2.5164 - (1.2); -2.5025 - (0.7); -2.4776 - (0.3); -2.4703 - (0.3); -2.4276 - (10.6); -2.4205 - (11.2); -2.4043 - (1.7); -2.3785 - (0.8); -2.3699 - (0.7); -2.3499 - (16.0); -2.3277 - (1.5); -2.2991 - (0.6); -2.2745 - (1.0); -2.0036 - (1.0); -1.5584 - (1.6); -1.2693 - (8.8); -1.2609 - (6.2); -1.2484 - (5.2); -1.2424 - (2.4); -1.2243 - (0.7); -1.2063 - (0.4); -0.0496 - (0.5); -0.0079 - (0.8); -0.0002 - (19.8); -0.0073 - (1.4); -0.0502 - (0.5)$

10

I-075:  $^1\text{H-NMR}$  (400.2-MHz,  $-\text{d}_6\text{-DMSO}$ ):  $-\$

$\delta = 8.9505 - (0.6); -8.9363 - (1.2); -8.9217 - (0.6); -8.5717 - (5.9); -7.0341 - (0.7); -7.0148 - (1.5); -6.9941 - (0.9); -6.7883 - (1.1); -6.7823 - (1.1); -6.7679 - (2.3); -6.7474 - (1.5); -5.7497 - (3.9); -4.0022 - (1.6); -3.9856 - (3.5); -3.9691 - (1.8); -3.5109 - (0.9); -3.4949 - (2.3); -3.4793 - (2.3); -3.4632 - (0.8); -3.3377 - (22.6); -2.8907 - (1.1); -2.7315 - (1.0); -2.6645 - (16.0); -2.5252 - (0.6); -2.5205 - (0.9); -2.5117 - (10.9); -2.5073 - (21.7); -2.5028 - (28.5); -2.4983 - (20.8); -2.4939 - (10.2); -2.1729 - (13.5); -2.0983 - (0.5); -2.0904 - (0.7); -2.0768 - (1.4); -2.0694 - (15.6); -2.0568 - (0.7); -1.0309 - (0.7); -1.0200 - (2.0); -1.0145 - (2.1); -1.0100 - (1.0); -1.0042 - (1.0); -0.9988 - (2.0); -0.9934 - (2.1); -0.9832 - (0.8); -0.7698 - (0.9); -0.7595 - (2.2); -0.7544 - (2.3); -0.7467 - (2.2); -0.7415 - (2.3); -0.7304 - (0.7); -0.0002 - (1.5)$

20

I-076:  $^1\text{H-NMR}$  (400.2-MHz,  $-\text{d}_6\text{-DMSO}$ ):  $-\$

$\delta = 9.2824 - (1.2); -9.2620 - (1.2); -8.5999 - (6.1); -7.0278 - (0.6); -7.0251 - (0.7); -7.0059 - (1.5); -6.9874 - (0.9); -6.9849 - (0.9); -6.9331 - (3.6); -6.9236 - (4.3); -6.8345 - (2.4); -6.8321 - (2.4); -6.8250 - (2.0); -6.8225 - (2.0); -6.7826 - (1.4); -6.7802 - (1.4); -6.7626 - (3.3); -6.7430 - (2.2); -5.2023 - (0.7); -5.1845 - (1.1); -5.1667 - (0.7); -3.3386 - (9.8); -3.3350 - (11.7); -2.8905 - (1.9); -2.7313 - (1.6); -2.6709 - (16.0); -2.5251 - (0.5); -2.5203 - (0.8); -2.5116 - (8.8); -2.5072 - (17.6); -2.5026 - (23.0); -2.4981 - (16.8); -2.4936 - (8.1); -2.1004 - (0.5); -2.0921 - (0.5); -2.0794 - (1.0); -2.0666 - (0.6); -2.0584 - (0.5); -1.4713 - (5.9); -1.4540 - (5.8); -1.0345 - (0.7); -1.0238 - (2.0); -1.0182 - (2.1); -1.0135 - (1.0); -1.0082 - (1.0); -1.0026 - (2.0); -0.9971 - (2.0); -0.9872 - (0.8); -0.7743 - (0.9); -0.7642 - (2.2); -0.7590 - (2.2); -0.7514 - (2.1); -0.7461 - (2.2); -0.7353 - (0.7); -0.0002 - (1.9)$

30

40



I-077:  $^1\text{H-NMR}$  (400.2-MHz,  $-\text{d}_6\text{-DMSO}$ ): -

$\delta = 8.7906 - (0.6); -8.7763 - (1.2); -8.7621 - (0.6); -8.5408 - (5.8); -7.9531 - (0.7); -7.0439 - (0.6); -7.0412 - (0.7); -7.0236 - (1.4); -7.0214 - (1.5); -7.0037 - (0.9); -7.0010 - (0.9); -6.8050 - (0.6); -6.8014 - (1.0); -6.7846 - (1.8); -6.7817 - (1.9); -6.7683 - (1.4); -6.7652 - (1.3); -6.7613 - (1.0); -6.7518 - (0.8); -6.7184 - (2.4); -6.7111 - (2.7); -6.7062 - (3.1); -6.6980 - (4.3); -6.6558 - (2.1); -6.6509 - (1.7); -6.6353 - (1.1); -6.6303 - (1.0); -4.1881 - (0.9); -4.1786 - (15.3); -4.1687 - (0.8); -3.3668 - (0.9); -3.3383 - (22.5); -3.3150 - (0.9); -2.8908 - (5.4); -2.7320 - (4.5); -2.7313 - (4.4); -2.6717 - (0.4); -2.6583 - (16.0); -2.6348 - (1.7); -2.6153 - (2.2); -2.5974 - (1.4); -2.5256 - (0.6); -2.5208 - (0.8); -2.5121 - (9.9); -2.5077 - (19.7); -2.5031 - (25.6); -2.4985 - (18.5); -2.4940 - (8.7); -2.1006 - (0.5); -2.0923 - (0.5); -2.0796 - (1.0); -2.0668 - (0.6); -2.0586 - (0.5); -1.0318 - (0.7); -1.0208 - (2.0); -1.0153 - (2.1); -1.0107 - (1.0); -1.0051 - (1.1); -0.9997 - (2.0); -0.9942 - (2.1); -0.9841 - (0.8); -0.7714 - (0.9); -0.7611 - (2.2); -0.7559 - (2.3); -0.7484 - (2.1); -0.7431 - (2.3); -0.7320 - (0.7); -0.0002 - (1.8)$

10

I-078:  $^1\text{H-NMR}$  (400.2-MHz,  $-\text{d}_6\text{-DMSO}$ ): -

$\delta = 8.9435 - (1.4); -8.9231 - (1.4); -8.5509 - (6.0); -7.0253 - (0.7); -7.0058 - (1.6); -6.9851 - (1.0); -6.7969 - (0.9); -6.7764 - (2.2); -6.7562 - (2.0); -6.7389 - (0.7); -4.9867 - (0.4); -4.9765 - (0.8); -4.9670 - (0.7); -4.9566 - (0.8); -3.3411 - (30.4); -3.3384 - (34.7); -2.8909 - (2.0); -2.7316 - (2.2); -2.7030 - (0.5); -2.6925 - (0.9); -2.6818 - (0.6); -2.6715 - (0.4); -2.6670 - (0.3); -2.6487 - (16.0); -2.6240 - (0.7); -2.6102 - (0.4); -2.5842 - (0.3); -2.5249 - (0.8); -2.5200 - (1.3); -2.5114 - (14.5); -2.5070 - (28.8); -2.5025 - (37.5); -2.4980 - (27.5); -2.4937 - (13.6); -2.3095 - (0.4); -2.2973 - (0.8); -2.2888 - (0.8); -2.2856 - (0.6); -2.2768 - (1.5); -2.2647 - (0.8); -2.2562 - (0.8); -2.2441 - (0.4); -2.1091 - (0.5); -2.1007 - (0.6); -2.0880 - (1.0); -2.0753 - (0.6); -2.0672 - (0.6); -1.8154 - (0.7); -1.7941 - (1.2); -1.7810 - (0.6); -1.7423 - (0.3); -1.7190 - (0.4); -1.7089 - (0.7); -1.6934 - (0.5); -1.6796 - (0.5); -1.6690 - (0.7); -1.6577 - (0.6); -1.6431 - (0.6); -1.6328 - (0.5); -1.0571 - (0.8); -1.0500 - (1.4); -1.0467 - (1.2); -1.0403 - (2.0); -1.0293 - (3.4); -1.0232 - (2.8); -1.0131 - (1.8); -1.0082 - (2.1); -1.0025 - (2.1); -0.9932 - (0.8); -0.8432 - (0.9); -0.8349 - (2.0); -0.8269 - (2.1); -0.8230 - (2.0); -0.8163 - (1.8); -0.8073 - (0.7); -0.7744 - (0.9); -0.7648 - (1.9); -0.7608 - (2.2); -0.7519 - (2.0); -0.7473 - (1.8); -0.7366 - (0.7); -0.0002 - (2.5)$

20

30

40

50

I-079:  $^1\text{H-NMR}$  (400.1-MHz,  $-\text{CDCl}_3$ ): -

$\delta = 8.5669 - (5.1); -8.2073 - (1.0); -8.0156 - (0.8); -7.4497 - (0.8); -7.4303 - (2.3); -7.4104 - (2.2); -7.3932 - (2.7); -7.3741 - (1.2); -7.3449 - (2.1); -7.3252 - (2.3); -7.2594 - (6.1); -7.1864 - (1.3); -7.1837 - (1.4); -7.1698 - (1.0); -7.1635 - (1.3); -7.1134 - (2.4); -7.0347 - (3.0); -7.0043 - (1.4); -4.0790 - (1.1); -4.0632 - (1.1); -4.0415 - (2.3); -4.0256 - (2.2); -4.0039 - (1.2); -3.9881 - (1.2); -2.9522 - (5.4); -2.8810 - (5.0); -2.8226 - (16.0); -2.7234 - (0.9); -2.4995 - (0.5); -2.4449 - (7.6); -2.3218 - (10.4); -1.9991 - (8.5); -1.5636 - (6.8); -0.0002 - (3.2)$

10

I-080:  $^1\text{H-NMR}$  (400.2-MHz,  $-\text{d}_6\text{-DMSO}$ ): -

$\delta = 9.2482 - (1.4); -9.2270 - (1.5); -8.6235 - (5.9); -7.9528 - (0.6); -7.0593 - (0.7); -7.0395 - (1.7); -7.0195 - (1.1); -7.0092 - (2.0); -6.9894 - (3.3); -6.9734 - (3.0); -6.8494 - (0.9); -6.8295 - (1.6); -6.8095 - (1.5); -6.7913 - (1.4); -6.7746 - (0.7); -5.1974 - (0.4); -5.1790 - (0.5); -5.1690 - (0.5); -5.1598 - (0.5); -5.1496 - (0.5); -5.1312 - (0.4); -3.3357 - (61.2); -2.8908 - (4.1); -2.7309 - (3.6); -2.6771 - (16.0); -2.5248 - (1.4); -2.5111 - (26.1); -2.5070 - (50.0); -2.5025 - (64.2); -2.4980 - (46.6); -2.4937 - (22.5); -2.3295 - (0.4); -2.1095 - (0.5); -2.1008 - (0.6); -2.0884 - (1.1); -2.0754 - (0.7); -2.0680 - (1.3); -2.0529 - (1.1); -2.0353 - (1.1); -2.0197 - (1.0); -1.8564 - (0.9); -1.8259 - (1.2); -1.7940 - (0.7); -1.3854 - (10.4); -1.2621 - (10.1); -1.0410 - (0.7); -1.0306 - (2.0); -1.0250 - (2.1); -1.0201 - (1.0); -1.0152 - (1.1); -1.0095 - (2.0); -1.0039 - (2.0); -0.9943 - (0.8); -0.7815 - (0.9); -0.7717 - (2.1); -0.7670 - (2.3); -0.7588 - (2.1); -0.7538 - (2.0); -0.7432 - (0.7); -0.0002 - (4.1)$

20

I-081:  $^1\text{H-NMR}$  (400.2-MHz,  $-\text{d}_6\text{-DMSO}$ ): -

$\delta = 8.9853 - (0.5); -8.9713 - (1.1); -8.9570 - (0.6); -8.5785 - (5.8); -7.8138 - (2.0); -7.8089 - (2.1); -7.6833 - (0.9); -7.6791 - (0.9); -7.6616 - (1.1); -7.6573 - (1.0); -7.3493 - (1.6); -7.3277 - (1.5); -7.0008 - (0.6); -6.9979 - (0.6); -6.9805 - (1.4); -6.9779 - (1.4); -6.9605 - (0.8); -6.9578 - (0.9); -6.7923 - (0.7); -6.7886 - (0.8); -6.7721 - (1.3); -6.7687 - (1.4); -6.7521 - (0.6); -6.7485 - (0.6); -6.7369 - (0.7); -6.7335 - (0.7); -6.7172 - (1.2); -6.7007 - (0.7); -6.6974 - (0.5); -4.2339 - (1.4); -4.2196 - (3.1); -4.2054 - (1.5); -3.6577 - (0.8); -3.6436 - (2.2); -3.6292 - (2.2); -3.6150 - (0.8); -3.3389 - (23.1); -2.8922 - (0.8); -2.7335 - (0.6); -2.7324 - (0.6); -2.6682 - (16.0); -2.5272 - (0.6); -2.5225 - (0.8); -2.5138 - (10.0); -2.5093 - (20.0); -2.5047 - (26.2); -2.5001 - (18.9); -2.4956 - (9.0); -2.0590 - (0.5); -2.0507 - (0.5); -2.0380 - (1.0); -2.0252 - (0.6); -2.0170 - (0.5); -1.0114 - (0.7); -1.0004 - (2.0); -0.9949 - (2.0); -0.9904 - (1.0); -0.9847 - (1.0); -0.9793 - (2.0); -0.9738 - (2.0); -0.9637 - (0.8); -0.7438 - (0.8); -0.7335 - (2.1); -0.7283 - (2.2); -0.7207 - (2.0); -0.7155 - (2.2); -0.7044 - (0.7); -0.0002 - (2.0)$

30

40

50

I-082:  $^1\text{H-NMR}$  (400.1-MHz,  $-\text{CDCl}_3$ ):-

$\delta = 7.9093 - (0.4)$ ;  $-7.8945 - (0.8)$ ;  $-7.8802 - (0.5)$ ;  $-7.3852 - (1.7)$ ;  $-7.3654 - (2.0)$ ;  $-7.3217 - (1.0)$ ;  $-7.3013 - (2.1)$ ;  $-7.2813 - (1.4)$ ;  $-7.2595 - (4.2)$ ;  $-7.0639 - (2.1)$ ;  $-7.0467 - (1.3)$ ;  $-7.0262 - (1.1)$ ;  $-6.8148 - (1.0)$ ;  $-6.8093 - (1.3)$ ;  $-6.7899 - (1.2)$ ;  $-6.7877 - (1.3)$ ;  $-6.7837 - (1.2)$ ;  $-6.7783 - (1.5)$ ;  $-6.7590 - (3.5)$ ;  $-6.7537 - (2.6)$ ;  $-6.7483 - (1.2)$ ;  $-5.2965 - (5.0)$ ;  $-4.1971 - (0.9)$ ;  $-4.1814 - (0.9)$ ;  $-4.1602 - (1.9)$ ;  $-4.1447 - (2.0)$ ;  $-4.1294 - (1.6)$ ;  $-4.1234 - (1.2)$ ;  $-4.1114 - (1.7)$ ;  $-4.1080 - (1.3)$ ;  $-4.0938 - (0.6)$ ;  $-3.7905 - (16.0)$ ;  $-3.7412 - (0.4)$ ;  $-2.5165 - (0.4)$ ;  $-2.4987 - (6.5)$ ;  $-2.4936 - (4.2)$ ;  $-2.4842 - (1.9)$ ;  $-2.4771 - (0.9)$ ;  $-2.4701 - (0.9)$ ;  $-2.4652 - (0.8)$ ;  $-2.4515 - (0.6)$ ;  $-2.3264 - (8.2)$ ;  $-2.2923 - (0.4)$ ;  $-2.0427 - (5.4)$ ;  $-2.0017 - (0.8)$ ;  $-1.5631 - (1.1)$ ;  $-1.2757 - (1.7)$ ;  $-1.2579 - (3.4)$ ;  $-1.2401 - (1.8)$ ;  $-1.2190 - (1.2)$ ;  $-1.2128 - (2.9)$ ;  $-1.2003 - (3.5)$ ;  $-1.1913 - (5.2)$ ;  $-0.0705 - (0.8)$ ;  $-0.0002 - (5.2)$

10

I-083:  $^1\text{H-NMR}$  (400.2-MHz,  $-\text{d}_6\text{-DMSO}$ ):-

$\delta = 9.1516 - (0.6)$ ;  $-9.1358 - (1.2)$ ;  $-9.1197 - (0.6)$ ;  $-8.4959 - (5.2)$ ;  $-7.9573 - (0.4)$ ;  $-7.3047 - (1.9)$ ;  $-7.2847 - (2.2)$ ;  $-7.1173 - (0.4)$ ;  $-7.1007 - (1.3)$ ;  $-7.0855 - (3.2)$ ;  $-7.0752 - (1.9)$ ;  $-7.0554 - (1.9)$ ;  $-7.0351 - (0.7)$ ;  $-6.9909 - (1.2)$ ;  $-6.9714 - (1.0)$ ;  $-6.8843 - (0.7)$ ;  $-6.8804 - (0.7)$ ;  $-6.8645 - (1.2)$ ;  $-6.8605 - (1.1)$ ;  $-6.8456 - (0.6)$ ;  $-6.8407 - (0.5)$ ;  $-4.0126 - (0.6)$ ;  $-3.9966 - (0.6)$ ;  $-3.9742 - (1.4)$ ;  $-3.9581 - (1.4)$ ;  $-3.9357 - (0.7)$ ;  $-3.9197 - (0.7)$ ;  $-3.3504 - (42.5)$ ;  $-2.8950 - (3.3)$ ;  $-2.7363 - (2.7)$ ;  $-2.7354 - (2.7)$ ;  $-2.6665 - (16.0)$ ;  $-2.5302 - (0.6)$ ;  $-2.5254 - (1.0)$ ;  $-2.5167 - (11.8)$ ;  $-2.5123 - (23.3)$ ;  $-2.5077 - (30.3)$ ;  $-2.5031 - (22.0)$ ;  $-2.4985 - (10.6)$ ;  $-2.4127 - (5.8)$ ;  $-2.3755 - (0.5)$ ;  $-2.2916 - (7.0)$ ;  $-2.2866 - (6.6)$ ;  $-2.2498 - (8.2)$ ;  $-1.3604 - (1.4)$

20

I-084:  $^1\text{H-NMR}$  (400.2-MHz,  $-\text{d}_6\text{-DMSO}$ ):-

$\delta = 9.1524 - (0.5)$ ;  $-9.1367 - (1.1)$ ;  $-9.1206 - (0.6)$ ;  $-8.5322 - (5.3)$ ;  $-7.3013 - (1.8)$ ;  $-7.2813 - (2.1)$ ;  $-7.1155 - (0.6)$ ;  $-7.1106 - (0.5)$ ;  $-7.0943 - (1.5)$ ;  $-7.0892 - (2.3)$ ;  $-7.0841 - (2.2)$ ;  $-7.0734 - (1.1)$ ;  $-7.0687 - (1.0)$ ;  $-7.0269 - (0.8)$ ;  $-7.0234 - (0.9)$ ;  $-7.0053 - (1.3)$ ;  $-6.9879 - (1.3)$ ;  $-6.9721 - (1.0)$ ;  $-6.6029 - (0.7)$ ;  $-6.5992 - (0.8)$ ;  $-6.5819 - (1.4)$ ;  $-6.5788 - (0.8)$ ;  $-6.5642 - (0.8)$ ;  $-6.5607 - (0.7)$ ;  $-4.0106 - (0.6)$ ;  $-3.9947 - (0.6)$ ;  $-3.9723 - (1.3)$ ;  $-3.9562 - (1.3)$ ;  $-3.9338 - (0.7)$ ;  $-3.9179 - (0.6)$ ;  $-3.8831 - (16.0)$ ;  $-3.3415 - (17.0)$ ;  $-2.8954 - (1.0)$ ;  $-2.7367 - (0.9)$ ;  $-2.7354 - (0.8)$ ;  $-2.6696 - (15.1)$ ;  $-2.5300 - (0.7)$ ;  $-2.5253 - (1.0)$ ;  $-2.5165 - (12.4)$ ;  $-2.5121 - (25.0)$ ;  $-2.5075 - (32.7)$ ;  $-2.5029 - (24.1)$ ;  $-2.4984 - (11.8)$ ;  $-2.4104 - (5.5)$ ;  $-2.2519 - (7.8)$ ;  $-1.3606 - (1.4)$

30

40

50

I-085:  $^1\text{H-NMR}$  (400.2-MHz,  $-\text{d}_6\text{-DMSO}$ ): -

$\delta = 9.1349 - (0.6); -9.1191 - (1.3); -9.1030 - (0.6); -8.6516 - (6.4); -7.9578 - (0.5); -7.3555 - (0.6); -7.3513 - (0.5); -7.3376 - (4.7); -7.3315 - (1.8); -7.3212 - (2.7); -7.3013 - (0.7); -7.2822 - (2.0); -7.2622 - (2.3); -7.2016 - (2.1); -7.1986 - (2.5); -7.1939 - (1.8); -7.0851 - (2.4); -7.0136 - (1.1); -7.0079 - (1.9); -7.0009 - (2.0); -6.9961 - (2.2); -6.9908 - (2.0); -6.9842 - (1.3); -6.9780 - (1.2); -3.9976 - (0.7); -3.9818 - (0.7); -3.9594 - (1.6); -3.9434 - (1.5); -3.9210 - (0.8); -3.9049 - (0.7); -3.3432 - (19.2); -2.8951 - (3.6); -2.7363 - (3.1); -2.6905 - (16.0); -2.6767 - (0.3); -2.5297 - (0.8); -2.5163 - (12.8); -2.5120 - (23.9); -2.5075 - (30.1); -2.5029 - (21.6); -2.4986 - (10.3); -2.3985 - (6.4); -2.2676 - (9.0); -1.3608 - (1.4)$

