

(12) 特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局

(43) 国際公開日
2014 年 12 月 4 日(04.12.2014)



(10) 国際公開番号
WO 2014/192936 A1

- (51) 国際特許分類:
C07D 471/04 (2006.01) A01P 13/02 (2006.01)
A01N 43/90 (2006.01)
- (21) 国際出願番号: PCT/JP2014/064492
- (22) 国際出願日: 2014 年 5 月 30 日(30.05.2014)
- (25) 国際出願の言語: 日本語
- (26) 国際公開の言語: 日本語
- (30) 優先権データ:
特願 2013-115196 2013 年 5 月 31 日(31.05.2013) JP
特願 2013-217697 2013 年 10 月 18 日(18.10.2013) JP
特願 2014-013999 2014 年 1 月 29 日(29.01.2014) JP
特願 2014-072736 2014 年 3 月 31 日(31.03.2014) JP
- (71) 出願人: 日産化学工業株式会社(NISSAN CHEMICAL INDUSTRIES, LTD.) [JP/JP]; 〒1010054 東京都千代田区神田錦町三丁目 7 番地 1 Tokyo (JP).
- (72) 発明者: 中屋 潔彦(NAKAYA, Yoshihiko); 〒2748507 千葉県船橋市坪井西二丁目 1 〇 番 1 号 日産化学工業株式会社物質科学研究所内 Chiba (JP). 谷間 大輔(TANIMA, Daisuke); 〒2748507 千葉県船橋市坪井西二丁目 1 〇 番 1 号 日産化学工業株式会社物質科学研究所内 Chiba (JP). 稲葉正光(INABA, Masamitsu); 〒2748507 千葉県船橋市坪井西二丁目 1 〇 番 1 号 日産化学工業株式会社物質科学研究所内 Chiba (JP). 宮角 裕喜

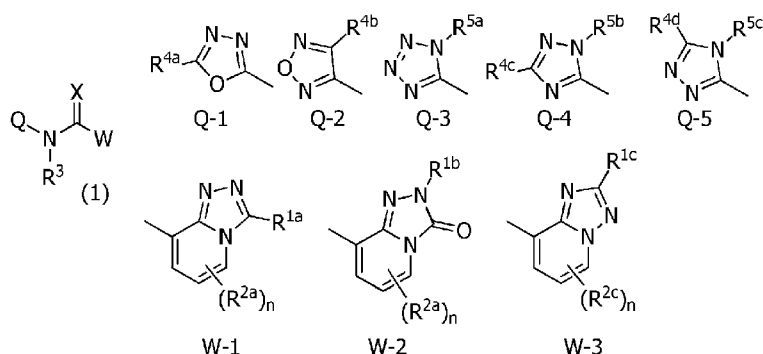
(MIYAKADO, Yuuki); 〒3490294 埼玉県白岡市白岡 1 4 7 〇 日産化学工業株式会社 生物科学研究所内 Saitama (JP). 古橋 孝将(FURUHASHI, Takamasa); 〒3490294 埼玉県白岡市白岡 1 4 7 〇 日産化学工業株式会社 生物科学研究所内 Saitama (JP). 前田 兼成(MAEDA, Kazushige); 〒2748507 千葉県船橋市坪井西二丁目 1 〇 番 1 号 日産化学工業株式会社物質科学研究所内 Chiba (JP).

- (74) 代理人: 萼 経夫, 外(HANABUSA, Tsuneo et al.); 〒1010062 東京都千代田区神田駿河台 3 丁目 2 番地 新御茶ノ水アーバントリニティ 萼特許事務所内 Tokyo (JP).
- (81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BN, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IR, IS, JP, KE, KG, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PA, PE, PG, PH, PL, PT, QA, RO, RS, RU, RW, SA, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.
- (84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW,

[続葉有]

(54) Title: HETEROCYCLIC AMIDE COMPOUND

(54) 発明の名称: 複素環アミド化合物



(57) Abstract: Provided are heterocyclic amide compounds represented by formula (1), and an agricultural chemical, specifically a herbicide, which contains said compounds (in formula (1), Q represents an aromatic heterocycle indicated by any of Q1 to Q5, W represents an aromatic heterocycle indicated by W-1, W-2, or W-3, X represents an oxygen atom, or the like, R^{1a} represents a hydrogen atom, a halogen atom, or a C₁-C₆ alkyl, or the like, R^{1b} represents a hydrogen atom, or the like, R^{1c} represents a C₁-C₆ alkyl, R^{2a} represents a halogen atom, or a C₁-C₆ alkyl, or the like, R^{2c} represents a C₁-C₆ haloalkyl, R³ represents a hydrogen atom, or the like, R^{4a} represents a hydrogen atom, or a C₁-C₆ alkyl, or the like, R^{4b} represents a hydrogen atom, or a C₁-C₆ alkyl, or the like, R^{4c} represents a hydrogen atom, or a C₁-C₆ alkyl, or the like, R^{4d} represents a hydrogen atom, or a C₁-C₆ alkyl, or the like, R^{5a} and R^{5b} each independently represent a hydrogen atom, or a C₁-C₆ alkyl, or the like, R^{5c} represents a hydrogen atom, or a C₁-C₆ alkyl, or the like, and n represents the integer 0, 1, 2, or 3).

(57) 要約:

[続葉有]



WO 2014/192936 A1



MZ, NA, RW, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラ
シア (AM, AZ, BY, KG, KZ, RU, TJ, TM), ヨーロッ
パ (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),

OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, KM,
ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:

— 国際調査報告 (条約第 21 条(3))

本発明は、式 (1) : [式中、QはQ-1からQ-5の何れかで示される芳香族複素環、WはW-1、W-2又はW-3で示される芳香族複素環、Xは酸素原子等、R^{1a}は水素原子、ハロゲン原子又はC₁~C₆アルキル等、R^{1b}は水素原子等、R^{1c}はC₁~C₆アルキル、R^{2a}はハロゲン原子又はC₁~C₆アルキル等、R^{2c}はC₁~C₆ハロアルキル、R³は水素原子等、R^{4a}は水素原子又はC₁~C₆アルキル等、R^{4b}は水素原子又はC₁~C₆アルキル等、R^{4c}は水素原子又はC₁~C₆アルキル等、R^{4d}は水素原子又はC₁~C₆アルキル等、R^{5a}及びR^{5b}は各々独立して水素原子又はC₁~C₆アルキル等、R^{5c}は水素原子又はC₁~C₆アルキル等、並びに、nは0、1、2又は3の整数を表す。]で表される複素環アミド化合物及びそれらを含む農薬、特に除草剤を提供する。

明 細 書

発明の名称：複素環アミド化合物

技術分野

[0001] 本発明は、新規な複素環アミド化合物及びその塩、並びに該複素環アミド化合物及びその塩を有効成分として含有する農薬、特に除草剤に関するものである。また、本発明における農薬とは、農園芸分野における殺虫・殺ダニ剤、殺線虫剤、除草剤及び殺菌剤等を意味する。

背景技術

[0002] 例えば、特許文献1乃至6には、ある種の複素環アミド化合物が開示されているが、本発明に係る複素環アミド化合物に関しては何ら開示されていない。

先行技術文献

特許文献

[0003] 特許文献1：国際公開第2012/028579号
特許文献2：国際公開第2012/123409号
特許文献3：国際公開第2012/123416号
特許文献4：国際公開第2012/126932号
特許文献5：国際公開第2013/017559号
特許文献6：国際公開第2013/064457号

発明の概要

発明が解決しようとする課題

[0004] 本発明の目的は、より低薬量で各種雑草に対して効果を確実に示し、且つ、土壌汚染や後作物への影響等の問題が軽減された、安全性の高く、除草剤の有効成分として有用な化学物質を提供することである。

課題を解決するための手段

[0005] 本発明者らは、上記の課題解決を目標に鋭意研究を重ねた結果、本発明に係る下記式(1)で表される新規な複素環アミド化合物が除草剤として優れ

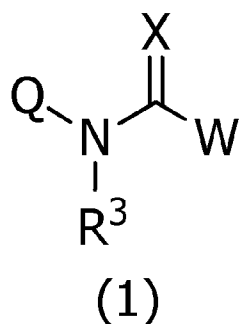
た除草活性並びに対象となる作物に対する高い安全性を有し、且つ、ホ乳動物、魚類及び益虫等の非標的生物に対してほとんど悪影響の無い、極めて有用な化合物であることを見出し、本発明を完成した。

[0006] すなわち、本発明は下記〔１〕～〔１１５〕に関するものである。

〔１〕

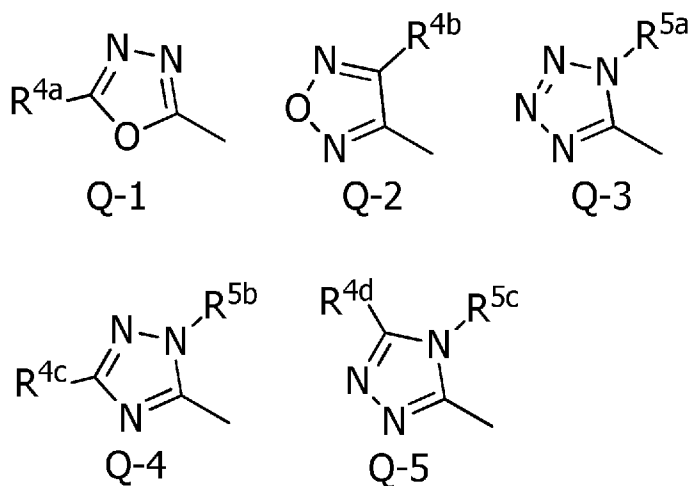
式（１）：

[化1]



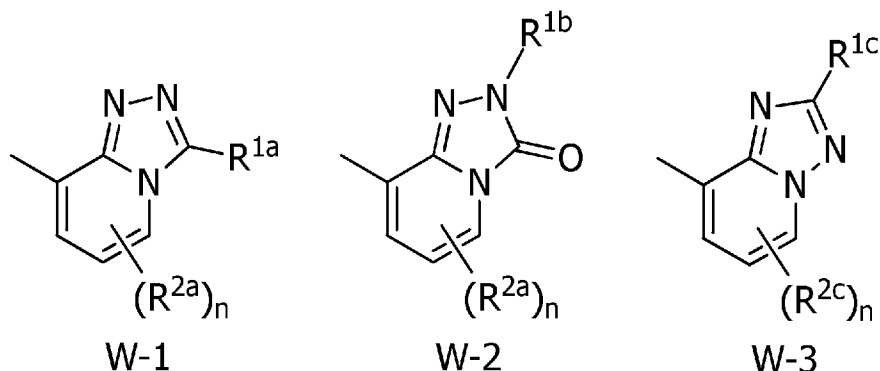
[式中、Qは、Q－１からQ－５の何れかで示される芳香族複素環を表し、

[化2]



Wは、W－１、W－２又はW－３で示される芳香族複素環を表し、

[化3]



Xは、酸素原子又は硫黄原子を表し、

R^{1a} は、水素原子、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^6 によって任意に置換された($C_1 \sim C_6$)アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 R^6 によって任意に置換された($C_3 \sim C_6$)シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルケニル、 $-C(O)R^8$ 、 $-C(O)OR^{16}$ 、シアノ、 $-OR^9$ 、 $-S(O)_{m1}R^{10}$ 、 $-N(R^{11})R^{12}$ 、 $-C(=NR^{12b})R^{8b}$ 、フェニル、 $(R^7)_p$ によって置換されたフェニル、ナフチル又はU-1からU-25の何れかの基を表し、

R^{1b} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^6 によって任意に置換された($C_1 \sim C_6$)アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 R^6 によって任意に置換された($C_3 \sim C_6$)シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、フェニル、 $(R^7)_p$ によって置換されたフェニル、ナフチル、5-6員ヘテロアリール、(R^{28} 及び R^{28a} によって任意に置換された)5-6員ヘテロアリール、3-7員ヘテロシクリル又は(R^{28} 及び R^{28a} によって任意に置換された)3-7員ヘテロシクリルを表し、

R^{1c} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^{2a} は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $-C(O)R^{18}$ 、 $-C(O)OR^{24}$ 、シアノ、ニトロ、 $-OR^{19}$ 、 $-S(O)_{m3}R^{20}$ 、 $-N(R^{21})R^{22}$ 、フェニル又は $(R^7)_p$ によって置換されたフェニルを表し、nが2以上の整数を表すとき、各々の R^{2a} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、更に、2つの R^{2a} が隣接する場合には、隣

接する2つの R^{2a} は、 $-CH=CH-CH=CH-$ を形成することにより、それぞれの R^{2a} が結合する炭素原子と共に6員環を形成してもよく、

R^{2c} は、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルを表し、

R^3 は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{27} によって任意に置換された($C_1 \sim C_6$)アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $-C(O)R^{25}$ 又は $-C(O)OR^{26}$ を表し、

R^{4a} は、水素原子、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{27} によって任意に置換された($C_1 \sim C_6$)アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 R^{27} によって任意に置換された($C_3 \sim C_6$)シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルケニル、 $-NH_2$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノ、ジ($C_1 \sim C_6$ アルキル)アミノ、 $-NHC(O)R^8$ 、フェニル、 $(R^{28})_r$ によって置換されたフェニル、5-6員ヘテロアリール、(R^{28} 及び R^{28a} によって任意に置換された)5-6員ヘテロアリール、3-7員ヘテロシクリル又は(R^{28} 及び R^{28a} によって任意に置換された)3-7員ヘテロシクリルを表し、

R^{4b} は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{27} によって任意に置換された($C_1 \sim C_6$)アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 R^{27} によって任意に置換された($C_3 \sim C_6$)シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルケニル、 $-C(O)OR^{16}$ 、 $-OR^{38}$ 、 $-S(O)_{m3}R^{20}$ 、 $-NH_2$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノ、ジ($C_1 \sim C_6$ アルキル)アミノ、 $-NHC(O)R^8$ 、フェニル、 $(R^{28})_r$ によって置換されたフェニル、5-6員ヘテロアリール、(R^{28} 及び R^{28a} によって任意に置換された)5-6員ヘテロアリール、3-7員ヘテロシクリル又は(R^{28} 及び R^{28a} によって任意に置換された)3-7員ヘテロシクリルを表し、

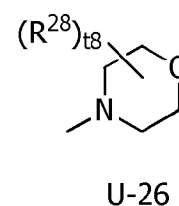
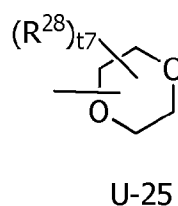
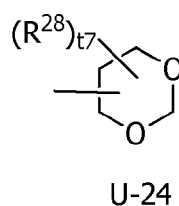
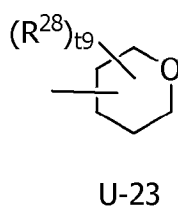
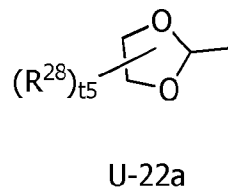
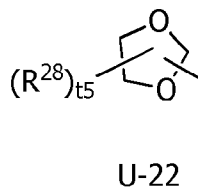
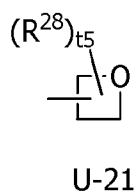
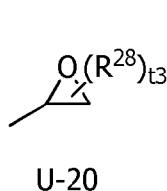
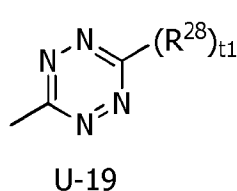
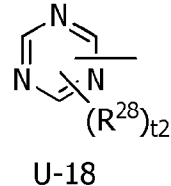
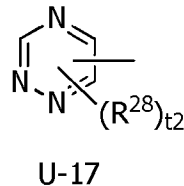
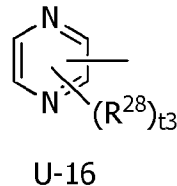
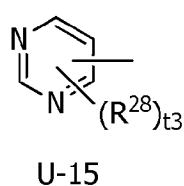
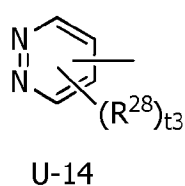
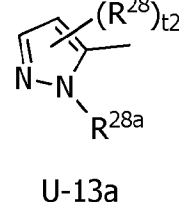
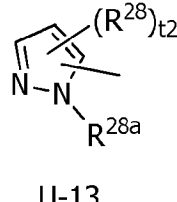
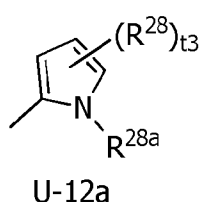
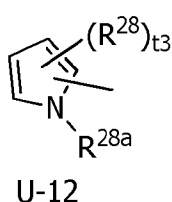
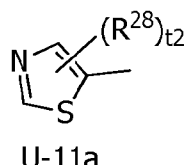
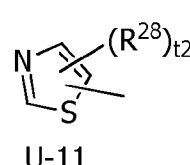
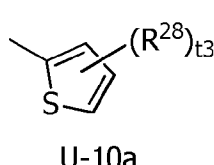
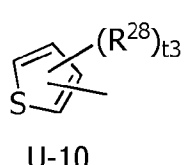
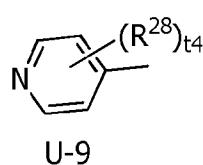
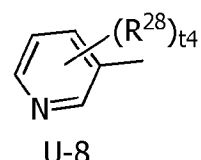
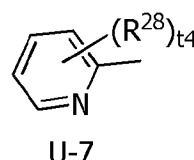
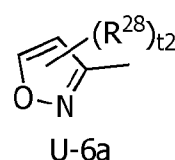
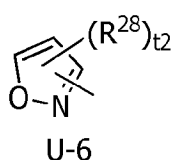
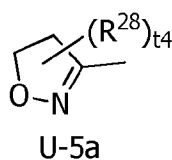
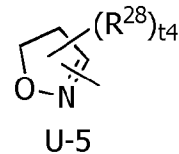
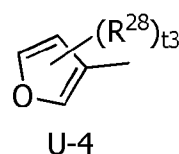
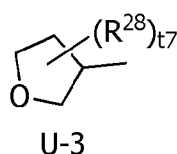
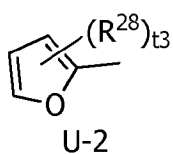
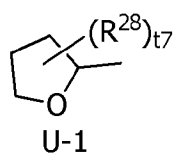
R^{4c} は、水素原子、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{27} によって任意に置換された($C_1 \sim C_6$)アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 R^{27} によっ

て任意に置換された ($C_3 \sim C_6$) シクロアルキル、フェニル、(R^{28})_rによって置換されたフェニル、5-6員ヘテロアリール、(R^{28} 及び R^{28a} によって任意に置換された) 5-6員ヘテロアリール、3-7員ヘテロシクリル又は(R^{28} 及び R^{28a} によって任意に置換された) 3-7員ヘテロシクリルを表し、

R^{4d} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は R^{35} によって任意に置換された($C_1 \sim C_6$) アルキルを表し、

U-1乃至U-6、U-6a、U-7乃至U-10、U-10a、U-11、U-11a、U-12、U-12a、U-13、U-13a、U-14乃至U-22、U-22a、U-23、U-24、U-25、U-26は、それぞれ以下の構造で表される複素環を表し、

[化4]



R^{5a} 及び R^{5b} は、各々独立して水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{27} によって任意に置換された($C_1 \sim C_6$)アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルケニル、フェニル又は(R^{28})_rによって置換されたフェニルを表し、

R^{5c} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は R^{36} によって任意に置換された($C_1 \sim C_6$)アルキルを表すか、或いは R^{5c} は、 R^{4d} と $-(CH_2)_4-$ 又は $-CH=CH-CH=CH-$ を形成することにより、 R^{5c} が結合する窒素原子及び R^{4d} が結合する炭素原子と共に6員環を形成してもよく、

R^6 は、ハロゲン原子、シアノ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $-C(O)R^8$ 、 $-C(O)OR^{16}$ 、 $-OR^{13}$ 、 $-S(O)_{m2}R^{14}$ 、フェニル又は(R^7)_pによって置換されたフェニルを表し、

R^7 は、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{27} によって任意に置換された($C_1 \sim C_6$)アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルケニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルカルボニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルアミノカルボニル、ジ($C_1 \sim C_6$ アルキルアミノ)カルボニル、 $-OR^{15}$ 、 $-S(O)_{m3}R^{20}$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノスルホニル、ジ($C_1 \sim C_6$ アルキル)アミノスルホニル、 $-NH_2$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノ、ジ($C_1 \sim C_6$ アルキル)アミノ、5-6員ヘテロアリール、(R^{28} 及び R^{28a} によって任意に置換された)5-6員ヘテロアリール、3-7員ヘテロシクリル又は(R^{28} 及び R^{28a} によって任意に置換された)3-7員ヘテロシクリルを表し、

R^8 は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $-N(R^{11a})R^{12a}$ を表し、

R^{8b} は、水素原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^9 は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又はフェニルを表し、

R^{10} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{34} によって任意に置換された ($C_1 \sim C_6$) アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル又は $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニルを表し、

R^{11} 及び R^{12} は、各々独立して水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{34} によって任意に置換された ($C_1 \sim C_6$) アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、フェニルスルホニル、フェニル、 $(R^7)_p$ によって置換されたフェニル、U-7、U-8、U-9又はU-14乃至U-19を表すか、或いは、 R^{11} は R^{12} と一緒になって $C_2 \sim C_6$ アルキレン鎖を形成することにより、 R^{11} 及び R^{12} が結合する窒素原子と共に3～7員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖はO、S、S(O)、S(O)₂又はN(R^{33})を1個含んでもよく、且つオキソ基又はチオキソ基によって置換されていてもよく、

R^{11a} 及び R^{12a} は、各々独立して水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又はフェニルを表すか、或いは、 R^{11a} は R^{12a} と一緒になって $C_2 \sim C_6$ アルキレン鎖を形成することにより、 R^{11a} 及び R^{12a} が結合する窒素原子と共に3～7員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖はO、S、S(O)、S(O)₂又はN(R^{33})を1個含んでもよく、且つオキソ基又はチオキソ基によって置換されていてもよく、

R^{12b} は、 $-OR^{19b}$ を表し、

R^{13} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{34} によって任意に置換された ($C_1 \sim C_6$) アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $-C(O)R^8$ 又はフェニルを表し、

R^{14} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{34} によって任意に置換された ($C_1 \sim C_6$) アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 C_2

～C₆アルキニル、C₂～C₆ハロアルキニル又はフェニルを表し、

R¹⁵は、水素原子、C₁～C₆アルキル、R²⁷によって任意に置換された（C₁～C₆）アルキル、C₃～C₆シクロアルキル、C₃～C₆ハロシクロアルキル、C₂～C₆アルケニル、C₂～C₆ハロアルケニル、C₂～C₆アルキニル、C₂～C₆ハロアルキニル又はC₃～C₆シクロアルケニルを表し、

R¹⁶は、水素原子、C₁～C₆アルキル又はR³⁷によって任意に置換された（C₁～C₆）アルキルを表し、

R¹⁸は、水素原子又はC₁～C₆アルキルを表し、

R¹⁹は、水素原子、C₁～C₆アルキル又はフェニルを表し、

R^{19b}は、水素原子又はC₁～C₆アルキルを表し、

R²⁰は、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆ハロアルキル、C₃～C₆シクロアルキル、C₂～C₆アルケニル、C₂～C₆ハロアルケニル、C₂～C₆アルキニル、C₂～C₆ハロアルキニル又はC₃～C₆シクロアルケニルを表し、

R²¹及びR²²は、各々独立して水素原子、C₁～C₆アルキル又はフェニルを表すか、或いは、R²¹はR²²と一緒になってC₂～C₆アルキレン鎖を形成することにより、R²¹及びR²²が結合する窒素原子と共に3～7員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖はO、S、S(O)、S(O)₂又はN(R³⁹)を1個含んでもよく、且つオキソ基又はチオキソ基によって置換されていてもよく、

R²⁴は、水素原子又はC₁～C₆アルキルを表し、

R²⁵及びR²⁶は、各々独立しては、水素原子、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆ハロアルキル、C₃～C₆シクロアルキル、C₃～C₆ハロシクロアルキル、C₂～C₆アルケニル、C₂～C₆ハロアルケニル、C₂～C₆アルキニル、C₂～C₆ハロアルキニル、C₃～C₆シクロアルケニル又はフェニルを表し、

R²⁷は、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、フェニル、(R²⁸)_rによって置換されたフェニル、-C(O)OR¹⁶、-OR²⁹、-S(O)_{m4}R³⁰、5-6員ヘテロアリール、(R²⁸及びR^{28a}によって任意に置換された)5-6員ヘテロアリール、3-7員ヘテロシクリル又は(R²⁸及びR^{28a}によって任意

に置換された) 3-7員ヘテロシクリルを表し、

R^{28} は、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $(C_1 \sim C_6 \text{アルコキシ}) C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-OR^{31}$ 又は $-S(O)_{m4}R^{30}$ を表し、 t_2 、 t_3 、 t_4 、 t_5 、 t_7 、 t_8 又は t_9 が2以上の整数を表すとき、各々の R^{28} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、更に2つの R^{28} が隣接する場合には、隣接する2つの R^{28} は一緒になって $-CH=CH-CH=CH-$ を形成することにより、それぞれの R^{28} が結合する炭素原子と共に6員環を形成してもよく、

R^{28a} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $(C_1 \sim C_6 \text{アルコキシ}) C_1 \sim C_6$ アルキル又は $(C_1 \sim C_6 \text{アルキルチオ}) C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^{29} 、 R^{30} 及び R^{31} は、各々独立して、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルケニル又はフェニルを表し、

R^{33} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し

R^{34} は、ハロゲン原子、シアノ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $-C(O)R^8$ 、 $-C(O)OR^{16}$ 、 $-OR^{33}$ 、 $-S(O)_{m6}R^{33}$ 、フェニル、 $(R^7)_p$ によって置換されたフェニル、 $U-1$ 、 $U-3$ 、 $U-7$ 、 $U-8$ 、 $U-9$ 又は $U-14$ 乃至 $U-25$ を表し、

R^{35} は、ハロゲン原子又は $C_1 \sim C_6$ アルコキシを表し、

R^{36} は、ハロゲン原子又は $C_1 \sim C_6$ アルコキシを表し、

R^{37} は、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシを表し、

R^{38} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{34} によって任意に置換された $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ ハ

ロアルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルケニル又はフェニルを表し、

R^{39} は、水素原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

t_1 は、0又は1の整数を表し

m_1 、 m_2 、 m_3 、 m_4 、 m_6 及び t_2 は、各々独立して0、1又は2の整数を表し、

n 及び t_3 は、各々独立して0、1、2又は3の整数を表し、

p 及び r は、各々独立して1、2、3、4又は5の整数を表し、

t_4 は、0、1、2、3又は4の整数を表し、

t_5 は、0、1、2、3、4又は5の整数を表し、

t_7 は、0、1、2、3、4、5、6又は7の整数を表し、

t_8 は、0、1、2、3、4、5、6、7又は8の整数を表し、

t_9 は、0、1、2、3、4、5、6、7、8又は9の整数を表す。]で

表される複素環アミド化合物又はその塩。

[0007] [2]

W は、 $W-1$ 又は $W-2$ で示される芳香族複素環を表し、

R^{2a} は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $-C(O)R^{18}$ 、 $-C(O)OR^{24}$ 、シアノ、ニトロ、 $-OR^{19}$ 又は $-S(O)_{m3}R^{20}$ を表し、 n が2以上の整数を表すとき、各々の R^{2a} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよい上記[1]記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0008] [3]

R^{1b} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^6 によって任意に置換された($C_1 \sim C_6$)アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 R^6 によって任意に置換された($C_3 \sim C_6$)シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、フェニル、(R^7) $_p$ によって置換されたフェニル、ナフチル又は $U-1$ から $U-25$ の何れかの基を表し、

R^{4a} は、水素原子、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{27} によって任意に置換された($C_1 \sim C_6$)アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 R^{27} によって任意に置換された($C_3 \sim C_6$)シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 C_2

～C₆ハロアルケニル、C₂～C₆アルキニル、C₂～C₆ハロアルキニル、C₃～C₆シクロアルケニル、-NH₂、C₁～C₆アルキルアミノ、ジ(C₁～C₆アルキル)アミノ、-NHC(O)R⁸、フェニル、(R²⁸)_rによって置換されたフェニル又はU-1からU-26の何れかの基を表し、

R⁷は、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、C₁～C₆アルキル、R²⁷によって任意に置換された(C₁～C₆)アルキル、C₃～C₆シクロアルキル、C₃～C₆ハロシクロアルキル、C₂～C₆アルケニル、C₂～C₆ハロアルケニル、C₂～C₆アルキニル、C₂～C₆ハロアルキニル、C₃～C₆シクロアルケニル、C₁～C₆アルキルカルボニル、C₃～C₆シクロアルキルカルボニル、C₁～C₆ハロアルキルカルボニル、C₃～C₆ハロシクロアルキルカルボニル、C₁～C₆アルコキシカルボニル、C₁～C₆ハロアルコキシカルボニル、C₁～C₆アルキルアミノカルボニル、C₁～C₆ハロアルキルアミノカルボニル、ジ(C₁～C₆アルキルアミノ)カルボニル、-OR¹⁵、-S(O)_{m3}R²⁰、C₁～C₆アルキルアミノスルホニル、ジ(C₁～C₆アルキル)アミノスルホニル、-NH₂、C₁～C₆アルキルアミノ、ジ(C₁～C₆アルキル)アミノ又はU-1からU-26の何れかの基を表し、

R²⁷は、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、フェニル、(R²⁸)_rによって置換されたフェニル、-C(O)OR¹⁶、-OR²⁹、-S(O)_{m4}R³⁰又はU-1からU-26の何れかの基を表す上記〔2〕記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0009] [4]

R^{1a}は、水素原子、ハロゲン原子、C₁～C₆アルキル、R⁶によって任意に置換された(C₁～C₆)アルキル、C₃～C₆シクロアルキル、R⁶によって任意に置換された(C₃～C₆)シクロアルキル、C₂～C₆アルケニル、C₂～C₆アルキニル、C₃～C₆シクロアルケニル、-C(O)R⁸、-OR⁹、-S(O)_{m1}R¹⁰、-N(R¹¹)R¹²、-C(=NR^{12b})R^{8b}、フェニル、(R⁷)_pによって置換されたフェニル、U-3、U-5a、U-6a、U-7、U-8、U-10a、U-11a、U-12a、又はU-13aを表し、

R^{1b} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は R^6 によって任意に置換された ($C_1 \sim C_6$) アルキルを表し、

R^{2a} は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $-S(O)_{m3}R^{20}$ 、 n が2以上の整数を表すとき、各々の R^{2a} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^3 は、水素原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^{4a} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{27} によって任意に置換された ($C_1 \sim C_6$) アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、フェニル、 $(R^{28})_r$ によって置換されたフェニル、U-1、U-2、U-7、U-10a又はU-26で示される複素環を表し、

R^{4b} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^{4c} は、水素原子を表し、

R^{4d} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^{5a} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{27} によって任意に置換された ($C_1 \sim C_6$) アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル又はフェニルを表し、

R^{5b} は、水素原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^{5c} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルを表すか、或いは R^{5c} は、 R^{4d} と $-(CH_2)_4-$ 又は $-CH=CH-CH=CH-$ を形成することにより、 R^{5c} が結合する窒素原子及び R^{4d} が結合する炭素原子と共に6員環を形成してもよく、

R^7 は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{27} によって任意に置換された ($C_1 \sim C_6$) アルキル又は $-OR^{15}$ を表し、

R^{8b} は、水素原子を表し、

R^9 は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^{10} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{34} によって任意に置換された ($C_1 \sim C_6$) アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル又は $C_2 \sim C_6$ アルキニルを表し、

R^{11} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{34} によって任意に置換された ($C_1 \sim C_6$) アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキ

ニル、フェニルスルホニル、フェニル、 $(R^7)_p$ によって置換されたフェニル又はU-7を表し、

R^{12} は、水素原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^{11} は R^{12} と一緒にあって $C_4 \sim C_5$ アルキレン鎖を形成することにより、 R^{11} 及び R^{12} が結合する窒素原子と共に5～6員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖はO、S、S(O)又はS(O)₂を1個含んでもよく、

R^{11a} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^{12a} は、水素原子を表し、

R^{13} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{34} によって任意に置換された($C_1 \sim C_6$)アルキル、 $-C(O)R^8$ 又はフェニルを表し、

R^{14} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は R^{34} によって任意に置換された($C_1 \sim C_6$)アルキルを表し、

R^{15} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^{19b} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^{20} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^{27} は、ハロゲン原子、フェニル、 $(R^{28})_r$ によって置換されたフェニル、 $-OR^{29}$ 、 $-C(O)OR^{16}$ 又は $-S(O)_{m4}R^{30}$ を表し、

R^{28} は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $-OR^{31}$ を表し、 t_2 、 t_3 、 t_4 、 t_5 又は t_7 が2以上の整数を表すとき、各々の R^{28} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、更に2つの R^{28} が隣接する場合には、隣接する2つの R^{28} と一緒にあって $-CH=CH-CH=CH-$ を形成することにより、それぞれの R^{28} が結合する炭素原子と共に6員環を形成してもよく、

R^{29} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^{30} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^{31} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^{33} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^{34} は、ハロゲン原子、シアノ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $-C(O)R^8$ 、 $-C(O)OR^{16}$ 、 $-OR^{33}$ 、 $-S(O)_{m6}R^{33}$ 、フェニル、 $(R^7)_p$ によって置換されたフェニル、U-1、U-8又はU-22aを表す上記〔3〕記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0010] [5]

Qは、Q-1で示される芳香族複素環を表し、

Wは、W-1で示される芳香族複素環を表す上記〔4〕記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0011] [6]

Xは、酸素原子を表し、

R^{1a} は、水素原子、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^6 によって任意に置換された($C_1 \sim C_6$)アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 R^6 によって任意に置換された($C_3 \sim C_6$)シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルケニル、 $-C(O)R^8$ 、 $-OR^9$ 、 $-S(O)_{m1}R^{10}$ 、 $-N(R^{11})R^{12}$ 、 $-C(=NR^{12b})R^{8b}$ 、フェニル、 $(R^7)_p$ によって置換されたフェニル、U-5a、U-6a、U-7、U-8、U-10a、U-11a、U-12a、又はU-13aを表し、

R^{2a} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $-S(O)_{m3}R^{20}$ 、nが2以上の整数を表すとき、各々の R^{2a} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^6 は、ハロゲン原子、シアノ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $-C(O)R^8$ 、 $-C(O)OR^{16}$ 、 $-OR^{13}$ 、 $-S(O)_{m2}R^{14}$ 又は $(R^7)_p$ によって置換されたフェニルを表し、

R^{27} は、ハロゲン原子、フェニル、 $-OR^{29}$ 又は $-S(O)_{m4}R^{30}$ を表す上記〔5〕記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0012] [7]

R^{4a} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{27} によって任意に置換された($C_1 \sim C_6$)アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルを表し、

R^{27} は、ハロゲン原子、 $-OR^{29}$ を表す上記〔6〕記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0013] 〔8〕

Qは、Q-3で示される芳香族複素環を表し、

Wは、W-1で示される芳香族複素環を表す上記〔4〕記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0014] 〔9〕

R^{1a} は、水素原子、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^6 によって任意に置換された($C_1 \sim C_6$)アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 R^6 によって任意に置換された($C_3 \sim C_6$)シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $-C(O)R^8$ 、 $-S(O)_{m1}R^{10}$ 、 $-N(R^{11})R^{12}$ 、フェニル、 $(R^7)_p$ によって置換されたフェニル、U-3、U-5a、U-6a、U-8、U-10a、又はU-13aを表し、

R^{2a} は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルを表し、 n が2以上の整数を表すとき、各々の R^{2a} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^6 は、ハロゲン原子、 $-C(O)OR^{16}$ 、 $-OR^{13}$ 、 $-S(O)_{m2}R^{14}$ 又は $(R^7)_p$ によって置換されたフェニルを表し、

R^7 は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $-OR^{15}$ を表し、

R^8 は、水素原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^{11} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{34} によって任意に置換された($C_1 \sim C_6$)アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、フェニル又は $(R^7)_p$ によって置換されたフェニルを表し、

R^{11} は R^{12} と一緒になって C_5 アルキレン鎖を形成することにより、 R^{11} 及び R^{12} が結合する窒素原子と共に6員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖はO、S、 $S(O)$ 又は $S(O)_2$ を1個含んでもよく、

R^{16} は、水素原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^{27} は、 $(R^{28})_r$ によって置換されたフェニル、 $-OR^{29}$ 、 $-C(O)OR^{16}$ 又は $-S(O)_{m4}R^{30}$ を表し、

R^{28} は、ハロゲン原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^{34} は、ハロゲン原子、シアノ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $-OR^{33}$ 、 $-S(O)_{m6}R^{33}$ 、フェニル、 $(R^7)_p$ によって置換されたフェニル、 $U-1$ 又は $U-8$ を表す上記〔8〕記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0015] [10]

R^{5a} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{27} によって任意に置換された $(C_1 \sim C_6)$ アルキル又は $C_2 \sim C_6$ アルケニルを表し、

R^{27} は、 $-OR^{29}$ 又は $-S(O)_{m4}R^{30}$ を表す上記〔9〕記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0016] [11]

Xは、酸素原子を表す上記〔1〕～〔10〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0017] [12]

Xは、硫黄原子を表す上記〔1〕～〔10〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0018] [13]

R^3 は、水素原子を表す上記〔1〕～〔12〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0019] [14]

R^3 は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルを表す上記〔1〕～〔12〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0020] [15]

R^{2a} は、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルを表す上記〔1〕～〔14〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0021] [16]

R^{2a} は、ハロゲン原子を表す上記〔1〕～〔14〕のいずれかに記載の複素

環アミド化合物又はその塩。

[0022] [17]

R^{2a} は、 $-S(O)_m R^{20}$ を表し、

R^{20} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルを表す上記〔1〕～〔14〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0023] [18]

R^{2a} は、トリフルオロメチルを表す上記〔1〕～〔14〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0024] [19]

n は、1、2又は3の整数を表す上記〔1〕～〔18〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0025] [20]

n は、1の整数を表す上記〔1〕～〔18〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0026] [21]

Q は、 $Q-2$ で示される芳香族複素環を表し、

W は、 $W-1$ で示される芳香族複素環を表す上記〔1〕～〔20〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0027] [22]

Q は、 $Q-4$ で示される芳香族複素環を表し、

W は、 $W-1$ で示される芳香族複素環を表す上記〔1〕～〔20〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0028] [23]

Q は、 $Q-5$ で示される芳香族複素環を表し、

W は、 $W-1$ で示される芳香族複素環を表す上記〔1〕～〔20〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0029] [24]

Q は、 $Q-1$ で示される芳香族複素環を表し、

Wは、W-2で示される芳香族複素環を表す上記〔1〕～〔20〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0030] 〔25〕

Qは、Q-2で示される芳香族複素環を表し、

Wは、W-2で示される芳香族複素環を表す上記〔1〕～〔20〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0031] 〔26〕

Qは、Q-3で示される芳香族複素環を表し、

Wは、W-2で示される芳香族複素環を表す上記〔1〕～〔20〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0032] 〔27〕

Qは、Q-4で示される芳香族複素環を表し、

Wは、W-2で示される芳香族複素環を表す上記〔1〕～〔20〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0033] 〔28〕

Qは、Q-5で示される芳香族複素環を表し、

Wは、W-2で示される芳香族複素環を表す上記〔1〕～〔20〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0034] 〔29〕

Qは、Q-1で示される芳香族複素環を表し、

Wは、W-3で示される芳香族複素環を表す上記〔1〕～〔20〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0035] 〔30〕

Qは、Q-2で示される芳香族複素環を表し、

Wは、W-3で示される芳香族複素環を表す上記〔1〕～〔20〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0036] 〔31〕

Qは、Q-3で示される芳香族複素環を表し、

Wは、W-3で示される芳香族複素環を表す上記〔1〕～〔20〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0037] 〔32〕

Qは、Q-4で示される芳香族複素環を表し、

Wは、W-3で示される芳香族複素環を表す上記〔1〕～〔20〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0038] 〔33〕

Qは、Q-5で示される芳香族複素環を表し、

Wは、W-3で示される芳香族複素環を表す上記〔1〕～〔20〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0039] 〔34〕

R^{4a}は、水素原子を表す上記〔1〕～〔33〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0040] 〔35〕

R^{4a}は、水素原子又はC₁～C₆アルキルを表す上記〔1〕～〔33〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0041] 〔36〕

R^{4a}は、C₁～C₆アルキルを表す上記〔1〕～〔33〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0042] 〔37〕

R^{4a}は、C₁～C₃アルキルを表す上記〔1〕～〔33〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0043] 〔38〕

R^{4a}は、メチルを表す上記〔1〕～〔33〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0044] 〔39〕

R^{4a}は、エチルを表す上記〔1〕～〔33〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0045] [4 0]

R^{4a}は、C₃～C₆シクロアルキルを表す上記〔1〕～〔3 3〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0046] [4 1]

R^{4a}は、C₁～C₃ハロアルキルを表す上記〔1〕～〔3 3〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0047] [4 2]

R^{5a}は、水素原子を表す上記〔1〕～〔4 1〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0048] [4 3]

R^{5a}は、C₁～C₆アルキルを表す上記〔1〕～〔4 1〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0049] [4 4]

R^{5a}は、C₁～C₃アルキルを表す上記〔1〕～〔4 1〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0050] [4 5]

R^{5a}は、メチルを表す上記〔1〕～〔4 1〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0051] [4 6]

R^{5a}は、エチルを表す上記〔1〕～〔4 1〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0052] [4 7]

R^{5a}は、R²⁷によって任意に置換された（C₁～C₆）アルキルを表し、

R²⁷は、－OR²⁹又は－S（O）_{m4}R³⁰を表し、

R²⁹は、C₁～C₆アルキルを表し、

R³⁰は、C₁～C₆アルキルを表す上記〔1〕～〔4 1〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0053] [4 8]

R^{5a} は、 $C_2 \sim C_6$ アルケニルを表す上記〔1〕～〔41〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0054] 〔49〕

R^{1a} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^6 によって任意に置換された($C_1 \sim C_6$)アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 R^6 によって任意に置換された($C_3 \sim C_6$)シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $-CHO$ 、 $-S(O)_{m1}R^{10}$ 、 $-N(R^{11})R^{12}$ 、フェニル、 $(R^7)_p$ によって置換されたフェニル、 $U-3$ 、 $U-5a$ 、 $U-6a$ 、 $U-7$ 、 $U-8$ 、 $U-10a$ 、 $U-11a$ 、 $U-12a$ 、又は $U-13a$ を表し、

R^6 は、ハロゲン原子、シアノ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $-C(O)OR^{16}$ 、 $-OR^{13}$ 、 $-S(O)_{m2}R^{14}$ 、フェニル又は $(R^7)_p$ によって置換されたフェニルを表し、

R^8 は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^{10} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{34} によって任意に置換された($C_1 \sim C_6$)アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル又は $C_2 \sim C_6$ アルケニルを表し、

R^{11} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{34} によって任意に置換された($C_1 \sim C_6$)アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、フェニル、 $(R^7)_p$ によって置換されたフェニル又は $U-7$ を表し、

R^{12} は、水素原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^{11} は R^{12} と一緒になって $C_4 \sim C_5$ アルキレン鎖を形成することにより、 R^{11} 及び R^{12} が結合する窒素原子と共に5～6員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖はO、S、 $S(O)$ 又は $S(O)_2$ を1個含んでもよく、

R^{13} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は R^{34} によって任意に置換された($C_1 \sim C_6$)アルキルを表し、

R^{14} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は R^{34} によって任意に置換された($C_1 \sim C_6$)アルキルを表し、

R^{16} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は R^{37} によって任意に置換された(C

$_1 \sim C_6$) アルキルを表し、

R^{34} は、シアノ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $-C(O)R^8$ 、 $-C(O)OR^{16}$ 、 $-OR^{33}$ 、 $-S(O)_m R^{33}$ 又はU-1を表す上記〔1〕～〔48〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0055] 〔50〕

R^{1a} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $-CHO$ を表す上記〔1〕～〔48〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0056] 〔51〕

R^{1a} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルを表す上記〔1〕～〔48〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0057] 〔52〕

R^{1a} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルを表す上記〔1〕～〔48〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0058] 〔53〕

R^{1a} は、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルを表す上記〔1〕～〔48〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0059] 〔54〕

R^{1a} は、 R^6 によって任意に置換された($C_1 \sim C_6$)アルキルを表し、
 R^6 は、ハロゲン原子を表す上記〔1〕～〔48〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0060] 〔55〕

R^{1a} は、 R^6 によって任意に置換された($C_1 \sim C_6$)アルキルを表し、
 R^6 は、シアノを表す上記〔1〕～〔48〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0061] 〔56〕

R^{1a} は、 R^6 によって任意に置換された($C_1 \sim C_6$)アルキルを表し、
 R^6 は、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルを表す上記〔1〕～〔48〕のいずれかに記

載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0062] [57]

R^{1a} は、 R^6 によって任意に置換された ($C_1 \sim C_6$) アルキルを表し、

R^6 は、 $-C(O)OR^{16}$ を表す上記〔1〕～〔48〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0063] [58]

R^{1a} は、 R^6 によって任意に置換された ($C_1 \sim C_6$) アルキルを表し、

R^6 は、 $-OR^{13}$ を表し、

R^{13} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルを表す上記〔1〕～〔48〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0064] [59]

R^{1a} は、 R^6 によって任意に置換された ($C_1 \sim C_6$) アルキルを表し、

R^6 は、 $-OR^{13}$ を表し、

R^{13} は、 R^{34} によって任意に置換された ($C_1 \sim C_6$) アルキルを表し、

R^{34} は、 $-OR^{33}$ を表し、

R^{33} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルを表す上記〔1〕～〔48〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0065] [60]

R^{1a} は、 R^6 によって任意に置換された ($C_1 \sim C_6$) アルキルを表し、

R^6 は、 $-S(O)_{m2}R^{14}$ を表し、

R^{14} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は R^{34} によって任意に置換された ($C_1 \sim C_6$) アルキルを表し、

R^{34} は、ハロゲン原子又は $-OR^{33}$ を表し、

R^{33} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルを表す上記〔1〕～〔48〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0066] [61]

R^{1a} は、 R^6 によって任意に置換された ($C_1 \sim C_6$) アルキルを表し、

R^6 は、 $-S(O)_{m2}R^{14}$ を表し、

R^8 は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^{14} は、 R^{34} によって任意に置換された ($C_1 \sim C_6$) アルキルを表し、

R^{16} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^{34} は、シアノ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $-C(O)R^8$ 、 $-C(O)OR^{16}$ 、 $-OR^{33}$ 又は $-S(O)_{m6}R^{33}$ を表し、

R^{33} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルを表す上記〔1〕～〔48〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0067] 〔62〕

R^{1a} は、 R^6 によって任意に置換された ($C_1 \sim C_6$) アルキルを表し、

R^6 は、 $-S(O)_{m2}R^{14}$ を表し、

R^{14} は、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル又は $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニルを表す上記〔1〕～〔48〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0068] 〔63〕

R^{1a} は、 R^6 によって任意に置換された ($C_3 \sim C_6$) シクロアルキル表し、

R^6 は、ハロゲン原子を表す上記〔1〕～〔48〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0069] 〔64〕

R^{1a} は、 R^6 によって任意に置換された ($C_3 \sim C_6$) シクロアルキル表し、

R^6 は、 $-OR^{13}$ を表し、

R^{13} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルを表す上記〔1〕～〔48〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0070] 〔65〕

R^{1a} は、 $-S(O)_{m1}R^{10}$ を表す上記〔1〕～〔48〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0071] 〔66〕

R^{1a} は、 $-S(O)_{m1}R^{10}$ を表し、

R^{10} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{34} によって任意に置換された ($C_1 \sim C_6$) アル

キル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル又は $C_2 \sim C_6$ アルケニルを表し、

R^{34} は、ハロゲン原子、シアノ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $-C(O)R^8$ 、 $-C(O)OR^{16}$ 、 $-OR^{33}$ を表し、

R^8 は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^{16} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^{33} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルを表す上記〔1〕～〔48〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0072] 〔67〕

R^{1a} は、 $-S(O)_{m1}R^{10}$ を表し、

R^{10} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルを表す上記〔1〕～〔48〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0073] 〔68〕

R^{1a} は、 $-S(O)_{m1}R^{10}$ を表し、

R^{10} は、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルを表す上記〔1〕～〔48〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0074] 〔69〕

R^{1a} は、 $-S(O)_{m1}R^{10}$ を表し、

R^{10} は、 $C_2 \sim C_6$ アルケニルを表す上記〔1〕～〔48〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0075] 〔70〕

R^{1a} は、 $-S(O)_{m1}R^{10}$ を表し、

R^{10} は、 $C_2 \sim C_6$ アルキニルを表す上記〔1〕～〔48〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0076] 〔71〕

R^{1a} は、 $-S(O)_{m1}R^{10}$ を表し、

R^{10} は、 R^{34} によって任意に置換された($C_1 \sim C_6$)アルキルを表し、

R^{34} は、ハロゲン原子を表す上記〔1〕～〔48〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0077] [7 2]

R^{1a} は、 $-S(O)_{m1}R^{10}$ を表し、

R^{10} は、 R^{34} によって任意に置換された ($C_1 \sim C_6$) アルキルを表し、

R^{34} は、シアノを表す上記 [1] ~ [4 8] のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0078] [7 3]

R^{1a} は、 $-S(O)_{m1}R^{10}$ を表し、

R^{10} は、 R^{34} によって任意に置換された ($C_1 \sim C_6$) アルキルを表し、

R^{34} は、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルを表す上記 [1] ~ [4 8] のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0079] [7 4]

R^{1a} は、 $-S(O)_{m1}R^{10}$ を表し、

R^{10} は、 R^{34} によって任意に置換された ($C_1 \sim C_6$) アルキルを表し、

R^{34} は、 $-C(O)R^8$ 、 $-C(O)OR^{16}$ を表し、

R^8 は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^{16} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルを表す上記 [1] ~ [4 8] のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0080] [7 5]

R^{1a} は、 $-S(O)_{m1}R^{10}$ を表し、

R^{10} は、 R^{34} によって任意に置換された ($C_1 \sim C_6$) アルキルを表し、

R^{34} は、 $-OR^{33}$ を表し、

R^{33} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルを表す上記 [1] ~ [4 8] のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0081] [7 6]

R^{1a} は、 $-S(O)_{m1}R^{10}$ を表し、

R^{10} は、 R^{34} によって任意に置換された ($C_1 \sim C_6$) アルキルを表し、

R^{34} は、 $-S(O)_{m6}R^{33}$ を表し、

R^{33} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルを表す上記 [1] ~ [4 8] のいずれかに記載の

複素環アミド化合物又はその塩。

[0082] [7 7]

R^{1a} は、 $-N(R^{11})R^{12}$ を表す上記〔1〕～〔48〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0083] [7 8]

R^{1a} は、 $-N(R^{11})R^{12}$ を表し、

R^{11} は、 $C_1\sim C_6$ アルキルを表し、

R^{12} は、水素原子又は $C_1\sim C_6$ アルキルを表す上記〔1〕～〔48〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0084] [7 9]

R^{1a} は、 $-N(R^{11})R^{12}$ を表し、

R^{11} は、 R^{34} によって任意に置換された($C_1\sim C_6$)アルキル、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキル、 $C_2\sim C_6$ アルケニルを表し、

