

(19)日本国特許庁(JP)

(12)特許公報(B2)

(11)特許番号
特許第7576548号
(P7576548)

(45)発行日 令和6年10月31日(2024.10.31)

(24)登録日 令和6年10月23日(2024.10.23)

(51)国際特許分類

F I

C 0 7 D 471/04 (2006.01)	C 0 7 D 471/04	1 0 1
A 0 1 N 43/90 (2006.01)	C 0 7 D 471/04	C S P
A 0 1 P 13/02 (2006.01)	A 0 1 N 43/90	1 0 4
A 0 1 N 53/14 (2006.01)	A 0 1 P 13/02	
	A 0 1 N 53/14	

請求項の数 11 (全178頁)

(21)出願番号 特願2021-538292(P2021-538292)
 (86)(22)出願日 令和2年7月17日(2020.7.17)
 (65)公表番号 特表2022-549537(P2022-549537
 A)
 (43)公表日 令和4年11月28日(2022.11.28)
 (86)国際出願番号 PCT/CN2020/102660
 (87)国際公開番号 WO2021/008607
 (87)国際公開日 令和3年1月21日(2021.1.21)
 審査請求日 令和4年7月20日(2022.7.20)
 (31)優先権主張番号 201910650905.6
 (32)優先日 令和1年7月18日(2019.7.18)
 (33)優先権主張国・地域又は機関
 中国(CN)

(73)特許権者 520479722
 チンタオ、キングアグルート、ケミカル
 、コンパウンド、カンパニー、リミテッ
 ド
 QINGDAO KINGAGROOT
 CHEMICAL COMPOUND C
 O . , L T D .
 中華人民共和国シャントン、チンタオ、
 ファンタオ、ディストリクト、チンロン
 へ、ロード、ナンバー53
 NO . 5 3 , Q I N G L O N G H E R
 O A D , H U A N G D A O D I S T R
 I C T , Q I N G D A O , S H A N D O
 N G , C H I N A
 (74)代理人 100091487

最終頁に続く

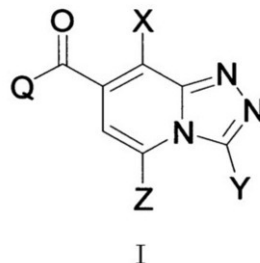
(54)【発明の名称】 置換1, 2, 4 - トリアゾロ[4, 3 - a]ピリジン誘導体、その製造方法、除草剤組成
 および使用

(57)【特許請求の範囲】

【請求項1】

式Iに示される置換1, 2, 4 - トリアゾロ[4, 3 - a]ピリジン誘導体：

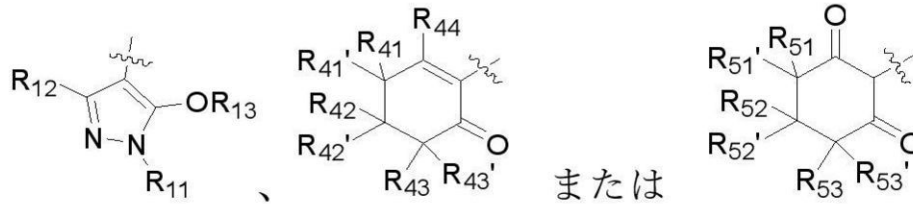
【化1】



[式中、

Q は、下記式で表される基

【化2】



で表され;

R_{11} は $C_1 - C_8$ アルキルを表し;

R_{12} は水素を表し;

R_{41} 、 R_{41}' 、 R_{42} 、 R_{42}' 、 R_{43} および R_{43}' はそれぞれ独立して、水素、またはハロゲンを含まない $C_1 - C_8$ アルキルを表すか;または、異なる炭素原子上にある R_{41} 、 R_{41}' 、 R_{42} 、 R_{42}' 、 R_{43} および R_{43}' の2個が結合して、 CH_2 または $(CH_2)_2$ を形成し;

R_{44} は $-OR_{45}$ および $-SR_{45}$ から選択され;

R_{51} 、 R_{51}' 、 R_{52} 、 R_{52}' 、 R_{53} および R_{53}' はそれぞれ独立して、水素、またはハロゲンを含まない $C_1 - C_8$ アルキルを表すか;または、異なる炭素原子上にある R_{51} 、 R_{51}' 、 R_{52} 、 R_{52}' 、 R_{53} および R_{53}' の2個が結合して、 CH_2 または $(CH_2)_2$ を形成し;

R_{13} および R_{45} はそれぞれ独立して、水素またはアルカリ金属イオンを表し;

Xはハロゲン、 $C_3 - C_8$ シクロアルキルまたは $C_1 - C_8$ アルキルチオを表し;

Zは水素を表し;

Yは、それぞれハロゲンを含むかまたは含まない $C_1 - C_{18}$ アルキルまたは $C_2 - C_8$ アルケニル; $-OR_3$; $-SR_3$; $-SOR_4$; $-(C_1 - C_8 \text{アルキル}) - OR_3$;それぞれ非置換であるかまたは $C_1 - C_8$ アルキルまたはハロゲンで置換されている $C_3 - C_8$ シクロアルキルまたは $C_3 - C_8$ シクロアルキル- $C_1 - C_8$ アルキル;アリアル;またはヘテロシクリルを表し;

R_3 はそれぞれ独立して $C_1 - C_8$ アルキルを表し;

R_4 はそれぞれ独立して $C_1 - C_8$ アルキルを表し;

前記アリアルは非置換であるかまたはハロゲンで置換されている。]

【請求項2】

R_{11} が $C_1 - C_6$ アルキルを表し;

R_{12} が水素を表し;

R_{41} 、 R_{41}' 、 R_{42} 、 R_{42}' 、 R_{43} および R_{43}' がそれぞれ独立して、水素、またはハロゲンを含むかまたは含まない $C_1 - C_8$ アルキルを表すか;または、異なる炭素原子上にある R_{41} 、 R_{41}' 、 R_{43} および R_{43}' の2個が結合して、 $(CH_2)_2$ を形成し;

R_{44} が $-OR_{45}$ であり;

R_{51} 、 R_{51}' 、 R_{52} 、 R_{52}' 、 R_{53} および R_{53}' がそれぞれ独立して水素または $C_1 - C_8$ アルキルを表すか;または、異なる炭素原子上にある R_{51} 、 R_{51}' 、 R_{52} 、 R_{52}' 、 R_{53} および R_{53}' の2個が結合して、 CH_2 または $(CH_2)_2$ を形成し;

R_{13} が水素を表し;

R_{45} がナトリウムイオンを表し;

Xがハロゲン、 $C_3 - C_6$ シクロアルキルまたは $C_1 - C_6$ アルキルチオを表し;

Zが水素を表し;

Yが、それぞれハロゲンを含むかまたは含まない $C_1 - C_{12}$ アルキルまたは $C_2 - C_6$ アルケニル; $-OR_3$; $-SR_3$; $-SOR_4$; $-(C_1 - C_6 \text{アルキル}) - OR_3$;それぞれ非置換であるかまたは $C_1 - C_6$ アルキルおよびハロゲンから選択される1~3個の基で置換されている $C_3 - C_8$ シクロアルキルまたは $C_3 - C_6$ シクロアルキル- $C_1 - C$

10

20

30

40

50

6 アルキル；アリール；またはヘテロシクリルを表し；

R₃ がそれぞれ独立して C₁ - C₆ アルキルを表し；

R₄ がそれぞれ独立して C₁ - C₆ アルキルを表し；

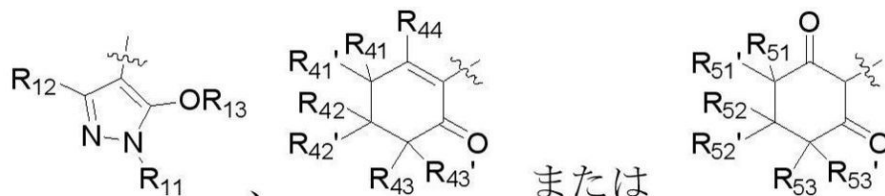
前記アリールが非置換であるかまたは 1 ~ 3 個のハロゲンで置換されている、

請求項 1 に記載の式 I に示される置換 1, 2, 4 - トリアゾール [4, 3 - a] ピリジン誘導体。

【請求項 3】

Q が、下記式で表される基

【化 3】



10

を表し；

R₁₁ が C₁ - C₆ アルキルを表し；

R₁₂ が水素を表し；

R₁₃ が水素を表し；

R₄₁、R_{41'}、R₄₂、R_{42'}、R₄₃ および R_{43'} がそれぞれ独立して、水素またはハロゲン化 C₁ - C₆ アルキルを表すか；または異なる炭素原子上にある R₄₁、R_{41'}、R₄₃ および R_{43'} の 2 個が結合して、(CH₂)₂ を形成し；

R₄₄ が - ONa であり；

R₅₁、R_{51'}、R₅₂、R_{52'}、R₅₃ および R_{53'} がそれぞれ独立して、水素または C₁ - C₆ アルキルを表すか；または異なる炭素原子上にある R₅₁、R_{51'}、R₅₂、R_{52'}、R₅₃ および R_{53'} の 2 個が結合して、CH₂ または (CH₂)₂ を形成し；

X が、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、C₃ - C₆ シクロアルキルまたは C₁ - C₆ アルキルチオを表し；

Y がそれぞれフッ素または塩素を含むかまたは含まない C₁ - C₁₀ アルキルまたは C₂ - C₆ アルケニル； - OR₃； - SR₃； - SOR₄； - (C₁ - C₃ アルキル) - OR₃；それぞれ非置換であるかまたは C₁ - C₆ アルキルおよびフッ素から選択される 1 ~ 2 個の基で置換されている C₃ - C₆ シクロアルキルまたは C₃ - C₆ シクロアルキル - C₁ - C₃ アルキル；アリール；またはヘテロシクリルを表し；

R₃ がそれぞれ独立して C₁ - C₆ アルキルを表し；

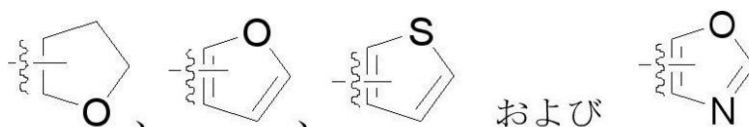
R₄ がそれぞれ独立して C₁ - C₆ アルキルを表し；

Z が水素を表し；

前記アリールが非置換であるかまたはフッ素および塩素から選択される 1 ~ 2 個の基で置換されており；

前記アリールがフェニルであり；前記ヘテロシクリルが、下記式で表される基

【化 4】



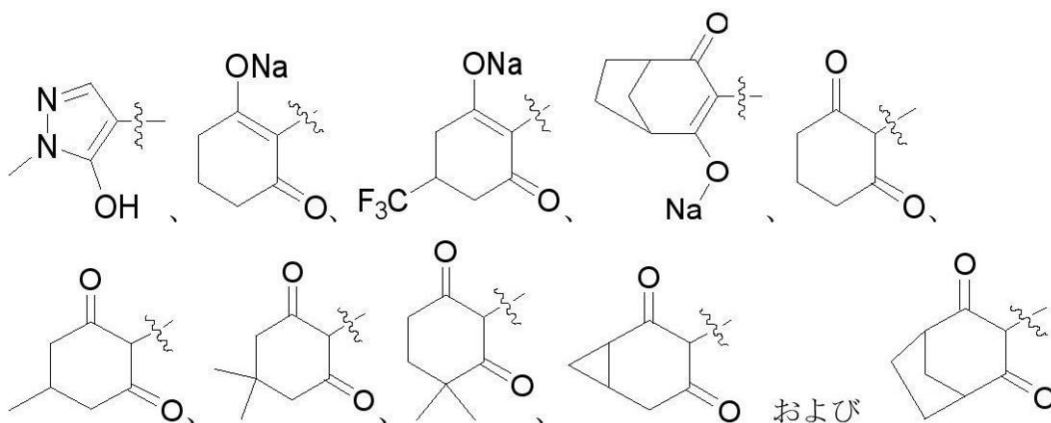
から選択される、請求項 1 または 2 に記載の式 I で示される置換 1, 2, 4 - トリアゾール [4, 3 - a] ピリジン誘導体。

【請求項 4】

Q が、下記式で表される基

50

【化 5】



10

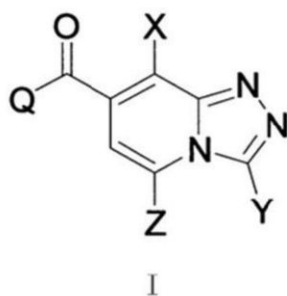
から選択される、請求項 3 に記載の式 I で示される置換 1, 2, 4 - トリアゾール [4, 3 - a] ピリジン誘導体。

【請求項 5】

以下の化合物 2、41、43、45、68、69、70、83、87、88、114、115、118、133、263、264、265、271、274、297、305、317、622、628、630、632、638、643、647、652、669、671、700、701、702、703、707、708、711、712、721、724、725、727、731、741、743、745、746、749、750、751、752、753、754、755、756、760、761、764、765、767、768、771、776、789 および 791 から選択される、請求項 1 に記載の式 I で示される置換 1, 2, 4 - トリアゾール [4, 3 - a] ピリジン誘導体。

20

【化 6】

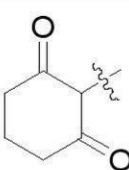
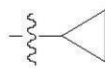
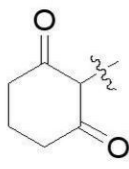
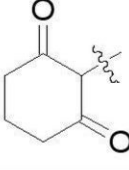
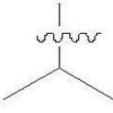
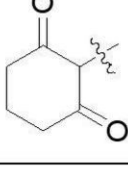
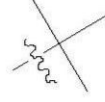


30

40

50

【表 1】

番号	Q	X	Y	Z
2		Cl		H
41		Cl	CH ₂ CH ₃	H
43		Cl		H
45		Cl		H

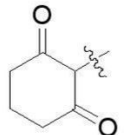
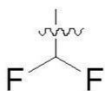
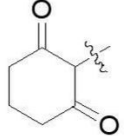
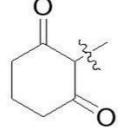
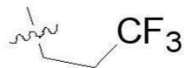
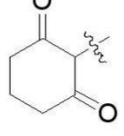

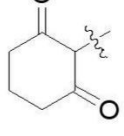

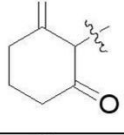

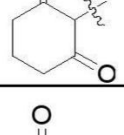

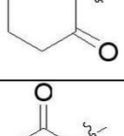
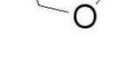
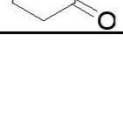
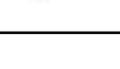
10

20

30

40

50

68		Cl		H
69		Cl	CF ₃	H
70		Cl		H
83		Cl		H
87		Cl		H
88		Cl		H
114		Cl		H
115		Cl		H
118		Cl		H

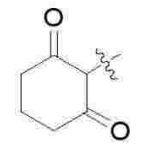
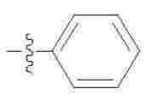
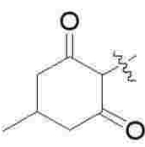
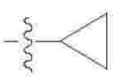
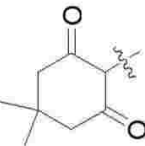
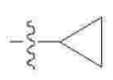
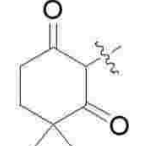
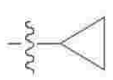
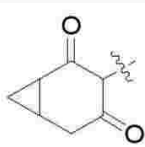
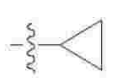
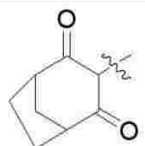
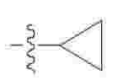
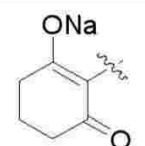
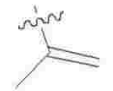
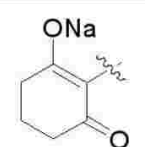
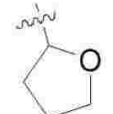
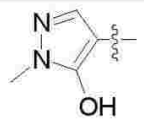
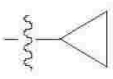
10

20

30

40

50

133		Cl		H
263		Cl		H
264		Cl		H
265		Cl		H
271		Cl		H
274		Cl		H
297		Cl		H
305		Cl		H
317		Cl		H

10

20

30

40

50

622			CH ₂ CH ₃	H
628		Cl		H
630		Cl		H
632		Cl		H
638		Cl		H
643		Cl		H
647		Cl		H
652		Cl		H
669		Cl		H

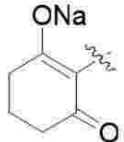
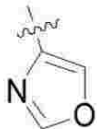
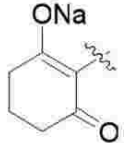

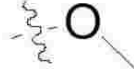
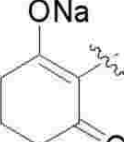
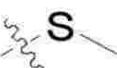

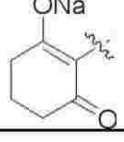

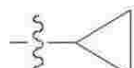
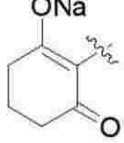
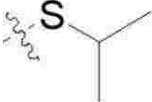
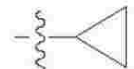
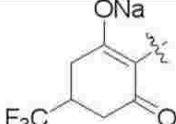
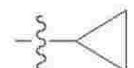
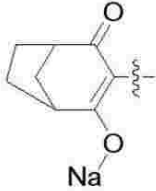
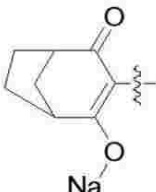

10

20

30

40

50

671		Cl		H
700				H
701				H
702				H
703				H
707		Cl		H
708		Cl	CH ₃	H
711		Cl		H

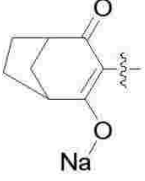

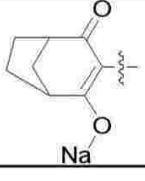
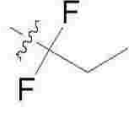
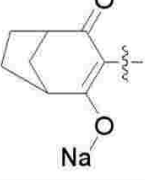
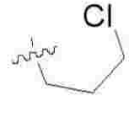
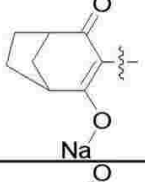
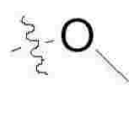
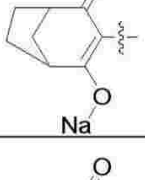
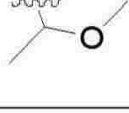
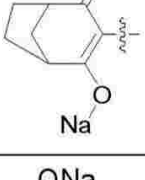
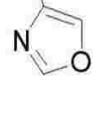
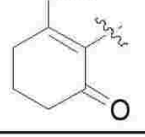
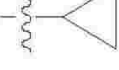
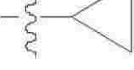
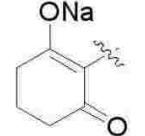
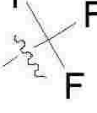
10

20

30

40

50

712		Cl		H
721		Cl		H
724		Cl		H
725		Cl		H
727		Cl		H
731		Cl		H
741				H
743		Cl		H

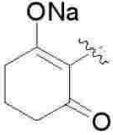
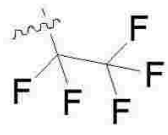
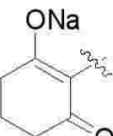
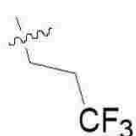
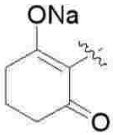
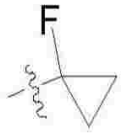
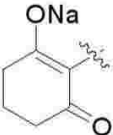
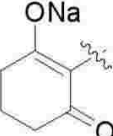
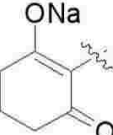


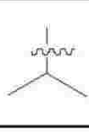
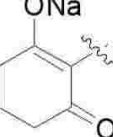

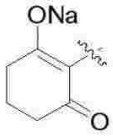
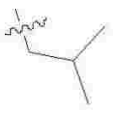
10

20

30

40

50

745		Cl		H
746		Cl		H
749		Cl		H
750		Cl	CH ₃	H
751		Cl	CH ₂ CH ₃	H
752		Cl		H
753		Cl		H
754		Cl		H
755		Cl		H

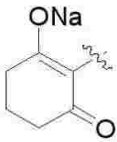

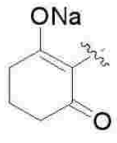

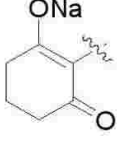

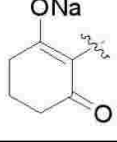
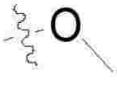
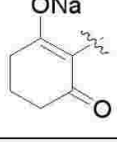
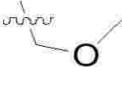
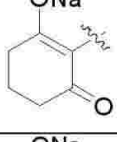

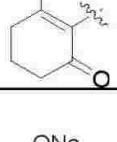

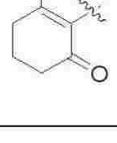

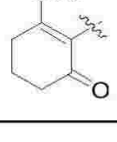

10

20

30

40

50

756		Cl		H
760		Cl		H
761		Cl		H
764		Cl		H
765		Cl		H
767		Cl		H
768		Cl		H
771		Cl		H
776		Cl		H

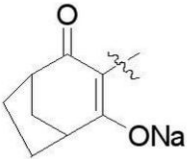
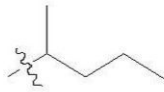
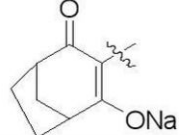
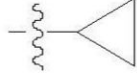
10

20

30

40

50

789		Cl		H
791		Cl		H

10

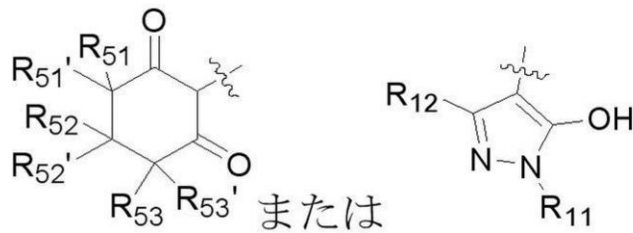
【請求項 6】

置換 1, 2, 4 - トリアゾール [4, 3 - a] ピリジン誘導体の製造方法であって、
前記置換 1, 2, 4 - トリアゾール [4, 3 - a] ピリジン誘導体が式 I で示され、
【化 7】



20

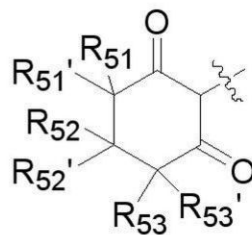
Q が、下記式で表される基
【化 8】



30

であり、R₁₁、R₁₂、R₅₁、R_{51'}、R₅₂、R_{52'}、R₅₃、R_{53'}、X、Y および Z は請求項 1 で定義した通りであり、

Q が、下記式で表される基
【化 9】

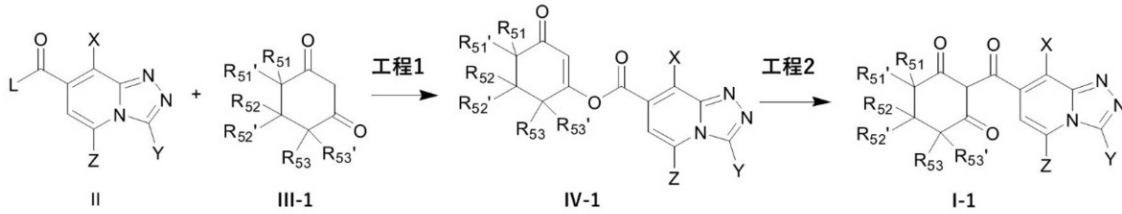


40

である場合、前記製造方法が下記の工程：

50

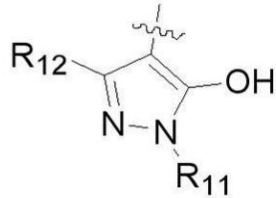
【化 1 0】



を含み、

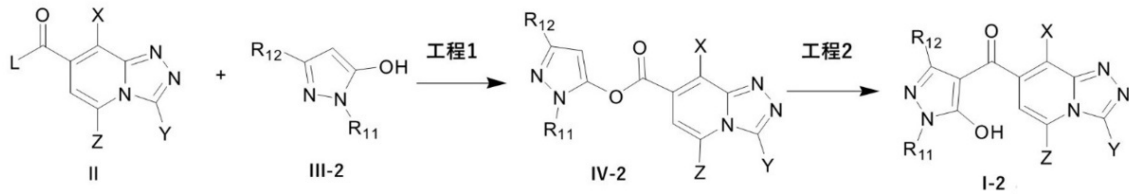
Q が、下記式で表される基

【化 1 1】



である場合、前記製造方法が下記の工程：

【化 1 2】



を含み、

前記工程 1 が、塩基および溶媒の存在下で 0 ~ 25 で行われる縮合反応であり、

前記工程 2 が、触媒、塩基および溶媒の存在下で 20 ~ 70 で行われる転位反応であり、

上記各式中、L は脱離基を表す、前記製造方法。

【請求項 7】

請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の式 I で示される置換 1, 2, 4 - トリアゾロ [4, 3 - a] ピリジン誘導体を含む、除草剤組成物。

【請求項 8】

1 種以上のさらなる除草剤および / または安全剤をさらに含む、請求項 7 に記載の除草剤組成物。

【請求項 9】

農薬的に許容可能な製剤助剤をさらに含む、請求項 7 または 8 に記載の除草剤組成物。

【請求項 10】

雑草を防除するための方法であって、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の式 I で示される置換 1, 2, 4 - トリアゾロ [4, 3 - a] ピリジン誘導体または請求項 7 ~ 9 のいずれか一項に記載の除草剤組成物の少なくとも 1 種の除草有効量を植物または雑草地に適用することを含む、前記方法。

【請求項 11】

雑草を防除するための、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の式 I で示される置換 1, 2, 4 - トリアゾール [4, 3 - a] ピリジン誘導体または請求項 7 ~ 9 のいずれか一項に記載の除草剤組成物の少なくとも 1 種の、使用。

【発明の詳細な説明】

10

20

30

40

50

【技術分野】

【0001】

本発明は、農薬技術の分野、特に、置換1, 2, 4-トリアゾール[4, 3-a]ピリジン誘導体のタイプ農薬技術、その製造方法、除草剤組成物および使用に関する。

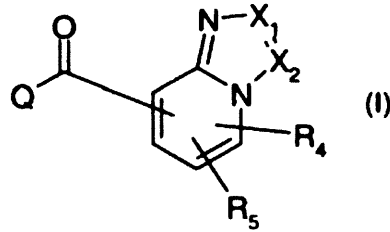
【背景技術】

【0002】

雑草の防除は、効率の高い農業を実現する上で最も重要なリンクの1つです。様々な除草剤が市場で入手可能であり、例えば、特許WO2008006540A1には、以下の一般式(I)

【化1】

10



で表されるトリアゾロピリジン誘導体が除草剤として使用されることが開示されている。しかしながら、高い効力、安全性、経済性および様々な作用機序を備える新しい除草剤を開発する必要性が依然として存在する。

20

【発明の詳細な説明】

【0003】

これに基づいて、本発明は、ある種の置換1, 2, 4-トリアゾール[4, 3-a]ピリジン誘導体、その製造方法、除草剤組成物および使用を提供する。この化合物およびその組成物は、優れた除草活性および高い作物安全性、特にイネ等の主要作物に対する優れた選択性を備えている。

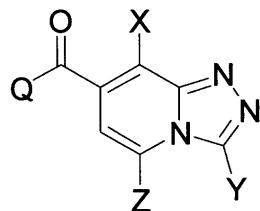
【0004】

本発明によって採用される技術的解決方法は以下の通りである：

式Iに示される置換1, 2, 4-トリアゾロ[4, 3-a]ピリジン誘導体：

30

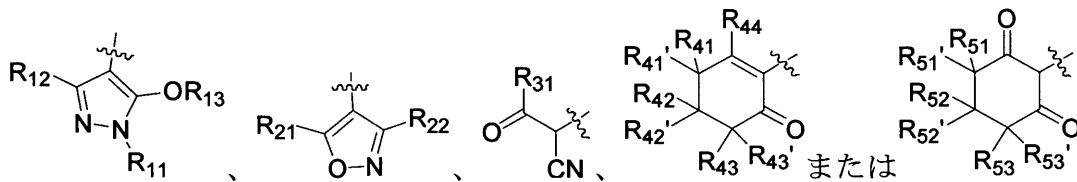
【化2】



[式中、Qは

【化3】

40



を表し；

R₁₁はアルキル、ハロゲン化アルキルまたはアリアルを表し；

R₁₂は水素；それぞれハロゲンを含むかまたは含まないアルキル、アルケニルまたはアルキニル；非置換であるかまたはアルキル、シアノおよびハロゲンから選択される少な

50

くとも1個の基で置換されているシクロアルキルを表し；

R_{21} および R_{22} はそれぞれ独立して、水素；それぞれハロゲンを含むかまたは含まないアルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシ、アルキルチオ、アルキルスルホキシド、アルキルスルホニル、アルコキシアルキル、アルキルカルボニルまたはアルコキシカルボニル；非置換であるかまたはアルキル、シアノおよびハロゲンから選択される少なくとも1個の基で置換されているシクロアルキル；アリールまたはヘテロシクリルを表し；

R_{31} は水素；それぞれハロゲンを含むかまたは含まないアルキル、アルケニルまたはアルキニル；非置換であるかまたはアルキル、シアノおよびハロゲンから選択される少なくとも1個の基で置換されているシクロアルキル；アリールまたはヘテロシクリルを表し；

R_{41} 、 R_{41}' 、 R_{42} 、 R_{42}' 、 R_{43} および R_{43}' はそれぞれ独立して、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル；アルコキシ、アルキルチオ、アルコキシアルキル、アルキルチオアルキル、アルキルカルボニル、アルコキシカルボニル、アリールまたはヘテロシクリルを表すか；または、異なる炭素原子上にある R_{41} 、 R_{41}' 、 R_{42} 、 R_{42}' 、 R_{43} および R_{43}' の2個が結合して、 CH_2 、 $(CH_2)_2$ 、 $(CH_2)_3$ 、 $(CH_2)_4$ 、 $(CH_2)_5$ 、 $(CH_2)_6$ 、O、 $O(CH_2)_2O$ 、 $O(CH_2)_3O$ 、 $O(CH_2)_4O$ 、 $S(CH_2)_2S$ または $S(CH_2)_3S$ を形成するか；または、同じ炭素原子上にある R_{41} 、 R_{41}' 、 R_{42} 、 R_{42}' 、 R_{43} および R_{43}' の2個が結合して、 $(CH_2)_2$ 、 $(CH_2)_3$ 、 $(CH_2)_4$ 、 $(CH_2)_5$ 、 $(CH_2)_6$ 、O、 $O(CH_2)_2O$ 、 $O(CH_2)_3O$ 、 $O(CH_2)_4O$ 、 $S(CH_2)_2S$ または $S(CH_2)_3S$ を形成し；

R_{44} は $-OR_{45}$ および $-SR_{45}$ から選択され；

R_{51} 、 R_{51}' 、 R_{52} 、 R_{52}' 、 R_{53} および R_{53}' はそれぞれ独立して、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、アルコキシ、アルキルチオ、アルコキシアルキル、アルキルチオアルキル、アルキルカルボニル、アルコキシカルボニル、アリールまたはヘテロシクリルを表すか；または、異なる炭素原子上にある R_{51} 、 R_{51}' 、 R_{52} 、 R_{52}' 、 R_{53} および R_{53}' の2個が結合して、 CH_2 、 $(CH_2)_2$ 、 $(CH_2)_3$ 、 $(CH_2)_4$ 、 $(CH_2)_5$ 、 $(CH_2)_6$ 、O、 $O(CH_2)_2O$ 、 $O(CH_2)_3O$ 、 $O(CH_2)_4O$ 、 $S(CH_2)_2S$ または $S(CH_2)_3S$ を形成するか；または、同じ炭素原子上にある R_{51} 、 R_{51}' 、 R_{52} 、 R_{52}' 、 R_{53} および R_{53}' の2個が結合して、 $(CH_2)_2$ 、 $(CH_2)_3$ 、 $(CH_2)_4$ 、 $(CH_2)_5$ 、 $(CH_2)_6$ 、O、 $O(CH_2)_2O$ 、 $O(CH_2)_3O$ 、 $O(CH_2)_4O$ 、 $S(CH_2)_2S$ または $S(CH_2)_3S$ を形成し；

R_{13} および R_{45} はそれぞれ独立して、水素、 $-R_{61}$ 、 $-S(O)_nR_{62}$ 、 $-CH_2R_{63}$ 、 $-(C=O)R_{64}$ 、 $-PO(OR_{65})_2$ または $-Si(OR_{66})_3$ を表し；

R_{61} は金属イオン；アンモニウムイオン；それぞれハロゲンを含むかまたは含まないアルキル、アルケニルまたはアルキニル；アリールまたはヘテロシクリルを表し；

R_{62} は、それぞれハロゲンを含むかまたは含まないアルキル、アルケニルまたはアルキニル；アリールまたはヘテロシクリルを表し；nは1、2または3を表し；

R_{63} はハロゲン；ニトロ；シアノ；それぞれハロゲンを含むかまたは含まないアルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシ、アルコキシカルボニルまたはアルキルチオ；非置換であるかまたはアルキル、シアノおよびハロゲンから選択される少なくとも1個の基で置換されているシクロアルキル；それぞれ非置換であるかまたはアルキル、アルキルカルボニルおよびハロゲン化アルキルから選択される少なくとも1個の基で置換されているアミノまたはアミノカルボニル；アリール；ヘテロシクリル；アリールカルボニルまたはヘテロシクリルカルボニルを表し；

R_{64} はハロゲン；ニトロ；シアノ；それぞれハロゲンを含むかまたは含まないアルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシ、アルキルチオ、アルコキシアルキルまたはアルキルチオアルキル；それぞれ非置換であるかまたはアルキル、アルキルカルボニルおよびハロゲン化アルキルから選択される少なくとも1個の基で置換されているアミノまたはアミノアルキル；アリール；ヘテロシクリル；アリールアルキル；ヘテロシクリルアルキ

10

20

30

40

50

ル；アリーールオキシ；ヘテロシクリロキシ；アリーールオキシアルキルまたはヘテロシクリルオキシアルキルを表し；

R₆₅およびR₆₆はそれぞれ独立して、水素、アルキル、ハロゲン化アルキル、シクロアルキル、アリーールまたはヘテロシクリルを表し；

XおよびZはそれぞれ独立して、水素；ハロゲン；シアノ；ニトロ；-NR₁R₂；それぞれハロゲンを含むかまたは含まないアルケニル、アルキニル、シクロアルキル、アルコキシ、アルキルチオ、アルキルスルホキシド、アルキルスルホニル、アルコキシアルキル、アルキルチオアルキル、アルキルスルホキシアルキルまたはアルキルスルホニルアルキルを表し；

R₁およびR₂はそれぞれ独立して、水素、アルキルまたはハロゲン化アルキルを表し、-NR₁R₂は5～8員のラクタム基を表し；

Yは水素；ハロゲン；ホルミル；それぞれハロゲンを含むかまたは含まないアルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシ、アルキルチオ、アルキルスルホキシド、アルキルスルホニル、アルキルアシル、シアノアルキル、アルコキシアルキル、アルキルチオアルキル、アルキルスルホキシアルキルまたはアルキルスルホニルアルキル；それぞれ非置換であるかまたはアルキル、アルケニル、アルキニル、アルキルアシル、ハロゲン化アルキル、ハロゲン化アルケニル、ハロゲン化アルキニル、ハロゲン化アルキルアシルおよびアリーールから選択される少なくとも1個の基で置換されているアミノアルキルまたはアミノアシル；それぞれ非置換であるかまたはアルキル、シアノおよびハロゲンから選択される少なくとも1個の基で置換されているシクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルケニルまたはシクロアルケニルアルキル；アリーール；ヘテロシクリル；アリーールアルキルまたはヘテロシクリルアルキルで表し；

上記アリーールまたはヘテロシクリルはそれぞれ置換または非置換であり、前記「置換」は、ハロゲン；ニトロ；シアノ；チオシアノ；シアノアルキル；メルカプト；ヒドロキシ；ヒドロキシアルキル；カルボキシル；ホルミル；アジド；トリアルキルシリル；ジアルキルホスホノ；それぞれ非置換であるかまたはアルキル、ハロゲン化アルキル、アルキルスルホニル、アルキルアシル、アルキルアシルオキシ、アルコキシアシル、ハロゲン、アルコキシ、アルキルチオ、シアノ、アミノおよびアルキルアミノから選択される少なくとも1個の基で置換されているヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、アリーールまたはアリーールアルキル；それぞれハロゲンを含むかまたは含まないアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルケニル、シクロアルキルアルキル、シクロアルケニルアルキル、アルキル置換シクロアルキル、OR[']、SR[']、-アルキル-OR[']、-O-アルキル-OR[']、-アルキル-SR[']、COR[']、-アルキル-COR[']、-O-アルキル-COR[']、COOR[']、-アルキル-COOR[']、-O-アルキル-COOR[']、COSR[']、SOR[']、₂SR[']、-O-S₂OR[']、-アルキル-S₂OR[']、OCOR[']、-アルキル-OCOR[']またはSCOR[']；それぞれ非置換であるかまたはR[']、COR[']、COOR[']、S₂OR[']、-アルキル-S₂OR[']およびOR[']から選択される1または2個の基で置換されており、上記各基がハロゲンを含むかまたは含まないアミノ、アミノカルボニル、アミノカルボニルアルキルまたはアミノスルホニルから選択される少なくとも1個の基で置換されているか；または、環内の任意の2個の隣接する炭素原子と基-CH₂CH₂CH₂-、-OCH₂CH₂-、-OCH₂O-、-OCH₂CH₂O-または-CH=CH-CH=CH-とが結合して縮合環が形成されることを指し；

R[']はそれぞれ独立して、アルキル；アルケニル；アルキニル；シクロアルキル；シクロアルキルアルキル；シクロアルケニル；シクロアルケニルアルキル；または、それぞれ非置換であるかまたは置換されているヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、アリーールまたはアリーールアルキルを表す。]

【0005】

別の実施形態において、Qは

10

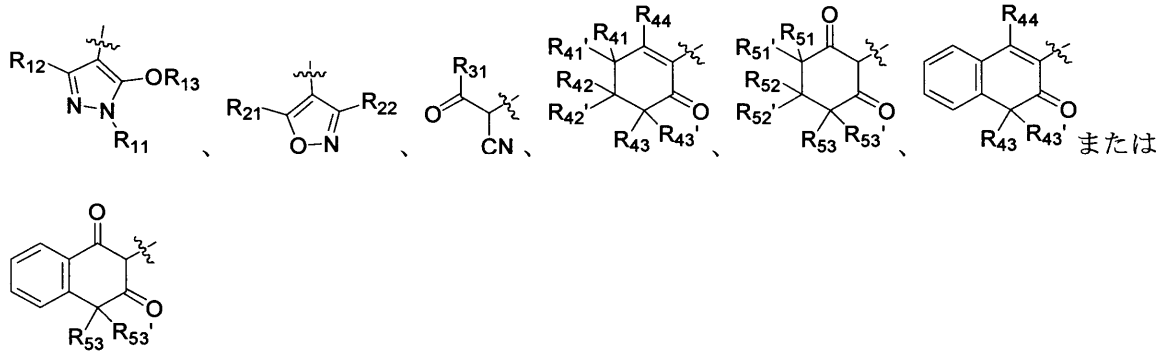
20

30

40

50

【化 4】



10

を表し；

R_{11} はアルキル、ハロゲン化アルキルまたはアリールを表し；

R_{12} は水素；それぞれハロゲンを含むかまたは含まないアルキル、アルケニルまたはアルキニル；非置換であるかまたはアルキル、シアノおよびハロゲンから選択される少なくとも1個の基で置換されているシクロアルキル；

R_{21} および R_{22} はそれぞれ独立して、水素；それぞれハロゲンを含むかまたは含まないアルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシ、アルキルチオ、アルキルスルホキシド、アルキルスルホニル、アルコキシアルキル、アルキルカルボニルまたはアルコキシカルボニル；非置換であるかまたはアルキル、シアノおよびハロゲンから選択される少なくとも1個の基で置換されているシクロアルキル；アリールまたはヘテロシクリルを表し；

20

R_{31} は水素；それぞれハロゲンを含むかまたは含まないアルキル、アルケニルまたはアルキニル；非置換であるかまたはアルキル、シアノおよびハロゲンから選択される少なくとも1個の基で置換されているシクロアルキル；アリールまたはヘテロシクリルを表し；

R_{41} 、 R_{41}' 、 R_{42} 、 R_{42}' 、 R_{43} および R_{43}' はそれぞれ独立して、水素；それぞれハロゲンを含むかまたは含まないアルキル、アルケニル、アルキニルまたはシクロアルキル；アルコキシ；アルキルチオ；アルコキシアルキル；アルキルチオアルキル；アルキルカルボニル；アルコキシカルボニル；アリールまたはヘテロシクリルを表すか；または、異なる炭素原子上にある R_{41} 、 R_{41}' 、 R_{42} 、 R_{42}' 、 R_{43} および R_{43}' の2個が結合して、 CH_2 、 $(CH_2)_2$ 、 $(CH_2)_3$ 、 $(CH_2)_4$ 、 $(CH_2)_5$ 、 $(CH_2)_6$ 、 O 、 $O(CH_2)_2O$ 、 $O(CH_2)_3O$ 、 $O(CH_2)_4O$ 、 $S(CH_2)_2S$ または $S(CH_2)_3S$ を形成するか；または、同じ炭素原子上にある R_{41} 、 R_{41}' 、 R_{42} 、 R_{42}' 、 R_{43} および R_{43}' の2個が結合して、 $(CH_2)_2$ 、 $(CH_2)_3$ 、 $(CH_2)_4$ 、 $(CH_2)_5$ 、 $(CH_2)_6$ 、 O 、 $O(CH_2)_2O$ 、 $O(CH_2)_3O$ 、 $O(CH_2)_4O$ 、 $S(CH_2)_2S$ または $S(CH_2)_3S$ を形成し；

30

R_{44} は $-OR_{45}$ および $-SR_{45}$ から選択され；

R_{51} 、 R_{51}' 、 R_{52} 、 R_{52}' 、 R_{53} および R_{53}' はそれぞれ独立して、水素；それぞれハロゲンを含むかまたは含まないアルキル、アルケニル、アルキニルまたはシクロアルキル；アルコキシ；アルキルチオ；アルコキシアルキル；アルキルチオアルキル；アルキルカルボニル；アルコキシカルボニル；アリールまたはヘテロシクリルを表すか；または、異なる炭素原子上にある R_{51} 、 R_{51}' 、 R_{52} 、 R_{52}' 、 R_{53} および R_{53}' の2個が結合して、 CH_2 、 $(CH_2)_2$ 、 $(CH_2)_3$ 、 $(CH_2)_4$ 、 $(CH_2)_5$ 、 $(CH_2)_6$ 、 O 、 $O(CH_2)_2O$ 、 $O(CH_2)_3O$ 、 $O(CH_2)_4O$ 、 $S(CH_2)_2S$ または $S(CH_2)_3S$ を形成するか；または、同じ炭素原子上にある R_{51} 、 R_{51}' 、 R_{52} 、 R_{52}' 、 R_{53} および R_{53}' の2個が結合して、 $(CH_2)_2$ 、 $(CH_2)_3$ 、 $(CH_2)_4$ 、 $(CH_2)_5$ 、 $(CH_2)_6$ 、 O 、 $O(CH_2)_2O$ 、 $O(CH_2)_3O$ 、 $O(CH_2)_4O$ 、 $S(CH_2)_2S$ または $S(CH_2)_3S$ を形成し；

40

R_{13} および R_{45} はそれぞれ独立して、水素、 $-R_{61}$ 、 $-S(O)_nR_{62}$ 、 $-CH_2R_{63}$ 、 $-(C=O)R_{64}$ 、 $-PO(OR_{65})_2$ または $-Si(OR_{66})_3$ を表し、

50

R₆₁は金属イオン；アンモニウムイオン；それぞれハロゲンを含むかまたは含まないアルキル、アルケニルまたはアルキニル；アリールまたはヘテロシクリルを表し；

R₆₂は、それぞれハロゲンを含むかまたは含まないアルキル、アルケニル、またはアルキニル；アリールまたはヘテロシクリルを表し；nは1、2または3を表し；

R₆₃はハロゲン；ニトロ；シアノ；それぞれハロゲンを含むかまたは含まないアルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシ、アルコキシカルボニルまたはアルキルチオ；非置換であるかまたはアルキル、シアノおよびハロゲンから選択される少なくとも1個の基で置換されているシクロアルキル；それぞれ非置換であるかまたはアルキル、アルキルカルボニルおよびハロゲン化アルキルから選択される少なくとも1個の基で置換されているアミノまたはアミノカルボニル；アリール；ヘテロシクリル；アリールカルボニルまたはヘテロシクリルカルボニルを表し；

10

R₆₄はハロゲン；ニトロ；シアノ；それぞれハロゲンを含むかまたは含まないアルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシ、アルキルチオ、アルコキシアルキルまたはアルキルチオアルキル；それぞれ非置換であるかまたはアルキル、アルキルカルボニルおよびハロゲン化アルキルから選択される少なくとも1個の基で置換されているアミノまたはアミノアルキル；アリール；ヘテロシクリル；アリールアルキル；ヘテロシクリルアルキル；アリールオキシ；ヘテロシクリロキシ；アリールオキシアルキルまたはヘテロシクリルオキシアルキルを表し；

R₆₅およびR₆₆はそれぞれ独立して、水素、アルキル、ハロゲン化アルキル、シクロアルキル、アリールまたはヘテロシクリルを表し；

20

XおよびZはそれぞれ独立して、水素；ハロゲン；シアノ；ニトロ；-NR₁R₂；それぞれハロゲンを含むかまたは含まないアルケニル、アルキニル、シクロアルキル、アルコキシ、アルキルチオ、アルキルスルホキシド、アルキルスルホニル、アルコキシアルキル、アルキルチオアルキル、アルキルスルホキシアルキルまたはアルキルスルホニルアルキルを表し；

R₁およびR₂はそれぞれ独立して、水素、アルキルもしくはハロゲン化アルキルを表すか、または-NR₁R₂は5～8員のラクタム基を表し；

Yは水素；ハロゲン；ホルミル；シアノアルキル；それぞれハロゲンを含むかまたは含まないアルキル、アルケニルまたはアルキニル；-OR₃；-OCOR₄；-COR₄；-SR₃；-SOR₄；-SO₂R₄；-アルキル-OR₃；-アルキル-OCOR₄；-アルキル-COR₄；-アルキル-SR₃；-アルキル-SOR₄；-アルキル-SO₂R₄；それぞれ非置換であるかまたはアルキル、アルケニル、アルキニル、アルキルアシル、ハロゲン化アルキル、ハロゲン化アルケニル、ハロゲン化アルキニル、ハロゲン化アルキルアシルおよびアリールから選択される少なくとも1個の基で置換されているアミノ、アミノアルキルまたはアミノアシル；それぞれ非置換であるかまたはアルキル、シアノおよびハロゲンから選択される少なくとも1個の基で置換されているシクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルケニルまたはシクロアルケニルアルキル；アリール；ヘテロシクリル；アリールアルキルまたはヘテロシクリルアルキルを表し；

