

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 公表特許公報(A)

(11) 特許出願公表番号

特表2020-507579  
(P2020-507579A)

(43) 公表日 令和2年3月12日(2020.3.12)

(51) Int.Cl.	F I	テーマコード (参考)
AO1N 43/653 (2006.01)	AO1N 43/653	2B051
AO1N 47/02 (2006.01)	AO1N 47/02	4H011
AO1P 3/00 (2006.01)	AO1P 3/00	
AO1N 43/30 (2006.01)	AO1N 43/30	
AO1N 47/32 (2006.01)	AO1N 47/32	

審査請求 未請求 予備審査請求 未請求 (全 215 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号 特願2019-543307 (P2019-543307)  
 (86) (22) 出願日 平成30年1月26日 (2018.1.26)  
 (85) 翻訳文提出日 令和1年10月8日 (2019.10.8)  
 (86) 国際出願番号 PCT/EP2018/051932  
 (87) 国際公開番号 W02018/145921  
 (87) 国際公開日 平成30年8月16日 (2018.8.16)  
 (31) 優先権主張番号 17155515.4  
 (32) 優先日 平成29年2月10日 (2017.2.10)  
 (33) 優先権主張国・地域又は機関 欧州特許庁 (EP)

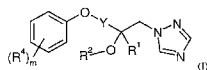
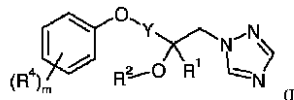
(71) 出願人 591063187  
 バイエル アクチェンゲゼルシャフト  
 Bayer Aktiengesellschaft  
 ドイツ・51373・レーバークーゼン・  
 カイザー・ヴィルヘルム・アレー・1  
 (71) 出願人 507203353  
 バイエル・クロップサイエンス・アクチエ  
 ンゲゼルシャフト  
 ドイツ国、40789・モンハイム・アム  
 ・ライン、アルフレート・ノベル・シエト  
 ラーセ・50  
 (74) 代理人 100108453  
 弁理士 村山 靖彦

最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 1 - (フェノキシ・ピリジニル) - 2 - (1, 2, 4-トリアゾール-1-イル) - エタノール誘導体を含む有害微生物を制御するための組成物

(57) 【要約】

本発明は、少なくとも1種の請求項1に定義される式 (1) のトリアゾール誘導体



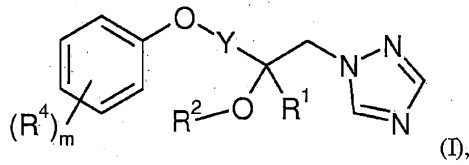
ならびに少なくとも1種のさらなる殺真菌剤を含む活性化合物の組合せ、このような化合物組合せを含む組成物、ならびに特に作物保護および材料の保護において有害微生物を制御するための生物活性剤としておよび植物成長調節剤としてのその使用に関する。

## 【特許請求の範囲】

## 【請求項 1】

(A) 少なくとも1種の式(1)のトリアゾール誘導体

## 【化 1】



10

(式中、

$R^1$ は、水素、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_2 \sim C_6$ -アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ -アルキニル、 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル- $C_1 \sim C_4$ -アルキル、フェニル、フェニル- $C_1 \sim C_4$ -アルキル、フェニル- $C_2 \sim C_4$ -アルケニルまたはフェニル- $C_2 \sim C_4$ -アルキニルを表し；

$R^2$ は、水素、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_2 \sim C_6$ -アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ -アルキニル、 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル- $C_1 \sim C_4$ -アルキル、フェニル、フェニル- $C_1 \sim C_4$ -アルキル、フェニル- $C_2 \sim C_4$ -アルケニルまたはフェニル- $C_2 \sim C_4$ -アルキニルを表し、

20

$R^1$ および/または $R^2$ のシクロアルキル部分を除く脂肪族部分は、互いに独立に、ハロゲン、CN、ニトロ、フェニル、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシおよび $C_1 \sim C_4$ -ハロゲンアルコキシから選択される1、2、3または最大可能数までの同一のまたは異なる基 $R^a$ を有していてもよく、前記フェニルは、ハロゲン、CN、ニトロ、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ -ハロゲンアルキル、 $C_1 \sim C_4$ -ハロゲンアルコキシから選択される1、2、3、4または5個の置換基によって置換されていてもよく、

$R^1$ および/または $R^2$ のシクロアルキルおよび/またはフェニル部分は、互いに独立にハロゲン、CN、ニトロ、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ -ハロゲンアルキルおよび $C_1 \sim C_4$ -ハロゲンアルコキシから選択される1、2、3、4、5または最大数までの同一のまたは異なる基 $R^b$ を有していてもよく；

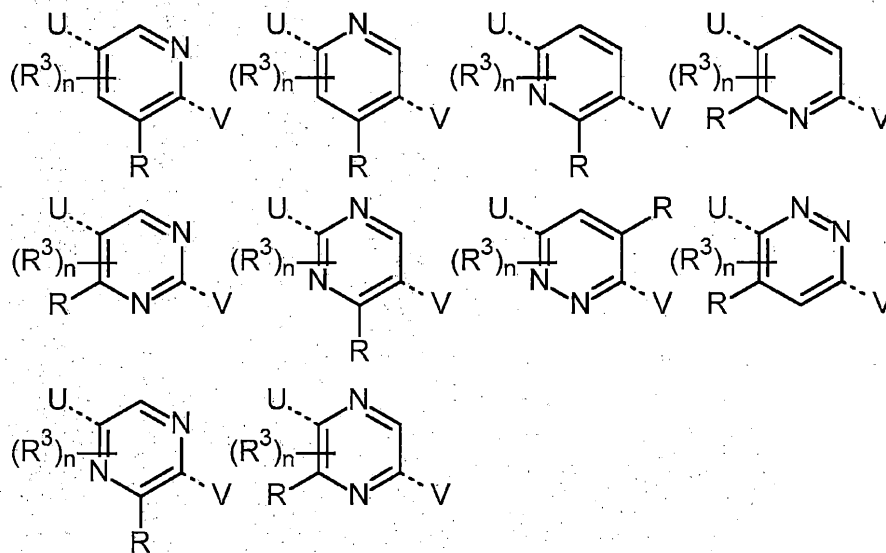
30

各 $R^4$ は、互いに独立に、ハロゲン、CN、ニトロ、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_1 \sim C_4$ -ハロゲンアルキル、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ -ハロゲンアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ -アルキルカルボニル、ヒドロキシ置換 $C_1 \sim C_4$ -アルキルまたはペンタフルオロ-<sup>6</sup>-スルファニルを表し；

$m$ は、整数であり、0、1、2、3、4または5であり；

Yは、

## 【化2】



10

から選択される、1個または複数のヘテロ原子として1個または2個の窒素原子を含有する6員芳香族複素環を表し、

20

Yは、「U」で識別される結合を介して式(1)のOに結合しており、Yは、「V」で識別される結合を介して式(1)の $CR^1$  ( $OR^2$ ) 部分に結合しており、

Rは、水素、 $C_1 \sim C_2$ -ハロゲンアルキル、 $C_1 \sim C_2$ -ハロゲンアルコキシ、 $C_1 \sim C_2$ -アルキルカルボニルまたはハロゲンを表し；

各 $R^3$ は、互いに独立に、ハロゲン、CN、ニトロ、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_1 \sim C_4$ -ハロゲンアルキル、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシまたは $C_1 \sim C_4$ -ハロゲンアルコキシを表し；

nは、整数であり、0、1または2である)

またはその塩もしくはN-オキドと、

(B) 少なくとも1種の以下の群から選択されるさらなる活性化合物

- (1) エルゴステロール合成の阻害剤、
- (2) 複合体IまたはIIにおける呼吸鎖の阻害剤、
- (3) 複合体IIIにおける呼吸鎖の阻害剤、
- (4) 有糸分裂および細胞分裂の阻害剤、
- (5) 多部位作用を有することができる化合物、
- (6) 宿主防御を誘導することができる化合物、
- (7) アミノ酸および/またはタンパク質生合成の阻害剤、
- (8) ATP産生の阻害剤、
- (9) 細胞壁合成の阻害剤、
- (10) 脂質および膜合成の阻害剤、
- (11) メラニン生合成の阻害剤、
- (12) 核酸合成の阻害剤、
- (13) シグナル伝達の阻害剤、
- (14) 脱共役剤として作用することができる化合物、
- (15) 他の殺真菌剤

30

40

とを含む、活性化合物の組合せ。

## 【請求項2】

前記式(1)のトリアゾール誘導体が、

各 $R^4$ が、互いに独立に、ハロゲン、CN、ニトロ、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_1 \sim C_4$ -ハロゲンアルキル、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ -ハロゲンアルコキシもしくはペンタフルオロ-6-スルファニルを表す；

50

および/または

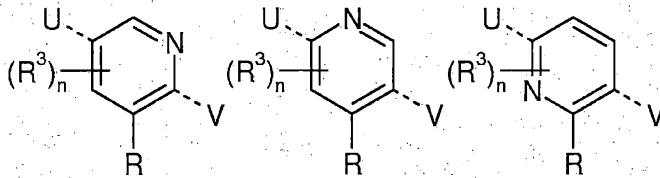
Rが、水素、 $C_1 \sim C_2$ -ハロゲンアルキルもしくはハロゲンを表す、  
式(1)のトリアゾール誘導体またはその塩もしくはN-オキシドである、請求項1に記載  
の活性化合物の組合せ。

【請求項3】

前記式(1)のトリアゾール誘導体が、

Yが、

【化3】



10

から選択される、1個または複数のヘテロ原子として1個または2個の窒素原子を含有する6  
員芳香族複素環を表し、

Yが、「U」で識別される結合を介して式(1)のOに結合しており、Yが、「V」で識別  
される結合を介して式(1)の $CR^1$  ( $OR^2$ ) 部分に結合しており、

R、 $R^3$ およびnが、請求項1により定義される、

20

式(1)のトリアゾール誘導体またはその塩もしくはN-オキシドである、請求項1に記載  
の活性化合物の組合せ。

【請求項4】

前記式(1)のトリアゾール誘導体が、

$R^1$ が、水素、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_2 \sim C_6$ -アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ -アルキニル、シクロプ  
ロピル、フェニル、ベンジル、フェニルエチニルまたはフェニルエチニルを表し；

$R^2$ が、水素、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、アリル、プロパルギルまたはベンジルを表し；

$R^1$ および/または $R^2$ のシクロアルキル部分を除く脂肪族部分が、互いに独立に、ハロ  
ゲン、CN、ニトロ、フェニル、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシおよび $C_1 \sim C_4$ -ハロゲンアルコキシか  
ら選択される1、2、3または最大可能数までの同一のまたは異なる基 $R^a$ を有していてもよ  
く、前記フェニルが、互いに独立に、ハロゲン；CN；ニトロ； $C_1 \sim C_4$ -アルキル； $C_1 \sim C_4$ -  
アルコキシ； $C_1 \sim C_4$ -ハロゲンアルキル； $C_1 \sim C_4$ -ハロゲンアルコキシから選択される  
1、2、3、4または5個の置換基によって置換されていてもよく；

30

$R^1$ および/または $R^2$ のシクロアルキルおよび/またはフェニル部分が、互いに独立に  
、ハロゲン、CN、ニトロ、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ -ハロゲンア  
ルキルおよび $C_1 \sim C_4$ -ハロゲンアルコキシから選択される1、2、3、4、5または最大数ま  
での同一のまたは異なる基 $R^b$ を有していてもよく；

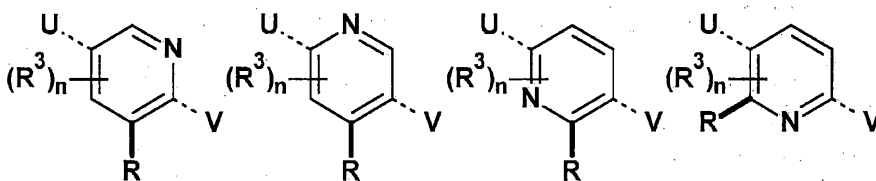
各 $R^4$ が、互いに独立に、 $CF_3$ 、 $OCF_3$ 、Br、Clまたはペンタフルオロ-<sup>6</sup>-スルファニル  
を表し；

mが、1、2または3であり；

40

Yが、

【化4】



を表し、

50

Yが、「U」で識別される結合を介して式(1)のOに結合しており、Yが、「V」で識別される結合を介して式(1)のCR<sup>1</sup>(OR<sup>2</sup>)部分に結合しており、

R、R<sup>3</sup>およびnが、請求項1により定義される、

式(1)のトリアゾール誘導体またはその塩もしくはN-オキシドである、請求項1または2の少なくとも一項に記載の活性化合物の組合せ。

【請求項5】

前記式(1)のトリアゾール誘導体が、

R<sup>1</sup>が、水素、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>-アルキルまたはシクロプロピルを表し；

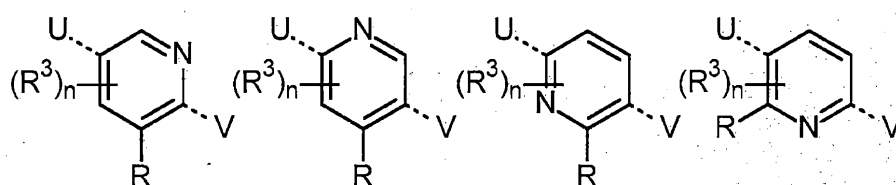
R<sup>2</sup>が、水素を表し；

R<sup>4</sup>が、CF<sub>3</sub>、OCF<sub>3</sub>、Br、Clまたはペンタフルオロ-6-スルファニルを表し；

mが、1であり；

Yが、

【化5】



10

20

を表し、

Yが、「U」で識別される結合を介して式(1)のOに結合しており、Yが、「V」で識別される結合を介して式(1)のCR<sup>1</sup>(OR<sup>2</sup>)部分に結合しており、

Rが、C<sub>1</sub>-ハロゲンアルキルを表し；

nが、0である、

式(1)のトリアゾール誘導体またはその塩もしくはN-オキシドである、請求項1または2の少なくとも一項に記載の活性化合物の組合せ。

【請求項6】

前記式(1)のトリアゾール誘導体が、

R<sup>4</sup>が、式(1)のフェニル部分の4位のClまたはBrを表す、

30

式(1)のトリアゾール誘導体またはその塩もしくはN-オキシドである、請求項1から5の少なくとも一項に記載の活性化合物の組合せ。

【請求項7】

前記式(1)のトリアゾール誘導体が、(1.01)2-[6-(4-クロロフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル]-1-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)プロパン-2-オール、(1.59)2-[6-(4-プロモフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル]-1-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)プロパン-2-オール、(1.81)1-[6-(4-プロモフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル]-1-シクロプロピル-2-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)エタノールおよび(1.91)1-[6-(4-クロロフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル]-1-シクロプロピル-2-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)エタノールからなる群から選択される、請求項1から6の少なくとも一項に記載の活性化合物の組合せ。

40

【請求項8】

前記さらなる活性化合物が、(1.001)シプロコナゾール、(1.002)ジフェノコナゾール、(1.003)エポキシコナゾール、(1.004)フェンヘキサミド、(1.005)フェンプロピジン、(1.006)フェンプロピモルフ、(1.007)フェンピラザミン、(1.008)フルキンコナゾール、(1.009)フルトリアホル、(1.010)イマザリル、(1.011)硫酸イマザリル、(1.012)イブコナゾール、(1.013)メトコナゾール、(1.014)ミクロブタニル、(1.015)パクロブトラゾール、(1.016)プロクロラズ、(1.017)プロ

50

ピコナゾール、(1.018) プロチオコナゾール、(1.019) ピリソキサゾール、(1.020)  
 )スピロキサミン、(1.021) テブコナゾール、(1.022) テトラコナゾール、(1.023)  
 ) トリアジメノール、(1.024) トリデモルフ、(1.025) トリチコナゾール、(1.026)  
 ) (1R, 2S, 5S) - 5 - (4 - クロロベンジル) - 2 - (クロロメチル) - 2 - メチル - 1 -  
 (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イルメチル) シクロペンタノール、(1.027) (1S,  
 2R, 5R) - 5 - (4 - クロロベンジル) - 2 - (クロロメチル) - 2 - メチル - 1 - (1H - 1,  
 2, 4 - トリアゾール - 1 - イルメチル) シクロペンタノール、(1.028) (2R) - 2 - (1  
 - クロロシクロプロピル) - 4 - [(1R) - 2, 2 - ジクロロシクロプロピル] - 1 - (1H -  
 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) ブタン - 2 - オール、(1.029) (2R) - 2 - (1 - ク  
 ロロシクロプロピル) - 4 - [(1S) - 2, 2 - ジクロロシクロプロピル] - 1 - (1H - 1, 2  
 , 4 - トリアゾール - 1 - イル) ブタン - 2 - オール、(1.030) (2R) - 2 - [4 - (4 - ク  
 ロロフェノキシ) - 2] - (トリフルオロメチル) フェニル] - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリ  
 アゾール - 1 - イル) プロパン - 2 - オール、(1.031) (2S) - 2 - (1 - クロロシクロプロ  
 ピル) - 4 - [(1R) - 2, 2 - ジクロロシクロプロピル] - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリア  
 ザール - 1 - イル) ブタン - 2 - オール、(1.032) (2S) - 2 - (1 - クロロシクロプロピ  
 ル) - 4 - [(1S) - 2, 2 - ジクロロシクロプロピル] - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾ  
 ール - 1 - イル) ブタン - 2 - オール、(1.033) (2S) - 2 - [4 - (4 - クロロフェノキシ  
 )] - 2 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 -  
 イル) プロパン - 2 - オール、(1.034) (R) - [3 - (4 - クロロ - 2 - フルオロフェニ  
 ル) - 5 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) - 1, 2 - オキサゾール - 4 - イル] (ピリジン -  
 3 - イル) メタノール、(1.035) (S) - [3 - (4 - クロロ - 2 - フルオロフェニル) - 5  
 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) - 1, 2 - オキサゾール - 4 - イル] (ピリジン - 3 - イル)  
 ) メタノール、(1.036) [3 - (4 - クロロ - 2 - フルオロフェニル) - 5 - (2, 4 - ジフ  
 ルオロフェニル) - 1, 2 - オキサゾール - 4 - イル] (ピリジン - 3 - イル) メタノール、  
 (1.037) 1 - ( { (2R, 4S) - 2 - [2 - クロロ - 4 - (4 - クロロフェノキシ) フェニル  
 ] - 4 - メチル - 1, 3 - ジオキサラン - 2 - イル } メチル) - 1H - 1, 2, 4 - トリアゾ  
 ール、(1.038) 1 - ( { (2S, 4S) - 2 - [2 - クロロ - 4 - (4 - クロロフェノキシ) フェ  
 ニル] - 4 - メチル - 1, 3 - ジオキサラン - 2 - イル } メチル) - 1H - 1, 2, 4 - トリア  
 ザール、(1.039) 1 - { [3 - (2 - クロロフェニル) - 2 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) オ  
 キシラン - 2 - イル] メチル } - 1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 5 - イルチオシアネート、  
 (1.040) 1 - { [rel (2R, 3R) - 3 - (2 - クロロフェニル) - 2 - (2, 4 - ジフルオロ  
 フェニル) オキシラン - 2 - イル] メチル } - 1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 5 - イルチ  
 オシアネート、(1.041) 1 - { [rel (2R, 3S) - 3 - (2 - クロロフェニル) - 2 - (2, 4  
 - ジフルオロフェニル) オキシラン - 2 - イル] メチル } - 1H - 1, 2, 4 - トリアゾ  
 ール - 5 - イルチオシアネート、(1.042) 2 - [(2R, 4R, 5R) - 1 - (2, 4 - ジクロロフェ  
 ニル) - 5 - ヒドロキシ - 2, 6, 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2, 4 - ジヒドロ - 3H  
 - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1.043) 2 - [(2R, 4R, 5S) - 1 - (2, 4 - ジ  
 クロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2, 6, 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2, 4 -  
 ジヒドロ - 3H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1.044) 2 - [(2R, 4S, 5R) - 1  
 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2, 6, 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イ  
 ル] - 2, 4 - ジヒドロ - 3H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1.045) 2 - [(2R  
 , 4S, 5S) - 1 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2, 6, 6 - トリメチル  
 ヘ  
 プタン - 4 - イル] - 2, 4 - ジヒドロ - 3H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1.04  
 6) 2 - [(2S, 4R, 5R) - 1 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2, 6, 6 -  
 トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2, 4 - ジヒドロ - 3H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チ  
 オン、(1.047) 2 - [(2S, 4R, 5S) - 1 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキ  
 シ - 2, 6, 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2, 4 - ジヒドロ - 3H - 1, 2, 4 - トリ  
 ア  
 ザール - 3 - チオン、(1.048) 2 - [(2S, 4S, 5R) - 1 - (2, 4 - ジクロロフェニル)  
 - 5 - ヒドロキシ - 2, 6, 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2, 4 - ジヒドロ - 3H - 1,  
 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1.049) 2 - [(2S, 4S, 5S) - 1 - (2, 4 - ジクロ

ロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2, 6, 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2, 4 - ジヒ  
 ドロ - 3H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1.050) 2 - [1 - (2, 4 - ジクロロフ  
 エニル) - 5 - ヒドロキシ - 2, 6, 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2, 4 - ジヒドロ  
 - 3H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1.051) 2 - [2 - クロロ - 4 - (2, 4 - ジ  
 クロロフェノキシ)フェニル] - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル)プロパン  
 - 2 - オール、(1.052) 2 - [2 - クロロ - 4 - (4 - クロロフェノキシ)フェニル] - 1 -  
 (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル)ブタン - 2 - オール、(1.053) 2 - [4 - (4 -  
 クロロフェノキシ) - 2 - (トリフルオロメチル)フェニル] - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリ  
 アゾール - 1 - イル)ブタン - 2 - オール、(1.054) 2 - [4 - (4 - クロロフェノキシ)  
 - 2 - (トリフルオロメチル)フェニル] - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) 10  
 ペンタン - 2 - オール、(1.055) 2 - [4 - (4 - クロロフェノキシ) - 2 - (トリフルオ  
 ロメチル)]フェニル] - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル)プロパン - 2 - オ  
 ール、(1.056) 2 - { [3 - (2 - クロロフェニル) - 2 - (2, 4 - ジフルオロフェニル)  
 オキシラン - 2 - イル]メチル} - 2, 4 - ジヒドロ - 3H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チ  
 オン、(1.057) 2 - { [rel (2R, 3R) - 3 - (2 - クロロフェニル)] - 2 - (2, 4 - ジ  
 フルオロフェニル)オキシラン - 2 - イル]メチル} - 2, 4 - ジヒドロ - 3H - 1, 2, 4 - ト  
 リアゾール - 3 - チオン、(1.058) 2 - { [rel (2R, 3S) - 3 - (2 - クロロフェニル)  
 - 2 - (2, 4 - ジフルオロフェニル)オキシラン - 2 - イル]メチル} - 2, 4 - ジヒドロ -  
 3H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1.059) 5 - (4 - クロロベンジル) - 2 - (ク  
 クロロメチル) - 2 - メチル - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イルメチル)シクロ  
 ペンタノール、(1.060) 5 - (アリルスルファニル) - 1 - { [3 - (2 - クロロフェニル)  
 ) - 2 - (2, 4 - ジフルオロフェニル)オキシラン - 2 - イル]メチル} - 1H - 1, 2, 4 -  
 トリアゾール、(1.061) 5 - (アリルスルファニル) - 1 - { [rel (2R, 3R) - 3 - (2  
 - クロロフェニル) - 2 - (2, 4 - ジフルオロフェニル)オキシラン - 2 - イル]メチル}  
 - 1H - 1, 2, 4 - トリアゾール、(1.062) 5 - (アリルスルファニル) - 1 - { [rel (2R  
 , 3S) - 3 - (2 - クロロフェニル) - 2 - (2, 4 - ジフルオロフェニル)オキシラン - 2 -  
 イル]メチル} - 1H - 1, 2, 4 - トリアゾール、(1.063) N' - (2, 5 - ジメチル - 4 -  
 { [3 - (1, 1, 2, 2 - テトラフルオロエトキシ)フェニル]スルファニル}フェニル)  
 - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、(1.064) N' - (2, 5 - ジメチル - 4 - {  
 [3 - (2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ)フェニル]スルファニル}フェニル) - N - エ  
 チル - N - メチルイミドホルムアミド、(1.065) N' - (2, 5 - ジメチル - 4 - { [3 - (2,  
 2, 3, 3 - テトラフルオロプロポキシ)フェニル]スルファニル}フェニル) - N - エ  
 チル - N - メチルイミドホルムアミド、(1.066) N' - (2, 5 - ジメチル - 4 - { [3 - (2,  
 2, 3, 3 - テトラフルオロエトキシ)フェニル]スルファニル}フェニル) - N - エチル - N -  
 メチル  
 イミドホルムアミド、(1.067) N' - (2, 5 - ジメチル - 4 - {3 - [(1, 1, 2, 2 - テ  
 トラフルオロエチル)スルファニル]フェノキシ}フェニル) - N - エチル - N - メチルイ  
 ミドホルムアミド、(1.068) N' - (2, 5 - ジメチル - 4 - {3 - [(2, 2, 2 - トリフル  
 オロエチル)スルファニル]フェノキシ}フェニル) - N - エチル - N - メチルイミドホル  
 ムアミド、(1.069) N' - (2, 5 - ジメチル - 4 - {3 - [(2, 2, 3, 3 - テトラフルオ  
 ロプロピル)スルファニル]フェノキシ}フェニル) - N - エチル - N - メチルイミドホル  
 ムアミド、  
 (1.070) N' - (2, 5 - ジメチル - 4 - {3 - [(ペンタフルオロエチル)スルファニル  
 ]フェノキシ}フェニル) - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、(1.071) N'  
 - (2, 5 - ジメチル - 4 - フェノキシフェニル) - N - エチル - N - メチルイミドホルムア  
 ミド、(1.072) N' - (4 - { [3 - (ジフルオロメトキシ)フェニル]スルファニル}  
 - 2, 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、(1.073) N'  
 - (4 - {3 - [(ジフルオロメチル)スルファニル]フェノキシ} - 2, 5 - ジメチルフェ  
 ニル) - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、(1.074) N' - [5 - プロモ - 6  
 - (2, 3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 2 - イルオキシ) - 2 - メチルピリジン - 3 - イル]  
 - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、(1.075) N' - {4 - [(4, 5 - ジクロロ  
 40 50

- 1, 3 - チアゾール - 2 - イル) オキシ] - 2, 5 - ジメチルフェニル} - N - エチル - N -  
 メチルイミドホルムアミド、(1.076)N' - {5 - プロモ - 6 - [(1R) - 1 - (3, 5 - ジ  
 フルオロフェニル) エトキシ] - 2 - メチルピリジン - 3 - イル} - N - エチル - N - メチル  
 イミドホルムアミド、(1.077)N' - {5 - プロモ - 6 - [(1S) - 1 - (3, 5 - ジフルオ  
 ロフェニル) エトキシ] - 2 - メチルピリジン - 3 - イル} - N - エチル - N - メチルイミド  
 ホルムアミド、(1.078)N' - {5 - プロモ - 6 - [(シス - 4 - イソプロピルシクロヘキ  
 シル) オキシ] - 2 - メチルピリジン - 3 - イル} - N - エチル - N - メチルイミドホルムア  
 ミド、(1.079)N' - {5 - プロモ - 6 - [(トランス - 4 - イソプロピルシクロヘキシル  
 ) オキシ] - 2 - メチルピリジン - 3 - イル} - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド  
 、(1.080)N' - {5 - プロモ - 6 - [1 - (3, 5 - ジフルオロフェニル)] エトキシ] - 10  
 2 - メチルピリジン - 3 - イル} - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、(1.081)  
 メフェントリフルコナゾール、(1.082)イブフェントリフルコナゾール、(2.001)ベ  
 ンゾピンジフルピル、(2.002)ピキサフェン、(2.003)ボスカリド、(2.004)カル  
 ボキシム、(2.005)フルオピラム、(2.006)フルトラニル、(2.007)フルキサピロ  
 キサド、(2.008)フラメトピル、(2.009)イソフェタミド、(2.010)イソピラザム  
 (アンチエピマー - エナンチオマー - 1R, 4S, 9S)、(2.011)イソピラザム (アンチエピマ  
 - エナンチオマー - 1S, 4R, 9R)、(2.012)イソピラザム (アンチエピマー - ラセミ体1RS  
 , 4SR, 9SR)、(2.013)イソピラザム (シンエピマー - ラセミ体1RS, 4SR, 9RSとアンチ  
 エピマー - ラセミ体1RS, 4SR, 9SRの混合物)、(2.014)イソピラザム (シンエピマー - エ  
 ナンチオマー - 1R, 4S, 9R)、(2.015)イソピラザム (シンエピマー - エナンチオマー - 1S,  
 4R, 9S)、(2.016)イソピラザム (シンエピマー - ラセミ体1RS, 4SR, 9RS)、(2.017  
 )ペンフルフェン、(2.018)ペンチオピラド、(2.019)ピジフルメトフェン、(2.0  
 20)ピラジフルミド、(2.021)セダキサム、(2.022)1, 3 - ジメチル - N - (1, 1, 3  
 - トリメチル - 2, 3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 4 - イル) - 1H - ピラゾール - 4 - カルボ  
 キサミド、(2.023)1, 3 - ジメチル - N - [(3R) - 1, 1, 3 - トリメチル - 2, 3 - ジヒ  
 ドロ - 1H - インデン - 4 - イル] - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.024)1, 3  
 - ジメチル - N - [(3S) - 1, 1, 3 - トリメチル - 2, 3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 4 -  
 イル] - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.025)1 - メチル - 3 - (トリフルオ  
 ロメチル) - N - [2' - (トリフルオロメチル) ピフェニル - 2 - イル] - 1H - ピラゾー  
 ル - 4 - カルボキサミド、(2.026)2 - フルオロ - 6 - (トリフルオロメチル) - N - (1  
 , 1, 3 - トリメチル - 2, 3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 4 - イル)ベンズアミド、(2.02  
 7)3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - N - (1, 1, 3 - トリメチル - 2, 3 - ジヒドロ  
 - 1H - インデン - 4 - イル) - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.028)3 - (ジ  
 フルオロメチル) - 1 - メチル - N - [(3R) - 1, 1, 3 - トリメチル - 2, 3 - ジヒドロ - 1  
 H - インデン - 4 - イル] - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.029)3 - (ジフル  
 オロメチル) - 1 - メチル - N - [(3S) - 1, 1, 3 - トリメチル - 2, 3 - ジヒドロ - 1H -  
 インデン - 4 - イル] - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.030)3 - (ジフルオ  
 ロメチル) - N - (7 - フルオロ - 1, 1, 3 - トリメチル - 2, 3 - ジヒドロ - 1H - インデン  
 - 4 - イル) - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.031)3 - (ジフル  
 オロメチル) - N - [(3R) - 7 - フルオロ - 1, 1, 3 - トリメチル - 2, 3 - ジヒドロ - 1H  
 - インデン - 4 - イル] - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.032)3  
 - (ジフルオロメチル) - N - [(3S) - 7 - フルオロ - 1, 1, 3 - トリメチル - 2, 3 - ジ  
 ヒドロ - 1H - インデン - 4 - イル] - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、  
 (2.033)5, 8 - ジフルオロ - N - [2 - (2 - フルオロ - 4 - { [4 - (トリフルオロメチ  
 ル) ピリジン - 2 - イル] オキシ} フェニル) エチル] キナゾリン - 4 - アミン、(2.034  
 )N - (2 - シクロペンチル - 5 - フルオロベンジル) - N - シクロプロピル - 3 - (ジフル  
 オロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.03  
 5)N - (2 - tert - ブチル - 5 - メチルベンジル) - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロ  
 メチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.036)N  
 - (2 - tert - ブチルベンジル) - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フ  
 40  
 50



ルオロ - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.037)N - (5 - クロロ - 2 - エチルベンジル) - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.038)N - (5 - クロロ - 2 - イソプロピルベンジル) - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.039)N - [(1R, 4S) - 9 - (ジクロロメチレン) - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロ - 1, 4 - メタノナフタレン - 5 - イル] - 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.040)N - [(1S, 4R) - 9 - (ジクロロメチレン) - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロ - 1, 4 - メタノナフタレン - 5 - イル] - 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.041)N - [1 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 1 - メトキシプロパン - 2 - イル] - 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.042)N - [2 - クロロ - 6 - (トリフルオロメチル)ベンジル] - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.043)N - [3 - クロロ - 2 - フルオロ - 6 - (トリフルオロメチル)ベンジル] - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.044)N - [5 - クロロ - 2 - (トリフルオロメチル)ベンジル] - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.045)N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - N - [5 - メチル - 2 - (トリフルオロメチル)ベンジル] - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.046)N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - N - (2 - フルオロ - 6 - イソプロピルベンジル) - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.047)N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - N - (2 - イソプロピル - 5 - メチルベンジル) - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.048)N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - N - (2 - イソプロピルベンジル) - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボチオアミド、(2.049)N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - N - (2 - イソプロピルベンジル) - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.050)N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - N - (5 - フルオロ - 2 - イソプロピルベンジル) - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.051)N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - N - (2 - エチル - 4, 5 - ジメチルベンジル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.052)N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - N - (2 - エチル - 5 - フルオロベンジル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.053)N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - N - (2 - エチル - 5 - メチルベンジル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.054)N - シクロプロピル - N - (2 - シクロプロピル - 5 - フルオロベンジル) - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.055)N - シクロプロピル - N - (2 - シクロプロピル - 5 - メチルベンジル) - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.056)N - シクロプロピル - N - (2 - シクロプロピルベンジル) - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(3.001)アメトクトラジン、(3.002)アミスルプロム、(3.003)アゾキシストロピン、(3.004)クメトキシストロピン、(3.005)クモキシストロピン、(3.006)シアゾファミド、(3.007)ジモキシストロピン、(3.008)エノキサストロピン、(3.009)ファミキサドン、(3.010)フェナミドン、(3.011)フルフェノキシストロピン、(3.012)フルオキサストロピン、(3.013)クレソキシム - メチル、(3.014)メトミノストロピン、(3.015)オリサストロピン、(3.016)ピコキシストロピン、(3.017)ピラクロストロピン、(3.018)ピラメトストロピン、(3.019)ピラオキシストロピン、(3.020)トリフロキシストロピン、(3.021)(2E) - 2 - {2 - [(1E) - 1 - (3 - {[(E) - 1 - フルオロ - 2 - フェニルビニル]オキシ}フェニル)エチリデン]アミノ}オキシ}メチ

ル]フェニル}-2-(メトキシイミノ)-N-メチルアセトアミド、(3.022)(2E,3Z)-5-{[1-(4-クロロフェニル)-1H-ピラゾール-3-イル]オキシ}-2-(メトキシイミノ)-N,3-ジメチルペンタ-3-エンアミド、(3.023)(2R)-2-{2-[(2,5-ジメチルフェノキシ)メチル]フェニル}-2-メトキシ-N-メチルアセトアミド、(3.024)(2S)-2-{2-[(2,5-ジメチルフェノキシ)メチル]フェニル}-2-メトキシ-N-メチルアセトアミド、(3.025)(3S,6S,7R,8R)-8-ベンジル-3-[(3-[(イソブチリルオキシ)メトキシ]-4-メトキシピリジン-2-イル}カルボニル)アミノ]-6-メチル-4,9-ジオキソ-1,5-ジオキソナン-7-イル2-メチルプロパノエート、(3.026)2-{2-[(2,5-ジメチルフェノキシ)メチル]フェニル}-2-メトキシ-N-メチルアセトアミド、(3.027)N-(3-エチル-3,5,5-トリメチルシクロヘキシル)-3-ホルムアミド-2-ヒドロキシベンズアミド、(3.028)(2E,3Z)-5-{[1-(4-クロロ-2-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-3-イル]オキシ}-2-(メトキシイミノ)-N,3-ジメチルペンタ-3-エンアミド、(3.029)メチル{5-[3-(2,4-ジメチルフェニル)-1H-ピラゾール-1-イル]-2-メチルベンジル}カルバメート、(4.001)カルベンダジム、(4.002)ジエトフェンカルブ、(4.003)エタボキサム、(4.004)フルオピコリド、(4.005)ペンシクロン、(4.006)チアベンダゾール、(4.007)チオファネート-メチル、(4.008)ゾキサミド、(4.009)3-クロロ-4-(2,6-ジフルオロフェニル)-6-メチル-5-フェニルピリダジン、(4.010)3-クロロ-5-(4-クロロフェニル)-4-(2,6-ジフルオロフェニル)-6-メチルピリダジン、(4.011)3-クロロ-5-(6-クロロピリジン-3-イル)-6-メチル-4-(2,4,6-トリフルオロフェニル)ピリダジン、(4.012)4-(2-プロモ-4-フルオロフェニル)-N-(2,6-ジフルオロフェニル)-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン、(4.013)4-(2-プロモ-4-フルオロフェニル)-N-(2-プロモ-6-フルオロフェニル)-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン、(4.014)4-(2-プロモ-4-フルオロフェニル)-N-(2-プロモフェニル)-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン、(4.015)4-(2-プロモ-4-フルオロフェニル)-N-(2-クロロ-6-フルオロフェニル)-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン、(4.016)4-(2-プロモ-4-フルオロフェニル)-N-(2-クロロフェニル)-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン、(4.017)4-(2-プロモ-4-フルオロフェニル)-N-(2-フルオロフェニル)-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン、(4.018)4-(2-クロロ-4-フルオロフェニル)-N-(2,6-ジフルオロフェニル)-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン、(4.019)4-(2-クロロ-4-フルオロフェニル)-N-(2-クロロ-6-フルオロフェニル)-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン、(4.020)4-(2-クロロ-4-フルオロフェニル)-N-(2-クロロフェニル)-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン、(4.021)4-(2-クロロ-4-フルオロフェニル)-N-(2-フルオロフェニル)-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン、(4.022)4-(4-クロロフェニル)-5-(2,6-ジフルオロフェニル)-3,6-ジメチルピリダジン、(4.023)N-(2-プロモ-6-フルオロフェニル)-4-(2-クロロ-4-フルオロフェニル)-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン、(4.024)N-(2-プロモフェニル)-4-(2-クロロ-4-フルオロフェニル)-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン、(4.025)N-(4-クロロ-2,6-ジフルオロフェニル)-4-(2-クロロ-4-フルオロフェニル)-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン、(5.001)ボルドー混合物、(5.002)カプタホール、(5.003)キャプタン、(5.004)クロロタロニル、(5.005)水酸化銅、(5.006)ナフテン酸銅、(5.007)酸化銅、(5.008)オキシ塩化銅、(5.009)硫酸銅(2+)、(5.010)ジチアノン、(5.011)ドジン、(5.012)フォルペット、(5.013)マンコゼブ、(5.014)マネブ、(5.015)メチラム、(5.016)メチラム亜鉛、(5.017)オキシニル-銅、(5.018)プロピネブ、(5.019)多硫化カルシウムを含む硫黄および硫黄調製物、(5.020)チラム、(5.021)ジネブ、(5.022)ジラム、(5.023)6-エチル-5,7-ジオキソ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ

[3', 4' : 5, 6] [1, 4] ジチイノ [2, 3 - c] [1, 2] チアゾール - 3 - カルボニトリル、(6.001) アシベンゾラル - S - メチル、(6.002) イソチアニル、(6.003) プロベナゾール、(6.004) チアジニル、(7.001) シプロジニル、(7.002) カスガマイシン、(7.003) カスガマイシン塩酸塩水和物、(7.004) オキシテトラサイクリン、(7.005) ピリメタニル、(7.006) 3 - (5 - フルオロ - 3, 3, 4, 4 - テトラメチル - 3, 4 - ジヒドロイソキノリン - 1 - イル) キノロン、(8.001) シルチオフアム、(9.001) ベンチアバリカルブ、(9.002) ジメトモルフ、(9.003) フルモルフ、(9.004) イプロバリカルブ、(9.005) マンジプロパミド、(9.006) ピリモルフ、(9.007) パリフェナレート、(9.008) (2E) - 3 - (4 - tert - ブチルフェニル) - 3 - (2 - クロロピリジン - 4 - イル) - 1 - (モルホリン - 4 - イル) プロパ - 2 - エン - 1 - オン、(9.009) (2Z) - 3 - (4 - tert - ブチルフェニル) - 3 - (2 - クロロピリジン - 4 - イル) - 1 - (モルホリン - 4 - イル) プロパ - 2 - エン - 1 - オン、(10.001) プロバモカルブ、(10.002) プロバモカルブ塩酸塩、(10.003) トルクロホスメチル、(11.001) トリシクラゾール、(11.002) 2, 2, 2 - トリフルオロエチル {3 - メチル - 1 - [(4 - メチルベンゾイル) アミノ] ブタン - 2 - イル} カルバメート、(12.001) ベナラキシル、(12.002) ベナラキシル - M (キララキシル)、(12.003) メタラキシル、(12.004) メタラキシル - M (メフェノキサム)、(13.001) フルジオキソニル、(13.002) イプロジオン、(13.003) プロシミドン、(13.004) プロキナジド、(13.005) キノキシフェン、(13.006) ピンクロゾリン、(14.001) フルアジナム、(14.002) メブチルジノキャップ、(15.001) アブシジン酸、(15.002) ベンチアゾール、(15.003) ベトキサジン、(15.004) カブシマイシン、(15.005) カルボン、(15.006) チノメチオナト、(15.007) クフラネブ、(15.008) シフルフェナミド、(15.009) シモキサニル、(15.010) シプロスルファミド、(15.011) フルチアニル、(15.012) ホセチル - アルミニウム、(15.013) ホセチル - カルシウム、(15.014) ホセチル - ナトリウム、(15.015) メチルイソチオシアネート、(15.016) メトラフェノン、(15.017) ミルジオマイシン、(15.018) ナタマイシン、(15.019) ニッケルジメチルジチオカルバメート、(15.020) ニトロタル - イソプロピル、(15.021) オキサモカルブ、(15.022) オキサチアピプロリン、(15.023) オキシフェンチン、(15.024) ペンタクロロフェノールおよび塩、(15.025) 亜リン酸およびその塩、(15.026) プロバモカルブ - フォセチレート、(15.027) ピリオフェノン (クラザフェノン)、(15.028) テブフロキン、(15.029) テクロフタラム、(15.030) トルニファニド、(15.031) 1 - (4 - {4 - [(5R) - 5 - (2, 6 - ジフルオロフェニル) - 4, 5 - ジヒドロ - 1, 2 - オキサゾール - 3 - イル] - 1, 3 - チアゾール - 2 - イル} ピペリジン - 1 - イル) - 2 - [5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1H - ピラゾール - 1 - イル] エタノン、(15.032) 1 - (4 - {4 - [(5S) - 5 - (2, 6 - ジフルオロフェニル) - 4, 5 - ジヒドロ - 1, 2 - オキサゾール - 3 - イル] - 1, 3 - チアゾール - 2 - イル} ピペリジン - 1 - イル) - 2 - [5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1H - ピラゾール - 1 - イル] エタノン、(15.033) 2 - (6 - ベンジルピリジン - 2 - イル) キナゾリン、(15.034) 2, 6 - ジメチル - 1H, 5H - [1, 4] ジチイノ [2, 3 - c : 5, 6 - c'] ジピロール - 1, 3, 5, 7 (2H, 6H) - テترون、(15.035) 2 - [3, 5 - ビス (ジフルオロメチル) - 1H - ピラゾール - 1 - イル] - 1 - [4 - (4 - {5 - [2 - (プロパ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) フェニル] - 4, 5 - ジヒドロ} - 1, 2 - オキサゾール - 3 - イル} - 1, 3 - チアゾール - 2 - イル) ピペリジン - 1 - イル] エタノン、(15.036) 2 - [3, 5 - ビス (ジフルオロメチル) - 1H - ピラゾール - 1 - イル] - 1 - [4 - (4 - {5 - [2 - クロロ - 6 - (プロパ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) フェニル] - 4, 5 - ジヒドロ - 1, 2 - オキサゾール - 3 - イル} - 1, 3 - チアゾール - 2 - イル) ピペリジン - 1 - イル] エタノン、(15.037) 2 - [3, 5 - ビス (ジフルオロメチル) - 1H - ピラゾール - 1 - イル] - 1 - [4 - (4 - {5 - [2 - フルオロ - 6 - (プロパ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) フェニル] - 4, 5 - ジヒドロ - 1, 2 - オキサゾール - 3 - イル} - 1, 3 - チアゾール - 2 - イル) ピペリジン - 1 - イル] エタノン、(15.038) 2 - [6 - (3 - フルオロ - 4 - メトキシフェニル) - 5 - メチルピリジン - 2 - イル] キナゾリン、(15.039)

2 - { (5R) - 3 - [ 2 - ( 1 - { [ 3, 5 - ビス (ジフルオロメチル) - 1H - ピラゾール - 1 - イル ] アセチル } ピペリジン - 4 - イル ) - 1, 3 - チアゾール - 4 - イル ] - 4, 5 - ジヒドロ - 1, 2 - オキサゾール - 5 - イル } - 3 - クロロフェニルメタンスルホネート、 ( 15 . 040 ) 2 - { (5S) - 3 - [ 2 - ( 1 - { [ 3, 5 - ビス (ジフルオロメチル) - 1H - ピラゾール - 1 - イル ] アセチル } ピペリジン - 4 - イル ) - 1, 3 - チアゾール - 4 - イル ] - 4, 5 - ジヒドロ - 1, 2 - オキサゾール - 5 - イル } - 3 - クロロフェニルメタンスルホネート、 ( 15 . 041 ) 2 - { 2 - [ ( 7, 8 - ジフルオロ - 2 - メチルキノリン - 3 イル ) オキシ ] - 6 - フルオロフェニル } プロパン - 2 - オール、 ( 15 . 042 ) 2 - { 2 - フルオロ - 6 - [ ( 8 - フルオロ - 2 - メチルキノリン - 3 - イル ) オキシ ] フェニル } プロパン - 2 - オール、 ( 15 . 043 ) 2 - { 3 - [ 2 - ( 1 - { [ 3, 5 - ビス (ジフルオロメチル) - 1H - ピラゾール - 1 - イル ] アセチル } ピペリジン - 4 - イル ) - 1, 3 - チアゾール - 4 - イル ] - 4, 5 - ジヒドロ - 1, 2 - オキサゾール - 5 - イル } - 3 - クロロフェニルメタンスルホネート、 ( 15 . 044 ) 2 - { 3 - [ 2 - ( 1 - { [ 3, 5 - ビス (ジフルオロメチル) - 1H - ピラゾール - 1 - イル ] アセチル } ピペリジン - 4 - イル ) - 1, 3 - チアゾール - 4 - イル ] - 4, 5 - ジヒドロ - 1, 2 - オキサゾール - 5 - イル } フェニルメタンスルホネート、 ( 15 . 045 ) 2 - フェニルフェノールおよび塩、 ( 15 . 046 ) 3 - ( 4, 4, 5 - トリフルオロ - 3, 3 - ジメチル - 3, 4 - ジヒドロイソキノリン - 1 - イル ) キノリン、 ( 15 . 047 ) 3 - ( 4, 4 - ジフルオロ - 3, 3 - ジメチル - 3, 4 - ジヒドロイソキノリン - 1 - イル ) キノリン、 ( 15 . 048 ) 4 - アミノ - 5 - フルオロピリミジン - 2 - オール ( 互変異性型 : 4 - アミノ - 5 - フルオロピリミジン - 2 ( 1H ) ) - オン)、 ( 15 . 049 ) 4 - オキサ - 4 - [ ( 2 - フェニルエチル ) アミノ ] ブタン酸、 ( 15 . 050 ) 5 - アミノ - 1, 3, 4 - チアジアゾール - 2 - チオール、 ( 15 . 051 ) 5 - クロロ - N' - フェニル - N' - ( プロパ - 2 - イン - 1 - イル ) チオフェン - 2 - スルホノヒドラジド、 ( 15 . 052 ) 5 - フルオロ - 2 - [ ( 4 - フルオロベンジル ) オキシ ] ピリミジン - 4 - アミン、 ( 15 . 053 ) 5 - フルオロ - 2 - [ ( 4 - メチルベンジル ) オキシ ] ピリミジン - 4 - アミン、 ( 15 . 054 ) 9 - フルオロ - 2, 2 - ジメチル - 5 - ( キノリン - 3 - イル ) - 2, 3 - ジヒドロ - 1, 4 - ベンゾオキサゼピン、 ( 15 . 055 ) ブタ - 3 - イン - 1 - イル { 6 - [ ( { [ ( Z ) - ( 1 - メチル - 1H - テトラゾール - 5 - イル ) ( フェニル ) メチレン ] アミノ } オキシ ) メチル ] ピリジン - 2 - イル } カルバメート、 ( 15 . 056 ) エチル ( 2Z ) - 3 - アミノ - 2 - シアノ - 3 - フェニルアクリレート、 ( 15 . 057 ) フェナジン - 1 - カルボン酸、 ( 15 . 058 ) プロピル 3, 4, 5 - トリヒドロキシベンゾエート、 ( 15 . 059 ) キノリン - 8 - オール、 ( 15 . 060 ) キノリン - 8 - オールサルフェート ( 2 : 1 )、 ( 15 . 061 ) tert - ブチル { 6 - [ ( { [ ( 1 - メチル - 1H - テトラゾール - 5 - イル ) ( フェニル ) メチレン ] アミノ } オキシ ) メチル ] ピリジン - 2 - イル } カルバメート、 および ( 15 . 062 ) 5 - フルオロ - 4 - イミノ - 3 - メチル - 1 - [ ( 4 - メチルフェニル ) スルホニル ] - 3, 4 - ジヒドロピリミジン - 2 ( 1H ) - オンからなる群から選択される、請求項1から7の少なくとも一項目に記載の活性化化合物の組合せ。

10

20

30

40

50

【請求項 9】

前記さらなる活性化化合物が、 ( 1 . 012 ) イブコナゾール、 ( 1 . 018 ) プロチオコナゾール、 ( 1 . 020 ) スピロキサミン、 ( 1 . 021 ) テブコナゾール、 ( 2 . 002 ) ビキサフェン、 ( 2 . 005 ) フルオピラム、 ( 2 . 017 ) ペンフルフェン、 ( 2 . 027 ) 3 - ( ジフルオロメチル ) - 1 - メチル - N - ( 1, 1, 3 - トリメチル - 2, 3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 4 - イル ) - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 ( 2 . 038 ) N - ( 5 - クロロ - 2 - イソプロピルベンジル ) - N - シクロプロピル - 3 - ( ジフルオロメチル ) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 ( 3 . 020 ) トリフロキシストロピン、 ( 3 . 025 ) ( 3S, 6S, 7R, 8R ) - 8 - ベンジル - 3 - [ ( { 3 - [ ( イソブチリルオキシ ) メトキシ ] - 4 - メトキシピリジン - 2 - イル } カルボニル ) - アミノ ] - 6 - メチル - 4, 9 - ジオキソ - 1, 5 - ジオキソナン - 7 - イル 2 - メチルプロパノエート、 ( 4 . 005 ) ペンシクロン、 ( 5 . 004 ) クロロタロニル、 ( 5 . 013 ) マンコゼブ、 ( 5 . 018 ) プロピネブ、 ( 12 . 003 ) メタラキシル、 ( 12 . 004 ) メタラキシル - M ( メフェノキサム )、 ( 13 . 001 ) フルジオキソニル、 ( 13 . 004 ) プロキナジド、 ( 15 . 008 ) シフルフェナミド、 および ( 15 . 04

7) 3 - (4, 4 - ジフルオロ - 3, 3 - ジメチル - 3, 4 - ジヒドロイソキノリン - 1 - イル) キノロンからなる群から選択される、請求項1から8の少なくとも一項に記載の活性化合物の組合せ。

【請求項10】

少なくとも1種の増量剤および/または界面活性剤に加えて、請求項1から9の少なくとも一項に記載の活性化合物の組合せの含量によって特徴づけられる、作物保護および材料の保護において有害微生物、好ましくは植物病原性有害真菌を制御するための組成物。

【請求項11】

作物保護および材料の保護において有害微生物、好ましくは植物病原性有害真菌を制御する方法であって、請求項1から9の少なくとも一項に記載の活性化合物の組合せまたは請求項10に記載の組成物を前記有害微生物および/またはその生息地に施用することを特徴とする、方法。

【請求項12】

作物保護および材料の保護において有害微生物、好ましくは植物病原性有害真菌を制御するための、請求項1から9の少なくとも一項に記載の活性化合物の組合せまたは請求項10に記載の組成物の使用。

【請求項13】

トランスジェニック植物を処理するための、請求項1から9の少なくとも一項に記載の活性化合物の組合せまたは請求項10に記載の組成物の使用。

【請求項14】

種子、好ましくはトランスジェニック植物の種子を処理するための、請求項1から9の少なくとも一項に記載の活性化合物の組合せまたは請求項10に記載の組成物の使用。

【請求項15】

請求項1から9の少なくとも一項に記載の活性化合物の組合せまたは請求項10に記載の組成物でコーティングされた種子。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、(A)式(1)のトリアゾール誘導体と、さらなる殺真菌活性化合物(B)とを含む、特に殺真菌組成物内の活性化合物の組合せに関する。さらに、本発明は、このような化合物組合せを含む組成物、ならびに特に作物保護および材料の保護において有害微生物を制御するための生物活性組合せとして、および植物成長調節剤としてのその使用に関する。

【背景技術】

【0002】

特定のフェノキシ - フェニル - 置換トリアゾール誘導体を殺真菌剤として作物保護に使用することができることは既に知られている(例えば、欧州特許第0275955号明細書; J. Agric. Food Chem. 2009、57、4854 ~ 4860; 中国特許第101225074号明細書、独国特許第4003180号明細書; 欧州特許第0113640号明細書; 欧州特許第0470466号明細書; 米国特許第4949720号明細書; 欧州特許第0126430号明細書; 独国特許第3801233号明細書; 国際公開第2013/007767号パンフレット; 国際公開第2013/010862号パンフレット; 国際公開第2013/010885号パンフレット; 国際公開第2013/010894号パンフレット; 国際公開第2013/024075号パンフレット; 国際公開第2013/024076号パンフレット; 国際公開第2013/024077号パンフレット; 国際公開第2013/024080号パンフレット; 国際公開第2013/024081号パンフレット; 国際公開第2013/024082号パンフレット; 国際公開第2013/024083号パンフレットおよび国際公開第2014/082872号パンフレット)。特定のフェノキシ - フェニル - 置換トリアゾリンチオン誘導体(例えば、国際公開第2010/146114号パンフレット)および特定のフェノキシ - ヘタリール - 置換トリアゾリンチオン誘導体(例えば、国際公開第2010/146116号パンフレット)を殺真菌剤として作物保護に使用することができることも知られている。式(1)の新規なフェノキシ - ヘタリール置換トリアゾール誘導体が開

10

20

30

40

50

発されており、国際公開第2017/029179号パンフレットの主題である。

【先行技術文献】

【特許文献】

【0003】

【特許文献1】欧州特許第0275955号明細書

【特許文献2】中国特許第101225074号明細書

【特許文献3】独国特許第4003180号明細書

【特許文献4】欧州特許第0113640号明細書

【特許文献5】欧州特許第0470466号明細書

【特許文献6】米国特許第4949720号明細書

10

【特許文献7】欧州特許第0126430号明細書

【特許文献8】独国特許第3801233号明細書

【特許文献9】国際公開第2013/007767号パンフレット

【特許文献10】国際公開第2013/010862号パンフレット

【特許文献11】国際公開第2013/010885号パンフレット

【特許文献12】国際公開第2013/010894号パンフレット

【特許文献13】国際公開第2013/024075号パンフレット

【特許文献14】国際公開第2013/024076号パンフレット

【特許文献15】国際公開第2013/024077号パンフレット

【特許文献16】国際公開第2013/024080号パンフレット

20

【特許文献17】国際公開第2013/024081号パンフレット

【特許文献18】国際公開第2013/024082号パンフレット

【特許文献19】国際公開第2013/024083号パンフレット

【特許文献20】国際公開第2014/082872号パンフレット

【特許文献21】国際公開第2010/146114号パンフレット

【特許文献22】国際公開第2010/146116号パンフレット

【特許文献23】国際公開第2017/029179

【非特許文献】

【0004】

【非特許文献1】J. Agric. Food Chem. 2009、57、4854 ~ 4860

30

【発明の概要】

【発明が解決しようとする課題】

【0005】

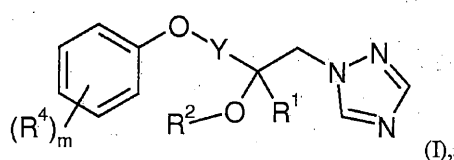
現代の作物保護剤および組成物に課される環境的および経済的要件は、例えば作用範囲、毒性、選択性、施用量、残留物の形成および好ましい調製能力に関して絶えず増加しており、さらに、例えば耐性に関する課題があり得るので、継続した課題は、ある分野で、上記要件を満たすのを少なくとも助ける新しい組成物、特に殺真菌剤を開発することである。本発明は、いくつかの態様で、少なくとも言及される目的を達成する活性化化合物の組合せおよび組合せを含む組成物を提供する。

【課題を解決するための手段】

40

【0006】

したがって、本発明は、(A) 少なくとも1種の式(I)のトリアゾール誘導体【化1】



(式中、

R<sup>1</sup>は水素、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> - アルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> - アルケニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> - アルキニル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>8</sub> - シ

50

クロアルキル、 $C_3 \sim C_8$  - シクロアルキル -  $C_1 \sim C_4$  - アルキル、フェニル、フェニル -  $C_1 \sim C_4$  - アルキル、フェニル -  $C_2 \sim C_4$  - アルケニルまたはフェニル -  $C_2 \sim C_4$  - アルキニルを表し；

$R^2$ は水素、 $C_1 \sim C_6$  - アルキル、 $C_2 \sim C_6$  - アルケニル、 $C_2 \sim C_6$  - アルキニル、 $C_3 \sim C_8$  - シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$  - シクロアルキル -  $C_1 \sim C_4$  - アルキル、フェニル、フェニル -  $C_1 \sim C_4$  - アルキル、フェニル -  $C_2 \sim C_4$  - アルケニルまたはフェニル -  $C_2 \sim C_4$  - アルキニルを表し、

$R^1$ および/または $R^2$ のシクロアルキル部分を除く脂肪族部分は、互いに独立に、ハロゲン、CN、ニトロ、フェニル、 $C_1 \sim C_4$  - アルコキシおよび $C_1 \sim C_4$  - ハロゲンアルコキシから選択される1、2、3または最大可能数までの同一のまたは異なる基 $R^a$ を有していてもよく、フェニルは互いに独立に、ハロゲン、CN、ニトロ、 $C_1 \sim C_4$  - アルキル、 $C_1 \sim C_4$  - アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$  - ハロゲンアルキル、 $C_1 \sim C_4$  - ハロゲンアルコキシから選択される1、2、3、4または5個の置換基によって置換されていてもよく、

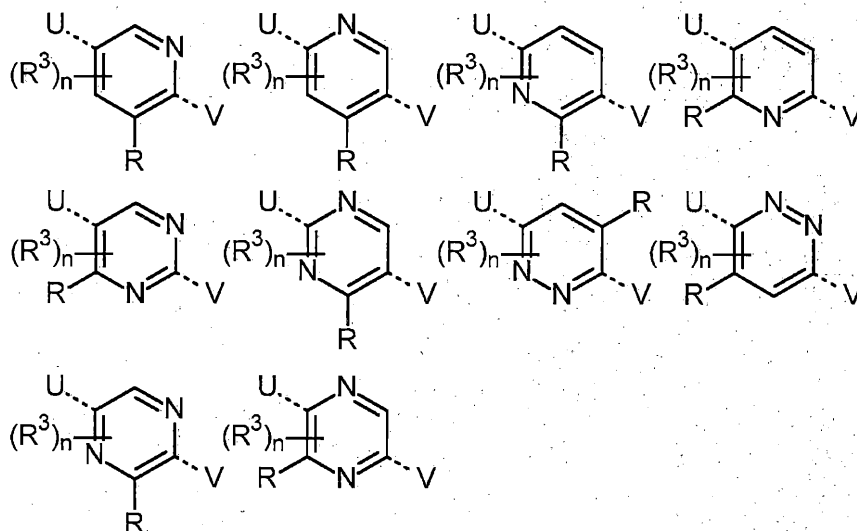
$R^1$ および/または $R^2$ のシクロアルキルおよび/またはフェニル部分は、互いに独立にハロゲン、CN、ニトロ、 $C_1 \sim C_4$  - アルキル、 $C_1 \sim C_4$  - アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$  - ハロゲンアルキルおよび $C_1 \sim C_4$  - ハロゲンアルコキシから選択される1、2、3、4、5または最大数までの同一のまたは異なる基 $R^b$ を有していてもよく；

各 $R^4$ は互いに独立に、ハロゲン、CN、ニトロ、 $C_1 \sim C_4$  - アルキル、 $C_1 \sim C_4$  - ハロゲンアルキル、 $C_1 \sim C_4$  - アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$  - ハロゲンアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$  - アルキルカルボニル、ヒドロキシ置換 $C_1 \sim C_4$  - アルキルまたはペンタフルオロ -  $^6$  - スルファニル；好ましくはハロゲン、CN、ニトロ、 $C_1 \sim C_4$  - アルキル、 $C_1 \sim C_4$  - ハロゲンアルキル、 $C_1 \sim C_4$  - アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$  - ハロゲンアルコキシまたはペンタフルオロ -  $^6$  - スルファニルを表し；

mは整数であり、0、1、2、3、4または5であり；

Yは

【化2】



から選択される、1個または複数のヘテロ原子として1個または2個の窒素原子を含有する6員芳香族複素環を表し、

Yは「U」で識別される結合を介して式(1)のOに結合しており、Yは「V」で識別される結合を介して式(1)のCR<sup>1</sup>(OR<sup>2</sup>)部分に結合しており、

Rは水素、 $C_1 \sim C_2$  - ハロゲンアルキル、 $C_1 \sim C_2$  - ハロゲンアルコキシ、 $C_1 \sim C_2$  - アルキルカルボニルまたはハロゲン；好ましくは水素、 $C_1 \sim C_2$  - ハロゲンアルキルまたはハロゲンを表し；

各 $R^3$ は互いに独立に、ハロゲン、CN、ニトロ、 $C_1 \sim C_4$  - アルキル、 $C_1 \sim C_4$  - ハロゲン

アルキル、 $C_1 \sim C_4$  - アルコキシまたは $C_1 \sim C_4$  - ハロゲンアルコキシを表し；  
nは整数であり、0、1または2である)

またはその塩もしくはN - オキシドと、

(B) 少なくとも1種の以下の群から選択されるさらなる活性化合物

- (1) エルゴステロール合成の阻害剤、
- (2) 複合体IまたはIIにおける呼吸鎖の阻害剤、
- (3) 複合体IIIにおける呼吸鎖の阻害剤、
- (4) 有糸分裂および細胞分裂の阻害剤、
- (5) 多部位作用を有することができる化合物、
- (6) 宿主防御を誘導することができる化合物、
- (7) アミノ酸および/またはタンパク質生合成の阻害剤、
- (8) ATP産生の阻害剤、
- (9) 細胞壁合成の阻害剤、
- (10) 脂質および膜合成の阻害剤、
- (11) メラニン生合成の阻害剤、
- (12) 核酸合成の阻害剤、
- (13) シグナル伝達の阻害剤、
- (14) 脱共役剤として作用することができる化合物、
- (15) 他の殺真菌剤

10

とを含む活性化合物の組合せを提供する。

20

【発明を実施するための形態】

【0007】

本発明による活性化合物の組合せは、(A) 少なくとも1種の式(1)のトリアゾール誘導体またはその塩もしくはN - オキシドを含む。式(1)のトリアゾール誘導体の塩またはN - オキシドも殺真菌特性を有する。

【0008】

式(1)は、本発明による化合物組合せ中に存在するトリアゾール誘導体の一般的な定義を提供する。上および下に示される式の好ましい基の定義を以下に示す。これらの定義を、式(1)の最終生成物および同様に全ての中間体にも適用する。

【0009】

$R^1$ は、好ましくは、水素、 $C_1 \sim C_4$  - アルキル、 $C_2 \sim C_6$  - アルケニル、 $C_2 \sim C_6$  - アルキニル、シクロプロピル、フェニル、ベンジル、フェニルエチニルまたはフェニルエチニルを表し、

30

$R^1$ のシクロアルキル部分を除く脂肪族部分は、互いに独立に、ハロゲン、CN、ニトロ、フェニル、 $C_1 \sim C_4$  - アルコキシおよび $C_1 \sim C_4$  - ハロゲンアルコキシから選択される1、2、3または最大可能数までの同一のまたは異なる基 $R^a$ を有していてもよく、フェニルは互いに独立に、ハロゲン、CN、ニトロ、 $C_1 \sim C_4$  - アルキル、 $C_1 \sim C_4$  - アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$  - ハロゲンアルキル、 $C_1 \sim C_4$  - ハロゲンアルコキシから選択される1、2、3、4または5個の置換基によって置換されていてもよく；

$R^1$ のシクロアルキルおよび/またはフェニル部分は、互いに独立にハロゲン、CN、ニトロ、 $C_1 \sim C_4$  - アルキル、 $C_1 \sim C_4$  - アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$  - ハロゲンアルキルおよび $C_1 \sim C_4$  - ハロゲンアルコキシから選択される1、2、3、4、5または最大数までの同一のまたは異なる基 $R^b$ を有していてもよい。

40

【0010】

$R^1$ は、より好ましくは、水素、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、シクロプロピル、 $CF_3$ 、アリル、 $CH_2C \equiv C - CH_3$ または $CH_2C \equiv CH$ を表し、

$R^1$ のシクロアルキル部分を除く脂肪族部分は、互いに独立に、ハロゲン、CN、ニトロ、フェニル、 $C_1 \sim C_4$  - アルコキシおよび $C_1 \sim C_4$  - ハロゲンアルコキシから選択される1、2、3または最大可能数までの同一のまたは異なる基 $R^a$ を有していてもよく、フェニルは互いに独立に、ハロゲン；CN；ニトロ； $C_1 \sim C_4$  - アルキル； $C_1 \sim C_4$  - アルコキシ； $C_1 \sim C_4$  -

50



ハロゲンアルキル； $C_1 \sim C_4$  - ハロゲンアルコキシから選択される1、2、3、4または5個の置換基によって置換されていてもよい。

【0011】

$R^1$ は、より好ましくは、水素または非置換メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、シクロプロピル、 $CF_3$ 、アリル、 $CH_2C(C)CH_3$ または $CH_2C(CH_3)CH_2$ を表す。

【0012】

$R^1$ は、より好ましくは、水素、メチル、エチルまたはシクロプロピルを表す。

【0013】

$R^1$ は、さらにより好ましくは、メチルまたはシクロプロピルを表す。

【0014】

$R^1$ は、最も好ましくは、メチルを表す。

【0015】

$R^2$ は、好ましくは、水素、 $C_1 \sim C_4$  - アルキル、アリル、プロパルギルまたはベンジルを表し、

$R^2$ のシクロアルキル部分を除く脂肪族基は、互いに独立に、ハロゲン、CN、ニトロ、フェニル、 $C_1 \sim C_4$  - アルコキシおよび $C_1 \sim C_4$  - ハロゲンアルコキシから選択される1、2、3または最大可能数までの同一のまたは異なる基 $R^a$ を有していてもよく、フェニルは互いに独立に、ハロゲン、CN、ニトロ、 $C_1 \sim C_4$  - アルキル、 $C_1 \sim C_4$  - アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$  - ハロゲンアルキル、 $C_1 \sim C_4$  - ハロゲンアルコキシから選択される1、2、3、4または5個の置換基によって置換されていてもよく；

$R^2$ のシクロアルキルおよび/またはフェニル部分は、互いに独立に、ハロゲン、CN、ニトロ、 $C_1 \sim C_4$  - アルキル、 $C_1 \sim C_4$  - アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$  - ハロゲンアルキルおよび $C_1 \sim C_4$  - ハロゲンアルコキシから選択される1、2、3、4、5または最大数までの同一のまたは異なる基 $R^b$ を有していてもよい。

【0016】

$R^2$ は、より好ましくは、水素、メチル、エチル、イソプロピルまたはアリルを表し、

$R^2$ のシクロアルキル部分を除く脂肪族部分は、互いに独立に、ハロゲン、CN、ニトロ、フェニル、 $C_1 \sim C_4$  - アルコキシおよび $C_1 \sim C_4$  - ハロゲンアルコキシから選択される1、2、3または最大可能数までの同一のまたは異なる基 $R^a$ を有していてもよく、フェニルは互いに独立に、ハロゲン、CN、ニトロ、 $C_1 \sim C_4$  - アルキル、 $C_1 \sim C_4$  - アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$  - ハロゲンアルキル、 $C_1 \sim C_4$  - ハロゲンアルコキシから選択される1、2、3、4または5個の置換基によって置換されていてもよい。

【0017】

$R^2$ は、より好ましくは、水素または非置換メチル、エチル、イソプロピルまたはアリルを表す。

【0018】

$R^2$ は、より好ましくは、水素またはメチルを表す。

【0019】

$R^2$ は、最も好ましくは、水素を表す。

【0020】

各 $R^4$ は、好ましくは、互いに独立に、 $CF_3$ 、 $OCF_3$ 、Br、Clまたはペンタフルオロ - 6 - スルファニルを表す。

【0021】

$R^4$ は、より好ましくは、式(1)のフェニル部分の4位の $CF_3$ 、 $OCF_3$ 、Br、Clまたはペンタフルオロ - 6 - スルファニルを表す。

【0022】

$R^4$ は、さらにより好ましくは、ClまたはBr、最も好ましくは、式(1)のフェニル部分の4位のClまたはBrを表す。

【0023】

mは、好ましくは、1、2または3である。

10

20

30

40

50

【0024】

mは、より好ましくは、1または2である。

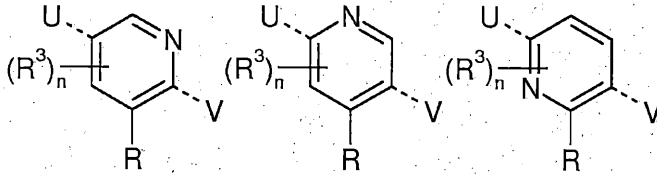
【0025】

mは、最も好ましくは、1である。

【0026】

Yは、好ましくは、

【化3】



10

(式中、

R、R<sup>3</sup>およびnは式(1)について上述の通り定義される)

を表す。

【0027】

Rは、好ましくは、水素、C<sub>1</sub>-ハロゲンアルキル、FまたはClを表す。

【0028】

Rは、より好ましくは、C<sub>1</sub>-ハロゲンアルキル、FまたはClを表す。

20

【0029】

Rは、より好ましくは、CF<sub>3</sub>またはClを表す。

【0030】

Rは、最も好ましくは、CF<sub>3</sub>を表す。

【0031】

nは、好ましくは、0である。

【0032】

しかしながら、一般的な用語で上に示されるまたは好ましい範囲内で明言される基の定義および説明は、所望されるように、すなわち特定の範囲および好ましい範囲の間を含めて互いに組み合わせることもできる。これらを最終生成物と、それに対応して前駆体および中間体にも適用する。さらに、個々の定義を適用しないこともある。

30

【0033】

基の各々が上記の好ましい定義を有する式(1)の化合物の存在が好ましい。

【0034】

基の各々が上記のよりおよび/または最も好ましい定義を有する式(1)の化合物の存在が特に好ましい。

【0035】

本発明の好ましい実施形態では、

R<sup>1</sup>が水素、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>-アルキルまたはシクロプロピルを表し；

R<sup>2</sup>が水素を表し；

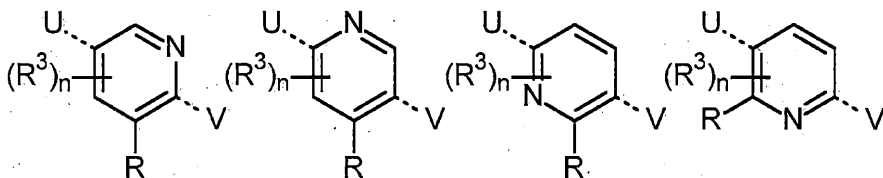
40

R<sup>4</sup>がCF<sub>3</sub>、OCF<sub>3</sub>、Br、Clまたはペンタフルオロ-<sup>6</sup>-スルファニルを表し；

mが1であり；

Yが

【化4】



50

を表し、

Yが「U」で識別される結合を介して式(1)のOに結合しており、Yが「V」で識別される結合を介して式(1)のCR<sup>1</sup>(OR<sup>2</sup>)部分に結合しており、

RがC<sub>1</sub>-ハロゲンアルキルを表し；

nが0である、

式(1)の化合物が存在する。

【0036】

本発明のより好ましい実施形態では、

R<sup>1</sup>がメチルまたはシクロプロピルを表し；

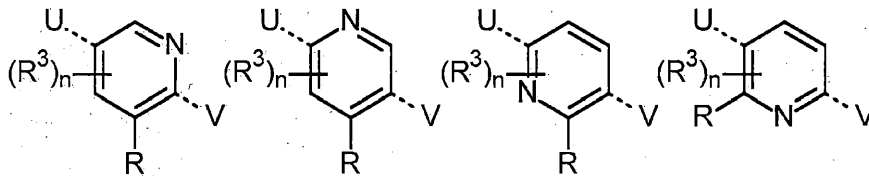
R<sup>2</sup>が水素を表し；

R<sup>4</sup>が式(1)のフェニル部分の4位のClまたはBrを表し；

mが1であり；

Yが

【化5】



を表し、

Yが「U」で識別される結合を介して式(1)のOに結合しており、Yが「V」で識別される結合を介して式(1)のCR<sup>1</sup>(OR<sup>2</sup>)部分に結合しており、

RがCF<sub>3</sub>を表し；

nが0である、

式(1)の化合物が存在する。

【0037】

本発明によるより好ましい化合物組合せは、(A) (1.01) 2-[6-(4-クロロフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル]-1-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)プロパン-2-オール、(1.59) 2-[6-(4-プロモフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル]-1-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)プロパン-2-オール、(1.81) 1-[6-(4-プロモフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル]-1-シクロプロピル-2-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)エタノールおよび(1.91) 1-[6-(4-クロロフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル]-1-シクロプロピル-2-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)エタノールからなる群から選択される式(1)の化合物を含む。

【0038】

本発明によるなおさらに好ましい化合物組合せは、(A) 式(1)の化合物としての(1.01) 2-[6-(4-クロロフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル]-1-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)プロパン-2-オールおよび/または(1.59) 2-[6-(4-プロモフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル]-1-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)プロパン-2-オールを含む。

【0039】

上記の式で示される記号の定義では、一般的に以下の置換基を表す総称を使用した：

【0040】

定義C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>-アルキルは、アルキル基についてここで定義される最大範囲を含む。具体的には、この定義は、メチル、エチル、n-、イソプロピル、n-、イソ-、sec-、tert-ブチルおよび各場合で、全ての異性体ペンチルおよびヘキシル、例えば、メチル、エチル、プロピル、1-メチルエチル、ブチル、1-メチルプロピル、2-メチルプロピル、1,1-ジメチルエチル、n-ペンチル、1-メチルブチル、2-メチルブチル、3-メチルブチ

ル、1,2-ジメチルプロピル、1,1-ジメチルプロピル、2,2-ジメチルプロピル、1-エチルプロピル、n-ヘキシル、1-メチルペンチル、2-メチルペンチル、3-メチルペンチル、4-メチルペンチル、1,2-ジメチルブチル、1,3-ジメチルブチル、2,3-ジメチルブチル、1,1-ジメチルブチル、2,2-ジメチルブチル、3,3-ジメチルブチル、1,1,2-トリメチルプロピル、1,2,2-トリメチルプロピル、1-エチルブチル、2-エチルブチル、1-エチル-3-メチルプロピル、特にプロピル、1-メチルエチル、ブチル、1-メチルブチル、2-メチルブチル、3-メチルブチル、1,1-ジメチルエチル、1,2-ジメチルブチル、1,3-ジメチルブチル、n-ペンチル、1-メチルブチル、1-エチルプロピル、ヘキシル、3-メチルペンチルの意味を含む。好ましい範囲は、メチル、エチル、n-、イソプロピル、n-、イソ-、sec-、tert-ブチルなどの $C_1 \sim C_4$ -アルキルである。定義 $C_1 \sim C_2$ -アルキルは、メチルおよびエチルを含む。

10

## 【0041】

定義ハロゲンは、フッ素、塩素、臭素およびヨウ素を含む。ハロゲン置換は一般に、接頭辞ハロ、ハロゲンまたはハロゲノによって示される。

## 【0042】

例えば、ハロゲンアルキル、ハロゲノアルキルまたはハロアルキルと呼ばれるハロゲン置換アルキル、例えば $C_1 \sim C_4$ -ハロゲンアルキルまたは $C_1 \sim C_2$ -ハロゲンアルキルは、例えば、同じであっても異なってもよい1つまたは複数のハロゲン置換基によって置換された上に定義される $C_1 \sim C_4$ -アルキルまたは $C_1 \sim C_2$ -アルキルを表す。好ましくは、 $C_1 \sim C_4$ -ハロゲンアルキルはクロロメチル、ジクロロメチル、トリクロロメチル、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロフルオロメチル、ジクロロフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、1-フルオロエチル、2-フルオロエチル、2,2-ジフルオロエチル、2,2,2-トリフルオロエチル、2-クロロ-2-フルオロエチル、2-クロロ-2,2-ジフルオロエチル、2,2-ジクロロ-2-フルオロエチル、2,2,2-トリクロロエチル、1,1-ジフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、1-フルオロ-1-メチルエチル、2-フルオロ-1,1-ジメチルエチル、2-フルオロ-1-フルオロメチル-1-メチルエチル、2-フルオロ-1,1-ジ(フルオロメチル)-エチル、1-クロロブチルを表す。好ましくは、 $C_1 \sim C_2$ -ハロゲンアルキルはクロロメチル、ジクロロメチル、トリクロロメチル、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロフルオロメチル、ジクロロフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、1-フルオロエチル、2-フルオロエチル、2,2-ジフルオロエチル、2,2,2-トリフルオロエチル、2-クロロ-2-フルオロエチル、2-クロロ-2,2-ジフルオロエチル、2,2-ジクロロ-2-フルオロエチル、2,2,2-トリクロロエチル、1,1-ジフルオロエチル、ペンタフルオロエチルを表す。

20

30

## 【0043】

モノ-または多フッ素化 $C_1 \sim C_4$ -アルキルは、例えば、1つまたは複数のフッ素置換基によって置換された上に定義される $C_1 \sim C_4$ -アルキルを表す。好ましくは、モノ-または多フッ素化 $C_1 \sim C_4$ -アルキルは、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、1-フルオロエチル、2-フルオロエチル、2,2-ジフルオロエチル、2,2,2-トリフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、1-フルオロ-1-メチルエチル、2-フルオロ-1,1-ジメチルエチル、2-フルオロ-1-フルオロメチル-1-メチルエチル、2-フルオロ-1,1-ジ(フルオロメチル)-エチル、1-メチル-3-トリフルオロメチルブチル、3-メチル-1-トリフルオロメチルブチルを表す。

40

## 【0044】

定義 $C_2 \sim C_6$ -アルケニルは、アルケニル基についてここで定義される最大範囲を含む。具体的には、この定義は、エテニル、n-、イソプロペニル、n-、イソ-、sec-、tert-ブテニルおよび各場合で、全ての異性体ペンテニル、ヘキセニル、1-メチル-1-プロペニル、1-エチル-1-ブテニルの意味を含む。例えば $C_2 \sim C_6$ -ハロアルケニルと呼ばれるハロゲン置換アルケニルは、例えば、同じであっても異なってもよい1つまたは複数のハロゲン置換基によって置換された上に定義される $C_2 \sim C_6$ -アルケニルを表す。

50

## 【 0 0 4 5 】

定義 $C_2 \sim C_6$ -アルキニルは、アルキニル基についてここで定義される最大範囲を含む。具体的には、この定義は、エチニル、*n*-、イソプロピニル、*n*-、イソ-、*sec*-、*tert*-ブチニルおよび各場合で、全ての異性体ペンチニル、ヘキシニルの意味も含む。例えば $C_2 \sim C_6$ -ハロアルキニルと呼ばれるハロゲン置換アルキニルは、例えば、同じであっても異なってもよい1つまたは複数のハロゲン置換基によって置換された上に定義される $C_2 \sim C_6$ -アルキニルを表す。

## 【 0 0 4 6 】

定義 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキルは、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチルおよびシクロオクチルなどの3~8個の炭素環員を有する単環式飽和ヒドロカルビル基を含む。

10

## 【 0 0 4 7 】

定義ハロゲン置換シクロアルキル、ハロゲノシクロアルキル、ハロシクロアルキルおよびハロゲンシクロアルキルは、1-フルオロ-シクロプロピルおよび1-クロロ-シクロプロピルなどの3~8個の炭素環員を有する単環式飽和ヒドロカルビル基を含む。

## 【 0 0 4 8 】

アリーの定義は、芳香族の単環式、二環式または三環式環、例えばフェニル、ナフチル、アントラセニル(アントリル)、フェナントラセニル(フェナントリル)を含む。

## 【 0 0 4 9 】

場合により置換された基は、一置換または多置換されていてもよく、多置換の場合、置換基は同一でも異なってもよい。

20

## 【 0 0 5 0 】

特に指示されない限り、本発明により置換された基または置換基は、好ましくはハロゲン；SH；ニトロ；ヒドロキシル；シアノ；アミノ；スルファニル；ペンタフルオロ-<sup>6</sup>-スルファニル；ホルミル；ホルミルオキシ；ホルミルアミノ；カルバモイル；N-ヒドロキシカルバモイル；カルバメート；(ヒドロキシイミノ)- $C_1 \sim C_6$ -アルキル； $C_1 \sim C_8$ -アルキル； $C_1 \sim C_8$ -ハロゲンアルキル； $C_1 \sim C_8$ -アルキルオキシ； $C_1 \sim C_8$ -ハロゲンアルキルオキシ； $C_1 \sim C_8$ -アルキルチオ； $C_1 \sim C_8$ -ハロゲンアルキルチオ；トリ( $C_1 \sim C_8$ -アルキル)シリル；トリ( $C_1 \sim C_8$ -アルキル)シリル- $C_1 \sim C_8$ -アルキル； $C_3 \sim C_7$ -シクロアルキル； $C_3 \sim C_7$ -ハロシクロアルキル； $C_3 \sim C_7$ -シクロアルケニル； $C_3 \sim C_7$ -ハロシクロアルケニル； $C_4 \sim C_{10}$ -シクロアルキルアルキル； $C_4 \sim C_{10}$ -ハロシクロアルキルアルキル； $C_6 \sim C_{12}$ -シクロアルキルシクロアルキル；トリ( $C_1 \sim C_8$ -アルキル)シリル- $C_3 \sim C_7$ -シクロアルキル； $C_2 \sim C_8$ -アルケニル； $C_2 \sim C_8$ -アルキニル； $C_2 \sim C_8$ -アルケニルオキシ； $C_2 \sim C_8$ -ハロゲンアルケニルオキシ； $C_2 \sim C_8$ -アルキニルオキシ； $C_1 \sim C_8$ -アルキルアミノ；ジ- $C_1 \sim C_8$ -アルキルアミノ； $C_1 \sim C_8$ -ハロゲンアルキルアミノ；ジ- $C_1 \sim C_8$ -ハロゲンアルキルアミノ； $C_1 \sim C_8$ -アルキルアミノアルキル；ジ- $C_1 \sim C_8$ -アルキルアミノアルキル； $C_1 \sim C_8$ -アルコキシ； $C_1 \sim C_8$ -ハロゲノアルコキシ； $C_1 \sim C_8$ -シアノアルコキシ； $C_4 \sim C_8$ -シクロアルキルアルコキシ； $C_3 \sim C_6$ -シクロアルコキシ； $C_2 \sim C_8$ -アルコキシアルコキシ； $C_1 \sim C_8$ -アルキルカルボニルアルコキシ； $C_1 \sim C_8$ -アルキルスルファニル； $C_1 \sim C_8$ -ハロゲノアルキルスルファニル； $C_2 \sim C_8$ -アルケニルオキシ； $C_2 \sim C_8$ -ハロゲノアルケニルオキシ； $C_3 \sim C_8$ -アルキニルオキシ； $C_3 \sim C_8$ -ハロゲノアルキニルオキシ； $C_1 \sim C_8$ -アルキルカルボニル； $C_1 \sim C_8$ -ハロゲノアルキルカルボニル； $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキルカルボニル； $C_3 \sim C_8$ -ハロゲノシクロアルキルカルボニル； $C_1 \sim C_8$ -アルキルカルバモイル；ジ- $C_1 \sim C_8$ -アルキルカルバモイル；N- $C_1 \sim C_8$ -アルキルオキシカルバモイル； $C_1 \sim C_8$ -アルコキシカルバモイル；N- $C_1 \sim C_8$ -アルキル- $C_1 \sim C_8$ -アルコキシカルバモイル； $C_1 \sim C_8$ -アルコキシカルボニル； $C_1 \sim C_8$ -ハロゲノアルコキシカルボニル； $C_3 \sim C_8$ -シクロアルコキシカルボニル； $C_2 \sim C_8$ -アルコキシアルキルカルボニル； $C_2 \sim C_8$ -ハロゲノアルコキシアルキルカルボニル； $C_3 \sim C_{10}$ -シクロアルコキシアルキルカルボニル； $C_1 \sim C_8$ -アルキルアミノカルボニル；ジ- $C_1 \sim C_8$ -アルキルアミノカルボニル； $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキルアミノカルボニル； $C_1 \sim C_8$ -アルキルカルボニルオキシ； $C_1 \sim$

30

40

50

C<sub>8</sub> - ハロゲンアルキルカルボニルオキシ ; C<sub>3</sub> ~ C<sub>8</sub> - シクロアルキルカルボニルオキシ ; C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> - アルキルカルボニルアミノ ; C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> - ハロゲンアルキルカルボニルアミノ ; C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> - アルキルアミノカルボニルオキシ ; ジ - C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> - アルキルアミノカルボニルオキシ ; C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> - アルキルオキシカルボニルオキシ ; C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> - アルキルスルフィニル ; C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> - ハロゲンアルキルスルフィニル ; C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> - アルキルスルホニル ; C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> - ハロゲンアルキルスルホニル ; C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> - アルキルアミノスルファモイル ; ジ - C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> - アルキルアミノスルファモイル ; (C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> - アルコキシイミノ) - C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> - アルキル ; (C<sub>3</sub> ~ C<sub>7</sub> - シクロアルコキシイミノ) - C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> - アルキル ; ヒドロキシイミノ - C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> - アルキル ; (C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> - アルコキシイミノ) - C<sub>3</sub> ~ C<sub>7</sub> - シクロアルキル ; ヒドロキシイミノ - C<sub>3</sub> ~ C<sub>7</sub> - シクロアルキル ; (C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> - アルキルイミノ) - オキシ ; (C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> - アルキルイミノ) - オキシ - C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> - アルキル ; (C<sub>3</sub> ~ C<sub>7</sub> - シクロアルキルイミノ) - オキシ - C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> - アルキル ; (C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> - アルキルイミノ) - オキシ - C<sub>3</sub> ~ C<sub>7</sub> - シクロアルキル ; (C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> - アルケニルオキシイミノ) - C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> - アルキル ; (C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> - アルキニルオキシイミノ) - C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> - アルキル ; 2 - オキソピロリジン - 1 - イル、(ベンジルオキシイミノ) - C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> - アルキル ; C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> - アルコキシアルキル ; C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> - アルキルチオアルキル ; C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> - アルコキシアルコキシアルキル ; C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> - ハロゲンアルコキシアルキル ; ベンジル ; フェニル ; 5員ヘテロアリアル ; 6員ヘテロアリアル ; 7員ヘテロアリアル ; ベンジルオキシ ; フェニルオキシ ; ベンジルスルファニル ; ベンジルアミノ ; フェノキシ ; フェニルスルファニル ; またはフェニルアミノからなるリストから選択される1つまたは複数の基によって置換れていてもよく ; ベンジル、フェニル、5員ヘテロアリアル、6員ヘテロアリアル、ベンジルオキシまたはフェニルオキシは上記リストから選択される1つまたは複数の基によって置換されていてもよい。

#### 【0051】

特に指示しない限り、定義5員、6員もしくは7員ヘタリアルまたはヘテロアリアルは、N、OおよびSから選択される最大4個のヘテロ原子を含む、不飽和の複素環式5~7員環を含む：例えば2-フリル、3-フリル、2-チエニル、3-チエニル、2-ピロリル、3-ピロリル、1-ピロリル、3-ピラゾリル、4-ピラゾリル、5-ピラゾリル、1-ピラゾリル、1H-イミダゾール-2-イル、1H-イミダゾール-4-イル、1H-イミダゾール-5-イル、1H-イミダゾール-1-イル、2-オキサゾリル、4-オキサゾリル、5-オキサゾリル、2-チアゾリル、4-チアゾリル、5-チアゾリル、3-イソオキサゾリル、4-イソオキサゾリル、5-イソオキサゾリル、3-イソチアゾリル、4-イソチアゾリル、5-イソチアゾリル、1H-1,2,3-トリアゾール-1-イル、1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル、1H-1,2,3-トリアゾール-5-イル、2H-1,2,3-トリアゾール-2-イル、2H-1,2,3-トリアゾール-4-イル、1H-1,2,4-トリアゾール-3-イル、1H-1,2,4-トリアゾール-5-イル、1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル、4H-1,2,4-トリアゾール-3-イル、4H-1,2,4-トリアゾール-4-イル、1H-テトラゾール-1-イル、1H-テトラゾール-5-イル、2H-テトラゾール-2-イル、2H-テトラゾール-5-イル、1,2,4-オキサジアゾール-3-イル、1,2,4-オキサジアゾール-5-イル、1,2,4-チアジアゾール-3-イル、1,2,4-チアジアゾール-5-イル、1,3,4-オキサジアゾール-2-イル、1,3,4-チアジアゾール-2-イル、1,2,3-オキサジアゾール-4-イル、1,2,3-オキサジアゾール-5-イル、1,2,3-チアジアゾール-4-イル、1,2,3-チアジアゾール-5-イル、1,2,5-オキサジアゾール-3-イル、1,2,5-チアジアゾール-3-イル、2-ピリジニル、3-ピリジニル、4-ピリジニル、3-ピリダジニル、4-ピリダジニル、2-ピリミジニル、4-ピリミジニル、5-ピリミジニル、2-ピラジニル、1,3,5-トリアジン-2-イル、1,2,4-トリアジン-3-イル、1,2,4-トリアジン-5-イル、1,2,4-トリアジン-6-イルである。

#### 【0052】

置換基の性質に応じて、式(1)の化合物は、種々の可能な異性体形態、特に立体異性体、例えばEおよびZ、トレオおよびエリトロ、ならびに光学異性体、適切であれば互変異性体の混合物としても存在し得る。該当する場合、式(1)の化合物は、E異性体とZ異性

体の両方、およびトレオとエリトロの両方、および光学異性体、ならびにこれらの異性体の任意の混合物、ならびに可能な互変異性体形態を含む。

【0053】

置換基の性質に応じて、式(1)の化合物は、化合物中の不斉中心の数に応じた1つまたは複数の光学異性体またはキラル異性体形態で存在することができる。したがって、本発明は、光学異性体および全ての割合のそれらのラセミ混合物またはスカレミック(scalemic)混合物(「スカレミック」という用語は異なる割合のエナンチオマーの混合物を意味する)および全ての可能な立体異性体の混合物のいずれかを含む組合せに等しく関連する。ジアステレオ異性体および/または光学異性体は、当業者によってそれ自体公知の方法によって分離することができる。

10

【0054】

置換基の性質に応じて、式(1)の化合物はまた、化合物中の二重結合の数に応じた1つまたは複数の幾何異性体形態で存在することができる。したがって、本発明は、全ての幾何異性体および全ての割合の全ての可能な混合物に等しく関連する。幾何異性体は、当業者によってそれ自体公知の一般的な方法によって分離することができる。

【0055】

置換基の性質に応じて、式(1)の化合物はまた、環の置換基の相対位置(シン/アンチまたはシス/トランス)に応じた1つまたは複数の幾何異性体形態で存在することができる。したがって、本発明は、全てのシン/アンチ(またはシス/トランス)異性体および全ての割合の全ての可能なシン/アンチ(またはシス/トランス)混合物に等しく関連する。シン/アンチ(またはシス/トランス)異性体は、当業者によってそれ自体公知の一般的な方法によって分離することができる。

20

【0056】

式(1)の化合物および中間体の合成の説明

式(1)の化合物は、公知の先行技術の方法と同様に種々の経路によって(例えば、J. Agric. Food Chem. (2009) 57, 4854~4860; 欧州特許第0275955号明細書; 独国特許第4003180号明細書; 欧州特許第0113640号明細書; 欧州特許第0126430号明細書; 国際公開第2013/007767号パンフレットおよびその参考文献を参照)ならびに以下および本出願の実験部に概略的に示される合成経路によって得ることができる。特に指示しない限り、基Y、R、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、mおよびnは、式(1)の化合物について上に示される意味を有する。これらの定義を、式(1)の最終生成物だけでなく、同様に全ての中間体にも適用する。