R^{12} は、水素原子又は $C_1\sim C_6$ アルキルを表し、

R^{34} は、ハロゲン原子、シアノ、 $-S(O)_{m6}R^{33}$ を表し、

R^{33} は、 $C_1\sim C_6$ アルキルを表す上記〔1〕～〔48〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0085] [8 0]

R^{1a} は、 $-N(R^{11})R^{12}$ を表し、

R^{11} は、 R^{34} によって任意に置換された($C_1\sim C_6$)アルキルを表し、

R^{12} は、水素原子又は $C_1\sim C_6$ アルキルを表し、

R^{34} は、 $-OR^{33}$ を表し、

R^{33} は、 $C_1\sim C_6$ アルキルを表す上記〔1〕～〔48〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0086] [8 1]

R^{1a} は、 $-N(R^{11})R^{12}$ を表し、

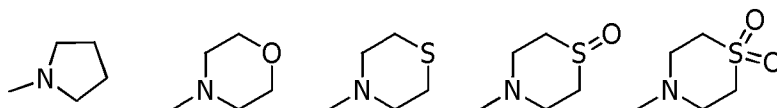
R^{11} は R^{12} と一緒になって $C_4\sim C_5$ アルキレン鎖を形成することにより、 R^{11} 及び R^{12} が結合する窒素原子と共に5～6員環を形成し、このときこのアルキ

レン鎖はO、S、S(O)又はS(O)₂を1個含んでもよい上記〔1〕～〔48〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0087] 〔82〕

R^{1a}は、以下の構造式で表される置換基を表す上記〔1〕～〔48〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

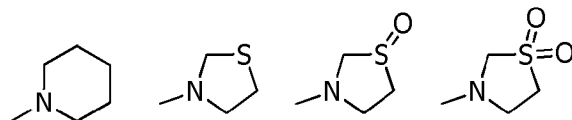
[化5]



[0088] 〔83〕

R^{1a}は、以下の構造式で表される置換基を表す上記〔1〕～〔48〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[化6]



[0089] 〔84〕

R^{1a}は、フェニル又は(R⁷)_pによって置換されたフェニルを表す上記〔1〕～〔48〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0090] 〔85〕

R^{1a}は、R⁶によって任意に置換された(C₁～C₆)アルキルを表し、

R⁶は、フェニル又は(R⁷)_pによって置換されたフェニルを表す上記〔1〕～〔48〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0091] 〔86〕

R^{1a}は、R⁶によって任意に置換された(C₁～C₆)アルキルを表し、

R⁶は、-OR¹³を表し、

R¹³は、R³⁴によって任意に置換された(C₁～C₆)アルキルを表し、

R³⁴は、フェニル又は(R⁷)_pによって置換されたフェニルを表す上記〔1〕～〔48〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0092] [8 7]

R^{1a} は、 R^6 によって任意に置換された ($C_1 \sim C_6$) アルキルを表し、

R^6 は、 $-S(O)_{m2}R^{14}$ を表し、

R^{14} は、 R^{34} によって任意に置換された ($C_1 \sim C_6$) アルキルを表し、

R^{34} は、フェニル又は $(R^7)_p$ によって置換されたフェニルを表す上記 [1] ~ [4 8] のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0093] [8 8]

R^{1a} は、 $-S(O)_{m1}R^{10}$ を表し、

R^{10} は、 R^{34} によって任意に置換された ($C_1 \sim C_6$) アルキルを表し、

R^{34} は、フェニル又は $(R^7)_p$ によって置換されたフェニルを表す上記 [1] ~ [4 8] のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0094] [8 9]

R^{1a} は、 $-N(R^{11})R^{12}$ を表し、

R^{11} は、 R^{34} によって任意に置換された ($C_1 \sim C_6$) アルキルを表し、

R^{12} は、水素原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^{34} は、フェニル、 $(R^7)_p$ によって置換されたフェニルを表す上記 [1] ~ [4 8] のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0095] [9 0]

R^{1a} は、 $-N(R^{11})R^{12}$ を表し、

R^{11} は、フェニル、 $(R^7)_p$ によって置換されたフェニルを表し、

R^{12} は、水素原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキルを表す上記 [1] ~ [4 8] のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0096] [9 1]

R^7 は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{27} によって任意に置換された ($C_1 \sim C_6$) アルキル又は $-OR^{15}$ を表し、

R^{15} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^{27} は、ハロゲン原子、 $-OR^{29}$ 又は $-S(O)_{m4}R^{30}$ を表し、

R^{29} 及び R^{30} は、各々独立して $C_1 \sim C_6$ アルキルを表す上記 [8 4] ~ [9 0]

〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0097] 〔 9 2 〕

R^7 は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{27} によって任意に置換された ($C_1 \sim C_6$) アルキル又は $-OR^{15}$ を表し、

R^{15} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^{27} は、ハロゲン原子を表す上記〔 8 4 〕～〔 9 0 〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0098] 〔 9 3 〕

R^{1a} は、U-1 乃至 U-25 のいずれかの複素環を表す上記〔 1 〕～〔 4 8 〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0099] 〔 9 4 〕

R^{1a} は、U-3、U-5 a、U-6 a、U-7、U-8、U-10 a、U-11 a、U-12 a、又はU-13 aを表す上記〔 1 〕～〔 4 8 〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0100] 〔 9 5 〕

R^{1a} は、 $-N(R^{11})R^{12}$ を表し、

R^{11} は、U-7、U-8、U-9 又は U-14 乃至 U-19 を表し、

R^{12} は、水素原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキルを表す上記〔 1 〕～〔 4 8 〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0101] 〔 9 6 〕

R^{1a} は、 $-N(R^{11})R^{12}$ を表し、

R^{11} は、U-7 を表し、

R^{12} は、水素原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキルを表す上記〔 1 〕～〔 4 8 〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0102] 〔 9 7 〕

R^{1a} は、 $-S(O)_{m1}R^{10}$ を表し、

R^{10} は、 R^{34} によって任意に置換された ($C_1 \sim C_6$) アルキルを表し、

R^{34} は、U-7、U-8、U-9 又は U-14 乃至 U-19 を表す上記〔 1

] ～ [4 8] のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0103] [9 8]

R^{1a} は、 $-S(O)_{m1}R^{10}$ を表し、

R^{10} は、 R^{34} によって任意に置換された ($C_1 \sim C_6$) アルキルを表し、

R^{34} は、U-1、U-3 又は U-20 乃至 U-25 を表す上記 [1] ～ [4 8] のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0104] [9 9]

R^{1a} は、 $-S(O)_{m1}R^{10}$ を表し、

R^{10} は、 R^{34} によって任意に置換された ($C_1 \sim C_6$) アルキルを表し、

R^{34} は、U-1、U-3 又は U-22a を表す上記 [1] ～ [4 8] のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0105] [1 0 0]

R^{1a} は、 $-N(R^{11})R^{12}$ を表し、

R^{11} は、 R^{34} によって任意に置換された ($C_1 \sim C_6$) アルキルを表し、

R^{12} は、水素原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^{34} は、U-7、U-8、U-9 又は U-14 乃至 U-19 を表す上記 [1] ～ [4 8] のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0106] [1 0 1]

R^{1a} は、 $-N(R^{11})R^{12}$ を表し、

R^{11} は、 R^{34} によって任意に置換された ($C_1 \sim C_6$) アルキルを表し、

R^{12} は、水素原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^{34} は、U-1、U-3 又は U-20 乃至 U-25 を表す上記 [1] ～ [4 8] のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0107] [1 0 2]

R^{1a} は、 $-N(R^{11})R^{12}$ を表し、

R^{11} は、 R^{34} によって任意に置換された ($C_1 \sim C_6$) アルキルを表し、

R^{12} は、水素原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^{34} は、U-1、U-3 又は U-22a を表す上記 [1] ～ [4 8] のいづ

れかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0108] [103]

R^{1a} は、 R^6 によって任意に置換された ($C_1 \sim C_6$) アルキルを表し、

R^6 は、 $-OR^{13}$ を表し、

R^{13} は、 R^{34} によって任意に置換された ($C_1 \sim C_6$) アルキルを表し、

R^{34} は、U-7、U-8、U-9又はU-14乃至U-19を表す上記〔1〕～〔48〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0109] [104]

R^{1a} は、 R^6 によって任意に置換された ($C_1 \sim C_6$) アルキルを表し、

R^6 は、 $-OR^{13}$ を表し、

R^{13} は、 R^{34} によって任意に置換された ($C_1 \sim C_6$) アルキルを表し、

R^{34} は、U-1、U-3又はU-20乃至U-25を表す上記〔1〕～〔48〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0110] [105]

R^{1a} は、 R^6 によって任意に置換された ($C_1 \sim C_6$) アルキルを表し、

R^6 は、 $-OR^{13}$ を表し、

R^{13} は、 R^{34} によって任意に置換された ($C_1 \sim C_6$) アルキルを表し、

R^{34} は、U-1、U-3又はU-22aを表す上記〔1〕～〔48〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0111] [106]

R^{1a} は、 R^6 によって任意に置換された ($C_1 \sim C_6$) アルキルを表し、

R^6 は、 $-S(O)_{m2}R^{14}$ を表し、

R^{14} は、 R^{34} によって任意に置換された ($C_1 \sim C_6$) アルキルを表し、

R^{34} は、U-7、U-8、U-9又はU-14乃至U-19を表す上記〔1〕～〔48〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0112] [107]

R^{1a} は、 R^6 によって任意に置換された ($C_1 \sim C_6$) アルキルを表し、

R^6 は、 $-S(O)_{m2}R^{14}$ を表し、

R^{14} は、 R^{34} によって任意に置換された ($C_1 \sim C_6$) アルキルを表し、

R^{34} は、U-1、U-3 又は U-20 乃至 U-25 を表す上記〔1〕～〔48〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0113] 〔108〕

R^{1a} は、 R^6 によって任意に置換された ($C_1 \sim C_6$) アルキルを表し、

R^6 は、 $-S(O)_{m2}R^{14}$ を表し、

R^{14} は、 R^{34} によって任意に置換された ($C_1 \sim C_6$) アルキルを表し、

R^{34} は、U-1、U-3 又は U-22a を表す上記〔1〕～〔48〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0114] 〔109〕

t1、t2、t3、t4、t5、t7、t8 及び t9 は、各々独立して0の整数を表す上記〔93〕～〔108〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0115] 〔110〕

R^{28} は、ハロゲン原子、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、($C_1 \sim C_6$ アルコキシ) $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-OR^{31}$ 又は $-S(O)_{m4}R^{30}$ を表す上記〔93〕～〔108〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0116] 〔111〕

R^{28} は、ハロゲン原子を表す上記〔93〕～〔108〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0117] 〔112〕

R^{28} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルを表す上記〔93〕～〔108〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0118] 〔113〕

R^{28} は、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシを表す上記〔93〕～〔108〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0119] 〔114〕

上記〔１〕～〔１１３〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物及びその塩から選ばれる１種又は２種以上を有効成分として含有する農薬。

[0120] 〔１１５〕

上記〔１〕～〔１１３〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物及びその塩から選ばれる１種又は２種以上を有効成分として含有する除草剤。

発明の効果

[0121] 本発明化合物は、各種雑草に対して優れた除草活性を有し、且つ、対象となる作物に対しては高い安全性を有する。さらに、ホ乳動物、魚類及び益虫等の非標的生物に対してほとんど悪影響を及ぼさず、低残留性で環境に対する負荷も軽い。

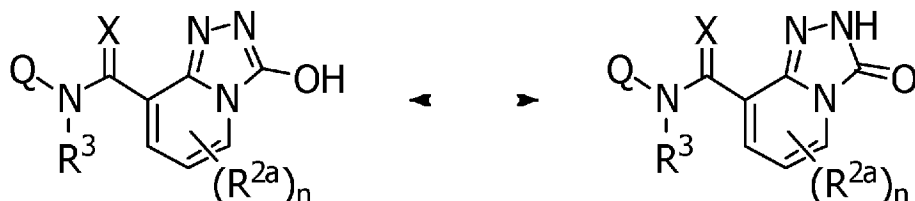
従って、本発明は水田、畑地及び果樹園等の農園芸分野において有用な除草剤を提供することができる。

発明を実施するための形態

[0122] 本発明に包含される化合物には、置換基の種類によってはＥ－体及びＺ－体の幾何異性体が存在する場合があるが、本発明はこれらＥ－体、Ｚ－体又はＥ－体及びＺ－体を任意の割合で含む混合物を包含するものである。また、本発明に包含される化合物は、１個又は２個以上の不斉炭素原子の存在に起因する光学活性体が存在するが、本発明は全ての光学活性体又はラセミ体を包含する。

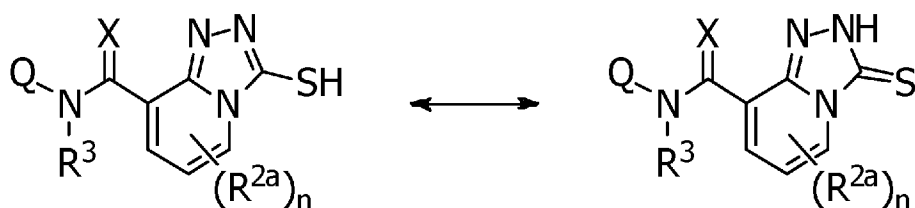
[0123] また、本発明に包含される化合物には、置換基の種類によって互変異性体が存在する場合があるが、本発明は全ての互変異性体又は任意の割合で含む互変異性体の混合物を包含するものである。例えば一般式（１）〔式中、WはW－１を表し、R^{1a}はヒドロキシ基を表し、n、Q、R^{2a}、R³、Xは前記と同じ意味を表す。〕で表される化合物の場合、次のような互変異性体を包含するものである。

[化7]



[0124] 同様に、例えば一般式(1)〔式中、WはW-1を表し、R^{1a}は-SH基を表し、n、Q、R^{2a}、R³、Xは前記と同じ意味を表す。〕で表される化合物の場合、次のような互変異性体を包含するものである。

[化8]



[0125] 本発明に包含される化合物のうちで、常法に従って酸付加塩にすることができるものは、例えば、フッ化水素酸、塩酸、臭化水素酸、沃化水素酸等のハロゲン化水素酸の塩、硝酸、硫酸、リン酸、塩素酸、過塩素酸等の無機酸の塩、メタンスルホン酸、エタンスルホン酸、トリフルオロメタンスルホン酸、ベンゼンスルホン酸、p-トルエンスルホン酸等のスルホン酸の塩、ギ酸、酢酸、プロピオン酸、トリフルオロ酢酸、フマル酸、酒石酸、蔞酸、マレイン酸、リンゴ酸、コハク酸、安息香酸、マンデル酸、アスコルビン酸、乳酸、グルコン酸、クエン酸等のカルボン酸の塩又はグルタミン酸、アスパラギン酸等のアミノ酸の塩とすることができる。

[0126] 或いは、本発明に包含される化合物のうちで、常法に従って金属塩にすることができるものは、例えば、リチウム、ナトリウム、カリウムといったアルカリ金属の塩、カルシウム、バリウム、マグネシウムといったアルカリ土類金属の塩又はアルミニウムの塩とすることができる。

次に、本明細書において示した各置換基の具体例を以下に示す。ここで、n-はノルマル、i-はイソ、s-はセカンダリー及びt e r t-はターシ

ャリーを各々意味し、Phはフェニルを意味する。

- [0127] 本明細書におけるハロゲン原子としては、フッ素原子、塩素原子、臭素原子及びヨウ素原子が挙げられる。尚、本明細書中「ハロ」の表記もこれらのハロゲン原子を表す。

本明細書におけるC_a～C_bアルキルの表記は、炭素原子数がa～b個よりなる直鎖状又は分岐鎖状の炭化水素基を表し、例えばメチル基、エチル基、n-プロピル基、i-プロピル基、n-ブチル基、i-ブチル基、s-ブチル基、tert-ブチル基、n-ペンチル基、1,1-ジメチルプロピル基、n-ヘキシル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

- [0128] 本明細書におけるC_a～C_bシクロアルキルの表記は、炭素原子数がa～b個よりなる環状の炭化水素基を表し、3員環から6員環までの単環又は複合環構造を形成することが出来る。また、各々の環は指定の炭素原子数の範囲でアルキル基によって任意に置換されていてもよい。例えばシクロプロピル基、1-メチルシクロプロピル基、2-メチルシクロプロピル基、2,2-ジメチルシクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

- [0129] 本明細書におけるC_a～C_bハロシクロアルキルの表記は、炭素原子に結合した水素原子がハロゲン原子によって任意に置換された、炭素原子数がa～b個よりなる環状の炭化水素基を表し、3員環から10員環までの単環又は複合環構造を形成することが出来る。また、各々の環は指定の炭素原子数の範囲でアルキル基によって任意に置換されていてもよく、ハロゲン原子による置換は環構造部分であっても、側鎖部分であっても、或いはそれらの両方であってもよく、さらに、2個以上のハロゲン原子によって置換されている場合、それらのハロゲン原子は互いに同一でも、又は互いに相異なってもよい。例えば2,2-ジフルオロシクロプロピル基、2,2-ジクロロシクロプロピル基、2,2-ジブロモシクロプロピル基、2,2-ジフルオロ-1-メチル

シクロプロピル基、2,2-ジクロロ-1-メチルシクロプロピル基、2,2-ジブromo-1-メチルシクロプロピル基、2,2,3,3-テトラフルオロシクロブチル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0130] 本明細書における $C_a \sim C_b$ アルケニルの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる直鎖状又は分岐鎖状で、且つ分子内に1個又は2個以上の二重結合を有する不飽和炭化水素基を表し、例えばビニル基、1-プロペニル基、2-プロペニル基、1-メチルエテニル基、2-ブテニル基、2-メチル-2-プロペニル基、3-メチル-2-ブテニル基、1,1-ジメチル-2-プロペニル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0131] 本明細書における $C_a \sim C_b$ ハロアルケニルの表記は、炭素原子に結合した水素原子が、ハロゲン原子によって任意に置換された、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる直鎖状又は分岐鎖状で、且つ分子内に1個又は2個以上の二重結合を有する不飽和炭化水素基を表す。このとき、2個以上のハロゲン原子によって置換されている場合、それらのハロゲン原子は互いに同一でも、又は互いに相異なってもよい。例えば2,2-ジクロロビニル基、2-フルオロ-2-プロペニル基、2-クロロ-2-プロペニル基、3-クロロ-2-プロペニル基、2-ブromo-2-プロペニル基、3,3-ジフルオロ-2-プロペニル基、2,3-ジクロロ-2-プロペニル基、3,3-ジクロロ-2-プロペニル基、2,3,3-トリフルオロ-2-プロペニル基、2,3,3-トリクロロ-2-プロペニル基、1-(トリフルオロメチル)エテニル基、4,4-ジフルオロ-3-ブテニル基、3,4,4-トリフルオロ-3-ブテニル基、3-クロロ-4,4,4-トリフルオロ-2-ブテニル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0132] 本明細書における $C_a \sim C_b$ シクロアルケニルの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる環状の、且つ1個又は2個以上の二重結合を有する不飽和炭化水素基を表し、3員環から6員環までの単環又は複合環構造を形成することが

出来る。また、各々の環は指定の炭素原子数の範囲でアルキル基によって任意に置換されていてもよく、さらに、二重結合は *endo* 又は *exo* のどちらの形式であってもよい。例えば 1-シクロペンテン-1-イル基、2-シクロペンテン-1-イル基、1-シクロヘキセン-1-イル基、2-シクロヘキセン-1-イル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0133] 本明細書における $C_a \sim C_b$ アルキニルの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる直鎖状又は分岐鎖状で、且つ分子内に 1 個又は 2 個以上の三重結合を有する不飽和炭化水素基を表し、例えばエチニル基、1-プロピニル基、2-プロピニル基、1-ブチニル基、2-ブチニル基、3-ブチニル基、1, 1-ジメチル-2-プロピニル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0134] 本明細書における $C_a \sim C_b$ ハロアルキニルの表記は、炭素原子に結合した水素原子が、ハロゲン原子によって任意に置換された、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる直鎖状又は分岐鎖状で、且つ分子内に 1 個又は 2 個以上の三重結合を有する不飽和炭化水素基を表す。このとき、2 個以上のハロゲン原子によって置換されている場合、それらのハロゲン原子は互いに同一でも、又は互いに相異なってもよい。例えば 2-クロロエチニル基、2-ブロモエチニル基、2-ヨードエチニル基、3-クロロ-2-プロピニル基、3-ブロモ-2-プロピニル基、3-ヨード-2-プロピニル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0135] 本明細書における $C_a \sim C_b$ ハロアルキルの表記は、炭素原子に結合した水素原子が、ハロゲン原子によって任意に置換された、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる直鎖状又は分岐鎖状の炭化水素基を表し、このとき、2 個以上のハロゲン原子によって置換されている場合、それらのハロゲン原子は互いに同一でも、又は互いに相異なってもよい。例えばフルオロメチル基、クロロメチル基、ブロモメチル基、ヨードメチル基、ジフルオロメチル基、ジクロロメチル基、トリフルオロメチル基、クロロジフルオロメチル基、トリクロ

ロメチル基、ブロモジフルオロメチル基、2-フルオロエチル基、2-クロロエチル基、2-ブromoエチル基、2, 2-ジフルオロエチル基、2, 2, 2-トリフルオロエチル基、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエチル基、2, 2, 2-トリクロロエチル基、1, 1, 2, 2-テトラフルオロエチル基、2-クロロ-1, 1, 2-トリフルオロエチル基、ペンタフルオロエチル基、3, 3, 3-トリフルオロプロピル基、2, 2, 3, 3, 3-ペンタフルオロプロピル基、1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘキサフルオロプロピル基、ヘプタフルオロプロピル基、2, 2, 2-トリフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル基、1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル基、2, 2, 3, 3, 4, 4, 4-ヘプタフルオロブチル基、ノナフルオロブチル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0136] 本明細書における $C_a \sim C_b$ アルコキシの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルキル-O-基を表し、例えばメトキシ基、エトキシ基、 n -プロピルオキシ基、 i -プロピルオキシ基、 n -ブチルオキシ基、 i -ブチルオキシ基、 s -ブチルオキシ基、 $tert$ -ブチルオキシ基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0137] 本明細書における $C_a \sim C_b$ アルキルチオの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルキル-S-基を表し、例えばメチルチオ基、エチルチオ基、 n -プロピルチオ基、 i -プロピルチオ基、 n -ブチルチオ基、 i -ブチルチオ基、 s -ブチルチオ基、 $tert$ -ブチルチオ基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0138] 本明細書における $C_a \sim C_b$ アルキルカルボニルの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルキル-C(O)-基を表し、例えばアセチル基、プロピオニル基、ブチリル基、イソブチリル基、バレリル基、イソバレリル基、2-メチルブタノイル基、ピバロイル基、ヘキサノイル基、ヘプタノイル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0139] 本明細書における $C_a \sim C_b$ ハロアルキルカルボニルの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるハロアルキル- $C(O)-$ 基を表し、例えばフルオロアセチル基、クロロアセチル基、ジフルオロアセチル基、ジクロロアセチル基、トリフルオロアセチル基、クロロジフルオロアセチル基、ブロモジフルオロアセチル基、トリクロロアセチル基、ペンタフルオロプロピオニル基、ヘプタフルオロブタノイル基、3-クロロ-2, 2-ジメチルプロパノイル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0140] 本明細書における $C_a \sim C_b$ シクロアルキルカルボニルの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるシクロアルキル- $C(O)-$ 基を表し、例えばシクロプロピルカルボニル基、2-メチルシクロプロピルカルボニル基、シクロブチルカルボニル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0141] 本明細書における $C_a \sim C_b$ ハロシクロアルキルカルボニルの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるハロシクロアルキル- $C(O)-$ 基を表し、例えば2, 2-ジクロロシクロプロピルカルボニル基、2, 2-ジクロロ-1-メチルシクロプロピルカルボニル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0142] 本明細書における $C_a \sim C_b$ アルコキシカルボニルの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルキル- $O-C(O)-$ 基を表し、例えばメトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、 n -プロピルオキシカルボニル基、 i -プロピルオキシカルボニル基、 n -ブトキシカルボニル基、 i -ブトキシカルボニル基、*tert*-ブトキシカルボニル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0143] 本明細書における $C_a \sim C_b$ ハロアルコキシカルボニルの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるハロアルキル- $O-C(O)-$ 基を表し、例えばクロロメトキシカルボニル基、2-クロロエトキシカルボニル基、2, 2-ジフルオロエトキシカルボニル基、2, 2, 2-トリフルオロエ

トキシカルボニル基、2, 2, 2-トリクロロエトキシカルボニル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0144] 本明細書における $C_a \sim C_b$ アルキルアミノカルボニルの表記は、水素原子の一方が炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルキル基によって置換されたカルバモイル基を表し、例えばメチルカルバモイル基、エチルカルバモイル基、 n -プロピルカルバモイル基、 i -プロピルカルバモイル基、 n -ブチルカルバモイル基、 i -ブチルカルバモイル基、 s -ブチルカルバモイル基、 $tert$ -ブチルカルバモイル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0145] 本明細書における $C_a \sim C_b$ ハロアルキルアミノカルボニルの表記は、水素原子の一方が炭素原子数 $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるハロアルキル基によって置換されたカルバモイル基を表し、例えば2-フルオロエチルカルバモイル基、2-クロロエチルカルバモイル基、2, 2-ジフルオロエチルカルバモイル基、2, 2, 2-トリフルオロエチルカルバモイル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0146] 本明細書におけるジ($C_a \sim C_b$ アルキル)アミノカルボニルの表記は、水素原子が両方とも、それぞれ同一でも又は互いに相異なってもよい炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルキル基によって置換されたカルバモイル基を表し、例えば N , N -ジメチルカルバモイル基、 N -エチル- N -メチルカルバモイル基、 N , N -ジエチルカルバモイル基、 N , N -ジ(n -プロピル)カルバモイル基、 N , N -ジ(n -ブチル)カルバモイル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0147] 本明細書における $C_a \sim C_b$ アルキルアミノスルホニルの表記は、水素原子の一方が炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルキル基によって置換されたスルファモイル基を表し、例えばメチルスルファモイル基、エチルスルファモイル基、 n -プロピルスルファモイル基、 i -プロピルスルファモイル基、 n -ブチルスルファモイル基、 i -ブチルスルファモイル基、

s-ブチルスルファモイル基、tert-ブチルスルファモイル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0148] 本明細書におけるジ ($C_a \sim C_b$ アルキル) アミノスルホニルの表記は、水素原子が両方とも、それぞれ同一でも又は互いに相異なってもよい炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルキル基によって置換されたスルファモイル基を表し、例えばN, N-ジメチルスルファモイル基、N-エチル-N-メチルスルファモイル基、N, N-ジエチルスルファモイル基、N, N-ジ(n-プロピル)スルファモイル基、N, N-ジ(n-ブチル)スルファモイル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0149] 本明細書における $C_a \sim C_b$ アルキルアミノの表記は、水素原子の一方が炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルキル基によって置換されたアミノ基を表し、例えばメチルアミノ基、エチルアミノ基、n-プロピルアミノ基、i-プロピルアミノ基、n-ブチルアミノ基、i-ブチルアミノ基、tert-ブチルアミノ基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0150] 本明細書におけるジ ($C_a \sim C_b$ アルキル) アミノの表記は、水素原子が両方とも、それぞれ同一でも又は互いに相異なってもよい炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルキル基によって置換されたアミノ基を表し、例えばジメチルアミノ基、エチル(メチル)アミノ基、ジエチルアミノ基、n-プロピル(メチル)アミノ基、i-プロピル(メチル)アミノ基、ジ(n-プロピル)アミノ基、ジ(n-ブチル)アミノ基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0151] 本明細書における R^6 によって任意に置換された ($C_a \sim C_b$) アルキル、 R^{27} によって任意に置換された ($C_a \sim C_b$) アルキル、 R^{34} によって任意に置換された ($C_a \sim C_b$) アルキル、 R^{35} によって任意に置換された ($C_a \sim C_b$) アルキル又は R^{36} によって任意に置換された ($C_a \sim C_b$) アルキル等の表記は、任意の R^6 、 R^{27} 、 R^{34} 、 R^{35} 又は R^{36} によって、炭素原子に結合した水素原子が任意

に置換された炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルキル基を表し、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。このとき、それぞれの ($C_a \sim C_b$) アルキル基上の置換基 R^6 、 R^{27} 、 R^{34} 、 R^{35} 又は R^{36} が 2 個以上存在するとき、それぞれの R^6 、 R^{27} 、 R^{34} 、 R^{35} 又は R^{36} は互いに同一でも異なってもよい。

[0152] 本明細書における R^6 によって任意に置換された ($C_a \sim C_b$) シクロアルキル又は R^{27} によって任意に置換された ($C_a \sim C_b$) シクロアルキル等の表記は、任意の R^6 又は R^{27} によって、炭素原子に結合した水素原子が任意に置換された炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるシクロアルキル基を表し、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。このとき、それぞれの ($C_a \sim C_b$) シクロアルキル基上の置換基 R^6 又は R^{27} が 2 個以上存在するとき、それぞれの R^6 又は R^{27} は互いに同一でも異なってもよく、さらに置換位置は環構造部分であっても、側鎖部分であっても、或いはそれらの両方にあってもよい。

[0153] 本明細書における「 R^{11} は R^{12} と一緒になって $C_2 \sim C_6$ アルキレン鎖を形成することにより、 R^{11} 及び R^{12} が結合する窒素原子と共に 3～7 員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は O、S、S(O)、S(O)₂ 又は N(R^{33}) を 1 個含んでもよく、且つオキソ基又はチオキソ基によって置換されていてもよく」、「 R^{11a} は R^{12a} と一緒になって $C_2 \sim C_6$ アルキレン鎖を形成することにより、 R^{11a} 及び R^{12a} が結合する窒素原子と共に 3～7 員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は O、S、S(O)、S(O)₂ 又は N(R^{33}) を 1 個含んでもよく、且つオキソ基又はチオキソ基によって置換されていてもよく」及び「 R^{21} は R^{22} と一緒になって $C_2 \sim C_6$ アルキレン鎖を形成することにより、 R^{21} 及び R^{22} が結合する窒素原子と共に 3～7 員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は O、S、S(O)、S(O)₂ 又は N(R^{39}) を 1 個含んでもよく、且つオキソ基又はチオキソ基によって置換されていてもよく」の表記の具体例としては、例えばアジリジン、アゼチジン、アゼチジン-2-オ

ン、ピロリジン、ピロリジン-2-オン、オキサゾリジン、オキサゾリジン-2-オン、オキサゾリジン-2-チオン、チアゾリジン、チアゾリジン-2-オン、チアゾリジン-2-チオン、イミダゾリジン、イミダゾリジン-2-オン、イミダゾリジン-2-チオン、ピペリジン、ピペリジン-2-オン、ピペリジン-2-チオン、2H-3, 4, 5, 6-テトラヒドロ-1, 3-オキサジン-2-オン、2H-3, 4, 5, 6-テトラヒドロ-1, 3-オキサジン-2-チオン、モルホリン、2H-3, 4, 5, 6-テトラヒドロ-1, 3-チアジン-2-オン、2H-3, 4, 5, 6-テトラヒドロ-1, 3-チアジン-2-チオン、チオモルホリン、チオモルホリン-1-オキシド、チオモルホリン-1, 1-ジオキシド、ペルヒドロピリミジン-2-オン、ピペラジン、ホモピペリジン、ホモピペリジン-2-オン、ヘプタメチレンイミン等が挙げられ、各々の指定の原子数の範囲で選択される。

[0154] 本明細書における ($C_a \sim C_b$ アルコキシ) $C_d \sim C_e$ アルキル又は ($C_a \sim C_b$ アルキルチオ) $C_d \sim C_e$ アルキル等の表記は、それぞれ前記の意味である任意の $C_a \sim C_b$ アルコキシ基又は $C_a \sim C_b$ アルキルチオ基によって、炭素原子に結合した水素原子が任意に置換された炭素原子数が $d \sim e$ 個よりなる直鎖状又は分岐鎖状の炭化水素基を表し、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0155] 本明細書における「5-6員芳香族複素環」とは、環を構成する原子数が5乃至6個であり、環を構成する原子中に1乃至5個のヘテロ原子（該ヘテロ原子は、窒素原子、酸素原子又は硫黄原子を意味する。）を含有する単環の芳香族複素環であるものを意味し、具体例としては、例えばピロール、ピラゾール、イミダゾール、トリアゾール、テトラゾール、ピリジン、ピリダジン、ピリミジン、ピラジン、トリアジン、フラン、チオフエン、チアゾール、イソチアゾール、オキサゾール、イソキサゾール、オキサジアゾール、チアジアゾール等が挙げられる。

また、この「5-6員芳香族複素環」が $C=N$ 二重結合を有する場合はその窒素原子はN-オキシドであってもよい。

[0156] 本明細書における「5-6員ヘテロアリアル」とは、前記定義「5-6員

芳香族複素環」から任意の位置の水素原子を1個取り除いた1価の置換基を意味する。なお、それらの結合位置は特に限定されず、所望の位置で結合していてもよい。

[0157] 本明細書における「3-7員非芳香族複素環」とは、

- 1) 環を構成する原子数が3乃至7個であり、
 - 2) 環を構成する原子中に1乃至3個のヘテロ原子（該ヘテロ原子は、窒素原子、酸素原子又は硫黄原子を意味する。）を含有し、
 - 3) 環中にカルボニル基、チオカルボニル基、二重結合又は三重結合を含んでいてもよく、
 - 4) 環を構成する原子中に硫黄原子が含まれる場合、その硫黄原子はスルフィニル基又はスルホニル基であってもよい、
- 単環の非芳香族性の複素環を意味し、具体例としては、例えばアゼチジン、ピロリジン、ピロリジノン、オキサゾリジン、イソキサゾリジン、チアゾリジン、イソチアゾリジン、ピペラジン、ピペラジノン、ピペリジン、ピペリジノン、モルホリン、チオモルホリン、アゼピン、ジアゼピン、オキセタン、テトラヒドロフラン、1,3-ジオキサラン、テトラヒドロピラン、1,4-ジオキサン、オキセパン、ホモモルホリン等が挙げられる。

[0158] 本明細書における「3-7員ヘテロシクリル」とは、前記定義「3-7員非芳香族複素環」から任意の位置の水素原子を1個取り除いた1価の置換基を意味する。なお、それらの結合位置は特に限定されず、所望の位置で結合していてもよい。

[0159] 本明細書における「 R^{28} 及び R^{28a} によって任意に置換された5-6員ヘテロアリール」とは、「5-6員ヘテロアリール」の環を構成する炭素原子上の水素原子が、存在する水素の数の範囲で任意の R^{28} によって炭素原子上で任意に置換された「5-6員ヘテロアリール」を表し、このとき、「5-6員ヘテロアリール」の環を構成する原子に窒素が存在し、かつその窒素原子がNH構造を取りうる場合は、その窒素原子上の水素原子が、存在する水素の数の範囲で任意の R^{28a} によって窒素原子上で任意に置換されてもよい「5-6員

ヘテロアリール」を表す。このとき、それぞれの「5－6員ヘテロアリール」の環を構成する炭素原子上の置換基 R^{28} 及び環を構成するNH構造を取りうる窒素原子に置換される置換基 R^{28a} がそれぞれ独立して2個以上存在するとき、それぞれの R^{28} 及び R^{28a} は互いに同一でも異なってもよく、更に2つの R^{28} が隣接する場合には、隣接する2つの R^{28} は一緒になって $-CH=CH-CH=CH-$ を形成することにより、それぞれの R^{28} が結合する炭素原子と共に6員環を形成してもよい。

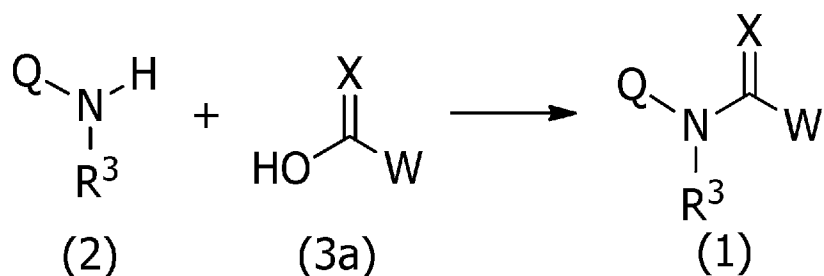
[0160] 本明細書における「 R^{28} 及び R^{28a} によって任意に置換された3－7員ヘテロシクリル」とは、「3－7員ヘテロシクリル」の環を構成する炭素原子上の水素原子が、存在する水素の数の範囲で任意の R^{28} によって炭素原子上で任意に置換された「3－7員ヘテロシクリル」を表し、このとき、「3－7員ヘテロシクリル」の環を構成する原子に窒素が存在し、かつその窒素原子がNH構造を取りうる場合は、その窒素原子上の水素原子が、存在する水素の数の範囲で任意の R^{28a} によって窒素原子上で任意に置換されてもよい「3－7員ヘテロシクリル」を表す。このとき、それぞれの「3－7員ヘテロシクリル」の環を構成する炭素原子上の置換基 R^{28} 及び環を構成するNH構造を取りうる窒素原子に置換される置換基 R^{28a} がそれぞれ独立して2個以上存在するとき、それぞれの R^{28} 及び R^{28a} は互いに同一でも異なってもよく、更に2つの R^{28} が隣接する場合には、隣接する2つの R^{28} は一緒になって $-CH=CH-CH=CH-$ を形成することにより、それぞれの R^{28} が結合する炭素原子と共に6員環を形成してもよい。

[0161] 次に、本発明化合物の製造法を以下に説明する。

製造法A

式(1)で表される複素環アミド化合物は、例えば、式(2)で表される化合物と式(3a)で表される化合物を反応させることにより製造することができる。

[化9]



[0162] 式(2) [式中、Q及びR³は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物又はその塩と、式(3a) [式中、W及びXは前記と同じ意味を表す。] で表される化合物又はその塩を溶媒中、又は無溶媒で、必要であれば塩基、必要であれば縮合剤、必要であれば触媒を使用し、必要であれば添加物を添加して反応させることによって式(1) [式中、Q、R³、W及びXは前記と同じ意味を表す。] で表される本発明化合物を製造することができる。

本反応では式(2) で表される化合物1当量に対して、式(3a) で表される化合物は、0.1から100当量の範囲で用いることができる。

[0163] 溶媒を用いる場合、用いられる溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド、アセトニトリル、ジメチルスルホキシド、1,3-ジメチル-2-イミダゾリノン等の極性溶媒、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、1,4-ジオキサン、1,2-ジメトキシエタン、ジフェニルエーテル等のエーテル類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、n-ペンタン、n-ヘキサン等の脂肪族炭化水素類が挙げられる。これらの溶媒は単独で用いても、これらの内の2種類以上を混合して用いてもよい。

[0164] 塩基を用いる場合、用いられる塩基としては、トリエチルアミン、ピリジン、4-(ジメチルアミノ)ピリジン等の有機塩基、炭酸カリウム、炭酸ナトリウム等の無機塩基を使用することができ、式(2) で表される化合物1当量に対して0.1から50当量の範囲で用いることができる。

[0165] 縮合剤を用いる場合、用いられる縮合剤としては、1 H-ベンゾトリアゾール-1-イルオキシトリス(ジメチルアミノ)ホスホニウムヘキサフルオロホスファート、N, N'-ジシクロヘキシルカルボジイミド、1-(3-ジメチルアミノプロピル)-3-エチルカルボジイミド塩酸塩、2-クロロ-1-メチルピリジニウムヨード等が挙げられ、式(2)で表される化合物1当量に対して、0.1から50当量の範囲で用いることができる。

[0166] 添加物を用いる場合、用いられる添加物としては、3 H-[1, 2, 3]トリアゾロ[4, 5-b]ピリジン-3-オール、1-ヒドロキシベンゾトリアゾール等が挙げられ、式(2)で表される化合物1当量に対して、0.1から50当量の範囲で用いることができる。

[0167] 反応温度は、-78℃から反応混合物の還流温度までの任意の温度を設定することができ、反応時間は、反応基質の濃度、反応温度によって変化するが、通常5分から100時間の範囲で任意に設定できる。

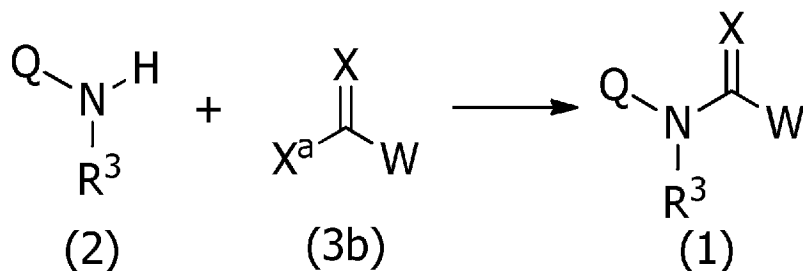
式(2)で表される化合物の或るものは公知化合物であり、一部は市販品として入手できる。

式(3a)で表される化合物の或るものは公知化合物であり、文献記載の公知の方法に準じた方法によって合成できる。文献既知の公知の方法とは、例えば、国際公開第2008/006540号に記載の方法が挙げられる。

[0168] 製造法B

式(1)で表される複素環アミド化合物は、例えば、式(2)で表される化合物と式(3b)で表される化合物を反応させることにより製造することができる。

[化10]



[0169] 式(2) [式中、Q及びR³は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物又はその塩と、式(3b) [式中、W及びXは前記と同じ意味を表し、X^aはハロゲン原子等の脱離基を表す。] で表される化合物又はその塩を溶媒中、又は無溶媒で、必要であれば塩基を使用して反応させることによって式(1) [式中、Q、R³、W及びXは前記と同じ意味を表す。] で表される本発明化合物を製造することができる。

本反応では式(2) で表される化合物1当量に対して、式(3b) で表される化合物は、0.1から100当量の範囲で用いることができる。

[0170] 溶媒を用いる場合、用いられる溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド、アセトニトリル、ジメチルスルホキシド、1,3-ジメチル-2-イミダゾリノン等の極性溶媒、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、1,4-ジオキサン、1,2-ジメトキシエタン、ジフェニルエーテル等のエーテル類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、n-ペンタン、n-ヘキサン等の脂肪族炭化水素類が挙げられる。これらの溶媒は単独で用いても、これらの内の2種類以上を混合して用いてもよい。

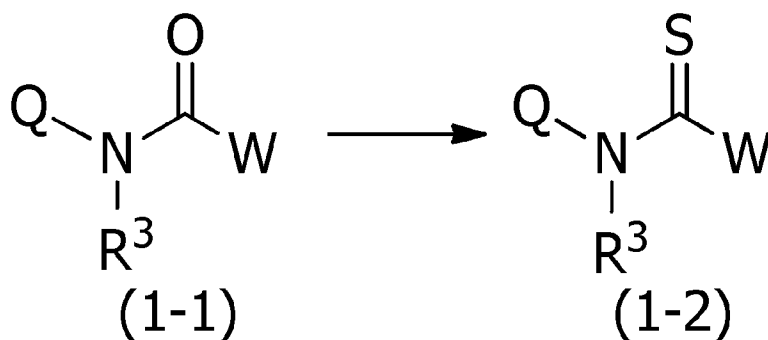
[0171] 塩基を用いる場合、用いられる塩基としては、トリエチルアミン、ピリジン、4-(ジメチルアミノ)ピリジン等の有機塩基、炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素カリウム、炭酸水素ナトリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基を使用することができ、式(2) で表される化合物1当量に対して0.1から50当量の範囲で用いることができる。これらの塩基は単独で用いても、これらの内の2種類以上を混合して用いてもよい。

[0172] 反応温度は、-78℃から反応混合物の還流温度までの任意の温度を設定することができ、反応時間は、反応基質の濃度、反応温度によって変化するが、通常5分から100時間の範囲で任意に設定できる。

[0173] 製造法C

式(1-2) [式中、W、Q及びR³は前記と同じ意味を表す。] で表される本発明化合物は、例えば、式(1-1) [式中、W、Q及びR³は前記と同じ意味を表す。] で表される本発明化合物と五硫化二磷、五硫化二磷-HMD O (ヘキサメチルジシロキサン)、ローソン試薬(Lawesson's Reagent; 2,4-ビス(4-メトキシフェニル)-1,3,2,4-ジチアジホスフェタン-2,4-ジスルフィド)等の硫化剤を反応させることにより製造することができる。

[化11]



[0174] 本反応で用いる硫化剤は、式(1-1)で表される化合物1当量に対して0.5～50当量の範囲で用いることができる。

必要ならば、炭酸カリウム、トリエチルアミン、ピリジン、4-(ジメチルアミノ)ピリジン等の塩基を使用することができる。

[0175] 本反応は、無溶媒でも実施することができるが、溶媒を用いてもよい。例えば、N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド、アセトニトリル、ジメチルスルホキシド、1,3-ジメチル-2-イミダゾリノン、水等の極性溶媒、メタノール、エタノール、プロパノール、2-プロパノール、エチレングリコール等のアルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジフェニルエーテル等のエーテル類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、ペンタン、n-ヘキサン等の脂肪族炭化水素類が挙げられる。これらの溶媒は単独で用いても、これらの内の2種類以上

を混合して用いてもよい。

反応温度は、 -60°C から反応混合物の還流温度までの任意の温度を設定することができ、反応時間は、反応基質の濃度、反応温度によって変化するが、通常5分から100時間の範囲で任意に設定できる。

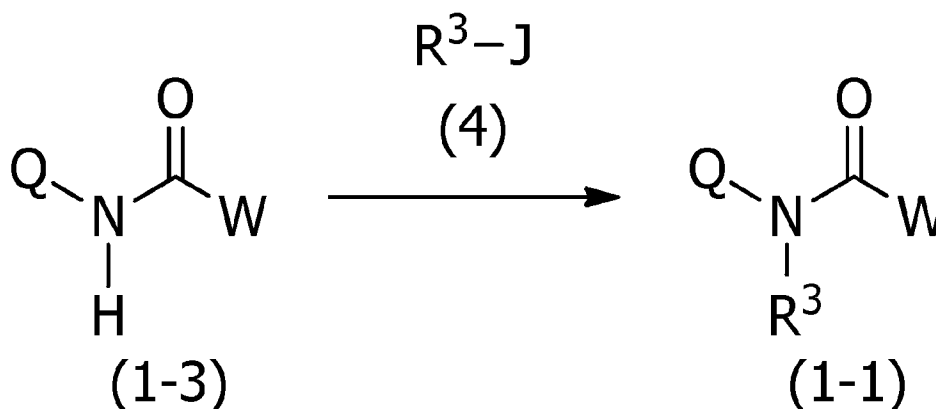
[0176] 製造法A～製造法Cにおいて、反応終了後の反応混合物は、直接濃縮、又は有機溶媒に溶解し、水洗後濃縮、又は氷水に投入、有機溶媒抽出後濃縮といった通常の後処理を行い、本発明化合物を得ることができる。また、精製の必要が生じたときには、再結晶、カラムクロマトグラフ、薄層クロマトグラフ、液体クロマトグラフ分取等の任意の精製方法によって分離、精製することができる。

式(3b)で表される化合物の或るものは、以下に示す反応式1によって合成することができる。

[0177] 製造法D

式(1-1)で表される複素環アミド化合物は、例えば、式(1-3)[式中、W及びQは前記と同じ意味を表す。]で表される化合物と式(4)[式中、 R^3 は前記と同じ意味を表し、Jはハロゲン原子、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{OSO}_2\text{Me}$ 、 $-\text{OSO}_2\text{CF}_3$ 等の脱離基を表す。]で表される化合物を反応させることにより製造することができる。

[化12]



[0178] 本反応は、式(1-3)で表される化合物1当量に対して、式(4)で表される化合物を、0.5～50当量の範囲で用いることができる。必要なら

ば塩酸、硫酸、p-トルエンスルホン酸等の酸、炭酸カリウム、トリエチルアミン、ピリジン、4-(ジメチルアミノ)ピリジン、水素化ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等の塩基を、又は、ジエチルアゾジカルボキシレート及びトリフェニルホスフィン等を使用する光延反応を使用することができる。

[0179] 本反応は、無溶媒でも実施することができるが、溶媒を用いてもよい。例えば、N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド、アセトニトリル、ジメチルスルホキシド、1,3-ジメチル-2-イミダゾリノン、水等の極性溶媒、メタノール、エタノール、プロパノール、2-プロパノール、エチレングリコール等のアルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジフェニルエーテル等のエーテル類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、ペンタン、n-ヘキサン等の脂肪族炭化水素類が挙げられる。これらの溶媒は単独で用いても、これらの内の2種類以上を混合して用いてもよい。

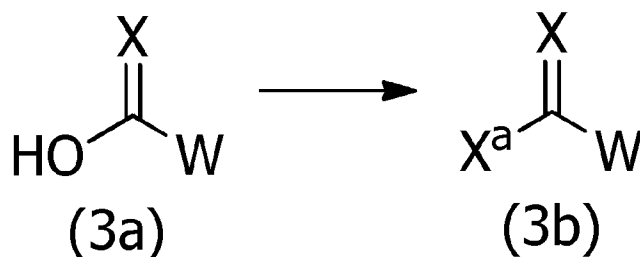
[0180] 反応温度は、-60℃から反応混合物の還流温度までの任意の温度を設定することができ、反応時間は、反応基質の濃度、反応温度によって変化するが、通常5分から100時間の範囲で任意に設定できる。

式(4)で表される化合物の或るものは公知化合物であり、一部は市販品として入手できる。また、それ以外のものも文献記載の公知の方法に準じて合成することができる。

[0181] 反応式1

式(3b)で表される化合物は、例えば、式(3a)で表される化合物とハロゲン化剤を反応させることにより製造することができる。

[化13]



[0182] 式(3a) [式中、W及びXは前記と同じ意味を表す。] で表される化合物又はその塩と、ハロゲン化剤を溶媒中、又は無溶媒で、必要であれば塩基を使用して反応させることによって式(3b) [式中、W、X及びX^aは前記と同じ意味を表す。] で表される化合物を製造することができる。

ハロゲン化剤としては、例えば塩化チオニル、塩化オキサリル、塩化ホスホリル等が挙げられる。ハロゲン化剤の当量としては、式(3a)で表される化合物1当量に対して、0.1から100当量の範囲で用いることができる。

[0183] 溶媒を用いる場合、用いられる溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド、アセトニトリル、ジメチルスルホキシド、1,3-ジメチル-2-イミダゾリノン等の極性溶媒、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、1,4-ジオキサン、1,2-ジメトキシエタン、ジフェニルエーテル等のエーテル類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、n-ペンタン、n-ヘキサン等の脂肪族炭化水素類が挙げられる。これらの溶媒は単独で用いても、これらの内の2種類以上を混合して用いてもよい。

[0184] 塩基を用いる場合、用いられる塩基としては、トリエチルアミン、ピリジン、4-(ジメチルアミノ)ピリジン等の有機塩基、炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素カリウム、炭酸水素ナトリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基を使用することができ、式(3a)で表される化合物1当量に対し

て0.1から50当量の範囲で用いることができる。これらの塩基は単独で用いても、これらの内の2種類以上を混合して用いてもよい。

[0185] 反応温度は、 -78°C から反応混合物の還流温度までの任意の温度を設定することができ、反応時間は、反応基質の濃度、反応温度によって変化するが、通常5分から100時間の範囲で任意に設定できる。