30

R₃はそれぞれ独立して、水素；金属イオン；それぞれハロゲンを含むかまたは含まないアルキル、アルケニル、アルキニルまたはシクロアルキルを表し；

40

R₄はそれぞれ独立して、それぞれハロゲンを含むかまたは含まないアルキル、アルケニル、アルキニルまたはシクロアルキルを表し；

前記アリールまたはヘテロシクリルはそれぞれ置換または非置換であり、前記「置換」は、ハロゲン；ニトロ；シアノ；チオシアノ；シアノアルキル；メルカプト；ヒドロキシ；ヒドロキシアルキル；カルボキシル；ホルミル；アジド；トリアルキルシリル；ジアルキルホスホノ；それぞれ非置換であるかまたはアルキル、ハロゲン化アルキル、アルキルスルホニル、アルキルアシル、アルキルアシルオキシ、アルコキシアシル、ハロゲン、アルコキシ、アルキルチオ、シアノ、アミノおよびアルキルアミノから選択される少なくとも1個の基で置換されているヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、アリールまたはアリールアルキル；それぞれハロゲンを含むかまたは含まないアルキル、アルケニル、ア

50

ルキニル、シクロアルキル、シクロアルケニル、シクロアルキルアルキル、シクロアルケニルアルキル、アルキル置換シクロアルキル、OR'、SR'、-アルキル-OR'、-O-アルキル-OR'、-アルキル-SR'、COR'、-アルキル-COR'、-O-アルキル-COR'、COOR'、-アルキル-COOR'、-O-アルキル-COOR'、COSR'、SOR'、 S_2OR' 、-O- S_2OR' 、-アルキル- S_2OR' 、OCOR'、-アルキル-OCOR'またはSCOR'；それぞれ非置換であるかまたはR'、COR'、COOR'、 S_2OR' 、-アルキル- S_2OR' およびOR'から選択される1または2個の基で置換されており、前記各基はハロゲンを含むかまたは含まないアミノ、アミノカルボニル、アミノカルボニルアルキルまたはアミノスルホニルから選択される少なくとも1個の基で置換されているかまたは、環内の任意の2個の隣接する炭素原子と基-CH₂CH₂CH₂-、-OCH₂CH₂-、-OCH₂O-、-OCH₂CH₂O-または-CH=CH-CH=CH-とが結合して縮合環を形成されることを指し；

R'はそれぞれ独立して、アルキル；アルケニル；アルキニル；シクロアルキル；シクロアルキルアルキル；シクロアルケニル；シクロアルケニルアルキル；または、それぞれ非置換であるかまたは置換されているヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、アリールまたはアリールアルキルを表す。

【0006】

好ましくは、R₁₁はC₁-C₈アルキル、ハロゲン化C₁-C₈アルキルまたはアリールを表し；

R₁₂は水素；それぞれハロゲンを含むかまたは含まないC₁-C₈アルキル、C₂-C₈アルケニルまたはC₂-C₈アルキニル；非置換であるかまたはC₁-C₈アルキル、シアノおよびハロゲンから選択される1~3個の基で置換されているC₃-C₈シクロアルキルを表し；

R₂₁およびR₂₂はそれぞれ独立して、水素；それぞれハロゲンを含むかまたは含まないC₁-C₈アルキル、C₂-C₈アルケニル、C₂-C₈アルキニル、C₁-C₈アルコキシ、C₁-C₈アルキルチオ、C₁-C₈アルキルスルホキシド、C₁-C₈アルキルスルホニル、C₁-C₈アルコキシ-C₁-C₈アルキル、C₁-C₈アルキルカルボニルまたはC₁-C₈アルコキシカルボニル；非置換であるかまたはC₁-C₈アルキル、シアノおよびハロゲンから選択される1~3個の基で置換されているC₃-C₈シクロアルキル；アリールまたはヘテロシクリルを表し；

R₃₁は水素；それぞれハロゲンを含むかまたは含まないC₁-C₈アルキル、C₂-C₈アルケニルまたはC₂-C₈アルキニル；非置換であるかまたはC₁-C₈アルキル、シアノおよびハロゲンから選択される1~3で置換されているC₃-C₈シクロアルキル；アリール、ヘテロシクリルを表し；

R₄₁、R₄₁'、R₄₂、R₄₂'、R₄₃およびR₄₃'はそれぞれ独立して、水素、C₁-C₈アルキル、C₂-C₈アルケニル、C₂-C₈アルキニル、C₃-C₈シクロアルキル、C₁-C₈アルコキシ、C₁-C₈アルキルチオ、C₁-C₈アルコキシ-C₁-C₈アルキル、C₁-C₈アルキルチオ-C₁-C₈アルキル、C₁-C₈アルキルカルボニル、C₁-C₈アルコキシカルボニル、アリールまたはヘテロシクリルを表すか；または、異なる炭素原子上にあるR₄₁、R₄₁'、R₄₂、R₄₂'、R₄₃およびR₄₃'の2個が結合して、CH₂、(CH₂)₂、(CH₂)₃、(CH₂)₄、(CH₂)₅、(CH₂)₆、O、O(CH₂)₂O、O(CH₂)₃O、O(CH₂)₄O、S(CH₂)₂SまたはS(CH₂)₃Sを形成するか、または同じ炭素原子上にあるR₄₁、R₄₁'、R₄₂、R₄₂'、R₄₃およびR₄₃'の2個が結合して、(CH₂)₂、(CH₂)₃、(CH₂)₄、(CH₂)₅、(CH₂)₆、O、O(CH₂)₂O、O(CH₂)₃O、O(CH₂)₄O、S(CH₂)₂SまたはS(CH₂)₃Sを形成し；

R₄₄は-OR₄₅または-SR₄₅から選択され；

R₅₁、R₅₁'、R₅₂、R₅₂'、R₅₃およびR₅₃'はそれぞれ独立して、水素、C₁-C₈アルキル、C₂-C₈アルケニル、C₂-C₈アルキニル、C₃-C₈シクロアルキル、C₁-C₈アルコキシ、C₁-C₈アルキルチオ；C₁-C₈アルコキシ-C₁-C₈

10

20

30

40

50

アルキル、 $C_1 - C_8$ アルキルチオ、 $C_1 - C_8$ アルキル、 $C_1 - C_8$ アルキルカルボニル、 $C_1 - C_8$ アルコキシカルボニル、アリールまたはヘテロシクリルを表すか；または、異なる炭素原子上にある R_{51} 、 R_{51}' 、 R_5 、 R_{52}' 、 R_3 および R_{53}' の2個が結合して、 CH_2 、 $(CH_2)_2$ 、 $(CH_2)_3$ 、 $(CH_2)_4$ 、 $(CH_2)_5$ 、 $(CH_2)_6$ 、 O 、 $O(CH_2)_2O$ 、 $O(CH_2)_3O$ 、 $O(CH_2)_4O$ 、 $S(CH_2)_2S$ または $S(CH_2)_3S$ を形成するか、または同じ炭素原子上にある R_{51} 、 R_{51}' 、 R_5 、 R_{52}' 、 R_3 および R_{53}' の2個が結合して、 $(CH_2)_2$ 、 $(CH_2)_3$ 、 $(CH_2)_4$ 、 $(CH_2)_5$ 、 $(CH_2)_6$ 、 O 、 $O(CH_2)_2O$ 、 $O(CH_2)_3O$ 、 $O(CH_2)_4O$ 、 $S(CH_2)_2S$ または $S(CH_2)_3S$ を形成し；

R_{13} および R_{45} はそれぞれ独立して、水素、 $-R_{61}$ 、 $-S(O)_nR_{62}$ 、 $-CH_2R_{63}$ 、 $-(C=O)R_{64}$ 、 $-PO(OR_{65})_2$ または $-Si(OR_{66})_3$ を表し；

R_{61} は金属イオン；アンモニウムイオン；それぞれハロゲンを含むかまたは含まない $C_1 - C_8$ アルキル、 $C_2 - C_8$ アルケニルまたは $C_2 - C_8$ アルキニル；アリールまたはヘテロシクリルを表し；

R_{62} は、それぞれハロゲンを含むかまたは含まない $C_1 - C_8$ アルキル、 $C_2 - C_8$ アルケニルまたは $C_2 - C_8$ アルキニル；アリールまたはヘテロシクリルを表し； n は1、2または3を表し；

R_{63} はハロゲン；ニトロ；シアノ；それぞれハロゲンを含むかまたは含まない $C_1 - C_8$ アルキル、 $C_2 - C_8$ アルケニル、 $C_2 - C_8$ アルキニル、 $C_1 - C_8$ アルコキシ、 $C_1 - C_8$ アルコキシカルボニルまたは $C_1 - C_8$ アルキルチオ；非置換であるかまたは $C_1 - C_8$ アルキル、シアノおよびハロゲンから選択される1～3個の基で置換されている $C_3 - C_8$ シクロアルキル；それぞれ非置換であるかまたは $C_1 - C_8$ アルキル、 $C_1 - C_8$ アルキルカルボニルおよびハロゲン化 $C_1 - C_8$ アルキルから選択される1または2個の基で置換されているアミノまたはアミノカルボニル；アリール；ヘテロシクリル；アリールカルボニルまたはヘテロシクリルカルボニルを表し；

R_{64} はハロゲン；ニトロ；シアノ；それぞれハロゲンを含むかまたは含まない $C_1 - C_8$ アルキル、 $C_2 - C_8$ アルケニル、 $C_2 - C_8$ アルキニル、 $C_1 - C_8$ アルコキシ、 $C_1 - C_8$ アルキルチオ、 $C_1 - C_8$ アルコキシ- $C_1 - C_8$ アルキルまたは $C_1 - C_8$ アルキルチオ- $C_1 - C_8$ アルキル；それぞれ非置換であるかまたは $C_1 - C_8$ アルキル、 $C_1 - C_8$ アルキルカルボニルおよびハロゲン化 $C_1 - C_8$ アルキルから選択される1または2個の基で置換されているアミノまたはアミノ- $C_1 - C_8$ アルキル；アリール；ヘテロシクリル；アリール- $C_1 - C_8$ アルキル；ヘテロシクリル- $C_1 - C_8$ アルキル；アリールオキシ；ヘテロシクリルオキシ；アリールオキシ- $C_1 - C_8$ アルキルまたはヘテロシクリルオキシ- $C_1 - C_8$ アルキルを表し；

R_{65} および R_{66} はそれぞれ独立して、水素、 $C_1 - C_8$ アルキル、ハロゲン化 $C_1 - C_8$ アルキル、 $C_3 - C_8$ シクロアルキル、アリールまたはヘテロシクリルを表し；

X および Z はそれぞれ独立して、水素；ハロゲン；シアノ；ニトロ； $-NR_1R_2$ ；それぞれハロゲンを含むかまたは含まない $C_2 - C_8$ アルケニル、 $C_2 - C_8$ アルキニル、 $C_3 - C_8$ シクロアルキル、 $C_1 - C_8$ アルコキシ、 $C_1 - C_8$ アルキルチオ、 $C_1 - C_8$ アルキルスルホキッド、 $C_1 - C_8$ アルキルスルホニル、 $C_1 - C_8$ アルコキシ- $C_1 - C_8$ アルキル、 $C_1 - C_8$ アルキルチオ- $C_1 - C_8$ アルキル、 $C_1 - C_8$ アルキルスルホキッド- $C_1 - C_8$ アルキルまたは $C_1 - C_8$ アルキルスルホニル- $C_1 - C_8$ アルキルを表し；

R_1 および R_2 はそれぞれ独立して、水素、 $C_1 - C_8$ アルキルまたはハロゲン化 $C_1 - C_8$ アルキルを表すか、または $-NR_1R_2$ は5～8員のラクタム基を表し；

Y は水素；ハロゲン；ホルミル；それぞれハロゲンを含むかまたは含まない $C_1 - C_{18}$ アルキル、 $C_2 - C_8$ アルケニル、 $C_2 - C_8$ アルキニル、 $C_1 - C_8$ アルコキシ、 $C_1 - C_8$ アルキルチオ、 $C_1 - C_8$ アルキルスルホキッド、 $C_1 - C_8$ アルキルスルホニル、 $C_1 - C_8$ アルキルアシル、シアノ- $C_1 - C_8$ アルキル、 $C_1 - C_8$ アルコキシ- $C_1 - C_8$ アルキル、 $C_1 - C_8$ アルキルチオ- $C_1 - C_8$ アルキル、 $C_1 - C_8$ アルキルスルホキ

10

20

30

40

50

シド - $C_1 - C_8$ アルキルまたは $C_1 - C_8$ アルキルスルホニル - $C_1 - C_8$ アルキル；それぞれ非置換であるかまたは $C_1 - C_8$ アルキル、 $C_2 - C_8$ アルケニル、 $C_2 - C_8$ アルキニル、 $C_1 - C_8$ アルキルアシル、ハロゲン化 $C_1 - C_8$ アルキル、ハロゲン化 $C_2 - C_8$ アルケニル、ハロゲン化 $C_2 - C_8$ アルキニル、ハロゲン化 $C_1 - C_8$ アルキルアシルおよびアリールから選択される1または2個の基で置換されているアミノ - $C_1 - C_8$ アルキルまたはアミノアシル；それぞれ非置換であるかまたは $C_1 - C_8$ アルキル、シアノおよびハロゲンから選択される1～3個の基で置換されている $C_3 - C_8$ シクロアルキル、 $C_3 - C_8$ シクロアルキル - $C_1 - C_8$ アルキル、 $C_3 - C_8$ シクロアルケニルまたは $C_3 - C_8$ シクロアルケニル - $C_1 - C_8$ アルキル；アリール；ヘテロシクリル；アリール - $C_1 - C_8$ アルキルまたはヘテロシクリル - $C_1 - C_8$ アルキルを表し；

10

前記アリールまたはヘテロシクリルはそれぞれ置換または非置換であり、前記「置換」は、ハロゲン；ニトロ；シアノ；チオシアノ；シアノ - $C_1 - C_8$ アルキル；メルカプト；ヒドロキシル；ヒドロキシ - $C_1 - C_8$ アルキル；カルボキシル；ホルミル；アジド；トリ - $C_1 - C_8$ アルキルシリル；ジ - $C_1 - C_8$ アルキルホスホノ；それぞれ非置換であるかまたは $C_1 - C_8$ アルキル、ハロゲン化 $C_1 - C_8$ アルキル、 $C_1 - C_8$ アルキルスルホニル、 $C_1 - C_8$ アルキルアシル、 $C_1 - C_8$ アルキルアシルオキシ、 $C_1 - C_8$ アルコキシアシル、ハロゲン、 $C_1 - C_8$ アルコキシ、 $C_1 - C_8$ アルキルチオ、シアノ、アミノおよび $C_1 - C_8$ アルキルアミノから選択される1～3個の基で置換されているヘテロシクリル、ヘテロシクリル - $C_1 - C_8$ アルキル、アリールまたはアリール - $C_1 - C_8$ アルキル；それぞれハロゲンを含むかまたは含まない $C_1 - C_8$ アルキル、 $C_2 - C_8$ アルケニル、 $C_2 - C_8$ アルキニル、 $C_3 - C_8$ シクロアルキル、 $C_3 - C_8$ シクロアルケニル、 $C_3 - C_8$ シクロアルキル - $C_1 - C_8$ アルキル、 $C_3 - C_8$ シクロアルケニル - $C_1 - C_8$ アルキルまたは $C_1 - C_8$ アルキル - 置換 $C_3 - C_8$ シクロアルキル、 OR'' 、 SR'' 、 $(C_1 - C_8)$ アルキル - OR'' 、 $-O-(1C-C_8)$ アルキル - OR'' 、 $(1C-C_8)$ アルキル - SR'' 、 COR'' 、 $-(1C-C_8)$ アルキル - COR'' 、 $-O-(1C-C_8)$ アルキル - $COOR''$ 、 $COOR''$ 、 $-(1C-C_8)$ アルキル - $COOR''$ 、 $-O-(1C-C_8)$ アルキル - $COSR''$ 、 SOR'' 、 RSO 、 $-O-S_2OR''$ 、 $(C_1 - C_8)$ アルキル - SO_2R'' 、 $OCOR''$ 、 $-(1C-C_8)$ アルキル - $OCOR''$ または $SCOR''$ ；それぞれ非置換であるかまたは R'' 、 COR'' 、 $COOR''$ 、 RSO 、 $(C_1 - C_8)$ アルキル - SO_2R'' または OR'' から選択される1または2個の基で置換されており、前記各基がハロゲンを含むかまたは含まないアミノ、アミノカルボニル、アミノカルボニル - $C_1 - C_8$ アルキルまたはアミノスルホニルから選択される1～3個の基で置換されているか；または、環内の任意の2個の隣接する炭素原子と基 - $CH_2CH_2CH_2-$ 、 $-OCH_2CH_2-$ 、 $-OCH_2O-$ 、 $-OCH_2CH_2O-$ または $-CH=CH-CH=CH-$ とが結合して縮合環を形成されることを指し；

20

30

R'' はそれぞれ独立して、 $1C - C_8$ アルキル； $C_2 - C_8$ アルケニル； $C_2 - C_8$ アルキニル； $C_3 - C_8$ シクロアルキル； $C_3 - C_8$ シクロアルキル - $C_1 - C_8$ アルキル； $C_3 - C_8$ シクロアルケニル； $C_3 - C_8$ シクロアルケニル - $C_1 - C_8$ アルキル；または、それぞれ非置換であるかまたはハロゲン、 $C_1 - C_8$ アルキル、ハロゲン化 $C_1 - C_8$ アルキル、 $C_1 - C_8$ アルコキシおよびアミノから選択される1～3個の基で置換されているヘテロシクリル、ヘテロシクリル - $C_1 - C_8$ アルキル、アリールまたはアリール - $C_1 - C_8$ アルキルを表す。

40

【0007】

別の実施形態において、 R_{11} は $C_1 - C_8$ アルキル、ハロゲン化 $C_1 - C_8$ アルキルまたはアリールを表し；

R_{12} は水素；それぞれハロゲンを含むかまたは含まない $C_1 - C_8$ アルキル、 $C_2 - C_8$ アルケニルまたは $C_2 - C_8$ アルキニル；非置換であるかまたは $C_1 - C_8$ アルキル、シアノおよびハロゲンから選択される少なくとも1個の基で置換されている $C_3 - C_8$ シクロアルキルを表し；

R_{21} および R_{22} はそれぞれ独立して、水素；それぞれハロゲンを含むかまたは含ま

50

い $C_1 - C_8$ アルキル、 $C_2 - C_8$ アルケニル、 $C_2 - C_8$ アルキニル、 $C_1 - C_8$ アルコキシ、 $C_1 - C_8$ アルキルチオ、 $C_1 - C_8$ アルキルスルホキシド、 $C_1 - C_8$ アルキルスルホニル、 $C_1 - C_8$ アルコキシ - $C_1 - C_8$ アルキル、 $C_1 - C_8$ アルキルカルボニルまたは $C_1 - C_8$ アルコキシカルボニル；非置換であるかまたは $C_1 - C_8$ アルキル、シアノおよびハロゲンから選択される少なくとも 1 個の基で置換されている $C_3 - C_8$ シクロアルキル；アリールまたはヘテロシクリルを表し；

R_{31} は水素；それぞれハロゲンを含むかまたは含まない $C_1 - C_8$ アルキル、 $C_2 - C_8$ アルケニルまたは $C_2 - C_8$ アルキニル；非置換であるかまたは $C_1 - C_8$ アルキル、シアノおよびハロゲンから選択される少なくとも 1 個の基で置換されている $C_3 - C_8$ シクロアルキル；アリール、ヘテロシクリルを表し；

R_{41} 、 R_{41}' 、 R_{42} 、 R_{42}' 、 R_{43} および R_{43}' はそれぞれ独立して、水素；それぞれハロゲンを含むかまたは含まない $C_1 - C_8$ アルキル、 $C_2 - C_8$ アルケニル、 $C_2 - C_8$ アルキニルまたは $C_3 - C_8$ シクロアルキル； $C_1 - C_8$ アルコキシ； $C_1 - C_8$ アルキルチオ； $C_1 - C_8$ アルコキシ - $C_1 - C_8$ アルキル； $C_1 - C_8$ アルキルチオ - $C_1 - C_8$ アルキル； $C_1 - C_8$ アルキルカルボニル； $C_1 - C_8$ アルコキシカルボニル；アリールまたはヘテロシクリルを表すか；または、異なる炭素原子上にある R_{41} 、 R_{41}' 、 R_{42} 、 R_{42}' 、 R_{43} および R_{43}' の 2 個が結合して、 CH_2 、 $(CH_2)_2$ 、 $(CH_2)_3$ 、 $(CH_2)_4$ 、 $(CH_2)_5$ 、 $(CH_2)_6$ 、 O 、 $O(CH_2)_2O$ 、 $O(CH_2)_3O$ 、 $O(CH_2)_4O$ 、 $S(CH_2)_2S$ または $S(CH_2)_3S$ を形成するか、または同じ炭素原子上にある R_{41} 、 R_{41}' 、 R_{42} 、 R_{42}' 、 R_{43} および R_{43}' の 2 つが結合して、 $(CH_2)_2$ 、 $(CH_2)_3$ 、 $(CH_2)_4$ 、 $(CH_2)_5$ 、 $(CH_2)_6$ 、 O 、 $O(CH_2)_2O$ 、 $O(CH_2)_3O$ 、 $O(CH_2)_4O$ 、 $S(CH_2)_2S$ または $S(CH_2)_3S$ を形成し；

R_{44} は $-OR_{45}$ または $-SR_{45}$ から選択され；

R_{51} 、 R_{51}' 、 R_{52} 、 R_{52}' 、 R_{53} および R_{53}' はそれぞれ独立して、水素；それぞれハロゲンを含むかまたは含まない $C_1 - C_8$ アルキル、 $C_2 - C_8$ アルケニル、 $C_2 - C_8$ アルキニルまたは $C_3 - C_8$ シクロアルキル； $C_1 - C_8$ アルコキシ； $C_1 - C_8$ アルキルチオ； $C_1 - C_8$ アルコキシ - $C_1 - C_8$ アルキル； $C_1 - C_8$ アルキルチオ - $C_1 - C_8$ アルキル； $C_1 - C_8$ アルキルカルボニル； $C_1 - C_8$ アルコキシカルボニル；アリールまたはヘテロシクリルを表すか；または、異なる炭素原子上にある R_{51} 、 R_{51}' 、 R_{52} 、 R_{52}' 、 R_{53} および R_{53}' の 2 個が結合して、 CH_2 、 $(CH_2)_2$ 、 $(CH_2)_3$ 、 $(CH_2)_4$ 、 $(CH_2)_5$ 、 $(CH_2)_6$ 、 O 、 $O(CH_2)_2O$ 、 $O(CH_2)_3O$ 、 $O(CH_2)_4O$ 、 $S(CH_2)_2S$ または $S(CH_2)_3S$ を形成するか、または同じ炭素原子上にある R_{51} 、 R_{51}' 、 R_{52} 、 R_{52}' 、 R_{53} および R_{53}' の 2 個が結合して、 $(CH_2)_2$ 、 $(CH_2)_3$ 、 $(CH_2)_4$ 、 $(CH_2)_5$ 、 $(CH_2)_6$ 、 O 、 $O(CH_2)_2O$ 、 $O(CH_2)_3O$ 、 $O(CH_2)_4O$ 、 $S(CH_2)_2S$ または $S(CH_2)_3S$ を形成し；

R_{13} および R_{45} はそれぞれ独立して、水素、 $-R_{61}$ 、 $-S(O)_nR_{62}$ 、 $-CH_2R_{63}$ 、 $-(C=O)R_{64}$ 、 $-PO(OR_{65})_2$ または $-Si(OR_{66})_3$ を表し；

R_{61} はアルカリ金属イオン；アンモニウムイオン；それぞれハロゲンを含むかまたは含まない $C_1 - C_8$ アルキル、 $C_2 - C_8$ アルケニルまたは $C_2 - C_8$ アルキニル；アリールまたはヘテロシクリルを表し；

R_{62} は、それぞれハロゲンを含むかまたは含まない $C_1 - C_8$ アルキル、 $C_2 - C_8$ アルケニルまたは $C_2 - C_8$ アルキニル；アリールまたはヘテロシクリルを表し； n は 1、2 または 3 を表し；

R_{63} はハロゲン；ニトロ；シアノ；それぞれハロゲンを含むかまたは含まない $C_1 - C_8$ アルキル、 $C_2 - C_8$ アルケニル、 $C_2 - C_8$ アルキニル、 $C_1 - C_8$ アルコキシ、 $C_1 - C_8$ アルコキシカルボニルまたは $C_1 - C_8$ アルキルチオ；非置換であるかまたは $C_1 - C_8$ アルキル、シアノおよびハロゲンから選択される少なくとも 1 個の基で置換されている $C_3 - C_8$ シクロアルキル；それぞれ非置換であるかまたは $C_1 - C_8$ アルキル、 $C_1 -$

10

20

30

40

50

C₈アルキルカルボニルおよびハロゲン化C₁-C₈アルキルから選択される1または2個の基で置換されているアミノまたはアミノカルボニル；アリール；ヘテロシクリル；アリールカルボニルまたはヘテロシクリルカルボニルを表し；

R₆₄はハロゲン；ニトロ；シアノ；それぞれハロゲンを含むかまたは含まないC₁-C₈アルキル、C₂-C₈アルケニル、C₂-C₈アルキニル、C₁-C₈アルコキシ、C₁-C₈アルキルチオ、C₁-C₈アルコキシ-C₁-C₈アルキルまたはC₁-C₈アルキルチオ-C₁-C₈アルキル；それぞれ非置換であるか、またはC₁-C₈アルキル、C₁-C₈アルキルカルボニルおよびハロゲン化C₁-C₈アルキルから選択される1または2個の基で置換されているアミノまたはアミノ-C₁-C₈アルキル；アリール；ヘテロシクリル；アリール-C₁-C₈アルキル；ヘテロシクリル-C₁-C₈アルキル；アリールオキシ；ヘテロシクリルオキシ；アリールオキシ-C₁-C₈アルキルまたはヘテロシクリルオキシ-C₁-C₈アルキルを表し；

10

R₆₅およびR₆₆はそれぞれ独立して、水素、C₁-C₈アルキル、ハロゲン化C₁-C₈アルキル、C₃-C₈シクロアルキル、アリールまたはヘテロシクリルを表し；

XおよびZはそれぞれ独立して、水素；ハロゲン；シアノ；ニトロ；-NR₁R₂；それぞれハロゲンを含むかまたは含まないC₂-C₈アルケニル、C₂-C₈アルキニル、C₃-C₈シクロアルキル、C₁-C₈アルコキシ、C₁-C₈アルキルチオ、C₁-C₈アルキルスルホキシド、C₁-C₈アルキルスルホニル、C₁-C₈アルコキシ-C₁-C₈アルキル、C₁-C₈アルキルチオ-C₁-C₈アルキル、C₁-C₈アルキルスルホキシド-C₁-C₈アルキルまたはC₁-C₈アルキルスルホニル-C₁-C₈アルキルを表し；

20

R₁およびR₂はそれぞれ独立して、水素、C₁-C₈アルキルまたはハロゲン化C₁-C₈アルキルを表すか、または-NR₁R₂は5~8員のラクタム基を表し；

Yは水素；ハロゲン；ホルミル；シアノ-C₁-C₈アルキル；それぞれハロゲンを含むかまたは含まないC₁-C₁₈アルキル、C₂-C₈アルケニルまたはC₂-C₈アルキニル；-OR₃；-OCOR₄；-COR₄；-SR₃；-SOR₄；-SO₂R₄；-(C₁-C₈アルキル)-OR₃；-(C₁-C₈アルキル)-OCOR₄；-(C₁-C₈アルキル)-COR₄；-(C₁-C₈アルキル)-SR₃；-(C₁-C₈アルキル)-SOR₄；-(C₁-C₈アルキル)-SO₂R₄；それぞれ非置換であるかまたはC₁-C₈アルキル、C₂-C₈アルケニル、C₂-C₈アルキニル、C₁-C₈アルキルアシル、ハロゲン化C₁-C₈アルキル、ハロゲン化C₂-C₈アルケニル、ハロゲン化C₂-C₈アルキニル、ハロゲン化C₁-C₈アルキルアシルおよびアリールから選択される1または2個の基で置換されているアミノ、アミノ-C₁-C₈アルキルまたはアミノアシル；それぞれ非置換であるかまたはC₁-C₈アルキル、シアノおよびハロゲンから選択される少なくとも1個の基で置換されているC₃-C₈シクロアルキル、C₃-C₈シクロアルキル-C₁-C₈アルキル、C₃-C₈シクロアルケニルまたはC₃-C₈シクロアルケニル-C₁-C₈アルキル；アリール；ヘテロシクリル；アリール-C₁-C₈アルキルまたはヘテロシクリル-C₁-C₈アルキルを表し；

30

R₃はそれぞれ独立して、水素；アルカリ金属イオン；それぞれハロゲンを含むかまたは含まないC₁-C₈アルキル、C₂-C₈アルケニル、C₂-C₈アルキニルまたはC₃-C₈シクロアルキルを表し；

40

R₄はそれぞれ独立して、それぞれハロゲンを含むかまたは含まないC₁-C₈アルキル基、C₂-C₈アルケニル基、C₂-C₈アルキニル基またはC₃-C₈シクロアルキルを表し；

前記アリールまたはヘテロシクリルはそれぞれ置換または非置換であり、前記「置換」は、ハロゲン；ニトロ；シアノ；チオシアノ；シアノ-C₁-C₈アルキル；メルカプト；ヒドロキシル；ヒドロキシ-C₁-C₈アルキル；カルボキシル；ホルミル；アジド；トリ-C₁-C₈アルキルシリル；ジ-C₁-C₈アルキルホスホノ；それぞれ非置換であるかまたはC₁-C₈アルキル、ハロゲン化C₁-C₈アルキル、C₁-C₈アルキルスルホニル、C₁-C₈アルキルアシル、C₁-C₈アルキルアシルオキシ、C₁-C₈アルコ

50

キシアシル、ハロゲン、 $C_1 - C_8$ アルコキシ、 $C_1 - C_8$ アルキルチオ、シアノ、アミノおよび $C_1 - C_8$ アルキルアミノから選択される少なくとも1個の基で置換されているヘテロシクリル、ヘテロシクリル- $C_1 - C_8$ アルキル、アリールまたはアリール- $C_1 - C_8$ アルキル；それぞれハロゲンを含むかまたは含まない $C_1 - C_8$ アルキル、 $C_2 - C_8$ アルケニル、 $C_2 - C_8$ アルキニル、 $C_3 - C_8$ シクロアルキル、 $C_3 - C_8$ シクロアルケニル、 $C_3 - C_8$ シクロアルキル- $C_1 - C_8$ アルキル、 $C_3 - C_8$ シクロアルケニル- $C_1 - C_8$ アルキルまたは $C_1 - C_8$ アルキル-置換 $C_3 - C_8$ シクロアルキル、 OR'' 、 SR'' 、 $- (C_1 - C_8)$ アルキル- OR'' 、 $- O - (C_1 - C_8)$ アルキル- OR'' 、 $- (C_1 - C_8)$ アルキル- SR'' 、 COR'' 、 $- (C_1 - C_8)$ アルキル- COR'' 、 $- O - (C_1 - C_8)$ アルキル- COR'' 、 $COOR''$ 、 $- (C_1 - C_8)$ アルキル- $COOR''$ 、 $- O - (C_1 - C_8)$ アルキル- $COOR''$ 、 $COSR''$ 、 SOR'' 、 R_2SO 、 $- O - S_2OR''$ 、 $- (C_1 - C_8)$ アルキル- SO_2R'' 、 $OCOR''$ 、 $- (C_1 - C_8)$ アルキル- $OCOR''$ または $SCOR''$ ；それぞれ非置換であるかまたは R'' 、 COR'' 、 $COOR''$ 、 SOR'' 、 S_2R'' 、 $- (C_1 - C_8)$ アルキル- SO_2R'' または OR'' から選択される1または2個の基で置換されており、前記各基がハロゲンを含むかまたは含まないアミノ、アミノカルボニル、アミノカルボニル- $C_1 - C_8$ アルキルまたはアミノスルホニルから選択される少なくとも1個の基で置換されているか；または、環内の任意の2個の隣接する炭素原子と基- $CH_2CH_2CH_2-$ 、 $-OCH_2CH_2-$ 、 $-OCH_2O-$ 、 $-OCH_2CH_2O-$ または $-CH=CH-CH=CH-$ とが結合して縮合環が形成されることを指し；

R'' はそれぞれ独立して、 $C_1 - C_8$ アルキル； $C_2 - C_8$ アルケニル； $C_2 - C_8$ アルキニル； $C_3 - C_8$ シクロアルキル； $C_3 - C_8$ シクロアルキル- $C_1 - C_8$ アルキル； $C_3 - C_8$ シクロアルケニル； $C_3 - C_8$ シクロアルケニル- $C_1 - C_8$ アルキル；または、それぞれ非置換であるかまたはハロゲン、 $C_1 - C_8$ アルキル、ハロゲン化 $C_1 - C_8$ アルキル、 $C_1 - C_8$ アルコキシおよびアミノから選択される少なくとも1個の基で置換されているヘテロシクリル、ヘテロシクリル- $C_1 - C_8$ アルキル、アリールまたはアリール- $C_1 - C_8$ アルキルを表す。

【0008】

より好ましくは、 R_{11} は $C_1 - C_6$ アルキル、ハロゲン化 $C_1 - C_6$ アルキルまたはアリールを表し；

R_{12} は水素；それぞれハロゲンを含むかまたは含まない $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_2 - C_6$ アルケニルまたは $C_2 - C_6$ アルキニル；非置換であるかまたは $C_1 - C_6$ アルキル、シアノおよびハロゲンから選択される1~2個の基で置換されている $C_3 - C_6$ シクロアルキルを表し；

R_{21} および R_{22} はそれぞれ独立して、水素；それぞれハロゲンを含むかまたは含まない $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_2 - C_6$ アルケニル、 $C_2 - C_6$ アルキニル、 $C_1 - C_6$ アルコキシ、 $C_1 - C_6$ アルキルチオ、 $C_1 - C_6$ アルキルスルホキシド、 $C_1 - C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 - C_6$ アルコキシ- $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ アルキルカルボニルまたは $C_1 - C_6$ アルコキシカルボニル；非置換であるかまたは $C_1 - C_6$ アルキル、シアノおよびハロゲンから選択される1~2個の基で置換されている $C_3 - C_6$ シクロアルキル；アリールまたはヘテロシクリルを表し；

R_{31} は水素；それぞれハロゲンを含むかまたは含まない $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_2 - C_6$ アルケニルまたは $C_2 - C_6$ アルキニル；非置換であるかまたは $C_1 - C_6$ アルキル、シアノおよびハロゲンから選択される1~2個の基で置換されている $C_3 - C_6$ シクロアルキル；アリールまたはヘテロシクリルを表し；

R_{41} 、 R_{41}' 、 R_{42} 、 R_{42}' 、 R_{43} および R_{43}' はそれぞれ独立して、水素、 $C_1 - C_8$ アルキル、 $C_2 - C_8$ アルケニル、 $C_2 - C_8$ アルキニル、 $C_3 - C_8$ シクロアルキル、 $C_1 - C_6$ アルコキシ、 $C_1 - C_6$ アルキルチオ、 $C_1 - C_6$ アルコキシ- $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ アルキルチオ- $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 - C_6$ アルコキシカルボニル、アリールまたはヘテロシクリルを表すか；または、異なる炭素原子上にある R_{41} 、 R_{41}' 、 R_{42} 、 R_{42}' 、 R_{43} および R_{43}' の2個が結

10

20

30

40

50

合して、 CH_2 、 $(\text{CH}_2)_2$ 、 $(\text{CH}_2)_3$ 、 $(\text{CH}_2)_4$ 、 $(\text{CH}_2)_5$ 、 $(\text{CH}_2)_6$ 、 O 、 $\text{O}(\text{CH}_2)_2\text{O}$ 、 $\text{O}(\text{CH}_2)_3\text{O}$ 、 $\text{O}(\text{CH}_2)_4\text{O}$ 、 $\text{S}(\text{CH}_2)_2\text{S}$ または $\text{S}(\text{CH}_2)_3\text{S}$ を形成するか；または、同じ炭素原子上にある R_{41} 、 R_{41}' 、 R_{42} 、 R_{42}' 、 R_{43} および R_{43}' の2個が結合して、 $(\text{CH}_2)_2$ 、 $(\text{CH}_2)_3$ 、 $(\text{CH}_2)_4$ 、 $(\text{CH}_2)_5$ 、 $(\text{CH}_2)_6$ 、 O 、 $\text{O}(\text{CH}_2)_2\text{O}$ 、 $\text{O}(\text{CH}_2)_3\text{O}$ 、 $\text{O}(\text{CH}_2)_4\text{O}$ 、 $\text{S}(\text{CH}_2)_2\text{S}$ または $\text{S}(\text{CH}_2)_3\text{S}$ を形成し；

R_{44} は $-\text{OR}_{45}$ および $-\text{SR}_{45}$ から選択され；

R_{51} 、 R_{51}' 、 R_{52} 、 R_{52}' 、 R_{53} および R_{53}' はそれぞれ独立して、水素、 $\text{C}_1 - \text{C}_8$ アルキル、 $\text{C}_2 - \text{C}_8$ アルケニル、 $\text{C}_2 - \text{C}_8$ アルキニル、 $\text{C}_3 - \text{C}_8$ シクロアルキル、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ アルコキシ、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ アルキルチオ、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ アルコキシ- $\text{C}_1 - \text{C}_6$ アルキル、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ アルキルチオ- $\text{C}_1 - \text{C}_6$ アルキル、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ アルキルカルボニル、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ アルコキシカルボニル、アリーールまたはヘテロシクリルを表すか；または、異なる炭素原子上にある R_{51} 、 R_{51}' 、 R_{52} 、 R_{52}' 、 R_{53} および R_{53}' の2個が結合して、 CH_2 、 $(\text{CH}_2)_2$ 、 $(\text{CH}_2)_3$ 、 $(\text{CH}_2)_4$ 、 $(\text{CH}_2)_5$ 、 $(\text{CH}_2)_6$ 、 O 、 $\text{O}(\text{CH}_2)_2\text{O}$ 、 $\text{O}(\text{CH}_2)_3\text{O}$ 、 $\text{O}(\text{CH}_2)_4\text{O}$ 、 $\text{S}(\text{CH}_2)_2\text{S}$ または $\text{S}(\text{CH}_2)_3\text{S}$ を形成するか、または同じ炭素原子上にある R_{51} 、 R_{51}' 、 R_{52} 、 R_{52}' 、 R_{53} および R_{53}' の2個が結合して、 $(\text{CH}_2)_2$ 、 $(\text{CH}_2)_3$ 、 $(\text{CH}_2)_4$ 、 $(\text{CH}_2)_5$ 、 $(\text{CH}_2)_6$ 、 O 、 $\text{O}(\text{CH}_2)_2\text{O}$ 、 $\text{O}(\text{CH}_2)_3\text{O}$ 、 $\text{O}(\text{CH}_2)_4\text{O}$ 、 $\text{S}(\text{CH}_2)_2\text{S}$ または $\text{S}(\text{CH}_2)_3\text{S}$ を形成し；

R_{13} および R_{45} はそれぞれ独立して、水素、 $-\text{R}_{61}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_n\text{R}_{62}$ 、 $-\text{CH}_2\text{R}_{63}$ 、 $-(\text{C}=\text{O})\text{R}_{64}$ 、 $-\text{PO}(\text{OR}_{65})_2$ または $-\text{Si}(\text{OR}_{66})_3$ を表し；

R_{61} は金属イオン；アンモニウムイオン；それぞれハロゲンを含むかまたは含まない $\text{C}_1 - \text{C}_6$ アルキル、 $\text{C}_2 - \text{C}_6$ アルケニルまたは $\text{C}_2 - \text{C}_6$ アルキニル；アリーールまたはヘテロシクリルを表し；

R_{62} は、それぞれハロゲンを含むかまたは含まない $\text{C}_1 - \text{C}_6$ アルキル、 $\text{C}_2 - \text{C}_6$ アルケニルまたは $\text{C}_2 - \text{C}_6$ アルキニル；アリーールまたはヘテロシクリルを表し； n は1、2または3を表し；

R_{63} はハロゲン；ニトロ；シアノ；それぞれハロゲンを含むかまたは含まない $\text{C}_1 - \text{C}_6$ アルキル、 $\text{C}_2 - \text{C}_6$ アルケニル、 $\text{C}_2 - \text{C}_6$ アルキニル、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ アルコキシ、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ アルコキシカルボニルまたは $\text{C}_1 - \text{C}_6$ アルキルチオ；非置換であるかまたは $\text{C}_1 - \text{C}_6$ アルキル、シアノまたはハロゲンから選択される1~2個の基で置換されている $\text{C}_3 - \text{C}_6$ シクロアルキル；それぞれ非置換であるかまたは $\text{C}_1 - \text{C}_6$ アルキル、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ アルキルカルボニルおよびハロゲン化 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ アルキルから選択される1~2個の基で置換されているアミノまたはアミノカルボニル；アリーール；ヘテロシクリル；アリーールカルボニルまたはヘテロシクリルカルボニルを表し；

R_{64} はハロゲン；ニトロ；シアノ；それぞれハロゲンを含むかまたは含まない $\text{C}_1 - \text{C}_6$ アルキル、 $\text{C}_2 - \text{C}_6$ アルケニル、 $\text{C}_2 - \text{C}_6$ アルキニル、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ アルコキシ、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ アルキルチオ、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ アルコキシ- $\text{C}_1 - \text{C}_6$ アルキルまたは $\text{C}_1 - \text{C}_6$ アルキルチオ- $\text{C}_1 - \text{C}_6$ アルキル；それぞれ非置換であるかまたは $\text{C}_1 - \text{C}_6$ アルキル、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ アルキルカルボニルおよびハロゲン化 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ アルキルから選択される1~2個の基で置換されているアミノまたはアミノ- $\text{C}_1 - \text{C}_6$ アルキル；アリーール；ヘテロシクリル；アリーール- $\text{C}_1 - \text{C}_6$ アルキル；ヘテロシクリル- $\text{C}_1 - \text{C}_6$ アルキル；アリーールオキシ；ヘテロシクリロキシ；アリーールオキシ- $\text{C}_1 - \text{C}_6$ アルキルまたはヘテロシクリロキシ- $\text{C}_1 - \text{C}_6$ アルキルを表し；

R_{65} および R_{66} はそれぞれ独立して、水素、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ アルキル、ハロゲン化 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ アルキル、 $\text{C}_3 - \text{C}_6$ シクロアルキル、アリーールまたはヘテロシクリルを表し；

X および Z はそれぞれ独立して、水素；ハロゲン；シアノ；ニトロ； $-\text{NR}_1\text{R}_2$ ；それぞれハロゲンを含むかまたは含まない $\text{C}_2 - \text{C}_6$ アルケニル、 $\text{C}_2 - \text{C}_6$ アルキニル、 $\text{C}_3 - \text{C}_6$ シクロアルキル、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ アルコキシ、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ アルキルチオ、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ アルキルスルホキッド、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ アルキルスルホニル、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ アルコキシ- $\text{C}_1 - \text{C}_6$

10

20

30

40

50

アルキル、C₁ - C₆アルキルチオ - C₁ - C₆アルキル、C₁ - C₆アルキルスルホキシド - C₁ - C₆アルキルまたはC₁ - C₆アルキルスルホニル - C₁ - C₆アルキルを表し；

R₁およびR₂はそれぞれ独立して、水素、C₁ - C₆アルキルまたはハロゲン化C₁ - C₆アルキルを表すか、または - NR₁R₂は5 ~ 8員のラクタム基を表し；

Yは水素；ハロゲン；ホルミル；それぞれハロゲンを含むかまたは含まないC₁ - C₁₂アルキル、C₂ - C₆アルケニル、C₂ - C₆アルキニル、C₁ - C₆アルコキシ、C₁ - C₆アルキルチオ、C₁ - C₆アルキルスルホキシド、C₁ - C₆アルキルスルホニル、C₁ - C₆アルキルアシル、シアノ - C₁ - C₆アルキル、C₁ - C₆アルコキシ - C₁ - C₆アルキル、C₁ - C₆アルキルチオ - C₁ - C₆アルキル、C₁ - C₆アルキルスルホキシド - C₁ - C₆アルキルまたはC₁ - C₆アルキルスルホニル - C₁ - C₆アルキル；それぞれ非置換であるかまたはC₁ - C₆アルキル、C₂ - C₆アルケニル、C₂ - C₆アルキニル、C₁ - C₆アルキルアシル、ハロゲン化C₁ - C₆アルキル、ハロゲン化C₂ - C₆アルケニル、ハロゲン化C₂ - C₆アルキニル、ハロゲン化C₁ - C₆アルキルアシルおよびアリールから選択される1 ~ 2個の基で置換されているアミノ - C₁ - C₆アルキルまたはアミノアシル；それぞれ非置換であるかまたはC₁ - C₆アルキル、シアノおよびハロゲンから選択される1 ~ 2個の基で置換されているC₃ - C₆シクロアルキル、C₃ - C₆シクロアルケニル - C₁ - C₆アルキル、C₃ - C₆シクロアルケニルまたはC₃ - C₆シクロアルケニル - C₁ - C₆アルキル；アリール；ヘテロシクリル；アリール - C₁ - C₆アルキルまたはヘテロシクリル - C₁ - C₆アルキルを表し；

10

20

前記アリールまたはヘテロシクリルはそれぞれ置換または非置換であり、前記「置換」は、ハロゲン；ニトロ；シアノ；チオシアノ；シアノ - C₁ - C₆アルキル；メルカプト；ヒドロキシル；ヒドロキシ - C₁ - C₆アルキル；カルボキシル；ホルミル；アジド；トリ - C₁ - C₆アルキルシリル；ジ - C₁ - C₆アルキルホスホノ；それぞれ非置換であるかまたはC₁ - C₆アルキル、ハロゲン化C₁ - C₆アルキル、C₁ - C₆アルキルスルホニル、C₁ - C₆アルキルアシル、C₁ - C₆アルキルアシルオキシ、C₁ - C₆アルコキシアシル、ハロゲン、C₁ - C₆アルコキシ、C₁ - C₆アルキルチオ、シアノ、アミノおよびC₁ - C₆アルキルアミノから選択される1 ~ 2個の基で置換されているヘテロシクリル、ヘテロシクリル - C₁ - C₆アルキル、アリールまたはアリール - C₁ - C₆アルキル；それぞれハロゲンを含むかまたは含まないC₁ - C₆アルキル、C₂ - C₆アルケニル、C₂ - C₆アルキニル、C₃ - C₆シクロアルキル、C₃ - C₆シクロアルケニル、C₃ - C₆シクロアルケニル - C₁ - C₆アルキル、C₁ - C₆アルキル - 置換C₃ - C₆シクロアルキル、OR'、SR'、-(C₁ - C₆)アルキル - OR'、-O-(C₁ - C₆)アルキル - OR'、-(C₁ - C₆)アルキル - SR'、COR'、-(C₁ - C₆)アルキル - COR'、-O-(C₁ - C₆)アルキル - COR'、COOR'、-(C₁ - C₆)アルキル - COOR'、-O-(C₁ - C₆)アルキル - COOR'、COSR'、SOR'、RSO、-O-S₂OR'、-(C₁ - C₆)アルキル - SO₂R'、OCOR'、-(C₁ - C₆)アルキル - OCOR'またはSCOR'；それぞれ非置換であるかまたはR'、COR'、COOR'₂R'、SO-(C₁ - C₆)アルキル - SO₂R'またはOR'から選択される1 ~ 2個の基で置換されて

30

40

おり、前記各基がハロゲンを含むかまたは含まないアミノ、アミノカルボニル、アミノカルボニル - C₁ - C₆アルキルまたはアミノスルホニルから選択される1 ~ 2個の基で置換されているか；または、環内の任意の2個の隣接する炭素原子と基 - CH₂CH₂CH₂-、-OCH₂CH₂-、-OCH₂O-、-OCH₂CH₂O-または-CH=CH-CH=CH-とが結合して縮合環が形成されることを指し；