30

【0057】

個々の化合物(1)をこれらの経路によって得ることができない場合、これらを他の化合物(1)の誘導体化によって調製することができる。

【0058】

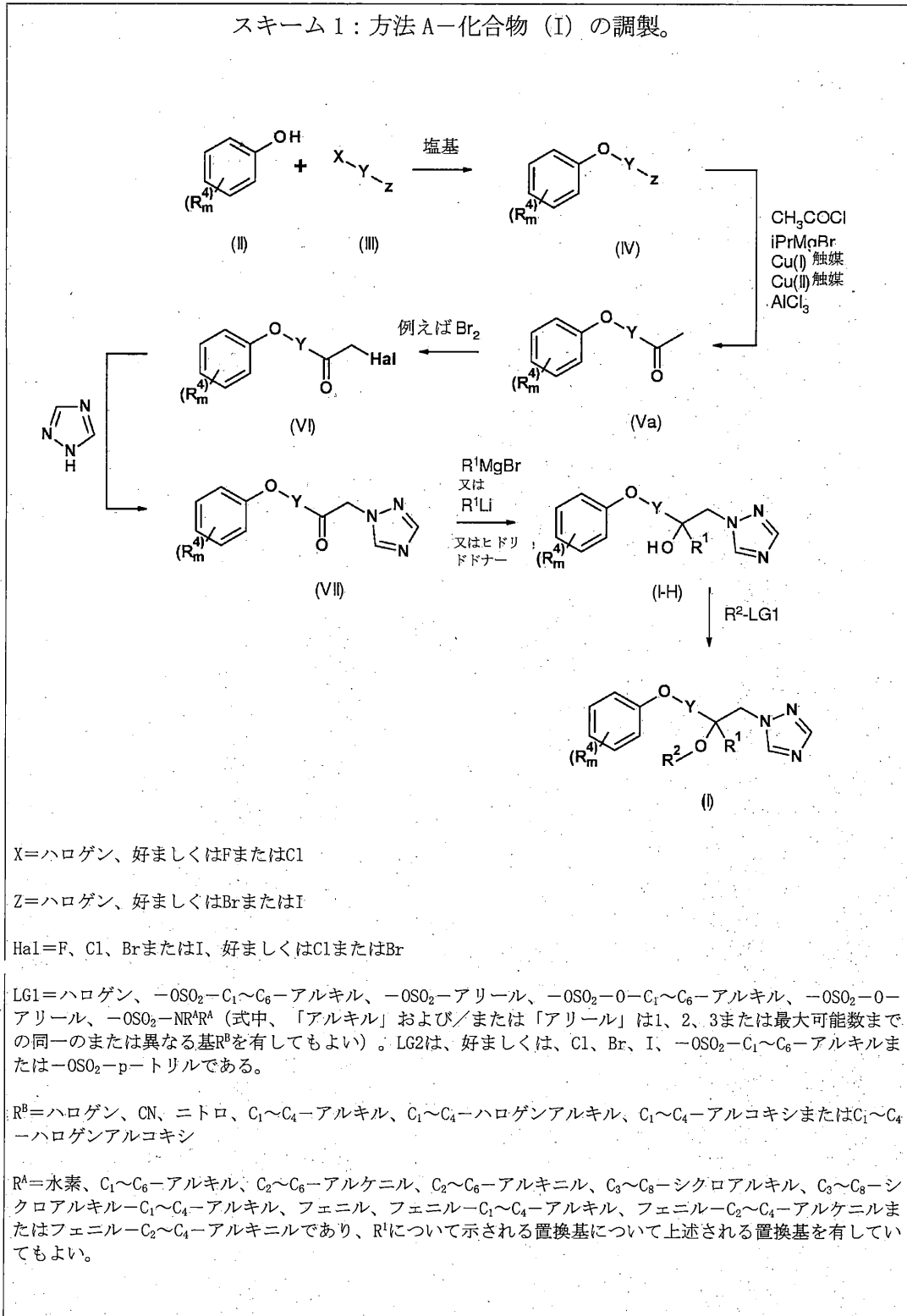
単に以下のスキームのより良い理解のために、式(1)のアルコールをアルコール(1-H)と命名したが、このようなアルコール(1-H)は上に定義される一般式(1)に含まれる。

【0059】

方法A(スキーム1):

40

【化6】



10

20

30

40

【0060】

化合物 (II) および (III) (スキーム1) を、文献に記載される方法によって対応する化合物 (IV)、およびその後に化合物 (Va)、(VI)、(VII)、(I-H) および (I) に変換することができる (例えば、国際公開第2013/007767号パンフレット参照)。フェノール (II) をアリール (III) (式中、XはFまたはClを表し、ZはBrまたはIを表す) と反

50



応させる。Zは特にBrであり、反応を場合により塩基の存在下で行って、化合物(IV)を得る。次いで、特にZがBrであるこれらの中間体を、マグネシウムとの反応により、またはイソプロピルマグネシウムハライドなどの試薬との金属交換反応によってグリニャール試薬に変換し、その後、塩化アセチルと反応させて、アセトフェノン(Va)を得る。これらの反応を、好ましくは、無水条件下で、CuCl、CuCl<sub>2</sub>、AlCl<sub>3</sub>、LiClおよびこれらの混合物などの触媒の存在下で行う。化合物(Va)を、次のステップで、 $\alpha$ -ハロケトン(VI)を得るために、例えばCl<sub>2</sub>またはBr<sub>2</sub>でハロゲン化することができる。反応を、好ましくは、ジエチルエーテル、メチルtert-ブチルエーテル、メタノールまたは酢酸などの有機溶媒中で行う。その後、 $\alpha$ 位のハロゲン、好ましくはClまたはBrを、1,2,4-トリアゾールによって置き換えることができる。好ましくは、この変換を、好ましくはテトラヒドロフラン、ジメチルホルムアミドまたはトルエンなどの有機溶媒の存在下、Na<sub>2</sub>CO<sub>3</sub>、K<sub>2</sub>CO<sub>3</sub>、Cs<sub>2</sub>CO<sub>3</sub>、NaOH、KOtBu、NaHまたはこれらの混合物などの塩基の存在下で行う。その後、ケトン(VII)をグリニャール試薬R<sup>1</sup>MgBrもしくは有機リチウム化合物R<sup>1</sup>Liなどの求核性基質または水素化ホウ素ナトリウムなどのヒドリド供与体と反応させてアルコール(I-H)を得る。これらの変換は、好ましくは無水条件下で、場合によりLaCl<sub>3</sub>·x2LiClまたはMgBr<sub>2</sub>·xOEt<sub>2</sub>などのルイス酸の存在下で行う。アルキル化剤R<sup>2</sup>-LGによるアルコール(I-H)のさらなる誘導体化後、一般式(1)の化合物を得ることができる。LGはハロゲン、アルキルスルホニル、アルキルスルホニルオキシおよびアリールスルホニルオキシ、好ましくはBr、Iおよびメチルスルホニルオキシなどの置換可能基である。これらの誘導体化は、場合によりNaHなどの塩基の存在下およびテトラヒドロフランなどの有機溶媒の存在下で行う。

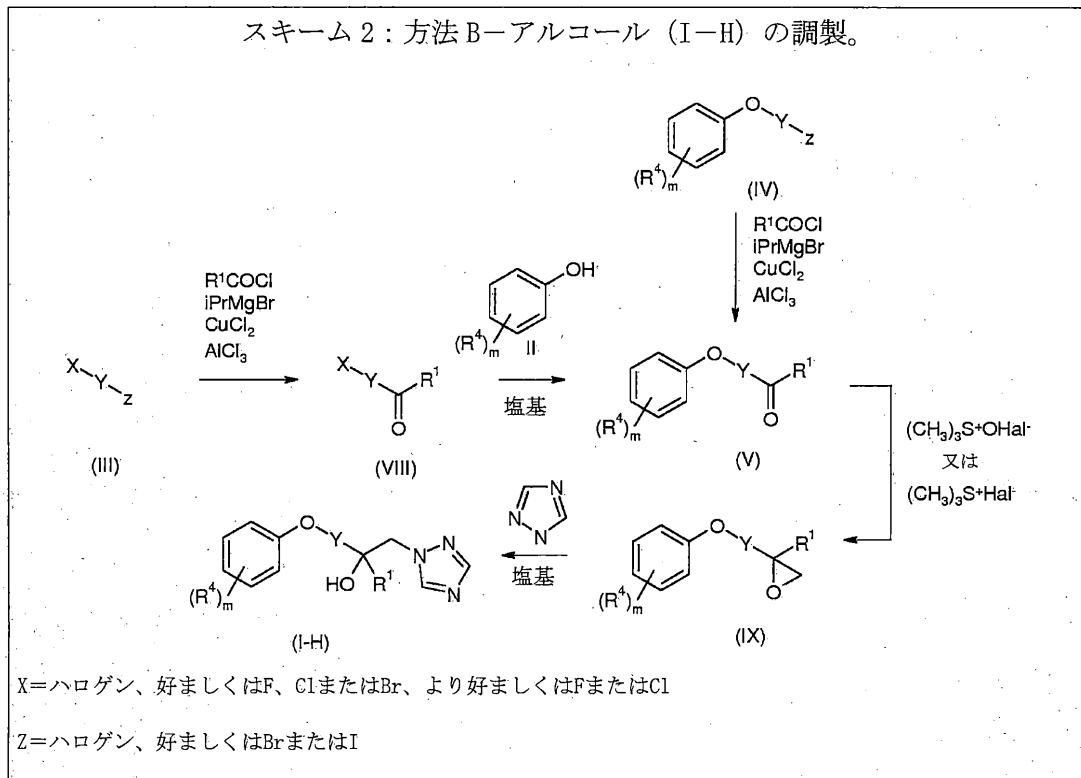
10

20

【0061】

方法B(スキーム2) :

【化7】



30

40

【0062】

特にZがBrである一般構造(III)の化合物を、マグネシウムとの反応により、またはイソプロピルマグネシウムハライドなどの試薬との金属交換反応によってグリニャール試薬

50

に変換し、その後、塩化アシルと反応させて、ケトン (VIII) を得る。これらの反応を、好ましくは、無水条件下で、 $\text{CuCl}_2$ 、 $\text{AlCl}_3$ 、 $\text{LiCl}$  およびこれらの混合物などの触媒の存在下で行う。その後、ケトン (VIII) を、場合により  $\text{K}_2\text{CO}_3$  または  $\text{Cs}_2\text{CO}_3$  などの塩基および DMF (ジメチルホルムアミド) などの溶媒の存在下で、フェノール (II) と反応させて、化合物 (V) を得る。あるいは、(IV) とマグネシウムまたは金属交換試薬との反応、およびその後の塩化アシル  $\text{R}^1\text{COCl}$  との反応によって、化合物 (V) を生成することができる。これらの反応を、好ましくは、無水条件下で、 $\text{CuCl}_2$ 、 $\text{AlCl}_3$ 、 $\text{LiCl}$  およびこれらの混合物などの触媒の存在下で行う (Z は好ましくは Br である)。その後、中間体 (V) を、文献に記載される方法によって対応するエポキシド (IX) に変換することができる (例えば、欧州特許第 461502 号明細書、独国特許第 3315681 号明細書、欧州特許第 291797 号明細書、国際公開第 2013/007767 号パンフレット)。中間体 (V) を、好ましくは水酸化ナトリウムなどの塩基の存在下で、好ましくはその場で調製され得るトリメチルスルホキソニウムまたはトリメチルスルホニウム塩、好ましくはトリメチルスルホキソニウムハライド、トリメチルスルホニウムハライド、トリメチルスルホキソニウムメチルサルフェートまたはトリメチルスルホニウムメチルサルフェートと反応させる。その後、化合物 (I-H) を得るために、エポキシド (IX) を 1, 2, 4-トリアゾールと反応させることができる。好ましくは、この変換を、好ましくはテトラヒドロフラン、ジメチルホルムアミドまたはトルエンなどの有機溶媒の存在下、 $\text{Na}_2\text{CO}_3$ 、 $\text{K}_2\text{CO}_3$ 、 $\text{Cs}_2\text{CO}_3$ 、 $\text{NaOH}$ 、 $\text{KOtBu}$ 、 $\text{NaH}$  またはこれらの混合物などの塩基の存在下で行う。

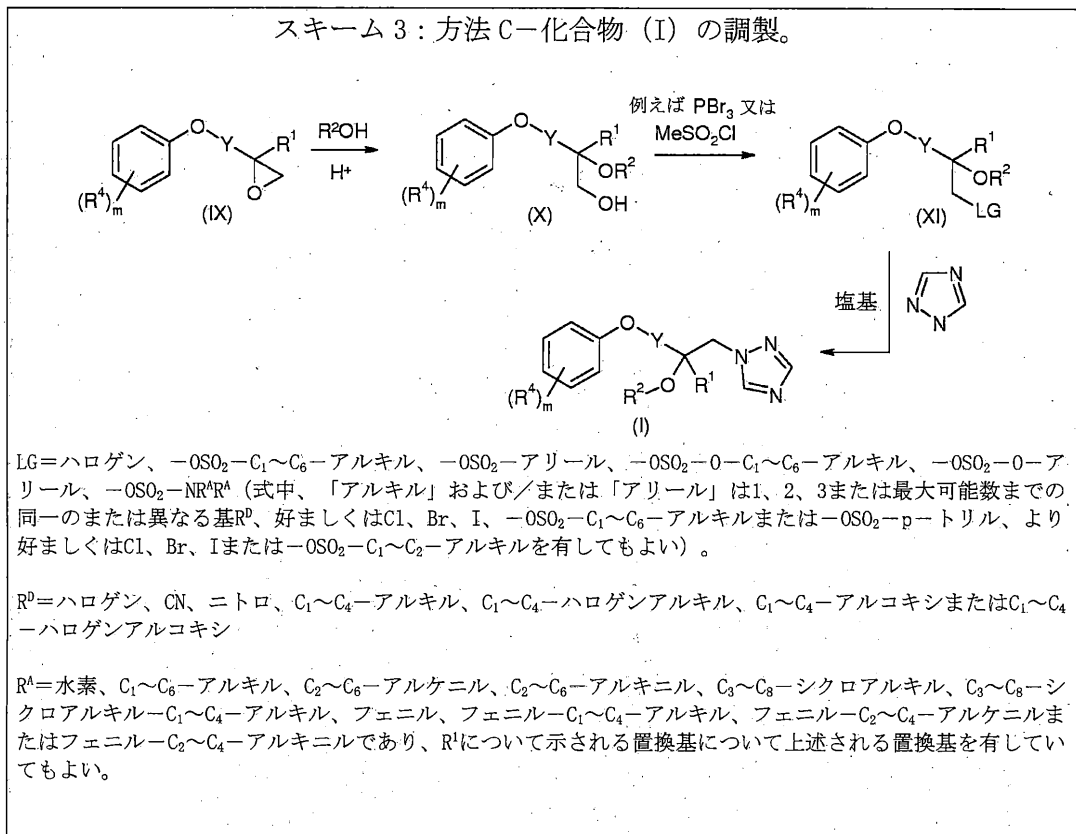
10

【0063】

方法 C (スキーム 3) :

【化 8】

20



30

40

【0064】

一般構造 (IX) のエポキシドをアルコール  $\text{R}^2\text{OH}$  と反応させてアルコール (X) を得ることができる。好ましくは、この変換を酸の存在下で行う。その後、アルコール (X) を求

50

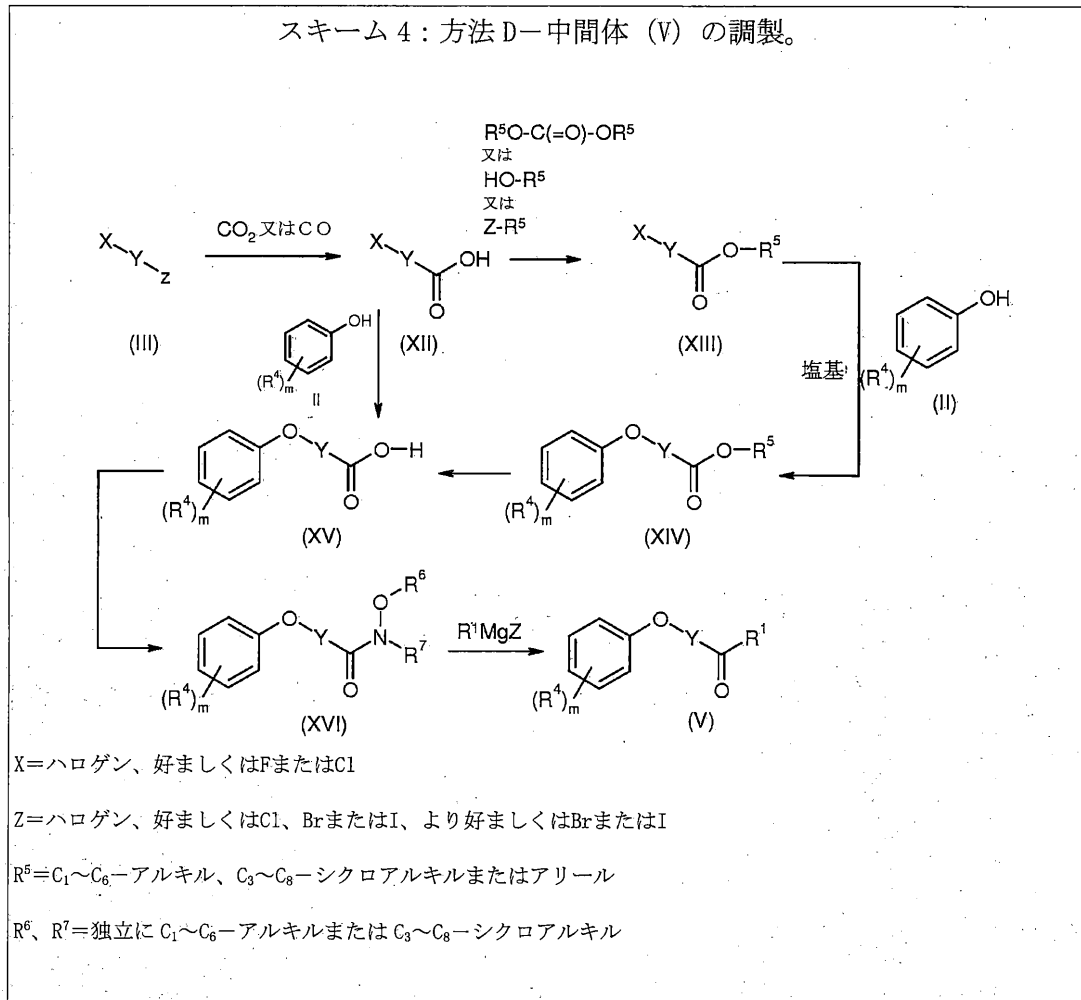
核置換反応のために調製する。これらの系統に沿って、化合物(X)中のアルコール官能基を $PBr_3$ 、 $PCl_3$ 、 $MeSO_2Cl$ 、塩化トシルまたは塩化チオニルなどのハロゲン化剤またはスルホン化剤と反応させて化合物(XI)を得る。その後、化合物(I)を得るために、中間体(XI)を1, 2, 4-トリアゾールと反応させることができる。場合により、この変換を、好ましくはテトラヒドロフラン、ジメチルホルムアミドまたはトルエンなどの有機溶媒の存在下、 $Na_2CO_3$ 、 $K_2CO_3$ 、 $Cs_2CO_3$ 、 $NaOH$ 、 $KOtBu$ 、 $NaH$ またはこれらの混合物などの塩基の存在下で行う。

【0065】

方法D(スキーム4)：

【化9】

10



20

30

【0066】

化合物(III)(スキーム4)を、文献に記載される方法によって対応する化合物(XII)、およびその後に化合物(XIII)、(XIV)、(XV)、(XVI)および(V)に変換することができる。あるいは、1つまたは複数の反応ステップをスキップしてもよい。これは、一定の保護基が必須ではなく、したがって方法Dが短縮され得る場合に特に当てはまる(例えば(XII)(XV))。

40

【0067】

$X$ がFまたはClを表し、 $Z$ がCl、BrまたはIを表す化合物(III)を場合により二酸化炭素またはギ酸塩と反応させて化合物(XII)を得る。この変換は、リチウム、マグネシウム、 $n$ -ブチルリチウム、メチルリチウムまたはニッケルなどの試薬または触媒の存在下で行う(例えば、Organic & Biomolecular Chemistry、8(7)、1688~1694; 2010; 国際公開第2003/033504号パンフレット; Organometallics、13(11)、4645~7; 1994およびそ

50

こに引用される参考文献)。あるいは、化合物(III)を、優先的にはPd(OAc)<sub>2</sub>およびCo(OAc)<sub>2</sub>などの触媒の存在下で、一酸化炭素またはギ酸塩とヒドロキシカルボニル化反応で反応させる(例えば、Dalton Transactions、40(29)、7632~7638; 2011; Synlett、(11)、1663~1666; 2006およびそこに引用される参考文献)。

【0068】

その後、一般構造(XIII)のエステルを得るために、酸(XII)を無水物R<sup>5</sup>O-C(=O)-OR<sup>5</sup>、アルコールHO-R<sup>5</sup>またはハロゲン化アルキルZ-R<sup>5</sup>と反応させる(例えば、Russian Journal of General Chemistry、70(9)、1371~1377、2000; 日本化学会欧文誌、76(8)、1645~1667、2003)。反応は、CDIもしくはDEADなどのカップリング試薬および/またはトリエチルアミンもしくはDMAPなどの塩基の存在下で優先的に行う。場合により、対応する酸塩化物が、アルコールHO-R<sup>5</sup>との反応が起こる前に形成される(例えば、国際公開第2007/059265号パンフレット)。その後、エステル(XIII)を、場合によりK<sub>2</sub>CO<sub>3</sub>、Cs<sub>2</sub>CO<sub>3</sub>、NEt<sub>3</sub>またはDABCOなどの塩基およびDMFなどの溶媒の存在下で、フェノール(II)と反応させて、化合物(XIV)を得る。以下の加水分解を、H<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>、HNO<sub>3</sub>もしくはp-トルエンスルホン酸などの酸の存在下またはKOHなどの塩基の存在下で行って酸(XV)を得ることができる。その後、酸(XV)をアルコキシアルキルアミン、優先的にメトキシメチルアミンと反応させることができる。対応する反応は、カルボジイミド(例えば、国際公開第2011/076744号パンフレット)、ジイミダゾリルケトンCDI、N-アルコキシ-N-アルキルカルバモイルクロリド(例えば、Bulletin of the Korean Chemical Society 2002、23、521~524)、S,S-ジ-2-ピリジルジチオカーボネート(例えば、Bulletin of the Korean Chemical Society 2001、22、421~423)、トリクロロメチルクロロホルメート(例えばSynthetic communications 2003、33、4013~4018)またはペプチドカップリング試薬HATUなどの試薬の存在下で行うことができる。中間体(V)は、優先的にTHFなどの溶媒中で、Weinrebアミド(XVI)をメチルマグネシウムブロミド、メチルマグネシウムクロリドまたはエチルマグネシウムブロミドなどのハロゲン化マグネシウムR<sub>1</sub>MgZと反応させた後に得ることができる。

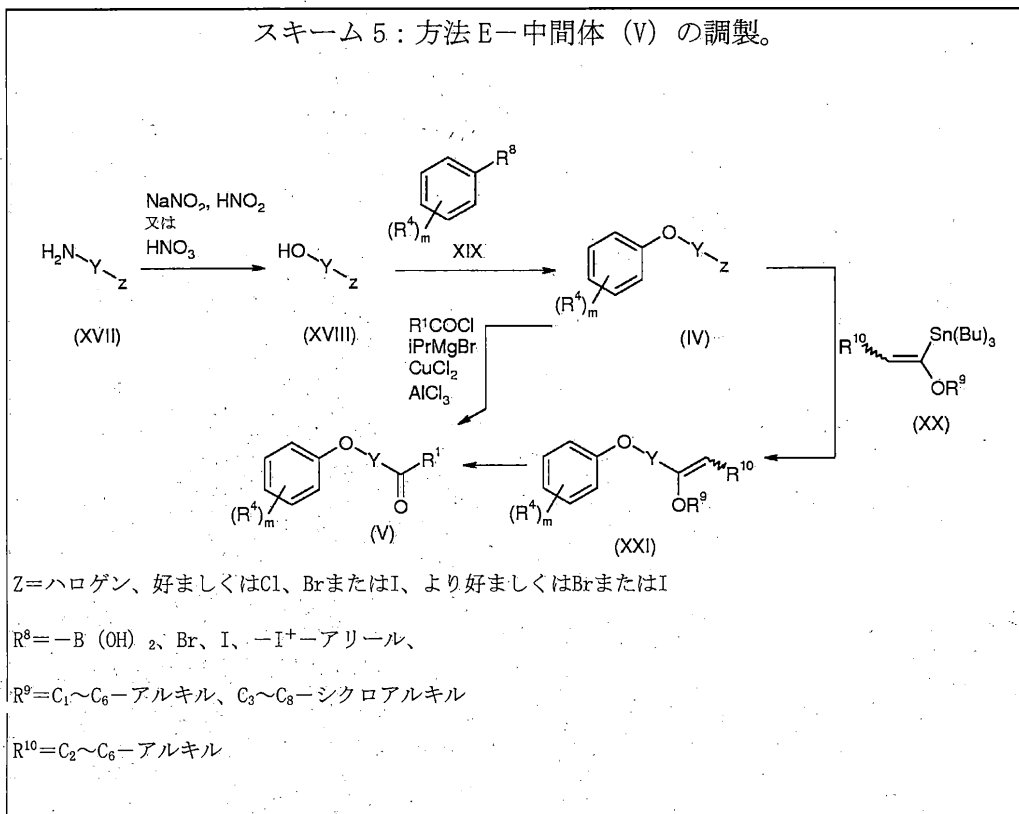
10

20

【0069】

方法E(スキーム5) :

## 【化10】



10

20

## 【0070】

アミン(XVII)(スキーム5)を、優先的に硫酸または塩酸ならびにNaNO<sub>2</sub>の存在下で、文献(例えばJournal of Medicinal Chemistry 1999、42、95~108; 国際公開第2007/017754号パンフレット; 国際公開第2007/016525号パンフレット; Tetrahedron Let. 2003、44、725~728)に記載される方法によって、対応するアルコール(XVIII)に変換することができる。その後、アルコール(XVIII)を、文献公知の方法(例えば、Chemistry - A European Journal 2012、18、1414014149; Organic Letters 2011、13、1552~1555; Synlett 2012、23、101~106; 国際公開第2005/040112号パンフレット; Organic Letters 2007、9、643~646; 国際公開第2009/044160号パンフレットおよびそこに引用される参考文献)によって、一般構造(IV)の化合物に変換することができる。化合物(XIX)は、例えば、場合により反応前にジアリールヨードニウム塩に変換されるアリールヨード、好ましくはCuもしくはCuIなどの触媒の存在下で反応するアリールプロミドもしくは-ヨード、または優先的にCu(OAc)<sub>2</sub>などの触媒の存在下で反応するアリールボロン酸もしくは-エステルであり得るだろう。化合物(IV)を、Pd(PPh<sub>3</sub>)<sub>4</sub>、PdCl<sub>2</sub>(PPh<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、PdCl<sub>2</sub>またはCuIなどの遷移金属触媒の存在下で、(XX)などのスタンナンと反応させることができる(例えば、国際公開第2011/126960号パンフレット; 国際公開第2011/088025号パンフレット; Journal of Organic Chemistry 1997、62、2774~2781; 国際公開第2005/019212号パンフレット)。その後、化合物(XXI)を、優先的にHClまたはH<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>などの酸の存在下で加水分解して、化合物(V)(式中、R<sup>1</sup>はC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>-アルキルによって表される)を得ることができる(例えば、Journal of Organic Chemistry 1990、55、3114~3118)。あるいは、(IV)とマグネシウムまたは金属交換試薬との反応、およびその後の塩化アシルR<sup>1</sup>COClとの反応によって、化合物(V)を生成することができる。これらの反応を、好ましくは、無水条件下で、CuCl<sub>2</sub>、AlCl<sub>3</sub>、LiClおよびこれらの混合物などの触媒の存在下で行う(Zは好ましくはBrである)。

30

40

## 【0071】

概要

50

式(1)の化合物を調製するための方法A~Eは、場合により、1種または複数の反応助剤を用いて行われる。

【0072】

有用な反応助剤は、適宜、無機もしくは有機塩基または酸受容体である。これらは、好ましくは、アルカリ金属またはアルカリ土類金属の酢酸塩、アミド、炭酸塩、炭酸水素塩、水素化物、水酸化物またはアルコキシド、例えば酢酸ナトリウム、酢酸カリウムまたは酢酸カルシウム、リチウムアミド、ナトリウムアミド、カリウムアミドまたはカルシウムアミド、炭酸ナトリウム、炭酸カリウムまたは炭酸カルシウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウムまたは炭酸水素カルシウム、水素化リチウム、水素化ナトリウム、水素化カリウムまたは水素化カルシウム、水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウムまたは水酸化カルシウム、*n*-ブチルリチウム、*sec*-ブチルリチウム、*tert*-ブチルリチウム、リチウムジイソプロピルアミド、リチウムビス(トリメチルシリル)アミド、ナトリウムメトキシド、エトキシド、*n*-または*i*-プロポキシド、*n*-、*i*-、*s*-または*t*-ブトキシドまたはカリウムメトキシド、エトキシド、*n*-または*i*-プロポキシド、*n*-、*i*-、*s*-または*t*-ブトキシド；および塩基性有機窒素化合物、例えばトリメチルアミン、トリエチルアミン、トリプロピルアミン、トリブチルアミン、エチルジイソプロピルアミン、*N,N*-ジメチルシクロヘキシルアミン、ジシクロヘキシルアミン、エチルジシクロヘキシルアミン、*N,N*-ジメチルアニリン、*N,N*-ジメチルベンジルアミン、ピリジン、2-メチル-、3-メチル-、4-メチル-、2,4-ジメチル-、2,6-ジメチル-、3,4-ジメチル-および3,5-ジメチルピリジン、5-エチル-2-メチルピリジン、4-ジメチルアミノピリジン、*N*-メチルピペリジン、1,4-ジアザビシクロ[2.2.2]-オクタン(DABCO)、1,5-ジアザビシクロ[4.3.0]-ノナ-5-エン(DBN)または1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]-ウンデカ-7-エン(DBU)も含む。

10

20

【0073】

有用な反応助剤は、適宜、無機または有機酸である。これらは、好ましくは、無機酸、例えばフッ化水素酸、塩化水素酸、臭化水素酸およびヨウ化水素酸、硫酸、リン酸および硝酸、ならびに酸性塩、例えばNaHSO<sub>4</sub>およびKHSO<sub>4</sub>、または有機酸、例えばギ酸、炭酸およびアルカン酸、例えば酢酸、トリフルオロ酢酸、トリクロロ酢酸およびプロピオン酸、ならびにグリコール酸、チオシアン酸、乳酸、コハク酸、クエン酸、安息香酸、桂皮酸、シュウ酸、飽和またはモノ-もしくはジ不飽和C<sub>6</sub>~C<sub>20</sub>脂肪酸、アルキルスルホン酸モノエステル、アルキルスルホン酸(炭素原子数1~20の直鎖または分岐アルキル基を有するスルホン酸)、アリールスルホン酸またはアリールジスルホン酸(1個または2個のスルホン酸基を有する、フェニルおよびナフチルなどの芳香族基)、アルキルホスホン酸(炭素原子数1~20の直鎖または分岐アルキル基を有するホスホン酸)、アリールホスホン酸またはアリールジホスホン酸(1個または2個のホスホン酸基を有する、フェニルおよびナフチルなどの芳香族基)(アルキルおよびアリール基はさらなる置換基を有していてもよく、例えば*p*-トルエンスルホン酸、サリチル酸、*p*-アミノサリチル酸、2-フェノキシ安息香酸、2-アセトキシ安息香酸等が挙げられる)を含む。

30

【0074】

方法A~Eは、場合により、1種または複数の希釈剤を用いて行われる。有用な希釈剤は事実上全ての不活性有機溶媒である。上記の方法A~Eについて特に指示されない限り、これらは、好ましくは、脂肪族および芳香族の場合によりハロゲン化された炭化水素、例えばペンタン、ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン、石油エーテル、ベンジン、リグロイン、ベンゼン、トルエン、キシレン、塩化メチレン、塩化エチレン、クロロホルム、四塩化炭素、クロロベンゼンおよび*o*-ジクロロベンゼン、エーテル、例えばジエチルエーテル、ジブチルエーテルおよびメチル*tert*-ブチルエーテル、グリコールジメチルエーテルおよびジグリコールジメチルエーテル、テトラヒドロフランおよびジオキサン、ケトン、例えばアセトン、メチルエチルケトン、メチルイソプロピルケトンおよびメチルイソブチルケトン、エステル、例えば酢酸メチルおよび酢酸エチル、ニトリル、例えばアセトニトリルおよびプロピオニトリル、アミド、例えばジメチルホルムアミド、ジメチルアセトア

40

50

ミドおよびN-メチルピロリドン、ならびにジメチルスルホキシド、テトラメチレンスルホンおよびヘキサメチルホスホラミドおよびDMPUを含む。

【0075】

本方法では、反応温度を比較的広範囲内で変えることができる。一般に、使用される温度は -78 ~ 250 の間、好ましくは -78 ~ 150 の間の温度である。

【0076】

反応時間は、反応の規模および反応温度の関数として変化するが、一般的には数分~48時間の間である。

【0077】

本発明による方法は、一般的に標準圧力下で行われる。しかしながら、高圧または減圧下で実施することも可能である。

【0078】

本発明による方法を実施するために、各場合で要求される出発物質は一般的にほぼ等モル量で使用される。しかしながら、各場合で使用される成分の1つを比較的過剰に使用することも可能である。

【0079】

反応が終了した後、化合物を場合により慣用的な分離技術の1つによって反応混合物から分離する。必要であれば、化合物を再結晶またはクロマトグラフィーによって精製する。

【0080】

適切であれば、方法A~Eで、出発化合物の塩および/またはN-オキシドを使用することもできる。

【0081】

本発明はさらに、本発明の一部を形成する式(1)の化合物の新規な中間体に関する。

【0082】

式(1)の化合物は、例えば、酸付加塩または金属塩錯体として、生理学的に許容される塩に変換することができる。

【0083】

上で定義される置換基の性質に応じて、式(1)の化合物は酸性または塩基性の特性を有し、塩、適切な場合には、分子内塩、あるいは無機もしくは有機酸または塩基または金属イオンとの付加物を形成することもできる。式(1)の化合物がアミノ、アルキルアミノまたは塩基性特性を誘導する他の基を有する場合、これらの化合物を酸と反応させて塩を得ることができる、またはこれらの化合物が合成において塩として直接得られる。式(1)の化合物がヒドロキシル、カルボキシルまたは酸性特性を誘導する他の基を有する場合、これらの化合物を塩基と反応させて塩を得ることができる。適当な塩基は、例えばアルカリ金属およびアルカリ土類金属の水酸化物、炭酸塩、重炭酸塩、特にナトリウム、カリウム、マグネシウムおよびカルシウムのもので、さらにアンモニア、(C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>)-アルキル基を有する一級、二級および三級アミン、(C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>)-アルカノールのモノ-、ジ-およびトリアルカノールアミン、コリンおよび同様にクロロコリンである。

【0084】

このようにして得られる塩も殺真菌特性を有する。

【0085】

無機酸の例は、フッ化水素、塩化水素、臭化水素およびヨウ化水素などのハロゲン化水素酸、硫酸、リン酸ならびに硝酸、ならびにNaHSO<sub>4</sub>およびKHSO<sub>4</sub>などの酸性塩である。適当な有機酸は、例えばギ酸、炭酸およびアルカン酸、例えば酢酸、トリフルオロ酢酸、トリクロロ酢酸およびプロピオン酸、ならびにグリコール酸、チオシアン酸、乳酸、コハク酸、クエン酸、安息香酸、桂皮酸、マレイン酸、フマル酸、酒石酸、ソルビン酸、シュウ酸、アルキルスルホン酸(炭素原子数1~20の直鎖または分岐アルキル基を有するスルホン酸)、アリールスルホン酸またはアリールジスルホン酸(1個または2個のスルホン酸基を有する、フェニルおよびナフチルなどの芳香族基)、アルキルホスホン酸(炭素原子数

10

20

30

40

50

1~20の直鎖または分岐アルキル基を有するホスホン酸)、アリアルホスホン酸またはアリアルジホスホン酸(1個または2個のホスホン酸基を有する、フェニルおよびナフチルなどの芳香族基)(アルキルおよびアリアル基はさらなる置換基を有していてもよく、例えばp-トルエンスルホン酸、1,5-ナフタレンジスルホン酸、サリチル酸、p-アミノサリチル酸、2-フェノキシ安息香酸、2-アセトキシ安息香酸等が挙げられる)である。

【0086】

適当な金属イオンは、特に、第2主族の元素、特にカルシウムおよびマグネシウム、第3および第4主族の元素、特にアルミニウム、スズおよび鉛、ならびに第1~第8遷移族の元素、特にクロム、マンガン、鉄、コバルト、ニッケル、銅、亜鉛などである。第4周期の元素の金属イオンが特に好ましい。ここで、金属は、それらがとることができる種々の価数で存在することができる。

10

【0087】

式(1)の化合物の酸付加塩を、簡単な様式で、塩を形成するための慣用的な方法によって、例えば式(1)の化合物を適当な不活性溶媒に溶解し、酸、例えば塩酸を添加することによって得て、これらを公知の様式で、例えば濾過によって単離し、必要に応じて、不活性有機溶媒で洗浄することによって精製することができる。

【0088】

塩の適当なアニオンは、好ましくは以下の酸：ハロゲン化水素酸、例えば塩酸および臭化水素酸、さらにリン酸、硝酸および硫酸から誘導されるものである。

【0089】

式(1)の化合物の金属塩錯体は、慣用の方法によって、例えば金属塩をアルコール、例えばエタノールに溶解し、溶液を式(1)の化合物に添加することによって簡単な様式で得ることができる。金属塩錯体は、公知の様式で、例えば濾過によって単離することができ、必要に応じて、再結晶によって精製することができる。

20

【0090】

中間体の塩は、式(1)の化合物の塩について上述の方法によって調製することもできる。

【0091】

式(1)の化合物またはその中間体のN-オキシドは、慣用的な方法によって、例えば過酸化水素( $H_2O_2$ )、過酸、例えばペルオキシ硫酸またはペルオキシカルボン酸、例えばメタ-クロロペルオキシ安息香酸またはペルオキシモノ硫酸(カロ酸)を用いたN-酸化によって簡単な様式で得ることができる。

30

【0092】

例えば、対応するN-オキシドは、慣用的な酸化方法を用いて、例えば、化合物(1)をメタクロロ過安息香酸などの有機過酸(例えば、国際公開第2003/64572号パンフレットまたはJ. Med. Chem. 38(11)、1892~1903、1995);または過酸化水素などの無機酸化剤(例えば、J. Heterocyc. Chem. 18(7)、1305~1308、1981)またはオキシソ(例えば、J. Am. Chem. Soc. 123(25)、5962~5973、2001)で処理することによって、化合物(1)から出発して調製することができる。酸化は、純粋なモノ-N-オキシドまたは異なるN-オキシドの混合物をもたらす得、これを、クロマトグラフィーなどの慣用的な方法によって分離することができる。

40

【0093】

さらなる活性化化合物

本発明による活性化化合物の組合せは、(B)少なくとも1種の以下の群から選択されるさらなる活性化化合物を含む

- (1) エルゴステロール合成の阻害剤、
- (2) 複合体IまたはIIにおける呼吸鎖の阻害剤、
- (3) 複合体IIIにおける呼吸鎖の阻害剤、
- (4) 有糸分裂および細胞分裂の阻害剤、
- (5) 多部位作用を有することができる化合物、

50



- (6) 宿主防御を誘導することができる化合物、
- (7) アミノ酸および/またはタンパク質生合成の阻害剤、
- (8) ATP産生の阻害剤、
- (9) 細胞壁合成の阻害剤、
- (10) 脂質および膜合成の阻害剤、
- (11) メラニン生合成の阻害剤、
- (12) 核酸合成の阻害剤、
- (13) シグナル伝達の阻害剤、
- (14) 脱共役剤として作用することができる化合物、
- (15) 他の殺真菌剤。

10

## 【0094】

本発明による好ましい化合物組合せは、(B)少なくとも1種の以下から選択されるさらなる活性化化合物を含む：

(1.001) シプロコナゾール、(1.002) ジフェノコナゾール、(1.003) エポキシコナゾール、(1.004) フェンヘキサミド、(1.005) フェンプロピジン、(1.006) フェンプロピモルフ、(1.007) フェンピラザミン、(1.008) フルキンコナゾール、(1.009) フルトリアホル、(1.010) イマザリル、(1.011) 硫酸イマザリル、(1.012) イブコナゾール、(1.013) メトコナゾール、(1.014) ミクロブタニル、(1.015) パクロブトラゾール、(1.016) プロクロラズ、(1.017) プロピコナゾール、(1.018) プロチオコナゾール、(1.019) ピリソキサゾール、(1.020) スピロキサミン、(1.021) テブコナゾール、(1.022) テトラコナゾール、(1.023) トリアジメノール、(1.024) トリデモルフ、(1.025) トリチコナゾール、(1.026) (1R, 2S, 5S) - 5 - (4 - クロロベンジル) - 2 - (クロロメチル) - 2 - メチル - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イルメチル) シクロペンタノール、(1.027) (1S, 2R, 5R) - 5 - (4 - クロロベンジル) - 2 - (クロロメチル) - 2 - メチル - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イルメチル) - シクロペンタノール、(1.028) (2R) - 2 - (1 - クロロシクロプロピル) - 4 - [(1R) - 2, 2 - ジクロロシクロプロピル] - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) ブタン - 2 - オール、(1.029) (2R) - 2 - (1 - クロロシクロプロピル) - 4 - [(1S) - 2, 2 - ジクロロシクロプロピル] - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) ブタン - 2 - オール、(1.030) (2R) - 2 - [4 - (4 - クロロフェノキシ) - 2 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) プロパン - 2 - オール、(1.031) (2S) - 2 - (1 - クロロシクロプロピル) - 4 - [(1R) - 2, 2 - ジクロロシクロプロピル] - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) ブタン - 2 - オール、(1.032) (2S) - 2 - (1 - クロロシクロプロピル) - 4 - [(1S) - 2, 2 - ジクロロシクロプロピル] - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) ブタン - 2 - オール、(1.033) (2S) - 2 - [4 - (4 - クロロフェノキシ) - 2 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) プロパン - 2 - オール、(1.034) (R) - [3 - (4 - クロロ - 2 - フルオロフェニル) - 5 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) - 1, 2 - オキサゾール - 4 - イル] (ピリジン - 3 - イル) メタノール、(1.035) (S) - [3 - (4 - クロロ - 2 - フルオロフェニル) - 5 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) - 1, 2 - オキサゾール - 4 - イル] (ピリジン - 3 - イル) メタノール、(1.036) [3 - (4 - クロロ - 2 - フルオロフェニル) - 5 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) - 1, 2 - オキサゾール - 4 - イル] (ピリジン - 3 - イル) メタノール、(1.037) 1 - ( { (2R, 4S) - 2 - [2 - クロロ - 4 - (4 - クロロフェノキシ) フェニル] - 4 - メチル - 1, 3 - ジオキシラン - 2 - イル } メチル ) - 1H - 1, 2, 4 - トリアゾール、(1.038) 1 - ( { (2S, 4S) - 2 - [2 - クロロ - 4 - (4 - クロロフェノキシ) フェニル] - 4 - メチル - 1, 3 - ジオキシラン - 2 - イル } メチル ) - 1H - 1, 2, 4 - トリアゾール、(1.039) 1 - { [3 - (2 - クロロフェニル) - 2 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) オキシラン - 2 - イル] メチル } - 1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 5 - イルチオシアネート、(1.040) 1 - { [rel (2R, 3R) - 3 - (2 - クロロフェニル) - 2 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) オキシラン - 2 - イル] メチ

20

30

40

50

ル} - 1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 5 - イルチオシアネート、(1.041) 1 - { [rel (2R, 3S) - 3 - (2 - クロロフェニル) - 2 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) オキシラン - 2 - イル] メチル} - 1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 5 - イルチオシアネート、(1.042) 2 - [(2R, 4R, 5R) - 1 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2, 6, 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2, 4 - ジヒドロ - 3H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1.043) 2 - [(2R, 4R, 5S) - 1 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2, 6, 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2, 4 - ジヒドロ - 3H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1.044) 2 - [(2R, 4S, 5R) - 1 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2, 6, 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2, 4 - ジヒドロ - 3H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1.045) 2 - [(2R, 4S, 5S) - 1 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2, 6, 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2, 4 - ジヒドロ - 3H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1.046) 2 - [(2S, 4R, 5R) - 1 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2, 6, 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2, 4 - ジヒドロ - 3H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1.047) 2 - [(2S, 4R, 5S) - 1 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2, 6, 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2, 4 - ジヒドロ - 3H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1.048) 2 - [(2S, 4S, 5R) - 1 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2, 6, 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2, 4 - ジヒドロ - 3H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1.049) 2 - [(2S, 4S, 5S) - 1 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2, 6, 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2, 4 - ジヒドロ - 3H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1.050) 2 - [1 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2, 6, 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2, 4 - ジヒドロ - 3H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1.051) 2 - [2 - クロロ - 4 - (2, 4 - ジクロロフェノキシ) フェニル] - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) プロパン - 2 - オール、(1.052) 2 - [2 - クロロ - 4 - (4 - クロロフェノキシ) フェニル] - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) ブタン - 2 - オール、(1.053) 2 - [4 - (4 - クロロフェノキシ) - 2 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) ブタン - 2 - オール、(1.054) 2 - [4 - (4 - クロロフェノキシ) - 2 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) ペンタン - 2 - オール、(1.055) 2 - [4 - (4 - クロロフェノキシ) - 2 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) プロパン - 2 - オール、(1.056) 2 - { [3 - (2 - クロロフェニル) - 2 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) オキシラン - 2 - イル] メチル} - 2, 4 - ジヒドロ - 3H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1.057) 2 - { [rel (2R, 3R) - 3 - (2 - クロロフェニル) - 2 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) オキシラン - 2 - イル] メチル} - 2, 4 - ジヒドロ - 3H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1.058) 2 - { [rel (2R, 3S) - 3 - (2 - クロロフェニル) - 2 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) オキシラン - 2 - イル] メチル} - 2, 4 - ジヒドロ - 3H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1.059) 5 - (4 - クロロベンジル) - 2 - (クロロメチル) - 2 - メチル - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) シクロペンタノール、(1.060) 5 - (アリルスルファニル) - 1 - { [3 - (2 - クロロフェニル) - 2 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) オキシラン - 2 - イル] メチル} - 1H - 1, 2, 4 - トリアゾール、(1.061) 5 - (アリルスルファニル) - 1 - { [rel (2R, 3R) - 3 - (2 - クロロフェニル) - 2 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) オキシラン - 2 - イル] メチル} - 1H - 1, 2, 4 - トリアゾール、(1.062) 5 - (アリルスルファニル) - 1 - { [rel (2R, 3S) - 3 - (2 - クロロフェニル) - 2 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) オキシラン - 2 - イル] メチル} - 1H - 1, 2, 4 - トリアゾール、(1.063) N' - (2, 5 - ジメチル - 4 - { [3 - (1, 1, 2, 2 - テトラフルオロエトキシ) フェニル] スルファニル} フェニル) - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、(1.064) N' - (2, 5 - ジメチル - 4 - { [3 - (2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ) フェニル] スルファニル} フェニル) - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、(1.065) N' - (2, 5 - ジメチル - 4 - { [3 - (2, 2, 3, 3 - テトラフルオロプロボキシ) フェ

10

20

30

40

50

ニル]スルファニル}フェニル)-N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(1.066)N'- (2,5-ジメチル-4-{[3-(ペンタフルオロエトキシ)フェニル]スルファニル}フェニル)-N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(1.067)N'- (2,5-ジメチル-4-{3-[ (1,1,2,2-テトラフルオロエチル)スルファニル]フェノキシ}フェニル)-N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(1.068)N'- (2,5-ジメチル-4-{3-[ (2,2,2-トリフルオロエチル)スルファニル]フェノキシ}フェニル)-N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(1.069)N'- (2,5-ジメチル-4-{3-[ (2,2,3,3-テトラフルオロプロピル)スルファニル]フェノキシ}フェニル)-N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(1.070)N'- (2,5-ジメチル-4-{3-[ (ペンタフルオロエチル)スルファニル]フェノキシ}フェニル)-N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(1.071)N'- (2,5-ジメチル-4-フェノキシフェニル)-N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(1.072)N'- (4-{[3-(ジフルオロメトキシ)フェニル]スルファニル}-2,5-ジメチルフェニル)-N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(1.073)N'- (4-{3-[ (ジフルオロメチル)スルファニル]フェノキシ}-2,5-ジメチルフェニル)-N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(1.074)N'- [5-プロモ-6-(2,3-ジヒドロ-1H-インデン-2-イルオキシ)-2-メチルピリジン-3-イル]-N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(1.075)N'- {4-[ (4,5-ジクロロ-1,3-チアゾール-2イル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}-N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(1.076)N'- {5-プロモ-6-[ (1R)-1-(3,5-ジフルオロフェニル)エトキシ]-2-メチルピリジン-3-イル}-N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(1.077)N'- {5-プロモ-6-[ (1S)-1-(3,5-ジフルオロフェニル)エトキシ]-2-メチルピリジン-3-イル}-N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(1.078)N'- {5-プロモ-6-[ (シス-4-イソプロピルシクロヘキシル)オキシ]-2-メチルピリジン-3-イル}-N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(1.079)N'- {5-プロモ-6-[ (トランス-4-イソプロピルシクロヘキシル)オキシ]-2-メチルピリジン-3-イル}-N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(1.080)N'- {5-プロモ-6-[1-(3,5-ジフルオロフェニル)エトキシ]-2-メチルピリジン-3-イル}-N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(1.081)メフェントリフルコナゾールおよび(1.082)イプフェントリフルコナゾールからなる群から選択されるエルゴステロール合成の阻害剤、

(2.001)ベンゾピンジフルピル、(2.002)ピキサフェン、(2.003)ボスカリド、(2.004)カルボキシ、(2.005)フルオピラム、(2.006)フルトラニル、(2.007)フラキサピロキサド、(2.008)フラメトピル、(2.009)イソフェタミド、(2.010)イソピラザム(アンチエピマー-エナンチオマー-1R,4S,9S)、(2.011)イソピラザム(アンチエピマー-エナンチオマー-1S,4R,9R)、(2.012)イソピラザム(アンチエピマー-ラセミ体1RS,4SR,9SR)、(2.013)イソピラザム(シンエピマー-ラセミ体1RS,4SR,9RSとアンチエピマー-ラセミ体1RS,4SR,9SRの混合物)、(2.014)イソピラザム(シンエピマー-エナンチオマー-1R,4S,9R)、(2.015)イソピラザム(シンエピマー-エナンチオマー-1S,4R,9S)、(2.016)イソピラザム(シンエピマー-ラセミ体1RS,4SR,9RS)、(2.017)ペンフルフェン、(2.018)ペンチオピラド、(2.019)ピジフルメトフェン、(2.020)ピラジフルミド、(2.021)セダキサン、(2.022)1,3-ジメチル-N-(1,1,3-トリメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル)-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.023)1,3-ジメチル-N-[ (3R)-1,1,3-トリメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル]-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.024)1,3-ジメチル-N-[ (3S)-1,1,3-トリメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル]-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.025)1-メチル-3-(トリフルオロメチル)-N-[2'-(トリフルオロメチル)ピフェニル-2-イル]-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.026)2-フルオロ-6-(トリフルオロメチル)-N-(1,1,3-トリメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル)ベンズアミ

ド、(2.027)3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-N-(1,1,3-トリメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル)-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.028)3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-N-[(3R)-1,1,3-トリメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル]-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.029)3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-N-[(3S)-1,1,3-トリメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル]-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.030)3-(ジフルオロメチル)-N-(7-フルオロ-1,1,3-トリメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.031)3-(ジフルオロメチル)-N-[(3R)-7-フルオロ-1,1,3-トリメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル]-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.032)3-(ジフルオロメチル)-N-[(3S)-7-フルオロ-1,1,3-トリメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル]-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.033)5,8-ジフルオロ-N-[2-(2-フルオロ-4-{[4-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-イル]オキシ}フェニル)エチル]キナゾリン-4-アミン、(2.034)N-(2-シクロペンチル-5-フルオロベンジル)-N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.035)N-(2-tert-ブチル-5-メチルベンジル)-N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.036)N-(2-tert-ブチルベンジル)-N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.037)N-(5-クロロ-2-エチルベンジル)-N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.038)N-(5-クロロ-2-イソプロピルベンジル)-N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.039)N-[(1R,4S)-9-(ジクロロメチレン)-1,2,3,4-テトラヒドロ-1,4-メタノナフタレン-5-イル]-3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.040)N-[(1S,4R)-9-(ジクロロメチレン)-1,2,3,4-テトラヒドロ-1,4-メタノナフタレン-5-イル]-3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.041)N-[1-(2,4-ジクロロフェニル)-1-メトキシプロパン-2-イル]-3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.042)N-[2-クロロ-6-(トリフルオロメチル)ベンジル]-N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.043)N-[3-クロロ-2-フルオロ-6-(トリフルオロメチル)ベンジル]-N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.044)N-[5-クロロ-2-(トリフルオロメチル)ベンジル]-N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.045)N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-N-(2-フルオロ-6-イソプロピルベンジル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.047)N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-N-(2-イソプロピル-5-メチルベンジル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.048)N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-N-(2-イソプロピルベンジル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボチオアミド、(2.049)N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-N-(2-イソプロピルベンジル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.050)N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-N-(5-フルオロ-2-イソプロピルベンジル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.051)N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-N-(2-エチル-4,5-ジメチルベンジル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、

ル - 4 - カルボキサミド、(2.052)N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - N - (2 - エチル - 5 - フルオロベンジル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.053)N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - N - (2 - エチル - 5 - メチルベンジル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.054)N - シクロプロピル - N - (2 - シクロプロピル - 5 - フルオロベンジル) - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.055)N - シクロプロピル - N - (2 - シクロプロピル - 5 - メチルベンジル) - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミドおよび(2.056)N - シクロプロピル - N - (2 - シクロプロピルベンジル) - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミドからなる群から選択される複合体IまたはIIにおける呼吸鎖の阻害剤、

(3.001)アメトクトラジン、(3.002)アミスルプロム、(3.003)アゾキシストロピン、(3.004)クメトキシストロピン、(3.005)クモキシストロピン、(3.006)シアゾファミド、(3.007)ジモキシストロピン、(3.008)エノキサストロピン、(3.009)ファモキサドン、(3.010)フェナミドン、(3.011)フルフェノキシストロピン、(3.012)フルオキサストロピン、(3.013)クレソキシム - メチル、(3.014)メトミノストロピン、(3.015)オリサストロピン、(3.016)ピコキシストロピン、(3.017)ピラクロストロピン、(3.018)ピラメトストロピン、(3.019)ピラオキシストロピン、(3.020)トリフロキシストロピン、(3.021)(2E) - 2 - {2 - [ ( { [ (1E) - 1 - (3 - { [ (E) - 1 - フルオロ - 2 - フェニルビニル ] オキシ } フェニル ) エチリデン ] アミノ } オキシ ) メチル ] フェニル } - 2 - (メトキシイミノ) - N - メチルアセトアミド、(3.022)(2E, 3Z) - 5 - { [1 - (4 - クロロフェニル) - 1H - ピラゾール - 3 - イル ] オキシ } - 2 - (メトキシイミノ) - N, 3 - ジメチルペンタ - 3 - エンアミド、(3.023)(2R) - 2 - {2 - [ (2, 5 - ジメチルフェノキシ) メチル ] フェニル } - 2 - メトキシ - N - メチルアセトアミド、(3.024)(2S) - 2 - {2 - [ (2, 5 - ジメチルフェノキシ) メチル ] フェニル } - 2 - メトキシ - N - メチルアセトアミド、(3.025)(3S, 6S, 7R, 8R) - 8 - ベンジル - 3 - [ ( {3 - [ (イソブチリルオキシ) メトキシ ] - 4 - メトキシピリジン - 2 - イル } カルボニル ) アミノ ] - 6 - メチル - 4, 9 - ジオキソ - 1, 5 - ジオキソナン - 7 - イル2 - メチルプロパノエート、(3.026)2 - {2 - [ (2, 5 - ジメチルフェノキシ) メチル ] フェニル } - 2 - メトキシ - N - メチルアセトアミド、(3.027)N - (3 - エチル - 3, 5, 5 - トリメチルシクロヘキシル) - 3 - ホルムアミド - 2 - ヒドロキシベンズアミド、(3.028)(2E, 3Z) - 5 - { [1 - (4 - クロロ - 2 - フルオロフェニル) - 1H - ピラゾール - 3 - イル ] オキシ } - 2 - (メトキシイミノ) - N, 3 - ジメチルペンタ - 3 - エンアミドおよび(3.029)メチル {5 - [3 - (2, 4 - ジメチルフェニル) - 1H - ピラゾール - 1 - イル ] - 2 - メチルベンジル } カルバメートからなる群から選択される複合体IIIにおける呼吸鎖の阻害剤、

(4.001)カルベンダジム、(4.002)ジエトフェンカルブ、(4.003)エタボキサム、(4.004)フルオピコリド、(4.005)ペンシクロン、(4.006)チアベンダゾール、(4.007)チオファネート - メチル、(4.008)ゾキサミド、(4.009)3 - クロロ - 4 - (2, 6 - ジフルオロフェニル) - 6 - メチル - 5 - フェニルピリダジン、(4.010)3 - クロロ - 5 - (4 - クロロフェニル) - 4 - (2, 6 - ジフルオロフェニル) - 6 - メチルピリダジン、(4.011)3 - クロロ - 5 - (6 - クロロピリジン - 3 - イル) - 6 - メチル - 4 - (2, 4, 6 - トリフルオロフェニル)ピリダジン、(4.012)4 - (2 - プロモ - 4 - フルオロフェニル) - N - (2, 6 - ジフルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1H - ピラゾール - 5 - アミン、(4.013)4 - (2 - プロモ - 4 - フルオロフェニル) - N - (2 - プロモ - 6 - フルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1H - ピラゾール - 5 - アミン、(4.014)4 - (2 - プロモ - 4 - フルオロフェニル) - N - (2 - プロモフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1H - ピラゾール - 5 - アミン、(4.015)4 - (2 - プロモ - 4 - フルオロフェニル) - N - (2 - クロロ - 6 - フルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1H - ピラゾール - 5 - アミン、(4.016)4 - (2 - プロモ - 4 - フルオロフェニル) - N - (2 - クロロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1H

10

20

30

40

50

- ピラゾール - 5 - アミン、(4.017) 4 - (2 - ブロモ - 4 - フルオロフェニル) - N - (2 - フルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1H - ピラゾール - 5 - アミン、(4.018) 4 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - N - (2, 6 - ジフルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1H - ピラゾール - 5 - アミン、(4.019) 4 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - N - (2 - クロロ - 6 - フルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1H - ピラゾール - 5 - アミン、(4.020) 4 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - N - (2 - クロロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1H - ピラゾール - 5 - アミン、(4.021) 4 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - N - (2 - フルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1H - ピラゾール - 5 - アミン、(4.022) 4 - (4 - クロロフェニル) - 5 - (2, 6 - ジフルオロフェニル) - 3, 6 - ジメチルピリダジン、(4.023) N - (2 - ブロモ - 6 - フルオロフェニル) - 4 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1H - ピラゾール - 5 - アミン、(4.024) N - (2 - ブロモフェニル) - 4 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1H - ピラゾール - 5 - アミンおよび(4.025) N - (4 - クロロ - 2, 6 - ジフルオロフェニル) - 4 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1H - ピラゾール - 5 - アミンからなる群から選択される有糸分裂および細胞分裂の阻害剤、
- (5.001) ボルドー混合物、(5.002) カプタホール、(5.003) キャプタン、(5.004) クロクタロニル、(5.005) 水酸化銅、(5.006) ナフテン酸銅、(5.007) 酸化銅、(5.008) オキシ塩化銅、(5.009) 硫酸銅(2+)、(5.010) ジチアノン、(5.011) ドジン、(5.012) フォルベット、(5.013) マンコゼブ、(5.014) マネブ、(5.015) メチラム、(5.016) メチラム亜鉛、(5.017) オキシニ - 銅、(5.018) プロピネブ、(5.019) 多硫化カルシウムを含む硫黄および硫黄調製物、(5.020) チラム、(5.021) ジネブ、(5.022) ジラムおよび(5.023) 6 - エチル - 5, 7 - ジオキソ - 6, 7 - ジヒドロ - 5H - ピロロ [3', 4' : 5, 6] [1, 4] ジチイノ [2, 3 - c] [1, 2] チアゾール - 3 - カルボニトリルからなる群から選択される多部位作用を有することができる化合物、
- (6.001) アシベンゾラル - S - メチル、(6.002) イソチアニル、(6.003) プロベナゾールおよび(6.004) チアジニルからなる群から選択される宿主防御を誘導することができる化合物、
- (7.001) シプロジニル、(7.002) カスガマイシン、(7.003) カスガマイシン塩酸塩水和物、(7.004) オキシテトラサイクリン、(7.005) ピリメタニルおよび(7.006) 3 - (5 - フルオロ - 3, 3, 4, 4 - テトラメチル - 3, 4 - ジヒドロイソキノリン - 1 - イル) キノロンからなる群から選択されるアミノ酸および/またはタンパク質生合成の阻害剤、
- (8.001) シルチオフアムからなる群から選択されるATP産生の阻害剤、
- (9.001) ベンチアパリカルブ、(9.002) ジメトモルフ、(9.003) フルモルフ、(9.004) イプロパリカルブ、(9.005) マンジプロバミド、(9.006) ビリモルフ、(9.007) パリフェナレート、(9.008) (2E) - 3 - (4 - tert - ブチルフェニル) - 3 - (2 - クロロピリジン - 4 - イル) - 1 - (モルホリン - 4 - イル) プロバ - 2 - エン - 1 - オンおよび(9.009) (2Z) - 3 - (4 - tert - ブチルフェニル) - 3 - (2 - クロロピリジン - 4 - イル) - 1 - (モルホリン - 4 - イル) プロバ - 2 - エン - 1 - オンからなる群から選択される細胞壁合成の阻害剤、
- (10.001) プロパモカルブ、(10.002) プロパモカルブ塩酸塩および(10.003) トルクロホスメチルからなる群から選択される脂質および膜合成の阻害剤、
- (11.001) トリシクラゾールおよび(11.002) 2, 2, 2 - トリフルオロエチル {3 - メチル - 1 - [(4 - メチルベンゾイル) アミノ] ブタン - 2 - イル} カルバメートからなる群から選択されるメラニン生合成の阻害剤、
- (12.001) ベナラキシル、(12.002) ベナラキシル - M (キララキシル)、(12.003) メタラキシルおよび(12.004) メタラキシル - M (メフェノキサム) からなる群から選択される核酸合成の阻害剤、
- (13.001) フルジオキソニル、(13.002) イプロジオン、(13.003) プロシミドン、

(13.004) プロキナジド、(13.005) キノキシフェンおよび(13.006) ピンクロゾリンからなる群から選択されるシグナル伝達の阻害剤、

(14.001) フルアジナムおよび(14.002) メブチルジノキャップからなる群から選択される脱共役剤として作用することができる化合物、

(15.001) アブシジン酸、(15.002) ベンチアゾール、(15.003) ベトキサジン、(15.004) カプシマイシン、(15.005) カルボン、(15.006) チノメチオナト、(15.007) クフラネブ、(15.008) シフルフェナミド、(15.009) シモキサニル、(15.010) シプロスルファミド、(15.011) フルチアニル、(15.012) ホセチル - アルミニウム、(15.013) ホセチル - カルシウム、(15.014) ホセチル - ナトリウム、(15.015) メチルイソチオシアネート、(15.016) メトラフェノン、(15.017) ミルジオマイシン、(15.018) ナタマイシン、(15.019) ニッケルジメチルジチオカルバメート、(15.020) ニトロタル - イソプロピル、(15.021) オキサモカルブ、(15.022) オキサチアピプロリン、(15.023) オキシフェンチイン、(15.024) ペンタクロロフェノールおよび塩、(15.025) 亜リン酸およびその塩、(15.026) プロパモカルブ - フォセチレート、(15.027) ピリオフェノン (クラザフェノン)、(15.028) テブフロキン、(15.029) テクロフタラム、(15.030) トルニファニド、(15.031) 1 - (4 - {4 - [(5R) - 5 - (2,6 - ジフルオロフェニル) - 4,5 - ジヒドロ - 1,2 - オキサゾール - 3 - イル] - 1,3 - チアゾール - 2 - イル} ピペリジン - 1 - イル) - 2 - [5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1H - ピラゾール - 1 - イル] エタノン、(15.032) 1 - (4 - {4 - [(5S) - 5 - (2,6 - ジフルオロフェニル) - 4,5 - ジヒドロ - 1,2 - オキサゾール - 3 - イル] - 1,3 - チアゾール - 2 - イル} ピペリジン - 1 - イル) - 2 - [5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1H - ピラゾール - 1 - イル] エタノン、(15.033) 2 - (6 - ベンジルピリジン - 2 - イル) キナゾリン、(15.034) 2,6 - ジメチル - 1H,5H - [1,4] ジチノ [2,3 - c : 5,6 - c'] ジピロール - 1,3,5,7 (2H,6H) - テトロン、(15.035) 2 - [3,5 - ビス (ジフルオロメチル) - 1H - ピラゾール - 1 - イル] - 1 - [4 - (4 - {5 - [2 - (プロパ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) フェニル] - 4,5 - ジヒドロ) - 1,2 - オキサゾール - 3 - イル} - 1,3 - チアゾール - 2 - イル) ピペリジン - 1 - イル] エタノン、(15.036) 2 - [3,5 - ビス (ジフルオロメチル) - 1H - ピラゾール - 1 - イル] - 1 - [4 - (4 - {5 - [2 - クロロ - 6 - (プロパ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) フェニル] - 4,5 - ジヒドロ - 1,2 - オキサゾール - 3 - イル} - 1,3 - チアゾール - 2 - イル) ピペリジン - 1 - イル] エタノン、(15.037) 2 - [3,5 - ビス (ジフルオロメチル) - 1H - ピラゾール - 1 - イル] - 1 - [4 - (4 - {5 - [2 - フルオロ - 6 - (プロパ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) フェニル] - 4,5 - ジヒドロ - 1,2 - オキサゾール - 3 - イル} - 1,3 - チアゾール - 2 - イル) ピペリジン - 1 - イル] エタノン、(15.038) 2 - [6 - (3 - フルオロ - 4 - メトキシフェニル) - 5 - メチルピリジン - 2 - イル] キナゾリン、(15.039) 2 - { (5R) - 3 - [2 - (1 - { [3,5 - ビス (ジフルオロメチル) - 1H - ピラゾール - 1 - イル] アセチル} ピペリジン - 4 - イル) - 1,3 - チアゾール - 4 - イル] - 4,5 - ジヒドロ - 1,2 - オキサゾール - 5 - イル} - 3 - クロロフェニルメタンスルホネート、(15.040) 2 - { (5S) - 3 - [2 - (1 - { [3,5 - ビス (ジフルオロメチル) - 1H - ピラゾール - 1 - イル] アセチル} ピペリジン - 4 - イル) - 1,3 - チアゾール - 4 - イル] - 4,5 - ジヒドロ - 1,2 - オキサゾール - 5 - イル} - 3 - クロロフェニルメタンスルホネート、(15.041) 2 - {2 - [(7,8 - ジフルオロ - 2 - メチルキノリン - 3 イル) オキシ] - 6 - フルオロフェニル} プロパン - 2 - オール、(15.042) 2 - {2 - フルオロ - 6 - [(8 - フルオロ - 2 - メチルキノリン - 3 - イル) オキシ] フェニル} プロパン - 2 - オール、(15.043) 2 - {3 - [2 - (1 - { [3,5 - ビス (ジフルオロメチル) - 1H - ピラゾール - 1 - イル] アセチル} ピペリジン - 4 - イル) - 1,3 - チアゾール - 4 - イル] - 4,5 - ジヒドロ - 1,2 - オキサゾール - 5 - イル} - 3 - クロロフェニルメタンスルホネート、(15.044) 2 - {3 - [2 - (1 - { [3,5 - ビス (ジフルオロメチル) - 1H - ピラゾール - 1 - イル] アセチル} ピペリジン - 4 - イル) - 1,3 - チアゾール - 4 - イル] - 4,5 - ジヒドロ - 1,2 - オキサゾール - 5 - イル} フェニルメタンスルホネート、(15.045) 2 - フェニルフェノー

ルおよび塩、(15.046)3-(4,4,5-トリフルオロ-3,3-ジメチル-3,4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン、(15.047)3-(4,4-ジフルオロ-3,3-ジメチル-3,4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン、(15.048)4-アミノ-5-フルオロピリミジン-2-オール(互変異性型:4-アミノ-5-フルオロピリミジン-2(1H))-オン)、(15.049)4-オキソ-4-[ (2-フェニルエチル)アミノ]ブタン酸、(15.050)5-アミノ-1,3,4-チアジアゾール-2-チオール、(15.051)5-クロロ-N'-フェニル-N'-(プロパ-2-イン-1-イル)チオフエン-2-スルホノヒドラジド、(15.052)5-フルオロ-2-[ (4-フルオロベンジル)オキシ]ピリミジン-4-アミン、(15.053)5-フルオロ-2-[ (4-メチルベンジル)オキシ]ピリミジン-4-アミン、(15.054)9-フルオロ-2,2-ジメチル-5-(キノリン-3-イル)-2,3-ジヒドロ-1,4-ベンゾオキサゼピン、(15.055)ブタ-3-イン-1-イル{6-[ ( { [ (Z) - (1-メチル-1H-テトラゾール-5-イル) (フェニル)メチレン]アミノ } オキシ)メチル]ピリジン-2-イル}カルバメート、(15.056)エチル(2Z)-3-アミノ-2-シアノ-3-フェニルアクリレート、(15.057)フェナジン-1-カルボン酸、(15.058)プロピル3,4,5-トリヒドロキシベンゾエート、(15.059)キノリン-8-オール、(15.060)キノリン-8-オールサルフェート(2:1)、(15.061)tert-ブチル{6-[ ( { [ (1-メチル-1H-テトラゾール-5-イル) (フェニル)メチレン]アミノ } オキシ)メチル]ピリジン-2-イル}カルバメートおよび(15.062)5-フルオロ-4-イミノ-3-メチル-1-[ (4-メチルフェニル)スルホニル]-3,4-ジヒドロピリミジン-2(1H)-オンからなる群から選択される、他の殺真菌剤。

10

20

#### 【0095】

本発明によるより好ましい化合物組合せは、(B)少なくとも1種の以下から選択されるさらなる活性化化合物を含む：

(1.001)シプロコナゾール、(1.002)ジフェノコナゾール、(1.003)エボキシコナゾール、(1.004)フェンヘキサミド、(1.010)イマザリル、(1.012)イブコナゾール、(1.013)メトコナゾール、(1.017)プロピコナゾール、(1.018)プロチオコナゾール、(1.020)スピロキサミン、(1.021)テブコナゾール、(1.026)(1R,2S,5S)-5-(4-クロロベンジル)-2-(クロロメチル)-2-メチル-1-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イルメチル)シクロペンタノール、(1.027)(1S,2R,5R)-5-(4-クロロベンジル)-2-(クロロメチル)-2-メチル-1-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イルメチル)シクロペンタノール、(1.059)5-(4-クロロベンジル)-2-(クロロメチル)-2-メチル-1-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イルメチル)シクロペンタノール、(1.081)メフェントリフルコナゾールおよび(1.082)イブフェントリフルコナゾール、

30

40

(2.001)ベンゾピンジフルピル、(2.002)ピキサフェン、(2.003)ボスカリド、(2.005)フルオピラム、(2.007)フルキサピロキサド、(2.009)イソフェタミド、(2.010)イソピラザム(アンチエピマー-エナンチオマー-1R,4S,9S)、(2.011)イソピラザム(アンチエピマー-エナンチオマー-1S,4R,9R)、(2.012)イソピラザム(アンチエピマー-ラセミ体1RS,4SR,9SR)、(2.013)イソピラザム(シンエピマー-ラセミ体1RS,4SR,9RSとアンチエピマー-ラセミ体1RS,4SR,9SRの混合物)、(2.014)イソピラザム(シンエピマー-エナンチオマー-1R,4S,9R)、(2.015)イソピラザム(シンエピマー-エナンチオマー-1S,4R,9S)、(2.016)イソピラザム(シンエピマー-ラセミ体1RS,4SR,9RS)、(2.017)ペンフルフェン、(2.018)ペンチオピラド、(2.019)ピジフルメトフェン、(2.021)セダキサソ、(2.027)3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-N-(1,1,3-トリメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル)-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.030)3-(ジフルオロメチル)-N-(7-フルオロ-1,1,3-トリメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.038)N-(5-クロロ-2-イソプロピルベンジル)-N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、

50



(3.003) アゾキシストロピン、(3.007) ジモキシストロピン、(3.012) フルオキサストロピン、(3.013) クレソキシム - メチル、(3.016) ピコキシストロピン、(3.017) ピラクロストロピン、(3.020) トリフロキシストロピン、(3.025) (3S, 6S, 7R, 8R) - 8 - ベンジル - 3 - [ ( { 3 - [ ( イソブチリルオキシ ) メトキシ ] - 4 - メトキシピリジン - 2 - イル } カルボニル ) アミノ ] - 6 - メチル - 4, 9 - ジオキソ - 1, 5 - ジオキソナン - 7 - イル 2 - メチルプロパノエート、(3.026) 2 - { 2 - [ ( 2, 5 - ジメチルフェノキシ ) メチル ] フェニル } - 2 - メトキシ - N - メチルアセトアミド、  
 (4.005) ペンシクロン、(4.007) チオファネート - メチル、(4.012) 4 - ( 2 - ブロモ - 4 - フルオロフェニル ) - N - ( 2, 6 - ジフルオロフェニル ) - 1, 3 - ジメチル - 1H - ピラゾール - 5 - アミン、(4.015) 4 - ( 2 - ブロモ - 4 - フルオロフェニル ) - N - ( 2 - クロロ - 6 - フルオロフェニル ) - 1, 3 - ジメチル - 1H - ピラゾール - 5 - アミン、(4.025) N - ( 4 - クロロ - 2, 6 - ジフルオロフェニル ) - 4 - ( 2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル ) - 1, 3 - ジメチル - 1H - ピラゾール - 5 - アミン、  
 (5.003) キャプタン、(5.004) クロロタロニル、(5.011) ドジン、(5.012) フォルペット、(5.013) マンコゼブ、(5.015) メチラム、(5.018) プロピネブ、  
 (6.002) イソチアニル、  
 (7.001) シプロジニル、(7.005) ピリメタニル、  
 (12.003) メタラキシル、(12.004) メタラキシル - M ( メフェノキサム )、  
 (13.001) フルジオキソニル、(13.002) イプロジオン、(13.004) プロキナジド、  
 (13.005) キノキシフェン、  
 (14.001) フルアジナム、(14.002) メブチルジノキャップ、  
 (15.008) シフルフェナミド、(15.010) シプロスルファミド、(15.011) フルチアニル、(15.012) ホセチル - アルミニウム、(15.016) メトラフェノン、(15.027) ピリオフェノン ( クラザフェノン ) および (15.047) 3 - ( 4, 4 - ジフルオロ - 3, 3 - ジメチル - 3, 4 - ジヒドロイソキノリン - 1 - イル ) キノロン、(15.048) 4 - アミノ - 5 - フルオロピリミジン - 2 - オール ( 互変異性型 : 4 - アミノ - 5 - フルオロピリミジン - 2 ( 1H ) - オン )、(15.052) 5 - フルオロ - 2 - [ ( 4 - フルオロベンジル ) オキシ ] ピリミジン - 4 - アミン、(15.053) 5 - フルオロ - 2 - [ ( 4 - メチルベンジル ) オキシ ] ピリミジン - 4 - アミン、(15.062) 5 - フルオロ - 4 - イミノ - 3 - メチル - 1 - [ ( 4 - メチルフェニル ) スルホニル ] - 3, 4 - ジヒドロピリミジン - 2 ( 1H ) - オン。

10

20

30

## 【 0 0 9 6 】

本発明によるなおさらに好ましい化合物組合せは、(B) 少なくとも1種の以下から選択されるさらなる活性化化合物を含む：

(1.002) ジフェノコナゾール、(1.010) イマザリル、(1.012) イブコナゾール、(1.018) プロチオコナゾール、(1.020) スピロキサミン、(1.021) テブコナゾール、(1.026) (1R, 2S, 5S) - 5 - ( 4 - クロロベンジル ) - 2 - ( クロロメチル ) - 2 - メチル - 1 - ( 1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イルメチル ) シクロペンタノール、(1.027) (1S, 2R, 5R) - 5 - ( 4 - クロロベンジル ) - 2 - ( クロロメチル ) - 2 - メチル - 1 - ( 1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イルメチル ) シクロペンタノール、(1.059) 5 - ( 4 - クロロベンジル ) - 2 - ( クロロメチル ) - 2 - メチル - 1 - ( 1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イルメチル ) シクロペンタノール、(1.081) メフェントリフルコナゾールおよび(1.082) イブフェントリフルコナゾール、  
 (2.001) ベンゾピンジフルピル、(2.002) ピキサフェン、(2.005) フルオピラム、(2.007) フルキサピロキサド、(2.017) ペンフルフェン、(2.018) ペンチオピラド、(2.019) ピジフルメトフェン、(2.021) セダキサン、(2.027) 3 - ( ジフルオロメチル ) - 1 - メチル - N - ( 1, 1, 3 - トリメチル - 2, 3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 4 - イル ) - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.030) 3 - ( ジフルオロメチル ) - N - ( 7 - フルオロ - 1, 1, 3 - トリメチル - 2, 3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 4 - イル ) - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.038) N - ( 5 - クロロ - 2 - イソプロピルベンジル ) - N - シクロプロピル - 3 - ( ジフルオロメチル ) - 5 - フルオロ - 1 - メ

40

50

チル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、

(3.003) アゾキシストロピン、(3.012) フルオキサストロピン、(3.016) ピコキシストロピン、(3.017) ピラクロストロピン、(3.020) トリフロキシストロピン、(3.025) (3S, 6S, 7R, 8R) - 8 - ベンジル - 3 - [ ( { 3 - [ ( イソブチリルオキシ ) メトキシ ] - 4 - メトキシピリジン - 2 - イル } カルボニル ) アミノ ] - 6 - メチル - 4, 9 - ジオキソ - 1, 5 - ジオキソナン - 7 - イル2 - メチルプロパノエート、(3.026) 2 - { 2 - [ ( 2, 5 - ジメチルフェノキシ ) メチル ] フェニル } - 2 - メトキシ - N - メチルアセトアミド、

(4.005) ペンシクロン、(4.007) チオファネート - メチル、(4.012) 4 - ( 2 - ブロモ - 4 - フルオロフェニル ) - N - ( 2, 6 - ジフルオロフェニル ) - 1, 3 - ジメチル - 1H - ピラゾール - 5 - アミン、(4.015) 4 - ( 2 - ブロモ - 4 - フルオロフェニル ) - N - ( 2 - クロロ - 6 - フルオロフェニル ) - 1, 3 - ジメチル - 1H - ピラゾール - 5 - アミン、(4.025) N - ( 4 - クロロ - 2, 6 - ジフルオロフェニル ) - 4 - ( 2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル ) - 1, 3 - ジメチル - 1H - ピラゾール - 5 - アミン、

(5.004) クロロタロニル、(5.011) ドジン、(5.012) フォルペット、(5.013) マンコゼブ、(5.018) プロピネブ、

(6.002) イソチアニル、

(7.005) ピリメタニル、

(12.003) メタラキシル、(12.004) メタラキシル - M (メフェノキサム)、

(13.001) フルジオキソニル、(13.004) プロキナジド、

(14.001) フルアジナム、(14.002) メブチルジノキャップ、

(15.008) シフルフェナミド、(15.027) ピリオフェノン (クラザフェノン)、(15.047) 3 - ( 4, 4 - ジフルオロ - 3, 3 - ジメチル - 3, 4 - ジヒドロイソキノリン - 1 - イル ) キノロン、(15.048) 4 - アミノ - 5 - フルオロピリミジン - 2 - オール ( 互変異性型 : 4 - アミノ - 5 - フルオロピリミジン - 2 ( 1H ) - オン )、(15.052) 5 - フルオロ - 2 - [ ( 4 - フルオロベンジル ) オキシ ] ピリミジン - 4 - アミン、(15.053) 5 - フルオロ - 2 - [ ( 4 - メチルベンジル ) オキシ ] ピリミジン - 4 - アミン、(15.062) 5 - フルオロ - 4 - イミノ - 3 - メチル - 1 - [ ( 4 - メチルフェニル ) スルホニル ] - 3, 4 - ジヒドロピリミジン - 2 ( 1H ) - オン。

【 0 0 9 7 】

本発明による最も好ましい化合物組合せは、(B) 少なくとも1種の以下から選択されるさらなる活性化化合物を含む：

(1.012) イブコナゾール、(1.018) プロチオコナゾール、(1.020) スピロキサミン、(1.021) テブコナゾール、

(2.002) ピキサフェン、(2.005) フルオピラム、(2.017) ペンフルフェン、(2.027) 3 - ( ジフルオロメチル ) - 1 - メチル - N - ( 1, 1, 3 - トリメチル - 2, 3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 4 - イル ) - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.038) N - ( 5 - クロロ - 2 - イソプロピルベンジル ) - N - シクロプロピル - 3 - ( ジフルオロメチル ) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、

(3.020) トリフロキシストロピン、(3.025) (3S, 6S, 7R, 8R) - 8 - ベンジル - 3 - [ ( { 3 - [ ( イソブチリルオキシ ) メトキシ ] - 4 - メトキシピリジン - 2 - イル } カルボニル ) アミノ ] - 6 - メチル - 4, 9 - ジオキソ - 1, 5 - ジオキソナン - 7 - イル2 - メチルプロパノエート、

(4.005) ペンシクロン、

(5.004) クロロタロニル、(5.013) マンコゼブ、(5.018) プロピネブ、

(12.003) メタラキシル、(12.004) メタラキシル - M (メフェノキサム)、

(13.001) フルジオキソニル、(13.004) プロキナジド、

(15.008) シフルフェナミドおよび (15.047) 3 - ( 4, 4 - ジフルオロ - 3, 3 - ジメチル - 3, 4 - ジヒドロイソキノリン - 1 - イル ) キノリン。

【 0 0 9 8 】

10

20

30

40

50



) + (4.001)、(1.01) + (4.002)、(1.01) + (4.003)、(1.01) + (4.004)、(1.01) + (4.005)、(1.01) + (4.006)、(1.01) + (4.007)、(1.01) + (4.008)、(1.01) + (4.009)、(1.01) + (4.010)、(1.01) + (4.011)、(1.01) + (4.012)、(1.01) + (4.013)、(1.01) + (4.014)、(1.01) + (4.015)、(1.01) + (4.016)、(1.01) + (4.017)、(1.01) + (4.018)、(1.01) + (4.019)、(1.01) + (4.020)、(1.01) + (4.021)、(1.01) + (4.022)、(1.01) + (4.023)、(1.01) + (4.024)、(1.01) + (4.025)、(1.01) + (5.001)、(1.01) + (5.002)、(1.01) + (5.003)、(1.01) + (5.004)、(1.01) + (5.005)、(1.01) + (5.006)、(1.01) + (5.007)、(1.01) + (5.008)、(1.01) + (5.009)、(1.01) + (5.010)、(1.01) + (5.011)、(1.01) + (5.012)、(1.01) + (5.013)、(1.01) + (5.014)、(1.01) + (5.015)、(1.01) + (5.016)、(1.01) + (5.017)、(1.01) + (5.018)、(1.01) + (5.019)、(1.01) + (5.020)、(1.01) + (5.021)、(1.01) + (5.022)、(1.01) + (5.023)、(1.01) + (6.001)、(1.01) + (6.002)、(1.01) + (6.003)、(1.01) + (6.004)、(1.01) + (7.001)、(1.01) + (7.002)、(1.01) + (7.003)、(1.01) + (7.004)、(1.01) + (7.005)、(1.01) + (7.006)、(1.01) + (8.001)、(1.01) + (9.001)、(1.01) + (9.002)、(1.01) + (9.003)、(1.01) + (9.004)、(1.01) + (9.005)、(1.01) + (9.006)、(1.01) + (9.007)、(1.01) + (9.008)、(1.01) + (9.009)、(1.01) + (10.001)、(1.01) + (10.002)、(1.01) + (10.003)、(1.01) + (11.001)、(1.01) + (11.002)、(1.01) + (12.001)、(1.01) + (12.002)、(1.01) + (12.003)、(1.01) + (12.004)、(1.01) + (13.001)、(1.01) + (13.002)、(1.01) + (13.003)、(1.01) + (13.004)、(1.01) + (13.005)、(1.01) + (13.006)、(1.01) + (14.001)、(1.01) + (14.002)、(1.01) + (15.001)、(1.01) + (15.002)、(1.01) + (15.003)、(1.01) + (15.004)、(1.01) + (15.005)、(1.01) + (15.006)、(1.01) + (15.007)、(1.01) + (15.008)、(1.01) + (15.009)、(1.01) + (15.010)、(1.01) + (15.011)、(1.01) + (15.012)、(1.01) + (15.013)、(1.01) + (15.014)、(1.01) + (15.015)、(1.01) + (15.016)、(1.01) + (15.017)、(1.01) + (15.018)、(1.01) + (15.019)、(1.01) + (15.020)、(1.01) + (15.021)、(1.01) + (15.022)、(1.01) + (15.023)、(1.01) + (15.024)、(1.01) + (15.025)、(1.01) + (15.026)、(1.01) + (15.027)、(1.01) + (15.028)、(1.01) + (15.029)、(1.01) + (15.030)、(1.01) + (15.031)、(1.01) + (15.032)、(1.01) + (15.033)、(1.01) + (15.034)、(1.01) + (15.035)、(1.01) + (15.036)、(1.01) + (15.037)、(1.01) + (15.038)、(1.01) + (15.039)、(1.01) + (15.040)、(1.01) + (15.041)、(1.01) + (15.042)、(1.01) + (15.043)、(1.01) + (15.044)、(1.01) + (15.045)、(1.01) + (15.046)、(1.01) + (15.047)、(1.01) + (15.048)、(1.01) + (15.049)、(1.01) + (15.050)、(1.01) + (15.051)、(1.01) + (15.052)、(1.01) + (15.053)、(1.01) + (15.054)、(1.01) + (15.055)、(1.01) + (15.056)、(1.01) + (15.057)、(1.01) + (15.058)、(1.01) + (15.059)、(1.01) + (15.060)、(1.01) + (15.061) および (1.01) + (15.062)。

【0099】

また好ましい化合物組合せは、以下の混合物からなる群(G2)から選択される：

(1.59) + (1.001)、(1.59) + (1.002)、(1.59) + (1.003)、(1.59) + (1.004)、(1.59) + (1.005)、(1.59) + (1.006)、(1.59) + (1.007)、(1.59) + (1.008)、(1.59) + (1.009)、(1.59) + (1.010)、(1.59) + (1.011)、(1.59) + (1.012)、(1.59) + (1.013)、(1.59) + (1.014

10

20

30

40

50



18)、(1.59) + (4.019)、(1.59) + (4.020)、(1.59) + (4.021)、(1.59) + (4.022)、(1.59) + (4.023)、(1.59) + (4.024)、(1.59) + (4.025)、(1.59) + (5.001)、(1.59) + (5.002)、(1.59) + (5.003)、(1.59) + (5.004)、(1.59) + (5.005)、(1.59) + (5.006)、(1.59) + (5.007)、(1.59) + (5.008)、(1.59) + (5.009)、(1.59) + (5.010)、(1.59) + (5.011)、(1.59) + (5.012)、(1.59) + (5.013)、(1.59) + (5.014)、(1.59) + (5.015)、(1.59) + (5.016)、(1.59) + (5.017)、(1.59) + (5.018)、(1.59) + (5.019)、(1.59) + (5.020)、(1.59) + (5.021)、(1.59) + (5.022)、(1.59) + (5.023)、(1.59) + (6.001)、(1.59) + (6.002)、(1.59) + (6.003)、(1.59) + (6.004)、(1.59) + (7.001)、(1.59) + (7.002)、(1.59) + (7.003)、(1.59) + (7.004)、(1.59) + (7.005)、(1.59) + (7.006)、(1.59) + (8.001)、(1.59) + (9.001)、(1.59) + (9.002)、(1.59) + (9.003)、(1.59) + (9.004)、(1.59) + (9.005)、(1.59) + (9.006)、(1.59) + (9.007)、(1.59) + (9.008)、(1.59) + (9.009)、(1.59) + (10.001)、(1.59) + (10.002)、(1.59) + (10.003)、(1.59) + (11.001)、(1.59) + (11.002)、(1.59) + (12.001)、(1.59) + (12.002)、(1.59) + (12.003)、(1.59) + (12.004)、(1.59) + (13.001)、(1.59) + (13.002)、(1.59) + (13.003)、(1.59) + (13.004)、(1.59) + (13.005)、(1.59) + (13.006)、(1.59) + (14.001)、(1.59) + (14.002)、(1.59) + (15.001)、(1.59) + (15.002)、(1.59) + (15.003)、(1.59) + (15.004)、(1.59) + (15.005)、(1.59) + (15.006)、(1.59) + (15.007)、(1.59) + (15.008)、(1.59) + (15.009)、(1.59) + (15.010)、(1.59) + (15.011)、(1.59) + (15.012)、(1.59) + (15.013)、(1.59) + (15.014)、(1.59) + (15.015)、(1.59) + (15.016)、(1.59) + (15.017)、(1.59) + (15.018)、(1.59) + (15.019)、(1.59) + (15.020)、(1.59) + (15.021)、(1.59) + (15.022)、(1.59) + (15.023)、(1.59) + (15.024)、(1.59) + (15.025)、(1.59) + (15.026)、(1.59) + (15.027)、(1.59) + (15.028)、(1.59) + (15.029)、(1.59) + (15.030)、(1.59) + (15.031)、(1.59) + (15.032)、(1.59) + (15.033)、(1.59) + (15.034)、(1.59) + (15.035)、(1.59) + (15.036)、(1.59) + (15.037)、(1.59) + (15.038)、(1.59) + (15.039)、(1.59) + (15.040)、(1.59) + (15.041)、(1.59) + (15.042)、(1.59) + (15.043)、(1.59) + (15.044)、(1.59) + (15.045)、(1.59) + (15.046)、(1.59) + (15.047)、(1.59) + (15.048)、(1.59) + (15.049)、(1.59) + (15.050)、(1.59) + (15.051)、(1.59) + (15.052)、(1.59) + (15.053)、(1.59) + (15.054)、(1.59) + (15.055)、(1.59) + (15.056)、(1.59) + (15.057)、(1.59) + (15.058)、(1.59) + (15.059)、(1.59) + (15.060)、(1.59) + (15.061) および (1.59) + (15.062)。

10

20

30

40

50

【0100】

また好ましい化合物組合せは、以下の混合物からなる群(G3)から選択される：

(1.81) + (1.001)、(1.81) + (1.002)、(1.81) + (1.003)、(1.81) + (1.004)、(1.81) + (1.005)、(1.81) + (1.006)、(1.81) + (1.007)、(1.81) + (1.008)、(1.81) + (1.009)、(1.81) + (1.010)、(1.81) + (1.011)、(1.81) + (1.012)、(1.81) + (1.013)、(1.81) + (1.014)、(1.81) + (1.015)、(1.81) + (1.016)、(1.81) + (1.017)、(1.81) + (1.018)、(1.81) + (1.019)、(1.81) + (1.020)、(1.81) + (1.021)、(1.81) + (1.022)、(1.81) + (1.023)、(1.81) + (1.024)、(1.81) + (1.025)、(1.81) + (1.026)、(1.81) + (1.027)、(1.81) + (1.028)、(1.81) + (1.029)、(1.81) + (1.030)、(1.81) + (1.031)、(1.81) + (1.032)、(1.81) + (1.033)、(1.81) + (1.034)、(1.81) + (1.035)、(1.81) + (1.036)、(1.81) + (1.037)、(1.81) + (1.038)、(1.81) + (1.039)、(1.81) + (1.040)、(1.81) + (1.041)、(1.81) + (1.042)、(1.81) + (1.043)、(1.81) + (1.044)、(1.81) + (1.045)、(1.81) + (1.046)、(1.81) + (1.047)、(1.81) + (1.048)、(1.81) + (1.049)、(1.81) + (1.050)、(1.81) + (1.051)、(1.81) + (1.052)、(1.81) + (1.053)、(1.81) + (1.054)、(1.81) + (1.055)、(1.81) + (1.056)、(1.81) + (1.057)、(1.81) + (1.058)、(1.81) + (1.059)、(1.81) + (1.060)、(1.81) + (1.061) および (1.81) + (1.062)。