10

I-086:  $^1\text{H-NMR}$  (400.2-MHz,  $-\text{d}_6\text{-DMSO}$ ): -

$\delta = 8.9147 - (0.6); -8.9006 - (1.2); -8.8860 - (0.6); -8.5435 - (5.7); -7.9532 - (0.3); -7.8921 - (5.2); -7.5172 - (4.9); -7.5160 - (5.1); -7.0464 - (0.7); -7.0440 - (0.7); -7.0244 - (1.6); -7.0061 - (1.0); -7.0039 - (1.0); -6.8095 - (1.0); -6.7926 - (2.2); -6.7897 - (2.4); -6.7731 - (2.0); -6.7566 - (0.8); -4.2154 - (1.7); -4.1998 - (3.7); -4.1843 - (1.9); -3.6048 - (1.0); -3.5896 - (2.6); -3.5744 - (2.5); -3.5591 - (0.9); -3.3401 - (23.3); -2.8911 - (2.2); -2.7315 - (2.0); -2.6618 - (16.0); -2.5259 - (0.5); -2.5123 - (9.6); -2.5080 - (18.5); -2.5035 - (23.6); -2.4990 - (17.2); -2.4946 - (8.4); -2.0993 - (0.5); -2.0911 - (0.6); -2.0784 - (1.0); -2.0655 - (0.6); -2.0574 - (0.6); -1.0315 - (0.7); -1.0205 - (2.1); -1.0151 - (2.2); -1.0107 - (1.1); -1.0048 - (1.1); -0.9994 - (2.1); -0.9940 - (2.1); -0.9838 - (0.8); -0.7731 - (0.9); -0.7627 - (2.4); -0.7577 - (2.4); -0.7500 - (2.3); -0.7449 - (2.4); -0.7337 - (0.7); -0.0002 - (1.4)$

20

I-087:  $^1\text{H-NMR}$  (400.2-MHz,  $-\text{d}_6\text{-DMSO}$ ): -

$\delta = 8.7955 - (0.6); -8.7813 - (1.1); -8.7671 - (0.5); -8.5458 - (5.7); -7.9531 - (0.5); -7.0702 - (2.1); -7.0467 - (0.6); -7.0438 - (0.6); -7.0262 - (1.4); -7.0239 - (1.4); -7.0064 - (0.9); -7.0037 - (0.9); -6.9125 - (1.0); -6.9082 - (1.0); -6.8922 - (1.2); -6.8880 - (1.1); -6.8082 - (0.6); -6.8046 - (1.0); -6.7878 - (1.7); -6.7850 - (1.9); -6.7702 - (1.4); -6.7647 - (1.0); -6.7541 - (0.7); -6.6254 - (2.6); -6.6052 - (2.3); -4.4813 - (2.3); -4.4596 - (4.7); -4.4378 - (2.5); -3.3680 - (0.8); -3.3363 - (12.9); -3.3159 - (0.9); -3.1158 - (1.4); -3.0942 - (2.8); -3.0724 - (1.3); -2.8905 - (3.6); -2.7320 - (3.0); -2.7308 - (3.0); -2.6604 - (16.0); -2.6480 - (2.2); -2.6299 - (1.4); -2.5253 - (0.5); -2.5206 - (0.8); -2.5118 - (9.5); -2.5073 - (18.8); -2.5027 - (24.6); -2.4981 - (17.8); -2.4936 - (8.4); -2.1013 - (0.5); -2.0931 - (0.5); -2.0804 - (0.9); -2.0676 - (0.5); -2.0594 - (0.5); -1.0315 - (0.7); -1.0206 - (2.0); -1.0151 - (2.0); -1.0105 - (1.0); -1.0048 - (1.0); -0.9994 - (2.0); -0.9939 - (2.0); -0.9838 - (0.8); -0.7704 - (0.9); -0.7602 - (2.2); -0.7573 - (1.8); -0.7549 - (2.2); -0.7474 - (2.1); -0.7421 - (2.2); -0.7310 - (0.7); -0.0002 - (2.3)$

30

40

50

I-088:  $^1\text{H-NMR}$  (400.2-MHz,  $-\text{d}_6\text{-DMSO}$ ): -

$\delta = 8.5113 - (4.4); -7.3469 - (1.3); -7.3409 - (1.4); -7.3274 - (2.4); -7.3230 - (2.4); -7.3160 - (0.4); -7.3002 - (0.4); -7.2888 - (0.8); -7.2855 - (0.7); -7.2772 - (2.7); -7.2714 - (2.0); -7.2642 - (3.9); -7.2595 - (3.7); -7.2525 - (0.6); -7.2485 - (0.4); -7.0694 - (0.6); -7.0667 - (0.7); -7.0493 - (1.3); -7.0466 - (1.4); -7.0291 - (0.8); -7.0265 - (0.8); -6.8404 - (1.2); -6.8375 - (1.4); -6.8237 - (1.4); -6.8180 - (2.1); -6.8038 - (0.8); -6.7980 - (0.8); -4.9456 - (5.2); -3.6841 - (3.0); -3.6688 - (3.0); -3.3308 - (20.6); -2.6712 - (0.4); -2.6549 - (16.0); -2.5248 - (0.8); -2.5202 - (1.2); -2.5114 - (15.3); -2.5069 - (31.4); -2.5023 - (42.0); -2.4976 - (30.8); -2.4931 - (15.0); -2.1159 - (0.4); -2.1079 - (0.5); -2.0952 - (0.9); -2.0824 - (0.6); -2.0743 - (0.5); -1.5033 - (0.6); -1.4871 - (0.8); -1.4704 - (0.6); -1.4542 - (0.3); -1.0536 - (0.6); -1.0426 - (1.8); -1.0371 - (1.9); -1.0326 - (1.1); -1.0269 - (1.1); -1.0215 - (1.9); -1.0160 - (2.0); -1.0059 - (0.9); -0.8005 - (0.7); -0.7947 - (1.0); -0.7843 - (2.6); -0.7792 - (2.4); -0.7716 - (2.1); -0.7663 - (2.3); -0.7553 - (0.8); -0.5125 - (12.4); -0.4957 - (12.0); -0.0002 - (5.6)$

I-089:  $^1\text{H-NMR}$  (400.2-MHz,  $-\text{d}_6\text{-DMSO}$ ): -

$\delta = 9.0654 - (0.6); -9.0507 - (1.2); -9.0360 - (0.6); -8.5525 - (5.7); -7.9537 - (0.9); -7.4226 - (2.1); -7.4026 - (2.3); -7.1582 - (2.3); -7.0423 - (0.6); -7.0397 - (0.7); -7.0199 - (1.5); -7.0020 - (0.9); -6.9995 - (1.0); -6.9869 - (1.2); -6.9669 - (1.1); -6.8106 - (0.6); -6.8072 - (0.9); -6.7905 - (2.0); -6.7873 - (2.2); -6.7709 - (1.8); -6.7675 - (1.4); -6.7547 - (0.7); -5.7009 - (0.4); -5.6905 - (0.5); -5.6827 - (0.5); -5.6723 - (0.4); -5.5812 - (0.4); -5.5714 - (0.5); -5.5624 - (0.5); -5.5528 - (0.4); -3.8742 - (16.0); -3.7438 - (0.4); -3.7255 - (0.5); -3.7185 - (0.3); -3.7116 - (0.6); -3.6985 - (0.9); -3.6874 - (0.5); -3.6832 - (0.5); -3.6794 - (0.5); -3.6640 - (0.4); -3.6442 - (0.4); -3.6340 - (0.4); -3.6297 - (0.4); -3.6196 - (0.3); -3.3373 - (14.6); -2.8913 - (6.6); -2.7324 - (5.7); -2.6718 - (15.5); -2.5261 - (0.5); -2.5213 - (0.7); -2.5127 - (9.4); -2.5082 - (19.0); -2.5036 - (24.9); -2.4990 - (18.2); -2.4946 - (8.8); -2.0991 - (0.5); -2.0908 - (0.5); -2.0779 - (1.0); -2.0651 - (0.6); -2.0569 - (0.5); -1.0323 - (0.7); -1.0215 - (2.0); -1.0160 - (2.1); -1.0113 - (1.0); -1.0058 - (1.0); -1.0004 - (2.0); -0.9949 - (2.0); -0.9848 - (0.8); -0.7735 - (0.8); -0.7633 - (2.1); -0.7581 - (2.2); -0.7506 - (2.1); -0.7453 - (2.2); -0.7343 - (0.7); -0.0002 - (2.2)$

10

20

30

40

50

I-090:  $^1\text{H-NMR}$  (400.1-MHz,  $-\text{CDCl}_3$ ): -

$\delta = 8.6161 - (5.2); -8.2397 - (1.2); -8.2273 - (0.7); -8.0164 - (1.0); -7.9789 - (1.4); -7.9762 - (1.5); -7.9585 - (1.6); -7.9558 - (1.6); -7.6478 - (1.7); -7.6425 - (2.9); -7.6375 - (1.9); -7.5275 - (1.3); -7.5069 - (2.8); -7.4863 - (1.5); -7.3367 - (2.1); -7.3166 - (3.8); -7.2989 - (1.4); -7.2946 - (1.4); -7.2625 - (4.3); -7.0273 - (3.2); -6.9961 - (1.5); -4.0690 - (1.1); -4.0532 - (1.1); -4.0316 - (2.3); -4.0157 - (2.2); -3.9940 - (1.2); -3.9781 - (1.2); -2.9565 - (5.9); -2.8836 - (5.5); -2.8411 - (16.0); -2.4330 - (8.0); -2.3158 - (11.0); -1.6051 - (3.0); -0.0709 - (0.9); -0.0002 - (4.6)$

10

I-091:  $^1\text{H-NMR}$  (400.2-MHz,  $-\text{d}_6\text{-DMSO}$ ): -

$\delta = 8.9863 - (1.4); -8.9762 - (1.4); -8.6009 - (6.1); -7.3472 - (2.2); -7.3434 - (2.4); -7.2921 - (1.3); -7.2875 - (1.1); -7.2719 - (1.4); -7.2673 - (1.2); -7.0330 - (0.6); -7.0302 - (0.7); -7.0128 - (1.4); -7.0101 - (1.5); -6.9927 - (0.9); -6.9900 - (0.9); -6.7769 - (3.2); -6.7664 - (1.2); -6.7568 - (3.8); -6.7465 - (1.9); -6.7427 - (1.5); -6.7377 - (0.8); -6.7266 - (0.8); -6.7231 - (0.6); -3.3380 - (16.6); -2.8902 - (1.2); -2.8753 - (0.3); -2.8502 - (0.5); -2.8323 - (1.3); -2.8195 - (1.2); -2.8115 - (1.0); -2.8006 - (1.0); -2.7885 - (0.7); -2.7731 - (1.0); -2.7526 - (0.7); -2.7318 - (1.2); -2.6799 - (16.0); -2.5251 - (0.6); -2.5202 - (0.9); -2.5117 - (10.2); -2.5072 - (20.3); -2.5026 - (26.4); -2.4980 - (19.0); -2.4934 - (9.0); -2.0957 - (0.5); -2.0875 - (0.5); -2.0748 - (1.0); -2.0619 - (0.6); -2.0539 - (0.5); -1.9138 - (1.0); -1.9101 - (1.0); -1.8947 - (2.6); -1.8880 - (1.2); -1.8741 - (1.4); -1.4521 - (1.0); -1.4375 - (1.3); -1.4315 - (1.2); -1.4169 - (1.0); -1.1422 - (1.0); -1.1285 - (1.7); -1.1146 - (0.9); -1.0366 - (0.6); -1.0259 - (2.0); -1.0204 - (2.1); -1.0156 - (0.9); -1.0104 - (1.0); -1.0048 - (2.0); -0.9993 - (2.1); -0.9894 - (0.7); -0.7698 - (0.9); -0.7599 - (2.1); -0.7548 - (2.1); -0.7471 - (2.1); -0.7418 - (2.0); -0.7312 - (0.7); -0.0002 - (2.5)$

20

I-092:  $^1\text{H-NMR}$  (400.2-MHz,  $-\text{d}_6\text{-DMSO}$ ): -

$\delta = 9.1246 - (0.6); -9.1089 - (1.4); -9.0929 - (0.7); -8.3616 - (6.1); -7.9579 - (0.7); -7.3037 - (2.1); -7.2837 - (2.4); -7.1634 - (0.9); -7.1444 - (2.2); -7.1249 - (1.6); -7.0856 - (3.8); -7.0658 - (1.3); -6.9820 - (1.3); -6.9619 - (1.2); -6.6851 - (2.0); -6.6654 - (1.9); -4.0158 - (0.7); -3.9999 - (0.7); -3.9775 - (1.6); -3.9614 - (1.5); -3.9388 - (0.8); -3.9230 - (0.7); -3.3433 - (18.5); -2.9319 - (1.4); -2.9133 - (2.8); -2.8953 - (6.1); -2.7364 - (4.3); -2.7279 - (1.4); -2.7094 - (2.8); -2.6909 - (1.6); -2.6478 - (16.0); -2.5302 - (0.7); -2.5253 - (1.1); -2.5167 - (12.7); -2.5123 - (24.6); -2.5077 - (31.8); -2.5032 - (23.1); -2.4988 - (11.2); -2.4162 - (6.4); -2.2510 - (9.0); -2.0529 - (0.5); -2.0344 - (1.7); -2.0158 - (2.4); -1.9975 - (1.6); -1.9785 - (0.4); -1.3608 - (1.2)$

30

40

50

I-093:  $^1\text{H-NMR}$  (400.2-MHz,  $-\text{d}_6\text{-DMSO}$ ): -

$\delta = 9.1234 - (0.6)$ ;  $-9.1076 - (1.3)$ ;  $-9.0923 - (0.6)$ ;  $-8.5890 - (5.8)$ ;  $-7.9577 - (0.5)$ ;  $-7.3527 - (2.1)$ ;  $-7.3314 - (2.3)$ ;  $-7.2859 - (2.1)$ ;  $-7.2659 - (2.4)$ ;  $-7.0844 - (5.2)$ ;  $-7.0782 - (3.6)$ ;  $-6.9926 - (1.3)$ ;  $-6.9727 - (1.2)$ ;  $-6.9136 - (1.6)$ ;  $-6.9071 - (1.5)$ ;  $-6.8925 - (1.5)$ ;  $-6.8861 - (1.4)$ ;  $-4.0047 - (0.7)$ ;  $-3.9886 - (0.7)$ ;  $-3.9663 - (1.6)$ ;  $-3.9503 - (1.5)$ ;  $-3.9278 - (0.8)$ ;  $-3.9119 - (0.7)$ ;  $-3.3414 - (32.2)$ ;  $-2.8956 - (3.7)$ ;  $-2.7361 - (3.3)$ ;  $-2.6761 - (16.0)$ ;  $-2.5301 - (1.0)$ ;  $-2.5164 - (18.5)$ ;  $-2.5123 - (36.5)$ ;  $-2.5078 - (48.2)$ ;  $-2.5033 - (36.6)$ ;  $-2.4992 - (19.0)$ ;  $-2.4007 - (6.5)$ ;  $-2.2977 - (13.0)$ ;  $-2.2629 - (9.2)$ ;  $-2.1887 - (0.4)$ ;  $-1.3606 - (2.5)$

10

I-094:  $^1\text{H-NMR}$  (400.2-MHz,  $-\text{d}_6\text{-DMSO}$ ): -

$\delta = 9.1379 - (0.6)$ ;  $-9.1220 - (1.2)$ ;  $-9.1061 - (0.6)$ ;  $-8.6848 - (6.6)$ ;  $-7.5052 - (1.4)$ ;  $-7.4844 - (3.2)$ ;  $-7.4637 - (1.8)$ ;  $-7.2825 - (2.0)$ ;  $-7.2625 - (2.2)$ ;  $-7.1547 - (1.0)$ ;  $-7.1521 - (1.1)$ ;  $-7.1495 - (1.0)$ ;  $-7.1340 - (0.9)$ ;  $-7.1313 - (1.0)$ ;  $-7.1288 - (0.9)$ ;  $-7.0837 - (2.2)$ ;  $-7.0288 - (2.0)$ ;  $-7.0086 - (1.7)$ ;  $-7.0023 - (1.9)$ ;  $-6.9893 - (1.5)$ ;  $-6.9879 - (1.5)$ ;  $-6.9818 - (1.9)$ ;  $-3.9861 - (0.6)$ ;  $-3.9700 - (0.6)$ ;  $-3.9476 - (1.5)$ ;  $-3.9316 - (1.4)$ ;  $-3.9089 - (0.7)$ ;  $-3.8930 - (0.7)$ ;  $-3.3428 - (17.0)$ ;  $-2.8954 - (0.6)$ ;  $-2.7368 - (0.5)$ ;  $-2.6991 - (16.0)$ ;  $-2.5303 - (0.7)$ ;  $-2.5256 - (1.0)$ ;  $-2.5170 - (11.7)$ ;  $-2.5125 - (23.6)$ ;  $-2.5079 - (31.2)$ ;  $-2.5033 - (23.0)$ ;  $-2.4988 - (11.4)$ ;  $-2.3904 - (5.9)$ ;  $-2.2617 - (8.4)$ ;  $-1.3610 - (0.4)$

20

I-095:  $^1\text{H-NMR}$  (400.2-MHz,  $-\text{d}_6\text{-DMSO}$ ): -

$\delta = 8.9922 - (0.7)$ ;  $-8.9375 - (1.5)$ ;  $-8.9233 - (3.0)$ ;  $-8.9090 - (1.6)$ ;  $-8.8635 - (11.0)$ ;  $-7.6202 - (1.9)$ ;  $-7.6002 - (4.6)$ ;  $-7.5801 - (3.2)$ ;  $-7.5368 - (0.5)$ ;  $-7.5133 - (4.8)$ ;  $-7.4934 - (3.0)$ ;  $-7.4654 - (0.9)$ ;  $-7.4439 - (0.4)$ ;  $-7.4049 - (14.6)$ ;  $-7.3842 - (11.6)$ ;  $-7.3444 - (3.2)$ ;  $-7.3396 - (2.9)$ ;  $-7.3241 - (2.6)$ ;  $-7.3192 - (2.5)$ ;  $-7.2337 - (0.6)$ ;  $-7.2129 - (0.6)$ ;  $-7.1681 - (0.5)$ ;  $-7.1434 - (10.3)$ ;  $-7.1226 - (9.2)$ ;  $-5.7592 - (16.0)$ ;  $-3.4110 - (2.2)$ ;  $-3.3936 - (5.5)$ ;  $-3.3775 - (5.7)$ ;  $-3.3607 - (2.9)$ ;  $-3.3305 - (97.6)$ ;  $-3.1746 - (1.3)$ ;  $-3.1615 - (1.2)$ ;  $-2.8413 - (0.4)$ ;  $-2.7084 - (4.3)$ ;  $-2.6905 - (8.1)$ ;  $-2.6722 - (5.1)$ ;  $-2.5065 - (154.3)$ ;  $-2.5023 - (210.5)$ ;  $-2.4982 - (167.2)$ ;  $-2.3290 - (1.2)$ ;  $-2.3250 - (0.9)$ ;  $-1.2573 - (0.3)$ ;  $-1.2337 - (0.8)$ ;  $-0.8592 - (0.5)$ ;  $-0.0002 - (2.8)$

30

40

50

I-096:  $^1\text{H-NMR}$  (400.2-MHz,  $-\text{d}_6\text{-DMSO}$ ): -

$\delta = 10.1034 - (0.4); -9.2665 - (3.6); -9.2464 - (3.7); -8.4068 - (2.1); -7.6778 - (0.4); -7.6417 - (6.8); -7.6146 - (0.5); -7.5790 - (3.3); -7.5605 - (4.9); -7.5454 - (3.1); -7.5254 - (6.0); -7.4987 - (8.3); -7.4792 - (7.2); -7.4594 - (1.9); -7.4363 - (0.5); -7.4168 - (0.6); -7.3904 - (4.9); -7.3711 - (3.6); -7.3517 - (0.5); -7.3301 - (0.4); -7.2743 - (0.3); -7.2381 - (0.6); -7.2330 - (0.6); -7.2129 - (11.5); -7.1927 - (3.4); -5.7587 - (8.9); -5.0479 - (0.6); -5.0304 - (2.2); -5.0121 - (3.2); -4.9935 - (2.2); -4.9761 - (0.6); -4.0099 - (0.5); -3.4723 - (0.4); -3.4453 - (0.4); -3.4241 - (0.5); -3.4115 - (0.6); -3.3900 - (0.8); -3.3684 - (1.8); -3.3360 - (690.8); -3.2842 - (0.4); -3.2720 - (0.3); -3.1615 - (0.3); -2.8141 - (0.6); -2.7995 - (0.8); -2.7883 - (0.6); -2.6760 - (1.7); -2.6715 - (2.4); -2.6669 - (1.8); -2.5783 - (0.4); -2.5694 - (0.3); -2.5481 - (1.0); -2.5248 - (5.7); -2.5199 - (8.7); -2.5112 - (135.4); -2.5069 - (286.4); -2.5025 - (385.3); -2.4980 - (277.4); -2.4937 - (132.4); -2.3337 - (1.6); -2.3293 - (2.3); -2.3247 - (1.7); -1.5117 - (0.4); -1.4940 - (0.5); -1.3850 - (0.6); -1.3646 - (0.7); -1.3362 - (16.0); -1.3186 - (15.8); -1.2877 - (0.6); -1.2579 - (0.7); -1.2343 - (2.5); -0.8533 - (0.6); -0.8336 - (0.5); -0.0002 - (5.5)$

10

20

I-097:  $^1\text{H-NMR}$  (400.2-MHz,  $-\text{d}_6\text{-DMSO}$ ): -

$\delta = 12.0722 - (1.0); -8.5580 - (4.7); -7.9525 - (1.4); -7.8046 - (2.6); -7.7841 - (3.2); -7.5994 - (2.8); -7.5790 - (2.3); -7.0549 - (0.6); -7.0366 - (1.3); -7.0163 - (0.8); -6.8126 - (1.7); -6.7936 - (2.7); -6.7744 - (1.4); -4.9370 - (5.6); -3.3297 - (229.9); -2.8902 - (11.2); -2.7311 - (9.4); -2.7299 - (9.4); -2.6798 - (0.9); -2.6753 - (1.9); -2.6707 - (2.6); -2.6661 - (1.9); -2.6615 - (1.0); -2.6483 - (16.0); -2.6127 - (0.5); -2.5243 - (9.2); -2.5196 - (13.8); -2.5109 - (154.6); -2.5063 - (307.3); -2.5017 - (399.8); -2.4971 - (286.5); -2.4925 - (134.6); -2.3378 - (0.8); -2.3331 - (1.7); -2.3286 - (2.4); -2.3240 - (1.6); -2.3196 - (0.7); -2.0966 - (0.4); -2.0883 - (0.5); -2.0758 - (0.9); -2.0629 - (0.5); -2.0549 - (0.5); -1.2360 - (1.1); -1.0364 - (0.7); -1.0255 - (2.0); -1.0200 - (2.0); -1.0155 - (1.1); -1.0097 - (1.1); -1.0043 - (2.0); -0.9989 - (2.0); -0.9887 - (0.8); -0.8538 - (0.5); -0.7764 - (0.8); -0.7660 - (2.1); -0.7609 - (2.2); -0.7532 - (2.0); -0.7481 - (2.2); -0.7369 - (0.7); -0.0080 - (2.1); -0.0002 - (65.1); -0.0085 - (1.8)$