R'はそれぞれ独立して、C₁ - C₆アルキル；C₂ - C₆アルケニル；C₂ - C₆アルキニル；C₃ - C₆シクロアルキル；C₃ - C₆シクロアルケニル - C₁ - C₆アルキル；C₃ - C₆シクロアルケニル；C₃ - C₆シクロアルケニル - C₁ - C₆アルキル；または、それぞれ非置換であるかまたはハロゲン、C₁ - C₆アルキル、ハロゲン化C₁ - C₆アルキル、C₁ - C₆アルコキシおよびアミノから選択される1 ~ 3個の基で置換されている

50

ヘテロシクリル、ヘテロシクリル - C₁ - C₆アルキル、アリールまたはアリール - C₁ - C₆アルキルを表す。

【0009】

別の実施形態では、R₁₁はC₁ - C₆アルキル、ハロゲン化C₁ - C₆アルキルまたはアリールを表し；

R₁₂は水素；それぞれハロゲンを含むかまたは含まないC₁ - C₆アルキル、C₂ - C₆アルケニルまたはC₂ - C₆アルキニル；非置換であるかまたはC₁ - C₆アルキル、シアノおよびハロゲンから選択される1～3個の基で置換されているC₃ - C₆シクロアルキルを表し；

R₂₁およびR₂₂はそれぞれ独立して、水素；それぞれハロゲンを含むかまたは含まないC₁ - C₆アルキル、C₂ - C₆アルケニル、C₂ - C₆アルキニル、C₁ - C₆アルコキシ、C₁ - C₆アルキルチオ、C₁ - C₆アルキルスルホキシド、C₁ - C₆アルキルスルホニル、C₁ - C₆アルコキシ - C₁ - C₆アルキル、C₁ - C₆アルキルカルボニルまたはC₁ - C₆アルコキシカルボニル；非置換であるかまたはC₁ - C₆アルキル、シアノおよびハロゲンから選択される1～3個の基で置換されているC₃ - C₆シクロアルキル；アリールまたはヘテロシクリルを表し；

10

R₃₁は水素；それぞれハロゲンを含むかまたは含まないC₁ - C₆アルキル、C₂ - C₆アルケニルまたはC₂ - C₆アルキニル；非置換であるかまたはC₁ - C₆アルキル、シアノおよびハロゲンから選択される1～3個の基で置換されているC₃ - C₆シクロアルキル；アリールまたはヘテロシクリルを表し；

20

R₄₁、R₄₁'、R₄₂、R₄₂'、R₄₃およびR₄₃'はそれぞれ独立して、水素；それぞれハロゲンを含むかまたは含まないC₁ - C₈アルキル、C₂ - C₈アルケニル、C₂ - C₈アルキニルまたはC₃ - C₈シクロアルキル；C₁ - C₆アルコキシ；C₁ - C₆アルキルチオ；C₁ - C₆アルコキシ - C₁ - C₆アルキル；C₁ - C₆アルキルチオ - C₁ - C₆アルキル；C₁ - C₆アルキルカルボニル；C₁ - C₆アルコキシカルボニル；アリールまたはヘテロシクリルを表すか；または、異なる炭素原子上にあるR₄₁、R₄₁'、R₄₂、R₄₂'、R₄₃およびR₄₃'の2個が結合して、CH₂、(CH₂)₂、(CH₂)₃、(CH₂)₄、(CH₂)₅、(CH₂)₆、O、O(CH₂)₂O、O(CH₂)₃O、O(CH₂)₄O、S(CH₂)₂SまたはS(CH₂)₃Sを形成するか；または、同じ炭素原子上にあるR₄₁、R₄₁'、R₄₂、R₄₂'、R₄₃およびR₄₃'の2個が結合して、(CH₂)₂、(CH₂)₃、(CH₂)₄、(CH₂)₅、(CH₂)₆、O、O(CH₂)₂O、O(CH₂)₃O、O(CH₂)₄O、S(CH₂)₂SまたはS(CH₂)₃Sを形成し；

30

R₄₄は - OR₄₅および - SR₄₅から選択され；

R₅₁、R₅₁'、R₅₂、R₅₂'、R₅₃およびR₅₃'はそれぞれ独立して、水素；それぞれハロゲンを含むかまたは含まないC₁ - C₈アルキル、C₂ - C₈アルケニル、C₂ - C₈アルキニルまたはC₃ - C₈シクロアルキル；C₁ - C₆アルコキシ；C₁ - C₆アルキルチオ；C₁ - C₆アルコキシ - C₁ - C₆アルキル；C₁ - C₆アルキルチオ - C₁ - C₆アルキル；C₁ - C₆アルキルカルボニル；C₁ - C₆アルコキシカルボニル；アリールまたはヘテロシクリルを表すか；または、異なる炭素原子上にあるR₅₁、R₅₁'、R₅₂、R₅₂'、R₅₃およびR₅₃'の2個が結合して、CH₂、(CH₂)₂、(CH₂)₃、(CH₂)₄、(CH₂)₅、(CH₂)₆、O、O(CH₂)₂O、O(CH₂)₃O、O(CH₂)₄O、S(CH₂)₂SまたはS(CH₂)₃Sを形成するか、または同じ炭素原子上にあるR₅₁、R₅₁'、R₅₂、R₅₂'、R₅₃およびR₅₃'の2個が結合して、(CH₂)₂、(CH₂)₃、(CH₂)₄、(CH₂)₅、(CH₂)₆、O、O(CH₂)₂O、O(CH₂)₃O、O(CH₂)₄O、S(CH₂)₂SまたはS(CH₂)₃Sを形成し；

40

R₁₃およびR₄₅はそれぞれ独立して、水素、-R₆₁、-S(O)_nR₆₂、-CH₂R₆₃、-(C=O)R₆₄、-PO(OR₆₅)₂または-Si(OR₆₆)₃を表し；

R₆₁はナトリウムイオン、アンモニウムイオン；それぞれハロゲンを含むかまたは含

50

まない $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_2 - C_6$ アルケニルまたは $C_2 - C_6$ アルキニル；アリールまたはヘテロシクリルを表し；

R_{62} は、それぞれハロゲンを含むかまたは含まない $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_2 - C_6$ アルケニル、または $C_2 - C_6$ アルキニル；アリールまたはヘテロシクリルを表し； n は 1、2 または 3 を表し；

R_{63} はハロゲン；ニトロ；シアノ；それぞれハロゲンを含むかまたは含まない $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_2 - C_6$ アルケニル、 $C_2 - C_6$ アルキニル、 $C_1 - C_6$ アルコキシ、 $C_1 - C_6$ アルコキシカルボニルまたは $C_1 - C_6$ アルキルチオ；非置換であるかまたは $C_1 - C_6$ アルキル、シアノまたはハロゲンから選択される 1 ~ 3 個の基で置換されている $C_3 - C_6$ シクロアルキル；それぞれ非置換であるかまたは $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ アルキルカルボニルおよびハロゲン化 $C_1 - C_6$ アルキルから選択される 1 ~ 2 個の基で置換されているアミノまたはアミノカルボニル；アリール；ヘテロシクリル；アリールカルボニルまたはヘテロシクリルカルボニルを表し；

R_{64} はハロゲン；ニトロ；シアノ；それぞれハロゲンを含むかまたは含まない $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_2 - C_6$ アルケニル、 $C_2 - C_6$ アルキニル、 $C_1 - C_6$ アルコキシ、 $C_1 - C_6$ アルキルチオ、 $C_1 - C_6$ アルコキシ - $C_1 - C_6$ アルキルまたは $C_1 - C_6$ アルキルチオ - $C_1 - C_6$ アルキル；それぞれ非置換であるかまたは $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ アルキルカルボニルおよびハロゲン化 $C_1 - C_6$ アルキルから選択される 1 ~ 2 個の基で置換されているアミノまたはアミノ - $C_1 - C_6$ アルキル；アリール；ヘテロシクリル；アリール - $C_1 - C_6$ アルキル；ヘテロシクリル - $C_1 - C_6$ アルキル；アリールオキシ；ヘテロシクリロキシ；アリールオキシ - $C_1 - C_6$ アルキルまたはヘテロシクリロキシ - $C_1 - C_6$ アルキルを表し；

R_{65} および R_{66} はそれぞれ独立して、水素、 $C_1 - C_6$ アルキル、ハロゲン化 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、アリールまたはヘテロシクリルを表し；

X および Z はそれぞれ独立して、水素；ハロゲン；シアノ；ニトロ；- NR_1R_2 ；それぞれハロゲンを含むかまたは含まない $C_2 - C_6$ アルケニル、 $C_2 - C_6$ アルキニル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $C_1 - C_6$ アルコキシ、 $C_1 - C_6$ アルキルチオ、 $C_1 - C_6$ アルキルスルホキシド、 $C_1 - C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 - C_6$ アルコキシ - $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ アルキルチオ - $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ アルキルスルホキシド - $C_1 - C_6$ アルキルまたは $C_1 - C_6$ アルキルスルホニル - $C_1 - C_6$ アルキルを表し；

R_1 および R_2 はそれぞれ独立して、水素、 $C_1 - C_6$ アルキルまたはハロゲン化 $C_1 - C_6$ アルキルを表すか、または - NR_1R_2 は 5 ~ 8 員のラクタム基を表し；

Y は水素；ハロゲン；ホルミル；シアノ - $C_1 - C_6$ アルキル；それぞれハロゲンを含むかまたは含まない $C_1 - C_12$ アルキル、 $C_2 - C_6$ アルケニルまたは $C_2 - C_6$ アルキニル；- OR_3 ；- $OCOR_4$ ；- COR_4 ；- SR_3 ；- SOR_4 ；- SO_2R_4 ；- ($C_1 - C_6$ アルキル) - OR_3 ；- ($C_1 - C_6$ アルキル) - $OCOR_4$ ；- ($C_1 - C_6$ アルキル) - COR_4 ；- ($C_1 - C_6$ アルキル) - SR_3 ；- ($C_1 - C_6$ アルキル) - SOR_4 ；- ($C_1 - C_6$ アルキル) - SO_2R_4 ；それぞれ非置換であるかまたは $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_2 - C_6$ アルケニル、 $C_2 - C_6$ アルキニル、 $C_1 - C_6$ アルキルアシル、ハロゲン化 $C_1 - C_6$ アルキル、ハロゲン化 $C_2 - C_6$ アルケニル、ハロゲン化 $C_2 - C_6$ アルキニル、ハロゲン化 $C_1 - C_6$ アルキルアシルおよびアリールから選択される 1 ~ 2 個の基で置換されているアミノ、アミノ - $C_1 - C_6$ アルキルまたはアミノアシル；それぞれ非置換であるかまたは $C_1 - C_6$ アルキル、シアノおよびハロゲンから選択される 1 ~ 3 個の基で置換されている $C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル - $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_3 - C_6$ シクロアルケニルまたは $C_3 - C_6$ シクロアルケニル - $C_1 - C_6$ アルキル；アリール；ヘテロシクリル；アリール - $C_1 - C_6$ アルキルまたはヘテロシクリル - $C_1 - C_6$ アルキルを表し；

R_3 はそれぞれ独立して、水素；ナトリウムイオン；それぞれハロゲンを含むかまたは含まない $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_2 - C_6$ アルケニル、 $C_2 - C_6$ アルキニルまたは $C_3 -$

10

20

30

40

50

C₆シクロアルキルを表し；

R₄はそれぞれ独立して、それぞれハロゲンを含むかまたは含まないC₁ - C₆アルキル、C₂ - C₆アルケニル、C₂ - C₆アルキニルまたはC₃ - C₆シクロアルキルを表し；

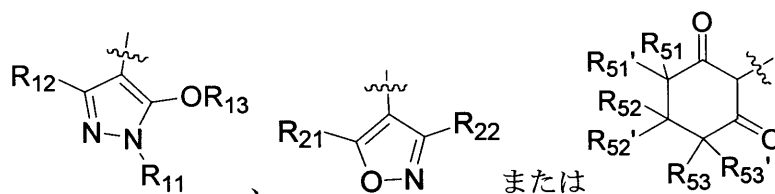
前記アリールまたはヘテロシクリルはそれぞれ置換または非置換であり、前記「置換」は、ハロゲン；ニトロ；シアノ；チオシアノ；シアノ - C₁ - C₆アルキル；メルカプト；ヒドロキシル；ヒドロキシ - C₁ - C₆アルキル；カルボキシル；ホルミル；アジド；トリ - C₁ - C₆アルキルシリル；ジ - C₁ - C₆アルキルホスホノ；それぞれ、非置換であるかまたはC₁ - C₆アルキル、ハロゲン化C₁ - C₆アルキル、C₁ - C₆アルキルスルホニル、C₁ - C₆アルキルアシル、C₁ - C₆アルキルアシルオキシ、C₁ - C₆アルコキシアシル、ハロゲン、C₁ - C₆アルコキシ、C₁ - C₆アルキルチオ、シアノ、アミノおよびC₁ - C₆アルキルアミノから選択される1～3個の基で置換されているヘテロシクリル、ヘテロシクリル - C₁ - C₆アルキル、アリールまたはアリール - C₁ - C₆アルキル；それぞれハロゲンを含むかまたは含まないC₁ - C₆アルキル、C₂ - C₆アルケニル、C₂ - C₆アルキニル、C₃ - C₆シクロアルキル、C₃ - C₆シクロアルケニル、C₃ - C₆シクロアルキル - C₁ - C₆アルキル、C₃ - C₆シクロアルケニル - C₁ - C₆アルキル、C₁ - C₆アルキル - 置換C₃ - C₆シクロアルキル、OR'、SR'、-(C₁ - C₆)アルキル - OR'、-O-(C₁ - C₆)アルキル - OR'、-(C₁ - C₆)アルキル - SR'、COR'、-(C₆)アルキル - COR'、-O-(C₁ - C₆)アルキル - COR'、COOR'、-(C₆)アルキル - COOR'、-O-(C₁ - C₆)アルキル - COOR'、COSR'、SOR'、R₂SO、-O-S₂OR'、-(C₁ - C₆)アルキル - SO₂R'、OCOR'、-(C₆)アルキル - OCOR'またはSCOR'；それぞれ非置換であるかまたはR'、COR'、COOR'₂R'、SO-(C₁ - C₆)アルキル - SO₂R'またはOR'から選択される1～2個の基で置換されており、前記各基がハロゲンを含むかまたは含まないアミノ、アミノカルボニル、アミノカルボニル - C₁ - C₆アルキルまたはアミノスルホニルから選択される1～3個の基で置換されているか；または、環内の任意の2個の隣接する炭素原子と基 - CH₂CH₂CH₂-、-OCH₂CH₂-、-OCH₂O-、-OCH₂CH₂O-または-CH=CH-CH=CH-とが結合して縮合環を形成されることを指し；

R'はそれぞれ独立して、C₁ - C₆アルキル；C₂ - C₆アルケニル；C₂ - C₆アルキニル；C₃ - C₆シクロアルキル；C₃ - C₆シクロアルキル - C₁ - C₆アルキル；C₃ - C₆シクロアルケニル；C₃ - C₆シクロアルケニル - C₁ - C₆アルキル；または、それぞれ非置換であるかまたはハロゲン、C₁ - C₆アルキル、ハロゲン化C₁ - C₆アルキル、C₁ - C₆アルコキシおよびアミノから選択される1～3個の基で置換されているヘテロシクリル、ヘテロシクリル - C₁ - C₆アルキル、アリールまたはアリール - C₁ - C₆アルキルを表す。

【0010】

より好ましくは、Qは

【化5】



を表し；

R₁₁はC₁ - C₆アルキルを表し；

R₁₂は水素、フッ素を含むかまたは含まないC₁ - C₆アルキル、またはC₃ - C₆シクロアルキルを表し；

R₁₃は水素を表し；

10

20

30

40

50

R₂₁およびR₂₂はそれぞれ独立して、水素またはC₃-C₆シクロアルキルを表し；

R₅₁、R_{51'}、R₅₂、R_{52'}、R₅₃およびR_{53'}はそれぞれ独立して、水素またはC₁-C₆アルキルを表すか、または、異なる炭素原子上にあるR₅₁、R_{51'}、R₅₂、R_{52'}、R₅₃およびR_{53'}の2個が結合して、CH₂または(CH₂)₂を形成し；

Xは水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、-NR₁R₂、C₂-C₆アルケニル、C₂-C₆アルキニル、C₃-C₆シクロアルキル、C₁-C₆アルコキシ、C₁-C₆アルキルチオ、C₁-C₆アルキルスルホキシド、C₁-C₆アルキルスルホニルまたはC₁-C₆アルコキシ-C₁-C₆アルキルを表し；

R₁およびR₂はそれぞれ独立して、C₁-C₆アルキルを表すか、または-NR₁R₂はブチロラクタム基を表し；

10

Yは水素；フッ素；塩素；臭素；ヨウ素；ホルミル；それぞれフッ素または塩素を含むかまたは含まないC₁-C₁₀アルキル、C₂-C₆アルケニルまたはC₂-C₆アルキニル；C₁-C₆アルコキシ、C₁-C₆アルキルチオ、C₁-C₆アルキルスルホキシド、C₁-C₆アルキルスルホニル、C₁-C₆アルキルアシル、シアノ-C₁-C₆アルキル、C₁-C₆アルコキシ-C₁-C₆アルキル、C₁-C₆アルキルチオ-C₁-C₆アルキル、C₁-C₆アルキルスルホキシド-C₁-C₆アルキル、C₁-C₆アルキルスルホニル-C₁-C₆アルキル；それぞれ非置換であるかまたはC₁-C₆アルキルから選択される1~2個の基で置換されているアミノ-C₁-C₆アルキルまたはアミノアシル；それぞれ非置換であるかまたはC₁-C₆アルキル、シアノおよびフッ素から選択される1~2個の基で置換されているC₃-C₆シクロアルキル、C₃-C₆シクロアルキル-C₁-C₆アルキルまたはC₃-C₆シクロアルケニル；アリール；ヘテロシクリル；アリール-C₁-C₆アルキルまたはヘテロシクリル-C₁-C₆アルキルを表し；

20

Zは水素、フッ素または塩素を表し；

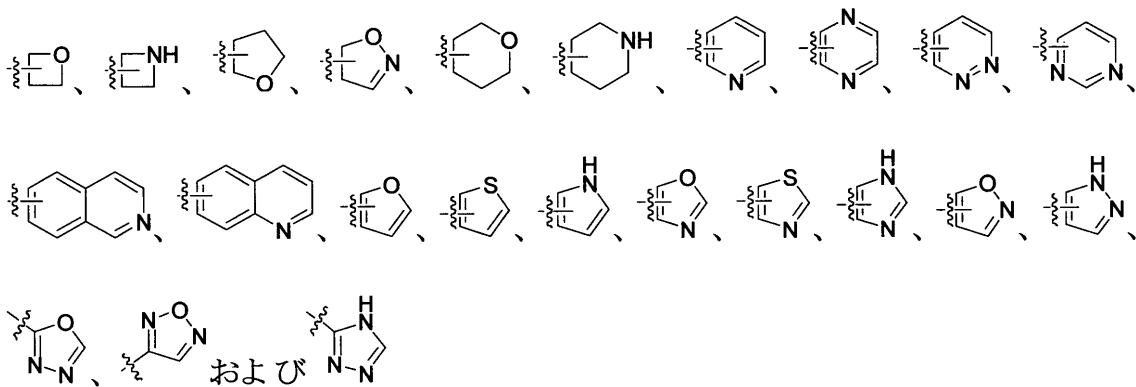
前記アリールまたはヘテロシクリルはそれぞれ置換または非置換であり、前記「置換」は、フッ素、塩素、シアノ、C₁-C₆アルキルおよびフェニルから選択される1~2個の基で置換されることを指し；

前記アリールはフェニルおよびナフチルから選択され；

前記ヘテロシクリルは

【化6】

30



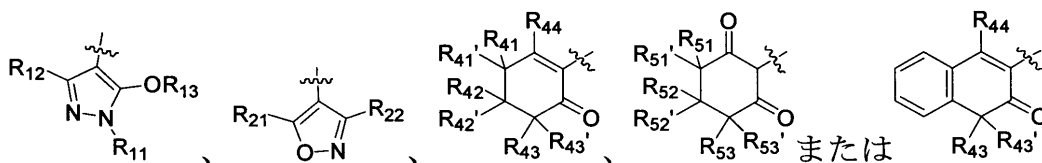
40

から選択される。

【0011】

別の実施形態において、Qは

【化7】



50

を表し；

R_{11} は $C_1 - C_6$ アルキルを表し；

R_{12} は水素、 $C_1 - C_6$ アルキルまたは $C_3 - C_6$ シクロアルキルを表し；

R_{13} は水素、ナトリウムイオンまたは $-(C=O)R_{64}$ を表し；

R_{21} および R_{22} はそれぞれ独立して、水素または $C_3 - C_6$ シクロアルキルを表し；

R_{41} 、 R_{41}' 、 R_{42} 、 R_{42}' 、 R_{43} および R_{43}' はそれぞれ独立して、水素、 $C_1 - C_6$ アルキルまたは八口ゲン化 $C_1 - C_6$ アルキルを表すか、または異なる炭素原子上にある R_{41} 、 R_{41}' 、 R_{42} 、 R_{42}' 、 R_{43} および R_{43}' の2個が結合して、 $(CH_2)_2$ を形成し；

R_{44} は $-ONa$ から選択され；

R_{51} 、 R_{51}' 、 R_{52} 、 R_{52}' 、 R_{53} および R_{53}' はそれぞれ独立して、水素、 $C_1 - C_6$ アルキルまたは八口ゲン化 $C_1 - C_6$ アルキルを表すか、または異なる炭素原子上にある R_{51} 、 R_{51}' 、 R_{52} 、 R_{52}' 、 R_{53} および R_{53}' の2個が結合して CH_2 または $(CH_2)_2$ を形成し；

R_{64} はアリールまたはヘテロシクリルを表し；

Xは水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、 $-NR_1R_2$ 、 $C_2 - C_6$ アルケニル、 $C_2 - C_6$ アルキニル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $C_1 - C_6$ アルコキシ、 $C_1 - C_6$ アルキルチオ、 $C_1 - C_6$ アルキルスルホキシド、 $C_1 - C_6$ アルキルスルホニルまたは $C_1 - C_6$ アルコキシ- $C_1 - C_3$ アルキルを表し；

R_1 および R_2 はそれぞれ独立して、 $C_1 - C_6$ アルキルを表すか、または $-NR_1R_2$ はブチロラクタム基を表し；

Yは水素；フッ素；塩素；臭素；ヨウ素；ホルミル；シアノ- $C_1 - C_3$ アルキル；それぞれフッ素または塩素を含むかまたは含まない $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_2 - C_6$ アルケニルまたは $C_2 - C_6$ アルキニル； $-OR_3$ ； $-COR_4$ ； $-SR_3$ ； $-SOR_4$ ； $-SO_2R_4$ ； $-(C_1 - C_3\text{アルキル}) - OR_3$ ； $-(C_1 - C_6\text{アルキル}) - OCOR_4$ ； $-(C_1 - C_3\text{アルキル}) - SR_3$ ； $-(C_1 - C_3\text{アルキル}) - SOR_4$ ； $-(C_1 - C_3\text{アルキル}) - SO_2R_4$ ；それぞれ非置換であるかまたは $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_2 - C_6$ アルケニル、 $C_2 - C_6$ アルキニルおよび $C_1 - C_6$ アルキルアシルから選択される1~2個の基で置換されているアミノ、アミノ- $C_1 - C_3$ アルキルまたはアミノアシル；それぞれ非置換であるかまたは $C_1 - C_6$ アルキル、シアノおよびフッ素から選択される1~2個の基で置換されている $C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル- $C_1 - C_3$ アルキルまたは $C_3 - C_6$ シクロアルケニル；アリール；ヘテロシクリル；アリール- $C_1 - C_3$ アルキルまたはヘテロシクリル- $C_1 - C_3$ アルキルを表し；

R_3 はそれぞれ独立して、水素、ナトリウムイオン、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_2 - C_6$ アルケニルまたは $C_2 - C_6$ アルキニルを表し；

R_4 はそれぞれ独立して $C_1 - C_6$ アルキルを表し；

Zは水素、フッ素または塩素を表し；

前記アリールまたはヘテロシクリルはそれぞれ置換または非置換であり、前記「置換」は、フッ素、塩素、シアノ、 $C_1 - C_6$ アルキルおよびフェニルから選択される1~2個の基で置換されることを指し；

前記アリールはフェニルおよびナフチルから選択され；

前記ヘテロシクリルは

10

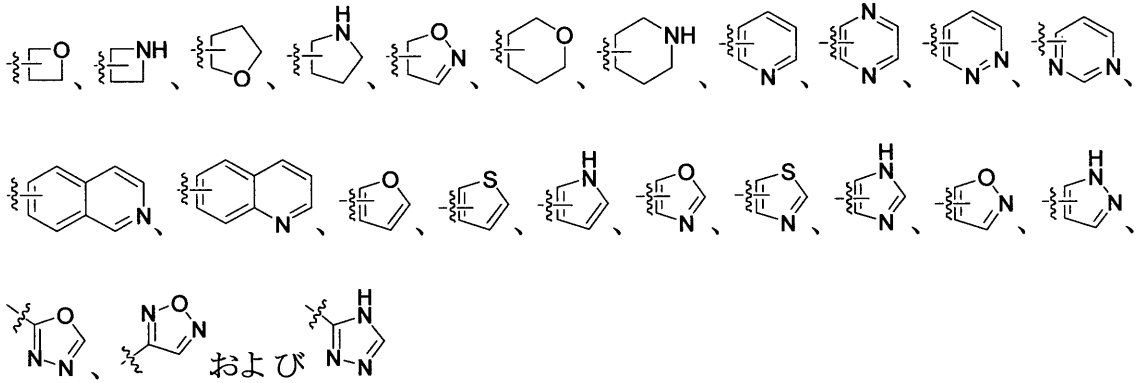
20

30

40

50

【化 8】



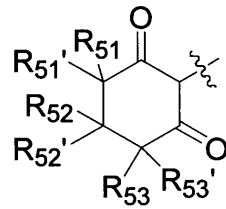
10

から選択される。

【 0 0 1 2】

より好ましくは、Qは

【化 9】



20

を表し；

R_{51} 、 R_{51}' 、 R_{52} 、 R_{52}' 、 R_{53} および R_{53}' はそれぞれ独立して、水素または $C_1 - C_6$ アルキルを表すか、または、異なる炭素原子上にある R_{51} 、 R_{51}' 、 R_{52} 、 R_{52}' 、 R_{53} および R_{53}' の2個が結合して CH_2 または $(CH_2)_2$ を形成し；

Xは塩素を表し；

Yは、フッ素を含むかまたは含まない $C_1 - C_6$ アルキル； $C_1 - C_6$ アルコキシ、 $C_1 - C_6$ アルキルチオ、 $C_1 - C_6$ アルコキシ- $C_1 - C_6$ アルキル；非置換であるかまたは $C_3 - C_6$ シクロアルキル；またはフェニルを表し；

30

Zは水素を表す。

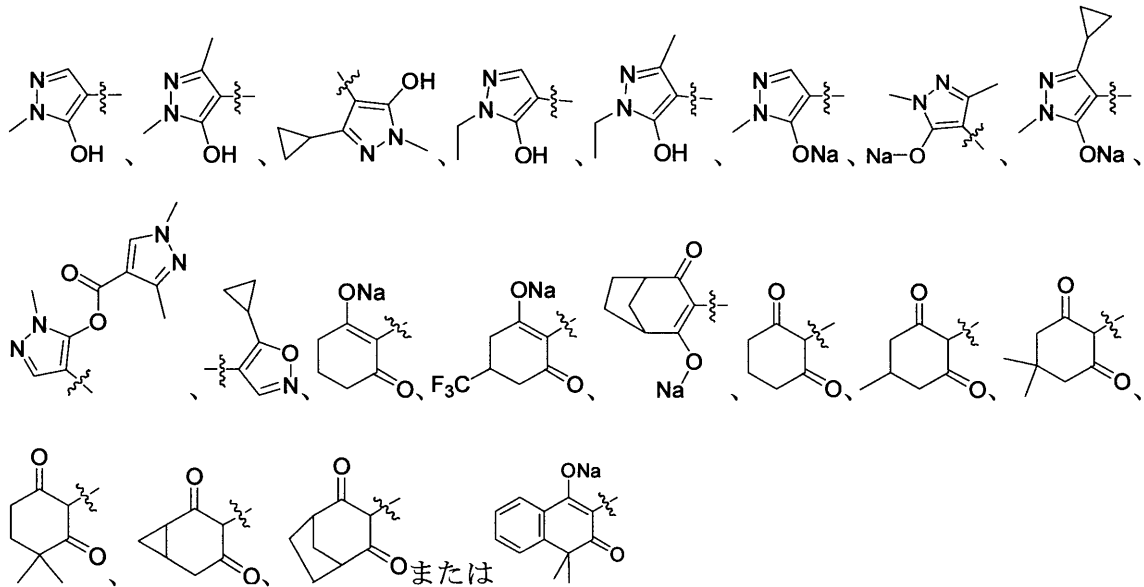
【 0 0 1 3】

別の実施形態において、Qは

40

50

【化10】



10

を表す。

【0014】

20

上記の式および下記のすべての構造式で表される化合物の定義において、使用される専門用語は、単独で使用されるかまたは複合語で使用されるかにかかわらず、下記の置換基を表す：2個超の炭素原子を有するアルキルは直鎖であっても分岐鎖であってもよい。例えば、複合語「-アルキル-OR」中のアルキルは、 $-CH_2-$ 、 $-CH_2CH_2-$ 、 $-CH(CH_3)-$ 、 $-C(CH_3)_2-$ 等であり得る。アルキルは、例えば、 C_1 アルキル：メチル； C_2 アルキル：エチル； C_3 アルキル：n-プロピルまたはイソプロピル等のプロピル； C_4 アルキル：n-ブチル、イソブチル、tert-ブチルまたは2-ブチル等のブチル； C_5 アルキル：n-ペンチル等のペンチル； C_6 アルキル：n-ヘキシル、イソヘキシルおよび1,3-ジメチルブチル等のヘキシル。同様に、アルケニルは、例えば、アリル、1-メチルプロプ-2-エン-1-イル、2-メチルプロプ-2-エン-1-イル、ブト-2-エン-1-イル、ブチル-3-エン-1-イル、1-メチルブト-3-エン-1-イルおよび1-メチルブト-2-エン-1-イルである。アルキニルは、例えば、プロパルギル、ブト-2-イン-1-イル、ブト-3-イン-1-イル、1-メチルブト-3-イン-1-イルである。少なくとも1個（例えば、1、2または3個）の複数の結合を、各不飽和基の任意の位置に配置することができる。シクロアルキルは、例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチルまたはシクロヘキシル等の3~6個の炭素原子を有する炭素環式飽和環系である。同様に、シクロアルケニルは、例えば、シクロプロペニル、シクロブテニル、シクロペンテニルおよびシクロヘキセニル等の3~6個の炭素環員を有するモノシクロアルケニルであり、二重結合は任意の位置にあり得る。ハロゲンはフッ素、塩素、臭素またはヨウ素である。

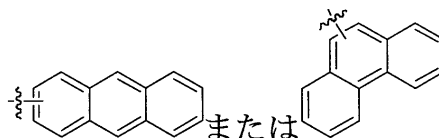
30

40

【0015】

特に明記しない限り、使用される専門用語は、単独で使用されるかまたは複合語で使用されるかにかかわらず、下記の意味を表す：本発明の「アリール」としては、フェニル、ナフチル、

【化11】

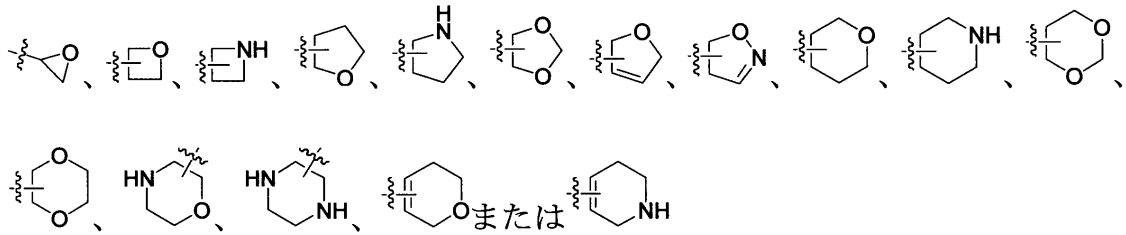


50

が挙げられ；

「ヘテロシクリル」としては、例えば、0、1または2個のオキソ基を有する

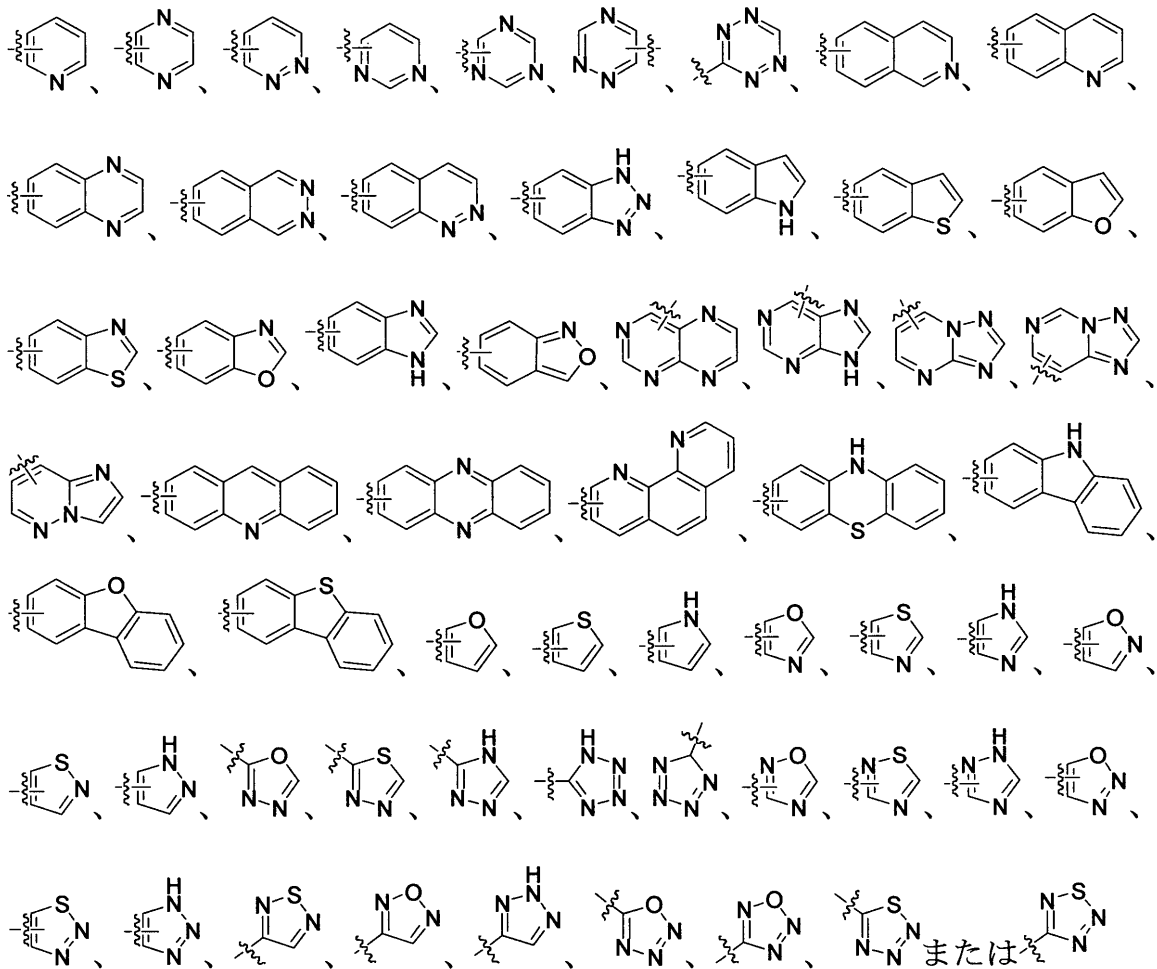
【化12】



10

だけでなく、例えば、3～6個（例えば3、4、5または6個）の環原子を有し、ベンゾ環と融合されていてもよく、環の1～4個（例えば1、2、3または4個）のヘテロ原子が酸素、窒素および硫黄からなる群から選択される「ヘテロアリール」（「芳香族複素環基」ともいう）もが挙げられる。例えば、

【化13】



20

30

40

である。

【0016】

基が基によって置換される場合、基が、言及された基から選択される、同じまたは異なる基である1個以上の基によって置換されることを意味すると理解されるべきである。さらに、同じまたは異なる置換基に含まれる同じまたは異なる置換文字は独立して選択され、同じであっても異なってもよい。これは、異なる原子と単位で形成された環系にも適用される。一方、特許請求の範囲からは、当業者に公知の標準的な条件下で化学的に不

50

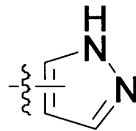
安定な化合物が除外される。

【0017】

さらに、特に定義されていない限り、本発明において複数の並置された置換基（「、」または「または」で区切られている）の前または後にある用語は、「ハロゲンを含むかまたは含まないアルキル、アルケニル、またはアルキニル」の「ハロゲンを含むかまたは含まない」という用語が、以下の基「アルキル」、「アルケニル」および「アルキニル」のそれぞれを制限する効果を有するように、各置換基に限定的な効果を有し；「アルキルアミノ」は、アルキル基で1（mono-）または2（di-）置換されたアミノ基を指し、他の置換アミノ基は同様の定義を有する；結合部位が特定されていない基（ヘテロシクリル、アリール、ヘテロアリール等を含む）は、CまたはN部位を含む任意の部位において結合され得る；置換されている場合、置換基は、原子価結合理論に従う限り、任意の部位において置換され得る。例えば、ヘテロアリール

10

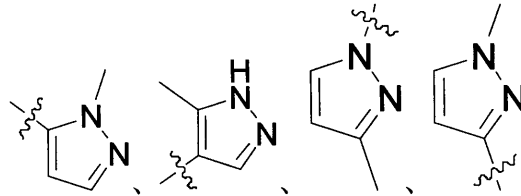
【化14】



が1個のメチルで置換されている場合、

【化15】

20



等になり得る。

【0018】

30

置換基の特性およびその結合方法に応じて、式Iの化合物およびその誘導体は、立体異性体として存在し得る。例えば、化合物が1個以上の不斉炭素原子を有する場合、エナンチオマーおよびジアステレオマーを有し得る。立体異性体は、従来分離方法、例えばクロマトグラフィー分離による調製で得られる混合物から得ることができる。立体異性体はまた、立体選択的反応を使用することによって、ならびに光学活性の出発物質および/または助剤を使用することによって選択的に調製され得る。本発明はまた、一般式Iに含まれるが具体的には定義されていないすべての立体異性体およびそれらの混合物に関する。

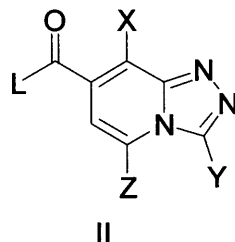
【0019】

置換1, 2, 4-トリアゾロ[4,3-a]ピリジン誘導体を調製するための方法は、以下の工程を含む：

40

中間体としての化合物

【化16】



50

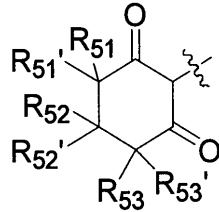
[式中、L は、ハロゲン (F または Cl)、p - ニトロフェノキシまたはシアノ等の脱離基を表す]

との反応。

【 0 0 2 0 】

例えば、目的生成物が式 I の化合物であり、Q が

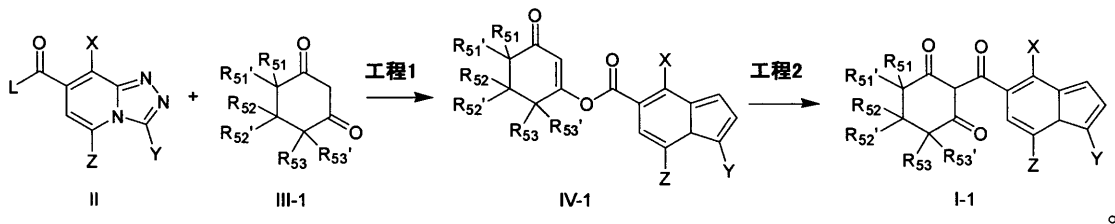
【 化 1 7 】



10

を表す場合、その調製方法は以下の工程を含む：

【 化 1 8 】

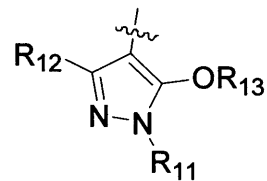


20

【 0 0 2 1 】

目的生成物が式 I の化合物であり、Q が

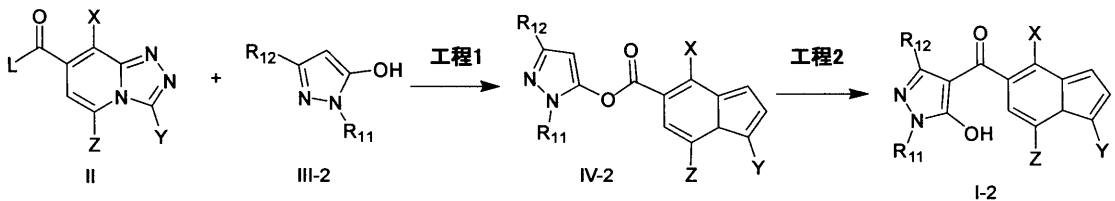
【 化 1 9 】



30

を表す場合、その調製方法は以下の工程を含む：

【 化 2 0 】



40

【 0 0 2 2 】

ここで、工程 1 は、塩基 (トリエチルアミン等) および溶媒 (ジクロロメタン等) の存在下で行われる縮合反応であり；反応温度は 0 ~ 2 5 である。

【 0 0 2 3 】

工程 2 は、触媒 (アセトンシアノヒドリン等)、塩基 (トリエチルアミン等) および溶媒 (アセトニトリル等) の存在下で行われる転位反応であり；反応温度は 2 0 ~ 7 0 である。

50

【 0 0 2 4 】

本発明の化合物は、特許WO 2 0 0 8 0 0 6 5 4 0 A 1に記載される関連する方法を参照することによって調製することができる。

【 0 0 2 5 】

除草剤組成物は、(i) 置換 1 , 2 , 4 - トリアゾロ [4 , 3 - a] ピリジン誘導体を含み；好ましくは、(i i) 1 種以上のさらなる除草剤および/または安全剤をさらに含み；より好ましくは、(i i i) 農薬的に許容可能な製剤助剤をさらに含む。

【 0 0 2 6 】

雑草を防除するための方法は、置換 1 , 2 , 4 - トリアゾロ [4 , 3 - a] ピリジン誘導体または除草剤組成物の少なくとも 1 種の除草有効量を植物または雑草地に適用することを含む。

10

【 0 0 2 7 】

上記の置換 1 , 2 , 4 - トリアゾロ [4 , 3 - a] ピリジン誘導体または除草剤組成物の少なくとも 1 種、好ましくは、有用な作物における雑草を抑制および/または防除するために使用される置換 1 , 2 , 4 - トリアゾロ [4 , 3 - a] ピリジン誘導体は、雑草を防除するために使用され、有用な作物は、トランスジェニック作物または遺伝子編集技術によって処理された作物である。

【 0 0 2 8 】

本発明の式 I の化合物は、広範囲の経済的に重要な単子葉植物および双子葉植物の有害植物に対して優れた除草活性を有する。活性化化合物はまた、地下茎 (rhizome) 、根茎 (r o o t s t o c k) または他の多年生器官から新芽を生成し、防除が困難な多年生雑草に効率的に作用する。この文脈において、物質が播種前、発芽前または発芽後に適用されるかどうかは一般に重要ではない。具体的には、本発明の化合物によって防除することができる単子葉および双子葉の雑草植物相のいくつかの代表例に言及されるが、これらが特定の種に限定されることはない。活性化化合物が効率的に作用する雑草種の例は、単子葉植物の中から、カラスムギ属 (Avena) 種、ドクムギ属 (Lolium) 種、スズメノテッポウ属 (Alopecurus) 種、クサヨシ属 (Phalaris) 種、ヒエ属 (Echinochloa) 種、メヒシバ属 (Digitaria) 種、エノコログサ属 (Setaria) 種、および一年生植物の部門のカヤツリグサ属 (Cyperus) 種、ならびに多年生種の中から、コムギダマシ属 (Agropyron) 、ギョウギシバ属 (Cynodon) 、チガヤ属 (Imperata) およびモロコシ属 (Sorghum) 、および多年生のカヤツリグサ属 (Cyperus) 種である。

20

30

【 0 0 2 9 】

双子葉植物の雑草種の場合、作用範囲は、例えば、一年生植物の中から、ヤエムグラ属 (Galium) 、スミレ属 (Viola) 、クワガタソウ属 (Veronica) 、オドリコソウ属 (Lamium) 、ハコベ属 (Stellaria) 、アマランサス属 (Amaranthus) 、シロガラシ属 (Sinapis) 、サツマイモ属 (Ipomoea) 、キンゴジカ属 (Sida) 、シカギク属 (Matricaria) およびアブチロン属 (Abutilon) 、ならびに多年生雑草の場合にはセイヨウヒルガオ属 (Convolvulus) 、アザミ属 (Cirsium) 、スイバ属 (Rumex) およびヨモギ属 (Artemisia) 等の種に及ぶ。本発明の活性化化合物はまた、例えば、ヒエ属 (Echinochloa) 、オモダカ属 (Sagittaria) 、サジオモダカ属 (Alisma) 、ハリイ属 (Eleocharis) 、ホタルイ属 (Scirpus) およびカヤツリグサ属 (Cyperus) 等の稲作の特定の条件下で発生する有害な植物の優れた防除に影響を与える。本発明の化合物が発芽前に土壌表面に適用される場合、雑草の実生が発生するのを完全に抑制されるか、または雑草が子葉段階に達するまで生長するもののその後生長が停止し、最終的にその後 3 ~ 4 週間が経過すると完全に死滅する。特に、本発明の化合物は、セイヨウヌカボ (Apera spica venti) 、シロザ (Chenopodium album) 、ヒメオドリコソウ (Lamium purpureum) 、ソバカズラ (Polygonum convulvulus) 、コハコベ (Stellaria media) 、フラサバソウ (Veronica hederifolia) 、オオイヌフグリ (Veronica persica) 、サンシキスミレ (Viola tricolor) に対して、ならびにアマランサス属 (Amaranthus) 、ヤエムグラ属 (Galium) およびホウキギ属 (Kochia) 属の種に対して優れた活性を示す。

40

50

【 0 0 3 0 】

本発明の化合物は、単子葉および双子葉の雑草に対して優れた除草活性を有するが、例えば、小麦、大麦、ライ麦、米、トウモロコシ、サトウキビ、ワタおよび大豆等の経済的に重要な作物である作物植物には全く損傷を与えないか、またはごくわずかな程度の損傷を与えるに過ぎない。特に小麦、大麦およびトウモロコシ等の穀物、特に小麦との適合性に優れている。これらの理由から、本発明の化合物は、農業用の植栽または観賞用の植栽における望ましくない植物の生長を選択的に防除するのに非常に適している。