81) + (1.032)、(1.81) + (1.033)、(1.81) + (1.034)、(1.81) + (1.035)、(1.81) + (1.036)、(1.81) + (1.037)、(1.81) + (1.038)、(1.81) + (1.039)、(1.81) + (1.040)、(1.81) + (1.041)、(1.81) + (1.042)、(1.81) + (1.043)、(1.81) + (1.044)、(1.81) + (1.045)、(1.81) + (1.046)、(1.81) + (1.047)、(1.81) + (1.048)、(1.81) + (1.049)、(1.81) + (1.050)、(1.81) + (1.051)、(1.81) + (1.052)、(1.81) + (1.053)、(1.81) + (1.054)、(1.81) + (1.055)、(1.81) + (1.056)、(1.81) + (1.057)、(1.81) + (1.058)、(1.81) + (1.059)、(1.81) + (1.060)、(1.81) + (1.061)、(1.81) + (1.062)、(1.81) + (1.063)、(1.81) + (1.064)、(1.81) + (1.065)、(1.81) + (1.066)、(1.81) + (1.067)、(1.81) + (1.068)、(1.81) + (1.069)、(1.81) + (1.070)、(1.81) + (1.071)、(1.81) + (1.072)、(1.81) + (1.073)、(1.81) + (1.074)、(1.81) + (1.075)、(1.81) + (1.076)、(1.81) + (1.077)、(1.81) + (1.078)、(1.81) + (1.079)、(1.81) + (1.080)、(1.81) + (1.081)、(1.81) + (1.082)、(1.81) + (2.001)、(1.81) + (2.002)、(1.81) + (2.003)、(1.81) + (2.004)、(1.81) + (2.005)、(1.81) + (2.006)、(1.81) + (2.007)、(1.81) + (2.008)、(1.81) + (2.009)、(1.81) + (2.010)、(1.81) + (2.011)、(1.81) + (2.012)、(1.81) + (2.013)、(1.81) + (2.014)、(1.81) + (2.015)、(1.81) + (2.016)、(1.81) + (2.017)、(1.81) + (2.018)、(1.81) + (2.019)、(1.81) + (2.020)、(1.81) + (2.021)、(1.81) + (2.022)、(1.81) + (2.023)、(1.81) + (2.024)、(1.81) + (2.025)、(1.81) + (2.026)、(1.81) + (2.027)、(1.81) + (2.028)、(1.81) + (2.029)、(1.81) + (2.030)、(1.81) + (2.031)、(1.81) + (2.032)、(1.81) + (2.033)、(1.81) + (2.034)、(1.81) + (2.035)、(1.81) + (2.036)、(1.81) + (2.037)、(1.81) + (2.038)、(1.81) + (2.039)、(1.81) + (2.040)、(1.81) + (2.041)、(1.81) + (2.042)、(1.81) + (2.043)、(1.81) + (2.044)、(1.81) + (2.045)、(1.81) + (2.046)、(1.81) + (2.047)、(1.81) + (2.048)、(1.81) + (2.049)、(1.81) + (2.050)、(1.81) + (2.051)、(1.81) + (2.052)、(1.81) + (2.053)、(1.81) + (2.054)、(1.81) + (2.055)、(1.81) + (2.056)、(1.81) + (3.001)、(1.81) + (3.002)、(1.81) + (3.003)、(1.81) + (3.004)、(1.81) + (3.005)、(1.81) + (3.006)、(1.81) + (3.007)、(1.81) + (3.008)、(1.81) + (3.009)、(1.81) + (3.010)、(1.81) + (3.011)、(1.81) + (3.012)、(1.81) + (3.013)、(1.81) + (3.014)、(1.81) + (3.015)、(1.81) + (3.016)、(1.81) + (3.017)、(1.81) + (3.018)、(1.81) + (3.019)、(1.81) + (3.020)、(1.81) + (3.021)、(1.81) + (3.022)、(1.81) + (3.023)、(1.81) + (3.024)、(1.81) + (3.025)、(1.81) + (3.026)、(1.81) + (3.027)、(1.81) + (3.028)、(1.81) + (3.029)、(1.81) + (4.001)、(1.81) + (4.002)、(1.81) + (4.003)、(1.81) + (4.004)、(1.81) + (4.005)、(1.81) + (4.006)、(1.81) + (4.007)、(1.81) + (4.008)、(1.81) + (4.009)、(1.81) + (4.010)、(1.81) + (4.011)、(1.81) + (4.012)、(1.81) + (4.013)、(1.81) + (4.014)、(1.81) + (4.015)、(1.81) + (4.016)、(1.81) + (4.017)、(1.81) + (4.018)、(1.81) + (4.019)、(1.81) + (4.020)、(1.81) + (4.021)、(1.81) + (4.022)、(1.81) + (4.023)、(1.81) + (4.024)、(1.81) + (4.025)、(1.81) + (5.001)、(1.81) + (5.002)、(1.81) + (5.003)、(1.81) + (5.004)、(1.81) + (5.005)、(1.81) + (5.006)、(1.81) + (5.007)、(1.81) + (5.008)、(1.81) + (5.009)、(1.81) + (5.010)、(1.81) + (5.011)、(1.81) + (5.012)、(1.81) + (

5.013)、(1.81)+(5.014)、(1.81)+(5.015)、(1.81)+(5.016)、  
 (1.81)+(5.017)、(1.81)+(5.018)、(1.81)+(5.019)、(1.81)+  
 (5.020)、(1.81)+(5.021)、(1.81)+(5.022)、(1.81)+(5.023)  
 、(1.81)+(6.001)、(1.81)+(6.002)、(1.81)+(6.003)、(1.81)  
 +(6.004)、(1.81)+(7.001)、(1.81)+(7.002)、(1.81)+(7.003  
 )、(1.81)+(7.004)、(1.81)+(7.005)、(1.81)+(7.006)、(1.81  
 )+(8.001)、(1.81)+(9.001)、(1.81)+(9.002)、(1.81)+(9.00  
 3)、(1.81)+(9.004)、(1.81)+(9.005)、(1.81)+(9.006)、(1.8  
 1)+(9.007)、(1.81)+(9.008)、(1.81)+(9.009)、(1.81)+(10.  
 001)、(1.81)+(10.002)、(1.81)+(10.003)、(1.81)+(11.001)、  
 (1.81)+(11.002)、(1.81)+(12.001)、(1.81)+(12.002)、(1.81  
 )+(12.003)、(1.81)+(12.004)、(1.81)+(13.001)、(1.81)+(13  
 .002)、(1.81)+(13.003)、(1.81)+(13.004)、(1.81)+(13.005)  
 、(1.81)+(13.006)、(1.81)+(14.001)、(1.81)+(14.002)、(1.8  
 1)+(15.001)、(1.81)+(15.002)、(1.81)+(15.003)、(1.81)+(1  
 5.004)、(1.81)+(15.005)、(1.81)+(15.006)、(1.81)+(15.007)  
 、(1.81)+(15.008)、(1.81)+(15.009)、(1.81)+(15.010)、(1.8  
 1)+(15.011)、(1.81)+(15.012)、(1.81)+(15.013)、(1.81)+(1  
 5.014)、(1.81)+(15.015)、(1.81)+(15.016)、(1.81)+(15.017)  
 、(1.81)+(15.018)、(1.81)+(15.019)、(1.81)+(15.020)、(1.8  
 1)+(15.021)、(1.81)+(15.022)、(1.81)+(15.023)、(1.81)+(1  
 5.024)、(1.81)+(15.025)、(1.81)+(15.026)、(1.81)+(15.027)  
 、(1.81)+(15.028)、(1.81)+(15.029)、(1.81)+(15.030)、(1.8  
 1)+(15.031)、(1.81)+(15.032)、(1.81)+(15.033)、(1.81)+(1  
 5.034)、(1.81)+(15.035)、(1.81)+(15.036)、(1.81)+(15.037)  
 、(1.81)+(15.038)、(1.81)+(15.039)、(1.81)+(15.040)、(1.8  
 1)+(15.041)、(1.81)+(15.042)、(1.81)+(15.043)、(1.81)+(1  
 5.044)、(1.81)+(15.045)、(1.81)+(15.046)、(1.81)+(15.047)  
 、(1.81)+(15.048)、(1.81)+(15.049)、(1.81)+(15.050)、(1.8  
 1)+(15.051)、(1.81)+(15.052)、(1.81)+(15.053)、(1.81)+(1  
 5.054)、(1.81)+(15.055)、(1.81)+(15.056)、(1.81)+(15.057)  
 、(1.81)+(15.058)、(1.81)+(15.059)、(1.81)+(15.060)、(1.8  
 1)+(15.061)および(1.81)+(15.062)。

10

20

30

【0101】

また好ましい化合物組合せは、以下の混合物からなる群(G4)から選択される：

(1.91)+(1.001)、(1.91)+(1.002)、(1.91)+(1.003)、(1.91)+  
 (1.004)、(1.91)+(1.005)、(1.91)+(1.006)、(1.91)+(1.007)  
 、(1.91)+(1.008)、(1.91)+(1.009)、(1.91)+(1.010)、(1.91)  
 +(1.011)、(1.91)+(1.012)、(1.91)+(1.013)、(1.91)+(1.014  
 )、(1.91)+(1.015)、(1.91)+(1.016)、(1.91)+(1.017)、(1.91  
 )+(1.018)、(1.91)+(1.019)、(1.91)+(1.020)、(1.91)+(1.02  
 1)、(1.91)+(1.022)、(1.91)+(1.023)、(1.91)+(1.024)、(1.9  
 1)+(1.025)、(1.91)+(1.026)、(1.91)+(1.027)、(1.91)+(1.0  
 28)、(1.91)+(1.029)、(1.91)+(1.030)、(1.91)+(1.031)、(1.  
 91)+(1.032)、(1.91)+(1.033)、(1.91)+(1.034)、(1.91)+(1.  
 035)、(1.91)+(1.036)、(1.91)+(1.037)、(1.91)+(1.038)、(1  
 .91)+(1.039)、(1.91)+(1.040)、(1.91)+(1.041)、(1.91)+(1  
 .042)、(1.91)+(1.043)、(1.91)+(1.044)、(1.91)+(1.045)、(1  
 .91)+(1.046)、(1.91)+(1.047)、(1.91)+(1.048)、(1.91)+(1  
 .049)、(1.91)+(1.050)、(1.91)+(1.051)、(1.91)+(1.052)、

40

50



(1.91) + (1.053)、(1.91) + (1.054)、(1.91) + (1.055)、(1.91) +  
 (1.056)、(1.91) + (1.057)、(1.91) + (1.058)、(1.91) + (1.059)  
 、(1.91) + (1.060)、(1.91) + (1.061)、(1.91) + (1.062)、(1.91)  
 + (1.063)、(1.91) + (1.064)、(1.91) + (1.065)、(1.91) + (1.066  
 )、(1.91) + (1.067)、(1.91) + (1.068)、(1.91) + (1.069)、(1.91  
 ) + (1.070)、(1.91) + (1.071)、(1.91) + (1.072)、(1.91) + (1.07  
 3)、(1.91) + (1.074)、(1.91) + (1.075)、(1.91) + (1.076)、(1.9  
 1) + (1.077)、(1.91) + (1.078)、(1.91) + (1.079)、(1.91) + (1.0  
 80)、(1.91) + (1.081)、(1.91) + (1.082)、(1.91) + (2.001)、(1.  
 91) + (2.002)、(1.91) + (2.003)、(1.91) + (2.004)、(1.91) + (2.  
 005)、(1.91) + (2.006)、(1.91) + (2.007)、(1.91) + (2.008)、(1  
 .91) + (2.009)、(1.91) + (2.010)、(1.91) + (2.011)、(1.91) + (2  
 .012)、(1.91) + (2.013)、(1.91) + (2.014)、(1.91) + (2.015)、(1  
 .91) + (2.016)、(1.91) + (2.017)、(1.91) + (2.018)、(1.91) + (2  
 .019)、(1.91) + (2.020)、(1.91) + (2.021)、(1.91) + (2.022)、  
 (1.91) + (2.023)、(1.91) + (2.024)、(1.91) + (2.025)、(1.91) +  
 (2.026)、(1.91) + (2.027)、(1.91) + (2.028)、(1.91) + (2.029)  
 、(1.91) + (2.030)、(1.91) + (2.031)、(1.91) + (2.032)、(1.91)  
 + (2.033)、(1.91) + (2.034)、(1.91) + (2.035)、(1.91) + (2.036  
 )、(1.91) + (2.037)、(1.91) + (2.038)、(1.91) + (2.039)、(1.91  
 ) + (2.040)、(1.91) + (2.041)、(1.91) + (2.042)、(1.91) + (2.04  
 3)、(1.91) + (2.044)、(1.91) + (2.045)、(1.91) + (2.046)、(1.9  
 1) + (2.047)、(1.91) + (2.048)、(1.91) + (2.049)、(1.91) + (2.0  
 50)、(1.91) + (2.051)、(1.91) + (2.052)、(1.91) + (2.053)、(1.  
 91) + (2.054)、(1.91) + (2.055)、(1.91) + (2.056)、(1.91) + (3.  
 001)、(1.91) + (3.002)、(1.91) + (3.003)、(1.91) + (3.004)、(1  
 .91) + (3.005)、(1.91) + (3.006)、(1.91) + (3.007)、(1.91) + (3  
 .008)、(1.91) + (3.009)、(1.91) + (3.010)、(1.91) + (3.011)、(1  
 .91) + (3.012)、(1.91) + (3.013)、(1.91) + (3.014)、(1.91) + (3  
 .015)、(1.91) + (3.016)、(1.91) + (3.017)、(1.91) + (3.018)、  
 (1.91) + (3.019)、(1.91) + (3.020)、  
 (1.91) + (3.021)、(1.91) + (3.022)、(1.91) + (3.023)、(1.91) +  
 (3.024)、(1.91) + (3.025)、(1.91) + (3.026)、(1.91) + (3.027)  
 、(1.91) + (3.028)、(1.91) + (3.029)、(1.91) + (4.001)、(1.91)  
 + (4.002)、(1.91) + (4.003)、(1.91) + (4.004)、(1.91) + (4.005  
 )、(1.91) + (4.006)、(1.91) + (4.007)、(1.91) + (4.008)、(1.91  
 ) + (4.009)、(1.91) + (4.010)、(1.91) + (4.011)、(1.91) + (4.01  
 2)、(1.91) + (4.013)、(1.91) + (4.014)、(1.91) + (4.015)、(1.9  
 1) + (4.016)、(1.91) + (4.017)、(1.91) + (4.018)、(1.91) + (4.0  
 19)、(1.91) + (4.020)、(1.91) + (4.021)、(1.91) + (4.022)、(1.  
 91) + (4.023)、(1.91) + (4.024)、(1.91) + (4.025)、(1.91) + (5.  
 001)、(1.91) + (5.002)、(1.91) + (5.003)、(1.91) + (5.004)、(1  
 .91) + (5.005)、(1.91) + (5.006)、(1.91) + (5.007)、(1.91) + (5  
 .008)、(1.91) + (5.009)、(1.91) + (5.010)、(1.91) + (5.011)、(1  
 .91) + (5.012)、(1.91) + (5.013)、(1.91) + (5.014)、(1.91) + (5  
 .015)、(1.91) + (5.016)、(1.91) + (5.017)、(1.91) + (5.018)、  
 (1.91) + (5.019)、(1.91) + (5.020)、(1.91) + (5.021)、(1.91) +  
 (5.022)、(1.91) + (5.023)、(1.91) + (6.001)、(1.91) + (6.002)  
 、(1.91) + (6.003)、(1.91) + (6.004)、(1.91) + (7.001)、(1.91)  
 + (7.002)、(1.91) + (7.003)、(1.91) + (7.004)、(1.91) + (7.005

)、(1.91) + (7.006)、(1.91) + (8.001)、(1.91) + (9.001)、(1.91) + (9.002)、(1.91) + (9.003)、(1.91) + (9.004)、(1.91) + (9.005)、(1.91) + (9.006)、(1.91) + (9.007)、(1.91) + (9.008)、(1.91) + (9.009)、(1.91) + (10.001)、(1.91) + (10.002)、(1.91) + (10.003)、(1.91) + (11.001)、(1.91) + (11.002)、(1.91) + (12.001)、(1.91) + (12.002)、(1.91) + (12.003)、(1.91) + (12.004)、(1.91) + (13.001)、(1.91) + (13.002)、(1.91) + (13.003)、(1.91) + (13.004)、(1.91) + (13.005)、(1.91) + (13.006)、(1.91) + (14.001)、(1.91) + (14.002)、(1.91) + (15.001)、(1.91) + (15.002)、(1.91) + (15.003)、(1.91) + (15.004)、(1.91) + (15.005)、(1.91) + (15.006)、(1.91) + (15.007)、(1.91) + (15.008)、(1.91) + (15.009)、(1.91) + (15.010)、(1.91) + (15.011)、(1.91) + (15.012)、(1.91) + (15.013)、(1.91) + (15.014)、(1.91) + (15.015)、(1.91) + (15.016)、(1.91) + (15.017)、(1.91) + (15.018)、(1.91) + (15.019)、(1.91) + (15.020)、(1.91) + (15.021)、(1.91) + (15.022)、(1.91) + (15.023)、(1.91) + (15.024)、(1.91) + (15.025)、(1.91) + (15.026)、(1.91) + (15.027)、(1.91) + (15.028)、(1.91) + (15.029)、(1.91) + (15.030)、(1.91) + (15.031)、(1.91) + (15.032)、(1.91) + (15.033)、(1.91) + (15.034)、(1.91) + (15.035)、(1.91) + (15.036)、(1.91) + (15.037)、(1.91) + (15.038)、(1.91) + (15.039)、(1.91) + (15.040)、(1.91) + (15.041)、(1.91) + (15.042)、(1.91) + (15.043)、(1.91) + (15.044)、(1.91) + (15.045)、(1.91) + (15.046)、(1.91) + (15.047)、(1.91) + (15.048)、(1.91) + (15.049)、(1.91) + (15.050)、(1.91) + (15.051)、(1.91) + (15.052)、(1.91) + (15.053)、(1.91) + (15.054)、(1.91) + (15.055)、(1.91) + (15.056)、(1.91) + (15.057)、(1.91) + (15.058)、(1.91) + (15.059)、(1.91) + (15.060)、(1.91) + (15.061) および (1.91) + (15.062)。

10

20

**【0102】**

より好ましい化合物組合せは、群(G1)または(G2)に属する混合物から選択される。

30

**【0103】**

さらにより好ましい化合物組合せは、以下の混合物からなる群(G1-A)から選択される：

(1.01) + (1.012)、(1.01) + (1.018)、(1.01) + (1.020)、(1.01) + (1.021)、(1.01) + (2.002)、(1.01) + (2.005)、(1.01) + (2.017)、(1.01) + (2.027)、(1.01) + (2.038)、(1.01) + (3.020)、(1.01) + (3.025)、(1.01) + (4.005)、(1.01) + (5.004)、(1.01) + (5.013)、(1.01) + (5.018)、(1.01) + (12.003)、(1.01) + (12.004)、(1.01) + (13.001)、(1.01) + (13.004)、(1.01) + (15.008)、(1.01) + (15.047)。

40

**【0104】**

さらにより好ましい化合物組合せはまた、以下の混合物からなる群(G2-A)から選択される：

(1.59) + (1.012)、(1.59) + (1.018)、(1.59) + (1.020)、(1.59) + (1.021)、(1.59) + (2.002)、(1.59) + (2.005)、(1.59) + (2.017)、(1.59) + (2.027)、(1.59) + (2.038)、(1.59) + (3.020)、(1.59) + (3.025)、(1.59) + (4.005)、(1.59) + (5.004)、(1.59) + (5.013)、(1.59) + (5.018)、(1.59) + (12.003)、(1.59) + (12.004)、(1.59) + (13.001)、(1.59) + (13.004)、(1.59) + (15.008)、(1.59) + (15.047)。

**【0105】**

50

さらにより好ましい化合物組合せはまた、以下の混合物からなる群 (G3 - A) から選択される：

(1.81) + (1.012)、(1.81) + (1.018)、(1.81) + (1.020)、(1.81) + (1.021)、(1.81) + (2.002)、(1.81) + (2.005)、(1.81) + (2.017)、(1.81) + (2.027)、(1.81) + (2.038)、(1.81) + (3.020)、(1.81) + (3.025)、(1.81) + (4.005)、(1.81) + (5.004)、(1.81) + (5.013)、(1.81) + (5.018)、(1.81) + (12.003)、(1.81) + (12.004)、(1.81) + (13.001)、(1.81) + (13.004)、(1.81) + (15.008)、(1.81) + (15.047)。

【0106】

10

さらにより好ましい化合物組合せはまた、以下の混合物からなる群 (G4 - A) から選択される：

(1.91) + (1.012)、(1.91) + (1.018)、(1.91) + (1.020)、(1.91) + (1.021)、(1.91) + (2.002)、(1.91) + (2.005)、(1.91) + (2.017)、(1.91) + (2.027)、(1.91) + (2.038)、(1.91) + (3.020)、(1.91) + (3.025)、(1.91) + (4.005)、(1.91) + (5.004)、(1.91) + (5.013)、(1.91) + (5.018)、(1.91) + (12.003)、(1.91) + (12.004)、(1.91) + (13.001)、(1.91) + (13.004)、(1.91) + (15.008)、(1.91) + (15.047)。

【0107】

20

最も好ましい化合物組合せは、群 (G1 - A) または (G2 - A) に属する混合物から選択される。

【0108】

本発明による組合せにおいて、化合物 (A)、すなわち式 (1) のトリアゾール誘導体、および (B)、すなわち群 (1) ~ (15) から選択されるさらなる活性化合物は、広範囲の A : B の有効重量比、例えば 100 : 1 ~ 1 : 100 の範囲、好ましくは 50 : 1 ~ 1 : 50 の重量比、最も好ましくは 20 : 1 ~ 1 : 20 の重量比で存在することができる。本発明により使用され得る A : B のさらなる比率は、示される順序で好ましさが増加して、95 : 1 ~ 1 : 95、90 : 1 ~ 1 : 90、85 : 1 ~ 1 : 85、80 : 1 ~ 1 : 80、75 : 1 ~ 1 : 75、70 : 1 ~ 1 : 70、65 : 1 ~ 1 : 65、60 : 1 ~ 1 : 60、55 : 1 ~ 1 : 55、45 : 1 ~ 1 : 45、40 : 1 ~ 1 : 40、35 : 1 ~ 1 : 35、30 : 1 ~ 1 : 30、25 : 1 ~ 1 : 25、15 : 1 ~ 1 : 15、10 : 1 ~ 1 : 10、5 : 1 ~ 1 : 5、4 : 1 ~ 1 : 4、3 : 1 ~ 1 : 3、2 : 1 ~ 1 : 2 である。

30

【0109】

化合物 (A) または化合物 (B) が異性体型および / または互変異性型で存在し得る場合、このような化合物は、上記および下記において、該当する場合、各場合でこれらが具体的に言及されていない場合も、対応する異性体型および / または互変異性型またはこれらの混合物も含むと理解される。

【0110】

方法および使用

本発明はまた、本発明による化合物組合せまたはこのような組合せを含む組成物を微生物および / またはその生息地に施用することを特徴とする、望まない微生物を制御する方法に関する。

40

【0111】

本発明はさらに、本発明による化合物組合せまたはこのような組合せを含む組成物で処理された種子に関する。

【0112】

本発明は最後に、本発明による化合物組合せまたはこのような組合せを含む組成物で処理された種子を使用することによって、望まない微生物から種子を保護する方法を提供する。

【0113】

50

本発明による化合物組合せおよびこのような組合せを含む組成物は、強力な殺微生物活性を有し、作物保護および材料の保護において、真菌および細菌などの望まない微生物の制御に使用することができる。

【0114】

本発明による化合物組合せおよびこのような組合せを含む組成物は、極めて優れた殺真菌特性を有し、例えば、ネコブカビ類 (Plasmodiophoromycetes)、卵菌類 (Oomycetes)、ツボカビ類 (Chytridiomycetes)、接合菌類 (Zygomycetes)、子囊菌類 (Ascomycetes)、担子菌類 (Basidiomycetes) および不完全菌類 (Deuteromycetes) の制御のために、作物保護に使用することができる。

【0115】

殺菌剤は、例えばシュードモナス科 (Pseudomonadaceae)、リゾビウム科 (Rhizobiaceae)、腸内細菌科 (Enterobacteriaceae)、コリネバクテリア科 (Corynebacteriaceae) およびストレプトミセス科 (Streptomycetaceae) の制御のために、作物保護に使用することができる。

【0116】

本発明による化合物組合せおよびこのような組合せを含む組成物は、植物病原性真菌の治療的または防御的制御に使用することができる。そのため、本発明はまた、種子、植物または植物部分、果実または植物が成長する土壌に施用される、本発明の組合せまたは組成物の使用によって植物病原性真菌を制御するための治療的および防御的方法に関する。

【0117】

植物

全ての植物および植物部分を本発明により処理することができる。植物は、ここでは、所望のおよび望ましくない野生植物または作物植物 (天然に存在する作物植物を含む) などの全ての植物および植物集団を意味すると理解される。作物植物は、従来の育種および最適化方法によって、またはトランスジェニック植物を含むならびに植物育種家の権利によって保護可能および保護不可能な植物栽培品種を含むバイオテクノロジーおよび遺伝子工学方法またはこれらの方法の組み合わせによって得ることができる植物であり得る。植物部分は、その例として、葉、針葉、柄、茎、花、子実体、果実および種子、ならびに根、塊茎および根茎も挙げられる、苗条、葉、花および根などの地上および地下の植物の全ての部分および器官を意味すると理解される。植物部分はまた、収穫された材料ならびに栄養性および生殖性の繁殖材料、例えば、挿し穂、塊茎、根茎、接ぎ穂および種子を含む。

【0118】

本発明により処理することができる植物には以下が含まれる：ワタ、アマ、ブドウ、果実、野菜、例えばバラ科 (Rosaceae) 種 (例えば、リンゴおよびナシなどの仁果類果実だけでなく、アプリコット、チェリー、アーモンドおよびモモなどの核果類、およびイチゴなどの柔らかい果実)、リベシオイダ工科 (Ribesioideae) 種、クルミ科 (Juglandaceae) 種、カバノキ科 (Betulaceae) 種、ウルシ科 (Anacardiaceae) 種、ブナ科 (Fagaceae) 種、クワ科 (Moraceae) 種、モクセイ科 (Oleaceae) 種、マタタビ科 (Actinidaceae) 種、クスノキ科 (Lauraceae) 種、バショウ科 (Musaceae) 種 (例えば、バナナの木およびプランテーション)、アカネ科 (Rubiaceae) 種 (例えば、コーヒー)、ツバキ科 (Theaceae) 種、アオギリ科 (Sterculiaceae) 種、ミカン科 (Rutaceae) 種 (例えば、レモン、オレンジおよびグレープフルーツ)；ナス科 (Solanaceae) 種 (例えばトマト)、ユリ科 (Liliaceae) 種、キク科 (Asteraceae) 種 (例えば、レタス)、セリ科 (Umbelliferae) 種、アブラナ科 (Cruciferae) 種、アカザ科 (Chenopodiaceae) 種、ウリ科 (Cucurbitaceae) 種 (例えば、キュウリ)、ネギ科 (Alliaceae) 種 (例えば、ニラ、タマネギ)、マメ科 (Papilionaceae) 種 (例えばエンドウ)；主要な作物植物、例えばイネ科 (Gramineae) 種 (例えば、トウモロコシ、芝、コムギ、ライムギ、イネ、オオムギ、エンバク、キビおよびライコムギなどの穀物)、キク科 (Asteraceae) 種 (例えばヒマワリ)、アブラナ科 (Brassicaceae) 種 (例えば、白キャベツ、赤キャベツ、ブロッコリー、カリフ

10

20

30

40

50

ラワー、芽キャベツ、チンゲン菜、コールラビ、ライムギ、ダイコンおよびアブラナ、カラシ、セイヨウワサビおよびクレソン)、マメ科 (Fabaceae) 種 (例えば、マメ、ピーナッツ)、マメ科 (Papilionaceae) 種 (例えば、ダイズ)、ナス科 (Solanaceae) 種 (例えば、ジャガイモ)、アカザ科 (Chenopodiaceae) 種 (例えば、サトウダイコン、飼料ビート、スイスチャード、ビートルート); 庭園および森林地域に有用な植物および観賞植物; ならびにこれらの植物の各々の遺伝子組換え品種。

【0119】

病原体

本発明により治療することができる真菌疾患の病原体の非限定的な例としては、

うどんこ病の病原体、例えばブルメリア属 (*Blumeria*) 種、例えばブルメリア・グラミニス (*Blumeria graminis*); ポドスフェラ属 (*Podosphaera*) 種、例えばポドスフェラ・ロイコトリカ (*Podosphaera leucotricha*); スファエロテカ属 (*Sphaerotheca*) 種、例えばスファエロテカ・フリギネア (*Sphaerotheca fuliginea*); ウンシヌラ属 (*Uncinula*) 種、例えば、ウンシヌラ・ネカトル (*Uncinula necator*) によって引き起こされる病気;

10

さび病の病原体、例えば、ギムノスポランギウム属 (*Gymnosporangium*) 種、例えば、ギムノスポランギウム・サビナエ (*Gymnosporangium sabinae*); ヘミレイア属 (*Hemileia*) 種、例えば、ヘミレイア・バスタトリクス (*Hemileia vastatrix*); ファコプソラ属 (*Phakopsora*) 種、例えばファコプソラ・パキリジ (*Phakopsora pachyrhizi*) またはファコプソラ・メイボミアエ (*Phakopsora meibomiae*); プクキニア属 (*Puccinia*) 種、例えば、プクキニア・レコンディタ (*Puccinia recondita*)、プクキニア・グラミニス (*Puccinia graminis*) またはプクキニア・ストリイホルミス (*Puccinia striiformis*); ウロミセス属 (*Uromyces*) 種、例えばウロミセス・アペンディクラツス (*Uromyces appendiculatus*) によって引き起こされる病気;

20

卵菌類、例えば、アルブゴ属 (*Albugo*) 種、例えばアルブゴ・カンジダ (*Albugo candida*); プレミア属 (*Bremia*) 種、例えば、プレミア・ラクツカエ (*Bremia lactucae*); ペロノスポラ属 (*Peronospora*) 種、例えばペロノスポラ・ピシ (*Peronospora pisi*) または *P. brassicae*); フィトフトラ属 (*Phytophthora*) 種、例えばフィトフトラ・インフェスタンス (*Phytophthora infestans*); プラスモバラ属 (*Plasmopara*) 種、例えばプラスモバラ・ピチコラ (*Plasmopara viticola*); シュードペロノスポラ属 (*Pseudoperonospora*) 種、例えばシュードペロノスポラ・フムリ (*Pseudoperonospora humuli*) またはシュードペロノスポラ・クベンシス (*Pseudoperonospora cubensis*); ピシウム属 (*Pythium*) 種、例えばピシウム・ウルティマム (*Pythium ultimum*) の群の病原体によって引き起こされる病気;

30

例えば、アルテルナリア属 (*Alternaria*) 種、例えばアルテルナリア・ソラニ (*Alternaria solani*); セルコスボラ属 (*Cercospora*) 種、例えばセルコスボラ・ベチコラ (*Cercospora beticola*); クラジオスポリウム属 (*Cladosporium*) 種、例えば、クラジオスポリウム・ククメリナム (*Cladosporium cucumerinum*); コクリオボルス属 (*Cochliobolus*) 種、例えばコクリオボルス・サチブス (*Cochliobolus sativus*) (分生子形態: ドレックスレラ属 (*Drechslera*), 別名: ヘルミントスポリウム属 (*Helminthosporium*)) またはコクリオボルス・ミヤベアヌス (*Cochliobolus miyabeanus*); コレトトリカム属 (*Colletotrichum*) 種、例えばコレトトリカム・リンデムタニウム (*Colletotrichum lindemuthianum*); シクロコニウム属 (*Cyloconium*) 種、例えばシクロコニウム・オレアギナム (*Cyloconium oleaginum*); ジアポルテ属 (*Diaporthe*) 種、例えばジアポルテ・シトリ (*Diaporthe citri*); エルシノエ属 (*Elsinoe*) 種、例えばエルシノエ・ファウセツチ (*Elsinoe fawcettii*); グロエオスポリウム属 (*Gloeosporium*) 種、例えばグロエオスポリウム・ラエチコロール (*Gloeosporium laeticolor*); グロメラ属 (*Glomerella*) 種、例えばグロメラ・シングラータ (*Glomerella cingulata*); ギグナルディア属 (*Guignardia*) 種、例えばギグナルディア・ビドウェリ (*Guignardia bidwellii*); レプトスフェリア属 (*Leptosphaeria*) 種、例えばレプトスフェリア・マクランズ (*Leptosp*

40

50

haeria maculans) ; マグナポルテ属 (Magnaporthe) 種、例えばマグナポルテ・グリセア (Magnaporthe grisea) ; ミクロドキウム属 (Microdochium) 種、例えばミクロドキウム・ニバレ (Microdochium nivale) ; ミコスファエレラ属 (Mycosphaerella) 種、例えばミコスファエレラ・グラミニコラ (Mycosphaerella graminicola)、ミコスファエレラ・アラキジコラ (Mycosphaerella arachidicola) またはミコスファエレラ・フィジエンシス (Mycosphaerella fijiensis) ; ファエオスファエリア属 (Phaeosphaeria) 種、例えばファエオスファエリア・ノドルム (Phaeosphaeria nodorum) ; ピレノフォラ属 (Pyrenophora) 種、例えばピレノフォラ・テレス (Pyrenophora teres) またはピレノフォラ・トリチシ・レペンティス (Pyrenophora tritici repentis) ; ラムラリア属 (Ramularia) 種、例えばラムラリア・コロ - シグニ (Ramularia collo - cygni) またはラムラリア・アレオラ (Ramularia areola) ; リンコスפורリウム属 (Rhynchosporium) 種、例えばリンコスפורリウム・セカリス (Rhynchosporium secalis) ; セプトリア属 (Septoria) 種、例えばセプトリア・アピイ (Septoria apii) またはセプトリア・リコペルシシ (Septoria lycopersici) ; スタゴノスポラ属 (Stagonospora) 種、例えばスタゴノスポラ・ノドルム (Stagonospora nodorum) ; ティフラ属 (Typhula) 種、例えばティフラ・インカルナタ (Typhula incarnata) ; ベンツリア属 (Venturia) 種、例えばベンツリア・イナエクアリス (Venturia inaequalis) によって引き起こされる葉枯病および葉萎凋病 ;

10

例えば、コルチシウム属 (Corticium) 種、例えばコルチシウム・グラミネアルム (Corticium graminearum) ; フザリウム属 (Fusarium) 種、例えばフザリウム・オキシスポラム (Fusarium oxysporum) ; ガエウマンノミセス属 (Gaeumannomyces) 種、例えばガエウマンノミセス・グラミニス (Gaeumannomyces graminis) ; プラスモジオフォラ属 (Plasmodiophora) 種、例えばプラスモジオフォラ・ブラシカエ (Plasmodiophora brassicae) ; リゾクトニア属 (Rhizoctonia) 種、例えばリゾクトニア・ソラニ (Rhizoctonia solani) ; サロクラジウム属 (Sarocladium) 種、例えばサロクラジウム・オリザエ (Sarocladium oryzae) ; スクレロチウム属 (Sclerotium) 種、例えばスクレロチウム・オリザエ (Sclerotium oryzae) ; タペシア属 (Tapesia) 種、例えば、タペシア・アクホルミス (Tapesia acuformis) ; チエラビオプシス属 (Thielaviopsis) 種、例えばチエラビオプシス・バシコラ (Thielaviopsis basicola) によって引き起こされる根および茎の病気 ;

20

例えば、アルテルナリア属 (Alternaria) 種、例えばアルテルナリア属 (Alternaria) 亜種 ; アスペルギルス属 (Aspergillus) 種、例えばアスペルギルス・フラバス (Aspergillus flavus) ; クラドスポリウム属 (Cladosporium) 種、例えばクラドスポリウム・クラドスポリオイデス (Cladosporium cladosporioides) ; クラビセプス属 (Claviceps) 種、例えばクラビセプス・ブルブレア (Claviceps purpurea) ; フザリウム属 (Fusarium) 種、例えばフザリウム・クルモルム (Fusarium culmorum) ; ジベレラ属 (Gibberella) 種、例えばジベレラ・ゼアエ (Gibberella zeae) ; モノグラフェラ属 (Monographella) 種、例えばモノグラフェラ・ニバリス (Monographella nivalis) ; スタグノスポラ属 (Stagnospora) 種、例えばスタグノスポラ・ノドルム (Stagnospora nodorum) によって引き起こされる穂および円錐花序の病気 (トウモロコシの穂軸を含む) ;

30

黒穂菌類、例えばスファセロテカ属 (Sphacelotheca) 種、例えばスファセロテカ・レイリアナ (Sphacelotheca reiliana) ; チルレチア属 (Tilletia) 種、例えばチルレチア・カリエス (Tilletia caries) またはチルレチア・コントロベルサ (Tilletia controversa) ; ウロシスチス属 (Urocystis) 種、例えばウロシスチス・オクルタ (Urocystis occulta) ; ウスチラゴ属 (Ustilago) 種、例えばウスチラゴ・ヌダ (Ustilago nuda) によって引き起こされる病気 ;

40

例えば、アスペルギルス属 (Aspergillus) 種、例えばアスペルギルス・フラバス (Aspergillus flavus) ; ボトリチス属 (Botrytis) 種、例えばボトリチス・シネレア (Botrytis cinerea) ; ペニシリウム属 (Penicillium) 種、例えばペニシリウム・エクスパンサム (Penicillium expansum) またはペニシリウム・ブルプロゲナム (Penicillium purpurogenum) ; リゾプス属 (Rhizopus) 種、例えばリゾプス・ストロニファー (Rhizopus stolonifer) ; スクレロチニア属 (Sclerotinia) 種、例えばスクレロチニア・スクレロチオ

50

ラム (*Sclerotinia sclerotiorum*) ; ベルチシリウム属 (*Verticillium*) 種、例えばベルチシリウム・アルボタルム (*Verticillium alboatrum*) によって引き起こされる果実腐敗 ;

例えば、アルテルナリア属 (*Alternaria*) 属、例えばアルテルナリア・ブラッシシコラ (*Alternaria brassicicola*) ; アファノミセス属 (*Aphanomyces*) 種、例えばアファノミセス・エウテイケス (*Aphanomyces euteiches*) ; アスコキタ属 (*Ascochyta*) 種、例えばアスコキタ・レンチス (*Ascochyta lentis*) ; アスペルギルス属 (*Aspergillus*) 種、例えばアスペルギルス・フラバス (*Aspergillus flavus*) ; クラドスポリウム属 (*Cladosporium*) 種、例えばクラドスポリウム・ヘルバルム (*Cladosporium herbarum*) ; コクリオボルス属 (*Cochliobolus*) 種、例えばコクリオボルス・サチブス (*Cochliobolus sativus*) (分生子形態 : ドレックスレラ属 (*Drechslera*)、ビポラリス属 (*Bipolaris*)、別名 : ヘルミントスポリウム属 (*Helminthosporium*)) ; コレトトリカム属 (*Colletotrichum*) 種、例えばコレトトリカム・コッコデス (*Colletotrichum coccodes*) ; フザリウム属 (*Fusarium*) 種、例えばフザリウム・クルモルム (*Fusarium culmorum*) ; ジベレラ属 (*Gibberella*) 種、例えばジベレラ・ゼアエ (*Gibberella zeae*) ; マクロフォミナ属 (*Macrophomina*) 種、例えばマクロフォミナ・ファセオリナ (*Macrophomina phaseolina*) ; ミクロドキウム属 (*Microdochium*) 種、例えばミクロドキウム・ニバレ (*Microdochium nivale*) ; モノグラフェラ属 (*Monographella*) 種、例えばモノグラフェラ・ニバリス (*Monographella nivalis*) ; ペニシリウム属 (*Penicillium*) 種、例えばペニシリウム・エクspansum (*Penicillium expansum*) ; フォーマ属 (*Phoma*) 種、例えばフォーマ・リングラム (*Phoma lingam*) ; フォモプシス属 (*Phomopsis*) 種、例えばフォモプシス・ソジャエ (*Phomopsis sojae*) ; フィトフトラ属 (*Phytophthora*) 種、例えばフィトフトラ・カクトルム (*Phytophthora cactorum*) ; ピレノフォラ属 (*Pyrenophora*) 種、例えばピレノフォラ・グラミネア (*Pyrenophora graminea*) ; ピリキュラリア属 (*Pyricularia*) 種、例えばピリキュラリア・オリザエ (*Pyricularia oryzae*) ; ピシウム属 (*Pythium*) 種、例えばピシウム・ウルティマム (*Pythium ultimum*) ; リゾクトニア属 (*Rhizoctonia*) 種、例えばリゾクトニア・ソラニ (*Rhizoctonia solani*) ; リゾプス属 (*Rhizopus*) 種、例えばリゾプス・オリザエ (*Rhizopus oryzae*) ; スクレロチウム属 (*Sclerotium*) 種、例えばスクレロチウム・ロルフシイ (*Sclerotium rolfsii*) ; セプトリア属 (*Septoria*) 種、例えばセプトリア・ノドルム (*Septoria nodorum*) ; ティフラ属 (*Typhula*) 種、例えばティフラ・インカルナタ (*Typhula incarnata*) ; ベルチシリウム属 (*Verticillium*) 種、例えばベルチシリウム・ダヒリアエ (*Verticillium dahliae*) によって引き起こされる種子および土壌の腐敗病および萎凋病、ならびに実生の病気 ;

例えば、ネクトリア属 (*Nectria*) 種、例えばネクトリア・ガリゲナ (*Nectria galligena*) によって引き起こされるがん腫、こぶおよび天狗巣病 ;

例えば、モニリニア属 (*Monilinia*) 種、例えばモニリニア・ラキサ (*Monilinia laxa*) によって引き起こされる萎凋病 ;

例えば、エクソバシジウム属 (*Exobasidium*) 種、例えばスエクソバシジウム・ベキサンス (*Exobasidium vexans*) ; タフリナ属 (*Taphrina*) 種、例えばタフリナ・デフォルマンス (*Taphrina deformans*) によって引き起こされる葉、花および果実の変形 ;

例えば、エスカ (*Esca*) 種、例えばファエオモニエラ・クラミドスポラ (*Phaeoemoniella chlamydospora*)、ファエオアクレモニウム・アレオフィルム (*Phaeoacremonium aleophilum*) またはフォミチポリア・メジテラネア (*Fomitiporia mediterranea*) ; ガノデルマ属 (*Ganoderma*) 種、例えばガノデルマ・ボニネンセ (*Ganoderma boninense*) によって引き起こされる木本植物の変性病 ;

例えば、ボトリチス属 (*Botrytis*) 種、例えばボトリチス・シネレア (*Botrytis cinerea*) によって引き起こされる花および種子の病気 ;

例えば、リゾクトニア属 (*Rhizoctonia*) 種、例えばリゾクトニア・ソラニ (*Rhizoctonia solani*) ; ヘルミントスポリウム属 (*Helminthosporium*) 種、例えばヘルミントスポリウム・ソラニ (*Helminthosporium solani*) によって引き起こされる植物塊茎の病気 ;

細菌病原体、例えばキサントモナス属 (*Xanthomonas*) 種、例えばキサントモナス・カンペストリス *pv.* オリザエ (*Xanthomonas campestris pv. oryzae*) ; シュードモナス属 (*Pseudomonas*) 種、例えばシュードモナス・シリंगाエ *pv.* ラクリマンズ (*Pseudomonas syringae pv. lachrymans*) ; エルウィニア属 (*Erwinia*) 種、例えばエルウィニア・アミロボラ (*Erwinia amylovora*) によって引き起こされる病気が挙げられる。

#### 【0120】

ダイズの以下の病気を制御することが好ましい :

例えば、アルテルナリア斑点病 (アルテルナリア属 (*Alternaria*) 種アトランス・テヌイシマ (*atrans tenuissima*))、炭そ病 (コレトトリカム・グロエオスポロイデス・デマティウム (*Colletotrichum gloeosporoides dematium*) 変種トルンカツム (*truncatum*))、褐斑病 (セプトリア・グリシネス (*Septoria glycines*))、セレコスボラ葉斑点病および枯れ病 (セレコスボラ・キクチイ (*Cercospora kikuchii*))、コアネフォラ葉枯れ病 (コアネフォラ・インファンディブリフェラ・トリスポラ (*Choanephora infundibulifera trispora*) (同義))、ダクツリオフォラ葉斑点病 (ダクツリオフォラ・グリシネス (*Dactuliophora glycines*))、べと病 (ペロノスポラ・マンシュリカ (*Peronospora manshurica*))、ドレックスレラ胴枯れ病 (ドレックスレラ・グリシニ (*Drechslera glycini*))、フログアイ葉斑点病 (セルコスボラ・ソジナ (*Cercospora sojae*))、レプトスファエルリナ葉斑点病 (レプトスファエルリナ・トリフォリイ (*Leptosphaerulina trifolii*))、フィロスチカ葉斑点病 (フィロスチカ・ソジェコラ (*Phyllosticta sojaecola*))、さやおよび茎枯れ病 (フォモプシス・ソジャエ (*Phomopsis sojae*))、うどんこ病 (ミクロスファエラ・ディフサ (*Microsphaera diffusa*))、ピレノケータ葉斑点病 (ピレノケータ・グリシネス (*Pyrenochaeta glycines*))、リゾクトニア・アエリアル (*rhizoctonia aerial*)、群葉およびクモの巣病 (リゾクトニア・ソラニ (*Rhizoctonia solani*))、さび病 (ファコプソラ・パキリジ (*Phakopsora pachyrhizi*))、ファコプソラ・メイボミアエ (*Phakopsora meibomiae*))、黒痘病 (スファセロマ・グリシネス (*Sphaceloma glycines*))、ステムフィリウム葉枯れ病 (ステムフィリウム・ボトリオスム (*Stemphylium botryosum*))、輪紋病 (コリネスボラ・カッシコラ (*Corynespora cassicola*)) によって引き起こされる葉、茎、さやおよび種子の真菌病。

#### 【0121】

例えば、黒根腐病 (カロネクトリア・クロタラリアエ (*Calonectria crotalariae*))、炭腐病 (マクロフォミナ・ファセオリナ (*Macrophomina phaseolina*))、フザリウム葉枯れ病または萎凋病、根腐病、ならびにさやおよび輪腐病 (collar rot) (フザリウム・オキシスポラム (*Fusarium oxysporum*))、フザリウム・オルトセラ (*Fusarium orthoceras*)、フザリウム・セミテクトム (*Fusarium semitectum*)、フザリウム・エキセチ (*Fusarium equiseti*)、ミコレプトジスクス根腐病 (ミコレプトジスクス・テレストリス (*Mycoleptodiscus terrestris*))、ネオコスモスポラ (ネオコスモスポラ・バシンフェクタ (*Neocosmospora vasinfecta*))、さやおよび茎枯れ病 (ジアボルテ・ファセオロルム (*Diaporthe phaseolorum*))、茎がん腫病 (ジアボルテ・ファセオロルム変種カウリボラ (*Diaporthe phaseolorum var. caulivora*))、フィトフソラ根腐病 (フィトフソラ・メガスペルマ (*Phytophthora megasperma*))、落葉病 (フィアロフォラ・グレガタ (*Phialophora gregata*))、ピシウム腐敗病 (ピシウム・アフアニデルマツム (*Pythium aphanidermatum*))、ピシウム・イレグラレ (*Pythium irregulare*)、ピシウム・デバリアヌム (*Pythium debaryanum*)、ピシウム・ミリオチルム (*Pythium myriotylum*)、ピシウム・ウルティマム (*Pythium ultimum*))、リゾクトニア根腐病、茎腐敗および立枯病 (リゾクトニア・ソラニ (*Rhizoctonia solani*))、スクレロチニア茎腐敗 (スクレロチニア・スクレロチオルム (*Sclerotinia sclerotiorum*))、スクレロチニア白絹病 (スクレロチニア・ロルフシイ (*Sclerotinia rolfsii*))、チエラビオプシス根腐病 (チエラビオプシス・バシコラ (*Thielaviopsis basicola*)) によって引き起こされる根および稈の真菌病。



【0122】

さらに、葉枯病および葉萎凋病ならびに果実および野菜の根および茎の病気を制御することがさらに好ましい。

【0123】

植物成長調節

ある場合には、本発明による化合物組合せおよびこのような組合せを含む組成物は、特定の濃度または施用量で、成長調節剤もしくは植物特性を改善するための薬剤として、または殺微生物剤、例えば殺真菌剤、抗真菌剤、殺菌剤、殺ウイルス剤（ウイロイドに対する組成物を含む）、またはMLO（マイコプラズマ様生物）およびRLO（リケッチア様生物）に対する組成物として使用することができる。

10

【0124】

本発明による化合物組合せおよびこのような組合せを含む組成物は、植物の生理学的過程に介入するので、植物成長調節剤としても使用することができる。植物成長調節剤は、植物に種々の効果を及ぼし得る。物質の効果は、本質的に、植物の発生段階に対する施用時間、ならびに植物またはその環境に施用される有効成分の量、ならびに施用の種類にも依存する。各場合で、成長調節剤は、作物植物に対する特定の所望の効果を有するべきである。

【0125】

成長調節効果は、早期の発芽、良好な出芽、発達した根系および/または根の成長の改善、分けつの能力の増加、生産性の高い分けつ、早い開花、植物の高さおよび/またはバイオマスの増加、茎の短絡、苗条成長、穀粒数/穂、穂数/m<sup>2</sup>、走根数および/または花数の改善、収穫指数の増強、大きな葉、死んだ根出葉の減少、葉序の改善、早熟/早い果実終わり、均質な成熟、登熟期間の増加、良好な果実終わり、大きな果実/野菜サイズ、新芽形成抵抗性、および倒伏減少を含む。

20

【0126】

収量増加または改善は、

大きさの分布（仁、果実等）、均質な成熟、穀粒水分、優れた粉砕、優れたワイン醸造、優れたビール醸造、果汁収量増加、収穫性、消化率、沈降価、落下数、さや安定性、貯蔵安定性、繊維長/強度/均一性の改善、牛乳の増加および/またはサイレージ飼育動物の満たされた品質、調理と揚げへの適応に関連する加工性改善を含み；

30

果実/仁品質、大きさの分布（仁、果実等）、貯蔵/貯蔵寿命の増加、堅さ/柔らかさ、味（香り、テクスチャ等）、等級（大きさ、形状、液果数等）、1房あたりの液果/果実の数、クリスピー性、新鮮さ、ワックスによる被覆度、生理学的障害の頻度、色等の改善に関連する市場性改善をさらに含み；

例えば、タンパク質含量、脂肪酸、油含量、油品質、アミノ酸組成、糖含量、酸含量（pH）、糖/アミノ酸比（ブリックス）、ポリフェノール、デンプン含量、栄養価、グルテン含量/指数、エネルギー含量、味などの所望の成分の増加をさらに含み；

例えば、少ないマイコトキシン、少ないアフラトキシン、ゲオスミンレベル、フェノール性芳香、ラッカーゼ（lacchase）、ポリフェノールオキシダーゼおよびペルオキシダーゼ、硝酸塩含量などの不要な成分の減少をさらに含む、

40

1ヘクタール当たりの総バイオマス、1ヘクタール当たりの収量、仁/果実の重量、種子の大きさおよび/またはヘクトリットル重量ならび製品品質改善を指している。

【0127】

植物成長調節化合物は、例えば、植物の栄養生長を減速させるために使用することができる。このような成長の落ち込みは、例えば、イネ科牧草類の場合には、装飾園、公園およびスポーツ施設、路側、空港または果物作物における草刈りの頻度を減らすことができるために、経済的に重要である。また、路側およびパイプラインもしくはオーバーヘッドケーブルの近く、または活発な植物の成長が望ましくない領域での草本植物および木本植物の生育を抑制することが重要である。

【0128】

50

また、穀物の縦成長を阻害するための成長調節剤の使用も重要である。これにより、収穫前の植物の倒伏のリスクが低減または完全に排除される。さらに、穀物の場合の成長調節剤は、倒伏に対抗する稈を強化することができる。稈を短絡および強化するための成長調節剤を使用することによって、穀物倒伏のリスクを伴わずに高い肥料量を配置して収量を増やすことができる。

【0129】

多くの作物植物では、栄養生長の落ち込みによって高密度の定植が可能になるため、土壌表面基準でより高い収量を達成することが可能となる。このようにして得られた小さい植物の別の利点は、作物を栽培および収穫することが容易であることである。

【0130】

栄養分および同化産物が植物の栄養部分よりも花および果実形成に多くの利益をもたらすので、栄養植物生長の減少は増加または改善した収量につながる可能性もある。

【0131】

あるいは、成長調節剤を用いて栄養生長を促進することもできる。これは、栄養植物部分を収穫する場合に極めて有益である。しかしながら、栄養生長を促進することによって、より多くの同化産物が形成され、より多くのまたはより大きな果実をもたらすという点で、生殖生長を促進する可能性もある。

【0132】

さらに、栄養利用効率、特に窒素(N)利用効率、リン(P)利用効率、水利用効率の改善、蒸散、呼吸および/またはCO<sub>2</sub>同化率の改善、優れた結節形成、Ca代謝改善等を通して、成長または収量に対する有益な効果を達成することができる。

【0133】

同様に、成長調整剤を用いて植物の組成を変えることができ、これにより収穫された製品の品質が改善され得る。成長調節剤の影響下で、単為結実果実が形成され得る。さらに、花の性別に影響を与えることが可能である。ハイブリッド種子の繁殖および生産において非常に重要な不稔性花粉を生産することも可能である。

【0134】

成長調節剤の使用により、植物分枝を制御することができる。一方では、頂芽優性を破壊することによって、特に観賞植物の栽培において、成長の阻害とも組み合わせ、非常に望ましくなり得る側枝の発生を促進することが可能である。しかしながら、他方では、側枝の成長を抑制することも可能である。この効果は、例えばタバコの栽培またはトマトの栽培において特に重要である。

【0135】

成長調節剤の影響下で、植物の葉の量を、植物の落葉が所望の時間に達成されるように制御することができる。このような落葉はワタの機械的収穫において重要な役割を果たすが、他の作物、例えば、例えばブドウ栽培における収穫を容易にするためにも重要である。植物を移植する前に植物の落葉を行って植物の蒸散を低下させることもできる。

【0136】

さらに、成長調節剤は、植物の老化を調節することができ、これにより緑葉面積の持続時間が長くなり、登熟期が長くなり、収量品質等が改善され得る。

【0137】

同様に、成長調節剤を用いて果実の裂開を調節することができる。一方では、時期尚早の果実の裂開を防ぐことが可能である。他方では、所望のかさを達成するために(「間引」)果実の裂開または花の発育不全を促進することも可能である。さらに、機械的収穫を可能にするため、または手動収穫を容易にするために、収穫時に成長調節剤を使用して果実を引き離すのに必要な力を低減することが可能である。

【0138】

成長調節剤を使用して、収穫前または収穫後に収穫された材料のより早いまたは遅れた熟成を達成することもできる。これは、市場の要求に対する最適な調整を可能にするので、特に有利である。さらに、成長調節剤は果実の色を改善することができる場合もある。

10

20

30

40

50

さらに、成長調節剤を使用して、一定期間内に成熟を同期させることもできる。これは、例えば、タバコ、トマトまたはコーヒーの場合において、一回の作業での完全な機械的収穫または手動収穫の必要条件を確立する。

【0139】

成長調節剤を用いることによって、例えば、苗床のピナップルまたは観賞植物などの植物が、そのようにするために通常傾けていない時に発芽、分芽または開花するように植物の種子または芽の休息に影響を与えることがさらに可能である。霜のリスクがある地域では、晩霜に起因する損傷を回避するために、成長調節剤の助けを借りて種子の出芽または発芽を遅らせることが望ましい場合がある。

【0140】

最後に、成長調節剤は、土壌の霜、干ばつまたは高い塩分に対する植物の耐性を誘導することができる。これによって、通常、この目的には適さない領域での植物の栽培が可能になる。

【0141】

耐性誘導 / 植物の健康およびその他の効果

本発明による化合物組合せおよびこのような組合せを含む組成物はまた、植物において強力な強化効果を示し得る。したがって、これらを望ましくない微生物による攻撃に対して植物の防御を動員するために使用することができる。

【0142】

本文脈における植物強化（耐性誘導）物質は、処理植物が、後に望ましくない微生物を接種した場合に、これらの微生物に対して高度の耐性を生じるように、植物の防御系を刺激することができる物質である。

【0143】

さらに、本発明に関連して、植物生理学的効果は、以下を含む：

高温または低温耐性、干ばつ耐性および干ばつストレス後の回復、水利用効率（水消費量の減少と相関する）、洪水耐性、オゾンストレスおよびUV耐性、重金属、塩、殺有害生物剤等の化学物質に対する耐性を含む非生物的ストレス耐性。

【0144】

真菌耐性の増加ならびに線虫、ウイルスおよび細菌に対する耐性の増加を含む生物的ストレス耐性。本発明の文脈では、生物的ストレス耐性は、好ましくは、真菌耐性増加および線虫に対する耐性増加を含む。

【0145】

植物の健康 / 植物の品質および種子の活力、立木失敗の減少、外観の改善、ストレス後の回復の増加、色素沈着（例えば、クロロフィル含量、ステイグリーン効果（stay-green effect）等）の改善および光合成効率の改善を含む植物の活力の増加。

【0146】

マイコトキシン

さらに、本発明による化合物組合せおよびこのような組合せを含む組成物は、収穫された材料ならびにそれから調製された食品および飼料中のマイコトキシン含量を減らすことができる。マイコトキシンには、特に、排他的ではないが、以下が含まれる：例えば、以下の真菌：フザリウム属（*Fusarium*）種、例えば *F. アクミナタム*（*F. acuminatum*）、*F. アシアチカム*（*F. asiaticum*）、*F. アベナセウム*（*F. avenaceum*）、*F. クロクウェレンス*（*F. crookwellense*）、*F. クルモルム*（*F. culmorum*）、*F. グラミネアルム*（*F. graminearum*）（*ジベレラ・ゼアエ*（*Gibberella zeae*））、*F. エキセチ*（*F. equiseti*）、*F. フジコロイ*（*F. fujikoroi*）、*F. ムサルム*（*F. musarum*）、*F. オキシスポルム*（*F. oxysporum*）、*F. プロリフェラツム*（*F. proliferatum*）、*F. ポアエ*（*F. poae*）、*F. シュードグラミネアルム*（*F. pseudograminearum*）、*F. サム - ブシヌム*（*F. sam - bucinum*）、*F. シルピ*（*F. scirpi*）、*F. セミテクトム*（*F. semitectum*）、*F. ソラニ*（*F. solani*）、*F. スポロトリコイデス*（*F. sporotrichoides*）、*F. ラングセチアエ*（*F. langsethiae*）、*F. スブグルチナンス*（*F. subglutinans*）、*F. トリシンクツム*（*F. tricinctum*

10

20

30

40

50

)、F. ベルチシリオイデス (F. verticillioides) 等、および同様にアスペルギルス属 (Aspergillus) 種、例えばA. フラバス (A. flavus)、A. パラシチクス (A. parasiticus)、A. ノミウス (A. nomius)、A. オクラセウス (A. ochraceus)、A. クラバツス (A. clavatus)、A. テレウス (A. terreus)、A. ベルシコロール (A. versicolor)、ペニシリウム属 (Penicillium) 種、例えばP. ベルコスム (P. verrucosum)、P. ビリジカツム (P. viridicatum)、P. シトリヌム (P. citrinum)、P. エクспанスム (P. expansum)、P. クラビフォルメ (P. claviforme)、P. ロケフォルチ (P. roqueforti)、クラビセプス属 (Claviceps) 種、例えばC. プルプレア (C. purpurea)、C. フシフォルミス (C. fusiformis)、C. パスパリ (C. paspali)、C. アフリカナ (C. africana)、スタキボトリス属 (Stachybotrys) 種などによって産生され得るデオキシニバレノール (DON)、ニバレノール、15 - Ac - DON、3 - Ac - DON、T2 - およびHT2 - 毒素、フモニシン、ゼアラレノン、モニリホルミン、フザリン、ジアセトキシシルベノール (DAS)、ビューベリシン、エンニアチン、フザロプロリフェリン (fusaroproliferin)、フザレノール (fusarenol)、オクラトキシシン、パツリン、麦角アルカロイドおよびアフマトキシシン。

10

**【0147】**

## 材料保護

本発明による化合物組合せおよびこのような組合せを含む組成物を、植物病原性真菌による攻撃および破壊に対する産業材料の保護のために、材料の保護に使用することもできる。

**【0148】**

さらに、本発明による化合物組合せおよびこのような組合せを含む組成物は、単独でまたは他の有効成分と組み合わせて防汚組成物として使用することができる。

20

**【0149】**

本文脈における産業材料は、産業での使用のために調製された無生物材料を意味すると理解される。例えば、本発明の組成物によって微生物の変質または破壊から保護される産業材料は、接着剤、にかわ、紙、壁紙および板紙/厚紙、織物、カーペット、皮革、木材、繊維および組織、塗料およびプラスチック製品、冷却潤滑剤、ならびに微生物に感染するまたは微生物によって破壊され得る他の材料であり得る。微生物の増殖によって損なわれる可能性のある、冷却水回路、冷却および加熱システムならびに換気および空調装置などの生産プラントおよび建物の一部もまた、保護されるべき材料の範囲内で言及され得る。本発明の範囲内の産業材料は、好ましくは接着剤、サイズ、紙およびカード、皮革、木材、塗料、冷却潤滑剤および熱伝達流体、より好ましくは木材を含む。

30

**【0150】**

本発明による化合物組合せおよびこのような組合せを含む組成物は、腐敗、崩壊、変色、脱色またはカビの形成などの有害効果を防ぐことができる。

**【0151】**

木材の処理の場合、本発明による化合物組合せおよびこのような組合せを含む組成物を、材木の上または内側で成長する真菌病に対して使用することもできる。「材木」という用語は、全ての種類の木材、ならびに建造を意図したこの木材の全ての種類のもの、例えば、無垢材、圧縮材、積層材および合板などを意味する。本発明により材木を処理する方法は、主として、本発明による組成物を接触させることにあり、これには、例えば、直接施用、噴霧、浸漬、注入または他の適切な手段が含まれる。

40

**【0152】**

さらに、本発明による化合物組合せおよびこのような組合せを含む組成物を、塩水または汽水と接触する物体、特に船体、スクリーン、ネット、建物、係船具および信号システムを汚損から保護するために使用することができる。

**【0153】**

本発明による化合物組合せおよびこのような組合せを含む組成物はまた、貯蔵品を保護するために使用することもできる。貯蔵品とは、植物もしくは動物由来の天然物質、または天然起源で長期間の保護が望まれるその加工品を意味すると理解される。茎、葉、塊茎

50

、種子、果実、穀物などの植物または植物部分などの植物起源の貯蔵品は、新たに収穫して、または（予備）乾燥、加湿、微粉碎、粉碎、プレスもしくは焙煎した後に保護することができる。貯蔵品には、材木、未処理のもの、例えば建設用材木、電気ポールおよび障壁の、または完成品の形態のもの、例えば家具の両者が含まれる。動物起源の貯蔵品は、例えば、皮革、なめし革、毛皮および毛髪である。本発明の組成物は、腐敗、崩壊、変色、脱色またはカビの形成などの有害効果を防止することができる。

【0154】

産業材料を分解するまたは変化させることができる微生物には、例えば、細菌、真菌、酵母、藻類および粘液生物が含まれる。式(1)の化合物は、好ましくは真菌、特にカビ、木材変色および木材破壊真菌（子囊菌類、担子菌類、不完全菌類および接合菌類）に対して、ならびに粘液生物および藻類に対して作用する。例としては、以下の属の微生物が挙げられる：アルテルナリア属（*Alternaria*）、例えばアルテルナリア・テヌイス（*Alternaria tenuis*）；アスペルギルス属（*Aspergillus*）、例えばアスペルギルス・ニガー（*Aspergillus niger*）；ケトミウム属（*Chaetomium*）、例えばケトミウム・グロボスム（*Chaetomium globosum*）；コニオフォラ属（*Coniophora*）、例えばコニオフォラ・プエタナ（*Coniophora puetana*）；レンチヌス属（*Lentinus*）、例えばレンチヌス・チグリヌス（*Lentinus tigrinus*）；ペニシリウム属（*Penicillium*）、例えばペニシリウム・グラウクム（*Penicillium glaucum*）；ポリポルス属（*Polyporus*）、例えばポリポルス・ベルシコロル（*Polyporus versicolor*）；アウレオバシジウム属（*Aureobasidium*）、例えばアウレオバシジウム・プルランス（*Aureobasidium pullulans*）；スクレロフォマ属（*Sclerophoma*）、例えば、スクレロフォマ・ピチオフィラ（*Sclerophoma pityophila*）；トリコデルマ属（*Trichoderma*）、例えばトリコデルマ・ビリデ（*Trichoderma viride*）；オフィオストマ属（*Ophiostoma*）菌種、セラトシスチス属（*Ceratocystis*）菌種、フミコラ属（*Humicola*）菌種、ペトリエラ属（*Petriella*）菌種、トリチュルス属（*Trichurus*）菌種、コリオラス属（*Coriolus*）菌種、グロエオフィルム属（*Gloeophyllum*）菌種、プレウロツス属（*Pleurotus*）菌種、ポリア属（*Poria*）菌種、セルブラ属（*Serpula*）菌種およびチロミセス属（*Tyromyces*）菌種、クラドスポリウム属（*Cladosporium*）菌種、パエシロミセス属（*Paecilomyces*）菌種、ムコール属（*Mucor*）菌種、エシェリキア属（*Escherichia*）、例えばエシェリキア・コリ（*Escherichia coli*）；シュードモナス属（*Pseudomonas*）、例えばシュードモナス・アエルギノーサ（*Pseudomonas aeruginosa*）；スタフィロコッカス属（*Staphylococcus*）、例えばスタフィロコッカス・アウレウス（*Staphylococcus aureus*）、カンジダ属（*Candida*）菌種およびサッカロマイセス属（*Saccharomyces*）菌種、例えばサッカロマイセス・セレビスエ（*Saccharomyces cerevisiae*）。

【0155】

製剤

本発明はさらに、本発明による化合物組合せを含む、望まない微生物を制御するための組成物に関する。これらは、好ましくは、農業上適切な助剤、例えば溶媒、担体、界面活性剤または増量剤を含む殺真菌組成物である。

【0156】

本発明によると、担体は、優れた施用性（applicability）、特に植物または植物の部分または種子への施用のために、有効成分が混合または結合された天然または合成の有機または無機物質である。担体は固体でも液体でもよく、一般に不活性であり、農業での使用に適しているべきである。

【0157】

有用な固体担体には、例えば、アンモニウム塩および天然岩粉、例えばカオリン、粘土、タルク、チョーク、石英、アタパルジャイト、モンモリロナイトまたは珪藻土、ならびに合成岩粉、例えば微細シリカ、アルミナおよびケイ酸塩が含まれ；顆粒のための有用な固体担体には、例えば、粉碎および分別された天然岩、例えば方解石、大理石、軽石、セピオライトおよびドロマイト、ならびに無機および有機粉の合成顆粒、および有機材料の顆粒、例えば紙、おがくず、ヤシ殻、トウモロコシ穂軸およびタバコ茎が含まれ；有用

な乳化剤および/または泡形成剤には、例えば、非イオン性およびアニオン性乳化剤、例えばポリオキシエチレン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレン脂肪アルコールエーテル、例えばアルキルアリアルポリグリコールエーテル、アルキルスルホネート、アルキルサルフェート、アリアルスルホネートおよびさらにはタンパク質加水分解物が含まれ；適当な分散剤は例えばアルコール - POEおよび/または - POPエーテル、酸および/またはPOP POEエステル、アルキルアリアルおよび/またはPOP POEエーテル、脂肪および/またはPOP POE付加物、POE - および/またはPOP - ポリオール誘導体、POE - および/またはPOP - ソルビタンまたは糖付加物、アルキルまたはアリアルサルフェート、アルキル - またはアリアルスルホネートおよびアルキルまたはアリアルホスフェートあるいは対応するPO - エーテル付加物のクラスの非イオン性および/またはイオン性物質である。さらに、オリゴマーまたはポリマー、例えば単独で、または例えば、(ポリ)アルコールまたは(ポリ)アミンと組み合わせて、ビニルモノマー、アクリル酸、EOおよび/またはPOから誘導されるものが適している。リグニンおよびそのスルホン酸誘導体、非改質および改質セルロース、芳香族および/または脂肪族スルホン酸ならびにこれらのホルムアルデヒド付加物を使用することも可能である。

10

## 【0158】

有効成分は、液剤、乳剤、水和剤、水性および油性懸濁剤、散剤、粉剤、ペースト、可溶性散剤、可溶性顆粒剤、散布用顆粒剤、サスポエマルジョン (suspoemulsion) 濃縮物、有効成分を含浸した天然産物、有効成分を含浸した合成物質、肥料およびポリマー物質中のマイクロカプセルなどの慣用的な製剤に変換することができる。

20

## 【0159】

有効成分は、そのまま、その製剤の形態またはそれらから調製した使用形態、例えば、使用準備済液剤、乳剤、水性または油性懸濁剤、散剤、水和剤、ペースト、可溶性散剤、可溶性顆粒剤、粉剤、散布用顆粒剤、サスポエマルジョン濃縮物、有効成分を含浸した天然産物、有効成分を含浸した合成物質、肥料およびポリマー物質中のマイクロカプセルで施用することができる。施用は、慣用的な様式で、例えば散水、噴霧、霧化、散布、散粉、発泡、分散などによって達成される。超低容量法で有効成分を展開する、または有効成分製剤/有効成分そのものを土壌に注入することも可能である。植物の種子を処理することも可能である。

## 【0160】

言及される製剤は、例えば有効成分を少なくとも1種の慣用的な増量剤、溶媒または希釈剤、乳化剤、分散剤および/または結合剤または固定剤、湿潤剤、撥水剤、適当な場合には乾燥剤、およびUV安定剤、および適当な場合には染料および顔料、消泡剤、保存剤、二次増粘剤、展着剤、ジベレリンおよび他の加工助剤と混合することによって、それ自体公知の様式で調製することができる。

30

## 【0161】

本発明は、既に使用準備が整っており、植物または種子に適した装置と共に展開することができる製剤だけでなく、使用前に水で希釈しなければならない商業的濃縮物も含む。

## 【0162】

本発明による化合物組合せは、それ自体で、またはそれらの(商業的)製剤ならびに殺虫剤、誘引剤、滅菌剤、殺菌剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、成長調節剤、除草剤、肥料、毒性緩和剤および/または情報化学物質などの他の(既知の)有効成分との混合物としてこれらの製剤から調製された使用形態で存在し得る。

40

## 【0163】

使用される助剤は、一定の技術的特性および/または特定の生物学的特性などの特定の特性を組成物自体および/またはそれに由来する調製物(例えば噴霧液、種子粉衣)に付与するのに適した物質であり得る。典型的な助剤には、増量剤、溶媒および担体が含まれる。

## 【0164】

適当な増量剤は、例えば、水、芳香族および非芳香族炭化水素(パラフィン、アルキル

50

ベンゼン、アルキルナフタレン、クロロベンゼンなど)、アルコールおよびポリオール(場合により置換されていても、エーテル化されていてもおよび/またはエステル化されていてもよい)、ケトン(アセトン、シクロヘキサノンなど)、エステル(脂肪および油を含む)ならびに(ポリ)エーテル、未置換および置換アミン、アミド、ラクタム(N-アルキルピロリドンなど)ならびにラクトン、スルホンおよびスルホキシド(ジメチルスルホキシドなど)のクラスの極性および非極性有機化学液体である。

【0165】

液化ガス増量剤または担体は、標準温度および標準圧力下で気体である液体、例えば八口炭化水素、またはブタン、プロパン、窒素および二酸化炭素などのエアロゾル噴霧剤を意味すると理解される。

10

【0166】

製剤において、カルボキシメチルセルロース、粉末、顆粒またはラテックスの形態の天然および合成ポリマー、例えばアラビアゴム、ポリビニルアルコールおよびポリ酢酸ビニル、または天然リン脂質、例えばセファリンおよびレシチンならびに合成リン脂質などの粘着剤を使用することが可能である。さらなる添加剤は鉱油および植物油であり得る。

【0167】

使用される増量剤が水である場合、補助溶剤として例えば有機溶剤を使用することも可能である。有用な液体溶媒は、本質的には、芳香族、例えばキシレン、トルエンまたはアルキルナフタレン、塩素化芳香族または塩素化脂肪族炭化水素、例えばクロロベンゼン、クロロエチレンまたは塩化メチレン、脂肪族炭化水素、例えばシクロヘキサンまたはパラフィン、例えば石油留分、アルコール、例えばブタノールまたはグリコールならびにそれらのエーテルおよびエステル、ケトン、例えばアセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトンまたはシクロヘキサノン、強極性溶媒、例えばジメチルホルムアミドおよびジメチルスルホキシド、または水である。

20

【0168】

本発明による化合物組合せを含む組成物は、さらなる成分、例えば界面活性剤をさらに含む得る。適当な界面活性剤は、イオン性または非イオン性の特性を有する乳化剤および/または泡形成剤、分散剤または湿潤剤、あるいはこれらの界面活性剤の混合物である。その例は、ポリアクリル酸の塩、リグノスルホン酸の塩、フェノールスルホン酸またはナフタレンスルホン酸の塩、エチレンオキシドと脂肪アルコールまたは脂肪酸または脂肪族アミンとの重縮合物、置換フェノール(好ましくはアルキルフェノールまたはアリールフェノール)、スルホコハク酸エステルの塩、タウリン誘導體(好ましくは、アルキルタウレート)、ポリエトキシ化アルコールまたはフェノールのリン酸エステル、ポリオールの脂肪エステル、ならびに硫酸エステル、スルホン酸エステルおよびリン酸エステルを含む化合物の誘導體、例えばアルキルアリールポリグリコールエーテル、アルキルスルホネート、アルキルサルフェート、アリールスルホネート、タンパク質加水分解物、リグノサルファイト(lignosulphite)廃液およびメチルセルロースである。界面活性剤の存在は、有効成分の1つおよび/または不活性担体の1つが水に不溶性であり、施用が水中で行われる場合に必要である。界面活性剤の割合は、本発明の組成物の5~40重量%である。

30

【0169】

無機顔料、例えば酸化鉄、酸化チタンおよびブルシアンブルー、ならびに有機染料、例えばアリザリン染料、アゾ染料および金属フタロシアニン染料、ならびに微量栄養素、例えば鉄、マンガン、ホウ素、銅、コバルト、モリブデンおよび亜鉛の塩などの染料を使用することが可能である。

40

【0170】

さらなる添加剤は、香料、鉱物または植物、場合により変性油、ワックスおよび栄養素(微量栄養素を含む)、例えば鉄、マンガン、ホウ素、銅、コバルト、モリブデンおよび亜鉛の塩であり得る。

【0171】

追加の成分は、安定剤、例えば低温安定剤、保存剤、抗酸化剤、光安定剤、あるいは化

50

学のおよび / または物理的安定性を改善する他の剤であり得る。

【0172】

適当な場合には、例えば、保護コロイド、結合剤、接着剤、増粘剤、チキソトロピック物質、浸透剤、安定剤、封鎖剤、錯体形成剤などの他の追加の成分が存在してもよい。一般に、有効成分は、製剤化目的のために一般的に使用される任意の固体または液体添加剤と組み合わせることができる。

【0173】

製剤は、一般的に0.05~99重量%、0.01~98重量%、好ましくは0.1~95重量%、より好ましくは0.5~90重量%の有効成分、最も好ましくは10~70重量%の有効成分を含有する。

10

【0174】

上記の製剤を望まない微生物を制御するために使用することができ、ここでは式(1)の化合物を含む組成物を微生物および / またはその生息地に施用する。

【0175】

混合物

本発明による化合物組合せはそのまままたはその製剤で使用することができ、例えば活性スペクトルを広げるためまたは耐性の発達を防止するために既知の殺菌剤、殺ダニ剤、殺線虫剤または殺虫剤と混合することができる。

【0176】

有用な混合パートナーには、例えば、既知の殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤または殺菌剤が含まれる(Pesticide Manual、第14版も参照)。

20

【0177】

他の既知の有効成分、例えば除草剤、または肥料および成長調節剤、毒性緩和剤および / または情報化学物質との混合物も可能である。

【0178】

種子処理

本発明はさらに、種子を処理する方法を含む。

【0179】

本発明のさらなる態様は、特に、本発明による化合物組合せまたはこのような組合せを含む組成物で処理された種子(休眠、プライミング、発芽、催芽(pregerminated)または根および葉が出たものさえ)に関する。本発明の種子は、植物病原性有害真菌から種子および出芽した植物を保護する方法に使用される。これらの方法では、少なくとも1つの本発明の有効成分で処理した種子が使用される。

30

【0180】

本発明による化合物組合せおよびこのような組合せを含む組成物はまた、種子および稚苗の処理にも適している。有害生物によって引き起こされる作物植物への損傷の大部分は、植物の播種前または発芽後の種子の感染によって誘因される。成長している植物の根および苗条が特に敏感であり、わずかな損傷ですら植物が死滅する可能性があるため、この段階は特に重要である。したがって、適当な組成物を使用することによって種子および発芽植物を保護することに大きな関心が持たれている。

40

【0181】

使用される有効成分によって植物自体を損傷することなく、種子、発芽植物および出芽した実生に植物病原性真菌による攻撃からの最良の可能な保護を提供するために使用される有効成分の量を最適化することも望ましい。特に、最小限の作物保護組成物を使用して、種子および発芽植物の最適な保護を達成するために、種子の処理方法は、トランスジェニック植物の固有の表現型を考慮する必要もある。

【0182】

そのため、本発明はまた、種子を本発明の組合せまたは組成物で処理することによって、種子、発芽植物および出芽した実生を、動物有害生物および / または植物病原性有害微生物による攻撃から保護する方法に関する。本発明はまた、種子、発芽植物および出芽し

50



た実生を動物有害生物および/または植物病原性微生物から保護するために種子を処理するための、本発明による組合せまたは組成物の使用に関する。本発明はさらに、動物有害生物および/または植物病原性微生物から保護するために本発明の組合せまたは組成物で処理された種子に関する。

【0183】

本発明の利点の1つは、種子をこれらの組成物で処理することにより、種子自体だけでなく、出芽後に得られた植物も、動物有害生物および/または植物病原性有害微生物から保護されることである。このようにして、播種時または播種のすぐ後に作物を直ちに処理することによって、播種前の種子処理と同様に植物が保護される。同様に、本発明の有効成分組合せまたは組成物を、特にトランスジェニック種子にも使用することができ、この場合、この種子から成長する植物は、有害生物、除草剤の損傷または非生物学的ストレスに対して作用するタンパク質を発現することができることが有利であると考えられる。このような種子を本発明の有効成分または組成物、例えば殺虫性タンパク質で処理すると、一定の有害生物を制御することができる。

10

【0184】

本発明による化合物組合せおよびこのような組合せを含む組成物は、農業、温室、森林または園芸において使用される任意の植物品種の種子の保護に適している。より具体的には、種子は、穀物（コムギ、オオムギ、ライムギ、キビおよびエンバクなど）、ナタネ、トウモロコシ、ワタ、ダイズ、イネ、ジャガイモ、ヒマワリ、マメ、コーヒー、ビート（例えばサトウダイコンおよび飼料ビート）、ピーナッツ、野菜（トマト、キュウリ、タマネギ、レタスなど）、芝生および観賞植物の種子である。特に重要なのは、コムギ、ダイズ、ナタネ、トウモロコシおよびイネの種子の処理である。

20

【0185】

以下にも記載されるように、本発明の有効成分または組成物によるトランスジェニック種子の処理が、特に重要である。これは、例えば、殺虫性を有する、ポリペプチドまたはタンパク質の発現を可能にする少なくとも1つの異種遺伝子を含む植物の種子を指す。トランスジェニック種子中のこれらの異種遺伝子は、例えば、バチルス属（*Bacillus*）、リゾビウム属（*Rhizobium*）、シュードモナス属（*Pseudomonas*）、セラチア属（*Serratia*）、トリコデルマ属（*Trichoderma*）、クラビクター属（*Clavibacter*）、グロムス属（*Glomus*）またはグリオクラジウム属（*Gliocladium*）の種の微生物に由来し得る。これらの異種遺伝子は、好ましくは、バチルス属（*Bacillus*）の種由来であり、この場合、遺伝子産物は、アワノメイガの幼虫および/または西洋コーンルートワームに対して有効である。特に好ましくは、異種遺伝子はバチルス・チューリンゲンシス（*Bacillus thuringiensis*）に由来する。

30

【0186】

本発明の文脈において、本発明の組合せまたは組成物は、単独でまたは適当な製剤で種子に施用される。好ましくは、種子は、処理過程において損傷が生じないように十分に安定した状態で処理される。一般に、種子は、収穫と播種してからしばらくしてからのもので処理することができる。植物から分離され、穂軸、殻、柄、皮、毛または果肉から解放された種子を使用することが通例である。例えば、収穫され、洗浄され、15重量%未満の含水量まで乾燥された種子を使用することが可能である。あるいは、乾燥後に、例えば水で処理し、次いで再び乾燥させた種子、またはプライミング直後の種子、またはプライミング条件下で保存した種子または催芽種子、または苗床トレイ、テープもしくは紙に播種した種子を使用することも可能である。

40

【0187】

種子を処理する場合、種子の発芽が損なわれないように、または得られた植物が損傷されないように、種子に施用される本発明の組合せもしくは組成物の量および/またはさらなる添加剤の量が選択されることが一般的に保証されなければならない。これは、一定の施用量で植物毒性効果を示し得る有効成分の場合に特に保証されなければならない。

【0188】

50

本発明による化合物組合せおよびこのような組合せを含む組成物は直接、すなわち他の成分を一切含有しないで、希釈することなく施用することができる。一般に、組成物を適当な製剤の形態で種子に施用することが好ましい。種子処理に適した製剤および方法は、当業者に知られている。本発明による化合物組合せは、液剤、乳剤、懸濁剤、散剤、発泡剤、スラリーなどの種子施用に関連する通常の製剤に変換され得る、または種子用の他のコーティング組成物、例えば被膜形成材料、ペレット化材料、微細な鉄もしくは他の金属粉末、顆粒、不活性化種子のための被覆材料およびULV配合物と組み合わせられ得る。

【0189】

これらの製剤は、有効成分または有効成分の組み合わせを慣用的な添加剤、例えば慣用的な増量剤および溶媒もしくは希釈剤、染料、湿潤剤、分散剤、乳化剤、消泡剤、保存剤、二次増粘剤、接着剤、ジベレリン、および水と混合することによって既知の様式で調製される。

10

【0190】

本発明により使用可能な種子粉衣製剤中に存在し得る有用な染料は、このような目的のために慣用的な全ての染料である。水に難溶性の顔料または水に可溶性の染料のいずれかを使用することが可能である。例としては、ローダミンB、C.I.ピグメントレッド112およびC.I.ソルベントレッド1の名称で知られている染料が挙げられる。

【0191】

本発明により使用可能な種子粉衣製剤中に存在し得る有用な湿潤剤は、湿潤を促進し、活性農薬成分の製剤に従来から使用されている全ての物質である。アルキルナフタレンスルホネート、例えばジイソプロピルまたはジイソブチルナフタレンスルホネートが好ましく使用可能である。

20

【0192】

本発明により使用可能な種子粉衣製剤中に存在し得る有用な分散剤および/または乳化剤は、活性農薬成分の製剤に従来から使用されている全ての非イオン性、アニオン性およびカチオン性分散剤である。非イオン性もしくはアニオン性分散剤または非イオン性もしくはアニオン性分散剤の混合物が好ましく使用可能である。有用な非イオン性分散剤には、特に、エチレンオキシド/プロピレンオキシドブロックポリマー、アルキルフェノールポリグリコールエーテルおよびトリスチリルフェノールポリグリコールエーテル、ならびにこれらのリン酸化または硫酸化誘導体が含まれる。適当なアニオン性分散剤は、特にリグノスルホネート、ポリアクリル酸塩およびアリアルスルホネート/ホルムアルデヒド縮合物である。

30

【0193】

本発明により使用可能な種子粉衣製剤中に存在し得る消泡剤は、活性農薬成分の製剤に従来から使用されている全ての発泡阻害物質である。シリコーン消泡剤およびステアリン酸マグネシウムを好ましく使用することができる。

【0194】

本発明により使用可能な種子粉衣製剤中に存在し得る保存剤は、農薬組成物にこのような目的のために使用可能な全ての物質である。例としては、ジクロロフェンおよびベンジルアルコールヘミホルマルが挙げられる。

40

【0195】

本発明により使用可能な種子粉衣製剤中に存在し得る二次増粘剤は、農薬組成物にこのような目的のために使用可能な全ての物質である。好ましい例としては、セルロース誘導体、アクリル酸誘導体、キサントラン、改質粘土および微細シリカが挙げられる。

【0196】

本発明により使用可能な種子粉衣製剤中に存在し得る接着剤は、種子粉衣製品に使用可能な全ての慣用的な結合剤である。好ましい例としては、ポリビニルピロリドン、ポリ酢酸ビニル、ポリビニルアルコールおよびチロースが挙げられる。

【0197】

本発明により使用可能な種子施用のための製剤を、直接または事前に水で希釈した後に

50

多種多様な種類の種子を処理するために使用することができる。例えば、水で希釈することによってそこから得ることができる濃縮物または調製物を使用してコムギ、オオムギ、ライムギ、エンパクおよびライコムギなどの穀物の種子、ならびにトウモロコシ、ダイズ、イネ、アブラナ、エンドウ、マメ、ワタ、ヒマワリおよびビートの種子、ならびに多種多様な野菜の種子をドレッシングすることができる。本発明により使用可能な製剤またはその希釈調製物を、トランスジェニック植物の種子に使用することもできる。この場合、発現によって形成される物質との相互作用において、さらなる相乗効果が生じることもある。

#### 【0198】

本発明により使用可能な製剤または水を添加することによってそれから調製された調製物で種子を処理するために、種子施用に慣用的に使用可能な全ての混合装置が有用である。具体的には、種子施用での手順は、種子をミキサーに入れ、特定の所望量の製剤をそれ自体で、または水で事前に希釈した後に添加し、施用された製剤全てが種子に均質に分配されるまで全てを混合するというものである。適切であれば、これに続いて乾燥操作が行われる。

10

#### 【0199】

本発明により使用可能な製剤の施用量は、比較的広範囲内で変えることができる。これは、製剤中の有効成分の特定の含量および種子によって導かれる。各単一有効成分の施用量は、一般的に、種子1キログラム当たり0.001~15g、好ましくは種子1キログラム当たり0.01~5gである。

20

#### 【0200】

##### 抗真菌効果

さらに、本発明による化合物組合せおよびこのような組合せを含む組成物はまた、極めて優れた抗真菌効果を有する。化合物は、特に皮膚糸状菌および酵母、カビおよび二相性真菌（例えば、カンジダ（*Candida*）種、例えばカンジダ・アルビカンス（*Candida albicans*）、カンジダ・グラブラタ（*Candida glabrata*））、ならびにエピデルモフィトン・フロッコサム（*Epidermophyton floccosum*）、アスペルギルス属（*Aspergillus*）種、例えばアスペルギルス・ニガー（*Aspergillus niger*）およびアスペルギルス・フミガーツス（*Aspergillus fumigatus*）、白癬菌属（*Trichophyton*）種、例えばトリコフィトン・メンタグロフィテス；（*Trichophyton mentagrophytes*）、ミクロスポロン属（*Microsporon*）種、例えばミクロスポロン・カニス（*Microsporon canis*）およびアウドウイニイ（*audouinii*）に対する極めて広い抗真菌活性スペクトルを有する。これら真菌の列挙は決してカバーされる真菌スペクトルの制限を構成するものではなく、単なる例示的な性質にすぎない。

30

#### 【0201】

本発明による化合物組合せおよびこのような組合せを含む組成物を、魚および甲殻類の養殖において重要な真菌病原体、例えばマスのサプロレグニア・ディクリナ（*saprolegnia diclina*）、ザリガニのサプロレグニア・パラシチカ（*saprolegnia parasitica*）を制御するために使用することもできる。

#### 【0202】

そのため、本発明による化合物組合せおよびこのような組合せを含む組成物を、医学的用途と非医学的用途の両方に使用することができる。

40

#### 【0203】

本発明による化合物組合せおよびこのような組合せを含む組成物は、そのまま、その製剤の形態で、またはそこから調製した使用形態で、例えば使用準備液剤、懸濁剤、水和剤、ペースト、可溶性散剤、粉剤および顆粒剤で使用することができる。施用は、慣用的な様式で、例えば散水、噴霧、霧化、散布、散粉、発泡、分散などによって達成される。超低容量法で有効成分を展開する、または有効成分製剤/有効成分そのものを土壤に注入することも可能である。植物の種子を処理することも可能である。

#### 【0204】

50

## GMO

既に上述したように、本発明により全ての植物およびその部分を処理することが可能である。好ましい実施形態では、野生植物種および植物栽培品種、または交配もしくはプロトプラスト融合などの従来の生物学的育種法によって得られたもの、ならびにこれらの部分が処理される。さらに好ましい実施形態では、適切であれば従来の方法（遺伝子組換え体）と組み合わせた遺伝子工学的的方法によって得られたトランスジェニック植物および植物栽培品種、またはその部分が処理される。「部分」または「植物の部分」または「植物部分」という用語は上で説明されている。より好ましくは、商業的に入手可能であるまたは使用されている植物栽培品種の植物が本発明により処理される。植物栽培品種は、新しい特性（「形質」）を有し、従来育種、突然変異誘発または組換えDNA技術によって得られた植物を意味すると理解される。これらは栽培品種、品種、生物型または遺伝子型であり得る。

10

## 【0205】

本発明による処理方法を、遺伝子組換え体（GMO）、例えば植物または種子の処理に使用することができる。遺伝子組換え植物（またはトランスジェニック植物）は、異種遺伝子がゲノムに安定に組み込まれている植物である。「異種遺伝子」という表現は、本質的に、植物の外部で提供されるまたは組み立てられ、核、葉緑体またはミトコンドリアゲノムに導入されると、目的のタンパク質もしくはポリペプチドを発現させることによって、または植物中に存在する1種もしくは複数の他の遺伝子を（例えば、アンチセンス技術、コサプレッション技術、RNA干渉 - RNAi技術もしくはマイクロRNA - miRNA技術を用いて）下方制御もしくはサイレンシングすることによって形質転換植物に新たなまたは改善した農学的もしくは他の特性を与えるゲノムを意味する。ゲノム中に位置する異種遺伝子は、導入遺伝子とも呼ばれる。植物ゲノムにおけるその特定の位置によって定義される導入遺伝子は、形質転換またはトランスジェニックイベントと呼ばれる。

20

## 【0206】

本発明により好ましく処理される植物および植物栽培品種は、これらの植物（育種および/または生物工学的的手段によって得られたものであっても）に特に有利で有用な形質を付与する遺伝物質を有する全ての植物を含む。

## 【0207】

本発明により好ましく処理される植物および植物品種は、1つまたは複数の生物的ストレスに対して耐性である、すなわち、植物は、線虫、昆虫、ダニ、植物病原性真菌、細菌、ウイルスおよび/またはウイロイドなどの動物および微生物有害生物に対してより優れた防御を示す。

30

## 【0208】

本発明により同様に処理することができる植物および植物栽培品種は、1つまたは複数の非生物的ストレスに耐性である植物である。非生物的ストレス条件には、例えば、干ばつ、低温暴露、熱暴露、浸透圧ストレス、洪水、土壌塩分の増加、ミネラル暴露の増加、オゾン暴露、高い光暴露、窒素栄養素の限られた入手可能性、リン栄養素の限られた入手可能性、日陰回避が含まれ得る。

## 【0209】

本発明により同様に処理することができる植物および植物栽培品種は、収量特性の向上を特徴とする植物である。植物における収量の増加は、例えば、水利用効率、保水効率、窒素利用改善、炭素同化増強、光合成改善、発芽効率増加および成熟促進などの植物生理学、成長および発育の改善の結果であり得る。収量は、それだけに限らないが、初期開花、ハイブリッド種子産生のための開花制御、実生の活力、植物の大きさ、節間数および距離、根の成長、種子の大きさ、果実の大きさ、さやの大きさ、さやまたは穂の数、種子数/さやまたは穂、種子質量、種子充満度の増強、種子分散の減少、さや裂開の減少ならびに倒伏耐性を含む改良された植物構造（ストレスおよび非ストレス条件下）によってさらに影響され得る。さらなる収量形質は、炭水化物含量および組成（例えば、ワタまたはデンプン）、タンパク質含量、油含量および組成、栄養価、抗栄養化合物の減少、加工性改

40

50

善ならびにより優れた貯蔵安定性などの種子組成を含む。

【0210】

本発明により処理することができる植物は、一般に、高い収量、活力、健康ならびに生物学的および非生物学的ストレスに対する耐性をもたらすヘテロシスまたは雑種強勢の特性を既に示すハイブリッド植物である。

【0211】

本発明により処理することができる植物または植物栽培品種（遺伝子工学などの植物バイオテクノロジー法によって得られる）は、除草剤耐性植物、すなわち1つまたは複数の所与の除草剤に耐性にされた植物である。このような植物は、遺伝子形質転換によって、またはこのような除草剤耐性を付与する突然変異を含有する植物の選択によって得ることができる。

10

【0212】

本発明により同様に処理することができる植物または植物栽培品種（遺伝子工学などの植物バイオテクノロジー法によって得られる）は、昆虫耐性トランスジェニック植物、すなわち一定の標的昆虫による攻撃に対して耐性にされた植物である。このような植物は、遺伝子形質転換によって、またはこのような昆虫耐性を付与する突然変異を含有する植物の選択によって得ることができる。

【0213】

本発明により同様に処理することができる植物または植物栽培品種（遺伝子工学などの植物バイオテクノロジー法によって得られる）は、非生物学的ストレスに耐性である。このような植物は、遺伝子形質転換によって、またはこのようなストレス耐性を付与する突然変異を含有する植物の選択によって得ることができる。

20

【0214】

本発明により同様に処理することができる植物または植物栽培品種（遺伝子工学などの植物バイオテクノロジー法によって得られる）は、収穫物の変化した量、品質および/または貯蔵安定性ならびに/あるいは収穫物の特定の成分の変化した特性を示す。

【0215】

本発明により同様に処理することができる植物または植物栽培品種（遺伝子工学などの植物バイオテクノロジー法によって得ることができる）は、変化した繊維特性を有するワタ植物などの植物である。このような植物は、遺伝子形質転換によって、またはこのような変化した繊維特性を付与する突然変異を含有する植物の選択によって得ることができる。

30

【0216】

本発明により同様に処理することができる植物または植物栽培品種（遺伝子工学などの植物バイオテクノロジー法によって得ることができる）は、変化した油プロファイル特性を有するアブラナまたは関連アブラナ科植物などの植物である。このような植物は、遺伝子形質転換によって、またはこのような変化した油プロファイル特性を付与する突然変異を含有する植物の選択によって得ることができる。

【0217】

本発明により同様に処理することができる植物または植物栽培品種（遺伝子工学などの植物バイオテクノロジー法によって得ることができる）は、変化した種子脱粒特性を有するアブラナまたは関連アブラナ科植物などの植物である。このような植物は、遺伝子形質転換によって、またはこのような変化した種子脱粒特性を付与する突然変異を含有する植物の選択によって得ることができ、これらには種子脱粒が遅れたまたは減少したアブラナ植物などの植物が含まれる。

40

【0218】

本発明により同様に処理することができる植物または植物栽培品種（遺伝子工学などの植物バイオテクノロジー法によって得ることができる）は、変化した翻訳後タンパク質修飾パターンを有するタバコ植物などの植物である。

【0219】

50

### 施用量

殺真菌剤として本発明による化合物組合せおよびこのような組合せを含む組成物を使用する場合、施用量を施用の種類に応じて比較的広い範囲内で変えることができる。施用量は、

植物部分、例えば葉の処理の場合：0.1~10000g/ha、好ましくは10~1000g/ha、より好ましくは50~300g/ha（散水または滴下による施用の場合、特にロックウールまたはパーライトなどの不活性基剤を使用する場合に施用量を減少させることさえ可能である）であり；

種子処理の場合、種子100kg当たり0.1~200g、好ましくは種子100kg当たり1~150g、より好ましくは種子100kg当たり2.5~25g、さらにより好ましくは種子100kg当たり2.5~12.5gであり；