30

40

50



I-098:  $^1\text{H-NMR}$  (400.2-MHz,  $-\text{d}_6\text{-DMSO}$ ): -

$\delta = 9.0666 - (1.4); -9.0448 - (1.4); -8.5693 - (6.0); -7.9524 - (0.4); -7.0571 - (1.3); -7.0476 - (1.0); -7.0375 - (2.2); -7.0271 - (4.5); -7.0090 - (1.2); -6.9802 - (2.6); -6.9609 - (1.6); -6.8443 - (1.0); -6.8245 - (1.7); -6.8068 - (1.7); -6.7872 - (1.6); -6.7704 - (0.8); -5.0891 - (0.4); -5.0755 - (0.8); -5.0645 - (0.7); -5.0546 - (0.8); -5.0411 - (0.4); -4.7278 - (0.6); -4.6902 - (2.5); -4.6705 - (2.5); -4.6330 - (0.6); -3.9282 - (1.0); -3.9166 - (1.1); -3.8998 - (1.4); -3.8883 - (1.3); -3.7247 - (1.3); -3.7095 - (1.3); -3.6964 - (1.1); -3.6812 - (1.0); -3.3349 - (15.6); -2.8906 - (2.8); -2.7314 - (2.6); -2.6709 - (0.4); -2.6551 - (1.2); -2.6469 - (16.0); -2.5243 - (0.6); -2.5065 - (22.8); -2.5021 - (29.0); -2.4979 - (21.4); -2.3049 - (0.5); -2.1371 - (11.4); -2.1199 - (0.7); -2.1114 - (0.7); -2.0989 - (1.2); -2.0861 - (0.7); -2.0780 - (0.7); -1.0470 - (0.7); -1.0366 - (2.2); -1.0310 - (2.3); -1.0211 - (1.2); -1.0155 - (2.2); -1.0100 - (2.3); -1.0003 - (0.9); -0.7855 - (0.9); -0.7753 - (2.4); -0.7712 - (2.6); -0.7627 - (2.4); -0.7580 - (2.4); -0.7470 - (0.8); -0.0002 - (1.8)$

10

I-099:  $^1\text{H-NMR}$  (400.2-MHz,  $-\text{d}_6\text{-DMSO}$ ): -

$\delta = 8.8270 - (0.5); -8.8126 - (1.0); -8.7981 - (0.5); -8.5275 - (4.7); -7.9658 - (1.8); -7.9602 - (1.8); -7.5383 - (1.2); -7.5321 - (1.2); -7.5172 - (1.3); -7.5110 - (1.2); -7.0465 - (0.5); -7.0436 - (0.6); -7.0259 - (1.2); -7.0237 - (1.2); -7.0062 - (0.7); -7.0035 - (0.8); -6.8121 - (0.5); -6.8085 - (0.8); -6.7917 - (1.5); -6.7889 - (1.6); -6.7737 - (1.2); -6.7579 - (0.6); -6.6083 - (2.0); -6.5873 - (2.0); -5.1852 - (0.4); -5.1698 - (1.1); -5.1543 - (1.6); -5.1389 - (1.1); -5.1235 - (0.4); -3.4116 - (0.6); -3.3944 - (1.5); -3.3789 - (1.5); -3.3613 - (0.7); -3.3383 - (19.4); -2.8915 - (1.4); -2.7326 - (1.2); -2.7318 - (1.2); -2.6958 - (1.2); -2.6778 - (2.3); -2.6557 - (13.6); -2.5263 - (0.5); -2.5216 - (0.7); -2.5129 - (9.1); -2.5084 - (18.1); -2.5038 - (23.6); -2.4992 - (17.0); -2.4946 - (8.1); -2.0994 - (0.4); -2.0912 - (0.4); -2.0783 - (0.8); -2.0655 - (0.5); -2.0573 - (0.4); -1.2533 - (16.0); -1.2379 - (15.8); -1.0316 - (0.6); -1.0207 - (1.7); -1.0152 - (1.8); -1.0105 - (0.8); -1.0049 - (0.9); -0.9995 - (1.7); -0.9940 - (1.7); -0.9839 - (0.7); -0.7727 - (0.7); -0.7624 - (1.8); -0.7572 - (1.9); -0.7497 - (1.8); -0.7444 - (1.9); -0.7333 - (0.6); -0.0002 - (1.9)$

20

30

40

50

I-100:  $^1\text{H-NMR}$  (400.2-MHz,  $-\text{d}_6\text{-DMSO}$ ): -

$\delta = 12.0170 - (0.7); -8.5646 - (5.8); -7.5388 - (2.3); -7.5175 - (2.8); -7.3343 - (2.7); -7.3142 - (2.3); -7.0674 - (0.6); -7.0474 - (1.4); -7.0272 - (0.9); -6.8432 - (0.6); -6.8224 - (1.3); -6.8021 - (1.5); -6.7831 - (0.7); -4.8631 - (6.9); -3.3392 - (12.9); -2.8914 - (1.5); -2.7327 - (1.2); -2.6530 - (16.0); -2.6420 - (0.7); -2.5263 - (0.5); -2.5216 - (0.8); -2.5129 - (9.4); -2.5084 - (19.1); -2.5039 - (25.2); -2.4993 - (18.4); -2.4948 - (8.9); -2.1021 - (0.5); -2.0939 - (0.6); -2.0812 - (1.0); -2.0684 - (0.6); -2.0601 - (0.6); -1.0332 - (0.7); -1.0223 - (2.0); -1.0168 - (2.2); -1.0123 - (1.1); -1.0065 - (1.2); -1.0012 - (2.1); -0.9957 - (2.1); -0.9855 - (0.9); -0.7723 - (0.9); -0.7620 - (2.3); -0.7569 - (2.5); -0.7493 - (2.3); -0.7441 - (2.5); -0.7329 - (0.8); -0.0002 - (2.3)$

10

I-102:  $^1\text{H-NMR}$  (400.1-MHz,  $-\text{CDCl}_3$ ): -

$\delta = 8.4836 - (5.1); -8.1828 - (1.1); -7.3569 - (2.2); -7.3371 - (2.4); -7.3220 - (0.9); -7.3027 - (2.3); -7.2833 - (2.3); -7.2701 - (3.2); -7.2599 - (9.8); -7.0361 - (3.4); -7.0225 - (4.2); -7.0014 - (2.8); -6.9848 - (1.6); -5.2980 - (8.1); -4.1303 - (0.6); -4.1210 - (1.2); -4.1127 - (0.9); -4.1054 - (1.2); -4.0948 - (0.5); -4.0836 - (2.3); -4.0678 - (2.3); -4.0460 - (1.3); -4.0303 - (1.2); -3.0756 - (5.0); -2.7834 - (16.0); -2.4664 - (8.2); -2.3163 - (11.2); -2.0439 - (2.2); -1.5590 - (14.0); -1.2765 - (0.9); -1.2587 - (1.6); -1.2410 - (0.7); -0.8816 - (0.4); -0.0697 - (3.1); -0.0002 - (12.3)$

20

I-103:  $^1\text{H-NMR}$  (400.2-MHz,  $-\text{d}_6\text{-DMSO}$ ): -

$\delta = 9.1483 - (0.6); -9.1324 - (1.3); -9.1164 - (0.6); -8.5103 - (5.9); -7.2980 - (2.0); -7.2780 - (2.3); -7.0791 - (2.3); -7.0555 - (0.7); -7.0357 - (1.6); -7.0153 - (1.0); -6.9811 - (1.2); -6.9611 - (1.1); -6.8211 - (1.0); -6.8016 - (2.1); -6.7857 - (1.7); -6.7701 - (0.8); -4.0108 - (0.6); -3.9949 - (0.6); -3.9726 - (1.5); -3.9565 - (1.4); -3.9341 - (0.7); -3.9180 - (0.7); -3.3401 - (24.8); -2.8906 - (1.8); -2.7314 - (1.6); -2.6648 - (16.0); -2.5256 - (0.5); -2.5209 - (0.7); -2.5121 - (9.5); -2.5078 - (19.0); -2.5032 - (25.1); -2.4987 - (18.3); -2.4942 - (9.0); -2.4089 - (6.1); -2.2447 - (8.7); -2.1028 - (0.5); -2.0946 - (0.6); -2.0818 - (1.1); -2.0691 - (0.6); -2.0609 - (0.6); -1.0390 - (0.7); -1.0281 - (2.0); -1.0226 - (2.1); -1.0181 - (1.1); -1.0124 - (1.1); -1.0070 - (2.0); -1.0015 - (2.1); -0.9913 - (0.8); -0.7816 - (0.9); -0.7712 - (2.2); -0.7662 - (2.4); -0.7585 - (2.2); -0.7534 - (2.4); -0.7422 - (0.7); -0.0002 - (1.5)$

30

40

50

I-104:  $^1\text{H-NMR}$  (400.2-MHz,  $-\text{d}_6\text{-DMSO}$ ): -

$\delta = 9.1088 - (0.6); -9.0933 - (1.3); -9.0774 - (0.6); -8.4439 - (6.8); -7.9578 - (0.7); -7.3055 - (2.0); -7.2855 - (2.3); -7.2213 - (1.8); -7.2009 - (2.0); -7.0911 - (2.4); -7.0035 - (1.3); -6.9836 - (1.1); -6.8761 - (2.2); -6.8710 - (2.2); -6.7958 - (1.4); -6.7898 - (1.2); -6.7754 - (1.3); -6.7695 - (1.1); -4.0113 - (0.7); -3.9956 - (0.6); -3.9730 - (1.5); -3.9570 - (1.4); -3.9344 - (0.8); -3.9185 - (0.7); -3.3429 - (20.6); -2.8953 - (4.6); -2.8493 - (2.4); -2.8309 - (4.8); -2.8124 - (2.7); -2.7367 - (3.9); -2.7360 - (3.9); -2.6497 - (16.0); -2.5299 - (0.7); -2.5164 - (12.6); -2.5121 - (23.8); -2.5076 - (30.4); -2.5031 - (22.2); -2.4987 - (10.9); -2.4129 - (6.2); -2.2633 - (8.8); -2.0689 - (0.5); -2.0503 - (1.8); -2.0318 - (2.5); -2.0135 - (1.8); -1.9948 - (0.4); -1.3610 - (1.7)$

10

I-105:  $^1\text{H-NMR}$  (400.1-MHz,  $-\text{CDCl}_3$ ): -

$\delta = 9.5437 - (0.9); -9.5175 - (1.0); -7.6112 - (0.8); -7.3573 - (1.3); -7.3532 - (1.5); -7.3412 - (1.6); -7.3370 - (2.9); -7.3328 - (2.0); -7.3213 - (3.6); -7.3168 - (2.1); -7.3037 - (3.3); -7.2909 - (0.6); -7.2823 - (1.5); -7.2782 - (1.4); -7.2656 - (1.9); -7.2591 - (36.6); -7.2451 - (2.5); -7.2409 - (2.1); -7.2196 - (0.4); -7.2104 - (0.6); -7.1801 - (0.4); -7.1722 - (2.1); -7.1680 - (2.1); -7.1596 - (0.6); -7.1518 - (3.0); -7.1475 - (3.0); -7.1368 - (0.9); -7.1313 - (1.4); -7.1270 - (1.3); -7.0681 - (4.0); -7.0396 - (1.9); -6.9927 - (2.5); -6.9656 - (2.3); -6.9259 - (2.5); -6.8988 - (2.2); -2.5733 - (0.6); -2.5585 - (1.1); -2.5556 - (1.2); -2.5477 - (1.0); -2.5412 - (3.5); -2.5339 - (1.0); -2.5235 - (1.3); -2.5083 - (0.8); -2.4755 - (0.3); -2.4315 - (9.9); -2.4244 - (10.2); -2.4039 - (0.7); -2.3898 - (0.8); -2.3825 - (1.8); -2.3522 - (14.3); -2.3034 - (0.5); -1.5877 - (0.4); -1.5376 - (27.6); -1.5202 - (0.4); -1.4885 - (0.4); -1.3314 - (0.4); -1.3060 - (0.7); -1.2812 - (16.0); -1.2757 - (3.7); -1.2686 - (6.4); -1.2633 - (5.7); -1.2612 - (6.2); -1.2546 - (3.0); -1.2353 - (0.7); -1.2220 - (0.5); -1.2133 - (0.6); -1.2061 - (0.5); -1.1931 - (0.5); -1.1860 - (0.4); -0.8817 - (0.6); -0.0693 - (1.9); -0.0500 - (0.6); -0.0079 - (1.8); -0.0002 - (55.6); -0.0085 - (2.5); -0.0493 - (0.7)$

20

30

40

50

I-106:  $^1\text{H-NMR}$  (400.2-MHz,  $-\text{d}_6\text{-DMSO}$ ): -

$\delta = 9.1602 - (0.6)$ ;  $-9.1443 - (1.3)$ ;  $-9.1280 - (0.6)$ ;  $-8.6654 - (6.9)$ ;  $-7.9804 - (1.8)$ ;  $-7.9588 - (2.9)$ ;  $-7.9396 - (1.4)$ ;  $-7.9198 - (1.6)$ ;  $-7.8210 - (1.4)$ ;  $-7.8010 - (1.6)$ ;  $-7.5265 - (0.6)$ ;  $-7.5233 - (0.7)$ ;  $-7.5092 - (1.3)$ ;  $-7.5063 - (1.5)$ ;  $-7.4895 - (1.2)$ ;  $-7.4858 - (1.1)$ ;  $-7.4752 - (1.2)$ ;  $-7.4716 - (1.3)$ ;  $-7.4549 - (1.6)$ ;  $-7.4520 - (1.3)$ ;  $-7.4379 - (0.7)$ ;  $-7.4347 - (0.6)$ ;  $-7.3247 - (5.8)$ ;  $-7.3033 - (2.0)$ ;  $-7.2969 - (1.2)$ ;  $-7.2562 - (2.0)$ ;  $-7.2362 - (2.3)$ ;  $-7.0543 - (2.3)$ ;  $-6.9288 - (1.2)$ ;  $-6.9091 - (1.1)$ ;  $-6.8774 - (0.4)$ ;  $-3.9801 - (0.6)$ ;  $-3.9639 - (0.6)$ ;  $-3.9416 - (1.5)$ ;  $-3.9256 - (1.4)$ ;  $-3.9031 - (0.7)$ ;  $-3.8871 - (0.7)$ ;  $-3.3409 - (23.8)$ ;  $-2.8951 - (7.2)$ ;  $-2.7366 - (6.1)$ ;  $-2.7358 - (6.0)$ ;  $-2.7094 - (16.0)$ ;  $-2.6766 - (0.3)$ ;  $-2.5300 - (1.0)$ ;  $-2.5166 - (19.0)$ ;  $-2.5122 - (36.9)$ ;  $-2.5077 - (47.6)$ ;  $-2.5031 - (34.7)$ ;  $-2.4987 - (16.8)$ ;  $-2.3742 - (6.1)$ ;  $-2.2143 - (8.7)$ ;  $-2.1892 - (0.6)$ ;  $-1.3612 - (4.2)$

10

I-107:  $^1\text{H-NMR}$  (400.1-MHz,  $-\text{CDC13}$ ): -

$\delta = 8.9189 - (0.8)$ ;  $-8.8932 - (0.9)$ ;  $-7.3370 - (2.9)$ ;  $-7.3144 - (3.0)$ ;  $-7.3092 - (3.1)$ ;  $-7.2931 - (2.1)$ ;  $-7.2867 - (3.6)$ ;  $-7.2739 - (2.5)$ ;  $-7.2704 - (2.6)$ ;  $-7.2598 - (11.8)$ ;  $-7.1214 - (3.8)$ ;  $-7.1062 - (1.6)$ ;  $-7.1034 - (1.4)$ ;  $-7.0948 - (1.9)$ ;  $-7.0853 - (1.6)$ ;  $-7.0838 - (1.8)$ ;  $-7.0773 - (3.1)$ ;  $-7.0583 - (7.2)$ ;  $-7.0453 - (4.6)$ ;  $-7.0404 - (3.6)$ ;  $-7.0344 - (3.6)$ ;  $-7.0226 - (1.4)$ ;  $-7.0134 - (2.2)$ ;  $-6.9959 - (0.5)$ ;  $-5.2968 - (16.0)$ ;  $-5.2849 - (0.4)$ ;  $-2.4588 - (0.6)$ ;  $-2.4468 - (1.2)$ ;  $-2.4382 - (1.4)$ ;  $-2.4349 - (1.0)$ ;  $-2.4262 - (2.6)$ ;  $-2.4176 - (1.0)$ ;  $-2.4142 - (1.5)$ ;  $-2.4056 - (1.6)$ ;  $-2.3936 - (0.9)$ ;  $-2.3765 - (0.5)$ ;  $-2.3559 - (10.6)$ ;  $-2.3493 - (11.3)$ ;  $-2.3280 - (11.7)$ ;  $-2.3243 - (12.1)$ ;  $-2.3004 - (1.1)$ ;  $-2.2839 - (12.0)$ ;  $-2.2791 - (13.0)$ ;  $-2.2349 - (0.6)$ ;  $-2.2295 - (0.6)$ ;  $-2.0024 - (0.5)$ ;  $-1.5741 - (0.8)$ ;  $-1.2551 - (1.2)$ ;  $-1.2130 - (0.4)$ ;  $-1.1965 - (0.3)$ ;  $-1.1486 - (1.0)$ ;  $-1.1374 - (3.1)$ ;  $-1.1305 - (3.8)$ ;  $-1.1203 - (2.1)$ ;  $-1.1168 - (3.4)$ ;  $-1.1099 - (3.7)$ ;  $-1.1001 - (1.6)$ ;  $-1.0835 - (0.4)$ ;  $-0.9683 - (1.4)$ ;  $-0.9586 - (3.8)$ ;  $-0.9519 - (3.7)$ ;  $-0.9468 - (4.0)$ ;  $-0.9401 - (4.2)$ ;  $-0.9290 - (1.3)$ ;  $-0.0079 - (0.5)$ ;  $-0.0002 - (15.0)$ ;  $-0.0085 - (0.8)$

20

I-108:  $^1\text{H-NMR}$  (400.2-MHz,  $-\text{d}_6\text{-DMSO}$ ): -

$\delta = 9.1668 - (0.6)$ ;  $-9.1510 - (1.3)$ ;  $-9.1350 - (0.6)$ ;  $-8.7527 - (6.6)$ ;  $-7.7009 - (2.0)$ ;  $-7.6787 - (2.2)$ ;  $-7.4565 - (2.4)$ ;  $-7.4491 - (2.6)$ ;  $-7.2875 - (1.3)$ ;  $-7.2800 - (1.3)$ ;  $-7.2715 - (2.1)$ ;  $-7.2657 - (1.4)$ ;  $-7.2577 - (1.3)$ ;  $-7.2516 - (2.4)$ ;  $-7.0760 - (2.3)$ ;  $-6.9865 - (1.3)$ ;  $-6.9660 - (1.1)$ ;  $-3.9901 - (0.6)$ ;  $-3.9740 - (0.6)$ ;  $-3.9517 - (1.5)$ ;  $-3.9356 - (1.4)$ ;  $-3.9130 - (0.8)$ ;  $-3.8969 - (0.7)$ ;  $-3.3412 - (45.1)$ ;  $-2.8958 - (1.2)$ ;  $-2.7360 - (1.0)$ ;  $-2.7064 - (16.0)$ ;  $-2.6815 - (0.4)$ ;  $-2.6769 - (0.4)$ ;  $-2.5302 - (1.5)$ ;  $-2.5167 - (26.7)$ ;  $-2.5124 - (51.3)$ ;  $-2.5078 - (65.8)$ ;  $-2.5032 - (48.1)$ ;  $-2.4988 - (23.4)$ ;  $-2.3775 - (6.2)$ ;  $-2.3393 - (0.3)$ ;  $-2.3347 - (0.4)$ ;  $-2.2558 - (8.8)$ ;  $-2.1888 - (0.4)$ ;  $-1.3605 - (2.4)$

30

40

50

I-109:  $^1\text{H-NMR}$  (400.1-MHz,  $-\text{CDCl}_3$ ): -

$\delta = 8.8904 - (0.7)$ ;  $-8.8639 - (0.7)$ ;  $-7.3497 - (0.9)$ ;  $-7.3452 - (1.0)$ ;  $-7.3335 - (1.1)$ ;  $-7.3290 - (1.8)$ ;  $-7.3253 - (1.6)$ ;  $-7.3205 - (2.1)$ ;  $-7.3143 - (1.4)$ ;  $-7.3092 - (1.5)$ ;  $-7.2981 - (3.3)$ ;  $-7.2926 - (2.3)$ ;  $-7.2796 - (2.1)$ ;  $-7.2701 - (2.1)$ ;  $-7.2598 - (9.0)$ ;  $-7.2329 - (0.4)$ ;  $-7.2102 - (0.4)$ ;  $-7.2020 - (0.8)$ ;  $-7.1977 - (0.9)$ ;  $-7.1864 - (0.8)$ ;  $-7.1815 - (1.9)$ ;  $-7.1771 - (1.5)$ ;  $-7.1660 - (2.0)$ ;  $-7.1521 - (4.1)$ ;  $-7.1320 - (1.9)$ ;  $-7.1287 - (2.1)$ ;  $-7.1118 - (0.8)$ ;  $-7.1082 - (0.9)$ ;  $-7.0894 - (1.7)$ ;  $-7.0701 - (1.5)$ ;  $-5.2979 - (4.1)$ ;  $-2.4626 - (0.4)$ ;  $-2.4506 - (0.8)$ ;  $-2.4419 - (0.9)$ ;  $-2.4301 - (1.6)$ ;  $-2.4181 - (1.1)$ ;  $-2.4095 - (1.2)$ ;  $-2.3975 - (0.7)$ ;  $-2.3627 - (16.0)$ ;  $-2.3136 - (0.6)$ ;  $-2.0041 - (0.4)$ ;  $-1.5567 - (1.1)$ ;  $-1.2552 - (0.7)$ ;  $-1.1657 - (0.8)$ ;  $-1.1546 - (2.2)$ ;  $-1.1477 - (2.6)$ ;  $-1.1341 - (2.5)$ ;  $-1.1273 - (2.4)$ ;  $-1.1173 - (1.1)$ ;  $-0.9445 - (1.0)$ ;  $-0.9343 - (2.8)$ ;  $-0.9278 - (2.7)$ ;  $-0.9228 - (2.8)$ ;  $-0.9161 - (2.9)$ ;  $-0.9051 - (0.9)$ ;  $-0.0002 - (11.5)$