反応終了後、通常の後処理を行うことにより製造法Bの原料化合物となる製造中間体を得ることができる。

また、この方法により製造された製造中間体は、単離・精製することなく、そのまま次工程の反応に用いることもできる。

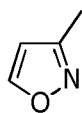
[0186] 本発明に包含される活性化合物としては、具体的に例えば第1表乃至第3表に示す化合物が挙げられる。但し、第1表乃至第3表の化合物は例示のためのものであって、本発明はこれらだけに限定されるものではない。尚、表中、Meと記載される置換基はメチル基を表し、以下、Etとの記載はエチル基を表し、n-Pr及びPr-nはノルマルプロピル基を、i-Pr及びPr-iはイソプロピル基を、c-Pr及びPr-cはシクロプロピル基を、n-Bu及びBu-nはノルマルブチル基を、s-Bu及びBu-sはセカンダリーブチル基を、i-Bu及びBu-iはイソブチル基を、t-Bu及びBu-tはターシャリーブチル基を、c-Bu及びBu-cはシクロブチル基を、n-Pen及びPen-nはノルマルペンチル基を、i-Pen及びPen-iはイソペンチル基を、s-Pen及びPen-sはセカンダリーペンチル基を、t-Pen及びPen-tはターシャリーペンチル基を、c-Pen及びPen-cはシクロペンチル基を、3-Penは $-\text{CH}(\text{Et})_2$ 基を、n-Hex及びHex-nはノルマルヘキシル基を、c-Hex及びHex-cはシクロヘキシル基を、Phはフェニル基をそれぞれ表す。

[0187] 表中、D-3、D-3a、D-4、D-4a、D-4b、D-8、D-8a、D-8b、D-8c、D-8d、D-8e、D-8f、D-8g、D-8h、D-9、D-9a、D-9b、D-9c、D-9d、D-9e、D-

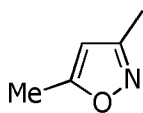
9 f、D-9 g、D-9 h、D-9 i、D-9 j、D-9 k、D-9 m、D-10 a、D-11、D-12、D-13 a、D-14、D-15、D-16、D-16 a、D-16 b、D-16 c、D-16 d、D-16 e、D-16 f、D-16 g、D-16 h、D-16 i、D-16 j、D-16 k、D-16 m、D-16 n、D-16 p、D-17、D-17 a、D-17 b、D-18、D-19、D-21、D-24 a、D-24 b、D-24 c、D-24 d、D-24 e 及び D-24 f で表される構造は下記の構造を表す。

[0188]

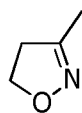
[化14]



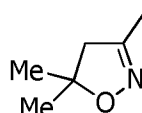
D-3



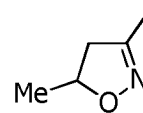
D-3a



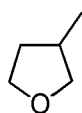
D-4



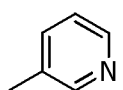
D-4a



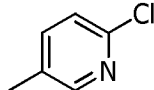
D-4b



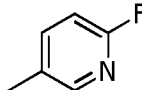
D-5



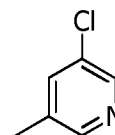
D-8



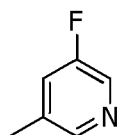
D-8a



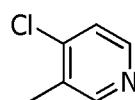
D-8b



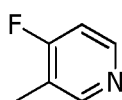
D-8c



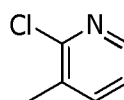
D-8d



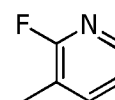
D-8e



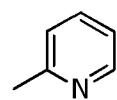
D-8f



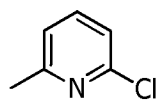
D-8g



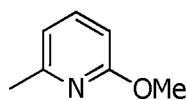
D-8h



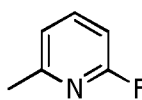
D-9



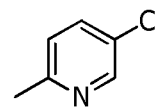
D-9a



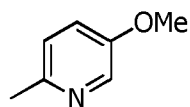
D-9b



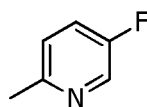
D-9c



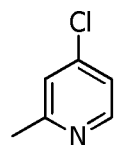
D-9d



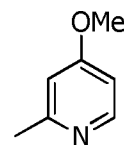
D-9e



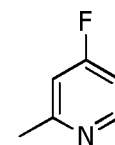
D-9f



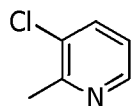
D-9g



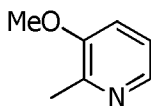
D-9h



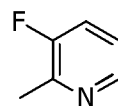
D-9i



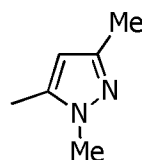
D-9j



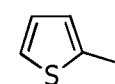
D-9k



D-9m

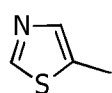


D-10a

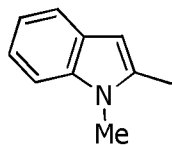


D-11

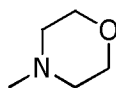
[化15]



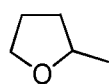
D-12



D-13a



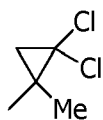
D-14



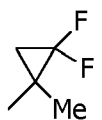
D-15



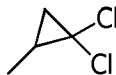
D-16



D-16a



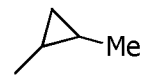
D-16b



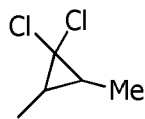
D-16c



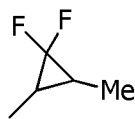
D-16d



D-16e



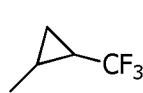
D-16f



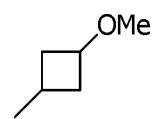
D-16g



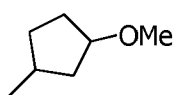
D-16h



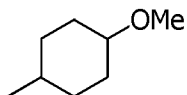
D-16i



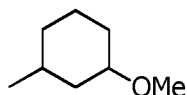
D-16j



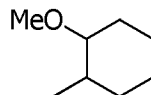
D-16k



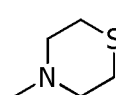
D-16m



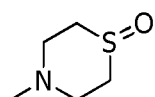
D-16n



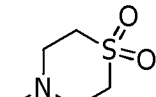
D-16p



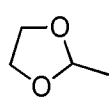
D-17



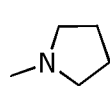
D-17a



D-17b



D-18



D-19



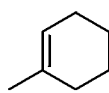
D-24a



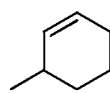
D-24b



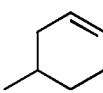
D-24c



D-24d



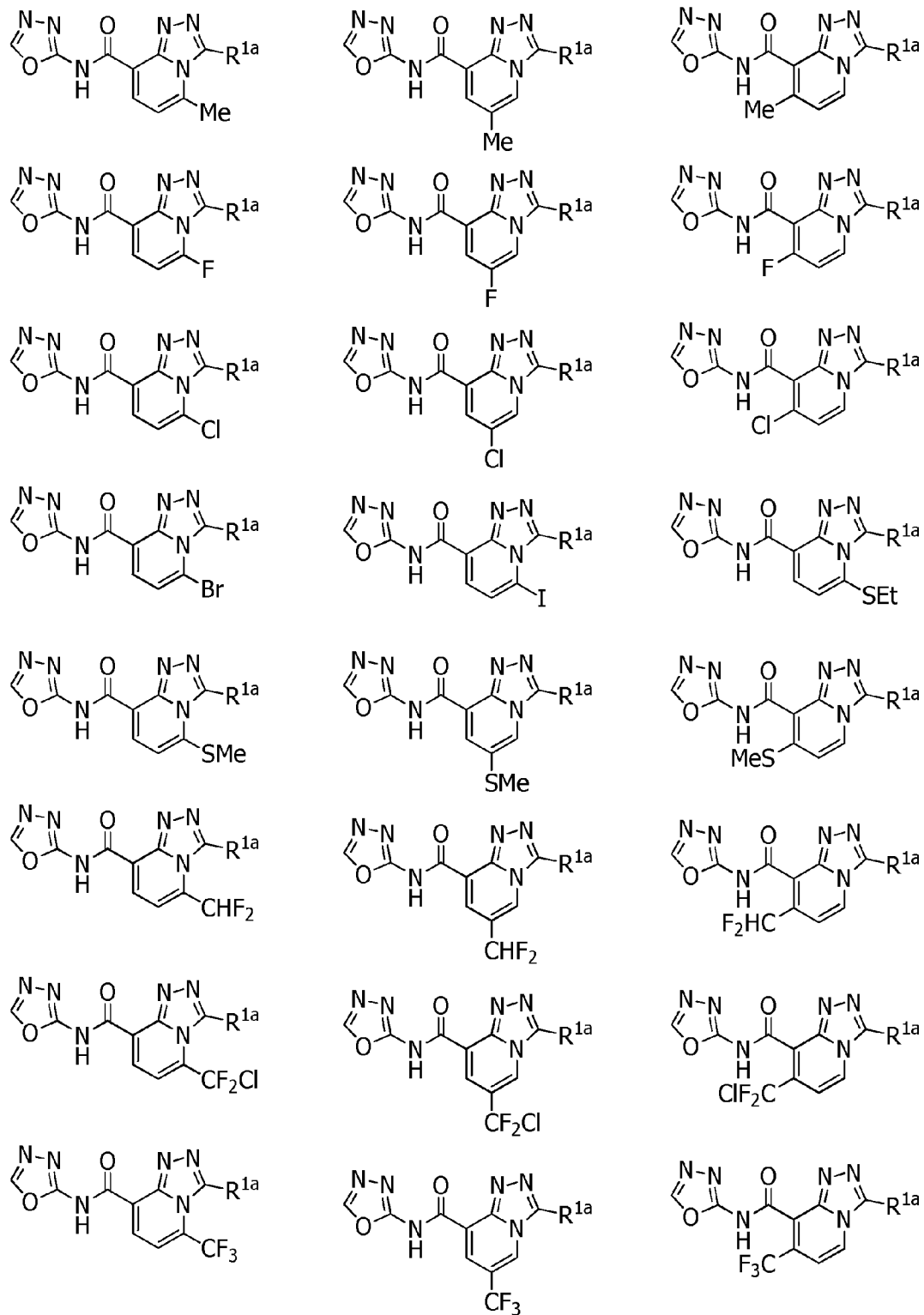
D-24e



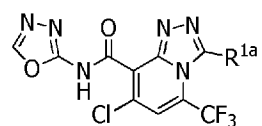
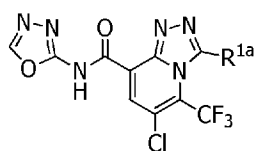
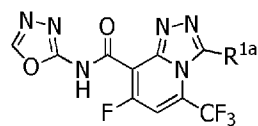
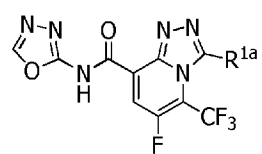
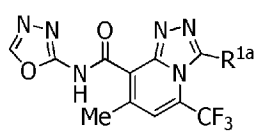
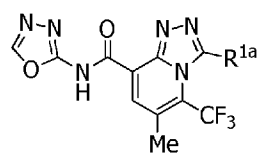
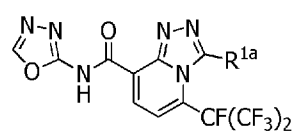
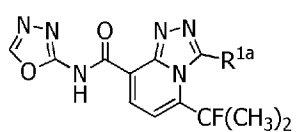
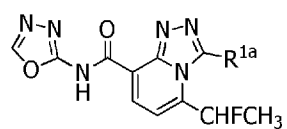
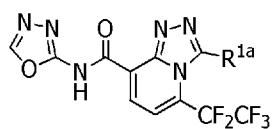
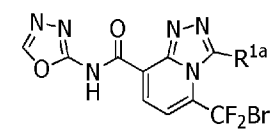
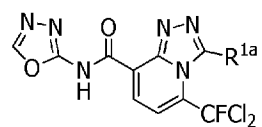
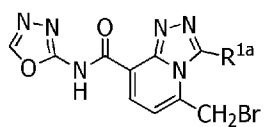
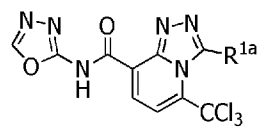
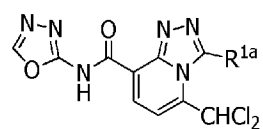
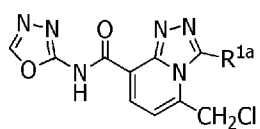
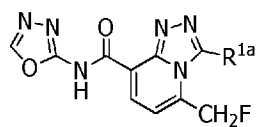
D-24f

[0189] [第1表]

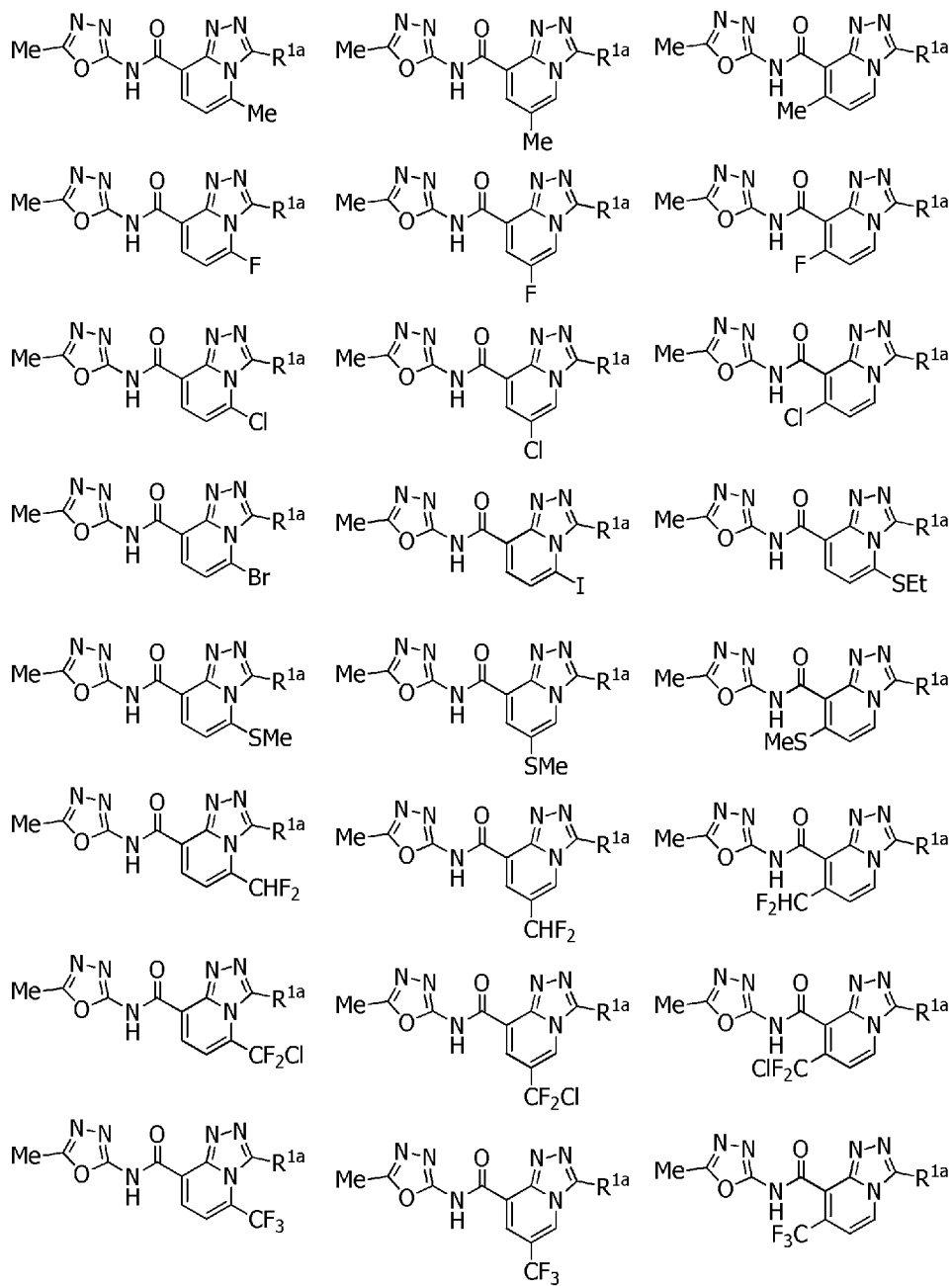
[化16]



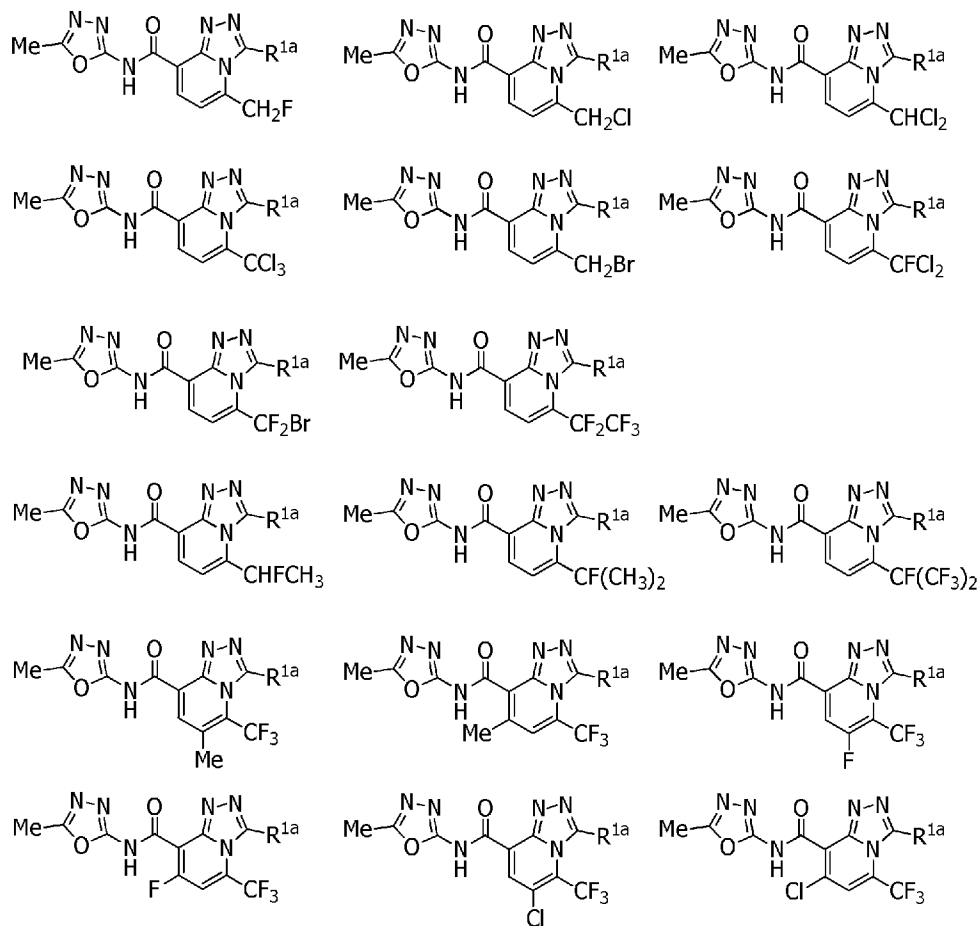
[化17]



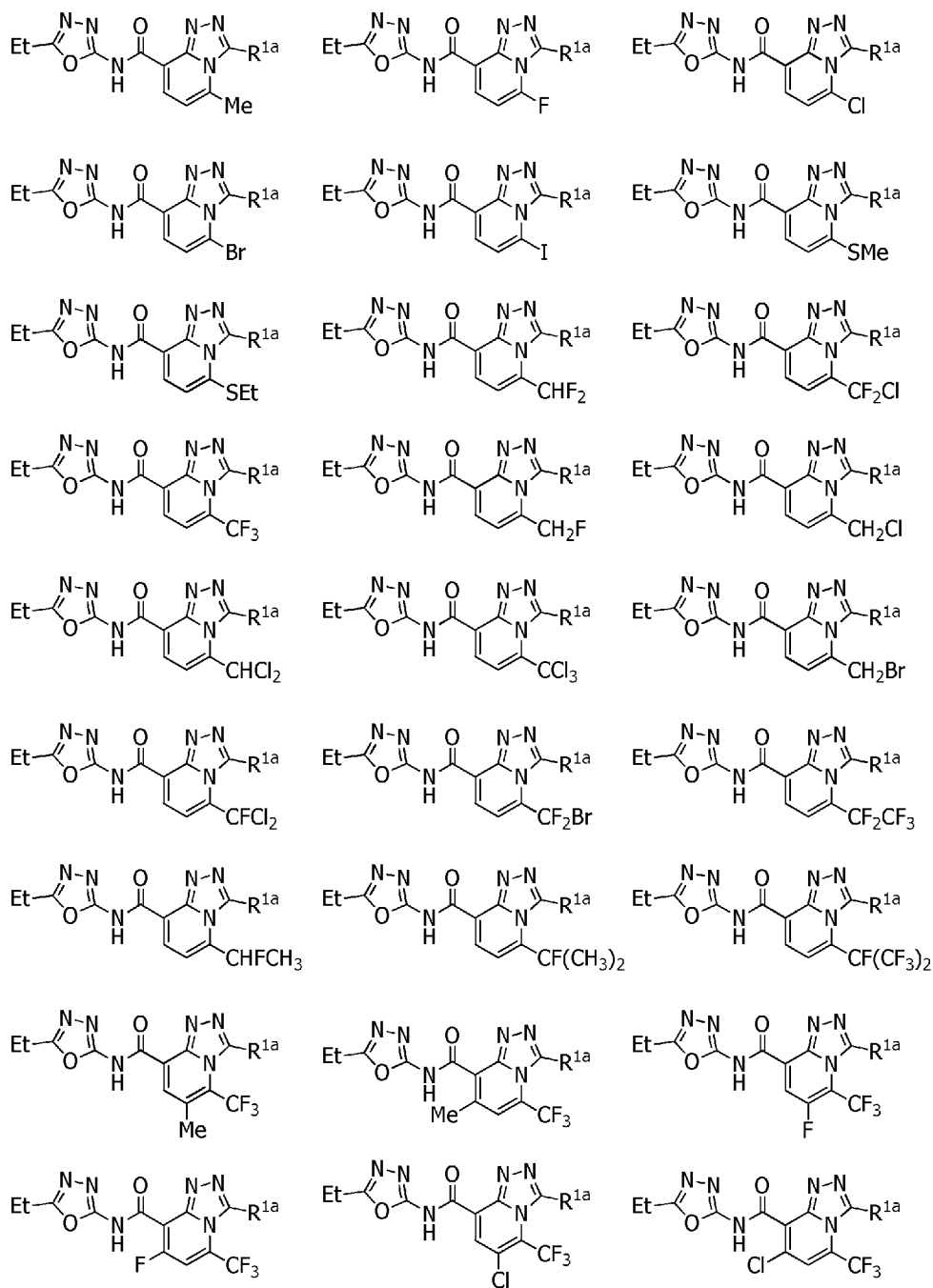
[化18]



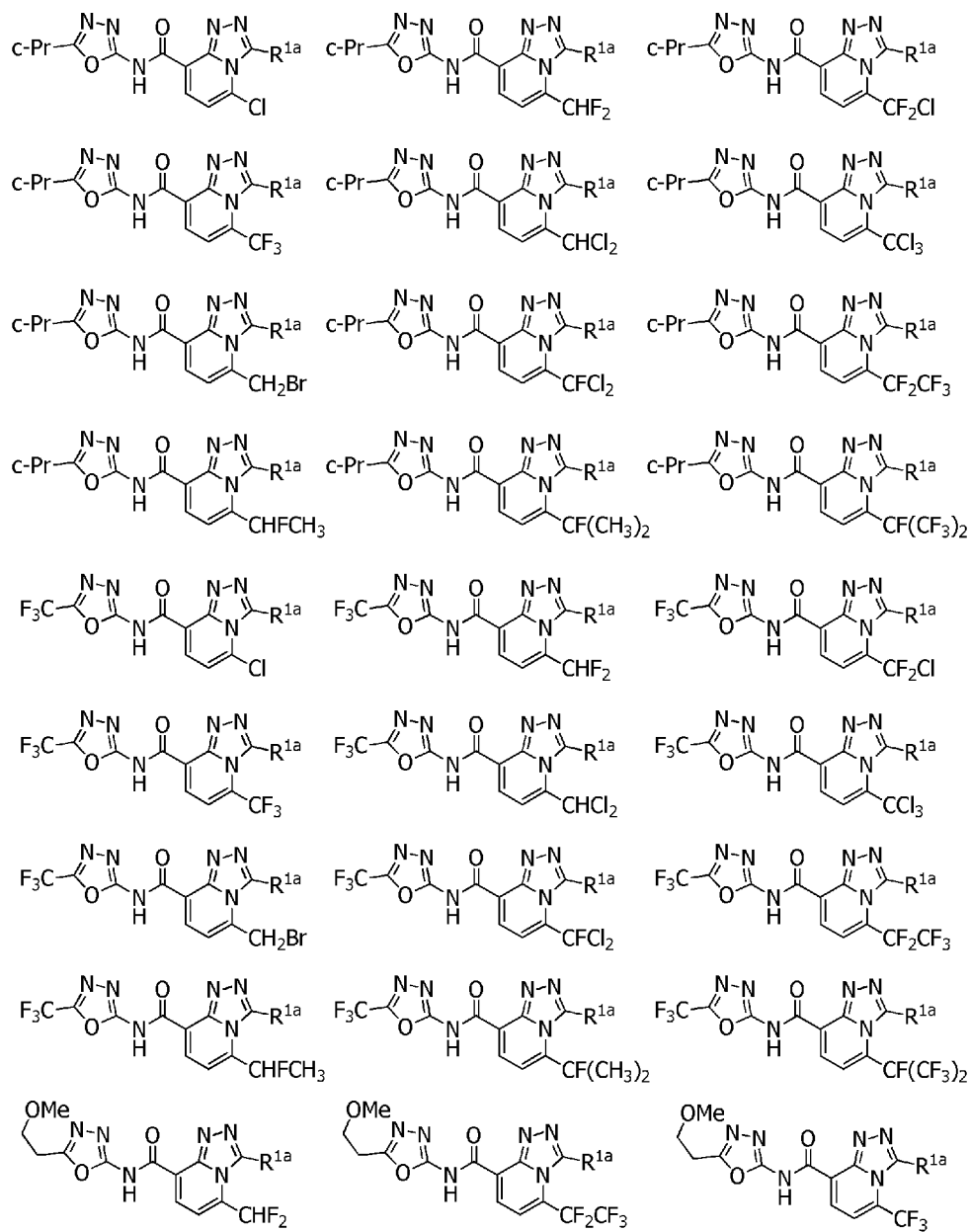
[化19]



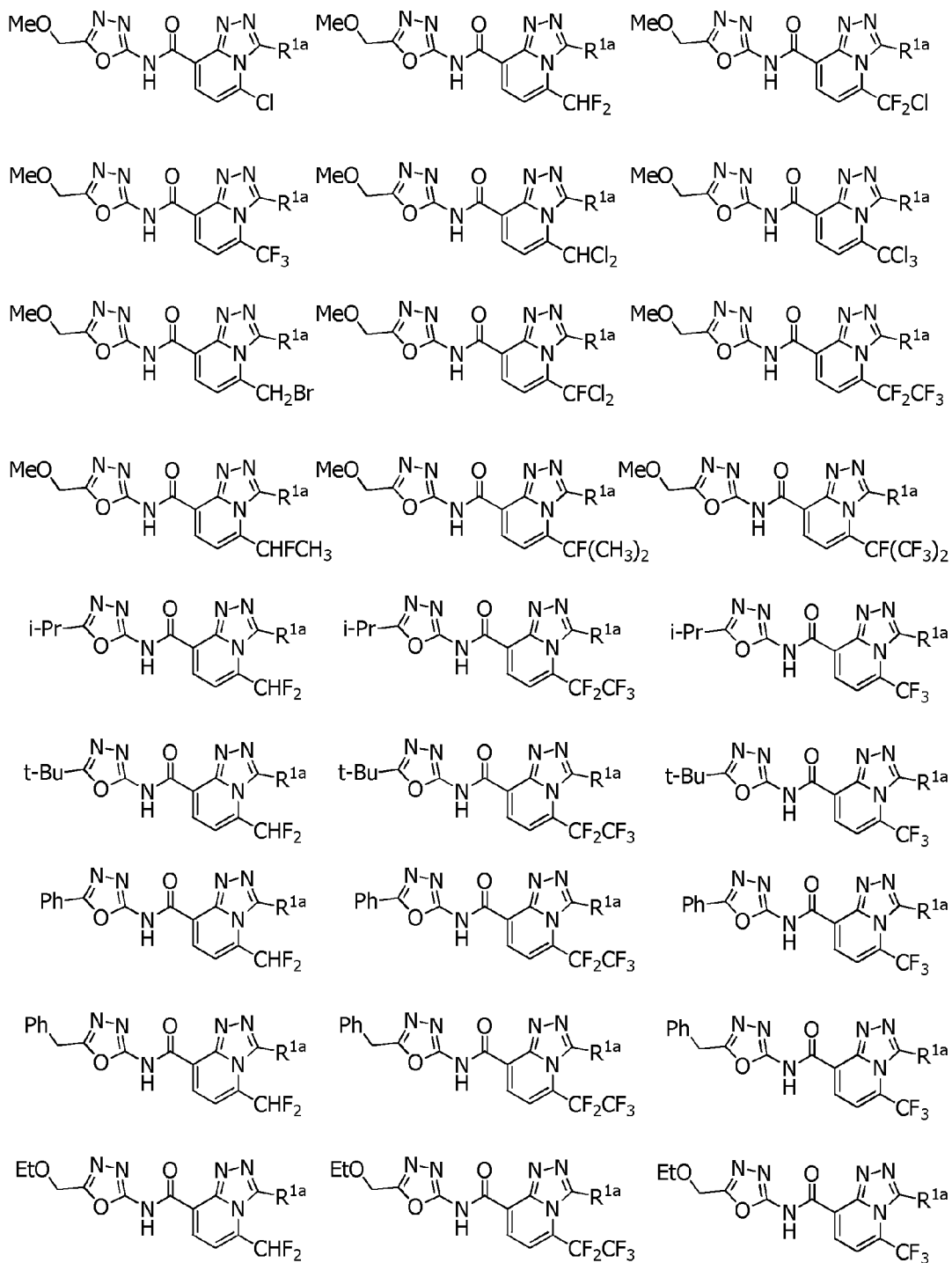
[化20]



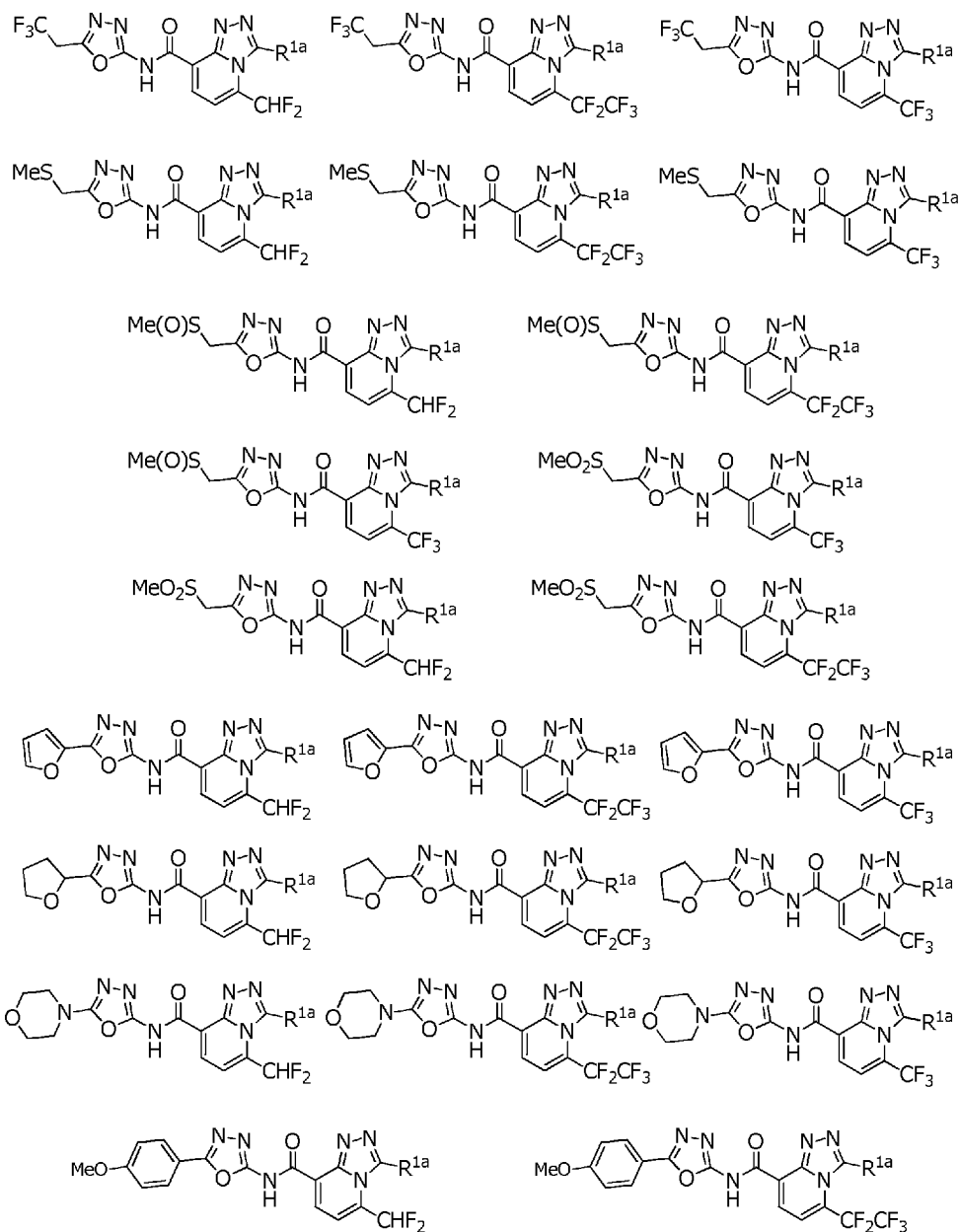
[化21]



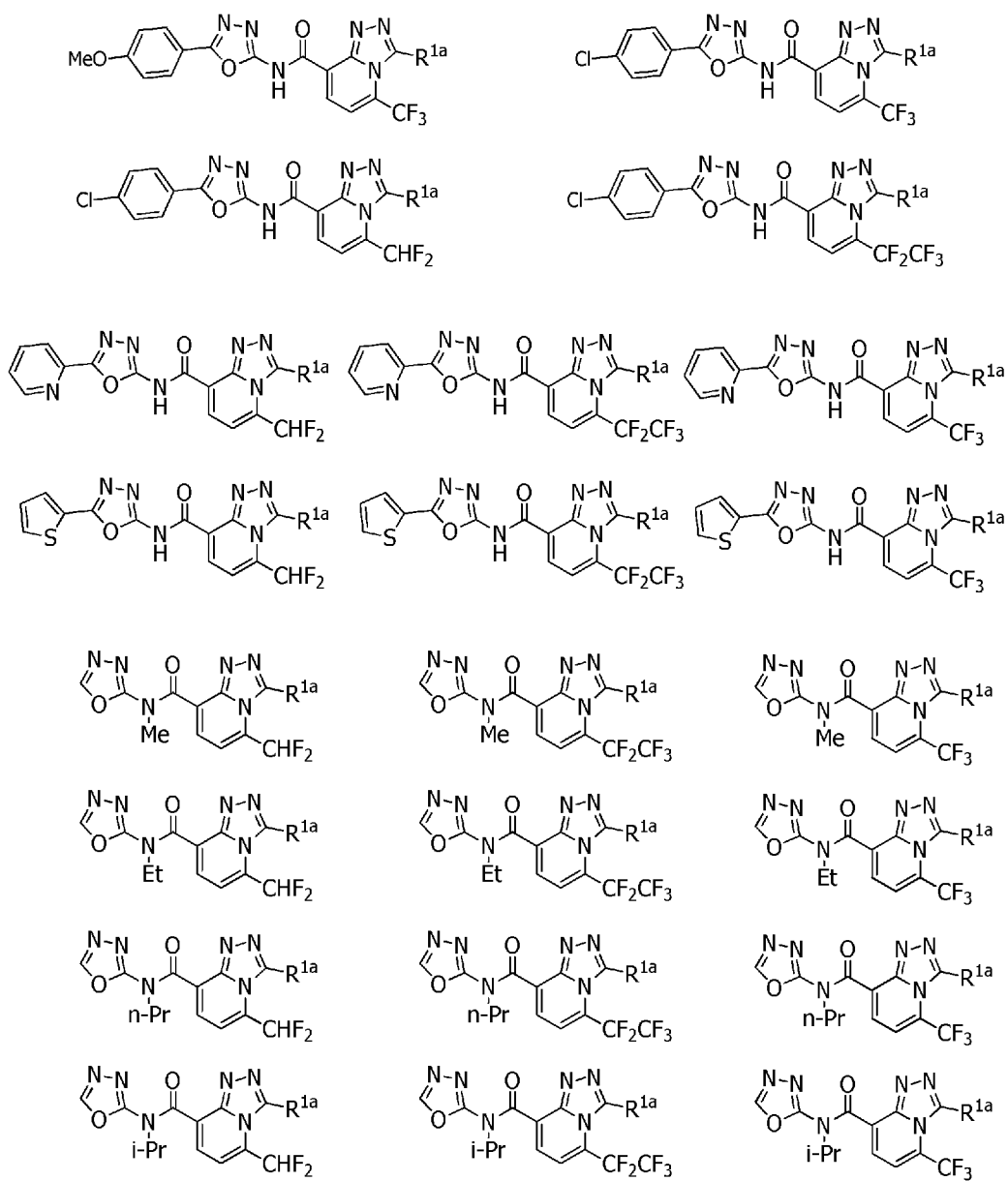
[化22]



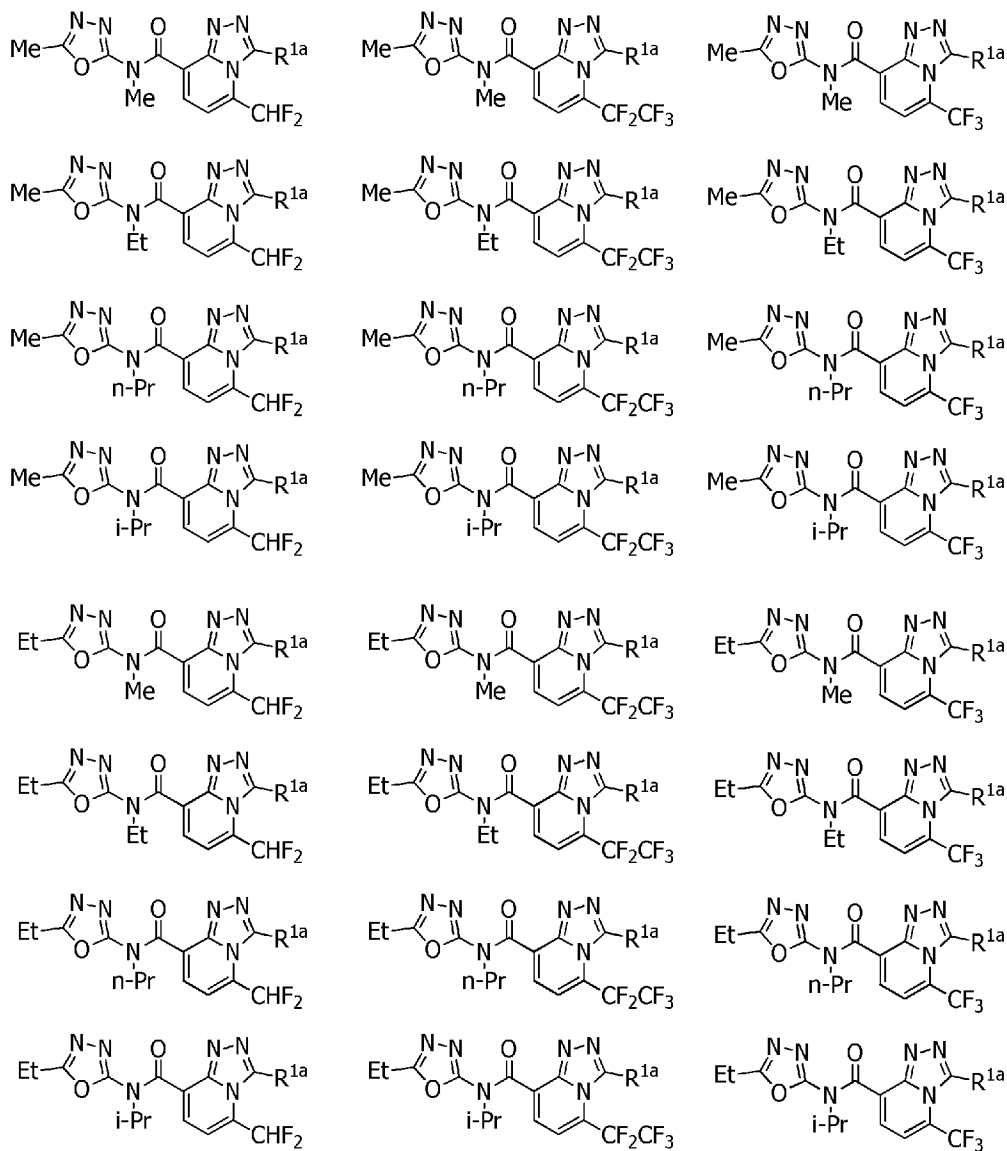
[化23]



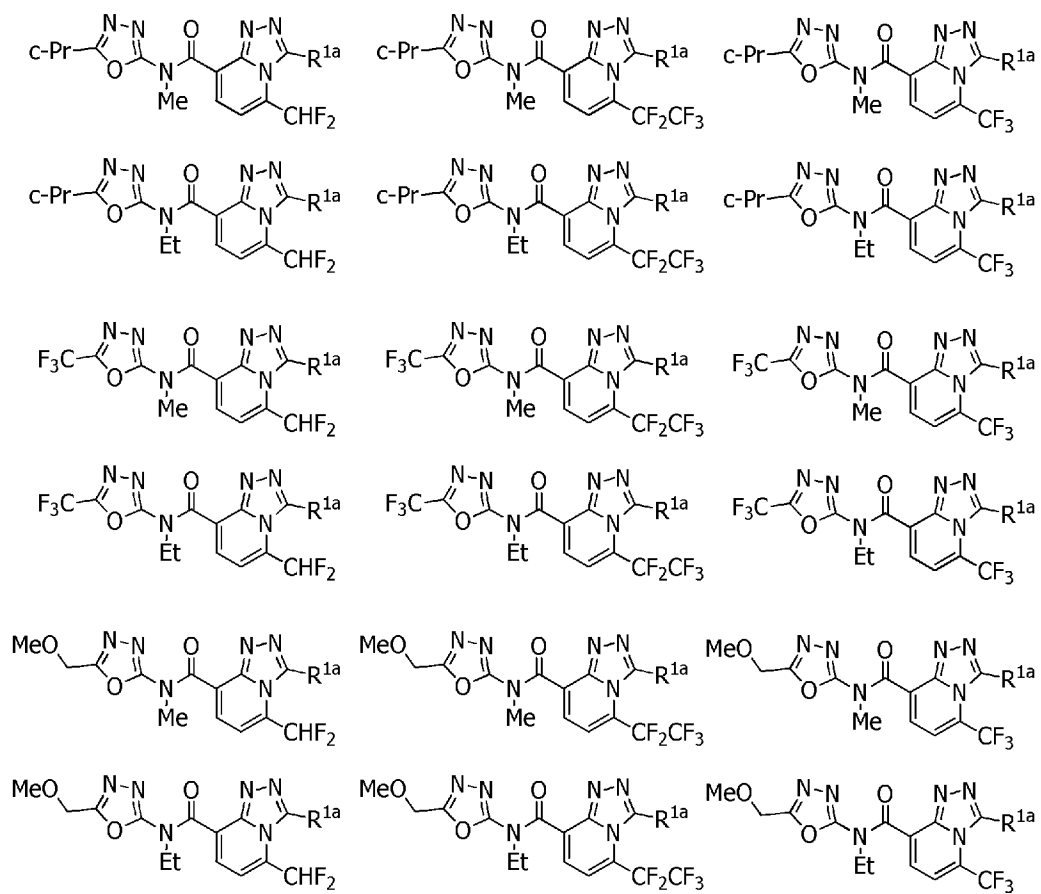
[化24]



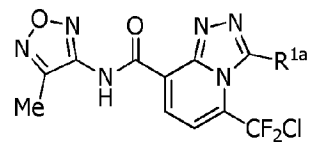
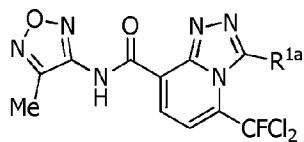
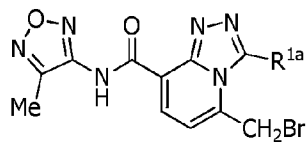
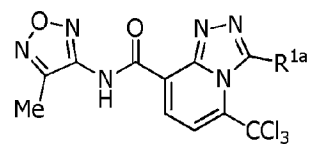
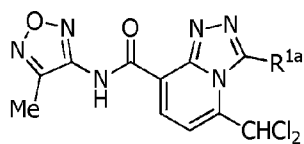
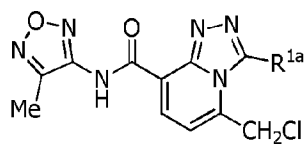
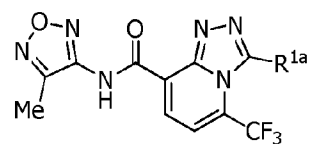
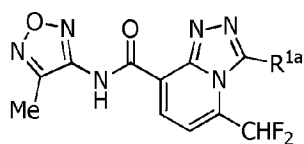
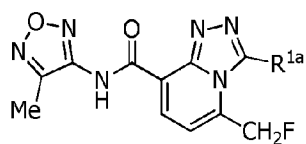
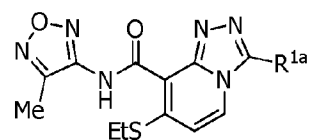
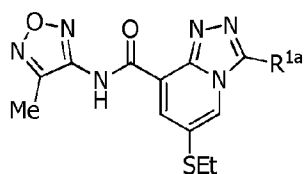
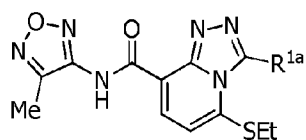
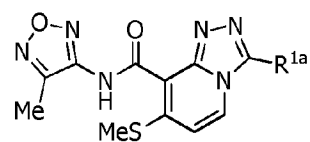
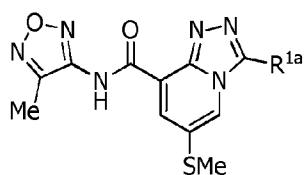
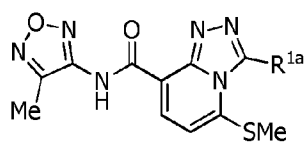
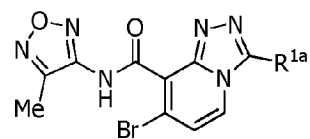
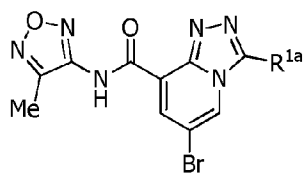
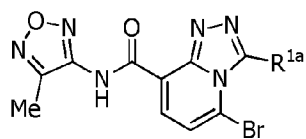
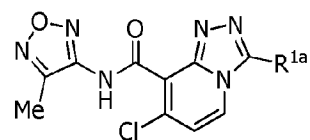
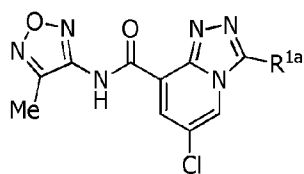
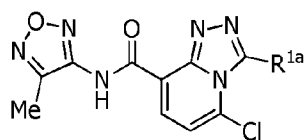
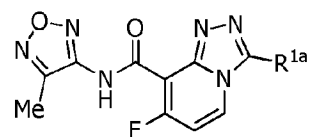
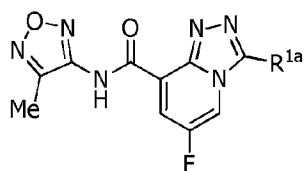
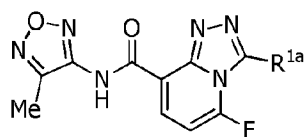
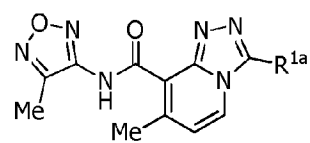
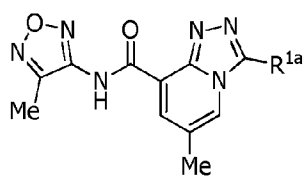
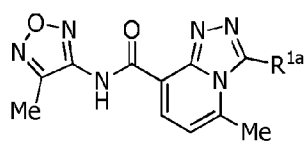
[化25]



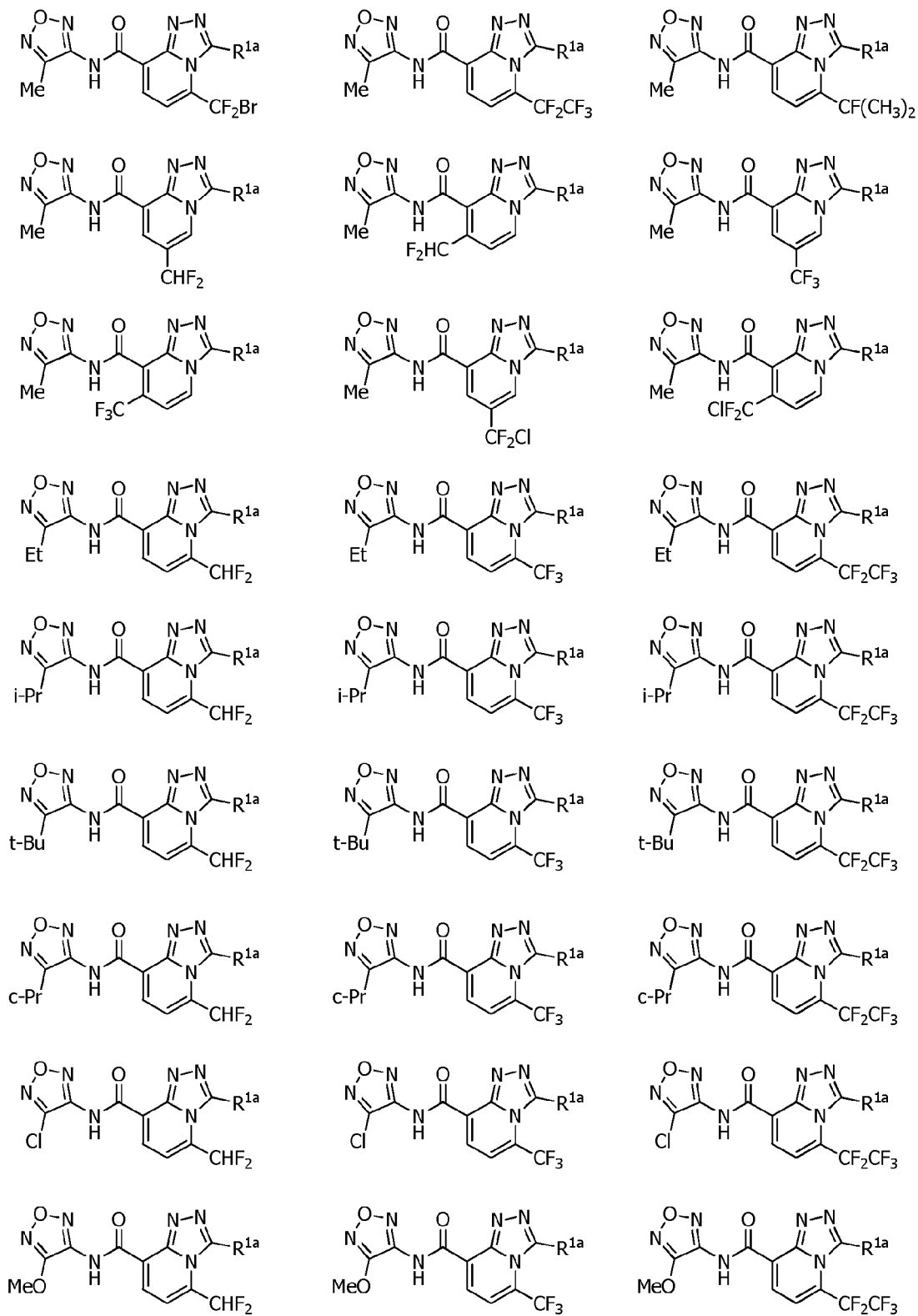
[化26]