土壌処理の場合、0.1~10000g/ha、好ましくは1~5000g/haであり、  
 所与の量はそれぞれの組合せまたは組成物中の有効成分の総量を指す。

#### 【0220】

これらの施用量は単なる例示にすぎず、本発明の目的を限定するものではない。

#### 【0221】

本発明を以下の実施例により説明する。しかしながら、本発明はこれらの実施例に限定されない。

#### 【0222】

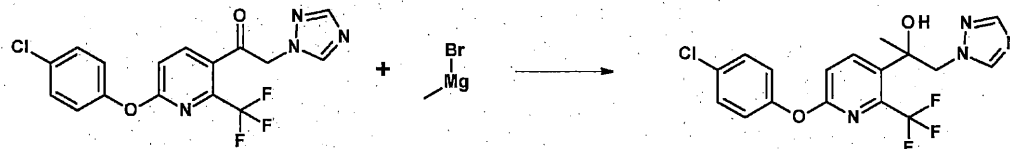
##### 実施例

式(1)の化合物の調製実施例

方法Aによる式(1)の化合物の調製：

2-[6-(4-クロロフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル]-1-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)プロパン-2-オール(1.01)の調製

#### 【化11】



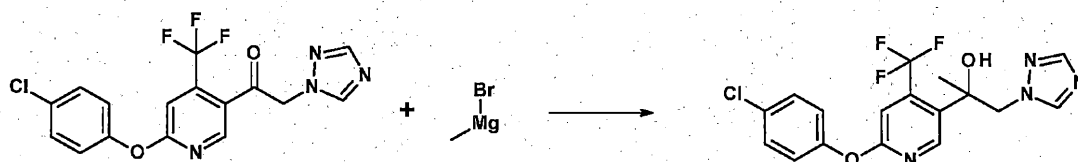
臭化マグネシウムジエチルエーテラート(4.8g、18.8mmol)のジクロロメタン(20mL)およびジエチルエーテル(10mL)中溶液を0℃に冷却した後、1-[6-(4-クロロフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)-3-ピリジル]-2-(1,2,4-トリアゾール-1-イル)エタノン(1.80g、4.70mmol)のジクロロメタン(10mL)中溶液を添加し、0℃で30分間攪拌した。次いで、メチルマグネシウムブロミド(3.1mL、9.4mmol、エチルエーテル中3M溶液)を添加し、冷却浴を除去し、混合物を21℃(室温、rt)で1.5時間(h)攪拌した後、混合物水、NH<sub>4</sub>Cl(飽和水溶液)でクエンチし、ジクロロメタンで抽出し、乾燥させ(MgSO<sub>4</sub>上)、濃縮した。出発ケトンと目的アルコールが保持時間に関して重複するので、濃縮物質(ケトンとアルコールの両方を含有する濃厚な無色の油約2g)をピリジン(15.0mL)に溶解し、メトキシルアミン塩酸塩(313mg、3.75mmol)で、室温で20時間処理した(ケトンと、有意に異なる保持時間を有する対応するメチルオキシムに変換するため)。次いで、混合物をジクロロメタンで希釈し、ChemElutで濾過し、濃縮した。分取HPLCにより、標的化合物319mg(2ステップにわたって収率17%、純度99%)が無色油として得られ、これは静置すると凝固した。

MS(ESI)：398.08([M+H]<sup>+</sup>)

#### 【0223】

2-[6-(4-クロロフェノキシ)-4-(トリフルオロメチル)-3-ピリジル]-1-(1,2,4-トリアゾール-1-イル)プロパン-2-オール(1.02)の調製

## 【化12】



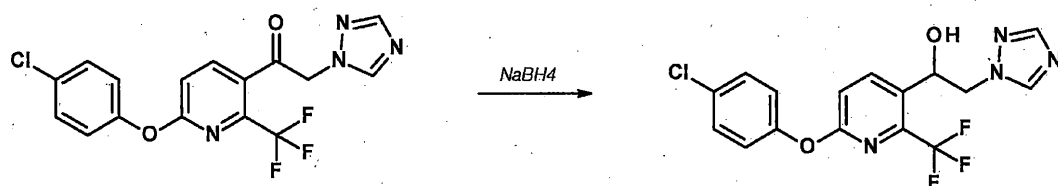
臭化マグネシウムジエチルエーテラート (1.2g、4.63mmol) のジクロロメタン (10mL) 中溶液を0 に冷却した後、1-[6-(4-クロロフェノキシ)-4-(トリフルオロメチル)-3-ピリジル]-2-(1,2,4-トリアゾール-1-イル)エタノン (443mg、1.16mmol) のジクロロメタン (2mL) 中溶液を添加し、0 で30分間撹拌した。次いで、メチルマグネシウムブロミド (0.78mL、2.3mmol、エチルエーテル中3M溶液) を添加し、冷却浴を除去し、混合物を室温で1時間撹拌した後、混合物を水でクエンチし、ジクロロメタンで抽出し、乾燥させ (MgSO<sub>4</sub>上)、濃縮した。分取HPLCにより、標的化合物126.6mg (収率27%、純度100%) が無色固体として得られた。

MS (ESI) : 398.08 ([M+H]<sup>+</sup>)

## 【0224】

1-[6-(4-クロロフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)-3-ピリジル]-2-(1,2,4-トリアゾール-1-イル)エタノール (1.03) の調製

## 【化13】



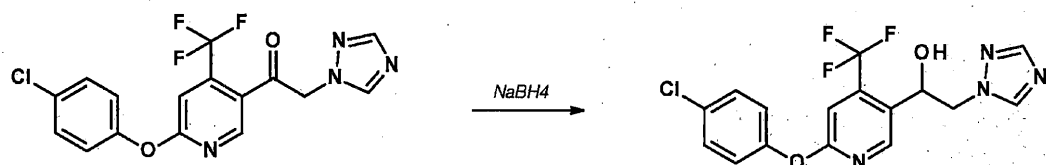
1-[6-(4-クロロフェノキシ)-4-(トリフルオロメチル)-3-ピリジル]-2-(1,2,4-トリアゾール-1-イル)エタノン (800mg、1.67mmol) の無水メタノール (25.0mL) 中溶液に、5 で水素化ホウ素ナトリウム (127mg、3.3mmol) を添加し、冷却浴を除去し、混合物を室温に加温し、1時間撹拌した。次いで、混合物を水でクエンチし、ジクロロメタンで希釈し、ChemElutで濾過し、濃縮した。分取HPLCにより、標的化合物286mg (収率60%、純度100%) が無色固体として得られた。

MS (ESI) : 384.06 ([M+H]<sup>+</sup>)

## 【0225】

1-[6-(4-クロロフェノキシ)-4-(トリフルオロメチル)-3-ピリジル]-2-(1,2,4-トリアゾール-1-イル)エタノール (1.04) の調製

## 【化14】



1-[6-(4-クロロフェノキシ)-4-(トリフルオロメチル)-3-ピリジル]-2-(1,2,4-トリアゾール-1-イル)エタノン (518mg、1.35mmol) の無水メタノール (5.0mL) 中溶液に、5 で水素化ホウ素ナトリウム (102mg、2.7mmol) を添加し、冷却浴を除去し、混合物を室温に加温し、1時間撹拌した。次いで、混合物を水でクエンチし、ジクロロメタンで希釈し、ChemElutで濾過し、濃縮した。分取HPLCにより、標的化合物252mg (収率48%、純度100%) が無色油として得られ、これは静置すると結晶化した。

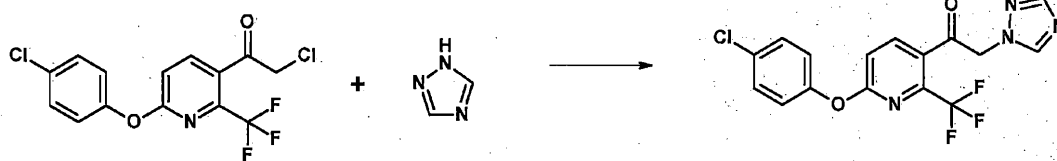
MS (ESI) : 384.06 ([M+H]<sup>+</sup>)

## 【0226】

方法Aによる式(VII)の化合物の調製:

1-[6-(4-クロロフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)-3-ピリジル]-2-(1,2,4-トリアゾール-1-イル)エタノン(VII.01)の調製

## 【化15】



10

2-クロロ-1-[6-(4-クロロフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)-3-ピリジル]エタノン(8.3g、23.7mmol)と1H-1,2,4-トリアゾール(1.8g、26.0mmol)のアセトニトリル(80mL)中混合物を75 に加熱した後、炭酸カリウム(3.9g、28.5mmol)を添加した。加熱を20分間(min)続けた後、混合物を氷水の添加によって室温に急速に冷却し、ジクロロメタンで抽出し、乾燥させ(MgSO<sub>4</sub>上)、濃縮した。フラッシュカラムクロマトグラフィー(勾配、DCM/DCM中10%MeOH=60/40まで、254nm)により、標的化合物4.30g(収率43%、純度91%)が黄色ガラスとして得られ、これを次の反応ステップにそのまま使用した。少量をHPLCによってさらに精製すると、標的生成物(純度100%)が黄色固体として得られた。

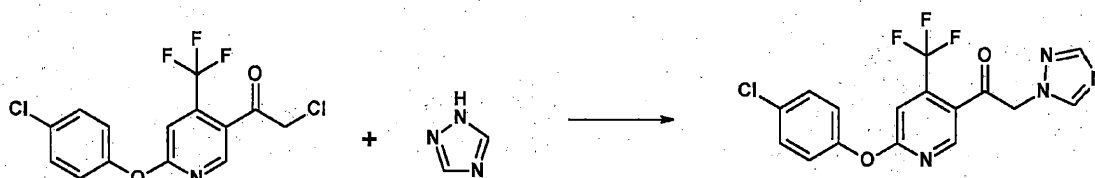
20

MS(ESI): 382.04([M+H]<sup>+</sup>)

## 【0227】

1-[6-(4-クロロフェノキシ)-4-(トリフルオロメチル)-3-ピリジル]-2-(1,2,4-トリアゾール-1-イル)エタノン(VII.02)の調製

## 【化16】



30

2-クロロ-1-[6-(4-クロロフェノキシ)-4-(トリフルオロメチル)-3-ピリジル]エタノン(3.4g、9.71mmol)と1H-1,2,4-トリアゾール(0.74g、10.6mmol)のアセトニトリル(50mL)中混合物を75 に加熱した後、炭酸カリウム(1.6g、11.6mmol)を添加した。加熱を20分間続けた後、混合物を氷水の添加によって室温に急速に冷却し、ジクロロメタンで抽出し、乾燥させ(MgSO<sub>4</sub>上)、濃縮した。フラッシュカラムクロマトグラフィー(勾配、DCM/DCM中10%MeOH=70/30まで、254nm)、引き続き分取HPLCにより、標的化合物1.50g(収率40%、純度100%)が黄色固体として得られた。

MS(ESI): 382.04([M+H]<sup>+</sup>)

## 【0228】

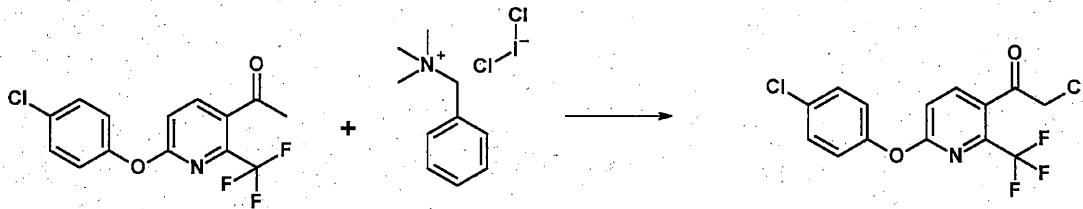
方法Aによる式(VI)の化合物の調製:

2-クロロ-1-[6-(4-クロロフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)-3-ピリジル]エタノン(VI.01)の調製

40



## 【化17】



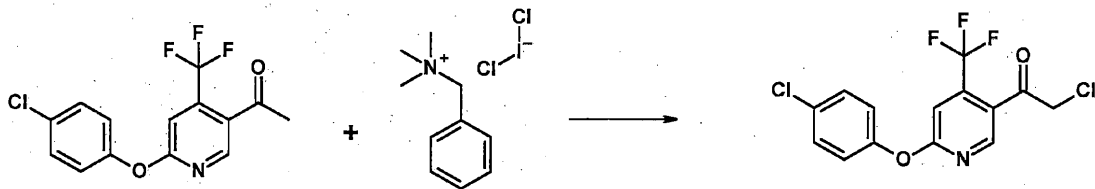
1-[6-(4-クロロフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)-3-ピリジル]エタノン(8.6g、27.2mmol)とジクロロヨウ素酸ベンジルトリメチルアンモニウム(18.9g、54.4mmol)の1,2-ジクロロエタン(60mL)およびメタノール(20mL)中混合物を4時間75 に加熱した後、混合物を濃縮し、次いで、酢酸エチルで希釈し、 $\text{Na}_2\text{S}_2\text{O}_3$ (10%w/w水溶液)で洗浄し、食塩水で洗浄し、乾燥させ( $\text{MgSO}_4$ 上)、濃縮し、シリカプラグ(ヘプタン/酢酸エチル=1/1、254nm)上を通過させると、標的化合物8.3g(収率83%、純度96%)が淡黄色固体として得られた。

MS(ESI): 348.99([M+H]<sup>+</sup>)

## 【0229】

2-クロロ-1-[6-(4-クロロフェノキシ)-4-(トリフルオロメチル)-3-ピリジル]エタノン(VI.02)の調製

## 【化18】



1-[6-(4-クロロフェノキシ)-4-(トリフルオロメチル)-3-ピリジル]エタノン(3.6g、11.4mmol)とジクロロヨウ素酸ベンジルトリメチルアンモニウム(7.93g、22.8mmol)の1,2-ジクロロエタン(30mL)およびメタノール(10mL)中混合物を4時間75 に加熱した後、混合物を濃縮し、次いで、酢酸エチルで希釈し、 $\text{Na}_2\text{S}_2\text{O}_3$ (10%w/w水溶液)で洗浄し、食塩水で洗浄し、乾燥させ( $\text{MgSO}_4$ 上)、濃縮し、シリカプラグ(ヘプタン/酢酸エチル=85/15、254nm)上を通過させると、標的化合物3.4g(収率58%、純度69%)が無色油として得られ、これをさらに精製することなく使用した。

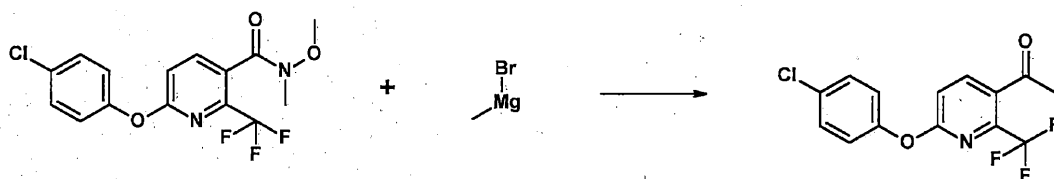
MS(ESI): 348.99([M+H]<sup>+</sup>)

## 【0230】

方法Dによる式(V)の化合物の調製:

1-[6-(4-クロロフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)-3-ピリジル]エタノン(V.01)の調製

## 【化19】



6-(4-クロロフェノキシ)-N-メトキシ-N-メチル-2-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-カルボキサミド(11.5g、31.9mmol)のTHF(150mL)中溶液を5 でメチルマグネシウムブロミド(21.2mL、63.7mmol、ジエチルエーテル中3M溶液)で処理した。次いで、混合物を室温に加熱し、攪拌を室温で4時間続けた後、反応物を水、 $\text{NH}_4\text{Cl}$ (飽和水溶液)でクエンチし、ジクロロメタンで抽出し、乾燥させ( $\text{Na}_2\text{SO}_4$ 上)、濃縮すると

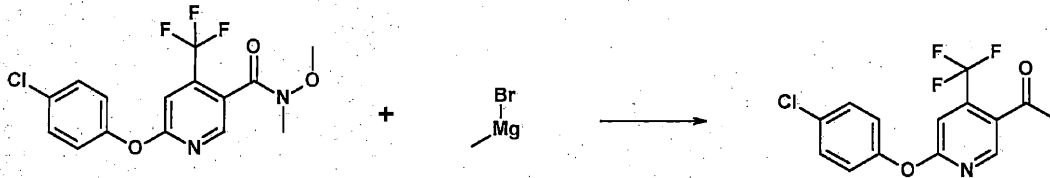
、標的化合物8.60g (収率82%、純度96%) が淡黄色固体として得られ、これをさらに精製することなく使用した。

MS (ESI) : 315.03 ([M+H]<sup>+</sup>)

【0231】

1-[6-(4-クロロフェノキシ)-4-(トリフルオロメチル)-3-ピリジル]エタノン(V.02)の調製

【化20】



10

6-(4-クロロフェノキシ)-N-メトキシ-N-メチル-4-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-カルボキサミド(6.9g、17.4mmol)のTHF(100mL)中溶液を5でメチルマグネシウムブロミド(11.6mL、34.8mmol、ジエチルエーテル中3M溶液)で処理した。次いで、混合物を室温に加温し、攪拌を室温で4時間続けた後、反応物を水、NH<sub>4</sub>Cl(飽和水溶液)でクエンチし、ジクロロメタンで抽出し、乾燥させ(Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>上)、濃縮した。フラッシュカラムクロマトグラフィー(勾配、ヘプタン/酢酸エチル=80/20まで、254nm)により、標的化合物3.60g(収率61%、純度94%)が無色油として得られた。

20

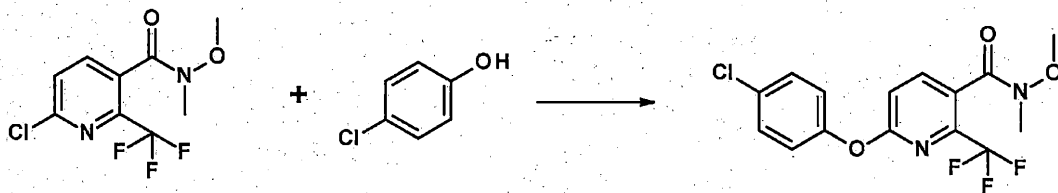
MS (ESI) : 315.03 ([M+H]<sup>+</sup>)

【0232】

方法Dによる式(XVI)の化合物の調製:

6-(4-クロロフェノキシ)-N-メトキシ-N-メチル-2-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-カルボキサミド(XVI.01)の調製

【化21】



30

6-クロロ-N-メトキシ-N-メチル-2-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-カルボキサミド(9.0g、33.5mmol)、4-クロロフェノール(4.3g、33.5mmol)、炭酸カリウム(11.5g、83.7mmol)、ヨウ化銅(I)(638mg、3.35mmol)およびN,N,N',N'-テトラメチルエチレンジアミン(TMEDA;1.0mL、6.7mmol)のジメチルスルホキシド(DMSO;150mL)中混合物を100で3時間加熱した。次いで、反応混合物を室温に冷却し、水を添加し、酢酸エチルで抽出し、乾燥させ(Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>上)、濃縮し、シリカブラグ(ヘプタン/酢酸エチル=1/1、254nm)上を通過させると、標記化合物7.7g(収率58%、純度91%)が黄色油として得られた。

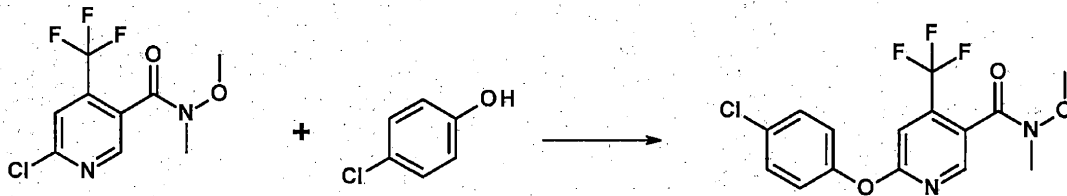
40

MS (ESI) : 360.05 ([M+H]<sup>+</sup>)

【0233】

6-(4-クロロフェノキシ)-N-メトキシ-N-メチル-4-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-カルボキサミド(XVI.02)の調製

## 【化22】



6-クロロ-N-メトキシ-N-メチル-4-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-カルボキサミド (5.7g、21.3mmol)、4-クロロフェノール (2.7g、21.3mmol)、炭酸カリウム (7.4g、53.3mmol)、ヨウ化銅 (I) (406mg、2.13mmol) およびTMEDA (0.64mL、4.26mmol) のDMSO (100mL) 中混合物を100℃で3時間加熱した。次いで、反応混合物を室温に冷却し、水を添加し、酢酸エチルで抽出し、乾燥させ (Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>上)、濃縮し、シリカプラグ (ヘプタン/酢酸エチル=1/1、254nm) 上を通過させると、標記化合物6.59g (収率85%、純度100%) が無色油として得られた。

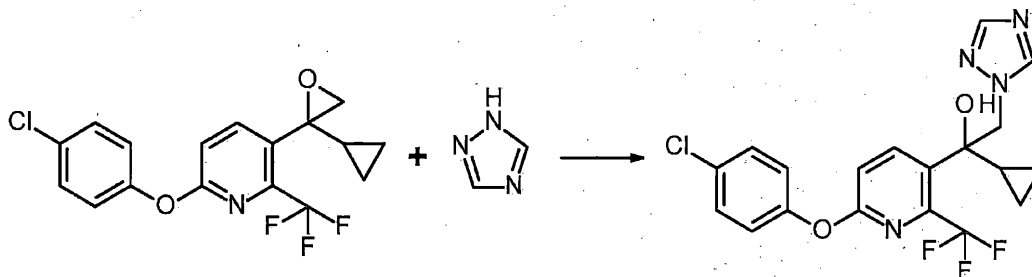
MS (ESI) : 360.05 ([M+H]<sup>+</sup>)

## 【0234】

方法Bによる式(1)の化合物の調製:

方法Bによる1-[6-(4-クロロフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル]-1-シクロプロピル-2-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)エタノール (1.91) の調製

## 【化23】



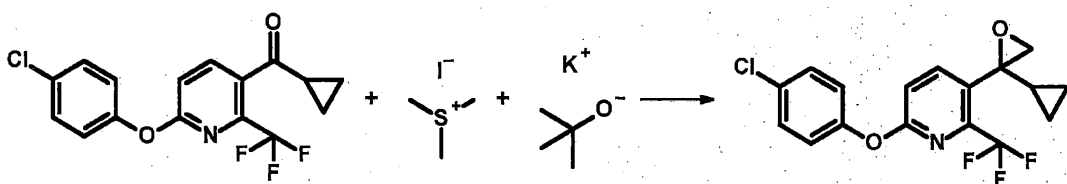
DMF (10mL) 中エポキシドIX.07 (1.0g、2.81mmol)、1H-1,2,4-トリアゾール (194mg、2.81mmol)、水酸化ナトリウム (40mg、0.984mmol)、水0.013mLを120℃で22時間加熱した後、水、NH<sub>4</sub>Cl (飽和水溶液) およびCH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub>を添加した。相を分離し、水相をCH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub>で2回抽出し、合わせた有機抽出物をNa<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>上で乾燥させ、濃縮すると、分取HPLCを介した精製後、所望のアルコール1.91 (362mg、30%) が無色油として得られた。

MS (ESI) : 425.09 ([M+H]<sup>+</sup>)

## 【0235】

方法Bによる6-(4-クロロフェノキシ)-3-(2-シクロプロピルオキシラン-2-イル)-2-(トリフルオロメチル)ピリジン (IX.07) の調製

## 【化24】



ヨウ化トリメチルスルホニウム (3.1g、15.2mmol) のTHF (100mL) 中懸濁液に0℃でカリウムtert-ブトキシド (1.7g、15.2mmol) を一度に添加し、混合物を5分間撹拌し

10

20

30

40

50

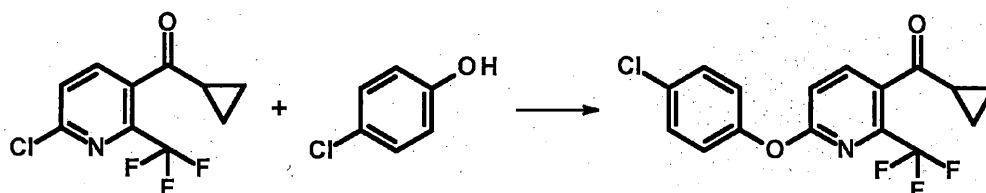
た。次いで、THF (10mL) 中ケトンV.41 (4.0g、11.7mmol) を添加し、混合物を室温に加温し、1.5時間攪拌した。次いで、水およびCH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub>を添加し、水相をCH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub>で抽出し、合わせた有機抽出物をNa<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>上で乾燥させ、濃縮すると、フラッシュカラムクロマトグラフィ後、所望のエポキシドIX.07 (138mg、3%) が無色油として得られた。

MS (ESI) : 356.06 ([M+H]<sup>+</sup>)

【0236】

方法Bによる[6-(4-クロロフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)-3-ピリジル]-シクロプロピル-メタノン(V.41)の調製

【化25】



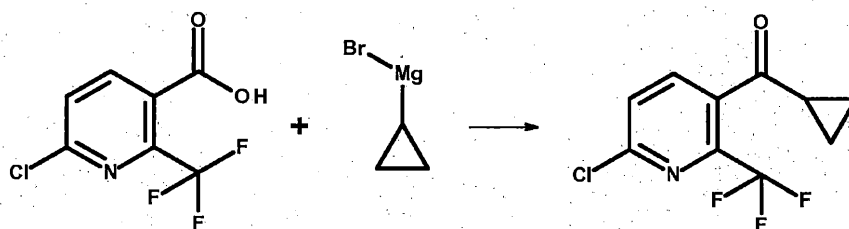
[6-クロロ-2-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル](シクロプロピル)メタノン(6.0g、24.0mmol)、4-クロロフェノール(3.1g、24.0mmol)、炭酸カリウム(8.3g、60.1mmol)、ヨウ化銅(I)(458mg、2.40mmol)およびN,N,N',N'-テトラメチルエチレンジアミン(TMEDA; 0.7mL、4.8mmol)のジメチルスルホキシド(DMSO; 100mL)中混合物を100℃で2時間加熱した。次いで、反応混合物を室温に冷却し、水を添加し、酢酸エチルで抽出し、乾燥させ(Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>上)、濃縮し、シリカブラグ(ヘプタン/酢酸エチル=1/1、254nm)上を通過させ、CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub>およびジイソプロピルエーテルから再結晶化すると、標記化合物V.41 4.2g(収率48%、純度95%)が無色固体として得られた。

MS (ESI) : 342.04 ([M+H]<sup>+</sup>)

【0237】

[6-クロロ-2-(トリフルオロメチル)-3-ピリジル]-シクロプロピル-メタノンの調製

【化26】



6-クロロ-2-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-カルボン酸(6.0g、26.6mmol)、塩化チオニル(3.9mL、53.2mmol)および数滴のジメチルホルムアミドのジクロロエタン(100mL)中溶液を85℃で4時間加熱した後、混合物を室温に冷却し、濃縮した。次いで、無水THF(150mL)およびFe(acac)<sub>3</sub>(470mg、1.33mmol)を添加し、溶液を-78℃に冷却した後、シクロプロピルマグネシウムブロミドの溶液(69mL、0.5M、34.6mmol)を内部温度を-70℃未満に保ちながら滴加した。添加が完了した後、冷却浴を除去し、反応物を室温に加温した。次いで、反応物をNH<sub>4</sub>Cl(飽和水溶液)でクエンチし、CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub>で抽出し、Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>上で乾燥させ、濃縮した。標的化合物[6-クロロ-2-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル](シクロプロピル)メタノン(6.0g、収率87%)をさらに精製することなく後のステップに使用した。

MS (ESI) : 250.02 ([M+H]<sup>+</sup>)

【0238】

10

20

30

40

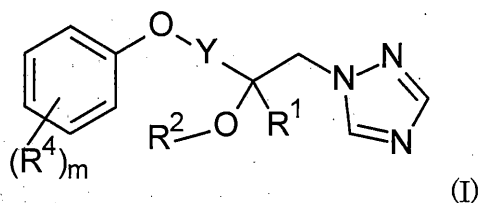
50

以下の表は、式 (I)、(V)、(VI)、(VII) および (IX) による化合物の例を非限定的に説明する。

【 0 2 3 9 】

【 表 1 A 】

表 1 : 式 (I) による化合物



実施例番号	Y	n	R <sup>3</sup>	R	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	m	R <sup>4</sup>	LogP
I.01		0	-	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	1	4-Cl	2,88 <sup>[a]</sup>
I.02 (*)		0	-	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	1	4-Cl	2,90 <sup>[a]</sup>
I.03		0	-	CF <sub>3</sub>	H	H	1	4-Cl	2,70 <sup>[a]</sup>
I.04		0	-	CF <sub>3</sub>	H	H	1	4-Cl	2,68 <sup>[a]</sup>
I.05		0	-	Cl	CH <sub>3</sub>	H	0	-	2,10 <sup>[a]</sup> ; 2,06 <sup>[b]</sup>
I.06		0	-	Cl	CH <sub>3</sub>	H	0	-	2,47 <sup>[a]</sup> ; 2,43 <sup>[b]</sup>
I.07		0	-	Cl	CH <sub>3</sub>	H	0	-	2,14 <sup>[a]</sup> ; 2,09 <sup>[b]</sup>

【表 1 B】

実施例番号	Y	n	R <sup>3</sup>	R	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	m	R <sup>4</sup>	LogP
I.08 (*)		0	-	Cl	CH <sub>3</sub>	H	1	4-Cl	2,50 <sup>[al]</sup>
I.09 (*)		0	-	Cl	CH <sub>3</sub>	H	1	4-Cl	2,66 <sup>[al]</sup>
I.10		0	-	Cl	H	H	2	3-Cl, 4-Cl	2,80 <sup>[al]</sup>
I.11		0	-	Cl	H	H	2	3-Cl, 4-OCF <sub>3</sub>	3,11 <sup>[al]</sup>
I.12		0	-	Cl	H	H	1	4-OCF <sub>3</sub>	2,73 <sup>[al]</sup>
I.13		0	-	Cl	H	H	0	-	1,98 <sup>[al]</sup>
I.14		0	-	Cl	H	H	1	4-Cl	2,42 <sup>[al]</sup>
I.15		0	-	Cl	H	H	2	2-Me, 4-Cl	2,75 <sup>[al]</sup>
I.16		0	-	Cl	H	H	2	3-Cl, 4-Me	2,73 <sup>[al]</sup>
I.17		0	-	Cl	H	H	1	4-F	2,08 <sup>[al]</sup>

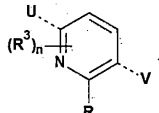
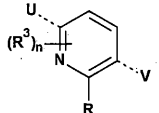
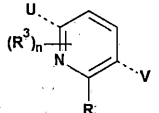
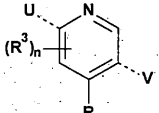
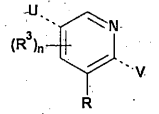
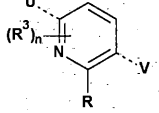
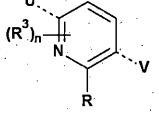
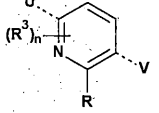
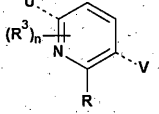
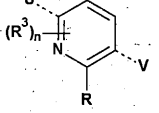
10

20

30

40

【表 1 C】

実施例番号	Y	n	R <sup>3</sup>	R	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	m	R <sup>4</sup>	LogP
I.18		0	-	Cl	H	H	2	2-F, 4-F	2,18 <sup>[a]</sup>
I.19		0	-	Cl	H	H	1	2-F	2,08 <sup>[a]</sup>
I.20		0	-	Cl	H	H	3	3-F, 4-F, 5-F	1,65 <sup>[a]</sup>
I.21		0	-	Cl	H	H	0	-	1,92 <sup>[a]</sup>
I.22		0	-	Cl	H	H	0	-	2,01 <sup>[a]</sup>
I.23		0	-	Cl	H	H	2	2-Cl, 4-Cl	2,75 <sup>[a]</sup>
I.24		0	-	Cl	H	H	1	4-(1-ヒドロキシエチル)	1,48 <sup>[a]</sup>
I.25		0	-	CHF <sub>2</sub>	H	H	1	4-Cl	2,44 <sup>[a]</sup>
I.26		0	-	OCF <sub>3</sub>	H	H	1	4-Cl	2,92 <sup>[a]</sup>
I.27		0	-	Cl	CH <sub>3</sub>	H	1	4-F	2,28 <sup>[a]</sup>

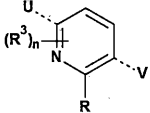
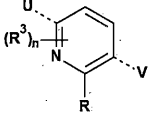
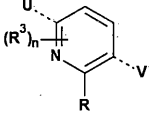
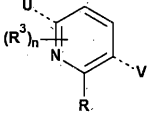
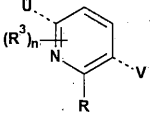
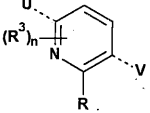
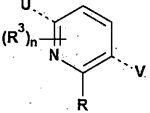
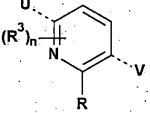
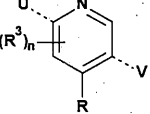
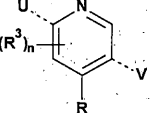
10

20

30

40

【表 1 D】

実施例番号	Y	n	R <sup>3</sup>	R	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	m	R <sup>4</sup>	LogP
I.28		0	-	Cl	CH <sub>3</sub>	H	2	2-Me, 4-Cl	2,94 <sup>[a]</sup>
I.29		0	-	Cl	CH <sub>3</sub>	H	2	3-Cl, 4-Me	3,00 <sup>[a]</sup>
I.30		0	-	Cl	H	H	2	2-Cl, 4-OMe	2,32 <sup>[a]</sup>
I.31		0	-	Cl	CH <sub>3</sub>	H	2	2-Cl, 4-OMe	2,56 <sup>[a]</sup>
I.32		0	-	Cl	CH <sub>3</sub>	H	2	3-Cl, 4-Cl	3,09 <sup>[a]</sup>
I.33		0	-	OCF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	1	4-Cl	3,29 <sup>[a]</sup>
I.34		0	-	Cl	H	H	1	4-SF <sub>5</sub>	2,90 <sup>[a]</sup>
I.35		0	-	Cl	CH <sub>3</sub>	H	1	4-SF <sub>5</sub>	3,17 <sup>[a]</sup>
I.36 (*)		0	-	CF <sub>3</sub>	H	H	1	4-SF <sub>5</sub>	3,15 <sup>[a]</sup>
I.37		0	-	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	1	4-SF <sub>5</sub>	3,33 <sup>[a]</sup>

10

20

30

40



【表 1 E】

実施例番号	Y	n	R <sup>3</sup>	R	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	m	R <sup>4</sup>	LogP
I.38		0	-	Cl	H	H	1	4-CHF <sub>2</sub>	2,17 <sup>[a]</sup>
I.39		0	-	Cl	CH <sub>3</sub>	H	1	4-CHF <sub>2</sub>	2,41 <sup>[a]</sup>
I.40		0	-	CF <sub>3</sub>	H	H	1	4-Br	2,82 <sup>[a]</sup>
I.41		0	-	F	H	H	1	4-Cl	2,23 <sup>[a]</sup>
I.42		0	-	F	CH <sub>3</sub>	H	1	4-Cl	2,46 <sup>[a]</sup>
I.43		0	-	CF <sub>3</sub>	H	H	1	4-OCF <sub>3</sub>	3,00 <sup>[a]</sup>
I.44		0	-	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	1	4-OCF <sub>3</sub>	3,23 <sup>[a]</sup>
I.45 (*)		0	-	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	1	4-Cl	2,84 <sup>[a]</sup>
I.46 (*)		0	-	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	1	4-Cl	2,93 <sup>[a]</sup>
I.47 (*)		0	-	CF <sub>3</sub>	H	H	1	4-CF <sub>3</sub>	2,84 <sup>[a]</sup>

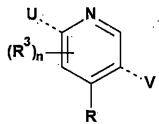
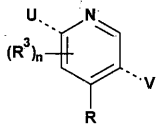
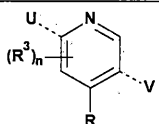
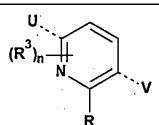
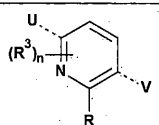
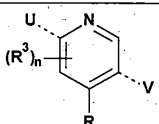
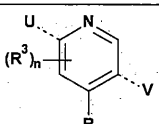
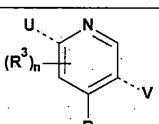
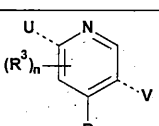
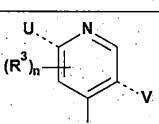
10

20

30

40

【表 1 F】

実施例番号	Y	n	R <sup>3</sup>	R	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	m	R <sup>4</sup>	LogP
I.48		0	-	CF <sub>3</sub>	H	H	1	4-Br	2,75 <sup>[a]</sup>
I.49		0	-	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	1	4-Br	2,96 <sup>[a]</sup>
I.50		0	-	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	1	4-CF <sub>3</sub>	3,11 <sup>[a]</sup>
I.51 (*)		0	-	Cl	CH <sub>3</sub>	H	1	4-Cl	2,62 <sup>[a]</sup>
I.52 (*)		0	-	Cl	CH <sub>3</sub>	H	1	4-Cl	2,62 <sup>[a]</sup>
I.53 (*)		0	-	Cl	CH <sub>3</sub>	H	1	4-Cl	2,53 <sup>[a]</sup>
I.54 (*)		0	-	Cl	CH <sub>3</sub>	H	1	4-Cl	2,53 <sup>[a]</sup>
I.55		0	-	CF <sub>3</sub>	H	H	1	4-CHF <sub>2</sub>	2,55 <sup>[a]</sup>
I.56		0	-	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	1	4-CHF <sub>2</sub>	2,73 <sup>[a]</sup>
I.57		0	-	CF <sub>3</sub>	H	H	2	2-F, 4-Cl	2,86 <sup>[a]</sup>

10

20

30

40

【表 1 G】

実施例番号	Y	n	R <sup>3</sup>	R	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	m	R <sup>4</sup>	LogP
I.58		0	-	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	2	2-F, 4-Cl	3,02 <sup>[a]</sup>
I.59 (*)		0	-	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	1	4-Br	2,94 <sup>[a]</sup>
I.60		0	-	CF <sub>3</sub>	H	H	1	4-SF <sub>5</sub>	3,08 <sup>[a]</sup>
I.61		0	-	CF <sub>3</sub>	H	H	1	4-CF <sub>3</sub>	2,84 <sup>[a]</sup>
I.62		0	-	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	1	4-SF <sub>5</sub>	3,25 <sup>[a]</sup>
I.63		0	-	CHF <sub>2</sub>	H	H	1	4-Br	2,59 <sup>[a]</sup>
I.64		0	-	CHF <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	H	1	4-Cl	2,68 <sup>[a]</sup>
I.65		0	-	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	1	4-CF <sub>3</sub>	3,04 <sup>[a]</sup>
I.66		0	-	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	2	2-F, 4-Cl	2,80 <sup>[a]</sup>
I.67		0	-	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	1	4-Cl	2,68 <sup>[a]</sup>

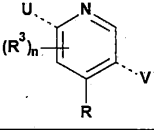
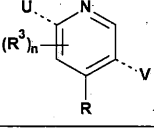
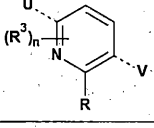
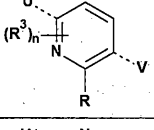
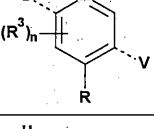
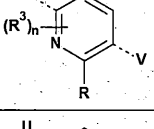
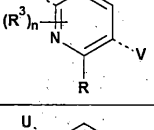
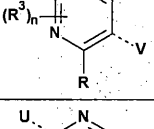
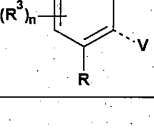
10

20

30

40

【表 1 H】

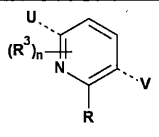
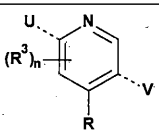
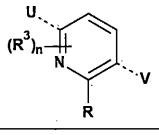
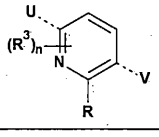
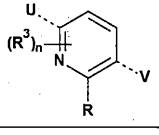
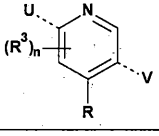
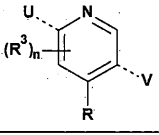
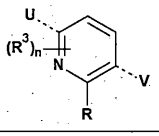
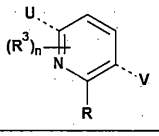
実施例番号	Y	n	R <sup>3</sup>	R	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	m	R <sup>4</sup>	LogP
I.68		0	-	Cl	H	H	1	4-Cl	2,48 <sup>[a]</sup>
I.69		0	-	CF <sub>3</sub>	ビニル	H	1	4-CF <sub>3</sub>	3,33 <sup>[a]</sup>
I.70		0	-	CF <sub>3</sub>	H	H	2	2-F, 4-Cl	2,78 <sup>[a]</sup>
I.71		0	-	CF <sub>3</sub>	シクロプロピル	H	1	4-Cl	3,35 <sup>[a]</sup>
I.72 (*)		0	-	CF <sub>3</sub>	H	H	1	4-CF <sub>3</sub>	2,86 <sup>[a]</sup>
I.73		0	-	CHF <sub>2</sub>	H	H	1	4-Br	2,50 <sup>[a]</sup>
I.74		0	-	CF <sub>3</sub>	H	H	1	4-CHF <sub>2</sub>	2,49 <sup>[a]</sup>
I.75		0	-	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	1	4-イソプロピル	3,35 <sup>[a]</sup>
I.76		0	-	CF <sub>3</sub>	Et	H	1	4-CF <sub>3</sub>	3,52 <sup>[a]</sup>

10

20

30

【表 1 I】

実施 例番 号	Y	n	R <sup>3</sup>	R	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	m	R <sup>4</sup>	LogP
I.77		0	-	4-フル ルオ ロフ エノ キシ	CH <sub>3</sub>	H	1	4-F	3,13 <sup>[a]</sup>
I.78		0	-	Cl	CH <sub>3</sub>	H	1	4-CF <sub>3</sub>	2,88 <sup>[a]</sup>
I.79		0	-	CF <sub>3</sub>	H	H	1	4-OCF <sub>3</sub>	2,89 <sup>[a]</sup>
I.80		0	-	CF <sub>3</sub>	シクロ プロピ ル	H	1	4-Cl	3,32 <sup>[a]</sup>
I.81 (*)		0	-	CF <sub>3</sub>	シクロ プロピ ル	H	1	4-Br	3,70 <sup>[a]</sup>
I.82		0	-	CHF 2	CH <sub>3</sub>	H	1	4-Br	2,78 <sup>[a]</sup>
I.83 (*)		0	-	CF <sub>3</sub>	H	H	1	4-SF <sub>5</sub>	3,11 <sup>[a]</sup>
I.84 (*)		0	-	CF <sub>3</sub>	シクロ プロピ ル	H	1	4-Br	3,41 <sup>[a]</sup>
I.85		0	-	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	1	4-Br	3,48 <sup>[a]</sup>

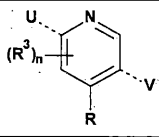
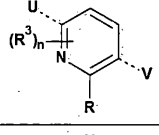
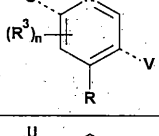
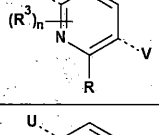
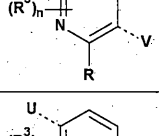
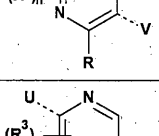
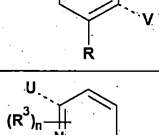
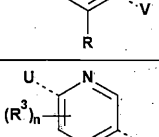
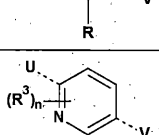
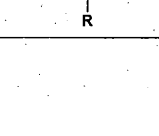
10

20

30

40

【表 1 J】

実施例番号	Y	n	R <sup>3</sup>	R	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	m	R <sup>4</sup>	LogP
I.86 (*)		0	-	CF <sub>3</sub>	H	H	1	4-SF <sub>5</sub>	3,11 <sup>[al]</sup>
I.87		0	-	CF <sub>3</sub>	シクロプロピル	H	1	4-CF <sub>3</sub>	3,57 <sup>[al]</sup>
I.88		0	-	Cl	H	H	1	4-CF <sub>3</sub>	2,64 <sup>[al]</sup>
I.89		0	-	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	2	2-F, 4-Cl	3,15 <sup>[al]</sup>
I.90		0	-	CF <sub>3</sub>	H	H	2	2-F, 4-Cl	2,88 <sup>[al]</sup>
I.91		0	-	CF <sub>3</sub>	シクロプロピル	H	1	4-Cl	3,26 <sup>[al]</sup>
I.92 (*)		0	-	CF <sub>3</sub>	H	H	1	4-CF <sub>3</sub>	2,86 <sup>[al]</sup>
I.93		0	-	CF <sub>3</sub>	シクロプロピル	H	1	4-CHF <sub>2</sub>	3,13 <sup>[al]</sup>
I.94		0	-	CHF <sub>2</sub>	H	H	1	4-Cl	2,13 <sup>[al]</sup>
I.95		0	-	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	1	4-OCF <sub>3</sub>	2,98 <sup>[al]</sup>

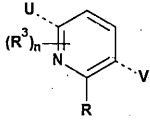
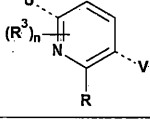
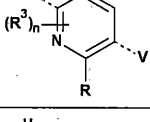
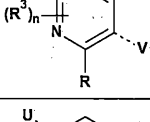
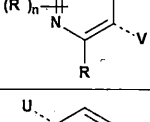
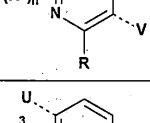
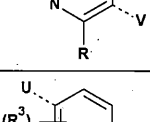
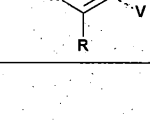
10

20

30

40

【表 1 K】

実施例番号	Y	n	R <sup>3</sup>	R	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	m	R <sup>4</sup>	LogP
I.96		0	-	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	1	4-Cl	2,68 <sup>[a]</sup>
I.97		0	-	CF <sub>3</sub>	シクロプロピル	H	1	4-SF <sub>5</sub>	3,80 <sup>[a]</sup>
I.98		0	-	CF <sub>3</sub>	ブチル	H	1	4-Cl	3,87 <sup>[a]</sup>
I.99 (*)		0	-	CF <sub>3</sub>	シクロプロピル	H	1	4-Br	3,41 <sup>[a]</sup>
I.100		0	-	CF <sub>3</sub>	プロピル	H	1	4-Cl	3,55 <sup>[a]</sup>
I.101 (*)		0	-	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	1	4-Br	2,94 <sup>[a]</sup>
I.102 (*)		0	-	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	1	4-Br	2,94 <sup>[a]</sup>
I.103		0	-	CF <sub>3</sub>	Et	H	1	4-Cl	3,19 <sup>[a]</sup>

10

20

30

## 【 0 2 4 0 】

旋光度

濃度cをg / 100mLで表す

( \* ) 実施例 1.45 および 1.46 は実施例 1.02 の 2 つのエナンチオマーである

( \* ) 実施例 1.53 および 1.54 は実施例 1.08 の 2 つのエナンチオマーである

実施例 1.53 : 旋光度 : - 35 ° ( c = 0.52、DCM、20 )

実施例 1.54 : 旋光度 : + 52 ° ( c = 0.50、DCM、20 )

( \* ) 実施例 1.51 および 1.52 は実施例 1.09 の 2 つのエナンチオマーである

実施例 1.51 : 旋光度 : - 128.2 ° ( c = 0.52、DCM、20 )

実施例 1.52 : 旋光度 : + 133.3 ° ( c = 0.51、DCM、20 )

( \* ) 実施例 1.83 および 1.86 は実施例 1.36 の 2 つのエナンチオマーである

実施例 1.83 : 旋光度 : + 10.0 ° ( c = 0.50、CDCl<sub>3</sub>、25 )実施例 1.86 : 旋光度 : - 11.0 ° ( c = 0.73、CDCl<sub>3</sub>、25 )

( \* ) 実施例 1.72 および 1.92 は実施例 1.47 の 2 つのエナンチオマーである

実施例 1.72 : 旋光度 : + 11.7 ° ( c = 0.52、CDCl<sub>3</sub>、25 )

40

50

例 I . 92 : 旋光度 :  $-10.4^\circ$  (  $c=0.58$ 、 $\text{CDCl}_3$ 、 $25^\circ$  )

( \* ) 実施例 I . 101 および I . 102 は実施例 I . 59 の 2 つのエナンチオマーである

実施例 I . 101 : 旋光度 :  $+27.5^\circ$  (  $c=0.88$  ;  $\text{MeOH}$  ;  $20^\circ$  )

実施例 I . 102 : 旋光度 :  $-31.5^\circ$  (  $c=1.02$  ;  $\text{MeOH}$  ;  $20^\circ$  )

( \* ) 実施例 I . 84 および I . 99 は実施例 I . 81 の 2 つのエナンチオマーである

実施例 I . 84 : 旋光度 :  $-8^\circ$  (  $c=1.00$ 、 $\text{MeOH}$ 、 $25^\circ$  )

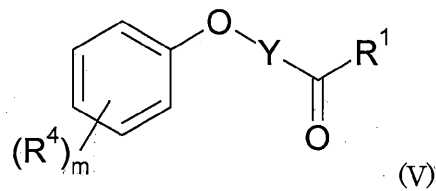
実施例 I . 99 : 旋光度 :  $+7.3^\circ$  (  $c=1.10$ 、 $\text{MeOH}$ 、 $25^\circ$  )

【 0 2 4 1 】

【 表 2 A 】

10

表 2 : 式 (V) による化合物



実施例番号	Y	n	R <sup>3</sup>	R	R <sup>1</sup>	m	R <sup>4</sup>	LogP
V.01		0	-	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	1	4-Cl	3,80 <sup>[al]</sup>
V.02		0	-	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	1	4-Cl	3,89 <sup>[al]</sup>
V.03		0	-	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	1	4-SF <sub>5</sub>	4,32 <sup>[al]</sup>
V.04		0	-	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	1	4-CHF <sub>2</sub>	3,62 <sup>[al]</sup>
V.05		0	-	CHF <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	1	4-Cl	3,35 <sup>[al]</sup>
V.06		0	-	OCF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	1	4-Cl	4,37 <sup>[al]</sup>
V.07		0	-	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	2	2-F, 4-Cl	4,09 <sup>[al]</sup>

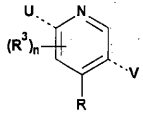
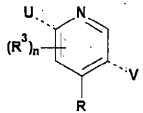
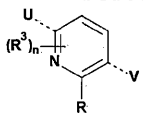
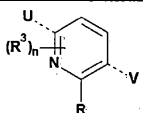
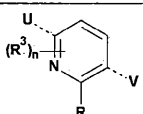
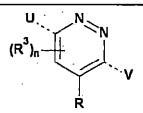
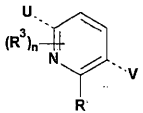
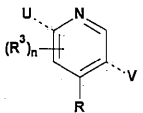
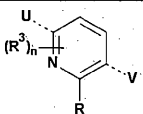
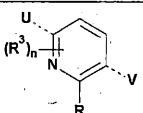
20

30

40



【表 2 B】

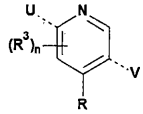
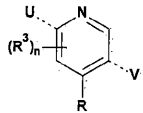
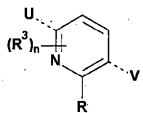
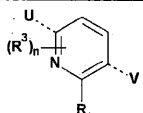
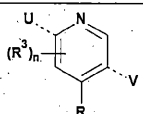
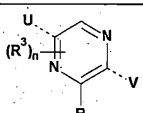
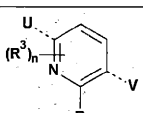
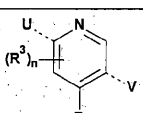
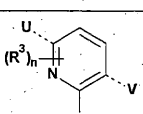
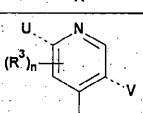
実施例番号	Y	n	R <sup>3</sup>	R	R <sup>1</sup>	m	R <sup>4</sup>	LogP
V.08		0	-	Cl	CH <sub>3</sub>	0	-	2,94 <sup>[a]</sup> ; 2,86 <sup>[b]</sup>
V.09		0	-	Cl	CH <sub>3</sub>	1	4-Cl	3,52 <sup>[a]</sup> ; 3,42 <sup>[b]</sup>
V.10		0	-	Cl	CH <sub>3</sub>	1	4-Cl	3,47 <sup>[a]</sup> ; 3,36 <sup>[b]</sup>
V.11		0	-	Cl	CH <sub>3</sub>	2	3-Cl, 4-Cl	4,10 <sup>[a]</sup>
V.12		0	-	Cl	CH <sub>3</sub>	1	4-F	3,11 <sup>[a]</sup>
V.13		0	-	H	CH <sub>3</sub>	1	4-Cl	2,73 <sup>[a]</sup>
V.14		0	-	Cl	CH <sub>3</sub>	1	4-CHF <sub>2</sub>	3,15 <sup>[a]</sup>
V.15		0	-	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	1	4-OCF <sub>3</sub>	4,20 <sup>[a]</sup>
V.16		0	-	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	1	4-SF <sub>5</sub>	4,09 <sup>[a]</sup>
V.17		0	-	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	1	4-CF <sub>3</sub>	3,96 <sup>[a]</sup>

10

20

30

【表 2 C】

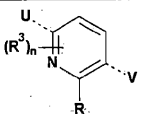
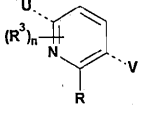
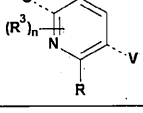
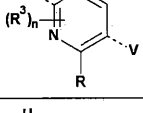
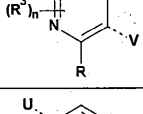
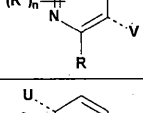
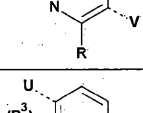
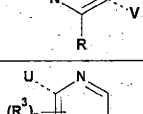
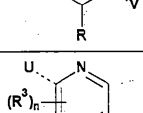
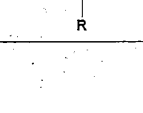
実施例番号	Y	n	R <sup>3</sup>	R	R <sup>1</sup>	m	R <sup>4</sup>	LogP
V.18		0	-	Cl	CH <sub>3</sub>	1	4-CF <sub>3</sub>	3,87 <sup>[a]</sup>
V.19		0	-	C(O)CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	1	4-Cl	3,11 <sup>[a]</sup>
V.20		0	-	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	1	4-Br	3,85 <sup>[a]</sup>
V.21		0	-	Cl	CH <sub>3</sub>	0	-	2,94 <sup>[a]</sup> ; 2,85 <sup>[b]</sup>
V.22		0	-	Cl	CH <sub>3</sub>	1	4-Cl	3,51 <sup>[a]</sup>
V.23		0	-	Cl	CH <sub>3</sub>	1	4-Cl	3,51 <sup>[a]</sup>
V.24		0	-	F	CH <sub>3</sub>	1	4-Cl	3,51 <sup>[a]</sup>
V.25		0	-	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	1	4-CF <sub>3</sub>	4,04 <sup>[a]</sup>
V.26		0	-	Cl	CH <sub>3</sub>	1	4-Cl	3,45 <sup>[a]</sup>
V.27		0	-	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	1	4-Br	3,99 <sup>[a]</sup>

10

20

30

【表 2 D】

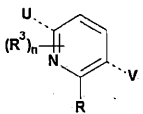
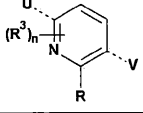
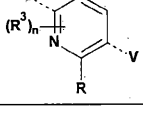
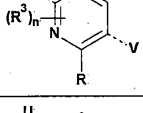
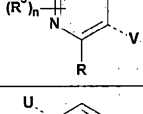
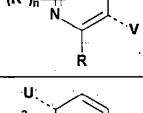
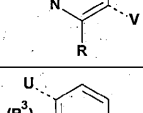
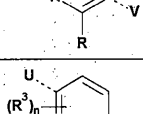
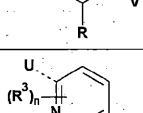
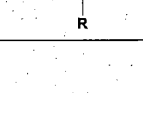
実施例番号	Y	n	R <sup>3</sup>	R	R <sup>1</sup>	m	R <sup>4</sup>	LogP
V.28		0	-	Cl	CH <sub>3</sub>	1	4-OCF <sub>3</sub>	3,89 <sup>[a]</sup>
V.29		0	-	Cl	CH <sub>3</sub>	2	2-Cl, 4-OCH <sub>3</sub>	3,44 <sup>[a]</sup>
V.30		0	-	Cl	CH <sub>3</sub>	1	4-SF <sub>5</sub>	3,99 <sup>[a]</sup>
V.31		0	-	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	3	2-F, 4-Cl, 6-F	4,06 <sup>[a]</sup>
V.32		0	-	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	1	4-CHF <sub>2</sub>	3,26 <sup>[a]</sup>
V.33		0	-	4-クロロフェノキシ	CH <sub>3</sub>	1	4-Cl	4,36 <sup>[a]</sup>
V.34		0	-	CHF <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	1	4-Br	3,46 <sup>[a]</sup>
V.35		0	-	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	1	4-OCF <sub>3</sub>	4,04 <sup>[a]</sup>
V.36		0	-	CHF <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	1	4-Br	3,74 <sup>[a]</sup>
V.37		0	-	CHF <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	1	4-Cl	3,57 <sup>[a]</sup>

10

20

30

【表 2 E】

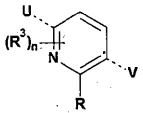
実施例番号	Y	n	R <sup>3</sup>	R	R <sup>1</sup>	m	R <sup>4</sup>	LogP
V.38		0	-	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	2	2-F, 4-Cl	3,87 <sup>[a]</sup>
V.39		0	-	CF <sub>3</sub>	シクロプロピル	1	4-CF <sub>3</sub>	4,37 <sup>[a]</sup>
V.40		0	-	CF <sub>3</sub>	シクロプロピル	1	4-Br	4,49 <sup>[a]</sup>
V.41		0	-	CF <sub>3</sub>	シクロプロピル	1	4-Cl	4,17 <sup>[a]</sup>
V.42		0	-	CF <sub>3</sub>	シクロプロピル	1	4-ホルミル	3,21 <sup>[a]</sup>
V.43		0	-	CF <sub>3</sub>	シクロプロピル	1	4-SF <sub>5</sub>	4,67 <sup>[a]</sup>
V.44		0	-	CF <sub>3</sub>	シクロプロピル	1	4-CHF <sub>2</sub>	3,80 <sup>[a]</sup>
V.45		0	-	CF <sub>3</sub>	エチル	1	4-Cl	4,20 <sup>[a]</sup>
V.46		0	-	CF <sub>3</sub>	プロピル	1	4-Cl	4,59 <sup>[a]</sup>
V.47		0	-	CF <sub>3</sub>	イソブチル	1	4-Cl	4,98 <sup>[a]</sup>

10

20

30

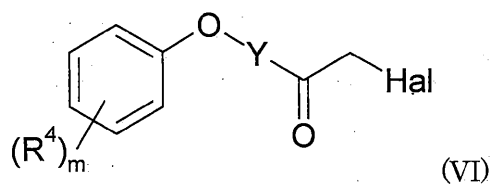
【表 2 F】

実施例番号	Y	n	R <sup>3</sup>	R	R <sup>1</sup>	m	R <sup>4</sup>	LogP
V.48		0	-	CF <sub>3</sub>	ブチル	1	4-Cl	5,03 <sup>[a]</sup>

40

【表 3 A】

表 3: 式 (VI) による化合物



実施例番号	Y	n	R <sup>3</sup>	R	Hal	m	R <sup>4</sup>	LogP
VI.01		0	-	CF <sub>3</sub>	Cl	1	4-Cl	4,01 <sup>[a]</sup>
VI.02		0	-	CF <sub>3</sub>	Cl	1	4-Cl	
VI.03		0	-	Cl	Cl	0	-	3,23 <sup>[a]</sup>
VI.04		0	-	Cl	Cl	1	4-Cl	3,72 <sup>[a]</sup>
VI.05		0	-	Cl	Cl	0	-	3,28 <sup>[a]</sup>
VI.06		0	-	Cl	Cl	1	4-Cl	3,77 <sup>[a]</sup>
VI.07		0	-	Cl	Br	2	3-Cl, 4-Cl	4,58 <sup>[a]</sup>
VI.08		0	-	Cl	Cl	1	4-OCF <sub>3</sub>	4,09 <sup>[a]</sup>

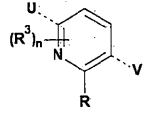
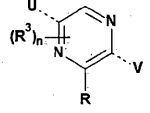
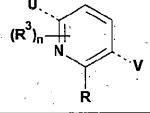
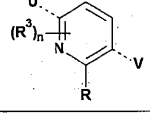
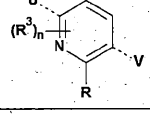
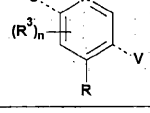
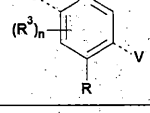
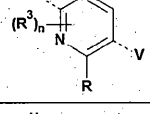
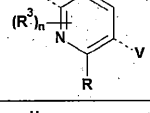
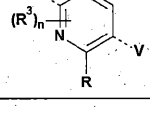
10

20

30

40

【表 3 B】

実施例番号	Y	n	R <sup>3</sup>	R	Hal	m	R <sup>4</sup>	LogP
VI.09		0	-	Cl	Cl	1	4-F	3,39 <sup>[a]</sup>
VI.10		0	-	Cl	Cl	1	4-Cl	3,78 <sup>[a]</sup>
VI.11		0	-	CHF <sub>2</sub>	Cl	1	4-Cl	3,62 <sup>[a]</sup>
VI.12		0	-	OCF <sub>3</sub>	Cl	1	4-Cl	4,51 <sup>[a]</sup>
VI.13		0	-	Cl	Cl	2	2-Cl, 4-OCH <sub>3</sub>	3,71 <sup>[a]</sup>
VI.14		0	-	CF <sub>3</sub>	Br	1	4-Cl	4,29 <sup>[a]</sup>
VI.15		0	-	CF <sub>3</sub>	Br	1	4-Br	4,34 <sup>[a]</sup>
VI.16		0	-	Cl	Cl	1	4-CHF <sub>2</sub>	3,42 <sup>[a]</sup>
VI.17		0	-	Cl	Br	1	4-CHF <sub>2</sub>	3,57 <sup>[a]</sup>
VI.18		0	-	CF <sub>3</sub>	Br	1	4-Br	4,23 <sup>[a]</sup>

10

20

30

40

【表 3 C】

実施例番号	Y	n	R <sup>3</sup>	R	Hal	m	R <sup>4</sup>	LogP
VI.19		0	-	CF <sub>3</sub>	Cl	1	4-Br	4,11 <sup>[a]</sup>
VI.20		0	-	F	Cl	1	4-Cl	3,69 <sup>[a]</sup>
VI.21		0	-	CF <sub>3</sub>	Cl	1	4-OCF <sub>3</sub>	4,37 <sup>[a]</sup>
VI.22		0	-	CF <sub>3</sub>	Cl	1	4-CF <sub>3</sub>	4,21 <sup>[a]</sup>
VI.23		0	-	CF <sub>3</sub>	Cl	1	4-Br	4,16 <sup>[a]</sup>
VI.24		0	-	CF <sub>3</sub>	Br	2	2-F, 4-Cl	4,34 <sup>[a]</sup>
VI.25		0	-	CF <sub>3</sub>	Cl	2	2-F, 4-Cl	4,15 <sup>[a]</sup>
VI.26		0	-	CF <sub>3</sub>	Cl	1	4-CHF <sub>2</sub>	3,76 <sup>[a]</sup>
VI.27		0	-	CF <sub>3</sub>	Br	1	4-CHF <sub>2</sub>	3,99 <sup>[a]</sup>
VI.28		0	-	CF <sub>3</sub>	Cl	1	4-CF <sub>3</sub>	4,19 <sup>[a]</sup>

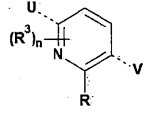
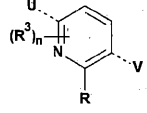
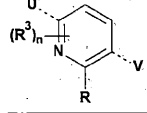
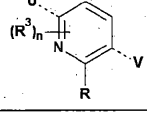
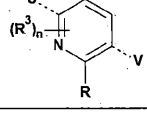
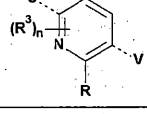
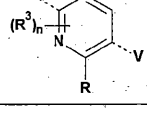
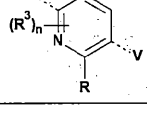
10

20

30

40

【表 3 D】

実施例番号	Y	n	R <sup>3</sup>	R	Hal	m	R <sup>4</sup>	LogP
VI.29		0	-	CF <sub>3</sub>	Cl	1	4-SF <sub>5</sub>	4,29 <sup>[a]</sup>
VI.30		0	-	Cl	Cl	1	4-SF <sub>5</sub>	4,21 <sup>[a]</sup>
VI.31		0	-	CF <sub>3</sub>	Cl	3	2-F, 4-Cl, 6-F	4,26 <sup>[a]</sup>
VI.32		0	-	CF <sub>3</sub>	Br	3	2-F, 4-Cl, 6-F	4,18 <sup>[a]</sup>
VI.33		0	-	CF <sub>3</sub>	Cl	1	4-OCF <sub>3</sub>	4,07 <sup>[a]</sup>
VI.34		0	-	CF <sub>3</sub>	Br	1	4-Cl	4,19 <sup>[a]</sup>
VI.35		0	-	CF <sub>3</sub>	Cl	2	2-F, 4-Cl	4,11 <sup>[a]</sup>
VI.36		0	-	CF <sub>3</sub>	Cl	1	4-CHF <sub>2</sub>	3,50 <sup>[a]</sup>

10

20

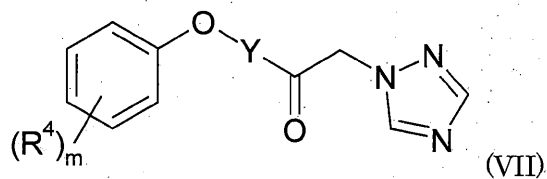
30

【 0 2 4 3 】



【表 4 A】

表 4 : 式 (VII) による化合物



実施例番号	Y	n	R <sup>3</sup>	R	m	R <sup>4</sup>	LogP
VII.01		0	-	CF <sub>3</sub>	1	4-Cl	2,92[a]
VII.02		0	-	CF <sub>3</sub>	1	4-Cl	2,92[a]
VII.03		0	-	Cl	2	3-Cl, 4-Cl	3,06[a]
VII.04		0	-	Cl	2	3-Cl, 4-OCF <sub>3</sub>	3,33[a]
VII.05		0	-	Cl	0	-	2,20[a]
VII.06		0	-	Cl	0	-	2,21[a]
VII.07		0	-	Cl	0	-	2,45[a]
VII.08		0	-	Cl	1	4-OCF <sub>3</sub>	2,95[a]

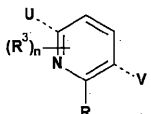
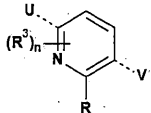
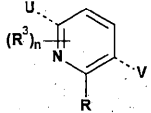
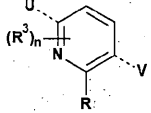
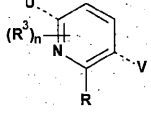
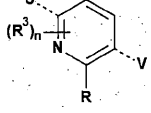
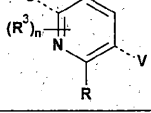
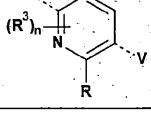
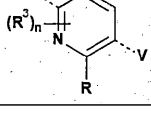
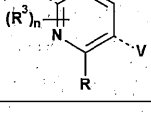
10

20

30

40

【表 4 B】

実施例番号	Y	n	R <sup>3</sup>	R	m	R <sup>4</sup>	LogP
VII.09		0	-	Cl	1	4-Cl	2,66 <sup>[a]</sup>
VII.10		0	-	Cl	2	2-CH <sub>3</sub> , 4-Cl	2,94 <sup>[a]</sup>
VII.11		0	-	Cl	2	3-Cl, 4-CH <sub>3</sub>	3,02 <sup>[a]</sup>
VII.12		0	-	Cl	1	4-F	2,30 <sup>[a]</sup>
VII.13		0	-	Cl	2	2-F, 4-F	2,41 <sup>[a]</sup>
VII.14		0	-	Cl	1	2-F	2,28 <sup>[a]</sup>
VII.15		0	-	Cl	3	3-F, 4-F, 5-F	2,66 <sup>[a]</sup>
VII.16		0	-	Cl	2	2-Cl, 4-Cl	3,02 <sup>[a]</sup>
VII.17		0	-	Cl	1	4-C(O)CH <sub>3</sub>	1,96 <sup>[a]</sup>
VII.18		0	-	OCF <sub>3</sub>	1	4-Cl	3,23 <sup>[a]</sup>

10

20

30

40

【表 4 C】

実施例番号	Y	n	R <sup>3</sup>	R	m	R <sup>4</sup>	LogP
VII.19		0	-	Cl	2	2-Cl, 4-OCH <sub>3</sub>	2,58 <sup>[a]</sup>
VII.20		0	-	Cl	1	4-SF <sub>5</sub>	3,11 <sup>[a]</sup>
VII.21		0	-	CF <sub>3</sub>	1	4-SF <sub>5</sub>	3,35 <sup>[a]</sup>
VII.22		0	-	Cl	1	4-CHF <sub>2</sub>	2,39 <sup>[a]</sup>
VII.23		0	-	Cl	1	4-Cl	2,54 <sup>[a]</sup>
VII.24		0	-	CF <sub>3</sub>	1	4-Br	2,99 <sup>[a]</sup>
VII.25		0	-	F	1	4-Cl	2,50 <sup>[a]</sup>
VII.26		0	-	CF <sub>3</sub>	1	4-OCF <sub>3</sub>	3,27 <sup>[a]</sup>
VII.27		0	-	CF <sub>3</sub>	1	4-Br	3,02 <sup>[a]</sup>
VII.28		0	-	CF <sub>3</sub>	1	4-CF <sub>3</sub>	3,17 <sup>[a]</sup>

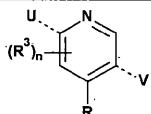
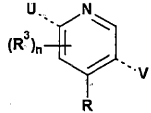
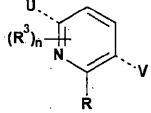
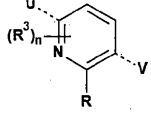
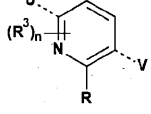
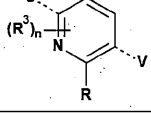
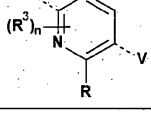
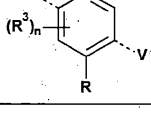
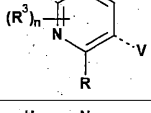
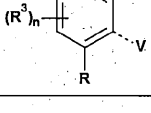
10

20

30

40

【表 4 D】

実施例番号	Y	n	R <sup>3</sup>	R	m	R <sup>4</sup>	LogP
VII.29		0	-	CF <sub>3</sub>	1	4-CHF <sub>2</sub>	2,80 <sup>[a]</sup>
VII.30		0	-	CF <sub>3</sub>	2	2-F, 4-Cl	3,06 <sup>[a]</sup>
VII.31		0	-	CF <sub>3</sub>	1	4-SF <sub>5</sub>	3,23 <sup>[a]</sup>
VII.32		0	-	CF <sub>3</sub>	1	4-CF <sub>3</sub>	3,04 <sup>[a]</sup>
VII.33		0	-	CF <sub>3</sub>	3	2-F, 4-Cl, 6-F	2,96 <sup>[a]</sup>
VII.34		0	-	CF <sub>3</sub>	1	4-イソプロピル	3,44 <sup>[a]</sup>
VII.35		0	-	CHF <sub>2</sub>	1	4-Br	2,68 <sup>[a]</sup>
VII.36		0	-	CHF <sub>2</sub>	1	4-Cl	2,51 <sup>[a]</sup>
VII.37		0	-	CF <sub>3</sub>	2	2-F, 4-Cl	2,74 <sup>[a]</sup>
VII.38		0	-	Cl	1	4-Cl	2,60 <sup>[a]</sup>

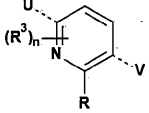
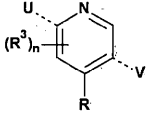
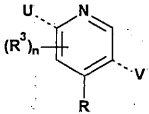
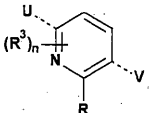
10

20

30

40

【表 4 E】

実施例番号	Y	n	R <sup>3</sup>	R	m	R <sup>4</sup>	LogP
VII.39		0	-	CF <sub>3</sub>	1	4-OCF <sub>3</sub>	2,95 <sup>[a]</sup>
VII.40		0	-	Cl	1	4-CF <sub>3</sub>	2,92 <sup>[a]</sup>
VII.41		0	-	CHF <sub>2</sub>	1	4-Br	2,61 <sup>[a]</sup>
VII.42		0	-	CF <sub>3</sub>	1	4-CHF <sub>2</sub>	2,41 <sup>[a]</sup>

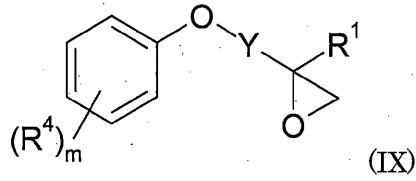
10

20

【 0 2 4 4 】

【表 5 A】

表 5 : 式 (IX) による化合物



実施例番号	Y	n	R <sup>3</sup>	R	R <sup>1</sup>	m	R <sup>4</sup>	LogP
IX.01		0	-	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	1	4-Cl	4,41[a]
IX.02		0	-	Cl	CH <sub>3</sub>	0	-	3,40[a]; 3,38[b]
IX.03		0	-	Cl	CH <sub>3</sub>	1	4-Cl	4,06[a]; 4,00[b]
IX.04		0	-	Cl	CH <sub>3</sub>	0	-	3,42[a]; 3,39[b]
IX.05		0	-	CF <sub>3</sub>	シクロプロピル	1	4-CHF <sub>2</sub>	4,49[a]
IX.06		0	-	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	1	4-Cl	4,44[a]
IX.07		0	-	CF <sub>3</sub>	シクロプロピル	1	4-Cl	4,80[a]
IX.08		0	-	CF <sub>3</sub>	シクロプロピル	1	4-Br	5,11[a]

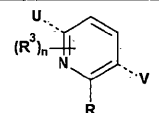
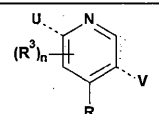
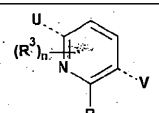
10

20

30

40

【表 5 B】

実施例番号	Y	n	R <sup>3</sup>	R	R <sup>1</sup>	m	R <sup>4</sup>	LogP
IX.09		0	-	CF <sub>3</sub>	シクロプロピル	1	4-SF <sub>5</sub>	5,22 <sup>[a]</sup>
IX.10		0	-	Cl	CH <sub>3</sub>	1	4-Cl	4,06 <sup>[a]</sup>
IX.11		0	-	CF <sub>3</sub>	シクロプロピル	1	4-CF <sub>3</sub>	5,00 <sup>[a]</sup>

10

## 【 0 2 4 5 】

LogP値：

LogP値の測定は、EEC指令79 / 831付属書V . A8に従って、以下の方法で逆相カラムを用いてHPLC（高速液体クロマトグラフィー）によって行った：

20

〔<sup>a</sup>〕 LogP値は、溶離液として水中0.1%ギ酸およびアセトニトリル（10%アセトニトリル～95%アセトニトリルの直線勾配）を用いて、酸性範囲でLC - UVの測定によって決定される。

〔<sup>b</sup>〕 LogP値は、溶離液として水中0.001モル濃度酢酸アンモニウムおよびアセトニトリル（10%アセトニトリル～95%アセトニトリルの直線勾配）を用いて、中性範囲でLC - UVの測定によって決定される。

〔<sup>c</sup>〕 LogP値は、溶離液として水中0.1%リン酸およびアセトニトリル（10%アセトニトリル～95%アセトニトリルの直線勾配）を用いて、酸性範囲でLC - UVの測定によって決定される。

30

## 【 0 2 4 6 】

同じ方法内で2つ以上のLogP値が入手可能な場合は、全ての値が与えられ、「+」で区切られる。

## 【 0 2 4 7 】

較正は、既知のLogP値（連続するアルカノン間の線形補間による保持時間を用いたLogP値の測定）を有する直鎖アルカン2 - オン（炭素原子数3～16）を用いて行った。max値は、200nm～400nmのUVスペクトルおよびクロマトグラフシグナルのピーク値を用いて決定した。

## 【 0 2 4 8 】

NMRピークリスト

40

選択された実施例の<sup>1</sup>H - NMRデータを<sup>1</sup>H - NMRピークリストの形態で記載する。各シグナルピークについて、値（ppm）および丸括弧中のシグナル強度を列挙する。値 - シグナル強度の対の間には区切り記号としてセミコロンがある。

## 【 0 2 4 9 】

したがって、実施例のピークリストは以下の形態を有する：

$\delta_1$ （強度<sub>1</sub>）；  $\delta_2$ （強度<sub>2</sub>）； ……；  $\delta_i$ （強度<sub>i</sub>）； ……；  $\delta_n$ （強度<sub>n</sub>）。

シャープなシグナルの強度は、NMRスペクトルの印刷された実施例のシグナルの高さ（cm）と相関し、シグナル強度の実際の関係を示す。ブロードなシグナルからは、数個のピークまたはシグナルの中央とその相対強度をスペクトル中の最も強いシグナルと比較して示すことができる。

50

## 【0250】

1Hスペクトルの化学シフトを較正するために、特にDMSOで測定したスペクトルの場合、テトラメチルシランおよび/または使用する溶媒の化学シフトを使用する。そのため、NMRピークリストでは、必ずしもそうではないが、テトラメチルシランピークが生じる可能性がある。

## 【0251】

1H-NMRピークリストは、古典的な1H-NMRプリントと同様であるので、通常、古典的なNMR解釈で列挙される全てのピークを含む。

## 【0252】

さらに、それらは、古典的な1H-NMRプリントのように、溶媒のシグナル、本発明の目的である標的化合物の立体異性体、および/または不純物のピークを示し得る。

10

## 【0253】

溶媒および/または水の 範囲の化合物シグナル示すため、通常、溶媒ピーク、例えば、DMSO-D<sub>6</sub>中DMSOのピークおよび水のピークを1H-NMRピーク中に示し、これらは通常平均で高い強度を有する。

## 【0254】

標的化合物の立体異性体のピークおよび/または不純物のピークは通常、標的化合物（例えば、90%超の純度を有する）のピークより平均して低い強度を有する。

## 【0255】

このような立体異性体および/または不純物は特定の調製方法に固有のものであり得る。そのため、それらのピークは、「副産物指紋」による調製方法の再現を認識するのに役立つ。

20

## 【0256】

既知の方法（MestReC、ACDシミュレーション、但し、経験的に評価した期待値も使用）で標的化合物のピークを計算する専門家は、場合によりさらなる強度フィルタを用いて、必要とされる標的化合物のピークを単離することができる。この単離は古典的な1H-NMR解釈での関連ピークピッキングと同様であるだろう。

## 【0257】

ピークリストを含むNMRデータの記載のさらなる詳細は、Research Disclosure Database Number 564025の刊行物「Citation of NMR Peaklist Data within Patent Applications」に見出される。

30

実施例1.01: <sup>1</sup>H-NMR (300.2 MHz, CDCl<sub>3</sub>):

= 8.232 (2.4); 8.203 (2.5); 8.041 (5.3); 8.022 (0.4); 7.955 (5.9); 7.645 (0.5); 7.424 (0.8); 7.414 (5.5); 7.406 (1.8); 7.391 (2.1); 7.384 (6.6); 7.373 (0.8); 7.368 (0.4); 7.299 (88.2); 7.188 (0.9); 7.177 (6.9); 7.170 (1.8); 7.155 (1.8); 7.147 (5.0); 7.136 (0.4); 7.031 (3.0); 7.002 (2.7); 6.948 (0.5); 5.424 (0.4); 4.764 (2.2); 4.716 (3.6); 4.702 (5.8); 4.554 (3.5); 4.507 (2.4); 4.197 (1.1); 4.173 (3.5); 4.150 (3.5); 4.126 (1.1); 2.085 (16.0); 1.679 (12.3); 1.579 (44.1); 1.323 (4.5); 1.299 (9.1); 1.275 (4.2); 0.917 (0.3); 0.235 (0.6); 0.108 (9.3); 0.050 (4.1); 0.039 (119.3); 0.028 (4.6); -0.027 (0.3); -0.159 (0.5)

40

実施例1.02: <sup>1</sup>H-NMR (300.2 MHz, CDCl<sub>3</sub>):

= 8.470 (5.6); 8.063 (6.3); 7.956 (6.4); 7.450 (0.6); 7.439 (5.5); 7.432 (2.0); 7.416 (2.1); 7.409 (7.0); 7.398 (0.8); 7.316 (6.6); 7.300 (30.3); 7.138 (0.8); 7.127 (6.8); 7.120 (2.3); 7.105 (1.9); 7.097 (5.7); 7.087 (0.6); 5.340 (0.7); 4.727 (2.5); 4.679 (3.6); 4.480 (3.9); 4.440 (7.0); 1.675 (16.0); 1.587 (17.3); 1.294 (0.7); 0.109 (1.8); 0.051 (1.7); 0.040 (41

50



. 5) ; 0.029 (1.8)

实施例 I.03 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.134 (3.3) ; 8.113 (1.4) ; 8.084 (1.4) ; 8.045 (3.4) ; 7.430 (3.0) ; 7.423 (1.0) ; 7.408 (1.1) ; 7.400 (3.8) ; 7.390 (0.5) ; 7.299 (12.4) ; 7.202 (0.5) ; 7.192 (3.8) ; 7.184 (1.2) ; 7.169 (1.0) ; 7.162 (3.0) ; 7.151 (1.7) ; 7.121 (1.4) ; 5.551 (0.5) ; 5.524 (0.5) ; 4.528 (0.7) ; 4.520 (0.7) ; 4.481 (1.0) ; 4.473 (1.0) ; 4.312 (1.0) ; 4.285 (1.0) ; 4.265 (0.7) ; 4.238 (0.7) ; 4.032 (0.9) ; 1.600 (16.0) ; 0.108 (1.3) ; 0.049 (0.6) ; 0.038 (14.7) ; 0.027 (0.6)

10

实施例 I.04 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.582 (3.2) ; 8.159 (4.0) ; 8.055 (3.9) ; 7.646 (0.5) ; 7.452 (3.3) ; 7.430 (1.2) ; 7.422 (4.4) ; 7.412 (0.6) ; 7.367 (0.6) ; 7.300 (81.3) ; 7.259 (3.7) ; 7.234 (0.4) ; 7.160 (0.5) ; 7.149 (4.3) ; 7.126 (1.2) ; 7.119 (3.5) ; 6.949 (0.5) ; 5.470 (0.8) ; 5.452 (0.9) ; 5.340 (16.0) ; 4.515 (0.8) ; 4.508 (0.8) ; 4.469 (1.4) ; 4.461 (1.4) ; 4.343 (1.2) ; 4.315 (1.2) ; 4.297 (0.8) ; 4.269 (0.7) ; 3.835 (2.3) ; 3.824 (2.3) ; 1.647 (0.6) ; 1.607 (0.4) ; 1.581 (79.0) ; 1.515 (0.4) ; 1.351 (0.7) ; 1.293 (1.5) ; 0.920 (0.6) ; 0.900 (0.3) ; 0.235 (0.6) ; 0.109 (6.3) ; 0.051 (3.5) ; 0.040 (105.0) ; 0.029 (5.2) ; 0.006 (0.4) ; -0.026 (0.4) ; -0.159 (0.5)

20

实施例 I.05 :  $^1\text{H}$ -NMR (400.0 MHz,  $d_6$ -DMSO) :

= 8.339 (3.2) ; 8.187 (3.4) ; 7.953 (2.1) ; 7.790 (3.1) ; 7.443 (1.0) ; 7.438 (0.4) ; 7.424 (1.8) ; 7.422 (1.7) ; 7.407 (0.5) ; 7.403 (1.5) ; 7.248 (0.7) ; 7.246 (0.4) ; 7.230 (1.1) ; 7.211 (0.5) ; 7.147 (3.6) ; 7.120 (1.6) ; 7.117 (1.9) ; 7.112 (0.5) ; 7.098 (1.6) ; 7.096 (1.4) ; 6.002 (2.8) ; 4.747 (0.9) ; 4.711 (1.4) ; 4.597 (1.4) ; 4.561 (0.9) ; 3.328 (18.0) ; 2.891 (16.0) ; 2.732 (13.3) ; 2.511 (6.5) ; 2.507 (13.1) ; 2.502 (17.3) ; 2.498 (12.5) ; 2.493 (5.9) ; 1.989 (1.1) ; 1.615 (7.6) ; 1.175 (0.6) ; 0.000 (4.4)

30

实施例 I.06 :  $^1\text{H}$ -NMR (400.0 MHz,  $d_6$ -DMSO) :

= 8.367 (6.6) ; 8.224 (4.5) ; 8.218 (4.6) ; 7.808 (6.2) ; 7.619 (4.5) ; 7.613 (4.4) ; 7.491 (0.3) ; 7.486 (2.3) ; 7.480 (0.9) ; 7.473 (0.5) ; 7.467 (3.6) ; 7.464 (3.4) ; 7.459 (0.5) ; 7.451 (1.1) ; 7.446 (3.1) ; 7.440 (0.4) ; 7.268 (0.8) ; 7.265 (1.5) ; 7.263 (0.9) ; 7.247 (2.4) ; 7.231 (0.6) ; 7.228 (1.1) ; 7.226 (0.6) ; 7.133 (3.3) ; 7.130 (4.2) ; 7.125 (1.1) ; 7.114 (1.9) ; 7.111 (3.5) ; 7.109 (3.0) ; 7.102 (0.3) ; 5.809 (7.5) ; 5.757 (4.9) ; 4.764 (1.4) ; 4.729 (3.5) ; 4.690 (3.7) ; 4.655 (1.5) ; 4.038 (0.4) ; 4.020 (0.4) ; 3.327 (20.9) ; 2.525 (0.4) ; 2.512 (8.5) ; 2.507 (17.1) ; 2.503 (22.5) ; 2.498 (16.1) ; 2.493 (7.6) ; 1.989 (1.8) ; 1.551 (16.0) ; 1.397 (0.9) ; 1.193 (0.5) ; 1.175 (1.0) ; 1.157 (0.5) ; 0.000 (6.5)

40

实施例 I.07 :  $^1\text{H}$ -NMR (400.0 MHz,  $d_6$ -DMSO) :

= 8.327 (6.5) ; 7.985 (3.8) ; 7.963 (4.1) ; 7.953 (1.2) ; 7.785 (6.2) ; 7.477 (0.3) ; 7.472 (2.2) ; 7.467 (0.9) ; 7.453 (3.6) ; 7.451 (3.5) ; 7.437 (1.1) ; 7.432 (3.0) ; 7.426 (0.4) ; 7.275 (1.4) ; 7.256 (2.3) ; 7.238 (1.0) ; 7.162 (3.2) ; 7.160 (4.0) ; 7.155 (1.1) ; 7.141 (3.3) ; 7.139 (2.9) ; 7.132 (0.3) ; 6.917 (4.0) ; 6

50

. 896 (4.0) ; 6.009 (5.5) ; 4.776 (2.0) ; 4.740 (2.7) ; 4.595 (2.8) ; 4.560 (2.0) ; 4.056 (0.6) ; 4.038 (1.9) ; 4.020 (1.9) ; 4.002 (0.6) ; 3.328 (25.8) ; 2.891 (9.0) ; 2.732 (7.3) ; 2.525 (0.6) ; 2.511 (11.8) ; 2.507 (23.5) ; 2.502 (30.8) ; 2.498 (22.2) ; 2.493 (10.6) ; 1.989 (8.2) ; 1.612 (16.0) ; 1.397 (1.9) ; 1.193 (2.2) ; 1.175 (4.4) ; 1.157 (2.2) ; 0.000 (8.0)

実施例 I . 08 :  $^1\text{H}$ -NMR (499.9 MHz,  $\text{d}_6$ -DMSO) :

= 8.369 (6.3) ; 8.251 (6.6) ; 7.785 (5.9) ; 7.614 (4.8) ; 7.597 (5.6) ; 7.400 (5.7) ; 7.382 (4.8) ; 6.581 (6.6) ; 6.047 (5.9) ; 4.777 (2.3) ; 4.749 (2.9) ; 4.542 (2.9) ; 4.514 (2.3) ; 3.319 (6.7) ; 2.892 (0.5) ; 2.733 (0.5) ; 2.504 (2.7) ; 1.629 (16.0) ; 0.000 (0.7)

実施例 I . 09 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.077 (3.7) ; 8.049 (3.9) ; 8.006 (4.7) ; 7.860 (4.4) ; 7.378 (0.4) ; 7.367 (4.5) ; 7.360 (1.5) ; 7.345 (1.7) ; 7.337 (5.5) ; 7.326 (0.7) ; 7.269 (2.2) ; 7.084 (0.6) ; 7.074 (5.6) ; 7.066 (1.7) ; 7.051 (1.5) ; 7.044 (4.5) ; 7.033 (0.5) ; 6.718 (3.9) ; 6.690 (3.8) ; 5.300 (0.7) ; 5.260 (2.0) ; 5.213 (2.3) ; 4.991 (1.5) ; 4.536 (2.4) ; 4.489 (2.1) ; 1.744 (0.5) ; 1.697 (16.0) ; 0.000 (2.5)

実施例 I . 10 :  $^1\text{H}$ -NMR (400.1 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.092 (12.5) ; 7.992 (0.9) ; 7.963 (15.1) ; 7.913 (11.8) ; 7.892 (12.2) ; 7.861 (0.4) ; 7.839 (0.4) ; 7.520 (0.3) ; 7.476 (14.5) ; 7.454 (16.0) ; 7.311 (0.4) ; 7.288 (15.7) ; 7.281 (16.1) ; 7.261 (38.0) ; 7.045 (9.1) ; 7.039 (8.5) ; 7.023 (8.2) ; 7.017 (7.6) ; 6.997 (0.4) ; 6.919 (0.6) ; 6.900 (13.5) ; 6.879 (12.9) ; 5.378 (5.7) ; 5.372 (6.0) ; 5.358 (6.3) ; 5.353 (5.8) ; 4.603 (5.8) ; 4.597 (5.8) ; 4.568 (7.1) ; 4.562 (6.9) ; 4.260 (6.5) ; 4.241 (6.4) ; 4.225 (5.6) ; 4.206 (5.3) ; 4.145 (1.0) ; 4.127 (2.4) ; 4.109 (2.4) ; 4.092 (0.9) ; 2.952 (3.0) ; 2.872 (2.7) ; 2.040 (9.7) ; 1.331 (0.5) ; 1.324 (0.5) ; 1.309 (0.5) ; 1.284 (0.8) ; 1.275 (3.2) ; 1.257 (7.5) ; 1.239 (2.8) ; 0.880 (0.6) ; 0.862 (0.3) ; 0.070 (5.2) ; 0.008 (1.3) ; 0.000 (27.0)

実施例 I . 11 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.116 (0.6) ; 8.097 (14.9) ; 7.990 (16.0) ; 7.955 (0.5) ; 7.931 (7.3) ; 7.930 (7.3) ; 7.904 (7.8) ; 7.902 (7.7) ; 7.608 (0.5) ; 7.372 (3.9) ; 7.368 (4.0) ; 7.342 (5.1) ; 7.338 (5.1) ; 7.308 (9.9) ; 7.299 (10.9) ; 7.262 (69.8) ; 7.125 (6.8) ; 7.116 (6.2) ; 7.095 (5.4) ; 7.086 (5.1) ; 6.946 (0.4) ; 6.927 (8.4) ; 6.911 (0.8) ; 6.900 (8.0) ; 5.390 (2.4) ; 5.365 (2.5) ; 5.302 (14.5) ; 4.623 (3.7) ; 4.615 (3.7) ; 4.576 (4.7) ; 4.568 (4.7) ; 4.286 (4.5) ; 4.260 (4.3) ; 4.239 (3.6) ; 4.214 (3.7) ; 4.185 (2.8) ; 2.716 (1.6) ; 2.046 (0.6) ; 1.584 (3.2) ; 1.267 (1.0) ; 1.260 (0.9) ; 1.253 (1.0) ; 1.244 (1.8) ; 1.236 (0.4) ; 1.221 (0.9) ; 0.011 (1.7) ; 0.000 (56.1) ; -0.011 (2.6)

実施例 I . 12 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.087 (14.9) ; 7.953 (16.0) ; 7.928 (0.3) ; 7.909 (7.3) ; 7.908 (7.1) ; 7.881 (7.7) ; 7.880 (7.4) ; 7.276 (5.2) ; 7.270 (3.8) ; 7.264 (27.5) ; 7.248 (10.2) ; 7.245 (9.9) ; 7.201 (2.6) ; 7.191 (19.5) ; 7.183 (4.9) ; 7.168 (4.0) ; 7.160 (8.9) ; 7.150 (1.1) ; 7.1

10

20

30

40

50

39 (0.5) ; 6.883 (8.4) ; 6.855 (8.1) ; 5.380 (2.1) ; 5.354 (2.3) ;  
4.610 (3.5) ; 4.603 (3.5) ; 4.564 (4.5) ; 4.556 (4.4) ; 4.419 (2.  
9) ; 4.407 (2.8) ; 4.373 (0.3) ; 4.262 (4.4) ; 4.236 (4.1) ; 4.216  
(3.4) ; 4.189 (3.3) ; 4.155 (0.5) ; 4.131 (1.3) ; 4.107 (1.3) ; 4  
.083 (0.5) ; 2.045 (6.0) ; 1.644 (4.8) ; 1.283 (1.7) ; 1.259 (3.5  
) ; 1.235 (1.6) ; 0.071 (1.7) ; 0.011 (0.6) ; 0.000 (19.0) ; -0.0  
11 (0.8)