10

I-110:  $^1\text{H-NMR}$  (300.2-MHz,  $-\text{CDCl}_3$ ): -

$\delta = 7.8131 - (0.4)$ ;  $-7.7964 - (0.7)$ ;  $-7.6465 - (0.3)$ ;  $-7.6178 - (1.4)$ ;  $-7.5969 - (4.0)$ ;  $-7.5767 - (0.4)$ ;  $-7.5224 - (1.8)$ ;  $-7.4658 - (0.8)$ ;  $-7.4562 - (1.2)$ ;  $-7.4490 - (0.9)$ ;  $-7.4425 - (0.5)$ ;  $-7.4345 - (0.8)$ ;  $-7.4258 - (0.8)$ ;  $-7.4162 - (3.6)$ ;  $-7.4099 - (1.3)$ ;  $-7.3942 - (1.4)$ ;  $-7.3880 - (4.2)$ ;  $-7.3013 - (16.5)$ ;  $-7.1057 - (0.6)$ ;  $-7.0974 - (4.3)$ ;  $-7.0909 - (1.3)$ ;  $-7.0752 - (1.3)$ ;  $-7.0692 - (3.5)$ ;  $-7.0604 - (0.5)$ ;  $-5.3404 - (0.7)$ ;  $-5.0483 - (3.6)$ ;  $-5.0277 - (4.5)$ ;  $-4.8842 - (4.7)$ ;  $-4.8634 - (3.8)$ ;  $-4.1735 - (0.5)$ ;  $-4.1499 - (0.5)$ ;  $-4.1053 - (3.8)$ ;  $-4.0844 - (3.8)$ ;  $-2.9389 - (0.3)$ ;  $-2.8950 - (16.0)$ ;  $-2.0859 - (2.0)$ ;  $-1.6068 - (5.4)$ ;  $-1.5205 - (0.4)$ ;  $-1.4972 - (0.4)$ ;  $-1.4695 - (0.6)$ ;  $-1.4522 - (0.6)$ ;  $-1.4443 - (0.5)$ ;  $-1.4158 - (0.4)$ ;  $-1.3400 - (1.4)$ ;  $-1.3328 - (1.3)$ ;  $-1.3234 - (1.5)$ ;  $-1.2992 - (3.9)$ ;  $-1.2758 - (1.5)$ ;  $-1.1032 - (0.4)$ ;  $-1.0807 - (0.4)$ ;  $-0.9161 - (1.3)$ ;  $-0.8916 - (3.4)$ ;  $-0.8685 - (3.2)$ ;  $-0.1092 - (3.0)$ ;  $-0.0500 - (0.5)$ ;  $-0.0394 - (14.4)$ ;  $-0.0284 - (0.6)$

20

30

40

50

I-111:  $^1\text{H-NMR}$  (400.2-MHz,  $-\text{d}_6\text{-DMSO}$ ): -

$\delta = 8.5451 - (4.2); -8.4879 - (5.4); -7.2734 - (1.0); -7.2558 - (3.0); -7.2527 - (2.3); -7.2372 - (9.7); -7.2318 - (4.7); -7.2217 - (4.2); -7.2015 - (2.2); -7.1931 - (1.0); -7.1870 - (1.5); -7.1826 - (1.8); -7.1744 - (0.9); -7.1714 - (1.0); -7.1619 - (0.6); -7.1572 - (0.4); -7.1099 - (0.7); -7.0901 - (1.6); -7.0695 - (1.6); -7.0605 - (2.0); -7.0571 - (2.6); -7.0449 - (1.8); -7.0398 - (2.2); -7.0260 - (0.9); -7.0034 - (0.8); -6.9997 - (1.0); -6.9834 - (1.3); -6.9801 - (1.4); -6.9636 - (0.7); -6.9570 - (0.8); -6.9528 - (0.8); -6.9365 - (1.0); -6.9331 - (1.1); -6.9166 - (0.5); -6.9130 - (0.5); -6.8609 - (0.7); -6.8577 - (0.8); -6.8413 - (1.4); -6.8246 - (0.7); -6.8203 - (1.0); -6.7996 - (1.0); -6.7830 - (0.5); -6.7797 - (0.5); -3.5747 - (1.5); -3.5562 - (1.9); -3.5517 - (1.6); -3.5365 - (1.6); -3.4210 - (0.6); -3.4035 - (2.0); -3.3858 - (2.0); -3.3679 - (0.7); -3.3366 - (25.2); -3.2892 - (1.0); -3.2702 - (1.3); -3.2494 - (1.2); -3.0756 - (0.7); -3.0582 - (2.3); -3.0405 - (2.3); -3.0229 - (0.7); -2.8912 - (0.9); -2.8815 - (1.1); -2.8606 - (1.2); -2.8419 - (0.9); -2.7773 - (1.6); -2.7577 - (1.9); -2.7392 - (1.4); -2.7322 - (0.9); -2.6627 - (12.5); -2.6369 - (16.0); -2.5263 - (1.1); -2.5214 - (1.7); -2.5128 - (17.6); -2.5085 - (35.4); -2.5039 - (46.8); -2.4994 - (34.6); -2.4949 - (17.0); -2.0917 - (0.5); -2.0833 - (0.6); -2.0705 - (1.0); -2.0572 - (0.7); -2.0503 - (0.8); -2.0320 - (0.8); -2.0190 - (0.5); -2.0105 - (0.4); -1.0453 - (2.8); -1.0277 - (8.0); -1.0191 - (1.7); -1.0087 - (9.2); -1.0027 - (3.0); -0.9972 - (2.9); -0.9913 - (4.6); -0.9871 - (3.4); -0.9813 - (3.0); -0.9758 - (1.8); -0.9706 - (2.3); -0.9601 - (0.7); -0.7684 - (0.9); -0.7579 - (2.3); -0.7528 - (2.5); -0.7452 - (2.4); -0.7399 - (4.0); -0.7346 - (2.1); -0.7272 - (2.0); -0.7216 - (1.8); -0.7105 - (0.5); -0.0002 - (4.1)$

10

20

30

40

50

I-112:  $^1\text{H-NMR}$  (400.1-MHz,  $-\text{CDCl}_3$ ):  $-\text{}$

$\delta = 8.9285 - (0.9); -8.9022 - (1.0); -7.3412 - (2.4); -7.3187 - (2.5); -7.3135 - (2.5); -7.2913 - (4.3); -7.2755 - (2.6); -7.2729 - (2.6); -7.2599 - (7.4); -7.1195 - (4.0); -7.0696 - (1.2); -7.0510 - (2.9); -7.0305 - (4.6); -7.0174 - (2.3); -7.0124 - (3.6); -7.0002 - (2.3); -6.9966 - (2.6); -6.9801 - (1.2); -6.9760 - (1.1); -6.8112 - (1.2); -6.8065 - (1.3); -6.7913 - (2.1); -6.7754 - (1.2); -6.7712 - (1.2); -5.2966 - (16.0); -2.4654 - (0.5); -2.4532 - (1.1); -2.4446 - (1.2); -2.4327 - (2.2); -2.4210 - (1.4); -2.4122 - (1.3); -2.4004 - (0.9); -2.3574 - (10.8); -2.3508 - (11.5); -2.3199 - (12.8); -2.2701 - (0.6); -2.0796 - (0.5); -2.0666 - (0.9); -2.0583 - (1.0); -2.0454 - (1.8); -2.0326 - (1.1); -2.0243 - (1.0); -2.0113 - (0.6); -2.0022 - (0.4); -1.5771 - (0.7); -1.2560 - (1.1); -1.1957 - (0.3); -1.1517 - (1.1); -1.1406 - (3.0); -1.1335 - (3.7); -1.1201 - (3.2); -1.1133 - (3.5); -1.1035 - (1.6); -1.0865 - (0.4); -1.0662 - (0.3); -1.0161 - (1.4); -1.0046 - (3.5); -0.9996 - (3.7); -0.9885 - (2.1); -0.9833 - (3.7); -0.9780 - (4.2); -0.9666 - (5.1); -0.9595 - (3.9); -0.9545 - (4.1); -0.9478 - (4.3); -0.9365 - (1.4); -0.9158 - (0.4); -0.9028 - (0.4); -0.7607 - (1.5); -0.7490 - (4.1); -0.7452 - (4.0); -0.7368 - (3.7); -0.7324 - (4.5); -0.7202 - (1.4); -0.0078 - (0.4); -0.0002 - (9.2); -0.0075 - (0.6)$

10

20

I-113:  $^1\text{H-NMR}$  (400.2-MHz,  $-\text{d}_6\text{-DMSO}$ ):  $-\text{}$

$\delta = 9.1579 - (1.3); -9.1368 - (1.3); -8.6075 - (6.1); -7.9522 - (1.3); -7.0359 - (0.7); -7.0326 - (0.9); -7.0258 - (1.3); -7.0156 - (1.7); -7.0124 - (2.0); -6.9958 - (0.9); -6.9931 - (0.9); -6.9313 - (1.1); -6.9136 - (1.4); -6.7874 - (2.3); -6.7675 - (3.2); -6.7479 - (1.1); -6.7235 - (1.6); -6.7048 - (2.5); -6.6860 - (1.2); -5.1444 - (0.4); -5.1292 - (0.8); -5.1088 - (0.8); -5.0940 - (0.4); -4.2217 - (1.4); -4.2092 - (2.2); -4.1946 - (1.3); -3.3386 - (16.7); -3.3362 - (19.4); -2.8904 - (9.4); -2.7315 - (8.3); -2.7304 - (7.5); -2.6531 - (16.0); -2.5244 - (0.6); -2.5197 - (0.8); -2.5110 - (10.5); -2.5065 - (21.0); -2.5019 - (27.4); -2.4973 - (19.8); -2.4928 - (9.5); -2.1221 - (0.5); -2.1133 - (0.7); -2.0988 - (11.5); -2.0801 - (0.7); -2.0672 - (0.4); -2.0569 - (0.5); -2.0431 - (0.6); -2.0366 - (0.4); -2.0241 - (0.5); -2.0198 - (0.5); -2.0070 - (0.5); -1.8688 - (0.4); -1.8632 - (0.5); -1.8527 - (0.6); -1.8461 - (0.4); -1.8366 - (0.4); -1.8321 - (0.4); -1.8160 - (0.4); -1.0507 - (0.7); -1.0400 - (2.0); -1.0345 - (2.1); -1.0296 - (1.0); -1.0244 - (1.0); -1.0188 - (2.0); -1.0133 - (2.1); -1.0034 - (0.8); -0.7857 - (0.9); -0.7757 - (2.1); -0.7705 - (2.2); -0.7629 - (2.1); -0.7577 - (2.1); -0.7468 - (0.7); -0.0002 - (2.0)$

30

40

50

I-114:  $^1\text{H-NMR}$  (400.2-MHz,  $-\text{d}_6\text{-DMSO}$ ): -

$\delta = 9.1561 - (1.2)$ ;  $-9.1342 - (1.2)$ ;  $-8.5558 - (5.7)$ ;  $-7.9526 - (1.1)$ ;  $-7.2089 - (0.6)$ ;  $-7.2038 - (1.4)$ ;  $-7.1952 - (1.9)$ ;  $-7.1886 - (3.4)$ ;  $-7.1824 - (0.9)$ ;  $-7.1388 - (2.3)$ ;  $-7.1259 - (0.4)$ ;  $-7.1167 - (1.2)$ ;  $-7.0573 - (0.6)$ ;  $-7.0544 - (0.6)$ ;  $-7.0369 - (1.4)$ ;  $-7.0345 - (1.4)$ ;  $-7.0169 - (0.9)$ ;  $-7.0143 - (0.9)$ ;  $-6.8693 - (0.7)$ ;  $-6.8656 - (0.9)$ ;  $-6.8492 - (1.3)$ ;  $-6.8457 - (1.4)$ ;  $-6.8292 - (0.7)$ ;  $-6.8256 - (0.7)$ ;  $-6.8053 - (0.7)$ ;  $-6.8018 - (0.7)$ ;  $-6.7855 - (1.3)$ ;  $-6.7690 - (0.6)$ ;  $-6.7657 - (0.6)$ ;  $-5.0989 - (0.7)$ ;  $-5.0848 - (0.6)$ ;  $-5.0783 - (0.5)$ ;  $-3.3363 - (12.7)$ ;  $-2.8906 - (8.0)$ ;  $-2.7318 - (6.9)$ ;  $-2.7306 - (6.9)$ ;  $-2.7048 - (1.7)$ ;  $-2.6918 - (1.0)$ ;  $-2.6759 - (0.4)$ ;  $-2.6613 - (16.0)$ ;  $-2.5249 - (0.6)$ ;  $-2.5202 - (0.8)$ ;  $-2.5115 - (10.2)$ ;  $-2.5070 - (20.4)$ ;  $-2.5024 - (26.4)$ ;  $-2.4978 - (19.0)$ ;  $-2.4932 - (9.0)$ ;  $-2.1090 - (0.5)$ ;  $-2.1007 - (0.5)$ ;  $-2.0880 - (1.0)$ ;  $-2.0752 - (0.6)$ ;  $-2.0670 - (0.5)$ ;  $-1.9260 - (0.5)$ ;  $-1.9178 - (0.4)$ ;  $-1.9123 - (0.4)$ ;  $-1.9008 - (0.8)$ ;  $-1.8882 - (0.9)$ ;  $-1.8746 - (0.5)$ ;  $-1.8698 - (0.4)$ ;  $-1.8615 - (0.5)$ ;  $-1.8565 - (0.6)$ ;  $-1.8437 - (0.4)$ ;  $-1.7303 - (0.5)$ ;  $-1.7139 - (0.8)$ ;  $-1.7032 - (0.6)$ ;  $-1.6931 - (0.8)$ ;  $-1.6688 - (0.5)$ ;  $-1.6648 - (0.5)$ ;  $-1.0363 - (0.7)$ ;  $-1.0259 - (1.9)$ ;  $-1.0203 - (1.9)$ ;  $-1.0152 - (1.0)$ ;  $-1.0105 - (1.0)$ ;  $-1.0048 - (1.9)$ ;  $-0.9992 - (1.9)$ ;  $-0.9895 - (0.8)$ ;  $-0.7760 - (0.9)$ ;  $-0.7662 - (2.0)$ ;  $-0.7612 - (2.0)$ ;  $-0.7533 - (2.0)$ ;  $-0.7480 - (1.8)$ ;  $-0.7376 - (0.7)$ ;  $-0.0002 - (2.8)$

10

20

I-115:  $^1\text{H-NMR}$  (400.1-MHz,  $-\text{CDCl}_3$ ): -

$\delta = 8.4587 - (5.0)$ ;  $-8.1978 - (1.3)$ ;  $-8.0197 - (0.4)$ ;  $-7.3650 - (2.1)$ ;  $-7.3452 - (2.5)$ ;  $-7.3259 - (1.3)$ ;  $-7.3063 - (2.6)$ ;  $-7.2864 - (1.8)$ ;  $-7.2609 - (18.4)$ ;  $-7.2069 - (2.3)$ ;  $-7.1876 - (1.6)$ ;  $-7.0433 - (4.0)$ ;  $-7.0149 - (1.9)$ ;  $-6.9958 - (1.7)$ ;  $-6.9209 - (0.6)$ ;  $-6.8750 - (1.5)$ ;  $-6.8710 - (1.5)$ ;  $-6.8550 - (1.4)$ ;  $-6.8512 - (1.3)$ ;  $-6.6941 - (1.1)$ ;  $-6.6669 - (1.2)$ ;  $-6.6502 - (1.3)$ ;  $-6.6230 - (1.4)$ ;  $-5.7415 - (2.5)$ ;  $-5.6975 - (2.3)$ ;  $-5.2952 - (2.4)$ ;  $-5.2683 - (2.4)$ ;  $-4.1430 - (1.1)$ ;  $-4.1275 - (1.1)$ ;  $-4.1053 - (2.3)$ ;  $-4.0897 - (2.2)$ ;  $-4.0677 - (1.2)$ ;  $-4.0521 - (1.2)$ ;  $-2.9571 - (2.0)$ ;  $-2.8848 - (1.9)$ ;  $-2.7721 - (16.0)$ ;  $-2.5225 - (0.6)$ ;  $-2.4751 - (8.2)$ ;  $-2.3653 - (1.2)$ ;  $-2.3137 - (11.2)$ ;  $-2.2141 - (1.3)$ ;  $-1.5723 - (9.2)$ ;  $-1.2568 - (0.5)$ ;  $-0.0695 - (3.0)$ ;  $-0.0002 - (18.8)$

30

40

50



I-116:  $^1\text{H-NMR}$  (500.1 MHz,  $-\text{d}_6\text{-DMSO}$ ): -

$\delta = 8.7903 - (1.7); -8.7716 - (1.8); -8.5264 - (4.9); -7.9568 - (0.6); -7.0430 - (1.0); -7.0261 - (2.7); -7.0214 - (2.4); -7.0052 - (2.4); -6.8948 - (1.1); -6.8797 - (1.8); -6.8641 - (0.9); -6.7939 - (1.1); -6.7799 - (1.9); -6.7577 - (6.4); -6.7424 - (1.9); -5.3187 - (1.1); -5.3116 - (1.2); -5.3003 - (1.2); -5.2933 - (1.1); -3.6583 - (1.5); -3.6096 - (0.3); -3.5873 - (0.6); -3.5701 - (16.0); -3.3141 - (6.3); -3.2854 - (15.5); -2.8944 - (3.0); -2.7842 - (0.4); -2.7673 - (0.5); -2.7522 - (0.9); -2.7356 - (3.6); -2.7224 - (0.7); -2.6607 - (14.7); -2.6419 - (1.6); -2.6303 - (0.9); -2.6206 - (0.6); -2.6086 - (0.8); -2.5973 - (0.5); -2.5047 - (4.8); -2.1579 - (0.7); -2.1438 - (0.9); -2.1309 - (1.0); -2.1179 - (1.0); -2.1099 - (1.0); -2.1040 - (1.1); -2.0934 - (1.4); -2.0834 - (1.0); -2.0770 - (0.8); -2.0665 - (0.4); -1.8601 - (0.5); -1.8465 - (0.8); -1.8329 - (0.8); -1.8191 - (0.7); -1.8054 - (0.4); -1.0406 - (0.9); -1.0317 - (2.7); -1.0280 - (2.8); -1.0151 - (2.8); -1.0115 - (2.6); -1.0033 - (1.0); -0.7815 - (1.1); -0.7705 - (3.4); -0.7630 - (3.3); -0.7606 - (3.2); -0.7510 - (1.0)$

10

I-117:  $^1\text{H-NMR}$  (400.1 MHz,  $-\text{CDCl}_3$ ): -

$\delta = 8.0410 - (0.8); -7.3886 - (1.8); -7.3686 - (2.0); -7.3109 - (1.2); -7.2911 - (2.5); -7.2712 - (1.7); -7.2594 - (14.5); -7.0629 - (2.3); -7.0349 - (1.4); -7.0150 - (1.3); -7.0018 - (1.7); -6.9830 - (2.5); -6.9779 - (2.2); -6.9631 - (1.2); -6.9610 - (1.2); -6.9573 - (1.4); -6.8997 - (1.8); -6.8950 - (2.3); -6.8902 - (1.6); -4.2119 - (0.9); -4.1962 - (0.9); -4.1746 - (2.0); -4.1589 - (2.0); -4.1483 - (0.7); -4.1372 - (1.2); -4.1304 - (1.4); -4.1216 - (1.2); -4.1125 - (1.3); -4.0947 - (0.5); -2.8803 - (16.0); -2.8453 - (0.4); -2.5040 - (6.1); -2.3235 - (8.4); -2.2770 - (0.4); -2.0436 - (4.5); -1.9251 - (0.6); -1.9165 - (0.7); -1.9041 - (1.2); -1.8914 - (0.8); -1.8830 - (0.7); -1.8703 - (0.4); -1.5467 - (2.3); -1.2764 - (1.3); -1.2586 - (2.8); -1.2407 - (1.3); -0.9891 - (0.7); -0.9775 - (1.9); -0.9727 - (2.1); -0.9613 - (1.3); -0.9563 - (2.2); -0.9517 - (2.1); -0.9404 - (1.1); -0.7192 - (0.8); -0.7076 - (2.4); -0.7034 - (2.3); -0.6953 - (2.3); -0.6911 - (2.8); -0.6790 - (1.0); -0.0694 - (1.5); -0.0078 - (0.7); --0.0002 - (18.0)$

20

30

40

50

I-118:  $^1\text{H-NMR}$  (400.2-MHz,  $-\text{d}_6\text{-DMSO}$ ): -

$\delta = 9.1417 - (0.6); -9.1259 - (1.2); -9.1101 - (0.6); -8.5853 - (6.3); -8.0612 - (1.6); -8.0552 - (1.6); -7.9578 - (0.8); -7.2945 - (1.9); -7.2744 - (2.3); -7.2668 - (2.1); -7.2602 - (2.0); -7.0872 - (2.2); -7.0005 - (1.2); -6.9809 - (1.0); -6.8758 - (0.6); -6.6611 - (0.3); -4.0073 - (0.6); -3.9913 - (0.6); -3.9686 - (1.4); -3.9527 - (1.4); -3.9299 - (0.7); -3.9141 - (0.7); -3.3441 - (35.9); -2.8957 - (5.9); -2.8841 - (2.7); -2.8652 - (5.0); -2.8461 - (2.6); -2.7524 - (0.3); -2.7362 - (4.9); -2.6716 - (16.0); -2.5300 - (1.9); -2.5251 - (3.1); -2.5165 - (35.9); -2.5121 - (69.7); -2.5075 - (89.5); -2.5029 - (64.8); -2.4985 - (31.0); -2.4032 - (5.9); -2.3389 - (0.4); -2.3344 - (0.6); -2.3298 - (0.4); -2.2595 - (8.4); -2.1883 - (1.0); -2.1235 - (0.5); -2.1046 - (1.7); -2.0855 - (2.3); -2.0670 - (1.6); -2.0481 - (0.4); -1.3691 - (0.6); -1.3600 - (7.4)$