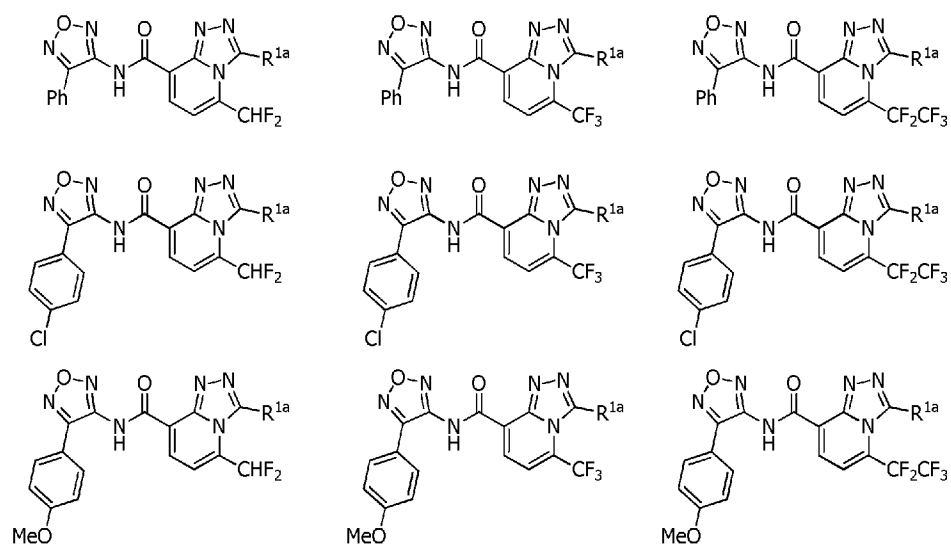
[化27]



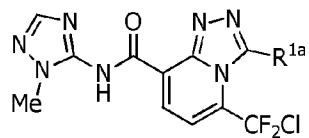
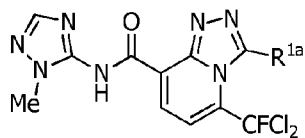
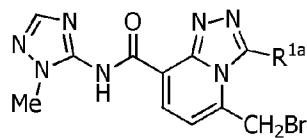
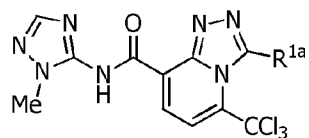
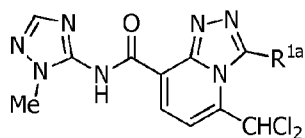
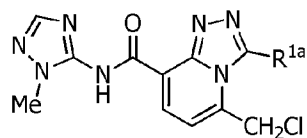
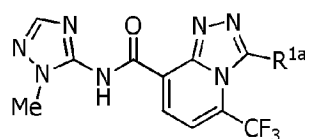
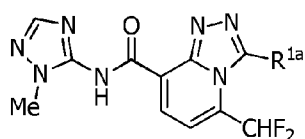
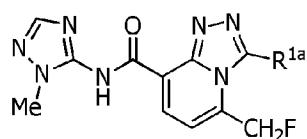
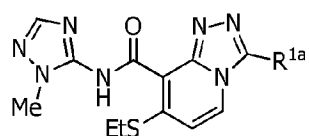
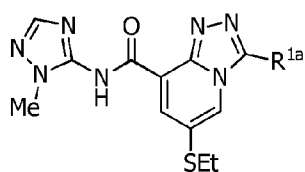
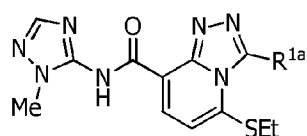
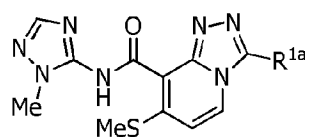
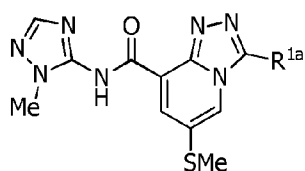
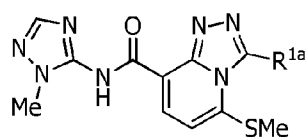
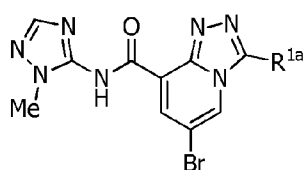
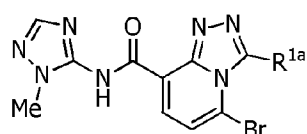
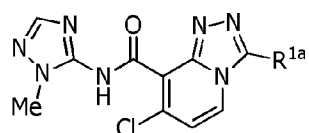
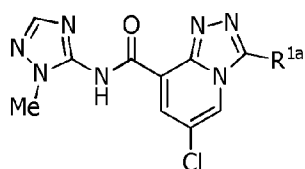
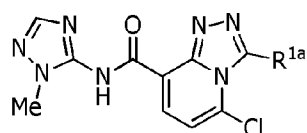
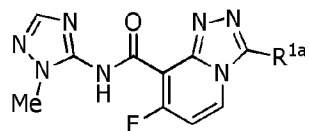
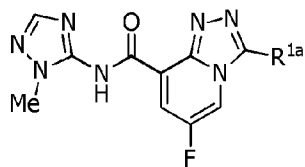
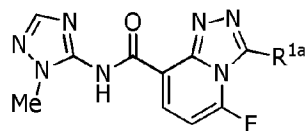
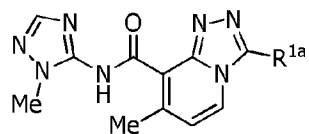
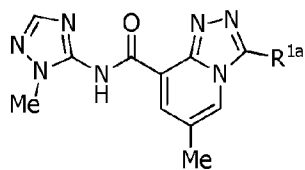
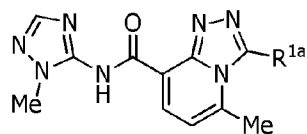
[化28]



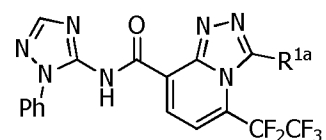
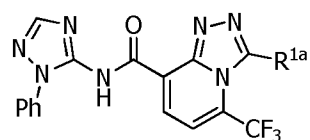
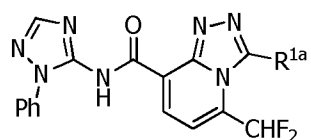
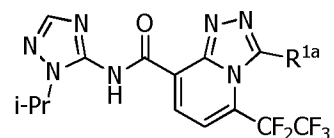
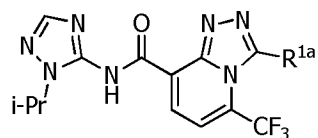
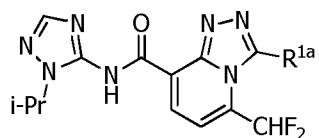
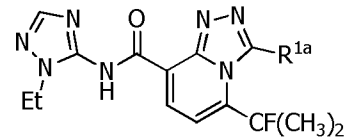
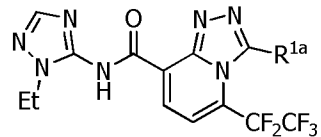
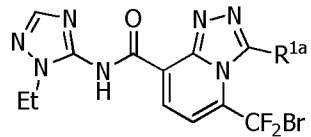
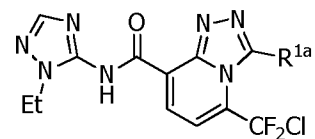
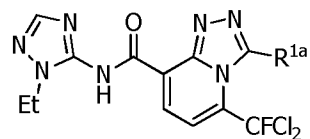
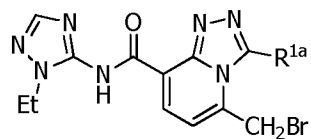
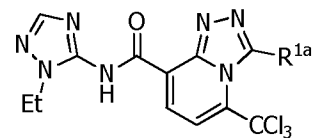
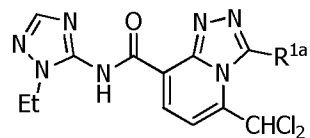
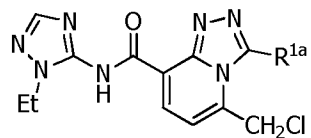
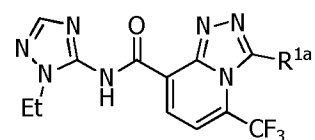
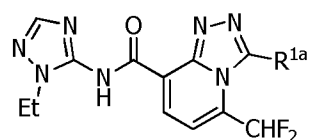
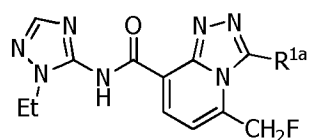
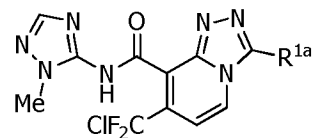
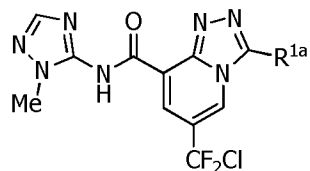
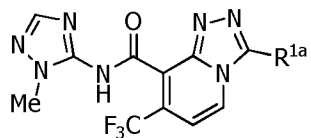
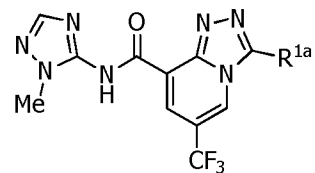
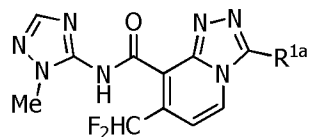
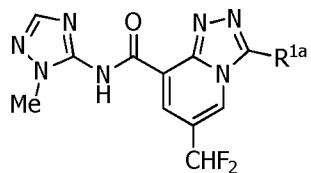
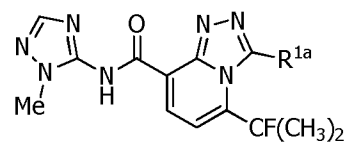
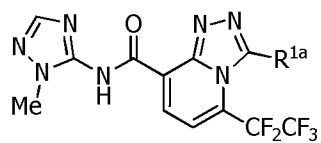
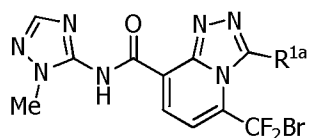
[化29]



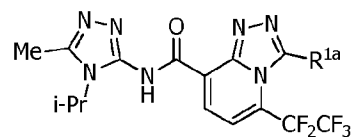
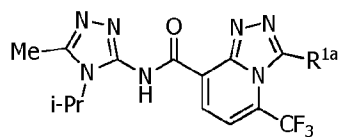
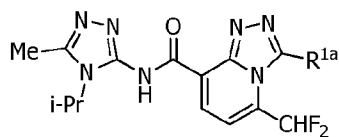
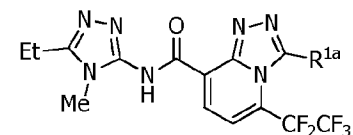
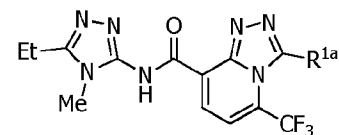
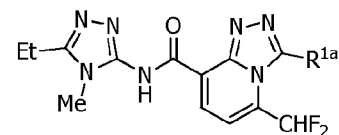
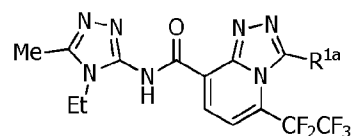
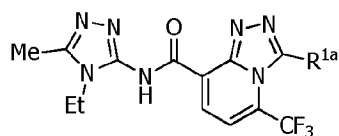
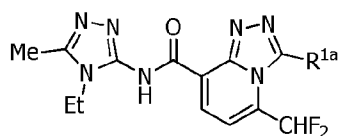
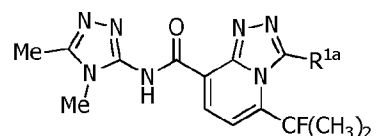
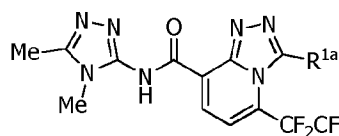
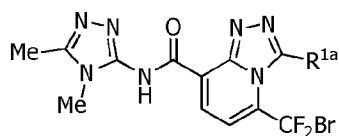
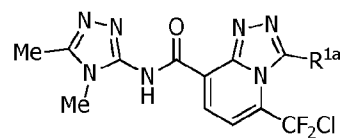
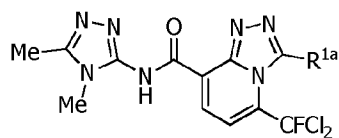
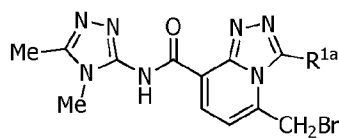
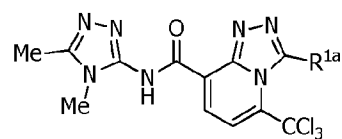
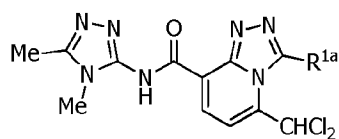
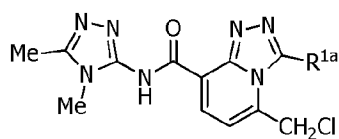
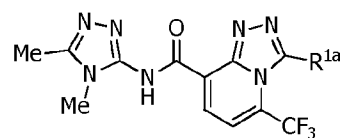
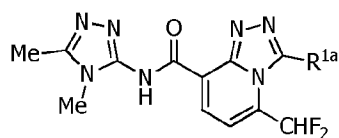
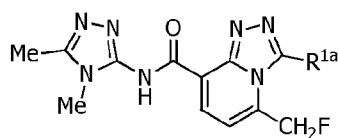
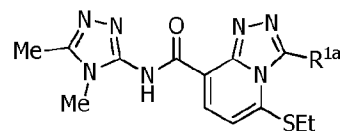
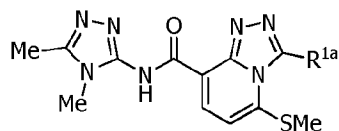
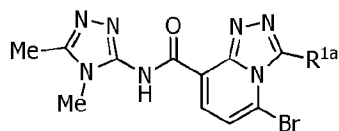
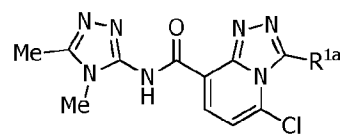
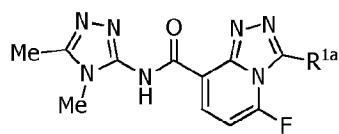
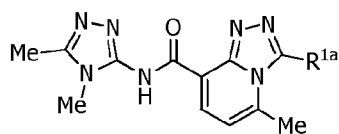
[化30]



[化31]



[化32]



[表1]

R ^{1a}	R ^{1a}	R ^{1a}
H	CH ₂ CF ₃	C(Me) ₂ CH ₂ CN
F	(CH ₂) ₃ Cl	CH ₂ Pr-c
Cl	(CH ₂) ₃ Br	CH ₂ (D-16)
Br	(CH ₂) ₂ CF ₃	CH ₂ (D-16d)
I	CHFCH ₃	CH ₂ Bu-c
Me	CF ₂ CH ₃	CH ₂ Pen-c
Et	CF(CH ₃) ₂	CH ₂ Hex-c
Pr-n	CF ₂ CF ₂ H	CH(Me)Pr-c
Pr-i	CF ₂ CF ₃	CH(Me)(D-16)
Pr-c	CF ₂ CF ₂ CF ₃	CH(Me)(D-16e)
Bu-n	CF(CF ₃)	CH(Me)Bu-c
Bu-i	CH(Me)Cl	CH(Me)Pen-c
Bu-c	CH(Me)Br	CH(Me)Hex-c
Bu-s	CH(Et)Cl	(CH ₂) ₂ Pr-c
Bu-t	CH(Et)Br	(CH ₂) ₂ (D-16)
Pen-n	CH(Pr-n)Cl	(CH ₂) ₂ (D-16e)
Pen-i	CH(Pr-n)Br	(CH ₂) ₂ Bu-c
Pen-c	CH(Pr-i)Cl	(CH ₂) ₂ Pen-c
Pen-s	CH(Pr-i)Br	(CH ₂) ₂ Hex-c
Pen-t	C(Me) ₂ Cl	CH ₂ OMe
3-Pen	C(Me) ₂ Br	CH ₂ OEt
Hex-n	CH(Me)CH ₂ Cl	CH ₂ OPr-n
Hex-c	CH(Me)CH ₂ Br	CH ₂ OPr-i
CH ₂ Cl	C(Me) ₂ CH ₂ Cl	CH ₂ OBu-n
CH ₂ Br	C(Me) ₂ CH ₂ Br	CH ₂ OBu-i
CHBr ₂	CH ₂ CN	CH ₂ OBu-s
CF ₂ H	(CH ₂) ₂ CN	CH ₂ OBu-t
CF ₂ Cl	(CH ₂) ₃ CN	CH ₂ OPen-n
CF ₂ Br	CH(Me)CN	CH ₂ OPen-i
CF ₃	CH(Et)CN	CH ₂ OPen-s
(CH ₂) ₂ Cl	CH(Pr-n)CN	CH ₂ OPen-t
(CH ₂) ₂ Br	CH(Pr-i)CN	CH ₂ OHex-n
CH ₂ CF ₂ H	C(Me) ₂ CN	CH(Me)OMe
CH ₂ CF ₂ Cl	CH(Me)CH ₂ CN	CH(Me)OEt
CH ₂ CF ₂ Br	CH(Et)CH ₂ CN	CH(Me)OPr-n

[表2]

R ^{1a}	R ^{1a}	R ^{1a}
CH(Me)OPr-i	C(Me) ₂ OBu-n	CH ₂ O(CH ₂) ₂ Cl
CH(Me)OBu-n	C(Me) ₂ OBu-i	CH ₂ O(CH ₂) ₂ Br
CH(Me)OBu-i	C(Me) ₂ OBu-s	CH(Me)OCF ₂ H
CH(Me)OBu-s	C(Me) ₂ OBu-t	CH(Me)OCF ₃
CH(Me)OBu-t	(CH ₂) ₂ OMe	CH(Me)OCH ₂ CF ₂ H
CH(Me)OPen-n	(CH ₂) ₂ OEt	CH(Me)OCH ₂ CF ₃
CH(Me)OPen-i	(CH ₂) ₂ OPr-n	CH(Me)O(CH ₂) ₂ CF ₃
CH(Me)OPen-s	(CH ₂) ₂ OPr-i	CH(Me)O(CH ₂) ₂ Cl
CH(Me)OPen-t	(CH ₂) ₂ OBu-n	CH(Me)O(CH ₂) ₂ Br
CH(Me)OHex-n	(CH ₂) ₂ OBu-i	CH(Et)OCF ₂ H
CH(Et)OMe	(CH ₂) ₂ OBu-s	CH(Et)OCF ₃
CH(Et)OEt	(CH ₂) ₂ OBu-t	CH(Et)OCH ₂ CF ₂ H
CH(Et)OPr-n	CH(Me)CH ₂ OMe	CH(Et)OCH ₂ CF ₃
CH(Et)OPr-i	CH(Me)CH ₂ OEt	CH(Et)O(CH ₂) ₂ CF ₃
CH(Et)OBu-n	CH(Me)CH ₂ OPr-n	CH(Et)O(CH ₂) ₂ Cl
CH(Et)OBu-i	CH(Me)CH ₂ OPr-i	CH(Et)O(CH ₂) ₂ Br
CH(Et)OBu-s	CH(Me)CH ₂ OBu-n	C(Me) ₂ OCF ₂ H
CH(Et)OBu-t	CH(Me)CH ₂ OBu-i	C(Me) ₂ OCF ₃
CH(Et)OPen-n	CH(Me)CH ₂ OBu-s	C(Me) ₂ OCH ₂ CF ₂ H
CH(Et)OPen-i	CH(Me)CH ₂ OBu-t	C(Me) ₂ OCH ₂ CF ₃
CH(Et)OPen-s	CH(Et)CH ₂ OMe	C(Me) ₂ O(CH ₂) ₂ CF ₃
CH(Et)OPen-t	CH(Et)CH ₂ OEt	C(Me) ₂ O(CH ₂) ₂ Cl
CH(Et)OHex-n	(CH ₂) ₃ OMe	C(Me) ₂ O(CH ₂) ₂ Br
CH(Pr-n)OMe	(CH ₂) ₃ OEt	(CH ₂) ₂ OCF ₃
CH(Pr-n)OEt	(CH ₂) ₃ OPr-n	(CH ₂) ₂ OCH ₂ CF ₂ H
CH(Pr-n)OPr-n	(CH ₂) ₃ OPr-i	(CH ₂) ₂ OCH ₂ CF ₃
CH(Pr-n)OPr-i	(CH ₂) ₃ OBu-n	(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂ Cl
CH(Pr-i)OMe	(CH ₂) ₃ OBu-i	(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂ Br
CH(Pr-i)OEt	(CH ₂) ₃ OBu-s	CH ₂ OH
CH(Pr-i)OPr-n	(CH ₂) ₃ OBu-t	CH(Me)OH
CH(Pr-i)OPr-i	CH ₂ OCF ₂ H	CH(Et)OH
C(Me) ₂ OMe	CH ₂ OCF ₃	CH(iPr)OH
C(Me) ₂ OEt	CH ₂ OCH ₂ CF ₂ H	C(Me) ₂ OH
C(Me) ₂ OPr-n	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	(CH ₂) ₂ OH
C(Me) ₂ OPr-i	CH ₂ O(CH ₂) ₂ CF ₃	CH(Me)CH ₂ OH

[表3]

R ^{1a}	R ^{1a}	R ^{1a}
(CH ₂) ₃ OH	C(Me) ₂ O(CH ₂) ₂ OPr-n	CH(Me)OC(O)Pr-i
CH ₂ OCH ₂ OMe	C(Me) ₂ O(CH ₂) ₂ OPr-i	CH(Et)OC(O)Me
CH ₂ OCH ₂ OEt	(CH ₂) ₂ OCH ₂ OMe	CH(Et)OC(O)Et
CH ₂ OCH ₂ OPr-n	(CH ₂) ₂ OCH ₂ OEt	CH(Et)OC(O)Pr-i
CH ₂ OCH ₂ OPr-i	(CH ₂) ₂ OCH ₂ OPr-n	CH ₂ OPh
CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	(CH ₂) ₂ OCH ₂ OPr-i	CH(Me)OPh
CH ₂ O(CH ₂) ₂ OEt	(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	CH ₂ C(O)OH
CH ₂ O(CH ₂) ₂ OPr-n	(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂ OEt	CH ₂ C(O)OMe
CH ₂ O(CH ₂) ₂ OPr-i	(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂ OPr-n	CH ₂ C(O)OEt
CH ₂ OCH(Me)CH ₂ OMe	(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂ OPr-i	CH ₂ C(O)OPr-n
CH ₂ OCH(Me)CH ₂ OEt	CH(Me)CH ₂ OCH ₂ OMe	CH ₂ C(O)OPr-i
CH ₂ OCH ₂ CH(Me)OMe	CH(Me)CH ₂ OCH ₂ OEt	CH ₂ C(O)OBu-n
CH ₂ OCH ₂ CH(Me)OEt	CH(Me)CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	CH ₂ C(O)OBu-i
CH ₂ OCH(Me)OMe	CH(Me)CH ₂ O(CH ₂) ₂ OEt	CH ₂ C(O)OBu-s
CH ₂ OCH(Me)OEt	CH(Et)CH ₂ OCH ₂ OMe	CH ₂ C(O)OBu-t
CH ₂ O(CH ₂) ₃ OMe	CH(Et)CH ₂ OCH ₂ OEt	CH ₂ C(O)OPen-n
CH ₂ O(CH ₂) ₃ OEt	CH(Et)CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	CH ₂ C(O)OPen-i
CH(Me)OCH ₂ OMe	CH(Et)CH ₂ O(CH ₂) ₂ OEt	CH ₂ C(O)OPen-s
CH(Me)OCH ₂ OEt	CH(Et)O(CH ₂) ₂ OMe	CH ₂ C(O)OPen-t
CH(Me)OCH ₂ OPr-n	CH(Et)O(CH ₂) ₂ OEt	CH ₂ C(O)OHex-n
CH(Me)OCH ₂ OPr-i	CH(Et)O(CH ₂) ₂ OPr-n	CH ₂ C(O)OCH ₂ OMe
CH(Me)O(CH ₂) ₂ OMe	CH(Et)O(CH ₂) ₂ OPr-i	CH ₂ C(O)O(CH ₂) ₂ OMe
CH(Me)O(CH ₂) ₂ OEt	CH(Pr-n)O(CH ₂) ₂ OMe	CH ₂ C(O)O(CH ₂) ₂ OEt
CH(Me)O(CH ₂) ₂ OPr-n	CH(Pr-n)O(CH ₂) ₂ OEt	CH ₂ C(O)O(CH ₂) ₂ OPr-i
CH(Me)O(CH ₂) ₂ OPr-i	CH(Pr-n)O(CH ₂) ₂ OPr-n	CH ₂ C(O)NHMe
CH(Me)OCH(Me)CH ₂ OMe	CH(Pr-n)O(CH ₂) ₂ OPr-i	CH ₂ C(O)NHEt
CH(Me)OCH(Me)CH ₂ OEt	CH(Pr-i)O(CH ₂) ₂ OMe	CH ₂ C(O)NHPr-n
CH(Me)OCH ₂ CH(Me)OMe	CH(Pr-i)O(CH ₂) ₂ OEt	CH ₂ C(O)NHPr-i
CH(Me)OCH ₂ CH(Me)OEt	CH(Pr-i)O(CH ₂) ₂ OPr-n	CH(Me)C(O)OH
C(Me) ₂ OCH ₂ OMe	CH(Pr-i)O(CH ₂) ₂ OPr-i	CH(Me)C(O)OMe
C(Me) ₂ OCH ₂ OEt	CH ₂ OC(O)Me	CH(Me)C(O)OEt
C(Me) ₂ OCH ₂ OPr-n	CH ₂ OC(O)Et	CH(Me)C(O)OPr-i
C(Me) ₂ OCH ₂ OPr-i	CH ₂ OC(O)Pr-i	CH(Me)C(O)OCH ₂ OMe
C(Me) ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	CH(Me)OC(O)Me	CH(Me)C(O)O(CH ₂) ₂ OMe
C(Me) ₂ O(CH ₂) ₂ OEt	CH(Me)OC(O)Et	CH(Me)C(O)O(CH ₂) ₂ OEt

[表4]

R ^{1a}	R ^{1a}	R ^{1a}
CH(Me)C(O)O(CH ₂) ₂ OPr-i	CH ₂ S(O) ₂ Pr-i	CH(Me)SPr-i
CH(Me)C(O)NHMe	CH ₂ SBu-n	CH(Me)S(O)Pr-i
CH(Me)C(O)NHEt	CH ₂ S(O)Bu-n	CH(Me)S(O) ₂ Pr-i
CH(Me)C(O)NHPr-n	CH ₂ S(O) ₂ Bu-n	CH(Me)SBu-n
CH(Me)C(O)NHPr-i	CH ₂ SBu-i	CH(Me)S(O)Bu-n
CH(Et)C(O)OH	CH ₂ S(O)Bu-i	CH(Me)S(O) ₂ Bu-n
CH(Et)C(O)OMe	CH ₂ S(O) ₂ Bu-i	CH(Me)SBu-i
CH(Et)C(O)OEt	CH ₂ SBu-s	CH(Me)S(O)Bu-i
CH(Et)C(O)OPr-i	CH ₂ S(O)Bu-s	CH(Me)S(O) ₂ Bu-i
CH(Et)C(O)OCH ₂ OMe	CH ₂ S(O) ₂ Bu-s	CH(Me)SBu-s
CH(Et)C(O)O(CH ₂) ₂ OMe	CH ₂ SBu-t	CH(Me)S(O)Bu-s
CH(Et)C(O)O(CH ₂) ₂ OEt	CH ₂ S(O)Bu-t	CH(Me)S(O) ₂ Bu-s
CH(Et)C(O)O(CH ₂) ₂ OPr-i	CH ₂ S(O) ₂ Bu-t	CH(Me)SBu-t
CH(Et)C(O)NHMe	CH ₂ SPen-n	CH(Me)S(O)Bu-t
CH(Et)C(O)NHEt	CH ₂ S(O)Pen-n	CH(Me)S(O) ₂ Bu-t
(CH ₂) ₂ C(O)OH	CH ₂ S(O) ₂ Pen-n	CH(Me)SPen-n
(CH ₂) ₂ C(O)OMe	CH ₂ SPen-i	CH(Me)S(O)Pen-n
(CH ₂) ₂ C(O)OEt	CH ₂ S(O)Pen-i	CH(Me)S(O) ₂ Pen-n
(CH ₂) ₂ C(O)O(CH ₂) ₂ OMe	CH ₂ S(O) ₂ Pen-i	CH(Me)SPen-i
(CH ₂) ₂ C(O)O(CH ₂) ₂ OEt	CH ₂ SPen-s	CH(Me)S(O)Pen-i
(CH ₂) ₂ C(O)NHMe	CH ₂ S(O)Pen-s	CH(Me)S(O) ₂ Pen-i
(CH ₂) ₂ C(O)NHEt	CH ₂ S(O) ₂ Pen-s	CH(Me)SPen-s
(CH ₂) ₂ C(O)NHPr-n	CH ₂ SPen-t	CH(Me)S(O)Pen-s
(CH ₂) ₂ C(O)NHPr-i	CH ₂ S(O)Pen-t	CH(Me)S(O) ₂ Pen-s
CH ₂ SMe	CH ₂ S(O) ₂ Pen-t	CH(Me)SPen-t
CH ₂ S(O)Me	CH ₂ SHex-n	CH(Me)S(O)Pen-t
CH ₂ S(O) ₂ Me	CH(Me)SMe	CH(Me)S(O) ₂ Pen-t
CH ₂ SEt	CH(Me)S(O)Me	CH(Me)SHex-n
CH ₂ S(O)Et	CH(Me)S(O) ₂ Me	C(Me) ₂ SMe
CH ₂ S(O) ₂ Et	CH(Me)SEt	C(Me) ₂ S(O)Me
CH ₂ SPr-n	CH(Me)S(O)Et	C(Me) ₂ S(O) ₂ Me
CH ₂ S(O)Pr-n	CH(Me)S(O) ₂ Et	C(Me) ₂ SEt
CH ₂ S(O) ₂ Pr-n	CH(Me)SPr-n	C(Me) ₂ S(O)Et
CH ₂ SPr-i	CH(Me)S(O)Pr-n	C(Me) ₂ S(O) ₂ Et
CH ₂ S(O)Pr-i	CH(Me)S(O) ₂ Pr-n	C(Me) ₂ SPr-n

[表5]

R ^{1a}	R ^{1a}	R ^{1a}
C(Me) ₂ S(O)Pr-n	(CH ₂) ₂ SPr-n	C(Me) ₂ CH ₂ S(O) ₂ Et
C(Me) ₂ S(O) ₂ Pr-n	(CH ₂) ₂ S(O)Pr-n	C(Me) ₂ CH ₂ SPr-n
C(Me) ₂ SPr-i	(CH ₂) ₂ S(O) ₂ Pr-n	C(Me) ₂ CH ₂ S(O)Pr-n
C(Me) ₂ S(O)Pr-i	(CH ₂) ₂ SPr-i	C(Me) ₂ CH ₂ S(O) ₂ Pr-n
C(Me) ₂ S(O) ₂ Pr-i	(CH ₂) ₂ S(O)Pr-i	C(Me) ₂ CH ₂ SPr-i
C(Me) ₂ SBU-n	(CH ₂) ₂ S(O) ₂ Pr-i	C(Me) ₂ CH ₂ S(O)Pr-i
C(Me) ₂ S(O)BU-n	(CH ₂) ₃ SMe	C(Me) ₂ CH ₂ S(O) ₂ Pr-i
C(Me) ₂ S(O) ₂ BU-n	(CH ₂) ₃ (O)Me	CH(Et)SMe
C(Me) ₂ SBU-i	(CH ₂) ₃ S(O) ₂ Me	CH(Et)S(O)Me
C(Me) ₂ S(O)BU-i	(CH ₂) ₃ SEt	CH(Et)S(O) ₂ Me
C(Me) ₂ S(O) ₂ BU-i	(CH ₂) ₃ S(O)Et	CH(Et)SEt
C(Me) ₂ SBU-s	(CH ₂) ₃ S(O) ₂ Et	CH(Et)S(O)Et
C(Me) ₂ S(O)BU-s	CH(Me)CH ₂ SMe	CH(Et)S(O) ₂ Et
C(Me) ₂ S(O) ₂ BU-s	CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH(Et)SPr-n
C(Me) ₂ SBU-t	CH(Me)CH ₂ S(O) ₂ Me	CH(Et)S(O)Pr-n
C(Me) ₂ S(O)BU-t	CH(Me)CH ₂ SEt	CH(Et)S(O) ₂ Pr-n
C(Me) ₂ S(O) ₂ BU-t	CH(Me)CH ₂ S(O)Et	CH(Et)SPr-i
C(Me) ₂ SPen-n	CH(Me)CH ₂ S(O) ₂ Et	CH(Et)S(O)Pr-i
C(Me) ₂ S(O)Pen-n	CH(Me)CH ₂ SPr-n	CH(Et)S(O) ₂ Pr-i
C(Me) ₂ S(O) ₂ Pen-n	CH(Me)CH ₂ S(O)Pr-n	CH(Pr-n)SMe
C(Me) ₂ SPen-i	CH(Me)CH ₂ S(O) ₂ Pr-n	CH(Pr-n)S(O)Me
C(Me) ₂ S(O)Pen-i	CH(Me)CH ₂ SPr-i	CH(Pr-n)S(O) ₂ Me
C(Me) ₂ S(O) ₂ Pen-i	CH(Me)CH ₂ S(O)Pr-i	CH(Pr-n)SEt
C(Me) ₂ SPen-s	CH(Me)CH ₂ S(O) ₂ Pr-i	CH(Pr-n)S(O)Et
C(Me) ₂ S(O)Pen-s	CH(Et)CH ₂ SMe	CH(Pr-n)S(O) ₂ Et
C(Me) ₂ S(O) ₂ Pen-s	CH(Et)CH ₂ S(O)Me	CH(Pr-n)SPr-n
C(Me) ₂ SPen-t	CH(Et)CH ₂ S(O) ₂ Me	CH(Pr-n)S(O)Pr-n
C(Me) ₂ S(O)Pen-t	CH(Et)CH ₂ SEt	CH(Pr-n)S(O) ₂ Pr-n
C(Me) ₂ S(O) ₂ Pen-t	CH(Et)CH ₂ S(O)Et	CH(Pr-n)SPr-i
(CH ₂) ₂ SMe	CH(Et)CH ₂ S(O) ₂ Et	CH(Pr-n)S(O)Pr-i
(CH ₂) ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ CH ₂ SMe	CH(Pr-n)S(O) ₂ Pr-i
(CH ₂) ₂ S(O) ₂ Me	C(Me) ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Pr-i)SMe
(CH ₂) ₂ SEt	C(Me) ₂ CH ₂ S(O) ₂ Me	CH(Pr-i)S(O)Me
(CH ₂) ₂ S(O)Et	C(Me) ₂ CH ₂ SEt	CH(Pr-i)S(O) ₂ Me
(CH ₂) ₂ S(O) ₂ Et	C(Me) ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Pr-i)SEt

[表6]

R ^{1a}	R ^{1a}	R ^{1a}
CH(Pr-i)S(O)Et	CH ₂ SCF(CF ₃) ₂	C(Me) ₂ S(O)(CH ₂) ₂ CF ₃
CH(Pr-i)S(O) ₂ Et	CH(Me)SCF ₂ H	C(Me) ₂ S(O) ₂ (CH ₂) ₂ CF ₃
CH(Pr-i)SPr-n	CH(Me)S(O)CF ₂ H	C(Me) ₂ S(CH ₂) ₂ Cl
CH(Pr-i)S(O)Pr-n	CH(Me)S(O) ₂ CF ₂ H	C(Me) ₂ S(O)(CH ₂) ₂ Cl
CH(Pr-i)S(O) ₂ Pr-n	CH(Me)SCF ₃	C(Me) ₂ S(O) ₂ (CH ₂) ₂ Cl
CH(Pr-i)SPr-i	CH(Me)S(O)CF ₃	C(Me) ₂ S(CH ₂) ₂ Br
CH(Pr-i)S(O)Pr-i	CH(Me)S(O) ₂ CF ₃	C(Me) ₂ S(O)(CH ₂) ₂ Br
CH(Pr-i)S(O) ₂ Pr-i	CH(Me)SCH ₂ CF ₂ H	C(Me) ₂ S(O) ₂ (CH ₂) ₂ Br
CH ₂ SCF ₂ H	CH(Me)S(O)CH ₂ CF ₂ H	(CH ₂) ₂ SCF ₃
CH ₂ S(O)CF ₂ H	CH(Me)S(O) ₂ CH ₂ CF ₂ H	(CH ₂) ₂ S(O)CF ₃
CH ₂ S(O) ₂ CF ₂ H	CH(Me)SCH ₂ CF ₃	(CH ₂) ₂ S(O) ₂ CF ₃
CH ₂ SCF ₃	CH(Me)S(O)CH ₂ CF ₃	(CH ₂) ₂ SCH ₂ CF ₂ H
CH ₂ S(O)CF ₃	CH(Me)S(O) ₂ CH ₂ CF ₃	(CH ₂) ₂ S(O)CH ₂ CF ₂ H
CH ₂ S(O) ₂ CF ₃	CH(Me)S(CH ₂) ₂ CF ₃	(CH ₂) ₂ S(O) ₂ CH ₂ CF ₂ H
CH ₂ SCH ₂ CF ₂ H	CH(Me)S(O)(CH ₂) ₂ CF ₃	(CH ₂) ₂ SCH ₂ CF ₃
CH ₂ S(O)CH ₂ CF ₂ H	CH(Me)S(O) ₂ (CH ₂) ₂ CF ₃	(CH ₂) ₂ S(O)CH ₂ CF ₃
CH ₂ S(O) ₂ CH ₂ CF ₂ H	CH(Me)S(CH ₂) ₂ Cl	(CH ₂) ₂ S(O) ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ SCH ₂ CF ₃	CH(Me)S(O)(CH ₂) ₂ Cl	(CH ₂) ₂ S(CH ₂) ₂ Cl
CH ₂ S(O)CH ₂ CF ₃	CH(Me)S(O) ₂ (CH ₂) ₂ Cl	(CH ₂) ₂ S(O)(CH ₂) ₂ Cl
CH ₂ S(O) ₂ CH ₂ CF ₃	CH(Me)S(CH ₂) ₂ Br	(CH ₂) ₂ S(O) ₂ (CH ₂) ₂ Cl
CH ₂ S(CH ₂) ₂ CF ₃	CH(Me)S(O)(CH ₂) ₂ Br	(CH ₂) ₂ S(CH ₂) ₂ Br
CH ₂ S(O)(CH ₂) ₂ CF ₃	CH(Me)S(O) ₂ (CH ₂) ₂ Br	(CH ₂) ₂ S(O)(CH ₂) ₂ Br
CH ₂ S(O) ₂ (CH ₂) ₂ CF ₃	C(Me) ₂ SCF ₂ H	(CH ₂) ₂ S(O) ₂ (CH ₂) ₂ Br
CH ₂ S(CH ₂) ₂ Cl	C(Me) ₂ S(O)CF ₂ H	CH=CH ₂
CH ₂ S(O)(CH ₂) ₂ Cl	C(Me) ₂ S(O) ₂ CF ₂ H	CH=CHMe
CH ₂ S(O) ₂ (CH ₂) ₂ Cl	C(Me) ₂ SCF ₃	CH=CMe ₂
CH ₂ S(CH ₂) ₂ Br	C(Me) ₂ S(O)CF ₃	CH ₂ CH=CH ₂
CH ₂ S(O)(CH ₂) ₂ Br	C(Me) ₂ S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ CH=CHMe
CH ₂ S(O) ₂ (CH ₂) ₂ Br	C(Me) ₂ SCH ₂ CF ₂ H	CH ₂ C(Me)=CH ₂
CH ₂ SCHFCH ₃	C(Me) ₂ S(O)CH ₂ CF ₂ H	(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂
CH ₂ SCF ₂ CH ₃	C(Me) ₂ S(O) ₂ CH ₂ CF ₂ H	C(Me)=CH ₂
CH ₂ SCF(CF ₃) ₂	C(Me) ₂ SCH ₂ CF ₃	C(Me)=CHMe
CH ₂ SCF ₂ CF ₂ H	C(Me) ₂ S(O)CH ₂ CF ₃	C(Me)=CMe ₂
CH ₂ SCF ₂ CF ₃	C(Me) ₂ S(O) ₂ CH ₂ CF ₃	CH(Me)CH=CH ₂
CH ₂ SCF ₂ CF ₂ CF ₃	C(Me) ₂ S(CH ₂) ₂ CF ₃	C(Et)=CH ₂

[表7]

R ^{1a}	R ^{1a}	R ^{1a}
C(Et)=CHMe	2,4-(Cl) ₂ -Ph	3-F-4-Cl-Ph
C(Et)=CMe ₂	2,5-(Cl) ₂ -Ph	3-F-5-Cl-Ph
CH(Et)CH=CH ₂	2,6-(Cl) ₂ -Ph	2-Me-3-F-Ph
C≡CH	3,4-(Cl) ₂ -Ph	2-Me-4-F-Ph
C≡CMe	3,5-(Cl) ₂ -Ph	2-Me-5-F-Ph
CH ₂ C≡CH	2,3-(Me) ₂ -Ph	3-Me-4-F-Ph
CH ₂ C≡CMe	2,4-(Me) ₂ -Ph	3-Me-5-F-Ph
CH(Me)C≡CH	2,5-(Me) ₂ -Ph	2-Cl-3-MeO-Ph
CH(Me)C≡CMe	2,6-(Me) ₂ -Ph	2-Cl-4-MeO-Ph
Ph	3,4-(Me) ₂ -Ph	2-Cl-5-MeO-Ph
2-F-Ph	3,5-(Me) ₂ -Ph	2-Cl-6-MeO-Ph
3-F-Ph	2,3-(MeO) ₂ -Ph	3-Cl-4-MeO-Ph
4-F-Ph	2,4-(MeO) ₂ -Ph	3-Cl-5-MeO-Ph
2-Cl-Ph	2,5-(MeO) ₂ -Ph	2-F-3-MeO-Ph
3-Cl-Ph	2,6-(MeO) ₂ -Ph	2-F-4-MeO-Ph
4-Cl-Ph	3,4-(MeO) ₂ -Ph	2-F-5-MeO-Ph
2-Br-Ph	3,5-(MeO) ₂ -Ph	2-F-6-MeO-Ph
3-Br-Ph	2-Cl-3-Me-Ph	3-F-4-MeO-Ph
4-Br-Ph	2-Cl-4-Me-Ph	3-F-5-MeO-Ph
2-Me-Ph	2-Cl-5-Me-Ph	2-MeO-3-F-Ph
3-Me-Ph	3-Cl-4-Me-Ph	2-MeO-4-F-Ph
4-Me-Ph	3-Cl-5-Me-Ph	2-MeO-5-F-Ph
2-CF ₃ -Ph	2-Cl-3-F-Ph	2-MeO-6-F-Ph
3-CF ₃ -Ph	2-Cl-4-F-Ph	3-MeO-4-F-Ph
4-CF ₃ -Ph	2-Cl-5-F-Ph	3-MeO-5-F-Ph
2-MeO-Ph	3-Cl-4-F-Ph	2-MeO-3-Cl-Ph
3-MeO-Ph	3-Cl-5-F-Ph	2-MeO-4-Cl-Ph
4-MeO-Ph	2-F-3-Me-Ph	2-MeO-5-Cl-Ph
2,3-(F) ₂ -Ph	2-F-4-Me-Ph	2-MeO-6-Cl-Ph
2,4-(F) ₂ -Ph	2-F-5-Me-Ph	3-MeO-4-Cl-Ph
2,5-(F) ₂ -Ph	3-F-4-Me-Ph	3-MeO-5-Cl-Ph
2,6-(F) ₂ -Ph	3-F-5-Me-Ph	2-Me-3-MeO-Ph
3,4-(F) ₂ -Ph	2-F-3-Cl-Ph	2-Me-4-MeO-Ph
3,5-(F) ₂ -Ph	2-F-4-Cl-Ph	2-Me-5-MeO-Ph
2,3-(Cl) ₂ -Ph	2-F-5-Cl-Ph	2-Me-6-MeO-Ph

[表8]

R ^{1a}	R ^{1a}	R ^{1a}
3-Me-4-MeO-Ph	D-11	CH ₂ (2,5-(MeO) ₂ -Ph)
3-Me-5-MeO-Ph	D-12	CH ₂ (2,6-(MeO) ₂ -Ph)
2-MeO-3-Me-Ph	D-13a	CH ₂ (3,4-(MeO) ₂ -Ph)
2-MeO-4-Me-Ph	D-14	CH ₂ (3,5-(MeO) ₂ -Ph)
2-MeO-5-Me-Ph	D-16	CH(Me)(2-MeO-Ph)
2-MeO-6-Me-Ph	D-16a	CH(Me)(3-MeO-Ph)
3-MeO-4-Me-Ph	D-16b	CH(Me)(4-MeO-Ph)
3-MeO-5-Me-Ph	D-16c	CH(Me)(2,3-(MeO) ₂ -Ph)
3,5-(F) ₂ -4-Me-Ph	D-16d	CH(Me)(2,4-(MeO) ₂ -Ph)
3,5-(F) ₂ -4-MeO-Ph	D-16e	CH(Me)(2,5-(MeO) ₂ -Ph)
3,4,5-(MeO) ₃ -Ph	D-16f	CH(Me)(2,6-(MeO) ₂ -Ph)
D-3	D-16g	CH(Me)(3,4-(MeO) ₂ -Ph)
D-3a	D-16h	CH(Me)(3,5-(MeO) ₂ -Ph)
D-4	D-16i	CH(Et)(2-MeO-Ph)
D-4a	D-16j	CH(Et)(3-MeO-Ph)
D-4b	D-16k	CH(Et)(4-MeO-Ph)
D-8	D-16m	(CH ₂) ₂ (2-MeO-Ph)
D-8a	D-16n	(CH ₂) ₂ (3-MeO-Ph)
D-8b	D-16p	(CH ₂) ₂ (4-MeO-Ph)
D-8c	D-17	CHO
D-8d	D-17a	CH=NOMe
D-8e	D-17b	OMe
D-8f	D-19	OEt
D-8g	D-24a	OPr-n
D-8h	D-24b	OPr-i
D-9	D-24c	OBu-n
D-9a	D-24d	OBu-i
D-9c	D-24e	OBu-s
D-9d	D-24f	OBu-t
D-9f	CH ₂ Ph	OPen-n
D-9g	CH ₂ (2-MeO-Ph)	OPen-i
D-9i	CH ₂ (3-MeO-Ph)	OPen-s
D-9j	CH ₂ (4-MeO-Ph)	OPen-t
D-9m	CH ₂ (2,3-(MeO) ₂ -Ph)	OHex-n
D-10a	CH ₂ (2,4-(MeO) ₂ -Ph)	SMe

[表9]

R ^{1a}	R ^{1a}	R ^{1a}
S(O)Me	SPen-n	S(CH ₂) ₂ Cl
S(O) ₂ Me	S(O)Pen-n	S(O)(CH ₂) ₂ Cl
SEt	S(O) ₂ Pen-n	S(O) ₂ (CH ₂) ₂ Cl
S(O)Et	SPen-i	SCH(Me)CH ₂ Cl
S(O) ₂ Et	S(O)Pen-i	SCH ₂ CH(Me)Cl
SPr-n	S(O) ₂ Pen-i	S(CH ₂) ₃ Cl
S(O)Pr-n	SPen-c	SCF ₃
S(O) ₂ Pr-n	S(O)Pen-c	SCH ₂ CF ₃
SPr-i	S(O) ₂ Pen-c	S(O)CH ₂ CF ₃
S(O)Pr-i	SPen-s	S(O) ₂ CH ₂ CF ₃
S(O) ₂ Pr-i	S(O)Pen-s	SCH(Me)CF ₃
SPr-c	S(O) ₂ Pen-s	S(CH ₂) ₂ CF ₃
S(O)Pr-c	SPen-t	S(CH ₂) ₃ CF ₃
S(O) ₂ Pr-c	S(O)Pen-t	SCHFCH ₃
S(D-16)	S(O) ₂ Pen-t	SCF ₂ CH ₃
S(O)(D-16)	SHex-n	SCF(CH ₃) ₂
S(O) ₂ (D-16)	SHex-c	SCF ₂ CF ₂ H
S(D-16e)	SCH ₂ CH=CH ₂	SCF ₂ CF ₃
S(O)(D-16e)	S(O)CH ₂ CH=CH ₂	SCF ₂ CF ₂ CF ₃
S(O) ₂ (D-16e)	S(O) ₂ CH ₂ CH=CH ₂	SCF(CF ₃)
SBu-n	SCH(Me)CH=CH ₂	SCH ₂ OMe
S(O)Bu-n	SC(Me) ₂ CH=CH ₂	S(CH ₂) ₂ OMe
S(O) ₂ Bu-n	SCH ₂ CH=CHMe	S(O)(CH ₂) ₂ OMe
SBu-i	SCH ₂ C(Me)=CH ₂	S(O) ₂ (CH ₂) ₂ OMe
S(O)Bu-i	S(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂	SCH(Me)CH ₂ OMe
S(O) ₂ Bu-i	SC(Me)=CH ₂	S(O)CH(Me)CH ₂ OMe
SBu-c	SC(Me)=CH(Me)	S(O) ₂ CH(Me)CH ₂ OMe
S(O)Bu-c	SCH ₂ C≡CH	SCH ₂ CH(Me)OMe
S(O) ₂ Bu-c	S(O)CH ₂ C≡CH	S(O)CH ₂ CH(Me)OMe
SBu-s	S(O) ₂ CH ₂ C≡CH	S(O) ₂ CH ₂ CH(Me)OMe
S(O)Bu-s	SCH(Me)C≡CH	SC(Me) ₂ CH ₂ OMe
S(O) ₂ Bu-s	SC(Me) ₂ C≡CH	S(CH ₂) ₃ OMe
SBu-t	SCH ₂ C≡CMe	SCH ₂ OEt
S(O)Bu-t	SCH ₂ Cl	S(CH ₂) ₂ OEt
S(O) ₂ Bu-t	SCH(Me)Cl	S(O)(CH ₂) ₂ OEt

[表10]