实施例 I.13 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.115 (4.1) ; 8.089 (14.8) ; 7.985 (4.0) ; 7.958 (15.1) ; 7.88  
9 (2.2) ; 7.863 (9.8) ; 7.835 (8.2) ; 7.442 (9.1) ; 7.417 (16.0) ;  
7.393 (9.0) ; 7.291 (5.7) ; 7.277 (12.3) ; 7.267 (22.4) ; 7.264 (2  
5.4) ; 7.240 (7.6) ; 7.217 (3.0) ; 7.156 (17.9) ; 7.130 (11.9) ; 6  
.834 (2.2) ; 6.807 (10.1) ; 6.792 (4.5) ; 6.779 (7.8) ; 5.381 (6.6  
) ; 5.358 (5.6) ; 4.609 (5.8) ; 4.562 (7.4) ; 4.332 (6.4) ; 4.288  
(1.8) ; 4.261 (6.0) ; 4.235 (5.4) ; 4.215 (4.6) ; 4.188 (3.6) ; 4  
.158 (1.4) ; 4.131 (2.8) ; 4.107 (2.6) ; 4.087 (0.9) ; 2.072 (2.4  
) ; 2.058 (5.2) ; 2.048 (8.8) ; 2.045 (9.9) ; 1.718 (0.4) ; 1.711  
(0.4) ; 1.639 (7.3) ; 1.352 (0.4) ; 1.283 (4.6) ; 1.272 (4.2) ; 1  
.262 (7.0) ; 1.259 (7.6) ; 1.238 (2.8) ; 1.235 (3.0) ; 0.904 (0.4  
) ; 0.879 (0.5) ; 0.859 (0.5) ; 0.097 (0.6) ; 0.071 (1.8) ; 0.027  
(3.3) ; 0.013 (7.3) ; 0.003 (12.0) ; 0.000 (13.6)

10

20

30

40

50

实施例 I.14 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.148 (0.4) ; 8.140 (0.4) ; 8.083 (12.1) ; 7.916 (14.3) ; 7.90  
3 (7.1) ; 7.902 (7.0) ; 7.876 (7.1) ; 7.874 (7.0) ; 7.394 (1.2) ;  
7.383 (12.6) ; 7.376 (4.3) ; 7.370 (1.7) ; 7.361 (5.0) ; 7.353 (16  
.0) ; 7.342 (2.3) ; 7.330 (0.3) ; 7.266 (13.6) ; 7.117 (1.7) ; 7.  
106 (15.8) ; 7.099 (4.8) ; 7.084 (4.7) ; 7.076 (12.9) ; 7.065 (1.5  
) ; 7.056 (1.0) ; 6.954 (0.4) ; 6.926 (0.4) ; 6.861 (7.7) ; 6.833  
(7.3) ; 5.365 (1.9) ; 5.338 (2.0) ; 4.676 (2.8) ; 4.663 (2.7) ; 4  
.596 (3.2) ; 4.588 (3.2) ; 4.550 (4.0) ; 4.542 (4.0) ; 4.320 (0.4  
) ; 4.234 (3.8) ; 4.208 (3.7) ; 4.188 (3.1) ; 4.161 (3.0) ; 4.152  
(0.6) ; 4.128 (1.2) ; 4.104 (1.2) ; 4.080 (0.4) ; 2.042 (5.5) ; 1  
.729 (1.5) ; 1.281 (1.6) ; 1.257 (3.3) ; 1.234 (1.6) ; 0.072 (0.6  
) ; 0.000 (9.1) ; -0.011 (0.4)

实施例 I.15 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.085 (6.3) ; 7.972 (6.5) ; 7.868 (3.0) ; 7.867 (3.1) ; 7.840  
(3.1) ; 7.839 (3.3) ; 7.263 (20.3) ; 7.219 (1.5) ; 7.217 (1.5) ;  
7.210 (1.2) ; 7.208 (1.1) ; 7.189 (1.9) ; 7.182 (1.6) ; 7.180 (1.5  
) ; 7.002 (3.7) ; 6.973 (2.9) ; 6.789 (3.5) ; 6.761 (3.4) ; 5.367  
(0.9) ; 5.356 (0.9) ; 5.341 (0.9) ; 4.606 (1.5) ; 4.599 (1.5) ; 4  
.560 (1.9) ; 4.552 (1.9) ; 4.265 (1.9) ; 4.239 (1.8) ; 4.218 (1.8  
) ; 4.210 (2.0) ; 4.193 (2.4) ; 2.153 (16.0) ; 2.046 (0.4) ; 1.600  
(4.1) ; 1.259 (0.4) ; 1.254 (0.4) ; 0.070 (11.1) ; 0.011 (0.5) ;  
0.000 (13.3) ; -0.011 (0.6)

实施例 I.16 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.089 (6.2) ; 7.951 (6.5) ; 7.886 (2.9) ; 7.885 (3.0) ; 7.859  
(3.0) ; 7.857 (3.1) ; 7.264 (12.1) ; 7.236 (2.6) ; 7.163 (3.0) ;  
7.155 (3.4) ; 6.977 (2.0) ; 6.969 (1.9) ; 6.949 (1.7) ; 6.941 (1.6  
) ; 6.839 (3.4) ; 6.811 (3.3) ; 5.373 (0.9) ; 5.358 (0.8) ; 5.346  
(0.9) ; 5.301 (0.6) ; 4.607 (1.4) ; 4.599 (1.5) ; 4.560 (1.8) ; 4

. 552 (1.8) ; 4.405 (1.5) ; 4.391 (1.5) ; 4.251 (1.8) ; 4.224 (1.7)  
) ; 4.204 (1.4) ; 4.178 (1.3) ; 2.379 (16.0) ; 2.044 (0.4) ; 1.645  
(1.7) ; 1.259 (0.4) ; 0.071 (11.6) ; 0.000 (7.2) ; -0.011 (0.3)

实施例 1.17 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.152 (0.3) ; 8.143 (0.3) ; 8.083 (6.0) ; 7.950 (6.7) ; 7.877  
(3.1) ; 7.875 (3.0) ; 7.849 (3.3) ; 7.847 (3.2) ; 7.264 (11.5) ;  
7.130 (0.5) ; 7.125 (0.7) ; 7.114 (16.0) ; 7.102 (3.1) ; 7.096 (7.  
1) ; 7.090 (6.9) ; 7.081 (1.9) ; 7.070 (0.6) ; 7.060 (0.5) ; 7.055  
(0.4) ; 6.939 (0.3) ; 6.911 (0.3) ; 6.831 (3.6) ; 6.803 (3.4) ; 5  
.369 (0.9) ; 5.343 (1.0) ; 5.301 (0.6) ; 4.602 (1.5) ; 4.594 (1.5  
10  
) ; 4.555 (1.9) ; 4.547 (1.9) ; 4.389 (1.3) ; 4.375 (1.4) ; 4.363  
(0.5) ; 4.255 (1.9) ; 4.228 (1.8) ; 4.208 (1.5) ; 4.182 (1.4) ; 1  
.643 (1.4) ; 0.071 (10.5) ; 0.000 (7.9) ; -0.011 (0.4)

实施例 1.18 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.118 (0.9) ; 8.109 (1.0) ; 8.087 (14.8) ; 7.994 (16.0) ; 7.90  
2 (8.0) ; 7.901 (7.6) ; 7.874 (8.4) ; 7.873 (8.0) ; 7.748 (0.5) ;  
7.740 (0.5) ; 7.719 (0.5) ; 7.712 (0.5) ; 7.608 (0.7) ; 7.292 (0.4  
) ; 7.262 (110.9) ; 7.252 (1.9) ; 7.244 (1.0) ; 7.233 (2.8) ; 7.21  
5 (2.5) ; 7.203 (4.4) ; 7.185 (4.3) ; 7.175 (2.5) ; 7.157 (2.1) ;  
7.033 (0.9) ; 7.005 (0.8) ; 6.996 (2.4) ; 6.986 (3.0) ; 6.968 (2.6  
20  
) ; 6.958 (3.8) ; 6.953 (4.3) ; 6.944 (11.6) ; 6.934 (3.3) ; 6.926  
(4.3) ; 6.922 (6.0) ; 6.917 (12.2) ; 6.893 (2.2) ; 6.888 (1.9) ;  
6.883 (1.4) ; 6.878 (1.4) ; 5.365 (2.6) ; 5.346 (2.8) ; 5.302 (2.2  
) ; 5.143 (0.4) ; 4.600 (3.8) ; 4.592 (3.9) ; 4.554 (5.0) ; 4.546  
(5.0) ; 4.377 (0.6) ; 4.365 (0.6) ; 4.340 (0.6) ; 4.313 (0.7) ; 4  
.268 (5.0) ; 4.242 (4.6) ; 4.221 (3.8) ; 4.195 (3.6) ; 4.098 (0.3  
) ; 4.086 (0.4) ; 4.034 (1.5) ; 3.735 (0.4) ; 3.712 (0.5) ; 2.047  
(0.9) ; 2.011 (0.5) ; 1.574 (8.0) ; 1.482 (0.3) ; 1.284 (0.5) ; 1  
.268 (1.2) ; 1.260 (1.2) ; 1.254 (1.6) ; 1.245 (1.9) ; 1.221 (0.9  
) ; 1.151 (0.3) ; 1.000 (0.3) ; 0.978 (0.3) ; 0.070 (43.6) ; 0.011  
30  
(2.7) ; 0.000 (78.1) ; -0.011 (3.3) ; -0.199 (0.3)

实施例 1.19 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.588 (0.4) ; 8.134 (3.1) ; 8.088 (16.0) ; 7.974 (15.3) ; 7.90  
0 (7.7) ; 7.872 (7.4) ; 7.746 (1.8) ; 7.716 (1.6) ; 7.284 (8.3) ;  
7.274 (19.9) ; 7.266 (31.0) ; 7.263 (37.2) ; 7.228 (21.4) ; 7.217 (21.  
2) ; 7.207 (23.6) ; 7.027 (2.1) ; 6.999 (1.8) ; 6.924 (8.0) ; 6  
.896 (7.1) ; 5.367 (5.2) ; 5.348 (4.8) ; 5.301 (2.5) ; 5.155 (1.4  
) ; 5.140 (1.4) ; 5.130 (1.4) ; 4.599 (5.1) ; 4.553 (6.6) ; 4.417  
(0.8) ; 4.371 (2.3) ; 4.332 (1.7) ; 4.307 (1.6) ; 4.256 (4.9) ; 4  
.229 (4.9) ; 4.208 (4.5) ; 4.181 (9.4) ; 3.716 (1.8) ; 2.045 (0.4  
40  
) ; 1.603 (15.3) ; 1.544 (0.4) ; 1.258 (1.8) ; 1.003 (0.3) ; 0.865  
(0.4) ; 0.074 (37.2) ; 0.022 (5.6) ; 0.011 (13.2) ; 0.003 (19.8)  
; 0.000 (23.5) ; -0.036 (0.4)

实施例 1.20 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.182 (0.5) ; 8.173 (0.6) ; 8.096 (14.1) ; 7.991 (16.0) ; 7.95  
1 (0.4) ; 7.934 (7.8) ; 7.932 (7.6) ; 7.906 (8.3) ; 7.904 (8.0) ;  
7.608 (0.4) ; 7.279 (0.4) ; 7.263 (80.1) ; 7.000 (0.5) ; 6.972 (0.  
5) ; 6.927 (9.2) ; 6.912 (0.8) ; 6.900 (8.8) ; 6.878 (1.4) ; 6.865  
(6.7) ; 6.859 (2.0) ; 6.845 (7.2) ; 6.838 (6.9) ; 6.824 (2.5) ; 6  
.818 (6.6) ; 6.805 (1.4) ; 6.796 (0.7) ; 6.792 (0.8) ; 5.394 (1.5  
50

) ; 5.387 (2.1) ; 5.382 (2.0) ; 5.372 (2.5) ; 5.356 (2.2) ; 5.348 (1.8) ; 5.302 (2.4) ; 4.619 (4.0) ; 4.611 (3.9) ; 4.573 (5.1) ; 4.565 (5.0) ; 4.396 (0.4) ; 4.385 (0.4) ; 4.349 (0.4) ; 4.282 (4.9) ; 4.256 (4.6) ; 4.236 (3.8) ; 4.210 (3.7) ; 4.177 (6.6) ; 4.163 (6.5) ; 4.133 (0.4) ; 4.109 (0.4) ; 3.719 (0.4) ; 2.046 (1.3) ; 2.011 (0.4) ; 1.579 (32.0) ; 1.284 (0.5) ; 1.260 (1.3) ; 1.253 (1.7) ; 1.236 (0.6) ; 0.070 (20.4) ; 0.011 (1.8) ; 0.000 (54.2) ; -0.011 (2.3)

実施例 1.21 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.328 (11.3) ; 8.120 (10.1) ; 8.059 (0.4) ; 7.965 (11.4) ; 7.458 (0.8) ; 7.450 (4.0) ; 7.443 (1.9) ; 7.425 (8.2) ; 7.423 (7.5) ; 7.415 (1.7) ; 7.404 (3.2) ; 7.398 (7.2) ; 7.390 (1.4) ; 7.373 (0.4) ; 7.273 (2.4) ; 7.269 (4.7) ; 7.262 (54.0) ; 7.253 (1.7) ; 7.250 (2.7) ; 7.245 (5.6) ; 7.239 (2.1) ; 7.224 (1.7) ; 7.220 (2.4) ; 7.216 (1.5) ; 7.205 (0.4) ; 7.140 (8.0) ; 7.136 (10.0) ; 7.129 (2.9) ; 7.115 (4.9) ; 7.112 (8.0) ; 7.108 (6.8) ; 7.099 (1.1) ; 6.940 (16.0) ; 6.911 (0.4) ; 5.428 (2.3) ; 5.421 (2.4) ; 5.401 (2.6) ; 5.394 (2.5) ; 4.568 (3.1) ; 4.560 (3.1) ; 4.522 (4.3) ; 4.514 (4.2) ; 4.307 (4.0) ; 4.279 (3.8) ; 4.260 (2.9) ; 4.233 (2.8) ; 4.132 (0.8) ; 4.109 (0.8) ; 4.085 (0.4) ; 4.025 (0.7) ; 3.915 (0.8) ; 2.046 (3.1) ; 1.605 (2.2) ; 1.283 (1.0) ; 1.260 (2.0) ; 1.236 (0.9) ; 0.011 (1.4) ; 0.000 (38.0) ; -0.011 (1.2)

実施例 1.22 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.179 (15.5) ; 8.164 (9.7) ; 8.156 (9.8) ; 7.834 (14.8) ; 7.609 (0.3) ; 7.462 (1.0) ; 7.454 (4.7) ; 7.448 (2.4) ; 7.438 (1.6) ; 7.430 (9.4) ; 7.427 (8.6) ; 7.419 (1.9) ; 7.408 (3.5) ; 7.402 (8.1) ; 7.394 (1.4) ; 7.339 (12.1) ; 7.331 (12.0) ; 7.268 (8.1) ; 7.263 (59.3) ; 7.252 (1.7) ; 7.248 (3.0) ; 7.243 (6.5) ; 7.238 (2.4) ; 7.222 (1.8) ; 7.219 (2.8) ; 7.215 (1.7) ; 7.076 (2.3) ; 7.071 (8.8) ; 7.067 (11.3) ; 7.060 (3.2) ; 7.046 (5.4) ; 7.042 (8.9) ; 7.039 (8.0) ; 7.030 (1.2) ; 6.912 (0.4) ; 5.382 (2.0) ; 5.371 (2.3) ; 5.362 (2.8) ; 5.358 (2.7) ; 5.352 (2.8) ; 5.347 (2.8) ; 5.339 (2.7) ; 5.328 (2.3) ; 4.644 (2.8) ; 4.633 (2.9) ; 4.597 (6.5) ; 4.585 (16.0) ; 4.561 (11.5) ; 4.532 (6.3) ; 4.513 (6.0) ; 4.485 (2.8) ; 4.466 (2.7) ; 2.047 (0.8) ; 1.596 (48.3) ; 1.260 (0.6) ; 0.011 (1.7) ; 0.000 (43.8) ; -0.011 (1.6)

実施例 1.23 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.088 (15.2) ; 8.032 (0.6) ; 8.001 (16.0) ; 7.950 (0.4) ; 7.908 (7.7) ; 7.906 (7.9) ; 7.880 (8.1) ; 7.878 (8.5) ; 7.844 (0.6) ; 7.763 (0.4) ; 7.608 (1.1) ; 7.490 (10.6) ; 7.482 (11.6) ; 7.433 (0.4) ; 7.405 (0.4) ; 7.334 (0.7) ; 7.319 (6.0) ; 7.311 (5.6) ; 7.290 (9.1) ; 7.282 (8.8) ; 7.262 (212.9) ; 7.215 (0.9) ; 7.202 (0.8) ; 7.175 (13.6) ; 7.147 (9.3) ; 7.115 (0.5) ; 7.087 (0.5) ; 6.969 (0.5) ; 6.934 (9.1) ; 6.906 (8.4) ; 6.879 (0.3) ; 6.818 (0.4) ; 5.370 (2.5) ; 5.346 (2.7) ; 5.302 (9.4) ; 4.606 (3.9) ; 4.599 (3.9) ; 4.560 (5.1) ; 4.552 (4.8) ; 4.281 (4.8) ; 4.255 (4.5) ; 4.235 (3.9) ; 4.209 (3.5) ; 4.158 (0.9) ; 4.134 (2.8) ; 4.110 (3.0) ; 4.086 (1.1) ; 3.980 (2.3) ; 2.174 (0.3) ; 2.047 (13.9) ; 1.569 (38.7) ; 1.473 (0.4) ; 1.284 (3.8) ; 1.260 (8.2) ; 1.237 (3.9) ; 0.195 (0.5) ; 0.069 (33.5) ; 0.057 (1.8) ; 0.035 (0.6) ; 0.011 (4.7) ; 0.

10

20

30

40

50

000 (141.0) ; -0.011 (5.6) ; -0.060 (0.4) ; -0.200 (0.4)

实施例 I.24 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.073 (2.1) ; 7.905 (2.3) ; 7.854 (1.0) ; 7.826 (1.1) ; 7.416 (1.5) ; 7.410 (0.6) ; 7.394 (0.7) ; 7.388 (1.8) ; 7.379 (0.3) ; 7.271 (3.2) ; 7.117 (2.1) ; 7.110 (0.7) ; 7.095 (0.7) ; 7.088 (1.8) ; 6.808 (1.2) ; 6.780 (1.2) ; 5.352 (0.4) ; 5.331 (0.4) ; 5.326 (0.4) ; 4.931 (0.6) ; 4.909 (0.6) ; 4.577 (0.5) ; 4.569 (0.5) ; 4.531 (0.6) ; 4.523 (0.6) ; 4.239 (0.5) ; 4.213 (0.5) ; 4.192 (0.4) ; 4.166 (0.4) ; 4.152 (1.1) ; 4.128 (3.4) ; 4.104 (3.5) ; 4.081 (1.2) ; 2.042 (16.0) ; 2.031 (0.4) ; 1.523 (3.9) ; 1.502 (3.9) ; 1.281 (4.4) ; 1.258 (8.9) ; 1.234 (4.6) ; 0.072 (5.8) ; 0.060 (0.3) ; 0.000 (1.7)

10

实施例 I.25 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.089 (9.2) ; 8.022 (7.1) ; 7.994 (7.6) ; 7.947 (11.2) ; 7.397 (1.3) ; 7.386 (12.9) ; 7.379 (4.6) ; 7.364 (5.3) ; 7.357 (16.0) ; 7.346 (2.2) ; 7.265 (9.5) ; 7.113 (1.9) ; 7.102 (15.8) ; 7.095 (5.3) ; 7.080 (4.7) ; 7.073 (13.0) ; 7.062 (1.8) ; 7.042 (5.8) ; 7.013 (5.5) ; 6.678 (3.7) ; 6.496 (7.5) ; 6.314 (3.8) ; 5.645 (2.4) ; 5.619 (2.6) ; 4.524 (3.1) ; 4.516 (3.2) ; 4.477 (4.5) ; 4.470 (4.5) ; 4.327 (2.6) ; 4.287 (4.4) ; 4.260 (4.1) ; 4.240 (3.1) ; 4.213 (2.9) ; 4.129 (0.7) ; 4.105 (0.7) ; 3.953 (1.1) ; 2.042 (2.9) ; 1.694 (4.8) ; 1.281 (1.2) ; 1.257 (3.9) ; 1.234 (1.1) ; 0.879 (0.5) ; 0.855 (0.4) ; 0.071 (5.7) ; 0.000 (9.7)

20

实施例 I.26 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 18.304 (0.4) ; 16.267 (0.4) ; 15.166 (0.4) ; 12.449 (0.4) ; 8.100 (0.5) ; 8.057 (13.2) ; 7.993 (14.6) ; 7.886 (6.8) ; 7.858 (7.1) ; 7.607 (1.0) ; 7.531 (0.4) ; 7.382 (1.8) ; 7.371 (12.6) ; 7.364 (4.5) ; 7.349 (4.9) ; 7.342 (16.0) ; 7.331 (1.9) ; 7.300 (0.7) ; 7.262 (159.5) ; 7.127 (2.5) ; 7.116 (15.0) ; 7.109 (4.3) ; 7.093 (4.3) ; 7.086 (11.8) ; 7.075 (1.3) ; 7.065 (0.5) ; 6.910 (0.7) ; 6.820 (0.5) ; 6.793 (8.0) ; 6.766 (7.4) ; 5.343 (0.5) ; 5.329 (0.5) ; 5.313 (1.7) ; 5.302 (5.4) ; 5.289 (3.3) ; 5.279 (2.3) ; 4.528 (3.4) ; 4.519 (3.0) ; 4.481 (4.9) ; 4.473 (4.6) ; 4.317 (4.5) ; 4.292 (4.2) ; 4.270 (3.0) ; 4.246 (2.9) ; 3.929 (6.7) ; 3.914 (6.2) ; 2.516 (0.5) ; 2.221 (0.5) ; 2.174 (0.7) ; 1.617 (0.4) ; 1.553 (141.0) ; 1.524 (1.1) ; 1.508 (0.8) ; 1.477 (0.5) ; 1.308 (1.2) ; 1.255 (3.7) ; 0.896 (0.6) ; 0.881 (1.1) ; 0.853 (0.6) ; 0.196 (0.8) ; 0.069 (18.0) ; 0.011 (6.2) ; 0.000 (185.3) ; -0.011 (8.4) ; -0.065 (0.6) ; -0.199 (0.9) ; -1.451 (0.4) ; -3.269 (0.5)

30

实施例 I.27 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.062 (3.3) ; 8.034 (3.5) ; 8.007 (4.0) ; 7.860 (4.2) ; 7.269 (1.8) ; 7.088 (13.5) ; 7.067 (12.6) ; 6.686 (3.5) ; 6.658 (3.4) ; 5.300 (1.5) ; 5.261 (2.2) ; 5.214 (2.4) ; 4.978 (1.7) ; 4.535 (2.5) ; 4.488 (2.2) ; 1.696 (16.0) ; 1.255 (0.6) ; 0.000 (0.9)

40

实施例 I.28 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.054 (3.3) ; 8.026 (3.4) ; 8.000 (4.4) ; 7.859 (4.1) ; 7.317 (0.3) ; 7.298 (0.4) ; 7.291 (0.4) ; 7.266 (3.8) ; 7.245 (1.5) ; 7.238 (1.9) ; 7.199 (1.0) ; 7.197 (1.0) ; 7.190 (0.8) ; 7.189 (0.7) ; 7.170 (1.2) ; 7.169 (1.2) ; 7.162 (1.0) ; 7.160 (1.0) ; 6.973 (2.6) ; 6.945 (2.0) ; 6.642 (3.4) ; 6.613 (3.3) ; 5.713 (0.4) ; 5

50

. 301 (0.7) ; 5.253 (1.9) ; 5.206 (2.1) ; 4.950 (0.5) ; 4.535 (2.2)  
) ; 4.488 (2.0) ; 2.150 (0.5) ; 2.115 (11.2) ; 1.697 (16.0) ; 0.00  
0 (3.9)

实施例 I.29 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.067 (3.6) ; 8.052 (0.6) ; 8.039 (3.8) ; 8.023 (0.5) ; 8.013  
(4.3) ; 7.863 (4.4) ; 7.268 (2.6) ; 7.247 (1.6) ; 7.219 (1.9) ; 7  
.141 (2.4) ; 7.133 (2.5) ; 6.943 (1.6) ; 6.935 (1.5) ; 6.916 (1.3  
) ; 6.907 (1.2) ; 6.702 (0.4) ; 6.695 (3.8) ; 6.673 (0.4) ; 6.667  
(3.7) ; 5.300 (0.4) ; 5.250 (1.9) ; 5.203 (2.2) ; 4.968 (0.9) ; 4  
.544 (2.3) ; 4.497 (2.1) ; 2.368 (12.5) ; 1.735 (1.3) ; 1.697 (16.  
0) ; 0.000 (2.4)

10

实施例 I.30 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.089 (4.3) ; 8.005 (4.2) ; 7.861 (2.4) ; 7.833 (2.6) ; 7.608  
(0.4) ; 7.313 (0.4) ; 7.262 (51.7) ; 7.141 (2.3) ; 7.111 (2.9) ;  
7.012 (3.0) ; 7.002 (2.6) ; 6.872 (2.1) ; 6.863 (1.6) ; 6.842 (2.9  
) ; 6.837 (3.3) ; 6.809 (2.3) ; 5.375 (1.3) ; 5.361 (1.3) ; 5.350  
(1.2) ; 4.606 (1.4) ; 4.559 (1.9) ; 4.280 (1.4) ; 4.254 (1.4) ; 4  
.234 (1.1) ; 4.209 (1.1) ; 3.904 (2.9) ; 3.890 (2.3) ; 3.828 (16.0  
) ; 1.664 (0.4) ; 1.570 (143.6) ; 1.293 (0.9) ; 1.257 (1.8) ; 0.88  
7 (0.6) ; 0.856 (0.4) ; 0.069 (7.1) ; 0.000 (47.4) ; -0.032 (0.4)

20

实施例 I.31 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.055 (2.8) ; 8.027 (2.8) ; 7.989 (3.8) ; 7.866 (3.5) ; 7.263  
(46.0) ; 7.115 (2.3) ; 7.086 (2.8) ; 6.993 (2.2) ; 6.983 (2.6) ;  
6.854 (1.6) ; 6.844 (1.4) ; 6.824 (1.3) ; 6.814 (1.1) ; 6.687 (2.8  
) ; 6.658 (2.7) ; 5.302 (9.2) ; 5.246 (1.6) ; 5.199 (1.9) ; 4.874  
(2.9) ; 4.532 (2.0) ; 4.486 (1.7) ; 3.819 (16.0) ; 1.692 (10.3) ;  
1.571 (113.0) ; 1.254 (1.0) ; 0.069 (8.2) ; 0.011 (1.2) ; 0.000 (3  
8.4) ; -0.011 (1.7)

实施例 I.32 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.141 (1.5) ; 8.116 (3.9) ; 8.088 (3.3) ; 8.047 (2.6) ; 8.024  
(4.8) ; 7.878 (2.7) ; 7.859 (5.6) ; 7.489 (1.4) ; 7.480 (1.4) ; 7  
.466 (3.7) ; 7.452 (1.7) ; 7.437 (3.3) ; 7.273 (4.3) ; 7.269 (4.2  
) ; 7.035 (1.5) ; 7.019 (3.0) ; 7.015 (3.0) ; 6.990 (2.2) ; 6.795  
(1.5) ; 6.770 (3.9) ; 6.758 (1.7) ; 6.742 (2.8) ; 5.358 (0.3) ; 5  
.324 (0.9) ; 5.316 (0.8) ; 5.301 (2.0) ; 5.238 (2.6) ; 5.192 (2.9  
) ; 5.053 (1.0) ; 4.581 (1.4) ; 4.555 (2.9) ; 4.534 (1.5) ; 4.523  
(1.2) ; 4.509 (2.6) ; 2.194 (0.5) ; 2.187 (0.5) ; 2.172 (1.2) ; 1  
.761 (0.9) ; 1.724 (7.3) ; 1.715 (6.9) ; 1.702 (16.0) ; 0.000 (0.8  
)

30

实施例 I.33 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.447 (0.4) ; 8.418 (0.4) ; 8.193 (0.5) ; 8.024 (10.1) ; 8.011  
(0.8) ; 7.996 (10.5) ; 7.915 (13.4) ; 7.865 (13.2) ; 7.418 (0.5)  
; 7.388 (0.6) ; 7.365 (1.3) ; 7.354 (12.7) ; 7.347 (4.4) ; 7.332 (4  
.8) ; 7.324 (16.3) ; 7.314 (1.8) ; 7.268 (5.6) ; 7.142 (0.6) ; 7  
.112 (0.6) ; 7.097 (1.8) ; 7.087 (16.0) ; 7.079 (4.8) ; 7.064 (4.4  
) ; 7.057 (12.9) ; 7.046 (1.3) ; 6.954 (0.3) ; 6.926 (0.3) ; 6.684  
(9.4) ; 6.656 (9.1) ; 5.571 (1.1) ; 4.939 (8.6) ; 4.819 (5.6) ; 4  
.773 (7.0) ; 4.454 (7.6) ; 4.407 (6.0) ; 1.750 (3.6) ; 1.579 (41.0  
) ; 0.000 (4.9)

40

实施例 I.34 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

50

= 8.099 (2.6) ; 7.999 (2.7) ; 7.942 (1.3) ; 7.914 (1.3) ; 7.817 (2.3) ; 7.810 (0.7) ; 7.794 (0.8) ; 7.786 (2.5) ; 7.262 (13.8) ; 7.254 (1.6) ; 7.223 (1.3) ; 6.956 (1.5) ; 6.928 (1.5) ; 5.396 (0.4) ; 5.385 (0.3) ; 5.372 (0.4) ; 5.302 (0.4) ; 4.628 (0.6) ; 4.621 (0.6) ; 4.582 (0.8) ; 4.574 (0.8) ; 4.299 (0.8) ; 4.274 (0.8) ; 4.253 (0.6) ; 4.227 (0.6) ; 4.157 (1.1) ; 4.133 (3.6) ; 4.110 (3.9) ; 4.086 (1.2) ; 2.046 (16.0) ; 1.575 (3.4) ; 1.284 (4.3) ; 1.260 (8.6) ; 1.236 (4.2) ; 0.069 (1.6) ; 0.011 (0.5) ; 0.000 (16.0) ; -0.011 (0.7)

実施例 I.35 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.234 (1.6) ; 8.231 (1.7) ; 8.203 (1.2) ; 8.143 (4.1) ; 8.115 (4.3) ; 8.006 (5.8) ; 7.872 (5.1) ; 7.866 (1.8) ; 7.859 (0.5) ; 7.842 (0.5) ; 7.835 (1.5) ; 7.810 (0.5) ; 7.799 (4.5) ; 7.792 (1.5) ; 7.776 (1.5) ; 7.769 (5.0) ; 7.758 (0.5) ; 7.307 (0.8) ; 7.277 (0.9) ; 7.262 (35.5) ; 7.215 (2.8) ; 7.185 (2.5) ; 7.053 (1.2) ; 7.025 (1.2) ; 6.818 (4.3) ; 6.789 (4.1) ; 5.717 (3.4) ; 5.302 (15.9) ; 5.249 (2.5) ; 4.994 (2.7) ; 4.537 (2.7) ; 4.490 (2.4) ; 2.010 (0.3) ; 1.713 (16.0) ; 1.559 (3.1) ; 1.269 (0.4) ; 1.254 (0.5) ; 1.246 (0.5) ; 0.069 (9.3) ; 0.057 (0.4) ; 0.011 (1.2) ; 0.000 (40.7) ; -0.011 (1.7)

実施例 I.36 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.603 (7.8) ; 8.160 (9.7) ; 8.044 (3.2) ; 8.038 (2.8) ; 8.024 (2.6) ; 7.882 (9.0) ; 7.875 (3.1) ; 7.858 (3.6) ; 7.852 (9.8) ; 7.841 (1.1) ; 7.327 (9.7) ; 7.300 (34.9) ; 7.271 (5.5) ; 5.496 (1.9) ; 5.468 (2.0) ; 5.339 (16.0) ; 4.526 (2.0) ; 4.520 (1.9) ; 4.479 (3.2) ; 4.473 (3.1) ; 4.347 (2.3) ; 4.319 (2.1) ; 4.300 (1.5) ; 4.272 (1.4) ; 4.180 (0.4) ; 4.157 (0.5) ; 4.093 (0.4) ; 4.086 (0.4) ; 4.079 (0.4) ; 4.061 (0.4) ; 4.021 (0.9) ; 1.596 (11.1) ; 1.334 (0.4) ; 1.304 (0.9) ; 1.292 (1.9) ; 1.259 (0.4) ; 0.108 (3.2) ; 0.039 (35.5) ; 0.028 (1.8)

実施例 I.37 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.500 (5.7) ; 8.071 (5.5) ; 7.959 (6.6) ; 7.881 (0.6) ; 7.870 (5.8) ; 7.863 (1.9) ; 7.847 (1.9) ; 7.840 (6.5) ; 7.829 (0.7) ; 7.378 (6.6) ; 7.300 (51.6) ; 7.277 (3.7) ; 7.247 (3.2) ; 5.339 (13.2) ; 4.742 (2.7) ; 4.694 (3.7) ; 4.503 (5.4) ; 4.499 (5.5) ; 4.451 (2.8) ; 1.693 (16.0) ; 1.588 (17.9) ; 0.108 (0.6) ; 0.050 (1.8) ; 0.039 (52.9) ; 0.028 (2.0)

実施例 I.38 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.136 (0.4) ; 8.047 (0.5) ; 7.587 (0.3) ; 7.300 (6.7) ; 7.285 (0.4) ; 7.255 (0.3) ; 6.905 (0.3) ; 1.603 (16.0) ; 0.108 (0.7) ; 0.038 (7.0) ; 0.028 (0.3)

実施例 I.39 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.138 (3.4) ; 8.109 (4.7) ; 8.083 (1.3) ; 8.041 (5.3) ; 8.014 (2.1) ; 7.909 (4.9) ; 7.882 (2.0) ; 7.598 (3.4) ; 7.569 (5.2) ; 7.543 (2.0) ; 7.307 (9.3) ; 7.300 (23.3) ; 7.273 (7.8) ; 7.250 (4.7) ; 7.222 (5.3) ; 7.197 (1.8) ; 6.892 (1.4) ; 6.864 (0.6) ; 6.794 (3.6) ; 6.766 (4.5) ; 6.740 (1.2) ; 6.703 (2.7) ; 6.677 (1.1) ; 6.515 (1.4) ; 6.488 (0.6) ; 5.339 (4.3) ; 5.323 (2.9) ; 5.313 (1.8) ; 5.297 (1.4) ; 5.276 (2.9) ; 5.250 (1.3) ; 4.990 (4.1) ; 4.963 (1.9) ; 4.573 (2.9) ; 4.545 (1.3) ; 4.526 (2.7) ; 4.500 (1.0) ; 1

10

20

30

40

50



.745 (16.0) ; 1.718 (6.5) ; 1.598 (16.5) ; 1.571 (7.7) ; 1.294 (0.7) ; 1.266 (0.5) ; 0.108 (3.2) ; 0.082 (1.2) ; 0.046 (9.2) ; 0.039 (22.4) ; 0.012 (7.1)

実施例 1.40 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.131 (4.9) ; 8.117 (2.0) ; 8.088 (2.0) ; 8.033 (5.1) ; 7.589 (0.4) ; 7.578 (4.6) ; 7.571 (1.5) ; 7.555 (1.5) ; 7.548 (5.3) ; 7.538 (0.5) ; 7.300 (15.7) ; 7.153 (2.5) ; 7.141 (5.4) ; 7.134 (1.7) ; 7.125 (2.2) ; 7.119 (1.7) ; 7.112 (4.6) ; 7.101 (0.5) ; 5.549 (0.7) ; 5.524 (0.7) ; 4.525 (0.9) ; 4.517 (1.0) ; 4.478 (1.4) ; 4.471 (1.4) ; 4.308 (1.4) ; 4.281 (1.4) ; 4.261 (1.0) ; 4.234 (1.0) ; 4.116 (2.3) ; 4.104 (2.3) ; 1.609 (16.0) ; 1.293 (0.5) ; 0.108 (1.4) ; 0.049 (0.5) ; 0.039 (15.0) ; 0.028 (0.5)

実施例 1.41 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.115 (14.5) ; 8.025 (14.6) ; 7.948 (3.6) ; 7.919 (4.4) ; 7.889 (3.7) ; 7.646 (0.6) ; 7.438 (1.2) ; 7.427 (12.9) ; 7.420 (4.2) ; 7.405 (4.6) ; 7.397 (15.8) ; 7.386 (1.7) ; 7.367 (0.6) ; 7.300 (12.1) ; 7.270 (0.4) ; 7.233 (0.5) ; 7.144 (1.6) ; 7.133 (16.0) ; 7.126 (4.7) ; 7.111 (4.1) ; 7.103 (12.7) ; 7.093 (1.2) ; 6.949 (0.7) ; 6.828 (5.9) ; 6.801 (5.5) ; 5.364 (1.4) ; 5.350 (1.8) ; 5.339 (2.9) ; 5.330 (2.1) ; 5.315 (1.6) ; 4.590 (3.1) ; 4.581 (3.2) ; 4.543 (4.8) ; 4.534 (4.8) ; 4.393 (4.7) ; 4.368 (4.5) ; 4.346 (3.1) ; 4.321 (2.9) ; 4.000 (8.1) ; 3.985 (8.0) ; 1.660 (0.5) ; 1.594 (134.6) ; 1.527 (0.7) ; 1.380 (0.4) ; 1.342 (0.5) ; 1.292 (1.1) ; 0.920 (0.4) ; 0.234 (0.5) ; 0.120 (1.1) ; 0.108 (33.8) ; 0.049 (3.9) ; 0.038 (128.9) ; 0.027 (5.1) ; -0.008 (0.3) ; -0.029 (0.6) ; -0.160 (0.6)

実施例 1.42 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.045 (1.5) ; 8.017 (1.8) ; 8.011 (1.8) ; 8.001 (4.0) ; 7.983 (1.7) ; 7.921 (3.9) ; 7.424 (0.5) ; 7.413 (4.0) ; 7.406 (1.4) ; 7.391 (1.5) ; 7.383 (4.9) ; 7.372 (0.6) ; 7.300 (17.2) ; 7.118 (0.6) ; 7.107 (4.9) ; 7.100 (1.5) ; 7.085 (1.3) ; 7.078 (4.0) ; 7.067 (0.4) ; 6.722 (1.7) ; 6.717 (1.7) ; 6.695 (1.6) ; 6.690 (1.7) ; 4.855 (2.7) ; 4.811 (1.4) ; 4.765 (1.8) ; 4.496 (2.0) ; 4.449 (1.5) ; 2.047 (2.0) ; 1.607 (16.0) ; 0.107 (2.0) ; 0.049 (0.8) ; 0.038 (18.3) ; 0.027 (0.8)

実施例 1.43 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.591 (11.5) ; 8.161 (14.7) ; 8.045 (16.0) ; 7.646 (0.6) ; 7.367 (0.5) ; 7.339 (6.0) ; 7.308 (11.8) ; 7.300 (110.2) ; 7.279 (13.8) ; 7.242 (2.4) ; 7.232 (19.4) ; 7.224 (4.8) ; 7.209 (3.8) ; 7.201 (10.4) ; 7.190 (0.9) ; 6.949 (0.6) ; 5.480 (2.5) ; 5.453 (2.5) ; 4.518 (2.8) ; 4.510 (2.9) ; 4.471 (4.6) ; 4.463 (4.7) ; 4.342 (4.6) ; 4.314 (4.2) ; 4.295 (2.8) ; 4.267 (2.8) ; 3.948 (4.5) ; 3.938 (4.5) ; 2.048 (8.9) ; 1.664 (0.4) ; 1.597 (53.9) ; 1.533 (0.3) ; 1.290 (1.1) ; 0.234 (0.4) ; 0.108 (2.3) ; 0.049 (4.1) ; 0.038 (119.4) ; 0.027 (4.2) ; -0.160 (0.4)

実施例 1.44 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.477 (5.7) ; 8.070 (6.8) ; 7.958 (7.2) ; 7.335 (7.2) ; 7.328 (3.3) ; 7.325 (3.3) ; 7.318 (1.7) ; 7.300 (48.0) ; 7.220 (1.2) ; 7.209 (8.8) ; 7.201 (2.3) ; 7.186 (1.9) ; 7.179 (5.0) ; 7.167 (0.5) ; 5.340 (4.8) ; 4.732 (2.5) ; 4.685 (3.7) ; 4.484 (4.1) ; 4.461

10

20

30

40

50

(6.6) ; 4.437 (2.8) ; 1.680 (16.0) ; 1.655 (0.6) ; 1.598 (17.9) ;  
1.307 (0.4) ; 1.292 (0.4) ; 1.284 (0.4) ; 0.108 (1.4) ; 0.049 (2.3) ; 0.038 (48.0) ; 0.027 (1.7)

实施例 1.45 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 15.116 (0.4) ; 15.105 (0.4) ; 8.468 (5.5) ; 8.066 (6.4) ; 7.957 (6.7) ; 7.646 (1.0) ; 7.439 (6.4) ; 7.431 (2.1) ; 7.416 (2.3) ; 7.409 (7.4) ; 7.398 (1.0) ; 7.366 (1.1) ; 7.316 (8.1) ; 7.300 (198.5) ; 7.233 (0.5) ; 7.137 (0.9) ; 7.126 (7.5) ; 7.119 (2.0) ; 7.104 (1.9) ; 7.097 (6.0) ; 6.949 (1.1) ; 5.340 (12.4) ; 4.727 (2.5) ; 4.680 (3.7) ; 4.480 (3.9) ; 4.433 (9.2) ; 1.721 (0.4) ; 1.675 (16.0) ; 1.593 (225.5) ; 1.526 (1.0) ; 1.500 (0.5) ; 1.466 (0.4) ; 1.306 (0.9) ; 1.293 (1.4) ; 1.260 (0.5) ; 0.918 (0.5) ; 0.897 (0.5) ; 0.234 (0.7) ; 0.172 (0.4) ; 0.119 (0.9) ; 0.108 (28.9) ; 0.069 (0.5) ; 0.049 (5.8) ; 0.038 (187.8) ; 0.027 (7.4) ; -0.028 (0.6) ; -0.159 (0.8)

10

实施例 1.46 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.468 (5.6) ; 8.067 (6.3) ; 7.957 (6.9) ; 7.646 (0.6) ; 7.449 (0.7) ; 7.438 (6.5) ; 7.431 (2.2) ; 7.416 (2.5) ; 7.409 (7.8) ; 7.398 (0.9) ; 7.366 (0.5) ; 7.348 (0.3) ; 7.316 (7.3) ; 7.300 (94.3) ; 7.137 (1.0) ; 7.126 (7.9) ; 7.119 (2.3) ; 7.104 (2.3) ; 7.097 (6.2) ; 7.086 (0.6) ; 6.949 (0.4) ; 5.340 (12.1) ; 4.726 (2.6) ; 4.679 (3.6) ; 4.480 (4.1) ; 4.434 (7.8) ; 1.675 (16.0) ; 1.598 (49.3) ; 1.307 (0.8) ; 1.293 (1.2) ; 1.284 (0.7) ; 1.261 (0.6) ; 1.240 (0.4) ; 0.107 (14.9) ; 0.096 (0.7) ; 0.049 (3.9) ; 0.038 (89.4) ; 0.027 (3.4) ; -0.160 (0.3)

20

实施例 1.47 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.600 (7.4) ; 8.161 (10.0) ; 8.036 (6.8) ; 7.756 (5.5) ; 7.727 (6.4) ; 7.322 (6.6) ; 7.314 (10.8) ; 7.300 (44.3) ; 5.489 (1.6) ; 5.462 (1.6) ; 4.523 (1.8) ; 4.516 (1.9) ; 4.476 (3.0) ; 4.469 (3.0) ; 4.345 (2.9) ; 4.317 (2.7) ; 4.298 (1.8) ; 4.270 (1.7) ; 4.059 (1.2) ; 1.604 (16.0) ; 1.291 (0.4) ; 0.108 (2.6) ; 0.049 (1.5) ; 0.039 (45.1) ; 0.028 (1.6)

30

实施例 1.48 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.585 (10.3) ; 8.154 (13.4) ; 8.011 (12.8) ; 7.608 (1.2) ; 7.598 (12.2) ; 7.591 (3.8) ; 7.575 (4.0) ; 7.569 (13.3) ; 7.558 (1.4) ; 7.300 (26.5) ; 7.256 (11.7) ; 7.105 (1.4) ; 7.094 (13.6) ; 7.088 (4.0) ; 7.072 (3.8) ; 7.065 (11.9) ; 7.055 (1.2) ; 5.467 (2.2) ; 5.439 (2.2) ; 4.504 (2.5) ; 4.497 (2.6) ; 4.457 (4.2) ; 4.450 (4.1) ; 4.328 (4.0) ; 4.300 (3.7) ; 4.281 (2.5) ; 4.253 (2.4) ; 4.153 (2.2) ; 2.045 (8.3) ; 1.632 (16.0) ; 1.291 (0.4) ; 0.107 (1.9) ; 0.048 (1.0) ; 0.038 (28.3) ; 0.027 (1.1)

40

实施例 1.49 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.469 (5.6) ; 8.359 (0.4) ; 8.327 (0.4) ; 8.216 (0.9) ; 8.065 (6.5) ; 8.024 (1.1) ; 7.958 (6.8) ; 7.657 (0.5) ; 7.646 (0.8) ; 7.637 (0.8) ; 7.598 (0.9) ; 7.588 (6.5) ; 7.580 (2.2) ; 7.565 (2.1) ; 7.558 (7.3) ; 7.547 (0.8) ; 7.428 (0.4) ; 7.389 (0.4) ; 7.358 (0.6) ; 7.317 (7.5) ; 7.300 (122.9) ; 7.085 (0.8) ; 7.074 (7.2) ; 7.067 (2.2) ; 7.052 (2.1) ; 7.045 (6.4) ; 7.034 (0.8) ; 6.949 (0.6) ; 5.299 (1.0) ; 5.281 (1.1) ; 4.728 (2.5) ; 4.680 (3.6) ; 4.480 (3.8) ; 4.442 (6.4) ; 4.433 (3.1) ; 2.944 (0.3) ; 2.888 (0.4) ; 2

50

. 638 (0.3) ; 2.579 (0.4) ; 2.049 (0.5) ; 1.675 (16.0) ; 1.655 (3.0)  
) ; 1.590 (46.1) ; 1.293 (1.5) ; 0.918 (0.4) ; 0.235 (0.5) ; 0.108  
(7.9) ; 0.050 (5.5) ; 0.039 (133.6) ; 0.028 (5.0) ; -0.160 (0.5)

実施例 I.50 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.490 (5.7) ; 8.071 (6.6) ; 7.959 (7.1) ; 7.743 (3.8) ; 7.715  
(4.4) ; 7.369 (6.6) ; 7.300 (49.1) ; 7.271 (3.8) ; 5.340 (11.7) ;  
4.738 (2.6) ; 4.690 (3.7) ; 4.493 (4.7) ; 4.486 (6.7) ; 4.445 (2.  
9) ; 1.688 (16.0) ; 1.596 (17.8) ; 1.293 (1.0) ; 0.108 (3.1) ; 0.0  
49 (1.7) ; 0.038 (47.7) ; 0.027 (1.9)

実施例 I.51 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.112 (4.7) ; 8.084 (5.0) ; 8.036 (5.7) ; 7.905 (5.5) ; 7.646  
(0.6) ; 7.417 (0.7) ; 7.407 (5.8) ; 7.400 (1.9) ; 7.385 (2.2) ; 7  
.377 (7.2) ; 7.366 (1.5) ; 7.300 (116.3) ; 7.289 (2.0) ; 7.234 (0.  
5) ; 7.122 (0.9) ; 7.112 (7.1) ; 7.104 (2.1) ; 7.089 (1.9) ; 7.082  
(5.7) ; 7.071 (0.6) ; 6.949 (0.5) ; 6.755 (5.0) ; 6.727 (4.8) ; 5  
.340 (1.2) ; 5.320 (2.6) ; 5.273 (2.9) ; 4.977 (4.3) ; 4.564 (3.2  
) ; 4.516 (2.8) ; 1.737 (16.0) ; 1.735 (15.7) ; 1.709 (0.4) ; 1.65  
6 (1.0) ; 1.589 (156.0) ; 1.523 (0.7) ; 1.323 (0.4) ; 1.293 (2.8)  
; 0.234 (0.4) ; 0.120 (0.5) ; 0.108 (7.1) ; 0.049 (4.7) ; 0.039 (1  
14.3) ; 0.028 (4.5) ; -0.028 (0.6) ; -0.160 (0.3)

実施例 I.52 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 17.800 (0.4) ; 17.078 (0.4) ; 12.484 (0.4) ; 11.639 (0.4) ; 10  
.368 (0.4) ; 8.112 (4.3) ; 8.084 (4.5) ; 8.036 (5.6) ; 7.906 (5.5  
) ; 7.646 (1.1) ; 7.435 (0.4) ; 7.407 (5.3) ; 7.400 (1.9) ; 7.385  
(1.9) ; 7.378 (6.6) ; 7.367 (1.7) ; 7.327 (0.6) ; 7.300 (179.7) ;  
7.233 (0.6) ; 7.122 (0.7) ; 7.112 (6.4) ; 7.105 (2.0) ; 7.089 (1.  
6) ; 7.082 (5.2) ; 6.949 (0.9) ; 6.755 (4.5) ; 6.727 (4.3) ; 5.811  
(0.4) ; 5.340 (0.7) ; 5.320 (2.7) ; 5.274 (2.9) ; 4.976 (4.2) ; 4  
.563 (3.1) ; 4.517 (2.8) ; 1.736 (16.0) ; 1.700 (0.4) ; 1.671 (0.5  
) ; 1.654 (1.4) ; 1.587 (240.3) ; 1.521 (1.1) ; 1.340 (0.4) ; 1.29  
3 (3.9) ; 0.893 (0.4) ; 0.234 (0.8) ; 0.108 (10.8) ; 0.050 (5.5) ;  
0.039 (174.0) ; 0.028 (6.1) ; -0.028 (0.9) ; -0.160 (0.7) ; -1.  
485 (0.4) ; -3.388 (0.4)

実施例 I.53 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.472 (4.8) ; 8.023 (3.8) ; 7.898 (3.5) ; 7.416 (0.4) ; 7.405  
(3.6) ; 7.398 (1.2) ; 7.383 (1.3) ; 7.375 (4.3) ; 7.365 (0.5) ; 7  
.300 (13.9) ; 7.097 (0.5) ; 7.086 (4.3) ; 7.079 (1.3) ; 7.064 (1.1  
) ; 7.057 (3.5) ; 7.046 (0.4) ; 6.913 (4.9) ; 5.339 (0.5) ; 5.215  
(1.7) ; 5.168 (1.9) ; 4.834 (2.2) ; 4.557 (2.1) ; 4.510 (1.8) ; 2  
.211 (16.0) ; 1.736 (11.9) ; 1.613 (3.4) ; 0.107 (0.8) ; 0.049 (0.  
5) ; 0.038 (13.4) ; 0.027 (0.5)

実施例 I.54 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.472 (4.0) ; 8.023 (3.1) ; 7.899 (2.9) ; 7.405 (3.0) ; 7.398  
(1.0) ; 7.383 (1.1) ; 7.376 (3.6) ; 7.365 (0.4) ; 7.300 (19.7) ;  
7.097 (0.4) ; 7.087 (3.6) ; 7.079 (1.1) ; 7.064 (1.0) ; 7.057 (2.9  
) ; 6.913 (4.1) ; 5.339 (0.5) ; 5.218 (1.4) ; 5.171 (1.6) ; 4.830  
(2.0) ; 4.557 (1.7) ; 4.510 (1.5) ; 2.220 (0.4) ; 2.211 (16.0) ;  
1.737 (9.1) ; 1.602 (8.9) ; 1.294 (0.5) ; 0.108 (1.2) ; 0.049 (0.8  
) ; 0.038 (19.1) ; 0.027 (0.7)

実施例 I.55 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $d_6$ -DMSO) :

10

20

30

40

50

= 8.537 (11.6) ; 8.485 (16.0) ; 7.988 (14.8) ; 7.706 (8.1) ; 7.678 (9.3) ; 7.491 (13.1) ; 7.426 (0.4) ; 7.373 (10.4) ; 7.345 (8.7) ; 7.287 (3.3) ; 7.101 (7.2) ; 6.915 (3.5) ; 6.216 (6.8) ; 6.200 (7.0) ; 5.781 (12.7) ; 5.229 (2.2) ; 5.216 (2.6) ; 5.204 (2.3) ; 4.494 (1.9) ; 4.466 (1.8) ; 4.447 (3.8) ; 4.420 (3.6) ; 4.372 (3.8) ; 4.360 (3.8) ; 4.325 (1.8) ; 4.313 (1.6) ; 3.954 (0.6) ; 3.351 (40.4) ; 3.201 (0.4) ; 3.184 (0.4) ; 2.531 (6.3) ; 2.525 (8.2) ; 2.519 (6.1) ; 2.012 (0.7) ; 1.258 (0.4) ; 1.198 (0.4) ; 1.079 (0.4) ; 0.023 (7.0)

实施例 I.56 :  $^1\text{H}$ -NMR (400.1 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.441 (5.7) ; 8.072 (2.9) ; 7.900 (3.8) ; 7.581 (3.9) ; 7.560 (4.3) ; 7.310 (6.8) ; 7.264 (3.5) ; 7.227 (4.8) ; 7.206 (4.3) ; 6.808 (1.7) ; 6.666 (3.5) ; 6.525 (1.7) ; 4.666 (2.5) ; 4.630 (3.4) ; 4.451 (3.6) ; 4.416 (2.6) ; 1.641 (16.0) ; 0.000 (2.4)

实施例 I.57 :  $^1\text{H}$ -NMR (400.1 MHz,  $d_6$ -DMSO) :

= 8.476 (11.7) ; 8.441 (16.0) ; 7.946 (16.0) ; 7.681 (4.1) ; 7.676 (4.3) ; 7.655 (4.2) ; 7.650 (4.2) ; 7.547 (13.2) ; 7.472 (2.9) ; 7.450 (7.0) ; 7.429 (5.3) ; 7.395 (4.6) ; 7.391 (4.4) ; 7.373 (2.6) ; 7.370 (2.3) ; 6.165 (6.6) ; 6.153 (6.8) ; 5.197 (2.1) ; 5.187 (2.4) ; 5.178 (2.1) ; 4.455 (2.0) ; 4.434 (1.9) ; 4.420 (3.6) ; 4.399 (3.5) ; 4.348 (3.5) ; 4.339 (3.5) ; 4.313 (1.9) ; 4.304 (1.8) ; 3.304 (25.8) ; 2.505 (9.5) ; 2.500 (12.7) ; 2.496 (9.4) ; 0.000 (11.0) ; -0.008 (0.6)

实施例 I.58 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $d_6$ -DMSO) :

= 8.539 (0.4) ; 8.336 (10.3) ; 8.315 (7.2) ; 8.057 (0.4) ; 7.859 (10.1) ; 7.702 (2.7) ; 7.694 (2.7) ; 7.667 (2.5) ; 7.660 (2.6) ; 7.547 (8.9) ; 7.490 (1.7) ; 7.461 (4.2) ; 7.434 (3.8) ; 7.412 (3.4) ; 7.410 (3.3) ; 7.405 (3.0) ; 7.381 (1.4) ; 7.373 (1.3) ; 5.949 (0.7) ; 5.865 (9.5) ; 4.565 (0.9) ; 4.517 (5.2) ; 4.502 (5.2) ; 4.455 (1.0) ; 3.348 (18.9) ; 2.537 (3.9) ; 2.531 (7.7) ; 2.525 (10.3) ; 2.519 (7.5) ; 2.513 (3.6) ; 1.583 (16.0) ; 0.034 (0.5) ; 0.023 (11.3) ; 0.012 (0.5)

实施例 I.59 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.231 (3.2) ; 8.202 (3.3) ; 8.043 (7.2) ; 8.005 (0.3) ; 7.952 (8.0) ; 7.572 (0.8) ; 7.561 (7.5) ; 7.554 (2.3) ; 7.538 (2.4) ; 7.531 (8.4) ; 7.521 (0.9) ; 7.300 (36.8) ; 7.137 (0.9) ; 7.126 (8.6) ; 7.119 (2.5) ; 7.104 (2.3) ; 7.097 (7.4) ; 7.086 (0.7) ; 7.033 (3.8) ; 7.004 (3.6) ; 5.339 (8.7) ; 4.761 (2.9) ; 4.714 (8.4) ; 4.554 (4.7) ; 4.506 (3.0) ; 2.996 (0.6) ; 2.923 (0.5) ; 1.678 (16.0) ; 1.604 (13.6) ; 1.306 (0.5) ; 1.292 (1.0) ; 1.283 (0.6) ; 0.108 (5.8) ; 0.049 (1.1) ; 0.038 (37.9) ; 0.027 (1.4)

实施例 I.60 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.172 (3.7) ; 8.147 (10.6) ; 8.063 (8.6) ; 7.875 (0.9) ; 7.864 (7.6) ; 7.857 (2.5) ; 7.841 (2.6) ; 7.833 (8.6) ; 7.823 (1.1) ; 7.646 (0.8) ; 7.365 (4.8) ; 7.334 (4.4) ; 7.300 (127.8) ; 7.241 (3.9) ; 7.213 (3.6) ; 6.949 (0.8) ; 5.573 (1.4) ; 5.547 (1.4) ; 5.340 (16.0) ; 4.547 (1.7) ; 4.539 (1.7) ; 4.500 (2.7) ; 4.492 (2.6) ; 4.330 (2.7) ; 4.304 (2.6) ; 4.284 (1.7) ; 4.257 (1.8) ; 4.025 (2.6) ; 1.663 (0.5) ; 1.596 (86.9) ; 1.410 (0.3) ; 1.349 (0.6) ; 1.321 (0.8) ; 1.307 (1.2) ; 1.292 (1.8) ; 1.284 (1.3) ; 1.260 (0.6) ; 0

10

20

30

40

50

. 919 (0.6) ; 0.892 (0.5) ; 0.866 (0.4) ; 0.854 (0.4) ; 0.233 (0.5)  
) ; 0.119 (1.1) ; 0.107 (26.2) ; 0.095 (1.0) ; 0.049 (4.5) ; 0.038  
(124.6) ; 0.027 (4.6) ; 0.009 (0.4) ; -0.029 (0.5) ; -0.160 (0.5  
)

实施例 I . 61 :  $^1\text{H}$  - NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 9.881 (0.4) ; 8.157 (6.4) ; 8.144 (15.5) ; 8.128 (6.6) ; 8.060  
(16.0) ; 7.736 (8.7) ; 7.707 (10.2) ; 7.646 (0.9) ; 7.373 (9.5) ;  
7.345 (8.3) ; 7.300 (151.7) ; 7.233 (0.6) ; 7.220 (6.7) ; 7.192 (6  
.2) ; 6.949 (0.9) ; 5.566 (2.2) ; 5.543 (2.2) ; 5.340 (1.2) ; 4.5  
43 (2.9) ; 4.536 (3.1) ; 4.497 (4.7) ; 4.489 (4.4) ; 4.327 (4.4) ;  
4.300 (4.4) ; 4.280 (3.2) ; 4.254 (3.0) ; 4.024 (5.3) ; 4.013 (5.  
2) ; 2.260 (0.4) ; 1.727 (0.3) ; 1.593 (37.5) ; 1.519 (0.3) ; 1.44  
1 (0.3) ; 1.410 (0.7) ; 1.372 (1.0) ; 1.324 (2.0) ; 1.293 (3.9) ;  
1.213 (0.4) ; 1.207 (0.4) ; 1.181 (0.3) ; 0.942 (0.7) ; 0.919 (1.1  
) ; 0.894 (1.0) ; 0.866 (1.2) ; 0.234 (0.7) ; 0.108 (3.3) ; 0.049  
(5.2) ; 0.038 (165.4) ; 0.028 (5.9) ; -0.029 (0.6) ; -0.159 (0.5  
)

实施例 I . 62 :  $^1\text{H}$  - NMR (300.2 MHz,  $d_6$  - DMSO) :

= 8.432 (0.5) ; 8.383 (6.8) ; 8.339 (0.5) ; 8.333 (0.4) ; 8.314  
(0.4) ; 8.264 (0.3) ; 8.184 (3.3) ; 8.155 (3.6) ; 8.045 (6.1) ; 8  
.015 (6.8) ; 7.890 (6.5) ; 7.537 (0.4) ; 7.452 (6.0) ; 7.423 (6.2  
) ; 7.381 (3.6) ; 5.944 (6.6) ; 5.793 (8.8) ; 5.756 (0.4) ; 4.637  
(0.3) ; 4.608 (1.1) ; 4.558 (5.8) ; 4.545 (6.1) ; 4.497 (1.1) ; 3  
.363 (10.9) ; 2.648 (0.4) ; 2.627 (0.6) ; 2.535 (23.4) ; 2.388 (0.  
4) ; 1.699 (0.3) ; 1.599 (16.0) ; 1.273 (0.6) ; 0.094 (0.4) ; 0.03  
2 (10.8)

实施例 I . 63 :  $^1\text{H}$  - NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.386 (8.8) ; 8.163 (0.4) ; 8.141 (12.3) ; 8.045 (12.9) ; 7.64  
6 (0.5) ; 7.601 (1.4) ; 7.591 (12.3) ; 7.584 (4.1) ; 7.568 (4.1) ;  
7.561 (14.1) ; 7.550 (1.6) ; 7.300 (117.8) ; 7.233 (3.1) ; 7.201 (  
9.0) ; 7.103 (1.4) ; 7.092 (14.0) ; 7.085 (4.3) ; 7.069 (3.9) ; 7  
.062 (12.6) ; 7.051 (6.7) ; 6.949 (0.6) ; 6.868 (3.2) ; 5.410 (2.0  
) ; 5.396 (1.8) ; 5.383 (2.1) ; 5.340 (16.0) ; 4.500 (0.9) ; 4.488  
(1.4) ; 4.453 (5.6) ; 4.441 (5.7) ; 4.437 (6.3) ; 4.409 (4.7) ; 4  
.390 (1.0) ; 4.362 (1.3) ; 3.956 (8.5) ; 3.945 (8.5) ; 2.438 (0.4  
) ; 1.592 (49.0) ; 1.293 (1.3) ; 0.920 (0.3) ; 0.234 (0.6) ; 0.108  
(3.4) ; 0.050 (4.1) ; 0.039 (124.2) ; 0.028 (4.4) ; -0.160 (0.5)

实施例 I . 64 :  $^1\text{H}$  - NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.160 (3.6) ; 8.105 (5.2) ; 8.006 (5.6) ; 7.840 (1.4) ; 7.659  
(1.6) ; 7.654 (1.6) ; 7.473 (1.5) ; 7.446 (0.5) ; 7.435 (4.9) ; 7  
.427 (1.6) ; 7.412 (1.7) ; 7.405 (6.0) ; 7.394 (0.6) ; 7.356 (3.6  
) ; 7.300 (14.9) ; 7.145 (0.7) ; 7.134 (6.1) ; 7.126 (1.8) ; 7.111  
(1.6) ; 7.104 (4.8) ; 7.093 (0.4) ; 4.655 (1.8) ; 4.607 (2.7) ; 4  
.592 (2.8) ; 4.385 (3.2) ; 4.338 (2.4) ; 2.047 (1.9) ; 1.632 (6.3  
) ; 1.613 (16.0) ; 1.291 (0.7) ; 0.107 (3.4) ; 0.037 (9.5) ; 0.026  
(0.4)

实施例 I . 65 :  $^1\text{H}$  - NMR (300.2 MHz,  $d_6$  - DMSO) :

= 8.381 (9.7) ; 8.172 (3.2) ; 8.143 (3.5) ; 7.889 (10.0) ; 7.872  
(5.0) ; 7.843 (5.6) ; 7.452 (5.3) ; 7.424 (4.8) ; 7.376 (4.2) ; 7  
.347 (4.0) ; 5.933 (6.7) ; 5.902 (0.5) ; 4.603 (0.9) ; 4.556 (5.1

10

20

30

40

50

); 4.541 (5.1); 4.494 (0.9); 3.361 (24.8); 2.547 (3.8); 2.541 (7.9); 2.535 (10.8); 2.529 (7.9); 2.523 (3.7); 2.108 (4.3); 1.598 (16.0); 0.032 (4.5)

実施例 1.66:  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ):

= 8.258 (3.0); 8.229 (3.2); 8.043 (6.3); 7.951 (7.2); 7.302 (7.9); 7.269 (2.0); 7.261 (3.2); 7.231 (5.6); 7.208 (7.4); 7.203 (3.5); 7.179 (0.8); 7.172 (0.7); 7.136 (3.6); 7.107 (3.4); 4.733 (2.6); 4.702 (4.8); 4.686 (4.4); 4.550 (4.4); 4.503 (2.7); 1.668 (16.0); 1.648 (3.7); 0.109 (0.9); 0.049 (0.4); 0.038 (8.0); 0.028 (0.3)

10

実施例 1.67:  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ):

= 8.227 (3.1); 8.198 (3.2); 8.047 (7.0); 7.944 (7.5); 7.423 (0.7); 7.412 (6.6); 7.405 (2.2); 7.390 (2.5); 7.383 (8.3); 7.372 (0.9); 7.301 (7.7); 7.188 (1.0); 7.177 (8.5); 7.169 (2.4); 7.154 (2.2); 7.147 (6.4); 7.136 (0.6); 7.030 (3.7); 7.001 (3.5); 5.338 (1.7); 4.759 (7.7); 4.706 (4.2); 4.554 (4.5); 4.506 (2.9); 1.677 (16.0); 1.660 (2.0); 1.292 (1.8); 0.108 (0.4); 0.038 (7.7)

実施例 1.68:  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $d_6$ -DMSO):

= 8.478 (14.2); 8.223 (12.7); 7.975 (14.2); 7.539 (1.1); 7.527 (11.7); 7.520 (3.9); 7.505 (4.6); 7.498 (14.1); 7.486 (1.6); 7.307 (15.3); 7.241 (1.6); 7.230 (14.5); 7.223 (4.3); 7.208 (4.2); 7.200 (11.3); 7.189 (1.2); 6.100 (7.2); 6.084 (7.4); 5.786 (16.0); 5.274 (1.3); 5.256 (3.1); 5.236 (3.3); 5.219 (1.4); 4.445 (0.4); 4.416 (9.4); 4.398 (6.8); 3.353 (42.4); 2.754 (0.3); 2.534 (33.1); 2.528 (43.2); 2.522 (30.5); 1.261 (0.8); 0.037 (1.6); 0.026 (43.6); 0.015 (1.5)

20

実施例 1.69:  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ):

= 8.538 (13.2); 8.208 (0.4); 8.143 (0.3); 8.113 (14.6); 8.057 (0.5); 8.026 (0.5); 8.020 (0.3); 8.016 (0.3); 7.934 (16.0); 7.744 (9.4); 7.716 (10.5); 7.670 (0.4); 7.373 (15.2); 7.352 (0.6); 7.302 (20.9); 7.278 (9.0); 6.321 (2.7); 6.286 (3.0); 6.264 (3.1); 6.229 (3.3); 5.507 (0.5); 5.427 (8.8); 5.372 (12.5); 5.338 (8.3); 5.223 (0.5); 5.201 (0.4); 4.816 (10.5); 4.775 (5.7); 4.728 (9.9); 4.619 (9.7); 4.571 (5.4); 1.690 (1.9); 1.294 (1.0); 0.110 (1.3); 0.039 (8.0); 0.028 (0.5)

30

実施例 1.70:  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ):

= 8.193 (6.1); 8.164 (6.7); 8.139 (15.6); 8.059 (16.0); 7.646 (0.7); 7.350 (7.0); 7.321 (6.9); 7.300 (146.0); 7.135 (1.4); 7.124 (2.8); 7.113 (14.4); 7.089 (14.0); 7.078 (2.7); 7.067 (1.3); 6.949 (0.8); 5.539 (2.3); 5.514 (2.3); 5.385 (0.4); 4.521 (2.9); 4.513 (3.2); 4.474 (4.6); 4.466 (4.5); 4.306 (4.7); 4.279 (4.4); 4.259 (3.2); 4.232 (2.9); 4.001 (9.0); 3.989 (8.9); 2.282 (0.3); 2.260 (0.3); 2.047 (0.3); 1.590 (65.8); 1.538 (0.3); 1.346 (0.9); 1.305 (1.5); 1.293 (2.2); 0.919 (0.7); 0.896 (0.5); 0.234 (0.7); 0.108 (26.4); 0.049 (5.0); 0.039 (156.4); 0.028 (6.1); -0.160 (0.7)

40

実施例 1.71:  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $d_6$ -DMSO):

= 15.167 (0.3); 13.267 (0.3); 12.426 (0.3); 8.396 (0.5); 8.361 (15.7); 8.236 (0.4); 8.229 (0.6); 8.206 (5.2); 8.177 (5.3)

50

; 7.892 (0.3) ; 7.832 (15.6) ; 7.548 (1.8) ; 7.537 (12.2) ; 7.530 (4.2) ; 7.515 (4.8) ; 7.508 (14.8) ; 7.497 (1.3) ; 7.315 (0.5) ; 7.289 (2.2) ; 7.278 (15.6) ; 7.270 (5.8) ; 7.264 (7.6) ; 7.255 (4.8) ; 7.248 (12.3) ; 7.235 (7.0) ; 6.331 (0.3) ; 5.297 (14.6) ; 4.785 (4.0) ; 4.737 (6.0) ; 4.580 (5.7) ; 4.532 (3.9) ; 4.380 (0.5) ; 4.152 (1.4) ; 4.134 (3.9) ; 4.117 (4.3) ; 4.099 (1.3) ; 3.491 (0.4) ; 3.445 (0.5) ; 3.419 (0.6) ; 3.353 (79.3) ; 3.202 (16.7) ; 3.185 (16.0) ; 2.761 (0.4) ; 2.755 (0.4) ; 2.534 (37.5) ; 2.528 (50.5) ; 2.522 (36.5) ; 2.297 (0.5) ; 1.621 (0.7) ; 1.607 (1.4) ; 1.597 (1.5) ; 1.579 (2.6) ; 1.560 (1.7) ; 1.534 (0.8) ; 1.325 (0.4) ; 1.312 (0.4) ; 1.263 (1.1) ; 1.104 (0.6) ; 1.081 (1.4) ; 1.057 (0.5) ; 0.881 (0.4) ; 0.620 (0.6) ; 0.607 (1.3) ; 0.588 (2.1) ; 0.572 (2.5) ; 0.557 (2.0) ; 0.539 (0.8) ; 0.467 (0.6) ; 0.436 (1.6) ; 0.415 (1.8) ; 0.376 (1.0) ; 0.352 (1.0) ; 0.341 (1.4) ; 0.323 (2.2) ; 0.312 (2.1) ; 0.297 (2.5) ; 0.280 (2.6) ; 0.266 (2.7) ; 0.248 (2.2) ; 0.037 (2.0) ; 0.026 (51.2) ; 0.015 (2.4) ; -0.173 (0.4) ; -3.527 (0.4)

10

実施例 I.72 :  $^1\text{H}$ -NMR (499.9 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.565 (0.3) ; 8.115 (0.4) ; 7.977 (0.4) ; 7.274 (0.5) ; 7.261 (1.1) ; 5.298 (16.0) ; 1.561 (0.7) ; 0.000 (0.8)

20

実施例 I.73 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $d_6$ -DMSO) :

= 8.471 (16.0) ; 8.108 (5.9) ; 8.079 (6.5) ; 7.975 (15.7) ; 7.677 (1.4) ; 7.666 (13.7) ; 7.659 (4.1) ; 7.644 (4.6) ; 7.637 (14.5) ; 7.626 (1.5) ; 7.296 (5.6) ; 7.267 (5.2) ; 7.217 (1.7) ; 7.206 (15.6) ; 7.199 (4.4) ; 7.184 (4.4) ; 7.177 (12.9) ; 7.165 (1.2) ; 7.147 (3.0) ; 6.969 (6.4) ; 6.790 (3.2) ; 6.114 (7.2) ; 6.099 (7.4) ; 5.785 (1.5) ; 5.377 (2.2) ; 5.367 (2.3) ; 5.355 (2.3) ; 4.445 (1.4) ; 4.420 (1.2) ; 4.400 (4.1) ; 4.373 (4.3) ; 4.361 (4.2) ; 4.347 (4.1) ; 4.314 (1.4) ; 4.300 (1.1) ; 3.349 (65.1) ; 2.762 (0.4) ; 2.541 (19.3) ; 2.535 (40.9) ; 2.529 (55.5) ; 2.523 (39.2) ; 2.517 (17.8) ; 2.305 (0.3) ; 1.275 (0.6) ; 1.264 (0.7) ; 0.223 (0.4) ; 0.038 (2.1) ; 0.027 (63.3) ; 0.016 (2.0)

30

実施例 I.74 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $d_6$ -DMSO) :

= 8.488 (16.0) ; 8.298 (5.9) ; 8.269 (6.4) ; 7.992 (15.3) ; 7.710 (8.2) ; 7.682 (9.6) ; 7.496 (6.7) ; 7.467 (6.3) ; 7.393 (10.8) ; 7.365 (9.0) ; 7.291 (3.4) ; 7.105 (7.4) ; 6.919 (3.6) ; 6.209 (7.0) ; 6.193 (7.3) ; 5.786 (1.0) ; 5.286 (2.3) ; 5.274 (2.5) ; 4.464 (1.9) ; 4.437 (1.8) ; 4.418 (3.9) ; 4.390 (3.8) ; 4.343 (3.8) ; 4.331 (3.9) ; 4.296 (1.9) ; 4.284 (1.7) ; 3.358 (44.1) ; 3.046 (0.5) ; 2.534 (9.3) ; 2.528 (12.2) ; 2.523 (9.0) ; 1.262 (0.7) ; 0.026 (5.7)

40

実施例 I.75 :  $^1\text{H}$ -NMR (499.9 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.113 (1.8) ; 8.095 (1.9) ; 8.027 (3.6) ; 7.890 (3.9) ; 7.264 (1.9) ; 7.259 (0.5) ; 7.254 (3.2) ; 7.237 (4.0) ; 7.094 (0.6) ; 7.088 (4.2) ; 7.085 (1.7) ; 7.075 (1.3) ; 7.071 (3.5) ; 6.886 (2.2) ; 6.868 (2.1) ; 4.684 (1.7) ; 4.655 (2.3) ; 4.509 (2.5) ; 4.481 (1.8) ; 2.961 (0.3) ; 2.947 (0.9) ; 2.933 (1.2) ; 2.919 (0.9) ; 2.906 (0.4) ; 1.634 (9.6) ; 1.274 (15.8) ; 1.260 (16.0) ; 0.000 (1.7)

実施例 I.76 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

50

= 8.411 (9.1) ; 7.994 (11.0) ; 7.980 (0.5) ; 7.912 (11.4) ; 7.742 (6.3) ; 7.713 (7.2) ; 7.354 (10.9) ; 7.302 (12.7) ; 7.276 (6.1) ; 4.732 (4.0) ; 4.684 (13.3) ; 4.524 (6.3) ; 4.476 (4.1) ; 2.196 (0.4) ; 2.172 (1.4) ; 2.147 (1.9) ; 2.123 (2.3) ; 2.099 (2.0) ; 2.074 (0.6) ; 2.042 (2.4) ; 1.904 (0.5) ; 1.879 (1.9) ; 1.855 (2.4) ; 1.831 (2.0) ; 1.807 (1.5) ; 1.783 (0.6) ; 1.737 (0.9) ; 1.292 (0.3) ; 0.924 (7.5) ; 0.900 (16.0) ; 0.875 (6.9) ; 0.109 (0.5) ; 0.037 (4.4)

実施例 I . 77 :  $^1\text{H}$  - NMR (499.9 MHz,  $\text{d}_6$  - DMSO) :

= 8.502 (1.5) ; 8.378 (1.0) ; 8.361 (1.0) ; 8.339 (6.0) ; 8.009 (1.4) ; 7.827 (3.4) ; 7.811 (3.7) ; 7.799 (5.4) ; 7.261 (0.6) ; 7.251 (0.7) ; 7.242 (0.9) ; 7.233 (0.9) ; 7.199 (0.8) ; 7.188 (1.9) ; 7.181 (6.8) ; 7.176 (7.1) ; 7.171 (5.5) ; 7.160 (5.0) ; 7.148 (1.3) ; 7.140 (2.2) ; 7.133 (1.6) ; 7.123 (2.6) ; 7.115 (2.4) ; 7.097 (4.9) ; 7.080 (3.4) ; 7.073 (0.5) ; 7.041 (3.6) ; 7.031 (3.8) ; 7.023 (2.3) ; 7.018 (1.2) ; 7.013 (2.0) ; 6.835 (1.0) ; 6.819 (1.0) ; 6.523 (3.6) ; 6.506 (3.6) ; 5.897 (2.7) ; 5.844 (4.9) ; 5.754 (3.5) ; 4.745 (2.2) ; 4.717 (2.8) ; 4.564 (2.9) ; 4.536 (2.2) ; 3.324 (9.8) ; 2.502 (4.9) ; 1.590 (16.0) ; 1.235 (1.0) ; 0.000 (1.0)

実施例 I . 78 :  $^1\text{H}$  - NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.488 (5.3) ; 8.039 (2.3) ; 7.895 (2.8) ; 7.702 (2.5) ; 7.674 (2.8) ; 7.298 (3.4) ; 7.247 (2.7) ; 7.219 (2.4) ; 6.977 (5.9) ; 5.333 (11.1) ; 5.205 (1.9) ; 5.158 (2.2) ; 4.573 (2.3) ; 4.526 (2.0) ; 1.743 (16.0) ; 1.290 (0.4) ; 0.034 (3.5)

実施例 I . 79 :  $^1\text{H}$  - NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.133 (5.0) ; 8.099 (1.7) ; 8.033 (3.9) ; 8.012 (0.5) ; 7.325 (1.0) ; 7.316 (0.7) ; 7.313 (0.7) ; 7.300 (15.8) ; 7.295 (5.1) ; 7.294 (5.0) ; 7.285 (2.5) ; 7.277 (7.1) ; 7.268 (1.2) ; 7.256 (0.9) ; 7.248 (1.3) ; 7.171 (2.0) ; 7.142 (1.9) ; 5.552 (0.8) ; 5.527 (0.8) ; 5.339 (16.0) ; 4.530 (0.8) ; 4.522 (0.9) ; 4.483 (1.3) ; 4.476 (1.3) ; 4.312 (1.2) ; 4.285 (1.2) ; 4.265 (0.8) ; 4.238 (0.8) ; 4.156 (0.7) ; 1.627 (0.9) ; 1.304 (0.4) ; 1.293 (0.4) ; 1.280 (0.4) ; 0.108 (1.9) ; 0.049 (0.7) ; 0.038 (15.8) ; 0.027 (0.6)

実施例 I . 80 :  $^1\text{H}$  - NMR (300.2 MHz,  $\text{d}_6$  - DMSO) :

= 8.362 (11.2) ; 8.206 (3.8) ; 8.177 (4.0) ; 7.832 (11.0) ; 7.537 (8.6) ; 7.530 (3.0) ; 7.515 (3.7) ; 7.508 (10.5) ; 7.496 (1.1) ; 7.288 (1.5) ; 7.278 (10.9) ; 7.270 (4.5) ; 7.265 (5.6) ; 7.255 (3.7) ; 7.248 (8.7) ; 7.236 (5.4) ; 5.297 (10.6) ; 4.785 (3.0) ; 4.738 (4.4) ; 4.581 (4.4) ; 4.533 (2.9) ; 4.396 (0.4) ; 4.380 (0.8) ; 4.362 (0.4) ; 4.152 (1.3) ; 4.135 (4.1) ; 4.117 (4.2) ; 4.100 (1.6) ; 3.485 (0.7) ; 3.469 (0.6) ; 3.462 (0.5) ; 3.445 (0.6) ; 3.354 (53.8) ; 3.202 (16.6) ; 3.185 (16.0) ; 2.534 (23.6) ; 2.528 (30.7) ; 2.522 (22.1) ; 1.624 (0.5) ; 1.595 (1.1) ; 1.578 (1.9) ; 1.562 (1.3) ; 1.534 (0.5) ; 1.266 (0.5) ; 1.104 (1.1) ; 1.081 (2.0) ; 1.058 (1.0) ; 0.603 (1.0) ; 0.589 (1.7) ; 0.573 (1.8) ; 0.557 (1.4) ; 0.468 (0.4) ; 0.437 (1.2) ; 0.417 (1.6) ; 0.376 (0.8) ; 0.339 (1.1) ; 0.324 (1.5) ; 0.312 (1.7) ; 0.295 (1.9) ; 0.280 (1.9) ; 0.266 (2.0) ; 0.247 (1.5) ; 0.237 (1.0) ; 0.026 (30.3)

実施例 I . 81 :  $^1\text{H}$  - NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :



= 8.268 (5.9) ; 8.239 (6.2) ; 8.064 (14.1) ; 7.948 (16.0) ; 7.560 (1.3) ; 7.550 (13.2) ; 7.543 (4.3) ; 7.527 (4.4) ; 7.520 (15.2) ; 7.509 (1.6) ; 7.302 (2.9) ; 7.146 (1.7) ; 7.135 (15.3) ; 7.128 (4.6) ; 7.113 (4.2) ; 7.106 (13.1) ; 7.095 (1.3) ; 7.040 (7.2) ; 7.011 (6.8) ; 4.833 (5.6) ; 4.785 (8.3) ; 4.740 (7.2) ; 4.609 (8.1) ; 4.577 (0.4) ; 4.561 (5.4) ; 2.028 (0.7) ; 1.620 (3.7) ; 1.493 (0.6) ; 1.469 (1.6) ; 1.449 (2.6) ; 1.439 (1.3) ; 1.427 (1.9) ; 1.403 (0.8) ; 0.502 (0.6) ; 0.495 (0.7) ; 0.488 (1.0) ; 0.477 (1.6) ; 0.466 (1.7) ; 0.458 (2.8) ; 0.448 (1.6) ; 0.441 (1.5) ; 0.421 (0.6) ; 0.413 (0.4) ; 0.403 (0.7) ; 0.392 (0.8) ; 0.373 (4.2) ; 0.359 (10.7) ; 0.349 (6.0) ; 0.330 (7.5) ; 0.320 (2.6) ; 0.288 (0.4) ; 0.029 (1.5)

10

実施例 I . 82 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.160 (2.5) ; 8.104 (3.6) ; 8.011 (3.7) ; 7.840 (0.9) ; 7.660 (1.1) ; 7.654 (1.0) ; 7.594 (0.3) ; 7.583 (3.3) ; 7.576 (1.0) ; 7.561 (1.1) ; 7.554 (3.6) ; 7.543 (0.4) ; 7.473 (1.0) ; 7.358 (2.4) ; 7.300 (13.6) ; 7.093 (0.4) ; 7.082 (3.7) ; 7.075 (1.1) ; 7.060 (1.0) ; 7.053 (3.2) ; 5.339 (4.3) ; 4.657 (1.2) ; 4.610 (1.7) ; 4.571 (2.1) ; 4.385 (2.1) ; 4.337 (1.6) ; 1.613 (16.0) ; 1.292 (0.4) ; 0.107 (1.3) ; 0.038 (9.4) ; 0.027 (0.4)

20

実施例 I . 83 :  $^1\text{H}$ -NMR (499.9 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.567 (0.8) ; 8.116 (0.9) ; 7.984 (0.9) ; 7.836 (0.7) ; 7.818 (0.8) ; 7.286 (0.9) ; 7.260 (2.4) ; 7.239 (0.6) ; 5.298 (16.0) ; 4.110 (0.5) ; 4.103 (0.6) ; 2.004 (0.3) ; 1.556 (2.1) ; 0.000 (1.8)

実施例 I . 84 :  $^1\text{H}$ -NMR (499.9 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.238 (6.8) ; 8.221 (7.0) ; 8.021 (14.6) ; 7.923 (15.1) ; 7.522 (1.4) ; 7.516 (13.0) ; 7.512 (5.0) ; 7.502 (4.8) ; 7.498 (14.1) ; 7.492 (1.8) ; 7.262 (10.7) ; 7.107 (1.6) ; 7.101 (14.2) ; 7.097 (5.2) ; 7.087 (4.7) ; 7.083 (13.0) ; 7.077 (1.6) ; 7.006 (7.6) ; 6.988 (7.4) ; 5.297 (8.4) ; 4.794 (6.6) ; 4.765 (8.5) ; 4.679 (13.5) ; 4.574 (8.4) ; 4.545 (6.6) ; 1.608 (16.0) ; 1.443 (0.8) ; 1.429 (2.0) ; 1.416 (3.2) ; 1.403 (2.2) ; 1.389 (0.9) ; 1.256 (0.5) ; 0.460 (1.3) ; 0.449 (2.5) ; 0.445 (2.6) ; 0.438 (3.4) ; 0.427 (2.1) ; 0.416 (0.3) ; 0.357 (0.5) ; 0.344 (2.3) ; 0.341 (3.5) ; 0.330 (7.2) ; 0.328 (7.2) ; 0.317 (8.1) ; 0.305 (4.4) ; 0.302 (4.0) ; 0.291 (1.9) ; 0.278 (0.7) ; 0.000 (9.6)

30

実施例 I . 85 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.139 (10.5) ; 8.067 (3.3) ; 8.037 (3.5) ; 7.996 (13.1) ; 7.583 (1.5) ; 7.572 (14.3) ; 7.565 (4.4) ; 7.550 (4.8) ; 7.543 (16.0) ; 7.532 (1.7) ; 7.300 (15.1) ; 7.156 (2.0) ; 7.145 (18.0) ; 7.140 (11.0) ; 7.122 (4.9) ; 7.115 (15.7) ; 7.111 (8.9) ; 6.001 (1.1) ; 5.337 (3.6) ; 4.954 (1.9) ; 4.905 (6.2) ; 4.863 (7.8) ; 4.815 (2.6) ; 2.216 (0.4) ; 2.211 (0.8) ; 1.723 (0.6) ; 1.666 (0.8) ; 1.409 (0.5) ; 1.372 (0.7) ; 1.346 (0.7) ; 1.339 (0.7) ; 1.321 (1.4) ; 1.293 (7.8) ; 1.258 (0.8) ; 1.216 (0.4) ; 1.201 (0.4) ; 1.074 (0.5) ; 0.966 (0.3) ; 0.937 (0.8) ; 0.917 (1.5) ; 0.892 (1.6) ; 0.865 (1.6) ; 0.108 (3.6) ; 0.048 (0.4) ; 0.037 (13.4) ; 0.026 (0.6)

40

実施例 I . 86 :  $^1\text{H}$ -NMR (499.9 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.115 (0.4) ; 7.972 (0.4) ; 7.817 (0.3) ; 7.286 (0.3) ; 7.261

50

(0.8) ; 5.299 (16.0) ; 1.567 (0.5) ; 0.000 (0.6)

实施例 1.87 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $d_6$ -DMSO) :

= 8.371 (10.5) ; 8.344 (0.6) ; 8.259 (3.5) ; 8.230 (3.8) ; 7.936 (0.4) ; 7.862 (6.1) ; 7.836 (16.0) ; 7.490 (0.7) ; 7.446 (6.4) ; 7.418 (5.5) ; 7.364 (4.7) ; 7.335 (4.4) ; 5.326 (10.2) ; 5.166 (0.6) ; 4.804 (2.8) ; 4.756 (4.0) ; 4.593 (4.0) ; 4.568 (0.4) ; 4.545 (2.7) ; 3.353 (24.0) ; 2.641 (0.4) ; 2.618 (0.4) ; 2.535 (4.9) ; 2.529 (6.5) ; 2.523 (4.8) ; 2.101 (0.3) ; 1.643 (0.4) ; 1.624 (1.0) ; 1.616 (1.2) ; 1.593 (3.1) ; 1.573 (5.3) ; 1.553 (0.7) ; 1.450 (2.0) ; 0.640 (0.3) ; 0.624 (0.9) ; 0.610 (1.5) ; 0.593 (1.7) ; 0.579 (1.3) ; 0.563 (0.6) ; 0.482 (0.4) ; 0.454 (1.1) ; 0.433 (1.4) ; 0.420 (1.3) ; 0.405 (0.9) ; 0.392 (0.7) ; 0.368 (0.7) ; 0.355 (1.1) ; 0.339 (1.5) ; 0.327 (1.6) ; 0.310 (1.7) ; 0.297 (2.0) ; 0.284 (2.0) ; 0.265 (1.6) ; 0.252 (1.0) ; 0.025 (4.3)

实施例 1.88 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.362 (11.7) ; 8.154 (10.1) ; 7.999 (12.2) ; 7.977 (0.4) ; 7.728 (7.6) ; 7.700 (8.7) ; 7.298 (34.0) ; 7.289 (8.6) ; 7.261 (7.2) ; 7.077 (16.0) ; 5.483 (2.1) ; 5.457 (2.2) ; 5.337 (8.0) ; 4.623 (3.2) ; 4.615 (3.1) ; 4.576 (4.2) ; 4.568 (4.2) ; 4.351 (4.0) ; 4.324 (3.8) ; 4.305 (2.9) ; 4.278 (2.9) ; 4.161 (2.1) ; 3.992 (0.4) ; 1.633 (4.5) ; 1.320 (0.4) ; 1.292 (1.2) ; 1.278 (0.5) ; 0.916 (0.4) ; 0.889 (0.3) ; 0.866 (0.4) ; 0.107 (0.6) ; 0.047 (1.1) ; 0.036 (34.2) ; 0.025 (1.4)

实施例 1.89 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.297 (2.9) ; 8.268 (3.1) ; 8.053 (7.1) ; 7.963 (5.5) ; 7.300 (21.3) ; 7.237 (3.7) ; 7.208 (3.5) ; 7.118 (0.7) ; 7.107 (1.3) ; 7.096 (6.9) ; 7.072 (6.7) ; 7.061 (1.2) ; 7.050 (0.6) ; 4.715 (2.1) ; 4.667 (3.9) ; 4.650 (1.7) ; 4.631 (0.9) ; 4.552 (4.9) ; 4.504 (2.8) ; 1.657 (16.0) ; 1.612 (2.8) ; 1.598 (3.3) ; 1.292 (0.5) ; 0.107 (5.8) ; 0.048 (0.5) ; 0.037 (14.7) ; 0.026 (0.5)

实施例 1.90 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.149 (6.4) ; 8.131 (15.9) ; 8.120 (6.6) ; 8.048 (16.0) ; 7.646 (0.4) ; 7.300 (87.7) ; 7.284 (4.7) ; 7.277 (5.6) ; 7.252 (8.6) ; 7.243 (11.8) ; 7.223 (22.1) ; 7.197 (1.5) ; 7.189 (1.4) ; 6.949 (0.5) ; 5.541 (2.3) ; 5.515 (2.5) ; 5.339 (1.8) ; 4.521 (3.1) ; 4.513 (3.1) ; 4.474 (4.7) ; 4.467 (4.5) ; 4.308 (4.7) ; 4.281 (4.4) ; 4.261 (3.1) ; 4.234 (3.1) ; 4.034 (5.3) ; 4.024 (5.2) ; 1.599 (21.4) ; 1.350 (0.5) ; 1.324 (0.7) ; 1.292 (1.6) ; 0.922 (0.4) ; 0.234 (0.4) ; 0.108 (22.6) ; 0.096 (0.8) ; 0.049 (3.4) ; 0.039 (97.6) ; 0.028 (3.5) ; 0.014 (0.4)

实施例 1.91 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $d_6$ -DMSO) :

= 8.362 (14.8) ; 8.344 (1.3) ; 8.206 (4.9) ; 8.177 (5.2) ; 7.964 (0.4) ; 7.934 (0.4) ; 7.832 (16.0) ; 7.548 (1.3) ; 7.537 (11.7) ; 7.529 (4.0) ; 7.514 (4.4) ; 7.507 (14.2) ; 7.496 (1.4) ; 7.288 (1.9) ; 7.277 (14.8) ; 7.270 (5.4) ; 7.264 (7.4) ; 7.255 (4.5) ; 7.248 (11.7) ; 7.235 (6.9) ; 6.890 (0.4) ; 6.861 (0.4) ; 5.297 (14.1) ; 5.169 (1.0) ; 4.786 (3.8) ; 4.738 (5.8) ; 4.690 (0.5) ; 4.581 (5.6) ; 4.533 (3.8) ; 3.357 (45.4) ; 2.534 (7.8) ; 2.528 (10.3) ; 2.522 (7.4) ; 2.101 (4.0) ; 1.623 (0.7) ; 1.602 (2.5) ; 1.572 (9.0) ; 1.553 (1.5) ; 1.534 (0.8) ; 1.261 (0.6) ; 0.621 (0.5) ; 0.604

10

20

30

40

50

(1.3) ; 0.589 (2.1) ; 0.572 (2.3) ; 0.558 (1.7) ; 0.541 (0.8) ; 0.465 (0.5) ; 0.436 (1.5) ; 0.416 (1.9) ; 0.404 (1.8) ; 0.388 (1.3) ; 0.376 (1.0) ; 0.353 (1.0) ; 0.341 (1.4) ; 0.323 (2.0) ; 0.312 (2.3) ; 0.295 (2.4) ; 0.280 (2.6) ; 0.267 (2.8) ; 0.248 (2.1) ; 0.236 (1.2) ; 0.036 (0.5) ; 0.025 (8.6) ; 0.014 (0.3)

实施例 1.92 :  $^1\text{H}$ -NMR (499.9 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.565 (0.8) ; 8.114 (1.0) ; 7.975 (1.0) ; 7.709 (0.7) ; 7.692 (0.8) ; 7.274 (1.3) ; 7.260 (2.9) ; 5.298 (16.0) ; 4.440 (0.3) ; 4.436 (0.3) ; 4.139 (0.5) ; 4.132 (0.6) ; 1.563 (1.7) ; 0.000 (2.0)