10

I-119:  $^1\text{H-NMR}$  (300.2-MHz,  $-\text{CDCl}_3$ ): -

$\delta = 7.9963 - (0.6); -7.9708 - (0.6); -7.6935 - (2.0); -7.6727 - (1.0); -7.6472 - (1.4); -7.6223 - (1.0); -7.5963 - (2.7); -7.5737 - (4.0); -7.5638 - (1.8); -7.5519 - (0.8); -7.5371 - (2.8); -7.5125 - (0.6); -7.5011 - (0.3); -7.4953 - (0.3); -7.4832 - (0.9); -7.4745 - (1.4); -7.4671 - (0.9); -7.4524 - (0.8); -7.4454 - (0.5); -7.2999 - (5.6); -5.4369 - (0.8); -5.4125 - (1.1); -5.3878 - (0.8); -5.3372 - (4.9); -4.1703 - (0.5); -4.1464 - (0.5); -2.9326 - (16.0); -2.0826 - (2.1); -1.7385 - (6.3); -1.7152 - (6.3); -1.6262 - (0.9); -1.3204 - (1.0); -1.2967 - (2.1); -1.2729 - (0.7); -0.9415 - (0.5); -0.9196 - (1.1); -0.8965 - (0.5); -0.1089 - (0.5); -0.0376 - (4.9)$

20

I-120:  $^1\text{H-NMR}$  (400.2-MHz,  $-\text{d}_6\text{-DMSO}$ ): -

$\delta = 9.1936 - (0.6); -9.1780 - (1.3); -9.1620 - (0.6); -8.8459 - (5.7); -8.8080 - (2.9); -8.8008 - (3.0); -8.0434 - (1.6); -8.0225 - (1.8); -7.9582 - (0.9); -7.8735 - (1.4); -7.8547 - (1.6); -7.7239 - (2.4); -7.7167 - (2.4); -7.7086 - (0.9); -7.7050 - (0.8); -7.6911 - (1.2); -7.6876 - (1.7); -7.6842 - (0.9); -7.6703 - (1.1); -7.6667 - (1.0); -7.6153 - (1.1); -7.6128 - (1.2); -7.5953 - (1.6); -7.5778 - (0.7); -7.5754 - (0.7); -7.2345 - (1.9); -7.2145 - (2.2); -7.0361 - (2.4); -6.9168 - (1.3); -6.8973 - (1.1); -6.8760 - (1.1); -3.9672 - (0.6); -3.9511 - (0.6); -3.9284 - (1.4); -3.9123 - (1.4); -3.8897 - (0.7); -3.8738 - (0.7); -3.3421 - (59.0); -2.8957 - (5.9); -2.7525 - (0.6); -2.7392 - (16.0); -2.6814 - (0.5); -2.6768 - (0.7); -2.6724 - (0.5); -2.5301 - (2.3); -2.5165 - (42.6); -2.5123 - (83.6); -2.5078 - (109.0); -2.5033 - (81.1); -2.4990 - (40.8); -2.3462 - (6.3); -2.2033 - (8.8); -2.1887 - (2.0); -1.3695 - (0.9); -1.3604 - (12.0)$

30

40

50

I-121:  $^1\text{H-NMR}$  (400.1 MHz,  $-\text{CDCl}_3$ ):  $-\$

$\delta = 7.9027 - (0.6); -7.8888 - (1.2); -7.8734 - (0.7); -7.5700 - (0.6); -7.5507 - (2.2); -7.5310 - (5.8); -7.5270 - (3.2); -7.5126 - (0.9); -7.4828 - (3.2); -7.4401 - (0.4); -7.4307 - (1.4); -7.4254 - (2.4); -7.4202 - (1.5); -7.4140 - (1.0); -7.4076 - (1.6); -7.4024 - (1.0); -7.3901 - (3.0); -7.3703 - (3.4); -7.3095 - (0.4); -7.2593 - (23.2); -7.2097 - (0.4); -7.0719 - (3.4); -7.0585 - (2.1); -7.0380 - (1.7); -5.2980 - (16.0); -4.1972 - (1.5); -4.1815 - (1.4); -4.1604 - (3.3); -4.1446 - (3.2); -4.1235 - (1.8); -4.1078 - (1.7); -2.5350 - (0.5); -2.5223 - (1.0); -2.5033 - (10.7); -2.4985 - (6.2); -2.4901 - (1.9); -2.4826 - (1.6); -2.4701 - (1.0); -2.4555 - (0.5); -2.3925 - (0.4); -2.3803 - (0.4); -2.3643 - (0.3); -2.3471 - (1.0); -2.3301 - (13.1); -2.3056 - (0.7); -2.2989 - (1.1); -2.2817 - (0.5); -1.5429 - (9.2); -1.2681 - (0.9); -1.2536 - (2.9); -1.2469 - (3.5); -1.2429 - (2.3); -1.2402 - (2.4); -1.2328 - (2.1); -1.2258 - (4.0); -1.2200 - (4.1); -1.2133 - (3.7); -1.2066 - (4.3); -1.2017 - (4.2); -1.1945 - (2.5); -1.1790 - (0.9); -1.1704 - (0.5); -1.1418 - (0.4); -1.1301 - (0.4); -0.0696 - (5.7); -0.0499 - (0.5); -0.0080 - (0.9); -0.0002 - (32.0); --0.0084 - (1.6); --0.0499 - (0.5)$

10

20

I-122:  $^1\text{H-NMR}$  (400.2 MHz,  $-\text{d}_6\text{-DMSO}$ ):  $-\$

$\delta = 9.1522 - (0.6); -9.1368 - (1.3); -9.1207 - (0.6); -8.7669 - (1.6); -8.7649 - (1.8); -8.7609 - (1.8); -8.6809 - (7.2); -7.7019 - (1.0); -7.6985 - (1.0); -7.6969 - (1.0); -7.6833 - (1.2); -7.6813 - (1.3); -7.6782 - (1.4); -7.6764 - (1.2); -7.5591 - (1.7); -7.5383 - (4.6); -7.5325 - (3.0); -7.5269 - (1.6); -7.5181 - (1.5); -7.2662 - (1.9); -7.2463 - (2.2); -7.0727 - (2.5); -7.0660 - (2.9); -7.0590 - (2.3); -7.0224 - (1.2); -7.0206 - (1.3); -7.0163 - (1.2); -7.0147 - (1.2); -7.0018 - (1.1); -6.9999 - (1.1); -6.9958 - (1.2); -6.9940 - (1.0); -6.9683 - (1.2); -6.9487 - (1.0); -4.0028 - (0.6); -3.9867 - (0.6); -3.9644 - (1.4); -3.9484 - (1.3); -3.9261 - (0.7); -3.9098 - (0.6); -3.3399 - (98.9); -2.8960 - (0.5); -2.7368 - (0.4); -2.7016 - (16.0); -2.6858 - (0.4); -2.6812 - (0.7); -2.6766 - (0.9); -2.6721 - (0.7); -2.5302 - (3.0); -2.5255 - (4.8); -2.5167 - (55.1); -2.5123 - (108.7); -2.5077 - (141.2); -2.5030 - (102.5); -2.4985 - (49.2); -2.3766 - (5.8); -2.3437 - (0.3); -2.3390 - (0.7); -2.3345 - (0.9); -2.3299 - (0.6); -2.2227 - (8.2); -2.1886 - (0.3); -1.3696 - (0.5); -1.3602 - (2.4)$

30

40

50

I-123:  $^1\text{H-NMR}$  (400.2-MHz,  $-\text{d}_6\text{-DMSO}$ ): -

$\delta = 8.5700 - (0.4); -8.5486 - (5.1); -7.3418 - (1.9); -7.3359 - (1.7); -7.3221 - (3.0); -7.3177 - (2.9); -7.3055 - (0.7); -7.2944 - (1.2); -7.2909 - (1.0); -7.2830 - (3.4); -7.2772 - (2.4); -7.2699 - (4.3); -7.2651 - (3.6); -7.2588 - (0.8); -7.2544 - (0.4); -7.0658 - (0.8); -7.0437 - (1.7); -7.0254 - (1.0); -7.0232 - (1.0); -6.8400 - (1.1); -6.8232 - (1.9); -6.8204 - (2.0); -6.8083 - (1.6); -6.8045 - (1.3); -6.8002 - (1.0); -6.7915 - (0.8); -4.9487 - (6.8); -4.6303 - (0.6); -3.9273 - (1.0); -3.9097 - (3.2); -3.8920 - (3.2); -3.8744 - (1.0); -3.3386 - (13.0); -3.3359 - (15.0); -2.8900 - (0.4); -2.6616 - (16.0); -2.5252 - (0.6); -2.5205 - (1.0); -2.5118 - (12.9); -2.5073 - (25.9); -2.5028 - (33.9); -2.4982 - (24.7); -2.4937 - (11.9); -2.1200 - (0.5); -2.1118 - (0.6); -2.0990 - (1.1); -2.0863 - (0.7); -2.0783 - (0.6); -2.0651 - (0.3); -1.0623 - (0.6); -1.0534 - (0.9); -1.0424 - (2.4); -1.0369 - (2.4); -1.0325 - (1.4); -1.0267 - (1.4); -1.0213 - (2.3); -1.0158 - (2.3); -1.0057 - (1.0); -0.8280 - (3.6); -0.8104 - (7.8); -0.7925 - (4.0); -0.7808 - (2.5); -0.7758 - (2.6); -0.7681 - (2.6); -0.7631 - (2.7); -0.7519 - (1.0); -0.0002 - (2.8)$

10

20

I-124:  $^1\text{H-NMR}$  (400.2-MHz,  $-\text{d}_6\text{-DMSO}$ ): -

$\delta = 8.7866 - (0.4); -8.7718 - (0.9); -8.7575 - (0.5); -8.5409 - (4.9); -7.0423 - (0.5); -7.0393 - (0.6); -7.0195 - (1.2); -7.0019 - (0.7); -6.9990 - (0.8); -6.8048 - (2.5); -6.8007 - (2.8); -6.7957 - (1.0); -6.7875 - (0.9); -6.7835 - (0.6); -6.7756 - (1.7); -6.7712 - (3.3); -6.7590 - (0.6); -6.7515 - (3.9); -6.6639 - (1.5); -6.6598 - (1.4); -6.6441 - (1.0); -6.6400 - (1.0); -5.9386 - (12.1); -3.3835 - (0.7); -3.3671 - (1.3); -3.3472 - (1.4); -3.3307 - (20.4); -2.8904 - (1.7); -2.7314 - (1.4); -2.7303 - (1.4); -2.6761 - (1.6); -2.6576 - (16.0); -2.6396 - (1.2); -2.5246 - (1.1); -2.5199 - (1.6); -2.5112 - (19.1); -2.5067 - (38.6); -2.5021 - (50.6); -2.4975 - (36.6); -2.4930 - (17.5); -2.0991 - (0.4); -2.0910 - (0.4); -2.0783 - (0.8); -2.0655 - (0.5); -2.0570 - (0.4); -1.0310 - (0.6); -1.0201 - (1.7); -1.0146 - (1.8); -1.0100 - (0.9); -1.0044 - (0.9); -0.9990 - (1.7); -0.9935 - (1.7); -0.9833 - (0.7); -0.7703 - (0.8); -0.7601 - (1.8); -0.7572 - (1.5); -0.7548 - (1.9); -0.7472 - (1.8); -0.7420 - (1.9); -0.7309 - (0.6); -0.0002 - (6.8)$

30

40

50

I-125:  $^1\text{H-NMR}$  (400.2-MHz,  $-\text{d}_6\text{-DMSO}$ ): -

$\delta = 9.3011 - (1.2); -9.2798 - (1.2); -8.5944 - (5.8); -7.9527 - (1.2); -7.1626 - (1.1); -7.1487 - (1.2); -7.1412 - (1.5); -7.1272 - (1.6); -7.0526 - (0.7); -7.0458 - (1.4); -7.0316 - (1.1); -7.0244 - (3.0); -7.0166 - (1.4); -7.0073 - (1.4); -7.0037 - (1.7); -6.9916 - (1.3); -6.9845 - (0.8); -6.8375 - (0.7); -6.8338 - (0.9); -6.8173 - (1.3); -6.8139 - (1.4); -6.7974 - (1.4); -6.7938 - (1.3); -6.7779 - (1.2); -6.7614 - (0.7); -6.7582 - (0.5); -5.1470 - (0.4); -5.1348 - (0.4); -5.1273 - (0.7); -5.1153 - (0.6); -5.1076 - (0.5); -5.0956 - (0.4); -3.3354 - (15.0); -3.0808 - (0.8); -3.0701 - (1.4); -3.0622 - (1.4); -3.0597 - (1.4); -3.0511 - (1.5); -3.0406 - (0.9); -2.8906 - (8.9); -2.7319 - (7.5); -2.7306 - (7.4); -2.6663 - (16.0); -2.5249 - (0.5); -2.5201 - (0.7); -2.5115 - (9.6); -2.5070 - (19.4); -2.5024 - (25.4); -2.4977 - (18.3); -2.4932 - (8.6); -2.1201 - (0.3); -2.1060 - (0.8); -2.0941 - (1.0); -2.0857 - (1.5); -2.0747 - (1.3); -2.0643 - (1.2); -2.0575 - (0.7); -2.0512 - (0.5); -2.0465 - (0.8); -2.0391 - (0.4); -2.0281 - (0.4); -1.0386 - (0.6); -1.0281 - (2.0); -1.0225 - (2.0); -1.0175 - (0.9); -1.0126 - (1.0); -1.0070 - (2.0); -1.0014 - (2.0); -0.9916 - (0.8); -0.7796 - (0.9); -0.7698 - (2.0); -0.7646 - (1.9); -0.7569 - (2.0); -0.7516 - (1.8); -0.7411 - (0.7); -0.0002 - (2.4)$

10

20

I-126:  $^1\text{H-NMR}$  (400.1-MHz,  $-\text{CDCl}_3$ ): -

$\delta = 8.4631 - (4.6); -8.1747 - (1.0); -7.3638 - (2.0); -7.3440 - (2.2); -7.2584 - (8.0); -7.2378 - (2.6); -7.2177 - (1.5); -7.0358 - (3.7); -7.0157 - (2.4); -7.0001 - (1.5); -6.8895 - (2.6); -6.7049 - (1.4); -6.6997 - (1.4); -6.6845 - (1.3); -6.6794 - (1.2); -4.1334 - (1.0); -4.1178 - (1.0); -4.0959 - (2.2); -4.0802 - (2.1); -4.0583 - (1.2); -4.0427 - (1.0); -2.9518 - (1.5); -2.8809 - (1.4); -2.7699 - (14.6); -2.4732 - (7.6); -2.4526 - (16.0); -2.4311 - (0.6); -2.3162 - (10.4); -1.9989 - (9.6); -1.5529 - (10.2); -0.0002 - (3.8)$

30

40

50

I-127:  $^1\text{H-NMR}$  (400.2-MHz,  $-\text{d}_6\text{-DMSO}$ ): -

$\delta = 9.0479 - (0.5); -9.0330 - (1.1); -9.0182 - (0.5); -8.5272 - (5.3); -7.9526 - (0.7); -7.6721 - (1.9); -7.6676 - (2.0); -7.6221 - (1.8); -7.6015 - (2.1); -7.3987 - (1.1); -7.3941 - (1.1); -7.3778 - (0.9); -7.3732 - (0.9); -7.0447 - (0.6); -7.0416 - (0.6); -7.0219 - (1.3); -7.0043 - (0.8); -7.0015 - (0.8); -6.8071 - (0.5); -6.8035 - (1.0); -6.7952 - (0.9); -6.7914 - (0.6); -6.7835 - (1.7); -6.7781 - (1.2); -6.7669 - (0.6); -6.7631 - (0.9); -6.7591 - (0.8); -5.7424 - (0.4); -5.7318 - (0.5); -5.7258 - (0.4); -5.7150 - (0.4); -5.6245 - (0.4); -5.6143 - (0.5); -5.6074 - (0.4); -5.5969 - (0.4); -3.7602 - (0.4); -3.7435 - (0.6); -3.7278 - (0.5); -3.7227 - (0.4); -3.7108 - (0.7); -3.6956 - (0.6); -3.6771 - (0.4); -3.6598 - (0.4); -3.6487 - (0.3); -3.6450 - (0.4); -3.6343 - (0.3); -3.3303 - (136.7); -2.8902 - (5.9); -2.7313 - (4.7); -2.7300 - (5.0); -2.6800 - (0.6); -2.6753 - (1.4); -2.6678 - (16.0); -2.5245 - (4.2); -2.5198 - (6.2); -2.5110 - (76.0); -2.5065 - (154.0); -2.5019 - (202.6); -2.4973 - (146.2); -2.4927 - (69.5); -2.3378 - (0.4); -2.3333 - (0.9); -2.3287 - (1.2); -2.3242 - (0.9); -2.3196 - (0.4); -2.0975 - (0.4); -2.0896 - (0.5); -2.0766 - (0.9); -2.0640 - (0.5); -2.0557 - (0.5); -1.0334 - (0.6); -1.0225 - (1.8); -1.0170 - (1.9); -1.0123 - (0.9); -1.0068 - (0.9); -1.0013 - (1.8); -0.9958 - (1.9); -0.9857 - (0.7); -0.7738 - (0.8); -0.7636 - (1.9); -0.7583 - (2.0); -0.7508 - (1.9); -0.7455 - (2.0); -0.7345 - (0.6); -0.0081 - (0.8); -0.0002 - (27.0); -0.0085 - (0.8)$

I-128:  $^1\text{H-NMR}$  (400.2-MHz,  $-\text{d}_6\text{-DMSO}$ ): -

$\delta = 9.1060 - (0.6); -9.0905 - (1.3); -9.0749 - (0.6); -8.3579 - (6.5); -7.3211 - (2.1); -7.3011 - (2.4); -7.0982 - (2.6); -7.0193 - (1.4); -6.9990 - (1.3); -6.9862 - (2.1); -6.9805 - (2.3); -6.8763 - (0.4); -6.8656 - (0.4); -6.8207 - (0.8); -6.8142 - (0.7); -6.7991 - (1.9); -6.7928 - (1.9); -6.7681 - (4.0); -6.7467 - (1.6); -6.7038 - (0.8); -6.6953 - (0.5); -6.6893 - (0.4); -4.5678 - (2.0); -4.5460 - (4.3); -4.5243 - (2.2); -4.5079 - (1.1); -4.4861 - (0.6); -4.0312 - (0.7); -4.0152 - (0.7); -3.9925 - (1.6); -3.9766 - (1.5); -3.9539 - (0.8); -3.9380 - (0.7); -3.3421 - (50.9); -3.1960 - (1.6); -3.1742 - (3.1); -3.1523 - (1.6); -3.1247 - (0.4); -2.8962 - (1.3); -2.7367 - (1.1); -2.6816 - (0.4); -2.6771 - (0.5); -2.6724 - (0.4); -2.6280 - (16.0); -2.5304 - (1.8); -2.5167 - (32.0); -2.5126 - (62.2); -2.5082 - (80.9); -2.5037 - (61.9); -2.4248 - (6.7); -2.3393 - (0.4); -2.3350 - (0.5); -2.3308 - (0.4); -2.2675 - (9.4); -2.1890 - (0.6); -1.3699 - (0.4); -1.3608 - (3.7); -1.2418 - (0.4)$

10

20

30

40

50

I-129:  $^1\text{H-NMR}$  (400.2-MHz,  $-\text{d}_6\text{-DMSO}$ ): -

$\delta = 9.1243 - (0.7); -9.1089 - (1.4); -9.0928 - (0.6); -8.6353 - (6.4); -7.9578 - (0.6); -7.4462 - (1.4); -7.4235 - (3.0); -7.4009 - (1.6); -7.2956 - (1.7); -7.2881 - (3.7); -7.2804 - (1.8); -7.2726 - (2.1); -7.2681 - (2.5); -7.0848 - (2.5); -7.0607 - (1.0); -7.0518 - (1.3); -7.0434 - (1.0); -7.0380 - (0.9); -7.0295 - (1.2); -7.0208 - (0.8); -6.9997 - (1.4); -6.9795 - (1.2); -4.0084 - (0.7); -3.9925 - (0.7); -3.9700 - (1.6); -3.9540 - (1.5); -3.9315 - (0.8); -3.9154 - (0.7); -3.3412 - (18.1); -2.8955 - (3.8); -2.7364 - (3.4); -2.6815 - (16.0); -2.5163 - (13.1); -2.5122 - (23.9); -2.5077 - (30.1); -2.5032 - (22.1); -2.4993 - (11.1); -2.3991 - (6.6); -2.2638 - (9.2); -1.3607 - (1.2)$

10

I-130:  $^1\text{H-NMR}$  (400.1-MHz,  $-\text{CDCl}_3$ ): -

$\delta = 7.8519 - (1.6); -7.8361 - (1.1); -7.5672 - (0.9); -7.5478 - (2.7); -7.5283 - (6.9); -7.5241 - (4.8); -7.5201 - (5.2); -7.4997 - (4.6); -7.4735 - (4.0); -7.4427 - (0.6); -7.4249 - (1.8); -7.4200 - (2.8); -7.4149 - (1.8); -7.4022 - (2.0); -7.3517 - (0.4); -7.3011 - (4.4); -7.2597 - (19.9); -7.2099 - (0.5); -7.1442 - (2.4); -7.1247 - (2.2); -5.2982 - (2.7); -4.3842 - (1.8); -4.3682 - (1.8); -4.3476 - (3.8); -4.3316 - (3.7); -4.3109 - (2.0); -4.2949 - (2.0); -2.5314 - (0.5); -2.5191 - (1.1); -2.5114 - (1.3); -2.5077 - (1.0); -2.4991 - (2.1); -2.4867 - (1.4); -2.4790 - (1.3); -2.4667 - (0.7); -2.4094 - (0.4); -2.3583 - (16.0); -2.3179 - (0.7); -2.0435 - (0.4); -1.5431 - (4.1); -1.2640 - (1.4); -1.2500 - (3.1); -1.2437 - (4.4); -1.2364 - (3.7); -1.2294 - (3.0); -1.2226 - (4.3); -1.2165 - (3.3); -1.2091 - (3.7); -1.2020 - (4.3); -1.1958 - (5.2); -1.1904 - (4.7); -1.1835 - (3.4); -1.1692 - (1.3); -1.1214 - (0.4); -1.1048 - (0.4); -0.0504 - (0.3); -0.0079 - (1.2); -0.0002 - (29.8); -0.0499 - (0.6)$