【 0 0 3 1 】

その除草特性のために、これらの活性化合物はまた、既知のまたはまだ開発されていない遺伝子組み換え植物の作物における有害な植物を防除するために使用することもできる。トランスジェニック植物は、一般に、特に有利な特性、例えば、特定の農薬、特に特定の除草剤に対する耐性、植物病害または植物病害の原因生物、例えば特定の昆虫もしくは微生物、例えば真菌、細菌もしくはウイルスに対する耐性を有する。他の特定の特性は、例えば、量、品質、貯蔵安定性、組成、および収穫物の特定の成分に関連する。したがって、デンプン含有量が増大されるかまたはデンプンの品質が改変されたトランスジェニック植物、または収穫物における異なる脂肪酸組成を有する植物が知られている。

10

【 0 0 3 2 】

有用植物および観賞植物である経済的に重要なトランスジェニック作物、例えば小麦、大麦、ライ麦、オーツ麦、キビ、米、キャッサバおよびトウモロコシ等の穀物における、またはサトウキビ、綿、大豆、菜種、ジャガイモ、トマト、エンドウ豆および他の植物種の作物における本発明の式 I の化合物またはそれらの塩の使用が好ましい。式 I の化合物は、好ましくは、除草剤の植物毒性効果に対して耐性を有するかまたは遺伝子工学によって耐性にされた有用な植物である作物における除草剤として使用することができる。

20

【 0 0 3 3 】

既知の植物と比較して改変された特性を有する新規植物を製造するための従来の方法は、例えば、従来 of 育種法および突然変異体の生成を含む。あるいは、改変された特性を有する新規植物は、遺伝子工学的な方法により生成することができる（例えば、EP - A 0 2 2 1 0 4 4、EP - A 0 1 3 1 6 2 4 を参照）。例えば、いくつかのケースが記載されている：

- 植物中で合成されるデンプンを改変するための作物植物の遺伝子工学的な改変（例えば、WO 9 2 / 1 1 3 7 6、WO 9 2 / 1 4 8 2 7、WO 9 1 / 1 9 8 0 6）、
- グルホシネート型（例えば、EP - A 0 2 4 2 2 3 6、EP - A 0 2 4 2 2 4 6 を参照）もしくはグリホサート型（WO 9 2 / 0 0 3 7 7）、またはスルホニル尿素型（EP - A 0 2 5 7 9 9 3、米国特許第 5, 0 1 3, 6 5 9 A）の特定の除草剤に耐性のあるトランスジェニック作物植物、
- 植物に特定の害虫に対する耐性を付与するバチルス・チューリングエンシス（*Bacillus thuringiensis*）毒素（Bt 毒素）を生産する能力を有するトランスジェニック作物植物、例えば綿（EP - A 0 1 4 2 9 2 4、EP - A 0 1 9 3 2 5 9）、
- 脂肪酸組成が改変されたトランスジェニック作物植物（WO 9 1 / 1 3 9 7 2）。

30

【 0 0 3 4 】

特性が改変された新規のトランスジェニック植物の製造を可能にする多くの分子生物学的技術が原理上知られている；例えば、Sambrook et al., 1989, Molecular Cloning, A Laboratory Manual, 2nd ed. Cold Spring Harbor Laboratory Press, Cold Spring Harbor, N.Y.; または Winnacker "Gene und Klone" [Genes and Clones], VCH Weinheim, 2nd edition 1996, or Christou, "Trends in Plant Science" 1 (1996) 423-431) を参照されたい。そのような遺伝子工学的操作を行うために、DNA 配列の組換えによって突然変異誘発または配列の変化を引き起こすことを可能にするプラスミドに核酸分子を導入することが可能である。上記の標準的なプロセスを使用して、例えば、塩基を置換すること、部分的な配列を除去すること、または天然または合成の配列を付加することが可能である。DNA 断片を相互に連結するために、アダプターまたはリンカーを

40

50

断片に結合することができる。

【0035】

遺伝子産物の活性が低下した植物細胞は、例えば、少なくとも1つの適切なアンチセンスRNA、共抑制効果を達成するためのセンスRNAを発現することによって、または上記の遺伝子産物の転写物を特異的に切断する少なくとも1つの適切に構築されたりボザイムを発現することによって製造することができる。

【0036】

この目的のために、存在する可能性のある隣接配列を含む遺伝子産物の全コード配列を含むDNA分子と、コード配列の部分のみを含むDNA分子との両方を使用することが可能であり、これらの部分は、細胞内でアンチセンス効果を引き起こすのに十分な長さであることが必要である。遺伝子産物のコード配列と高度な相同性を有するが、完全に同一ではないDNA配列を使用することも可能である。

10

【0037】

植物において核酸分子を発現させる場合、合成されるタンパク質は、植物細胞の任意の所望の区画に局在化し得る。しかしながら、特定の区画における局在化を達成するために、例えば、コード領域と特定の区画における局在化を確実にするDNA配列とを連結することが可能である。そのような配列は当業者に知られている（例えば、Braun et al., EMBO J. 11 (1992), 3219-3227; Wolter et al., Proc. Natl. Acad. Sci. USA 85 (1988), 846-850; Sonnewald et al., Plant J. 1 (1991), 95-106を参照されたい）。

【0038】

トランスジェニック植物細胞は、既知の技術を使用して植物全体に再生することができる。トランスジェニック植物は、原理上、任意の所望の植物種、すなわち単子葉植物および双子葉植物の両方の植物であり得る。このようにして、相同 (= 天然) 遺伝子または遺伝子配列の過剰発現、抑制または阻害によって、または異種 (= 外来) 遺伝子または遺伝子配列の発現によって特性が改変されたトランスジェニック植物を得ることが可能である。

20

【0039】

トランスジェニック作物において本発明の活性化合物を使用する場合、他の作物において観察され得る有害な植物に対する効果に加えて、それぞれのトランスジェニック作物における用途に特有の効果、例えば、雑草のスペクトルの改変または顕著な拡大、適用に使用され得る適用率の改変、好ましくはトランスジェニック作物が耐性を有する除草剤との良好な適合性、およびトランスジェニック作物植物の生長および収量への効果が頻繁に見られる。したがって、本発明はまた、トランスジェニック作物植物における有害植物を防除するための除草剤としての本発明の化合物の使用を提供する。

30

【0040】

さらに、本発明の物質は、作物植物において優れた生長調節特性を有する。それらは調節的な方法で植物の代謝に関与し、例えば乾燥および発育阻害を誘発することによって、植物成分の標的制御および収穫を容易にするために使用することができる。さらに、それらはまた、そのプロセス中で植物を破壊することなく、望ましくない栄養生長を広く調節および阻害するのに適している。栄養生長の阻害は、倒伏を低減するか、または完全に防ぐことができることから、多くの単子葉植物および双子葉植物の作物において重要な役割を果たす。

40

【0041】

本発明の化合物は、水和剤、乳化性濃縮物、噴霧性溶液、粉剤または顆粒の形態で通常の製剤に適用することができる。したがって、本発明はまた、式Iの化合物を含む除草剤組成物を提供する。式Iの化合物は、一般的な生物学的および/または化学物理的パラメータに応じて様々な方法で処方することができる。製剤の選択肢の好適な例は、水和剤 (WP)、水溶性粉末 (SP)、水溶性濃縮物、乳化性濃縮物 (EC)、エマルジョン (EW)、例えば水中油型および油中水型のエマルジョン、噴霧性溶液、懸濁濃縮物 (SC)、油分散液 (OD)、油性または水性の分散液、油混和性溶液、粉剤 (DP)、カプセル懸濁液 (CS)、種子粉衣 (seed-dressing) 組成物、散布用および土壌適用用の顆粒、

50

マイクロ顆粒、スプレー顆粒、コーティング顆粒および吸着顆粒の形態の顆粒（GR）、水分散性顆粒（WG）、水溶性顆粒（SG）、ULV製剤、マイクロカプセルおよびワックスである。これらの個々の製剤タイプは原則として公知であり、例えば、Winnacker-Kuchler, "Chemische Technologie" [Chemical Technology], Volume 7, C. Hauser Verlag Munich, 4th. Edition 1986; Wade van Valkenburg, "Pesticide Formulations", Marcel Dekker, N.Y., 1973; K. Martens, "Spray Drying" Handbook, 3rd Ed. 1979, G. Goodwin Ltd. Londonに記載されている。

【0042】

不活性材料、界面活性剤、溶媒および他の添加剤等の必要な製剤助剤も同様に公知であり、例えば、Watkins, "Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers", 2nd Ed., Darland Books, Caldwell N.J., H. v. Olphen, "Introduction to Clay Colloid Chemistry"; 2nd Ed., J. Wiley & Sons, N.Y.; C. Marsden, "Solvents Guide"; 2nd Ed., Interscience, N.Y. 1963; McCutcheon's "Detergents and Emulsifiers Annual", MC Publ. Corp., Ridgewood N.J.; Sisley and Wood, "Encyclopedia of Surface Active Agents", Chem. Publ. Co. Inc., N.Y. 1964; Schonfeldt, "Grenzfluochenaktive Athylenoxidaddkte" [Surface-active ethylene oxide adducts], Wiss. Verlagsgesell. Stuttgart 1976; Winnacker-Kuchler, "Chemische Technologie" [Chemical Technology], Volume 7, C. Hauser Verlag Munich, 4th Edition 1986に記載されている。

【0043】

水和剤は、水に均一に分散可能であり、活性化化合物および希釈剤または不活性物質に加えて、イオン性および/または非イオン性タイプの界面活性剤（湿潤剤、分散剤）、例えばポリエトキシ化アルキルフェノール、ポリエトキシ化脂肪アルコール、ポリエトキシ化脂肪アミン、脂肪アルコールポリグリコールエーテル硫酸塩、アルカンスルホン酸塩、アルキルベンゼンスルホン酸塩、リグニンスルホン酸ナトリウム、2,2'-ジナフチルメタン-6,6'-ジスルホン酸ナトリウム、ジブチルナフタレンスルホン酸ナトリウムまたはオレオイルメチルタウリン酸ナトリウムを含む製剤である。水和剤を調製するために、除草活性化化合物は、例えば、ハンマーミル、ファンミルおよびエアジェットミル等の通常の装置によって微細に粉碎され、製剤助剤と同時にまたはそれに続いて混合される。

【0044】

乳化性濃縮物は、活性化化合物を有機溶媒、1種以上のイオン性および/または非イオン性タイプの界面活性剤（乳化剤）の添加と共に、例えばブタノール、シクロヘキサノン、ジメチルホルムアミド、キシレンまたは他の比較的高沸点の芳香族化合物もしくは炭化水素、またはそれら溶媒の混合物に溶解することにより調製される。使用できる乳化剤の例は、ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム等のアルキルアリアルスルホン酸カルシウム、または非イオン性乳化剤、例えば、脂肪酸ポリグリコールエステル、アルキルアリアルポリグリコールエーテル、脂肪アルコールポリグリコールエーテル、プロピレン-酸化エチレンオキシド縮合物、アルキルポリエーテル、ソルピタンエステル、例えばソルピタン脂肪酸エステル、またはポリオキシエチレンソルピタンエステル、例えばポリオキシエチレンソルピタン脂肪酸エステルである。

【0045】

粉剤は、活性化化合物を、微細に粉碎された固体物質、タルク、天然粘土、例えばカオリン、ベントナイトおよびピロフィライト、または珪藻土と共に粉碎することによって得られる。懸濁濃縮物は、水性または油性であり得る。これらは、例えば、他の製剤タイプの場合、すでに上で述べたような界面活性剤の添加の有無にかかわらず、例えば市販の慣用的なピーズミルを使用する湿式粉碎によって調製することができる。

【0046】

エマルジョン、例えば水中油型エマルジョン（EW）は、例えば、スターラー、コロイドミルおよび/または静的ミキサーによって、水性有機溶媒を使用して、他の製剤タイプの場合、すでに上で述べたような界面活性剤を使用して調製することができる。

【 0 0 4 7 】

顆粒は、活性化化合物を吸着性の顆粒状不活性材料に噴霧するか、または接着性結合剤、例えばポリビニルアルコール、ポリアクリル酸ナトリウムまたはその他の鉱油を用いて、砂、カオリナイトまたは顆粒状不活性材料等の担体の表面に、活性化化合物濃縮物を塗布することによって調製することができる。好適な活性化化合物はまた、必要に応じて、肥料との混合物として、肥料顆粒の調製に慣用的な方法で造粒することができる。水分散性顆粒は、一般に、噴霧乾燥、流動床造粒、ディスク造粒、高速ミキサーを使用した混合、および固体不活性材料を使用しない押出し等の通常のプロセスによって調製される。

【 0 0 4 8 】

ディスク、流動床、押出機および噴霧による顆粒の調製については、例えば、“Spray-Drying Handbook” 3rd ed. 1979, G. Goodwin Ltd., London; J. E. Browning, “Agglomeration”, Chemical and Engineering 1967, pages 147 ff.; “Perry's Chemical Engineer's Handbook”, 5th Ed., McGraw-Hill, New York 1973, pp. 8-57を参照されたい。作物保護製品の製剤の詳細については、例えば、G. C. Klingman, “Weed Control as a Science”, John Wiley and Sons Inc., New York, 1961, pages 81-96 および J. D. Freyer, S. A. Evans, “Weed Control Handbook”, 5th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1968, pages 101-103を参照されたい。

10

【 0 0 4 9 】

農薬製剤は、一般に、0.1 ~ 99重量%、特に0.1 ~ 95重量%の式Iの活性化化合物を含む。水和剤では、活性化化合物の濃度は、例えば、約10 ~ 99重量%であり、100重量%までの残りは通常の製剤成分からなる。乳化性濃縮物において、活性化化合物の濃度は、約1 ~ 90重量%、好ましくは5 ~ 80重量%であり得る。粉剤の形態の製剤は、1 ~ 30重量%の活性化化合物、好ましくは最も一般的には5 ~ 20重量%の活性化化合物を含み、一方、噴霧溶液は、約0.05 ~ 80重量%、好ましくは2 ~ 50重量%を含む。水分散性顆粒の場合、活性化化合物の含有量は、活性化化合物が液体または固体のどちらの形態であるか、および使用される充填剤等の造粒助剤に部分的に依存する。水分散性顆粒において、活性化化合物の含有量は、例えば、1 ~ 95重量%、好ましくは10 ~ 80重量%である。

20

【 0 0 5 0 】

また、活性化化合物の製剤は、粘着付与剤、湿潤剤、分散剤、乳化剤、浸透剤、防腐剤、不凍剤、溶媒、充填剤、担体、着色剤、消泡剤、蒸発阻害剤、ならびにそれぞれの場合に慣用されるpHおよび粘度調節剤を含み得る。

30

【 0 0 5 1 】

これらの製剤に基づいて、例えば調合済みまたは容器混合の形態の、他の殺虫活性物質、例えば殺虫剤、殺ダニ剤、除草剤および殺菌剤との組み合わせ物、ならびにまた薬害軽減剤(safener)、肥料および/または生長調節剤との組み合わせ物を製造することができる。

【 0 0 5 2 】

混合製剤または容器混合物において本発明の活性化化合物と組み合わせることができる好適な活性化化合物は、例えば、World Herbicide New Product Technology Handbook, China Agricultural Science and Farming Techniques Press, 2010. 9およびそこで引用されている文献等に記載されている既知の活性化化合物である。例えば、下記の活性化化合物は、式Iの化合物と組み合わせることができる除草剤として言及され得る(注:これらの化合物は、国際標準化機構(ISO)に準拠した「一般名」によって、または化学名によって、適切な場合には慣用のコード番号と共に名付けられる):アセトクロル、ブタクロル、アラクロル、プロピソクロル、メトラクロル、s-メトラクロル、プレチラクロル、プロバクロル、エタクロル、ナプロパミド、R-左周り(R-left handed)ナプロパミド、プロパニル、メフェナセット、ジフェナミド、ジフルフェニカン、エタプロクロル、ベフルブタミド、プロモブチド、ジメテナミド、ジメテナミド-P、エトベンザニド、フルフェナセット、テニルクロル、メタザクロル、イソキサベン、フラムプロブ-M

40

50

- メチル、フラムプロブ - M - プロピル、アリドクロル、ベトキサミド、クロラノクリル、シブラジン、メフルイジド、モナリド、デラクロル、プリナクロル、テルブクロル、キシラクロル、ジメタクロル、シサニリド、トリメキサクロル、クロメプロブ、プロピザミド、ペンタノクロル、カルベタミド、ベンゾイルプロブエチル、シブラゾール、プテナクロル、テブタム、ベンジブラム、モグルトン、ジクロフルアニド、ナプロアニリド、ジエタチルエチル、ナプタラム、フルフェナセット、E L - 177、ベンザドクス、クロルチアミド、クロロフタルイミド、イソカルバミド、ピコリナフェン、アトラジン、シマジン、プロメトリン、シアナトリン、シメトリン、アメトリン、プロパジン、ジプロペトリン、SSH - 108、テルプトリン、テルブチラジン、トリアジフラム、シブラジン、プログリナジン、トリエタジン、プロメトン、シメトン、アジプロトリン、デスメトリン、ジメタメトリン、プロシアジン、メソプラジン、セブチラジン、セクブメトン、テルブメトン、メトプロトリン、シアナトリン、イパジン、クロラジン、アトラトン、ベンジメタリン、エグリナジン、シアヌル酸、インダジフラム、クロルスルフロソ、メトスルフロソメチル、ベンスルフロソメチル、クロリムロンエチル、トリベヌロンメチル、チフェンスルフロソメチル、ピラゾスルフロソエチル、メソスルフロソ、ヨードスルフロソメチルナトリウム、フォラムスルフロソ、シノスルフロソ、トリアスルフロソ、スルホメツロンメチル、ニコスルフロソ、エタメトスルフロソメチル、アミドスルフロソ、エトキシスルフロソ、シクロスルファミロン、リムスルフロソ、アジムスルフロソ、フラザスルフロソ、モノスルフロソ、モノスルフロソエステル、フルカルバゾンナトリウム、フルピルスルフロソメチル、

10

20

ハロスルフロソメチル、オキサスルフロソ、イマゾスルフロソ、プリミスルフロソ、プロボキシカルバゾン、プロスルフロソ、スルホスルフロソ、トリフロキシスルフロソ、トリフルスルフロソメチル、トリトスルフロソ、メトスルフロソメチルナトリウム、フルセトスルフロソ、HNPC - C、オルトスルファミロン、プロピリスルフロソ、メタゾスルフロソ、アシフルオルフェン、フォメサフェン、ラクトフェン、フルオログリコフェン、オキシフルオルフェン、クロルニトロフェン、アクロニフェン、エトキシフェンエチル、ピフェノクス、ニトロフルオルフェン、クロメトキシフェン、フルオロジフェン、フルオロニトロフェン、フリロキシフェン、ニトロフェン、TOPE、DMNP、PPG1013、AKH - 7088、ハロサフェン、クロルトロン、イソプロツロン、リヌロン、ジウロン、ジムロン、フルオメツロン、ベンズチアズロン、メタベンズチアズロン、クミルロン、エチジムロン、イソウロン、テブチウロン、ブツロン、クロルブロムロン、メチルジムロン、フェノベンズロン、SK - 85、メトブロムロン、メトクスロン、アフエシン、モヌロン、シズロン、フェヌロン、フルオチウロン、ネブロン、クロロクスロン、ノルロン、イソノルロン、3 - シクロオクチル - 1、チアズフルロン、テブチウロン、ジフェノクスロン、パラフルロン、メチルアミントリブニル、カルブチレート、トリメツロン、ジメフロソ、モニソウロン、アニスロン、メチウロン、クロレツロン、テトラフルロン、フェンメジファミン、フェンメディファミンエチル、デスメディファミン、アスラム、テルブカルブ、バルバン、プロファミン、クロルプロファミン、ロウメイト、スウェプ、クロルプロファミン、カルボキサゾール、クロルプロカルブ、フェナスラム、BCPC、CPPC、カルバスラム、ブチレート、ベンチオカルブ、ベルノレート、モリネート、トリアレート、ジメピペレート、エスプロカルブ、ピリブチカルブ、シクロエート、アバデックス、EPTC、エチオレート、オルベンカルブ、ペブレート、プロスルホカルブ、チオカルバジル、CDEC、ジメキサノ、イソポリネート、メチオベンカルブ、2, 4 - Dブチルエステル、MCPA - Na、2, 4 - Dイソオクチルエステル、MCPAイソオクチルエステル、2, 4 - Dナトリウム塩、2, 4 - Dジメチルアミン塩、MCPA - チオエチル、MCPA、2, 4 - Dプロピオン酸、高2, 4 - Dプロピオン酸塩、2, 4 - D酪酸、MCPAプロピオン酸、MCPAプロピオン酸塩、MCPA酪酸、2, 4, 5 - D、2, 4, 5 - Dプロピニル酸、2, 4, 5 - D酪酸、MCPAアミン塩、ジカンバ、エルボン、クロルフェナク、セゾン、TBA、クロラムベン、メトキシ - TBA、ジクロホップメチル、フルアジホップブチル、フルアジホップ - p - ブチル、ハロキシホップ - メチル、ハロキシホッ

30

40

50

プ - P、キザロホップエチル、キザロホップ - p - エチル、フェノキサプロブ - エチル、
 フェノキサプロブ - p - エチル、プロパキサホップ、シハロホップ - ブチル、メタミホッ
 プ、クロジナホップ - プロパルギル、フェンチアプロブ - エチル、クロロアジホップ - プ
 ロピニル、ポブペネート - メチル、トリフォブシム、イソキサピリホップ、パラクアット
 、ジクアット、オリザリン、エタルフルラリン、イソプロパリン、ニトラリン、プロフル
 ラリン、プロジナミン、ベンフルラリン、フルクロラリン、ジニトラミナ、ジプロパリン
 、クロルニジン、メタルプロパリン、ジノプロップ、グリホセート、アニコホス、グルホ
 シネート、アンモニウム、アミプロホス - メチル、スルホセート、ピペロホス、ピアラホ
 スナトリウム、ベンスリド、ブタミホス、ホカルブ、2, 4 - DEP、H - 9201、ザ
 イترون、イマザピル、イマゼタピル、イマザキン、イマザモクス、イマザモクスアンモ
 ニウム塩、イマザピック、イマザメタベンズメチル、フルロキシピル、フルロキシピルイ
 ソオクチルエステル、クロピラリドトリクロピル、ジチオピル、ハロキシジン、3, 5,
 6 - トリクロロ - 2 - ピリジノール、チアゾピル、フルリドン、アミノピラリド、ジフル
 フェンゾピル、トリクロピルブトチル、クリオジネート、セトキシジム、クレトジム、シ
 クロキシジム、アロキシジム、クレフォキシジム、ブトロキシジム、トラコキシジム、テ
 プラロキシジム、ブチダゾール、メトリブジン、ヘキサジノン、メタミトロン、エチオジ
 ン、アメトリジオン、アミブジン、プロモキシニル、プロモキシニルオクタノエート、イ
 ソキシニルオクタノエート、イソキシニル、ジクロベニル、ジフェナトリル、ピラクロニ
 ル、クロロキシニル、ヨードポニル、フルメトスラム、フロラスラム、ペノキスラム、メ
 トスラム、クロランスラムメチル、ジクロスラム、プロキシスラム、ペノフレセート、ピ
 スピリバック - ナトリウム、ピリベンゾキシム、ピリフタリド、ピリミノバック - メチル
 、ピリチオバック - ナトリウム、ベンゾピシロン、メソトリオン、スルコトリオン、テム
 ボトリオン、テフリルトリオン、ビシクロピロン、ケトドピラドクス、イソキサフルトー
 ル、クロマゾン、フェノキサスルホン、メチオゾリン、フルアゾレート、ピラフルフェン
 エチル、ピラゾリネート、ジフェンゾクアット、ピラゾキシフェン、ベンゾフェナブ、ニ
 ピラクロフェン、ピラスルフオトル、トブラメゾン、ピロキサスルホン、カフェンスト
 ロール、フルボキサム、アミノトリアゾール、アミカルバゾン、アザフェニジン、カルフ
 ェントラゾンエチル、スルフエントラゾン、ベンカルバゾン、ベンズフェンジゾン、ブタ
 フェナシル、プロマシル、イソシル、レナシル、テルバシル、フルプロパシル、シニドン
 エチル、フルミクロラックペンチル、フルミオキサジン、プロピザミド、MK - 129、
 フルメジン、ペンタクロロフェノール、ジノセブ、ジノテルブ、ジノテルブアセテート、
 ジノサム、DNOC、クロロニトロフェン、メジノテルブアセテート、ジノフェネート、
 オキサジアルギル、オキサジアゾン、ペントキサゾン、フルフェナセット、フルチアセッ
 トメチル、フェントラザミド、フルフェンピルエチル、ピラゾン、プロムピラゾン、メト
 フルラゾン、クサキラ、ジミダゾン、オキサピラゾン、ノルフルラゾン、ピリダフォル
 、キンクロラック、キンメラック、ベンタゾン、ピリデート、オキサジクロメフォン、ベ
 ナゾリン、クロマゾン、シンメチリン、ZJ0702、ピリバンベンズプロピル、インダ
 ノファン、塩素酸ナトリウム、ダラボン、トリクロロ酢酸、モノクロロ酢酸、ヘキサクロ
 ロアセトン、フルプロパネート、シペルクアット、プロモフェノキシム、エプロナズ、メ
 タゾール、フルルタモン、ベンフレセート、エトフメセート、チオクロリム、クロルター
 ル、フルオロクロリドン、タブロン、アクロレイン、ベントラニル、トリジファン、クロ
 ルフェンプロブメチル、チジアリゾナイミン、フェニソファミ、ブソキシノン、メトキシ
 フェノン、サフルフェナシル、クラシフォス、クロロポン、アロラック、ジエタムムクア
 ット、エトニプロミド、イブリミダム、イブフェンカルバゾン、チエンカルバゾンメチル
 、ピリミスルファン、クロルフルラゾール、トリプロピンダン、スルグリカピン、プロス
 ルファリン、カムベンジクロル、アミノシクロピラクロル、ロデタニル、ペノキサコール
 、フェンクロリム、フルラゾール、フェンクロラゾールエチル、クロキントセットメキシ
 ル、オキサベントリニル、MG/91、シオメトリニル、DKA - 24、メフェンピルジ
 エチル、フリラゾール、フルキソフェニム、イソキサジフェンエチル、ジクロルミド、ハ
 ロキシフェンメチル、DOWフロルピラウキシフェン、UBH - 509、D489、LS

10

20

30

40

50

82-556、KPP-300、NC-324、NC-330、KH-218、DPX-N8189、SC-0744、DOWCO535、DK-8910、V-53482、PP-600、MBH-001、KIH-9201、ET-751、KIH-6127およびKIH-2023。

【0053】

使用するために、市販の形態で存在する製剤は、適切な場合、通常の方法、例えば、水和剤、乳化性濃縮物、分散液および水分散性顆粒の場合には水を使用して希釈される。粉剤、土壌適用用または散布用の顆粒、および噴霧溶液の形態の製品は、通常、使用前に他の不活性物質でさらに希釈されることはない。必要とされる式Iの化合物の適用量は、温度、湿度、使用する除草剤の性質等の外的条件によって異なる。それは、広い範囲内、例えば0.001~1.0kg/ha以上の活性物質の間で変動し得るが、好ましくは0.005~750g/ha、特に0.005~250g/haである。

10

【0054】

本発明を実施するための特定の形態

以下の実施形態は、本発明を詳細に説明するために使用されるものであり、本発明に対するいかなる制限としても解釈されるべきではない。本発明の範囲は、請求項を通じて説明される。

【0055】

化合物の経済性および多様性を考慮して、いくつかの好ましい化合物を合成し、その一部を以下の表1に示す。特定の化合物の構造および情報を表1に示す。表1の化合物を、本発明のさらなる説明のために列挙するが、本発明を制限するものではない。本発明の主題は、以下の化合物に限定されるものとして当業者によって解釈されるべきではない。

20

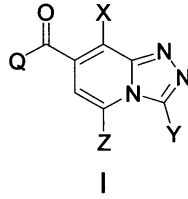
【0056】

30

40

50

【表 1】

化合物の構造と¹H NMRデータ

番号	Q	X	Y	Z	¹ H NMR
1		F		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム- <i>d</i>) δ 8.72 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 7.14 (dd, <i>J</i> = 7.0, 5.5 Hz, 1H), 4.64 (s, 1H), 2.67 - 2.52 (m, 5H), 1.81 - 1.67 (m, 4H), 1.59-1.55 (m, 2H).
2		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム- <i>d</i>) δ 8.94 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 7.80 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 4.39 (s, 1H), 2.95 (p, <i>J</i> = 5.5 Hz, 1H), 2.63 - 2.51 (m, 4H), 1.79 - 1.55 (m, 6H).
3		Br		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム- <i>d</i>) δ 9.01 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 7.39 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 4.48 (s, 1H), 2.95 (p, <i>J</i> = 5.5 Hz, 1H), 2.63-2.54 (m, 4H), 1.81 - 1.67 (m, 4H), 1.59-1.53 (m, 2H).
4		I		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム- <i>d</i>) δ 8.87 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 7.05 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 4.47 (s, 1H),

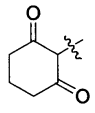


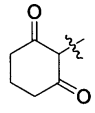


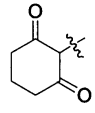


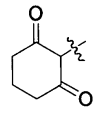

10

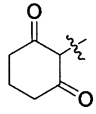

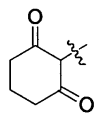


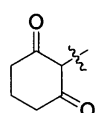


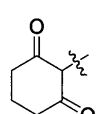


20

30

40

50

					2.95 (p, $J = 5.5$ Hz, 1H), 2.63-2.52 (m, 4H), 1.80 - 1.65 (m, 4H), 1.58-1.53 (m, 2H).	
5				H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム- <i>d</i>) δ 8.79 (d, $J = 7.5$ Hz, 1H), 7.17 (d, $J = 7.5$ Hz, 1H), 6.95 - 6.86 (m, 1H), 5.75 (d, $J = 14.0$ Hz, 2H), 4.54 (s, 1H), 2.70 - 2.52 (m, 5H), 1.81 - 1.67 (m, 4H), 1.59 (p, $J = 6.6$ Hz, 2H).	10
6				H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム- <i>d</i>) δ 8.85 (d, $J = 6.5$ Hz, 1H), 7.08 (d, $J = 6.5$ Hz, 1H), 4.60 (s, 1H), 4.40 (s, 1H), 2.95-2.91 (m, 1H), 2.63-2.57 (m, 4H), 1.82 - 1.66 (m, 4H), 1.59-1.55 (m, 2H).	20
7				H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム- <i>d</i>) δ 8.81 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 7.16 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 4.54 (s, 1H), 3.05 - 3.01 (m, 1H), 2.97 - 2.91 (m, 1H), 2.63 - 2.55 (m, 4H), 1.80 - 1.65 (m, 4H), 1.59 (p, $J = 6.5$ Hz, 2H), 1.46 - 1.32 (m, 4H).	30
8		CN		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム- <i>d</i>) δ 9.26 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 7.47 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 4.51 (s, 1H), 2.95 (p, $J = 5.5$ Hz, 1H), 2.63 - 2.58 (m, 4H), 1.79 -	40

					1.62 (m, 4H), 1.59 (p, $J = 6.5$ Hz, 2H).
9		NO_2		H	^1H NMR (500 MHz, クロロフォルム- d) δ 9.17 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 7.38 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 4.45 (s, 1H), 2.95 (p, $J = 5.5$ Hz, 1H), 2.67 - 2.60 (m, 4H), 1.80 - 1.55 (m, 6H).
10				H	^1H NMR (500 MHz, クロロフォルム- d) δ 8.85 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 7.26 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 4.78 (s, 2H), 4.51 (s, 1H), 3.36 (s, 3H), 2.63-2.57 (m, 4H), 2.63 - 2.51 (m, 1H), 1.78 - 1.55 (m, 6H).
11				H	^1H NMR (500 MHz, クロロフォルム- d) δ 8.71 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 7.15 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 4.52 (s, 1H), 2.95 (p, $J = 5.5$ Hz, 1H), 2.69 - 2.54 (m, 4H), 2.48 (s, 3H), 1.80 - 1.65 (m, 4H), 1.59 (p, $J = 6.5$ Hz, 2H).
12				H	^1H NMR (500 MHz, クロロフォルム- d) δ 9.00 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 7.34 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 4.37 (s, 1H), 3.05 (s, 3H), 2.95 (p, $J = 5.5$ Hz, 1H), 2.63 - 2.55 (m, 4H), 1.78 - 1.68 (m, 2H), 1.67 - 1.55 (m, 4H).

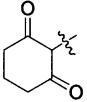


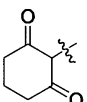


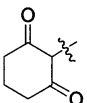

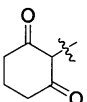


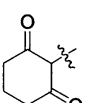


10

20

30

40

50

13				H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 9.16 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 7.44 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 4.45 (s, 1H), 3.20 (s, 3H), 2.95 (p, <i>J</i> = 5.5 Hz, 1H), 2.70 - 2.59 (m, 4H), 1.81 - 1.67 (m, 4H), 1.59 (p, <i>J</i> = 6.5 Hz, 2H).
14				H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 8.70 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 7.26 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 4.58 (s, 1H), 3.97 (s, 3H), 2.70 - 2.50 (m, 5H), 1.79 - 1.67 (m, 4H), 1.59 (p, <i>J</i> = 6.5 Hz, 2H).
15		NH ₂		H	
16				H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 8.59 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 7.15 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 4.71 (s, 1H), 3.10 (s, 6H), 2.70 - 2.51 (m, 5H), 1.79 - 1.55 (m, 6H).
17				H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 8.77 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 7.18 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 4.35 (s, 1H), 3.93 (t, <i>J</i> = 5.0 Hz, 2H), 2.95 (p, <i>J</i> = 5.5 Hz, 1H), 2.66 - 2.52 (m, 6H), 2.10 - 2.00 (m, 2H), 1.79 - 1.66 (m, 4H), 1.60 (p, <i>J</i> = 6.5 Hz, 2H).

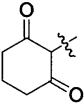
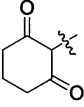
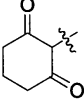
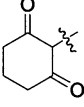
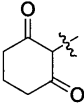
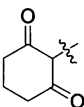

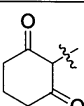

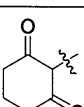

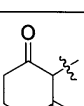
10

20

30

40

50

18		H	CH ₃	H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 8.86 (d, J = 6.5 Hz, 1H), 7.82 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 7.71 (dd, J = 6.5, 1.5 Hz, 1H), 4.50 (s, 1H), 2.78 (s, 3H), 2.67 - 2.52 (m, 4H), 1.59-1.55 (m, 2H).
19		F	CH ₃	H	
20		Cl	CH ₃	H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 8.92 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.26 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 4.51 (s, 1H), 2.84 (s, 3H), 2.67 - 2.52 (m, 4H), 1.59 (p, J = 6.5 Hz, 2H).
21		Br	CH ₃	H	
22		I	CH ₃	H	
23			CH ₃	H	
24			CH ₃	H	
25			CH ₃	H	
26		CN	CH ₃	H	

10

20

30

40

50

27		NO ₂	CH ₃	H	
28			CH ₃	H	
29			CH ₃	H	
30			CH ₃	H	
31			CH ₃	H	
32			CH ₃	H	
33		NH ₂	CH ₃	H	
34			CH ₃	H	
35			CH ₃	H	
36		Cl	H	H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム- <i>d</i>) δ 8.95 (d, <i>J</i> = 7.0Hz, 1H), 8.50 (s, 1H), 7.39 (d, <i>J</i> = 7.0Hz, 1H), 4.50 (s, 1H), 2.67 - 2.52 (m, 4H), 1.59 (p, <i>J</i> = 6.5 Hz, 2H).

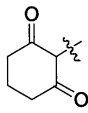
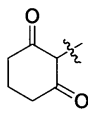
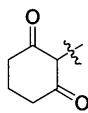
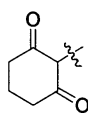
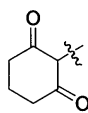
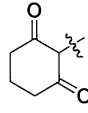

10

20

30

40

50

37		Cl	F	H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 8.97 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 7.30 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 4.51 (s, 1H), 2.67 - 2.54 (m, 4H), 1.59 (p, <i>J</i> = 6.5 Hz, 2H).
38		Cl	Cl	H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 8.96 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 7.29 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 4.50 (s, 1H), 2.67 - 2.54 (m, 4H), 1.59 (p, <i>J</i> = 6.5 Hz, 2H).
39		Cl	Br	H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 8.93 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 7.29 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 4.51 (s, 1H), 2.67 - 2.54 (m, 4H), 1.59 (p, <i>J</i> = 6.5 Hz, 2H).
40		Cl	I	H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 8.93 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 7.34 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 4.51 (s, 1H), 2.67 - 2.54 (m, 4H), 1.59 (p, <i>J</i> = 6.5 Hz, 2H).
41		Cl	CH ₂ CH ₃	H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 8.93 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 7.27 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 4.52 (s, 1H), 3.11 (q, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.67 - 2.52 (m, 4H), 1.59 (p, <i>J</i> = 6.5 Hz, 2H), 1.45 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H).
42		Cl		H	

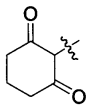

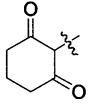

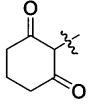

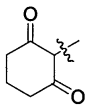

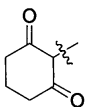

10

20

30

40

50

43		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 8.94 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 7.30 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 4.52 (s, 1H), 3.45-3.38 (m, 1H), 2.69 - 2.52 (m, 4H), 1.59 (p, <i>J</i> = 6.5 Hz, 2H), 1.32 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 6H).
44		Cl		H	
45		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 8.75 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 7.31 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 4.51 (s, 1H), 2.68 - 2.53 (m, 4H), 1.59 (p, <i>J</i> = 6.5 Hz, 2H), 1.44 (s, 9H).
46		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 8.94 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 7.28 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 4.51 (s, 1H), 3.65-3.62 (m, 1H), 2.68 - 2.52 (m, 4H), 1.83-1.80 (m, 2H), 1.59 (p, <i>J</i> = 6.5 Hz, 2H), 1.46 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 3H), 0.95 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H).
47		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 9.14 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 7.88 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 4.56 (s, 1H), 3.65-3.62 (m, 2H), 2.84 - 2.75 (m, 2H), 2.47 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 2H), 2.30-2.28 (m, 1H), 1.85-1.81 (m, 2H), 1.03

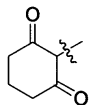
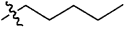
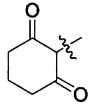

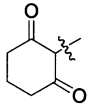

10

20

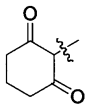

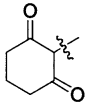

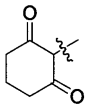

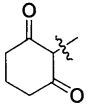

30

40

50

					(d, $J = 6.5$ Hz, 6H).	
48		Cl		H	$^1\text{H NMR}$ (500 MHz, クロロフォルム- d) δ 8.93 (d, $J = 6.5$ Hz, 1H), 7.28 (d, $J = 6.5$ Hz, 1H), 4.51 (s, 1H), 2.88 (t, $J = 6.5$ Hz, 2H), 2.68 - 2.52 (m, 4H), 1.88 - 1.85 (m, 2H), 1.59-1.55 (m, 2H), 1.44 - 1.27 (m, 4H), 0.89 (t, $J = 6.5$ Hz, 3H).	10
49		Cl		H	$^1\text{H NMR}$ (500 MHz, クロロフォルム- d) δ 9.12 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 7.89 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 4.56 (s, 1H), 3.35 - 3.23 (m, 2H), 3.07 - 3.04 (m, 1H), 2.84 - 2.75 (m, 2H), 2.15-2.13 (m, 1H), 1.94 - 1.93 (m, 1H), 1.85-1.82 (m, 2H), 1.70 - 1.56 (m, 1H), 1.55 - 1.48 (m, 1H), 1.42 (d, $J = 6.5$ Hz, 3H), 0.91 (t, $J = 8.0$ Hz, 3H).	20
50		Cl		H	$^1\text{H NMR}$ (500 MHz, クロロフォルム- d) δ 9.13 (d, $J = 6.5$ Hz, 1H), 7.86 (d, $J = 6.5$ Hz, 1H), 4.56 (s, 1H), 3.29-3.25 (m, 2H), 3.08 (d, $J = 6.5$ Hz, 2H), 2.84 - 2.72 (m, 2H), 2.08-2.05 (m, 1H), 1.85-1.81 (m, 2H), 1.73-1.70 (m, 1H), 1.61 - 1.49 (m, 1H), 1.08 (d, $J = 7.0$ Hz, 3H), 0.95 (t, $J = 8.0$ Hz, 3H).	30

40

51		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 9.13 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 7.86 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 4.56 (s, 1H), 3.35 - 3.23 (m, 2H), 2.84 - 2.75 (m, 2H), 2.53 (t, <i>J</i> = 8.0 Hz, 2H), 1.85-1.81 (m, 2H), 1.67 - 1.63 (m, 1H), 1.58 - 1.50 (m, 2H), 0.97 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 6H).	10
52		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 9.12 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 7.87 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 4.56 (s, 1H), 3.29 - 3.25 (m, 2H), 2.99 - 2.91 (m, 1H), 2.84 - 2.75 (m, 2H), 2.26-2.22 (m, 2H), 1.95-1.92 (m, 2H), 1.89 - 1.81 (m, 2H), 0.97 (t, <i>J</i> = 8.0 Hz, 6H).	20
53		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 9.09 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 7.64 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 4.67 (s, 1H), 2.98 - 2.88 (m, 2H), 2.66 - 2.62 (m, 2H), 1.89 - 1.80 (m, 2H), 1.75 (q, <i>J</i> = 8.0 Hz, 2H), 1.53 (s, 6H), 0.97 (t, <i>J</i> = 8.0 Hz, 3H).	30
54		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 9.12 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 7.87 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 4.57 (s, 1H), 3.34 - 3.22 (m, 2H), 2.84 - 2.75 (m, 2H), 2.41 (s, 2H), 1.85-1.81 (m, 2H), 1.05 (s,	40

					9H).
55		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 8.92 (d, J = 6.5Hz, 1H), 7.28 (d, J = 6.5 Hz, 1H), 4.52 (s, 1H), 2.85 (t, J = 6.5 Hz, 2H), 2.68 - 2.52 (m, 4H), 1.89 - 1.85 (m, 2H), 1.59 - 1.55 (m, 2H), 1.45 - 1.38 (m, 2H), 1.37 - 1.25 (m, 4H), 0.93 - 0.84 (m, 3H).
56		Cl		H	
57		Cl		H	
58		Cl		H	
59		Cl		H	
60		Cl		H	
61		Cl		H	
62		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 8.93 (d, J = 6.5Hz, 1H), 7.28 (d, J = 6.5Hz, 1H), 4.52 (s, 1H), 2.89 (t, J = 6.5Hz, 2H), 2.68 - 2.52 (m, 4H), 1.89 - 1.85 (m, 2H),

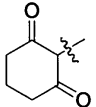
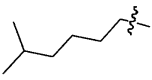
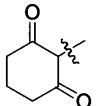

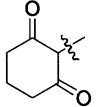
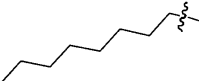
10

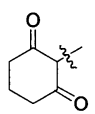
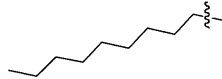
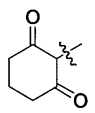
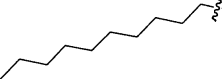
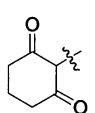

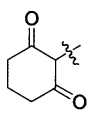
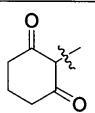

20

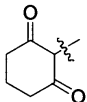

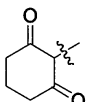

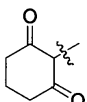

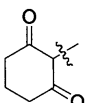

30

40

50

					1.59-1.55 (m, 2H), , 1.51 - 1.38 (m, 4H), 1.32 - 1.22 (m, 4H), 0.92 - 0.85 (m, 3H).	
63		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 9.14 (d, J = 6.5 Hz, 1H), 7.86 (d, J = 6.5 Hz, 1H), 4.56 (s, 1H), 3.34 - 3.24 (m, 2H), 2.84 - 2.75 (m, 2H), 2.53 (t, J = 8.0 Hz, 2H), 1.85-1.82 (m, 2H), 1.67 - 1.55 (m, 3H), 1.36 - 1.26 (m, 2H), 1.23 - 1.15 (m, 2H), 0.93 (d, J = 6.5 Hz, 6H).	10
64		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 9.12 (d, J = 6.5 Hz, 1H), 7.88 (d, J = 6.5 Hz, 1H), 4.56 (s, 1H), 3.27-3.24 (m, 2H), 2.84 - 2.72 (m, 3H), 2.26 - 2.10 (m, 2H), 1.94 - 1.77 (m, 4H), 1.58 - 1.31 (m, 4H), 0.91 - 0.85 (m, 6H).	20
65		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 9.14 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.86 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 4.56 (s, 1H), 3.34 - 3.24 (m, 2H), 2.84 - 2.75 (m, 2H), 2.57 - 2.49 (m, 2H), 1.89 - 1.81 (m, 2H), 1.60-1.56 (m, 2H), 1.36 - 1.21 (m, 11H), 0.93 - 0.85 (m, 2H).	30
						40

66		Cl		H	$^1\text{H NMR}$ (500 MHz, クロロフォルム- <i>d</i>) δ 9.14 (d, J = 6.5 Hz, 1H), 7.89 (d, J = 6.5 Hz, 1H), 4.56 (s, 1H), 3.34 - 3.24 (m, 2H), 2.84 - 2.75 (m, 2H), 2.57 - 2.49 (m, 2H), 1.86 - 1.82 (m, 2H), 1.60 - 1.54 (m, 2H), 1.38 - 1.21 (m, 13H), 0.93 - 0.85 (m, 2H).	10
67		Cl		H	$^1\text{H NMR}$ (500 MHz, クロロフォルム- <i>d</i>) δ 9.14 (d, J = 6.5 Hz, 1H), 7.86 (d, J = 6.5 Hz, 1H), 4.56 (s, 1H), 3.34 - 3.24 (m, 2H), 2.84 - 2.75 (m, 2H), 2.53 (t, J = 8.0 Hz, 2H), 1.85 - 1.80 (m, 2H), 1.60 - 1.54 (m, 2H), 1.36 - 1.20 (m, 15H), 0.93 - 0.85 (m, 2H).	20
68		Cl		H	$^1\text{H NMR}$ (500 MHz, クロロフォルム- <i>d</i>) δ 8.96 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.30 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.17 - 6.94 (m, 1H), 4.50 (s, 1H), 2.68 - 2.54 (m, 4H), 1.59 (p, J = 6.5 Hz, 2H).	30
69		Cl	CF_3	H	$^1\text{H NMR}$ (500 MHz, クロロフォルム- <i>d</i>) δ 8.85 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.33 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 4.50 (s, 1H), 2.68 - 2.54 (m, 4H), 1.59 (p, J = 6.5 Hz, 2H).	
70		Cl		H	$^1\text{H NMR}$ (500 MHz, クロロフォルム- <i>d</i>) δ 9.14 (d, J = 6.5 Hz, 1H), 7.88 (d, J =	40

					6.5Hz, 1H), 4.56 (s, 1H), 3.35 - 3.23 (m, 2H), 2.85 - 2.75 (m, 2H), 2.53 (t, $J = 8.5$ Hz, 2H), 2.14-2.11 (m, 2H), 1.85 -1.81 (m, 2H).
71		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム- <i>d</i>) δ 9.26 (d, $J = 6.5$ Hz, 1H), 7.93 (d, $J = 6.5$ Hz, 1H), 4.57 (s, 1H), 3.33 - 3.23 (m, 2H), 2.80 - 2.76 (m, 2H), 1.85-1.81 (m, 2H).
72		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム- <i>d</i>) δ 9.16 (d, $J = 6.5$ Hz, 1H), 7.87 (d, $J = 6.5$ Hz, 1H), 4.57 (s, 1H), 3.92-3.88 (m, 2H), 3.33 - 3.20 (m, 2H), 2.87 - 2.78 (m, 4H), 1.89 - 1.81 (m, 2H).
73		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム- <i>d</i>) δ 9.26 (d, $J = 6.5$ Hz, 1H), 7.90 (d, $J = 6.5$ Hz, 1H), 5.40 -5.38 (m, 1H), 4.56 (s, 1H), 3.36 - 3.23 (m, 2H), 2.84 - 2.75 (m, 2H), 2.06 -2.03 (m, 3H), 1.85-1.82 (m, 2H).
74		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム- <i>d</i>) δ 9.19 (d, $J = 6.5$ Hz, 1H), 7.88 (d, $J = 6.5$ Hz, 1H), 4.57 (s, 1H), 3.52-3.48 (m, 2H), 3.35 - 3.23 (m, 2H), 2.84 - 2.75 (m, 2H), 2.53-2.50 (m, 2H), 1.95 - 1.81 (m, 4H).