实施例 1.93 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.307 (6.4) ; 8.278 (6.7) ; 8.167 (0.5) ; 8.071 (14.1) ; 8.054 (1.1) ; 7.969 (16.0) ; 7.606 (7.5) ; 7.578 (9.2) ; 7.342 (10.5) ; 7.313 (8.5) ; 7.301 (16.3) ; 7.272 (0.6) ; 7.225 (0.8) ; 7.200 (0.4) ; 7.084 (7.7) ; 7.055 (7.4) ; 6.902 (3.9) ; 6.714 (7.9) ; 6.526 (4.0) ; 5.338 (1.9) ; 4.852 (6.2) ; 4.805 (9.2) ; 4.747 (14.0) ; 4.627 (9.0) ; 4.579 (6.0) ; 2.995 (6.6) ; 2.922 (5.7) ; 2.394 (2.3) ; 1.660 (13.4) ; 1.505 (0.7) ; 1.483 (1.8) ; 1.461 (2.8) ; 1.440 (2.0) ; 1.416 (0.8) ; 0.513 (1.0) ; 0.497 (2.0) ; 0.484 (2.1) ; 0.476 (2.6) ; 0.467 (1.7) ; 0.461 (1.9) ; 0.437 (0.7) ; 0.429 (0.4) ; 0.416 (0.9) ; 0.407 (0.9) ; 0.399 (2.6) ; 0.392 (3.3) ; 0.371 (8.5) ; 0.361 (3.5) ; 0.353 (6.5) ; 0.343 (6.4) ; 0.330 (1.9) ; 0.302 (0.4) ; 0.110 (1.3) ; 0.049 (0.5) ; 0.038 (13.4) ; 0.027 (0.5)

实施例 1.94 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.385 (6.4) ; 8.140 (8.7) ; 8.036 (9.1) ; 7.453 (1.0) ; 7.442 (8.1) ; 7.435 (3.0) ; 7.420 (3.1) ; 7.412 (10.0) ; 7.402 (1.3) ; 7.337 (0.4) ; 7.328 (0.4) ; 7.300 (55.7) ; 7.235 (2.3) ; 7.199 (6.5) ; 7.155 (1.3) ; 7.144 (9.8) ; 7.137 (3.2) ; 7.122 (2.9) ; 7.114 (8.0) ; 7.103 (1.0) ; 7.053 (4.1) ; 6.949 (0.3) ; 6.871 (2.3) ; 5.409 (1.4) ; 5.394 (1.3) ; 5.381 (1.6) ; 5.340 (11.4) ; 4.499 (0.7) ; 4.487 (1.0) ; 4.452 (4.0) ; 4.440 (4.2) ; 4.434 (4.4) ; 4.407 (3.3) ; 4.388 (0.8) ; 4.360 (1.0) ; 4.019 (4.2) ; 4.008 (4.2) ; 1.607 (16.0) ; 1.326 (0.4) ; 1.292 (1.3) ; 0.108 (4.5) ; 0.050 (2.7) ; 0.039 (60.0) ; 0.028 (2.3)

实施例 1.95 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.246 (3.1) ; 8.217 (3.2) ; 8.049 (4.1) ; 7.958 (5.0) ; 7.647 (0.4) ; 7.301 (80.0) ; 7.279 (7.6) ; 7.271 (3.8) ; 7.264 (11.9) ; 7.254 (1.6) ; 7.242 (1.1) ; 7.234 (1.8) ; 7.053 (3.7) ; 7.023 (3.5) ; 6.950 (0.5) ; 5.341 (0.5) ; 4.770 (2.4) ; 4.723 (5.7) ; 4.559 (3.6) ; 4.512 (2.4) ; 1.685 (16.0) ; 1.594 (22.2) ; 1.294 (1.1) ; 0.921 (0.4) ; 0.235 (0.3) ; 0.109 (9.9) ; 0.051 (2.6) ; 0.040 (81.7) ; 0.029 (2.9) ; -0.158 (0.4)

实施例 1.96 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.220 (2.8) ; 8.191 (2.9) ; 8.052 (6.8) ; 7.941 (6.1) ; 7.422 (0.6) ; 7.411 (6.2) ; 7.404 (2.0) ; 7.388 (2.2) ; 7.381 (7.7) ; 7.370 (0.8) ; 7.301 (10.0) ; 7.186 (0.9) ; 7.176 (8.2) ; 7.168 (2.3) ; 7.153 (2.0) ; 7.146 (6.0) ; 7.135 (0.6) ; 7.027 (3.4) ; 6.998 (3.3) ; 5.337 (0.7) ; 4.777 (3.4) ; 4.770 (1.7) ; 4.748 (2.2) ; 4.701 (3.5) ; 4.553 (4.3) ; 4.505 (2.7) ; 1.676 (16.0) ; 1.290 (1.5)

10

20

30

40

50

) ; 0.106 (0.7) ; 0.036 (9.8) ; 0.025 (0.4)

实施例 I.97 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.338 (6.4) ; 8.309 (6.8) ; 8.076 (14.5) ; 7.958 (16.0) ; 7.848 (1.4) ; 7.837 (12.2) ; 7.831 (4.0) ; 7.813 (4.8) ; 7.807 (13.6) ; 7.796 (1.5) ; 7.364 (8.7) ; 7.334 (7.7) ; 7.301 (3.1) ; 7.138 (7.6) ; 7.108 (7.2) ; 4.852 (5.8) ; 4.804 (9.6) ; 4.792 (8.1) ; 4.626 (8.4) ; 4.579 (5.7) ; 2.030 (2.1) ; 1.506 (0.7) ; 1.483 (1.9) ; 1.462 (2.9) ; 1.452 (1.4) ; 1.441 (2.1) ; 1.417 (0.8) ; 0.523 (0.7) ; 0.516 (0.9) ; 0.512 (0.9) ; 0.498 (1.9) ; 0.489 (2.2) ; 0.478 (2.8) ; 0.466 (1.6) ; 0.456 (1.1) ; 0.441 (0.6) ; 0.434 (0.4) ; 0.423 (0.8) ; 0.411 (0.9) ; 0.392 (4.0) ; 0.378 (9.6) ; 0.367 (5.8) ; 0.354 (7.2) ; 0.348 (6.8) ; 0.335 (3.0) ; 0.305 (0.4) ; 0.031 (1.8)

10

实施例 I.98 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 9.258 (0.4) ; 8.164 (3.3) ; 8.134 (3.3) ; 7.992 (6.9) ; 7.915 (8.0) ; 7.419 (0.7) ; 7.409 (6.7) ; 7.401 (2.2) ; 7.386 (2.5) ; 7.379 (8.4) ; 7.368 (0.9) ; 7.301 (5.7) ; 7.194 (1.1) ; 7.184 (8.8) ; 7.176 (2.4) ; 7.161 (2.3) ; 7.154 (6.4) ; 7.143 (0.6) ; 7.010 (3.8) ; 6.981 (3.6) ; 5.337 (16.0) ; 4.782 (2.9) ; 4.734 (4.1) ; 4.560 (4.1) ; 4.513 (2.8) ; 3.445 (1.2) ; 2.182 (0.5) ; 2.168 (0.7) ; 2.135 (0.9) ; 2.127 (1.0) ; 2.122 (1.0) ; 2.097 (0.8) ; 2.081 (0.8) ; 1.803 (0.7) ; 1.791 (0.8) ; 1.763 (1.0) ; 1.749 (1.1) ; 1.717 (0.7) ; 1.703 (0.7) ; 1.425 (0.5) ; 1.417 (0.4) ; 1.403 (0.6) ; 1.396 (0.7) ; 1.378 (0.9) ; 1.363 (0.8) ; 1.354 (0.8) ; 1.335 (2.0) ; 1.311 (3.1) ; 1.288 (2.7) ; 1.265 (1.4) ; 1.240 (0.5) ; 1.078 (0.5) ; 1.056 (0.6) ; 1.034 (1.1) ; 1.018 (0.7) ; 1.010 (1.1) ; 1.001 (0.5) ; 0.993 (0.6) ; 0.985 (0.5) ; 0.978 (0.4) ; 0.898 (5.8) ; 0.875 (11.4) ; 0.850 (4.4) ; 0.108 (0.5) ; 0.037 (5.4)

20

实施例 I.99 :  $^1\text{H}$ -NMR (499.9 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.239 (5.8) ; 8.221 (6.0) ; 8.021 (12.6) ; 7.923 (13.1) ; 7.523 (1.2) ; 7.516 (11.5) ; 7.512 (4.0) ; 7.499 (12.2) ; 7.492 (1.4) ; 7.262 (10.7) ; 7.107 (1.3) ; 7.101 (12.5) ; 7.097 (4.1) ; 7.087 (4.2) ; 7.083 (11.2) ; 7.077 (1.3) ; 7.006 (6.5) ; 6.988 (6.4) ; 5.297 (9.6) ; 4.794 (5.7) ; 4.765 (7.3) ; 4.679 (11.7) ; 4.574 (7.2) ; 4.545 (5.6) ; 1.601 (16.0) ; 1.443 (0.7) ; 1.429 (1.7) ; 1.416 (2.7) ; 1.403 (1.8) ; 1.389 (0.7) ; 0.460 (1.1) ; 0.449 (2.1) ; 0.445 (2.2) ; 0.438 (2.9) ; 0.427 (1.8) ; 0.357 (0.4) ; 0.347 (1.8) ; 0.344 (2.0) ; 0.341 (2.9) ; 0.330 (6.1) ; 0.328 (6.1) ; 0.317 (7.0) ; 0.305 (3.7) ; 0.302 (3.3) ; 0.291 (1.5) ; 0.278 (0.6) ; 0.006 (0.4) ; 0.000 (9.7)

30

40

实施例 I.100 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.217 (0.6) ; 8.157 (5.0) ; 8.128 (5.0) ; 8.040 (1.7) ; 8.017 (10.9) ; 7.906 (12.1) ; 7.413 (1.0) ; 7.402 (9.8) ; 7.395 (3.3) ; 7.380 (3.6) ; 7.372 (12.8) ; 7.362 (1.4) ; 7.305 (4.2) ; 7.198 (0.3) ; 7.185 (1.4) ; 7.175 (12.9) ; 7.167 (3.9) ; 7.152 (3.2) ; 7.145 (9.8) ; 7.134 (0.9) ; 7.005 (5.8) ; 6.976 (5.5) ; 4.760 (4.1) ; 4.713 (6.5) ; 4.565 (6.6) ; 4.518 (4.2) ; 4.164 (0.6) ; 4.141 (0.6) ; 3.446 (0.4) ; 2.994 (11.4) ; 2.977 (0.5) ; 2.916 (10.2) ; 2.745 (0.4) ; 2.158 (0.7) ; 2.144 (0.9) ; 2.112 (1.4) ; 2.098 (1.5) ; 2.077 (2.5) ; 2.071 (1.5) ; 2.056 (1.3) ; 1.778 (0.9) ; 1.763

50

(1.2) ; 1.738 (1.3) ; 1.732 (1.2) ; 1.723 (1.6) ; 1.691 (1.0) ; 1.676 (1.1) ; 1.497 (0.3) ; 1.480 (0.5) ; 1.473 (0.5) ; 1.455 (1.1) ; 1.438 (1.0) ; 1.431 (1.1) ; 1.414 (1.3) ; 1.389 (0.9) ; 1.373 (0.5) ; 1.314 (0.7) ; 1.290 (1.5) ; 1.267 (0.7) ; 1.138 (0.4) ; 1.123 (0.6) ; 1.114 (0.6) ; 1.098 (1.1) ; 1.091 (0.8) ; 1.074 (1.0) ; 1.056 (1.0) ; 1.035 (0.7) ; 1.031 (0.7) ; 1.016 (0.5) ; 1.009 (0.4) ; 0.995 (0.4) ; 0.919 (8.2) ; 0.895 (16.0) ; 0.870 (6.1) ; 0.106 (1.1) ; 0.032 (3.3)

実施例 I.101 :  $^1\text{H}$ -NMR (499.9 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.187 (3.1) ; 8.169 (3.2) ; 8.001 (6.6) ; 7.910 (6.8) ; 7.521 (0.6) ; 7.514 (6.3) ; 7.510 (2.1) ; 7.501 (2.2) ; 7.497 (6.7) ; 7.490 (0.8) ; 7.260 (16.3) ; 7.088 (0.7) ; 7.082 (6.8) ; 7.078 (2.2) ; 7.068 (2.1) ; 7.064 (6.2) ; 7.058 (0.7) ; 6.989 (3.5) ; 6.971 (3.4) ; 5.298 (1.1) ; 4.707 (2.9) ; 4.678 (3.8) ; 4.662 (5.5) ; 4.508 (4.0) ; 4.479 (3.0) ; 1.639 (16.0) ; 1.559 (8.7) ; 1.255 (1.5) ; 0.006 (0.6) ; 0.000 (16.6)

10

実施例 I.102 :  $^1\text{H}$ -NMR (499.9 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.187 (3.1) ; 8.169 (3.2) ; 8.001 (6.6) ; 7.908 (6.8) ; 7.521 (0.6) ; 7.514 (6.2) ; 7.510 (2.2) ; 7.501 (2.2) ; 7.496 (6.7) ; 7.490 (0.9) ; 7.260 (13.2) ; 7.088 (0.7) ; 7.082 (6.7) ; 7.078 (2.3) ; 7.068 (2.2) ; 7.064 (6.2) ; 7.058 (0.8) ; 6.989 (3.5) ; 6.971 (3.4) ; 5.298 (1.1) ; 4.705 (2.9) ; 4.677 (3.9) ; 4.667 (7.0) ; 4.508 (4.0) ; 4.479 (3.0) ; 1.639 (16.0) ; 1.562 (10.2) ; 1.255 (0.4) ; 0.006 (0.5) ; 0.000 (13.3)

20

実施例 I.103 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.163 (4.6) ; 8.133 (4.8) ; 7.994 (10.3) ; 7.909 (11.2) ; 7.419 (0.9) ; 7.408 (9.5) ; 7.401 (3.1) ; 7.386 (3.6) ; 7.379 (11.9) ; 7.368 (1.3) ; 7.304 (5.2) ; 7.192 (1.4) ; 7.181 (12.3) ; 7.174 (3.4) ; 7.159 (3.2) ; 7.152 (9.1) ; 7.141 (0.9) ; 7.016 (5.5) ; 6.987 (5.2) ; 4.821 (2.3) ; 4.783 (4.3) ; 4.736 (6.2) ; 4.568 (6.3) ; 4.520 (4.1) ; 4.169 (0.7) ; 4.146 (0.7) ; 2.238 (0.4) ; 2.213 (1.4) ; 2.188 (2.0) ; 2.165 (2.3) ; 2.140 (1.9) ; 2.116 (0.6) ; 2.082 (3.1) ; 1.883 (0.6) ; 1.859 (1.8) ; 1.834 (2.4) ; 1.811 (2.3) ; 1.786 (2.1) ; 1.762 (1.1) ; 1.319 (0.9) ; 1.295 (1.7) ; 1.272 (0.8) ; 0.885 (7.7) ; 0.861 (16.0) ; 0.836 (7.1) ; 0.110 (0.9) ; 0.037 (2.8)

30

【 0 2 5 8 】

実施例 V.01 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 7.881 (2.8) ; 7.852 (3.0) ; 7.449 (0.6) ; 7.438 (5.9) ; 7.431 (1.9) ; 7.415 (2.3) ; 7.408 (7.3) ; 7.397 (0.8) ; 7.299 (5.2) ; 7.241 (0.5) ; 7.211 (0.6) ; 7.201 (0.9) ; 7.191 (7.6) ; 7.183 (2.2) ; 7.168 (2.5) ; 7.161 (8.8) ; 7.150 (0.7) ; 7.133 (3.0) ; 6.818 (0.5) ; 6.789 (0.4) ; 5.338 (0.5) ; 2.614 (16.0) ; 2.612 (14.4) ; 1.606 (0.5) ; 1.470 (0.9) ; 0.108 (0.4) ; 0.038 (6.2)

40

実施例 V.02 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.519 (3.7) ; 7.478 (0.4) ; 7.467 (4.5) ; 7.460 (1.5) ; 7.445 (1.6) ; 7.438 (5.4) ; 7.427 (0.7) ; 7.330 (4.0) ; 7.300 (5.5) ; 7.172 (0.6) ; 7.161 (5.6) ; 7.154 (1.7) ; 7.139 (1.5) ; 7.131 (4.4) ; 7.120 (0.5) ; 2.635 (16.0) ; 1.595 (6.3) ; 0.921 (0.3) ; 0.109 (1.7) ; 0.039 (6.2)

50

实施例V.03:  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ):

= 8.518 (3.8); 7.912 (0.4); 7.901 (4.0); 7.894 (1.3); 7.878 (1.3); 7.871 (4.5); 7.860 (0.5); 7.695 (0.6); 7.665 (0.6); 7.391 (4.1); 7.323 (2.5); 7.299 (5.3); 7.293 (2.3); 6.908 (0.4); 6.878 (0.3); 5.504 (0.3); 2.651 (16.0); 1.608 (7.9); 1.306 (1.4); 0.942 (0.5); 0.921 (1.6); 0.897 (0.6); 0.109 (1.6); 0.038 (4.8)

实施例V.04:  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $d_6$ -DMSO):

= 8.845 (3.1); 7.724 (1.9); 7.695 (2.3); 7.651 (3.3); 7.435 (2.6); 7.407 (2.1); 7.293 (0.9); 7.107 (1.9); 6.921 (0.9); 3.350 (2.0); 2.640 (16.0); 2.531 (0.5); 2.525 (0.7); 2.519 (0.5); 0.020 (0.8)

实施例V.05:  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ):

= 8.098 (1.9); 8.069 (2.0); 7.411 (0.4); 7.400 (4.0); 7.393 (1.6); 7.378 (1.6); 7.371 (5.2); 7.361 (0.8); 7.262 (12.2); 7.225 (1.5); 7.181 (0.6); 7.170 (5.1); 7.162 (1.6); 7.155 (0.6); 7.147 (1.5); 7.140 (3.9); 7.129 (0.5); 7.053 (2.1); 7.044 (3.3); 7.024 (1.9); 6.862 (1.5); 4.158 (0.4); 4.134 (1.1); 4.110 (1.1); 4.087 (0.4); 2.620 (16.0); 2.047 (5.0); 1.562 (9.9); 1.432 (1.4); 1.284 (1.4); 1.260 (2.8); 1.236 (1.4); 0.070 (9.2); 0.057 (0.5); 0.011 (0.5); 0.000 (15.9); -0.011 (0.9)

实施例V.06:  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ):

= 8.350 (2.4); 8.322 (2.5); 7.394 (3.2); 7.387 (1.3); 7.372 (1.4); 7.365 (4.3); 7.352 (0.7); 7.263 (7.4); 7.141 (0.8); 7.132 (4.0); 7.125 (1.3); 7.110 (1.4); 7.102 (3.4); 7.092 (0.4); 6.868 (2.5); 6.840 (2.3); 2.682 (0.4); 2.665 (0.6); 2.659 (0.5); 2.617 (16.0); 1.584 (27.0); 1.432 (1.1); 0.070 (4.5); 0.000 (8.6); -0.011 (0.4)

实施例V.07:  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $d_6$ -DMSO):

= 8.832 (3.2); 7.763 (3.4); 7.743 (1.3); 7.735 (1.3); 7.708 (1.2); 7.700 (1.2); 7.550 (0.9); 7.521 (2.1); 7.493 (1.6); 7.448 (1.2); 7.444 (1.2); 7.440 (1.2); 7.436 (1.0); 7.419 (0.6); 7.415 (0.7); 7.411 (0.6); 7.407 (0.6); 3.344 (1.7); 2.641 (16.0); 2.537 (0.5); 2.531 (1.0); 2.525 (1.4); 2.519 (1.0); 2.513 (0.5); 0.021 (2.2)

实施例V.08:  $^1\text{H}$ -NMR (400.0 MHz,  $d_6$ -DMSO):

= 8.634 (5.1); 7.482 (1.7); 7.477 (0.7); 7.463 (3.0); 7.446 (1.0); 7.442 (2.4); 7.437 (0.4); 7.307 (5.0); 7.302 (1.4); 7.283 (1.8); 7.264 (0.8); 7.215 (2.6); 7.212 (3.2); 7.193 (2.7); 3.331 (4.3); 2.642 (0.5); 2.595 (16.0); 2.508 (4.1); 2.504 (5.4); 2.499 (4.1); 0.000 (1.0)

实施例V.09:  $^1\text{H}$ -NMR (400.0 MHz,  $d_6$ -DMSO):

= 8.628 (5.2); 7.529 (0.4); 7.520 (4.0); 7.515 (1.4); 7.504 (1.5); 7.498 (4.8); 7.490 (0.6); 7.368 (5.1); 7.275 (0.6); 7.267 (4.8); 7.261 (1.6); 7.250 (1.3); 7.244 (4.0); 7.236 (0.4); 3.333 (3.7); 2.598 (16.0); 2.514 (1.8); 2.510 (3.5); 2.505 (4.6); 2.501 (3.5); 2.496 (1.7); 1.186 (0.4); 0.000 (1.2)

实施例V.10:  $^1\text{H}$ -NMR (400.0 MHz,  $d_6$ -DMSO):

= 8.299 (2.8); 8.278 (2.9); 7.549 (0.4); 7.540 (3.6); 7.535 (1.3); 7.524 (1.4); 7.518 (4.3); 7.510 (0.5); 7.297 (0.5); 7.291 (0.5); 7.285 (0.5); 7.279 (0.5); 7.273 (0.5); 7.267 (0.5); 7.261 (0.5); 7.255 (0.5); 7.249 (0.5); 7.243 (0.5); 7.237 (0.5); 7.231 (0.5); 7.225 (0.5); 7.219 (0.5); 7.213 (0.5); 7.207 (0.5); 7.201 (0.5); 7.195 (0.5); 7.189 (0.5); 7.183 (0.5); 7.177 (0.5); 7.171 (0.5); 7.165 (0.5); 7.159 (0.5); 7.153 (0.5); 7.147 (0.5); 7.141 (0.5); 7.135 (0.5); 7.129 (0.5); 7.123 (0.5); 7.117 (0.5); 7.111 (0.5); 7.105 (0.5); 7.099 (0.5); 7.093 (0.5); 7.087 (0.5); 7.081 (0.5); 7.075 (0.5); 7.069 (0.5); 7.063 (0.5); 7.057 (0.5); 7.051 (0.5); 7.045 (0.5); 7.039 (0.5); 7.033 (0.5); 7.027 (0.5); 7.021 (0.5); 7.015 (0.5); 7.009 (0.5); 7.003 (0.5); 6.997 (0.5); 6.991 (0.5); 6.985 (0.5); 6.979 (0.5); 6.973 (0.5); 6.967 (0.5); 6.961 (0.5); 6.955 (0.5); 6.949 (0.5); 6.943 (0.5); 6.937 (0.5); 6.931 (0.5); 6.925 (0.5); 6.919 (0.5); 6.913 (0.5); 6.907 (0.5); 6.901 (0.5); 6.895 (0.5); 6.889 (0.5); 6.883 (0.5); 6.877 (0.5); 6.871 (0.5); 6.865 (0.5); 6.859 (0.5); 6.853 (0.5); 6.847 (0.5); 6.841 (0.5); 6.835 (0.5); 6.829 (0.5); 6.823 (0.5); 6.817 (0.5); 6.811 (0.5); 6.805 (0.5); 6.799 (0.5); 6.793 (0.5); 6.787 (0.5); 6.781 (0.5); 6.775 (0.5); 6.769 (0.5); 6.763 (0.5); 6.757 (0.5); 6.751 (0.5); 6.745 (0.5); 6.739 (0.5); 6.733 (0.5); 6.727 (0.5); 6.721 (0.5); 6.715 (0.5); 6.709 (0.5); 6.703 (0.5); 6.697 (0.5); 6.691 (0.5); 6.685 (0.5); 6.679 (0.5); 6.673 (0.5); 6.667 (0.5); 6.661 (0.5); 6.655 (0.5); 6.649 (0.5); 6.643 (0.5); 6.637 (0.5); 6.631 (0.5); 6.625 (0.5); 6.619 (0.5); 6.613 (0.5); 6.607 (0.5); 6.601 (0.5); 6.595 (0.5); 6.589 (0.5); 6.583 (0.5); 6.577 (0.5); 6.571 (0.5); 6.565 (0.5); 6.559 (0.5); 6.553 (0.5); 6.547 (0.5); 6.541 (0.5); 6.535 (0.5); 6.529 (0.5); 6.523 (0.5); 6.517 (0.5); 6.511 (0.5); 6.505 (0.5); 6.499 (0.5); 6.493 (0.5); 6.487 (0.5); 6.481 (0.5); 6.475 (0.5); 6.469 (0.5); 6.463 (0.5); 6.457 (0.5); 6.451 (0.5); 6.445 (0.5); 6.439 (0.5); 6.433 (0.5); 6.427 (0.5); 6.421 (0.5); 6.415 (0.5); 6.409 (0.5); 6.403 (0.5); 6.397 (0.5); 6.391 (0.5); 6.385 (0.5); 6.379 (0.5); 6.373 (0.5); 6.367 (0.5); 6.361 (0.5); 6.355 (0.5); 6.349 (0.5); 6.343 (0.5); 6.337 (0.5); 6.331 (0.5); 6.325 (0.5); 6.319 (0.5); 6.313 (0.5); 6.307 (0.5); 6.301 (0.5); 6.295 (0.5); 6.289 (0.5); 6.283 (0.5); 6.277 (0.5); 6.271 (0.5); 6.265 (0.5); 6.259 (0.5); 6.253 (0.5); 6.247 (0.5); 6.241 (0.5); 6.235 (0.5); 6.229 (0.5); 6.223 (0.5); 6.217 (0.5); 6.211 (0.5); 6.205 (0.5); 6.199 (0.5); 6.193 (0.5); 6.187 (0.5); 6.181 (0.5); 6.175 (0.5); 6.169 (0.5); 6.163 (0.5); 6.157 (0.5); 6.151 (0.5); 6.145 (0.5); 6.139 (0.5); 6.133 (0.5); 6.127 (0.5); 6.121 (0.5); 6.115 (0.5); 6.109 (0.5); 6.103 (0.5); 6.097 (0.5); 6.091 (0.5); 6.085 (0.5); 6.079 (0.5); 6.073 (0.5); 6.067 (0.5); 6.061 (0.5); 6.055 (0.5); 6.049 (0.5); 6.043 (0.5); 6.037 (0.5); 6.031 (0.5); 6.025 (0.5); 6.019 (0.5); 6.013 (0.5); 6.007 (0.5); 6.001 (0.5); 5.995 (0.5); 5.989 (0.5); 5.983 (0.5); 5.977 (0.5); 5.971 (0.5); 5.965 (0.5); 5.959 (0.5); 5.953 (0.5); 5.947 (0.5); 5.941 (0.5); 5.935 (0.5); 5.929 (0.5); 5.923 (0.5); 5.917 (0.5); 5.911 (0.5); 5.905 (0.5); 5.899 (0.5); 5.893 (0.5); 5.887 (0.5); 5.881 (0.5); 5.875 (0.5); 5.869 (0.5); 5.863 (0.5); 5.857 (0.5); 5.851 (0.5); 5.845 (0.5); 5.839 (0.5); 5.833 (0.5); 5.827 (0.5); 5.821 (0.5); 5.815 (0.5); 5.809 (0.5); 5.803 (0.5); 5.797 (0.5); 5.791 (0.5); 5.785 (0.5); 5.779 (0.5); 5.773 (0.5); 5.767 (0.5); 5.761 (0.5); 5.755 (0.5); 5.749 (0.5); 5.743 (0.5); 5.737 (0.5); 5.731 (0.5); 5.725 (0.5); 5.719 (0.5); 5.713 (0.5); 5.707 (0.5); 5.701 (0.5); 5.695 (0.5); 5.689 (0.5); 5.683 (0.5); 5.677 (0.5); 5.671 (0.5); 5.665 (0.5); 5.659 (0.5); 5.653 (0.5); 5.647 (0.5); 5.641 (0.5); 5.635 (0.5); 5.629 (0.5); 5.623 (0.5); 5.617 (0.5); 5.611 (0.5); 5.605 (0.5); 5.599 (0.5); 5.593 (0.5); 5.587 (0.5); 5.581 (0.5); 5.575 (0.5); 5.569 (0.5); 5.563 (0.5); 5.557 (0.5); 5.551 (0.5); 5.545 (0.5); 5.539 (0.5); 5.533 (0.5); 5.527 (0.5); 5.521 (0.5); 5.515 (0.5); 5.509 (0.5); 5.503 (0.5); 5.497 (0.5); 5.491 (0.5); 5.485 (0.5); 5.479 (0.5); 5.473 (0.5); 5.467 (0.5); 5.461 (0.5); 5.455 (0.5); 5.449 (0.5); 5.443 (0.5); 5.437 (0.5); 5.431 (0.5); 5.425 (0.5); 5.419 (0.5); 5.413 (0.5); 5.407 (0.5); 5.401 (0.5); 5.395 (0.5); 5.389 (0.5); 5.383 (0.5); 5.377 (0.5); 5.371 (0.5); 5.365 (0.5); 5.359 (0.5); 5.353 (0.5); 5.347 (0.5); 5.341 (0.5); 5.335 (0.5); 5.329 (0.5); 5.323 (0.5); 5.317 (0.5); 5.311 (0.5); 5.305 (0.5); 5.299 (0.5); 5.293 (0.5); 5.287 (0.5); 5.281 (0.5); 5.275 (0.5); 5.269 (0.5); 5.263 (0.5); 5.257 (0.5); 5.251 (0.5); 5.245 (0.5); 5.239 (0.5); 5.233 (0.5); 5.227 (0.5); 5.221 (0.5); 5.215 (0.5); 5.209 (0.5); 5.203 (0.5); 5.197 (0.5); 5.191 (0.5); 5.185 (0.5); 5.179 (0.5); 5.173 (0.5); 5.167 (0.5); 5.161 (0.5); 5.155 (0.5); 5.149 (0.5); 5.143 (0.5); 5.137 (0.5); 5.131 (0.5); 5.125 (0.5); 5.119 (0.5); 5.113 (0.5); 5.107 (0.5); 5.101 (0.5); 5.095 (0.5); 5.089 (0.5); 5.083 (0.5); 5.077 (0.5); 5.071 (0.5); 5.065 (0.5); 5.059 (0.5); 5.053 (0.5); 5.047 (0.5); 5.041 (0.5); 5.035 (0.5); 5.029 (0.5); 5.023 (0.5); 5.017 (0.5); 5.011 (0.5); 5.005 (0.5); 4.999 (0.5); 4.993 (0.5); 4.987 (0.5); 4.981 (0.5); 4.975 (0.5); 4.969 (0.5); 4.963 (0.5); 4.957 (0.5); 4.951 (0.5); 4.945 (0.5); 4.939 (0.5); 4.933 (0.5); 4.927 (0.5); 4.921 (0.5); 4.915 (0.5); 4.909 (0.5); 4.903 (0.5); 4.897 (0.5); 4.891 (0.5); 4.885 (0.5); 4.879 (0.5); 4.873 (0.5); 4.867 (0.5); 4.861 (0.5); 4.855 (0.5); 4.849 (0.5); 4.843 (0.5); 4.837 (0.5); 4.831 (0.5); 4.825 (0.5); 4.819 (0.5); 4.813 (0.5); 4.807 (0.5); 4.801 (0.5); 4.795 (0.5); 4.789 (0.5); 4.783 (0.5); 4.777 (0.5); 4.771 (0.5); 4.765 (0.5); 4.759 (0.5); 4.753 (0.5); 4.747 (0.5); 4.741 (0.5); 4.735 (0.5); 4.729 (0.5); 4.723 (0.5); 4.717 (0.5); 4.711 (0.5); 4.705 (0.5); 4.699 (0.5); 4.693 (0.5); 4.687 (0.5); 4.681 (0.5); 4.675 (0.5); 4.669 (0.5); 4.663 (0.5); 4.657 (0.5); 4.651 (0.5); 4.645 (0.5); 4.639 (0.5); 4.633 (0.5); 4.627 (0.5); 4.621 (0.5); 4.615 (0.5); 4.609 (0.5); 4.603 (0.5); 4.597 (0.5); 4.591 (0.5); 4.585 (0.5); 4.579 (0.5); 4.573 (0.5); 4.567 (0.5); 4.561 (0.5); 4.555 (0.5); 4.549 (0.5); 4.543 (0.5); 4.537 (0.5); 4.531 (0.5); 4.525 (0.5); 4.519 (0.5); 4.513 (0.5); 4.507 (0.5); 4.501 (0.5); 4.495 (0.5); 4.489 (0.5); 4.483 (0.5); 4.477 (0.5); 4.471 (0.5); 4.465 (0.5); 4.459 (0.5); 4.453 (0.5); 4.447 (0.5); 4.441 (0.5); 4.435 (0.5); 4.429 (0.5); 4.423 (0.5); 4.417 (0.5); 4.411 (0.5); 4.405 (0.5); 4.399 (0.5); 4.393 (0.5); 4.387 (0.5); 4.381 (0.5); 4.375 (0.5); 4.369 (0.5); 4.363 (0.5); 4.357 (0.5); 4.351 (0.5); 4.345 (0.5); 4.339 (0.5); 4.333 (0.5); 4.327 (0.5); 4.321 (0.5); 4.315 (0.5); 4.309 (0.5); 4.303 (0.5); 4.297 (0.5); 4.291 (0.5); 4.285 (0.5); 4.279 (0.5); 4.273 (0.5); 4.267 (0.5); 4.261 (0.5); 4.255 (0.5); 4.249 (0.5); 4.243 (0.5); 4.237 (0.5); 4.231 (0.5); 4.225 (0.5); 4.219 (0.5); 4.213 (0.5); 4.207 (0.5); 4.201 (0.5); 4.195 (0.5); 4.189 (0.5); 4.183 (0.5); 4.177 (0.5); 4.171 (0.5); 4.165 (0.5); 4.159 (0.5); 4.153 (0.5); 4.147 (0.5); 4.141 (0.5); 4.135 (0.5); 4.129 (0.5); 4.123 (0.5); 4.117 (0.5); 4.111 (0.5); 4.105 (0.5); 4.099 (0.5); 4.093 (0.5); 4.087 (0.5); 4.081 (0.5); 4.075 (0.5); 4.069 (0.5); 4.063 (0.5); 4.057 (0.5); 4.051 (0.5); 4.045 (0.5); 4.039 (0.5); 4.033 (0.5); 4.027 (0.5); 4.021 (0.5); 4.015 (0.5); 4.009 (0.5); 4.003 (0.5); 3.997 (0.5); 3.991 (0.5); 3.985 (0.5); 3.979 (0.5); 3.973 (0.5); 3.967 (0.5); 3.961 (0.5); 3.955 (0.5); 3.949 (0.5); 3.943 (0.5); 3.937 (0.5); 3.931 (0.5); 3.925 (0.5); 3.919 (0.5); 3.913 (0.5); 3.907 (0.5); 3.901 (0.5); 3.895 (0.5); 3.889 (0.5); 3.883 (0.5); 3.877 (0.5); 3.871 (0.5); 3.865 (0.5); 3.859 (0.5); 3.853 (0.5); 3.847 (0.5); 3.841 (0.5); 3.835 (0.5); 3.829 (0.5); 3.823 (0.5); 3.817 (0.5); 3.811 (0.5); 3.805 (0.5); 3.799 (0.5); 3.793 (0.5); 3.787 (0.5); 3.781 (0.5); 3.775 (0.5); 3.769 (0.5); 3.763 (0.5); 3.757 (0.5); 3.751 (0.5); 3.745 (0.5); 3.739 (0.5); 3.733 (0.5); 3.727 (0.5); 3.721 (0.5); 3.715 (0.5); 3.709 (0.5); 3.703 (0.5); 3.697 (0.5); 3.691 (0.5); 3.685 (0.5); 3.679 (0.5); 3.673 (0.5); 3.667 (0.5); 3.661 (0.5); 3.655 (0.5); 3.649 (0.5); 3.643 (0.5); 3.637 (0.5); 3.631 (0.5); 3.625 (0.5); 3.619 (0.5); 3.613 (0.5); 3.607 (0.5); 3.601 (0.5); 3.595 (0.5); 3.589 (0.5); 3.583 (0.5); 3.577 (0.5); 3.571 (0.5); 3.565 (0.5); 3.559 (0.5); 3.553 (0.5); 3.547 (0.5); 3.541 (0.5); 3.535 (0.5); 3.529 (0.5); 3.523 (0.5); 3.517 (0.5); 3.511 (0.5); 3.505 (0.5); 3.499 (0.5); 3.493 (0.5); 3.487 (0.5); 3.481 (0.5); 3.475 (0.5); 3.469 (0.5); 3.463 (0.5); 3.457 (0.5); 3.451 (0.5); 3.445 (0.5); 3.439 (0.5); 3.433 (0.5); 3.427 (0.5); 3.421 (0.5); 3.415 (0.5); 3.409 (0.5); 3.403 (0.5); 3.397 (0.5); 3.391 (0.5); 3.385 (0.5); 3.379 (0.5); 3.373 (0.5); 3.367 (0.5); 3.361 (0.5); 3.355 (0.5); 3.349 (0.5); 3.343 (0.5); 3.337 (0.5); 3.331 (0.5); 3.325 (0.5); 3.319 (0.5); 3.313 (0.5); 3.307 (0.5); 3.301 (0.5); 3.295 (0.5); 3.289 (0.5); 3.283 (0.5); 3.277 (0.5); 3.271 (0.5); 3.265 (0.5); 3.259 (0.5); 3.253 (0.5); 3.247 (0.5); 3.241 (0.5); 3.235 (0.5); 3.229 (0.5); 3.223 (0.5); 3.217 (0.5); 3.211 (0.5); 3.205 (0.5); 3.199 (0.5); 3.193 (0.5); 3.187 (0.5); 3.181 (0.5); 3.175 (0.5); 3.169 (0.5); 3.163 (0.5); 3.157 (0.5); 3.151 (0.5); 3.145 (0.5); 3.139 (0.5); 3.133 (0.5); 3.127 (0.5); 3.121 (0.5); 3.115 (0.5); 3.109 (0.5); 3.103 (0.5); 3.097 (0.5); 3.091 (0.5); 3.085 (0.5); 3.079 (0.5); 3.073 (0.5); 3.067 (0.5); 3.061 (0.5); 3.055 (0.5); 3.049 (0.5); 3.043 (0.5); 3.037 (0.5); 3.031 (0.5); 3.025 (0.5); 3.019 (0.5); 3.013 (0.5); 3.007 (0.5); 3.001 (0.5); 2.995 (0.5); 2.989 (0.5); 2.983 (0.5); 2.977 (0.5); 2.971 (0.5); 2.965 (0.5); 2.959 (0.5); 2.953 (0.5); 2.947 (0.5); 2.941 (0.5); 2.935 (0.5); 2.929 (0.5); 2.923 (0.5); 2.917 (0.5); 2.911 (0.5); 2.905 (0.5); 2.899 (0.5); 2.893 (0.5); 2.887 (0.5); 2.881 (0.5); 2.875 (0.5); 2.869 (0.5); 2.863 (0.5); 2.857 (0.5); 2.851 (0.5); 2.845 (0.5); 2.839 (0.5); 2.833 (0.5); 2.827 (0.5); 2.821 (0.5); 2.815 (0.5); 2.809 (0.5); 2.803 (0.5); 2.797 (0.5); 2.791 (0.5); 2.785 (0.5); 2.779 (0.5); 2.773 (0.5); 2.767 (0.5); 2.761 (0.5); 2.755 (0.5); 2.749 (0.5); 2.743 (0.5); 2.737 (0.5); 2.731 (0.5); 2.725 (0.5); 2.719 (0.5); 2.713 (0.5); 2.707 (0.5); 2.701 (0.5); 2.695 (0.5); 2.689 (0.5); 2.683 (0.5); 2.677 (0.5); 2.671 (0.5); 2.665 (0.5); 2.659 (0.5); 2.653 (0.5); 2.647 (0.5); 2.641 (0.5); 2.635 (0.5); 2.629 (0.5); 2.623 (0.5); 2.617 (0.5); 2.611 (0.5); 2.605 (0.5); 2.599 (0.5); 2.593 (0.5); 2.587 (0.5); 2.581 (0.5); 2.575 (0.5); 2.569 (0.5); 2.563 (0.5); 2.557 (0.5); 2.551 (0.5); 2.545 (0.5); 2.539 (0.5); 2.533 (0.5); 2.527 (0.5); 2.521 (0.5); 2.515 (0.5); 2.509 (0.5); 2.503 (0.5); 2.497 (0.5); 2.491 (0.5); 2.485 (0.5); 2.479 (0.5); 2.473 (0.5); 2.467 (0.5); 2.461 (0.5); 2.455 (0.5); 2.449 (0.5); 2.443 (0.5); 2.437 (0.5); 2.431 (0.5); 2.425 (0.5); 2.419 (0.5); 2.413 (0.5); 2.407 (0.5); 2.401 (0.5); 2.395 (0.5); 2.389 (0.5); 2.383 (0.5); 2.377 (0.5); 2.371 (0.5); 2.365 (0.5); 2.359 (0.5); 2.353 (0.5); 2.347 (0.5); 2.341 (0.5); 2.335 (0.5); 2.329 (0.5); 2.323 (0.5); 2.317 (0.5); 2.311 (0.5); 2.305 (0.5); 2.299 (0.5); 2.293 (0.5); 2.287 (0.5); 2.281 (0.5); 2.275 (0.5); 2.269 (0.5); 2.263 (0.5); 2.257 (0.5); 2.251 (0.5); 2.245 (0.5); 2.239 (0.5); 2.233 (0.5); 2.227 (0.5); 2.221 (0.5); 2.215 (0.5); 2.209 (0.5); 2.203 (0.5); 2.197 (0.5); 2.191 (0.5); 2.185 (0.5); 2.179 (0.5); 2.173 (0.5); 2.167 (0.5); 2.161 (0.5); 2.155 (0.5); 2.149 (0.5); 2.143 (0.5); 2.137 (0.5); 2.131 (0.5); 2.125 (0.5); 2.119 (0.5); 2.113

. 289 (4.3) ; 7.284 (1.4) ; 7.272 (1.2) ; 7.267 (3.6) ; 7.258 (0.4)  
) ; 7.178 (2.9) ; 7.157 (2.8) ; 3.329 (6.4) ; 2.599 (16.0) ; 2.508  
(7.2) ; 2.504 (9.2) ; 2.499 (6.8) ; 0.000 (1.5)

实施例V.11:  $^1\text{H}$ -NMR (400.1 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.081 (2.5) ; 8.060 (2.6) ; 7.498 (2.1) ; 7.476 (2.3) ; 7.312  
(2.1) ; 7.305 (2.2) ; 7.260 (6.5) ; 7.067 (1.4) ; 7.061 (1.3) ; 7  
.046 (1.3) ; 7.039 (1.2) ; 6.924 (2.7) ; 6.903 (2.6) ; 2.695 (16.0  
) ; 1.544 (0.4) ; 1.432 (0.6) ; 0.070 (1.2) ; 0.000 (5.1)

实施例V.12:  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $d_6$ -DMSO) :

= 8.382 (4.0) ; 8.369 (0.5) ; 8.354 (4.2) ; 8.342 (0.6) ; 7.808  
(0.4) ; 7.781 (0.3) ; 7.563 (0.5) ; 7.552 (5.5) ; 7.545 (2.3) ; 7  
.530 (2.2) ; 7.523 (7.1) ; 7.512 (1.0) ; 7.313 (0.7) ; 7.302 (6.9  
) ; 7.294 (2.6) ; 7.279 (2.0) ; 7.272 (5.6) ; 7.235 (4.5) ; 7.206  
(4.3) ; 7.184 (0.4) ; 7.155 (0.4) ; 5.107 (1.4) ; 5.081 (16.0) ;  
3.326 (9.1) ; 2.598 (1.3) ; 2.508 (5.1) ; 2.502 (6.9) ; 2.496 (5.2  
) ; 1.247 (1.0) ; 0.858 (0.8) ; 0.000 (5.2)

实施例V.13:  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.195 (2.5) ; 8.165 (2.7) ; 7.438 (3.2) ; 7.431 (1.1) ; 7.415  
(1.2) ; 7.409 (4.2) ; 7.398 (0.5) ; 7.315 (2.8) ; 7.284 (2.6) ; 7  
.262 (15.9) ; 7.216 (0.5) ; 7.205 (4.1) ; 7.198 (1.3) ; 7.183 (1.1  
) ; 7.176 (3.3) ; 7.165 (0.4) ; 7.081 (0.4) ; 4.240 (1.9) ; 2.826  
(1.9) ; 2.801 (16.0) ; 1.549 (14.2) ; 0.069 (3.3) ; 0.010 (0.5) ;  
0.000 (18.0) ; -0.011 (0.9)

实施例V.14:  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.127 (2.5) ; 8.099 (2.7) ; 7.637 (2.1) ; 7.608 (2.4) ; 7.313  
(3.1) ; 7.300 (19.5) ; 7.284 (2.5) ; 6.961 (2.7) ; 6.933 (2.6) ;  
6.911 (1.0) ; 6.723 (1.9) ; 6.535 (1.0) ; 2.740 (16.0) ; 1.585 (19  
.8) ; 1.307 (0.7) ; 0.921 (0.6) ; 0.108 (1.3) ; 0.049 (1.0) ; 0.0  
39 (17.8) ; 0.028 (0.9)

实施例V.15:  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.524 (3.9) ; 7.349 (5.7) ; 7.324 (3.8) ; 7.313 (1.1) ; 7.299  
(3.9) ; 7.256 (1.6) ; 7.245 (6.1) ; 7.237 (1.6) ; 7.222 (1.9) ; 7  
.215 (3.1) ; 2.650 (3.2) ; 2.638 (16.0) ; 1.636 (2.4) ; 1.623 (14.  
4) ; 1.304 (1.6) ; 0.940 (0.6) ; 0.932 (0.6) ; 0.918 (1.4) ; 0.895  
(0.5) ; 0.108 (0.5) ; 0.048 (0.5) ; 0.036 (3.2)

实施例V.16:  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 7.931 (2.8) ; 7.902 (3.0) ; 7.885 (0.6) ; 7.874 (5.5) ; 7.867  
(1.7) ; 7.851 (1.8) ; 7.844 (6.2) ; 7.833 (0.7) ; 7.368 (3.5) ; 7  
.337 (3.1) ; 7.300 (9.9) ; 7.253 (3.2) ; 7.225 (3.0) ; 2.630 (16.0  
) ; 2.628 (14.9) ; 1.589 (11.0) ; 0.109 (1.9) ; 0.049 (0.3) ; 0.03  
8 (10.2) ; 0.027 (0.4)

实施例V.17:  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 7.918 (2.8) ; 7.890 (3.0) ; 7.792 (0.4) ; 7.745 (3.7) ; 7.717  
(4.3) ; 7.645 (0.5) ; 7.618 (0.3) ; 7.376 (4.1) ; 7.348 (3.5) ; 7  
.300 (15.0) ; 7.232 (3.3) ; 7.204 (3.0) ; 2.627 (16.0) ; 2.625 (15  
.1) ; 1.588 (12.4) ; 0.109 (2.9) ; 0.049 (0.5) ; 0.038 (14.9) ; 0  
.027 (0.5)

实施例V.18:  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.654 (0.6) ; 8.527 (3.9) ; 7.752 (1.9) ; 7.724 (2.1) ; 7.491  
(0.7) ; 7.315 (2.0) ; 7.300 (2.3) ; 7.287 (1.8) ; 7.104 (4.2) ; 2

10

20

30

40

50

. 716 (2.7) ; 2.692 (16.0) ; 1.614 (2.8) ; 0.109 (0.5) ; 0.037 (2.0)

实施例V.19:  $^1\text{H}$ -NMR (499.9 MHz,  $d_6$ -DMSO) :

= 8.898 (4.8) ; 8.651 (0.4) ; 7.631 (0.4) ; 7.624 (3.7) ; 7.607 (4.4) ; 7.600 (0.9) ; 7.582 (0.5) ; 7.387 (0.5) ; 7.380 (4.7) ; 7.363 (4.1) ; 7.357 (0.6) ; 7.152 (5.1) ; 6.827 (0.5) ; 3.318 (1.2) ; 2.696 (16.0) ; 2.641 (1.6) ; 2.606 (15.0) ; 2.507 (0.8) ; 1.230 (0.3) ; 0.877 (0.3)

实施例V.20:  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 7.882 (2.9) ; 7.853 (3.1) ; 7.599 (0.7) ; 7.588 (6.6) ; 7.581 (2.1) ; 7.566 (2.2) ; 7.558 (7.3) ; 7.548 (0.7) ; 7.300 (14.6) ; 7.165 (3.4) ; 7.151 (0.9) ; 7.141 (8.3) ; 7.118 (2.1) ; 7.111 (6.4) ; 7.100 (0.6) ; 2.615 (16.0) ; 2.613 (15.2) ; 1.589 (10.9) ; 1.345 (0.6) ; 1.306 (3.4) ; 0.942 (1.2) ; 0.921 (4.0) ; 0.897 (1.5) ; 0.108 (0.9) ; 0.049 (0.5) ; 0.038 (14.0) ; 0.027 (0.5)

实施例V.21:  $^1\text{H}$ -NMR (400.0 MHz,  $d_6$ -DMSO) :

= 8.288 (2.9) ; 8.267 (3.0) ; 7.500 (1.6) ; 7.496 (0.8) ; 7.480 (3.0) ; 7.461 (2.4) ; 7.320 (1.1) ; 7.301 (1.8) ; 7.283 (0.8) ; 7.234 (2.6) ; 7.232 (3.2) ; 7.213 (2.6) ; 7.116 (3.1) ; 7.095 (2.9) ; 3.331 (5.0) ; 2.619 (0.8) ; 2.598 (16.0) ; 2.508 (5.0) ; 2.504 (6.5) ; 2.500 (4.9) ; 0.000 (1.1)

实施例V.22:  $^1\text{H}$ -NMR (399.8 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.488 (4.8) ; 7.405 (3.7) ; 7.383 (4.1) ; 7.261 (3.4) ; 7.098 (4.3) ; 7.076 (3.6) ; 7.002 (4.5) ; 2.642 (16.0) ; 1.565 (1.2) ; 1.432 (0.4) ; -0.001 (3.6)

实施例V.23:  $^1\text{H}$ -NMR (499.9 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.329 (4.9) ; 7.430 (0.4) ; 7.424 (3.6) ; 7.406 (4.1) ; 7.400 (0.5) ; 7.262 (2.5) ; 7.155 (0.5) ; 7.148 (4.1) ; 7.131 (3.6) ; 7.125 (0.4) ; 2.684 (16.0) ; 1.572 (7.9) ; 0.000 (2.7)

实施例V.24:  $^1\text{H}$ -NMR (499.9 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.389 (2.5) ; 8.373 (3.4) ; 8.371 (3.2) ; 8.354 (2.6) ; 8.323 (0.4) ; 8.306 (0.4) ; 7.412 (0.9) ; 7.406 (7.3) ; 7.402 (2.7) ; 7.392 (2.9) ; 7.388 (8.4) ; 7.382 (1.2) ; 7.372 (0.4) ; 7.262 (4.5) ; 7.247 (0.6) ; 7.229 (0.6) ; 7.203 (0.5) ; 7.185 (0.6) ; 7.124 (1.1) ; 7.117 (8.4) ; 7.113 (3.0) ; 7.104 (2.7) ; 7.099 (7.5) ; 7.093 (1.2) ; 6.934 (0.6) ; 6.916 (0.5) ; 6.884 (0.6) ; 6.864 (3.2) ; 6.861 (3.1) ; 6.847 (3.1) ; 6.844 (3.1) ; 6.626 (0.4) ; 6.610 (0.4) ; 3.769 (0.4) ; 3.350 (0.3) ; 2.734 (0.7) ; 2.708 (2.3) ; 2.643 (0.7) ; 2.618 (15.7) ; 2.609 (16.0) ; 2.559 (0.9) ; 1.580 (11.1) ; 1.431 (0.7) ; 1.345 (0.4) ; 0.000 (4.3)

实施例V.25:  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.519 (3.7) ; 7.775 (2.6) ; 7.746 (3.0) ; 7.381 (4.0) ; 7.341 (2.8) ; 7.313 (2.6) ; 7.300 (8.1) ; 2.675 (0.8) ; 2.646 (16.0) ; 1.598 (15.8) ; 0.108 (1.3) ; 0.038 (7.2)

实施例V.26:  $^1\text{H}$ -NMR (299.9 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.066 (2.6) ; 8.037 (2.6) ; 7.410 (0.5) ; 7.399 (3.4) ; 7.377 (1.6) ; 7.370 (4.0) ; 7.257 (6.1) ; 7.132 (0.6) ; 7.121 (4.2) ; 7.098 (1.4) ; 7.092 (3.2) ; 6.882 (2.8) ; 6.854 (2.6) ; 2.689 (16.0) ; 1.555 (7.5) ; -0.005 (5.4)

实施例V.27:  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :



= 8.517 (3.6) ; 7.627 (0.5) ; 7.617 (4.6) ; 7.610 (1.5) ; 7.594 (1.6) ; 7.587 (5.0) ; 7.577 (0.6) ; 7.330 (4.0) ; 7.299 (5.4) ; 7.119 (0.6) ; 7.108 (5.2) ; 7.101 (1.6) ; 7.085 (1.5) ; 7.078 (4.5) ; 7.068 (0.5) ; 2.635 (16.0) ; 1.590 (2.6) ; 0.109 (0.5) ; 0.039 (5.4)

実施例V.28 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $d_6$ -DMSO) :

= 8.316 (2.6) ; 8.288 (2.7) ; 7.500 (1.5) ; 7.472 (2.5) ; 7.404 (0.6) ; 7.392 (4.5) ; 7.385 (1.3) ; 7.370 (0.9) ; 7.362 (2.6) ; 7.274 (0.3) ; 7.206 (2.7) ; 7.178 (2.6) ; 3.324 (27.4) ; 2.667 (0.5) ; 2.642 (0.3) ; 2.618 (0.5) ; 2.601 (16.0) ; 2.513 (5.3) ; 2.507 (11.4) ; 2.501 (16.0) ; 2.495 (12.0) ; 2.490 (6.0) ; 0.000 (9.9)

実施例V.29 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.068 (2.6) ; 8.040 (2.7) ; 7.263 (12.9) ; 7.148 (1.9) ; 7.118 (2.4) ; 7.020 (1.9) ; 7.010 (2.1) ; 6.882 (1.4) ; 6.875 (2.9) ; 6.872 (1.6) ; 6.852 (1.3) ; 6.847 (2.8) ; 6.843 (1.2) ; 5.302 (5.1) ; 3.833 (13.6) ; 2.796 (0.5) ; 2.709 (0.4) ; 2.691 (16.0) ; 2.681 (0.5) ; 2.048 (0.8) ; 1.565 (16.4) ; 1.432 (0.5) ; 1.261 (0.5) ; 0.070 (2.6) ; 0.011 (0.4) ; 0.000 (11.7) ; -0.011 (0.5)

実施例V.30 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.115 (2.5) ; 8.087 (2.6) ; 7.839 (2.5) ; 7.832 (0.8) ; 7.816 (0.8) ; 7.809 (2.8) ; 7.798 (0.4) ; 7.290 (1.5) ; 7.263 (3.6) ; 6.982 (2.7) ; 6.954 (2.5) ; 2.720 (1.2) ; 2.716 (0.4) ; 2.708 (16.0) ; 2.698 (0.5) ; 1.432 (0.5) ; 0.072 (0.5) ; 0.000 (2.9)

実施例V.31 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 7.931 (2.8) ; 7.902 (3.0) ; 7.355 (3.3) ; 7.327 (3.0) ; 7.300 (15.7) ; 7.142 (0.8) ; 7.131 (1.4) ; 7.125 (2.2) ; 7.121 (6.6) ; 7.097 (6.5) ; 7.093 (2.1) ; 7.086 (1.3) ; 7.076 (0.7) ; 2.620 (15.4) ; 2.618 (16.0) ; 1.585 (4.9) ; 0.109 (2.3) ; 0.050 (0.7) ; 0.039 (17.2) ; 0.028 (0.8)

実施例V.32 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 7.899 (2.8) ; 7.898 (2.8) ; 7.871 (3.0) ; 7.870 (3.0) ; 7.626 (3.3) ; 7.597 (4.1) ; 7.337 (4.6) ; 7.308 (3.7) ; 7.300 (3.0) ; 7.193 (3.2) ; 7.192 (3.2) ; 7.165 (3.0) ; 7.164 (3.0) ; 6.908 (1.7) ; 6.720 (3.5) ; 6.532 (1.8) ; 3.200 (0.8) ; 2.617 (15.6) ; 2.615 (16.0) ; 1.630 (0.3) ; 1.469 (0.9) ; 1.381 (0.4) ; 1.268 (0.5) ; 1.247 (0.5) ; 0.036 (2.4)

実施例V.33 :  $^1\text{H}$ -NMR (499.9 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.094 (5.1) ; 7.263 (2.3) ; 7.251 (0.5) ; 7.245 (3.7) ; 7.241 (1.5) ; 7.231 (1.7) ; 7.227 (6.9) ; 7.222 (1.9) ; 7.212 (1.3) ; 7.208 (4.2) ; 7.202 (0.5) ; 6.940 (0.5) ; 6.934 (4.1) ; 6.930 (1.6) ; 6.920 (1.7) ; 6.916 (4.7) ; 6.914 (5.3) ; 6.910 (2.0) ; 6.900 (1.3) ; 6.896 (3.7) ; 6.890 (0.4) ; 2.729 (0.4) ; 2.716 (16.0) ; 1.594 (6.2) ; 0.000 (2.4)

実施例V.34 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.138 (1.9) ; 8.110 (2.0) ; 7.599 (0.5) ; 7.588 (4.5) ; 7.581 (1.5) ; 7.566 (1.8) ; 7.559 (5.0) ; 7.548 (0.7) ; 7.358 (0.3) ; 7.302 (11.2) ; 7.264 (1.6) ; 7.169 (0.7) ; 7.159 (5.1) ; 7.151 (1.6) ; 7.136 (1.7) ; 7.129 (4.4) ; 7.118 (0.6) ; 7.095 (2.2) ; 7.083 (3.4) ; 7.067 (2.0) ; 6.902 (1.6) ; 3.789 (0.4) ; 3.558 (0.4) ; 3.450 (0.4) ; 2.694 (0.5) ; 2.685 (0.6) ; 2.661 (16.0) ; 1.895 (0.5)

) ; 1.595 (1.1) ; 1.473 (0.4) ; 1.293 (0.6) ; 0.110 (1.0) ; 0.051 (0.6) ; 0.040 (11.7) ; 0.029 (0.6)

实施例V.35 :  $^1\text{H}$  - NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 7.895 (2.8) ; 7.893 (2.8) ; 7.866 (3.0) ; 7.865 (3.0) ; 7.328 (1.6) ; 7.321 (0.9) ; 7.318 (0.8) ; 7.299 (7.0) ; 7.297 (6.5) ; 7.284 (2.4) ; 7.276 (10.4) ; 7.267 (1.8) ; 7.255 (1.3) ; 7.245 (2.1) ; 7.238 (0.4) ; 7.180 (3.3) ; 7.179 (3.3) ; 7.152 (3.0) ; 7.151 (3.0) ; 2.615 (15.9) ; 2.612 (16.0) ; 1.627 (0.4) ; 1.468 (1.2) ; 0.111 (0.4) ; 0.036 (1.7)

实施例V.36 :  $^1\text{H}$  - NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.768 (2.5) ; 7.690 (1.0) ; 7.628 (0.4) ; 7.617 (3.5) ; 7.610 (1.1) ; 7.595 (1.2) ; 7.587 (3.8) ; 7.577 (0.4) ; 7.508 (2.0) ; 7.407 (2.6) ; 7.326 (1.0) ; 7.298 (4.7) ; 7.126 (0.4) ; 7.115 (4.0) ; 7.108 (1.1) ; 7.093 (1.1) ; 7.086 (3.4) ; 7.075 (0.3) ; 2.648 (16.0) ; 1.594 (3.9) ; 0.107 (0.3) ; 0.037 (4.5)

实施例V.37 :  $^1\text{H}$  - NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.769 (2.6) ; 7.692 (1.0) ; 7.510 (2.1) ; 7.479 (0.3) ; 7.469 (3.3) ; 7.462 (1.1) ; 7.446 (1.2) ; 7.439 (4.0) ; 7.428 (0.4) ; 7.407 (2.7) ; 7.328 (1.1) ; 7.298 (23.0) ; 7.179 (0.4) ; 7.168 (4.1) ; 7.161 (1.2) ; 7.146 (1.0) ; 7.139 (3.3) ; 2.648 (16.0) ; 1.581 (20.7) ; 0.107 (2.5) ; 0.048 (0.7) ; 0.037 (22.4) ; 0.027 (0.9)

实施例V.38 :  $^1\text{H}$  - NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 7.904 (2.8) ; 7.903 (2.8) ; 7.876 (3.1) ; 7.300 (2.5) ; 7.288 (1.7) ; 7.287 (1.7) ; 7.281 (2.1) ; 7.265 (1.1) ; 7.258 (3.8) ; 7.252 (2.6) ; 7.247 (2.2) ; 7.238 (3.6) ; 7.231 (3.7) ; 7.230 (3.7) ; 7.226 (3.7) ; 7.221 (7.3) ; 7.217 (4.6) ; 7.197 (0.6) ; 7.190 (0.5) ; 2.610 (16.0) ; 2.608 (15.9) ; 1.715 (0.7) ; 1.469 (1.2) ; 0.036 (2.4)

实施例V.40 :  $^1\text{H}$  - NMR (300.2 MHz,  $\text{d}_6$  - DMSO) :

= 9.719 (2.7) ; 8.342 (5.8) ; 8.314 (6.2) ; 7.712 (1.3) ; 7.701 (13.7) ; 7.694 (4.4) ; 7.678 (4.6) ; 7.671 (15.5) ; 7.660 (1.6) ; 7.492 (6.7) ; 7.463 (6.3) ; 7.350 (2.1) ; 7.342 (0.7) ; 7.327 (0.7) ; 7.320 (2.3) ; 7.309 (0.5) ; 7.302 (1.7) ; 7.291 (16.0) ; 7.284 (4.7) ; 7.269 (4.3) ; 7.261 (13.5) ; 7.250 (1.3) ; 6.762 (2.5) ; 6.754 (0.7) ; 6.739 (0.7) ; 6.732 (2.2) ; 3.356 (19.8) ; 2.541 (3.5) ; 2.535 (7.6) ; 2.529 (10.5) ; 2.523 (7.7) ; 2.516 (4.1) ; 2.499 (1.9) ; 2.489 (2.2) ; 2.485 (1.5) ; 2.474 (3.6) ; 2.467 (1.7) ; 2.458 (2.1) ; 2.449 (2.1) ; 2.433 (1.0) ; 1.361 (0.3) ; 1.240 (0.4) ; 1.233 (1.0) ; 1.216 (3.2) ; 1.205 (7.7) ; 1.198 (4.3) ; 1.190 (3.1) ; 1.179 (8.5) ; 1.172 (5.1) ; 1.169 (5.1) ; 1.161 (7.4) ; 1.146 (9.3) ; 1.135 (3.5) ; 1.117 (0.9) ; 0.035 (0.3) ; 0.025 (9.6) ; 0.014 (0.4)

实施例V.41 :  $^1\text{H}$  - NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 7.931 (5.8) ; 7.903 (6.2) ; 7.453 (1.2) ; 7.442 (12.6) ; 7.434 (4.2) ; 7.419 (4.6) ; 7.412 (16.0) ; 7.401 (1.7) ; 7.301 (28.1) ; 7.246 (1.1) ; 7.239 (0.4) ; 7.224 (0.5) ; 7.217 (1.5) ; 7.212 (1.9) ; 7.202 (16.3) ; 7.194 (4.7) ; 7.179 (4.2) ; 7.172 (12.8) ; 7.166 (7.5) ; 7.138 (6.2) ; 6.820 (1.3) ; 6.812 (0.4) ; 6.797 (0.3) ; 6.790 (1.1) ; 4.825 (1.3) ; 2.366 (0.8) ; 2.351 (1.8) ; 2.340 (2.0) ; 2.325 (3.7) ; 2.311 (2.1) ; 2.300 (2.0) ; 2.285 (1.0) ; 1.592

10

20

30

40

50

( 13 . 5 ) ; 1 . 471 ( 0 . 5 ) ; 1 . 407 ( 1 . 7 ) ; 1 . 393 ( 5 . 8 ) ; 1 . 381 ( 9 . 6 ) ;  
 1 . 367 ( 7 . 2 ) ; 1 . 356 ( 2 . 4 ) ; 1 . 320 ( 0 . 5 ) ; 1 . 306 ( 0 . 6 ) ; 1 . 294 ( 0 . 5  
 ) ; 1 . 277 ( 0 . 5 ) ; 1 . 251 ( 0 . 4 ) ; 1 . 228 ( 2 . 5 ) ; 1 . 216 ( 7 . 5 ) ; 1 . 205  
 ( 5 . 4 ) ; 1 . 202 ( 5 . 7 ) ; 1 . 190 ( 8 . 3 ) ; 1 . 183 ( 3 . 7 ) ; 1 . 179 ( 4 . 6 ) ; 1  
 . 163 ( 3 . 2 ) ; 0 . 110 ( 3 . 1 ) ; 0 . 051 ( 1 . 0 ) ; 0 . 040 ( 30 . 8 ) ; 0 . 029 ( 1 . 1  
 )

実施例V . 44 :  $^1\text{H}$  - NMR ( 300 . 2 MHz ,  $\text{d}_6$  - DMSO ) :

= 8 . 362 ( 9 . 6 ) ; 8 . 333 ( 10 . 2 ) ; 7 . 726 ( 11 . 4 ) ; 7 . 698 ( 14 . 0 ) ; 7 . 5  
 25 ( 11 . 0 ) ; 7 . 497 ( 10 . 4 ) ; 7 . 444 ( 16 . 0 ) ; 7 . 415 ( 13 . 0 ) ; 7 . 298 ( 5 . 7  
 ) ; 7 . 111 ( 12 . 3 ) ; 6 . 925 ( 6 . 0 ) ; 5 . 785 ( 0 . 9 ) ; 3 . 360 ( 11 . 1 ) ; 3 . 14  
 6 ( 1 . 1 ) ; 2 . 541 ( 2 . 8 ) ; 2 . 535 ( 6 . 1 ) ; 2 . 529 ( 8 . 7 ) ; 2 . 523 ( 7 . 6 ) ;  
 2 . 517 ( 3 . 3 ) ; 2 . 507 ( 3 . 1 ) ; 2 . 498 ( 3 . 6 ) ; 2 . 493 ( 2 . 5 ) ; 2 . 482 ( 6 . 0  
 ) ; 2 . 475 ( 2 . 6 ) ; 2 . 466 ( 3 . 4 ) ; 2 . 457 ( 3 . 5 ) ; 2 . 441 ( 1 . 6 ) ; 1 . 246  
 ( 0 . 6 ) ; 1 . 238 ( 1 . 6 ) ; 1 . 220 ( 5 . 1 ) ; 1 . 210 ( 12 . 9 ) ; 1 . 202 ( 7 . 0 ) ;  
 1 . 194 ( 4 . 8 ) ; 1 . 184 ( 14 . 4 ) ; 1 . 176 ( 10 . 9 ) ; 1 . 168 ( 12 . 6 ) ; 1 . 158 ( 1  
 0 . 7 ) ; 1 . 152 ( 15 . 7 ) ; 1 . 141 ( 5 . 6 ) ; 1 . 124 ( 1 . 4 ) ; 1 . 109 ( 0 . 4 ) ; 0  
 . 023 ( 10 . 1 ) ; 0 . 012 ( 0 . 4 )

10

実施例V . 45 :  $^1\text{H}$  - NMR ( 300 . 2 MHz ,  $\text{CDCl}_3$  ) :

= 7 . 806 ( 3 . 4 ) ; 7 . 778 ( 3 . 7 ) ; 7 . 432 ( 0 . 9 ) ; 7 . 422 ( 7 . 3 ) ; 7 . 414  
 ( 2 . 4 ) ; 7 . 399 ( 2 . 7 ) ; 7 . 392 ( 9 . 2 ) ; 7 . 381 ( 1 . 0 ) ; 7 . 297 ( 1 . 4 ) ; 7  
 . 213 ( 0 . 6 ) ; 7 . 191 ( 1 . 3 ) ; 7 . 181 ( 9 . 6 ) ; 7 . 173 ( 2 . 8 ) ; 7 . 158 ( 2 . 5  
 ) ; 7 . 151 ( 7 . 3 ) ; 7 . 143 ( 4 . 5 ) ; 7 . 115 ( 3 . 7 ) ; 6 . 805 ( 0 . 7 ) ; 6 . 775  
 ( 0 . 6 ) ; 2 . 902 ( 1 . 7 ) ; 2 . 878 ( 5 . 3 ) ; 2 . 854 ( 5 . 5 ) ; 2 . 830 ( 1 . 9 ) ; 1  
 . 388 ( 0 . 5 ) ; 1 . 363 ( 0 . 8 ) ; 1 . 337 ( 0 . 4 ) ; 1 . 297 ( 0 . 4 ) ; 1 . 259 ( 8 . 1  
 ) ; 1 . 235 ( 16 . 0 ) ; 1 . 211 ( 7 . 6 ) ; 0 . 911 ( 0 . 4 ) ; 0 . 031 ( 1 . 3 )

20

実施例V . 46 :  $^1\text{H}$  - NMR ( 300 . 2 MHz ,  $\text{CDCl}_3$  ) :

= 7 . 814 ( 3 . 5 ) ; 7 . 785 ( 3 . 8 ) ; 7 . 433 ( 0 . 7 ) ; 7 . 423 ( 7 . 5 ) ; 7 . 415  
 ( 2 . 6 ) ; 7 . 400 ( 2 . 8 ) ; 7 . 393 ( 9 . 2 ) ; 7 . 382 ( 1 . 0 ) ; 7 . 302 ( 1 . 1 ) ; 7  
 . 210 ( 0 . 4 ) ; 7 . 194 ( 1 . 1 ) ; 7 . 184 ( 9 . 7 ) ; 7 . 176 ( 2 . 8 ) ; 7 . 161 ( 2 . 6  
 ) ; 7 . 154 ( 7 . 3 ) ; 7 . 144 ( 4 . 7 ) ; 7 . 116 ( 3 . 8 ) ; 6 . 806 ( 0 . 4 ) ; 6 . 776  
 ( 0 . 3 ) ; 2 . 855 ( 3 . 5 ) ; 2 . 831 ( 7 . 0 ) ; 2 . 807 ( 3 . 9 ) ; 1 . 827 ( 0 . 8 ) ; 1  
 . 802 ( 2 . 9 ) ; 1 . 778 ( 5 . 4 ) ; 1 . 753 ( 5 . 3 ) ; 1 . 729 ( 2 . 8 ) ; 1 . 705 ( 0 . 7  
 ) ; 1 . 689 ( 0 . 8 ) ; 1 . 044 ( 8 . 2 ) ; 1 . 019 ( 16 . 0 ) ; 0 . 994 ( 7 . 3 ) ; 0 . 034  
 ( 1 . 0 )

30

実施例V . 47 :  $^1\text{H}$  - NMR ( 300 . 2 MHz ,  $\text{CDCl}_3$  ) :

= 7 . 816 ( 1 . 8 ) ; 7 . 788 ( 2 . 0 ) ; 7 . 441 ( 0 . 4 ) ; 7 . 431 ( 3 . 7 ) ; 7 . 423  
 ( 1 . 2 ) ; 7 . 408 ( 1 . 4 ) ; 7 . 401 ( 4 . 6 ) ; 7 . 390 ( 0 . 5 ) ; 7 . 302 ( 1 . 0 ) ; 7  
 . 199 ( 0 . 6 ) ; 7 . 188 ( 4 . 7 ) ; 7 . 181 ( 1 . 4 ) ; 7 . 166 ( 1 . 3 ) ; 7 . 159 ( 3 . 6  
 ) ; 7 . 148 ( 2 . 4 ) ; 7 . 119 ( 1 . 9 ) ; 2 . 760 ( 3 . 6 ) ; 2 . 737 ( 3 . 9 ) ; 2 . 337  
 ( 0 . 4 ) ; 2 . 314 ( 0 . 9 ) ; 2 . 292 ( 1 . 1 ) ; 2 . 270 ( 0 . 9 ) ; 2 . 247 ( 0 . 5 ) ; 1  
 . 625 ( 1 . 5 ) ; 1 . 039 ( 16 . 0 ) ; 1 . 017 ( 15 . 5 ) ; 0 . 989 ( 0 . 5 ) ; 0 . 967 ( 0 .  
 4 ) ; 0 . 038 ( 0 . 9 )

40

実施例V . 48 :  $^1\text{H}$  - NMR ( 300 . 2 MHz ,  $\text{CDCl}_3$  ) :

= 7 . 812 ( 3 . 3 ) ; 7 . 784 ( 3 . 6 ) ; 7 . 678 ( 0 . 4 ) ; 7 . 652 ( 0 . 4 ) ; 7 . 449  
 ( 0 . 7 ) ; 7 . 438 ( 7 . 2 ) ; 7 . 431 ( 2 . 4 ) ; 7 . 416 ( 3 . 0 ) ; 7 . 408 ( 8 . 9 ) ; 7  
 . 398 ( 1 . 1 ) ; 7 . 391 ( 0 . 6 ) ; 7 . 301 ( 24 . 8 ) ; 7 . 248 ( 1 . 2 ) ; 7 . 240 ( 0 . 4  
 ) ; 7 . 225 ( 0 . 5 ) ; 7 . 218 ( 1 . 4 ) ; 7 . 203 ( 1 . 1 ) ; 7 . 192 ( 9 . 2 ) ; 7 . 184  
 ( 2 . 6 ) ; 7 . 169 ( 2 . 5 ) ; 7 . 162 ( 7 . 0 ) ; 7 . 152 ( 4 . 4 ) ; 7 . 124 ( 3 . 6 ) ; 6  
 . 821 ( 1 . 5 ) ; 6 . 814 ( 0 . 4 ) ; 6 . 799 ( 0 . 4 ) ; 6 . 791 ( 1 . 2 ) ; 4 . 802 ( 0 . 7  
 ) ; 2 . 948 ( 0 . 4 ) ; 2 . 922 ( 0 . 5 ) ; 2 . 895 ( 0 . 5 ) ; 2 . 878 ( 3 . 3 ) ; 2 . 854

50

(6.1) ; 2.829 (3.6) ; 1.771 (1.2) ; 1.747 (3.0) ; 1.722 (3.7) ; 1.697 (2.7) ; 1.672 (1.2) ; 1.592 (17.5) ; 1.488 (0.7) ; 1.464 (2.2) ; 1.439 (3.2) ; 1.413 (3.3) ; 1.389 (2.2) ; 1.365 (0.8) ; 1.307 (1.2) ; 1.013 (1.0) ; 1.001 (8.2) ; 0.989 (2.2) ; 0.976 (16.0) ; 0.965 (1.2) ; 0.952 (6.6) ; 0.922 (1.3) ; 0.899 (0.5) ; 0.110 (2.8) ; 0.051 (0.9) ; 0.040 (26.0) ; 0.029 (1.0)

【 0 2 5 9 】

实施例VI.01:  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 7.879 (3.4) ; 7.851 (3.7) ; 7.460 (0.8) ; 7.449 (7.5) ; 7.442 (2.6) ; 7.427 (2.9) ; 7.419 (9.5) ; 7.409 (1.2) ; 7.300 (21.9) ; 7.246 (0.6) ; 7.216 (1.1) ; 7.210 (5.0) ; 7.199 (9.8) ; 7.192 (3.2) ; 7.180 (4.3) ; 7.177 (3.8) ; 7.169 (7.6) ; 7.158 (0.8) ; 6.819 (0.7) ; 6.790 (0.6) ; 4.798 (0.8) ; 4.509 (16.0) ; 2.616 (0.5) ; 1.587 (40.4) ; 1.347 (0.5) ; 1.306 (2.2) ; 0.942 (0.8) ; 0.921 (2.5) ; 0.897 (0.9) ; 0.108 (1.6) ; 0.049 (0.8) ; 0.039 (26.1) ; 0.028 (1.1)

10

实施例VI.03:  $^1\text{H}$ -NMR (299.9 MHz,  $d_6$ -DMSO) :

= 8.367 (4.1) ; 8.338 (4.3) ; 7.511 (1.7) ; 7.505 (0.8) ; 7.486 (3.3) ; 7.465 (1.2) ; 7.459 (2.8) ; 7.451 (0.5) ; 7.336 (0.7) ; 7.332 (1.4) ; 7.328 (0.9) ; 7.307 (2.0) ; 7.302 (0.7) ; 7.286 (0.5) ; 7.283 (0.8) ; 7.279 (0.5) ; 7.244 (2.9) ; 7.240 (3.8) ; 7.233 (1.1) ; 7.218 (1.7) ; 7.215 (2.9) ; 7.212 (2.5) ; 7.171 (4.2) ; 7.142 (4.1) ; 5.077 (16.0) ; 3.318 (33.7) ; 2.513 (4.2) ; 2.507 (9.0) ; 2.501 (12.4) ; 2.495 (9.1) ; 2.489 (4.4) ; 0.000 (4.6)

20

实施例VI.04:  $^1\text{H}$ -NMR (399.8 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.091 (3.3) ; 8.090 (3.9) ; 8.069 (4.0) ; 7.417 (0.7) ; 7.409 (5.3) ; 7.404 (1.9) ; 7.392 (2.8) ; 7.387 (5.6) ; 7.381 (0.9) ; 7.379 (0.9) ; 7.262 (6.3) ; 7.260 (7.5) ; 7.135 (0.9) ; 7.128 (6.2) ; 7.122 (2.2) ; 7.110 (2.6) ; 7.106 (4.9) ; 7.100 (0.8) ; 6.937 (4.0) ; 6.918 (3.4) ; 6.916 (3.9) ; 4.761 (13.8) ; 4.759 (16.0) ; 2.693 (0.7) ; 1.575 (1.1) ; 0.001 (6.9) ; 0.000 (7.6)

30

实施例VI.05:  $^1\text{H}$ -NMR (299.9 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.504 (5.4) ; 7.484 (0.4) ; 7.476 (1.7) ; 7.470 (0.8) ; 7.451 (3.5) ; 7.430 (1.2) ; 7.424 (2.9) ; 7.416 (0.5) ; 7.313 (1.4) ; 7.309 (0.9) ; 7.288 (2.1) ; 7.259 (5.4) ; 7.162 (2.9) ; 7.158 (3.8) ; 7.152 (1.1) ; 7.133 (2.9) ; 7.003 (5.7) ; 4.662 (0.3) ; 4.650 (16.0) ; 1.546 (2.7) ; 0.000 (5.4)

实施例VI.06:  $^1\text{H}$ -NMR (299.9 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.473 (6.4) ; 7.428 (0.6) ; 7.417 (4.5) ; 7.411 (1.7) ; 7.395 (1.8) ; 7.388 (5.9) ; 7.377 (0.6) ; 7.260 (12.9) ; 7.120 (0.7) ; 7.109 (5.6) ; 7.102 (1.9) ; 7.086 (1.6) ; 7.079 (4.9) ; 7.069 (0.5) ; 7.037 (6.7) ; 4.646 (16.0) ; 1.543 (12.4) ; 1.254 (0.4) ; 0.010 (0.7) ; 0.009 (0.7) ; 0.000 (12.0) ; -0.011 (0.4)

40

实施例VI.07:  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.111 (0.7) ; 8.092 (3.8) ; 8.083 (0.8) ; 8.064 (4.0) ; 7.512 (3.5) ; 7.483 (4.0) ; 7.323 (3.2) ; 7.315 (3.5) ; 7.265 (2.2) ; 7.084 (2.3) ; 7.075 (2.1) ; 7.054 (2.0) ; 7.045 (1.9) ; 6.983 (0.8) ; 6.976 (4.1) ; 6.955 (0.8) ; 6.948 (3.9) ; 4.760 (2.6) ; 4.569 (16.0) ; 4.559 (0.3) ; 4.542 (0.5) ; 2.045 (0.9) ; 1.259 (0.7) ; 0.074 (1.1) ; 0.000 (1.1)

50

实施例VI.08:  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ):

= 8.110 (3.7); 8.081 (3.9); 7.608 (0.5); 7.305 (1.9); 7.274 (4.5); 7.263 (78.5); 7.232 (1.2); 7.221 (6.8); 7.213 (1.8); 7.198 (1.4); 7.191 (3.1); 6.963 (4.0); 6.935 (3.9); 6.911 (0.4); 4.767 (16.0); 4.723 (0.6); 3.678 (0.3); 1.569 (243.3); 1.456 (0.4); 1.336 (0.4); 1.300 (0.5); 1.253 (1.6); 0.882 (0.6); 0.195 (0.4); 0.081 (0.9); 0.069 (26.9); 0.057 (1.4); 0.011 (2.6); 0.000 (76.2); -0.011 (3.7)

实施例VI.09:  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ):

= 8.409 (0.5); 8.381 (0.6); 8.094 (3.8); 8.065 (4.2); 8.039 (0.5); 7.263 (21.4); 7.139 (14.5); 7.133 (2.7); 7.120 (7.1); 7.117 (7.4); 7.087 (0.4); 6.975 (1.3); 6.954 (2.1); 6.921 (4.9); 6.897 (2.5); 6.893 (4.2); 6.864 (0.5); 6.836 (0.4); 6.665 (0.6); 6.638 (0.5); 4.852 (2.1); 4.767 (16.0); 2.694 (2.6); 1.571 (75.5); 1.306 (0.9); 1.266 (5.7); 0.904 (2.0); 0.882 (6.1); 0.859 (2.4); 0.070 (1.8); 0.011 (0.7); 0.000 (20.9); -0.011 (1.1)

10

实施例VI.10:  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ):

= 8.381 (7.3); 7.494 (0.5); 7.483 (4.7); 7.476 (1.5); 7.461 (1.7); 7.454 (5.8); 7.443 (0.6); 7.300 (15.7); 7.209 (0.7); 7.198 (5.8); 7.191 (1.8); 7.176 (1.5); 7.169 (4.6); 7.158 (0.4); 5.339 (0.6); 4.954 (16.0); 3.371 (0.4); 1.580 (7.4); 0.108 (5.5); 0.049 (0.6); 0.039 (16.3); 0.028 (0.6)

20

实施例VI.11:  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ):

= 8.035 (2.7); 8.007 (2.9); 7.420 (0.6); 7.409 (5.8); 7.402 (2.0); 7.387 (2.4); 7.379 (7.3); 7.369 (1.0); 7.262 (14.2); 7.173 (1.4); 7.162 (7.0); 7.155 (2.2); 7.140 (2.1); 7.132 (5.4); 7.121 (0.7); 7.093 (2.7); 7.065 (2.6); 7.049 (2.2); 6.903 (0.4); 6.868 (4.1); 6.687 (2.1); 4.569 (16.0); 4.322 (1.6); 3.500 (0.6); 1.558 (39.3); 1.260 (0.8); 0.882 (0.7); 0.070 (7.3); 0.058 (0.4); 0.011 (0.7); 0.000 (17.8); -0.011 (0.9)

30

实施例VI.12:  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ):

= 8.421 (3.7); 8.393 (3.8); 7.413 (0.5); 7.403 (4.8); 7.396 (1.9); 7.380 (2.0); 7.373 (6.4); 7.363 (0.9); 7.342 (0.5); 7.262 (9.5); 7.153 (0.5); 7.142 (0.9); 7.132 (6.0); 7.125 (2.2); 7.109 (1.9); 7.102 (4.9); 7.091 (0.6); 6.925 (3.5); 6.897 (3.3); 6.807 (0.4); 4.722 (0.3); 4.713 (0.3); 4.668 (16.0); 3.916 (0.5); 3.896 (0.9); 3.214 (2.9); 2.617 (0.8); 1.550 (6.0); 1.306 (0.5); 1.266 (3.1); 0.903 (1.1); 0.882 (3.4); 0.858 (1.3); 0.070 (2.1); 0.011 (0.4); 0.000 (10.9); -0.011 (0.5)

40

实施例VI.13:  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ):

= 8.100 (2.8); 8.072 (3.0); 7.262 (6.1); 7.149 (2.2); 7.120 (2.7); 7.023 (2.2); 7.013 (2.5); 6.936 (3.1); 6.908 (3.0); 6.886 (1.6); 6.876 (1.5); 6.856 (1.3); 6.847 (1.3); 4.775 (11.9); 3.835 (16.0); 2.690 (0.6); 1.563 (11.7); 1.266 (0.7); 1.260 (0.7); 0.882 (0.8); 0.000 (6.6)

实施例VI.14:  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ):

= 8.540 (4.2); 8.518 (0.5); 7.489 (0.5); 7.478 (5.3); 7.470 (1.9); 7.455 (2.0); 7.448 (6.5); 7.438 (1.2); 7.376 (4.6); 7.329 (0.5); 7.300 (25.9); 7.186 (0.7); 7.176 (6.5); 7.168 (2.0)

50

) ; 7.161 (0.9) ; 7.153 (2.0) ; 7.146 (5.1) ; 7.135 (0.7) ; 7.131 (0.6) ; 5.504 (0.4) ; 4.365 (16.0) ; 2.636 (1.6) ; 1.584 (37.7) ; 1.294 (0.4) ; 0.109 (2.6) ; 0.050 (1.0) ; 0.039 (28.1) ; 0.028 (1.2)

実施例VI.15 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.759 (0.6) ; 8.540 (4.4) ; 8.517 (0.7) ; 7.638 (0.7) ; 7.633 (1.2) ; 7.627 (5.8) ; 7.620 (2.1) ; 7.617 (1.4) ; 7.610 (0.9) ; 7.604 (2.5) ; 7.597 (6.3) ; 7.587 (1.6) ; 7.398 (0.7) ; 7.377 (4.8) ; 7.330 (0.7) ; 7.300 (7.5) ; 7.133 (0.9) ; 7.130 (1.2) ; 7.123 (6.5) ; 7.115 (2.0) ; 7.108 (1.5) ; 7.100 (2.6) ; 7.093 (5.6) ; 7.082 (0.8) ; 7.079 (1.0) ; 6.454 (1.2) ; 4.366 (16.0) ; 2.636 (2.7) ; 1.587 (4.6) ; 1.306 (1.6) ; 0.943 (0.6) ; 0.921 (1.8) ; 0.898 (0.7) ; 0.110 (0.7) ; 0.039 (6.9)

実施例VI.16 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.150 (3.8) ; 8.122 (4.0) ; 7.646 (2.9) ; 7.618 (3.3) ; 7.320 (3.7) ; 7.300 (17.0) ; 7.292 (3.4) ; 7.014 (4.0) ; 6.986 (3.8) ; 6.916 (1.4) ; 6.728 (2.9) ; 6.540 (1.5) ; 4.803 (16.0) ; 4.197 (0.4) ; 4.173 (1.3) ; 4.149 (1.3) ; 4.126 (0.5) ; 2.739 (1.2) ; 2.085 (5.9) ; 1.581 (7.3) ; 1.322 (1.6) ; 1.299 (3.2) ; 1.275 (1.5) ; 0.108 (1.3) ; 0.049 (0.5) ; 0.039 (16.8) ; 0.028 (0.6)

実施例VI.17 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.131 (1.1) ; 8.103 (1.2) ; 7.646 (1.0) ; 7.618 (1.2) ; 7.324 (1.3) ; 7.300 (8.7) ; 7.007 (1.2) ; 6.979 (1.1) ; 6.917 (0.5) ; 6.728 (0.9) ; 6.540 (0.5) ; 4.615 (4.6) ; 4.588 (0.4) ; 2.740 (0.8) ; 2.085 (0.9) ; 1.580 (3.7) ; 1.370 (1.2) ; 1.346 (2.7) ; 1.306 (15.9) ; 0.943 (5.6) ; 0.922 (16.0) ; 0.898 (6.3) ; 0.109 (0.6) ; 0.050 (0.4) ; 0.039 (8.0) ; 0.029 (0.4)

実施例VI.18 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 7.599 (0.5) ; 7.570 (0.6) ; 7.300 (5.0) ; 7.151 (0.6) ; 7.121 (0.5) ; 4.337 (1.2) ; 2.086 (0.5) ; 1.579 (2.4) ; 1.370 (0.9) ; 1.347 (2.1) ; 1.307 (13.6) ; 0.944 (5.0) ; 0.922 (16.0) ; 0.899 (5.9) ; 0.040 (5.0)

実施例VI.19 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 7.972 (0.4) ; 7.944 (0.4) ; 7.881 (3.4) ; 7.852 (3.7) ; 7.609 (0.9) ; 7.599 (8.7) ; 7.591 (2.7) ; 7.576 (3.1) ; 7.569 (9.6) ; 7.558 (1.2) ; 7.358 (0.3) ; 7.300 (29.3) ; 7.212 (3.9) ; 7.183 (4.1) ; 7.158 (1.4) ; 7.153 (2.2) ; 7.147 (9.3) ; 7.140 (2.8) ; 7.125 (3.3) ; 7.118 (7.6) ; 7.107 (0.8) ; 6.777 (0.3) ; 4.511 (16.0) ; 4.301 (2.0) ; 3.948 (0.4) ; 3.303 (1.5) ; 2.617 (0.4) ; 1.588 (24.4) ; 1.367 (0.4) ; 1.344 (0.9) ; 1.305 (5.0) ; 0.942 (1.8) ; 0.920 (5.8) ; 0.897 (2.1) ; 0.108 (2.5) ; 0.049 (1.0) ; 0.038 (29.1) ; 0.027 (1.1)

実施例VI.20 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.521 (3.8) ; 8.493 (4.8) ; 8.490 (4.6) ; 8.462 (3.9) ; 8.453 (0.7) ; 8.425 (0.7) ; 7.477 (1.1) ; 7.466 (10.0) ; 7.458 (3.3) ; 7.443 (3.7) ; 7.436 (12.2) ; 7.425 (1.6) ; 7.300 (40.9) ; 7.284 (0.5) ; 7.276 (1.0) ; 7.251 (0.8) ; 7.229 (0.3) ; 7.221 (1.0) ; 7.178 (1.5) ; 7.167 (12.2) ; 7.160 (3.8) ; 7.144 (3.3) ; 7.137 (9.6) ; 7.126 (1.0) ; 6.984 (4.3) ; 6.978 (4.9) ; 6.956 (4.4) ; 6.950 (4.9) ; 6.922 (1.0) ; 6.914 (0.4) ; 6.892 (0.8) ; 6.729 (0.7) ; 6.7

00 (0.6) ; 4.876 (3.1) ; 4.729 (16.0) ; 4.719 (16.0) ; 4.416 (0.4)  
; 4.410 (0.4) ; 2.665 (0.5) ; 2.649 (0.6) ; 1.581 (19.3) ; 1.369 (0.5)  
; 1.347 (0.9) ; 1.306 (5.0) ; 0.943 (1.8) ; 0.921 (5.7) ; 0.898 (2.1)  
; 0.120 (0.5) ; 0.108 (12.2) ; 0.096 (0.5) ; 0.050 (1.7)  
; 0.039 (44.7) ; 0.028 (1.7)

实施例VI.21:  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.573 (0.5) ; 8.490 (4.7) ; 7.397 (5.0) ; 7.363 (2.3) ; 7.334 (4.1)  
; 7.300 (5.5) ; 7.269 (1.0) ; 7.258 (7.4) ; 7.250 (1.9) ; 7.235 (1.5)  
; 7.228 (3.9) ; 7.217 (0.4) ; 7.159 (0.6) ; 6.870 (0.5) ; 6.839 (0.4)  
; 4.586 (1.8) ; 4.554 (16.0) ; 4.091 (2.8) ; 3.898 (0.7) ; 3.309 (2.1)  
; 2.640 (0.6) ; 1.605 (3.4) ; 1.305 (0.9) ; 0.920 (1.0) ; 0.897 (0.4)  
; 0.110 (0.9) ; 0.038 (5.4)

实施例VI.22:  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.484 (3.0) ; 7.785 (2.2) ; 7.756 (2.6) ; 7.427 (3.3) ; 7.354 (2.4)  
; 7.326 (2.2) ; 7.300 (8.2) ; 5.339 (0.4) ; 4.586 (0.9) ; 4.556 (10.7)  
; 4.090 (1.5) ; 3.314 (0.7) ; 2.646 (1.0) ; 1.600 (16.0) ; 1.346 (0.4)  
; 1.305 (2.1) ; 0.942 (0.8) ; 0.920 (2.4) ; 0.897 (0.9) ; 0.108 (1.6)  
; 0.038 (7.6)

实施例VI.23:  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.573 (0.4) ; 8.482 (3.4) ; 7.637 (0.4) ; 7.626 (4.2) ; 7.619 (1.4)  
; 7.604 (1.4) ; 7.597 (4.6) ; 7.587 (0.6) ; 7.378 (3.8) ; 7.356 (0.5)  
; 7.300 (8.1) ; 7.159 (0.4) ; 7.128 (0.5) ; 7.117 (4.7) ; 7.110 (1.4)  
; 7.095 (1.3) ; 7.088 (4.0) ; 7.078 (0.5) ; 6.775 (0.5) ; 6.745 (0.5)  
; 4.921 (0.4) ; 4.586 (1.4) ; 4.552 (12.1) ; 4.090 (2.1) ; 2.636 (0.6)  
; 1.602 (16.0) ; 1.304 (0.9) ; 0.942 (0.3) ; 0.920 (1.0) ; 0.897 (0.4)  
; 0.108 (1.5) ; 0.038 (7.5)

实施例VI.24:  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $d_6$ -DMSO) :

= 8.911 (0.8) ; 8.894 (5.3) ; 8.866 (0.4) ; 8.833 (1.0) ; 7.913 (0.4)  
; 7.898 (0.7) ; 7.834 (5.6) ; 7.813 (1.2) ; 7.758 (1.3) ; 7.746 (2.3)  
; 7.738 (2.5) ; 7.729 (0.7) ; 7.719 (0.7) ; 7.712 (2.3) ; 7.704 (2.4)  
; 7.695 (0.5) ; 7.564 (1.6) ; 7.555 (0.6) ; 7.548 (0.5) ; 7.535 (3.5)  
; 7.526 (0.6) ; 7.519 (0.9) ; 7.507 (2.7) ; 7.491 (0.6) ; 7.454 (2.2)  
; 7.450 (2.3) ; 7.446 (2.4) ; 7.442 (2.0) ; 7.434 (0.6) ; 7.425 (1.2)  
; 7.421 (1.4) ; 7.417 (1.3) ; 7.413 (1.2) ; 5.815 (0.7) ; 5.777 (3.6)  
; 4.986 (16.0) ; 2.641 (5.2) ; 2.537 (0.6) ; 2.531 (1.1) ; 2.525 (1.5)  
; 2.519 (1.1) ; 2.513 (0.5) ; 1.265 (0.5) ; 0.876 (0.5) ; 0.019 (1.9)