20

I-131:  $^1\text{H-NMR}$  (400.1-MHz,  $-\text{CDCl}_3$ ): -

$\delta = 7.9082 - (0.8); -7.8933 - (1.5); -7.8792 - (0.9); -7.3891 - (3.5); -7.3693 - (4.0); -7.3418 - (1.4); -7.3377 - (1.6); -7.3257 - (1.6); -7.3215 - (3.1); -7.3174 - (2.1); -7.3056 - (1.8); -7.3013 - (1.9); -7.2593 - (15.4); -7.2456 - (1.6); -7.2415 - (1.6); -7.2290 - (1.5); -7.2249 - (3.2); -7.2209 - (2.1); -7.2085 - (2.4); -7.2042 - (2.0); -7.1531 - (2.3); -7.1491 - (2.3); -7.1327 - (3.0); -7.1286 - (3.2); -7.1123 - (1.3); -7.1081 - (1.4); -7.0684 - (4.2); -7.0554 - (2.6); -7.0345 - (2.2); -5.2974 - (1.7); -4.2010 - (1.8); -4.1852 - (1.8); -4.1643 - (4.0); -4.1485 - (3.9); -4.1276 - (2.1); -4.1118 - (2.0); -2.5283 - (0.7); -2.5045 - (12.6); -2.4990 - (7.6); -2.4893 - (2.0); -2.4830 - (2.0); -2.4758 - (1.7); -2.4632 - (1.0); -2.3773 - (0.4); -2.3549 - (0.3); -2.3272 - (16.0); -2.2958 - (0.5); -2.2771 - (0.5); -2.0035 - (0.9); -1.5521 - (2.5); -1.2708 - (0.3); -1.2628 - (0.8); -1.2547 - (0.8); -1.2475 - (2.4); -1.2409 - (4.3); -1.2350 - (3.0); -1.2270 - (2.6); -1.2198 - (6.7); -1.2149 - (5.7); -1.2060 - (5.3); -1.2013 - (5.6); -1.1944 - (2.9); -1.1780 - (0.8); -1.1520 - (0.4); -1.1452 - (0.3); -0.0079 - (0.7); -0.0002 - (19.9); -0.0084 - (1.3); -0.0502 - (0.4)$

30

40

I-132:  $^1\text{H-NMR}$  (400.1-MHz,  $-\text{CDCl}_3$ ): -

$\delta = 8.8814 - (1.1)$ ;  $-8.8543 - (1.1)$ ;  $-7.4113 - (2.3)$ ;  $-7.3912 - (3.2)$ ;  $-7.3134 - (5.9)$ ;  $-7.3088 - (6.2)$ ;  $-7.3034 - (4.3)$ ;  $-7.3009 - (4.4)$ ;  $-7.2905 - (5.7)$ ;  $-7.2856 - (4.5)$ ;  $-7.2802 - (6.5)$ ;  $-7.2700 - (3.7)$ ;  $-7.2597 - (23.4)$ ;  $-7.2101 - (0.4)$ ;  $-7.1538 - (5.0)$ ;  $-7.1124 - (2.7)$ ;  $-7.1071 - (2.6)$ ;  $-7.0919 - (2.3)$ ;  $-7.0857 - (3.3)$ ;  $-7.0815 - (3.0)$ ;  $-7.0616 - (2.4)$ ;  $-2.4681 - (0.6)$ ;  $-2.4562 - (1.3)$ ;  $-2.4474 - (1.5)$ ;  $-2.4356 - (2.6)$ ;  $-2.4237 - (1.8)$ ;  $-2.4152 - (1.8)$ ;  $-2.4028 - (0.9)$ ;  $-2.3664 - (16.0)$ ;  $-2.3574 - (14.4)$ ;  $-2.3508 - (14.4)$ ;  $-2.3165 - (0.5)$ ;  $-2.3014 - (0.4)$ ;  $-2.0043 - (0.9)$ ;  $-1.5490 - (5.5)$ ;  $-1.2550 - (1.5)$ ;  $-1.1653 - (1.2)$ ;  $-1.1543 - (3.7)$ ;  $-1.1473 - (4.4)$ ;  $-1.1339 - (4.0)$ ;  $-1.1270 - (4.1)$ ;  $-1.1169 - (1.7)$ ;  $-1.1002 - (0.3)$ ;  $-0.9528 - (1.6)$ ;  $-0.9426 - (4.6)$ ;  $-0.9362 - (4.5)$ ;  $-0.9311 - (4.6)$ ;  $-0.9245 - (4.9)$ ;  $-0.9132 - (1.3)$ ;  $-0.0500 - (0.4)$ ;  $-0.0078 - (0.8)$ ;  $-0.0002 - (24.9)$ ;  $-0.0498 - (0.4)$

10

I-134:  $^1\text{H-NMR}$  (400.2-MHz,  $-\text{d}_6\text{-DMSO}$ ): -

$\delta = 8.8641 - (0.6)$ ;  $-8.8496 - (1.2)$ ;  $-8.8350 - (0.6)$ ;  $-8.5732 - (5.7)$ ;  $-7.0333 - (0.6)$ ;  $-7.0306 - (0.7)$ ;  $-7.0108 - (1.5)$ ;  $-6.9931 - (0.9)$ ;  $-6.9904 - (0.9)$ ;  $-6.8710 - (3.9)$ ;  $-6.7892 - (1.0)$ ;  $-6.7782 - (1.0)$ ;  $-6.7727 - (1.5)$ ;  $-6.7692 - (1.8)$ ;  $-6.7590 - (1.4)$ ;  $-6.7489 - (0.9)$ ;  $-6.7422 - (0.8)$ ;  $-3.3910 - (0.9)$ ;  $-3.3743 - (1.5)$ ;  $-3.3540 - (1.6)$ ;  $-3.3355 - (14.2)$ ;  $-2.8906 - (2.1)$ ;  $-2.7317 - (1.8)$ ;  $-2.6667 - (16.0)$ ;  $-2.6133 - (1.6)$ ;  $-2.5940 - (2.2)$ ;  $-2.5755 - (1.4)$ ;  $-2.5250 - (0.6)$ ;  $-2.5202 - (0.8)$ ;  $-2.5116 - (10.3)$ ;  $-2.5072 - (20.5)$ ;  $-2.5026 - (26.8)$ ;  $-2.4980 - (19.4)$ ;  $-2.4935 - (9.3)$ ;  $-2.2751 - (11.2)$ ;  $-2.0964 - (0.5)$ ;  $-2.0882 - (0.6)$ ;  $-2.0755 - (1.0)$ ;  $-2.0627 - (0.6)$ ;  $-2.0544 - (0.6)$ ;  $-2.0003 - (11.3)$ ;  $-1.0287 - (0.7)$ ;  $-1.0178 - (2.1)$ ;  $-1.0123 - (2.2)$ ;  $-1.0077 - (1.0)$ ;  $-1.0021 - (1.1)$ ;  $-0.9967 - (2.1)$ ;  $-0.9912 - (2.1)$ ;  $-0.9810 - (0.8)$ ;  $-0.7663 - (0.9)$ ;  $-0.7560 - (2.2)$ ;  $-0.7509 - (2.3)$ ;  $-0.7433 - (2.2)$ ;  $-0.7381 - (2.3)$ ;  $-0.7269 - (0.7)$ ;  $-0.0002 - (1.9)$

20

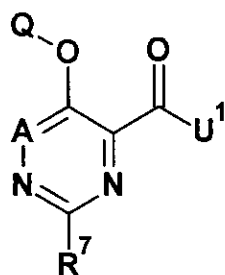
30

【 0 3 9 7 】

表 3 式 ( 1 ) に係る化合物

【 0 3 9 8 】

【 化 1 8 】



( 1 )

40

【 0 3 9 9 】

50



【表 4】

実施例番号	A	R <sup>7</sup>	Q	U <sup>1</sup>	Log P
1-01	CH	メチル	3-(トリフルオロメチル)フェニル	ヒドロキシ	1.69 [a]
1-02	N	メチル	3-(トリフルオロメチル)フェニル	エトキシ	3.18 [a]
1-03	CH	シクロプロピル	3-(トリフルオロメチル)フェニル	ヒドロキシ	2.49 [a]
1-04	CH	メトキシ	3-(トリフルオロメチル)フェニル	ヒドロキシ	1.96 [a]
1-05	N	シクロプロピル	3-(トリフルオロメチル)フェニル	エトキシ	3.95 [a]
1-06	N	シクロプロピル	3-クロロ-2-フルオロフェニル	エトキシ	3.86 [a]
1-07	N	シクロプロピル	3-ブromo-2-フルオロフェニル	エトキシ	3.93 [a]
1-08	N	シクロプロピル	3-シクロプロピル-2-フルオロフェニル	エトキシ	4.19 [a]
1-09	N	シクロプロピル	2-フルオロ-3-メチルフェニル	エトキシ	3.78 [a]
1-10	N	シクロプロピル	3-ブromoフェニル	エトキシ	3.94 [a]
1-11	N	シクロプロピル	3-エチルフェニル	エトキシ	3.59 [a]
1-12	N	シクロプロピル	3-メトキシフェニル	エトキシ	3.37 [a]

10

20

30

40

実施例番号	A	R <sup>7</sup>	Q	U <sup>1</sup>	Log P
1-13	CH	フルオロ	3-(トリフルオロメチル)フェニル	ヒドロキシ	1.52 [a]

50

【 0 4 0 0 】

【 表 5 】

表 4 式 (1) の化合物の<sup>1</sup>H-NMR

<p>1-01: <sup>1</sup>H-NMR (300.2-MHz, -CDCl<sub>3</sub>): -</p> <p>δ = 8.6429 - (5.5); -7.5904 - (0.6); -7.5646 - (1.8); -7.5384 - (1.6); -7.5149 - (2.1); -7.4891 - (0.9); -7.3041 - (48.7); -7.2543 - (1.3); -7.2302 - (1.1); -5.3438 - (0.6); -2.8770 - (16.0); -1.8227 - (0.5); -1.7542 - (0.6); -1.7206 - (0.6); -1.6818 - (0.6); -1.6615 - (0.6); -1.4810 - (0.4); -1.2972 - (1.1); -0.0530 - (1.4); -0.0423 - (41.8); -0.0313 - (1.4)</p>	10
<p>1-02: <sup>1</sup>H-NMR (300.2-MHz, -CDCl<sub>3</sub>): -</p> <p>δ = 7.6179 - (1.0); -7.5959 - (3.3); -7.5740 - (0.3); -7.5511 - (1.4); -7.5010 - (0.6); -7.4921 - (1.1); -7.4847 - (0.7); -7.4776 - (0.4); -7.4698 - (0.6); -7.4626 - (0.4); -7.2998 - (6.8); -5.3386 - (0.6); -4.6189 - (1.2); -4.5951 - (3.8); -4.5714 - (3.8); -4.5476 - (1.2); -2.9374 - (16.0); -1.5943 - (6.7); -1.5193 - (3.9); -1.4955 - (8.0); -1.4717 - (3.8); -0.1078 - (1.8); -0.0377 - (6.8)</p>	
<p>1-03: <sup>1</sup>H-NMR (500.1-MHz, -d<sub>6</sub>-DMSO): -</p> <p>δ = 8.7173 - (16.0); -7.6068 - (2.4); -7.5908 - (5.5); -7.5746 - (3.6); -7.4986 - (5.0); -7.4831 - (3.7); -7.3759 - (6.5); -7.2830 - (3.6); -7.2786 - (3.4); -7.2665 - (3.3); -7.2621 - (3.0); -5.7533 - (10.0); -3.3171 - (4.3); -2.5006 - (40.2); -2.3175 - (0.8); -2.3082 - (1.8); -2.3008 - (2.2); -2.2920 - (3.6); -2.2830 - (2.2); -2.2760 - (1.9); -2.2664 - (0.9); -1.2356 - (1.3); -1.1240 - (1.6); -1.1157 - (4.3); -1.1097 - (6.7); -1.1028 - (4.3); -1.0997 - (4.3); -1.0938 - (6.0); -1.0876 - (2.6); -1.0735 - (0.7); -1.0587 - (0.6); -1.0430 - (2.7); -1.0364 - (6.6); -1.0278 - (7.7); -1.0222 - (5.5); -1.0135 - (1.7); -0.0002 - (26.6)</p>	20

30

40

50

1-04:  $^1\text{H-NMR}$  (300.2-MHz,  $-\text{CDCl}_3$ ):  $-\$

$\delta = 15.4847 - (0.3); -13.2943 - (0.3); -12.3921 - (0.4); -10.8096 - (0.3); -$   
 $8.9120 - (0.5); -8.6237 - (2.8); -8.1726 - (0.4); -7.6448 - (1.0); -7.5960 -$   
 $(0.3); -7.5382 - (1.7); -7.5133 - (3.6); -7.4872 - (2.8); -7.4449 - (4.9); -$   
 $7.4208 - (2.8); -7.3913 - (1.2); -7.3655 - (2.0); -7.2989 - (135.4); -7.2634 -$   
 $(0.5); -7.2209 - (4.9); -7.1853 - (2.4); -7.1559 - (2.1); -7.1192 - (0.8); -$   
 $7.0599 - (0.6); -7.0336 - (0.6); -7.0187 - (1.1); -6.9479 - (0.8); -5.8347 -$   
 $(0.6); -5.3820 - (0.4); -5.0492 - (0.3); -4.2613 - (0.4); -4.2431 - (0.6); -$   
 $4.2281 - (0.5); -4.1682 - (16.0); -4.1362 - (2.5); -4.1011 - (1.2); -4.0832 -$   
 $(0.5); -3.7169 - (0.4); -3.6701 - (0.4); -3.5852 - (0.3); -3.5347 - (0.3); -$   
 $3.4388 - (0.4); -3.4275 - (0.3); -3.2217 - (0.3); -3.1436 - (0.3); -3.0824 -$   
 $(0.4); -3.0345 - (0.4); -3.0018 - (0.3); -2.8926 - (0.4); -2.8315 - (0.6); -$   
 $2.8012 - (0.4); -2.7486 - (0.4); -2.6987 - (0.5); -2.6436 - (0.6); -2.6299 -$   
 $(0.6); -2.5905 - (0.4); -2.5611 - (0.4); -2.5455 - (0.4); -2.5151 - (0.5); -$   
 $2.4644 - (0.5); -2.3938 - (0.6); -2.3102 - (1.9); -2.2916 - (0.6); -2.2668 -$   
 $(0.6); -2.2161 - (0.4); -2.1835 - (0.4); -2.1624 - (0.4); -2.1432 - (0.5); -$   
 $2.1318 - (0.4); -2.1197 - (0.4); -2.0847 - (2.4); -2.0588 - (0.5); -1.7147 -$   
 $(0.4); -1.6831 - (0.5); -1.6398 - (0.5); -1.6115 - (0.4); -1.5998 - (0.4); -$   
 $1.5517 - (0.4); -1.5237 - (0.4); -1.4699 - (14.4); -1.3313 - (2.3); -1.3214 -$   
 $(3.0); -1.3156 - (2.8); -1.2919 - (9.9); -1.2741 - (1.8); -1.2179 - (0.4); -$   
 $1.1918 - (0.5); -1.1415 - (0.5); -0.9180 - (2.0); -0.8929 - (1.3); -0.8638 -$   
 $(0.8); -0.2332 - (0.7); -0.1727 - (0.6); -0.1069 - (103.8); -0.0610 - (0.7); -$   
 $0.0481 - (5.8); -0.0373 - (178.4); -0.0264 - (7.6); -0.0163 - (0.5); -0.0306 -$   
 $(0.6); -0.0479 - (0.4); -0.0909 - (0.4); -0.1614 - (0.9); -3.0345 -$   
 $(0.4); -3.2471 - (0.3); -3.3909 - (0.3); -3.4700 - (0.4); -3.5030 - (0.4); -$   
 $-3.5679 - (0.3); -3.6452 - (0.3); -3.6858 - (0.3); -3.7823 - (0.4); -$   
 $3.8721 - (0.4)$

10

20

30

40

50

1-06:  $^1\text{H-NMR}$  (400.1-MHz, - $\text{CDCl}_3$ ): -

$\delta = 7.3499 - (2.3); -7.3458 - (2.7); -7.3338 - (2.6); -7.3296 - (5.4); -7.3254 - (3.7); -7.3136 - (3.1); -7.3094 - (3.6); -7.2947 - (0.4); -7.2781 - (0.4); -7.2603 - (28.0); -7.2487 - (3.1); -7.2446 - (3.0); -7.2322 - (2.7); -7.2280 - (5.9); -7.2239 - (3.9); -7.2116 - (4.2); -7.2073 - (3.8); -7.1838 - (0.5); -7.1582 - (4.0); -7.1541 - (4.2); -7.1378 - (5.3); -7.1336 - (5.8); -7.1174 - (2.3); -7.1131 - (2.5); -6.9417 - (0.3); -5.2987 - (0.4); -4.5535 - (5.0); -4.5356 - (15.6); -4.5178 - (16.0); -4.5000 - (5.6); -4.4679 - (0.4); -2.5166 - (1.1); -2.5041 - (2.2); -2.4964 - (2.5); -2.4842 - (4.2); -2.4756 - (1.9); -2.4715 - (2.7); -2.4640 - (2.7); -2.4515 - (1.4); -1.5948 - (0.4); -1.5446 - (29.3); -1.5156 - (0.7); -1.5060 - (0.4); -1.4979 - (0.8); -1.4948 - (0.7); -1.4799 - (0.6); -1.4655 - (16.2); -1.4477 - (32.9); -1.4298 - (16.6); -1.4201 - (1.8); -1.3979 - (0.9); -1.3798 - (0.5); -1.3040 - (0.5); -1.2868 - (0.8); -1.2688 - (0.9); -1.2519 - (2.1); -1.2375 - (5.1); -1.2305 - (8.3); -1.2249 - (9.1); -1.2186 - (8.2); -1.2120 - (6.4); -1.2055 - (5.6); -1.1994 - (8.2); -1.1927 - (5.5); -1.1854 - (6.8); -1.1783 - (8.2); -1.1722 - (5.7); -1.1578 - (2.3); -0.8802 - (0.4); -0.0779 - (0.4); -0.0694 - (9.7); -0.0603 - (0.6); -0.0499 - (0.6); -0.0079 - (1.3); -0.0002 - (36.6); -0.0084 - (2.3); -0.0501 - (0.6)$

10

20

1-07:  $^1\text{H-NMR}$  (400.1-MHz, - $\text{CDCl}_3$ ): -

$\delta = 7.4938 - (2.6); -7.4900 - (2.8); -7.4789 - (2.8); -7.4738 - (4.1); -7.4695 - (3.2); -7.4585 - (3.1); -7.4546 - (3.1); -7.3100 - (0.5); -7.2905 - (2.5); -7.2866 - (2.6); -7.2734 - (2.8); -7.2698 - (5.7); -7.2660 - (3.8); -7.2602 - (27.0); -7.2530 - (4.0); -7.2491 - (3.5); -7.2102 - (0.6); -7.1119 - (3.4); -7.1078 - (3.5); -7.0914 - (5.8); -7.0873 - (5.9); -7.0758 - (0.7); -7.0710 - (3.0); -7.0669 - (3.0); -7.0577 - (0.6); -7.0517 - (0.6); -6.9506 - (0.6); -6.9460 - (0.5); -6.9334 - (0.7); -6.9273 - (1.4); -6.9093 - (0.6); -6.9062 - (0.6); -5.2740 - (0.5); -4.5521 - (5.0); -4.5343 - (15.7); -4.5164 - (16.0); -4.4986 - (5.4); -4.4846 - (0.5); -4.4664 - (0.4); -2.5161 - (1.0); -2.5036 - (2.1); -2.4959 - (2.4); -2.4887 - (1.7); -2.4837 - (4.0); -2.4751 - (1.7); -2.4711 - (2.4); -2.4634 - (2.5); -2.4510 - (1.3); -1.5952 - (0.4); -1.5454 - (20.6); -1.5143 - (0.4); -1.4963 - (0.9); -1.4788 - (0.4); -1.4645 - (16.3); -1.4467 - (33.4); -1.4289 - (16.4); -1.4192 - (1.2); -1.3967 - (0.8); -1.3785 - (0.5); -1.3034 - (0.3); -1.2856 - (0.5); -1.2809 - (0.4); -1.2737 - (0.4); -1.2676 - (0.5); -1.2571 - (0.8); -1.2512 - (1.5); -1.2369 - (4.7); -1.2299 - (7.5); -1.2244 - (8.3); -1.2180 - (7.2); -1.2115 - (5.8); -1.2050 - (4.8); -1.1988 - (7.4); -1.1921 - (4.8); -1.1849 - (6.2); -1.1781 - (7.6); -1.1715 - (5.2); -1.1573 - (2.0); -1.1281 - (0.5); -0.0695 - (3.4); -0.0495 - (0.6); -0.0080 - (1.1); -0.0002 - (36.9); -0.0084 - (1.9); -0.0502 - (0.7)$