R ^{1a}	R ^{1a}	R ^{1a}
S(O) ₂ (CH ₂) ₂ OE _t	S(O) ₂ CH ₂ CN	SCH(Me)C(O)Me
SCH(Me)CH ₂ OE _t	SCH(Me)CN	S(CH ₂) ₂ C(O)Me
SCH ₂ OPr-i	S(O)CH(Me)CN	SCH ₂ C(O)OMe
S(CH ₂) ₂ OPr-i	S(O) ₂ CH(Me)CN	SCH(Me)C(O)OMe
S(O)(CH ₂) ₂ OPr-i	SC(Me) ₂ CN	S(CH ₂) ₂ C(O)OMe
S(O) ₂ (CH ₂) ₂ OPr-i	S(O)C(Me) ₂ CN	SCH ₂ C(O)OE _t
SCH(Me)CH ₂ OPr-i	S(O) ₂ C(Me) ₂ CN	SCH(Me)C(O)OE _t
SCH ₂ Pr-c	S(CH ₂) ₂ CN	S(CH ₂) ₂ C(O)OE _t
S(O)CH ₂ Pr-c	S(O)(CH ₂) ₂ CN	SCH ₂ (D-8a)
S(O) ₂ CH ₂ Pr-c	S(O) ₂ (CH ₂) ₂ CN	S(O)CH ₂ (D-8a)
SCH(Me)Pr-c	SCH ₂ Ph	S(O) ₂ CH ₂ (D-8a)
S(O)CH(Me)Pr-c	S(O)CH ₂ Ph	SCH ₂ (D-8b)
S(O) ₂ CH(Me)Pr-c	S(O) ₂ CH ₂ Ph	S(O)CH ₂ (D-8b)
S(CH ₂) ₂ Pr-c	SCH(Me)Ph	S(O) ₂ CH ₂ (D-8b)
SCH ₂ (D-16)	S(O)CH(Me)Ph	SCH ₂ (D-8c)
S(O)CH ₂ (D-16)	S(O) ₂ CH(Me)Ph	S(O)CH ₂ (D-8c)
S(O) ₂ CH ₂ (D-16)	SCH ₂ (2-MeO-Ph)	S(O) ₂ CH ₂ (D-8c)
SCH ₂ (D-16e)	S(O)CH ₂ (2-MeO-Ph)	SCH ₂ (D-8d)
S(O)CH ₂ (D-16e)	S(O) ₂ CH ₂ (2-MeO-Ph)	S(O)CH ₂ (D-8d)
S(O) ₂ CH ₂ (D-16e)	SCH(Me)(2-MeO-Ph)	S(O) ₂ CH ₂ (D-8d)
SCH ₂ Bu-c	S(O)CH(Me)(2-MeO-Ph)	SCH ₂ (D-8e)
S(O)CH ₂ Bu-c	S(O) ₂ CH(Me)(2-MeO-Ph)	S(O) ₂ CH ₂ (D-8e)
S(O) ₂ CH ₂ Bu-c	SCH ₂ (3-MeO-Ph)	SCH ₂ (D-8f)
SCH(Me)Bu-c	S(O)CH ₂ (3-MeO-Ph)	S(O) ₂ CH ₂ (D-8f)
S(CH ₂) ₂ Bu-c	S(O) ₂ CH ₂ (3-MeO-Ph)	SCH ₂ (D-8g)
SCH ₂ Pen-c	SCH(Me)(3-MeO-Ph)	S(O) ₂ CH ₂ (D-8g)
S(O)CH ₂ Pen-c	S(O)CH(Me)(3-MeO-Ph)	SCH ₂ (D-8h)
S(O) ₂ CH ₂ Pen-c	S(O) ₂ CH(Me)(3-MeO-Ph)	S(O) ₂ CH ₂ (D-8h)
SCH(Me)Pen-c	SCH ₂ (4-MeO-Ph)	SCH ₂ (D-15)
S(CH ₂) ₂ Pen-c	S(O)CH ₂ (4-MeO-Ph)	S(O)CH ₂ (D-15)
SCH ₂ Hex-c	S(O) ₂ CH ₂ (4-MeO-Ph)	S(O) ₂ CH ₂ (D-15)
SCH(Me)Hex-c	SCH(Me)(4-MeO-Ph)	SCH(Me)(D-15)
S(CH ₂) ₂ Hex-c	S(O)CH(Me)(4-MeO-Ph)	S(O)CH(Me)(D-15)
SCH ₂ CN	S(O) ₂ CH(Me)(4-MeO-Ph)	S(O) ₂ CH(Me)(D-15)
S(O)CH ₂ CN	SCH ₂ C(O)Me	S(CH ₂) ₂ (D-15)

[表11]

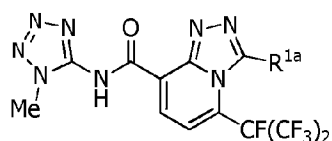
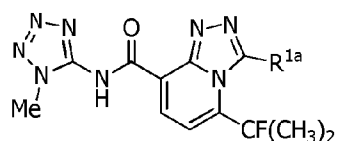
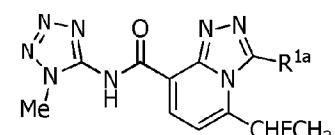
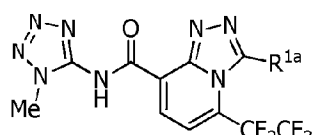
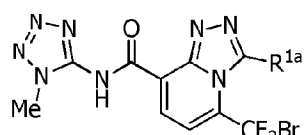
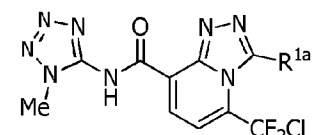
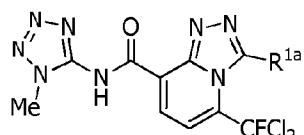
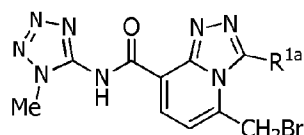
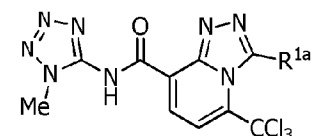
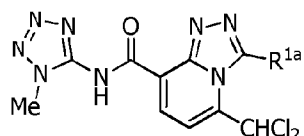
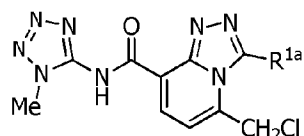
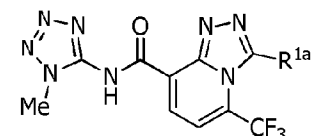
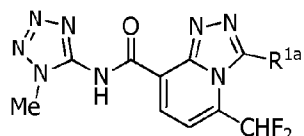
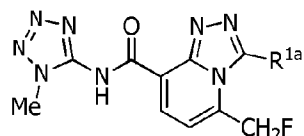
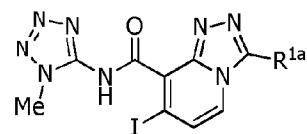
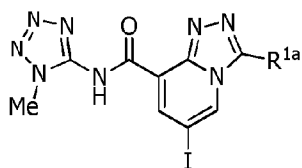
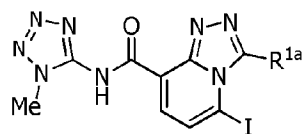
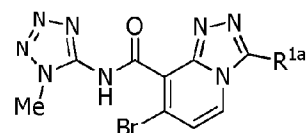
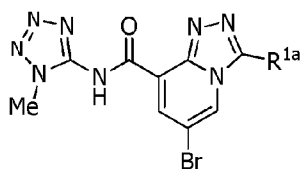
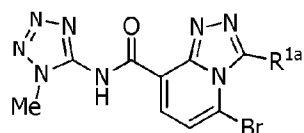
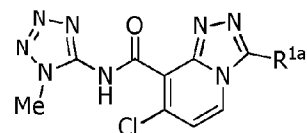
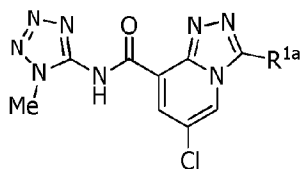
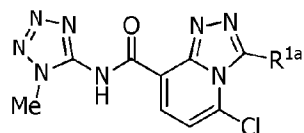
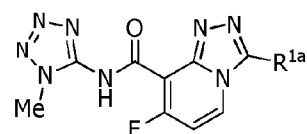
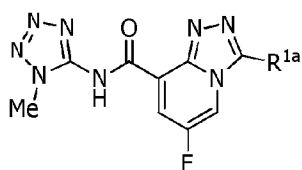
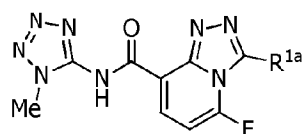
R ^{1a}	R ^{1a}	R ^{1a}
S(O)(CH ₂) ₂ (D-15)	N(Me)Pr-c	N(Pr-i)Pr-i
S(O) ₂ (CH ₂) ₂ (D-15)	N(Me)(D-16)	N(Pr-i)Pr-c
SCH ₂ (D-18)	N(Me)(D-16e)	N(Pr-i)(D-16)
S(O)CH ₂ (D-18)	N(Me)Bu-n	N(Pr-i)(D-16e)
S(O) ₂ CH ₂ (D-18)	N(Me)Bu-i	N(Pr-i)Bu-n
SCH(Me)(D-18)	N(Me)Bu-c	N(Pr-i)Bu-i
S(O)CH(Me)(D-18)	N(Me)Bu-s	N(Pr-i)Bu-c
S(O) ₂ CH(Me)(D-18)	N(Me)Bu-t	N(Pr-i)Bu-s
S(CH ₂) ₂ (D-18)	N(Me)Pen-n	NHCH ₂ OMe
S(O)(CH ₂) ₂ (D-18)	N(Me)Pen-i	NHCH ₂ OEt
S(O) ₂ (CH ₂) ₂ (D-18)	N(Me)Pen-c	NHCH(Me)OMe
NHMe	N(Me)Pen-s	NHCH(Me)OEt
NHEt	N(Me)Pen-t	NHC(Me) ₂ OMe
NHPr-n	N(Me)(3-Pen)	NHC(Me) ₂ OEt
NHPr-i	N(Me)Hex-n	NH(CH ₂) ₂ OMe
NHPr-c	N(Me)Hex-c	NH(CH ₂) ₂ OEt
NH(D-16)	N(Et)Et	NH(CH ₂) ₂ OPr-n
NH(D-16e)	N(Et)Pr-n	NH(CH ₂) ₂ OPr-i
NHBu-n	N(Et)Pr-i	N(Me)CH ₂ OMe
NHBu-i	N(Et)Pr-c	N(Me)CH ₂ OEt
NHBu-c	N(Et)(D-16)	N(Me)CH(Me)OMe
NHBu-s	N(Et)(D-16e)	N(Me)CH(Me)OEt
NHBu-t	N(Et)Bu-n	N(Me)C(Me) ₂ OMe
NHPen-n	N(Et)Bu-i	N(Me)C(Me) ₂ OEt
NHPen-i	N(Et)Bu-c	N(Me)(CH ₂) ₂ OMe
NHPen-c	N(Et)Bu-s	N(Me)(CH ₂) ₂ OEt
NHPen-s	N(Pr-n)Pr-n	N(Me)(CH ₂) ₂ OPr-n
NHPen-t	N(Pr-n)Pr-i	N(Me)(CH ₂) ₂ OPr-i
NH(3-Pen)	N(Pr-n)Pr-c	N(Et)C(Me) ₂ OMe
NHHex-n	N(Pr-n)(D-16)	N(Et)C(Me) ₂ OEt
NHHex-c	N(Pr-n)(D-16e)	N(Et)(CH ₂) ₂ OMe
N(Me)Me	N(Pr-n)Bu-n	N(Et)(CH ₂) ₂ OEt
N(Me)Et	N(Pr-n)Bu-i	N(Et)(CH ₂) ₂ OPr-n
N(Me)Pr-n	N(Pr-n)Bu-c	N(Et)(CH ₂) ₂ OPr-i
N(Me)Pr-i	N(Pr-n)Bu-s	N(Pr-n)(CH ₂) ₂ OMe

[表12]

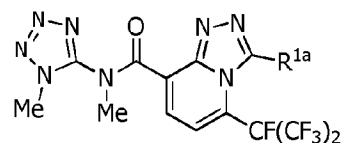
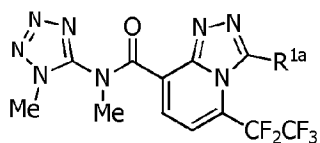
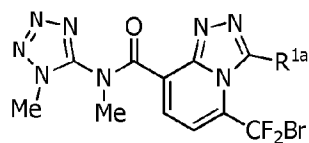
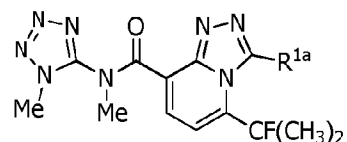
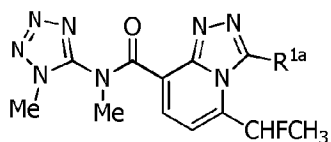
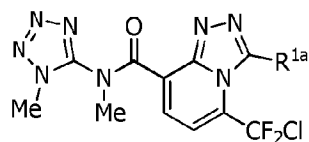
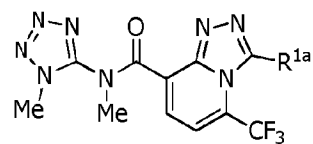
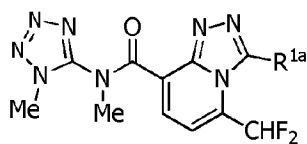
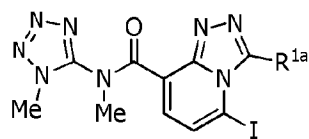
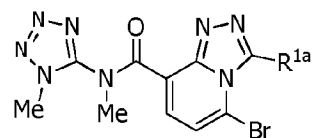
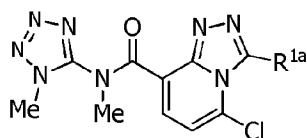
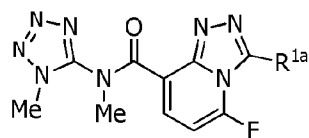
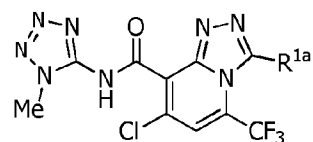
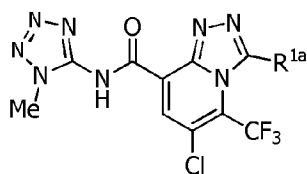
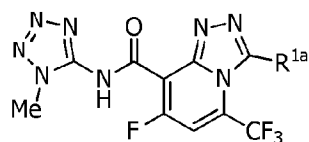
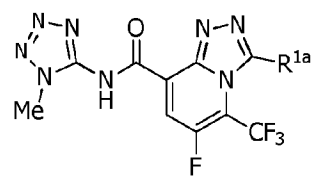
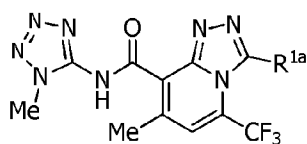
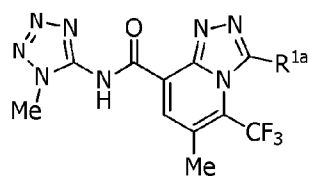
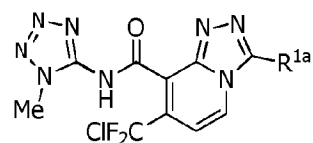
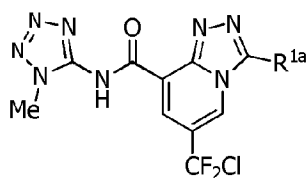
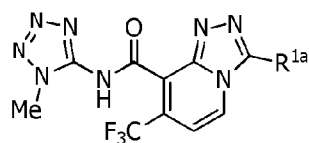
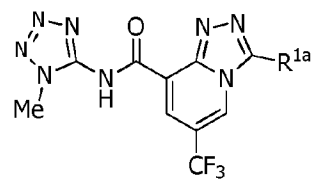
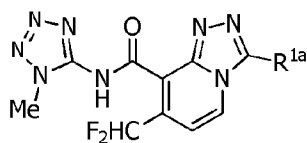
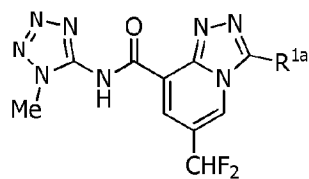
R ^{1a}	R ^{1a}	R ^{1a}
N(Pr-n)(CH ₂) ₂ OEt	N(Me)(CH ₂) ₂ S(O)Pr-i	NH(2,6-(MeO) ₂ -Ph)
N(Pr-n)(CH ₂) ₂ OPr-n	N(Me)(CH ₂) ₂ S(O) ₂ Pr-i	NH(3,4-(MeO) ₂ -Ph)
N(Pr-n)(CH ₂) ₂ OPr-i	NHCF ₂ H	NH(3,5-(MeO) ₂ -Ph)
N(Pr-i)(CH ₂) ₂ OMe	NHCF ₃	N(Me)Ph
N(Pr-i)(CH ₂) ₂ OEt	NHCH ₂ CF ₂ H	N(Me)(2-MeO-Ph)
N(Pr-i)(CH ₂) ₂ OPr-n	NHCH ₂ CF ₃	N(Me)(3-MeO-Ph)
N(Pr-i)(CH ₂) ₂ OPr-i	NH(CH ₂) ₂ CF ₃	N(Me)(4-MeO-Ph)
NHCH ₂ SMe	NH(CH ₂) ₂ Cl	N(Me)(2,3-(MeO) ₂ -Ph)
NHCH ₂ SEt	NH(CH ₂) ₃ Cl	N(Me)(2,4-(MeO) ₂ -Ph)
NHCH(Me)SMe	N(Me)CF ₂ H	N(Me)(2,5-(MeO) ₂ -Ph)
NHCH(Me)SEt	N(Me)CF ₃	N(Me)(2,6-(MeO) ₂ -Ph)
NHC(Me) ₂ SMe	N(Me)CH ₂ CF ₂ H	N(Me)(3,4-(MeO) ₂ -Ph)
NHC(Me) ₂ SEt	N(Me)CH ₂ CF ₃	N(Me)(3,5-(MeO) ₂ -Ph)
NH(CH ₂) ₂ SMe	N(Me)(CH ₂) ₂ CF ₃	NHCH ₂ Ph
NH(CH ₂) ₂ S(O)Me	N(Me)(CH ₂) ₂ Cl	NHCH ₂ (2-MeO-Ph)
NH(CH ₂) ₂ S(O) ₂ Me	N(Me)(CH ₂) ₃ Cl	NHCH ₂ (3-MeO-Ph)
NH(CH ₂) ₂ SEt	NHCH ₂ CH=CH ₂	NHCH ₂ (4-MeO-Ph)
NH(CH ₂) ₂ S(O)Et	N(Me)CH ₂ CH=CH ₂	N(Me)CH ₂ Ph
NH(CH ₂) ₂ S(O) ₂ Et	NHCH ₂ C≡CH	N(Me)CH ₂ (2-MeO-Ph)
NH(CH ₂) ₂ SPr-i	NHCH ₂ C≡CMe	N(Me)CH ₂ (3-MeO-Ph)
NH(CH ₂) ₂ S(O)Pr-i	N(Me)CH ₂ C≡CH	N(Me)CH ₂ (4-MeO-Ph)
NH(CH ₂) ₂ S(O) ₂ Pr-i	N(Me)CH ₂ C≡CMe	NH(D-9b)
N(Me)CH ₂ SMe	NHCH ₂ CN	NH(D-9e)
N(Me)CH ₂ SEt	NH(CH ₂) ₂ CN	NH(D-9h)
N(Me)CH(Me)SMe	NH(CH ₂) ₃ CN	NH(D-9k)
N(Me)CH(Me)SEt	N(Me)CH ₂ CN	N(Me)(D-9b)
N(Me)C(Me) ₂ SMe	N(Me)(CH ₂) ₂ CN	N(Me)(D-9e)
N(Me)C(Me) ₂ SEt	N(Me)(CH ₂) ₃ CN	N(Me)(D-9h)
N(Me)(CH ₂) ₂ SMe	NHPh	N(Me)(D-9k)
N(Me)(CH ₂) ₂ S(O)Me	NH(2-MeO-Ph)	NHSO ₂ Ph
N(Me)(CH ₂) ₂ S(O) ₂ Me	NH(3-MeO-Ph)	N(Me)SO ₂ Ph
N(Me)(CH ₂) ₂ SEt	NH(4-MeO-Ph)	
N(Me)(CH ₂) ₂ S(O)Et	NH(2,3-(MeO) ₂ -Ph)	
N(Me)(CH ₂) ₂ S(O) ₂ Et	NH(2,4-(MeO) ₂ -Ph)	
N(Me)(CH ₂) ₂ SPr-i	NH(2,5-(MeO) ₂ -Ph)	

[0190] [第2表]

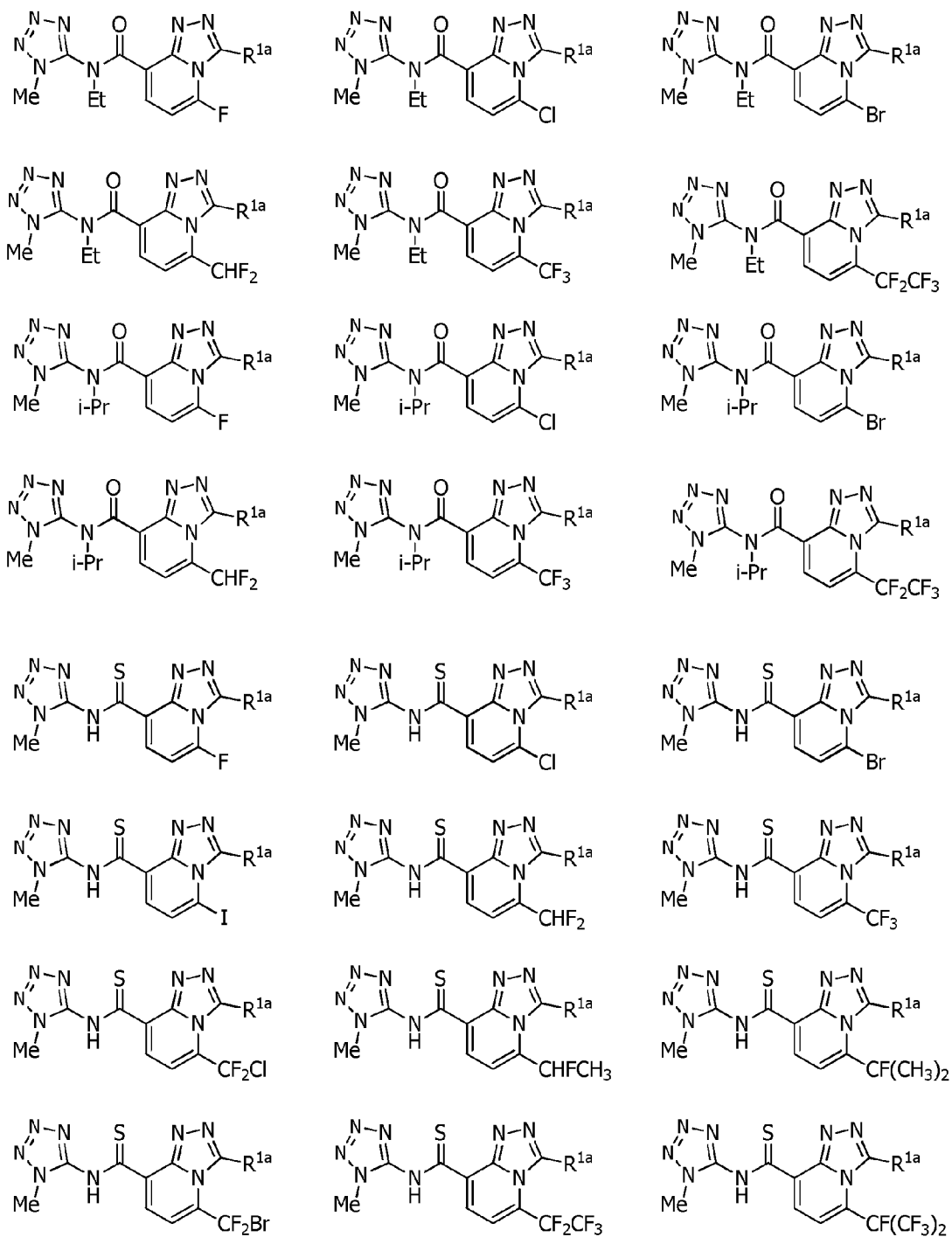
[化33]



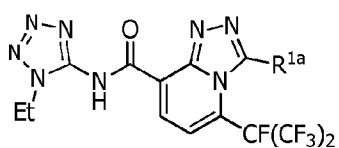
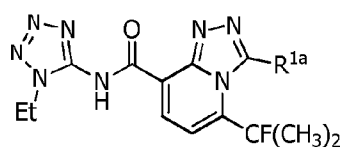
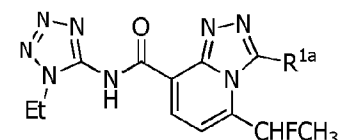
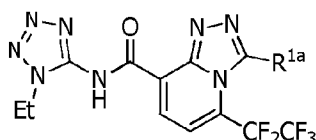
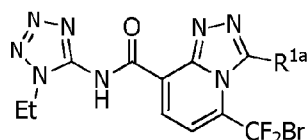
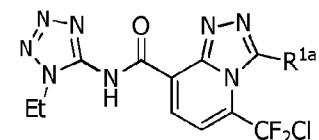
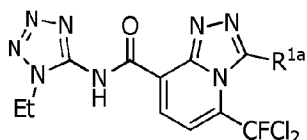
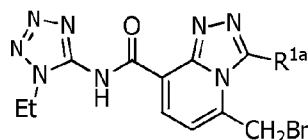
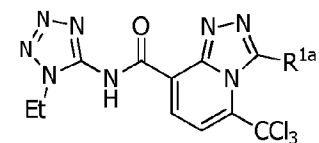
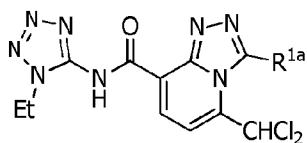
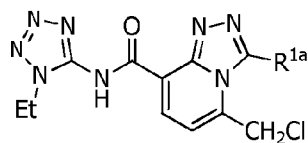
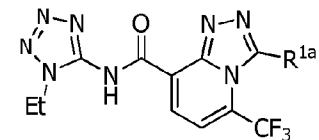
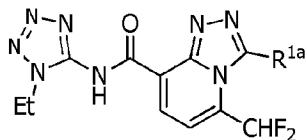
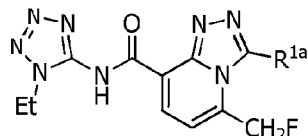
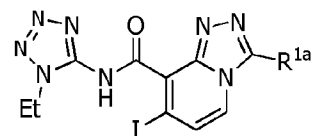
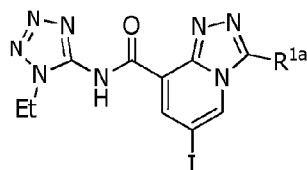
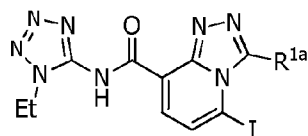
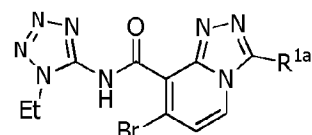
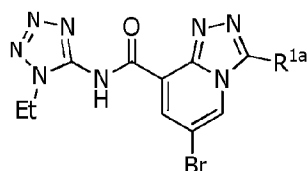
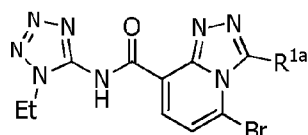
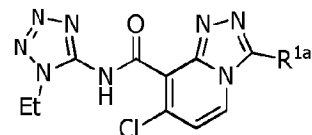
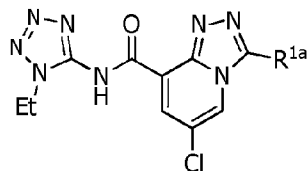
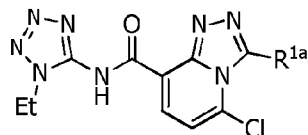
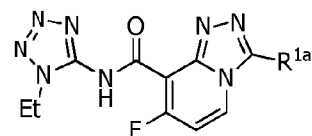
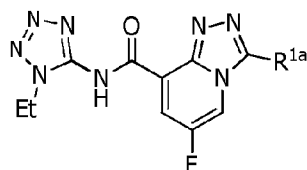
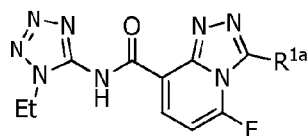
[化34]



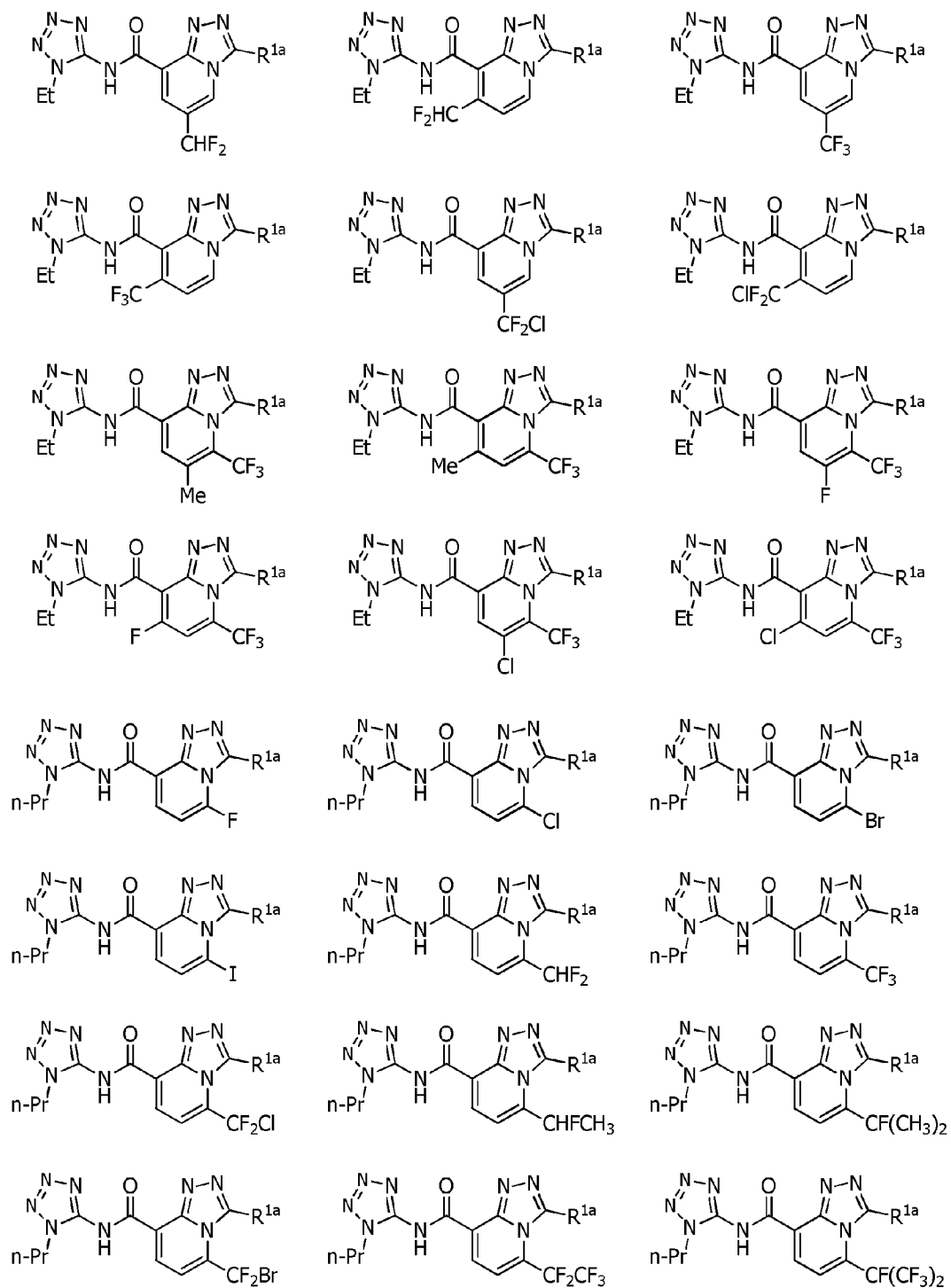
[化35]



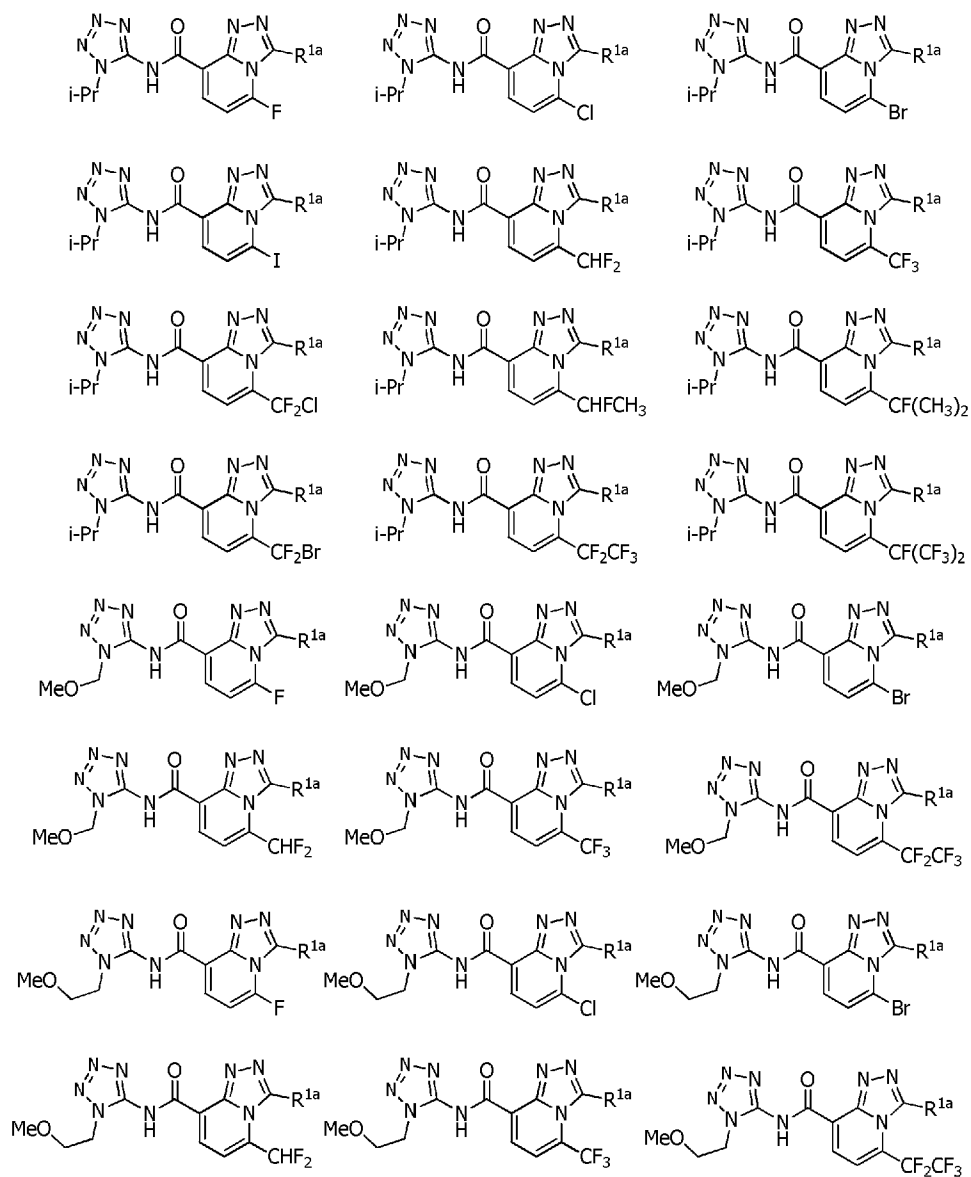
[化36]



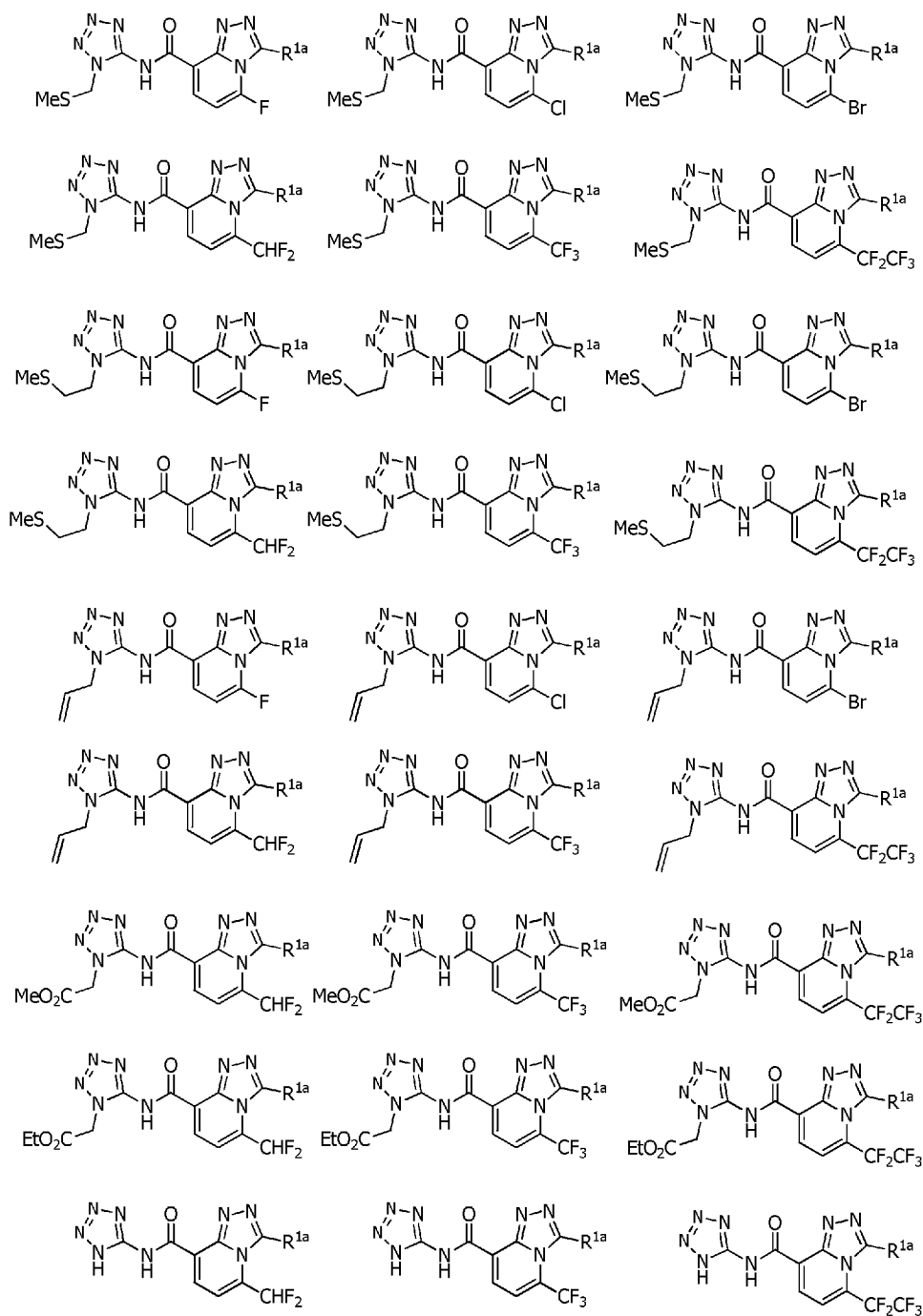
[化37]



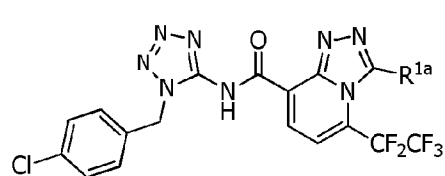
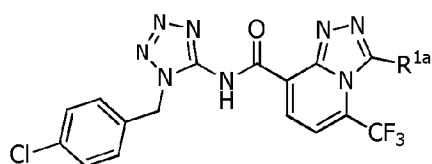
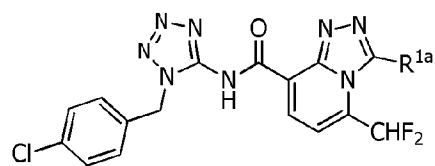
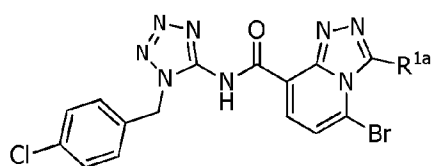
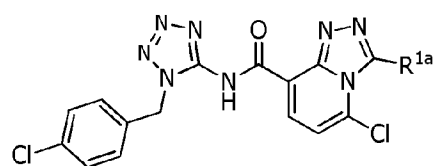
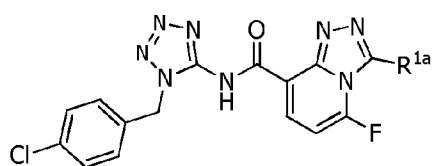
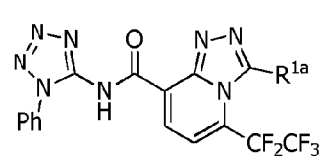
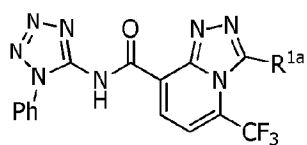
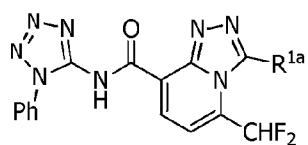
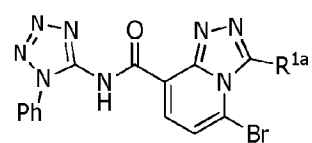
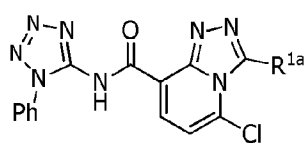
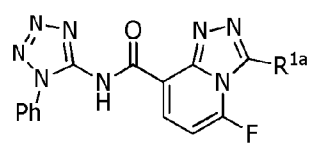
[化38]



[化39]



[化40]



[表13]

R ^{1a}	R ^{1a}	R ^{1a}
H	CH ₂ OHex-n	C(Me) ₂ OMe
F	CH(Me)OMe	C(Me) ₂ OEt
Cl	CH(Me)OEt	C(Me) ₂ OPr-n
Br	CH(Me)OPr-n	C(Me) ₂ OPr-i
I	CH(Me)OPr-i	C(Me) ₂ OBu-n
Me	CH(Me)OBu-n	C(Me) ₂ OBu-i
Et	CH(Me)OBu-i	C(Me) ₂ OBu-s
Pr-n	CH(Me)OBu-s	C(Me) ₂ OBu-t
Pr-i	CH(Me)OBu-t	(CH ₂) ₂ OMe
Pr-c	CH(Me)OPen-n	(CH ₂) ₂ OEt
Bu-n	CH(Me)OPen-i	(CH ₂) ₂ OPr-n
Bu-i	CH(Me)OPen-s	(CH ₂) ₂ OPr-i
Bu-c	CH(Me)OPen-t	(CH ₂) ₂ OBu-n
Bu-s	CH(Me)OHex-n	(CH ₂) ₂ OBu-i
Bu-t	CH(Et)OMe	(CH ₂) ₂ OBu-s
Pen-n	CH(Et)OEt	(CH ₂) ₂ OBu-t
Pen-i	CH(Et)OPr-n	CH(Me)CH ₂ OMe
Pen-c	CH(Et)OPr-i	CH(Me)CH ₂ OEt
Pen-s	CH(Et)OBu-n	CH(Me)CH ₂ OPr-n
Pen-t	CH(Et)OBu-i	CH(Me)CH ₂ OPr-i
3-Pen	CH(Et)OBu-s	CH(Me)CH ₂ OBu-n
Hex-n	CH(Et)OBu-t	CH(Me)CH ₂ OBu-i
Hex-c	CH(Et)OPen-n	CH(Me)CH ₂ OBu-s
CH ₂ OMe	CH(Et)OPen-i	CH(Me)CH ₂ OBu-t
CH ₂ OEt	CH(Et)OPen-s	CH(Et)CH ₂ OMe
CH ₂ OPr-n	CH(Et)OPen-t	CH(Et)CH ₂ OEt
CH ₂ OPr-i	CH(Et)OHex-n	(CH ₂) ₃ OMe
CH ₂ OBu-n	CH(Pr-n)OMe	(CH ₂) ₃ OEt
CH ₂ OBu-i	CH(Pr-n)OEt	(CH ₂) ₃ OPr-n
CH ₂ OBu-s	CH(Pr-n)OPr-n	(CH ₂) ₃ OPr-i
CH ₂ OBu-t	CH(Pr-n)OPr-i	(CH ₂) ₃ OBu-n
CH ₂ OPen-n	CH(Pr-i)OMe	(CH ₂) ₃ OBu-i
CH ₂ OPen-i	CH(Pr-i)OEt	(CH ₂) ₃ OBu-s
CH ₂ OPen-s	CH(Pr-i)OPr-n	(CH ₂) ₃ OBu-t
CH ₂ OPen-t	CH(Pr-i)OPr-i	CH ₂ OCF ₂ H

[表14]

R ^{1a}	R ^{1a}	R ^{1a}
CH ₂ OCF ₃	CH(iPr)OH	C(Me) ₂ OCH ₂ OPr-n
CH ₂ OCH ₂ CF ₂ H	C(Me) ₂ OH	C(Me) ₂ OCH ₂ OPr-i
CH ₂ OCH ₂ CF ₃	(CH ₂) ₂ OH	C(Me) ₂ O(CH ₂) ₂ OMe
CH ₂ O(CH ₂) ₂ CF ₃	CH(Me)CH ₂ OH	C(Me) ₂ O(CH ₂) ₂ OEt
CH ₂ O(CH ₂) ₂ Cl	(CH ₂) ₃ OH	C(Me) ₂ O(CH ₂) ₂ OPr-n
CH ₂ O(CH ₂) ₂ Br	CH ₂ OCH ₂ OMe	C(Me) ₂ O(CH ₂) ₂ OPr-i
CH(Me)OCF ₂ H	CH ₂ OCH ₂ OEt	(CH ₂) ₂ OCH ₂ OMe
CH(Me)OCF ₃	CH ₂ OCH ₂ OPr-n	(CH ₂) ₂ OCH ₂ OEt
CH(Me)OCH ₂ CF ₂ H	CH ₂ OCH ₂ OPr-i	(CH ₂) ₂ OCH ₂ OPr-n
CH(Me)OCH ₂ CF ₃	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	(CH ₂) ₂ OCH ₂ OPr-i
CH(Me)O(CH ₂) ₂ CF ₃	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OEt	(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂ OMe
CH(Me)O(CH ₂) ₂ Cl	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OPr-n	(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂ OEt
CH(Me)O(CH ₂) ₂ Br	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OPr-i	(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂ OPr-n
CH(Et)OCF ₂ H	CH ₂ OCH(Me)CH ₂ OMe	(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂ OPr-i
CH(Et)OCF ₃	CH ₂ OCH(Me)CH ₂ OEt	CH(Me)CH ₂ OCH ₂ OMe
CH(Et)OCH ₂ CF ₂ H	CH ₂ OCH ₂ CH(Me)OMe	CH(Me)CH ₂ OCH ₂ OEt
CH(Et)OCH ₂ CF ₃	CH ₂ OCH ₂ CH(Me)OEt	CH(Me)CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe
CH(Et)O(CH ₂) ₂ CF ₃	CH ₂ OCH(Me)OMe	CH(Me)CH ₂ O(CH ₂) ₂ OEt
CH(Et)O(CH ₂) ₂ Cl	CH ₂ OCH(Me)OEt	CH(Et)CH ₂ OCH ₂ OMe
CH(Et)O(CH ₂) ₂ Br	CH ₂ O(CH ₂) ₃ OMe	CH(Et)CH ₂ OCH ₂ OEt
C(Me) ₂ OCF ₂ H	CH ₂ O(CH ₂) ₃ OEt	CH(Et)CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe
C(Me) ₂ OCF ₃	CH(Me)OCH ₂ OMe	CH(Et)CH ₂ O(CH ₂) ₂ OEt
C(Me) ₂ OCH ₂ CF ₂ H	CH(Me)OCH ₂ OEt	CH(Et)O(CH ₂) ₂ OMe
C(Me) ₂ OCH ₂ CF ₃	CH(Me)OCH ₂ OPr-n	CH(Et)O(CH ₂) ₂ OEt
C(Me) ₂ O(CH ₂) ₂ CF ₃	CH(Me)OCH ₂ OPr-i	CH(Et)O(CH ₂) ₂ OPr-n
C(Me) ₂ O(CH ₂) ₂ Cl	CH(Me)O(CH ₂) ₂ OMe	CH(Et)O(CH ₂) ₂ OPr-i
C(Me) ₂ O(CH ₂) ₂ Br	CH(Me)O(CH ₂) ₂ OEt	CH(Pr-n)O(CH ₂) ₂ OMe
(CH ₂) ₂ OCF ₃	CH(Me)O(CH ₂) ₂ OPr-n	CH(Pr-n)O(CH ₂) ₂ OEt
(CH ₂) ₂ OCH ₂ CF ₂ H	CH(Me)O(CH ₂) ₂ OPr-i	CH(Pr-n)O(CH ₂) ₂ OPr-n
(CH ₂) ₂ OCH ₂ CF ₃	CH(Me)OCH(Me)CH ₂ OMe	CH(Pr-n)O(CH ₂) ₂ OPr-i
(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂ Cl	CH(Me)OCH(Me)CH ₂ OEt	CH(Pr-i)O(CH ₂) ₂ OMe
(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂ Br	CH(Me)OCH ₂ CH(Me)OMe	CH(Pr-i)O(CH ₂) ₂ OEt
CH ₂ OH	CH(Me)OCH ₂ CH(Me)OEt	CH(Pr-i)O(CH ₂) ₂ OPr-n
CH(Me)OH	C(Me) ₂ OCH ₂ OMe	CH(Pr-i)O(CH ₂) ₂ OPr-i
CH(Et)OH	C(Me) ₂ OCH ₂ OEt	CH ₂ OC(O)Me

[表15]