实施例VI.25:  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $d_6$ -DMSO) :

= 8.858 (5.1) ; 8.833 (2.8) ; 7.843 (5.4) ; 7.760 (3.0) ; 7.747 (2.1)  
; 7.740 (3.1) ; 7.732 (1.3) ; 7.713 (2.0) ; 7.705 (3.0) ; 7.697 (1.2)  
; 7.558 (1.5) ; 7.549 (0.9) ; 7.529 (3.4) ; 7.520 (2.0) ; 7.511 (0.4)  
; 7.501 (2.6) ; 7.492 (1.5) ; 7.454 (2.0) ; 7.449 (2.2) ; 7.446 (2.7)  
; 7.442 (2.5) ; 7.435 (1.0) ; 7.425 (1.1) ; 7.420 (1.3) ; 7.417 (1.5)  
; 7.413 (1.5) ; 7.406 (0.6) ; 5.778 (3.2) ; 5.188 (0.5) ; 5.171 (16.0)  
; 4.031 (0.4) ; 4.025 (0.4) ; 3.348 (3.6) ; 3.203 (1.5) ; 2.641 (13.6)  
; 2.537 (0.8) ; 2.531 (1.6) ; 2.525 (2.2) ; 2.519 (1.6) ; 2.513 (0.8)  
; 2.011 (0.4) ; 1.266 (1.1) ; 0.900 (0.3) ; 0.878 (1.1) ; 0.855 (0.4)  
; 0.020 (2.5)

实施例VI.26:  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $d_6$ -DMSO) :

= 9.951 (0.5) ; 8.972 (0.6) ; 8.870 (4.9) ; 7.732 (8.2) ; 7.704

10

20

30

40

50

(3.7) ; 7.445 (4.1) ; 7.416 (3.5) ; 7.388 (0.9) ; 7.298 (1.4) ; 7.111 (3.1) ; 6.926 (1.5) ; 5.190 (2.3) ; 5.166 (16.0) ; 4.031 (3.2) ; 3.351 (2.7) ; 3.213 (0.3) ; 2.641 (1.0) ; 2.537 (0.5) ; 2.531 (1.0) ; 2.525 (1.4) ; 2.519 (1.0) ; 2.513 (0.5) ; 0.021 (1.7)

实施例VI.27:  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{d}_6$ -DMSO) :

= 8.906 (5.4) ; 8.845 (1.1) ; 7.829 (0.8) ; 7.781 (0.5) ; 7.733 (3.8) ; 7.721 (7.0) ; 7.705 (4.4) ; 7.650 (1.2) ; 7.470 (0.5) ; 7.451 (4.6) ; 7.423 (3.8) ; 7.408 (0.9) ; 7.298 (1.6) ; 7.112 (3.5) ; 6.926 (1.7) ; 5.777 (0.8) ; 4.976 (16.0) ; 3.375 (0.8) ; 2.641 (5.2) ; 2.537 (0.4) ; 2.531 (0.9) ; 2.525 (1.2) ; 2.519 (0.9) ; 2.513 (0.4) ; 0.021 (1.4)

实施例VI.28:  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 7.917 (3.4) ; 7.889 (3.8) ; 7.810 (0.4) ; 7.757 (4.7) ; 7.728 (5.6) ; 7.688 (0.4) ; 7.661 (0.4) ; 7.386 (5.0) ; 7.358 (4.4) ; 7.300 (36.4) ; 7.276 (4.0) ; 7.248 (3.9) ; 7.233 (0.4) ; 7.219 (0.4) ; 4.516 (16.0) ; 4.506 (1.7) ; 4.308 (1.3) ; 3.312 (0.4) ; 2.628 (1.0) ; 1.585 (41.2) ; 1.345 (0.4) ; 1.307 (1.9) ; 0.943 (0.6) ; 0.921 (2.0) ; 0.898 (0.8) ; 0.108 (8.4) ; 0.096 (0.3) ; 0.049 (1.2) ; 0.039 (37.1) ; 0.028 (1.3)

实施例VI.29:  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 7.931 (3.5) ; 7.902 (4.0) ; 7.886 (7.3) ; 7.879 (2.3) ; 7.863 (2.4) ; 7.856 (8.1) ; 7.845 (1.3) ; 7.837 (0.9) ; 7.810 (1.0) ; 7.688 (1.1) ; 7.661 (0.9) ; 7.646 (0.3) ; 7.378 (4.5) ; 7.348 (4.0) ; 7.300 (41.0) ; 7.269 (3.9) ; 7.239 (0.4) ; 4.517 (16.0) ; 4.506 (4.3) ; 4.309 (1.2) ; 4.301 (0.4) ; 3.314 (0.5) ; 2.631 (1.4) ; 1.585 (43.2) ; 1.346 (1.3) ; 1.306 (7.3) ; 0.943 (2.6) ; 0.921 (8.6) ; 0.898 (3.1) ; 0.108 (8.3) ; 0.050 (1.3) ; 0.039 (39.4) ; 0.028 (1.4)

实施例VI.30:  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.148 (0.4) ; 8.135 (3.7) ; 8.120 (0.4) ; 8.106 (4.0) ; 7.862 (0.4) ; 7.851 (3.8) ; 7.844 (1.2) ; 7.827 (1.5) ; 7.820 (4.1) ; 7.810 (0.6) ; 7.300 (2.3) ; 7.269 (2.2) ; 7.263 (5.6) ; 7.051 (0.5) ; 7.031 (3.9) ; 7.022 (0.4) ; 7.003 (3.7) ; 6.865 (0.7) ; 4.803 (0.9) ; 4.787 (0.4) ; 4.765 (16.0) ; 4.724 (0.7) ; 2.708 (0.6) ; 1.572 (8.0) ; 1.266 (0.9) ; 1.260 (0.9) ; 0.903 (0.3) ; 0.882 (1.1) ; 0.858 (0.4) ; 0.000 (4.8)

实施例VI.31:  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 7.939 (3.3) ; 7.911 (3.6) ; 7.816 (0.3) ; 7.702 (0.8) ; 7.697 (0.9) ; 7.690 (0.8) ; 7.677 (1.1) ; 7.671 (1.1) ; 7.573 (0.4) ; 7.548 (1.6) ; 7.524 (1.1) ; 7.400 (3.9) ; 7.372 (3.7) ; 7.355 (0.5) ; 7.343 (0.3) ; 7.327 (0.5) ; 7.312 (0.5) ; 7.300 (44.0) ; 7.149 (0.8) ; 7.139 (1.6) ; 7.133 (2.6) ; 7.129 (8.1) ; 7.120 (1.3) ; 7.105 (7.9) ; 7.100 (2.7) ; 7.095 (2.1) ; 7.084 (0.9) ; 5.340 (2.0) ; 5.028 (3.2) ; 4.517 (16.0) ; 4.302 (1.2) ; 3.772 (3.2) ; 3.433 (15.9) ; 3.300 (0.8) ; 2.619 (1.8) ; 2.617 (1.9) ; 1.594 (22.3) ; 1.293 (0.6) ; 0.108 (5.0) ; 0.049 (1.6) ; 0.038 (48.2) ; 0.027 (1.9)

实施例VI.32:  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 7.982 (3.1) ; 7.954 (3.4) ; 7.406 (0.4) ; 7.394 (3.7) ; 7.379 (0.4) ; 7.365 (3.4) ; 7.300 (30.6) ; 7.149 (0.7) ; 7.139 (1.5) ;



7.133 (2.7) ; 7.129 (7.1) ; 7.121 (0.9) ; 7.105 (7.0) ; 7.100 (2.3)  
 ) ; 7.096 (1.6) ; 7.085 (0.7) ; 6.379 (0.7) ; 6.368 (0.3) ; 4.341  
 (16.0) ; 2.619 (1.3) ; 1.583 (29.3) ; 1.296 (0.4) ; 0.108 (6.3) ;  
 0.049 (1.1) ; 0.039 (32.1) ; 0.027 (1.2)

実施例VI.33 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 7.893 (3.3) ; 7.865 (3.6) ; 7.342 (1.9) ; 7.311 (7.1) ; 7.300  
 (23.1) ; 7.288 (12.0) ; 7.279 (2.3) ; 7.266 (1.5) ; 7.257 (2.8) ;  
 7.230 (3.9) ; 7.202 (3.6) ; 4.513 (16.0) ; 4.305 (0.5) ; 3.306 (0  
 .7) ; 2.619 (0.3) ; 1.580 (9.3) ; 1.479 (0.7) ; 1.306 (0.8) ; 0.9  
 21 (0.7) ; 0.109 (1.1) ; 0.050 (0.7) ; 0.039 (24.0) ; 0.028 (0.9)

実施例VI.34 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 7.925 (3.2) ; 7.924 (3.1) ; 7.897 (3.4) ; 7.895 (3.4) ; 7.460  
 (0.8) ; 7.450 (7.2) ; 7.442 (2.5) ; 7.427 (2.8) ; 7.420 (9.1) ; 7  
 .409 (1.1) ; 7.300 (24.4) ; 7.213 (1.4) ; 7.202 (12.8) ; 7.194 (3.  
 0) ; 7.179 (3.3) ; 7.172 (9.2) ; 7.161 (0.8) ; 4.338 (16.0) ; 1.58  
 2 (18.1) ; 0.050 (1.2) ; 0.039 (26.1) ; 0.028 (1.0)

実施例VI.35 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 7.906 (3.3) ; 7.905 (3.4) ; 7.878 (3.6) ; 7.877 (3.7) ; 7.309  
 (4.4) ; 7.300 (16.0) ; 7.294 (3.2) ; 7.293 (3.2) ; 7.282 (4.1) ;  
 7.281 (4.1) ; 7.269 (1.6) ; 7.264 (3.3) ; 7.259 (2.8) ; 7.247 (4.1  
 ) ; 7.245 (3.9) ; 7.238 (4.0) ; 7.232 (8.9) ; 7.227 (5.7) ; 7.210  
 (0.7) ; 7.203 (0.7) ; 7.187 (0.4) ; 4.512 (16.0) ; 4.299 (1.0) ;  
 3.300 (0.6) ; 2.615 (0.4) ; 1.720 (1.1) ; 1.583 (3.9) ; 1.479 (0.8  
 ) ; 1.322 (0.3) ; 1.294 (0.5) ; 0.109 (3.4) ; 0.050 (0.7) ; 0.039  
 (15.4) ; 0.028 (0.4)

実施例VI.36 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 7.903 (3.4) ; 7.902 (3.4) ; 7.875 (3.7) ; 7.873 (3.6) ; 7.638  
 (4.0) ; 7.609 (4.9) ; 7.348 (5.5) ; 7.319 (4.4) ; 7.302 (2.5) ; 7  
 .240 (3.9) ; 7.239 (3.9) ; 7.212 (3.6) ; 6.915 (2.1) ; 6.727 (4.2  
 ) ; 6.539 (2.1) ; 4.520 (16.0) ; 3.271 (0.5) ; 3.220 (0.3) ; 2.621  
 (0.5) ; 2.619 (0.5) ; 0.039 (2.5)

【0260】

実施例VII.01 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.222 (4.3) ; 8.019 (4.5) ; 7.927 (2.0) ; 7.898 (2.1) ; 7.462  
 (0.4) ; 7.452 (4.1) ; 7.444 (1.5) ; 7.429 (1.5) ; 7.422 (5.4) ; 7  
 .411 (0.6) ; 7.300 (12.6) ; 7.206 (2.3) ; 7.196 (0.7) ; 7.185 (5.3  
 ) ; 7.178 (3.7) ; 7.163 (1.5) ; 7.155 (4.3) ; 7.145 (0.5) ; 5.424  
 (8.1) ; 1.608 (16.0) ; 0.108 (1.3) ; 0.049 (0.5) ; 0.038 (14.8) ;  
 0.028 (0.6)

実施例VII.02 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.578 (5.9) ; 8.245 (6.7) ; 8.032 (6.7) ; 7.496 (0.8) ; 7.485  
 (6.2) ; 7.478 (2.3) ; 7.463 (2.4) ; 7.455 (7.7) ; 7.445 (1.0) ; 7  
 .397 (6.3) ; 7.300 (39.6) ; 7.178 (0.9) ; 7.168 (7.5) ; 7.160 (2.6  
 ) ; 7.145 (2.1) ; 7.138 (6.2) ; 7.127 (0.7) ; 5.499 (16.0) ; 5.340  
 (7.4) ; 1.587 (19.7) ; 0.109 (1.6) ; 0.050 (2.3) ; 0.039 (51.8) ;  
 0.029 (2.6)

実施例VII.03 :  $^1\text{H}$ -NMR (400.1 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.235 (2.1) ; 8.195 (5.7) ; 8.174 (5.8) ; 8.004 (3.3) ; 7.927  
 (0.5) ; 7.906 (0.6) ; 7.523 (5.1) ; 7.518 (0.6) ; 7.501 (5.6) ; 7  
 .374 (0.6) ; 7.354 (0.6) ; 7.328 (5.1) ; 7.321 (5.4) ; 7.309 (0.4

10

20

30

40

50

) ; 7.297 (0.8) ; 7.259 (70.7) ; 7.209 (0.4) ; 7.078 (3.3) ; 7.072 (3.1) ; 7.057 (3.0) ; 7.050 (2.9) ; 6.999 (6.0) ; 6.978 (5.9) ; 5.704 (16.0) ; 5.686 (0.5) ; 5.298 (0.3) ; 4.555 (0.4) ; 2.804 (1.2) ; 2.704 (3.5) ; 2.003 (2.4) ; 1.640 (0.3) ; 1.561 (0.7) ; 1.505 (0.4) ; 1.333 (0.4) ; 1.314 (0.5) ; 1.284 (0.8) ; 1.256 (1.7) ; 0.881 (0.6) ; 0.069 (1.9) ; 0.008 (1.6) ; 0.000 (46.8) ; -0.008 (1.6)

实施例VII.04 :  $^1\text{H}$ -NMR (499.9 MHz,  $d_6$ -DMSO) :

= 8.534 (8.6) ; 8.494 (5.1) ; 8.477 (5.3) ; 8.033 (8.1) ; 7.758 (4.7) ; 7.752 (4.9) ; 7.712 (2.1) ; 7.710 (2.2) ; 7.694 (2.4) ; 7.692 (2.5) ; 7.425 (2.9) ; 7.419 (2.9) ; 7.407 (2.6) ; 7.401 (2.6) ; 7.327 (5.4) ; 7.311 (5.3) ; 5.883 (16.0) ; 3.319 (14.6) ; 2.892 (0.5) ; 2.742 (0.8) ; 2.733 (0.5) ; 2.511 (1.1) ; 2.507 (2.4) ; 2.504 (3.3) ; 2.500 (2.5) ; 2.497 (1.3) ; 1.989 (0.5) ; 0.000 (1.3)

实施例VII.05 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.615 (8.1) ; 8.232 (6.5) ; 8.005 (6.6) ; 7.497 (0.4) ; 7.489 (2.0) ; 7.483 (1.0) ; 7.464 (4.1) ; 7.463 (3.8) ; 7.443 (1.5) ; 7.437 (3.6) ; 7.429 (0.8) ; 7.333 (1.0) ; 7.329 (2.0) ; 7.326 (1.3) ; 7.310 (0.9) ; 7.305 (2.6) ; 7.299 (0.9) ; 7.284 (0.8) ; 7.280 (1.3) ; 7.276 (0.9) ; 7.273 (0.5) ; 7.271 (0.6) ; 7.270 (0.7) ; 7.262 (34.2) ; 7.252 (0.7) ; 7.247 (0.5) ; 7.244 (0.4) ; 7.171 (1.0) ; 7.167 (3.8) ; 7.162 (5.1) ; 7.155 (1.4) ; 7.141 (2.2) ; 7.138 (3.8) ; 7.134 (3.5) ; 7.125 (0.6) ; 7.039 (8.7) ; 5.629 (16.0) ; 5.302 (5.5) ; 1.583 (4.9) ; 1.253 (0.5) ; 0.011 (0.8) ; 0.008 (0.4) ; 0.000 (25.6) ; -0.009 (0.7) ; -0.011 (1.1)

实施例VII.06 :  $^1\text{H}$ -NMR (400.1 MHz,  $d_6$ -DMSO) :

= 8.530 (8.6) ; 8.461 (5.5) ; 8.440 (5.8) ; 8.032 (8.3) ; 7.526 (0.5) ; 7.520 (2.8) ; 7.515 (1.3) ; 7.501 (5.0) ; 7.499 (5.0) ; 7.485 (1.7) ; 7.480 (4.2) ; 7.475 (0.6) ; 7.344 (1.1) ; 7.341 (2.0) ; 7.339 (1.4) ; 7.323 (3.2) ; 7.307 (0.8) ; 7.304 (1.4) ; 7.302 (0.9) ; 7.259 (4.6) ; 7.256 (5.8) ; 7.251 (1.7) ; 7.239 (2.8) ; 7.237 (4.7) ; 7.235 (4.1) ; 7.228 (0.6) ; 7.200 (5.9) ; 7.179 (5.9) ; 5.878 (16.0) ; 3.314 (5.3) ; 2.897 (0.5) ; 2.738 (0.4) ; 2.517 (6.1) ; 2.512 (12.3) ; 2.508 (16.5) ; 2.503 (11.7) ; 2.499 (5.6)

实施例VII.07 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.352 (5.4) ; 8.344 (5.5) ; 8.219 (6.7) ; 8.016 (6.8) ; 7.608 (0.5) ; 7.518 (2.0) ; 7.511 (1.0) ; 7.493 (4.2) ; 7.471 (1.5) ; 7.465 (3.5) ; 7.457 (0.7) ; 7.357 (1.0) ; 7.353 (2.0) ; 7.350 (1.2) ; 7.334 (1.0) ; 7.329 (2.6) ; 7.323 (0.8) ; 7.308 (0.7) ; 7.304 (1.2) ; 7.300 (0.7) ; 7.285 (5.7) ; 7.277 (5.8) ; 7.271 (1.1) ; 7.262 (77.9) ; 7.147 (3.9) ; 7.143 (5.1) ; 7.136 (1.4) ; 7.122 (2.3) ; 7.118 (3.9) ; 7.115 (3.5) ; 7.106 (0.6) ; 6.911 (0.4) ; 5.845 (16.0) ; 1.562 (52.8) ; 1.253 (0.5) ; 0.011 (1.9) ; 0.000 (56.2) ; -0.011 (2.2)

实施例VII.08 :  $^1\text{H}$ -NMR (499.9 MHz,  $d_6$ -DMSO) :

= 8.527 (8.3) ; 8.478 (4.7) ; 8.461 (4.8) ; 8.029 (7.7) ; 7.506 (4.1) ; 7.488 (5.8) ; 7.414 (1.0) ; 7.407 (8.4) ; 7.402 (2.8) ; 7.393 (2.2) ; 7.389 (6.0) ; 7.382 (0.7) ; 7.277 (4.9) ; 7.260 (4.8) ; 5.877 (16.0) ; 3.315 (10.4) ; 2.505 (3.5) ; 2.502 (4.8) ; 2.49

10

20

30

40

50

9 ( 3 . 8 ) ; 0 . 000 ( 1 . 7 )

実施例VII . 09 :  $^1\text{H}$  - NMR ( 400 . 1 MHz ,  $d_6$  - DMSO ) :

= 8 . 530 ( 8 . 8 ) ; 8 . 472 ( 5 . 7 ) ; 8 . 451 ( 5 . 9 ) ; 8 . 032 ( 8 . 6 ) ; 7 . 569 ( 0 . 7 ) ; 7 . 561 ( 7 . 5 ) ; 7 . 555 ( 2 . 5 ) ; 7 . 544 ( 2 . 7 ) ; 7 . 538 ( 9 . 0 ) ; 7 . 530 ( 0 . 9 ) ; 7 . 322 ( 1 . 0 ) ; 7 . 314 ( 9 . 1 ) ; 7 . 308 ( 2 . 8 ) ; 7 . 297 ( 2 . 4 ) ; 7 . 291 ( 7 . 5 ) ; 7 . 283 ( 0 . 7 ) ; 7 . 260 ( 6 . 1 ) ; 7 . 239 ( 6 . 1 ) ; 5 . 878 ( 16 . 0 ) ; 5 . 859 ( 0 . 3 ) ; 3 . 312 ( 7 . 1 ) ; 2 . 897 ( 1 . 1 ) ; 2 . 739 ( 0 . 9 ) ; 2 . 517 ( 7 . 1 ) ; 2 . 512 ( 14 . 4 ) ; 2 . 508 ( 19 . 4 ) ; 2 . 503 ( 13 . 6 ) ; 2 . 499 ( 6 . 3 )

実施例VII . 10 :  $^1\text{H}$  - NMR ( 400 . 1 MHz ,  $d_6$  - DMSO ) :

= 8 . 522 ( 7 . 4 ) ; 8 . 470 ( 4 . 9 ) ; 8 . 449 ( 5 . 2 ) ; 8 . 028 ( 7 . 2 ) ; 7 . 489 ( 2 . 5 ) ; 7 . 488 ( 2 . 5 ) ; 7 . 483 ( 2 . 8 ) ; 7 . 482 ( 2 . 8 ) ; 7 . 379 ( 1 . 4 ) ; 7 . 378 ( 1 . 4 ) ; 7 . 372 ( 1 . 3 ) ; 7 . 371 ( 1 . 3 ) ; 7 . 357 ( 1 . 9 ) ; 7 . 356 ( 1 . 9 ) ; 7 . 351 ( 1 . 8 ) ; 7 . 350 ( 1 . 8 ) ; 7 . 242 ( 5 . 4 ) ; 7 . 230 ( 4 . 5 ) ; 7 . 221 ( 5 . 5 ) ; 7 . 209 ( 3 . 4 ) ; 5 . 877 ( 13 . 2 ) ; 5 . 859 ( 0 . 5 ) ; 3 . 312 ( 6 . 2 ) ; 2 . 897 ( 0 . 4 ) ; 2 . 739 ( 0 . 4 ) ; 2 . 738 ( 0 . 4 ) ; 2 . 530 ( 0 . 4 ) ; 2 . 517 ( 6 . 2 ) ; 2 . 513 ( 12 . 6 ) ; 2 . 508 ( 17 . 3 ) ; 2 . 504 ( 12 . 5 ) ; 2 . 499 ( 6 . 3 ) ; 2 . 108 ( 16 . 0 )

実施例VII . 11 :  $^1\text{H}$  - NMR ( 400 . 1 MHz ,  $d_6$  - DMSO ) :

= 8 . 530 ( 7 . 2 ) ; 8 . 463 ( 4 . 5 ) ; 8 . 442 ( 4 . 7 ) ; 8 . 032 ( 7 . 0 ) ; 7 . 474 ( 2 . 4 ) ; 7 . 452 ( 2 . 8 ) ; 7 . 406 ( 3 . 4 ) ; 7 . 400 ( 3 . 6 ) ; 7 . 240 ( 4 . 9 ) ; 7 . 219 ( 4 . 9 ) ; 7 . 172 ( 2 . 1 ) ; 7 . 166 ( 2 . 1 ) ; 7 . 151 ( 1 . 9 ) ; 7 . 145 ( 1 . 8 ) ; 5 . 877 ( 12 . 9 ) ; 3 . 313 ( 5 . 3 ) ; 2 . 897 ( 0 . 4 ) ; 2 . 738 ( 0 . 3 ) ; 2 . 517 ( 5 . 5 ) ; 2 . 512 ( 11 . 1 ) ; 2 . 508 ( 14 . 9 ) ; 2 . 503 ( 10 . 6 ) ; 2 . 499 ( 5 . 0 ) ; 2 . 366 ( 16 . 0 )

実施例VII . 12 :  $^1\text{H}$  - NMR ( 400 . 1 MHz ,  $d_6$  - DMSO ) :

= 8 . 529 ( 8 . 8 ) ; 8 . 461 ( 5 . 7 ) ; 8 . 440 ( 5 . 9 ) ; 8 . 031 ( 8 . 6 ) ; 7 . 352 ( 0 . 8 ) ; 7 . 345 ( 0 . 6 ) ; 7 . 337 ( 1 . 0 ) ; 7 . 329 ( 6 . 9 ) ; 7 . 325 ( 3 . 2 ) ; 7 . 320 ( 7 . 1 ) ; 7 . 309 ( 11 . 1 ) ; 7 . 307 ( 11 . 1 ) ; 7 . 297 ( 1 . 1 ) ; 7 . 285 ( 0 . 4 ) ; 7 . 222 ( 6 . 1 ) ; 7 . 201 ( 6 . 0 ) ; 5 . 876 ( 16 . 0 ) ; 5 . 856 ( 0 . 4 ) ; 3 . 313 ( 5 . 9 ) ; 2 . 517 ( 6 . 5 ) ; 2 . 512 ( 13 . 1 ) ; 2 . 508 ( 17 . 7 ) ; 2 . 503 ( 12 . 4 ) ; 2 . 499 ( 5 . 8 )

実施例VII . 13 :  $^1\text{H}$  - NMR ( 400 . 1 MHz ,  $d_6$  - DMSO ) :

= 8 . 524 ( 8 . 8 ) ; 8 . 506 ( 5 . 6 ) ; 8 . 485 ( 5 . 8 ) ; 8 . 030 ( 8 . 5 ) ; 7 . 562 ( 1 . 2 ) ; 7 . 555 ( 1 . 3 ) ; 7 . 550 ( 1 . 2 ) ; 7 . 540 ( 1 . 5 ) ; 7 . 535 ( 2 . 5 ) ; 7 . 527 ( 3 . 4 ) ; 7 . 513 ( 3 . 4 ) ; 7 . 505 ( 2 . 3 ) ; 7 . 491 ( 1 . 2 ) ; 7 . 379 ( 6 . 0 ) ; 7 . 358 ( 5 . 8 ) ; 7 . 242 ( 0 . 8 ) ; 7 . 238 ( 0 . 9 ) ; 7 . 235 ( 0 . 8 ) ; 7 . 231 ( 0 . 8 ) ; 7 . 218 ( 1 . 4 ) ; 7 . 215 ( 1 . 4 ) ; 7 . 212 ( 1 . 3 ) ; 7 . 199 ( 0 . 7 ) ; 7 . 195 ( 0 . 8 ) ; 7 . 192 ( 0 . 7 ) ; 7 . 188 ( 0 . 6 ) ; 5 . 887 ( 16 . 0 ) ; 3 . 313 ( 9 . 6 ) ; 2 . 530 ( 0 . 3 ) ; 2 . 517 ( 7 . 3 ) ; 2 . 512 ( 14 . 7 ) ; 2 . 508 ( 19 . 7 ) ; 2 . 503 ( 13 . 9 ) ; 2 . 499 ( 6 . 5 )

実施例VII . 14 :  $^1\text{H}$  - NMR ( 400 . 1 MHz ,  $d_6$  - DMSO ) :

= 8 . 525 ( 8 . 8 ) ; 8 . 505 ( 6 . 2 ) ; 8 . 484 ( 6 . 4 ) ; 8 . 031 ( 8 . 5 ) ; 7 . 472 ( 1 . 0 ) ; 7 . 468 ( 1 . 1 ) ; 7 . 460 ( 1 . 2 ) ; 7 . 456 ( 1 . 4 ) ; 7 . 452 ( 1 . 9 ) ; 7 . 448 ( 2 . 1 ) ; 7 . 441 ( 3 . 4 ) ; 7 . 436 ( 2 . 9 ) ; 7 . 425 ( 1 . 9 ) ; 7 . 421 ( 3 . 2 ) ; 7 . 416 ( 2 . 1 ) ; 7 . 409 ( 1 . 0 ) ; 7 . 404 ( 1 . 0 ) ; 7 . 396 ( 1 . 0 ) ; 7 . 390 ( 1 . 8 ) ; 7 . 385 ( 1 . 4 ) ; 7 . 378 ( 1 . 8 ) ; 7 . 373 ( 1 . 4 ) ; 7 . 370 ( 1 . 3 ) ; 7 . 362 ( 7 . 0 ) ; 7 . 358 ( 1 . 3 ) ; 7 . 353 ( 1 . 0 ) ; 7 . 341 ( 7 . 3 ) ; 7 . 335 ( 2 . 2 ) ; 7 . 320 ( 2 . 1 ) ; 7 . 316 ( 2 . 1 ) ; 7 . 301 ( 0 . 8 ) ; 7 . 300 ( 0 . 8 ) ; 7 . 297 ( 0 . 8 ) ; 5 . 889 ( 16 . 0 ) ; 5 . 872 ( 0 . 4 ) ; 3 . 315 ( 6 . 3 ) ; 2 . 897 ( 0 . 5 ) ;

10

20

30

40

50

2.739 (0.4) ; 2.738 (0.4) ; 2.530 (0.4) ; 2.526 (0.6) ; 2.517 (6.0)  
) ; 2.513 (12.1) ; 2.508 (16.7) ; 2.504 (12.0) ; 2.499 (6.0) ; 2.4  
63 (0.3)

实施例VII.15:  $^1\text{H}$ -NMR (400.1 MHz,  $\text{d}_6$ -DMSO) :

= 8.537 (8.8) ; 8.494 (6.0) ; 8.472 (6.3) ; 8.035 (8.7) ; 7.500  
(0.6) ; 7.491 (2.9) ; 7.485 (1.0) ; 7.475 (3.0) ; 7.469 (3.0) ; 7  
.460 (1.1) ; 7.454 (2.8) ; 7.445 (0.8) ; 7.436 (0.4) ; 7.317 (6.5  
) ; 7.295 (6.5) ; 5.882 (16.0) ; 5.862 (0.5) ; 3.311 (8.5) ; 2.531  
(0.3) ; 2.517 (7.6) ; 2.513 (16.0) ; 2.508 (22.1) ; 2.504 (16.3)  
; 2.499 (8.3) ; 2.463 (0.5) ; 2.459 (0.4)

10

实施例VII.16:  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.222 (8.9) ; 8.194 (4.8) ; 8.020 (2.0) ; 8.004 (5.5) ; 7.608  
(0.4) ; 7.520 (3.5) ; 7.512 (3.9) ; 7.358 (2.0) ; 7.350 (1.8) ; 7  
.329 (2.9) ; 7.321 (2.8) ; 7.279 (0.4) ; 7.277 (0.4) ; 7.276 (0.4  
) ; 7.273 (0.7) ; 7.262 (62.1) ; 7.250 (1.2) ; 7.247 (0.9) ; 7.246  
(0.8) ; 7.244 (0.8) ; 7.240 (0.6) ; 7.234 (0.5) ; 7.228 (0.4) ; 7  
.200 (4.7) ; 7.171 (3.2) ; 7.054 (4.8) ; 7.025 (4.7) ; 6.911 (0.4  
) ; 5.710 (12.5) ; 2.959 (16.0) ; 2.886 (13.8) ; 2.885 (13.5) ; 1.  
570 (15.1) ; 1.252 (0.4) ; 0.011 (1.8) ; 0.009 (1.1) ; 0.000 (49.7  
) ; -0.010 (1.4) ; -0.011 (1.9) ; -0.018 (0.4)

20

实施例VII.17:  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.231 (3.3) ; 8.222 (2.9) ; 8.194 (2.8) ; 8.091 (0.4) ; 8.082  
(3.2) ; 8.075 (1.2) ; 8.059 (1.1) ; 8.053 (3.4) ; 8.044 (0.6) ; 8  
.019 (0.4) ; 8.008 (3.3) ; 7.299 (0.5) ; 7.290 (3.4) ; 7.283 (1.2  
) ; 7.278 (0.4) ; 7.276 (0.4) ; 7.275 (0.5) ; 7.273 (0.6) ; 7.263  
(33.8) ; 7.252 (1.0) ; 7.031 (2.8) ; 7.002 (2.8) ; 5.719 (7.4) ;  
2.959 (1.3) ; 2.887 (1.1) ; 2.885 (1.1) ; 2.641 (16.0) ; 2.562 (0.  
3) ; 2.048 (0.9) ; 1.567 (8.5) ; 1.261 (0.6) ; 0.011 (0.8) ; 0.007  
(0.5) ; 0.000 (25.4) ; -0.009 (0.8) ; -0.011 (1.1)

30

实施例VII.18:  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.450 (5.1) ; 8.422 (5.4) ; 8.193 (7.8) ; 8.019 (7.8) ; 7.608  
(0.5) ; 7.429 (0.8) ; 7.418 (6.5) ; 7.411 (2.4) ; 7.396 (2.6) ; 7  
.389 (8.3) ; 7.378 (1.2) ; 7.330 (0.4) ; 7.300 (0.5) ; 7.262 (77.9  
) ; 7.230 (0.3) ; 7.152 (1.1) ; 7.141 (7.6) ; 7.134 (2.5) ; 7.119  
(2.3) ; 7.112 (6.4) ; 7.101 (0.6) ; 6.955 (4.7) ; 6.927 (4.6) ; 6  
.911 (0.6) ; 5.568 (16.0) ; 5.302 (0.9) ; 1.554 (49.9) ; 1.340 (0.  
4) ; 1.252 (1.1) ; 0.881 (0.3) ; 0.195 (0.5) ; 0.081 (0.9) ; 0.069  
(25.4) ; 0.057 (1.3) ; 0.026 (0.3) ; 0.011 (2.9) ; 0.000 (87.8) ;  
-0.011 (4.3) ; -0.031 (0.6) ; -0.200 (0.4)

40

实施例VII.19:  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.221 (3.0) ; 8.196 (2.4) ; 8.167 (2.5) ; 8.001 (3.0) ; 7.264  
(6.6) ; 7.157 (1.8) ; 7.127 (2.3) ; 7.031 (1.8) ; 7.022 (2.1) ; 6  
.965 (2.6) ; 6.937 (2.4) ; 6.897 (1.4) ; 6.887 (1.2) ; 6.867 (1.1  
) ; 6.857 (1.0) ; 5.716 (6.8) ; 5.301 (16.0) ; 3.841 (13.1) ; 3.82  
7 (0.7) ; 3.818 (0.5) ; 3.808 (1.2) ; 1.610 (5.6) ; 0.070 (0.4) ;  
0.000 (6.8)

实施例VII.20:  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.233 (10.0) ; 8.205 (3.0) ; 8.201 (5.1) ; 8.005 (7.2) ; 7.865  
(6.9) ; 7.857 (3.0) ; 7.841 (5.6) ; 7.834 (6.7) ; 7.309 (5.6) ; 7  
.278 (5.7) ; 7.266 (5.9) ; 7.053 (5.2) ; 7.025 (4.9) ; 5.718 (16.0

50

) ; 5.305 (6.6) ; 5.301 (12.5) ; 1.662 (6.4) ; 1.258 (0.5) ; 0.003 (3.1) ; 0.000 (5.5)

实施例VII.21:  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.572 (6.1) ; 8.248 (6.8) ; 8.034 (7.0) ; 7.931 (0.6) ; 7.920 (5.9) ; 7.914 (2.2) ; 7.897 (2.0) ; 7.890 (6.7) ; 7.452 (6.4) ; 7.332 (4.0) ; 7.300 (30.7) ; 5.503 (16.0) ; 5.340 (5.5) ; 1.593 (10.7) ; 1.308 (0.5) ; 1.295 (0.6) ; 0.109 (7.2) ; 0.050 (1.3) ; 0.039 (35.7) ; 0.029 (1.7)

实施例VII.22:  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.266 (6.8) ; 8.246 (4.8) ; 8.217 (4.9) ; 8.044 (6.7) ; 7.660 (3.3) ; 7.631 (4.0) ; 7.327 (4.6) ; 7.300 (44.3) ; 7.039 (5.0) ; 7.010 (4.7) ; 6.923 (1.7) ; 6.735 (3.4) ; 6.547 (1.7) ; 5.753 (16.0) ; 5.339 (0.4) ; 1.591 (21.4) ; 1.352 (0.4) ; 1.293 (1.1) ; 0.108 (3.0) ; 0.050 (1.5) ; 0.039 (42.6) ; 0.028 (1.5)

实施例VII.23:  $^1\text{H}$ -NMR (499.9 MHz,  $d_6$ -DMSO) :

= 8.946 (1.3) ; 8.897 (1.3) ; 8.756 (9.9) ; 8.532 (8.7) ; 8.416 (1.2) ; 8.027 (8.2) ; 8.015 (0.3) ; 7.597 (0.7) ; 7.590 (7.0) ; 7.586 (2.5) ; 7.577 (2.7) ; 7.572 (8.6) ; 7.566 (1.2) ; 7.555 (0.6) ; 7.545 (1.1) ; 7.541 (0.5) ; 7.538 (0.4) ; 7.532 (0.5) ; 7.528 (1.2) ; 7.402 (1.0) ; 7.395 (8.5) ; 7.391 (2.8) ; 7.381 (2.5) ; 7.377 (7.2) ; 7.370 (1.9) ; 7.356 (0.6) ; 7.351 (1.1) ; 5.929 (16.0) ; 3.300 (185.7) ; 2.681 (3.9) ; 2.591 (0.4) ; 2.560 (0.4) ; 2.507 (8.9) ; 2.503 (18.2) ; 2.500 (25.1) ; 2.496 (18.7) ; 2.493 (9.8) ; 2.070 (0.8) ; 0.006 (0.3) ; 0.000 (7.5) ; -0.007 (0.5)

实施例VII.24:  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.223 (8.6) ; 8.022 (8.8) ; 7.930 (3.9) ; 7.902 (4.2) ; 7.646 (0.6) ; 7.613 (0.8) ; 7.602 (8.5) ; 7.595 (2.8) ; 7.579 (2.8) ; 7.572 (9.5) ; 7.562 (1.1) ; 7.366 (0.6) ; 7.300 (100.9) ; 7.233 (0.5) ; 7.209 (4.3) ; 7.181 (4.0) ; 7.145 (1.0) ; 7.134 (9.5) ; 7.127 (3.0) ; 7.112 (2.6) ; 7.104 (8.2) ; 7.094 (0.9) ; 6.949 (0.5) ; 5.425 (16.0) ; 1.657 (0.6) ; 1.597 (38.8) ; 1.593 (86.1) ; 1.524 (0.5) ; 1.326 (0.4) ; 1.292 (0.9) ; 0.919 (0.3) ; 0.233 (0.4) ; 0.120 (0.7) ; 0.108 (20.9) ; 0.095 (0.7) ; 0.049 (3.4) ; 0.038 (102.6) ; 0.027 (3.3) ; -0.028 (0.4) ; -0.161 (0.4)

实施例VII.25:  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.518 (4.9) ; 8.490 (6.7) ; 8.487 (5.9) ; 8.459 (5.1) ; 8.265 (0.4) ; 8.237 (14.7) ; 8.057 (15.0) ; 7.646 (0.3) ; 7.492 (1.4) ; 7.481 (13.5) ; 7.473 (4.4) ; 7.458 (5.0) ; 7.451 (16.0) ; 7.440 (2.0) ; 7.412 (0.5) ; 7.300 (55.9) ; 7.191 (1.9) ; 7.180 (16.7) ; 7.173 (5.0) ; 7.158 (4.6) ; 7.150 (13.0) ; 7.140 (1.6) ; 7.016 (5.7) ; 7.010 (5.5) ; 6.988 (5.5) ; 6.982 (5.2) ; 6.949 (0.3) ; 5.619 (15.7) ; 5.607 (15.6) ; 5.571 (0.9) ; 2.692 (1.1) ; 2.046 (0.5) ; 1.610 (13.9) ; 1.306 (0.4) ; 1.292 (0.5) ; 0.119 (0.5) ; 0.107 (10.3) ; 0.095 (0.5) ; 0.048 (2.4) ; 0.047 (1.7) ; 0.038 (60.4) ; 0.030 (1.9) ; 0.028 (1.8) ; 0.027 (2.3) ; 0.018 (0.4)

实施例VII.26:  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.584 (5.9) ; 8.245 (6.9) ; 8.030 (6.9) ; 7.414 (6.1) ; 7.368 (2.9) ; 7.340 (4.7) ; 7.338 (4.5) ; 7.300 (12.6) ; 7.264 (1.1) ; 7.253 (9.0) ; 7.245 (2.4) ; 7.231 (1.9) ; 7.223 (5.0) ; 7.212 (0.5) ; 5.502 (16.0) ; 5.337 (9.8) ; 4.170 (0.7) ; 4.146 (0.7) ; 2.082

10

20

30

40

50

(3.1) ; 1.639 (5.4) ; 1.320 (0.9) ; 1.296 (1.8) ; 1.273 (0.8) ; 0.107 (1.4) ; 0.048 (0.4) ; 0.037 (12.6) ; 0.026 (0.5)

实施例VII.27:  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.578 (5.8) ; 8.244 (6.8) ; 8.031 (6.9) ; 7.645 (0.8) ; 7.634 (6.9) ; 7.627 (2.2) ; 7.612 (2.3) ; 7.605 (7.7) ; 7.594 (0.8) ; 7.398 (6.0) ; 7.300 (24.3) ; 7.124 (0.8) ; 7.113 (7.8) ; 7.106 (2.3) ; 7.091 (2.2) ; 7.084 (6.9) ; 7.073 (0.7) ; 5.500 (16.0) ; 5.339 (3.1) ; 1.609 (14.4) ; 0.108 (1.0) ; 0.049 (0.9) ; 0.038 (25.7) ; 0.027 (1.0)

实施例VII.28:  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.576 (4.9) ; 8.247 (5.7) ; 8.033 (5.9) ; 7.793 (3.5) ; 7.765 (4.0) ; 7.445 (5.3) ; 7.350 (3.8) ; 7.322 (3.6) ; 7.310 (1.1) ; 7.300 (32.4) ; 5.504 (13.7) ; 5.339 (13.6) ; 1.600 (16.0) ; 1.293 (0.4) ; 0.108 (1.3) ; 0.049 (1.6) ; 0.038 (34.7) ; 0.027 (1.3)

实施例VII.29:  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $d_6$ -DMSO) :

= 9.008 (6.8) ; 8.549 (9.5) ; 8.059 (9.2) ; 7.752 (8.8) ; 7.717 (5.0) ; 7.462 (5.7) ; 7.434 (4.6) ; 7.307 (1.8) ; 7.121 (4.2) ; 6.935 (2.0) ; 5.945 (15.0) ; 5.781 (0.8) ; 4.088 (1.2) ; 4.064 (3.6) ; 4.057 (0.6) ; 4.041 (3.6) ; 4.017 (1.2) ; 3.347 (22.1) ; 2.537 (1.9) ; 2.531 (4.0) ; 2.525 (5.5) ; 2.519 (4.0) ; 2.513 (1.9) ; 2.012 (16.0) ; 1.221 (4.4) ; 1.198 (8.8) ; 1.174 (4.3) ; 0.023 (3.8)

实施例VII.30:  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $d_6$ -DMSO) :

= 8.999 (7.1) ; 8.539 (10.0) ; 8.057 (10.0) ; 7.866 (7.7) ; 7.770 (2.8) ; 7.762 (2.9) ; 7.735 (2.7) ; 7.727 (2.8) ; 7.579 (2.1) ; 7.550 (4.6) ; 7.522 (3.5) ; 7.471 (2.7) ; 7.467 (2.7) ; 7.463 (2.5) ; 7.459 (2.2) ; 7.441 (1.4) ; 7.438 (1.6) ; 7.433 (1.4) ; 7.430 (1.3) ; 5.950 (16.0) ; 5.781 (15.8) ; 3.352 (4.1) ; 2.537 (2.1) ; 2.531 (4.4) ; 2.525 (6.0) ; 2.519 (4.4) ; 2.513 (2.1) ; 0.022 (7.5) ; 0.011 (0.4)

实施例VII.31:  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.225 (8.9) ; 8.021 (9.1) ; 7.974 (4.0) ; 7.946 (4.2) ; 7.899 (1.0) ; 7.888 (7.9) ; 7.881 (2.8) ; 7.865 (2.9) ; 7.858 (8.7) ; 7.847 (1.1) ; 7.362 (5.1) ; 7.332 (4.6) ; 7.300 (30.4) ; 7.288 (5.0) ; 7.260 (4.3) ; 5.433 (16.0) ; 5.338 (10.9) ; 1.606 (6.4) ; 1.293 (0.6) ; 0.108 (0.7) ; 0.049 (1.4) ; 0.038 (32.7) ; 0.027 (1.3)

实施例VII.32:  $^1\text{H}$ -NMR (499.9 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.182 (8.2) ; 7.976 (8.1) ; 7.915 (3.9) ; 7.898 (4.1) ; 7.711 (5.5) ; 7.694 (6.0) ; 7.327 (5.7) ; 7.310 (5.3) ; 7.263 (5.1) ; 7.221 (4.3) ; 7.204 (4.1) ; 5.390 (16.0) ; 5.296 (0.4) ; 1.634 (0.7) ; 0.000 (5.5) ; -0.007 (0.4)

实施例VII.33:  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.225 (8.1) ; 8.030 (8.4) ; 7.994 (3.9) ; 7.966 (4.1) ; 7.646 (0.5) ; 7.408 (4.5) ; 7.380 (4.1) ; 7.319 (0.6) ; 7.300 (86.9) ; 7.153 (0.9) ; 7.142 (1.8) ; 7.132 (8.7) ; 7.108 (8.5) ; 7.104 (2.6) ; 7.099 (1.7) ; 7.088 (0.8) ; 6.949 (0.4) ; 5.431 (16.0) ; 1.589 (31.8) ; 1.354 (0.5) ; 1.292 (1.3) ; 0.920 (0.4) ; 0.234 (0.4) ; 0.108 (12.4) ; 0.049 (3.3) ; 0.039 (93.5) ; 0.028 (3.2) ; 0.015 (0.4) ; -0.160 (0.3)

实施例VII.34:  $^1\text{H}$ -NMR (499.9 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.186 (4.0) ; 7.970 (4.1) ; 7.847 (1.8) ; 7.830 (1.9) ; 7.288 (3.1) ; 7.271 (3.8) ; 7.267 (1.9) ; 7.106 (0.6) ; 7.101 (4.1) ; 7.097 (1.4) ; 7.087 (1.3) ; 7.084 (3.4) ; 7.078 (0.4) ; 7.061 (2.0) ; 7.044 (2.0) ; 5.393 (7.4) ; 2.966 (0.8) ; 2.952 (1.1) ; 2.938 (0.8) ; 2.924 (0.4) ; 1.286 (15.9) ; 1.272 (16.0) ; 1.259 (0.5) ; 0.000 (1.2)

実施例VII.35 : 1H - NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.250 (6.6) ; 8.098 (3.8) ; 8.070 (4.2) ; 8.040 (7.3) ; 7.647 (0.5) ; 7.615 (1.0) ; 7.604 (8.3) ; 7.597 (2.6) ; 7.582 (3.1) ; 7.574 (9.1) ; 7.564 (1.3) ; 7.302 (68.9) ; 7.158 (3.9) ; 7.147 (1.4) ; 7.136 (10.1) ; 7.129 (6.3) ; 7.113 (3.0) ; 7.106 (8.0) ; 7.096 (1.0) ; 7.018 (2.7) ; 6.950 (0.5) ; 6.836 (5.1) ; 6.655 (2.6) ; 5.561 (16.0) ; 5.341 (1.5) ; 1.613 (15.8) ; 1.293 (1.5) ; 0.122 (0.4) ; 0.109 (8.8) ; 0.098 (0.4) ; 0.051 (1.4) ; 0.040 (42.7) ; 0.029 (1.6)

10

実施例VII.36 : 1H - NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.819 (4.9) ; 8.252 (7.2) ; 8.056 (7.3) ; 7.644 (0.5) ; 7.586 (1.8) ; 7.502 (0.7) ; 7.491 (6.8) ; 7.483 (6.1) ; 7.468 (2.4) ; 7.461 (8.0) ; 7.450 (0.9) ; 7.405 (3.7) ; 7.298 (87.1) ; 7.223 (1.9) ; 7.193 (0.8) ; 7.182 (8.1) ; 7.174 (2.3) ; 7.159 (2.1) ; 7.152 (6.5) ; 7.141 (0.6) ; 6.947 (0.5) ; 5.624 (16.0) ; 5.338 (6.7) ; 1.583 (53.8) ; 1.291 (2.3) ; 0.107 (1.7) ; 0.048 (2.8) ; 0.038 (89.7) ; 0.027 (3.3) ; -0.161 (0.4)

20

実施例VII.37 : 1H - NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.222 (7.7) ; 8.024 (8.6) ; 7.993 (0.4) ; 7.957 (3.9) ; 7.930 (4.2) ; 7.646 (0.4) ; 7.337 (0.3) ; 7.311 (5.7) ; 7.300 (83.2) ; 7.283 (5.0) ; 7.267 (2.9) ; 7.265 (3.4) ; 7.261 (3.9) ; 7.239 (7.6) ; 7.233 (7.7) ; 7.226 (6.4) ; 7.222 (3.9) ; 7.198 (0.6) ; 6.949 (0.4) ; 5.426 (16.0) ; 5.340 (1.1) ; 1.591 (25.1) ; 1.368 (0.4) ; 1.350 (0.5) ; 1.293 (1.0) ; 0.920 (0.4) ; 0.234 (0.4) ; 0.108 (10.6) ; 0.067 (0.4) ; 0.049 (3.6) ; 0.039 (88.4) ; 0.028 (3.1) ; 0.018 (0.4)

30

実施例VII.38 : 1H - NMR (300.2 MHz,  $d_6$  - DMSO) :

= 8.833 (10.2) ; 8.551 (9.6) ; 8.057 (9.4) ; 7.585 (0.8) ; 7.573 (7.8) ; 7.566 (2.5) ; 7.551 (3.0) ; 7.544 (9.5) ; 7.533 (1.1) ; 7.496 (10.9) ; 7.334 (1.1) ; 7.323 (9.8) ; 7.315 (2.8) ; 7.300 (2.7) ; 7.293 (7.4) ; 7.282 (0.8) ; 5.912 (16.0) ; 5.786 (1.3) ; 3.355 (11.4) ; 2.540 (3.3) ; 2.534 (6.8) ; 2.528 (9.2) ; 2.522 (6.6) ; 2.516 (3.1) ; 0.026 (8.5) ; 0.015 (0.3)

実施例VII.39 : 1H - NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.225 (7.9) ; 8.021 (8.6) ; 7.940 (3.9) ; 7.912 (4.3) ; 7.342 (3.0) ; 7.312 (7.6) ; 7.300 (34.5) ; 7.284 (2.2) ; 7.275 (13.6) ; 7.266 (3.0) ; 7.252 (2.2) ; 7.244 (4.8) ; 7.227 (4.8) ; 7.198 (4.4) ; 5.428 (16.0) ; 5.339 (3.2) ; 2.084 (0.4) ; 1.608 (5.6) ; 1.298 (0.5) ; 1.292 (0.5) ; 0.108 (4.4) ; 0.049 (1.2) ; 0.038 (37.2) ; 0.027 (1.4)

40

実施例VII.40 : 1H - NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.606 (8.2) ; 8.265 (6.7) ; 8.026 (7.0) ; 7.762 (4.0) ; 7.733 (4.6) ; 7.321 (4.4) ; 7.298 (5.9) ; 7.294 (4.1) ; 7.159 (8.6) ; 5.663 (16.0) ; 5.329 (10.2) ; 0.031 (3.8)

50

实施例VII.41:  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ):

= 8.817 (5.5); 8.251 (7.2); 8.055 (7.1); 7.651 (0.8); 7.640 (6.4); 7.634 (2.7); 7.618 (2.3); 7.611 (7.3); 7.585 (1.8); 7.481 (5.6); 7.404 (3.9); 7.298 (49.1); 7.223 (1.9); 7.139 (0.9); 7.128 (7.1); 7.122 (2.9); 7.106 (2.2); 7.099 (6.5); 5.624 (16.0); 5.338 (4.5); 1.586 (30.9); 1.342 (0.5); 1.291 (2.2); 0.918 (0.4); 0.107 (2.0); 0.048 (2.4); 0.038 (51.2)

实施例VII.42:  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ):

= 8.223 (8.7); 8.017 (9.0); 7.947 (3.9); 7.918 (4.2); 7.637 (4.5); 7.609 (5.4); 7.332 (6.2); 7.301 (8.5); 7.234 (4.5); 7.206 (4.2); 6.915 (2.3); 6.727 (4.6); 6.539 (2.3); 5.432 (16.0); 5.334 (1.5); 3.292 (0.4); 1.741 (0.6); 0.034 (4.6)

【0261】

实施例IX.01:  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ):

= 8.496 (5.1); 7.450 (0.6); 7.439 (6.3); 7.432 (2.1); 7.417 (2.3); 7.409 (7.9); 7.399 (0.9); 7.300 (31.2); 7.183 (5.8); 7.151 (1.0); 7.140 (7.8); 7.133 (2.4); 7.118 (2.1); 7.110 (6.4); 7.099 (0.7); 5.340 (0.9); 3.053 (3.8); 3.037 (4.9); 2.917 (2.6); 2.901 (2.0); 1.682 (16.0); 1.582 (18.0); 1.304 (0.7); 0.921 (0.7); 0.109 (1.3); 0.050 (1.0); 0.049 (0.7); 0.047 (0.7); 0.039 (33.9); 0.029 (1.4)

实施例IX.02:  $^1\text{H}$ -NMR (400.0 MHz,  $d_6$ -DMSO):

= 8.630 (0.5); 8.170 (6.5); 7.467 (0.5); 7.462 (0.5); 7.450 (2.9); 7.445 (1.8); 7.431 (4.1); 7.429 (4.1); 7.415 (1.5); 7.410 (3.3); 7.404 (0.7); 7.281 (0.3); 7.263 (1.4); 7.260 (1.8); 7.258 (1.2); 7.242 (2.9); 7.236 (6.9); 7.226 (0.9); 7.223 (1.2); 7.220 (0.8); 7.191 (0.4); 7.188 (0.4); 7.173 (1.1); 7.170 (1.1); 7.155 (4.0); 7.152 (4.9); 7.147 (1.5); 7.135 (2.3); 7.133 (3.5); 7.131 (3.0); 7.124 (0.6); 7.105 (0.3); 6.428 (0.5); 3.327 (40.6); 3.251 (0.7); 3.077 (4.0); 3.022 (3.1); 3.009 (3.5); 2.996 (0.5); 2.825 (2.4); 2.812 (2.2); 2.711 (0.6); 2.622 (0.5); 2.592 (3.5); 2.562 (0.5); 2.542 (136.6); 2.525 (1.3); 2.511 (17.8); 2.507 (35.0); 2.502 (45.6); 2.498 (33.1); 2.493 (16.0); 2.472 (0.5); 2.432 (0.5); 2.429 (0.5); 2.368 (0.6); 2.329 (0.4); 1.989 (0.7); 1.642 (0.6); 1.582 (16.0); 1.258 (0.4); 1.235 (1.4); 1.135 (0.4); 1.119 (0.5); 1.106 (12.4); 0.853 (0.5); 0.836 (0.4); 0.000 (4.3)

实施例IX.03:  $^1\text{H}$ -NMR (400.0 MHz,  $d_6$ -DMSO):

= 9.657 (0.4); 8.172 (5.6); 7.502 (0.6); 7.496 (0.7); 7.487 (4.7); 7.481 (2.0); 7.470 (1.9); 7.465 (5.5); 7.456 (0.9); 7.447 (0.4); 7.430 (0.5); 7.421 (0.3); 7.408 (0.3); 7.303 (5.5); 7.218 (0.8); 7.213 (0.9); 7.204 (5.5); 7.199 (2.2); 7.188 (1.8); 7.182 (4.7); 7.176 (1.0); 7.149 (0.4); 6.772 (0.5); 6.750 (0.5); 3.748 (0.4); 3.660 (0.6); 3.602 (0.4); 3.327 (26.5); 3.251 (0.7); 3.077 (5.1); 3.025 (2.6); 3.013 (2.9); 2.996 (0.6); 2.821 (2.2); 2.808 (1.9); 2.712 (0.5); 2.594 (1.8); 2.564 (0.3); 2.542 (118.0); 2.511 (17.7); 2.507 (35.6); 2.502 (47.3); 2.498 (35.2); 2.494 (17.7); 2.368 (0.6); 2.329 (0.4); 1.989 (0.7); 1.760 (0.5); 1.622 (0.4); 1.581 (14.0); 1.298 (0.5); 1.259 (0.9); 1.235 (2.8); 1.193 (0.4); 1.183 (1.1); 1.169



(0.5) ; 1.135 (0.5) ; 1.119 (0.6) ; 1.106 (16.0) ; 1.082 (0.4) ;  
1.046 (0.6) ; 0.867 (0.4) ; 0.854 (0.9) ; 0.836 (0.7) ; 0.813 (0.3  
); 0.000 (3.9)

实施例 IX.04 :  $^1\text{H}$ -NMR (400.0 MHz,  $d_6$ -DMSO) :

= 9.319 (0.3) ; 7.931 (3.5) ; 7.910 (3.6) ; 7.489 (0.4) ; 7.473  
(2.5) ; 7.453 (4.3) ; 7.434 (3.4) ; 7.421 (0.9) ; 7.401 (0.6) ; 7  
.285 (1.6) ; 7.266 (2.5) ; 7.248 (1.3) ; 7.234 (0.6) ; 7.216 (0.8  
); 7.197 (0.7) ; 7.179 (4.3) ; 7.160 (3.8) ; 7.134 (0.8) ; 7.120  
(0.4) ; 7.013 (3.7) ; 6.993 (3.6) ; 6.389 (0.3) ; 3.744 (0.4) ; 3  
.628 (1.6) ; 3.601 (0.5) ; 3.329 (35.2) ; 3.251 (0.6) ; 3.077 (1.6  
); 3.040 (2.9) ; 3.027 (3.3) ; 2.996 (0.4) ; 2.818 (2.6) ; 2.805  
(2.4) ; 2.712 (1.2) ; 2.569 (1.9) ; 2.542 (199.7) ; 2.521 (2.1) ;  
2.507 (30.0) ; 2.503 (40.3) ; 2.498 (31.6) ; 2.459 (1.8) ; 2.368 (1  
.3) ; 2.330 (0.4) ; 1.989 (0.6) ; 1.769 (0.3) ; 1.760 (0.7) ; 1.  
751 (0.3) ; 1.630 (0.3) ; 1.585 (0.3) ; 1.565 (16.0) ; 1.259 (0.4)  
; 1.235 (1.1) ; 1.183 (0.3) ; 1.135 (0.4) ; 1.119 (0.4) ; 1.106 (5  
.1) ; 0.854 (0.4) ; 0.000 (3.4)

10

实施例 IX.05 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $d_6$ -DMSO) :

= 8.216 (1.9) ; 8.188 (3.6) ; 8.163 (2.2) ; 8.115 (6.9) ; 8.086  
(7.4) ; 7.721 (6.3) ; 7.707 (14.0) ; 7.678 (16.0) ; 7.450 (4.5) ;  
7.417 (10.0) ; 7.403 (13.1) ; 7.389 (14.5) ; 7.374 (10.6) ; 7.362  
(6.3) ; 7.289 (6.2) ; 7.103 (13.2) ; 6.917 (6.4) ; 3.358 (15.3) ;  
3.070 (8.3) ; 3.054 (10.1) ; 2.921 (7.8) ; 2.905 (6.5) ; 2.540 (5  
.5) ; 2.534 (10.8) ; 2.528 (14.3) ; 2.522 (10.3) ; 1.616 (4.3) ; 1  
.592 (0.3) ; 1.556 (0.6) ; 1.399 (0.8) ; 1.381 (1.7) ; 1.371 (1.9  
); 1.354 (3.0) ; 1.337 (1.9) ; 1.329 (1.8) ; 1.311 (0.9) ; 1.269  
(0.3) ; 1.218 (0.5) ; 1.165 (0.3) ; 1.140 (0.4) ; 1.133 (0.3) ; 1  
.125 (0.4) ; 1.110 (0.4) ; 0.519 (0.8) ; 0.512 (0.7) ; 0.500 (2.0  
); 0.482 (7.8) ; 0.468 (3.4) ; 0.455 (8.7) ; 0.449 (6.0) ; 0.441  
(5.0) ; 0.427 (3.2) ; 0.422 (3.2) ; 0.410 (3.6) ; 0.404 (2.9) ; 0  
.392 (3.1) ; 0.361 (1.0) ; 0.356 (1.4) ; 0.348 (3.1) ; 0.331 (3.9  
); 0.322 (1.9) ; 0.309 (2.6) ; 0.301 (1.5) ; 0.293 (1.0) ; 0.034  
(0.8) ; 0.024 (15.2) ; 0.013 (0.7)

20

30

实施例 IX.06 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 7.441 (0.4) ; 7.418 (0.4) ; 7.411 (0.7) ; 7.389 (0.3) ; 7.371  
(0.5) ; 7.360 (4.9) ; 7.353 (1.8) ; 7.343 (0.9) ; 7.338 (2.0) ; 7  
.330 (6.3) ; 7.320 (0.9) ; 7.313 (0.9) ; 7.300 (5.3) ; 7.202 (0.3  
); 7.193 (0.6) ; 7.181 (0.4) ; 7.172 (0.4) ; 7.163 (0.7) ; 7.143  
(0.4) ; 7.135 (0.3) ; 7.124 (0.7) ; 7.114 (6.5) ; 7.106 (2.0) ; 7  
.091 (1.9) ; 7.084 (6.9) ; 7.071 (1.1) ; 7.064 (0.5) ; 7.054 (3.0  
); 7.042 (0.6) ; 5.883 (2.6) ; 5.851 (2.5) ; 4.844 (2.7) ; 4.809  
(3.0) ; 4.633 (0.4) ; 4.198 (0.5) ; 4.192 (1.5) ; 4.186 (1.6) ; 4  
.181 (0.6) ; 4.162 (0.5) ; 4.157 (1.3) ; 4.151 (1.4) ; 4.145 (0.6  
); 3.827 (0.7) ; 3.536 (1.9) ; 3.171 (0.4) ; 2.892 (0.4) ; 2.654  
(0.6) ; 2.616 (0.9) ; 2.614 (0.9) ; 2.533 (0.5) ; 2.081 (16.0) ;  
1.985 (2.4) ; 1.725 (1.1) ; 1.676 (0.6) ; 1.596 (4.3) ; 1.550 (0.7  
); 1.263 (0.3) ; 0.041 (5.3)

40

实施例 IX.07 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $d_6$ -DMSO) :

= 8.092 (6.0) ; 8.064 (6.4) ; 7.891 (0.4) ; 7.864 (0.4) ; 7.565  
(1.5) ; 7.554 (12.8) ; 7.546 (5.0) ; 7.531 (5.1) ; 7.524 (16.0) ;

50

7.515 (2.3) ; 7.380 (6.8) ; 7.352 (6.4) ; 7.322 (2.3) ; 7.311 (16.0) ; 7.304 (4.8) ; 7.289 (5.7) ; 7.282 (12.3) ; 7.270 (1.4) ; 7.258 (1.0) ; 4.810 (0.5) ; 4.651 (0.6) ; 4.252 (0.7) ; 4.234 (0.6) ; 3.480 (0.5) ; 3.462 (0.5) ; 3.354 (13.8) ; 3.065 (7.0) ; 3.049 (8.4) ; 2.910 (6.7) ; 2.894 (5.6) ; 2.534 (9.4) ; 2.528 (12.6) ; 2.522 (9.1) ; 2.387 (0.4) ; 2.364 (0.5) ; 1.389 (0.6) ; 1.372 (1.3) ; 1.362 (1.5) ; 1.345 (2.5) ; 1.328 (1.5) ; 1.320 (1.6) ; 1.302 (0.8) ; 1.262 (0.4) ; 0.515 (0.6) ; 0.495 (1.8) ; 0.477 (6.5) ; 0.465 (3.0) ; 0.449 (7.1) ; 0.436 (3.0) ; 0.433 (3.1) ; 0.420 (2.6) ; 0.415 (2.4) ; 0.408 (1.7) ; 0.401 (3.0) ; 0.383 (2.6) ; 0.350 (1.0) ; 0.341 (2.6) ; 0.324 (3.3) ; 0.303 (2.4) ; 0.294 (1.1) ; 0.036 (0.6) ; 0.025 (12.4) ; 0.014 (0.5)

10

実施例 IX.08 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{d}_6$ -DMSO) :

= 8.193 (1.0) ; 8.165 (1.8) ; 8.140 (1.1) ; 8.092 (4.6) ; 8.064 (5.0) ; 7.696 (2.7) ; 7.689 (1.5) ; 7.678 (14.8) ; 7.671 (6.6) ; 7.656 (5.0) ; 7.648 (16.0) ; 7.637 (1.6) ; 7.414 (2.1) ; 7.383 (5.9) ; 7.354 (4.9) ; 7.262 (1.2) ; 7.251 (12.5) ; 7.243 (5.4) ; 7.241 (6.4) ; 7.233 (2.4) ; 7.228 (3.6) ; 7.221 (10.6) ; 7.211 (5.4) ; 7.200 (0.5) ; 3.357 (7.1) ; 3.064 (5.3) ; 3.048 (6.5) ; 2.910 (5.0) ; 2.894 (4.4) ; 2.540 (2.4) ; 2.534 (5.1) ; 2.528 (6.8) ; 2.522 (4.9) ; 2.516 (2.3) ; 2.014 (0.5) ; 1.604 (0.3) ; 1.591 (3.0) ; 1.391 (0.4) ; 1.372 (1.0) ; 1.361 (1.3) ; 1.344 (2.0) ; 1.328 (1.4) ; 1.320 (1.3) ; 1.302 (0.9) ; 1.268 (2.7) ; 0.902 (0.8) ; 0.880 (2.5) ; 0.857 (0.9) ; 0.513 (0.4) ; 0.493 (1.1) ; 0.475 (4.9) ; 0.462 (2.2) ; 0.448 (5.5) ; 0.434 (2.8) ; 0.420 (2.0) ; 0.415 (2.0) ; 0.401 (2.3) ; 0.384 (2.0) ; 0.349 (0.8) ; 0.341 (2.0) ; 0.324 (2.6) ; 0.311 (1.0) ; 0.302 (1.8) ; 0.294 (1.0) ; 0.286 (0.7) ; 0.022 (7.4)

20

実施例 IX.10 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :

= 8.255 (6.0) ; 7.429 (0.6) ; 7.418 (5.2) ; 7.410 (1.8) ; 7.395 (2.0) ; 7.388 (6.2) ; 7.377 (0.8) ; 7.300 (3.4) ; 7.128 (0.8) ; 7.117 (6.4) ; 7.109 (2.1) ; 7.094 (1.8) ; 7.087 (5.1) ; 7.076 (0.6) ; 6.970 (6.5) ; 5.337 (1.2) ; 3.029 (3.3) ; 3.012 (3.9) ; 2.841 (2.6) ; 2.839 (2.5) ; 2.824 (2.2) ; 2.822 (2.1) ; 1.696 (16.0) ; 1.612 (2.2) ; 0.039 (3.5)

30

実施例 IX.11 :  $^1\text{H}$ -NMR (300.2 MHz,  $\text{d}_6$ -DMSO) :

= 9.802 (0.3) ; 8.242 (1.1) ; 8.215 (2.0) ; 8.189 (1.2) ; 8.140 (7.8) ; 8.111 (8.5) ; 7.960 (0.3) ; 7.875 (13.8) ; 7.847 (16.0) ; 7.813 (0.5) ; 7.754 (2.7) ; 7.729 (2.5) ; 7.502 (3.6) ; 7.489 (12.2) ; 7.472 (14.1) ; 7.461 (11.1) ; 7.444 (10.1) ; 7.015 (0.5) ; 6.986 (0.4) ; 3.355 (20.6) ; 3.075 (9.2) ; 3.059 (11.3) ; 3.035 (0.5) ; 3.027 (0.8) ; 3.010 (0.7) ; 2.925 (8.6) ; 2.908 (7.3) ; 2.879 (0.5) ; 2.540 (6.0) ; 2.534 (12.8) ; 2.528 (17.5) ; 2.522 (12.6) ; 2.516 (5.9) ; 1.898 (0.3) ; 1.605 (1.2) ; 1.591 (10.7) ; 1.543 (1.0) ; 1.474 (0.3) ; 1.405 (0.7) ; 1.378 (2.1) ; 1.358 (3.4) ; 1.342 (2.2) ; 1.333 (2.1) ; 1.315 (1.2) ; 1.269 (2.5) ; 0.903 (0.7) ; 0.881 (2.3) ; 0.858 (0.9) ; 0.503 (1.7) ; 0.485 (9.0) ; 0.472 (3.7) ; 0.458 (10.9) ; 0.448 (5.1) ; 0.430 (4.0) ; 0.417 (4.5) ; 0.397 (3.3) ; 0.385 (1.2) ; 0.354 (3.6) ; 0.345 (2.1) ; 0.336 (4.0) ; 0.324 (1.9) ; 0.315 (2.5) ; 0.307 (2.2) ; 0.298 (1.4) ; 0.277 (0

40

50

.6) ; 0.034 (0.5) ; 0.023 (18.0) ; 0.012 (0.8)

【0262】

生物学的実施例

本発明による活性化合物の組合せの高度な殺真菌活性は、以下の実施例から自明である。個々の活性化合物は殺真菌活性に関して弱点を示すが、組合せは単純な活性の相加を超える活性を有する。

【0263】

殺真菌剤の相乗効果は、活性化合物の組合せの殺真菌活性が個々に施用された場合の活性化合物の活性の合計を超える場合常に存在する。2つの活性化合物の所与の組合せについて予想される活性は、以下のように計算することができる (Colby, S. R., 「Calculating Synergistic and Antagonistic Responses of Herbicide Combinations」、Weeds 1967、15、20~22参照) :

Xが、活性化合物Aをm ppm (またはg / ha) の施用量で施用した場合の有効性であり、Yが、活性化合物Bをn ppm (またはg / ha) の施用量で施用した場合の有効性であり、Eが、活性化合物AおよびBをそれぞれmおよびn ppm (またはg / ha) の施用量で施用した場合の有効性である場合、

【数1】

$$E = X + Y - \frac{X \cdot Y}{100}$$

【0264】

%で表される有効性の程度が示される。0%は対照の有効性に相当する有効性を意味し、100%の有効性は病気が観察されないことを意味する。

【0265】

実際の殺真菌活性が計算値を超える場合、組合せの活性は超加成性 (superadditive) である、すなわち相乗効果が存在する。この場合、実際に観察された有効性が、上記の式から計算された予想有効性 (E) についての値よりも大きくなければならない。

【0266】

相乗効果を実証するさらなる方法は、Tammesの方法である (「Isoboles, a graphic representation of synergism in pesticides」Neth. J. Plant Path., 1964、70、73~80参照)。

【0267】

本発明を以下の実施例により説明する。しかしながら、本発明はこれらの実施例に限定されない。

【0268】

実施例A: アルテルナリア (トマト) におけるインビボ予防試験

溶媒: 24.5重量部のアセトン

24.5重量部のジメチルアセトアミド

乳化剤: 1重量部のアルキルアリアルポリグリコールエーテル

【0269】

活性化合物の適切な調製物を製造するために、1重量部の活性化合物を上記の量の溶媒および乳化剤と混合し、濃縮物を水で所望の濃度に希釈する。

【0270】

予防活性を試験するために、苗に言及する施用量で活性化合物の調製物を噴霧する。噴霧コーティングを乾燥させた後、植物にアルテルナリア・ソラニ (Alternaria solani) の水性孢子懸濁液を接種する。次いで、植物を約20 および相対大気湿度100%のインキュベーションキャビネットに置く。

【0271】

接種3日後に試験を評価する。0%は未処理対照の有効性に相当する有効性を意味し、10

10

20

30

40

50

0%の有効性は病気が観察されないことを意味する。

【0272】

以下の表は、本発明による活性化合物の組合せの実測活性が計算された活性より大きいこと、すなわち相乗効果が存在することを明らかに示している。

【0273】

【表6】

表A1：アルテルナリア（トマト）におけるインビボ予防試験

活性化合物	活性化合物の施用量 (ppm a.i.)	有効性 (%)	
		実測値*	計算値**
(I.01) 2-[6-(4-クロロフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル]-1-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)プロパン-2-オール	5	49	
	1	13	
(I.59) 2-[6-(4-ブロモフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル]-1-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)プロパン-2-オール	5	54	
	1	13	
1.012 イブコナゾール	10	88	
	5	67	
	2.5	28	
1.020 スピロキサミン	100	49	
	50	38	
	25	13	
1.021 テブコナゾール	10	74	
	5	21	
	2.5	5	
4.005 ペンシクロン	100	33	
	50	21	
	25	5	

10

20

30

【0274】

【表 7】

表 A1: アルテルナリア (トマト) におけるインビゴ予防試験

活性化化合物	活性化化合物の施用量 (ppm a.i.)	有効性 (%)	
		実測値*	計算値**
13.001 フルジオキノニル	20	95	
	10	85	
	5	77	
(I.01) + 1.012 1:2	5 + 10	94	94
(I.01) + 1.012 1:1	5 + 5	85	83
(I.01) + 1.012 2:1	5 + 2.5	77	63
(I.01) + 1.012 1:10	1 + 10	90	90
(I.01) + 1.012 1:5	1 + 5	79	71
(I.01) + 1.012 1:2.5	1 + 2.5	44	37
(I.01) + 1.020 1:20	5 + 100	85	74
(I.01) + 1.020 1:10	5 + 50	67	68
(I.01) + 1.020 1:5	5 + 25	72	55
(I.01) + 1.020 1:100	1 + 100	64	55
(I.01) + 1.020 1:50	1 + 50	13	46
(I.01) + 1.020 1:25	1 + 25	0	24
(I.59) + 1.020 1:20	5 + 100	79	76
(I.59) + 1.020 1:10	5 + 50	77	72
(I.59) + 1.020 1:5	5 + 25	67	60
(I.59) + 1.020 1:100	1 + 100	85	55
(I.59) + 1.020 1:50	1 + 50	49	46
(I.59) + 1.020 1:25	1 + 25	33	24
(I.59) + 1.021 1:2	5 + 10	92	88
(I.59) + 1.021 1:1	5 + 5	87	63
(I.59) + 1.021 2:1	5 + 2.5	69	56
(I.59) + 1.021 1:10	1 + 10	69	78
(I.59) + 1.021 1:5	1 + 5	44	31
(I.59) + 1.021 1:2.5	1 + 2.5	33	17
(I.59) + 4.005 1:20	5 + 100	64	69
(I.59) + 4.005 1:10	5 + 50	79	63
(I.59) + 4.005 2:5	5 + 25	67	56
(I.59) + 4.005 1:100	1 + 100	64	42
(I.59) + 4.005 1:50	1 + 50	54	31
(I.59) + 4.005 1:25	1 + 25	5	17

10

20

30

【表 8】

表 A1: アルテルナリア (トマト) におけるインビゴ予防試験

活性化化合物	活性化化合物の施用量 (ppm a.i.)	有効性 (%)	
		実測値*	計算値**
(I.59) + 13.001 1:4	5 + 20	97	98
(I.59) + 13.001 1:2	5 + 10	95	93
(I.59) + 13.001 1:1	5 + 5	91	89
(I.59) + 13.001 1:20	1 + 20	95	96
(I.59) + 13.001 1:10	1 + 10	94	87
(I.59) + 13.001 1:5	1 + 5	87	80

\*実測値=実測活性

\*\*計算値=コルビーの式を使用して計算された活性

10

【 0 2 7 6 】

【表 9】

表 A2: アルテルナリア (トマト) におけるインビゴ予防試験

活性化化合物	活性化化合物の施用量 (ppm a.i.)	有効性 (%)	
		実測値*	計算値**
(I.01) 2-[6-(4-クロロフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル]-1-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)プロパン-2-オール	5	32	
	1	3	
(I.59) 2-[6-(4-プロモフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル]-1-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)プロパン-2-オール	5	18	
	1	11	
2.005 フルオピラム	20	84	
	10	61	
	5	53	
2.017 ペンフルフェン	20	47	
	10	26	
	5	11	
2.027 3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-N-(1,1,3-トリメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル)-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド	4	11	
	2	3	
	1	0	
3.020 トリフロキシストロビン	4	53	
	2	42	
	1	24	
3.025 (3S, 6S, 7R, 8R)-8-ベンジル-3-[(3-[(イソブチリルオキシ)メトキシ]-4-メトキシピリジン-2-イル)カルボニル]アミノ]-6-メチル-4,9-ジオキソ-1,5-ジオキソナン-7-イル2-メチルプロパノエート	20	58	
	10	18	
	5	18	

20

30

40

50

【 0 2 7 7 】

【 表 1 0 】

表 A2 : アルテルナリア (トマト) におけるインビゴ予防試験

活性化化合物	活性化化合物の施用量 (ppm a.i.)	有効性 (%)	
		実測値*	計算値**
(I.01) + 3.020 1:0.8	5 + 4	76	68
(I.01) + 3.020 1:0.4	5 + 2	63	60
(I.01) + 3.020 1:0.2	5 + 1	47	48
(I.01) + 3.020 1:4	1 + 4	66	54
(I.01) + 3.020 1:2	1 + 2	42	44
(I.01) + 3.020 1:1	1 + 1	11	26
(I.59) + 2.005 1:4	5 + 20	92	87
(I.59) + 2.005 1:2	5 + 10	82	68
(I.59) + 2.005 1:1	5 + 5	71	61
(I.59) + 2.005 1:20	1 + 20	86	86
(I.59) + 2.005 1:10	1 + 10	87	65
(I.59) + 2.005 1:5	1 + 5	53	58
(I.59) + 2.017 1:4	5 + 20	82	57
(I.59) + 2.017 1:2	5 + 10	37	40
(I.59) + 2.017 1:1	5 + 5	47	27
(I.59) + 2.017 1:20	1 + 20	63	53
(I.59) + 2.017 1:10	1 + 10	47	34
(I.59) + 2.017 1:5	1 + 5	32	20
(I.59) + 2.027 1:0.8	5 + 4	76	27
(I.59) + 2.027 1:0.4	5 + 2	37	21
(I.59) + 2.027 1:0.2	5 + 1	47	18
(I.59) + 2.027 1:4	1 + 4	37	20
(I.59) + 2.027 1:2	1 + 2	26	13
(I.59) + 2.027 1:1	1 + 1	11	11
(I.59) + 3.025 1:4	5 + 20	79	66
(I.59) + 3.025 1:2	5 + 10	71	33
(I.59) + 3.025 1:1	5 + 5	63	33
(I.59) + 3.025 1:20	1 + 20	76	62
(I.59) + 3.025 1:10	1 + 10	58	27
(I.59) + 3.025 1:5	1 + 5	53	27

\*実測値=実測活性

\*\*計算値=コルビーの式を使用して計算された活性

【 0 2 7 8 】

10

20

30

40

## 【表 1 1】

表 A3 : アルテルナリア (トマト) におけるインビボ予防試験

活性化化合物	活性化化合物の施用量 (ppm a.i.)	有効性 (%)	
		実測値*	計算値**
(I.59) 2-[6-(4-プロモフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル]-1-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)プロパン-2-オール	5	21	
	1	13	
5.004 クロロタロニル	50	33	
	25	13	
	12.5	0	
5.013 マンコゼブ	50	77	
	25	33	
	12.5	28	
(I.59) + 5.004 1:10	5 + 50	59	47
(I.59) + 5.004 1:5	5 + 25	59	31
(I.59) + 5.004 1:2.5	5 + 12.5	49	21
(I.59) + 5.004 1:50	1 + 50	38	42
(I.59) + 5.004 1:25	1 + 25	33	24
(I.59) + 5.004 1:12.5	1 + 12.5	13	13
(I.59) + 5.013 1:10	5 + 50	88	82
(I.59) + 5.013 1:5	5 + 25	74	47
(I.59) + 5.013 1:2.5	5 + 12.5	38	43
(I.59) + 5.013 1:50	1 + 50	87	80
(I.59) + 5.013 1:25	1 + 25	33	42
(I.59) + 5.013 1:12.5	1 + 12.5	5	37

\*実測値=実測活性

\*\*計算値=コルビーの式を使用して計算された活性

## 【 0 2 7 9 】

実施例B: コレトトリカム (Colletotrichum) (トマト) におけるインビボ予防試験

溶媒: 24.5重量部のアセトン

24.5重量部のジメチルアセトアミド

乳化剤: 1重量部のアルキルアリアルポリグリコールエーテル

## 【 0 2 8 0 】

活性化化合物の適切な調製物を製造するために、1重量部の活性化化合物を上記の量の溶媒および乳化剤と混合し、濃縮物を水で所望の濃度に希釈する。

## 【 0 2 8 1 】

予防活性を試験するために、苗に言及する施用量で活性化化合物の調製物を噴霧する。噴霧コーティングを乾燥させた後、植物にコレトトリカム・コッコデス (Colletotrichum coccodes) の水性孢子懸濁液を接種する。次いで、植物を約24 および相対大気湿度100%のインキュベーションキャビネットに置く。

## 【 0 2 8 2 】

接種3日後に試験を評価する。0%は未処理対照の有効性に相当する有効性を意味し、100%の有効性は病気が観察されないことを意味する。

## 【 0 2 8 3 】

以下の表は、本発明による活性化化合物の組合せの実測活性が計算された活性より大きいこと、すなわち相乗効果が存在することを明らかに示している。

## 【 0 2 8 4 】



【表 1 2】

表 B1: コレトトリカム (*Colletotrichum*) (トマト) におけるインビゴ予防試験

活性化化合物	活性化化合物の施用量 (ppm a.i.)	有効性 (%)	
		実測値*	計算値**
(I.59) 2-[6-(4-プロモフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル]-1-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)プロパン-2-オール	5	67	
	1	44	
1.018 プロチオコナゾール	10	79	
	5	59	
	2.5	38	
1.020 スピロキサミン	100	49	
	50	44	
	25	33	
1.021 テブコナゾール	10	64	
	5	44	
	2.5	44	
4.005 ペンシクロン	100	33	
	50	33	
	25	33	

10

20

【 0 2 8 5】

## 【表 1 3】

表 B1: コレトトリカム (*Colletotrichum*) (トマト) におけるインビゴ予防試験

活性化化合物	活性化化合物の施用量 (ppm a.i.)	有効性 (%)	
		実測値*	計算値**
(I.59) + 1.018 1:2	5 + 10	92	93
(I.59) + 1.018 1:1	5 + 5	92	86
(I.59) + 1.018 2:1	5 + 2.5	92	79
(I.59) + 1.018 1:10	1 + 10	85	88
(I.59) + 1.018 1:5	1 + 5	87	77
(I.59) + 1.018 1:2.5	1 + 2.5	74	65
(I.59) + 1.020 1:20	5 + 100	87	83
(I.59) + 1.020 1:10	5 + 50	91	81
(I.59) + 1.020 1:5	5 + 25	87	78
(I.59) + 1.020 1:100	1 + 100	79	71
(I.59) + 1.020 1:50	1 + 50	87	68
(I.59) + 1.020 1:25	1 + 25	67	62
(I.59) + 1.021 1:2	5 + 10	94	88
(I.59) + 1.021 1:1	5 + 5	91	81
(I.59) + 1.021 2:1	5 + 2.5	92	81
(I.59) + 1.021 1:10	1 + 10	92	80
(I.59) + 1.021 1:5	1 + 5	64	68
(I.59) + 1.021 1:2.5	1 + 2.5	44	68
(I.59) + 4.005 1:20	5 + 100	90	78
(I.59) + 4.005 1:10	5 + 50	85	78
(I.59) + 4.005 2:5	5 + 25	87	78
(I.59) + 4.005 1:100	1 + 100	74	62
(I.59) + 4.005 1:50	1 + 50	64	62
(I.59) + 4.005 1:25	1 + 25	64	62

\* 実測値=実測活性

\*\* 計算値=コルビーの式を使用して計算された活性

【 0 2 8 6 】

10

20

30

【表 1 4】

表 B2: コレトトリカム (*Colletotrichum*) (トマト) におけるインビボ予防試験

活性化化合物	活性化化合物の施用量 (ppm a.i.)	有効性 (%)	
		実測値*	計算値**
(I.59) 2-[6-(4-ブロモフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル]-1-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)プロパン-2-オール	5	0	
	1	0	
5.004 クロロタロニル	50	8	
	25	8	
	12.5	0	
5.013 マンコゼブ	50	0	
	25	0	
	12.5	0	
(I.59) + 5.004 1:10	5 + 50	60	8
(I.59) + 5.004 1:5	5 + 25	60	8
(I.59) + 5.004 1:2.5	5 + 12.5	55	0
(I.59) + 5.004 1:50	1 + 50	8	8
(I.59) + 5.004 1:25	1 + 25	0	8
(I.59) + 5.004 1:12.5	1 + 12.5	0	0
(I.59) + 5.013 1:10	5 + 50	58	0
(I.59) + 5.013 1:5	5 + 25	65	0
(I.59) + 5.013 1:2.5	5 + 12.5	50	0
(I.59) + 5.013 1:50	1 + 50	35	0
(I.59) + 5.013 1:25	1 + 25	23	0
(I.59) + 5.013 1:12.5	1 + 12.5	0	0

\*実測値=実測活性

\*\*計算値=コルビーの式を使用して計算された活性

## 【 0 2 8 7 】

実施例 C: ファコプソラ (*Phakopsora*) (ダイズ) におけるインビボ予防試験

溶媒: 24.5重量部のアセトン

24.5重量部のジメチルアセトアミド

乳化剤: 1重量部のアルキルアリアルポリグリコールエーテル

## 【 0 2 8 8 】

活性化化合物の適切な調製物を製造するために、1重量部の活性化化合物を上記の量の溶媒および乳化剤と混合し、濃縮物を水で所望の濃度に希釈する。

## 【 0 2 8 9 】

予防活性を試験するために、苗に言及する施用量で活性化化合物の調製物を噴霧する。噴霧コーティングを乾燥させた後、植物にダイズさび病 (ファコプソラ・パキリジ (*Phakopsora pachyrhizi*)) の病原の水性孢子懸濁液を接種し、約24 および相対大気湿度95%のインキュベーションキャビネット内で光なしで24時間静置する。植物を約24 および相対大気湿度約80%、および昼/夜間隔12時間のインキュベーションキャビネット内で静置する。

## 【 0 2 9 0 】

この試験を接種7日後に評価する。0%は未処理対照の有効性に相当する有効性を意味し、100%の有効性は病気が観察されないことを意味する。

## 【 0 2 9 1 】

10

20

30

40

50

以下の表は、本発明による活性化合物の組合せの実測活性が計算された活性より大きいこと、すなわち相乗効果が存在することを明らかに示している。

【 0 2 9 2 】

【 表 1 5 】

表 C1: ファコプソラ (*Phakopsora*) 試験 (ダイズ) におけるインビゴ予防試験

活性化合物	活性化合物の施用量 (ppm a.i.)	有効性 (%)	
		実測値*	計算値**
(I.01) 2-[6-(4-クロロフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル]-1-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)プロパン-2-オール	5 1	50 0	
(I.59) 2-[6-(4-ブロモフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル]-1-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)プロパン-2-オール	5 1	50 8	
1.020 スピロキサミン	100 50 25	75 50 23	
(I.01) + 1.020 1:20	5 + 100	96	88
(I.01) + 1.020 1:10	5 + 50	95	75
(I.01) + 1.020 1:5	5 + 25	85	61
(I.01) + 1.020 1:100	1 + 100	93	75
(I.01) + 1.020 1:50	1 + 50	83	50
(I.01) + 1.020 1:25	1 + 25	35	23
(I.59) + 1.020 1:20	5 + 100	98	88
(I.59) + 1.020 1:10	5 + 50	90	75
(I.59) + 1.020 1:5	5 + 25	90	61
(I.59) + 1.020 1:100	1 + 100	88	77
(I.59) + 1.020 1:50	1 + 50	78	54
(I.59) + 1.020 1:25	1 + 25	35	28

\*実測値=実測活性

\*\*計算値=コルビーの式を使用して計算された活性

【 0 2 9 3 】

【表 16 A】

表 C2 : ファコプソラ (*Phakopsora*) (ダイズ) におけるインビゴ予防試験

活性化化合物	活性化化合物の施用量 (ppm a.i.)	有効性 (%)	
		実測値*	計算値**
(I.01) 2-[6-(4-クロロフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル]-1-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)プロパン-2-オール	5	68	
	1	0	
(I.59) 2-[6-(4-ブromoフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル]-1-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)プロパン-2-オール	5	50	
	1	0	
2.002 ビキサフェン	10	15	
	5	0	
	2.5	0	
2.017 ペンフルフェン	20	83	
	10	43	
	5	8	
2.027 3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-N-(1,1,3-トリメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル)-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド	4	100	
	2	95	
	1	50	
3.025 (3S, 6S, 7R, 8R)-8-ベンジル-3-[(3-[(イソブチリルオキシ)メトキシ]-4-メトキシピリジン-2-イル)カルボニル]アミノ]-6-メチル-4,9-ジオキソ-1,5-ジオキソナン-7-イル2-メチルプロパノエート	20	63	
	10	40	
	5	23	
(I.01) + 2.002 1:2	5 + 10	80	72
(I.01) + 2.002 1:1	5 + 5	65	68
(I.01) + 2.002 2:1	5 + 2.5	73	68
(I.01) + 2.002 1:10	1 + 10	0	15
(I.01) + 2.002 1:5	1 + 5	0	0
(I.01) + 2.002 1:2.5	1 + 2.5	0	0
(I.01) + 2.017 1:4	5 + 20	100	94
(I.01) + 2.017 1:2	5 + 10	90	81
(I.01) + 2.017 1:1	5 + 5	96	70
(I.01) + 2.017 1:20	1 + 20	85	83
(I.01) + 2.017 1:10	1 + 10	75	43
(I.01) + 2.017 1:5	1 + 5	50	8
(I.01) + 1.027 1:0.8	5 + 4	100	100
(I.01) + 1.027 1:0.4	5 + 2	94	98
(I.01) + 1.027 1:0.2	5 + 1	90	84

10

20

30

40

【表 16 B】

活性化化合物	活性化化合物の施用量 (ppm a.i.)	有効性 (%)	
		実測値*	計算値**
(I.01) + 1.027 1:4	1 + 4	100	100
(I.01) + 1.027 1:2	1 + 2	99	95
(I.01) + 1.027 1:1	1 + 1	84	50

10

【 0 2 9 4 】

【表 17】

表 C2: ファコプソラ (*Phakopsora*) (ダイズ) におけるインビゴ予防試験

活性化化合物	活性化化合物の施用量 (ppm a.i.)	有効性 (%)	
		実測値*	計算値**
(I.01) + 3.025 1:4	5 + 20	91	88
(I.01) + 3.025 1:2	5 + 10	91	88
(I.01) + 3.025 1:1	5 + 5	90	75
(I.01) + 3.025 1:20	1 + 20	80	63
(I.01) + 3.025 1:10	1 + 10	65	40
(I.01) + 3.025 1:5	1 + 5	30	23
(I.59) + 2.002 1:2	5 + 10	65	58
(I.59) + 2.002 1:1	5 + 5	58	50
(I.59) + 2.002 2:1	5 + 2.5	58	50
(I.59) + 2.002 1:10	1 + 10	8	15
(I.59) + 2.002 1:5	1 + 5	0	0
(I.59) + 2.002 1:2.5	1 + 2.5	0	0
(I.59) + 2.017 1:4	5 + 20	98	91
(I.59) + 2.017 1:2	5 + 10	69	71
(I.59) + 2.017 1:1	5 + 5	65	54
(I.59) + 2.017 1:20	1 + 20	81	83
(I.59) + 2.017 1:10	1 + 10	80	43
(I.59) + 2.017 1:5	1 + 5	23	8
(I.59) + 2.027 1:0.8	5 + 4	100	100
(I.59) + 2.027 1:0.4	5 + 2	96	98
(I.59) + 2.027 1:0.2	5 + 1	88	75
(I.59) + 2.027 1:4	1 + 4	100	100
(I.59) + 2.027 1:2	1 + 2	98	95
(I.59) + 2.027 1:1	1 + 1	65	50
(I.59) + 3.025 1:4	5 + 20	90	81
(I.59) + 3.025 1:2	5 + 10	70	70
(I.59) + 3.025 1:1	5 + 5	70	61
(I.59) + 3.025 1:20	1 + 20	78	63
(I.59) + 3.025 1:10	1 + 10	40	40
(I.59) + 3.025 1:5	1 + 5	28	23

\*実測値=実測活性

\*\*計算値=コルビーの式を使用して計算された活性

20

30

40

50

【 0 2 9 5 】

【 表 1 8 】

表 C3 : ファコプソラ (*Phakopsora*) (ダイズ) におけるインビボ予防試験

活性化化合物	活性化化合物の施用量 (ppm a.i.)	有効性 (%)	
		実測値*	計算値**
(I.01) 2-[6-(4-クロロフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル]-1-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)プロパン-2-オール	5	50	
	1	0	
(I.59) 2-[6-(4-ブロモフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル]-1-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)プロパン-2-オール	5	40	
	1	0	
5.004 クロロタロニル	50	0	
	25	8	
	12.5	0	
5.013 マンコゼブ	50	90	
	25	45	
	12.5	23	
5.018 プロピネブ	20	83	
	10	23	
	5	0	
12.003 メタラキシル	200	23	
	100	0	
	50	0	
12.004 メタラキシル-M (メフェノキサム)	200	15	
	100	0	
	50	0	
(I.01) + 5.004 1:10	5 + 50	90	50
(I.01) + 5.004 1:5	5 + 25	48	54
(I.01) + 5.004 1:2.5	5 + 12.5	55	50
(I.01) + 5.004 1:50	1 + 50	40	0
(I.01) + 5.004 1:25	1 + 25	8	8
(I.01) + 5.004 1:12.5	1 + 12.5	0	0
(I.01) + 5.018 1:10	5 + 50	100	91
(I.01) + 5.018 1:5	5 + 25	73	61
(I.01) + 5.018 1:2.5	5 + 12.5	78	50
(I.01) + 5.018 1:50	1 + 50	94	83
(I.01) + 5.018 1:25	1 + 25	25	23
(I.01) + 5.018 1:12.5	1 + 12.5	8	0