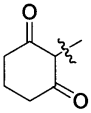

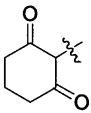

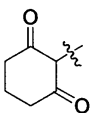

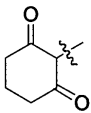

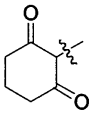

10

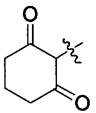

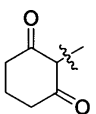

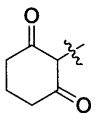

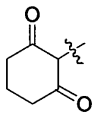

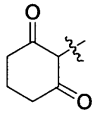

20

30

40

50

75		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 8.93 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 7.57 - 7.47 (m, 1H), 7.28 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 5.67 (d, <i>J</i> = 13.0 Hz, 2H), 4.51 (s, 1H), 2.67 - 2.53 (m, 4H), 1.59-1.55 (m, 2H).	10
76		Cl		H		
77		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 9.16 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 7.86 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 5.35-5.32 (m, 2H), 4.51 (s, 1H), 2.88-2.85 (m, 2H), 2.79 - 2.70 (m, 2H), 2.19 (s, 3H), 1.89 - 1.81 (m, 2H).	20
78		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 9.42 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 7.90 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 6.99 (d, <i>J</i> = 15.0 Hz, 1H), 6.26-6.23 (m, 1H), 4.57 (s, 1H), 3.29-3.24 (m, 2H), 2.85 - 2.75 (m, 2H), 1.85-1.81 (m, 2H), 1.79 - 1.74 (m, 3H).	30
79		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 9.08 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 8.01 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 4.08 (s, 1H), 2.49 - 2.44 (m, 2H), 2.37-2.34 (m, 2H), 1.85 - 1.82 (m, 2H).	40

80		Cl		H	
81		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム- <i>d</i>) δ 9.28 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 7.92 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 4.56 (s, 1H), 3.34 - 3.22 (m, 2H), 2.84 - 2.74 (m, 2H), 1.92 - 1.81 (m, 5H).
82		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム- <i>d</i>) δ 8.87 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 7.31 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 4.51 (s, 1H), 2.69 - 2.53 (m, 4H), 2.05 - 1.92 (m, 4H), 1.59 (p, <i>J</i> = 6.5 Hz, 2H), 1.39 (s, 3H).
83		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム- <i>d</i>) δ 8.94 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 7.28 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 4.52 (s, 1H), 2.69 - 2.53 (m, 5H), 1.88 - 1.77 (m, 2H), 1.62-1.58 (m, 3H), 1.05 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 3H).
84		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム- <i>d</i>) δ 8.93 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 7.27 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 5.11-5.02 (m, 1H), 4.52 (s, 1H), 3.01-2.98 (m, 1H), 2.68 - 2.53 (m, 4H), 2.34-2.21 (m, 2H), 1.59 (p, <i>J</i> = 6.5 Hz, 2H).

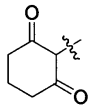

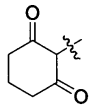

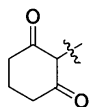

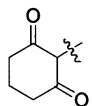

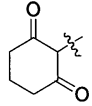

10

20

30

40

50

85		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム- <i>d</i>) δ 8.86 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 7.29 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 4.50 (s, 1H), 2.69 - 2.53 (m, 4H), 2.46 - 2.33 (m, 4H), 1.59 (p, <i>J</i> = 6.5 Hz, 2H).
86		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム- <i>d</i>) δ 8.94 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 7.27 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 4.51 (s, 1H), 2.85 (t, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 2.68 - 2.53 (m, 4H), 1.66 - 1.55 (m, 4H), 1.06 (s, 3H), 1.01 (s, 3H).
87		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム- <i>d</i>) δ 8.93 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 7.25 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 4.52 (s, 1H), 3.85-3.79 (m, 1H), 2.68 - 2.45 (m, 6H), 1.59 (p, <i>J</i> = 6.5 Hz, 2H).
88		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム- <i>d</i>) δ 8.94 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 7.28 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 4.51 (s, 1H), 3.41 (p, <i>J</i> = 5.5 Hz, 1H), 2.69 - 2.53 (m, 4H), 2.34 - 2.17 (m, 4H), 2.00 - 1.84 (m, 2H), 1.59 (p, <i>J</i> = 6.5 Hz, 2H).
89		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム- <i>d</i>) δ 9.12 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 7.89 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 4.56 (s, 1H), 3.37 - 3.34 (m, 1H), 3.28

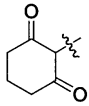

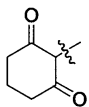

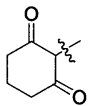

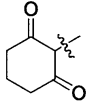

10

20

30

40

50

					-3.24(m, 2H), 2.84 - 2.74 (m, 2H), 2.19 - 2.07 (m, 2H), 1.89 - 1.73 (m, 6H), 1.61 -1.58(m, 2H).
90		C1		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 9.12 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 7.89 (d, <i>J</i> = 6.5Hz, 1H), 4.56 (s, 1H), 3.35 - 3.23 (m, 2H), 3.10-3.08 (m, 1H), 2.80-2.76 (m, 2H), 2.48 -2.44(m, 2H), 2.01 -1.98(m, 2H), 1.90 - 1.81 (m, 4H), 1.79-1.75 (m, 2H), 1.44-1.41 (m, 2H).
91		C1		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 9.28 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 7.91 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 6.14 (t, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 4.58 (s, 1H), 3.27 -3.23(m, 2H), 2.84 - 2.74 (m, 2H), 2.30 -2.22(m, 4H), 1.89 - 1.77 (m, 4H).
92		C1		H	
93		C1		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 9.09 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 7.85 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 4.57 (s, 1H), 3.27-3.23 (m, 2H), 2.84 - 2.74 (m, 2H), 2.47 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 2H), 1.85-1.81 (m, 2H), 1.00 -0.98(m, 1H), 0.56 -0.52(m, 2H), 0.42-0.39 (m, 2H).

10

20

30

40

50

94		Cl		H	
95		Cl		H	
96		Cl		H	
97		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 9.08 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 8.01 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 5.09 (s, 2H), 4.84 (s, 2H), 4.08 (s, 1H), 2.49 (t, <i>J</i> = 7.0 Hz, 2H), 2.37 (t, <i>J</i> = 7.0 Hz, 2H), 1.85-1.81 (m, 2H), 1.37 (s, 3H).
98		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 9.08 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 8.01 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 4.08 (s, 1H), 3.75-3.72 (m, 2H), 3.56-3.46 (m, 3H), 2.49 (t, <i>J</i> = 7.0 Hz, 2H), 2.37 (t, <i>J</i> = 7.0 Hz, 2H), 2.30 (s, 3H), 1.85-1.81 (m, 2H).
99		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 9.22 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 7.89 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 5.39 (t, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 4.57 (s, 1H), 4.06-4.03 (m, 1H), 3.93-3.91 (m, 1H), 3.30-3.25 (m, 2H), 2.84-2.74 (m, 2H), 2.55-2.53 (m, 1H),

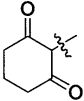

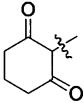

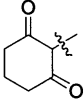

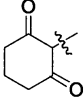

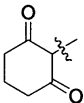

10

20

30

40

50

					2.24-2.21 (m, 1H), 2.07-2.05 (m, 1H), 1.85-1.81 (m, 2H), 1.67-1.65 (m, 1H).
100		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 9.14 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 7.89 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 4.56 (s, 1H), 4.50-4.48 (m, 1H), 4.26-4.24 (m, 1H), 4.01-3.98 (m, 1H), 3.89-3.86 (m, 1H), 3.51-3.48 (m, 1H), 3.28-3.25 (m, 2H), 2.84 - 2.75 (m, 2H), 2.58-2.55 (m, 1H), 2.19-2.17 (m, 1H), 1.85-1.82 (m, 2H).
101		Cl		H	
102		Cl		H	
103		Cl		H	
104		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 9.27 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 7.84 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 7.67-7.02 (m, 4H), 7.39-7.32 (m, 4H), 7.34 - 7.26 (m, 2H), 4.57 (s, 1H), 2.90 (s, 2H), 2.83 - 2.72 (m, 2H), 2.62 - 2.53 (m, 2H), 1.89 - 1.80 (m, 2H).

10

20

30

40

50

105		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 9.13 (d, J = 6.5 Hz, 1H), 7.87 (d, J = 6.5 Hz, 1H), 4.56 (s, 1H), 3.99-3.96 (m, 2H), 3.77-3.74 (m, 2H), 3.35 - 3.23 (m, 2H), 3.12-3.09 (m, 1H), 2.84 - 2.75 (m, 2H), 2.23-2.20 (m, 2H), 2.05-2.02 (m, 2H), 1.85-1.81 (m, 2H).
106		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 9.14 (d, J = 6.5 Hz, 1H), 7.87 (d, J = 6.5 Hz, 1H), 4.56 (s, 1H), 3.35 - 3.23 (m, 2H), 3.05-3.02 (m, 2H), 2.95-2.91 (m, 1H), 2.84 - 2.75 (m, 2H), 2.37 (s, 3H), 2.31 -2.29 (m, 2H), 2.18-2.15 (m, 2H), 1.93 - 1.81 (m, 4H).
107		Cl		H	
108		Cl		H	
109		Cl		H	
110		Cl		H	

10

20

30

40

50

111		Cl		H	
112		Cl		H	
113		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム- <i>d</i>) δ 8.65 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.27 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 4.51 (s, 1H), 4.06 (s, 2H), 2.69 - 2.53 (m, 4H), 1.59-1.55 (m, 2H).
114		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム- <i>d</i>) δ 9.03 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.32 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 4.52 (s, 1H), 4.06 (s, 3H), 2.67 - 2.54 (m, 4H), 1.59 (p, J = 6.5 Hz, 2H).
115		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム- <i>d</i>) δ 8.94 (d, J = 6.5 Hz, 1H), 7.30 (d, J = 6.5 Hz, 1H), 4.78 (s, 2H), 4.50 (s, 1H), 3.35 (s, 3H), 2.69 - 2.53 (m, 4H), 1.59-1.55 (m, 2H).
116		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム- <i>d</i>) δ 9.19 (d, J = 6.5 Hz, 1H), 7.85 (d, J = 6.5 Hz, 1H), 4.66 (s, 2H), 4.56 (s, 1H), 3.60 (q, J = 8.0 Hz, 2H), 3.36 - 3.24 (m, 2H), 2.84 - 2.74 (m, 2H), 1.89 - 1.81 (m, 2H), 1.23 (t, J = 8.0 Hz, 3H).

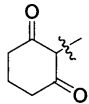

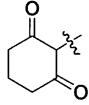

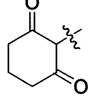

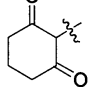

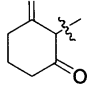

10

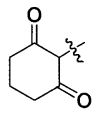
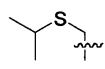
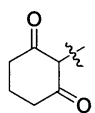
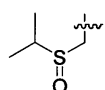
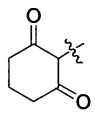
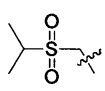
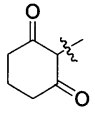

20

30

40

50

117		Cl		H	$^1\text{H NMR}$ (500 MHz, クロロフォルム- <i>d</i>) δ 9.08 (d, J = 6.5Hz, 1H), 7.88 (d, J = 6.5Hz, 1H), 4.63 (s, 1H), 3.55 (t, J = 7.5Hz, 2H), 3.25 (s, 3H), 2.90 (t, J = 7.5 Hz, 2H), 2.81 - 2.70 (m, 2H), 2.54 - 2.45 (m, 2H), 1.89 - 1.80 (m, 2H).	10
118		Cl		H	$^1\text{H NMR}$ (500 MHz, クロロフォルム- <i>d</i>) δ 8.86 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.29 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 4.51 (s, 1H), 2.71 (s, 3H), 2.68 - 2.54 (m, 4H), 1.59 (p, J = 6.5 Hz, 2H).	20
119		Cl		H	$^1\text{H NMR}$ (500 MHz, クロロフォルム- <i>d</i>) δ 9.01 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.25 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 4.50 (s, 1H), 3.01 (s, 3H), 2.68 - 2.54 (m, 4H), 1.59 (p, J = 6.5 Hz, 2H).	30
120		Cl		H	$^1\text{H NMR}$ (500 MHz, クロロフォルム- <i>d</i>) δ 9.03 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.34 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 4.49 (s, 1H), 3.18 (s, 3H), 2.68 - 2.54 (m, 4H), 1.59 (p, J = 6.5 Hz, 2H).	40
121		Cl		H	$^1\text{H NMR}$ (500 MHz, クロロフォルム- <i>d</i>) δ 9.24 (d, J = 6.5 Hz, 1H), 7.89 (d, J = 6.5Hz, 1H), 4.57 (s, 1H), 3.70 (s, 2H), 3.34 - 3.21 (m, 2H), 2.84 - 2.74 (m,	

					2H), 2.27 (s, 3H), 1.85-1.81 (m, 2H).	
122		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 8.93 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 7.25 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 4.51 (s, 1H), 4.12 (s, 2H), 3.10 (hept, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 2.68 - 2.53 (m, 4H), 1.60 (p, <i>J</i> = 6.5 Hz, 2H), 1.30 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 6H).	10
123		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 8.65 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 7.29 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 4.53 (s, 1H), 4.28 (s, 2H), 3.06-3.01 (m, 1H), 2.68 - 2.53 (m, 4H), 1.59 (p, <i>J</i> = 6.5 Hz, 2H), 1.37 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 6H).	20
124		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 8.91 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 7.36 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 4.56 (s, 2H), 4.51 (s, 1H), 3.62 (hept, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H), 2.69 - 2.53 (m, 4H), 1.59 (p, <i>J</i> = 6.5 Hz, 2H), 1.39 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 6H).	30
125		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 8.93 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 7.27 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 4.51 (s, 1H), 4.27 (s, 2H), 2.69 - 2.53 (m, 4H), 2.41 (s, 6H), 1.59-1.55 (m, 2H).	40

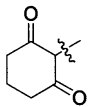

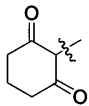

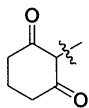

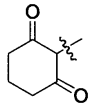

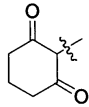

10

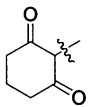

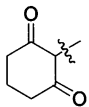

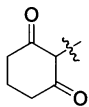

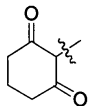
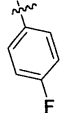
20

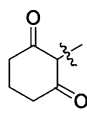

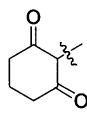

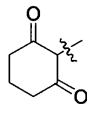
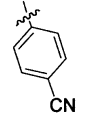
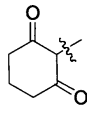

30

40

50

126		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 10.41 (s, 1H), 9.21 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 7.84 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 4.54 (s, 1H), 2.49-2.44(m, 2H), 2.37-2.34 (m, 2H), 1.85 -1.82(m, 2H).	10
127		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 9.60 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 7.92 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 4.62 (s, 1H), 2.80 - 2.70 (m, 2H), 2.67 (s, 3H), 2.51-2.48 (m, 2H), 1.89 - 1.80 (m, 2H).	20
128		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 9.76 (d, <i>J</i> = 6.5Hz, 1H), 7.95 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 4.59 (s, 1H), 3.33 - 3.24 (m, 2H), 3.15 (s, 6H), 2.85 - 2.73 (m, 2H), 1.85-1.82 (m, 2H).	30
129		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 9.15 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 7.84 (d, <i>J</i> = 6.5Hz, 1H), 7.50 - 7.45 (m, 2H), 7.29-7.25 (m, 2H), 7.15-7.13(m, 1H), 4.56 (s, 1H), 3.81 (s, 2H), 3.31 - 3.22 (m, 2H), 2.85 - 2.73 (m, 2H), 1.85-1.82 (m, 2H).	40
130		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 9.13 (d, <i>J</i> = 7.0Hz, 1H), 8.72 (s, 1H), 8.39 -8.36(m, 1H), 7.86 -7.83 (m, 2H), 7.41-7.38 (m, 1H), 4.55 (s, 1H), 3.81	

					(s, 2H), 3.34 - 3.22 (m, 2H), 2.83 - 2.74 (m, 2H), 1.85-1.82 (m, 2H).	
131		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 9.38 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 7.94 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 7.19-7.17 (m, 1H), 6.98 -6.96 (m, 1H), 6.90-6.88 (m, 1H), 4.58 (s, 1H), 4.08 (s, 2H), 3.36 - 3.24 (m, 2H), 2.85 - 2.76 (m, 2H), 1.85-1.82 (m, 2H).	10
132		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 9.30 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 7.90 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 7.28 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 7.12 (s, 1H), 7.06 (d, <i>J</i> = 7.0, 1H), 4.57 (s, 1H), 3.86 (s, 2H), 3.36 - 3.23 (m, 2H), 2.85 - 2.75 (m, 2H), 1.85-1.82 (m, 2H).	20
133		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 8.87 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 8.17-8.13 (m, 2H), 7.51-7.46 (m, 3H), 7.30 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 4.53 (s, 1H), 2.68 - 2.53 (m, 4H), 1.59 (p, <i>J</i> = 6.5 Hz, 2H).	30
134		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 9.22 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 7.91 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 7.76 - 7.69 (m, 2H), 7.29 - 7.21 (m, 2H), 4.64 (s, 1H), 2.82 - 2.72 (m, 2H), 2.50-2.46 (m, 2H),	40

					1.91 - 1.80 (m, 2H).
135		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 9.31 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 7.91 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 7.84-7.82 (m, 1H), 7.60-7.57 (m, 1H), 7.52-7.49 (m, 1H), 7.297.25 (m, 1H), 4.58 (s, 1H), 3.35 - 3.25 (m, 2H), 2.86 - 2.74 (m, 2H), 1.89 - 1.81 (m, 2H).
136		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 9.29 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 7.90 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 7.70-7.66 (m, 1H), 7.43-7.40 (m, 1H), 7.34-7.30 (m, 1H), 7.26-7.23 (m, 1H), 4.58 (s, 1H), 3.36 - 3.26 (m, 2H), 2.80-2.76 (m, 2H), 1.89 - 1.81 (m, 2H).
137		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 9.22 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 7.91-7.86 (m, 3H), 7.88 - 7.82 (m, 2H), 4.64 (s, 1H), 2.82 - 2.73 (m, 2H), 2.50-2.46 (m, 2H), 1.89 - 1.80 (m, 2H).
138		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 9.30 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 8.37-8.35 (m, 1H), 8.06 (s, 1H), 7.90 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 7.71 - 7.64 (m, 2H), 4.58 (s, 1H), 3.33 - 3.24 (m, 2H), 2.80-2.75 (m, 2H), 1.85-1.81 (m, 2H).

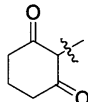

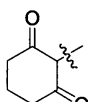
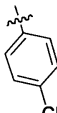
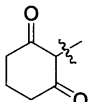

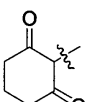

10

20

30

40

50

139		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム- <i>d</i>) δ 9.14 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 7.92 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 7.86 - 7.82 (m, 2H), 7.71 - 7.67 (m, 1H), 7.64 - 7.60 (m, 1H), 4.60 (s, 1H), 3.34 - 3.24 (m, 2H), 2.80 - 2.77 (m, 2H), 1.85 - 1.82 (m, 2H).
140		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム- <i>d</i>) δ 9.30 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 7.88 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 7.73 - 7.67 (m, 2H), 7.58 - 7.51 (m, 2H), 4.58 (s, 1H), 3.32 - 3.23 (m, 2H), 2.80 - 2.76 (m, 2H), 1.89 - 1.81 (m, 2H).
141		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム- <i>d</i>) δ 9.30 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 8.00 - 7.96 (m, 1H), 7.89 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 7.71 (s, 1H), 7.57 - 7.54 (m, 1H), 7.50 - 7.47 (m, 1H), 4.59 (s, 1H), 3.32 - 3.23 (m, 2H), 2.80 - 2.76 (m, 2H), 1.85 - 1.82 (m, 2H).
142		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム- <i>d</i>) δ 9.25 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 7.89 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 7.66 - 7.62 (m, 2H), 7.45 - 7.34 (m, 2H), 4.58 (s, 1H), 3.35 - 3.26 (m, 2H), 2.80 - 2.76 (m, 2H), 1.89 - 1.81 (m, 2H).

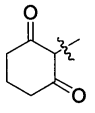
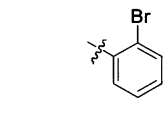
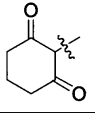
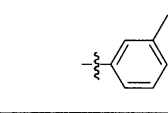
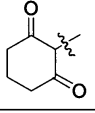
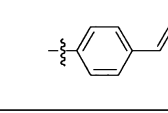
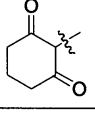
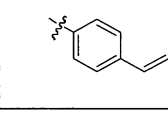
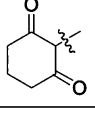
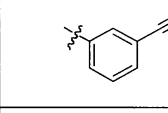
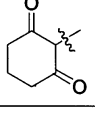
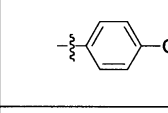
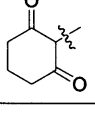
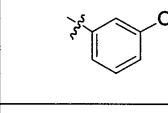
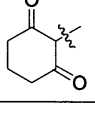
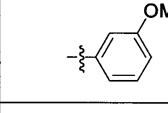
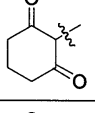
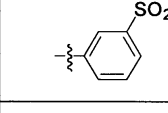
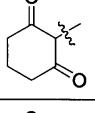
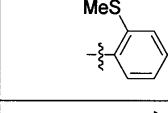
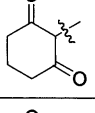
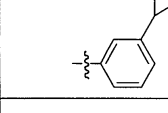
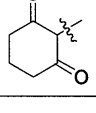
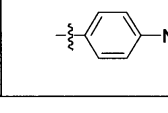
10

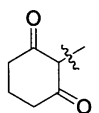
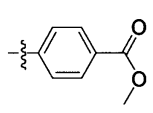
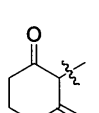
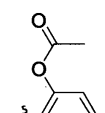
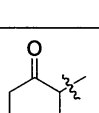
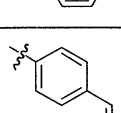
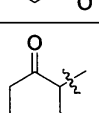
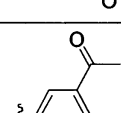
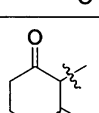
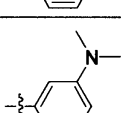
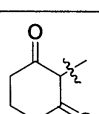
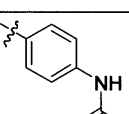
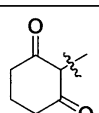
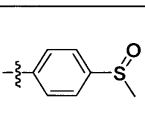
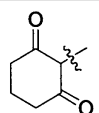
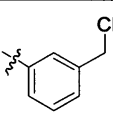
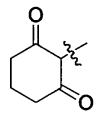
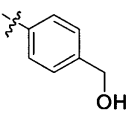
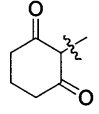
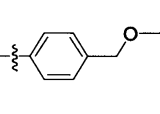
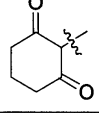
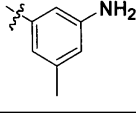
20

30

40

50

143		Cl		H	
144		Cl		H	
145		Cl		H	10
146		Cl		H	
147		Cl		H	
148		Cl		H	20
149		Cl		H	
150		Cl		H	
151		Cl		H	30
152		Cl		H	
153		Cl		H	
154		Cl		H	40

155		Cl		H	
156		Cl		H	
157		Cl		H	
158		Cl		H	
159		Cl		H	
160		Cl		H	
161		Cl		H	
162		Cl		H	
163		Cl		H	
164		Cl		H	
165		Cl		H	

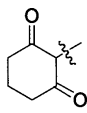

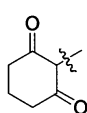
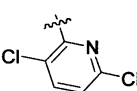
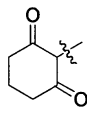
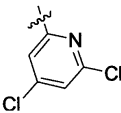
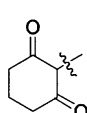
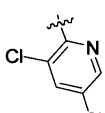
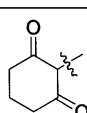

10

20

30

40

50

166		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 9.57 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 8.87 (d, <i>J</i> = 5.0 Hz, 1H), 8.09 (d, <i>J</i> = 8.0 Hz, 1H), 7.96 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 7.76 (t, <i>J</i> = 8.0, 1H), 7.29- 7.26 (m, 1H), 4.60 (s, 1H), 3.36 - 3.26 (m, 2H), 2.80-2.76 (m, 2H), 1.85-1.82 (m, 2H).
167		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 9.40 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 7.93 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 7.56-7.52 (m, 2H), 4.60 (s, 1H), 3.34 - 3.25 (m, 2H), 2.80 -2.76 (m, 2H), 1.85-1.81 (m, 2H).
168		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 9.60 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 8.04 (s, 1H), 7.97 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 7.77 (s, 1H), 4.60 (s, 1H), 3.35 - 3.26 (m, 2H), 2.80-2.76 (m, 2H), 1.85-1.81 (m, 2H).
169		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 9.36 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 8.84 (s, 1H), 8.15 (s, 1H), 7.93 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 4.59 (s, 1H), 3.35 - 3.26 (m, 2H), 2.80-2.76 (m, 2H), 1.85-1.82 (m, 2H).
170		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 9.31 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 9.12 (s, 1H),

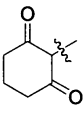
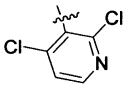
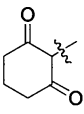
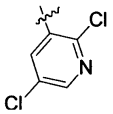
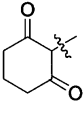
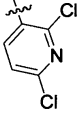
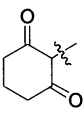
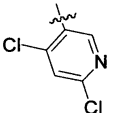
10

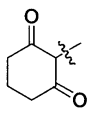
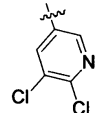
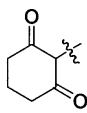

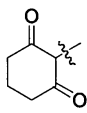
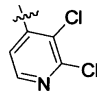
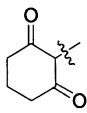
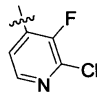
20

30

40

50

				8.65 (d, $J = 5.0$, 1H), 8.22 (d, $J = 8.0$, 1H), 7.94 (d, $J = 6.5$ Hz, 1H), 7.59 (dd, $J = 8.0, 5.0$ Hz, 1H), 4.58 (s, 1H), 3.34 - 3.25 (m, 2H), 2.80-2.75 (m, 2H), 1.85-1.82 (m, 2H).		
171		Cl		H	^1H NMR (500 MHz, クロロフォルム- <i>d</i>) δ 9.15 (d, $J = 6.5$ Hz, 1H), 8.58 (d, $J = 5.0$ Hz, 1H), 7.91 (d, $J = 6.5$ Hz, 1H), 7.74 (d, $J = 5.0$ Hz, 1H), 4.58 (s, 1H), 3.33 - 3.24 (m, 2H), 2.80-2.76 (m, 2H), 1.85 - 1.81 (m, 2H).	10
172		Cl		H	^1H NMR (500 MHz, クロロフォルム- <i>d</i>) δ 9.25 (d, $J = 6.5$ Hz, 1H), 8.65 (s 1H), 8.37 (s, 1H), 7.90 (d, $J = 6.5$ Hz, 1H), 4.57 (s, 1H), 3.35 - 3.25 (m, 2H), 2.80-2.76 (m, 2H), 1.85-1.81 (m, 2H).	20
173		Cl		H	^1H NMR (500 MHz, クロロフォルム- <i>d</i>) δ 9.26 (d, $J = 6.5$ Hz, 1H), 8.41 (d, $J = 8.0$ Hz, 1H), 7.90 (d, $J = 6.5$ Hz, 1H), 7.63 (d, $J = 8.0$ Hz, 1H), 4.57 (s, 1H), 3.35 - 3.25 (m, 2H), 2.86 - 2.74 (m, 2H), 1.89 - 1.81 (m, 2H).	30
174		Cl		H	^1H NMR (500 MHz, クロロフォルム- <i>d</i>) δ 9.23 (d, $J = 6.5$ Hz, 1H), 8.98 (s, 1H), 7.92 (d, $J = 6.5$ Hz, 1H),	40

					7.84 (s, 1H), 4.58 (s, 1H), 3.33 - 3.24 (m, 2H), 2.87 - 2.74 (m, 2H), 1.89 - 1.81 (m, 2H).	
175		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 9.30 (d, J = 6.5 Hz, 1H), 9.04 (s, 1H), 8.49 (s, 1H), 7.94 (d, J = 6.5 Hz, 1H), 4.58 (s, 1H), 3.34 - 3.24 (m, 2H), 2.81-2.78 (m, 2H), 1.85-1.81 (m, 2H).	10
176		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 8.87 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 8.81 - 8.76 (m, 2H), 8.02 - 7.97 (m, 2H), 7.32 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 4.53 (s, 1H), 2.68 - 2.53 (m, 4H), 1.59 (p, J = 6.5 Hz, 2H).	20
177		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 9.25 (d, J = 6.5 Hz, 1H), 8.58 (d, J = 5.0 Hz, 1H), 8.00 (d, J = 5.0 Hz, 1H), 7.90 (d, J = 6.5 Hz, 1H), 4.57 (s, 1H), 3.35 - 3.25 (m, 2H), 2.80-2.76 (m, 2H), 1.85 - 1.82 (m, 2H).	30
178		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 9.28 (d, J = 6.5 Hz, 1H), 8.36 (d, J = 5.0 Hz, 1H), 7.94 - 7.88 (m, 2H), 4.58 (s, 1H), 3.35 - 3.26 (m, 2H), 2.80-2.76 (m, 2H), 1.89 - 1.81 (m, 2H).	40

179		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 9.30 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 8.14 (s, 2H), 7.93 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 4.58 (s, 1H), 3.35 - 3.23 (m, 2H), 2.86 - 2.76 (m, 2H), 1.89 - 1.81 (m, 2H).
180		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 9.14 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 8.66 (s, 2H), 7.91 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 4.57 (s, 1H), 3.34 - 3.24 (m, 2H), 2.86 - 2.74 (m, 2H), 1.89 - 1.81 (m, 2H).
181		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 9.24 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 8.72 (s, 1H), 8.10 (s, 1H), 7.93 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 4.58 (s, 1H), 3.33 - 3.24 (m, 2H), 2.87 - 2.74 (m, 2H), 1.89 - 1.81 (m, 2H).
182		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 9.46 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 9.04 (d, <i>J</i> = 5.0 Hz, 2H), 7.91 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 7.47 (t, <i>J</i> = 5.0 Hz, 1H), 4.59 (s, 1H), 3.35 - 3.25 (m, 2H), 2.86 - 2.74 (m, 2H), 1.89 - 1.81 (m, 2H).
183		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 9.58 - 9.50 (m, 2H), 9.12 (d, <i>J</i> = 5.0 Hz, 1H), 7.97 - 7.89 (m, 2H), 4.59 (s, 1H),

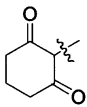

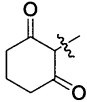

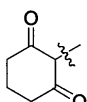

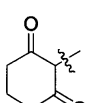

10

20

30

40

50

					3.30-3.26 (m, 2H), 2.85 - 2.76 (m, 2H), 1.85-1.82 (m, 2H).
184		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 9.30 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 9.16-9.12 (m, 3H), 7.85 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 4.60 (s, 1H), 3.32 - 3.23 (m, 2H), 2.81-2.78 (m, 2H), 1.85-1.81 (m, 2H).
185		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 9.56 - 9.49 (m, 2H), 8.18 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 7.97 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 7.87 (t, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 4.60 (s, 1H), 3.35 - 3.26 (m, 2H), 2.80-2.76 (m, 2H), 1.85-1.82 (m, 2H).
186		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 9.80 (s, 1H), 9.48 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H), 9.31 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 8.10 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H), 7.94 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 4.58 (s, 1H), 3.32 - 3.23 (m, 2H), 2.80-2.76 (m, 2H), 1.85-1.81 (m, 2H).
187		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 9.51 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 9.39 (s, 1H), 8.91 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H), 8.76 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H), 7.96 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 4.59 (s, 1H), 3.35 - 3.26 (m, 2H), 2.86 - 2.74 (m, 2H), 1.85 - 1.82 (m, 2H).

10

20

30

40

50

188		Cl		H	
189		Cl		H	
190		Cl		H	
191		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム- <i>d</i>) δ 9.50 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 7.89 (dd, <i>J</i> = 7.0, 1.5 Hz, 1H), 7.71 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 7.06 (dd, <i>J</i> = 7.0, 1.5 Hz, 1H), 6.70 (t, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 4.68 (s, 1H), 2.99 - 2.89 (m, 2H), 2.67 - 2.64 (m, 2H), 1.85 - 1.81 (m, 2H).
192		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム- <i>d</i>) δ 9.41 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 7.86 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 7.70 (dd, <i>J</i> = 7.0, 1.5 Hz, 1H), 7.62 (dd, <i>J</i> = 7.0, 1.5 Hz, 1H), 7.29 (t, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 4.62 (s, 1H), 3.17 - 3.14 (m, 2H), 2.80 - 2.71 (m, 2H), 1.85 - 1.82 (m, 2H).
193		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム- <i>d</i>) δ 9.51 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 7.97 - 7.92 (m, 2H), 7.63 - 7.60 (m, 2H), 4.59 (s, 1H), 3.28 - 3.25 (m, 2H), 2.85 - 2.75 (m, 2H), 1.85 - 1.82 (m, 2H).

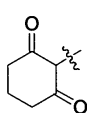

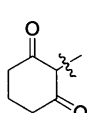

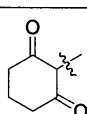

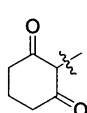

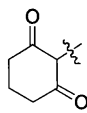

10

20

30

40

50

194		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 9.54 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 7.95 (d, <i>J</i> = 6.5Hz, 1H), 7.85 (d, <i>J</i> = 7.0, 1H), 7.63 (s 1H), 7.52 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 4.59 (s, 1H), 3.28-3.25 (m, 2H), 2.85 - 2.76 (m, 2H), 1.85-1.82 (m, 2H).
195		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 9.43 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 7.94 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 6.84-6.80 (m, 2H), 6.32 (t, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 4.59 (s, 1H), 3.85 (s, 3H), 3.29-3.25 (m, 2H), 2.85 - 2.75 (m, 2H), 1.85-1.82 (m, 2H).
196		Cl		H	
197		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 9.44 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 8.15 (s, 1H), 7.92 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 7.45 (s, 1H), 4.58 (s, 1H), 4.00 (s, 3H), 3.36 - 3.24 (m, 2H), 2.85 - 2.76 (m, 2H), 1.89 - 1.81 (m, 2H).
198		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 8.97 (d, <i>J</i> = 7.0Hz, 1H), 7.87 (s, 1H), 7.32 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 4.54 (s, 1H), 3.91 (s, 3H), 2.68 - 2.53 (m, 7H), 1.60 (p, <i>J</i> = 6.5Hz, 2H).

10

20

30

40

50

199		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 9.50 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 7.71 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 7.33 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 6.67 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 4.67 (s, 1H), 3.94 (s, 3H), 2.99 - 2.90 (m, 2H), 2.67-2.64 (m, 2H), 1.89 - 1.80 (m, 2H).	10
200		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 9.41 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 7.95 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 7.69 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 6.71 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 4.58 (s, 1H), 4.14 (s, 3H), 3.35 - 3.22 (m, 2H), 2.85 - 2.76 (m, 2H), 1.85-1.82 (m, 2H).	20
201		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 9.44 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 8.91 (s, 1H), 8.42 (s, 1H), 7.96 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 4.58 (s, 1H), 3.29-3.25 (m, 2H), 2.86 - 2.76 (m, 2H), 1.85-1.81 (m, 2H).	30
202		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 9.51 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 8.24 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 7.98 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 7.28 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 4.59 (s, 1H), 3.29-3.26 (m, 2H), 2.85 - 2.76 (m, 2H), 1.85 - 1.82 (m, 2H).	40

10

20

30

40

50

203		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 9.52 (d, J = 6.5 Hz, 1H), 8.74 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.96 (d, J = 6.5 Hz, 1H), 7.51 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 4.60 (s, 1H), 3.30-3.25 (m, 2H), 2.85 - 2.76 (m, 2H), 1.85-1.82 (m, 2H).
204		Cl		H	
205		Cl		H	
206		Cl		H	
207		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 9.55 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 8.34-8.30 (m, 2H), 7.95 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 4.60 (s, 1H), 3.35 - 3.23 (m, 2H), 2.84 - 2.74 (m, 2H), 1.85-1.82 (m, 2H).
208		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 9.47 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 8.03 (s, 1H), 7.97 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.43 (s, 1H), 4.59 (s, 1H), 3.30-3.26 (m, 2H), 2.86 - 2.76 (m, 2H), 1.89 - 1.81 (m, 2H).
209		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 9.43 (d, J = 6.5 Hz, 1H), 9.08 (s, 1H),

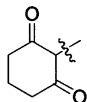

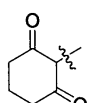

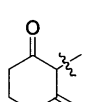

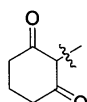

10

20

30

40

50

					8.61 (s, 1H), 7.96 (d, $J = 6.5$ Hz, 1H), 4.58 (s, 1H), 3.36 - 3.24 (m, 2H), 2.85 - 2.76 (m, 2H), 1.85-1.81 (m, 2H).	
210		Cl		H	^1H NMR (500 MHz, クロロフォルム- d) δ 9.58 (d, $J = 6.5$ Hz, 1H), 9.19 (s, 1H), 7.95 (d, $J = 6.5$ Hz, 1H), 7.71 (s, 1H), 4.60 (s, 1H), 3.29 -3.25(m, 2H), 2.84 - 2.75 (m, 2H), 1.85-1.81 (m, 2H).	10
211		Cl		H	^1H NMR (500 MHz, クロロフォルム- d) δ 9.58 (d, $J = 6.5$ Hz, 1H), 8.11 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 7.96 (d, $J = 6.5$ Hz, 1H), 7.46 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 4.60 (s, 1H), 3.29-3.25 (m, 2H), 2.84 - 2.75 (m, 2H), 1.89 - 1.81 (m, 2H).	20
212		Cl		H	^1H NMR (500 MHz, クロロフォルム- d) δ 9.44 (d, $J = 6.5$ Hz, 1H), 7.96 (d, $J = 6.5$ Hz, 1H), 7.83 (s, 1H), 7.73 (s, 1H), 4.59 (s, 1H), 4.08 (s, 3H), 3.35 - 3.23 (m, 2H), 2.85 - 2.76 (m, 2H), 1.85-1.82 (m, 2H).	30
213		Cl		H	^1H NMR (500 MHz, クロロフォルム- d) δ 9.57 (d, $J = 6.5$ Hz, 1H), 7.94 (d, $J = 6.5$ Hz, 1H), 7.80 (s, 1H), 7.52 (s, 1H), 4.60 (s, 1H), 3.69 (s, 3H), 3.31-3.28 (m,	40

					2H), 2.85 - 2.75 (m, 2H), 1.85-1.81 (m, 2H).	
214		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム- <i>d</i>) δ 9.56 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 7.95 (d, <i>J</i> = 6.5Hz, 1H), 7.47 (d, <i>J</i> = 6.0Hz, 1H), 7.16 (d, <i>J</i> = 6.0Hz, 1H), 4.60 (s, 1H), 3.89 (s, 3H), 3.35 - 3.23 (m, 2H), 2.84 - 2.74 (m, 2H), 1.85-1.82(m, 2H).	10
215		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム- <i>d</i>) δ 9.28 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 7.92 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 7.74 (s, 1H), 4.58 (s, 1H), 3.31 - 3.22 (m, 2H), 2.85 - 2.73 (m, 2H), 1.85-1.82 (m, 2H).	20
216		Cl		H		
217		Cl		H		
218		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム- <i>d</i>) δ 9.31 (d, <i>J</i> = 6.5Hz, 1H), 7.93 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 4.58 (s, 1H), 3.33 - 3.21 (m, 2H), 2.83 - 2.74 (m, 2H), 2.51 (s, 3H), 1.85-1.82 (m, 2H).	30
219		Cl		H		

10

20

30

40

50

220		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム- <i>d</i>) δ 11.00(s, 1H), 9.93 (s, 1H), 9.53 (d, <i>J</i> = 6.5Hz, 1H), 7.97 (d, <i>J</i> = 6.5Hz, 1H), 4.61 (s, 1H), 3.33 - 3.21 (m, 2H), 2.83 - 2.74 (m, 2H). 1.85-1.82 (m, 2H).
221		Cl		H	
222		Cl		H	
223		Cl		H	
224		Cl		H	
225		Cl		H	
226		Cl		H	
227		Cl		H	
228		Cl		H	
229		Cl		H	

10

20

30

40

50

230		Cl		H	
231		Cl		H	
232		Cl		H	
233		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム- <i>d</i>) δ 9.17 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 8.27 (d, <i>J</i> = 7.5, 1H), 8.11 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 8.03 (d, <i>J</i> = 7.5, 1H), 7.95-7.91 (m, 2H), 7.89 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 7.53-7.50 (m, 2H), 4.58 (s, 1H), 3.35 - 3.25 (m, 2H), 2.80-2.77 (m, 2H), 1.851.81 (m, 2H).
234		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム- <i>d</i>) δ 9.35 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 8.78 (s, 1H), 8.16 (d, <i>J</i> = 7.5, 1H), 8.09-8.05 (m, 2H), 7.95-7.91 (m, 2H), 7.55-7.51 (m, 2H), 4.59 (s, 1H), 3.34 - 3.25 (m, 2H), 2.81-2.78 (m, 2H), 1.85-1.82 (m, 2H).
235		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム- <i>d</i>) δ 9.27 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 9.05 (d, <i>J</i> = 5.0, 1H), 8.33 (d, <i>J</i> = 7.5, 1H), 8.20 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 8.00 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz,

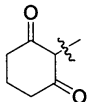
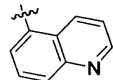
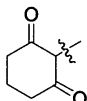
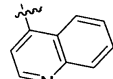
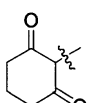
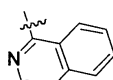
10

20

30

40

50

				1H), 7.89 (d, $J = 6.5$ Hz, 1H), 7.77 (t, $J = 7.5$ Hz, 1H), 7.52-7.49 (m, 1H), 4.60 (s, 1H), 3.37 - 3.28 (m, 2H), 2.80-2.76 (m, 2H), 1.85-1.81 (m, 2H).
236		Cl		H ^1H NMR (500 MHz, クロロフォルム- d) δ 9.18 (d, $J = 6.5$ Hz, 1H), 8.90 (d, $J = 7.5$, 1H), 8.38 (d, $J = 7.5$, 1H), 8.30 (d, $J = 7.5$, 1H), 8.06 - 7.96 (m, 2H), 7.87 (d, $J = 6.5$ Hz, 1H), 7.57-7.54 (m, 1H), 4.59 (s, 1H), 3.33 - 3.24 (m, 2H), 2.80-2.76 (m, 2H), 1.85-1.81 (m, 2H).
237		Cl		H ^1H NMR (500 MHz, クロロフォルム- d) δ 9.13-9.09 (m, 2H), 8.21-8.19 (m, 1H), 8.03-8.00 (m, 1H), 7.88-7.85 (m, 2H), 7.72 (t, $J = 7.5$, 1H), 7.58 (t, $J = 7.5$ Hz, 1H), 4.64 (s, 1H), 2.81 - 2.71 (m, 2H), 2.48-2.44 (m, 2H), 1.89 - 1.80 (m, 2H).
238		Cl		H ^1H NMR (500 MHz, クロロフォルム- d) δ 9.44 (d, $J = 6.5$ Hz, 1H), 8.87 (d, $J = 6.5$ Hz, 1H), 8.32 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 7.97 - 7.92 (m, 3H), 7.72 - 7.61 (m, 2H), 4.60 (s, 1H), 3.37 - 3.28 (m, 2H), 2.80-2.76 (m, 2H), 1.85-1.82 (m, 2H).