R ^{1a}	R ^{1a}	R ^{1a}
CH ₂ OC(O)Et	CH(Et)C(O)OEt	CH ₂ S(O)Pen-n
CH ₂ OC(O)Pr-i	CH(Et)C(O)OPr-i	CH ₂ S(O) ₂ Pen-n
CH(Me)OC(O)Me	CH(Et)C(O)OCH ₂ OMe	CH ₂ SPen-i
CH(Me)OC(O)Et	CH(Et)C(O)O(CH ₂) ₂ OMe	CH ₂ S(O)Pen-i
CH(Me)OC(O)Pr-i	CH(Et)C(O)O(CH ₂) ₂ OEt	CH ₂ S(O) ₂ Pen-i
CH(Et)OC(O)Me	CH(Et)C(O)O(CH ₂) ₂ OPr-i	CH ₂ SPen-s
CH(Et)OC(O)Et	(CH ₂) ₂ C(O)OMe	CH ₂ S(O)Pen-s
CH(Et)OC(O)Pr-i	(CH ₂) ₂ C(O)OEt	CH ₂ S(O) ₂ Pen-s
CH ₂ OPh	(CH ₂) ₂ C(O)O(CH ₂) ₂ OMe	CH ₂ SPen-t
CH(Me)OPh	(CH ₂) ₂ C(O)O(CH ₂) ₂ OEt	CH ₂ S(O)Pen-t
CH ₂ C(O)OMe	CH ₂ SMe	CH ₂ S(O) ₂ Pen-t
CH ₂ C(O)OEt	CH ₂ S(O)Me	CH ₂ SHex-n
CH ₂ C(O)OPr-n	CH ₂ S(O) ₂ Me	CH(Me)SMe
CH ₂ C(O)OPr-i	CH ₂ SEt	CH(Me)S(O)Me
CH ₂ C(O)OBu-n	CH ₂ S(O)Et	CH(Me)S(O) ₂ Me
CH ₂ C(O)OBu-i	CH ₂ S(O) ₂ Et	CH(Me)SEt
CH ₂ C(O)OBu-s	CH ₂ SPr-n	CH(Me)S(O)Et
CH ₂ C(O)OBu-t	CH ₂ S(O)Pr-n	CH(Me)S(O) ₂ Et
CH ₂ C(O)OPen-n	CH ₂ S(O) ₂ Pr-n	CH(Me)SPr-n
CH ₂ C(O)OPen-i	CH ₂ SPr-i	CH(Me)S(O)Pr-n
CH ₂ C(O)OPen-s	CH ₂ S(O)Pr-i	CH(Me)S(O) ₂ Pr-n
CH ₂ C(O)OPen-t	CH ₂ S(O) ₂ Pr-i	CH(Me)SPr-i
CH ₂ C(O)OHex-n	CH ₂ SBu-n	CH(Me)S(O)Pr-i
CH ₂ C(O)OCH ₂ OMe	CH ₂ S(O)Bu-n	CH(Me)S(O) ₂ Pr-i
CH ₂ C(O)O(CH ₂) ₂ OMe	CH ₂ S(O) ₂ Bu-n	CH(Me)SBu-n
CH ₂ C(O)O(CH ₂) ₂ OEt	CH ₂ SBu-i	CH(Me)S(O)Bu-n
CH ₂ C(O)O(CH ₂) ₂ OPr-i	CH ₂ S(O)Bu-i	CH(Me)S(O) ₂ Bu-n
CH(Me)C(O)OMe	CH ₂ S(O) ₂ Bu-i	CH(Me)SBu-i
CH(Me)C(O)OEt	CH ₂ SBu-s	CH(Me)S(O)Bu-i
CH(Me)C(O)OPr-i	CH ₂ S(O)Bu-s	CH(Me)S(O) ₂ Bu-i
CH(Me)C(O)OCH ₂ OMe	CH ₂ S(O) ₂ Bu-s	CH(Me)SBu-s
CH(Me)C(O)O(CH ₂) ₂ OMe	CH ₂ SBu-t	CH(Me)S(O)Bu-s
CH(Me)C(O)O(CH ₂) ₂ OEt	CH ₂ S(O)Bu-t	CH(Me)S(O) ₂ Bu-s
CH(Me)C(O)O(CH ₂) ₂ OPr-i	CH ₂ S(O) ₂ Bu-t	CH(Me)SBu-t
CH(Et)C(O)OMe	CH ₂ SPen-n	CH(Me)S(O)Bu-t

[表16]

R ^{1a}	R ^{1a}	R ^{1a}
CH(Me)S(O) ₂ Bu-t	C(Me) ₂ SBu-t	CH(Me)CH ₂ S(O) ₂ Me
CH(Me)SPen-n	C(Me) ₂ S(O)Bu-t	CH(Me)CH ₂ SEt
CH(Me)S(O)Pen-n	C(Me) ₂ S(O) ₂ Bu-t	CH(Me)CH ₂ S(O)Et
CH(Me)S(O) ₂ Pen-n	C(Me) ₂ SPen-n	CH(Me)CH ₂ S(O) ₂ Et
CH(Me)SPen-i	C(Me) ₂ S(O)Pen-n	CH(Me)CH ₂ SPr-n
CH(Me)S(O)Pen-i	C(Me) ₂ S(O) ₂ Pen-n	CH(Me)CH ₂ S(O)Pr-n
CH(Me)S(O) ₂ Pen-i	C(Me) ₂ SPen-i	CH(Me)CH ₂ S(O) ₂ Pr-n
CH(Me)SPen-s	C(Me) ₂ S(O)Pen-i	CH(Me)CH ₂ SPr-i
CH(Me)S(O)Pen-s	C(Me) ₂ S(O) ₂ Pen-i	CH(Me)CH ₂ S(O)Pr-i
CH(Me)S(O) ₂ Pen-s	C(Me) ₂ SPen-s	CH(Me)CH ₂ S(O) ₂ Pr-i
CH(Me)SPen-t	C(Me) ₂ S(O)Pen-s	CH(Et)CH ₂ SMe
CH(Me)S(O)Pen-t	C(Me) ₂ S(O) ₂ Pen-s	CH(Et)CH ₂ S(O)Me
CH(Me)S(O) ₂ Pen-t	C(Me) ₂ SPen-t	CH(Et)CH ₂ S(O) ₂ Me
CH(Me)SHex-n	C(Me) ₂ S(O)Pen-t	CH(Et)CH ₂ SEt
C(Me) ₂ SMe	C(Me) ₂ S(O) ₂ Pen-t	CH(Et)CH ₂ S(O)Et
C(Me) ₂ S(O)Me	(CH ₂) ₂ SMe	CH(Et)CH ₂ S(O) ₂ Et
C(Me) ₂ S(O) ₂ Me	(CH ₂) ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ CH ₂ SMe
C(Me) ₂ SEt	(CH ₂) ₂ S(O) ₂ Me	C(Me) ₂ CH ₂ S(O)Me
C(Me) ₂ S(O)Et	(CH ₂) ₂ SEt	C(Me) ₂ CH ₂ S(O) ₂ Me
C(Me) ₂ S(O) ₂ Et	(CH ₂) ₂ S(O)Et	C(Me) ₂ CH ₂ SEt
C(Me) ₂ SPr-n	(CH ₂) ₂ S(O) ₂ Et	C(Me) ₂ CH ₂ S(O)Et
C(Me) ₂ S(O)Pr-n	(CH ₂) ₂ SPr-n	C(Me) ₂ CH ₂ S(O) ₂ Et
C(Me) ₂ S(O) ₂ Pr-n	(CH ₂) ₂ S(O)Pr-n	C(Me) ₂ CH ₂ SPr-n
C(Me) ₂ SPr-i	(CH ₂) ₂ S(O) ₂ Pr-n	C(Me) ₂ CH ₂ S(O)Pr-n
C(Me) ₂ S(O)Pr-i	(CH ₂) ₂ SPr-i	C(Me) ₂ CH ₂ S(O) ₂ Pr-n
C(Me) ₂ S(O) ₂ Pr-i	(CH ₂) ₂ S(O)Pr-i	C(Me) ₂ CH ₂ SPr-i
C(Me) ₂ SBu-n	(CH ₂) ₂ S(O) ₂ Pr-i	C(Me) ₂ CH ₂ S(O)Pr-i
C(Me) ₂ S(O)Bu-n	(CH ₂) ₃ SMe	C(Me) ₂ CH ₂ S(O) ₂ Pr-i
C(Me) ₂ S(O) ₂ Bu-n	(CH ₂) ₃ S(O)Me	CH(Et)SMe
C(Me) ₂ SBu-i	(CH ₂) ₃ S(O) ₂ Me	CH(Et)S(O)Me
C(Me) ₂ S(O)Bu-i	(CH ₂) ₃ SEt	CH(Et)S(O) ₂ Me
C(Me) ₂ S(O) ₂ Bu-i	(CH ₂) ₃ S(O)Et	CH(Et)SEt
C(Me) ₂ SBu-s	(CH ₂) ₃ S(O) ₂ Et	CH(Et)S(O)Et
C(Me) ₂ S(O)Bu-s	CH(Me)CH ₂ SMe	CH(Et)S(O) ₂ Et
C(Me) ₂ S(O) ₂ Bu-s	CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH(Et)SPr-n

[表17]

R ^{1a}	R ^{1a}	R ^{1a}
CH(Et)S(O)Pr-n	CH ₂ SCH ₂ CF ₂ H	CH(Me)S(O)(CH ₂) ₂ CF ₃
CH(Et)S(O) ₂ Pr-n	CH ₂ S(O)CH ₂ CF ₂ H	CH(Me)S(O) ₂ (CH ₂) ₂ CF ₃
CH(Et)SPr-i	CH ₂ S(O) ₂ CH ₂ CF ₂ H	CH(Me)S(CH ₂) ₂ Cl
CH(Et)S(O)Pr-i	CH ₂ SCH ₂ CF ₃	CH(Me)S(O)(CH ₂) ₂ Cl
CH(Et)S(O) ₂ Pr-i	CH ₂ S(O)CH ₂ CF ₃	CH(Me)S(O) ₂ (CH ₂) ₂ Cl
CH(Pr-n)SMe	CH ₂ S(O) ₂ CH ₂ CF ₃	CH(Me)S(CH ₂) ₂ Br
CH(Pr-n)S(O)Me	CH ₂ S(CH ₂) ₂ CF ₃	CH(Me)S(O)(CH ₂) ₂ Br
CH(Pr-n)S(O) ₂ Me	CH ₂ S(O)(CH ₂) ₂ CF ₃	CH(Me)S(O) ₂ (CH ₂) ₂ Br
CH(Pr-n)SEt	CH ₂ S(O) ₂ (CH ₂) ₂ CF ₃	C(Me) ₂ SCF ₂ H
CH(Pr-n)S(O)Et	CH ₂ S(CH ₂) ₂ Cl	C(Me) ₂ S(O)CF ₂ H
CH(Pr-n)S(O) ₂ Et	CH ₂ S(O)(CH ₂) ₂ Cl	C(Me) ₂ S(O) ₂ CF ₂ H
CH(Pr-n)SPr-n	CH ₂ S(O) ₂ (CH ₂) ₂ Cl	C(Me) ₂ SCF ₃
CH(Pr-n)S(O)Pr-n	CH ₂ S(CH ₂) ₂ Br	C(Me) ₂ S(O)CF ₃
CH(Pr-n)S(O) ₂ Pr-n	CH ₂ S(O)(CH ₂) ₂ Br	C(Me) ₂ S(O) ₂ CF ₃
CH(Pr-n)SPr-i	CH ₂ S(O) ₂ (CH ₂) ₂ Br	C(Me) ₂ SCH ₂ CF ₂ H
CH(Pr-n)S(O)Pr-i	CH ₂ SCHFCH ₃	C(Me) ₂ S(O)CH ₂ CF ₂ H
CH(Pr-n)S(O) ₂ Pr-i	CH ₂ SCF ₂ CH ₃	C(Me) ₂ S(O) ₂ CH ₂ CF ₂ H
CH(Pr-i)SMe	CH ₂ SCF(CH ₃) ₂	C(Me) ₂ SCH ₂ CF ₃
CH(Pr-i)S(O)Me	CH ₂ SCF ₂ CF ₂ H	C(Me) ₂ S(O)CH ₂ CF ₃
CH(Pr-i)S(O) ₂ Me	CH ₂ SCF ₂ CF ₃	C(Me) ₂ S(O) ₂ CH ₂ CF ₃
CH(Pr-i)SEt	CH ₂ SCF ₂ CF ₂ CF ₃	C(Me) ₂ S(CH ₂) ₂ CF ₃
CH(Pr-i)S(O)Et	CH ₂ SCF(CF ₃) ₂	C(Me) ₂ S(O)(CH ₂) ₂ CF ₃
CH(Pr-i)S(O) ₂ Et	CH(Me)SCF ₂ H	C(Me) ₂ S(O) ₂ (CH ₂) ₂ CF ₃
CH(Pr-i)SPr-n	CH(Me)S(O)CF ₂ H	C(Me) ₂ S(CH ₂) ₂ Cl
CH(Pr-i)S(O)Pr-n	CH(Me)S(O) ₂ CF ₂ H	C(Me) ₂ S(O)(CH ₂) ₂ Cl
CH(Pr-i)S(O) ₂ Pr-n	CH(Me)SCF ₃	C(Me) ₂ S(O) ₂ (CH ₂) ₂ Cl
CH(Pr-i)SPr-i	CH(Me)S(O)CF ₃	C(Me) ₂ S(CH ₂) ₂ Br
CH(Pr-i)S(O)Pr-i	CH(Me)S(O) ₂ CF ₃	C(Me) ₂ S(O)(CH ₂) ₂ Br
CH(Pr-i)S(O) ₂ Pr-i	CH(Me)SCH ₂ CF ₂ H	C(Me) ₂ S(O) ₂ (CH ₂) ₂ Br
CH ₂ SCF ₂ H	CH(Me)S(O)CH ₂ CF ₂ H	(CH ₂) ₂ SCF ₃
CH ₂ S(O)CF ₂ H	CH(Me)S(O) ₂ CH ₂ CF ₂ H	(CH ₂) ₂ S(O)CF ₃
CH ₂ S(O) ₂ CF ₂ H	CH(Me)SCH ₂ CF ₃	(CH ₂) ₂ S(O) ₂ CF ₃
CH ₂ SCF ₃	CH(Me)S(O)CH ₂ CF ₃	(CH ₂) ₂ SCH ₂ CF ₂ H
CH ₂ S(O)CF ₃	CH(Me)S(O) ₂ CH ₂ CF ₃	(CH ₂) ₂ S(O)CH ₂ CF ₂ H
CH ₂ S(O) ₂ CF ₃	CH(Me)S(CH ₂) ₂ CF ₃	(CH ₂) ₂ S(O) ₂ CH ₂ CF ₂ H

[表18]

R ^{1a}	R ^{1a}	R ^{1a}
(CH ₂) ₂ SCH ₂ CF ₃	3-Cl-Ph	2-Cl-3-Me-Ph
(CH ₂) ₂ S(O)CH ₂ CF ₃	4-Cl-Ph	2-Cl-4-Me-Ph
(CH ₂) ₂ S(O) ₂ CH ₂ CF ₃	2-Br-Ph	2-Cl-5-Me-Ph
(CH ₂) ₂ S(CH ₂) ₂ Cl	3-Br-Ph	3-Cl-4-Me-Ph
(CH ₂) ₂ S(O)(CH ₂) ₂ Cl	4-Br-Ph	3-Cl-5-Me-Ph
(CH ₂) ₂ S(O) ₂ (CH ₂) ₂ Cl	2-Me-Ph	2-Cl-3-F-Ph
(CH ₂) ₂ S(CH ₂) ₂ Br	3-Me-Ph	2-Cl-4-F-Ph
(CH ₂) ₂ S(O)(CH ₂) ₂ Br	4-Me-Ph	2-Cl-5-F-Ph
(CH ₂) ₂ S(O) ₂ (CH ₂) ₂ Br	2-MeO-Ph	3-Cl-4-F-Ph
CH=CH ₂	3-MeO-Ph	3-Cl-5-F-Ph
CH=CHMe	4-MeO-Ph	2-F-3-Me-Ph
CH=CMe ₂	2,3-(F) ₂ -Ph	2-F-4-Me-Ph
CH ₂ CH=CH ₂	2,4-(F) ₂ -Ph	2-F-5-Me-Ph
CH ₂ CH=CHMe	2,5-(F) ₂ -Ph	3-F-4-Me-Ph
CH ₂ C(Me)=CH ₂	2,6-(F) ₂ -Ph	3-F-5-Me-Ph
(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂	3,4-(F) ₂ -Ph	2-F-3-Cl-Ph
C(Me)=CH ₂	3,5-(F) ₂ -Ph	2-F-4-Cl-Ph
C(Me)=CHMe	2,3-(Cl) ₂ -Ph	2-F-5-Cl-Ph
C(Me)=CMe ₂	2,4-(Cl) ₂ -Ph	3-F-4-Cl-Ph
CH(Me)CH=CH ₂	2,5-(Cl) ₂ -Ph	3-F-5-Cl-Ph
C(Et)=CH ₂	2,6-(Cl) ₂ -Ph	2-Me-3-F-Ph
C(Et)=CHMe	3,4-(Cl) ₂ -Ph	2-Me-4-F-Ph
C(Et)=CMe ₂	3,5-(Cl) ₂ -Ph	2-Me-5-F-Ph
CH(Et)CH=CH ₂	2,3-(Me) ₂ -Ph	3-Me-4-F-Ph
C≡CH	2,4-(Me) ₂ -Ph	3-Me-5-F-Ph
C≡CMe	2,5-(Me) ₂ -Ph	2-Cl-3-MeO-Ph
CH ₂ C≡CH	2,6-(Me) ₂ -Ph	2-Cl-4-MeO-Ph
CH ₂ C≡CMe	3,4-(Me) ₂ -Ph	2-Cl-5-MeO-Ph
CH(Me)C≡CH	3,5-(Me) ₂ -Ph	2-Cl-6-MeO-Ph
CH(Me)C≡CMe	2,3-(MeO) ₂ -Ph	3-Cl-4-MeO-Ph
Ph	2,4-(MeO) ₂ -Ph	3-Cl-5-MeO-Ph
2-F-Ph	2,5-(MeO) ₂ -Ph	2-F-3-MeO-Ph
3-F-Ph	2,6-(MeO) ₂ -Ph	2-F-4-MeO-Ph
4-F-Ph	3,4-(MeO) ₂ -Ph	2-F-5-MeO-Ph
2-Cl-Ph	3,5-(MeO) ₂ -Ph	2-F-6-MeO-Ph

[表19]

R ^{1a}	R ^{1a}	R ^{1a}
3-F-4-MeO-Ph	D-8	CH ₂ (2,4-(MeO) ₂ -Ph)
3-F-5-MeO-Ph	D-8a	CH ₂ (2,5-(MeO) ₂ -Ph)
2-MeO-3-F-Ph	D-8b	CH ₂ (2,6-(MeO) ₂ -Ph)
2-MeO-4-F-Ph	D-8c	CH ₂ (3,4-(MeO) ₂ -Ph)
2-MeO-5-F-Ph	D-8d	CH ₂ (3,5-(MeO) ₂ -Ph)
2-MeO-6-F-Ph	D-8e	CH(Me)(2-MeO-Ph)
3-MeO-4-F-Ph	D-8f	CH(Me)(3-MeO-Ph)
3-MeO-5-F-Ph	D-8g	CH(Me)(4-MeO-Ph)
2-MeO-3-Cl-Ph	D-8h	CH(Me)(2,3-(MeO) ₂ -Ph)
2-MeO-4-Cl-Ph	D-10a	CH(Me)(2,4-(MeO) ₂ -Ph)
2-MeO-5-Cl-Ph	D-11	CH(Me)(2,5-(MeO) ₂ -Ph)
2-MeO-6-Cl-Ph	D-14	CH(Me)(2,6-(MeO) ₂ -Ph)
3-MeO-4-Cl-Ph	D-16	CH(Me)(3,4-(MeO) ₂ -Ph)
3-MeO-5-Cl-Ph	D-16a	CH(Me)(3,5-(MeO) ₂ -Ph)
2-Me-3-MeO-Ph	D-16b	CH(Et)(2-MeO-Ph)
2-Me-4-MeO-Ph	D-16c	CH(Et)(3-MeO-Ph)
2-Me-5-MeO-Ph	D-16d	CH(Et)(4-MeO-Ph)
2-Me-6-MeO-Ph	D-16e	(CH ₂) ₂ (2-MeO-Ph)
3-Me-4-MeO-Ph	D-16f	(CH ₂) ₂ (3-MeO-Ph)
3-Me-5-MeO-Ph	D-16g	(CH ₂) ₂ (4-MeO-Ph)
2-MeO-3-Me-Ph	D-16h	CHO
2-MeO-4-Me-Ph	D-16i	SMe
2-MeO-5-Me-Ph	D-16j	S(O)Me
2-MeO-6-Me-Ph	D-16k	S(O) ₂ Me
3-MeO-4-Me-Ph	D-16m	SEt
3-MeO-5-Me-Ph	D-16n	S(O)Et
3,5-(F) ₂ -4-Me-Ph	D-16p	S(O) ₂ Et
3,5-(F) ₂ -4-MeO-Ph	D-17	SPr-n
3,4,5-(MeO) ₃ -Ph	D-17a	S(O)Pr-n
D-3	D-17b	S(O) ₂ Pr-n
D-3a	CH ₂ Ph	SPr-i
D-4	CH ₂ (2-MeO-Ph)	S(O)Pr-i
D-4a	CH ₂ (3-MeO-Ph)	S(O) ₂ Pr-i
D-4b	CH ₂ (4-MeO-Ph)	SPr-c
D-5	CH ₂ (2,3-(MeO) ₂ -Ph)	S(O)Pr-c

[表20]

R ^{1a}	R ^{1a}	R ^{1a}
S(O) ₂ Pr-c	S(O)Pen-t	SCHFCH ₃
S(D-16)	S(O) ₂ Pen-t	SCF ₂ CH ₃
S(O)(D-16)	SHex-n	SCF(CH ₃) ₂
S(O) ₂ (D-16)	SHex-c	SCF ₂ CF ₂ H
S(D-16e)	SCH ₂ CH=CH ₂	SCF ₂ CF ₃
S(O)(D-16e)	S(O)CH ₂ CH=CH ₂	SCF ₂ CF ₂ CF ₃
S(O) ₂ (D-16e)	S(O) ₂ CH ₂ CH=CH ₂	SCF(CF ₃)
SBu-n	SCH(Me)CH=CH ₂	SCH ₂ OMe
S(O)Bu-n	SC(Me) ₂ CH=CH ₂	S(CH ₂) ₂ OMe
S(O) ₂ Bu-n	SCH ₂ CH=CHMe	S(O)(CH ₂) ₂ OMe
SBu-i	SCH ₂ C(Me)=CH ₂	S(O) ₂ (CH ₂) ₂ OMe
S(O)Bu-i	S(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂	SCH(Me)CH ₂ OMe
S(O) ₂ Bu-i	SC(Me)=CH ₂	S(O)CH(Me)CH ₂ OMe
SBu-c	SC(Me)=CH(Me)	S(O) ₂ CH(Me)CH ₂ OMe
S(O)Bu-c	SCH ₂ C≡CH	SCH ₂ CH(Me)OMe
S(O) ₂ Bu-c	S(O)CH ₂ C≡CH	S(O)CH ₂ CH(Me)OMe
SBu-s	S(O) ₂ CH ₂ C≡CH	S(O) ₂ CH ₂ CH(Me)OMe
S(O)Bu-s	SCH(Me)C≡CH	SC(Me) ₂ CH ₂ OMe
S(O) ₂ Bu-s	SC(Me) ₂ C≡CH	S(CH ₂) ₃ OMe
SBu-t	SCH ₂ C≡CMe	SCH ₂ OEt
S(O)Bu-t	SCH ₂ Cl	S(CH ₂) ₂ OEt
S(O) ₂ Bu-t	SCH(Me)Cl	S(O)(CH ₂) ₂ OEt
SPen-n	S(CH ₂) ₂ Cl	S(O) ₂ (CH ₂) ₂ OEt
S(O)Pen-n	S(O)(CH ₂) ₂ Cl	SCH(Me)CH ₂ OEt
S(O) ₂ Pen-n	S(O) ₂ (CH ₂) ₂ Cl	SCH ₂ OPr-i
SPen-i	SCH(Me)CH ₂ Cl	S(CH ₂) ₂ OPr-i
S(O)Pen-i	SCH ₂ CH(Me)Cl	S(O)(CH ₂) ₂ OPr-i
S(O) ₂ Pen-i	S(CH ₂) ₃ Cl	S(O) ₂ (CH ₂) ₂ OPr-i
SPen-c	SCF ₃	SCH(Me)CH ₂ OPr-i
S(O)Pen-c	SCH ₂ CF ₃	SCH ₂ Pr-c
S(O) ₂ Pen-c	S(O)CH ₂ CF ₃	S(O)CH ₂ Pr-c
SPen-s	S(O) ₂ CH ₂ CF ₃	S(O) ₂ CH ₂ Pr-c
S(O)Pen-s	SCH(Me)CF ₃	SCH(Me)Pr-c
S(O) ₂ Pen-s	S(CH ₂) ₂ CF ₃	S(O)CH(Me)Pr-c
SPen-t	S(CH ₂) ₃ CF ₃	S(O) ₂ CH(Me)Pr-c

[表21]

R ^{1a}	R ^{1a}	R ^{1a}
S(CH ₂) ₂ Pr-c	SCH(Me)Ph	SCH ₂ (D-8f)
SCH ₂ (D-16)	S(O)CH(Me)Ph	S(O) ₂ CH ₂ (D-8f)
S(O)CH ₂ (D-16)	S(O) ₂ CH(Me)Ph	SCH ₂ (D-8g)
S(O) ₂ CH ₂ (D-16)	SCH ₂ (2-MeO-Ph)	S(O) ₂ CH ₂ (D-8g)
SCH ₂ (D-16e)	S(O)CH ₂ (2-MeO-Ph)	SCH ₂ (D-8h)
S(O)CH ₂ (D-16e)	S(O) ₂ CH ₂ (2-MeO-Ph)	S(O) ₂ CH ₂ (D-8h)
S(O) ₂ CH ₂ (D-16e)	SCH(Me)(2-MeO-Ph)	SCH ₂ (D-15)
SCH ₂ Bu-c	S(O)CH(Me)(2-MeO-Ph)	S(O)CH ₂ (D-15)
S(O)CH ₂ Bu-c	S(O) ₂ CH(Me)(2-MeO-Ph)	S(O) ₂ CH ₂ (D-15)
S(O) ₂ CH ₂ Bu-c	SCH ₂ (3-MeO-Ph)	SCH(Me)(D-15)
SCH(Me)Bu-c	S(O)CH ₂ (3-MeO-Ph)	S(O)CH(Me)(D-15)
S(CH ₂) ₂ Bu-c	S(O) ₂ CH ₂ (3-MeO-Ph)	S(O) ₂ CH(Me)(D-15)
SCH ₂ Pen-c	SCH(Me)(3-MeO-Ph)	S(CH ₂) ₂ (D-15)
S(O)CH ₂ Pen-c	S(O)CH(Me)(3-MeO-Ph)	S(O)(CH ₂) ₂ (D-15)
S(O) ₂ CH ₂ Pen-c	S(O) ₂ CH(Me)(3-MeO-Ph)	S(O) ₂ (CH ₂) ₂ (D-15)
SCH(Me)Pen-c	SCH ₂ (4-MeO-Ph)	NHMe
S(CH ₂) ₂ Pen-c	S(O)CH ₂ (4-MeO-Ph)	NHEt
SCH ₂ Hex-c	S(O) ₂ CH ₂ (4-MeO-Ph)	NHPr-n
SCH(Me)Hex-c	SCH(Me)(4-MeO-Ph)	NHPr-i
S(CH ₂) ₂ Hex-c	S(O)CH(Me)(4-MeO-Ph)	NHPr-c
SCH ₂ CN	S(O) ₂ CH(Me)(4-MeO-Ph)	NH(D-16)
S(O)CH ₂ CN	SCH ₂ (D-8a)	NH(D-16e)
S(O) ₂ CH ₂ CN	S(O)CH ₂ (D-8a)	NHBu-n
SCH(Me)CN	S(O) ₂ CH ₂ (D-8a)	NHBu-i
S(O)CH(Me)CN	SCH ₂ (D-8b)	NHBu-c
S(O) ₂ CH(Me)CN	S(O)CH ₂ (D-8b)	NHBu-s
SC(Me) ₂ CN	S(O) ₂ CH ₂ (D-8b)	NHBu-t
S(O)C(Me) ₂ CN	SCH ₂ (D-8c)	NHPen-n
S(O) ₂ C(Me) ₂ CN	S(O)CH ₂ (D-8c)	NHPen-i
S(CH ₂) ₂ CN	S(O) ₂ CH ₂ (D-8c)	NHPen-c
S(O)(CH ₂) ₂ CN	SCH ₂ (D-8d)	NHPen-s
S(O) ₂ (CH ₂) ₂ CN	S(O)CH ₂ (D-8d)	NHPen-t
SCH ₂ Ph	S(O) ₂ CH ₂ (D-8d)	NH(3-Pen)
S(O)CH ₂ Ph	SCH ₂ (D-8e)	NHHex-n
S(O) ₂ CH ₂ Ph	S(O) ₂ CH ₂ (D-8e)	NHHex-c

[表22]

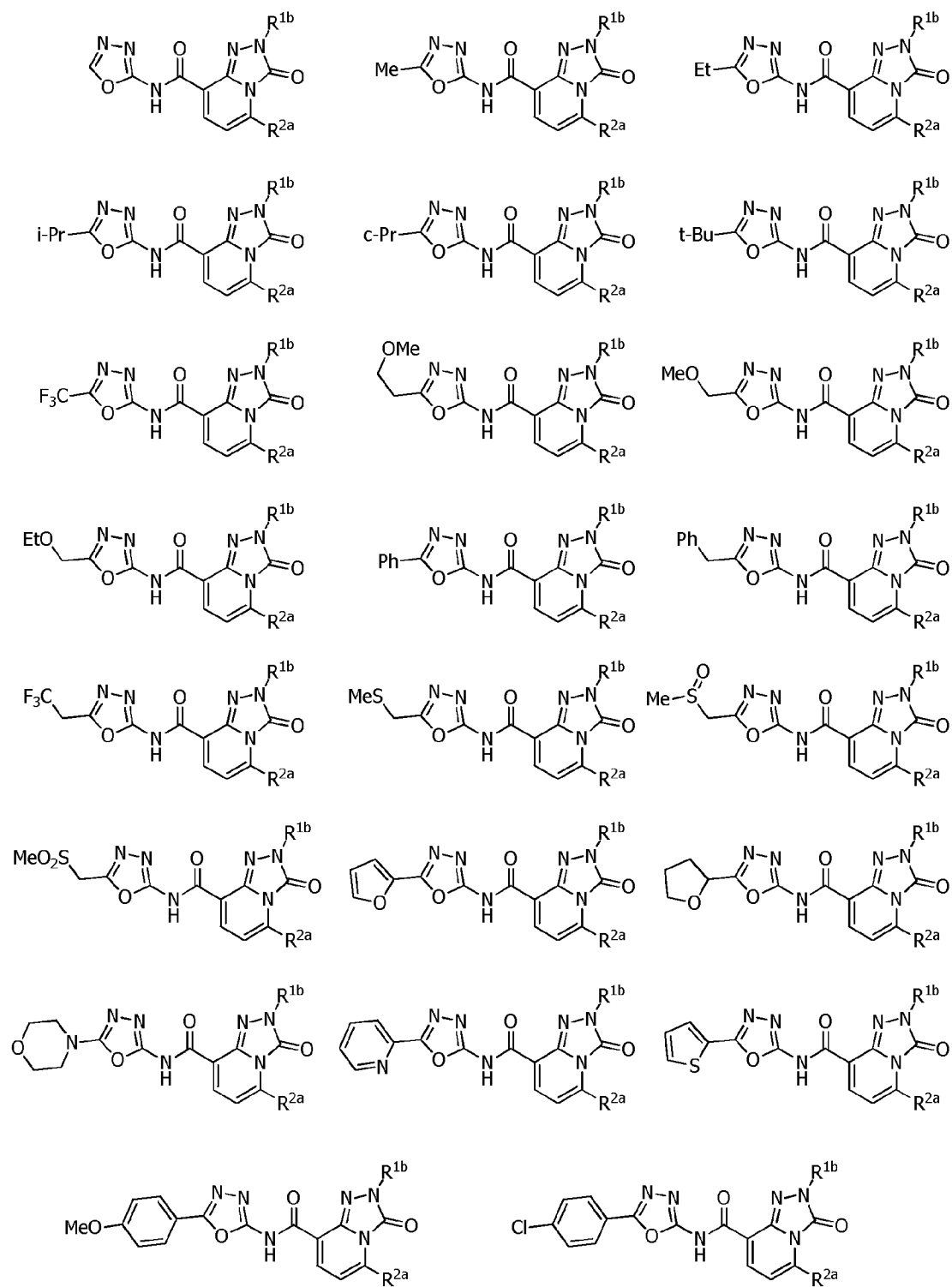
R ^{1a}	R ^{1a}	R ^{1a}
N(Me)Me	N(Pr-n)Bu-n	N(Et)(CH ₂) ₂ OEt
N(Me)Et	N(Pr-n)Bu-i	N(Et)(CH ₂) ₂ OPr-n
N(Me)Pr-n	N(Pr-n)Bu-c	N(Et)(CH ₂) ₂ OPr-i
N(Me)Pr-i	N(Pr-n)Bu-s	N(Pr-n)(CH ₂) ₂ OMe
N(Me)Pr-c	N(Pr-i)Pr-i	N(Pr-n)(CH ₂) ₂ OEt
N(Me)(D-16)	N(Pr-i)Pr-c	N(Pr-n)(CH ₂) ₂ OPr-n
N(Me)(D-16e)	N(Pr-i)(D-16)	N(Pr-n)(CH ₂) ₂ OPr-i
N(Me)Bu-n	N(Pr-i)(D-16e)	N(Pr-i)(CH ₂) ₂ OMe
N(Me)Bu-i	N(Pr-i)Bu-n	N(Pr-i)(CH ₂) ₂ OEt
N(Me)Bu-c	N(Pr-i)Bu-i	N(Pr-i)(CH ₂) ₂ OPr-n
N(Me)Bu-s	N(Pr-i)Bu-c	N(Pr-i)(CH ₂) ₂ OPr-i
N(Me)Bu-t	N(Pr-i)Bu-s	NHCH ₂ SMe
N(Me)Pen-n	NHCH ₂ OMe	NHCH ₂ SEt
N(Me)Pen-i	NHCH ₂ OEt	NHCH(Me)SMe
N(Me)Pen-c	NHCH(Me)OMe	NHCH(Me)SEt
N(Me)Pen-s	NHCH(Me)OEt	NHC(Me) ₂ SMe
N(Me)Pen-t	NHC(Me) ₂ OMe	NHC(Me) ₂ SEt
N(Me)(3-Pen)	NHC(Me) ₂ OEt	NH(CH ₂) ₂ SMe
N(Me)Hex-n	NH(CH ₂) ₂ OMe	NH(CH ₂) ₂ S(O)Me
N(Me)Hex-c	NH(CH ₂) ₂ OEt	NH(CH ₂) ₂ S(O) ₂ Me
N(Et)Et	NH(CH ₂) ₂ OPr-n	NH(CH ₂) ₂ SEt
N(Et)Pr-n	NH(CH ₂) ₂ OPr-i	NH(CH ₂) ₂ S(O)Et
N(Et)Pr-i	N(Me)CH ₂ OMe	NH(CH ₂) ₂ S(O) ₂ Et
N(Et)Pr-c	N(Me)CH ₂ OEt	NH(CH ₂) ₂ SPr-i
N(Et)(D-16)	N(Me)CH(Me)OMe	NH(CH ₂) ₂ S(O)Pr-i
N(Et)(D-16e)	N(Me)CH(Me)OEt	NH(CH ₂) ₂ S(O) ₂ Pr-i
N(Et)Bu-n	N(Me)C(Me) ₂ OMe	N(Me)CH ₂ SMe
N(Et)Bu-i	N(Me)C(Me) ₂ OEt	N(Me)CH ₂ SEt
N(Et)Bu-c	N(Me)(CH ₂) ₂ OMe	N(Me)CH(Me)SMe
N(Et)Bu-s	N(Me)(CH ₂) ₂ OEt	N(Me)CH(Me)SEt
N(Pr-n)Pr-n	N(Me)(CH ₂) ₂ OPr-n	N(Me)C(Me) ₂ SMe
N(Pr-n)Pr-i	N(Me)(CH ₂) ₂ OPr-i	N(Me)C(Me) ₂ SEt
N(Pr-n)Pr-c	N(Et)C(Me) ₂ OMe	N(Me)(CH ₂) ₂ SMe
N(Pr-n)(D-16)	N(Et)C(Me) ₂ OEt	N(Me)(CH ₂) ₂ S(O)Me
N(Pr-n)(D-16e)	N(Et)(CH ₂) ₂ OMe	N(Me)(CH ₂) ₂ S(O) ₂ Me

[表23]

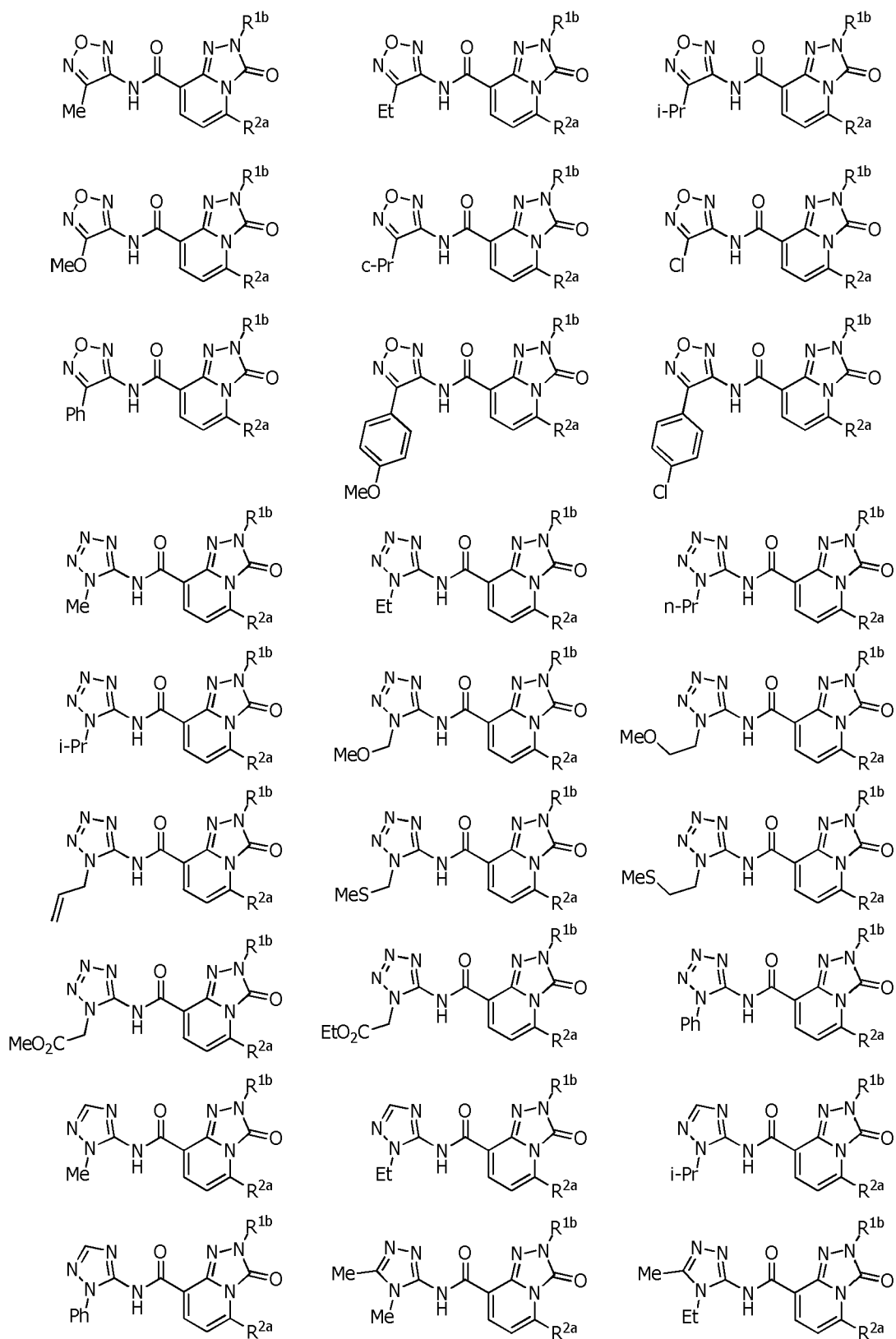
R ^{1a}	R ^{1a}
N(Me)(CH ₂) ₂ SEt	NH(4-MeO-Ph)
N(Me)(CH ₂) ₂ S(O)Et	NH(2,3-(MeO) ₂ -Ph)
N(Me)(CH ₂) ₂ S(O) ₂ Et	NH(2,4-(MeO) ₂ -Ph)
N(Me)(CH ₂) ₂ SPr-i	NH(2,5-(MeO) ₂ -Ph)
N(Me)(CH ₂) ₂ S(O)Pr-i	NH(2,6-(MeO) ₂ -Ph)
N(Me)(CH ₂) ₂ S(O) ₂ Pr-i	NH(3,4-(MeO) ₂ -Ph)
NHCF ₂ H	NH(3,5-(MeO) ₂ -Ph)
NHCF ₃	N(Me)Ph
NHCH ₂ CF ₂ H	N(Me)(2-MeO-Ph)
NHCH ₂ CF ₃	N(Me)(3-MeO-Ph)
NH(CH ₂) ₂ CF ₃	N(Me)(4-MeO-Ph)
NH(CH ₂) ₂ Cl	N(Me)(2,3-(MeO) ₂ -Ph)
NH(CH ₂) ₃ Cl	N(Me)(2,4-(MeO) ₂ -Ph)
N(Me)CF ₂ H	N(Me)(2,5-(MeO) ₂ -Ph)
N(Me)CF ₃	N(Me)(2,6-(MeO) ₂ -Ph)
N(Me)CH ₂ CF ₂ H	N(Me)(3,4-(MeO) ₂ -Ph)
N(Me)CH ₂ CF ₃	N(Me)(3,5-(MeO) ₂ -Ph)
N(Me)(CH ₂) ₂ CF ₃	
N(Me)(CH ₂) ₂ Cl	
N(Me)(CH ₂) ₃ Cl	
NHCH ₂ CH=CH ₂	
N(Me)CH ₂ CH=CH ₂	
NHCH ₂ C≡CH	
NHCH ₂ C≡CMe	
N(Me)CH ₂ C≡CH	
N(Me)CH ₂ C≡CMe	
NHCH ₂ CN	
NH(CH ₂) ₂ CN	
NH(CH ₂) ₃ CN	
N(Me)CH ₂ CN	
N(Me)(CH ₂) ₂ CN	
N(Me)(CH ₂) ₃ CN	
NHPh	
NH(2-MeO-Ph)	
NH(3-MeO-Ph)	

[0191] [第3表]

[化41]



[化42]



[表24]

R ^{2a}	R ^{1b}	R ^{2a}	R ^{1b}
CF ₂ H	Me	CF ₂ Cl	Pen-c
CF ₂ H	Et	CF ₂ Cl	Pen-s
CF ₂ H	Pr-n	CF ₂ Cl	Pen-t
CF ₂ H	Pr-i	CF ₂ Cl	3-Pen
CF ₂ H	Pr-c	CF ₂ Cl	Hex-n
CF ₂ H	Bu-n	CF ₂ Cl	Hex-c
CF ₂ H	Bu-i	CF ₂ Cl	CH ₂ Ph
CF ₂ H	Bu-c	CF ₂ Cl	CH(Me)Ph
CF ₂ H	Bu-s	CF ₂ Cl	(CH ₂) ₂ Ph
CF ₂ H	Bu-t	CF ₂ Cl	(CH ₂) ₃ Ph
CF ₂ H	Pen-n	CF ₂ Br	Me
CF ₂ H	Pen-i	CF ₂ Br	Et
CF ₂ H	Pen-c	CF ₂ Br	Pr-n
CF ₂ H	Pen-s	CF ₂ Br	Pr-i
CF ₂ H	Pen-t	CF ₂ Br	Pr-c
CF ₂ H	3-Pen	CF ₂ Br	Bu-n
CF ₂ H	Hex-n	CF ₂ Br	Bu-i
CF ₂ H	Hex-c	CF ₂ Br	Bu-c
CF ₂ H	CH ₂ Ph	CF ₂ Br	Bu-s
CF ₂ H	CH(Me)Ph	CF ₂ Br	Bu-t
CF ₂ H	(CH ₂) ₂ Ph	CF ₂ Br	CH ₂ Ph
CF ₂ H	(CH ₂) ₃ Ph	CF ₂ Br	CH(Me)Ph
CF ₂ Cl	Me	CF ₃	Me
CF ₂ Cl	Et	CF ₃	Et
CF ₂ Cl	Pr-n	CF ₃	Pr-n
CF ₂ Cl	Pr-i	CF ₃	Pr-i
CF ₂ Cl	Pr-c	CF ₃	Pr-c
CF ₂ Cl	Bu-n	CF ₃	Bu-n
CF ₂ Cl	Bu-i	CF ₃	Bu-i
CF ₂ Cl	Bu-c	CF ₃	Bu-c
CF ₂ Cl	Bu-s	CF ₃	Bu-s
CF ₂ Cl	Bu-t	CF ₃	Bu-t
CF ₂ Cl	Pen-n	CF ₃	Pen-n
CF ₂ Cl	Pen-i	CF ₃	Pen-i

[表25]

R ^{2a}	R ^{1b}	R ^{2a}	R ^{1b}
CF ₃	Pen-c	CHFCH ₃	Me
CF ₃	Pen-s	CHFCH ₃	Et
CF ₃	Pen-t	CHFCH ₃	Pr-n
CF ₃	3-Pen	CHFCH ₃	Pr-i
CF ₃	Hex-n	CHFCH ₃	Pr-c
CF ₃	Hex-c	CHFCH ₃	Bu-n
CF ₃	CH ₂ Ph	CHFCH ₃	Bu-i
CF ₃	CH(Me)Ph	CHFCH ₃	Bu-c
CF ₃	(CH ₂) ₂ Ph	CHFCH ₃	Bu-s
CF ₃	(CH ₂) ₃ Ph	CHFCH ₃	Bu-t
CH ₂ CF ₂ H	Me	CHFCH ₃	CH ₂ Ph
CH ₂ CF ₂ H	Et	CHFCH ₃	CH(Me)Ph
CH ₂ CF ₂ H	Pr-n	CF ₂ CH ₃	Me
CH ₂ CF ₂ H	Pr-i	CF ₂ CH ₃	Et
CH ₂ CF ₂ H	Pr-c	CF ₂ CH ₃	Pr-n
CH ₂ CF ₂ H	Bu-n	CF ₂ CH ₃	Pr-i
CH ₂ CF ₂ H	Bu-i	CF ₂ CH ₃	Pr-c
CH ₂ CF ₂ H	Bu-c	CF ₂ CH ₃	Bu-n
CH ₂ CF ₂ H	Bu-s	CF ₂ CH ₃	Bu-i
CH ₂ CF ₂ H	Bu-t	CF ₂ CH ₃	Bu-c
CH ₂ CF ₂ H	CH ₂ Ph	CF ₂ CH ₃	Bu-s
CH ₂ CF ₂ H	CH(Me)Ph	CF ₂ CH ₃	Bu-t
CH ₂ CF ₃	Me	CF ₂ CH ₃	CH ₂ Ph
CH ₂ CF ₃	Et	CF ₂ CH ₃	CH(Me)Ph
CH ₂ CF ₃	Pr-n	CF(CH ₃) ₂	Me
CH ₂ CF ₃	Pr-i	CF(CH ₃) ₂	Et
CH ₂ CF ₃	Pr-c	CF(CH ₃) ₂	Pr-n
CH ₂ CF ₃	Bu-n	CF(CH ₃) ₂	Pr-i
CH ₂ CF ₃	Bu-i	CF(CH ₃) ₂	Pr-c
CH ₂ CF ₃	Bu-c	CF(CH ₃) ₂	Bu-n
CH ₂ CF ₃	Bu-s	CF(CH ₃) ₂	Bu-i
CH ₂ CF ₃	Bu-t	CF(CH ₃) ₂	Bu-c
CH ₂ CF ₃	CH ₂ Ph	CF(CH ₃) ₂	Bu-s
CH ₂ CF ₃	CH(Me)Ph	CF(CH ₃) ₂	Bu-t

[表26]

R ^{2a}	R ^{1b}	R ^{2a}	R ^{1b}
CF(CH ₃) ₂	CH ₂ Ph	CF ₂ CF ₃	Pen-n
CF(CH ₃) ₂	CH(Me)Ph	CF ₂ CF ₃	Pen-i
CF ₂ CF ₂ H	Me	CF ₂ CF ₃	Pen-c
CF ₂ CF ₂ H	Et	CF ₂ CF ₃	Pen-s
CF ₂ CF ₂ H	Pr-n	CF ₂ CF ₃	Pen-t
CF ₂ CF ₂ H	Pr-i	CF ₂ CF ₃	3-Pen
CF ₂ CF ₂ H	Pr-c	CF ₂ CF ₃	Hex-n
CF ₂ CF ₂ H	Bu-n	CF ₂ CF ₃	Hex-c
CF ₂ CF ₂ H	Bu-i	CF ₂ CF ₃	CH ₂ Ph
CF ₂ CF ₂ H	Bu-c	CF ₂ CF ₃	CH(Me)Ph
CF ₂ CF ₂ H	Bu-s	CF ₂ CF ₃	(CH ₂) ₂ Ph
CF ₂ CF ₂ H	Bu-t	CF ₂ CF ₃	(CH ₂) ₃ Ph
CF ₂ CF ₂ H	Pen-n	CF ₂ CF ₂ CF ₃	Me
CF ₂ CF ₂ H	Pen-i	CF ₂ CF ₂ CF ₃	Et
CF ₂ CF ₂ H	Pen-c	CF ₂ CF ₂ CF ₃	Pr-n
CF ₂ CF ₂ H	Pen-s	CF ₂ CF ₂ CF ₃	Pr-i
CF ₂ CF ₂ H	Pen-t	CF ₂ CF ₂ CF ₃	Pr-c
CF ₂ CF ₂ H	3-Pen	CF ₂ CF ₂ CF ₃	Bu-n
CF ₂ CF ₂ H	Hex-n	CF ₂ CF ₂ CF ₃	Bu-i
CF ₂ CF ₂ H	Hex-c	CF ₂ CF ₂ CF ₃	Bu-s
CF ₂ CF ₂ H	CH ₂ Ph	CF ₂ CF ₂ CF ₃	Bu-t
CF ₂ CF ₂ H	CH(Me)Ph	CF(CF ₃) ₂	Me
CF ₂ CF ₂ H	(CH ₂) ₂ Ph	CF(CF ₃) ₂	Et
CF ₂ CF ₂ H	(CH ₂) ₃ Ph	CF(CF ₃) ₂	Pr-n
CF ₂ CF ₃	Me	CF(CF ₃) ₂	Pr-i
CF ₂ CF ₃	Et	CF(CF ₃) ₂	Pr-c
CF ₂ CF ₃	Pr-n	CF(CF ₃) ₂	Bu-n
CF ₂ CF ₃	Pr-i	CF(CF ₃) ₂	Bu-i
CF ₂ CF ₃	Pr-c	CF(CF ₃) ₂	Bu-s
CF ₂ CF ₃	Bu-n	CF(CF ₃) ₂	Bu-t
CF ₂ CF ₃	Bu-i		
CF ₂ CF ₃	Bu-c		
CF ₂ CF ₃	Bu-s		
CF ₂ CF ₃	Bu-t		