30

40

50

1-08:  $^1\text{H-NMR}$  (400.1-MHz, -CDCl<sub>3</sub>): -

$\delta = 7.3098 - (0.3); -7.2599 - (27.0); -7.2102 - (0.4); -7.0945 - (0.6); -7.0886 - (1.2); -7.0742 - (4.6); -7.0684 - (8.0); -7.0645 - (9.4); -7.0537 - (6.1); -7.0510 - (9.5); -7.0306 - (1.9); -7.0151 - (0.4); -7.0012 - (0.4); -6.9960 - (0.4); -6.8082 - (2.0); -6.8024 - (2.3); -6.7912 - (3.3); -6.7842 - (2.4); -6.7796 - (3.1); -6.7682 - (1.9); -6.7583 - (0.5); -4.5505 - (4.9); -4.5326 - (15.5); -4.5148 - (16.0); -4.4970 - (5.6); -4.4829 - (0.6); -4.4651 - (0.4); -2.5026 - (1.0); -2.4903 - (2.1); -2.4822 - (2.3); -2.4733 - (2.0); -2.4701 - (3.9); -2.4615 - (1.7); -2.4578 - (2.5); -2.4497 - (2.6); -2.4374 - (1.3); -2.1120 - (0.7); -2.0989 - (1.5); -2.0907 - (1.6); -2.0860 - (1.2); -2.0777 - (3.1); -2.0648 - (2.0); -2.0565 - (1.8); -2.0434 - (1.0); -1.5430 - (20.5); -1.5137 - (0.4); -1.4959 - (0.6); -1.4784 - (0.4); -1.4639 - (16.2); -1.4460 - (33.7); -1.4352 - (1.9); -1.4282 - (16.4); -1.3965 - (0.8); -1.3784 - (0.5); -1.3027 - (0.3); -1.2880 - (0.7); -1.2849 - (0.5); -1.2712 - (0.6); -1.2667 - (0.6); -1.2545 - (0.6); -1.2422 - (1.9); -1.2291 - (5.2); -1.2222 - (6.8); -1.2166 - (6.3); -1.2151 - (6.5); -1.2103 - (7.1); -1.2029 - (3.9); -1.1964 - (2.3); -1.1853 - (4.8); -1.1775 - (6.7); -1.1709 - (6.1); -1.1647 - (4.3); -1.1571 - (7.9); -1.1503 - (5.1); -1.1411 - (1.9); -1.1372 - (2.1); -1.1111 - (0.5); -1.0324 - (0.3); -1.0179 - (2.4); -1.0064 - (5.9); -1.0015 - (6.6); -0.9967 - (3.6); -0.9903 - (4.0); -0.9850 - (6.8); -0.9802 - (6.4); -0.9691 - (3.7); -0.9529 - (0.9); -0.9320 - (0.6); -0.8005 - (0.4); -0.7867 - (0.4); -0.7630 - (3.0); -0.7517 - (6.7); -0.7472 - (6.8); -0.7388 - (6.5); -0.7346 - (7.8); -0.7225 - (3.1); -0.7123 - (0.8); -0.7078 - (0.8); -0.6998 - (0.6); -0.6872 - (0.5); -0.0696 - (1.0); -0.0497 - (0.5); -0.0079 - (1.2); -0.0002 - (41.7); -0.0085 - (2.4); -0.0499 - (0.6)$

10

20

1-09:  $^1\text{H-NMR}$  (400.1-MHz, -CDCl<sub>3</sub>): -

$\delta = 7.3097 - (0.4); -7.2598 - (21.6); -7.2102 - (0.4); -7.1308 - (0.9); -7.1259 - (1.1); -7.1077 - (3.4); -7.0946 - (3.5); -7.0908 - (4.1); -7.0809 - (3.8); -7.0755 - (8.7); -7.0567 - (3.2); -7.0378 - (1.1); -4.5486 - (3.4); -4.5307 - (10.6); -4.5129 - (10.7); -4.4951 - (3.6); -4.4812 - (0.3); -2.4986 - (0.7); -2.4863 - (1.5); -2.4783 - (1.6); -2.4695 - (1.6); -2.4662 - (2.7); -2.4574 - (1.3); -2.4539 - (1.8); -2.4458 - (1.8); -2.4335 - (0.9); -2.3489 - (0.3); -2.3031 - (14.9); -2.2977 - (16.0); -2.2537 - (0.5); -2.2487 - (0.5); -1.5405 - (19.2); -1.5122 - (0.3); -1.4937 - (0.5); -1.4618 - (10.9); -1.4440 - (22.6); -1.4261 - (11.0); -1.3944 - (0.6); -1.3767 - (0.3); -1.2881 - (0.4); -1.2699 - (0.3); -1.2575 - (0.4); -1.2394 - (1.3); -1.2261 - (3.8); -1.2193 - (5.0); -1.2123 - (5.1); -1.2073 - (5.1); -1.2000 - (2.6); -1.1941 - (1.6); -1.1831 - (3.6); -1.1755 - (4.8); -1.1686 - (4.3); -1.1626 - (3.0); -1.1550 - (5.7); -1.1482 - (3.5); -1.1387 - (1.2); -1.1351 - (1.4); -0.0497 - (0.5); -0.0080 - (1.1); -0.0002 - (32.5); -0.0084 - (1.7); -0.0211 - (0.4); -0.0497 - (0.6)$

30

40

50

1-10:  $^1\text{H-NMR}$  (400.1-MHz,  $-\text{CDCl}_3$ ): -

$\delta = 7.4084 - (5.3); -7.4056 - (9.6); -7.4003 - (8.7); -7.3954 - (7.2); -7.3920 - (6.1); -7.3894 - (6.3); -7.3849 - (3.0); -7.3617 - (0.4); -7.3554 - (0.4); -7.3413 - (0.4); -7.3113 - (5.5); -7.3038 - (0.9); -7.2977 - (0.8); -7.2906 - (9.6); -7.2803 - (1.6); -7.2698 - (5.4); -7.2601 - (26.3); -7.2231 - (0.4); -7.2100 - (0.6); -7.1860 - (4.1); -7.1834 - (4.4); -7.1805 - (4.2); -7.1779 - (3.9); -7.1655 - (3.1); -7.1629 - (3.2); -7.1599 - (3.3); -7.1574 - (2.8); -4.5322 - (5.0); -4.5144 - (15.6); -4.4965 - (16.0); -4.4787 - (5.5); -4.4644 - (0.5); -4.4465 - (0.4); -2.5336 - (0.3); -2.5160 - (1.1); -2.5034 - (2.1); -2.4958 - (2.3); -2.4890 - (1.7); -2.4835 - (4.0); -2.4749 - (1.7); -2.4709 - (2.3); -2.4634 - (2.4); -2.4509 - (1.3); -1.5922 - (0.3); -1.5420 - (22.4); -1.4986 - (0.4); -1.4918 - (0.4); -1.4806 - (0.6); -1.4622 - (0.4); -1.4575 - (1.2); -1.4484 - (15.6); -1.4396 - (2.9); -1.4306 - (32.2); -1.4218 - (2.5); -1.4127 - (15.9); -1.4007 - (1.4); -1.3805 - (0.8); -1.3627 - (0.5); -1.2880 - (2.6); -1.2717 - (1.4); -1.2555 - (0.6); -1.2472 - (1.2); -1.2325 - (4.4); -1.2255 - (7.8); -1.2202 - (8.4); -1.2136 - (7.1); -1.2076 - (5.5); -1.2035 - (5.4); -1.1976 - (7.9); -1.1907 - (4.9); -1.1834 - (5.4); -1.1769 - (7.5); -1.1701 - (5.0); -1.1560 - (1.8); -0.0501 - (0.5); -0.0079 - (1.4); -0.0002 - (39.5); -0.0084 - (2.1); -0.0371 - (0.4); -0.0503 - (0.6)$

10

20

1-11:  $^1\text{H-NMR}$  (400.1-MHz,  $-\text{CDCl}_3$ ): -

$\delta = 7.3940 - (1.1); -7.3909 - (1.2); -7.3818 - (10.6); -7.3797 - (11.4); -7.3749 - (5.7); -7.3718 - (5.8); -7.3645 - (7.4); -7.3434 - (6.2); -7.3396 - (6.1); -7.3112 - (0.6); -7.2971 - (0.4); -7.2872 - (0.4); -7.2600 - (21.3); -7.2475 - (0.8); -7.2345 - (3.1); -7.2281 - (4.6); -7.2201 - (3.0); -7.2187 - (3.1); -7.2119 - (3.6); -7.2051 - (3.0); -7.1940 - (0.6); -7.1849 - (2.0); -7.1649 - (1.4); -7.0792 - (1.4); -7.0601 - (1.0); -6.9602 - (1.1); -6.9542 - (1.4); -6.9508 - (1.2); -6.8454 - (0.8); -6.8434 - (0.8); -6.8389 - (0.8); -6.8251 - (0.8); -6.8186 - (0.7); -5.2983 - (1.5); -4.9273 - (3.3); -4.5318 - (4.2); -4.5139 - (13.2); -4.4961 - (13.4); -4.4783 - (4.6); -4.4642 - (0.5); -4.4466 - (0.3); -3.0951 - (16.0); -3.0490 - (4.0); -2.5101 - (0.9); -2.4976 - (1.9); -2.4900 - (2.1); -2.4777 - (3.5); -2.4689 - (1.7); -2.4651 - (2.2); -2.4575 - (2.3); -2.4450 - (1.2); -1.5505 - (18.4); -1.5008 - (0.4); -1.4806 - (0.4); -1.4664 - (0.3); -1.4471 - (13.6); -1.4293 - (27.8); -1.4114 - (13.8); -1.4000 - (1.2); -1.3891 - (0.5); -1.3797 - (0.8); -1.3619 - (0.4); -1.2681 - (0.4); -1.2547 - (0.5); -1.2493 - (0.6); -1.2430 - (1.2); -1.2287 - (4.5); -1.2218 - (7.2); -1.2163 - (7.8); -1.2099 - (6.8); -1.2033 - (5.5); -1.1963 - (4.8); -1.1903 - (7.1); -1.1835 - (4.6); -1.1764 - (5.7); -1.1696 - (7.2); -1.1630 - (4.8); -1.1489 - (1.9); -1.1285 - (0.5); -0.0507 - (0.4); -0.0079 - (1.2); -0.0002 - (32.1); -0.0083 - (2.0); -0.0327 - (0.4); -0.0498 - (0.5)$

30

40

50

1-12:  $^1\text{H-NMR}$  (400.1-MHz,  $-\text{CDCl}_3$ ):-

$\delta = 7.3251 - (1.0); -7.3045 - (2.1); -7.2842 - (1.2); -7.2596 - (5.9); -7.1454 - (0.4); -7.1245 - (0.8); -7.1064 - (0.4); -7.1037 - (0.5); -6.8157 - (0.8); -6.8137 - (0.9); -6.8098 - (1.0); -6.8078 - (1.1); -6.7948 - (1.5); -6.7927 - (1.6); -6.7891 - (2.1); -6.7870 - (1.9); -6.7748 - (0.7); -6.7725 - (0.8); -6.7692 - (1.4); -6.7670 - (1.2); -6.7612 - (1.7); -6.7557 - (2.1); -6.7502 - (0.9); -6.5047 - (0.4); -6.5027 - (0.5); -6.4989 - (0.5); -6.4969 - (0.5); -6.4841 - (0.4); -6.4801 - (0.6); -6.4762 - (0.4); -6.4332 - (0.4); -6.4311 - (0.4); -6.4273 - (0.7); -6.4253 - (0.6); -6.4154 - (0.6); -6.4107 - (1.8); -6.4070 - (1.6); -4.8849 - (0.4); -4.5265 - (1.2); -4.5086 - (3.9); -4.4907 - (3.9); -4.4729 - (1.3); -3.7989 - (16.0); -3.7773 - (9.1); -3.7615 - (0.4); -3.7548 - (0.5); -3.7496 - (0.4); -2.4911 - (0.5); -2.4831 - (0.6); -2.4749 - (0.6); -2.4709 - (1.0); -2.4623 - (0.4); -2.4585 - (0.6); -2.4506 - (0.6); -2.4383 - (0.3); -1.5618 - (4.2); -1.4430 - (4.0); -1.4359 - (0.4); -1.4252 - (8.4); -1.4073 - (4.0); -1.2363 - (0.4); -1.2225 - (1.4); -1.2156 - (1.8); -1.2102 - (2.2); -1.2036 - (1.8); -1.1964 - (1.1); -1.1841 - (1.2); -1.1778 - (1.8); -1.1711 - (1.2); -1.1649 - (1.2); -1.1573 - (2.0); -1.1506 - (1.3); -1.1375 - (0.6); -0.0002 - (8.8); -0.0085 - (0.4)$

10

20

1-13:  $^1\text{H-NMR}$  (400.2-MHz,  $-\text{d}_6\text{-DMSO}$ ):-

$\delta = 8.9395 - (16.0); -7.6370 - (2.6); -7.6170 - (6.4); -7.5970 - (4.6); -7.5235 - (6.6); -7.5038 - (4.7); -7.4867 - (8.3); -7.4091 - (4.6); -7.4044 - (4.4); -7.3885 - (3.8); -7.3838 - (3.7); -5.7651 - (4.8); -3.9808 - (0.8); -3.7903 - (0.4); -3.3453 - (3.1); -3.1741 - (4.1); -2.6776 - (1.1); -2.5127 - (125.5); -2.5085 - (173.4); -2.5044 - (140.4); -2.3352 - (0.9)$

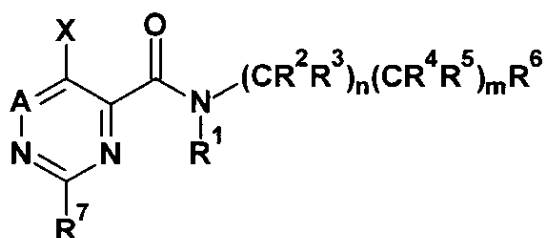
30

【 0 4 0 1 】

表 5 式 ( 3 ) に係る化合物

【 0 4 0 2 】

【 化 1 9 】

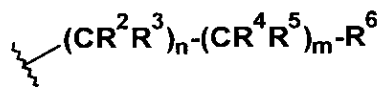


40

【 0 4 0 3 】

50

【表 6】

実施例番号	A	R <sup>7</sup>	X	R <sub>1</sub>		Log P
3-01	C H	エチル	C l	H	2-(2, 4-ジメチルフェニル)-2, 2-ジフルオロエチル	3. 77 [a]
3-02	C H	シクロプロピル	B r	H	2-(2, 4-ジメチルフェニル)-2, 2-ジフルオロエチル	4. 08 [a]
3-03	C H	メチルスルファニル	B r	H	2-(2, 4-ジメチルフェニル)-2, 2-ジフルオロエチル	4. 05 [a]
3-04	C H	メチル	B r	H	2-(2, 4-ジメチルフェニル)-2, 2-ジフルオロエチル	3. 25 [a]

10

【0404】

20

30

40

50



## 【表 7】

表 6 式 (3) の化合物の<sup>1</sup>H-NMR

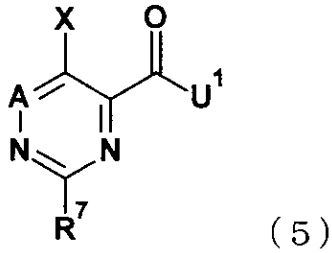
<p>3-01: <sup>1</sup>H-NMR (500.1-MHz, -CDCl<sub>3</sub>): -</p> <p>δ = 8.7835 - (5.9); -8.2381 - (0.6); -7.3894 - (1.9); -7.3735 - (2.0); -7.2598 - (10.7); -7.0640 - (2.0); -7.0480 - (1.1); -7.0317 - (1.0); -4.1495 - (1.0); -4.1368 - (1.0); -4.1198 - (2.3); -4.1071 - (2.2); -4.0900 - (1.1); -4.0773 - (1.1); -3.0473 - (1.4); -3.0321 - (4.5); -3.0170 - (4.6); -3.0018 - (1.6); -2.5084 - (3.3); -2.5046 - (5.9); -2.5002 - (3.2); -2.3491 - (0.4); -2.3318 - (8.4); -2.3007 - (0.3); -1.5504 - (16.0); -1.3954 - (5.0); -1.3802 - (10.3); -1.3650 - (5.0); -1.3412 - (0.3); -0.0695 - (2.2); -0.0063 - (0.4); --0.0002 - (12.0); --0.0068 - (0.4)</p>	10
<p>3-02: <sup>1</sup>H-NMR (500.1-MHz, -CDCl<sub>3</sub>): -</p> <p>δ = 8.8038 - (9.9); -8.7845 - (0.3); -8.1386 - (1.2); -7.3859 - (3.4); -7.3701 - (3.7); -7.2595 - (17.4); -7.0637 - (4.0); -7.0560 - (2.4); -7.0390 - (1.9); -5.2982 - (5.8); -4.1364 - (1.8); -4.1237 - (1.7); -4.1068 - (3.8); -4.0941 - (3.7); -4.0771 - (2.0); -4.0645 - (1.8); -2.4985 - (11.1); -2.3342 - (16.0); -2.3065 - (0.8); -2.3018 - (0.6); -2.2920 - (1.2); -2.2856 - (1.3); -2.2832 - (0.9); -2.2760 - (2.0); -2.2728 - (1.3); -2.2664 - (1.2); -2.2600 - (1.2); -2.2504 - (0.6); -1.5433 - (10.1); -1.2542 - (0.4); -1.1885 - (1.0); -1.1778 - (2.3); -1.1727 - (4.3); -1.1664 - (2.8); -1.1617 - (2.3); -1.1563 - (3.7); -1.1514 - (2.5); -1.1431 - (2.8); -1.1369 - (4.0); -1.1318 - (4.6); -1.1277 - (4.1); -1.1220 - (2.9); -1.1111 - (0.7); -0.0694 - (3.9); -0.0062 - (0.9); --0.0002 - (23.0); --0.0066 - (1.0)</p>	20
<p>3-03: <sup>1</sup>H-NMR (500.1-MHz, -CDCl<sub>3</sub>): -</p> <p>δ = 8.7717 - (5.5); -7.9942 - (0.5); -7.3765 - (1.5); -7.3607 - (1.6); -7.2593 - (8.3); -7.0618 - (1.7); -7.0508 - (0.9); -7.0345 - (0.8); -5.2980 - (3.6); -4.1348 - (0.8); -4.1222 - (0.8); -4.1053 - (1.8); -4.0926 - (1.7); -4.0757 - (0.9); -4.0631 - (0.8); -2.5729 - (0.3); -2.5646 - (16.0); -2.4928 - (4.8); -2.4881 - (2.8); -2.3326 - (7.0); -1.5394 - (6.5); -0.0694 - (0.7); -0.0063 - (0.4); --0.0002 - (11.4); --0.0068 - (0.4)</p>	30
<p>3-04: <sup>1</sup>H-NMR (500.1-MHz, -CDCl<sub>3</sub>): -</p> <p>δ = 8.9103 - (4.7); -8.2437 - (0.6); -7.3883 - (1.7); -7.3725 - (1.9); -7.2596 - (10.7); -7.0651 - (2.0); -7.0520 - (1.1); -7.0359 - (1.0); -5.2983 - (1.6); -4.1406 - (0.9); -4.1279 - (0.9); -4.1105 - (2.0); -4.0978 - (1.9); -4.0805 - (1.0); -4.0678 - (1.0); -2.7917 - (0.7); -2.7426 - (16.0); -2.5044 - (5.6); -2.5004 - (3.2); -2.3344 - (8.1); -1.5436 - (1.1); -0.0693 - (3.0); -0.0061 - (0.6); --0.0002 - (14.5); --0.0067 - (0.6)</p>	40

## 【0405】

表 7 式 (5) に係る化合物

## 【0406】

【化 2 0】



10

【 0 4 0 7】

【表 8】

実施例番号	A	R <sup>7</sup>	X	U <sup>1</sup>	Log P
5-01	N	シクロプロピル	クロロ	エトキシ	

【 0 4 0 8】

20

【表 9】

表 8 式 (5) の化合物の<sup>1</sup>H-NMR

5-01: <sup>1</sup>H-NMR (400-MHz, -CDCl<sub>3</sub>): -  
 $\delta$  - [ppm] = 4.50 - (q, -2H), -2.56 - - - 2.50 - (m, -1H), -1.44 - (t, -3H), -1.28 - (d, -4H)

【 0 4 0 9】

30

B . 生物学的実施例

B - 1 . アルタナリア・ブラシカエ ( *Alternaria brassicae* )  
 ( ラディッシュまたはキャベツの斑点病菌 ) に対するインビボ予防試験

溶媒 : 5 体積 % のジメチルスルホキシド

10 体積 % のアセトン

乳化剤 : 有効成分 1 mg あたり 1  $\mu$ L の Tween ( 登録商標 ) 80

有効成分をジメチルスルホキシド / アセトン / Tween ( 登録商標 ) 80 の混合物に可溶化させ、均質化し、次いで水で所望の濃度に希釈した。

【 0 4 1 0】

ラディッシュまたはキャベツの幼植物は、上記のように調製した有効成分をスプレーすることによって処理した。対照植物は、アセトン / ジメチルスルホキシド / Tween ( 登録商標 ) 80 の水溶液のみで処理した。 40

【 0 4 1 1】

24 時間後、葉にアルタナリア・ブラシカエ胞子の水性懸濁液をスプレーすることにより、植物を汚染した。汚染されたラディッシュまたはキャベツ植物を、20、相対湿度 100 % で 3 ~ 4 日間インキュベートした。

【 0 4 1 2】

接種の 3 ~ 4 日後に試験を評価した。0 % は対照植物の有効性に相当する有効性を意味し、100 % の有効性は病害が観察されなかったことを意味する。

【 0 4 1 3】

この試験において、本発明による以下の化合物は、有効成分の濃度 500 ppm で 70 50

% ~ 79%の間の有効性を示した： I - 026、I - 046、I - 100。

【0414】

この試験において、本発明による以下の化合物は、有効成分の濃度500ppmで80% ~ 89%の有効性を示した： I - 010、I - 019、I - 020、I - 042、I - 055、I - 065、I - 068、I - 070、I - 104、I - 113、I - 126、I - 133。。

【0415】

この試験において、本発明による以下の化合物は、有効成分の濃度500ppmで90% ~ 100%の有効性を示した： I - 003、I - 005、I - 006、I - 007、I - 008、I - 009、I - 011、I - 013、I - 014、I - 015、I - 016、I - 018、I - 028、I - 033、I - 039、I - 043、I - 044、I - 045、I - 052、I - 053、I - 054、I - 058、I - 064、I - 069、I - 076、I - 077、I - 083、I - 085、I - 086、I - 087、I - 089、I - 090、I - 096、I - 098、I - 099、I - 102、I - 103、I - 114、I - 115、I - 124、I - 127、I - 134。

【0416】

B - 2 . ボトリティス・シネレア ( *Botrytis cinerea* ) ( 灰色かび病 ) に対するインビボ予防試験

溶媒：5体積%のジメチルスルホキシド

10体積%のアセトン

乳化剤：有効成分1mgあたり1μLのTween ( 登録商標 ) 80

有効成分をジメチルスルホキシド/アセトン/Tween ( 登録商標 ) 80の混合物に可溶化させ、均質化し、次いで水で所望の濃度に希釈した。

【0417】

ガーキンまたはキャベツの幼植物は、上記のように調製した有効成分をスプレーすることによって処理した。対照植物は、アセトン/ジメチルスルホキシド/Tween ( 登録商標 ) 80の水溶液のみで処理した。