10

20

30

40

50

239		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 9.16 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 8.98 (s, 1H), 8.20 (d, <i>J</i> = 7.5, 1H), 8.09 (s, 1H), 7.88 (d, <i>J</i> = 7.5Hz, 1H), 7.78 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 4.59 (s, 1H), 3.31 - 3.22 (m, 2H), 2.85 - 2.73 (m, 2H), 1.85-1.82 (m, 2H).
240		Cl		H	
241		Cl		H	
242		Cl		H	
243		Cl		H	
244		Cl		H	
245		Cl		H	
246		Cl		H	
247		Cl		H	
248		Cl		H	

10

20

30

40

50

249		Cl		H	
250		Cl		H	
251		Cl		H	
252		Cl		H	
253		Cl		H	
254		Cl		H	
255		Cl		H	
256		Cl		H	
257		Cl		H	
258		Cl		H	
259		Cl		H	

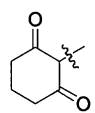
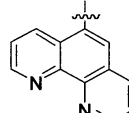
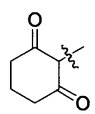

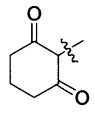

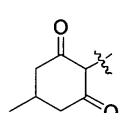

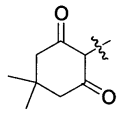

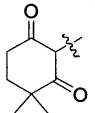

10

20

30

40

50

260		Cl		H	
261		Cl		F	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム- <i>d</i>) δ 7.89 (d, <i>J</i> = 11.0 Hz, 1H), 4.55 (s, 1H), 3.12-3.09 (m, 1H), 2.63-2.58 (m, 4H), 1.82 - 1.66 (m, 4H), 1.59-1.55 (m, 2H).
262		Cl		Cl	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム- <i>d</i>) δ 7.97 (s, 1H), 4.57 (s, 1H), 3.17-3.14 (m, 1H), 2.63-2.58 (m, 4H), 1.82 - 1.66 (m, 4H), 1.59-1.55 (m, 2H).
263		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム- <i>d</i>) δ 8.92 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 7.25 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 4.51 (s, 1H), 2.95 (p, <i>J</i> = 5.5 Hz, 1H), 2.51 - 2.43 (m, 4H), 2.31 - 2.17 (m, 1H), 1.79 - 1.62 (m, 4H), 1.09 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 3H).
264		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム- <i>d</i>) δ 8.92 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 7.28 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 4.50 (s, 1H), 2.95 (p, <i>J</i> = 5.5 Hz, 1H), 2.29 (s, 4H), 1.79 - 1.62 (m, 4H), 1.03 (s, 6H).
265		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム- <i>d</i>) δ 8.93 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 7.29 (d, <i>J</i> =

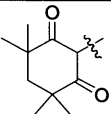

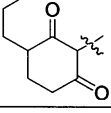

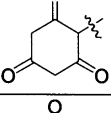

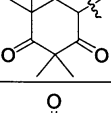

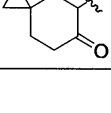

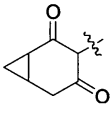

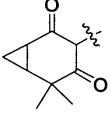

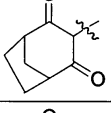

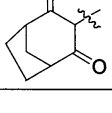

10

20

30

40

50

					7.0 Hz, 1H), 4.62 (s, 1H), 2.95 (p, $J = 5.5$ Hz, 1H), 2.65- 2.04 (m, 4H), 1.79 - 1.62 (m, 4H), 1.19 (s, 3H), 1.14 (s, 3H).
266		Cl		H	
267		Cl		H	
268		Cl		H	
269		Cl		H	
270		Cl		H	
271		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム- <i>d</i>) δ 8.94 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 7.30 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 4.67 (s, 1H), 2.95 (p, $J = 5.5$ Hz, 1H), 2.61- 2.38 (m, 3H), 1.88 -1.55 (m, 7H).
272		Cl		H	
273		F		H	
274		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム- <i>d</i>) δ 8.94 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 7.27 (d, $J =$

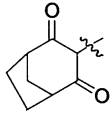

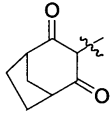

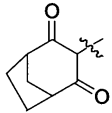


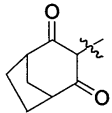


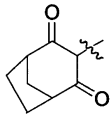


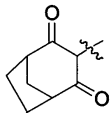

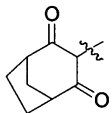

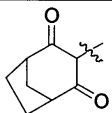


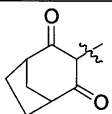


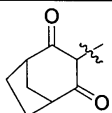


10

20

30

40

50

					7.0Hz, 1H), 4.42 (s, 1H), 3.06 - 2.91 (m, 3H), 2.20 - 2.11 (m, 2H), 2.00 - 1.88 (m, 2H), 1.88 - 1.62 (m, 6H).
275		Br		H	
276		I		H	
277				H	
278				H	
279				H	
280		CN		H	
281		NO ₂		H	
282				H	
283				H	
284				H	

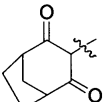


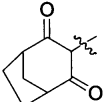


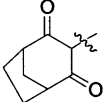

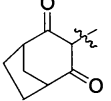


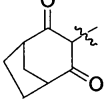


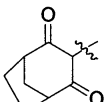
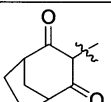
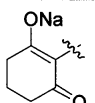
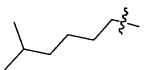
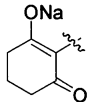
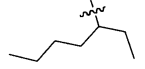
10

20

30

40

50

285				H	
286				H	
287		NH ₂		H	
288				H	
289				H	
290		H	CH ₃	H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 8.86 (d, J = 6.5 Hz, 1H), 7.82 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 7.68 (dd, J = 6.5, 1.5 Hz, 1H), 4.45 (s, 1H), 3.06 - 2.95 (m, 2H), 2.82 (s, 3H), 2.14-2.11 (m, 1H), 1.98 - 1.89 (m, 2H), 1.92 - 1.80 (m, 2H), 1.82 - 1.74 (m, 1H).
291		CN	CH ₃	H	
292		Cl		H	
293		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.25 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 6.88 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 2.61 - 2.55 (m, 1H), 2.30 (t, J = 6.5 Hz, 4H), 1.86 -

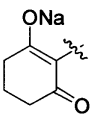
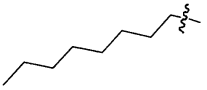
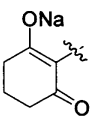
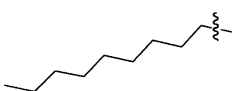
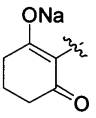
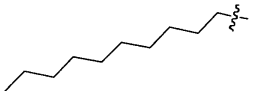
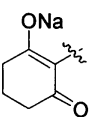

10

20

30

40

50

					1.78 (m, 2H), 1.66 - 1.14 (m, 8H), 0.90 (t, $J = 8.0$ Hz, 3H), 0.84 (t, $J = 8.0$ Hz, 3H).	
294		Cl		H	$^1\text{H NMR}$ (500 MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ 8.33 (d, $J = 7.5$ Hz, 1H), 6.98 (d, $J = 7.5$ Hz, 1H), 2.97 - 2.92 (m, 2H), 2.34 - 2.28 (m, 4H), 1.61-1.53 (m, 4H), 1.30 - 1.24 (m, 10H), 0.97 - 0.75 (m, 3H).	10
295		Cl		H	$^1\text{H NMR}$ (500 MHz, DMSO) δ 8.24 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 6.60 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 3.06 (t, $J = 7.5$ Hz, 2H), 2.23 - 2.15 (m, 4H), 1.76-1.72 (m, 3H), 1.37 - 1.20 (m, 13H), 0.86 (d, $J = 6.5$ Hz, 3H).	20
296		Cl		H	$^1\text{H NMR}$ (500 MHz, DMSO) δ 8.12 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H, 1H), 6.87 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 2.97 - 2.92 (m, 2H), 2.34 - 2.28 (m, 4H), 1.61-1.53 (m, 4H), 1.30 - 1.24 (m, 14H), 0.97 (t, $J = 7.0$ Hz, 3H).	30
297		Cl		H	$^1\text{H NMR}$ (500 MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ 8.26 (d, $J = 7.5$ Hz, 1H), 6.95 (d, $J = 7.5$ Hz, 1H), 5.33 (d, $J = 2.0$, 1H), 4.96 (d, $J = 2.0$, 1H), 2.42 - 2.35 (m, 4H), 2.13 (s, 3H), 1.79 - 1.71 (m, 2H)	40

298		Cl		H	
299		Cl		H	
300		Cl		H	
301		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.15 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 6.83 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 3.63 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 3.24-3.20 (m, 2H), 2.38-2.25 (m, 6H), 1.86-1.82 (m, 2H).
302		Cl		H	
303		Cl		H	
304		Cl		H	
305		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, DMSO) δ 8.28 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 6.66 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 5.47 (t, $J = 6.5$ Hz, 1H), 3.96 - 3.73 (m, 4H), 2.74 - 2.62 (m, 1H), 2.40 - 2.30 (m, 1H), 2.14 - 1.94 (m, 4H), 1.81 - 1.69 (m, 2H).

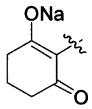

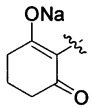

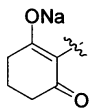

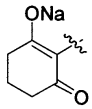

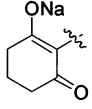

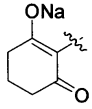

10

20

30

40

50

306		Cl		H	^1H NMR (500 MHz, DMSO) δ 8.28 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 6.66 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 5.47-5.43 (m, 1H), 3.96 - 3.73 (m, 2H), 2.56 - 2.54 (m, 2H), 2.41 - 2.38 (m, 2H), 2.04 - 1.94 (m, 4H), 1.80 - 1.75 (m, 2H).	10
307		Cl		H	^1H NMR (500 MHz, DMSO) δ 8.25 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 7.46-7.44 (m, 4H), 7.33-7.29 (m, 4H), 7.23 - 7.20 (m, 2H), 6.68 (d, $J =$ 7.0 Hz, 1H), 2.90 (s, 2H), 2.37 - 2.35 (m, 4H), 1.81 - 1.79 (m, 2H).	20
308		Cl		H	^1H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.02 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 7.35 - 7.30 (m, 2H), 7.29 - 7.23 (m, 3H), 6.75 (d, $J =$ 7.0 Hz, 1H), 4.50 (s, 2H), 2.34 (t, $J = 6.5$ Hz, 4H), 1.88 - 1.80 (m, 2H).	30
309		Cl		H		40
310		Cl		H	^1H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.07 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 7.27-7.24 (m, 1H), 6.93-6.92 (m, 2H), 6.77 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 2.32-2.44 (m, 6H), 1.82-1.76 (m, 2H).	50
311		Cl		H	^1H NMR (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8.63 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 8.38 (s, 1H), 7.85 (d, $J =$ 2.0 Hz, 1H), 7.73 (d, $J =$	

					2.0 Hz, 1H), 6.99 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 2.56-2.48 (m, 6H), 1.98 - 1.88 (m, 2H).
312		Cl		H	
313		Cl		H	
314		Cl		H	
315		Cl		H	
316		F		H	
317		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム- <i>d</i>) δ 8.99 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 7.89 (s, 1H), 7.33 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 5.23 (s, 1H), 3.75 (s, 3H), 2.95 (p, $J = 5.5$ Hz, 1H), 1.81 - 1.67 (m, 4H).
318		Br		H	
319		I		H	
320				H	


































10

20

30

40

50

321				H	
322				H	
323		CN		H	
324		NO ₂		H	
325				H	
326				H	
327				H	
328				H	
329				H	
330		NH ₂		H	
331				H	
332				H	

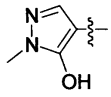
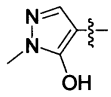
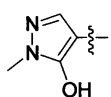
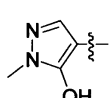
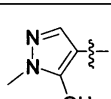
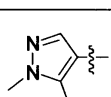

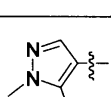

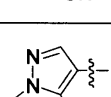

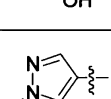
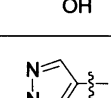
10

20

30

40

50

333		H	CH ₃	H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 8.92 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 8.02 (d, <i>J</i> = 1.5 Hz, 1H), 7.81 (s, 1H), 7.75 (dd, <i>J</i> = 6.5, 1.5 Hz, 1H), 5.25 (s, 1H), 3.76 (s, 3H), 2.85 (s, 3H).
334		F	CH ₃	H	
335		Cl	CH ₃	H	
336		Br	CH ₃	H	
337		I	CH ₃	H	
338			CH ₃	H	
339			CH ₃	H	
340			CH ₃	H	
341		CN	CH ₃	H	
342		NO ₂	CH ₃	H	

10

20

30

40

50

343			CH ₃	H	
344			CH ₃	H	
345			CH ₃	H	
346			CH ₃	H	
347			CH ₃	H	
348		NH ₂	CH ₃	H	
349			CH ₃	H	
350			CH ₃	H	
351		Cl	H	H	
352		Cl	F	H	
353		Cl	Cl	H	
354		Cl	Br	H	

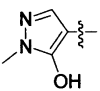
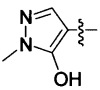

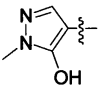
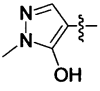

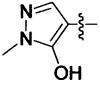
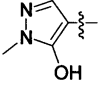

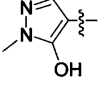

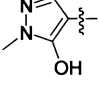

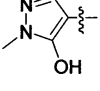

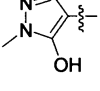

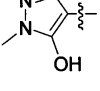

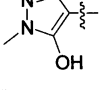

10

20

30

40

50

355		Cl	I	H	
356		Cl		H	
357		Cl	CF ₃	H	
358		Cl		H	
359		Cl	CH ₂ CH ₃	H	
360		Cl		H	
361		Cl		H	
362		Cl		H	
363		Cl		H	
364		Cl		H	
365		Cl		H	
366		Cl		H	

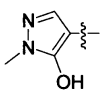

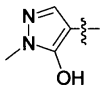

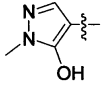

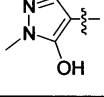

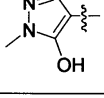

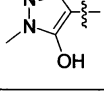

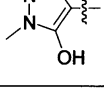

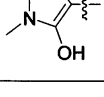

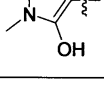

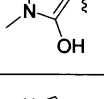

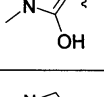

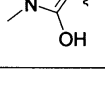

10

20

30

40

50

367		Cl		H	
368		Cl		H	
369		Cl		H	
370		Cl		H	
371		Cl		H	
372		Cl		H	
373		Cl		H	
374		Cl		H	
375		Cl		H	
376		Cl		H	
377		Cl		H	
378		Cl		H	






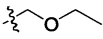


















10

20

30

40

50

379		Cl		H	
380		Cl		H	
381		Cl		H	
382		Cl		H	
383		Cl		H	
384		Cl		H	
385		Cl		H	
386		Cl		H	
387		Cl		H	
388		Cl		H	
389		Cl		H	
390		Cl		H	

























10

20

30

40

50

391		Cl		H	
392		Cl		H	
393		Cl		H	
394		Cl		H	
395		Cl		H	
396		Cl		H	
397		Cl		H	
398		Cl		H	
399		Cl		H	
400		Cl		H	
401		Cl		H	
402		Cl		H	

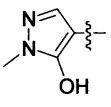

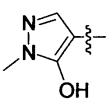

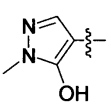

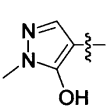
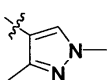
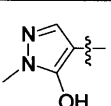

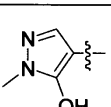

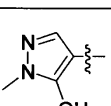

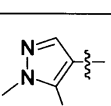

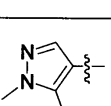

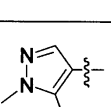

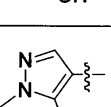

10

20

30

40

50

403		Cl		H	
404		Cl		H	
405		Cl		H	
406		Cl		H	
407		Cl		H	
408		Cl		H	
409		Cl		H	
410		Cl		H	
411		Cl		H	
412		Cl		H	
413		Cl		H	

10

20

30

40

50

414		Cl		H	
415		Cl		H	
416		Cl		H	
417		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム- <i>d</i>) δ 8.99 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 7.33 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 5.25 (s, 1H), 3.72 (s, 3H), 2.95 (p, <i>J</i> = 5.5 Hz, 1H), 2.66 (s, 3H), 1.79 - 1.62 (m, 4H).
418		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム- <i>d</i>) δ 8.99 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 7.33 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 5.25 (s, 1H), 3.72 (s, 3H), 4.12 (s, 2H), 3.10 (hept, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 2.66 (s, 3H), 1.30 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 6H).
419		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム- <i>d</i>) δ 8.99 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 7.33 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 5.25 (s, 1H), 3.74 (s, 3H), 2.95 (p, <i>J</i> = 5.5 Hz, 1H), 2.61 (p, <i>J</i> = 5.5 Hz, 1H), 1.79 - 1.62 (m, 4H), 1.03 - 0.87 (m, 4H).
420		Cl		H	

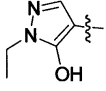

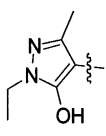

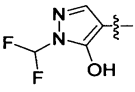

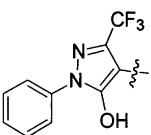





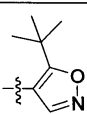



10

20

30

40

50

421		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 8.99 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 7.97 (s, 1H), 7.31 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 5.24 (s, 1H), 4.13 (q, <i>J</i> = 7.0 Hz, 2H), 2.95 (p, <i>J</i> = 5.5 Hz, 1H), 1.79 - 1.62 (m, 4H), 1.34 (t, <i>J</i> = 7.0 Hz, 3H).	10
422		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム-d) δ 8.99 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 7.33 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 5.25 (s, 1H), 4.11 (q, <i>J</i> = 7.0 Hz, 2H), 2.95 (p, <i>J</i> = 5.5 Hz, 1H), 2.64 (s, 3H), 1.79 - 1.62 (m, 4H), 1.36 (t, <i>J</i> = 7.0 Hz, 3H).	20
423		Cl		H		
424		Cl		H		
425		Cl		H		30
426		Cl		H		
427		Cl		H		
428		Cl		H		40

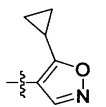

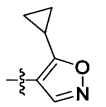

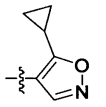

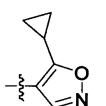

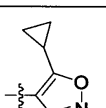


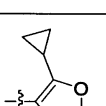


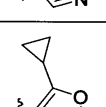


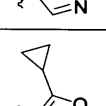

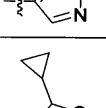

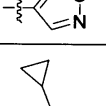


10

20

30

40

50

429		F		H	
430		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム- <i>d</i>) δ 8.99 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 8.64 (s, 1H), 7.29 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 2.95 (p, $J = 5.5$ Hz, 1H), 2.74 (p, $J = 5.5$ Hz, 1H), 1.79 - 1.70 (m, 4H), 1.72 - 1.58 (m, 4H).
431		Br		H	
432		I		H	
433				H	
434				H	
435				H	
436		CN		H	
437		NO ₂		H	
438				H	

10

20

30

40

50

439				H	
440				H	
441				H	
442				H	
443		NH ₂		H	
444				H	
445				H	
446		F	CH ₃	H	¹ H NMR (500 MHz, クロロフォルム- <i>d</i>) δ 8.90 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 8.57 (s, 1H), 7.79 - 7.71 (m, 1H), 2.84 (s, 3H), 2.74 (p, <i>J</i> = 5.5 Hz, 1H), 1.70 - 1.61 (m, 4H).
447		F	CH ₃	H	
448		Cl	CH ₃	H	
449		Br	CH ₃	H	

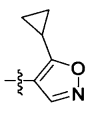
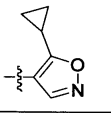

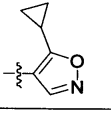

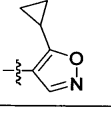

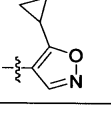
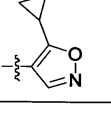
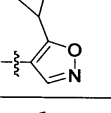

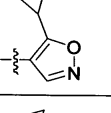

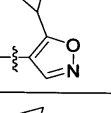

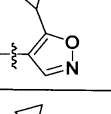

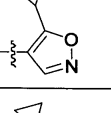

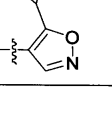
10

20

30

40

50

450		I	CH ₃	H	
451			CH ₃	H	
452			CH ₃	H	
453			CH ₃	H	
454		CN	CH ₃	H	
455		NO ₂	CH ₃	H	
456			CH ₃	H	
457			CH ₃	H	
458			CH ₃	H	
459			CH ₃	H	
460			CH ₃	H	
461		NH ₂	CH ₃	H	

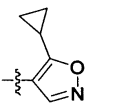

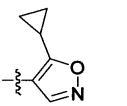

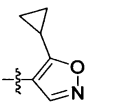
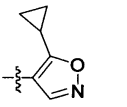
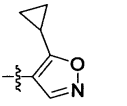
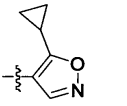
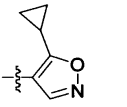
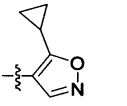

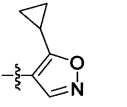
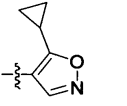

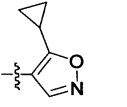
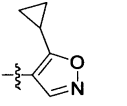

10

20

30

40

50

462			CH ₃	H	
463			CH ₃	H	
464		Cl	H	H	
465		Cl	F	H	
466		Cl	Cl	H	
467		Cl	Br	H	
468		Cl	I	H	
469		Cl		H	
470		Cl	CF ₃	H	
471		Cl		H	
472		Cl	CH ₂ CH ₃	H	
473		Cl		H	

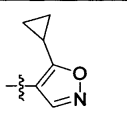

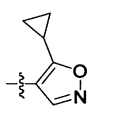

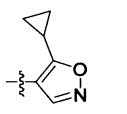

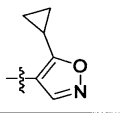

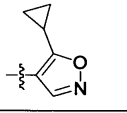

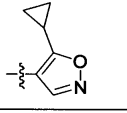

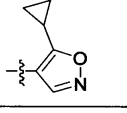

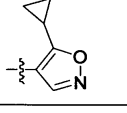

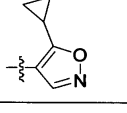

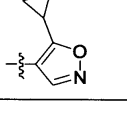

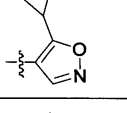

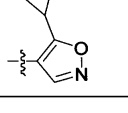

10

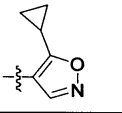

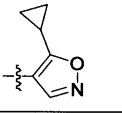

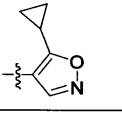

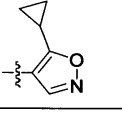

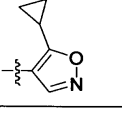

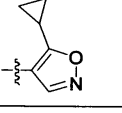

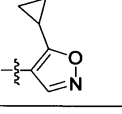

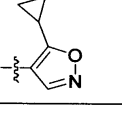

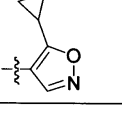
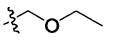
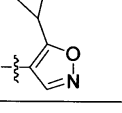

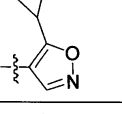

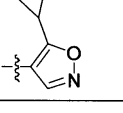

20

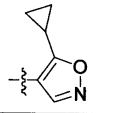
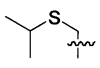
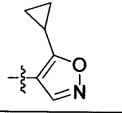
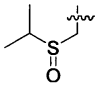
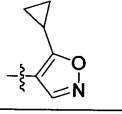
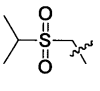
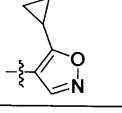

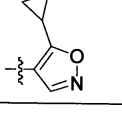

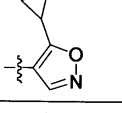

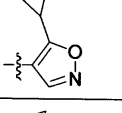

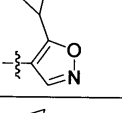

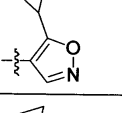

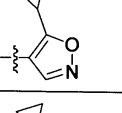

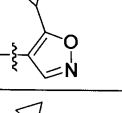

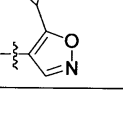

30

40

50

474		Cl		H	
475		Cl		H	
476		Cl		H	10
477		Cl		H	
478		Cl		H	
479		Cl		H	20
480		Cl		H	
481		Cl		H	
482		Cl		H	30
483		Cl		H	
484		Cl		H	
485		Cl		H	40

486		Cl		H	
487		Cl		H	
488		Cl		H	10
489		Cl		H	
490		Cl		H	
491		Cl		H	20
492		Cl		H	
493		Cl		H	
494		Cl		H	30
495		Cl		H	
496		Cl		H	
497		Cl		H	40

498		Cl		H	
499		Cl		H	
500		Cl		H	
501		Cl		H	
502		Cl		H	
503		Cl		H	
504		Cl		H	
505		Cl		H	
506		Cl		H	
507		Cl		H	
508		Cl		H	
509		Cl		H	

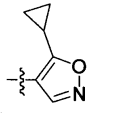
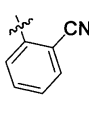
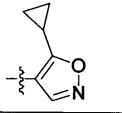
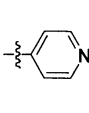
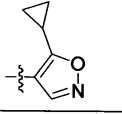
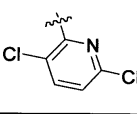
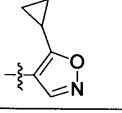
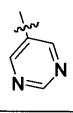
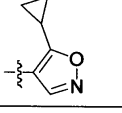
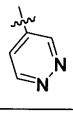
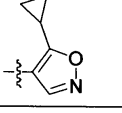
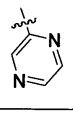
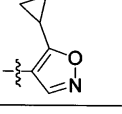
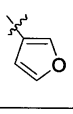
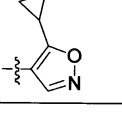
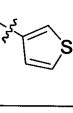
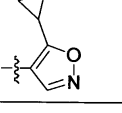
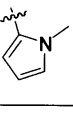
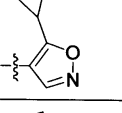
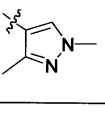
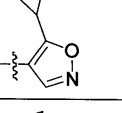
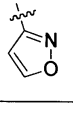
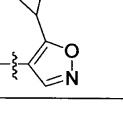
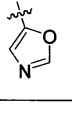
10

20

30

40

50

510		Cl		H	
511		Cl		H	
512		Cl		H	
513		Cl		H	
514		Cl		H	
515		Cl		H	
516		Cl		H	
517		Cl		H	
518		Cl		H	
519		Cl		H	
520		Cl		H	
521		Cl		H	

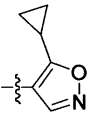

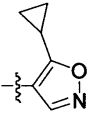

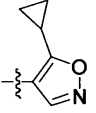

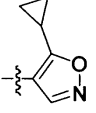

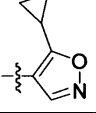

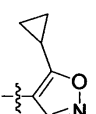
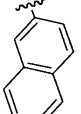
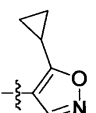
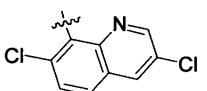
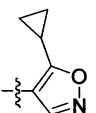
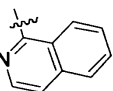
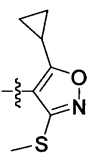

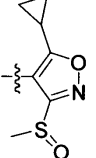

10

20

30

40

50

522		Cl		H	
523		Cl		H	
524		Cl		H	
525		Cl		H	
526		Cl		H	
527		Cl		H	
528		Cl		H	
529		Cl		H	
530		Cl		H	
531		Cl		H	

10

20

30

40

50

532		Cl		H	
533		Cl		H	
534		Cl		H	
535		Cl		F	
536		F		H	
537		Cl		H	
538		Br		H	
539		I		H	
540				H	
541				H	
542				H	

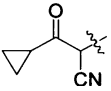

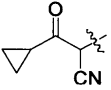

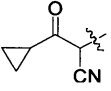


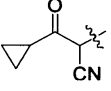


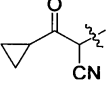


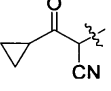


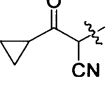


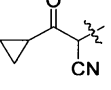

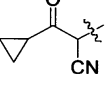


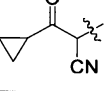


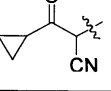
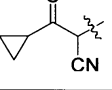
10

20

30

40

50

543		CN		H	
544		NO ₂		H	
545				H	
546				H	
547				H	
548				H	
549				H	
550		NH ₂		H	
551				H	
552				H	
553		Cl	H	H	
554		Cl	F	H	

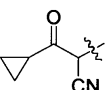
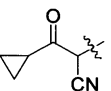
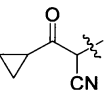
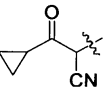

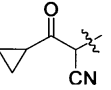
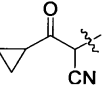

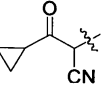
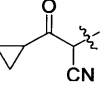
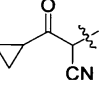

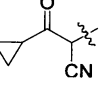

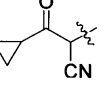

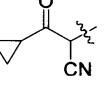

10

20

30

40

50

555		Cl	Cl	H	
556		Cl	Br	H	
557		Cl	I	H	
558		Cl		H	
559		Cl	CF ₃	H	
560		Cl		H	
561		Cl	CH ₃	H	
562		Cl	CH ₂ CH ₃	H	
563		Cl		H	
564		Cl		H	
565		Cl		H	
566		Cl		H	

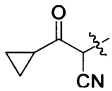

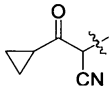

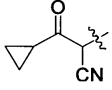

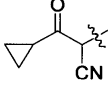

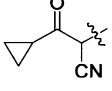

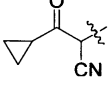

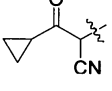

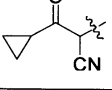

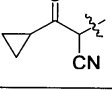

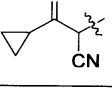

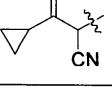

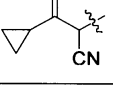

10

20

30

40

50

567		Cl		H	
568		Cl		H	
569		Cl		H	
570		Cl		H	
571		Cl		H	
572		Cl		H	
573		Cl		H	
574		Cl		H	
575		Cl		H	
576		Cl		H	
577		Cl		H	
578		Cl		H	

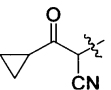

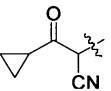

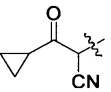

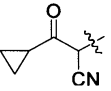

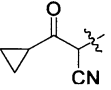

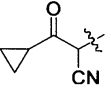

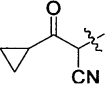

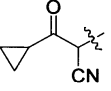

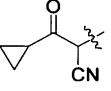

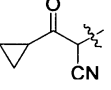

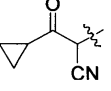

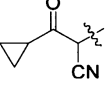

10

20

30

40

50

579		Cl		H	
580		Cl		H	
581		Cl		H	
582		Cl		H	
583		Cl		H	
584		Cl		H	
585		Cl		H	
586		Cl		H	
587		Cl		H	
588		Cl		H	
589		Cl		H	
590		Cl		H	

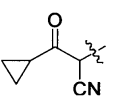

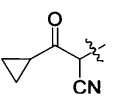

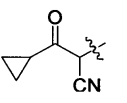

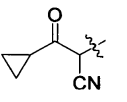

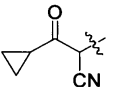

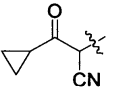

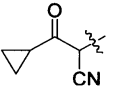

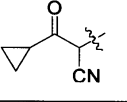

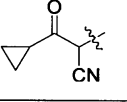

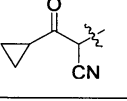

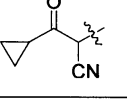
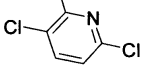
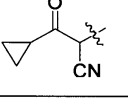

10

20

30

40

50

591		Cl		H	
592		Cl		H	
593		Cl		H	10
594		Cl		H	
595		Cl		H	
596		Cl		H	20
597		Cl		H	
598		Cl		H	
599		Cl		H	30
600		Cl		H	
601		Cl		H	
602		Cl		H	40

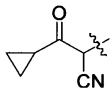

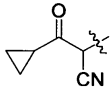

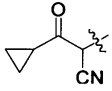

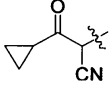

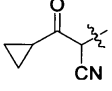

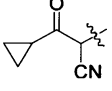

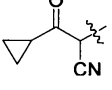

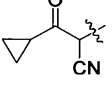

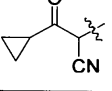

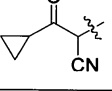

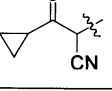

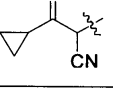

10

20

30

40

50

603		Cl		H	
604		Cl		H	
605		Cl		H	
606		Cl		H	
607		Cl		H	
608		Cl		H	
609		Cl		H	
610		Cl		H	
611		Cl		H	
612		Cl		H	
613		Cl		H	
614		Cl		H	

10

20

30

40

50

615		Cl		H	
616		Cl		H	
617		Cl		H	
618		Cl		H	
619		Cl		H	
620				H	
621			CH ₂ CH ₃	H	¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.37 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 7.30 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 4.71 (s, 1H), 3.35 (s, 3H), 3.20 - 3.08 (m, 4H), 2.56 - 2.51 (m, 2H), 2.14 - 2.08 (m, 2H), 1.40 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H).
622			CH ₂ CH ₃	H	¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.21 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 7.04 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 2.86 (q, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.56 (s, 3H), 2.36 - 2.32 (m, 4H), 1.86 - 1.79 (m, 2H), 1.46 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H)

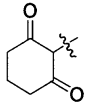


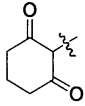

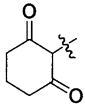


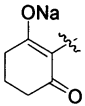
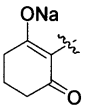
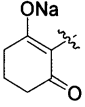

10

20

30

40

50

623				H	¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.23 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 7.03 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 2.86 - 2.76 (m, 5H), 2.36 - 2.33 (m, 4H), 1.84 - 1.78 (m, 2H), 1.42 - 1.33 (m, 2H), 0.95 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H).
624			CH ₂ CH ₃	H	¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.17 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 7.02 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 2.86 - 2.76 (m, 5H), 2.36 - 2.32 (m, 4H), 1.83 - 1.78 (m, 2H), 1.46 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H).
625				H	¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.19 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 6.98 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 2.86 - 2.76 (m, 5H), 2.36 - 2.32 (m, 4H), 1.83 - 1.78 (m, 2H), 1.42 - 1.33 (m, 2H), 0.95 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H).
626		Cl	Cl	H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.16 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 6.95 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 2.37-2.35 (m, 4H), 1.88 - 1.85 (m, 2H).
627		Cl	Br	H	¹ H NMR (500 MHz, DMSO) δ 8.23 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 6.67 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 2.36 - 2.34 (m, 4H), 1.80 - 1.78 (m, 2H).
628		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.29 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 6.84 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H),

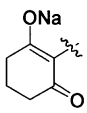

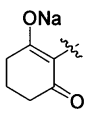

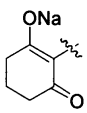

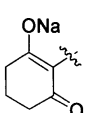

10

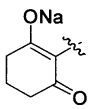
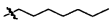
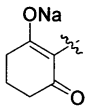

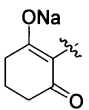

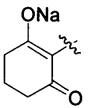

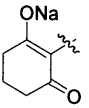

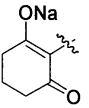

20

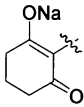

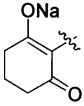

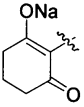

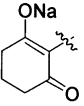

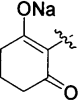

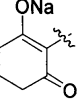

30

40

50

					3.16 - 3.12 (m, 1H), 2.22 (t, $J = 6.5$ Hz, 4H), 1.88 - 1.83 (m, 4H), 0.98 (d, $J = 7.5$ Hz, 3H), 0.74 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H).	
629		Cl		H	$^1\text{H NMR}$ (500 MHz, 重水) δ 8.35 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 6.96 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 2.61 - 2.55 (m, 1H), 2.31 (t, $J = 6.5$ Hz, 4H), 2.00 - 1.92 (m, 2H), 1.85 - 1.79 (m, 2H), 1.50 - 1.40 (m, 2H), 0.84 (t, $J = 8.0$ Hz, 6H).	10
630		Cl		H	$^1\text{H NMR}$ (500 MHz, 重水) δ 8.25 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 6.82 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 3.01 (s, 2H), 2.36-2.29 (m, 4H), 1.88-1.84 (m, 2H), 0.94 (s, 9H).	20
631		Cl		H	$^1\text{H NMR}$ (500 MHz, 重水) δ 8.13 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 6.82 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 3.06 (t, $J = 7.5$ Hz, 2H), 2.35 (t, $J = 6.5$ Hz, 4H), 1.87 - 1.84 (m, 2H), 1.79 - 1.71 (m, 2H), 1.24 - 1.18 (m, 6H), 0.75 (t, $J = 7.0$ Hz, 3H).	30
632		Cl		H	$^1\text{H NMR}$ (500 MHz, 重水) δ 8.37 (d, $J = 6.5$ Hz, 1H), 6.98 (d, $J = 6.5$ Hz, 1H), 2.64 - 2.58 (m, 4H), 1.90 (t, $J = 7.0$ Hz, 2H), 1.64 - 1.49 (m, 5H), 0.89 (d, $J = 6.5$ Hz, 6H).	40

633		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.18 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 6.85 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 3.06 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.35 (t, <i>J</i> = 6.5 Hz, 4H), 1.87 - 1.84 (m, 2H), 1.79 - 1.71 (m, 2H), 1.24 - 1.18 (m, 8H), 0.75 (t, <i>J</i> = 7.0 Hz, 3H).	10
634		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.19 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 6.93-6.88 (m, 1H), 6.83 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 6.63 (d, <i>J</i> = 16.0 Hz, 1H), 2.35 (t, <i>J</i> = 6.5 Hz, 4H), 1.99 - 1.92 (m, 3H), 1.86 (t, <i>J</i> = 6.5 Hz, 2H).	20
635		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.25 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 6.91 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 2.39-2.35 (m, 4H), 2.18 (s, 3H), 1.92-1.86 (m, 2H).	
636		Cl		H		
637		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.17 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 6.84 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 3.60 (t, <i>J</i> = 7.0 Hz, 2H), 3.13 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.37 (t, <i>J</i> = 6.5 Hz, 4H), 1.99 - 1.90 (m, 2H), 1.89 - 1.81 (m, 4H).	30
638		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, DMSO) δ 8.54 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 6.92 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H),	40

					3.35 (s, 2H), 2.38 - 2.32 (m, 4H) 1.87 - 1.84 (m, 2H).
639		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.42 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 6.94 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 2.57 - 2.44 (m, 2H), 2.35 (t, <i>J</i> = 6.5 Hz, 4H), 1.92 - 1.81 (m, 2H), 1.06 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H).
640		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.23 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 6.92 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 2.39 (t, <i>J</i> = 6.5 Hz, 4H), 1.88 - 1.84 (m, 2H), 1.19 (s, 6H)
641		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.19 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 7.36 (d, <i>J</i> = 13.5 Hz, 1H), 7.14 (d, <i>J</i> = 13.5 Hz, 1H), 6.86 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 2.37-2.35 (m, 4H), 1.86-1.85 (m, 2H).
642		Cl		H	
643		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.12 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 6.76 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 2.43 - 2.01 (m, 6H), 1.91 - 1.58 (m, 9H).
644		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.12 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 6.93 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 5.96 - 5.92 (m, 1H), 2.37 - 2.18 (m, 8H), 1.87 - 1.74 (m, 4H).

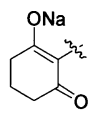

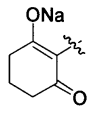

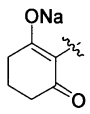

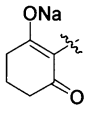

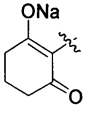
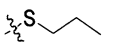
10

20

30

40

50

645		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.37 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 6.87 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 6.52-6.50 (m, 1H), 2.52-2.50 (m, 2H), 2.43 (t, <i>J</i> = 6.5 Hz, 4H), 2.34-2.32 (m, 2H), 1.96-1.91 (m, 2H), 1.88 - 1.79 (m, 2H), 1.79 - 1.70 (m, 2H).
646		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, DMSO) δ 8.24 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 6.65 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 4.79 (s, 2H), 2.37 - 2.35 (m, 4H), 1.81 - 1.78 (m, 2H).
647		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.21 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 6.89 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 4.70 - 4.66 (m, 1H), 3.33 (s, 3H), 2.30 (t, <i>J</i> = 6.5 Hz, 4H), 1.86 - 1.81 (m, 2H), 1.51 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 3H).
648		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.27 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 6.89 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 2.99 - 2.95 (m, 2H), 2.33-2.31 (m, 4H), 1.85 - 1.81 (m, 2H), 1.14 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H).
649		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, DMSO) δ 8.25 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 6.66 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 3.09 (t, <i>J</i> = 7.0 Hz, 2H), 2.35 - 2.32 (m, 4H), 1.81 - 1.77 (m, 2H), 1.75-1.68 (m, 2H), 1.03 (t,

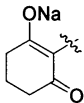

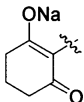

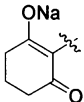

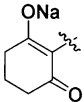
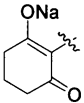

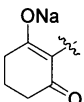
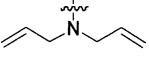
10

20

30

40

50

					$J = 8.0 \text{ Hz, 3H}$.
650		Cl		H	$^1\text{H NMR (500 MHz, DMSO)} \delta$ 8.26 (d, $J = 7.0 \text{ Hz, 1H}$), 6.70 (d, $J = 6.9 \text{ Hz, 1H}$), 5.92 - 5.80 (m, 1H), 4.99 - 4.95 (m, 1H), 4.95 - 4.90 (m, 1H), 3.90 - 3.87 (m, 2H), 2.73 - 2.70 (m, 2H), 2.19 - 2.06 (m, 2H), 1.77 - 1.71 (m, 2H).
651		Cl		H	$^1\text{H NMR (500 MHz, 重水)} \delta$ 8.37 (d, $J = 7.0 \text{ Hz, 1H}$), 6.99 (d, $J = 7.0 \text{ Hz, 1H}$), 4.91 - 4.86 (m, 1H), 3.18 (s, 2H), 2.39 (t, $J = 6.5$ Hz, 4H), 1.93 - 1.85 (m, 2H).
652		Cl		H	$^1\text{H NMR (500 MHz, 重水)} \delta$ 8.62 (d, $J = 7.0 \text{ Hz, 1H}$), 7.06 (d, $J = 7.0 \text{ Hz, 1H}$), 3.31 (s, 3H), 2.39-2.37 (m, 4H), 1.93-1.88 (m, 2H).
653		Cl	NH ₂	H	$^1\text{H NMR (500 MHz, DMSO)} \delta$ 8.35 (d, $J = 7.0 \text{ Hz, 1H}$), 6.69 (d, $J = 7.0 \text{ Hz, 1H}$), 5.91 (s, 2H), 2.55-2.49 (m, 4H), 2.14-2.10 (m, 2H).
654		Cl		H	$^1\text{H NMR (500 MHz, DMSO)} \delta$ 8.75 (d, $J = 7.0 \text{ Hz, 1H}$), 6.91 (d, $J = 7.0 \text{ Hz, 1H}$), 2.29 - 2.17 (m, 4H), 1.79- 1.65 (m, 8H).
655		Cl		H	$^1\text{H NMR (500 MHz, DMSO-}d_6) \delta$ 8.75 (d, $J = 7.0 \text{ Hz, 1H}$), 6.91 (d, $J = 7.0 \text{ Hz, 1H}$),

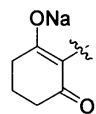
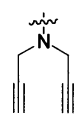
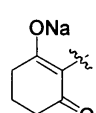
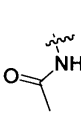
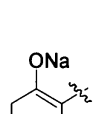
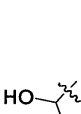

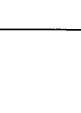


10

20

30

40

50

					5.86 -5.85(m, 2H), 5.18 - 5.02 (m, 4H), 3.73-3.72 (m, 4H), 2.64-2.58 (m, 4H), 1.84-1.79 (m, 2H).
656		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.09 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 6.84 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 4.18 (s, 4H), 4.14 (s, 2H), 2.38 (t, <i>J</i> = 6.5 Hz, 4H), 1.91 - 1.85 (m, 2H).
657		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, DMSO) δ 8.45 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 6.61 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 5.91 (s, 1H), 2.15-2.06 (m, 7H), 1.98-1.93 (m, 2H).
658		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.32 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 6.81 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 5.35 (q, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 2.31-2.29 (m, 4H), 1.83-1.78 (m, 2H), 1.67 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 3H).
659		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.29 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 6.89 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 4.22 (s, 2H), 2.37 (t, <i>J</i> = 6.5 Hz, 4H), 1.96 (s, 3H), 1.88-1.83 (m, 2H).
660		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, DMSO) δ 8.25 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 6.61 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 3.91 (s, 2H), 2.22 - 2.07 (m, 10H), 1.78 - 1.66 (m, 2H).