[0192] 本発明化合物は水田用の除草剤として、湛水下の土壌処理及び茎葉処理の

いずれの処理方法においても使用できる。水田雑草としては、例えば、ヒルムシロ (*Potamogeton distinctus*) 等に代表されるヒルムシロ科 (*Potamogetonaceae*) 雑草、ヘラオモダカ (*Alisma canaliculatum*)、ウリカワ (*Sagittaria pygmaea*) 及びオモダカ (*Sagittaria trifolia*) 等に代表されるオモダカ科 (*Alismataceae*) 雑草、アゼガヤ (*Leptochloa chinensis*)、イヌビエ (*Echinochloa crus-galli*)、タイヌビエ (*Echinochloa oryzicola*)、アシカキ (*Homalocenchrus japonicus*) 及びキシウスズメノヒエ (*Paspalum distichum*) 等に代表されるイネ科 (*Gramineae*) 雑草、クログワイ (*Eleocharis kuroguwai*)、ホタルイ (*Scirpus juncooides*)、シズイ (*Scirpus nipponicus*)、ミズガヤツリ (*Cyperus serotinus*)、タマガヤツリ (*Cyperus difformis*) 及びヒナガヤツリ (*Cyperus hakonensis*) 等に代表されるカヤツリグサ科 (*Cyperaceae*) 雑草、ウキクサ (*Spirodela polyrhiza*) 及びアオウキクサ (*Lemna paucicostata*) 等に代表されるウキクサ科 (*Lemnaceae*) 雑草、イボクサ (*Murdannia keisak*) 等に代表されるツユクサ科 (*Commelinaceae*) 雑草、ミズアオイ (*Monochoria korsakowii*) 及びコナギ (*Monochoria vaginalis*) 等に代表されるミズアオイ科 (*Pontederiaceae*) 雑草、ミゾハコベ (*Elatine triandra*) 等に代表されるミゾハコベ科 (*Elatinaceae*) 雑草、ヒメミソハギ (*Ammannia multiflora*) 及びキカシグサ (*Rotala indica*) 等に代表されるミソハギ科 (*Lythraceae*) 雑草、チョウジタデ (*Lidwigia epilobioides*) 等に代表されるアカバナ科 (*Oenot*

heraceae) 雑草、アブノメ (*Dopatrium junceum*)、オオアブノメ (*Gratiola japonica*)、キクモ (*Limnophila sessilifolia*)、アゼナ (*Lindernia pyxidaria*) 及びアメリカアゼナ (*Lindernia dubia*) 等に代表されるゴマノハグサ科 (*Scrophulariaceae*) 雑草、クサネム (*Aeschynomene indica*) 等に代表されるマメ科 (*Leguminosae*) 雑草、並びにアメリカセンダングサ (*Bidens frondosa*) 及びタウコギ (*Bidens tripartita*) 等に代表されるキク科 (*Compositae*) 雑草等が挙げられる。

[0193] また、本発明化合物は、畑地及び果樹園用の除草剤として、土壌処理、土壌混和処理及び茎葉処理のいずれの処理方法においても使用できる。畑地雑草としては、例えば、イヌホウズキ (*Solanum nigrum*) 及びチョウセンアサガオ (*Datura stramonium*) 等に代表されるナス科 (*Solanaceae*) 雑草、アメリカフウロ (*Geranium carolinianum*) 等に代表されるフウロソウ科 (*Geraniaceae*) 雑草、イチビ (*Abutilon theophrasti*) 及びアメリカキンゴジカ (*Sida spinosa*) 等に代表されるアオイ科 (*Malvaceae*) 雑草、マルバアサガオ (*Ipomoea purpurea*) 等のアサガオ類 (*Ipomoea* spp.) 及びヒルガオ類 (*Calystegia* spp.) 等に代表されるヒルガオ科 (*Convolvulaceae*) 雑草、イヌビユ (*Amaranthus lividus*) 及びアオビユ (*Amaranthus retroflexus*) 等に代表されるヒユ科 (*Amaranthaceae*) 雑草、オナモミ (*Xanthium pensylvanicum*)、ブタクサ (*Ambrosia artemisiaefolia*)、ヒマワリ (*Helianthus annuus*)、ハキダメギク (*Galinsoga ciliata*)、セイヨウトゲアザミ (*Cirsium arvense*)、ノボロギ

ク (*Senecio vulgaris*) 及びヒメジョオン (*Erigeron annuus*) 等に代表されるキク科 (*Compositae*) 雑草、イヌガラシ (*Rorippa indica*)、ノハラガラシ (*Sinapis arvensis*) 及びナズナ (*Capsella Bursapastoris*) 等に代表されるアブラナ科 (*Cruciferae*) 雑草、イヌタデ (*Polygonum Blumei*) 及びソバカズラ (*Polygonum convolvulus*) 等に代表されるタデ科 (*Polygonaceae*) 雑草、スベリヒユ (*Portulaca oleracea*) 等に代表されるスベリヒユ科 (*Portulacaceae*) 雑草、シロザ (*Chenopodium album*)、コアカザ (*Chenopodium ficifolium*) 及びホウキギ (*Kochia scoparia*) 等に代表されるアカザ科 (*Chenopodiaceae*) 雑草、ハコベ (*Stellaria media*) 等に代表されるナデシコ科 (*Caryophyllaceae*) 雑草、オオイヌノフグリ (*Veronica persica*) 等に代表されるゴマノハグサ科 (*Scrophulariaceae*) 雑草、ツユクサ (*Commelina communis*) 等に代表されるツユクサ科 (*Commelinaceae*) 雑草、ホトケノザ (*Lamium amplexicaule*) 及びヒメオドリコソウ (*Lamium purpureum*) 等に代表されるシソ科 (*Labiatae*) 雑草、コニシキソウ (*Euphorbia supina*) 及びオオニシキソウ (*Euphorbia maculata*) 等に代表されるトウダイグサ科 (*Euphorbiaceae*) 雑草、ヤエムグラ (*Galium spurium*) 及びアカネ (*Rubia akane*) 等に代表されるアカネ科 (*Rubiaceae*) 雑草、スミレ (*Viola mandshurica*) 等に代表されるスミレ科 (*Violaceae*) 雑草並びにアメリカツノクサネム (*Sesbania exaltata*) 及びエビスグサ (*Cassia obtusifolia*) 等に代表されるマメ科 (*Leguminosae*) 雑草、カタバミ (*Oxalis cournic*

ulata) に代表されるカタバミ科 (Oxalidaceae) 等の広葉雑草 (Broad-leaved weeds)。野生ソルガム (Sorghambicolor)、オオクサキビ (Panicum dichotomiflorum)、ジョンソングラス (Sorghum halepense)、イヌビエ (Echinochloa crus-galli var. crus-galli)、ヒメイヌビエ (Echinochloa crus-galli var. praticola)、栽培ビエ (Echinochloa utilis)、メヒシバ (Digitaria ciliaris)、カラスムギ (Avena fatua)、ブラックグラス (Alopecurus myosuroides)、オヒシバ (Eleusine indica)、エノコログサ (Setaria viridis)、アキノエノコログサ (Setaria faberi) 及びスズメノテッポウ (Alopecurus aequalis) 等に代表されるイネ科雑草 (Graminaceous weeds) 並びにハマスゲ (Cyperus rotundus, Cyperus esculentus) 等に代表されるカヤツリグサ科雑草 (Cyperaceous weeds) 等が挙げられる。

- [0194] また、本発明化合物は、水田、畑地及び果樹園等の農園芸分野以外に芝地、運動場、空地、道路脇、及び線路端等非農耕地において、土壌処理、土壌混和処理及び茎葉処理のいずれの処理方法においても使用できる。その雑草としては、畑地及び果樹園用雑草で述べたものに加えて、スズメノカタビラ (Poa annua)、セイヨウタンポポ (Taraxacum officinale)、オオアレチノギク (Conyza sumatrensis)、タネツケバナ (Cardamine flexuosa)、シロツメクサ (Trifolium repens)、チドメグサ (Hydrocotyle sibthorpioides)、オオバコ (Plantago asiatica)、ヒメクグ (Cyperus brevifolius, Kyllinga brevifolia)、スギナ (Equisetum ar

v e n s e) 等が挙げられる。

[0195] 本発明化合物を除草剤として施用するにあたっては、通常適当な固体担体又は液体担体と混合し、更に所望により界面活性剤、浸透剤、展着剤、増粘剤、凍結防止剤、結合剤、固結防止剤、崩壊剤及び分解防止剤等を添加して、水和剤、乳剤、フロアブル剤、ドライフロアブル剤、液剤、粉剤、粒剤又はゲル剤等任意の剤型の製剤にて実用に供することができる。また、省力化及び安全性向上の観点から、上記任意の剤型の製剤を水溶性包装体に封入して供することもできる。

[0196] 固体担体としては、例えば石英、カオリナイト、パイロフィライト、セリサイト、タルク、ベントナイト、酸性白土、アタパルジャイト、ゼオライト及び珪藻土等の天然鉱物質類、炭酸カルシウム、硫酸アンモニウム、硫酸ナトリウム及び塩化カリウム等の無機塩類、合成珪酸並びに合成珪酸塩が挙げられる。

[0197] 液体担体としては、例えばエチレングリコール、プロピレングリコール及びイソプロパノール等のアルコール類、キシレン、アルキルベンゼン及びアルキルナフタレン等の芳香族炭化水素類、ブチルセロソルブ等のエーテル類、シクロヘキサノン等のケトン類、 γ -ブチロラクトン等のエステル類、N-メチルピロリドン、N-オクチルピロリドン等の酸アミド類、大豆油、ナタネ油、綿実油及びヒマシ油等の植物油並びに水が挙げられる。

これら固体及び液体担体は、単独で用いても2種以上を併用してもよい。

[0198] 界面活性剤としては、例えばポリオキシエチレンアルキルエーテル、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル、ポリオキシエチレンスチリルフェニルエーテル、ポリオキシエチレンポリオキシプロピレンブロックコポリマー、ポリオキシエチレン脂肪酸エステル、ソルビタン脂肪酸エステル及びポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル等のノニオン性界面活性剤、アルキル硫酸塩、アルキルベンゼンスルホン酸塩、リグニンスルホン酸塩、アルキルスルホコハク酸塩、ナフタレンスルホン酸塩、アルキルナフタレンスルホン酸塩、ナフタレンスルホン酸のホルマリン縮合物の塩、アルキルナ

フタレンスルホン酸のホルマリン縮合物の塩、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル硫酸及び燐酸塩、ポリオキシエチレンスチリルフェニルエーテル硫酸及び燐酸塩、ポリカルボン酸塩及びポリスチレンスルホン酸塩等のアニオン性界面活性剤、アルキルアミン塩及びアルキル4級アンモニウム塩等のカチオン性界面活性剤並びにアミノ酸型及びベタイン型等の両性界面活性剤が挙げられる。

- [0199] これら界面活性剤の含有量は、特に限定されるものではないが、本発明の製剤100重量部に対し、通常0.05から20重量部の範囲が望ましい。また、これら界面活性剤は、単独で用いても2種以上を併用してもよい。

本発明化合物は必要に応じて製剤又は散布時に他種の除草剤、各種殺虫剤、殺菌剤、植物生長調節剤又は共力剤等と混合施用してもよい。

特に、他の除草剤と混合施用することにより、施用薬量の減少による低コスト化、混合薬剤の相乗作用による殺草スペクトラムの拡大や、より高い殺草効果が期待できる。この際、同時に複数の公知除草剤との組み合わせも可能である。

- [0200] 本発明化合物と混合使用されるのに好ましい除草剤としては、例えば、アセトクロール (a c e t o c h l o r / 一般名)、アシフルオルフェン (a c c i f l u o r f e n / 一般名)、アクロニフェン (a c l o n i f e n / 一般名)、アラクロール (a l a c h l o r / 一般名)、アロキシジム (a l l o x y d i m / 一般名)、アロキシジムナトリウム (a l l o x y d i m - s o d i u m / 一般名)、アメトリン (a m e t r y n / 一般名)、アミカルバゾン (a m i c a r b a z o n e / 一般名)、アミドスルフロン (a m i d o s u l f u r o n / 一般名)、アミノシクロピラクロール (a m i n o c y c l o p i r a c h l o r / 一般名)、アミノシクロピラクロールの塩およびエステル (a m i n o c y c l o p i r a c h l o r - s a l t s a n d e s t e r s)、アミノピラリド (a m i n o p y r a l i d / 一般名)、アミノピラリドの塩およびエステル (a m i n o p y r a l i d - s a l t s a n d e s t e r s)、アミプロホスメチル (a m i p r

ophos-methyl／一般名)、アミトロール (amitrol／一般名)、アニロホス (anilofos／一般名)、アシュラム (asulam／一般名)、アトラジン (atrazine／一般名)、アザフェニジン (azafenidin／一般名)、アジムスルフロン (azimsulfuron／一般名)、ベフルブタミド (beflubutamid／一般名)、ベナゾリンエチル (benazolin-ethyl／一般名)、ベンカルバゾン (bencarbazon／一般名)、ベンフルラリン (benfluralin、benefin／一般名)、ベンフレセート (benfuresate／一般名)、ベンスルフロンメチル (bensulfuron-methyl／一般名)、ベンスリド (bensulide／一般名)、ベントゾン (bentazone／一般名)、ベントゾンナトリウム (bentazone-sodium／一般名)、ベントゾンの塩 (bentazone-salts)、ベンチオカーブ (benthiocarb／一般名)、ベンズフェンジゾン (benzfendizone／一般名)、ベンゾビシクロン (benzobicyclon／一般名)、ベンゾフェナップ (benzofenap／一般名)、ビアラホス (bialaphos／一般名)、ビアラホスナトリウム (bialaphos-sodium／一般名)、ビシクロピロン (bicyclopypyrone／一般名)、ビフェノックス (bifenox／一般名)、ビスピリバック (bispyribac／一般名)、ビスピリバックナトリウム (bispyribac-sodium／一般名)、ブロマシル (bromacil／一般名)、ブロモブチド (bromobutide／一般名)、ブロモフェノキシム (bromofenoxim／一般名)、ブロモキシニル (bromoxynil／一般名)、ブロモキシニルの塩およびエステル (bromoxynil-salts and esters)、ブタクロール (butachlor／一般名)、ブタフェナシル (butafenacil／一般名)、ブタミホス (butamifos／一般名)、ブテナクロール (butenachlor／一般名)、ブトラリン (butralin／一般名)、ブトロキシジ

ム (butroxydim／一般名)、ブチレート (butylate／一般名)、カフェンストロール (cafenstrole／一般名)、カルベタミド (carbetamide／一般名)、カルフェントラゾンエチル (carfentrazone-ethyl)、クロメトキシフェン (chlomethoxyfen／一般名)、クロメトキシニル (chlomethoxynil／一般名)、クロランベン (chloramben／一般名)、クロランベンの塩およびエステル (chloramben-salts and esters)、クロランスラムメチル (chloransulam-methyl／一般名)、クロルフルレノールメチル (chlorflurenol-methyl／一般名)、クロリダゾン (chloridazon／一般名)、クロリムロンエチル (chlorimuron-ethyl／一般名)、クロロブロムロン (chlorobromuron／一般名)、クロロトルロン (chlorotoluron／一般名)、クロロクスロン (chloroxuron／一般名)、クロルフタリム (chlorphthalim／一般名)、クロルプロファム (chlorpropham／一般名)、クロロIPC (chlorpropham／一般名)、クロルスルフロロン (chlorsulfuron／一般名)、クロルタルジメチル (chlorthal-dimethyl／一般名)、クロルチアミド (chlorthiamid／一般名)、シニドンエチル (cinidon-ethyl／一般名)、シンメスリン (cinmethylin／一般名)、シノスルフロロン (cinosulfuron／一般名)、クレトジム (cl ethodim／一般名)、クロジナホップ (clodinafop／一般名)、クロジナホッププロパルギル (clodinafop-propargyl／一般名)、クロマゾン (clomazone／一般名)、クロメプロップ (clomeprop／一般名)、クロピラリド (clopyralid／一般名)、クロピラリドの塩およびエステル (clopyralid-salts and esters)、CNP (一般名)、クミルロン (cumyluron／一般名)、シアナジン (cyanazin／一般名)

、シクロエート (cycloate／一般名)、シクロピリモレート (cyclopyrimorate／一般名、SW-065／試験名)、シクロスルフアムロン (cyclosulfamuron／一般名)、シクロキシジム (cycloxydim／一般名)、シハロホップブチル (cyhalofop-butyl／一般名)、DAH-500 (試験名)、ダラポン (dalapon／一般名)、ダゾメット (dazomet／一般名)、デスメディファム (desmedipham／一般名)、デスメトリン (desmetryn／一般名)、ダイカンバ (dicamba／一般名)、ダイカンバの塩およびエステル (dicamba-salts and esters)、ジクロベニル (dichlobenil／一般名)、ジクロホップ (diclofop／一般名)、ジクロホップメチル (diclofop-methyl／一般名)、ジクロルプロップ (dichlorprop／一般名)、ジクロルプロップの塩およびエステル (dichlorprop-salts and esters)、Pジクロルプロップ (dichlorprop-P／一般名)、Pジクロルプロップの塩およびエステル (dichlorprop-P-salts and esters)、ジクロスラム (diclosulam／一般名)、ジフェンゾコート (difenzoquat／一般名)、ジフルフェニカン (diflufenican／一般名)、ジフルフェンゾピル (diflufenzopyr／一般名)、ジフルフェンゾピルナトリウム (diflufenzopyr-sodium／一般名)、ジメピペレート (dimepiperate／一般名)、ジメタメトリン (dimethametryn／一般名)、ジメタクロール (dimethachlor／一般名)、ジメテナミド (dimethenamid／一般名)、Pジメテナミド (dimethenamid-p／一般名)、ジメシピン (dimethipin／一般名)、ジニトロアミン (dinitramine／一般名)、ジノセブ (dinoseb／一般名)、ジノテルブ (dinoterb／一般名)、DNOC／一般名、ジフェナミド (diphenamid／一般名)、ジクワット (diquat／一般名)、ジ

チオピル (dithiopyl／一般名)、ジウロン (diuron／一般名)、DSMA／一般名、ダイムロン (dymron／一般名)、エンドタール (endothal／一般名)、EPTC／一般名、エスプロカルブ (esprocarb／一般名)、エタルフルリン (ethalfluralin／一般名)、エタメトスルフロンメチル (ethametsulfuron-methyl／一般名)、エトフメセート (ethofumesate／一般名)、エトベンザニド (etobenzanid／一般名)、エトキシスルフロン (ethoxysulfuron／一般名)、フラザスルフロン (flazasulfuron／一般名)、フェノキサプロップ (fenoxaprop／一般名)、フェノキサプロップエチル (fenoxaprop-ethyl／一般名)、フェノキサスルホン (fenoxasulfone／一般名)、フェンキノトリオン (fenquionotriol／一般名)、フェントラザミド (fentrazamide／一般名)、フラムプロップ (flamprop／一般名)、フラザスルフロン (flazasulfuron／一般名)、フロラスラム (florasulam／一般名)、フルアジホップ (fluaazifop／一般名)、フルアジホップブチル (fluaazifop-butyl／一般名)、フルアゾレート (fluaazolate／一般名)、フルカルバゾンナトリウム (flucarbazon-sodium／一般名)、フルセトスルフロン (flucetosulfuron／一般名)、フルクロラリン (flucloralin／一般名)、フルフェナセツ (flufenacet／一般名)、フルフェンピルエチル (flufenpyl-ethyl／一般名)、フルメツラム (flumetsulam／一般名)、フルミクロラックペンチル (flumiclorac-pentyl／一般名)、フルミオキサジン (flumioxazin／一般名)、フルオメツロン (fluometuron／一般名)、フルオログリコフェンエチル (fluoroglycofen-ethyl／一般名)、フルピルスルフロン (flupyrsulfuron／一般名)、フルポキサム (flupoxam／一般名)、フルレノール

(flurenol／一般名)、フルリドン (fluridone／一般名)、フルロクロリドン (flurochloridone／一般名)、フルロキシピル (fluroxypyr／一般名)、フルロキシピルのエステル (fluroxypyr-esters)、フルプリミドール (flurp rimidol／一般名)、フルタモン (flurtamone／一般名)、フルチアセットメチル (fluthiacet-methyl／一般名)、フォメサフェン (fomesafen／一般名)、フォラムスルフロン (foramsulfuron／一般名)、フォサミン (fosamine／一般名)、グルホシネート (glufosinate／一般名)、グルホシネートアンモニウム (glufosinate-ammonium／一般名)、グリホサート (glyphosate／一般名)、グリホサートアンモニウム (glyphosate-ammonium／一般名)、グリホサートイソプロピルアミン (glyphosate-isopropyl ammonium／一般名)、グリホサートカリウム (glyphosate-potassium／一般名)、グリホサートナトリウム (glyphosate-sodium／一般名)、グリホサートトリメシウム (glyphosate-trimesium／一般名)、ハロウキシフェン (halauxifen／一般名)、ハロウキシフェンの塩およびエステル (halauxifen-salts and esters)、ハロサフェン (halosafen／一般名)、ハロスルフロン (halosulfuron／一般名)、ハロスルフロンメチル (halosulfuron-methyl／一般名)、ハロキシホップ (haloxyfop／一般名)、ハロキシホップメチル (haloxyfop-methyl／一般名)、ヘキサジノン (hexazinone／一般名)、イマザメタベンズメチル (imazamethabenz-methyl／一般名)、イマザモックス (imazamox／一般名)、イマザピク (imazapic／一般名)、イマザピル (imazapyr／一般名)、イマゼタピル (imazethapyr／一般名)、イマザキン (imaza

quin／一般名)、イマゾスルフロン(imazosulfuron／一般名)、インダノファン(indanofan／一般名)、インダジフラム(indaziflam／一般名)、ヨードスルフロンメチルナトリウム(iodosulfuron-methyl-sodium／一般名)、アイオキシニル(ioxynil octanoate／一般名)、アイオキシニルの塩およびエステル(ioxynil-salts and esters)、イプフェンカルバゾン(ipfencarbazone／一般名)、イソプロチュロン(isoproturon／一般名)、イソウロン(isouron／一般名)、イソキサベン(isoxaben／一般名)、イソキサフルトール(isoxaflutole／一般名)、カルブチレート(karbutilate／一般名)、ラクトフェン(lactofen／一般名)、レナシル(lenacil／一般名)、リニユロン(linuron／一般名)、マレイン酸ヒドラジド(maleic hydrazide／一般名)、MCPA(一般名)、MCPAの塩およびエステル(MCPA-salts and esters)、MCPB(一般名)、MCPBの塩およびエステル(MCPB-salts and esters)、メコプロップ(mecoprop、MCP P／一般名)、メコプロップの塩およびエステル(mecoprop-salts and esters)、Pメコプロップ(mecoprop-P、MCP P-P／一般名)、Pメコプロップの塩およびエステル(mecoprop-P-salts and esters)、メフェナセット(mefenacet／一般名)、メフルイジド(mefluidide／一般名)、メソスルフロンメチル(mesosulfuron-methyl／一般名)、メソトリオン(mesotrione／一般名)、メタム(metam／一般名)、メタミホップ(metamifop／一般名)、メタミトロン(metamitron／一般名)、メタザクロール(metazachlor／一般名)、メタベンズチアズロン(methabenzthiazuron／一般名)、メタゾスルフロン(metazosulfuron／一般名)、メチオゾリン(me

thiozolin／一般名)、メチルアジド (methyl azide／一般名)、臭化メチル (methyl bromide／一般名)、メチルダイムロン (methyl dymron／一般名)、ヨウ化メチル (methyl iodide／一般名)、メトベンズロン (metobenzuron／一般名)、メトラクロール (metolachlor／一般名)、Sメトラクロール (metolachlor-S／一般名)、メトスラム (metosulam／一般名)、メトリブジン (metribuzin／一般名)、メトスルフロンメチル (metsulfuron-methyl／一般名)、メトクスロン (metoxuron／一般名)、モリネート (molinate／一般名)、モノリニュロン (monolinuron／一般名)、モノスルフロン (monosulfuron／一般名)、モノスルフロンメチル (monosulfuron-methyl／一般名)、MSMA／一般名、ナプロアニリド (naproanilide／一般名)、ナプロパミド (napropamide／一般名)、ナプタラム (naptalam／一般名)、ナプタラムナトリウム (naptalam-sodium／一般名)、ネブロン (neburon／一般名)、ニコスルフロン (nicosulfuron／一般名)、ノルフルラゾン (norflurazon／一般名)、OK-701 (試験名)、オレイン酸 (oleic acid／一般名)、オルベンカーブ (orbencarb／一般名)、オルソスルファムロン (orthosulfamuron／一般名)、オリザリン (oryzalin／一般名)、オキサジアルギル (oxadiargyl／一般名)、オキサジアゾン (oxadiazon／一般名)、オキサスルフロン (oxasulfuron／一般名)、オキサジクロメホン (oxaziclomefone／一般名)、オキシフルオルフェン (oxyfluorfen／一般名)、パラコート (paraquat／一般名)、ペラルゴン酸 (pelargonic acid／一般名)、ペンディメタリン (pendimethalin／一般名)、ペノキススラム (penoxsulam／一般名)、ペンタノクロール (pentanochlor／一般名)

)、ペントキサゾン (pentoxazone／一般名)、ペトキサミド (pethoxamid／一般名)、フェンメディファムエチル (phenmedipham-ethyl／一般名)、ピクロラム (picloram／一般名)、ピクロラムの塩およびエステル (picloram-salts and esters)、ピコリナフェン (picolinafen／一般名)、ピノキサデン (pinoxaden／一般名)、ピペロフォス (piperophos／一般名)、プレチラクロール (pretilachlor／一般名)、プリミスルフロンメチル (primisulfuron-methyl／一般名)、プロジアミン (prodiamine／一般名)、プロフルアゾール (profluazol／一般名)、プロフォキシジム (profoxydim／一般名)、プロメトン (prometon／一般名)、プロメトリン (prometryn／一般名)、プロパクロール (propachlor／一般名)、プロパニル (propanil／一般名)、プロパキザホップ (propaquizafoxop／一般名)、プロパジン (propazin／一般名)、プロファム (propham／一般名)、プロピソクロール (propisochlor／一般名)、プロポキシカルバゾンナトリウム (propoxycarbazon-sodium／一般名)、プロピリスルフロン (propyrisulfuron／一般名)、プロピザミド (propyzamide／一般名)、プルスルホカーブ (prosulfocarb／一般名)、プロスルフロン (prosulfuron／一般名)、ピラクロニル (pyraclonil／一般名)、ピラフルフェンエチル (pyraflufen-ethyl／一般名)、ピラスルホトール (pyrasulfotole／一般名)、ピラゾリネート (pyrazolynate／一般名)、ピラゾスルフロン (pyrazosulfuron／一般名)、ピラゾスルフロンエチル (pyrazosulfuron-ethyl／一般名)、ピラゾキシフェン (pyrazoxyfen／一般名)、ピリベンゾキシム (pyribenzoxim／一般名)、ピリブチカルブ (pyributicarb／一般名)、ピリダフォル (

pyridafol／一般名)、ピリデート(pyridate／一般名)、
ピリフタリド(pyrifthalid／一般名)、ピリミノバックメチル
(pyriminobac-methyl／一般名)、ピリミスルファン(
pyrimisulfan／一般名)、ピリチオバックナトリウム(pyr
ithiobac-sodium／一般名)、ピロキサスルホン(pyro
xasulfone／一般名)、ピロキシスラム(pyroxsulam／
一般名)、キンクロラック(quinclorac／一般名)、キンメラッ
ク(quinmerac／一般名)、キノクラミン(quinoclamine／
一般名)、キザロホップ(quizalofop／一般名)、キザロ
ホップエチル(quizalofop-ethyl／一般名)、キザロホッ
プテフリル(quizalofop-tefuryl／一般名)、Pキザロ
ホップ(quizalofop-P／一般名)、Pキザロホップエチル(q
uizalofop-P-ethyl／一般名)、Pキザロホップテフリル
(quizalofop-P-tefuryl／一般名)、リムスルフロン
(rimisulfuron／一般名)、サフルフェナシル(saflufe
nacyl／一般名)、セトキシジム(sethoxydim／一般名)、
シデュロン(siduron／一般名)、シマジン(simazine／一
般名)、シメトリン(simetryn／一般名)、SL-261(試験名)
、スルコトリオン(sulcotrione／一般名)、スルフエントラ
ゾン(sulfentrazone／一般名)、スルフォメツロンメチル(
sulfometuron-methyl／一般名)、スルフォスルフロン
(sulfosulfuron／一般名)、TCBA(2, 3, 6-TBA
／一般名)、TCBAの塩およびエステル(2, 3, 6-TBA-salts
and esters)、TCTP(chlorothal-dimeth
yl, tetra-chloro-thiophene／一般名)、テブタ
ム(tebutam／一般名)、テブティウロン(tebuthiuron
／一般名)、テフリルトリオン(tefuryltrione／一般名)、
テンボトリオン(tembotrione／一般名)、テプラロキシジム(

tepraloxym / 一般名)、ターバシル (terbacil / 一般名)、ターブメトン (terbumeton / 一般名)、ターブチラジン (terbutylazine / 一般名)、ターブトリン (terbutryn / 一般名)、テトラピオン (tetrapion / flupropionate / 一般名)、テニルクロール (thenylchlor / 一般名)、チアザフルロン (thiazafurion / 一般名)、チアゾピル (thiazopyr / 一般名)、チジアジミン (thidiazimin / 一般名)、チジアズロン (thidiazuron / 一般名)、チエンカルバゾンメチル (thiencarbazone-methyl / 一般名)、チフェンスルフロメチル (thifensulfuron-methyl / 一般名)、トルピラレート (tolpyralate / 一般名)、トプラメゾン (topramezon / 一般名)、トラルコキシジム (tralkoxydim / 一般名)、トリアファモン (triafamone / 一般名)、トリアレート (triallate / 一般名)、トリアスルフロ (triasulfuron / 一般名)、トリアジフラム (triaziflam / 一般名)、トリベニユロンメチル (tribenuron-methyl / 一般名)、トリクロピル (triclopyr / 一般名)、トリクロピルの塩およびエステル (triclopyr-salts and esters)、トリディファン (tridiphane / 一般名)、トリエタジン (trietazine / 一般名)、トリフルディモキサジン (trifludimoxadin / 一般名)、トリフロキシスルフロ (trifloxysulfuron / 一般名)、トリフルラリン (trifluralin / 一般名)、トリフルスルフロメチル (triflusulfuron-methyl / 一般名)、トリトスルフロ (tritofluro / 一般名)、2, 4-PA (一般名)、2, 4-PAの塩およびエステル (2, 4-PA-salts and esters)、2, 4-DB (一般名)、2, 4-DBの塩およびエステル (2, 4-DB-salts and esters) 等が挙げられる。これらの成分は単独でまたは2種以

上混合して使用することができ、混合する場合の比も自由に選択できる。

[0201] 薬害軽減剤としては、例えば、AD-67、ベノキサコル (benoxacor/一般名)、クロキントセツメキシル (cloquintocet-mexyl/一般名)、シオメトリニル (cyomerinil/一般名)、ジクロルミド (dichlormid/一般名)、ジシクロノン (dicyclonone/一般名)、シプロスルファミド (cyprosulfamide/一般名)、ジエトレート (diethorate/一般名)、DKA-24、ダイムロン (dymron/一般名)、フェンクロラゾールエチル (fenclorazole-ethyl/一般名)、フェンクロリム (fenclorim/一般名)、ヘキシム (HEXIM/一般名)、フルラゾール (flurazole/一般名)、フルキシフェニム (fluxofenim/一般名)、フリラゾール (furilazole/一般名)、イソキサジフェン (isoxadifen/一般名)、イソキサジフェンエチル (isoxadifen-ethyl/一般名)、MCPA、メコプロップ (mecoprop/一般名)、メフェンピル (mefenpyr/一般名)、メフェンピルエチル (mefenpyr-ethyl/一般名)、メフェンピルジエチル (mefenpyr-diethyl/一般名)、メフェネート (mephenate/一般名)、MG-191、NA (Naphthalic anhydride)、OM (Octamethylene-diamine)、オキサベトリニル (oxabetrinil/一般名)、PPG-1292、R-29148等が挙げられる。

これらの農薬活性成分は単独で又は2種以上混合して使用することができ、混合する場合の比も自由に選択できる。

[0202] 本発明化合物の施用薬量は適用場面、施用時期、施用方法、栽培作物等により差異はあるが一般には有効成分量としてヘクタール (ha) 当たり0.005から50kg程度が適当である。

[0203] 次に本発明化合物を用いる場合の製剤の配合例を示す。但し本発明の配合例は、これらのみに限定されるものではない。尚、以下の配合例において「

部」は重量部を意味する。

水和剤

本発明化合物 0.1～80部

固体担体 5～98.9部

界面活性剤 1～10部

その他 0～5部

その他として、例えば固結防止剤、分解防止剤等が挙げられる。

[0204] 乳 剤

本発明化合物 0.1～30部

液体担体 45～95部

界面活性剤 4.9～15部

その他 0～10部

その他として、例えば展着剤、分解防止剤等が挙げられる。

[0205] フロアブル (flowable) 剤

本発明化合物 0.1～70部

液体担体 15～98.89部

界面活性剤 1～12部

その他 0.01～30部

その他として、例えば凍結防止剤、増粘剤等が挙げられる。

[0206] ドライフロアブル (dry flowable) 剤

本発明化合物 0.1～90部

固体担体 0～98.9部

界面活性剤 1～20部

その他 0～10部

その他として、例えば結合剤、分解防止剤等が挙げられる。

[0207] 液 剤

本発明化合物 0.01～70部

液体担体 20～99.99部

その他 0～10部

その他として、例えば凍結防止剤、展着剤等が挙げられる。

[0208] 粒 剤

本発明化合物 0.01～80部

固体担体 10～99.99部

その他 0～10部

その他として、例えば結合剤、分解防止剤等が挙げられる。

[0209] 粉 剤

本発明化合物 0.01～30部

固体担体 65～99.99部

その他 0～10部

その他として、例えばドリフト防止剤、分解防止剤等が挙げられる。

使用に際しては上記製剤をそのまま、又は水で1～10000倍に希釈して散布する。

[0210] 製剤例

次に具体的に本発明化合物を有効成分とする農薬製剤例を示すがこれらのみに限定されるものではない。尚、以下の配合例において「部」は重量部を意味する。

〔配合例1〕水和剤

本発明化合物 N o. 1-001 20部

パイロフィライト 76部

ソルポール 5039 2部

(アニオン性界面活性剤：東邦化学工業(株)商品名)

カープレックス #80 2部

(合成含水珪酸：塩野義製薬(株)商品名)

以上を均一に混合粉碎して水和剤とする。

[0211] 〔配合例2〕乳 剤

本発明化合物 N o. 1-001 5部

キシレン 75部

N-メチルピロリドン 15部

ソルポール2680 5部

(アニオン性界面活性剤：東邦化学工業(株)商品名)

以上を均一に混合して乳剤とする。

[0212] 〔配合例3〕フロアブル剤

本発明化合物No. 1-001 25部

アグリゾールS-710 10部

(非イオン性界面活性剤：花王(株)商品名)

ルノックス1000C 0.5部

(アニオン性界面活性剤：東邦化学工業(株)商品名)

キサントガム 0.02部

水 64.48部

以上を均一に混合した後、湿式粉碎してフロアブル剤とする。

[0213] 〔配合例4〕ドライフロアブル剤

本発明化合物No. 1-001 75部

ハイテノールNE-15 5部

(アニオン性界面活性剤：第一工業製薬(株)商品名)

バニレックスN 10部

(アニオン性界面活性剤：日本製紙(株)商品名)

カープレックス#80 10部

(合成含水珪酸：塩野義製薬(株)商品名)

以上を均一に混合粉碎した後、少量の水を加えて攪拌混合捏和し、押出式造粒機で造粒し、乾燥してドライフロアブル剤とする。

[0214] 〔配合例5〕粒 剤

本発明化合物No. 1-001 1部

ベントナイト 55部

タルク 44部

以上を均一に混合粉碎した後、少量の水を加えて攪拌混合捏和し、押出式造粒機で造粒し、乾燥して粒剤とする。

実施例

[0215] 以下に本発明において、式(1)で表される複素環アミド化合物の合成例、試験例を実施例として具体的に述べることで、本発明を更に詳しく説明するが、本発明はこれらによって限定されるものではない。

[0216] 合成例及び参考例に記載した中圧分取液体クロマトグラフィーは、山善株式会社中圧分取装置；YFLC-Wprep（流速18ml/min、シリカゲル40μmのカラム）を使用した。

また、実施例のプロトン核磁気共鳴ケミカルシフト値は、基準物質としてMe₄Si（テトラメチルシラン）を用い、300MHzにて測定した。また測定に使用した溶媒を以下の合成例中に記載する。また、実施例のプロトン核磁気共鳴ケミカルシフト値における記号は、下記の意味を表す。

s：シングレット、d：ダブレット、t：トリプレット、m：マルチプレット、q：カルテット、br：ブロード

[0217] 合成例

〔合成例1〕

3-イソプロピル-5-メチル-N-(5-メチル-1,3,4-オキサジアゾール-2-イル)-[1,2,4]トリアゾロ[4,3-a]ピリジン-8-カルボキサミド（化合物No. 1-003）

工程1；2-ヒドラジニル-6-メチルニコチン酸メチルの合成

2-クロロ-6-メチルニコチン酸メチル3.0g（16.2mmol）及びジオキサン30mlの混合溶液に、室温にてヒドラジン・一水和物1.62g（32.3mmol）を添加した。添加終了後、該反応混合物を60℃にて4時間、続いて80℃にて6時間攪拌した。攪拌終了後、水を添加し反応を停止させ、該反応液を酢酸エチルにて抽出（150ml×2回）した。得られた有機層を飽和重曹水で洗浄した後、飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥し、減圧下にて溶媒を留去した。析出した固体

をヘキサンで洗浄し、濾取することにより目的物 1.60 g を橙色固体として得た。

融点：90～91℃

[0218] 工程 2；2-（2-イソブチリルヒドラジニル）-6-メチルニコチン酸メチルの合成

2-ヒドラジニル-6-メチルニコチン酸メチル 1.5 g（8.28 mmol）、トリエチルアミン 838 mg（8.28 mmol）及びテトラヒドロフラン 20 ml の混合溶液に、氷冷下にてイソブチリルクロリド 882 mg（8.28 mmol）を添加した。添加終了後、該反応混合物を氷冷下にて 30 分間攪拌した。攪拌終了後、水を添加し反応を停止させ、該反応液を酢酸エチルにて抽出（100 ml × 1 回）した。得られた有機層を水洗後、飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥し、減圧下にて溶媒を留去した。析出した固体をヘキサン及びジイソプロピルエーテルで洗浄し、濾取することにより目的物 1.68 g を肌色固体として得た。

融点：99～101℃

[0219] 工程 3；3-イソプロピル-5-メチル-[1, 2, 4] トリアゾロ[4, 3-a] ピリジン-8-カルボン酸メチルの合成

2-（2-イソブチリルヒドラジニル）-6-メチルニコチン酸メチル 1.6 g（63.7 mmol）及びトルエン 10 ml の混合溶液に、室温にて塩化ホスホリル 3 ml を添加した。添加終了後、該反応混合物を加熱還流下にて 5 時間攪拌した。攪拌終了後、該反応混合物を氷水に添加し反応を停止させ、該反応液を酢酸エチルにて洗浄（50 ml × 1 回）した。得られた水層に氷冷下にて炭酸カリウムを添加し pH を 8～9 とし、該反応液を酢酸エチルにて抽出（100 ml × 2 回）した。得られた有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下にて溶媒を留去した。析出した固体をジイソプロピルエーテルで洗浄し、濾取することにより目的物 490 mg を淡黄色固体として得た。

融点：138～140℃

[0220] 工程4；3-イソプロピル-5-メチル-[1, 2, 4]トリアゾロ[4, 3-a]ピリジン-8-カルボン酸の合成

3-イソプロピル-5-メチル-[1, 2, 4]トリアゾロ[4, 3-a]ピリジン-8-カルボン酸メチル450mg (1.93mmol) 及びメタノール4mlの混合溶液に、室温にて1M水酸化ナトリウム水溶液2mlを添加した。添加終了後、該反応混合物を室温にて2時間攪拌した。攪拌終了後、1M塩酸を添加し、pHを2~3とした。該反応液中の溶媒を減圧下にて留去した後、析出した固体を水洗し、濾取することにより、目的物250mgを淡黄色固体として得た。

融点：194~195℃

[0221] 工程5；3-イソプロピル-5-メチル-N-(5-メチル-1, 3, 4-オキサジアゾール-2-イル)-[1, 2, 4]トリアゾロ[4, 3-a]ピリジン-8-カルボキサミドの合成

3-イソプロピル-5-メチル-[1, 2, 4]トリアゾロ[4, 3-a]ピリジン-8-カルボン酸400mg (1.95mmol)、N, N-ジメチルホルムアミド0.1ml及び塩化メチレン3mlの混合溶媒に、塩化オキサリル463mg (3.91mmol)を室温にて添加した。添加終了後、該反応混合物を室温にて1時間攪拌した。攪拌終了後、該反応混合物中の溶媒を減圧下にて留去し、粗3-イソプロピル-5-メチル-[1, 2, 4]トリアゾロ[4, 3-a]ピリジン-8-カルボン酸クロリド・塩酸塩を得た。得られた粗3-イソプロピル-5-メチル-[1, 2, 4]トリアゾロ[4, 3-a]ピリジン-8-カルボン酸クロリド・塩酸塩540mg (1.95mmol)、5-メチル-1, 3, 4-オキサジアゾール-2-アミン180mg (1.82mmol)及び塩化メチレン5mlの混合溶液に、氷冷下にてトリエチルアミン368mg (3.91mmol)を添加した。添加終了後、該反応混合物を室温にて20時間攪拌した。攪拌終了後、該反応混合物にピリジン5ml及び4-(ジメチルアミノ)ピリジン10mgを添加した後、該反応混合物を60℃にて10時間攪拌した。攪拌終了後

、水を添加し反応を停止させ、該反応液を酢酸エチルにて抽出（20 ml × 1回）した。得られた有機層を水洗後、飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムで脱水・乾燥し、減圧下にて溶媒を留去した。析出した固体をジイソプロピルエーテル及び酢酸エチルで洗浄し、濾取することにより目的物60 mgを茶褐色固体として得た。

[0222] [合成例2]

3-イソプロピル-N-(5-メチル-1, 3, 4-オキサジアゾール-2-イル)-5-(トリフルオロメチル)-[1, 2, 4]トリアゾロ[4, 3-a]ピリジン-8-カルボキサミド（化合物No. 1-004）

3-イソプロピル-5-(トリフルオロメチル)-[1, 2, 4]トリアゾロ[4, 3-a]ピリジン-8-カルボン酸160 mg（0.59 mmol）、5-メチル-1, 3, 4-オキサジアゾール-2-アミン70 mg（0.71 mmol）及びN, N-ジメチルホルムアミド5 mlの混合溶液に、室温にて1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩135 mg（0.71 mmol）及び1-ヒドロキシ-7-アザベンゾトリアゾール96 mg（0.71 mmol）を添加した。添加終了後、該反応混合物を室温にて24時間攪拌した。攪拌終了後、水を添加し反応を停止させ、該反応液をクロロホルムにて抽出（10 ml × 1回）した。得られた有機層を水洗後、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下にて溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィー {n-ヘキサン：酢酸エチル=1：1～0：1（体積比、以下同じである）}にて精製し、目的物90 mgを白色固体として得た。

融点：176～178℃

[0223] [合成例3]

3-イソプロピル-N-(5-メチル-1, 3, 4-オキサジアゾール-2-イル)-5-(メチルチオ)-[1, 2, 4]トリアゾロ[4, 3-a]ピリジン-8-カルボキサミド（化合物No. 1-009）

工程1；2-ヒドラジニル-6-クロロニコチン酸メチルの合成

2、6-ジクロロニコチン酸メチル 11.5 g (55.8 mmol) 及びジオキサン 150 ml の混合溶液に、室温にてヒドラジン・一水和物 5.58 g (111 mmol) を添加した。添加終了後、該反応混合物を室温にて 18 時間攪拌した。攪拌終了後、水を添加し反応を停止させ、該反応液中の溶媒を減圧下にて留去した。析出した固体を水洗し、濾取することにより目的物 10.7 g を黄色固体として得た。

融点：82～83℃

[0224] 工程 2；2-(2-イソブチリルヒドラジニル)-6-クロロニコチン酸メチルの合成

2-ヒドラジニル-6-クロロニコチン酸メチル 5.0 g (24.8 mmol)、トリエチルアミン 2.5 g (24.8 mmol) 及びテトラヒドロフラン 20 ml の混合溶液に、氷冷下にてイソブチリルクロリド 2.64 g (24.8 mmol) を添加した。添加終了後、該反応混合物を氷冷下にて 2 時間攪拌した。攪拌終了後、水を添加し反応を停止させ、該反応液を酢酸エチルにて抽出 (150 ml × 1 回) した。得られた有機層を水洗後、飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥し、減圧下にて溶媒を留去した。析出した固体をジイソプロピルエーテル及びヘキサンで洗浄し、濾取することにより目的物 5.90 g を白色固体として得た。

融点：147～148℃

[0225] 工程 3；3-イソプロピル-5-クロロ-[1, 2, 4] トリアゾロ [4, 3-a] ピリジン-8-カルボン酸メチルの合成

2-(2-イソブチリルヒドラジニル)-6-クロロニコチン酸メチル 5.9 g (21.7 mmol) 及び塩化ホスホリル 20 ml を室温にて混合した後、該反応混合物を加熱還流下にて 5 時間攪拌した。攪拌終了後、該反応混合物を氷水に添加し反応を停止させ、該反応液を酢酸エチルにて洗浄 (50 ml × 1 回) した。得られた水層に氷冷下にて炭酸カリウムを添加し pH を 8～9 とし、該反応液を酢酸エチルにて抽出 (200 ml × 2 回) した。得られた有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下にて溶媒を留去した。

。析出した固体をジイソプロピルエーテルで洗浄し、濾取することにより目的物 4.75 g を茶色淡黄色固体として得た。

融点：105～107℃

[0226] 工程4；3-イソプロピル-5-(メチルチオ)-[1, 2, 4]トリアゾロ[4, 3-a]ピリジン-8-カルボン酸メチルの合成

3-イソプロピル-5-クロロ-[1, 2, 4]トリアゾロ[4, 3-a]ピリジン-8-カルボン酸メチル 420 mg (1.66 mmol) 及び N, N-ジメチルホルムアミド 3 ml の混合溶液に、氷冷下にてナトリウムチオメトキシド 140 mg (1.99 mmol) を添加した。添加終了後、該反応混合物を氷冷下にて45分間攪拌した。攪拌終了後、水を添加し反応を停止させ、該反応液を酢酸エチルにて抽出(30 ml × 3回)した。得られた有機層を飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥し、減圧下にて溶媒を留去した。析出した固体をジイソプロピルエーテルで洗浄し、濾取することにより目的物 280 mg を茶色固体として得た。

融点：142～145℃

[0227] 工程5；3-イソプロピル-N-(5-メチル-1, 3, 4-オキサジアゾール-2-イル)-5-(メチルチオ)-[1, 2, 4]トリアゾロ[4, 3-a]ピリジン-8-カルボキサミドの合成

3-イソプロピル-5-(メチルチオ)-[1, 2, 4]トリアゾロ[4, 3-a]ピリジン-8-カルボン酸メチル 140 mg (0.53 mmol)、メタノール 3 ml 及び水 1 ml の混合溶液に、1 M 水酸化ナトリウム水溶液 0.6 ml を室温下にて添加した。添加終了後、該反応混合物を室温にて17時間攪拌した。攪拌終了後、1 M 塩酸 1 ml を添加して反応を停止させた。該反応液中の溶媒を減圧下にて留去し、粗3-イソプロピル-5-(メチルチオ)-[1, 2, 4]トリアゾロ[4, 3-a]ピリジン-8-カルボン酸を得た。得られた粗3-イソプロピル-5-(メチルチオ)-[1, 2, 4]トリアゾロ[4, 3-a]ピリジン-8-カルボン酸 190 mg (0.53 mmol)、5-メチル-1, 3, 4-オキサジアゾール-2-

アミン 104 mg (1.06 mmol) 及びピリジン 3 ml の混合溶液に、室温にて塩化チオニル 126 mg (1.06 mmol) を添加した。添加終了後、該反応混合物を 60℃にて 5 時間攪拌した。攪拌終了後、水を添加し反応を停止させ、減圧下にて溶媒を留去した。析出した固体をジイソプロピルエーテル及びクロロホルムで洗浄し、濾取することにより目的物 57 mg を黄土色固体として得た。

[0228] [合成例 4]

3-クロロ-N-(5-メチル-1, 3, 4-オキサジアゾール-2-イル)-5-(トリフルオロメチル)-[1, 2, 4]トリアゾロ[4, 3-a]ピリジン-8-カルボキサミド (化合物 No. 1-013)

工程 1 ; 3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)-[1, 2, 4]トリアゾロ[4, 3-a]ピリジン-8-カルボン酸の合成

5-(トリフルオロメチル)-[1, 2, 4]トリアゾロ[4, 3-a]ピリジン-8-カルボン酸 300 mg (1.30 mmol) 及び N, N-ジメチルホルムアミド 6 ml の混合溶液に、N-クロロスクシンイミド 347 mg (2.60 mmol) を室温にて添加した。添加終了後、該反応混合物を 60℃にて 4 時間攪拌した。攪拌終了後、水を添加し反応を停止させ、該反応液を酢酸エチルにて抽出 (50 ml × 2 回) した。得られた有機層を飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥し、減圧下にて溶媒を留去した。析出した固体をジイソプロピルエーテルで洗浄し、濾取することにより目的物 210 mg を茶色固体として得た。

[0229] 工程 2 ; 3-クロロ-N-(5-メチル-1, 3, 4-オキサジアゾール-2-イル)-5-(トリフルオロメチル)-[1, 2, 4]トリアゾロ[4, 3-a]ピリジン-8-カルボキサミドの合成

3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)-[1, 2, 4]トリアゾロ[4, 3-a]ピリジン-8-カルボン酸 70 mg (0.26 mmol)、5-メチル-1, 3, 4-オキサジアゾール-2-アミン 52 mg (0.53 mmol)、4-(ジメチルアミノ)ピリジン 10 mg (0.03 mmol)

）及びピリジン 5 m l の混合溶液に、塩化チオニル 63 m g (0.53 m m o l) を室温にて添加した。該反応混合物を室温にて 1 時間攪拌した。攪拌終了後、水を添加し反応を停止させ、該反応液をクロロホルムにて抽出 (15 m l × 3 回) した。得られた有機層を飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥し、減圧下にて溶媒を留去した。析出した固体をジイソプロピルエーテルで洗浄し、濾取することにより目的物 52 m g を淡黄色固体として得た。

融点：238～241℃

[0230] [合成例 5]

3-イソプロピル-N-(4-メチル-1, 2, 5-オキサジアゾール-3-イル)-5-(トリフルオロメチル)-[1, 2, 4] トリアゾロ [4, 3-a] ピリジン-8-カルボキサミド (化合物 No. 3-001)

3-イソプロピル-5-(トリフルオロメチル)-[1, 2, 4] トリアゾロ [4, 3-a] ピリジン-8-カルボン酸 165 m g (0.60 m m o l)、N, N-ジメチルホルムアミド 0.1 m l 及び塩化メチレン 5 m l の混合溶液に、室温にて塩化オキサリル 83 m g (0.66 m m o l) を添加した。添加終了後、該反応混合物を室温にて 20 分間攪拌した。攪拌終了後、4-メチル-1, 2, 5-オキサジアゾール-3-アミン 119 m g (1.21 m m o l)、トリエチルアミン 122 m g (1.21 m m o l) 及び塩化メチレン 3 m l の混合溶液を添加した。添加終了後、該反応混合物を室温にて 1 時間攪拌した。攪拌終了後、減圧下にて溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (n-ヘキサン：酢酸エチル=9：1～2：1) にて精製し、目的物 168 m g を白色固体として得た。

融点：185～186℃

[0231] [合成例 6]

5-クロロ-3-イソプロピル-N-(1-メチル-1H-テトラゾール-5-イル)-[1, 2, 4] トリアゾロ [4, 3-a] ピリジン-8-カルボキサミド (化合物 No. 2-004)