【 0 2 9 6 】

【表 19】

表 C3: ファコプソラ (*Phakopsora*) (ダイズ) におけるインビゴ予防試験

活性化化合物	活性化化合物の施用量 (ppm a.i.)	有効性 (%)	
		実測値*	計算値**
(I.01) + 12.003 1:40	5 + 200	96	61
(I.01) + 12.003 1:20	5 + 100	85	50
(I.01) + 12.003 1:10	5 + 50	80	50
(I.01) + 12.003 1:200	1 + 200	53	23
(I.01) + 12.003 1:100	1 + 100	8	0
(I.01) + 12.003 1:50	1 + 50	0	0
(I.01) + 12.004 1:40	5 + 200	89	58
(I.01) + 12.004 1:20	5 + 100	86	50
(I.01) + 12.004 1:10	5 + 50	63	50
(I.01) + 12.004 1:200	1 + 200	50	15
(I.01) + 12.004 1:100	1 + 100	8	0
(I.01) + 12.004 1:50	1 + 50	0	0
(I.59) + 5.004 1:10	5 + 50	90	40
(I.59) + 5.004 1:5	5 + 25	53	45
(I.59) + 5.004 1:2.5	5 + 12.5	55	40
(I.59) + 5.004 1:50	1 + 50	38	0
(I.59) + 5.004 1:25	1 + 25	13	8
(I.59) + 5.004 1:12.5	1 + 12.5	0	0
(I.59) + 5.013 1:10	5 + 50	96	94
(I.59) + 5.013 1:5	5 + 25	81	67
(I.59) + 5.013 1:2.5	5 + 12.5	63	54
(I.59) + 5.013 1:50	1 + 50	89	90
(I.59) + 5.013 1:25	1 + 25	55	45
(I.59) + 5.013 1:12.5	1 + 12.5	8	23
(I.59) + 5.018 1:10	5 + 50	98	90
(I.59) + 5.018 1:5	5 + 25	80	54
(I.59) + 5.018 1:2.5	5 + 12.5	60	40
(I.59) + 5.018 1:50	1 + 50	89	83
(I.59) + 5.018 1:25	1 + 25	30	23
(I.59) + 5.018 1:12.5	1 + 12.5	0	0

10

20

30

【 0 2 9 7 】



## 【表 2 0】

表 C3：ファコプソラ (*Phakopsora*) (ダイズ) におけるインビゴ予防試験

活性化化合物	活性化化合物の施用量 (ppm a.i.)	有効性 (%)	
		実測値*	計算値**
(I.59) + 12.003 1:40	5 + 200	91	54
(I.59) + 12.003 1:20	5 + 100	89	40
(I.59) + 12.003 1:10	5 + 50	75	40
(I.59) + 12.003 1:200	1 + 200	65	23
(I.59) + 12.003 1:100	1 + 100	8	0
(I.59) + 12.003 1:50	1 + 50	0	0
(I.59) + 12.004 1:40	5 + 200	93	49
(I.59) + 12.004 1:20	5 + 100	88	40
(I.59) + 12.004 1:10	5 + 50	65	40
(I.59) + 12.004 1:200	1 + 200	60	15
(I.59) + 12.004 1:100	1 + 100	40	0
(I.59) + 12.004 1:50	1 + 50	0	0

\*実測値=実測活性

\*\*計算値=コルビーの式を使用して計算された活性

## 【 0 2 9 8 】

実施例D：スファエロテカ (*Sphaerotheca*) (キュウリ) におけるインビゴ予防試験

溶媒：24.5重量部のアセトン

24.5重量部のジメチルアセトアミド

乳化剤：1重量部のアルキルアリアルポリグリコールエーテル

## 【 0 2 9 9 】

活性化化合物の適切な調製物を製造するために、1重量部の活性化化合物を上記の量の溶媒および乳化剤と混合し、濃縮物を水で所望の濃度に希釈する。

## 【 0 3 0 0 】

予防活性を試験するために、苗に言及する施用量で活性化化合物の調製物を噴霧する。噴霧コーティングを乾燥させた後、植物にスファエロテカ・フリジネア (*Sphaerotheca fuliginea*) の水性孢子懸濁液を接種する。次いで、植物を約23 °Cおよび相対大気湿度約70%の温室に置く。

## 【 0 3 0 1 】

この試験を接種7日後に評価する。0%は未処理対照の有効性に相当する有効性を意味し、100%の有効性は病気が観察されないことを意味する。

## 【 0 3 0 2 】

以下の表は、本発明による活性化化合物の組合せの実測活性が計算された活性より大きいこと、すなわち相乗効果が存在することを明らかに示している。

## 【 0 3 0 3 】

【表 2 1 A】

表 D1 : スファエロデカ (*Sphaerotheca*) 試験 (キュウリ) におけるインビゴ予防試験

活性化化合物	活性化化合物の施用量 (ppm a.i.)	有効性 (%)	
		実測値*	計算値**
(I.01) 2-[6-(4-クロロフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル]-1-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)プロパン-2-オール	5	93	
	1	20	
(I.59) 2-[6-(4-ブロモフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル]-1-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)プロパン-2-オール	5	89	
	1	20	
1.012 イブコナゾール	10	100	
	5	87	
	2.5	26	
1.018 プロチオコナゾール	10	100	
	5	96	
	2.5	71	
1.020 スピロキサミン	100	49	
	50	37	
	25	31	
1.021 テブコナゾール	10	83	
	5	69	
	2.5	37	
(I.01) + 1.018 1:2	5 + 10	100	100
(I.01) + 1.018 1:1	5 + 5	100	100
(I.01) + 1.018 2:1	5 + 2.5	100	98
(I.01) + 1.018 1:10	1 + 10	100	100
(I.01) + 1.018 1:5	1 + 5	100	97
(I.01) + 1.018 1:2.5	1 + 2.5	96	77
(I.01) + 1.020 1:20	5 + 100	96	96
(I.01) + 1.020 1:10	5 + 50	96	96
(I.01) + 1.020 1:5	5 + 25	87	95
(I.01) + 1.020 1:100	1 + 100	91	59
(I.01) + 1.020 1:50	1 + 50	66	50
(I.01) + 1.020 1:25	1 + 25	20	45
(I.01) + 1.021 1:2	5 + 10	100	99
(I.01) + 1.021 1:1	5 + 5	99	98
(I.01) + 1.021 2:1	5 + 2.5	94	96
(I.01) + 1.021 1:10	1 + 10	93	86
(I.01) + 1.021 1:5	1 + 5	81	75
(I.01) + 1.021 1:2.5	1 + 2.5	63	50

10

20

30

40

【表 2 1 B】

活性化化合物	活性化化合物の施用量 (ppm a.i.)	有効性 (%)	
		実測値*	計算値**
(I.59) + 1.012 1:2	5 + 10	100	100
(I.59) + 1.012 1:1	5 + 5	100	99
(I.59) + 1.012 2:1	5 + 2.5	97	92
(I.59) + 1.012 1:10	1 + 10	97	100
(I.59) + 1.012 1:5	1 + 5	86	90
(I.59) + 1.012 1:2.5	1 + 2.5	63	41

\*実測値=実測活性

\*\*計算値=コルビーの式を使用して計算された活性

10

【 0 3 0 4 】

【表 2 2】

表 D2 : スファエロテカ (*Sphaerotheca*) (キュウリ) におけるインビゴ予防試験

20

活性化化合物	活性化化合物の施用量 (ppm a.i.)	有効性 (%)	
		実測値*	計算値**
(I.01) 2-[6-(4-クロロフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル]-1-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)プロパン-2-オール	5	65	
	1	15	
(I.59) 2-[6-(4-ブロモフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル]-1-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)プロパン-2-オール	5	55	
	1	8	
15.047 3-(4,4-ジフルオロ-3,3-ジメチル-3,4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン	10	8	
	5	0	
	2.5	0	
(I.01) + 15.047 1:2	5 + 10	93	68
(I.01) + 15.047 1:1	5 + 5	83	65
(I.01) + 15.047 2:1	5 + 2.5	88	65
(I.01) + 15.047 1:10	1 + 10	23	21
(I.01) + 15.047 1:5	1 + 5	0	15
(I.01) + 15.047 1:2.5	1 + 2.5	0	15
(I.59) + 15.047 1:2	5 + 10	93	58
(I.59) + 15.047 1:1	5 + 5	91	55
(I.59) + 15.047 2:1	5 + 2.5	70	55
(I.59) + 15.047 1:10	1 + 10	15	14
(I.59) + 15.047 1:5	1 + 5	0	8
(I.59) + 15.047 1:2.5	1 + 2.5	0	8

\*実測値=実測活性

\*\*計算値=コルビーの式を使用して計算された活性

30

40

【 0 3 0 5 】

## 【表 2 3】

表 D3: スファエロテカ (*Sphaerotheca*) (キュウリ) におけるインビボ予防試験

活性化合物	活性化合物の施用量 (ppm a.i.)	有効性 (%)	
		実測値*	計算値**
(I.59) 2-[6-(4-プロモフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル]-1-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)プロパン-2-オール	5 1	88 0	
2.038 N-(5-クロロ-2-イソプロピルベンジル)-N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド	4	98	
	2	93	
	1	40	
(I.59) + 2.038 1:0.8	5 + 4	100	100
(I.59) + 2.038 1:0.4	5 + 2	96	99
(I.59) + 2.038 1:0.2	5 + 1	86	93
(I.59) + 2.038 1:4	1 + 4	99	98
(I.59) + 2.038 1:2	1 + 2	98	93
(I.59) + 2.038 1:1	1 + 1	58	40

\*実測値=実測活性

\*\*計算値=コルビーの式を使用して計算された活性

10

20

## 【0306】

実施例E: ベンツリア (*Venturia*) (リンゴ) におけるインビボ予防試験

溶媒: 24.5重量部のアセトン

24.5重量部のジメチルアセトアミド

乳化剤: 1重量部のアルキルアリアルポリグリコールエーテル

## 【0307】

活性化合物の適切な調製物を製造するために、1重量部の活性化合物を上記の量の溶媒および乳化剤と混合し、濃縮物を水で所望の濃度に希釈する。

30

## 【0308】

予防活性を試験するために、苗に言及する施用量で活性化合物の調製物を噴霧する。噴霧コーティングを乾燥させた後、植物にリンゴ黒星病 (*Venturia inaequalis*) の病原の水性分生子懸濁液を接種し、次いで、約20 および相対大気湿度100%のインキュベーションキャビネット内で1日静置する。次いで、植物を約21 および相対大気湿度約90%の温室に置く。

## 【0309】

この試験を接種10日後に評価する。0%は未処理対照の有効性に相当する有効性を意味し、100%の有効性は病気が観察されないことを意味する。

40

## 【0310】

以下の表は、本発明による活性化合物の組合せの実測活性が計算された活性より大きいこと、すなわち相乗効果が存在することを明らかに示している。

## 【0311】

【表 2 4】

表 E1 : ベンツリア (*Venturia*) (リンゴ) におけるインビゴ予防試験

活性化化合物	活性化化合物の施用量 (ppm a.i.)	有効性 (%)	
		実測値*	計算値**
(I.01) 2-[6-(4-クロロフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル]-1-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)プロパン-2-オール	5	74	
	1	78	
(I.59) 2-[6-(4-ブロモフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル]-1-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)プロパン-2-オール	5	74	
	1	58	
1.018 プロチオコナゾール	10	61	
	5	30	
	2.5	0	
1.020 スピロキサミン	100	14	
	50	0	
	25	0	
1.021 テブコナゾール	10	44	
	5	34	
	2.5	4	
4.005 ペンシクロン	100	4	
	50	0	
	25	0	
13.001 フルジオキソニル	20	4	
	10	4	
	5	8	
13.004 プロキナジド	50	0	
	25	0	
	12.5	0	
(I.01) + 1.020 1:20	5 + 100	95	77
(I.01) + 1.020 1:10	5 + 50	86	74
(I.01) + 1.020 1:5	5 + 25	86	74
(I.01) + 1.020 1:100	1 + 100	91	81
(I.01) + 1.020 1:50	1 + 50	94	78
(I.01) + 1.020 1:25	1 + 25	73	78
(I.01) + 1.021 1:2	5 + 10	86	85
(I.01) + 1.021 1:1	5 + 5	91	83
(I.01) + 1.021 2:1	5 + 2.5	83	75
(I.01) + 1.021 1:10	1 + 10	93	87
(I.01) + 1.021 1:5	1 + 5	93	85
(I.01) + 1.021 1:2.5	1 + 2.5	89	78

## 【表 2 5】

表 E1 : ベンツリア (*Venturia*) (リンゴ) におけるインビゴ予防試験

活性化化合物	活性化化合物の施用量 (ppm a.i.)	有効性 (%)	
		実測値*	計算値**
(I.01) + 4.005 1:20	5 + 100	86	75
(I.01) + 4.005 1:10	5 + 50	94	74
(I.01) + 4.005 1:5	5 + 25	94	74
(I.01) + 4.005 1:100	1 + 100	92	78
(I.01) + 4.005 1:50	1 + 50	81	78
(I.01) + 4.005 1:25	1 + 25	86	78
(I.01) + 13.001 1:4	5 + 20	96	75
(I.01) + 13.001 1:2	5 + 10	93	75
(I.01) + 13.001 1:1	5 + 5	94	76
(I.01) + 13.001 1:20	1 + 20	90	78
(I.01) + 13.001 1:10	1 + 10	94	78
(I.01) + 13.001 1:5	1 + 5	93	79
(I.01) + 13.004 1:10	5 + 50	90	74
(I.01) + 13.004 1:5	5 + 25	92	74
(I.01) + 13.004 1:2.5	5 + 12.5	79	74
(I.01) + 13.004 1:50	1 + 50	90	78
(I.01) + 13.004 1:25	1 + 25	92	78
(I.01) + 13.004 1:12.5	1 + 12.5	76	78
(I.59) + 1.018 1:2	5 + 10	88	90
(I.59) + 1.018 1:1	5 + 5	74	82
(I.59) + 1.018 2:1	5 + 2.5	87	74
(I.59) + 1.018 1:10	1 + 10	85	84
(I.59) + 1.018 1:5	1 + 5	91	70
(I.59) + 1.018 1:2.5	1 + 2.5	70	58
(I.59) + 1.020 1:20	5 + 100	85	77
(I.59) + 1.020 1:10	5 + 50	90	74
(I.59) + 1.020 1:5	5 + 25	86	74
(I.59) + 1.020 1:100	1 + 100	79	63
(I.59) + 1.020 1:50	1 + 50	79	58
(I.59) + 1.020 1:25	1 + 25	88	58

10

20

30

【表 2 6】

表 E1 : ベンツリア (*Venturia*) (リンゴ) におけるインビゴ予防試験

活性化化合物	活性化化合物の施用量 (ppm a.i.)	有効性 (%)	
		実測値*	計算値**
(I.59) + 1.021 1:2	5 + 10	87	85
(I.59) + 1.021 1:1	5 + 5	85	83
(I.59) + 1.021 2:1	5 + 2.5	89	75
(I.59) + 1.021 1:10	1 + 1090	90	76
(I.59) + 1.021 1:5	1 + 5	80	72
(I.59) + 1.021 1:2.5	1 + 2.5	74	59
(I.59) + 4.005 1:20	5 + 100	94	75
(I.59) + 4.005 1:10	5 + 50	94	74
(I.59) + 4.005 1:5	5 + 25	84	74
(I.59) + 4.005 1:100	1 + 100	81	59
(I.59) + 4.005 1:50	1 + 50	92	58
(I.59) + 4.005 1:25	1 + 25	81	58
(I.59) + 13.001 1:4	5 + 20	89	75
(I.59) + 13.001 1:2	5 + 10	94	75
(I.59) + 13.001 1:1	5 + 5	90	76
(I.59) + 13.001 1:20	1 + 20	92	59
(I.59) + 13.001 1:10	1 + 10	83	59
(I.59) + 13.001 1:5	1 + 5	88	61
(I.59) + 13.004 1:10	5 + 50	86	74
(I.59) + 13.004 1:5	5 + 25	84	74
(I.59) + 13.004 1:2.5	5 + 12.5	78	74
(I.59) + 13.004 1:50	1 + 50	83	58
(I.59) + 13.004 1:25	1 + 25	82	58
(I.59) + 13.004 1:12.5	1 + 12.5	91	58

\*実測値=実測活性

\*\*計算値=コルビーの式を使用して計算された活性

【 0 3 1 4 】

【表 27】

表 E2: ベンツリア (*Venturia*) (リンゴ) におけるインビゴ予防試験

活性化合物	活性化合物の施用量 (ppm a.i.)	有効性 (%)	
		実測値*	計算値**
(I.01) 2-[6-(4-クロロフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル]-1-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)プロパン-2-オール	5	88	
	1	61	
(I.59) 2-[6-(4-プロモフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル]-1-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)プロパン-2-オール	5	37	
	1	33	
5.004 クロロタロニル	50	93	
	25	14	
	12.5	24	
5.013 マンコゼブ	50	95	
	25	18	
	12.5	0	
5.018 プロピネブ	20	100	
	10	94	
	5	54	
12.003 メタラキシル	200	19	
	100	11	
	50	11	
12.004 メタラキシル-M (メフェノキサム)	200	30	
	100	11	
	50	0	
15.008 シフルフェナミド	20	4	
	10	0	
	5	0	
(I.01) + 5.004 1:10	5 + 50	100	99
(I.01) + 5.004 1:5	5 + 25	99	89
(I.01) + 5.004 1:2.5	5 + 12.5	94	90
(I.01) + 5.004 1:50	1 + 50	100	97
(I.01) + 5.004 1:25	1 + 25	99	67
(I.01) + 5.004 1:12.5	1 + 12.5	88	70
(I.01) + 5.013 1:10	5 + 50	98	99
(I.01) + 5.013 1:5	5 + 25	98	90
(I.01) + 5.013 1:2.5	5 + 12.5	96	88
(I.01) + 5.013 1:50	1 + 50	99	98
(I.01) + 5.013 1:25	1 + 25	97	68
(I.01) + 5.013 1:12.5	1 + 12.5	95	61



【表 2 8】

表 E2 : ベンツリア (*Venturia*) 試験 (リンゴ) におけるインビゴ予防試験

活性化化合物	活性化化合物の施用量 (ppm a.i.)	有効性 (%)	
		実測値*	計算値**
(I.01) + 5.018 1:10	5 + 50	99	100
(I.01) + 5.018 1:5	5 + 25	99	99
(I.01) + 5.018 1:2.5	5 + 12.5	99	94
(I.01) + 5.018 1:50	1 + 50	100	100
(I.01) + 5.018 1:25	1 + 25	98	98
(I.01) + 5.018 1:12.5	1 + 12.5	96	82
(I.01) + 12.003 1:40	5 + 200	88	90
(I.01) + 12.003 1:20	5 + 100	82	89
(I.01) + 12.003 1:10	5 + 50	81	89
(I.01) + 12.003 1:200	1 + 200	78	69
(I.01) + 12.003 1:100	1 + 100	74	66
(I.01) + 12.003 1:50	1 + 50	70	66
(I.01) + 12.004 1:40	5 + 200	80	91
(I.01) + 12.004 1:20	5 + 100	84	89
(I.01) + 12.004 1:10	5 + 50	86	88
(I.01) + 12.004 1:200	1 + 200	93	73
(I.01) + 12.004 1:100	1 + 100	78	66
(I.01) + 12.004 1:50	1 + 50	60	61
(I.59) + 5.004 1:10	5 + 50	99	96
(I.59) + 5.004 1:5	5 + 25	99	45
(I.59) + 5.004 1:2.5	5 + 12.5	96	52
(I.59) + 5.004 1:50	1 + 50	98	95
(I.59) + 5.004 1:25	1 + 25	98	42
(I.59) + 5.004 1:12.5	1 + 12.5	93	49
(I.59) + 5.013 1:10	5 + 50	99	97
(I.59) + 5.013 1:5	5 + 25	98	48
(I.59) + 5.013 1:2.5	5 + 12.5	83	37
(I.59) + 5.013 1:50	1 + 50	100	97
(I.59) + 5.013 1:25	1 + 25	96	44
(I.59) + 5.013 1:12.5	1 + 12.5	90	33

10

20

30

【 0 3 1 6 】

## 【表 29】

表 E2: ベンツリア (*Venturia*) (リンゴ) におけるインビゴ予防試験

活性化化合物	活性化化合物の施用量 (ppm a.i.)	有効性 (%)	
		実測値*	計算値**
(I.59) + 5.018 1:10	5 + 50	100	100
(I.59) + 5.018 1:5	5 + 25	100	96
(I.59) + 5.018 1:2.5	5 + 12.5	95	71
(I.59) + 5.018 1:50	1 + 50	99	100
(I.59) + 5.018 1:25	1 + 25	99	96
(I.59) + 5.018 1:12.5	1 + 12.5	96	69
(I.59) + 12.003 1:40	5 + 200	93	49
(I.59) + 12.003 1:20	5 + 100	86	44
(I.59) + 12.003 1:10	5 + 50	92	44
(I.59) + 12.003 1:200	1 + 200	91	45
(I.59) + 12.003 1:100	1 + 100	85	40
(I.59) + 12.003 1:50	1 + 50	84	40
(I.59) + 12.004 1:40	5 + 200	91	46
(I.59) + 12.004 1:20	5 + 100	94	44
(I.59) + 12.004 1:10	5 + 50	84	37
(I.59) + 12.004 1:200	1 + 200	80	53
(I.59) + 12.004 1:100	1 + 100	81	40
(I.59) + 12.004 1:50	1 + 50	81	33
(I.59) + 15.008 1:4	5 + 20	79	39
(I.59) + 15.008 1:2	5 + 10	81	37
(I.59) + 15.008 1:1	5 + 5	75	37
(I.59) + 15.008 1:20	1 + 20	79	35
(I.59) + 15.008 1:10	1 + 10	65	33
(I.59) + 15.008 1:5	1 + 5	69	33

\*実測値=実測活性

\*\*計算値=コルビーの式を使用して計算された活性

## 【0317】

実施例F: インビゴ予防ブルメリア (*Blumeria*) 試験 (大麦)

溶媒: 49 重量部のN,N-ジメチルアセトアミド

乳化剤: 1 重量部のアルキルアリアルポリグリコールエーテル

## 【0318】

活性化化合物の適切な調製物を製造するために、1重量部の活性化化合物または活性化化合物の組合せを上記の量の溶媒および乳化剤と混合し、濃縮物を水で所望の濃度に希釈する。

## 【0319】

予防活性を試験するために、苗に言及する施用量で活性化化合物または活性化化合物の組合せの調製物を噴霧する。噴霧コーティングを乾燥させた後、植物にブルメリア・グラミニス *f. sp. ホルデイ* (*Blumeria graminis f. sp. hordei*) の胞子を散布する。植物を温度約18 および相対大気湿度約80%の温室に置いて、うどんこ病の発生を促進する。

## 【0320】

この試験を接種7日後に評価する。0%は未処理対照の有効性に相当する有効性を意味し、100%の有効性は病気が観察されないことを意味する。

## 【0321】

以下の表は、本発明による活性化化合物の組合せの実測活性が計算された活性より大きい

10

20

30

40

50

こと、すなわち相乗効果が存在することを明らかに示している。

【 0 3 2 2 】

【 表 3 0 】

表 F1 : インビゴ予防ブルメリア (*Blumeria*) 試験 (大麦)

活性化化合物	活性化化合物の施用量 (ppm a.i.)	有効性 (%)	
		実測値*	計算値**
(I.59) 2-[6-(4-ブロモフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル]-1-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)プロパン-2-オール	100	93	
	50	57	
	25	57	
2.005 フルオピラム	60	29	
	30	0	
	15	0	
(I.59) + 2.005 1.67:1	100 + 600	100	95
(I.59) + 2.005 1.67:1	50 + 30	100	57
(I.59) + 2.005 1.67:1	25 + 15	29	57

\* 実測値=実測活性

\*\* 計算値=コルビーの式を使用して計算された活性

【 0 3 2 3 】

【 表 3 1 】

表 F2 : インビゴ予防ブルメリア (*Blumeria*) 試験 (大麦)

活性化化合物	活性化化合物の施用量 (ppm a.i.)	有効性 (%)	
		実測値*	計算値**
(I.59) 2-[6-(4-ブロモフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル]-1-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)プロパン-2-オール	100	78	
	50	56	
	25	22	
1.020 スピロキサミン	250	100	
	125	89	
	62.5	33	
5.004 クロロタロニル	250	44	
	125	44	
	62.5	22	
(I.59) + 1.020 1:2.5	100 + 250	100	100
(I.59) + 1.020 1:2.5	50 + 125	100	95
(I.59) + 1.020 1:2.5	25 + 62.5	67	48
(I.59) + 5.004 1:2.5	100 + 250	100	88
(I.59) + 5.004 1:2.5	50 + 125	100	75
(I.59) + 5.004 1:2.5	25 + 62.5	44	40

\* 実測値=実測活性

\*\* 計算値=コルビーの式を使用して計算された活性

10

20

30

40

50

## 【0324】

実施例G：インビボ予防レプトスフェリア・ノドルム (*Leptosphaeria nodorum*) 試験 (小麦)

溶媒：49重量部のN,N-ジメチルアセトアミド

乳化剤：1重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテル

## 【0325】

活性化合物の適切な調製物を製造するために、1重量部の活性化合物または活性化合物の組合せを上記の量の溶媒および乳化剤と混合し、濃縮物を水で所望の濃度に希釈する。

## 【0326】

予防活性を試験するために、苗に言及する施用量で活性化合物または活性化合物の組合せの調製物を噴霧する。噴霧コーティングを乾燥させた後、植物にレプトスフェリア・ノドルム (*Leptosphaeria nodorum*) の孢子懸濁液を噴霧する。植物を約20 および相対大気湿度約100%のインキュベーションキャビネット内で48時間静置する。植物を温度約25 および相対大気湿度約80%の温室に置く。

10

## 【0327】

この試験を接種8日後に評価する。0%は未処理対照の有効性に相当する有効性を意味し、100%の有効性は病気が観察されないことを意味する。

## 【0328】

以下の表は、本発明による活性化合物の組合せの実測活性が計算された活性より大きいこと、すなわち相乗効果が存在することを明らかに示している。

20

## 【0329】

## 【表 3 2】

表 G1: インビゴ予防レプトスフェリア・ノドルム (*Leptosphaeria nodorum*) 試験 (小麦)

活性化化合物	活性化化合物の施用量 (ppm a.i.)	有効性 (%)	
		実測値*	計算値**
(I.01) 2-[6-(4-クロロフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル]-1-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)プロパン-2-オール	80	86	
	40	57	
	20	43	
4.005 ペンシクロン	250	29	
	125	14	
	62.5	14	
5.013 マンコゼブ	1000	14	
	500	14	
	250	14	
12.003 メタラキシル	1000	0	
	500	0	
	250	29	
12.004 メタラキシル-M (メフェノキサム)	1000	14	
	500	0	
	250	0	
13.004 プロキナジド	1000	14	
	500	14	
	250	0	
15.008 シフルフェナミド	1000	0	
	500	0	
	250	0	

10

20

30

【 0 3 3 0 】

【表 3 3】

表 G1: インビボ予防レプトスフェリア・ノドルム (*Leptosphaeria nodorum*) 試験 (小麦)

活性化化合物	活性化化合物の施用量 (ppm a.i.)	有効性 (%)	
		実測値*	計算値**
(I.01) + 4.005 1:3.125	80 + 250	93	90
(I.01) + 4.005 1:3.125	40 + 125	86	63
(I.01) + 4.005 1:3.125	20 + 62.5	57	51
(I.01) + 5.013 1:12.5	80 + 1000	100	88
(I.01) + 5.013 1:12.5	40 + 500	93	63
(I.01) + 5.013 1:12.5	20 + 250	43	51
(I.01) + 12.003 1:12.5	80 + 1000	93	86
(I.01) + 12.003 1:12.5	40 + 500	86	57
(I.01) + 12.003 1:12.5	20 + 250	57	59
(I.01) + 12.004 1:12.5	80 + 1000	100	88
(I.01) + 12.004 1:12.5	40 + 500	93	57
(I.01) + 12.004 1:12.5	20 + 250	71	43
(I.01) + 13.004 1:12.5	80 + 1000	100	88
(I.01) + 13.004 1:12.5	40 + 500	93	63
(I.01) + 13.004 1:12.5	20 + 250	86	43
(I.01) + 15.008 1:12.5	80 + 1000	93	86
(I.01) + 15.008 1:12.5	40 + 500	71	57
(I.01) + 15.008 1:12.5	20 + 250	29	43

\*実測値=実測活性

\*\*計算値=コルビーの式を使用して計算された活性

## 【0331】

実施例H: インビボ予防ブクキニア・トリチシナ (*Puccinia tritricina*) 試験 (小麦)

溶媒: 49重量部のN,N-ジメチルアセトアミド

乳化剤: 1重量部のアルキルアリアルポリグリコールエーテル

## 【0332】

活性化化合物の適切な調製物を製造するために、1重量部の活性化化合物または活性化化合物の組合せを上記の量の溶媒および乳化剤と混合し、濃縮物を水で所望の濃度に希釈する。

## 【0333】

予防活性を試験するために、苗に言及する施用量で活性化化合物または活性化化合物の組合せの調製物を噴霧する。噴霧コーティングを乾燥させた後、植物にブクキニア・トリチシナ (*Puccinia tritricina*) の孢子懸濁液を噴霧する。植物を約20 および相対大気湿度約100%のインキュベーションキャビネット内で48時間静置する。植物を温度約20 および相対大気湿度約80%の温室に置く。

## 【0334】

この試験を接種8日後に評価する。0%は未処理対照の有効性に相当する有効性を意味し、100%の有効性は病気が観察されないことを意味する。

## 【0335】

以下の表は、本発明による活性化化合物の組合せの実測活性が計算された活性より大きいこと、すなわち相乗効果が存在することを明らかに示している。

## 【0336】

## 【表 3 4】

表 H1：インビゴ予防ブクキニア・トリチシナ (*Puccinia triticina*) 試験 (小麦)

活性化化合物	活性化化合物の施用量 (ppm a.i.)	有効性 (%)	
		実測値*	計算値**
(I.01) 2-[6-(4-クロロフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル]-1-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)プロパン-2-オール	80	67	
	40	33	
	20	22	
1.012 イプロコナゾール	80	89	
	40	67	
	20	0	
1.018 プロチオコナゾール	100	0	
	50	0	
	25	0	
2.002 ビキサフェン	100	67	
	50	33	
	25	22	
2.005 フルオピラム	60	33	
	30	0	
	15	0	
2.038 N-(5-クロロ-2-イソプロピルベンジル)-N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド	30	33	
	15	33	
	7.5	33	
3.020 トリフロキシストロビン	10	11	
	5	0	
	2.5	0	
3.025 (3S, 6S, 7R, 8R)-8-ベンジル-3-[(3-[(イソブチリルオキシ)メトキシ]-4-メトキシピリジン-2-イル)カルボニル]アミノ]-6-メチル-4,9-ジオキソ-1,5-ジオキソナン-7-イル2-メチルプロパノエート	150	89	
	75	67	
	37.5	22	
13.001 フルジオキソニル	80	22	
	40	0	
	20	0	

## 【0337】

10

20

30

40

## 【表 3 5】

表 H1 : インビゴ予防 プクキニア・トリチシナ (*Puccinia triticina*) 試験 (小麦)

活性化化合物	活性化化合物の施用量 (ppm a.i.)	有効性 (%)	
		実測値*	計算値**
(I.01) + 1.012 1:1	80 + 80	94	96
(I.01) + 1.012 1:1	40 + 40	94	78
(I.01) + 1.012 1:1	20 + 20	56	22
(I.01) + 1.018 1:1.25	80 + 100	89	67
(I.01) + 1.018 1:1.25	40 + 50	44	33
(I.01) + 1.018 1:1.25	20 + 25	0	22
(I.01) + 2.002 1:1.25	80 + 100	100	89
(I.01) + 2.002 1:1.25	40 + 50	67	56
(I.01) + 2.002 1:1.25	20 + 25	33	40
(I.01) + 2.005 1.33:1	80 + 60	94	78
(I.01) + 2.005 1.33:1	40 + 30	67	33
(I.01) + 2.005 1.33:1	20 + 15	33	22
(I.01) + 2.038 1.67:1	80 + 30	100	78
(I.01) + 2.038 1.67:1	40 + 15	94	56
(I.01) + 2.038 1.67:1	20 + 7.5	56	48
(I.01) + 3.020 8:1	80 + 10	89	70
(I.01) + 3.020 8:1	40 + 5	67	33
(I.01) + 3.020 8:1	20 + 2.5	0	22
(I.01) + 3.025 1:1.875	80 + 150	94	96
(I.01) + 3.025 1:1.875	40 + 75	94	78
(I.01) + 3.025 1:1.875	20 + 37.5	33	40
(I.01) + 13.001 1:1	80 + 80	89	74
(I.01) + 13.001 1:1	40 + 40	56	33
(I.01) + 13.001 1:1	20 + 20	22	22

\*実測値=実測活性

\*\*計算値=コルビーの式を使用して計算された活性

【 0 3 3 8 】



【表 3 6】

表 H2 : インビゴ予防ブクキニア・トリチシナ (*Puccinia triticina*) 試験 (小麦)

活性化化合物	活性化化合物の施用量 (ppm a.i.)	有効性 (%)	
		実測値*	計算値**
(I.59) 2-[6-(4-プロモフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル]-1-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)プロパン-2-オール	100	78	
	50	44	
	25	11	
1.012 イプロコナゾール	80	100	
	40	44	
	20	0	
1.018 プロチオコナゾール	100	0	
	50	0	
	25	0	
1.021 テブコナゾール	100	89	
	50	78	
	25	22	
2.005 フルオピラム	60	0	
	30	0	
	15	0	
2.017 ペンフルフェン	80	100	
	40	89	
	20	56	
2.038 N-(5-クロロ-2-イソプロピルベンジル)-N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド	30	44	
	15	33	
	7.5	22	
13.001 フルジオキシニル	80	0	
	40	0	
	20	0	
(I.59) + 1.012 1.25:1	100 + 80	100	100
(I.59) + 1.012 1.25:1	50 + 40	100	69
(I.59) + 1.012 1.25:1	25 + 20	22	11
(I.59) + 1.018 1:1	100 + 100	100	78
(I.59) + 1.018 1:1	50 + 50	44	44
(I.59) + 1.018 1:1	25 + 25	22	11
(I.59) + 1.021 1:1	100 + 100	100	98
(I.59) + 1.021 1:1	50 + 50	100	88
(I.59) + 1.021 1:1	25 + 25	22	31
(I.59) + 2.005 1.67:1	100 + 60	94	78
(I.59) + 2.005 1.67:1	50 + 30	67	44
(I.59) + 2.005 1.67:1	25 + 15	0	11

## 【表 3 7】

表 H2 : インビゴ予防ブクキニア・トリチシナ (*Puccinia triticina*) 試験 (小麦)

活性化化合物	活性化化合物の施用量 (ppm a.i.)	有効性 (%)	
		実測値*	計算値**
(I.59) + 2.017 1.25:1	100 + 80	100	100
(I.59) + 2.017 1.25:1	50 + 40	100	94
(I.59) + 2.017 1.25:1	25 + 20	89	60
(I.59) + 2.038 3.33:1	100 + 30	89	88
(I.59) + 2.038 3.33:1	50 + 15	89	63
(I.59) + 2.038 3.33:1	25 + 7.5	44	31
(I.59) + 13.001 1.25:1	100 + 80	100	78
(I.59) + 13.001 1.25:1	50 + 40	78	44
(I.59) + 13.001 1.25:1	25 + 20	22	11

\* 実測値=実測活性

\*\* 計算値=コルビーの式を使用して計算された活性

10

20

## 【 0 3 4 0】

## 【表 3 8】

表 H3 : インビゴ予防ブクキニア・トリチシナ (*Puccinia triticina*) 試験 (小麦)

活性化化合物	活性化化合物の施用量 (ppm a.i.)	有効性 (%)	
		実測値*	計算値**
(I.01) 2-[6-(4-クロロフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル]-1-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)プロパン-2-オール	80	60	
	40	50	
	20	30	
4.005 ペンシクロン	250	0	
	125	0	
	62.5	0	
5.004 クロロタロニル	250	40	
	125	0	
	62.5	0	
12.003 メタラキシル	1000	30	
	500	0	
	250	0	
12.004 メタラキシル-M (メフェノキサム)	1000	0	
	500	0	
	250	0	
13.004 プロキナジド	1000	0	
	500	0	
	250	0	

30

40

## 【 0 3 4 1】

## 【表 3 9】

表 H3 : インビゴ予防プクキニア・トリチシナ (*Puccinia triticina*) 試験 (小麦)

活性化化合物	活性化化合物の施用量 (ppm a.i.)	有効性 (%)	
		実測値*	計算値**
(I.01) + 4.005 1:3:125	80 + 250	80	60
(I.01) + 4.005 1:3:125	40 + 125	70	50
(I.01) + 4.005 1:3:125	20 + 62.5	20	30
(I.01) + 5.004 1:3:125	80 + 250	100	76
(I.01) + 5.004 1:3:125	40 + 125	80	50
(I.01) + 5.004 1:3:125	20 + 62.5	50	30
(I.01) + 12.003 1:12:5	80 + 1000	70	72
(I.01) + 12.003 1:12:5	40 + 500	70	50
(I.01) + 12.003 1:12:5	20 + 250	40	30
(I.01) + 12.004 1:12:5	80 + 1000	90	60
(I.01) + 12.004 1:12:5	40 + 500	80	50
(I.01) + 12.004 1:12:5	20 + 250	60	30
(I.01) + 13.004 1:12:5	80 + 1000	90	60
(I.01) + 13.004 1:12:5	40 + 500	90	50
(I.01) + 13.004 1:12:5	20 + 250	60	30

\* 実測値=実測活性

\*\* 計算値=コルビーの式を使用して計算された活性

10

20

## 【 0 3 4 2 】

## 【表 4 0】

表 H4 : インビゴ予防ブクキニア・トリチシナ (*Puccinia triticina*) 試験 (小麦)

活性化化合物	活性化化合物の施用量 (ppm a.i.)	有効性 (%)	
		実測値*	計算値**
(I.59) 2-[6-(4-ブロモフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル]-1-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)プロパン-2-オール	100	94	
	50	56	
	25	11	
1.020 スピロキサミン	250	33	
	125	33	
	62.5	11	
4.005 ペンシクロン	250	33	
	125	11	
	62.5	0	
5.004 クロロタロニル	250	33	
	125	33	
	62.5	0	
12.003 メタラキシル	1000	44	
	500	44	
	250	11	
12.004 メタラキシル-M (メフェノキサム)	1000	44	
	500	22	
	250	0	
13.004 プロキナジド	1000	33	
	500	33	
	250	11	
15.008 シフルフェナミド	1000	22	
	500	0	
	250	0	
15.047 キノフメリン	500	22	
	250	11	
	125	11	

10

20

30

【 0 3 4 3 】

## 【表 4 1】

表 H4：インビボ予防プクキニア・トリチシナ (*Puccinia triticina*) 試験 (小麦)

活性化化合物	活性化化合物の施用量 (ppm a.i.)	有効性 (%)	
		実測値*	計算値**
(I.59) + 1.020 1:2.5	100 + 250	100	96
(I.59) + 1.020 1:2.5	50 + 125	89	70
(I.59) + 1.020 1:2.5	25 + 62.5	33	21
(I.59) + 4.005 1:2.5	100 + 250	100	96
(I.59) + 4.005 1:2.5	50 + 125	94	60
(I.59) + 4.005 1:2.5	25 + 62.5	56	11
(I.59) + 5.004 1:2.5	100 + 250	100	96
(I.59) + 5.004 1:2.5	50 + 125	100	70
(I.59) + 5.004 1:2.5	25 + 62.5	44	11
(I.59) + 12.003 1:10	100 + 1000	100	97
(I.59) + 12.003 1:10	50 + 500	94	75
(I.59) + 12.003 1:10	25 + 250	78	21
(I.59) + 12.004 1:10	100 + 1000	100	97
(I.59) + 12.004 1:10	50 + 500	94	65
(I.59) + 12.004 1:10	25 + 250	89	11
(I.59) + 13.004 1:10	100 + 1000	100	96
(I.59) + 13.004 1:10	50 + 500	100	70
(I.59) + 13.004 1:10	25 + 250	33	21
(I.59) + 15.008 1:10	100 + 1000	94	96
(I.59) + 15.008 1:10	50 + 500	94	56
(I.59) + 15.008 1:10	25 + 250	44	11
(I.59) + 15.047 1:5	100 + 500	94	96
(I.59) + 15.047 1:5	50 + 250	89	60
(I.59) + 15.047 1:5	25 + 125	22	21

\*実測値=実測活性

\*\*計算値=コルビーの式を使用して計算された活性

## 【0344】

実施例 I：インビボ予防セプトリア・トリチシ (*Septoria tritici*) 試験 (小麦)

溶媒：49重量部のN,N-ジメチルアセトアミド

乳化剤：1重量部のアルキルアリアルポリグリコールエーテル

## 【0345】

活性化化合物の適切な調製物を製造するために、1重量部の活性化化合物または活性化化合物の組合せを上記の量の溶媒および乳化剤と混合し、濃縮物を水で所望の濃度に希釈する。

## 【0346】

予防活性を試験するために、苗に言及する施用量で活性化化合物または活性化化合物の組合せの調製物を噴霧する。噴霧コーティングを乾燥させた後、植物にセプトリア・トリチシ (*Septoria tritici*) の孢子懸濁液を噴霧する。植物を約20 および相対大気湿度約100%のインキュベーションキャビネット内で48時間、その後、相対大気湿度約100%の半透明インキュベーションキャビネット内で約15 で60時間静置する。植物を温度約15 および相対大気湿度約80%の温室に置く。

## 【0347】

この試験を接種21日後に評価する。0%は未処理対照の有効性に相当する有効性を意味

10

20

30

40

50

し、100%の有効性は病気が観察されないことを意味する。

【0348】

以下の表は、本発明による活性化合物の組合せの実測活性が計算された活性より大きいこと、すなわち相乗効果が存在することを明らかに示している。

【0349】

【表42】

表II: インビゴ予防セプトリア・トリチシ (*Septoria tritici*) 試験 (小麦)

活性化合物	活性化合物の施用量 (ppm a.i.)	有効性 (%)	
		実測値*	計算値**
(I.01) 2-[6-(4-クロロフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル]-1-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)プロパン-2-オール	80	100	
	40	63	
	20	13	
2.005-フルオピラム	60	88	
	30	38	
	15	13	
2.027 3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-N-(1,1,3-トリメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル)-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド	250	88	
	125	63	
	62.5	25	
3.025 (3S, 6S, 7R, 8R)-8-ベンジル-3-[(3-[(イソブチリルオキシ)メトキシ]-4-メトキシピリジン-2-イル)カルボニル)アミノ]-6-メチル-4,9-ジオキソ-1,5-ジオキソナン-7-イル2-メチルプロパノエート	150	63	
	75	13	
	37.5	13	
(I.01) + 2.005 1.33:1	80 + 60	100	100
(I.01) + 2.005 1.33:1	40 + 30	88	77
(I.01) + 2.005 1.33:1	20 + 15	38	23
(I.01) + 2.027 1:3.125	80 + 250	100	100
(I.01) + 2.027 1:3.125	40 + 125	100	86
(I.01) + 2.027 1:3.125	20 + 62.5	63	34
(I.01) + 3.025 1:1.875	80 + 150	100	100
(I.01) + 3.025 1:1.875	40 + 75	94	67
(I.01) + 3.025 1:1.875	20 + 37.5	13	23

\*実測値=実測活性

\*\*計算値=コルビーの式を使用して計算された活性

【0350】

10

20

30

40

【表 4 3】

表 I2 : インビゴ予防セプトリア・トリチシ (*Septoria tritici*) 試験 (小麦)

活性化化合物	活性化化合物の施用量 (ppm a.i.)	有効性 (%)	
		実測値*	計算値**
(I.59) 2-[6-(4-プロモフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル]-1-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)プロパン-2-オール	100	86	
	50	0	
	25	0	
1.012 イプコナゾール	80	0	
	40	0	
	20	0	
1.018 プロチオコナゾール	100	43	
	50	14	
	25	0	
1.021 テブコナゾール	100	0	
	50	0	
	25	0	
2.005 フルオピラム	60	71	
	30	29	
	15	29	
2.017 ペンフルフェン	80	0	
	40	0	
	20	29	
2.027 3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-N-(1,1,3-トリメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル)-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド	250	43	
	125	43	
	62.5	29	
3.020 トリフロキシストロビン	10	29	
	5	29	
	2.5	29	
3.025 (3S, 6S, 7R, 8R)-8-ベンジル-3-[(3-[(イソブチリルオキシ)メトキシ]-4-メトキシピリジン-2-イル)カルボニル]アミノ]-6-メチル-4,9-ジオキソ-1,5-ジオキソナン-7-イル2-メチルプロパノエート	150	71	
	75	71	
	37.5	14	
13.001 フルジオキサニル	80	29	
	40	29	
	20	29	

10

20

30

40

【0351】

## 【表 4 4】

表 I2 : インビゴ予防セプトリア・トリチシ (*Septoria tritici*) 試験 (小麦)

活性化化合物	活性化化合物の施用量 (ppm a.i.)	有効性 (%)	
		実測値*	計算値**
(I.59) + 1.012 1.25:1	100 + 80	86	86
(I.59) + 1.012 1.25:1	50 + 40	57	0
(I.59) + 1.012 1.25:1	25 + 20	0	0
(I.59) + 1.018 1:1	100 + 100	86	92
(I.59) + 1.018 1:1	50 + 50	57	14
(I.59) + 1.018 1:1	25 + 25	43	0
(I.59) + 1.021 1:1	100 + 100	93	86
(I.59) + 1.021 1:1	50 + 50	71	0
(I.59) + 1.021 1:1	25 + 25	57	0
(I.59) + 2.005 1.67:1	100 + 60	100	96
(I.59) + 2.005 1.67:1	50 + 30	86	29
(I.59) + 2.005 1.67:1	25 + 15	43	29
(I.59) + 2.017 1.25:1	100 + 80	86	86
(I.59) + 2.017 1.25:1	50 + 40	86	0
(I.59) + 2.017 1.25:1	25 + 20	0	29
(I.59) + 2.027 1:2.5	100 + 250	100	92
(I.59) + 2.027 1:2.5	50 + 125	57	43
(I.59) + 2.027 1:2.5	25 + 62.5	43	29
(I.59) + 3.020 10:1	100 + 10	93	90
(I.59) + 3.020 10:1	50 + 5	57	29
(I.59) + 3.020 10:1	25 + 6.5	29	29
(I.59) + 3.025 1:1.5	100 + 150	100	96
(I.59) + 3.025 1:1.5	50 + 75	86	71
(I.59) + 3.025 1:1.5	25 + 37.5	71	14
(I.59) + 13.001 1.25:1	100 + 80	93	90
(I.59) + 13.001 1.25:1	50 + 40	93	29
(I.59) + 13.001 1.25:1	25 + 20	57	29

\*実測値=実測活性

\*\*計算値=コルビーの式を使用して計算された活性

【 0 3 5 2 】



【表 4 5】

表 I3 : インビゴ予防セプトリア・トリチシ (*Septoria tritici*) 試験 (小麦)

活性化化合物	活性化化合物の施用量 (ppm a.i.)	有効性 (%)	
		実測値*	計算値**
(I.01) 2-[6-(4-クロロフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル]-1-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)プロパン-2-オール	80	71	
	40	43	
	20	29	
1.020 スピロキサミン	250	57	
	125	14	
	62.5	0	
4.005 ペンシクロン	250	0	
	125	0	
	62.5	0	
5.004 クロタロニル	250	14	
	125	0	
	62.5	0	
5.013 マンコゼブ	1000	29	
	500	29	
	250	29	
12.003 メタラキシル	1000	0	
	500	0	
	250	0	
12.004 メタラキシル-M (メフェノキサム)	1000	0	
	500	0	
	250	0	
13.004 プロキナジド	1000	0	
	500	0	
	250	0	
15.008 シフルフェナミド	1000	29	
	500	29	
	250	14	
15.047 キノフメリン	500	0	
	250	0	
	125	0	

10

20

30

【 0 3 5 3 】

【表 4 6】

表 I3 : インビゴ予防セプトリア・トリチシ (*Septoria tritici*) 試験 (小麦)

活性化化合物	活性化化合物の施用量 (ppm a.i.)	有効性 (%)	
		実測値*	計算値**
(I.01) + 1.020 1:3.125	80 + 250	93	88
(I.01) + 1.020 1:3.125	40 + 125	71	51
(I.01) + 1.020 1:3.125	20 + 62.5	43	29
(I.01) + 4.005 1:3.125	80 + 250	100	71
(I.01) + 4.005 1:3.125	40 + 125	93	43
(I.01) + 4.005 1:3.125	20 + 62.5	71	29
(I.01) + 5.004 1:3.125	80 + 250	100	76
(I.01) + 5.004 1:3.125	40 + 125	86	43
(I.01) + 5.004 1:3.125	20 + 62.5	43	29
(I.01) + 5.013 1:12.5	80 + 1000	100	80
(I.01) + 5.013 1:12.5	40 + 500	93	59
(I.01) + 5.013 1:12.5	20 + 250	29	49
(I.01) + 12.003 1:12.5	80 + 1000	100	71
(I.01) + 12.003 1:12.5	40 + 500	100	43
(I.01) + 12.003 1:12.5	20 + 250	71	29
(I.01) + 12.004 1:12.5	80 + 1000	100	71
(I.01) + 12.004 1:12.5	40 + 500	100	43
(I.01) + 12.004 1:12.5	20 + 250	71	29
(I.01) + 13.004 1:12.5	80 + 1000	100	71
(I.01) + 13.004 1:12.5	40 + 500	93	43
(I.01) + 13.004 1:12.5	20 + 250	71	29
(I.01) + 15.008 1:12.5	80 + 1000	100	80
(I.01) + 15.008 1:12.5	40 + 500	86	59
(I.01) + 15.008 1:12.5	20 + 250	29	39
(I.01) + 15.047 1:6.25	80 + 500	100	71
(I.01) + 15.047 1:6.25	40 + 250	71	43
(I.01) + 15.047 1:6.25	20 + 125	0	29

\*実測値=実測活性

\*\*計算値=コルビーの式を使用して計算された活性

## 【 0 3 5 4 】

実施例 J : 真菌微生物によるインビトロ試験

96ウェルマイクロタイタープレートのウェルに、メタノール中の試験化合物または化合物組合せ + 乳化剤アルキルアール - ポリグリコール - エーテルの調製物10 µlを充填する。その後、溶媒をフード内で蒸発させる。次のステップで、各ウェルに液体ポテトデキストロース培地100 µlを入れ、これを試験真菌の適切な濃度の孢子または菌糸体懸濁液で補正した。

## 【 0 3 5 5 】

光度計を用いて、全てのウェルにおける吸光度を波長620nmで測定する。

## 【 0 3 5 6 】

マイクロタイタープレートを20 および85%相対湿度でインキュベートする。増殖阻害を施用3~5日後に再び測光法で測定する。有効性を未処理対照に関して計算し、0%有効性は未処理対照と同程度に高い真菌増殖を意味し、100%有効性は真菌増殖が測定されな

いことを意味する。

【 0 3 5 7 】

【 表 4 7 】

表 J1 : アルテルナリア・アルテルナータ (*Alternaria alternata*) によるインビトロ試験

実施例 I.01 (ppm)	実施例 1.018 プロチオコナゾール (ppm)	比	有効性%	コルビー予想値%
0.04			0	
	0.2		91	
0.04	0.2	1:5	99	91

10

【 0 3 5 8 】

【 表 4 8 】

表 J2 : アルテルナリア・アルテルナータ (*Alternaria alternata*) によるインビトロ試験

実施例 I.01 (ppm)	実施例 1.021 テブコナゾール (ppm)	比	有効性%	コルビー予想値%
0.2			10	
0.04			0	
0.008			12	
	1		36	
	0.2		24	
	0.04		19	
0.2	1	1:5	100	42
0.04	0.2	1:5	44	24
0.008	0.04	1:5	43	29

20

30

【 0 3 5 9 】

【表 4 9】

表 J3 : アルテルナリア・アルテルナータ (*Alternaria alternata*) によるインビトロ試験

実施例 I.01 (ppm)	実施例 2.002 ビキサフェン (ppm)	比	有効性%	コルビー予想値%
0.2			0	
0.04			0	
	1		88	
	0.2		84	
0.2	1	1:5	90	88
0.04	0.2	1:5	91	84

10

【 0 3 6 0】

【表 5 0】

表 J4 : アルテルナリア・アルテルナータ (*Alternaria alternata*) によるインビトロ試験

実施例 I.59 (ppm)	実施例 1.015 パクロブトラゾール (ppm)	比	有効性%	コルビー予想値%
0.2			38	
	1		0	
0.2	1	1:5	85	38

20

30

【 0 3 6 1】

【表 5 1】

表 J5 : アルテルナリア・アルテルナータ (*Alternaria alternata*) によるインビトロ試験

実施例 I.59 (ppm)	実施例 1.018 プロチオコナゾール (ppm)	比	有効性%	コルビー予想値%
0.008			44	
	0.04		0	
0.008	0.04	1:5	72	44

40

【 0 3 6 2】

## 【表 5 2】

表 J6 : アルテルナリア・アルテルナータ (*Alternaria alternata*) によるインビトロ試験

実施例 I.59 (ppm)	実施例 2.002 ビキサフェン (ppm)	比	有効性%	コルビー予想値%
0.04			0	
0.008			0	
	0.2		57	
	0.04		55	
0.04	0.2	1:5	83	57
0.008	0.04	1:5	66	55

10

## 【 0 3 6 3 】

## 【表 5 3】

表 J7 : アルテルナリア・アルテルナータ (*Alternaria alternata*) によるインビトロ試験

実施例 I.59 (ppm)	実施例 13.004 プロキナジド (ppm)	比	有効性%	コルビー予想値%
0.04			50	
0.008			44	
	4		0	
	0.8		0	
0.04	4	1:100	53	50
0.008	0.8	1:100	55	44

20

30

## 【 0 3 6 4 】

## 【表 5 4】

表 J8 : ボトリチス・シネレア (*Botrytis cinerea*) によるインビトロ試験

実施例 I.59 (ppm)	実施例 1.020 スピロキサミン (ppm)	比	有効性%	コルビー予想値%
0.2			1	
0.04			0	
	20		9	
	4		7	
0.2	20	1:100	83	10
0.04	4	1:100	27	7

40

50

【 0 3 6 5 】

【 表 5 5 】

表 J9 : ボトリチス・シネレア (*Botrytis cinerea*) によるインビトロ試験

実施例 I.59 (ppm)	実施例 2.002 ビキサフェン (ppm)	比	有効性%	コルビー予想値%
1			100	
0.2			0	
	5		91	
	1		63	
1	5	1:5	99	100
0.2	1	1:5	70	63

10

【 0 3 6 6 】

【 表 5 6 】

表 J10 : ボトリチス・シネレア (*Botrytis cinerea*) によるインビトロ試験

実施例 I.59 (ppm)	実施例 15.047 (ppm)	比	有効性%	コルビー予想値%
1			100	
0.2			0	
	5		0	
	1		0	
1	5	1:5	100	100
0.2	1	1:5	77	0

30

【 0 3 6 7 】

【 表 5 7 】

表 J11 : フザリウム・クルモルム (*Fusarium culmorum*) によるインビトロ試験

実施例 I.01 (ppm)	実施例 1.012 イプコナゾール (ppm)	比	有効性%	コルビー予想値%
1			19	
0.2			26	
	5		99	
	1		96	
1	5	1:5	100	99
0.2	1	1:5	99	97

40

50

【 0 3 6 8 】

【 表 5 8 】

表 J12 : フザリウム・クルモルム (*Fusarium culmorum*) によるインビトロ試験

実施例 I.01 (ppm)	実施例 1.018 プロチオコナゾール (ppm)	比	有効性%	コルビー予想値%
0.04			44	
	0.2		99	
0.04	0.2	1:5	100	99

10

【 0 3 6 9 】

【 表 5 9 】

表 J13 : フザリウム・クルモルム (*Fusarium culmorum*) によるインビトロ試験

実施例 I.59 (ppm)	実施例 1.012 イブコナゾール (ppm)	比	有効性%	コルビー予想値%
0.04			0	
0.008			0	
	0.2		13	
	0.04		7	
0.04	0.2	1:5	85	13
0.008	0.04	1:5	31	7

20

30

【 0 3 7 0 】

【 表 6 0 】

表 J14 : フザリウム・クルモルム (*Fusarium culmorum*) によるインビトロ試験

実施例 I.59 (ppm)	実施例 15.047 (ppm)	比	有効性%	コルビー予想値%
0.04			0	
0.008			0	
	0.2		100	
	0.04		83	
0.04	0.2	1:5	100	100
0.008	0.04	1:5	90	83

40

【 0 3 7 1 】

## 【表 6 1】

表 J15 : レプトスフェリア・ノドルム (*Leptosphaeria nodorum*) によるインビトロ試験

実施例 I.01 (ppm)	実施例 5.004 クロロタロニル (ppm)	比	有効性%	コルビー予想値%
0.008			91	
	0.04		0	
0.008	0.04	1:5	99	91

10

## 【 0 3 7 2 】

## 【表 6 2】

表 J16 : ピレノフォラ・テレス (*Pyrenophora teres*) によるインビトロ試験

実施例 I.01 (ppm)	実施例 1.018 プロチオコナゾール (ppm)	比	有効性%	コルビー予想値%
0.04			26	
	0.2		22	
0.04	0.2	1:5	56	42

20

## 【 0 3 7 3 】

## 【表 6 3】

表 J17 : ピレノフォラ・テレス (*Pyrenophora teres*) によるインビトロ試験

実施例 I.01 (ppm)	実施例 2.002 ビキサフェン (ppm)	比	有効性%	コルビー予想値%
1			5	
0.2			0	
0.04			0	
	5		72	
	1		60	
	0.2		46	
1	5	1:5	91	73
0.2	1	1:5	68	60
0.04	0.2	1:5	51	46

40

## 【 0 3 7 4 】



【表 6 4】

表 J18 : ピレノフォラ・テレス (*Pyrenophora teres*) によるインビトロ試験

実施例 I.01 (ppm)	実施例 2.027 (ppm)	比	有効性%	コルビー予想値%
0.2			0	
0.04			0	
	20		62	
	4		43	
0.2	20	1:100	74	62
0.04	4	1:100	48	43

10

【 0 3 7 5】

【表 6 5】

表 J19 : ピレノフォラ・テレス (*Pyrenophora teres*) によるインビトロ試験

実施例 I.01 (ppm)	実施例 2.038 (ppm)	比	有効性%	コルビー予想値%
0.2			0	
0.04			0	
0.008			0	
	20		55	
	4		82	
	0.8		57	
0.2	20	1:100	92	55
0.04	4	1:100	88	82
0.008	0.8	1:100	68	57

20

30

【 0 3 7 6】

【表 6 6】

表 J20 : ピレノフォラ・テレス (*Pyrenophora teres*) によるインビトロ試験

実施例 I.01 (ppm)	実施例 3.020 トリフロキシストロピ ン (ppm)	比	有効性%	コルビー予想値%
1			5	
	5		6	
1	5	1:5	32	11

40

50

【 0 3 7 7 】

【 表 6 7 】

表 J21 : ピレノフォラ・テレス (*Pyrenophora teres*) によるインビトロ試験

実施例 I.01 (ppm)	実施例 3.025 (ppm)	比	有効性%	コルビー予想値%
1			5	
	100		10	
1	100	1:100	53	15

10

【 0 3 7 8 】

【 表 6 8 】

表 J22 : ピレノフォラ・テレス (*Pyrenophora teres*) によるインビトロ試験

実施例 I.01 (ppm)	実施例 4.005 ペンシクロン (ppm)	比	有効性%	コルビー予想値%
1			21	
0.2			19	
	100		5	
	20		17	
1	100	1:100	51	25
0.2	20	1:100	35	33

20

30

【 0 3 7 9 】

【 表 6 9 】

表 J23 : ピレノフォラ・テレス (*Pyrenophora teres*) によるインビトロ試験

実施例 I.01 (ppm)	実施例 5.013 マンコゼブ (ppm)	比	有効性%	コルビー予想値%
0.2			14	
0.04			1	
	20		81	
	4		25	
0.2	20	1:100	91	84
0.04	4	1:100	32	26

40

【 0 3 8 0 】

## 【表 7 0】

表 J24 : ピレノフォラ・テレス (*Pyrenophora teres*) によるインビトロ試験

実施例 I.01 (ppm)	実施例 5.018 プロピネブ (ppm)	比	有効性%	コルビー予想値%
0.04			1	
	4		22	
0.04	4	1:100	45	23

10

## 【 0 3 8 1】

## 【表 7 1】

表 J25 : ピレノフォラ・テレス (*Pyrenophora teres*) によるインビトロ試験

実施例 I.01 (ppm)	実施例 15.047 (ppm)	比	有効性%	コルビー予想値%
0.2			14	
0.04			1	
0.008			0	
	1		64	
	0.2		76	
	0.04		28	
0.2	1	1:5	81	69
0.04	0.2	1:5	82	76
0.008	0.04	1:5	45	28

20

30

## 【 0 3 8 2】

## 【表 7 2】

表 J26 : ピレノフォラ・テレス (*Pyrenophora teres*) によるインビトロ試験

実施例 I.59 (ppm)	実施例 5.013 マンコゼブ (ppm)	比	有効性%	コルビー予想値%
1			0	
0.04			0	
	100		83	
	4		76	
1	100	1:100	94	83
0.04	4	1:100	93	76

40

## 【 0 3 8 3】

50

## 【表 7 3】

表 J27 : ピリキュラリア・オリザエ (*Pyricularia oryzae*) によるインビトロ試験

実施例 I.01 (ppm)	実施例 1.021 テブコナゾール (ppm)	比	有効性%	コルビー予想値%
0.2			7	
0.04			0	
	1		87	
	0.2		87	
0.2	1	1:5	96	88
0.04	0.2	1:5	100	87

10

## 【 0 3 8 4】

## 【表 7 4】

表 J28 : ピリキュラリア・オリザエ (*Pyricularia oryzae*) によるインビトロ試験

実施例 I.01 (ppm)	実施例 2.017 ペンフルフェン (ppm)	比	有効性%	コルビー予想値%
1			61	
0.2			0	
	5		91	
	1		44	
1	5	1:5	100	96
0.2	1	1:5	72	44

20

30

## 【 0 3 8 5】

## 【表 7 5】

表 J29 : ピリキュラリア・オリザエ (*Pyricularia oryzae*) によるインビトロ試験

実施例 I.01 (ppm)	実施例 2.038 (ppm)	比	有効性%	コルビー予想値%
0.2			0	
0.04			1	
0.008			4	
	20		75	
	4		51	
	0.8		0	
0.2	20	1:100	96	75
0.04	4	1:100	63	51
0.008	0.8	1:100	23	4

10

## 【 0 3 8 6 】

## 【表 7 6】

20

表 J30 : ピリキュラリア・オリザエ (*Pyricularia oryzae*) によるインビトロ試験

実施例 I.01 (ppm)	実施例 3.020 トリフロキシストロビ ン (ppm)	比	有効性%	コルビー予想値%
1			61	
	5		98	
1	5	1:5	100	99

30

## 【 0 3 8 7 】

## 【表 77】

表 J31 : ピリキュラリア・オリザエ (*Pyricularia oryzae*) によるインビトロ試験

実施例 I.01 (ppm)	実施例 3.025 (ppm)	比	有効性%	コルビー予想値%
0.2			0	
0.04			1	
0.008			4	
	20		100	
	4		84	
	0.8		91	
0.2	20	1:100	100	100
0.04	4	1:100	97	84
0.008	0.8	1:100	100	91

10

## 【0388】

## 【表 78】

20

表 J32 : ピリキュラリア・オリザエ (*Pyricularia oryzae*) によるインビトロ試験

実施例 I.01 (ppm)	実施例 13.001 フルジオキサニル (ppm)	比	有効性%	コルビー予想値%
1			95	
0.2			7	
	5		89	
	1		87	
1	5	1:5	100	99
0.2	1	1:5	97	88

30

## 【0389】

## 【表 79】

表 J33 : ピリキュラリア・オリザエ (*Pyricularia oryzae*) によるインビトロ試験

実施例 I.59 (ppm)	実施例 1.021 テブコナゾール (ppm)	比	有効性%	コルビー予想値%
0.2			0	
	1		89	
0.2	1	1:5	91	89

40

## 【0390】

50

【表 8 0】

表 J34 : ピリキュラリア・オリザエ (*Pyricularia oryzae*) によるインビトロ試験

実施例 I.59 (ppm)	実施例 3.025 (ppm)	比	有効性%	コルビー予想値%
0.2			0	
0.04			13	
0.008			11	
	20		72	
	4		85	
	0.8		67	
0.2	20	1:100	85	72
0.04	4	1:100	96	87
0.008	0.8	1:100	82	71

10

【 0 3 9 1】

【表 8 1】

20

表 J35 : ピリキュラリア・オリザエ (*Pyricularia oryzae*) によるインビトロ試験

実施例 I.59 (ppm)	実施例 13.001 フルジオキソニル (ppm)	比	有効性%	コルビー予想値%
1			49	
0.2			0	
0.04			0	
	5		79	
	1		88	
	0.2		82	
1	5	1:5	97	89
0.2	1	1:5	89	88
0.04	0.2	1:5	95	82

30

【 0 3 9 2】

## 【表 8 2】

表 J36 : ピリキュラリア・オリザエ (*Pyricularia oryzae*) によるインビトロ試験

実施例 I.59 (ppm)	実施例 15.008 シフルフェナミド (ppm)	比	有効性%	コルビー予想値%
0.2			0	
0.04			0	
	20		91	
	4		17	
0.2	20	1:100	93	91
0.04	20	1:100	20	17

10

## 【 0 3 9 3 】

## 【表 8 3】

例 J37 : リゾクトニア・ソラニ (*Rhizoctonia solani*) によるインビトロ試験

実施例 I.01 (ppm)	実施例 5.018 プロピネブ (ppm)	比	有効性%	コルビー予想値%
0.04			0	
	4		34	
0.04	4	1:100	58	34

20

30

## 【 0 3 9 4 】

## 【表 8 4】

例 J38 : リゾクトニア・ソラニ (*Rhizoctonia solani*) によるインビトロ試験

実施例 I.59 (ppm)	実施例 1.012 イプコナゾール (ppm)	比	有効性%	コルビー予想値%
0.04			0	
0.008			0	
	0.2		96	
	0.04		35	
0.04	0.2	1:5	97	96
0.008	0.04	1:5	52	35

40

## 【 0 3 9 5 】



【表 8 5】

例 J39 : リゾクトニア・ソラニ (*Rhizoctonia solani*) によるインビトロ試験

実施例 I.59 (ppm)	実施例 5.013 マンコゼブ (ppm)	比	有効性%	コルビー予想値%
0.2			97	
0.04			23	
	20		99	
	4		57	
0.2	20	1:100	99	100
0.04	4	1:100	91	67

10

【0396】

【表 8 6】

例 J40 : リゾクトニア・ソラニ (*Rhizoctonia solani*) によるインビトロ試験

実施例 I.59 (ppm)	実施例 15.047 (ppm)	比	有効性%	コルビー予想値%
1			100	
0.2			97	
	5		0	
	1		0	
1	5	1:5	100	100
0.2	1	1:5	100	97

20

30

【0397】

【表 8 7】

表 J41 : セプトリア・トリチシ (*Septoria tritici*) によるインビトロ試験

実施例 I.01 (ppm)	実施例 1.020 スピロキサミン (ppm)	比	有効性%	コルビー予想値%
0.04			95	
0.008			69	
	4		34	
	0.8		25	
0.04	4	1:100	100	97
0.008	0.8	1:100	85	77

40

【0398】

【表 8 8】

表 J42 : セプトリア・トリチシ (*Septoria tritici*) によるインビトロ試験

実施例 I.01 (ppm)	実施例 2.005 フルオピラム (ppm)	比	有効性%	コルビー予想値%
0.04			94	
0.008			61	
	0.2		93	
	0.04		43	
0.04	0.2	1:5	100	100
0.008	0.04	1:5	87	78

10

【 0 3 9 9 】

【表 8 9】

表 J43 : セプトリア・トリチシ (*Septoria tritici*) によるインビトロ試験

実施例 I.01 (ppm)	実施例 12.003 メタラキシル (ppm)	比	有効性%	コルビー予想値%
1			86	
0.2			85	
	100		35	
	20		51	
1	100	1:100	100	91
0.2	20	1:100	100	93

20

30

【 0 4 0 0 】

【表 9 0】

表 J44 : セプトリア・トリチシ (*Septoria tritici*) によるインビトロ試験

実施例 I.01 (ppm)	実施例 12.004 メフェンキサム (ppm)	比	有効性%	コルビー予想値%
1			86	
0.2			85	
	100		28	
	20		45	
1	100	1:100	100	90
0.2	20	1:100	100	92

40

50

【 0 4 0 1 】

【 表 9 1 】

表 J45 : セプトリア・トリチシ (*Septoria tritici*) によるインビトロ試験

実施例 I.01 (ppm)	実施例 13.004 メフェンキサム (ppm)	比	有効性%	コルビー予想値%
1			86	
0.2			85	
	100		28	
	20		55	
1	100	1:100	100	90
0.2	20	1:100	100	93

10

【 0 4 0 2 】

【 表 9 2 】

表 J46 : セプトリア・トリチシ (*Septoria tritici*) によるインビトロ試験

実施例 I.59 (ppm)	実施例 1.015 パクロブトラゾール (ppm)	比	有効性%	コルビー予想値%
0.2			53	
	1		13	
0.2	1	1:5	96	59

20

30

【 0 4 0 3 】

【 表 9 3 】

表 J47 : セプトリア・トリチシ (*Septoria tritici*) によるインビトロ試験

実施例 I.59 (ppm)	実施例 2.005 フルオピラム (ppm)	比	有効性%	コルビー予想値%
0.04			86	
0.008			49	
	0.2		67	
	0.04		22	
0.04	0.2	1:5	100	95
0.008	0.04	1:5	76	60

40

【 0 4 0 4 】

【表 9 4】

表 J48 : セプトリア・トリチシ (*Septoria tritici*) によるインビトロ試験

実施例 I.59 (ppm)	実施例 3.020 トリフロキシストロビン (ppm)	比	有効性%	コルビー予想値%
1			70	
	5		90	
1	5	1:5	100	97

10

【0405】

【表 9 5】

表 J49 : セプトリア・トリチシ (*Septoria tritici*) によるインビトロ試験

実施例 I.59 (ppm)	実施例 4.005 ペンシクロン (ppm)	比	有効性%	コルビー予想値%
1			65	
0.2			55	
	100		0	
	20		8	
1	100	1:100	71	65
0.2	20	1:100	68	59

20

30

【0406】

【表 9 6】

表 J50 : セプトリア・トリチシ (*Septoria tritici*) によるインビトロ試験

実施例 I.59 (ppm)	実施例 5.018 プロピネブ (ppm)	比	有効性%	コルビー予想値%
0.04			96	
0.008			54	
	4		19	
	0.8		12	
0.04	4	1:100	100	97
0.008	0.8	1:100	71	60

40

【0407】

【表 97】

表 J51: セプトリア・トリチシ (*Septoria tritici*) によるインビトロ試験

実施例 I.59 (ppm)	実施例 12.003 メタラキシル (ppm)	比	有効性%	コルビー予想値%
1			65	
0.2			55	
	100		5	
	20		15	
1	100	1:100	100	67
0.2	20	1:100	94	62

10

【0408】

【表 98】

表 J52: セプトリア・トリチシ (*Septoria tritici*) によるインビトロ試験

実施例 I.59 (ppm)	実施例 12.004 メフェンキサム (ppm)	比	有効性%	コルビー予想値%
1			65	
0.2			55	
	100		28	
	20		40	
1	100	1:100	96	75
0.2	20	1:100	96	73

20

30

【0409】

【表 99】

表 J53: ウスチラゴ・アベナエ (*Ustilago avenae*) によるインビトロ試験

実施例 I.59 (ppm)	実施例 1.018 プロチオコナゾール (ppm)	比	有効性%	コルビー予想値%
1			100	
0.2			0	
	5		100	
	1		85	
1	5	1:5	100	100
0.2	1	1:5	97	85

40

50

【 0 4 1 0 】

【 表 1 0 0 】

表 J54 : ウスチラゴ・アベナエ (*Ustilago avenae*) によるインビトロ試験

実施例 I.59 (ppm)	実施例 1.020 スピロキサミン (ppm)	比	有効性%	コルビー予想値%
1			100	
0.2			0	
	100		100	
	20		12	
1	100	1:100	100	100
0.2	20	1:100	93	12

10

【 0 4 1 1 】

【 表 1 0 1 】

表 J55 : ウスチラゴ・アベナエ (*Ustilago avenae*) によるインビトロ試験

実施例 I.59 (ppm)	実施例 2.005 フルオピラム (ppm)	比	有効性%	コルビー予想値%
1			86	
	5		0	
1	5	1:5	100	86

20

30

【 0 4 1 2 】

【 表 1 0 2 】

表 J56 : ウスチラゴ・アベナエ (*Ustilago avenae*) によるインビトロ試験

実施例 I.59 (ppm)	実施例 2.038 (ppm)	比	有効性%	コルビー予想値%
0.2			0	
0.04			0	
0.008			0	
	20		52	
	4		49	
	0.8		43	
0.2	20	1:100	55	52
0.04	4	1:100	54	49
0.008	0.8	1:100	57	43

40

【 0 4 1 3 】

50

### 非標的種に対する効果

本発明による活性化合物の組合せのいくつかは、改善された非標的種との適合性を有するので、より環境に優しい解決法を潜在的に提供する。これは以下の実施例から自明である。実験により、組合せが、個々の活性化合物の特性に基づいた予測と比較して、これらの非標的種に対する望ましくない効果を減少させる可能性を有することが示されている。それによって、本発明は環境上の利益をもたらすだろう。本発明はまた、例えば、環境品質を保護しながら、または環境に対する製品の安全な使用を保証するために必要な緩和措置を減らしながら、有害生物耐性を最小化する必要がある場合は、より高い登録施用量の可能性を通して農学的利益をもたらすであろう。

#### 【0414】

活性化合物の組合せの効果は、植物保護製品の規制環境リスク評価に古典的に使用されている濃度付加の仮説のもとで予想されるよりも低い場合、より環境に優しい殺真菌製品が識別される。いくつかの活性化合物の混合物に対する濃度付加の仮説の下では、 $x\%$ の効果を引き起こす混合物中のそれぞれの有効性 ( $1/EC_{xi}$ ) と掛け合わせた化学物質の濃度 ( $c_i$ ) の和は1に等しい (Cedergreen, N., 「Quantifying Synergy: A Systematic Review of Mixture Toxicity Studies within Environmental Toxicology」、PLoSone 2014, 9(5), e96580) :

#### 【数2】

$$\sum_{i=1}^n \frac{c_i}{EC_{xi}} = 1 \quad [1]$$

( $EC_{xi}$  で、各化学物質  $i$  の効果濃度 (EC) (ppm) は生態毒性試験の評価項目に  $x\%$  の効果を引き起こす)。

#### 【0415】

この仮説の下では、活性化合物の組合せの予想効果を以下のように計算することができる:

#### 【数3】

$$EC_{xmix} = \left( \sum_{i=1}^n \frac{p_i}{EC_{xi}} \right)^{-1} \quad [2]$$

( $p_i$  は組合せ中の各活性化合物の割合である)。

#### 【0416】

各化合物組合せについて、予想  $EC_x$  値を計算する。次いで、これを実験的に測定された値と比較する。次いで、組合せについての予想効果と測定された効果の比 (以後、モデル偏差比または MDR と呼ばれる) を計算する。結果は次のように解釈される:

- MDR < 1 の場合、化合物組合せは示す効果が小さい、すなわち、予想されるよりも環境上好ましい;

- MDR > 1 の場合、化合物組合せは示す効果が大きい、すなわち、予想されるよりもあまり環境上好ましくない。

#### 【0417】

化合物組合せの環境効果を、魚 (ゼブラフィッシュ (Danio rerio)) を用いた実験室生態毒性スクリーニング試験で実験的に測定した。魚の胚を 28.5 で 96 時間、本発明による活性化合物単独および組合せに暴露した。各試験濃度および参照対照について、96 時間後に死亡率を記録した。次いで、これらのデータを使用して、暴露魚の 50% の死亡率を引き起こす濃度、すなわち致死濃度 50%、 $LC_{50}$  を計算した。活性化合物単独について得られた  $LC_{50}$  値 (ppm (= mg/L) a.l.) を使用して、式 [2] を用いて化合物組合せの予想毒性を推定した。次いで、MDR 値を計算した。

#### 【0418】

10

20

30

40

50

本発明を以下の実施例により説明する。しかしながら、本発明はこれらの実施例に限定されない。

【0419】

実施例K：魚（ゼブラフィッシュ（*Danio rerio*））に対するインビボ生態毒性スクリーニング試験

溶媒：0.5重量% ジメチルスルホキシド

活性化化合物の適切な調製物を製造するために、化合物を最初にビヒクル溶媒ジメチルスルホキシドの純粋な溶液中に希釈する。次いで、この濃縮液を水で、0.5重量%の最大溶媒濃度をもたらす所望のa.i.濃度に希釈する。化合物単独および組合せを、0.01~1000ppm a.i.（例えば、0.1、1.0、10および100ppm a.i.）の5つの増加濃度について試験した。組合せについては、化合物AおよびBを5：1~1：5の重量比で混合し、5つの漸増濃度を各比について試験した。

10

【0420】

以下の表は、本発明による活性化化合物の組合せの観察された効果が予想効果より低いこと、すなわち本発明による組合せが非標的種に対する望ましくない環境効果を低下させる可能性を有することを明確に示している。

【0421】



【表 103A】

表 K1: 魚 (ゼブラフィッシュ (*D. rerio*)) に対するインビボ生態毒性スクリーニング試験: 96 時間後の結果

活性化化合物	試験した濃度範囲 (ppm a.i.)	生態毒性 LC <sub>50~96時間</sub> (ppm a.i.)		MD R
		実測値*	計算値**	
(I-01) 2-[6-(4-クロロフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル]-1-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)プロパン-2-オール	1-12	6.21		
(I-59) 2-[6-(4-ブロモフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル]-1-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)プロパン-2-オール	1-16	6.00		
1.012 イブコナゾール	0.01-40	6.57		
1.018 プロチオコナゾール	0.01-100	3.16		
1.020 スピロキサミン	0.01-40	14.81		
1.021 テブコナゾール	0.01-100	19.7		
2.002 ビキサフェン	0.01-100	0.154		
2.005 フルオピラム	10-200	>200		
2.017 ペンフルフェン	0.01-100	0.62		
2.038 N-(5-クロロ-2-イソプロピルベンジル)-N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド	0.01-100	1.74		
3.020 トリフロキシストロビン	0.01-30	0.24		
3.025 (3S, 6S, 7R, 8R)-8-ベンジル-3-[(3-[(イソブチリルオキシ)メトキシ]-4-メトキシピリジン-2-イル)カルボニル]アミノ]-6-メチル-4,9-ジオキソ-1,5-ジオキソナン-7-イル-2-メチルプロパノエート	0.01-30	1.87		
4.005 ペンシクロン	0.01-35	>200		
5.018 プロピネブ	0.01-100	25.18		
12.003 メタラキシル	0.01-200	>200		
12.004 メタラキシル-M (メフェノキサム)	0.01-200	>200		
13.001 フルジオキソニル	0.1-10	0.89		
13.004 プロキナジド	0.01-100	9.89		
15.008 シフルフェナミド	0.01-100	5.2		
15.047 3-(4,4-ジフルオロ-3,3-ジメチル-3,4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン	1-40	7.82		
(I-01) + 1.012 1:5	0.1+0.5-10+50	6.70	6.51	0.97
(I-01) + 1.012 5:1	1+0.2-12+2.4	7.28	6.27	0.86
(I-01) + 1.018 1:5	0.1+0.5-1.2+6	3.18	3.44	1.08
(I-01) + 1.018 5:1	1+0.2-12+2.4	6.58	5.35	0.81

10

20

30

40

【表 103B】

活性化化合物	試験した濃度範囲 (ppm a.i.)	生態毒性 LC <sub>50</sub> ~96時間 (ppm a.i.)		MD R
		実測 値*	計算 値**	
(I-01) + 1.020 1:5	1+5 · 12+60	13.43	12.04	0.90
(I-01) + 1.020 5:1	1+0.2 · 12+2.4	11.06	6.88	0.62
(I-01) + 1.021 1:5	1+5 · 12+60	17.52	14.47	0.83
(I-01) + 1.021 5:1	1+0.2 · 12+2.4	7.58	7.01	0.93
(I-01) + 2.002 1:5	0.01+0.05 · 0.12+0.6	0.18	0.18	1.00
(I-01) + 2.002 5:1	0.1+0.02 · 10+2	1.21	0.82	0.68
(I-01) + 2.005 1:5	1+5 · 12+60	27.63	32.27	1.17
(I-01) + 2.005 5:1	1+0.2 · 12+2.4	11.06	7.41	0.67
(I-01) + 2.017 1:5	0.1+0.5 · 1.2+6	1.14	0.73	0.64
(I-01) + 2.017 5:1	1+0.2 · 12+2.4	2.75	2.48	0.90
(I-01) + 2.038 1:5	0.1+0.5 · 1.2+6	1.56	1.98	1.27
(I-01) + 2.038 5:1	1+0.2 · 12+2.4	7.28	4.35	0.60
(I-01) + 3.020 1:5	0.01+0.05 · 0.12+0.6	0.36	0.29	0.78
(I-01) + 3.020 5:1	1+0.2 · 12+2.4	1.29	1.21	0.94
(I-01) + 3.025 1:5	0.1+0.5 · 1.2+6	3.80	2.12	0.56
(I-01) + 3.025 5:1	1+0.2 · 12+2.4	38.60	4.48	0.12
(I-01) + 4.005 1:5	1+5 · 12+60	55.32	32.27	0.58
(I-01) + 4.005 5:1	1+0.2 · 12+2.4	7.60	7.41	0.97
(I-01) + 5.018 1:5	0.3+1.5 · 30+150	19.22	16.69	0.87
(I-01) + 5.018 5:1	1+0.2 · 12+2.4	7.72	7.11	0.92
(I-01) + 12.003 1:5	1+5 · 12+60	42.08	32.27	0.77
(I-01) + 12.003 5:1	1+0.2 · 12+2.4	10.17	7.41	0.73
(I-01) + 12.004 1:5	1+5 · 12+60	38.32	32.27	0.84
(I-01) + 12.004 5:1	0.1+0.02 · 10+2	7.55	7.41	0.98
(I-01) + 13.001 1:5	0.01+0.05 · 1+5	0.77	1.04	1.34
(I-01) + 13.001 5:1	1+0.2 · 12+2.4	3.52	6.21	0.89
(I-01) + 13.004 1:5	0.1+0.5 · 10+50	9.47	9.00	0.95
(I-01) + 13.004 5:1	1+0.2 · 12+2.4	7.34	6.62	0.90
(I-01) + 15.008 1:5	1+5 · 12+60	8.00	2.83	0.35
(I-01) + 15.008 5:1	1+0.2 · 12+2.4	7.12	6.02	0.85
(I-01) + 15.047 1:5	1+5 · 12+60	6.17	7.50	1.21
(I-01) + 15.047 5:1	1+0.2 · 12+2.4	7.72	6.43	0.83
(I-59) + 1.012 1:5	0.1+0.5 · 10+50	10.40	6.47	0.62
(I-59) + 1.012 5:1	1+0.2 · 12+2.4	7.41	6.09	0.82
(I-59) + 1.018 1:5	0.1+0.5 · 1.2+6	3.46	3.43	0.99
(I-59) + 1.018 5:1	1+0.2 · 12+2.4	6.93	5.22	0.75

10

20

30

40

【表 103C】

活性化化合物	試験した濃度範囲 (ppm a.i.)	生態毒性 LC <sub>50</sub> ~96時間 (ppm a.i.)		MD R
		実測値*	計算値**	
(I-59) + 1.020 1:5	1+5 - 12+60	14.69	11.90	0.81
(I-59) + 1.020 5:1	1+0.2 - 12+2.4	7.49	6.66	0.89
(I-59) + 1.021 1:5	1+5 - 12+60	17.88	14.27	0.80
(I-59) + 1.021 5:1	1+0.2 - 12+2.4	7.12	6.79	0.95
(I-59) + 2.002 1:5	0.01+0.05 - 0.12+0.6	0.18	0.18	1.00
(I-59) + 2.002 5:1	0.1+0.02 - 10+2	1.30	0.82	0.63
(I-59) + 2.005 1:5	1+5 - 12+60	22.69	31.30	1.38
(I-59) + 2.005 5:1	1+0.2 - 12+2.4	7.34	7.16	0.97
(I-59) + 2.017 1:5	0.1+0.5 - 1.2+6	0.85	0.73	0.86
(I-59) + 2.017 5:1	1+0.2 - 12+2.4	1.90	2.45	1.29
(I-59) + 2.038 1:5	0.05+0.25 - 1.2+6	1.76	1.97	1.12
(I-59) + 2.038 5:1	1+0.2 - 12+2.4	6.46	4.26	0.66
(I-59) + 3.020 1:5	0.005+0.025 - 0.12+0.6	0.35	0.29	0.83
(I-59) + 3.020 5:1	0.1+0.02 - 10+2	2.36	1.20	0.51
(I-59) + 3.025 1:5	0.1+0.5 - 1.2+6	2.98	2.11	0.71
(I-59) + 3.025 5:1	1+0.2 - 12+2.4	7.28	4.39	0.60
(I-59) + 4.005 1:5	1+5 - 12+60	33.59	31.30	0.93
(I-59) + 4.005 5:1	1+0.2 - 12+2.4	6.25	7.16	1.15
(I-59) + 5.018 1:5	0.05+0.25 - 25+125	19.23	16.43	0.85
(I-59) + 5.018 5:1	1+0.2 - 12+2.4	7.03	6.87	0.98
(I-59) + 12.003 1:5	1+5 - 12+60	37.07	31.30	0.84
(I-59) + 12.003 5:1	1+0.2 - 12+2.4	7.96	7.16	0.90
(I-59) + 12.004 1:5	1+5 - 12+60	37.06	31.30	0.84
(I-59) + 12.004 5:1	1+0.2 - 12+2.4	7.28	7.16	0.98
(I-59) + 13.001 1:5	0.1+0.5 - 1.2+6	0.64	1.03	1.61
(I-59) + 13.001 5:1	0.1+0.2 - 12+2.4	3.59	3.06	0.85
(I-59) + 13.004 1:5	0.1+0.5 - 10+50	9.55	8.93	0.94
(I-59) + 13.004 5:1	1+0.2 - 12+2.4	6.84	6.42	0.94
(I-59) + 15.008 1:5	1+5 - 12+60	9.22	2.79	0.30
(I-59) + 15.008 5:1	1+0.2 - 12+2.4	7.28	5.85	0.80
(I-59) + 15.047 1:5	1+5 - 12+60	6.24	7.44	1.19
(I-59) + 15.047 5:1	1+0.2 - 12+2.4	7.12	6.24	0.88

\*実測値=実験的に測定された値

\*\*計算値=予測値

10

20

30

40

## 【 国際調査報告 】

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No  
PCT/EP2018/051932

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER INV. A01N43/653 A01P3/00 A01P21/00 ADD.		
According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC		
B. FIELDS SEARCHED		
Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) A01N		
Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched		
Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used) EPO-Internal, CHEM ABS Data, WPI Data		
C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO 2013/007767 A1 (BASF SE [DE]; DIETZ JOCHEN [DE]; RIGGS RICHARD [DE]; BOUDET NADEGE [DE] 17 January 2013 (2013-01-17) cited in the application page 134 - page 135; claims 11-15 page 90, line 38 - page 111, line 28 page 118; examples I-1, I-2; table I pages 99-111; table B -----	1-8, 10-15
A	WO 2010/146114 A1 (BASF SE [DE]; ULMSCHNEIDER SARAH [DE]; DIETZ JOCHEN [DE]; RENNER JENS) 23 December 2010 (2010-12-23) cited in the application page 208, line 209; claim 16 page 214; claims 26-29 page 195, line 26 - line 29 page 163, line 29 - page 185, line 23 ----- -/--	1-15
<input checked="" type="checkbox"/>	Further documents are listed in the continuation of Box C.	<input checked="" type="checkbox"/> See patent family annex.
* Special categories of cited documents :		
"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance		"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
"E" earlier application or patent but published on or after the international filing date		"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)		"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art
"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means		"&" document member of the same patent family
"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed		
Date of the actual completion of the international search 13 March 2018		Date of mailing of the international search report 22/03/2018
Name and mailing address of the ISA/ European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Fax: (+31-70) 340-3016		Authorized officer Galley, Carl

1

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No PCT/EP2018/051932
---

C(Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	WO 2010/146116 A1 (BASF SE [DE]; ULMSCHNEIDER SARAH [DE]; DIETZ JOCHEN [DE]; RENNER JENS) 23 December 2010 (2010-12-23) cited in the application page 176 - page 177; claims 15-19 page 38, line 24 - page 39, line 5 page 141, line 1 - page 163, line 3 -----	1-15
X,P	WO 2017/029179 A1 (BAYER CROPSCIENCE AG [DE]) 23 February 2017 (2017-02-23) page 133; claim 10 -----	1-7, 10-14

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No

PCT/EP2018/051932

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date		
WO 2013007767 A1	17-01-2013	AR 087194 A1	26-02-2014		
		AU 2012282501 A1	30-01-2014		
		BR 112014000625 A2	13-09-2016		
		CA 2840286 A1	17-01-2013		
		CL 2014000067 A1	11-07-2014		
		CN 103649057 A	19-03-2014		
		CN 105152899 A	16-12-2015		
		CO 6890103 A2	10-03-2014		
		CR 20130673 A	05-03-2014		
		DK 2731935 T3	06-06-2016		
		EA 201400125 A1	30-06-2014		
		EP 2731935 A1	21-05-2014		
		ES 2570187 T3	17-05-2016		
		HU E027461 T2	28-09-2016		
		JP 5789340 B2	07-10-2015		
		JP 2014520832 A	25-08-2014		
		KR 20140022483 A	24-02-2014		
		MA 35344 B1	01-08-2014		
		MY 163323 A	15-09-2017		
		NZ 619937 A	24-12-2015		
		PE 08262014 A1	09-07-2014		
		PL 2731935 T3	30-09-2016		
		US 2014155262 A1	05-06-2014		
		US 2017081296 A1	23-03-2017		
		UY 34203 A	28-02-2013		
		WO 2013007767 A1	17-01-2013		
		-----			
		WO 2010146114 A1	23-12-2010	AR 077151 A1	03-08-2011
				AU 2010261822 A1	19-01-2012
				BR P11009642 A2	18-08-2015
				CA 2762512 A1	23-12-2010
				CN 102459241 A	16-05-2012
CR 20110614 A	08-12-2011				
EA 201200018 A1	30-07-2012				
EC SP11011489 A	30-12-2011				
EP 2443109 A1	25-04-2012				
JP 2012530112 A	29-11-2012				
KR 20120062679 A	14-06-2012				
MA 33361 B1	01-06-2012				
PE 03502012 A1	18-04-2012				
TW 201103920 A	01-02-2011				
US 2012088663 A1	12-04-2012				
UY 32723 A	31-12-2010				
WO 2010146114 A1	23-12-2010				
ZA 201200304 B	26-03-2014				
-----					
WO 2010146116 A1	23-12-2010	AR 077153 A1	03-08-2011		
		TW 201103430 A	01-02-2011		
		UY 32725 A	31-12-2010		
		WO 2010146116 A1	23-12-2010		
-----					
WO 2017029179 A1	23-02-2017	AU 2016310123 A1	01-03-2018		
		TW 201718500 A	01-06-2017		
		UY 36852 A	31-03-2017		
		WO 2017029179 A1	23-02-2017		
-----					

## フロントページの続き

(51)Int.Cl.	F I	テーマコード(参考)
A 0 1 N 43/36 (2006.01)	A 0 1 N 43/36	A
A 0 1 N 43/40 (2006.01)	A 0 1 N 43/40	1 0 1 A
A 0 1 N 43/56 (2006.01)	A 0 1 N 43/56	C
A 0 1 N 37/50 (2006.01)	A 0 1 N 37/50	
A 0 1 N 43/24 (2006.01)	A 0 1 N 43/24	
A 0 1 N 37/34 (2006.01)	A 0 1 N 37/34	1 0 4
A 0 1 N 47/14 (2006.01)	A 0 1 N 47/14	C
A 0 1 N 59/16 (2006.01)	A 0 1 N 59/16	Z
A 0 1 N 37/46 (2006.01)	A 0 1 N 43/653	Q
A 0 1 N 43/42 (2006.01)	A 0 1 N 37/46	
A 0 1 N 43/54 (2006.01)	A 0 1 N 43/42	1 0 2
A 0 1 N 37/52 (2006.01)	A 0 1 N 43/54	G
A 0 1 C 1/06 (2006.01)	A 0 1 N 37/52	
	A 0 1 C 1/06	Z

(81)指定国・地域 AP(BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SD, SL, ST, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), EA(AM, AZ, BY, KG, KZ, RU, TJ, TM), EP(AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, RS, SE, SI, SK, SM, TR), OA(BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, KM, ML, MR, NE, SN, TD, TG), AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BN, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DJ, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IR, IS, JO, JP, KE, KG, KH, KN, KP, KR, KW, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PA, PE, PG, PH, PL, PT, QA, RO, RS, RU, RW, SA, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT

(74)代理人 100110364

弁理士 実広 信哉

(74)代理人 100133400

弁理士 阿部 達彦

(72)発明者 アンドレアス・ゲルツ

ドイツ・4 1 5 4 1・ドルマーゲン・テオドル・フォンターネ・シュトラッセ・6 3

(72)発明者 ルート・マイスナー

ドイツ・5 1 3 7 5・レーバークーゼン・クールマンヴェーク・3 5

(72)発明者 ペーター・ダーメン

ドイツ・4 1 4 7 0・ノイス・アルテブリュッカー・シュトラッセ・6 1

(72)発明者 ヴィルジニー・パスカレ・デュクロ

ドイツ・5 1 3 9 9・ブルシャイト・アードルフ・コルピング・シュトラッセ・5 6アー

(72)発明者 ピエール・イヴ・コクロン

フランス・6 9 0 0 9・リヨン・リュ・マサリク・2 2

(72)発明者 リカルダ・ミラー

ドイツ・4 0 2 2 7・デュッセルドルフ・ヴェルデナー・シュトラッセ・9 4

Fターム(参考) 2B051 AB01 BA15

4H011 AA01 BA06 BB06 BB08 BB09 BB11 BB13 BB14 BB18 DA13

DA16 DD03 DE15