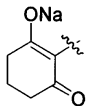
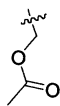
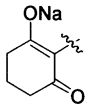
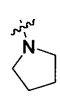
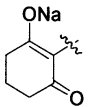
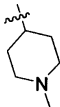
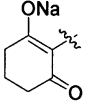
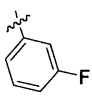
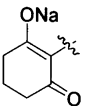
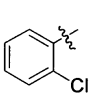
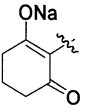
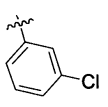
10

20

30

40

50

661		Cl		H	
662		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.09 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 6.63 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 3.45 - 3.40 (m, 4H), 2.36 - 2.32 (m, 4H), 2.02 - 1.94 (m, 4H), 1.86 - 1.82 (m, 2H).
663		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, DMSO) δ 8.26 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 6.67 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 2.68-2.63 (m, 1H), 2.58-2.53 (m, 4H), 2.36 - 2.33 (m, 4H), 2.25 (s, 3H), 1.82 - 1.78 (m, 2H), 1.57-1.50 (m, 4H).
664		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, DMSO) δ 7.79 - 7.57 (m, 3H), 7.46-7.43 (m, 1H), 7.41 - 6.83 (m, 1H), 6.69 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 2.26 - 2.15 (m, 4H), 1.86 - 1.73 (m, 2H).
665		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.30 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 7.75 - 7.64 (m, 2H), 7.44 - 7.35 (m, 2H), 6.95 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 2.35 (t, <i>J</i> = 6.5 Hz, 4H), 1.89-1.83 (m, 2H),
666		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.27 - 8.21 (m, 1H), 7.72 (s, 1H), 7.61 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 7.52 - 7.48 (m, 2H), 6.86 - 6.82 (m, 1H),

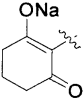
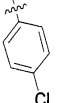
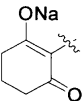

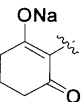

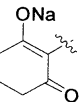

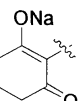

10

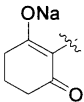

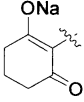

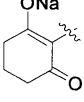

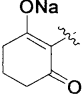

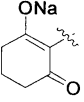

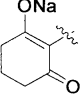

20

30

40

50

					2.38 - 2.32 (m, 4H), 1.87 - 1.79 (m, 2H).	
667		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.28 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 7.72 (d, <i>J</i> = 8.5 Hz, 2H), 7.60 (d, <i>J</i> = 8.5 Hz, 2H), 6.86 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 2.35 (t, <i>J</i> = 6.5 Hz, 4H), 1.92 - 1.81 (m, 2H).	10
668		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.19 - 8.15 (m, 2H), 7.56 (d, <i>J</i> = 5.0 Hz, 1H), 7.16 - 6.98 (m, 2H), 2.37 - 2.32 (m, 4H), 1.83 - 1.79 (m, 2H).	
669		Cl		H	MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.38(d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 8.18 (s, 1H), 7.65 (d, <i>J</i> = 2.0Hz, 1H), 7.23 (d, <i>J</i> = 2.0Hz, 1H), 6.85 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 2.56-2.48 (m, 4H), 1.94 - 1.88 (m, 2H).	20
670		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.34 (d, <i>J</i> = 5.0 Hz, 1H), 8.14 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 7.78 (d, <i>J</i> = 5.0 Hz, 1H), 6.89 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 2.38 - 2.33 (m, 4H), 1.85 - 1.79 (m, 2H).	30
671		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.12 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 7.94 (s, 1H), 7.48 (s, 1H), 6.94 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 2.36 - 2.31 (m, 4H), 1.85 - 1.79 (m, 2H).	40

672		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.26 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 8.19 (s, 1H), 8.04 (s, 1H), 6.95 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 2.22 (t, <i>J</i> = 6.5 Hz, 4H), 1.83 - 1.78 (m, 2H).
673		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.93 (s, 1H), 8.14 (d, <i>J</i> =7.0 Hz, 1H), 7.94 (s, 1H), 6.99 (d, <i>J</i> =7.0 Hz, 1H), 2.38 - 2.34 (m, 4H), 1.88 - 1.81 (m, 2H).
674		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.73 (s, 1H), 8.14 (d, <i>J</i> =7.0 Hz, 1H), 7.82 (s, 1H), 6.99 (d, <i>J</i> =7.0 Hz, 1H), 2.37 - 2.31 (m, 4H), 1.84 - 1.77 (m, 2H).
675		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) 8.16 (d, <i>J</i> =7.0 Hz, 1H), 7.88 (s, 1H), 7.36 (s, 1H), 6.92 (d, <i>J</i> =7.0 Hz, 1H), 3.92 (s, 3H), 2.34 - 2.30 (m, 4H), 1.82 - 1.77 (m, 2H).
676		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) 8.16 (d, <i>J</i> =7.0 Hz, 1H), 7.81 (s, 1H), 7.26 (s, 1H), 6.99 (d, <i>J</i> =7.0 Hz, 1H), 3.96 (s, 3H), 2.36 - 2.32 (m, 4H), 1.83 - 1.78 (m, 2H).
677		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.15 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 7.18 (d, <i>J</i> = 4.5 Hz, 1H), 7.15 (d, <i>J</i> = 4.5 Hz, 1H),

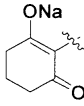

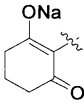

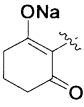

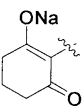
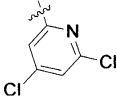
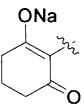
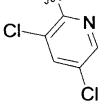
10

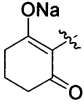
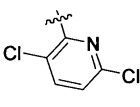
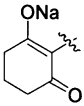
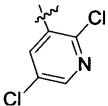
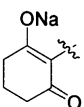
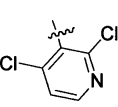
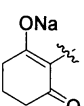
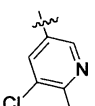
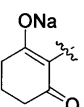
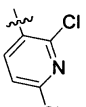
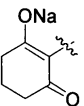
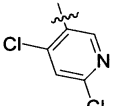
20

30

40

50

					6.90 (d, $J = 7.5$ Hz, 1H), 3.88 (s, 3H), 2.33 - 2.29 (m, 4H), 1.84 - 1.77 (m, 2H).	
678		Cl		H	^1H NMR (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8.39 (d, $J = 7.5$ Hz, 2H), 8.21 (d, $J = 7$ Hz, 1H), 7.68 (d, $J = 7.5$ Hz, 2H), 6.89 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 2.33 - 2.28 (m, 4H), 1.86 - 1.80 (m, 2H).	10
679		Cl		H	^1H NMR (500 MHz, 重水) δ 9.11 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 8.60 - 8.57 (m, 1H), 7.98-7.90 (m, 2H), 7.46-7.43 (m, 1H), 6.89 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 2.34 (t, J $= 6.5$ Hz, 4H), 1.92 - 1.77 (m, 2H).	20
680		Cl		H	^1H NMR (500 MHz, 重水) δ 9.20 - 8.70 (m, 2H), 8.40 - 8.30 (m, 3H), 6.92 (d, J $= 7.0$ Hz, 1H), 2.45 - 2.40 (m, 4H), 1.96 -- 1.91 (m, 2H).	
681		Cl		H	^1H NMR (500 MHz, DMSO) δ 9.20 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 8.39 (s, 1H), 7.95 (s, 1H), 6.93 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 2.16 (t, $J = 6.0$ Hz, 4H), 1.78 - 1.68 (m, 2H).	30
682		Cl		H	^1H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.95 (s, 1H), 8.36 (d, J $= 7.5$ Hz, 1H), 8.15 (s, 1H), 6.88 (d, $J = 7.5$ Hz, 1H), 2.46 - 2.38 (m, 4H), 1.89 -	40

					1.85 (m, 2H)
683		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.49 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 8.08 (d, <i>J</i> = 5.0 Hz, 1H), 7.60 (d, <i>J</i> = 5.0 Hz, 1H), 6.91 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 2.34-2.29 (m, 4H), 1.86-1.80 (m, 2H).
684		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.81 (s, 1H), 8.38 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 7.90 (s, 1H), 6.89 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 2.35-2.29 (m, 4H), 1.88-1.81 (m, 2H).
685		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.51 (d, <i>J</i> = 4.5 Hz, 1H), 8.32 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 7.80 (d, <i>J</i> = 4.5 Hz, 1H), 6.85 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 2.34 (t, <i>J</i> = 6.5 Hz, 4H), 1.92 - 1.77 (m, 2H).
686		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, DMSO) δ 8.92 (s, 1H), 8.70 (s, 1H), 8.52 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 6.76 - 6.69 (m, 1H), 2.19 (m, 4H), 1.83 - 1.73 (m, 2H).
687		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, DMSO) δ 8.34-8.30 (m, 2H), 7.91 (d, <i>J</i> = 8.0 Hz, 1H), 7.41 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 2.55-2.54 (m, 4H), 2.14-2.13 (m, 2H).
688		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, DMSO) δ 8.75 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 8.19 - 8.07 (m, 2H), 6.70

10

20

30

40

50

					(d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 2.20-2.19 (m, 4H), 1.83 - 1.70 (m, 2H).
689		Cl		H	^1H NMR (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8.49 (d, $J = 5.0$ Hz, 1H), 8.22 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 7.75 -7.66 (m, 1H), 6.95 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 2.39 - 2.33 (m, 4H), 1.84 - 1.76 (m, 2H).
690		Cl		H	^1H NMR (500 MHz, DMSO- d_6) δ 9.58 (s, 1H), 9.43 (d, $J =$ 5.5 Hz, 1H), 8.15 (d, $J =$ 7.5 Hz, 1H), 7.89 (d, $J =$ 5.5 Hz, 1H), 6.90 (d, $J = 7.5$ Hz, 1H), 2.35 - 2.31 (m, 4H), 1.86 - 1.80 (m, 2H).
691		Cl		H	^1H NMR (500 MHz, DMSO- d_6) δ 9.36 (s, 1H), 9.12 (s, 2H), 8.15 (d, $J = 7.5$ Hz, 1H), 6.90 (d, $J = 7.5$ Hz, 1H), 2.36 - 2.32 (m, 4H), 1.83 - 1.78 (m, 2H).
692		Cl		H	^1H NMR (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8.74 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 8.31- 8.22 (m, 4H), 7.77 - 7.62 (m, 2H), 7.04 (d, J =7.0 Hz, 1H), 2.39 - 2.34 (m, 4H), 1.81 - 1.76 (m, 2H),
693		Cl		H	^1H NMR (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8.68 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 8.21 - 7.92 (m, 4H), 7.04 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 2.35 - 2.30 (m, 4H), 1.82 - 1.77 (m, 2H),

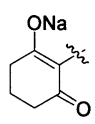

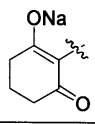

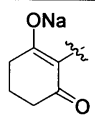


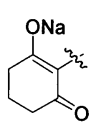


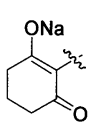


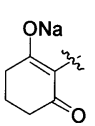


10

20

30

40

50

694		H		H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.28 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 7.83 (s, 1H), 7.13 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 2.35 (t, <i>J</i> = 6.5 Hz, 4H), 1.98- 1.89(m, 3H), 1.19-1.10 (m, 2H), 0.96-0.92 (m, 2H).
695			CH ₃	H	
696				H	
697				H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.29 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 6.88 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 3.60 (s, 3H), 2.33 (t, <i>J</i> = 6.5 Hz, 4H), 2.19 - 2.16 (m, 1H), 1.87 - 1.84 (m, 2H), 1.21 - 1.11(m, 2H), 1.00- 0.95 (m, 2H).
698				H	¹ H NMR (500 MHz, DMSO) δ 8.24 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 6.65 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 3.81 (s, 3H), 2.55 (s, 3H), 2.36 - 2.33 (m, 4H), 1.82 - 1.78 (m, 2H).
699				H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.22 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H), 6.95 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H), 2.45 (t, <i>J</i> = 7.0 Hz, 4H), 2.46 (s, 3H), 2.18-2.13 (m, 1H), 1.54-1.50 (m, 2H), 1.13-1.10 (m, 2H), 0.91-0.88 (m, 2H).

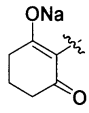


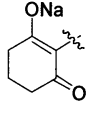


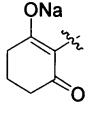


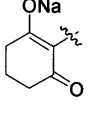


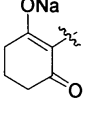


10

20

30

40

50

700				H	$^1\text{H NMR}$ (500 MHz, 重水) δ 7.70 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 6.46 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 3.58 (s, 3H), 2.32-2.30 (m, 4H), 2.24 (s, 3H), 1.84-1.80 (m, 2H).
701				H	$^1\text{H NMR}$ (500 MHz, DMSO) δ 8.26 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 6.67 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 2.55 (s, 3H), 2.46 (s, 3H), 2.37 - 2.35 (m, 4H), 1.83 - 1.79 (m, 2H).
702				H	$^1\text{H NMR}$ (500 MHz, 重水) δ 8.43 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 6.91 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 3.79 - 3.70 (m, 2H), 2.34 (t, $J = 6.5$ Hz, 4H), 2.20 - 2.16 (m, 1H), 1.89 - 1.84 (m, 4H), 1.23 - 1.13 (m, 2H), 1.07 (t, $J = 6.5$ Hz, 3H), 1.03 - 0.95 (m, 2H).
703				H	$^1\text{H NMR}$ (500 MHz, 重水) δ 8.33 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 6.81 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 3.72 - 3.67 (m, 1H), 2.34 (t, $J = 6.5$ Hz, 4H), 2.20 - 2.16 (m, 1H), 1.89 - 1.84 (m, 2H), 1.23 - 1.13 (m, 2H), 1.07 (d, $J = 6.5$ Hz, 6H), 1.03 - 0.95 (m, 2H).
704				H	$^1\text{H NMR}$ (500 MHz, 重水) δ 8.30 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 6.88 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 3.62 (s, 3H), 2.32 (t, $J =$ 6.5 Hz, 4H), 2.21 - 2.17 (m, 1H), 1.88 - 1.83 (m, 2H),

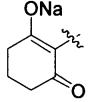


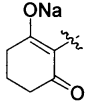


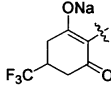

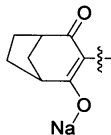
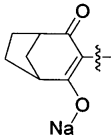

10

20

30

40

50

					1.22 - 1.12 (m, 2H), 1.01-0.95 (m, 2H).
705				H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 7.87 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 7.70 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 3.64 (s, 3H), 3.11 (s, 3H), 2.38-2.35 (m, 4H), 1.88 - 1.85 (m, 2H).
706				H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.19 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 7.26 - 7.23 (m, 1H), 3.26 (s, 6H), 2.35-2.30 (m, 4H), 1.95-1.88 (m, 3H), 1.12 - 0.96 (m, 2H), 0.95-0.90 (m, 2H)
707		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.38 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 6.68 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 2.85-2.83 (m, 1H), 2.39- 2.29 (m, 5H), 1.14-1.08 (m, 2H), 1.05-0.98 (m, 2H).
708		Cl	CH ₃	H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.12 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 6.81 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 2.70 (s, 3H), 2.10-2.03 (m, 4H), 1.72-1.69 (m, 2H), 1.59-1.56 (m, 2H).
709		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.12 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 6.74 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 3.03 - 3.00 (m, 2H), 2.69 - 2.65 (m, 2H), 2.03 - 1.97 (m, 4H), 1.81 - 1.75 (m, 2H), 1.66 - 1.63-1.59 (m, 2H), 0.88 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H).

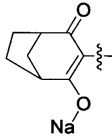

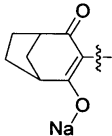
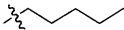
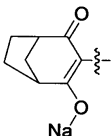

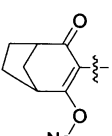

10

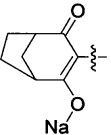

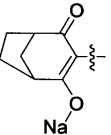

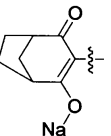
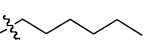
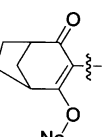
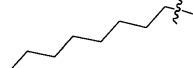
20

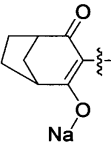
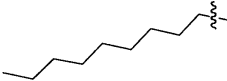
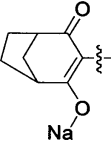

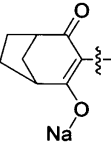

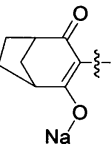

30

40

50

710		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.19 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 6.75 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 3.09-3.05 (m, 2H), 2.68-2.65 (m, 2H), 2.04-1.98 (m, 4H), 1.83 - 1.47 (m, 4H), 1.37- 0.97 (m, 2H), 0.76 (t, <i>J</i> = 6.5 Hz, 3H)	10
711		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.15 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 6.77 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 3.06 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.69-2.64 (m, 2H), 2.02-2.00 (m, 4H), 1.79-1.76 (m, 2H), 1.68-1.66 (m, 2H), 1.33- 1.26 (m, 4H), 0.78 (t, <i>J</i> = 7.0 Hz, 3H).	20
712		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.10 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 6.75 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 3.06-2.98 (m, 1H), 2.20-2.14 (m, 2H) 2.09-2.03 (m, 4H), 1.73-1.69 (m, 2H), 1.59-1.55 (m, 2H), 1.37-1.33 (m, 3H), 0.85 (t, <i>J</i> = 8.0 Hz, 3H)	30
713		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.22 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 6.74 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 2.98 (s, 2H), 2.67-2.66 (m, 2H), 2.01-1.99 (m, 4H), 1.65-1.63 (m, 2H), 0.91 (s, 9H).	40

714		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.10 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 6.74 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 3.04 (t, <i>J</i> = 8.0 Hz, 2H), 2.72 - 2.64 (m, 2H), 2.08 - 1.94 (m, 3H), 1.72 - 1.59 (m, 4H), 1.57 - 1.48 (m, 2H), 0.84 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 6H), .	10
715		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.13 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 6.74 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 3.06-3.02 (m, 1H), 2.88-2.84 (m, 1H), 2.67 (s, 2H), 2.09 - 1.85 (m, 4H), 1.65 (d, <i>J</i> = 8.5 Hz, 2H), 1.53-1.49 (m, 1H), 1.37 - 1.13 (m, 2H), 0.82-0.72 (m, 6H).	20
716		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.18 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 6.79 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 3.08-3.05 (m, 2H), 2.70-2.66 (m, 2H), 2.04-1.98 (m, 3H), 1.83 - 1.47 (m, 4H), 1.37- 0.97 (m, 7H), 0.74 (t, <i>J</i> = 6.5 Hz, 3H)	30
717		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.14 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 6.77 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 3.08-3.05 (m, 2H), 2.70-2.67 (m, 2H), 2.05-1.98 (m, 3H), 1.83 - 1.47 (m, 4H), 1.36 - 0.97 (m, 11H), 0.75 (t, <i>J</i> = 6.5	40

					Hz, 3H).
718		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.69 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 6.93 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 3.46 - 3.35 (m, 2H), 2.15-2.13 (m, 4H), 1.90 - 1.85 (m, 2H), 1.62 - 1.39 (m, 5H), 1.38 - 1.12 (m, 11H), 0.92 - 0.82 (m, 3H).
719		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.45 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 6.67 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 5.73 -5.68 (m, 2H), 2.85 - 2.64 (m, 2H), 2.33 (s, 3H), 2.08 - 1.83 (m, 4H), 1.67-1.63 (m, 2H).
720		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.31 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 6.88 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 3.31-3.27 (m, 1H), 2.89-2.83 (m, 2H), 2.71-2.65 (m, 2H), 2.21 - 2.09 (m, 2H), 1.99 - 1.84 (m, 4H), 1.83 - 1.58 (m, 7H).
721		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.41 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 6.88 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 2.70-2.68 (m, 1H), 2.60 - 2.37 (m, 2H), 2.03-1.99 (m, 3H), 1.91-1.89 (m, 1H), 1.72 - 1.41 (m, 3H), 1.06 (t, <i>J</i> = 7.0 Hz, 3H).

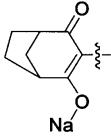

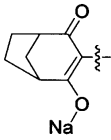
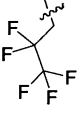
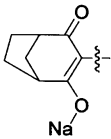

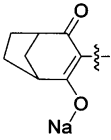

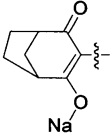
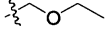
10

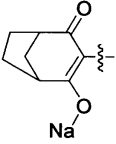

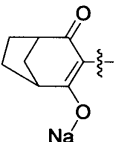

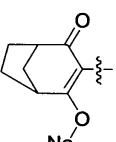

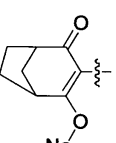

20

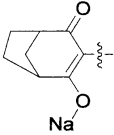

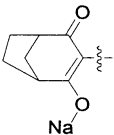

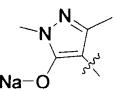

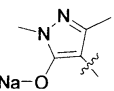

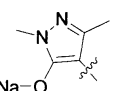

30

40

50

722		Cl		H	$^1\text{H NMR}$ (500 MHz, 重水) δ 8.16 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 6.81 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 3.38 (t, $J = 8.0$ Hz, 2H), 2.84 - 2.75 (m, 2H), 2.74 - 2.65 (m, 2H), 2.05 - 1.98 (m, 4H), 1.68 - 1.53 (m, 2H).	10
723		Cl		H	$^1\text{H NMR}$ (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8.56 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 6.99 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 4.71 (s, 1H), 2.62 - 2.57 (m, 2H), 2.11 - 2.08 (m, 2H), 2.06 - 1.92 (m, 2H), 1.71 - 1.67 (m, 2H), 1.54 - 1.49 (m, 2H).	20
724		Cl		H	$^1\text{H NMR}$ (500 MHz, 重水) δ 8.14 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 6.77 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 3.62 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 3.23 (t, $J = 7.0$ Hz, 2H), 2.72 - 2.65 (m, 2H), 2.34 - 2.24 (m, 2H), 2.05 - 1.97 (m, 4H), 1.69 - 1.65 (m, 2H).	30
725		Cl		H	$^1\text{H NMR}$ (500 MHz, 重水) δ 7.75 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 6.50 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 3.61 (s, 3H), 2.75 - 2.63 (m, 2H), 2.05 - 1.98 (m, 4H), 1.71 - 1.65 (m, 2H).	40
726		Cl		H	$^1\text{H NMR}$ (500 MHz, 重水) δ 8.29 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 6.86 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 5.05 (s, 2H), 3.60 (q, $J =$ 7.0 Hz, 2H), 2.75 - 2.70 (m,	

					2H), 2.06 - 2.01 (m, 4H), 1.72 - 1.67 (m, 2H), 1.15 (t, $J = 7.0$ Hz, 3H).	
727		Cl		H	^1H NMR (500 MHz, $\text{DMSO-}d_6$) δ 8.40 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 6.77 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 5.12 (q, $J = 6.7$ Hz, 1H), 3.29 (s, 3H), 2.85 - 2.64 (m, 2H), 2.08 - 1.83 (m, 4H), 1.67-1.63 (m, 2H), 1.55 (d, $J = 7.0$ Hz, 3H).	10
728		Cl		H	^1H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.25 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 6.80 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 4.18 (s, 2H), 2.67 (s, 3H), 2.03 - 1.99 (m, 4H), 1.91 - 1.88 (m, 4H).	20
729		Cl		H	^1H NMR (500 MHz, $\text{DMSO-}d_6$) δ 8.24 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 6.61 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 5.45 (t, $J = 6.5$ Hz, 1H), 3.89 - 3.71 (m, 2H), 2.72 - 2.59 (m, 2H), 2.39 - 2.22 (m, 2H), 2.13 - 1.76 (m, 4H), 1.63 - 1.58 (m, 2H), 1.51 - 1.33 (m, 2H).	30
730		Cl		H	^1H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.32 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 6.76 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 3.86 - 3.70 (m, 4H), 3.24 - 3.21 (m, 2H), 2.91 - 2.85 (m, 1H), 2.69 - 2.67 (m, 2H), 1.81 - 1.75 (m, 4H), 1.72 - 1.59 (m, 4H).	40

731		Cl		¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.04 (s, 1H), 8.88 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 8.81 (s, 1H), 6.78 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 2.00 - 1.84 (m, 4H), 1.68 - 1.62 (m, 2H), 1.48 - 1.42 (m, 2H).
732		Cl		¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.73 (s, 1H), 8.19 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 7.82 (s, 1H), 6.98 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 2.02 - 1.86 (m, 4H), 1.67 - 1.63 (m, 2H), 1.45 - 1.40 (m, 2H).
733		Cl		¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.22 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 6.79 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 3.10-3.06 (m, 1H), 3.19 (s, 3H), 1.80 (s, 3H), 1.62-1.58 (m, 2H), 1.39-1.35 (m, 3H), 0.87 (t, <i>J</i> = 8.0 Hz, 3H)
734		Cl		¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.29 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 6.84 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 3.18 (s, 3H), 3.16 - 3.12 (m, 1H), 2.17 (s, 3H), 1.87 - 1.82 (m, 4H), 0.74 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 6H).
735		Cl		¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.23 (d, 7.0 Hz, 1H), 6.83 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 3.17 (s, 3H), 2.30 - 2.15 (m, 1H), 2.08 - 2.03 (m, 2H), 1.76 - 1.69 (m, 3H), 1.39 - 1.34 (m, 3H), 1.25 - 1.17

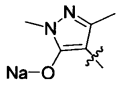

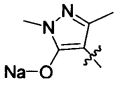
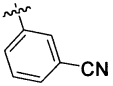
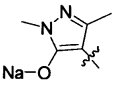

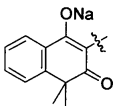

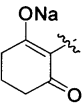
10

20

30

40

50

					(m, 2H), 0.79 - 0.75 (m, 3H).
736		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.15 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 6.88 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 3.15 (s, 3H), 3.08 - 3.01 (m, 2H), 2.14 (s, 3H), 1.78 - 1.71 (m, 2H), 1.27 - 1.17 (m, 6H), 0.77 - 0.68 (m, 3H).
737		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.35 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 8.15 (s, 1H), 8.06 (d, <i>J</i> = 8.0 Hz, 1H), 7.94 (d, <i>J</i> = 8.0 Hz, 1H), 7.79 - 7.68 (m, 1H), 6.89 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 3.14 (s, 3H), 2.16 (s, 3H).
738		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.88 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 7.75 - 7.63 (m, 2H), 7.24 - 7.21 (m, 1H), 6.78 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 3.18 (s, 3H), 2.18 (s, 3H)
739		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.35 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 7.94 (d, <i>J</i> = 8.0 Hz, 1H), 7.57 - 7.51 (m, 2H), 7.38 - 7.35 (m, 1H), 6.94 - 6.90 (m, 1H), 3.45 - 3.40 (m, 4H), 1.41 (s, 6H), 1.22 - 1.11 (m, 4H).
740		H	CH ₃	H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.09 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 7.86 (s, 1H), 7.13 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 2.66 (s, 3H),

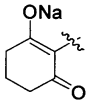


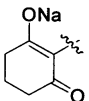
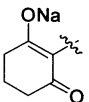

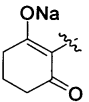
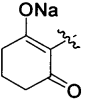

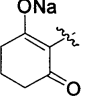

10

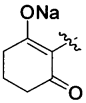
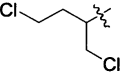
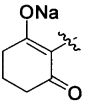
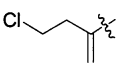
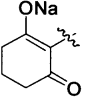

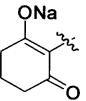
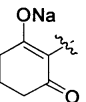
20

30

40

50

					2.36 (t, $J = 6.5$ Hz, 4H), 1.98 - 1.89 (m, 2H).	
741				H	¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8.13 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 6.92 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 2.36 - 2.32 (m, 4H), 2.23 - 2.08 (m, 2H) 1.83 - 1.78 (m, 2H), 1.29 - 1.12 (m, 4H), 1.02 - 0.83 (m, 4H).	10
742		Cl	H	H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 9.10 (s, 1H), 8.29 (d, $J =$ 7.0 Hz, 1H), 6.81 (d, $J =$ 7.0 Hz, 1H), 2.35-2.30 (m, 4H), 1.87 - 1.81 (m, 2H).	
743		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.29 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 6.99 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 2.38 (t, $J = 6.5$ Hz, 4H), 1.98 - 1.89 (m, 2H).	20
744		Cl	CF ₂ CH ₃	H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.15 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 6.80 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 2.35 (t, $J = 6.5$ Hz, 4H), 1.87 - 1.81 (m, 2H), 1.60 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H).	
745		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.41 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 7.01 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 2.33 (t, $J = 6.5$ Hz, 4H), 1.87 - 1.79 (m, 2H).	30
746		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.14 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 6.84 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 3.37 (t, $J = 7.0$ Hz, 2H), 2.78-2.74 (m, 2H), 2.40 - 2.24 (m, 4H), 1.91 - 1.80	40

					(m, 2H).
747		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.60 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 6.66 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 4.22 - 4.16 (m, 2H), 3.34 (m, 2H), 3.16-3.12 (m, 1H), 2.35- 2.15 (m, 6H), 1.76 -7.71 (m, 2H)
748		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.41 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 6.87 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 5.78-5.66 (m, 2H), 3.84-3.80 (m, 2H), 3.11-3.06 (m, 4H), 2.16-2.10 (m, 2H), 1.78 -1.73 (m, 2H).
749		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.38 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 6.75 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 2.16-2.14 (m, 4H), 1.76 - 1.72 (m, 2H), 1.23 - 1.20 (m, 4H).
750		Cl	CH ₃	H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.15 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 7.01 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 2.66 (s, 3H), 2.36 (t, <i>J</i> = 6.5 Hz, 4H), 1.98 - 1.89 (m, 2H).
751		Cl	CH ₂ CH ₃	H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.23 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 6.85 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 3.25 (q, <i>J</i> = 8.0 Hz, 2H), 2.36 (t, <i>J</i> = 6.5 Hz, 4H), 1.98 - 1.89 (m, 2H). 1.46 (t, <i>J</i> = 8.0 Hz, 3H)

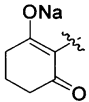

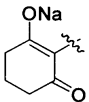

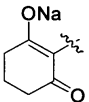

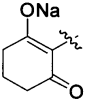

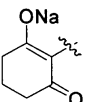

10

20

30

40

50

752		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.12 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 6.80 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 3.01 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.38-2.30 (m, 4H), 1.88-1.75 (m, 4H), 0.88 (t, <i>J</i> = 8.0 Hz, 3H).
753		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.14 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 6.78 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 3.45 - 3.38 (m, 1H), 2.33-2.28 (m, 4H), 1.85 - 1.79 (m, 2H), 1.34 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 6H).
754		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.13 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 6.81 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 3.06 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.34 (t, <i>J</i> = 6.5 Hz, 4H), 1.86 - 1.82 (m, 2H), 1.77 - 1.74 (m, 2H), 1.21 - 1.18 (m, 2H), 0.84 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H).
755		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.16 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 6.81 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 2.96 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.35-2.33 (m, 4H), 2.18-2.11 (m, 1H), 1.87-1.82 (m, 2H), 0.90 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 6H).
756		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.11 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 7.05 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 2.36 (t, <i>J</i> = 6.5 Hz, 4H), 1.98 - 1.89 (m, 2H),

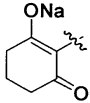
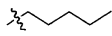
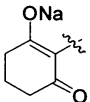

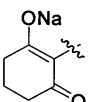
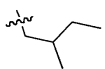
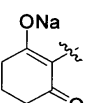

10

20

30

40

50

					1.48 (s, 9H).
757		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.14 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 6.82 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 3.06 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.36-2.33 (m, 4H), 1.86-1.84 (m, 2H), 1.27-1.25 (m, 6H), 0.79 (t, <i>J</i> = 7.0 Hz, 3H).
758		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.09 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 6.92 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 2.36 (t, <i>J</i> = 6.5 Hz, 4H), 1.98 - 1.89 (m, 2H). 1.65 (q, <i>J</i> = 8.0 Hz, 2H), 1.49 (s, 6H), 0.86 (t, <i>J</i> = 8.0 Hz, 3H).
759		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.15 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 6.81 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 3.10-3.05 (m, 1H), 2.92-2.88 (m, 1H), 2.35 (t, <i>J</i> = 6.5 Hz, 4H), 1.97- 1.82 (m, 3H), 1.40- 1.18 (m, 2H), 0.88 - 0.80 (m, 6H).
760		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.21 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 6.78 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 3.53 (q, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 2.31 (t, <i>J</i> = 6.5 Hz, 4H), 1.89 - 1.78 (m, 2H), 1.36-1.31 (m, 1H), 1.17 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 3H), 1.08 - 0.91 (m, 2H).

10

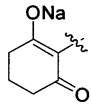
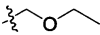
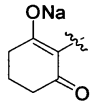

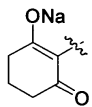

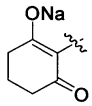

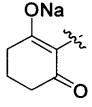

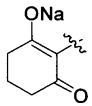
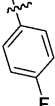
20

30

40

50

761		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.15 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 6.83 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 2.75 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 2H), 2.37-2.35 (m, 4H), 1.85-1.83 (m, 2H), 1.02 -0.98 (m, 1H), 0.44 - 0.41 (m, 4H).	10
762		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.17 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 6.79 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 3.15-3.09 (m, 1H), 2.34 (t, <i>J</i> = 6.5 Hz, 4H), 1.99 -1.93 (m, 3H), 1.88 - 1.75 (m, 4H), 1.62 - 1.50 (m, 2H), 1.40 -1.35 (m, 2H), 1.26 -1.21 (m, 1H).	20
763		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.13 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 6.81 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 3.92- 3.74 (m, 4H), 3.12-3.06 (m, 1H), 2.34 (t, <i>J</i> = 6.5 Hz, 4H), 1.98 -1.93 (m, 2H), 1.88 - 1.75 (m, 4H).	30
764		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.16 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 6.85 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 3.85 (s, 3H), 2.36-2.34 (m, 4H), 1.84-1.82 (m, 2H).	40
765		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.22 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 6.72 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 4.94 (s, 2H), 3.32 (s, 3H), 2.36 (t, <i>J</i> = 6.5 Hz, 4H), 1.98 - 1.89 (m, 2H).	

766		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.27 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 6.89 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 5.03 (s, 2H), 3.58 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 2H), 2.36-2.34 (m, 4H), 1.92 - 1.80 (m, 2H), 1.12 (t, <i>J</i> = 7.0 Hz, 3H).
767		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.18 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 6.84 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 3.90 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.36 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.29 (s, 3H), 2.35 (t, <i>J</i> = 6.5 Hz, 4H), 1.88-1.83 (m, 2H).
768		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.18 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 6.88 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 2.56 (s, 3H), 2.34 (t, <i>J</i> = 6.5 Hz, 4H), 1.87-1.82 (m, 2H).
769		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.18 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 6.88 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 3.70 (s, 2H), 2.56 (s, 3H), 2.34 (t, <i>J</i> = 6.5 Hz, 4H), 1.87-1.82 (m, 2H).
770		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.08 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 7.68 - 7.61 (m, 2H), 7.40 - 7.33 (m, 2H), 6.86 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 2.36-2.33 (m, 4H), 1.86-1.82 (m, 2H).
771		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.22 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 7.82 - 7.62 (m, 2H), 7.32 -

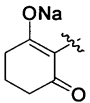
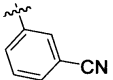
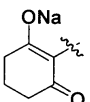
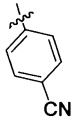
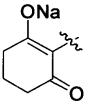
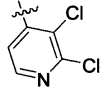
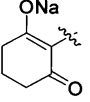

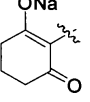

10

20

30

40

50

					7.21 (m, 2H), 6.81 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 2.33 (t, $J = 6.5$ Hz, 4H), 1.84 - 1.82 (m, 2H).
772		Cl		H	^1H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.30 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 8.15 (s, 1H), 8.05-7.94 (m, 2H), 7.78-7.72 (m, 1H), 6.89 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 2.41 - 2.27 (m, 4H), 1.89-1.80 (m, 2H).
773		Cl		H	^1H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.41 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 7.96-7.90 (m, 4H), 6.91 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 2.32-2.28 (m, 4H), 1.86-1.81 (m, 2H).
774		Cl		H	^1H NMR (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8.49 (d, $J = 5.0$ Hz, 1H), 8.19 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 7.72 (d, $J = 5.0$ Hz, 1H), 6.95 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 2.35 - 2.32 (m, 4H), 1.83 - 1.77 (m, 2H).
775		Cl		H	^1H NMR (500 MHz, DMSO- d_6) δ 9.02 (s, 1H), 8.79 - 8.72 (m, 2H), 8.08 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 6.90 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 2.36 - 2.32 (m, 4H), 1.82 - 1.78 (m, 2H).
776		Cl		H	^1H NMR (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8.19 - 8.15 (m, 2H), 7.10 - 6.92 (m, 2H), 6.71 (d, $J = 5.0$ Hz, 1H), 2.39 - 2.36 (m, 4H), 1.79 - 1.76 (m, 2H).

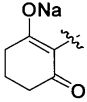

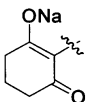

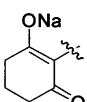

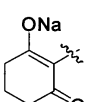

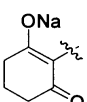

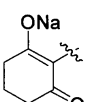
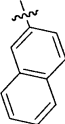
10

20

30

40

50

777		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ 8.21 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.75 -7.63 (m, 2H), 7.24 (m, 1H), 6.93 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 2.36 - 2.32 (m, 4H), 1.88 - 1.85 (m, 2H).
778		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ 8.22 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.75 -7.63 (m, 2H), 6.99 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 3.96 (s, 3H), 2.37 - 2.33 (m, 4H), 1.83 - 1.78 (m, 2H).
779		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ 8.12 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.24 -7.21 (m, 1H), 6.89 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 6.65 (d, J = 5.0 Hz, 1H), 3.92 (s, 3H), 2.33 - 2.30 (m, 4H), 1.83 - 1.77 (m, 2H).
780		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ 8.14 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.64-7.62 (m, 1H), 6.92 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 6.61 (d, J = 5.0 Hz, 1H), 3.94 (s, 3H), 2.34 - 2.30 (m, 4H), 1.79 - 1.76 (m, 2H).
781		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ 8.29 (s, 1H), 8.14 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 6.91 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 2.38 - 2.34 (m, 4H), 1.87 - 1.82 (m, 2H).
782		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ 8.39 (s, 1H), 8.29 - 8.02 (m, 5H), 7.78 - 7.65 (m, 2H), 6.91 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 2.36 - 2.32 (m, 4H),

10

20

30

40

50

					1.86 - 1.81 (m, 2H).
783		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8.86 - 8.74 (m, 2H), 8.17 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.98 - 7.75 (m, 4H), 6.95 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 2.38 - 2.34 (m, 4H), 1.82 - 1.78 (m, 2H).
784				H	¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8.18 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.01 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 2.92 - 2.86 (m, 4H) 2.36 - 2.32 (m, 4H), 1.87 - 1.82 (m, 2H), 1.26 (d, J = 7.5 Hz, 6H)
785				H	¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8.21 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.02 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 3.12 - 2.99 (m, 4H), 2.35 - 2.31 (m, 4H), 1.85 - 1.80 (m, 2H), 1.26 (d, J = 7.5 Hz, 6H)
786		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, DMSO) δ 8.16 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 6.93 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 5.75 (s, 2H), 2.71 - 2.63 (m, 4H), 2.10 (s, 3H), 1.67 - 1.54 (m, 2H).
787		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.13 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 6.82 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 4.26 (s, 2H), 3.38 (s, 1H) 2.37-2.35 (m, 4H), 1.85-1.83 (m, 2H).

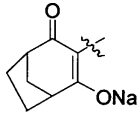
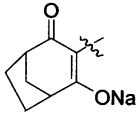
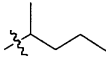
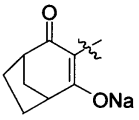

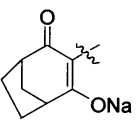

10

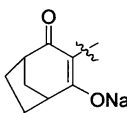

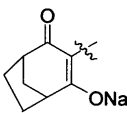

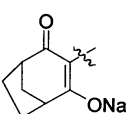

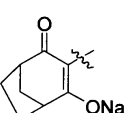

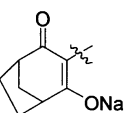

20

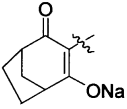

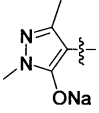

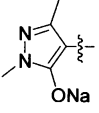

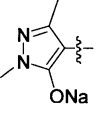

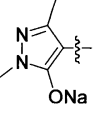

30

40

50

788		H	CH ₃	H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.12 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 7.86 (s, 1H), 6.81 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 2.70 (s, 3H), 2.10-2.03 (m, 4H), 1.72-1.69 (m, 2H), 1.59-1.56 (m, 2H).	10
789		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.12 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 6.81 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 3.06-2.99 (m, 1H), 2.20-2.14 (m, 2H), 2.10-2.03 (m, 4H), 1.72-1.69 (m, 2H), 1.59-1.56 (m, 2H), 1.50-1.40 (m, 2H), 1.37-1.35 (m, 3H), 0.87 (t, <i>J</i> = 8.0 Hz, 3H)	20
790		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.39 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 6.72 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 2.06 - 2.01 (m, 4H), 1.82 - 1.77 (m, 2H), 1.65 - 1.59 (m, 2H), 1.58 - 1.55 (m, 2H), 1.20 (s, 6H), 0.85 (t, d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 3H).	30
791		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.28 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 6.92 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 2.22-2.16 (m, 3H), 2.10-2.03 (m, 4H), 1.72-1.69 (m, 2H), 1.19-1.10 (m, 2H), 0.96-0.92 (m, 2H).	40

792		Cl		H	$^1\text{H NMR}$ (500 MHz, 重水) δ 8.12 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 6.78 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 3.01 - 2.98 (m, 2H), 2.64 - 2.62 (m, 1H), 2.03 - 1.98 (m, 4H), 1.83- 1.78 (m, 2H), 1.22-1.16 (m, 1H), 1.02-0.98 (m, 1H), 0.89 (s, 6H).	10
793		Cl		H	$^1\text{H NMR}$ (500 MHz, 重水) δ 8.17 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 6.73 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 2.59 - 2.49 (m, 1H), 2.06 - 2.01 (m, 4H), 1.80 - 1.72 (m, 2H), 1.65 - 1.59 (m, 2H), 1.20 - 1.08 (m, 10H).	20
794		Cl		H	$^1\text{H NMR}$ (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8.22 (d, 7.0 Hz, 1H), 6.98 (d, 7.0 Hz, 1H), 5.96 - 5.92 (m, 1H), 2.36 - 2.22 (m, 4H), 1.96 - 1.84 (m, 6H), 1.68 - 1.62 (m, 2H), 1.48 - 1.42 (m, 2H).	30
795		Cl		H	$^1\text{H NMR}$ (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8.88 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 7.98 (s, 1H), 7.90 (d, $J =$ 5.0 Hz, 1H), 7.89 (d, $J =$ 5.0 Hz, 1H), 6.81 (d, $J =$ 7.0 Hz, 1H), 2.00 - 1.84 (m, 4H), 1.67 - 1.62 (m, 2H), 1.45 - 1.41 (m, 2H).	40
796		Cl		H	$^1\text{H NMR}$ (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8.88 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 7.75 -7.63 (m, 2H), 7.24 (m, 1H), 6.88 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 2.00 - 1.85 (m,	

					4H), 1.68 - 1.62 (m, 2H), 1.47 - 1.42 (m, 2H).	
797		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8.88 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 8.34 (d, <i>J</i> = 5.0 Hz, 1H), 7.78 (d, <i>J</i> = 5.0 Hz, 1H), 6.78 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 2.00 - 1.84 (m, 4H), 1.66 - 1.61 (m, 2H), 1.47 - 1.42 (m, 2H).	10
798		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.23 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 6.88 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 3.40 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 3.17 (s, 3H), 2.86 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.17 (s, 3H).	20
799		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.24 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 6.88 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 3.26 - 2.79 (m, 5H), 2.15 (s, 3H), 1.74 - 1.66 (m, 2H), 0.90 (t, <i>J</i> = 8.0 Hz, 3H).	30
800		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.13 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 6.74 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 3.19 (s, 3H), 3.06-3.02 (m, 2H), 2.88-2.84 (m, 1H), 2.18 (s, 3H), 1.37 - 1.13 (m, 2H), 0.82-0.72 (m, 6H).	40
801		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.23 (d, 7.0 Hz, 1H), 6.83 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 3.17 (s, 3H), 1.76 (s, 3H), 1.39 (s, 6H), 1.25 - 1.17 (m, 2H), 0.79 - 0.75 (m, 3H).	

10

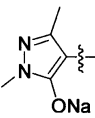

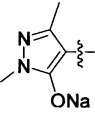

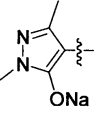

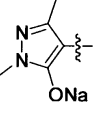

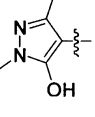

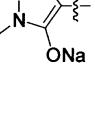
20

30

40

50

802		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.15 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 6.88 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 3.15 (s, 3H), 3.08 - 3.01 (m, 2H), 1.88 (s, 3H), 1.78 - 1.71 (m, 2H), 1.27 - 1.17 (m, 8H), 0.77 - 0.68 (m, 3H).	10
803		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 7.81 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 6.57 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 3.62 (s, 3H), 3.18 (s, 3H), 2.17 (s, 3H).	20
804		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.35 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 6.92 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 5.06 (s, 2H), 3.59 (q, <i>J</i> = 7.0 Hz, 2H), 3.17 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 1.20 - 1.05 (t, <i>J</i> = 7.0 Hz, 3H).	30
805		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.40 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 7.94-7.90 (m, 4H), 6.90 (t, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 3.16 (s, 3H), 2.18 (s, 3H).	40
806		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 9.02 (s, 1H), 8.79 - 8.72 (m, 2H), 8.25 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 6.85 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 3.18 (s, 3H), 2.17 (s, 3H).	
807		Cl		H	¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8.19 - 8.15 (m, 2H), 7.10 - 6.92 (m, 2H), 6.71 (d, 5.0 Hz, 1H), 3.18 (s, 3H), 2.17 (s, 3H).	

808		Cl		H	$^1\text{H NMR}$ (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8.21 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 7.75 -7.63 (m, 2H), 7.24 (m, 1H), 6.78 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 3.18 (s, 3H), 2.17 (s, 3H).
809		Cl		H	$^1\text{H NMR}$ (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8.10 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 7.75 -7.63 (m, 2H), 6.92 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 3.96 (s, 3H), 3.18 (s, 3H), 2.17 (s, 3H)..
810		Cl		H	$^1\text{H NMR}$ (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8.15 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 7.24 (m, 1H), 6.94 (d, $J =$ 7.0 Hz, 1H), 6.65 (d, $J =$ 5.0 Hz, 1H), 3.92 (s, 3H), 3.18 (s, 3H), 2.17 (s, 3H).
811		Cl		H	$^1\text{H NMR}$ (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8.20 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 7.75 -7.63 (m, 1H), 7.24-7.21 (m, 1H), 6.94 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 3.92 (s, 3H), 3.18 (s, 3H), 2.17 (s, 3H).
812		Cl		H	$^1\text{H NMR}$ (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8.49 (d, $J = 5.0$ Hz, 1H), 8.19 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 7.72 (d, $J = 5.0$ Hz, 1H), 6.93 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 3.18 (s, 3H), 2.17 (s, 3H).
813		H	CH ₃	H	$^1\text{H NMR}$ (500 MHz, 重水) δ 8.06 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 7.71 (s, 1H), 7.36 (s, 1H), 7.03 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 3.25 (s, 3H), 2.61 (s, 3H).

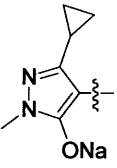

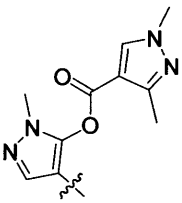

10

20

30

40

50

814		Cl		H ¹ H NMR (500 MHz, 重水) δ 8.30 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 6.95 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 3.63 (s, 3H), 2.67-2.64 (m, 1H), 2.18-2.15 (m, 1H), 1.13 -1.08 (m, 2H), 1.04 - 0.93 (m, 2H), 0.90-0.82 (m, 4H).
815		Cl		H ¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.46 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 8.05 (s, 1H), 7.95 (s, 1H), 6.89 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 3.67 (s, 3H), 3.63 (s, 3H), 2.25 - 2.21 (m, 1H), 2.15 (s, 3H), 1.12 - 1.08 (m, 2H), 1.02 - 0.99 (m, 2H).