【0418】

24時間後、葉にボトリティス・シネレア胞子の水性懸濁液をスプレーすることにより、植物を汚染した。汚染されたガーキン植物を、17、相対湿度90%で4~5日間インキュベートした。汚染されたキャベツ植物を、20、相対湿度100%で4~5日間インキュベートした。

【0419】

接種の4~5日後に試験を評価した。0%は対照植物の有効性に相当する有効性を意味し、100%の有効性は病害が観察されなかったことを意味する。

【0420】

この試験において、本発明による以下の化合物は、有効成分の濃度500ppmで70% ~ 79%の間の有効性を示した： I - 005、I - 052、I - 068。

【0421】

この試験において、本発明による以下の化合物は、有効成分の濃度500ppmで80% ~ 89%の有効性を示した： I - 026、I - 028、I - 034、I - 047、I - 054、I - 055、I - 064、I - 065、I - 072、I - 091、I - 094、I - 100、I - 129。

【0422】

この試験において、本発明による以下の化合物は、有効成分の濃度500ppmで90% ~ 100%の有効性を示した： I - 001、I - 002、I - 003、I - 006、I - 007、I - 008、I - 009、I - 010、I - 011、I - 013、I - 014、I - 015、I - 016、I - 017、I - 018、I - 019、I - 023、I - 033、I - 039、I - 042、I - 043、I - 044、I - 045、I - 046、I - 053、I - 058、I - 069、I - 070、I - 071、I - 076、I - 077

、 I - 0 8 3、 I - 0 8 5、 I - 0 8 7、 I - 0 8 9、 I - 0 9 0、 I - 0 9 8、 I - 0 9 9、 I - 1 0 2、 I - 1 0 3、 I - 1 0 4、 I - 1 1 3、 I - 1 1 4、 I - 1 1 5、 I - 1 1 6、 I - 1 2 4、 I - 1 2 5、 I - 1 2 6、 I - 1 2 7、 I - 1 3 4。

【 0 4 2 3 】

B - 3 . スファエロテカ・フリギネア ( *Sphaerotheca fuliginea* ) ( ウリ科うどん粉病 ) に対するインピボ予防試験

溶媒 : 5 体積 % のジメチルスルホキシド

1 0 体積 % のアセトン

乳化剤 : 有効成分 1 m g あたり 1  $\mu$  L の Tween ( 登録商標 ) 8 0

有効成分をジメチルスルホキシド / アセトン / Tween ( 登録商標 ) 8 0 の混合物に可溶化させ、均質化し、次いで水で所望の濃度に希釈した。 10

【 0 4 2 4 】

ガーキンの幼植物は、上記のように調製した有効成分をスプレーすることによって処理した。対照植物は、アセトン / ジメチルスルホキシド / Tween ( 登録商標 ) 8 0 の水溶液のみで処理した。

【 0 4 2 5 】

2 4 時間後、葉にスファエロテカ・フリギネア胞子の水性懸濁液をスプレーすることにより、植物を汚染した。汚染されたガーキン植物を、2 0 、相対湿度 7 0 % ~ 8 0 % で 8 日間インキュベートした。

【 0 4 2 6 】

接種の 8 日後に試験を評価した。0 % は対照植物の有効性に相当する有効性を意味し、1 0 0 % の有効性は病害が観察されなかったことを意味する。 20

【 0 4 2 7 】

この試験において、本発明による以下の化合物は、有効成分の濃度 5 0 0 p p m で 7 0 % ~ 7 9 % の間の有効性を示した : I - 0 1 8、I - 0 9 0。

この試験において、本発明による以下の化合物は、有効成分の濃度 5 0 0 p p m で 8 0 % ~ 8 9 % の間の有効性を示した : I - 0 1 0、I - 0 1 9、I - 0 5 8、I - 0 7 7、I - 1 2 4、I - 1 2 7。

この試験において、本発明による以下の化合物は、有効成分の濃度 5 0 0 p p m で 9 0 % ~ 1 0 0 % の有効性を示した : I - 0 0 2、I - 0 0 3、I - 0 0 8、I - 0 0 9、I - 0 1 1、I - 0 1 3、I - 0 1 5、I - 0 3 3、I - 0 3 9、I - 0 4 3、I - 0 8 3、I - 0 8 5、I - 0 8 9、I - 1 0 2、I - 1 0 3。 30

【 0 4 2 8 】

B - 4 . アルテルナリア・アルテルナータ ( *Alternaria alternata* ) でのインピトロ細胞試験

溶媒 : D M S O

培地 : 1 4 . 6 g の無水 D - グルコース ( V W R 社 )、7 . 1 g の真菌用ペプトン ( O x o i d 社 )、1 . 4 g の造粒酵母エキス ( M e r c k 社 )、1 リットルの Q S P

接種材料 : 胞子懸濁液

殺真菌剤を D M S O に可溶化させ、その溶液を使用して必要な範囲の濃度を調製した。アッセイで使用した D M S O の最終濃度は 1 % であった。 40

【 0 4 2 9 】

アルテルナリア・アルテルナータの胞子懸濁液を調製し、所望の胞子密度に希釈した。

【 0 4 3 0 】

殺真菌剤は、液体培養アッセイで胞子の発芽および菌糸体の成長を阻害する能力について評価した。前記化合物を胞子を含む培地に所望の濃度で添加した。5 日間のインキュベーション後、前記化合物の真菌毒性を、菌糸体成長の分光測定によって決定した。真菌増殖の阻害は、殺真菌剤を含むウェルの吸光度値を、殺真菌剤を含まない対照ウェルの吸光度と比較することによって決定した。

【 0 4 3 1 】

この試験において、本発明による以下の化合物は、有効成分の濃度 20 ppm で 70% ~ 79% の有効性を示した：I - 002、I - 016、I - 019、I - 020、I - 067、I - 071、I - 076、I - 090、I - 099、I - 100、I - 104、I - 125。。

【0432】

この試験において、本発明による以下の化合物は、有効成分の濃度 20 ppm で 80% ~ 89% の有効性を示した：I - 003、I - 004、I - 005、I - 006、I - 007、I - 042、I - 046、I - 058、I - 069、I - 098、I - 102、I - 113、I - 119。

【0433】

この試験において、本発明による以下の化合物は、有効成分の濃度 20 ppm で 90% ~ 100% の有効性を示した：I - 001、I - 008、I - 011、I - 013、I - 015、I - 018、I - 028、I - 033、I - 039、I - 043、I - 045、I - 053、I - 077、I - 083、I - 084、I - 085、I - 087、I - 089、I - 103、I - 114、I - 115、I - 124、I - 127、I - 134。

【0434】

B - 5 . ピリクラリア・オリゼ (*Pyricularia oryzae*) でのインビトロ細胞試験

溶媒：DMSO

培地：14.6g の無水 D - グルコース (VWR 社)、7.1g の真菌用ペプトン (Oxoid 社)、1.4g の造粒酵母エキス (Merck 社)、1リットルの QSP

接種材料：孢子懸濁液

殺真菌剤を DMSO に可溶化させ、その溶液を使用して必要な範囲の濃度を調製した。アッセイで使用した DMSO の最終濃度は 1% であった。

【0435】

ピリクラリア・オリゼの孢子懸濁液を調製し、所望の孢子密度に希釈した。

【0436】

殺真菌剤は、液体培養アッセイで孢子の発芽および菌糸体の成長を阻害する能力について評価した。前記化合物を孢子を含む培地に所望の濃度で添加した。5日間のインキュベーション後、前記化合物の真菌毒性を、菌糸体成長の分光測定によって決定した。真菌増殖の阻害は、殺真菌剤を含むウェルの吸光度値を、殺真菌剤を含まない対照ウェルの吸光度と比較することによって決定した。

【0437】

この試験において、本発明による以下の化合物は、有効成分の濃度 20 ppm で 70% ~ 79% の間の有効性を示した：I - 009、I - 015、I - 034、I - 043、I - 080、I - 106、I - 119、I - 124。。

【0438】

この試験において、本発明による以下の化合物は、有効成分の濃度 20 ppm で 80% ~ 89% の間の有効性を示した：I - 001、I - 003、I - 006、I - 010、I - 012、I - 014、I - 019、I - 028、I - 090、I - 115、I - 133

【0439】

この試験において、本発明による以下の化合物は、有効成分の濃度 20 ppm で 90% ~ 100% の有効性を示した：I - 005、I - 007、I - 011、I - 013、I - 033、I - 039、I - 070、I - 083、I - 084、I - 085、I - 100、I - 102、I - 103。。

【0440】

B - 6 . コレトトリカム・リンデムチアヌム (*Colletotrichum lindemuthianum*) でのインビトロ細胞試験

溶媒：DMSO

10

20

30

40

50

培地：14.6 gの無水D-グルコース(VWR社)、7.1 gの真菌用ペプトン(Oxoid社)、1.4 gの造粒酵母エキス(Merck社)、1リットルのQSP

接種材料：孢子懸濁液

殺真菌剤をDMSOに可溶化させ、その溶液を使用して必要な範囲の濃度を調製した。アッセイで使用したDMSOの最終濃度は1%であった。

【0441】

コレトリカム・リンデムチアヌムの孢子懸濁液を調製し、所望の孢子密度に希釈した。

【0442】

殺真菌剤は、液体培養アッセイで孢子の発芽および菌糸体の成長を阻害する能力について評価した。前記化合物を孢子を含む培地に所望の濃度で添加した。6日間のインキュベーション後、前記化合物の真菌毒性を、菌糸体成長の分光測定によって決定した。真菌増殖の阻害は、殺真菌剤を含むウェルの吸光度値を、殺真菌剤を含まない対照ウェルの吸光度と比較することによって決定した。 10

【0443】

この試験において、本発明による以下の化合物は、有効成分の濃度20ppmで70%~79%の間の有効性を示した：I-010、I-012、I-035、I-080、I-090、I-101、I-104、I-106。。

【0444】

この試験において、本発明による以下の化合物は、有効成分の濃度20ppmで80%~89%の間の有効性を示した：I-067、I-068、I-129。 20

【0445】

この試験において、本発明による以下の化合物は、有効成分の濃度20ppmで90%~100%の有効性を示した：I-002、I-005、I-006、I-007、I-008、I-009、I-011、I-013、I-014、I-015、I-016、I-017、I-018、I-019、I-026、I-029、I-030、I-033、I-039、I-041、I-042、I-043、I-044、I-045、I-046、I-047、I-052、I-053、I-054、I-055、I-056、I-060、I-064、I-065、I-069、I-070、I-071、I-072、I-076、I-077、I-078、I-081、I-083、I-084、I-085、I-086、I-087、I-089、I-091、I-094、I-098、I-099、I-100、I-102、I-103、I-113、I-114、I-115、I-116、I-124、I-125、I-126、I-127、I-134。 30

【0446】

B-7. ピレノフォーラ・テレス(Pyrenophora teres)でのインビトロ細胞試験

溶媒：DMSO

培地：14.6 gの無水D-グルコース(VWR社)、7.1 gの真菌用ペプトン(Oxoid社)、1.4 gの造粒酵母エキス(Merck社)、1リットルのQSP

接種材料：孢子懸濁液 40

殺真菌剤をDMSOに可溶化させ、その溶液を使用して必要な範囲の濃度を調製した。アッセイで使用したDMSOの最終濃度は1%であった。

【0447】

ピレノフォーラ・テレスの孢子懸濁液を調製し、所望の孢子密度に希釈した。

【0448】

殺真菌剤は、液体培養アッセイで孢子の発芽および菌糸体の成長を阻害する能力について評価した。前記化合物を孢子を含む培地に所望の濃度で添加した。6日間のインキュベーション後、前記化合物の真菌毒性を、菌糸体成長の分光測定によって決定した。真菌増殖の阻害は、殺真菌剤を含むウェルの吸光度値を、殺真菌剤を含まない対照ウェルの吸光度と比較することによって決定した。 50

## 【0449】

この試験において、本発明による以下の化合物は、有効成分の濃度20ppmで70%~79%の間の有効性を示した：I-026、I-046、I-068、I-070、I-111、I-123。

この試験において、本発明による以下の化合物は、有効成分の濃度20ppmで80%~89%の間の有効性を示した：I-030、I-065、I-081、I-091、I-093。

この試験において、本発明による以下の化合物は、有効成分の濃度20ppmで90%~100%の有効性を示した：I-008、I-009、I-010、I-011、I-012、I-013、I-014、I-015、I-016、I-017、I-018、I-019、I-028、I-029、I-033、I-039、I-041、I-042、I-043、I-044、I-045、I-052、I-053、I-054、I-055、I-056、I-058、I-064、I-067、I-069、I-071、I-076、I-077、I-083、I-084、I-085、I-086、I-087、I-089、I-090、I-098、I-099、I-100、I-102、I-103、I-104、I-113、I-114、I-115、I-124、I-125、I-126、I-127、I-129、I-134。

10

## 【0450】

B-8. ボトリチス・シネレア (*Botrytis cinerea*) でのインピトロ細胞試験

20

溶媒：DMSO

培地：1gのリン酸二水素カリウム ( $\text{KH}_2\text{PO}_4$ ) (VWR社)、1gのリン酸水素二カリウム ( $\text{K}_2\text{HPO}_4$ ) (VWR社)、0.5gのウレア (尿素) (VWR社)、3gの硝酸カリウム ( $\text{KNO}_3$ ) (ProLabo社)、10gのスクロース (VWR)、0.5gの硫酸マグネシウム七水和物 ( $\text{MgSO}_4 \cdot 7\text{H}_2\text{O}$ ) (Sigma社)、0.07gの塩化カルシウム二水和物 ( $\text{CaCl}_2 \cdot 2\text{H}_2\text{O}$ ) (ProLabo社)、0.2mgの硫酸マンガン一水和物 ( $\text{MnSO}_4 \cdot \text{H}_2\text{O}$ ) (Sigma社)、0.6mgの硫酸銅 (II) 五水和物 ( $\text{CuSO}_4 \cdot 5\text{H}_2\text{O}$ ) (Sigma社)、7.9mgの硫酸亜鉛七水和物 ( $\text{ZnSO}_4 \cdot 7\text{H}_2\text{O}$ ) (Sigma社)、0.1mgのホウ酸 ( $\text{H}_3\text{BO}_3$ ) (Merck社)、0.14mgのモリブデン酸ナトリウム二水和物 ( $\text{NaMoO}_4 \cdot 2\text{H}_2\text{O}$ ) (Sigma社)、2mgのチアミン (Sigma社)、0.1mgのピオチン (VWR社)、4mgの硫酸鉄 (II) 七水和物 ( $\text{FeSO}_4 \cdot 7\text{H}_2\text{O}$ ) (Sigma社)、1リットルのQSP

30

## 【0451】

接種材料：孢子懸濁液

殺真菌剤をDMSOに可溶化させ、その溶液を使用して必要な範囲の濃度を調製した。アッセイで使用したDMSOの最終濃度は1%であった。

## 【0452】

ボトリチス・シネレアの孢子懸濁液を調製し、所望の孢子密度に希釈した。

## 【0453】

殺真菌剤は、液体培養アッセイで孢子の発芽および菌糸体の成長を阻害する能力について評価した。前記化合物を孢子を含む培地に所望の濃度で添加した。6日間のインキュベーション後、前記化合物の真菌毒性を、菌糸体成長の分光測定によって決定した。真菌増殖の阻害は、殺真菌剤を含むウェルの吸光度値を、殺真菌剤を含まない対照ウェルの吸光度と比較することによって決定した。

40

## 【0454】

この試験において、本発明による以下の化合物は、有効成分の濃度20ppmで70%~79%の間の有効性を示した：I-035、I-078、I-086、I-101。

この試験において、本発明による以下の化合物は、有効成分の濃度20ppmで80%~89%の間の有効性を示した：I-047、I-052、I-054、I-060、I

50

- 072、I - 092。

この試験において、本発明による以下の化合物は、有効成分の濃度20ppmで90%~100%の有効性を示した：I - 008、I - 009、I - 010、I - 011、I - 012、I - 013、I - 014、I - 015、I - 016、I - 017、I - 018、I - 019、I - 023、I - 026、I - 028、I - 029、I - 030、I - 033、I - 039、I - 041、I - 042、I - 043、I - 044、I - 045、I - 046、I - 053、I - 055、I - 056、I - 058、I - 064、I - 065、I - 067、I - 068、I - 069、I - 070、I - 071、I - 076、I - 077、I - 081、I - 083、I - 084、I - 085、I - 087、I - 089、I - 090、I - 091、I - 093、I - 094、I - 098、I - 099、I - 100、I - 102、I - 103、I - 104、I - 106、I - 113、I - 114、I - 115、I - 116、I - 124、I - 125、I - 126、I - 127、I - 129、I - 134。

10

20

30

40

50



## 【 国際調査報告 】

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No PCT/EP2021/062253
---

<b>A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER</b>		
INV. C07D239/30	A01N43/54	A01N43/707
C07D239/52	C07D239/56	C07D253/07
C07D409/12	C07D417/12	C07D239/34
		C07D403/12
		C07D239/38
		C07D405/12
According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC		
<b>B. FIELDS SEARCHED</b>		
Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) C07D A01N		
Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched		
Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used) EPO-Internal, CHEM ABS Data, WPI Data		
<b>C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT</b>		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	DATABASE REGISTRY [Online] CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; 12 August 2016 (2016-08-12), XP002800372, Database accession no. 1972016-93-5 abstract	14
A	----- DATABASE REGISTRY [Online] CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; 17 January 2014 (2014-01-17), XP002800373, Database accession no. 1523221-06-8 abstract ----- -/--	14
<input checked="" type="checkbox"/> Further documents are listed in the continuation of Box C. <input checked="" type="checkbox"/> See patent family annex.		
* Special categories of cited documents :		
*A* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance *E* earlier application or patent but published on or after the international filing date *L* document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified) *O* document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means *P* document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed		*T* later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention *X* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone *Y* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art *&* document member of the same patent family
Date of the actual completion of the international search  21 May 2021		Date of mailing of the international search report  04/06/2021
Name and mailing address of the ISA/ European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Fax: (+31-70) 340-3016		Authorized officer  Brandstetter, T

1

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

page 1 of 2

10

20

30

40

50

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No  
PCT/EP2021/062253

C(Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	DATABASE REGISTRY [Online] CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; 27 November 2013 (2013-11-27), XP002800374, Database accession no. 1482083-36-2 abstract	14
A	----- DATABASE REGISTRY [Online] CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; 13 October 2013 (2013-10-13), XP002800375, Database accession no. 1456979-44-4 abstract	14
X	----- WO 2018/055135 A1 (SYNGENTA PARTICIPATIONS AG [CH]) 29 March 2018 (2018-03-29) cited in the application claims 1, 12, 13	1,4-12
X	----- WO 2004/016088 A2 (BAYER CROPSCIENCE SA [FR]; MANSFIELD DARREN JAMES [FR] ET AL.) 26 February 2004 (2004-02-26) cited in the application	1,4-12
A	claims 1, 11, 16 -----	2,3,13, 14

10

20

30

40

1

50

**INTERNATIONAL SEARCH REPORT**

Information on patent family members

International application No

PCT/EP2021/062253

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 2018055135 A1	29-03-2018	BR 112019005656 A2	04-06-2019
		CN 109923112 A	21-06-2019
		EP 3515908 A1	31-07-2019
		JP 2019537553 A	26-12-2019
		US 2020022370 A1	23-01-2020
		WO 2018055135 A1	29-03-2018
-----			
WO 2004016088 A2	26-02-2004	AR 040852 A1	20-04-2005
		AT 314808 T	15-02-2006
		AU 2003266316 A1	03-03-2004
		BR 0313340 A	12-07-2005
		CA 2492173 A1	26-02-2004
		CN 1674784 A	28-09-2005
		DE 60303147 T2	31-08-2006
		DK 1531673 T3	06-03-2006
		EC SP055594 A	11-08-2005
		EP 1531673 A2	25-05-2005
		ES 2250921 T3	16-04-2006
		HK 1080329 A1	28-04-2006
		HU S1400037 I1	28-08-2017
		IL 166335 A	30-11-2010
		JP 4782418 B2	28-09-2011
		JP 2005535714 A	24-11-2005
		KR 20050071476 A	07-07-2005
		LU 92504 I2	02-01-2015
		MA 27335 A1	02-05-2005
		MX PA05001580 A	25-04-2005
		NZ 537608 A	28-04-2006
		OA 19202 A	13-10-2006
		PL 222168 B1	29-07-2016
		PL 224002 B1	30-11-2016
		PL 224003 B1	30-11-2016
		RU 2316548 C2	10-02-2008
		SI 1531673 T1	30-06-2006
TW I343785 B	21-06-2011		
US 2005234110 A1	20-10-2005		
WO 2004016088 A2	26-02-2004		
-----			

10

20

30

40

50

## フロントページの続き

(51)国際特許分類	F I	テーマコード (参考)
C 0 7 D 401/12 (2006.01)	C 0 7 D 401/12	
C 0 7 D 409/12 (2006.01)	C 0 7 D 409/12	
C 0 7 D 417/12 (2006.01)	C 0 7 D 417/12	
C 0 7 D 239/42 (2006.01)	C 0 7 D 239/42	
C 0 7 D 239/52 (2006.01)	C 0 7 D 239/52	
C 0 7 D 239/56 (2006.01)	C 0 7 D 239/56	
C 0 7 D 239/38 (2006.01)	C 0 7 D 239/38	
A 0 1 P 1/00 (2006.01)	A 0 1 P 1/00	
A 0 1 P 3/00 (2006.01)	A 0 1 P 3/00	
A 0 1 N 43/653 (2006.01)	A 0 1 N 43/653	N
A 0 1 N 43/54 (2006.01)	A 0 1 N 43/54	B

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

3

- (72)発明者 リオネル、ニコラ  
フランス国リヨン、ケ、ピエール、シーズ、13テ
- (72)発明者 バレリー、トカン  
フランス国サン、ロマン、オー、モン、ドール、リュ、ド、ラ、レピュブリック、30
- (72)発明者 マチュー、ゲーグ  
フランス国リヨン、リュ、ド、ラトル、ド、タシニー、35ペー
- (72)発明者 バンサン、トマ  
フランス国リヨン、クール、ピットン、69
- (72)発明者 マツェン、エス - ザイード  
ドイツ連邦共和国ランゲンフェルト、リカルダ - フッフ - シュトラーセ、36
- F ターム (参考) 4C063 AA01 BB08 BB09 CC29 CC72 CC75 CC76 CC79 CC81 CC82  
CC92 CC94 CC95 DD06 DD12 DD14 DD22 DD29 DD44 EE03  
4H011 AA01 BB09