10

20

【0057】

本発明の化合物を調製するための方法は、以下のプログラムおよび実施形態において詳細に説明される。この材料は市販されているか、または文献において報告されている、もしくは経路に示されている既知の方法により調製される。当業者は、本発明の化合物が他の合成経路によっても合成され得ることを理解すべきである。合成経路の詳細な材料および反応条件は次の文章において説明されていますが、それでも他の同様の材料および条件に置き換えることは容易である。例えば、本発明の調製方法を変更して製造される化合物の異性体は、本発明の範囲に含まれる。さらに、以下の調製方法は、当業者に知られている一般的な化学的方法、例えば、反応の過程における適切な基の保護等を使用することによって、本発明の開示に従ってさらに変更することができる。

30

【0058】

以下の適用方法により、本発明の調製方法のさらなる理解を向上させることができる。特定の材料、クラスおよび条件は、本発明をさらに説明するものであり、その合理的な範囲を制限するものではない。代表的な化合物の例は以下の通りであり、他の化合物の合成方法も同様であり、ここでは詳細に説明しない。

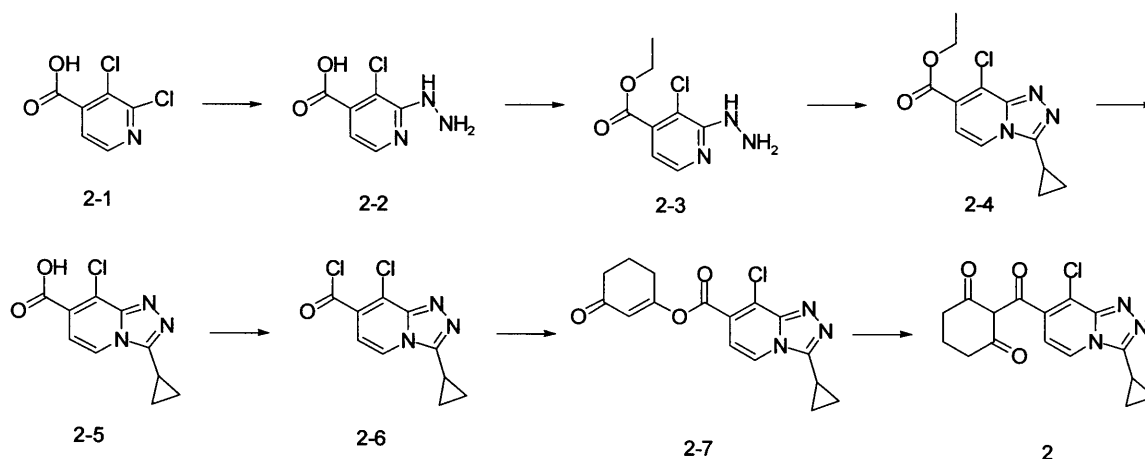
【0059】

1. 化合物2の合成

40

50

【化 2 1】



10

【0060】

100 g (1.0当量)の化合物2-1を反応器に入れ、1 Lのヒドラジン水和物(80%、10V)を添加し、次いで100 に加熱し、20時間反応させた。反応完了後、ヒドラジン水和物を真空下で除去して固体を得、固体をエタノールと共に撹拌する(beat)ことにより精製して、生成物2-2を収率98%で得た。

20

【0061】

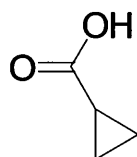
得られた生成物2-2を1 Lのエタノールに添加し、次いで触媒量の濃硫酸を添加し、80 に加熱し、18時間反応させた。反応完了後、不溶物を濾過により除去し、濾過ケーキ(filter cake)をエタノールで洗浄し、エタノール相を回収した。エタノールを真空下で除去した後、1 Lの酢酸エチルおよび1 Lの水を添加して抽出および液体分離を行い、水相を1 Lの酢酸エチルで1回抽出し、有機相を合わせて重炭酸ナトリウム溶液で1回洗浄し、次いで飽和ブライン(saturated brine)で1回洗浄し、有機相を回転蒸発させて酢酸エチルを除去した。乾燥後、生成物2-3を95%の収率で得た。

【0062】

得られた生成物2-3を反応器に入れ、次いで溶媒として10Vのトルエン、および

30

【化 2 2】



(1.1当量)を添加した。反応系を80 に加熱し、オキシ塩化リン(2.5当量)を添加して10時間反応させ、次いで100 に加熱して1時間反応させた。反応完了後、反応系を20 に制御し、水に添加し；抽出および分離を行い、トルエン相を回収し、水相を酢酸エチル(5V)で2回抽出し、有機相を回収した。重炭酸ナトリウム溶液(10V)で洗浄した後、有機相を真空下で除去して固体生成物を得、次いで生成物をイソプロピルエーテルと共に撹拌することにより精製し、濾過して、生成物2-4を92%の収率で得た。

40

【0063】

得られた生成物2-4を5Vのジオキサンに溶解し、20 に制御した後、調製した水酸化ナトリウム水溶液(5Vの水に溶解した1.2当量の水酸化ナトリウム)を滴下した後、2時間反応させた。反応完了後、ジオキサンを除去した。1Mの塩酸水溶液でpHを1~2に調整した。固体の沈殿後2時間にわたり撹拌を続け、次いで濾過を行い、濾過ケーキを水で1回洗浄し、固体を乾燥させて、生成物2-5を92%の収率で得た。

50

【0064】

得られた生成物 2 - 5 および 10 V のジクロロメタンを反応器に入れ、20 の制御温度で攪拌しながら 2.5 当量の塩化チオニルを滴下し、次いで 1 時間反応させた。反応完了後、ジクロロメタンおよび塩化チオニルを真空下で除去し、次いで残留物を後で使用するために 3 V のジクロロメタンに溶解した。

【0065】

1, 3 - シクロヘキサジオン、10 V のジクロロメタンおよび 2.5 当量のトリエチルアミンを反応器に入れ、次いで上記で得られたジクロロメタン溶液中の塩化アシルを、20 の制御温度で滴下して、4 時間反応させた。反応完了後、ジクロロメタンおよびトリエチルアミンを真空下で除去して、粗生成物 2 - 7 を得た。

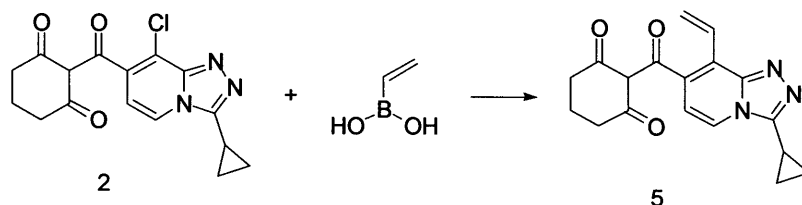
【0066】

粗生成物 2 - 7 を 10 V のアセトニトリルに溶解し、3.0 当量のトリエチルアミンを添加し、次いで触媒量のアセトンシアノヒドリンを窒素保護下で添加し、50 で 15 時間反応させた。反応完了後、生成物とシリカゲルとを混合し、カラムクロマトグラフィーにより精製して、目的生成物 2 を 54 % の収率で得た。

【0067】

2. 化合物 5 の合成

【化 2 3】



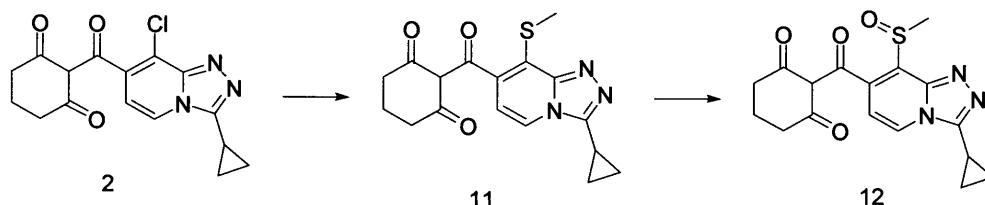
【0068】

1 グラムの化合物 2 をジオキサン / 水 (10 : 1) に溶解し、1.2 当量のビニルホウ酸および 3.0 当量の炭酸カリウム、次いで窒素保護下で触媒として 1, 1' - ビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセンパラジウム (II) ジクロリドジクロロメタン複合体を添加し、80 に加熱し、攪拌しながら 15 時間反応させた。反応完了後、生成物とシリカゲルとを混合し、カラムクロマトグラフィーにより精製して、生成物 5 を収率 78 % で得た。

【0069】

3. 化合物 11 および 12 の合成

【化 2 4】



【0070】

1 グラムの化合物 2 を 10 V の N, N - ジメチルホルムアミドに溶解し、8 当量のメチルメルカプチドナトリウム水溶液を添加し、90 で 3 時間反応させた。反応完了後、反応液を水で希釈し、酢酸エチルで抽出し、次いで酢酸エチル相を回収し、生成物とシリカゲルとを混合し、カラムクロマトグラフィーで精製して、目的物 11 を 56 % の収率で得た。

【0071】

得られた生成物 11 をジクロロメタンに溶解し、1.0 当量の m - クロロペルオキシ安

10

20

30

40

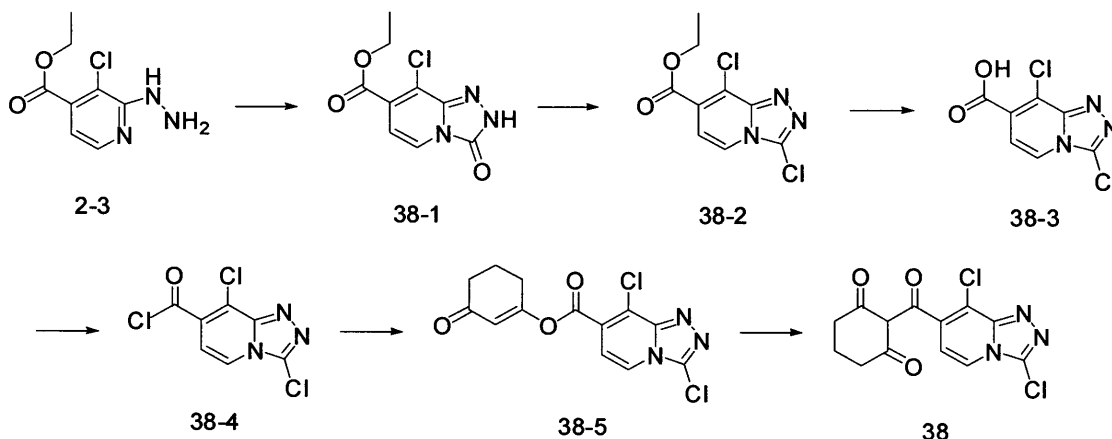
50

息香酸を添加し、室温で1時間反応させた。反応完了後、亜硫酸水素ナトリウムを添加して反応をクエンチ (quench) し、生成物とシリカゲルとを混合し、カラムクロマトグラフィーで精製して、目的生成物12を52%の収率で得た。

【0072】

4. 化合物38の合成

【化25】



10

【0073】

化合物2-3を反応器に入れ、溶解のために10VのDCMを添加した後、1.0当量のN,N'-カルボニルジイミダゾールを添加し、室温で4時間反応させた。反応終了後、pHを3~5に調整した。水で洗浄した後、有機相を回転蒸発させ、イソプロピルエーテルと共に攪拌することにより精製して、生成物38-1を75%の収率で得た。

【0074】

得られた生成物38-1、溶媒として10Vの1,2-ジクロロエタン、触媒量のN,N-ジメチルホルムアミド、および1.5当量のオキシ塩化リンを反応器に入れ、80に加熱し、20時間反応させた。反応終了後、反応液を水相に滴下し、有機相を重炭酸ナトリウム水溶液で洗浄し、有機相を回転蒸発させ、イソプロピルエーテルと共に攪拌することにより精製し、生成物38-2を51%の収率で得た。

30

【0075】

化合物38-2を5Vのジオキサンに溶解し、15に制御し、調製した水酸化ナトリウム水溶液(5Vの水に溶解した1.0当量の水酸化ナトリウム)をジオキサン溶液中の38-2に徐々に滴下し、0.5時間反応させた。反応終了後、ジオキサンを除去し、1Mの塩酸水溶液を添加してpHを1~2に調整した。固体の沈殿後1.5時間攪拌を続け、次いで濾過を行い、濾過ケーキを水で1回洗浄し、固体を乾燥させて、生成物38-3を78%の収率で得た。

【0076】

化合物38-3および10Vのジクロロメタンを反応器に入れ、15の制御温度で攪拌しながら2.5当量の塩化チオニルを滴下し、1時間反応させた。反応完了後、ジクロロメタンおよび塩化チオニルを真空下で除去し、次いで残留物を後で使用するために3Vのジクロロメタンに溶解した。

40

【0077】

1,3-シクロヘキサジオン、10Vのジクロロメタンおよび2.5当量のトリエチルアミンを反応器に入れ、次いで上記で得られたジクロロメタン溶液中の塩化アシルを、15の制御温度で滴下し、5時間反応させた。反応完了後、ジクロロメタンおよびトリエチルアミンを真空下で除去して、粗生成物38-5を得た。

【0078】

粗生成物38-5を10Vのアセトニトリルに溶解し、3.0当量のトリエチルアミンを添加し、次いで触媒量のアセトンシアノヒドリンを窒素保護下で添加し、70で5時

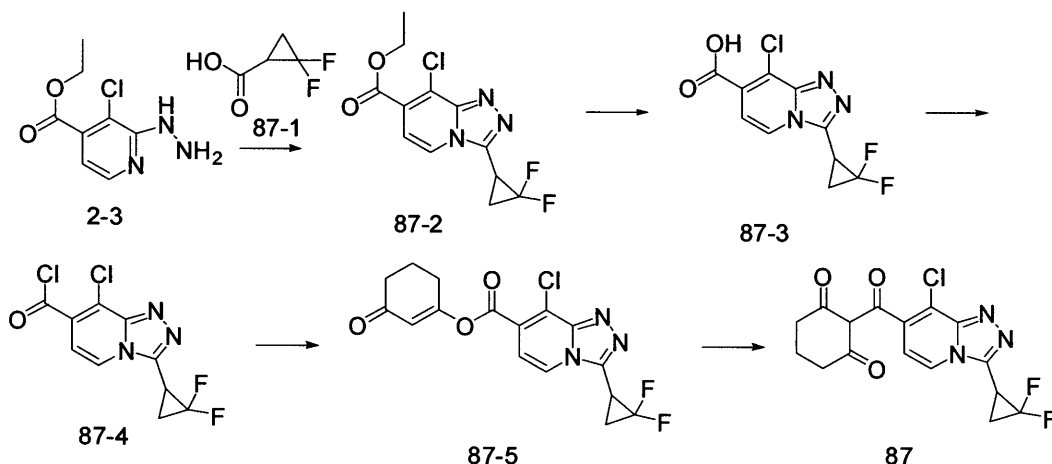
50

間反応させた。反応完了後、生成物とシリカゲルとを混合し、カラムクロマトグラフィーにより精製して、最終生成物 38 を 48 % の収率で得た。

【0079】

5. 化合物 87 の合成

【化26】



10

【0080】

化合物 2 - 3、溶媒として 10 V のトルエン、および 87 - 1 (1.1 当量) を反応器に添加し、反応系を 80 に加熱し、オキシ塩化リン (2.5 当量) を添加し、次いで 5 時間反応させ、次いで 100 に加熱し、1 時間反応させた。反応完了後、反応系を 25 に制御し、水に添加した。抽出および分離を行い、トルエン相を回収した。水相を酢酸エチル (5 V) で 2 回抽出し、有機相を回収した。重炭酸ナトリウム溶液 (10 V) で洗浄した後、有機相を真空下で除去して固体生成物を得、次いで生成物をイソプロピルエーテルと共に撹拌することにより精製し、濾過して、生成物 87 - 2 を 75 % の収率で得た。

【0081】

得られた生成物 87 - 2 を 5 V のジオキサンに溶解し、25 に制御した後、調製した水酸化ナトリウム水溶液 (5 V の水に溶解した 1.2 当量の水酸化ナトリウム) を滴下し、次いで 0.5 時間反応させた。反応完了後、ジオキサンを除去し、1 M の塩酸水溶液で pH を 1 ~ 2 に調整した。固体の沈殿後 0.5 時間撹拌を続け、次いで濾過を行い、濾過ケーキを水で 1 回洗浄し、固体を乾燥させて、生成物 87 - 3 を 82 % の収率で得た。

【0082】

得られた生成物 87 - 3 および 10 V のジクロロメタンを反応器に入れ、25 の制御温度で撹拌しながら 2.5 当量の塩化チオニルを滴下し、次いで 1 時間反応させた。反応完了後、ジクロロメタンおよび塩化チオニルを真空下で除去し、次いで残留物を後で使用するために 3 V のジクロロメタンに溶解した。

【0083】

1, 3 - シクロヘキサジオン、10 V のジクロロメタンおよび 2.5 当量のトリエチルアミンを反応器に入れ、次いで上記で得られたジクロロメタン溶液中の塩化アシルを、25 の制御温度で滴下し、3 時間反応させた。反応完了後、ジクロロメタンおよびトリエチルアミンを真空下で除去して、粗生成物 87 - 5 を得た。

【0084】

粗生成物 87 - 5 を 10 V のアセトニトリルに溶解し、3.0 当量のトリエチルアミンを添加し、次いで触媒量のアセトンシアノヒドリンを窒素保護下で添加し、20 で 24 時間反応させた。反応完了後、生成物とシリカゲルとを混合し、カラムクロマトグラフィーにより精製して、目的生成物 87 を 42 % の収率で得た。

【0085】

6. 化合物 114 の合成

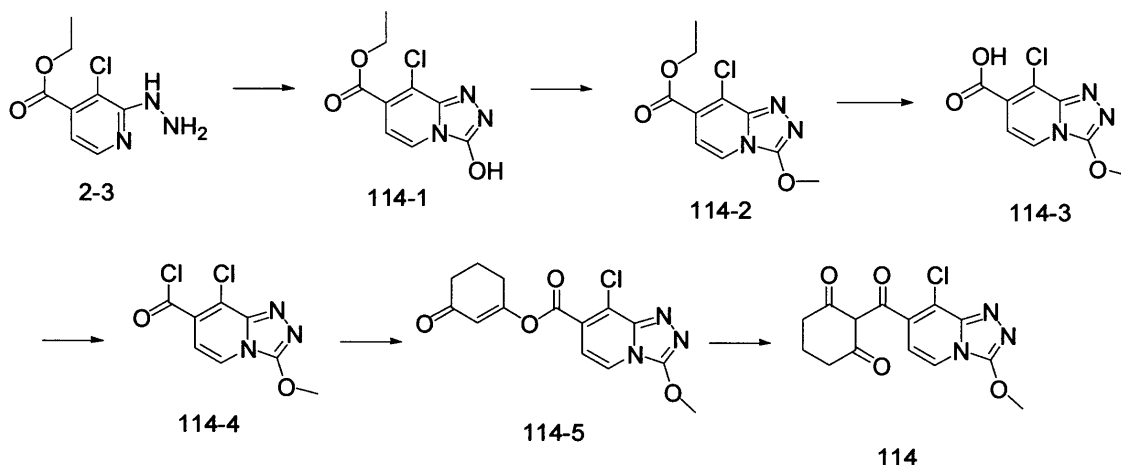
20

30

40

50

【化 2 7】



10

【0086】

生成物 2 - 3 を 10 容量の N , N - ジメチルホルムアミドに溶解し、そこに 1 . 2 当量の N , N - カルボニルジイミダゾールを添加し、次いで 80 に加熱し、3 時間撹拌した。反応完了後、反応系を室温まで冷却し、20 容量の水溶液を滴下した。固体の沈殿後 30 分間撹拌を続けた。固体を濾過により回収し、乾燥させて、生成物を 89 % の収率で得た。

20

【0087】

生成物 114 - 1 を 10 容量のアセトニトリルに溶解し、1 . 5 当量のヨウ化メチルおよび 2 当量の炭酸カリウムを添加し、次いで 80 に加熱し、撹拌しながら 2 時間反応させた。反応完了後、アセトニトリルを真空下で除去し、10 容量の水および 10 容量の酢酸エチルを添加し、抽出を行い、有機相を回収し、乾燥により有機溶媒を除去して、生成物 114 - 2 を 80 % の収率で得た。

【0088】

生成物 114 - 2 を 5 V のジオキサンに溶解し、25 に制御した後、調製した水酸化ナトリウム水溶液 (5 V の水に溶解した 1 . 2 当量の水酸化ナトリウム) を滴下し、次いで 3 時間反応させた。反応完了後、ジオキサンを除去し、1 M の塩酸水溶液で pH を 1 ~ 2 に調整した。固体の沈殿後 3 時間撹拌を続け、次いで濾過を行い、濾過ケーキを水で 1 回洗浄し、固体を乾燥させて、生成物 114 - 3 を 81 % の収率で得た。

30

【0089】

得られた生成物 114 - 3 および 10 V のジクロロメタンを反応器に入れ、25 の制御温度で撹拌しながら 2 . 5 当量の塩化チオニルを滴下し、次いで 40 に加熱し、1 時間反応させた。反応完了後、ジクロロメタンおよび塩化チオニルを真空下で除去し、次いで残留物を後で使用するために 3 V のジクロロメタンに溶解した。

【0090】

1 . 1 当量の 1 , 3 - シクロヘキサジオン、10 V のジクロロメタンおよび 3 . 0 当量のトリエチルアミンを反応器に入れ、次いで上記で得られたジクロロメタン溶液中の 114 - 4 を、10 の制御温度で滴下し、1 時間反応させた。反応完了後、ジクロロメタンおよびトリエチルアミンを真空下で除去して、粗生成物 114 - 5 を得た。

40

【0091】

粗生成物 114 - 5 を 10 V のアセトニトリルに溶解し、1 . 0 当量のトリエチルアミンを添加し、次いで触媒量のアセトンシアノヒドリンを窒素保護下で添加し、70 で 10 時間反応させた。反応完了後、不溶性の固体を濾過により除去し、アセトニトリルを真空下で除去した。残留物を 10 容量のジクロロメタンで溶解し、次いで 5 容量の水を添加し、1 M の塩酸で pH 3 ~ 4 に調整し、次いで抽出および分離を行い、有機相を回収し；有機相に 5 容量の水を添加し、次いで飽和重炭酸ナトリウム水溶液で pH 8 に調整し、次

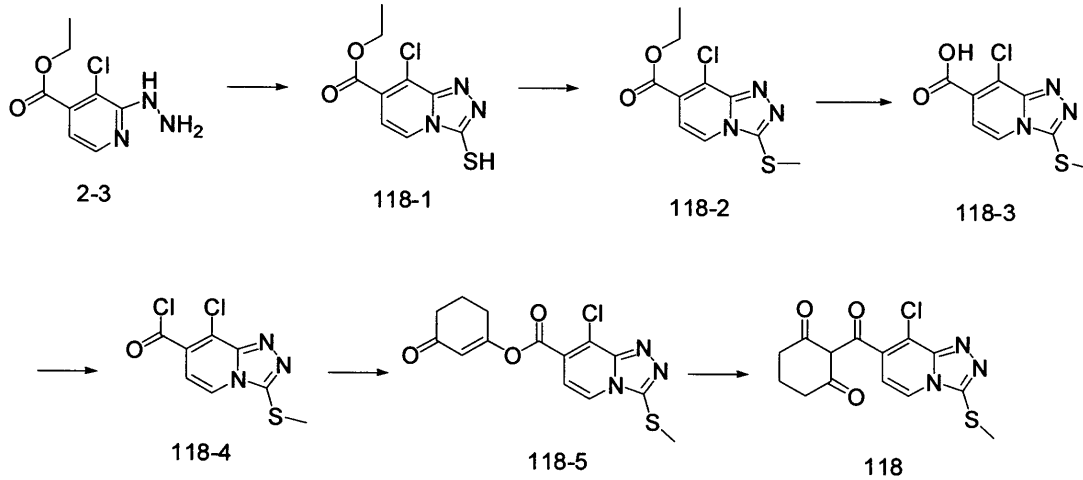
50

いで抽出および分離を行い、水溶液を回収し；水相を1 Mの塩酸でpH 2 ~ 3に調整し、ジクロロメタンによる抽出および分離を行い、有機相を回収した。有機相を回転蒸発に供して、生成物114を52%の収率で得た。

【0092】

7. 化合物118の合成

【化28】



10

20

【0093】

生成物2-3を10容量のエタノールに溶解し、3容量の二硫化炭素を添加し、次いで80に加熱し、20時間撹拌した。反応完了後、反応系を室温まで冷却した。エタノールおよび二硫化炭素を真空下で除去して、後で使用するための粗生成物118-1を得た。

【0094】

生成物118-1を10容量のアセトニトリルに溶解し、1.2当量のヨウ化メチルおよび2当量の炭酸カリウムを添加し、次いで80に加熱し、撹拌しながら3時間反応させた。反応完了後、アセトニトリルを真空下で除去し、生成物とシリカゲルとを混合し、カラムクロマトグラフィーにより精製して、生成物118-2を55%の収率で得た。

【0095】

生成物118-2を5Vのジオキサンに溶解し、15に制御した後、調製した水酸化ナトリウム水溶液(5Vの水に溶解した1.2当量の水酸化ナトリウム)を滴下し、次いで2時間反応させた。反応終了後、ジオキサンを除去し、1Mの塩酸水溶液でpHを1~2に調整し、10容量のジクロロメタンで抽出および液分離を2回行った。有機相を回収し、回転蒸発に供して溶媒を除去し、生成物118-3を70%の収率で得た。

30

【0096】

生成物118-3および10Vのジクロロメタンを反応器に入れ、10の制御温度で3.0当量の塩化チオニルを撹拌しながら滴下し、次いで50に加熱し、1時間反応させた。反応完了後、ジクロロメタンおよび塩化チオニルを真空下で除去し、次いで残留物を後で使用するために3Vのジクロロメタンに溶解した。

40

【0097】

1.1当量の1,3-シクロヘキサジオン、10Vのジクロロメタンおよび3.0当量のトリエチルアミンを反応器に入れ、次いで上記で得られたジクロロメタン溶液中の118-4を、10の制御温度で滴下し、0.5時間反応させた。反応完了後、ジクロロメタンおよびトリエチルアミンを真空下で除去して、粗生成物118-5を得た。

【0098】

粗生成物118-5を10Vのアセトニトリルに溶解し、1.2当量のトリエチルアミンを添加し、次いで触媒量のアセトンシアノヒドリンを窒素保護下で添加し、50で5時間反応させた。反応完了後、不溶性の固体を濾過により除去し、アセトニトリルを真空下で除去した。残留物に5容量の水を添加し、1Mの塩酸でpH 3~4に調整し、逆相ク

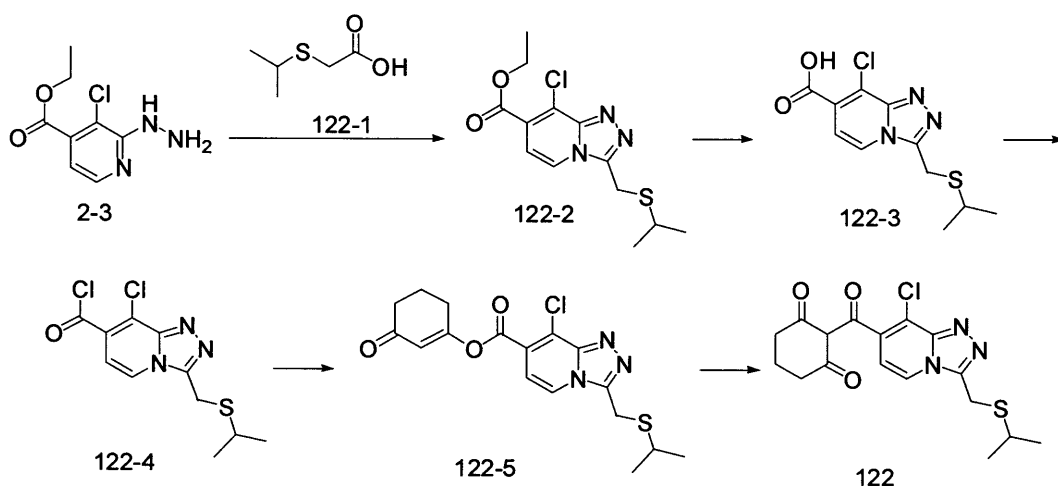
50

ロマトグラフィーにより精製して、目的生成物 118 を 45% の収率で得た。

【0099】

8. 化合物 122 の合成

【化29】



10

【0100】

に化合物 2-3、溶媒として 8 V のトルエン、および 122-1 (1.0 当量) を反応器に入れ、反応系を 80 に加熱し、オキシ塩化リン (2.5 当量) を添加し、次いで 16 時間反応させ、次いで 100 に加熱し、1 時間反応させた。反応完了後、反応系を 10 に制御し、水に添加した。抽出および分離を行い、トルエン相を回収した。水相を酢酸エチル (5 V) で 2 回抽出し、有機相を回収した。重炭酸ナトリウム溶液 (5 V) で洗浄した後、有機相を真空下で除去して固体生成物を得、これをイソプロピルエーテルと共に攪拌することにより精製し、濾過して、生成物 122-2 を 93% の収率で得た。

20

【0101】

得られた生成物 122-2 を 5 V のエタノールに溶解し、10 に制御した後、調製した水酸化ナトリウム水溶液 (5 V の水に溶解した 1.2 当量の水酸化ナトリウム) を滴下し、系を 3 時間反応させた。反応終了後、エタノールを除去し、1 M の塩酸水溶液で pH を 1 ~ 2 に調整し、10 V のジクロロメタンで 2 回抽出した。有機相を回収し、回転蒸発に供してジクロロメタンを除去し、生成物 122-3 を 89% の収率で得た。

30

【0102】

得られた生成物 122-3 および 10 V のジクロロメタンを反応器に入れ、10 の制御温度で攪拌しながら 2.5 当量の塩化チオニルを滴下し、次いで 1 時間反応させた。反応完了後、ジクロロメタンおよび塩化チオニルを真空下で除去し、次いで残留物を後で使用するために 3 V のジクロロメタンに溶解した。

【0103】

1, 3-シクロヘキサジオン、10 V のジクロロメタンおよび 2.5 当量のトリエチルアミンを反応器に入れ、次いで上記で得られたジクロロメタン溶液中の塩化アシルを、10 の制御温度で滴下し、3 時間反応させた。反応完了後、ジクロロメタンおよびトリエチルアミンを真空下で除去して、粗生成物 122-5 を得た。

40

【0104】

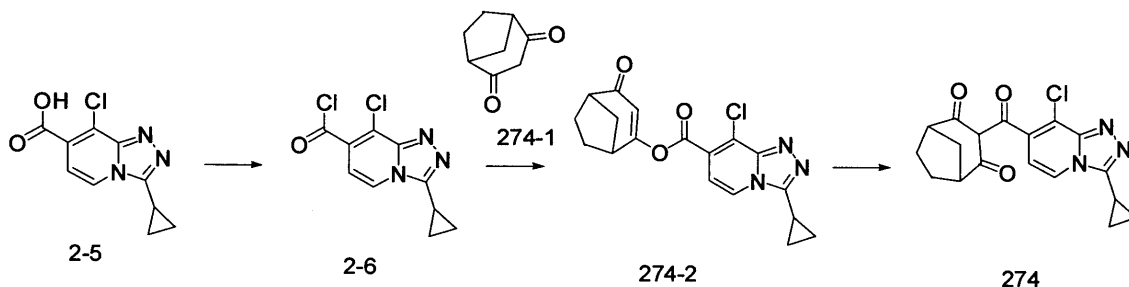
粗生成物 122-5 を 10 V のアセトニトリルに溶解し、3.0 当量のトリエチルアミンを添加し、次いで触媒量のアセトンシアノヒドリンを窒素保護下で添加し、60 で 12 時間反応させた。反応完了後、生成物とシリカゲルとを混合し、カラムクロマトグラフィーにより精製して、目的生成物 122 を 61% の収率で得た。

【0105】

9. 化合物 274 の合成

50

【化30】



10

【0106】

得られた生成物 2 - 5 および 10 V のジクロロメタンを反応器に入れ、15 の制御温度で攪拌しながら 2 . 5 当量の塩化チオニルを滴下し、次いで 40 に加熱し、1 時間反応させた。反応完了後、ジクロロメタンおよび塩化チオニルを真空下で除去し、次いで残留物を後で使用するために 3 V のジクロロメタンに溶解した。

【0107】

1 . 1 当量の 274 - 1、10 V のジクロロメタンおよび 3 . 0 当量のトリエチルアミンを反応器に入れ、次いで上記で得られたジクロロメタン溶液中の 2 - 6 を、5 の制御温度で滴下し、1 時間反応させた。反応完了後、ジクロロメタンおよびトリエチルアミンを真空下で除去して、粗生成物 274 - 2 を得た。

20

【0108】

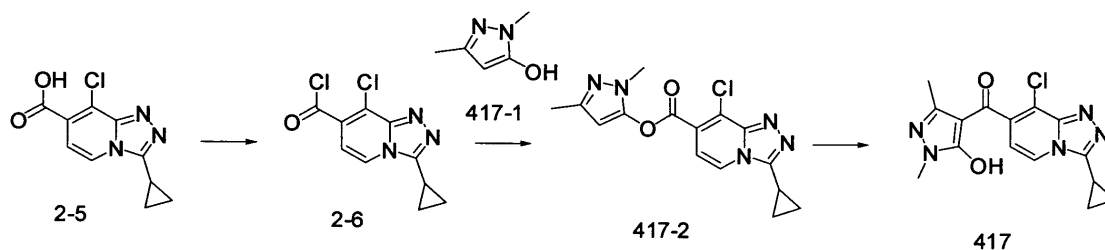
粗生成物 274 - 2 を 10 V のアセトニトリルに溶解し、1 . 2 当量のトリエチルアミンを添加し、次いで触媒量のアセトンシアノヒドリンを窒素保護下で添加し、70 で 20 時間反応させた。反応完了後、不溶性の固体を濾過により除去し、アセトニトリルを真空下で除去した。残留物を 10 容量のジクロロメタンで溶解し、次いで 5 容量の水を添加し、1 M の塩酸で pH 3 ~ 4 に調整し、次いで抽出および分離を行い、有機相を回収し；有機相に 5 容量の水を添加し、次いで飽和重炭酸ナトリウム水溶液で pH 8 に調整し、次いで抽出および分離を行い、水溶液を回収し；水相を 1 M の塩酸で pH 2 ~ 3 に調整し、次いでジクロロメタンにより抽出および分離を行い、有機相を回収した。有機相を回転蒸発に供して、生成物 274 を 78 % の収率で得た。

30

【0109】

10 . 化合物 417 の合成

【化31】



40

【0110】

得られた生成物 2 - 5 および 10 V のジクロロメタンを反応器に入れ、15 の制御温度で攪拌しながら 3 . 0 当量の塩化チオニルを滴下し、1 時間反応させた。反応完了後、ジクロロメタンおよび塩化チオニルを真空下で除去し、次いで残留物を後で使用するために 3 V のジクロロメタンに溶解した。

【0111】

原料 417 ~ 1、10 V のジクロロメタンおよび 3 . 0 当量のトリエチルアミンを反応器に入れ、次いで上記で得られたジクロロメタン溶液中の塩化アシルを 5 の制御温度で滴下し、4 時間反応させた。反応完了後、ジクロロメタンおよびトリエチルアミンを真空

50

下で除去して、粗生成物 4 1 7 - 2 を得た。

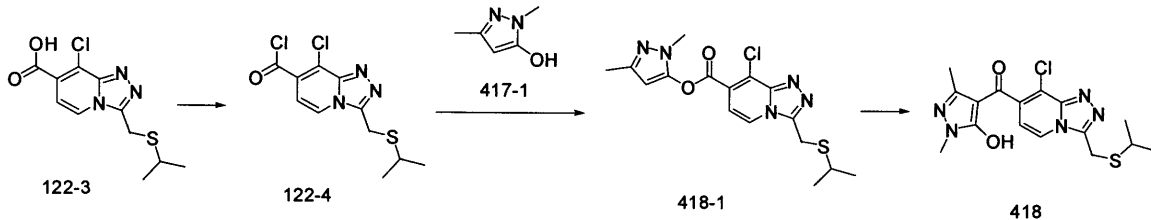
【 0 1 1 2 】

粗生成物 4 1 7 - 2 を 1 0 V のアセトニトリルに溶解し、3 . 0 当量のトリエチルアミンを添加し、次いで触媒量のアセトンシアノヒドリンを窒素保護下で添加し、5 0 で 1 5 時間反応させた。反応完了後、生成物とシリカゲルとを混合し、カラムクロマトグラフィーにより精製して、目的生成物 4 1 7 を 6 3 % の収率で得た。

【 0 1 1 3 】

1 1 . 化合物 4 1 8 の合成

【 化 3 2 】



10

【 0 1 1 4 】

得られた生成物 1 2 2 - 3 および 1 0 V のジクロロメタンを反応器に入れ、2 5 の制御温度で撹拌しながら 3 . 0 当量の塩化チオニルを滴下し、1 時間反応させた。反応完了後、ジクロロメタンおよび塩化チオニルを真空下で除去し、次いで残留物を後で使用するために 3 V のジクロロメタンに溶解した。

20

【 0 1 1 5 】

原料 4 1 7 - 1、1 0 V のジクロロメタンおよび 3 . 0 当量のトリエチルアミンを反応器に入れ、次いで上記で得られたジクロロメタン溶液中の塩化アシルを 2 5 の制御温度で滴下し、5 時間反応させた。反応完了後、ジクロロメタンおよびトリエチルアミンを真空下で除去して、粗生成物 4 1 8 - 1 を得た。

【 0 1 1 6 】

粗生成物 4 1 8 - 1 を 1 0 V のアセトニトリルに溶解し、3 . 0 当量のトリエチルアミンを添加し、次いで触媒量のアセトンシアノヒドリンを窒素保護下で添加し、3 0 で 1 5 時間反応させた。反応完了後、生成物とシリカゲルとを混合し、カラムクロマトグラフィーにより精製して、目的生成物 4 1 8 を 3 8 % の収率で得た。

30

【 0 1 1 7 】

生物活性評価：

植物の損傷に関する活性レベルの基準（すなわち生長制御率）は次のとおりである。

- レベル 5 : 生長制御率 8 5 % 超。
- レベル 4 : 生長制御率 6 0 % 以上 8 5 % 未満。
- レベル 3 : 生長制御率 4 0 % 以上 6 0 % 未満。
- レベル 2 : 生長制御率 2 0 % 以上 4 0 % 未満。
- レベル 1 : 生長制御率 5 % 以上 2 0 % 未満。
- レベル 0 : 生長制御率 5 % 未満。

40

上記生長制御率は、生体重制御率（fresh weight control rate）である。

【 0 1 1 8 】

（ 1 ）発芽後の除草効果の実験：

単子葉および双子葉の雑草および主要作物（小麦、トウモロコシ、米、大豆、綿、ナタネ、キビ、ソルガム）の種子を、土壌で満たされたプラスチックポットに入れ、0 . 5 ~ 2 c m の土壌で覆い、良好な温室環境で生長させた。播種の 2 週間後、試験植物を処理した。本発明の試験化合物をそれぞれアセトンに溶解し、次いで Tween 8 0 を添加し、特定量の水で希釈して特定濃度の溶液を得、相乗剤として 1 0 0 0 g / h a の乳化オレイン酸メチルを添加し、スプレー塔で植物に噴霧した。適用後、温室内で 3 週間栽培した

50

後の除草の実験結果を表 2 - 3 に示す。

【 0 1 1 9 】

【表 2】

発芽後の除草の結果（2～3葉段階の雑草）

化合物 番号	イヌビエ (<i>Echinochloa crusgalli</i>)	オニメヒシバ (<i>Digitaria sanguinalis</i>)	アゼガヤ (<i>Leptochloa chinensis</i>)	アオゲイトウ (<i>Amaranthus retroflexus L.</i>)	コメ (インディカ米 huanghuazhan)
2	5	5	5	5	0
41	5	5	5	5	0
43	5	5	5	5	0
45	5	5	5	5	0
68	3	4	4	3	1
69	5	4	5	5	0
70	5	5	5	5	0
83	5	5	5	5	0
87	4	4	5	5	0
88	3	3	4	3	0
114	5	5	5	5	0
115	5	5	5	5	0
118	5	5	5	5	0
133	4	4	5	5	0
263	5	5	5	5	1
264	4	5	4	4	N
265	3	N	3	3	0
271	5	5	5	5	1
274	5	5	5	5	0
297	N	N	N	3	0
305	3	3	3	4	0
317	N	N	3	N	0
622	3	N	5	4	1
628	3	3	N	3	1
630	N	N	N	3	0
632	3	N	N	3	0
638	4	5	3	N	0
643	N	N	N	3	1
647	3	3	3	4	1

10

20

30

40

50

652	3	3	4	N	0
669	N	N	N	3	0
671	N	N	3	3	0
700	N	3	3	3	0
701	4	4	5	4	N
702	3	4	5	3	1
703	3	N	N	3	0
707	3	N	3	N	0
708	3	3	5	N	0
711	N	N	3	N	0
712	3	N	5	4	0
721	3	3	3	3	1
724	3	N	3	N	0
725	N	N	N	3	1
727	N	N	4	N	0
731	N	N	N	3	0
741	4	3	5	3	N
743	N	N	N	3	0
745	4	3	N	4	0
746	3	3	N	3	0
749	3	3	3	3	1
750	3	5	4	N	0
751	4	5	4	4	0
752	3	4	4	4	1
753	4	5	4	3	0
754	N	N	N	3	0
755	3	N	N	3	0
756	4	4	5	3	1
760	3	4	3	4	0
761	3	4	N	4	0
764	N	3	N	3	1
765	4	5	4	3	0
767	3	N	N	N	0
768	4	5	5	3	0
771	N	N	N	3	1

10

20

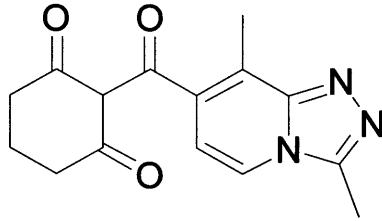
30

40

776	N	N	N	3	0
789	3	N	N	3	0
791	3	3	3	3	0
对照 化合物 A	3	N	N	N	2

50

【化 3 3】



対照化合物 A :

【 0 1 2 0 】

10

【表 3】

発芽後の除草効果の結果

化合物 番号	イヌビエ (<i>Echinochloa crusgalli</i>)	オニヒメシバ (<i>Digitaria sanguinalis</i>)	アゼガヤ (<i>Leptochloa chinensis</i>)	エノコログサ (<i>Setaria viridis</i>)	インディカ米	ジャポニカ米	用量
2	5	5	5	5	0	0	120 g/ha
2	5	5	5	5	0	0	60 g/ha
2	5	5	5	5	0	0	30 g/ha
274	5	5	5	5	0	0	120 g/ha
274	5	5	5	5	0	0	60 g/ha
274	5	5	5	5	0	0	30 g/ha

20

【 0 1 2 1 】

さらに、上記の特許出願 WO 2 0 0 8 0 0 6 5 4 0 A 1 には多くの特定の構造が記載されているが、ピリジン窒素のメタ位にケトンを有し、ケトンのパラ位にトリフルオロメチルを有する化合物についてのみ、より優れた有効性データが得られており；さらに、ピリジン窒素のパラ位にケトンを有する構造も少数記載されているが、それらの核磁気データおよび活性データのいずれも開示されていない。しかしながら、本発明者らは、置換ピリジン窒素のパラ位にケトンを有する本発明の化合物が、特に当技術分野で開示されている化合物および市販されている H P P D 除草剤と比較して、イネおよび他の作物に対して良好な除草活性および良好な選択性を示すことを予期せず発見した。

30

【 0 1 2 2 】

発芽前段階での除草効果に関する実験：

単子葉および双子葉の雑草ならびに主要作物（例えば、小麦、トウモロコシ、米、大豆、綿、ナタネ、キビ、ソルガム）の種子を、土壌を入れたプラスチックポットに入れ、0.5 ~ 2 cm の土で覆った。本発明の試験化合物をアセトンに溶解し、次に Tween 80 を添加し、特定量の水で希釈して特定濃度にし、播種直後に噴霧した。噴霧後、得られた種子を温室内で 4 週間インキュベートし、試験結果を観察した。除草剤は、特にイヌビエ (*Echinochloa crusgalli*)、オニヒメシバ (*Digitaria sanguinalis*)、アゼガヤ (*Leptochloa chinensis*) およびイチビ (*Abutilon theophrasti*) 等の雑草に対して、250 g a i / h a の適用量で主に優れた効果を発揮することが観察された。また、多くの化合物が、トウモロコシ、米、大豆およびナタネ等に対して良好な選択性を有していた。特に、本発明の化合物 2 および化合物 274 は、コメの直接播種に対して安全かつ効果的であり、イヌビエ (*Echinochloa crusgalli*)、アゼガヤ (*Leptochloa chinensis*)、オニヒメシバ (*Digitaria sanguinalis*) およびイチビ (*Abutilon theophrasti*) に対して優れたシール効果 (sealing effect) を有していた。

40

【 0 1 2 3 】

この実験から、本発明の化合物は、特に、トウモロコシ、米および小麦の畑において広く見られ、かつ商業的価値に優れるイヌビエ (*Echinochloa crusgalli*)、オニヒメシバ

50

(*Digitaria sanguinalis*) およびエノコログサ (*Setaria viridis*) のような主要なイヌガラシ雑草、およびイチビのような主要なカヤツリグサ科 (*Cyperaceae*) の雑草、ならびにイチビ (*Abutilon theophrasti*)、イヌガラシ (*Rorippa indica*) およびコセンダングサ (*Bidens pilosa* L.) 等のような主要な広葉雑草に対して、一般に良好な雑草防除効果を有することが示唆される。とりわけ、イヌガラシ (*Rorippa indica*)、クジラグサ (*Descurainia sophia*)、ナズナ (*Capsella bursa-pastoris*)、イヌムラサキ (*Lithospermum arvense*)、ヤエムグラ (*Galium aparine* L.)、コハコベ (*Stellaria media*) 等のような、ALS 阻害剤に耐性を有する広葉雑草に対して非常に高い活性を示すことが注目される。

【0124】

田んぼにおける移植イネの安全性評価および雑草防除効果の評価：

田んぼの土壌を 1 / 1 , 0 0 0 , 0 0 0 ヘクタールのポットに入れた。イヌビエ (*Echinochloa crusgalli*)、ホタルイ (*Scirpus juncooides*) およびタウコギ (*Bidens tripartita* L.) の種子を播種し、穏やかに土壌で覆い、次いで 0 . 5 ~ 1 c m の貯水状態で温室内に静置した。オモダカ (*Sagittaria trifolia*) の塊茎を翌日または 2 日後に植えた。その後は 3 ~ 4 c m の貯水量で維持した。本発明の化合物の一般的な調製方法に従って調製された WP または SC 水希釈物をピペットで均一に滴下して、イヌビエ (*Echinochloa crusgalli*)、ホタルイ (*Scirpus juncooides*) およびタウコギ (*Bidens tripartita* L.) が 0 . 5 葉期に達した時、またオモダカ (*Sagittaria trifolia*) が一次葉期の時点に達した時に、指定された有効量が達成されるように雑草を処理した。

【0125】

また、1 / 1 , 0 0 0 , 0 0 0 ヘクタールのポットにいれた田んぼの土壌を、3 ~ 4 c m の深さで貯水を維持するために平らにした。翌日、移植深さ 3 c m で 3 葉期のイネ (ジャポニカ米) を移植した。本発明の化合物を、移植 5 日後に同じ方法で処理した。

【0126】

本発明の化合物による処理の 1 4 日後におけるイヌビエ (*Echinochloa crusgalli*)、ホタルイ (*Scirpus juncooides*)、タウコギ (*Bidens tripartita* L.) およびオモダカ (*Sagittaria trifolia*) の生殖状態、および本発明の化合物による処理の 2 1 日後におけるイネの生殖状態をそれぞれ肉眼で観察した。上記の活性基準レベル 1 ~ 5 で雑草防除効果を評価した。多くの化合物は優れた活性および選択性を示した。

【0127】

注：イヌビエ (*Echinochloa crusgalli*)、ホタルイ (*Scirpus juncooides*)、オモダカ (*Sagittaria trifolia*) およびタウコギ (*Bidens tripartita* L.) の種子は、中国の黒竜江省から収集された。試験により、雑草がピラゾスルフロンエチルの一般的な用量に耐性を有することが示された。

【0128】

この実験から、本発明の化合物は、生産において深刻な課題である抗 ALS 雑草に対して優れた活性を有し、ますます深刻になる耐性の問題を解決することができる。分かる。

【0129】

同時に、いくつかの試験の結果、本発明の化合物は、シバ (*zoysia japonica*)、ギョウギシバ (*bermuda grass*)、ヒロハノウシノケグサ (*tall fescue*)、イチゴツナギ (*b luegrass*)、ライグラス (*ryegrass*) およびサワスズメノヒエ (*seashore paspalum*) 等の多くのイネ科草に対して良好な選択性を有し、多くの主要な草の雑草および広葉雑草を防除できることが見出された。これらの化合物は、さまざまな除草剤の散布方法でのサトウキビ、大豆、綿実、油ヒマワリ、ジャガイモ、果樹園および野菜の試験においても優れた選択性と商業的価値を示した。

10

20

30

40

50

フロントページの続き

- 弁理士 中村 行孝
 (74)代理人 100120031
 弁理士 宮嶋 学
 (74)代理人 100120617
 弁理士 浅野 真理
 (74)代理人 100126099
 弁理士 反町 洋
 (72)発明者 リエン、レイ
 中華人民共和国シャントン、チンタオ、ファンタオ、ディストリクト、チンロンへ、ロード、ナンバー 53
 (72)発明者 ボン、シュエカン
 中華人民共和国シャントン、チンタオ、ファンタオ、ディストリクト、チンロンへ、ロード、ナンバー 53
 (72)発明者 ホア、ロンバオ
 中華人民共和国シャントン、チンタオ、ファンタオ、ディストリクト、チンロンへ、ロード、ナンバー 53
 (72)発明者 チャオ、トー
 中華人民共和国シャントン、チンタオ、ファンタオ、ディストリクト、チンロンへ、ロード、ナンバー 53
 (72)発明者 ツイ、チー
 中華人民共和国シャントン、チンタオ、ファンタオ、ディストリクト、チンロンへ、ロード、ナンバー 53
 審査官 谷尾 忍
 (56)参考文献 国際公開第 2008/006540 (WO, A1)
 中国特許出願公開第 102870791 (CN, A)
 特開平 04 - 234881 (JP, A)
 特表 2002 - 544132 (JP, A)
 特開 2000 - 178268 (JP, A)
 国際公開第 2009/016841 (WO, A1)
 特表 2002 - 524554 (JP, A)
 (58)調査した分野 (Int.Cl., DB名)
 C07D 471/04
 A01N 43/90
 A01P 13/00
 A01P 13/02
 A01N 53/14
 Caplus/REGISTRY (STN)