5-クロロ-3-イソプロピル-[1, 2, 4]トリアゾロ[4, 3-a]ピリジン-8-カルボン酸メチル500mg (1.97mmol)、メタノール3ml及び水1mlの混合溶液に、氷冷下にて1M水酸化ナトリウム水溶液2mlを添加した。添加終了後、該反応混合物を室温にて1時間攪拌した。攪拌終了後、1M塩酸2.5mlを添加して反応を停止させた。該反応液中の溶媒を減圧下にて留去し、粗5-クロロ-3-イソプロピル-[1, 2, 4]トリアゾロ[4, 3-a]ピリジン-8-カルボン酸を得た。得られた粗5-クロロ-3-イソプロピル-[1, 2, 4]トリアゾロ[4, 3-a]ピリジン-8-カルボン酸500mg (1.97mmol)、1-メチル-1H-テトラゾール-5-アミン390mg (3.94mmol)、4-(ジメチルアミノ)ピリジン24mg (0.19mmol)及びピリジン5mlの混合溶液に、室温にて塩化チオニル469mg (3.94mmol)を添加した。添加終了後、該反応混合物を室温にて2日間攪拌した。攪拌終了後、水を添加し反応を停止させ、該反応液を酢酸エチルにて抽出(50ml×2回)した。得られた有機層を飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥し、減圧下にて溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(n-ヘキサン：酢酸エチル=4：1～1：1)にて精製し、目的物140mgを淡黄色固体として得た。

融点：189～190℃

[0232] [合成例7]

3-(メトキシメチル)-N-(1-メチル-1H-テトラゾール-5-イル)-5-(トリフルオロメチル)-[1, 2, 4]トリアゾロ[4, 3-a]ピリジン-8-カルボキサミド(化合物No. 2-010)

工程1；2-(2-(2-メトキシアセチル)ヒドラジニル)-6-(トリフルオロメチル)ニコチン酸メチルの合成(化合物No. A1-05a)

2-ヒドラジニル-6-(トリフルオロメチル)ニコチン酸メチル1.0g (4.25mmol)、トリエチルアミン473mg (4.68mmol)及びテトラヒドロフラン20mlの混合溶液に、氷冷下にてメトキシアセ

チルクロリド 508 mg (4.68 mmol) のテトラヒドロフラン 2 ml 溶液を添加した。添加終了後、該反応溶液を氷冷下にて 30 分間攪拌した。反応終了後、該反応溶液中の溶媒を減圧下にて留去し、水 15 ml を添加した後、クロロホルムにて抽出 (30 ml × 1 回、10 ml × 2 回) した。得られた有機層を飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥し、減圧下にて溶媒を留去した。析出した固体をジイソプロピルエーテルで洗浄し、濾取することにより目的物 1.16 g を白色固体として得た。

融点：76～77℃

[0233] 工程 2；3-(メトキシメチル)-5-(トリフルオロメチル)-[1, 2, 4] トリアゾロ [4, 3-a] ピリジン-8-カルボン酸メチルの合成 (化合物 No. B1-05a)

2-(2-(2-メトキシアセチル)ヒドラジニル)-6-(トリフルオロメチル)ニコチン酸メチル 1.16 g (3.78 mmol) 及びトルエン 17 ml の混合溶液に、室温にて塩化ホスホリル 1.74 g (11.3 mmol) を添加した。添加終了後、該反応溶液を加熱還流下にて 5 時間攪拌した。反応終了後、該反応溶液を別途用意した水 20 ml に注ぎ、炭酸水素ナトリウム水溶液を加えて pH を 8～9 とした後、酢酸エチルにて抽出 (30 ml × 1 回、15 ml × 3 回) した。合わせた有機層を飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥し、減圧下にて溶媒を留去した。析出した固体をジイソプロピルエーテルで洗浄し、濾取することにより目的物 721 mg を黄色固体として得た。

融点：95～97℃

[0234] 工程 3；3-(メトキシメチル)-5-(トリフルオロメチル)-[1, 2, 4] トリアゾロ [4, 3-a] ピリジン-8-カルボン酸の合成 (化合物 No. C1-05)

3-(メトキシメチル)-5-(トリフルオロメチル)-[1, 2, 4] トリアゾロ [4, 3-a] ピリジン-8-カルボン酸メチル 693 mg (2.39 mmol) 及びエタノール 7 ml の混合溶液に、氷冷下にて水酸化ナ

トリウム 115 mg (2.87 mmol) の水溶液 7 ml を添加した。添加終了後、該反応溶液を氷冷下にて 30 分間攪拌した。反応終了後、該反応溶液に 1 M 塩酸を添加し、pH を 2~3 とした後、クロロホルムにて抽出 (30 ml × 1 回、15 ml × 3 回) した。得られた有機層を飽和食塩水、無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥し、減圧下にて溶媒を留去した。析出した固体をジイソプロピルエーテルで洗浄し、濾取することにより目的物 553 mg を黄色固体として得た。

融点：111~112℃

[0235] 工程 4 ; 3-(メトキシメチル)-N-(1-メチル-1H-テトラゾール-5-イル)-5-(トリフルオロメチル)-[1, 2, 4] トリアゾロ [4, 3-a] ピリジン-8-カルボキサミドの合成

3-(メトキシメチル)-5-(トリフルオロメチル)-[1, 2, 4] トリアゾロ [4, 3-a] ピリジン-8-カルボン酸 100 mg (0.36 mmol)、1-メチル-1H-テトラゾール-5-アミン 72 mg (0.73 mmol)、4-ジメチルアミノピリジン 5 mg 及びピリジン 2 ml の混合溶液に、塩化チオニル 87 mg (0.73 mmol) を室温にて添加した。添加終了後、該反応溶液を室温にて 30 分間攪拌した。反応終了後、該反応溶液中の溶媒を減圧下にて留去した。得られた残渣に 1 mol/L 塩酸を添加し、pH を 2~3 とした後、クロロホルムにて抽出 (15 ml × 3 回) した。得られた有機層を飽和食塩水、無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥し、減圧下にて溶媒を留去した。析出した固体をジイソプロピルエーテルで洗浄し、濾取することにより目的物 76 mg を白色固体として得た。

融点：205~209℃

[0236] [合成例 8]

N-(5-メチル-1, 3, 4-オキサジアゾール-2-イル)-3-(メチルチオ)-5-(トリフルオロメチル)-[1, 2, 4] トリアゾロ [4, 3-a] ピリジン-8-カルボキサミド (化合物 No. 1-018)

工程 1 ; 3-チオキソ-5-(トリフルオロメチル)-2, 3-ジヒドロ

－ [1, 2, 4] トリアゾロ [4, 3-a] ピリジン－8－カルボン酸メチルの合成

2－ヒドラジニル－6－（トリフルオロメチル）ニコチン酸メチル 1.0 g (4.25 mmol)、1, 1'－チオカルボニルジイミダゾール 795 mg (4.46 mmol) 及び N, N－ジメチルホルムアミド 10 ml の混合溶液を、60℃にて3時間攪拌した。反応終了後、該反応溶液中の溶媒を減圧下にて留去した。析出した固体をジイソプロピルエーテルで洗浄し、濾取することにより目的物とイミダゾールの混合物 534 mg を赤色固体として得た。

[0237] 工程2；3－（メチルチオ）－5－（トリフルオロメチル）－[1, 2, 4] トリアゾロ [4, 3-a] ピリジン－8－カルボン酸メチルの合成

工程1で得られたイミダゾールを含む3－チオキソ－5－（トリフルオロメチル）－2, 3－ジヒドロ－[1, 2, 4] トリアゾロ [4, 3-a] ピリジン－8－カルボン酸メチル 534 mg の N, N－ジメチルホルムアミド 10 ml 溶液に、ヨウ化メチル 402 mg を室温にて添加した。添加終了後、該反応溶液を室温にて1.5時間攪拌した。反応終了後、該反応溶液中の溶媒を減圧下にて留去した。得られた残渣に水 15 ml を添加し、クロロホルムにて抽出（15 ml × 3回）した。得られた有機層を飽和食塩水、無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥し、減圧下にて溶媒を留去した。析出した固体をジイソプロピルエーテルで洗浄し、濾取することにより目的物 336 mg を黄色固体として得た。

融点：163～167℃

[0238] 工程3；3－（メチルチオ）－5－（トリフルオロメチル）－[1, 2, 4] トリアゾロ [4, 3-a] ピリジン－8－カルボン酸の合成

3－（メチルチオ）－5－（トリフルオロメチル）－[1, 2, 4] トリアゾロ [4, 3-a] ピリジン－8－カルボン酸メチル 332 mg (1.14 mmol) 及びメタノール 3 ml の混合溶液に、氷冷下にて 0.5 mol/L の水酸化ナトリウム水溶液 2.8 ml (1.4 mmol) を添加した。

添加終了後、該反応溶液を氷冷下にて1時間攪拌した。反応終了後、該反応溶液に1mol/L塩酸を添加し、pHを2~3とした。析出した固体を濾取し、1mol/L塩酸、水、ジイソプロピルエーテルで洗浄することにより目的物228mgを黄色固体として得た。

融点：158~162℃

[0239] 工程4；N-(5-メチル-1,3,4-オキサジアゾール-2-イル)-3-(メチルチオ)-5-(トリフルオロメチル)-[1,2,4]トリアゾロ[4,3-a]ピリジン-8-カルボキサミドの合成

3-(メチルチオ)-5-(トリフルオロメチル)-[1,2,4]トリアゾロ[4,3-a]ピリジン-8-カルボン酸100mg(0.36mmol)、5-メチル-1,3,4-オキサジアゾール-2-アミン71mg(0.72mmol)、4-ジメチルアミノピリジン4mg及びピリジン2mlの混合溶液に、塩化チオニル129mg(1.08mmol)を氷冷下にて添加した。添加終了後、該反応溶液を室温にて20分間攪拌した。反応終了後、該反応溶液中の溶媒を減圧下にて留去した。得られた残渣に1mol/L塩酸を添加し、pHを2~3とし、クロロホルムにて抽出(15ml×3回)した。得られた有機層を飽和食塩水、無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥し、減圧下にて溶媒を留去した。析出した固体をジイソプロピルエーテルで洗浄し、濾取することにより目的物100mgを黄色固体として得た。

融点：230~233℃

[0240] [合成例9]

3-イソプロピル-N-(1-メチル-1H-テトラゾール-5-イル)-5-(トリフルオロメチル)-[1,2,4]トリアゾロ[4,3-a]ピリジン-8-カルボチオアミド(化合物No. 2-039)

3-イソプロピル-N-(1-メチル-1H-テトラゾール-5-イル)-5-(トリフルオロメチル)-[1,2,4]トリアゾロ[4,3-a]ピリジン-8-カルボキサミド100mg(0.28mmol)、ローソン

試薬 [Lawesson's Reagent ; 2,4-ビス(4-メトキシフェニル)-1,3,2,4-ジチアジホスフェタン-2,4-ジスルフィド] 114 mg (0.28 mmol) 及びトルエン 3 ml の混合溶液を、110℃にて5時間攪拌した。攪拌終了後、該反応溶液にローソン試薬 114 mg (0.28 mmol) を添加し、110℃で3時間攪拌を継続した。反応終了後、該反応溶液に0.1規定塩酸 5 ml を添加し、酢酸エチル (15 ml × 1) で抽出した。得られた有機層を飽和食塩水、無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥し、減圧下にて溶媒を留去した。得られた残渣を n-ヘキサン-酢酸エチル (4 : 1 ~ 3 : 7 のグラジエント) にて溶出する中圧分取液体クロマトグラフィーにて精製し、目的物 66 mg を黄色固体として得た。

融点 : 198 ~ 200℃

[0241] [合成例 10]

3-アリル-N-(5-メチル-1,3,4-オキサジアゾール-2-イル)-5-(トリフルオロメチル)-[1,2,4]トリアゾロ[4,3-a]ピリジン-8-カルボキサミド及びN-(5-メチル-1,3,4-オキサジアゾール-2-イル)-3-(プロプ-1-エン-1-イル)-5-(トリフルオロメチル)-[1,2,4]トリアゾロ[4,3-a]ピリジン-8-カルボキサミド (化合物 No. 1-159 及び化合物 No. 1-159*)

工程 1 ; 3-アリル-5-(トリフルオロメチル)-[1,2,4]トリアゾロ[4,3-a]ピリジン-8-カルボン酸メチル及び3-(プロプ-1-エン-1-イル)-5-(トリフルオロメチル)-[1,2,4]トリアゾロ[4,3-a]ピリジン-8-カルボン酸メチルの合成

合成例 7 の工程 1 と同様の方法で合成した 2-(2-(ブチ-3-エノイル)ヒドラジニル)-6-(トリフルオロメチル)ニコチン酸メチル 1.20 g (3.96 mmol) 及びトルエン 18 ml の混合溶液に、室温にて塩化ホスホリル 1.82 g (11.9 mmol) を添加した。添加終了後、該反応溶液を加熱還流下にて 1.5 時間攪拌した。反応終了後、該反応溶液を別

途用意した水 20 ml に注ぎ、炭酸水素ナトリウム水溶液を加えて pH を 8 ～ 9 とした後、酢酸エチルにて抽出（30 ml × 1 回、15 ml × 3 回）した。合わせた有機層を飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥し、減圧下にて溶媒を留去した。得られた残渣を n-ヘキサン-酢酸エチル（7 : 3 ～ 0 : 1 のグラジエント）にて溶出する中圧分取液体クロマトグラフィーにて精製し、目的物 730 mg を白色固体として得た [3-アリル-5-(トリフルオロメチル)-[1, 2, 4] トリアゾロ [4, 3-a] ピリジン-8-カルボン酸メチル / 3-(プロプ-1-エン-1-イル)-5-(トリフルオロメチル)-[1, 2, 4] トリアゾロ [4, 3-a] ピリジン-8-カルボン酸メチル = 4 / 1]。

3-アリル-5-(トリフルオロメチル)-[1, 2, 4] トリアゾロ [4, 3-a] ピリジン-8-カルボン酸メチルの ^1H NMR (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 7.97 (d, 1H, $J=7.2\text{Hz}$), 7.44 (d, 1H, $J=7.2\text{Hz}$), 6.31-6.20 (m, 1H), 5.26-5.12 (m, 2H), 4.10 (s, 3H), 4.00 (dd, 2H, $J=6.3\text{Hz}$, 1.2Hz)。

3-(プロプ-1-エン-1-イル)-5-(トリフルオロメチル)-[1, 2, 4] トリアゾロ [4, 3-a] ピリジン-8-カルボン酸メチルの ^1H NMR (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 7.94 (d, 1H, $J=6.0\text{Hz}$), 7.42 (d, 1H, $J=6.0\text{Hz}$), 7.00-6.90 (m, 1H), 6.66-6.58 (m, 1H), 4.10 (s, 3H), 2.04 (dd, 3H, $J=6.6\text{Hz}$, 1.8Hz)。

融点：121～123℃

[0242] 工程 2 ; 3-アリル-5-(トリフルオロメチル)-[1, 2, 4] トリアゾロ [4, 3-a] ピリジン-8-カルボン酸及び 3-(プロプ-1-エン-1-イル)-5-(トリフルオロメチル)-[1, 2, 4] トリアゾロ [4, 3-a] ピリジン-8-カルボン酸の合成

3-アリル-5-(トリフルオロメチル)-[1, 2, 4] トリアゾロ [4, 3-a] ピリジン-8-カルボン酸メチル及び 3-(プロプ-1-エン-1-イル)-5-(トリフルオロメチル)-[1, 2, 4] トリアゾロ [4, 3-a] ピリジン-8-カルボン酸メチルの混合物 720 mg (2.6

5 mmol) 及びエタノール 10 ml の混合溶液に、氷冷下にて 0.5 mol/L の水酸化ナトリウム水溶液 7.0 ml (3.5 mmol) を添加した。添加終了後、該反応溶液を氷冷下にて 30 分間攪拌した。反応終了後、該反応溶液に 1 M 塩酸を添加し、pH を 2~3 とした後、酢酸エチルにて抽出 (15 ml × 2 回) した。得られた有機層を飽和食塩水、無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥し、減圧下にて溶媒を留去し、目的物 467 mg を白色固体として得た [3-アリル-5-(トリフルオロメチル)-[1, 2, 4] トリアゾロ [4, 3-a] ピリジン-8-カルボン酸/3-(プロペ-1-エン-1-イル)-5-(トリフルオロメチル)-[1, 2, 4] トリアゾロ [4, 3-a] ピリジン-8-カルボン酸=4/1]。

3-アリル-5-(トリフルオロメチル)-[1, 2, 4] トリアゾロ [4, 3-a] ピリジン-8-カルボン酸の ^1H NMR (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 8.25 (d, 1H, $J=7.5\text{Hz}$), 7.61 (d, 1H, $J=7.5\text{Hz}$), 6.34-6.20 (m, 1H), 5.35-5.22 (m, 2H), 4.00 (dd, 2H, $J=6.3\text{Hz}$, 1.2Hz)。 (CO_2H のプロトンピークは観測されなかった。)

3-(プロペ-1-エン-1-イル)-5-(トリフルオロメチル)-[1, 2, 4] トリアゾロ [4, 3-a] ピリジン-8-カルボン酸の ^1H NMR (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 8.22 (d, 1H, $J=8.1\text{Hz}$), 7.58 (d, 1H, $J=8.1\text{Hz}$), 7.12-7.00 (m, 1H), 6.67-6.60 (m, 1H), 2.07 (dd, 3H, $J=6.9\text{Hz}$, 1.8Hz)。 (CO_2H のプロトンピークは観測されなかった。)

融点: 103~104°C

[0243] 工程 3; 3-アリル-N-(5-メチル-1, 3, 4-オキサジアゾール-2-イル)-5-(トリフルオロメチル)-[1, 2, 4] トリアゾロ [4, 3-a] ピリジン-8-カルボキサミド及び N-(5-メチル-1, 3, 4-オキサジアゾール-2-イル)-3-(プロペ-1-エン-1-イル)-5-(トリフルオロメチル)-[1, 2, 4] トリアゾロ [4, 3-a] ピリジン-8-カルボキサミドの合成

3-アリル-5-(トリフルオロメチル)-[1, 2, 4] トリアゾロ [

4, 3-a] ピリジン-8-カルボン酸及び3-(プロプ-1-エン-1-イル)-5-(トリフルオロメチル)-[1, 2, 4] トリアゾロ[4, 3-a] ピリジン-8-カルボン酸の混合物100mg (0.37mmol)、5-メチル-1, 3, 4-オキサジアゾール-2-アミン55mg (0.55mmol)、1-ヒドロキシ-7-アザベンゾトリアゾール5mg (0.04mmol) 及びN,N-ジメチルホルムアミド2mlの混合溶液に、室温にて1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル) カルボジイミド塩酸塩106mg (0.55mmol) を添加した。添加終了後、該反応混合物を室温にて1時間攪拌した。攪拌終了後、1mol/l 塩酸3mlを添加し、該反応液を酢酸エチルにて抽出(10ml×2回)した。得られた有機層を水洗後、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下にて溶媒を留去した。得られた個体を酢酸エチルからの再結晶にて精製し、目的物67mgを淡黄色固体として得た [3-アリル-N-(5-メチル-1, 3, 4-オキサジアゾール-2-イル)-5-(トリフルオロメチル)-[1, 2, 4] トリアゾロ[4, 3-a] ピリジン-8-カルボキサミド/N-(5-メチル-1, 3, 4-オキサジアゾール-2-イル)-3-(プロプ-1-エン-1-イル)-5-(トリフルオロメチル)-[1, 2, 4] トリアゾロ[4, 3-a] ピリジン-8-カルボキサミド=4/1]。

3-アリル-N-(5-メチル-1, 3, 4-オキサジアゾール-2-イル)-5-(トリフルオロメチル)-[1, 2, 4] トリアゾロ[4, 3-a] ピリジン-8-カルボキサミドの¹H NMR (CDCl₃, Me₄Si, 300MHz) δ 12.9 (brs, 1H), 8.42 (d, 1H, J=7.5Hz), 7.63 (d, 1H, J=7.5Hz), 6.38-6.24 (m, 1H), 5.36-5.23 (m, 2H), 4.03 (dd, 2H, J=6.9Hz, 1.2Hz), 2.59 (s, 3H)。N-(5-メチル-1, 3, 4-オキサジアゾール-2-イル)-3-(プロプ-1-エン-1-イル)-5-(トリフルオロメチル)-[1, 2, 4] トリアゾロ[4, 3-a] ピリジン-8-カルボキサミドの¹H NMR (CDCl₃, Me₄Si, 300MHz) δ 12.9 (brs, 1H), 8.38 (d, 1H, J=6.9Hz), 7.60 (d, 1H, J=6.9Hz), 7.12-7.00 (m, 1H), 6.69-6.62 (m, 1H), 2.60 (s, 3H), 2.09 (d

d, 3H, J=6.6Hz, 1.8Hz)。

融点：159～161℃

[0244] [合成例11]

3-アリル-N-(1-メチル-1H-テトラゾール-5-イル)-5-(トリフルオロメチル)-[1, 2, 4]トリアゾロ[4, 3-a]ピリジン-8-カルボキサミド及びN-(1-メチル-1H-テトラゾール-5-イル)-3-(プロプ-1-エン-1-イル)-5-(トリフルオロメチル)-[1, 2, 4]トリアゾロ[4, 3-a]ピリジン-8-カルボキサミド(化合物No. 2-105及び化合物No. 2-105*)

合成例7の工程2で合成した3-アリル-5-(トリフルオロメチル)-[1, 2, 4]トリアゾロ[4, 3-a]ピリジン-8-カルボン酸及び3-(プロプ-1-エン-1-イル)-5-(トリフルオロメチル)-[1, 2, 4]トリアゾロ[4, 3-a]ピリジン-8-カルボン酸の混合物100mg(0.37mmol)、1-メチル-1H-テトラゾール-5-アミン56mg(0.57mmol)及びピリジン2mlの混合溶液に、塩化チオニル66mg(0.55mmol)を15℃以下の温度にて添加した。添加終了後、該反応溶液を15℃以下に保ち1.5時間攪拌した。反応終了後、該反応溶液中の溶媒を減圧下にて留去した。得られた残渣にアセトニトリル1.5ml及び1mol/L塩酸2mlを添加し、酢酸エチルにて抽出(10ml×2回)した。得られた有機層を飽和食塩水、無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥し、減圧下にて溶媒を留去した。析出した固体を酢酸エチルで洗浄し、濾取することにより目的物27mgをうす茶色固体として得た

[3-アリル-N-(1-メチル-1H-テトラゾール-5-イル)-5-(トリフルオロメチル)-[1, 2, 4]トリアゾロ[4, 3-a]ピリジン-8-カルボキサミド/N-(1-メチル-1H-テトラゾール-5-イル)-3-(プロプ-1-エン-1-イル)-5-(トリフルオロメチル)-[1, 2, 4]トリアゾロ[4, 3-a]ピリジン-8-カルボキサミド=3/1]。

3-アリル-N-(1-メチル-1H-テトラゾール-5-イル)-5-(トリフルオロメチル)-[1, 2, 4]トリアゾロ[4, 3-a]ピリジン-8-カルボキサミドの¹H NMR (CDCl₃, Me₄Si, 300MHz) δ 12.5 (brs, 1H), 8.40 (d, 1H, J=7.5Hz), 7.65 (d, 1H, J=7.5Hz), 6.37-6.24 (m, 1H), 5.37-5.24 (m, 2H), 4.13 (s, 3H), 4.06 (dd, 2H, J=6.6Hz, 1.2Hz)。

N-(1-メチル-1H-テトラゾール-5-イル)-3-(プロプ-1-エン-1-イル)-5-(トリフルオロメチル)-[1, 2, 4]トリアゾロ[4, 3-a]ピリジン-8-カルボキサミドの¹H NMR (CDCl₃, Me₄Si, 300 MHz) δ 12.5 (brs, 1H), 8.36 (d, 1H, J=7.2Hz), 7.62 (d, 1H, J=7.2Hz), 7.13-7.01 (m, 1H), 6.70-6.62 (m, 1H), 4.13 (s, 3H), 2.10 (dd, 3H, J=6.6Hz, 1.5Hz)。

融点：164～167℃

[0245] [合成例12]

3-(2,2-ジクロロ-1-メチルシクロプロピル)-N-エチル-N-(5-メチル-1,3,4-オキサジアゾール-2-イル)-5-(トリフルオロメチル)-[1, 2, 4]トリアゾロ[4, 3-a]ピリジン-8-カルボキサミド (化合物No. 1-174)

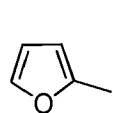
3-(2,2-ジクロロ-1-メチルシクロプロピル)-N-(5-メチル-1,3,4-オキサジアゾール-2-イル)-5-(トリフルオロメチル)-[1, 2, 4]トリアゾロ[4, 3-a]ピリジン-8-カルボキサミド 67 mg のN, N-ジメチルホルムアミド 1 ml 溶液に、炭酸カリウム 31 mg 及びヨウ化エチル 48 mg を室温にて添加した。添加終了後、該反応混合物を 55℃にて30分間攪拌した。反応終了後、水 2 ml を加え、酢酸エチル (3 ml × 2) で抽出した。得られた有機層を飽和食塩水、無水硫酸マグネシウムの順で脱水・乾燥し、減圧下にて溶媒を留去した。得られた残渣をn-ヘキサン-酢酸エチル (2:1～0:1のグラジエント) にて溶出する中圧分取液体クロマトグラフィーにて精製し、目的物 21 mg を無色樹脂状物質として得た。

^1H NMR (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 7.72 (d, 1H, $J=7.8\text{Hz}$), 7.53 (d, 1H, $J=7.8\text{Hz}$), 4.15 (q, 2H, $J=7.2\text{Hz}$), 2.78 (d, 1H, $J=7.8\text{Hz}$), 2.38 (s, 3H), 1.83 (d, 1H, $J=7.8\text{Hz}$), 1.80 (s, 3H), 1.43 (t, 3H, $J=7.2\text{Hz}$).

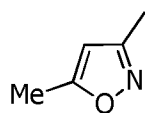
[0246] 本発明化合物は、前記合成例に準じて合成することができる。合成例 1 乃至合成例 9 と同様に製造した本発明化合物の例を第 4 表乃至第 10 表に示すが、本発明はこれらのみに限定されるものではない。尚、表中 Me との記載はメチル基を表し、以下同様に Et はエチル基を、Pr はプロピル基を、Pen はペンチル基を、Hex はヘキシル基を、Ph はフェニル基を、Bn はベンジル基を、i- はイソを、c- はシクロ及び t- はターシャリーを各々意味する。

[0247] また、表中 D-2、D-3 a、D-4 a、D-5、D-6 a、D-7 a、D-8 a、D-9、D-9 a、D-9 b、D-10 a、D-11、D-12、D-13 a、D-14、D-15、D-16 a、D-16 m、D-17、D-17 a、D-17 b、D-18、D-19、D-20 a、D-23 a、D-24 f で表される置換基は、以下の構造を表す。

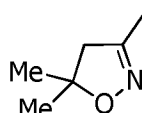
[化43]



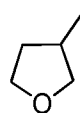
D-2



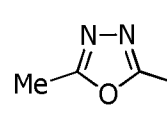
D-3a



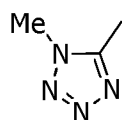
D-4a



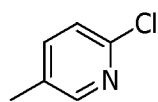
D-5



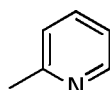
D-6a



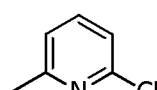
D-7a



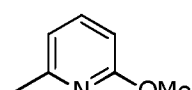
D-8a



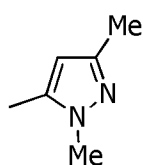
D-9



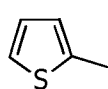
D-9a



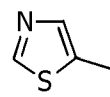
D-9b



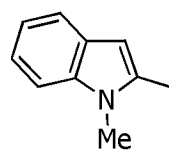
D-10a



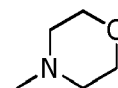
D-11



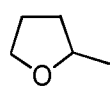
D-12



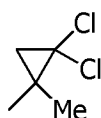
D-13a



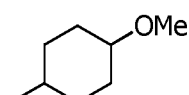
D-14



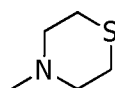
D-15



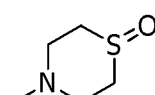
D-16a



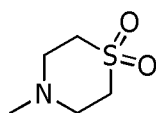
D-16m



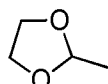
D-17



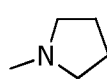
D-17a



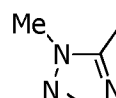
D-17b



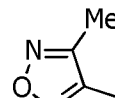
D-18



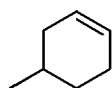
D-19



D-20a



D-23a



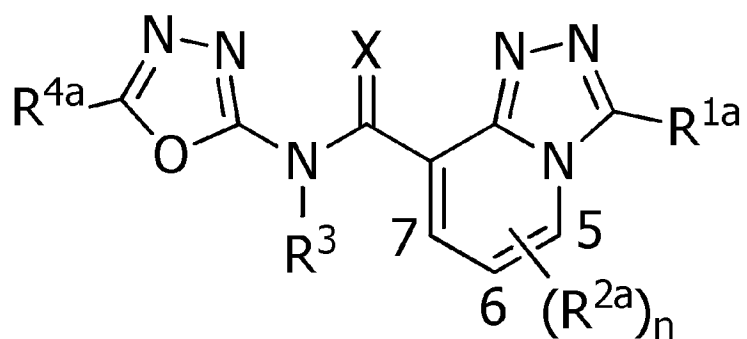
D-24f

[0248] 尚、表中、「* 1」は「樹脂状」を表す。「* 2」は融点測定時に分解が見られたことを意味する。「* 3」は構造の異なる異性体である本発明化合物 1-158 と 1-158* の混合物であり、その割合は 1-158 / 1-158* = 9 / 1 である。「* 4」は合成例 10 に記載の通り、構造の異なる異性体である本発明化合物 1-159 と 1-159* の混合物であり、その割合は 1-159 / 1-159* = 4 / 1 である。「* 5」は合成例 11 に記載の通り、構造の異なる異性体である本発明化合物 2-105 と 2-1

05*の混合物であり、その割合は $2-105/2-105^*=3/1$ である。

[0249] [第4表]

[化44]



[表27]

No.	R ^{1a}	(R ^{2a}) _n	X	R ³	R ^{4a}	融点 (°C)
1-001	H	5-CF ₃	0	H	Me	220-223
1-002	Me	5-CF ₃	0	H	Me	242-245
1-003	i-Pr	5-Me	0	H	Me	*2
1-004	i-Pr	5-CF ₃	0	H	Me	176-178
1-005	i-Pr	5-CF ₃	0	H	Et	176-180
1-006	i-Pr	5-CF ₃	0	H	Bn	141-150
1-007	i-Pr	5-CF ₃	0	H	Ph	173-177
1-008	i-Pr	5-CF ₃	0	H	D-2	152-156
1-009	i-Pr	5-SMe	0	H	Me	*2
1-010	c-Pr	5-CF ₃	0	H	Me	157-165
1-011	3-Pen	5-CF ₃	0	H	Me	171-174
1-012	Ph	5-CF ₃	0	H	Me	266-270
1-013	Cl	5-CF ₃	0	H	Me	238-241
1-014	Br	5-CF ₃	0	H	Me	252-260
1-015	CH ₂ OMe	5-CF ₃	0	H	Me	115-125
1-016	4-MeO-Ph	5-CF ₃	0	H	Me	205-208
1-017	4-Cl-Ph	5-CF ₃	0	H	Me	256-258
1-018	SMe	5-CF ₃	0	H	Me	230-233
1-019	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	5-CF ₃	0	H	Me	90-91
1-020	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	5-CF ₃	0	H	Me	148-149
1-021	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	5-CF ₃	0	H	Me	160-162
1-022	D-3a	5-CF ₃	0	H	Me	218-221
1-023	i-Pr	6-CF ₃	0	H	Me	160-162
1-024	n-Pr	5-CF ₃	0	H	Me	172-176
1-025	CH ₂ OPh	5-CF ₃	0	H	Me	188-190
1-026	c-Pen	5-CF ₃	0	H	Me	170-171
1-027	CH ₂ OEt	5-CF ₃	0	H	Me	141-143
1-028	t-Bu	5-CF ₃	0	H	Me	161-165
1-029	D-4a	5-CF ₃	0	H	Me	172-176
1-030	CH ₂ SMe	5-CF ₃	0	H	Me	153-155
1-031	CH ₂ SCH ₂ CF ₃	5-CF ₃	0	H	Me	162-163
1-032	SEt	5-CF ₃	0	H	Me	182-184
1-033	SCH(CH ₃) ₂	5-CF ₃	0	H	Me	186-188
1-034	S(O)Et	5-CF ₃	0	H	Me	192-193
1-035	S(O)CH(CH ₃) ₂	5-CF ₃	0	H	Me	153-157
1-036	CH ₂ S(O)Me	5-CF ₃	0	H	Me	190-191
1-037	CH ₂ S(O) ₂ Me	5-CF ₃	0	H	Me	*1
1-038	CH ₂ S(O)CH ₂ CF ₃	5-CF ₃	0	H	Me	200-202
1-039	CH ₂ S(O) ₂ CH ₂ CF ₃	5-CF ₃	0	H	Me	*1
1-040	S(O) ₂ Me	5-CF ₃	0	H	Me	*1
1-041	S(O) ₂ Et	5-CF ₃	0	H	Me	*1
1-042	CH ₂ C(O)OEt	5-CF ₃	0	H	Me	187-189
1-043	4-Me-Ph	5-CF ₃	0	H	Me	221-223
1-044	4-F-Ph	5-CF ₃	0	H	Me	203-208
1-045	4-CF ₃ -Ph	5-CF ₃	0	H	Me	196-198
1-046	3-MeO-Ph	5-CF ₃	0	H	Me	178-182
1-047	2-MeO-Ph	5-CF ₃	0	H	Me	180-185
1-048	CH ₂ C(O)OH	5-CF ₃	0	H	Me	139-141

[表28]

No.	R ^{1a}	(R ^{2a}) _n	X	R ³	R ^{4a}	融点 (°C)
1-049	CH ₂ C(O)OCH(CH ₃) ₂	5-CF ₃	0	H	Me	157-159
1-050	i-Pr	5-CF ₃	0	H	H	171-175
1-051	i-Pr	5-CF ₃	0	H	c-Pr	161-162
1-052	i-Pr	5-CF ₃	0	H	(CH ₂) ₂ OMe	125-135
1-053	i-Pr	5-CF ₂ H	0	H	Me	160-162
1-054	D-8a	5-CF ₃	0	H	Me	240-243
1-055	D-9a	5-CF ₃	0	H	Me	205-208
1-056	D-10a	5-CF ₃	0	H	Me	274-275
1-057	D-11	5-CF ₃	0	H	Me	222-224
1-058	D-12	5-CF ₃	0	H	Me	213-216
1-059	D-13a	5-CF ₃	0	H	Me	272-274
1-060	CH ₂ C(O)O(CH ₂) ₂ OMe	5-CF ₃	0	H	Me	152-153
1-061	CH ₂ C(O)NHCH(CH ₃) ₂	5-CF ₃	0	H	Me	222-227
1-062	CH ₂ OC(O)Me	5-CF ₃	0	H	Me	165-167
1-063	S(CH ₂) ₂ OMe	5-CF ₃	0	H	Me	99-101
1-064	SCH ₂ CH=CH ₂	5-CF ₃	0	H	Me	213-217
1-065	SCH ₂ C≡CH	5-CF ₃	0	H	Me	114-117
1-066	i-Pr	5-CF ₂ CF ₃	0	H	Me	193-195
1-067	CH ₂ OH	5-CF ₃	0	H	Me	236-238
1-068	CHO	5-CF ₃	0	H	Me	222-223
1-069	CH ₂ (4-MeO-Ph)	5-CF ₃	0	H	Me	172-174
1-070	3, 5-(MeO) ₂ -Ph	5-CF ₃	0	H	Me	228-229
1-071	3, 5-(Cl) ₂ -Ph	5-CF ₃	0	H	Me	254-256
1-072	CH=NOMe	5-CF ₃	0	H	Me	204-207
1-073	S(O)(CH ₂) ₂ OMe	5-CF ₃	0	H	Me	199-201
1-074	S(O)CH ₂ CH=CH ₂	5-CF ₃	0	H	Me	134-137
1-075	i-Pr	5-CF ₃ -6-Me	0	H	Me	168-169
1-076	NMe ₂	5-CF ₃	0	H	Me	184-185
1-077	S(O)CH ₂ C≡CH	5-CF ₃	0	H	Me	205-212
1-078	CH(Me)SMe	5-CF ₃	0	H	Me	137-139
1-079	CH(Me)S(O)Me	5-CF ₃	0	H	Me	127-129
1-080	CH(Me)S(O) ₂ Me	5-CF ₃	0	H	Me	159-160
1-081	i-Pr	5-Ph	0	H	Me	131-133
1-082	NHPh	5-CF ₃	0	H	Me	179-182
1-083	(CH ₂) ₂ SMe	5-CF ₃	0	H	Me	157-159
1-084	(CH ₂) ₂ S(O)Me	5-CF ₃	0	H	Me	179-181
1-085	(CH ₂) ₂ S(O) ₂ Me	5-CF ₃	0	H	Me	191-192
1-086	N(Me)Ph	5-CF ₃	0	H	Me	175-178
1-087	S(CH ₂) ₂ CH ₃	5-CF ₃	0	H	Me	141-142
1-088	i-Pr	5-{3, 5-(F) ₂ -Ph}	0	H	Me	191-193
1-089	i-Pr	5-CF ₃ -7-Me	0	H	Me	120-124
1-090	NHCH(CH ₃) ₂	5-CF ₃	0	H	Me	163-164
1-091	SCH(CH ₃) ₂	5-CF ₃	0	H	H	211-213
1-092	S(O)(CH ₂) ₂ CH ₃	5-CF ₃	0	H	Me	193-195
1-093	SCH ₂ CH(CH ₃) ₂	5-CF ₃	0	H	Me	143-145
1-094	SCH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	5-CF ₃	0	H	Me	150-153
1-095	SC(CH ₃) ₃	5-CF ₃	0	H	Me	178-180
1-096	D-14	5-CF ₃	0	H	Me	166-168

[表29]

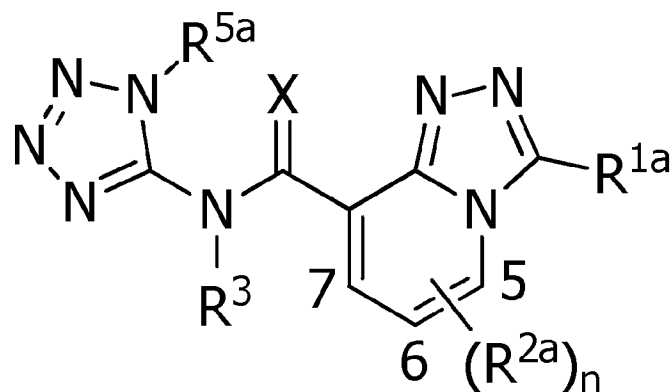
No.	R ^{1a}	(R ^{2a}) _n	X	R ³	R ^{4a}	融点 (°C)
1-097	i-Pr	5-CF ₃	0	H	D-15	108-111
1-098	i-Pr	5-CF ₃	0	H	D-14	*1
1-099	i-Pr	5-CF ₃	0	H	4-MeO-Ph	154-158
1-100	i-Pr	5-CF ₃	0	H	CF ₃	111-116
1-101	i-Pr	5-CF ₃	0	H	D-9	167-169
1-102	NH(D-9b)	5-CF ₃	0	H	Me	219-221
1-103	NMe ₂	5-CF ₃	0	H	H	200-205
1-104	CH ₂ (c-Pr)	5-CF ₃	0	H	Me	160-163
1-105	D-16a	5-CF ₃	0	H	Me	232-235
1-106	SEt	5-CF ₃	0	H	H	189-191
1-107	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	5-CF ₃	0	H	H	117-118
1-108	S(CH ₂) ₂ CH ₃	5-CF ₃	0	H	H	198-200
1-109	NH(CH ₂) ₂ OMe	5-CF ₃	0	H	Me	150-155
1-110	D-14	5-CF ₃	0	H	H	180-182
1-111	NHS(O) ₂ Ph	5-CF ₃	0	H	Me	259-261
1-112	OEt	5-CF ₃	0	H	H	135-145
1-113	SCH ₂ Ph	5-CF ₃	0	H	Me	187-190
1-114	SCH ₂ (4-MeO-Ph)	5-CF ₃	0	H	Me	155-158
1-115	SCH ₂ (c-Pr)	5-CF ₃	0	H	Me	135-137
1-116	SCH ₂ (D-15)	5-CF ₃	0	H	Me	142-143
1-117	SCH ₂ CN	5-CF ₃	0	H	Me	179-182
1-118	D-17	5-CF ₃	0	H	Me	*1
1-119	D-17a	5-CF ₃	0	H	Me	250-255
1-120	D-17b	5-CF ₃	0	H	Me	235-238
1-121	N(Me)(CH ₂) ₂ OMe	5-CF ₃	0	H	H	131-134
1-122	N(Me)CH(CH ₃) ₂	5-CF ₃	0	H	H	155-157
1-123	N(Me)(c-Hex)	5-CF ₃	0	H	H	64-66
1-124	SCH ₂ CF ₃	5-CF ₃	0	H	Me	156-157
1-125	SCH ₂ C(O)CH ₃	5-CF ₃	0	H	Me	178-182
1-126	SCH ₂ (D-18)	5-CF ₃	0	H	Me	200-203
1-127	SCH ₂ C(O)OMe	5-CF ₃	0	H	Me	184-185
1-128	SCH ₂ CH=CH ₂	5-CF ₃	0	H	H	188-190
1-129	N(Me)(CH ₂) ₂ OMe	5-CF ₃	0	H	Me	75-80
1-130	NH(CH ₂) ₂ SMe	5-CF ₃	0	H	Me	111-115
1-131	NHCH ₂ CF ₃	5-CF ₃	0	H	Me	140-144
1-132	N(Me)CH(CH ₃) ₂	5-CF ₃	0	H	Me	164-168
1-133	N(Me)(c-Hex)	5-CF ₃	0	H	Me	135-140
1-134	N(Me)Et	5-CF ₃	0	H	Me	125-128
1-135	N(Et) ₂	5-CF ₃	0	H	Me	135-137
1-136	D-19	5-CF ₃	0	H	Me	151-152
1-137	N(Me)Et	5-CF ₃	0	H	H	141-143
1-138	N(Et) ₂	5-CF ₃	0	H	H	130-131
1-139	D-19	5-CF ₃	0	H	H	217-218
1-140	i-Pr	5-CF ₃	0	H	D-11	200-201
1-141	i-Pr	5-CF ₃	0	H	CH ₂ SMe	114-116
1-142	i-Pr	5-CF ₃	0	H	CH ₂ S(O) ₂ Me	171-173
1-143	i-Pr	5-CF ₃	0	H	CH ₂ S(O)Me	149-150
1-144	c-Pr	5-CF ₃	0	H	H	170-174

[表30]

No.	R ^{1a}	(R ^{2a}) _n	X	R ³	R ^{4a}	融点 (°C)
1-145	3-Pen	5-CF ₃	0	H	H	228-231
1-146	CH ₂ SMe	5-CF ₃	0	H	H	176-179
1-147	4-F-Ph	5-CF ₃	0	H	H	222-226
1-148	3, 5-(MeO) ₂ -Ph	5-CF ₃	0	H	H	217-220
1-149	4-MeO-Ph	5-CF ₃	0	H	H	210-213
1-150	D-8a	5-CF ₃	0	H	H	244-248
1-151	CH ₂ (4-MeO-Ph)	5-CF ₃	0	H	H	187-190
1-152	N(Me)CH ₂ C≡CH	5-CF ₃	0	H	Me	161-163
1-153	N(Me)(CH ₂) ₂ CN	5-CF ₃	0	H	Me	138-143
1-154	S(c-Pen)	5-CF ₃	0	H	Me	153-155
1-155	S(c-Pen)	5-CF ₃	0	H	H	214-216
1-156	SCH ₂ (D-8a)	5-CF ₃	0	H	Me	171-172
1-157	SCH ₂ (D-8a)	5-CF ₃	0	H	H	204-207
1-158	CH ₂ CH=CH ₂	5-CF ₃	0	H	H	155-158(*3)
1-158*	CH=CHMe	5-CF ₃	0	H	H	155-158(*3)
1-159	CH ₂ CH=CH ₂	5-CF ₃	0	H	Me	159-161(*4)
1-159*	CH=CHMe	5-CF ₃	0	H	Me	159-161(*4)
1-160	C≡CMe	5-CF ₃	0	H	H	*2
1-161	C≡CMe	5-CF ₃	0	H	Me	>280
1-162	CH ₂ CF ₃	5-CF ₃	0	H	Me	199-203
1-163	N(Me)CH ₂ C≡CH	5-CF ₃	0	H	H	216-218
1-164	N(Me)(CH ₂) ₂ CN	5-CF ₃	0	H	H	105-110
1-165	N(Me)(4-MeO-Ph)	5-CF ₃	0	H	Me	136-139
1-166	N(Me)CH ₂ CH=CH ₂	5-CF ₃	0	H	Me	127-129
1-167	N(Me)CH ₂ (4-MeO-Ph)	5-CF ₃	0	H	Me	191-194
1-168	CH ₂ CN	5-CF ₃	0	H	Me	196-199
1-169	D-16m	5-CF ₃	0	H	Me	146-147
1-170	D-24f	5-CF ₃	0	H	Me	182-185
1-171	N(Me)(4-MeO-Ph)	5-CF ₃	0	H	H	180-185
1-172	N(Me)CH ₂ CH=CH ₂	5-CF ₃	0	H	H	135-137
1-173	(CH ₂) ₂ OMe	5-CF ₃	0	H	Me	157-158
1-174	D-16a	5-CF ₃	0	Et	Me	*1

[0250] [第5表]

[化45]



[表31]

No.	R ^{1a}	(R ^{2a}) _n	X	R ³	R ^{5a}	融点 (°C)
2-001	H	5-CF ₃	0	H	Me	247-251
2-002	Me	5-CF ₃	0	H	Me	215-219
2-003	i-Pr	5-CF ₃	0	H	Me	215-220
2-004	i-Pr	5-Cl	0	H	Me	189-190
2-005	c-Pr	5-CF ₃	0	H	Me	190-195
2-006	3-Pen	5-CF ₃	0	H	Me	143-144
2-007	Ph	5-CF ₃	0	H	Me	245-247
2-008	Cl	5-CF ₃	0	H	Me	193-195
2-009	Br	5-CF ₃	0	H	Me	186-193
2-010	CH ₂ OMe	5-CF ₃	0	H	Me	205-209
2-011	4-MeO-Ph	5-CF ₃	0	H	Me	173-177
2-012	4-Cl-Ph	5-CF ₃	0	H	Me	256-258
2-013	SMe	5-CF ₃	0	H	Me	210-215
2-014	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	5-CF ₃	0	H	Me	152-154
2-015	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	5-CF ₃	0	H	Me	170-171
2-016	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	5-CF ₃	0	H	Me	181-184
2-017	D-3a	5-CF ₃	0	H	Me	251-253
2-018	i-Pr	6-CF ₃	0	H	Me	169-171
2-019	n-Pr	5-CF ₃	0	H	Me	149-150
2-020	CH ₂ OPh	5-CF ₃	0	H	Me	116-117
2-021	c-Pen	5-CF ₃	0	H	Me	197-201
2-022	D-5	5-CF ₃	0	H	Me	147-149
2-023	i-Pr	5-CF ₃	0	Me	Me	215-216
2-024	SEt	5-CF ₃	0	H	Me	157-159
2-025	SCH(CH ₃) ₂	5-CF ₃	0	H	Me	200-204
2-026	CH ₂ OEt	5-CF ₃	0	H	Me	183-184
2-027	t-Bu	5-CF ₃	0	H	Me	217-218
2-028	D-4a	5-CF ₃	0	H	Me	186-188
2-029	CH ₂ SMe	5-CF ₃	0	H	Me	189-191
2-030	CH ₂ SCCH ₂ CF ₃	5-CF ₃	0	H	Me	155-158
2-031	S(O)Et	5-CF ₃	0	H	Me	190-191
2-032	S(O)CH(CH ₃) ₂	5-CF ₃	0	H	Me	163-167
2-033	CH ₂ S(O)Me	5-CF ₃	0	H	Me	204-206
2-034	CH ₂ S(O) ₂ Me	5-CF ₃	0	H	Me	212-214
2-035	CH ₂ S(O)CH ₂ CF ₃	5-CF ₃	0	H	Me	138-142
2-036	CH ₂ S(O) ₂ CH ₂ CF ₃	5-CF ₃	0	H	Me	176-178
2-037	S(O) ₂ Me	5-CF ₃	0	H	Me	*1
2-038	S(O) ₂ Et	5-CF ₃	0	H	Me	*1
2-039	i-Pr	5-CF ₃	S	H	Me	198-200
2-040	CH ₂ C(O)OEt	5-CF ₃	0	H	Me	202-204
2-041	i-Pr	5-CF ₃	0	H	CH ₂ CH ₂ OMe	*1
2-042	4-Me-Ph	5-CF ₃	0	H	Me	221-225
2-043	4-F-Ph	5-CF ₃	0	H	Me	236-240
2-044	3-MeO-Ph	5-CF ₃	0	H	Me	210-212
2-045	2-MeO-Ph	5-CF ₃	0	H	Me	150-153
2-046	i-Pr	5-CF ₃	0	H	CH ₂ C(O)OMe	149-154
2-047	i-Pr	5-CF ₂ H	0	H	Me	172-173
2-048	i-Pr	5-CF ₃	0	H	CH ₂ CH ₂ SMe	*1

[表32]

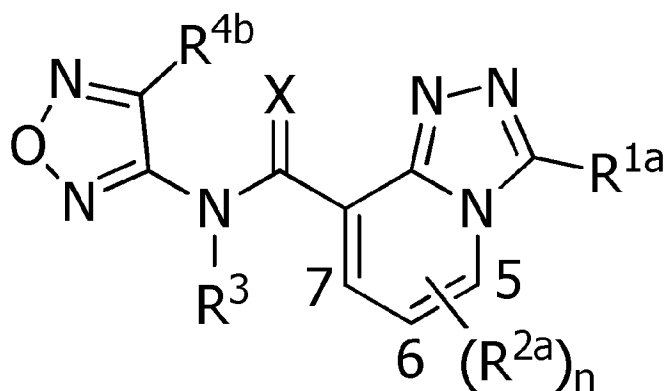
No.	R ^{1a}	(R ^{2a}) _n	X	R ³	R ^{5a}	融点 (°C)
2-049	i-Pr	5-CF ₂ CF ₃	0	H	Me	240-241
2-050	i-Pr	5-CF ₃ -6-Me	0	H	Me	208-209
2-051	NMe ₂	5-CF ₃	0	H	Me	222-225
2-052	CH(Me)SMe	5-CF ₃	0	H	Me	202-204
2-053	CH(Me)S(O)Me	5-CF ₃	0	H	Me	150-152
2-054	CH(Me)S(O) ₂ Me	5-CF ₃	0	H	Me	117-125
2-055	i-Pr	5-Ph	0	H	Me	193-198
2-056	NHPh	5-CF ₃	0	H	Me	255-260
2-057	(CH ₂) ₂ SMe	5-CF ₃	0	H	Me	144-146
2-058	(CH ₂) ₂ S(O)Me	5-CF ₃	0	H	Me	96-102
2-059	(CH ₂) ₂ S(O) ₂ Me	5-CF ₃	0	H	Me	173-175
2-060	D-8a	5-CF ₃	0	H	Me	217-220
2-061	D-11	5-CF ₃	0	H	Me	223-224
2-062	D-10a	5-CF ₃	0	H	Me	246-248
2-063	3, 5-(MeO) ₂ -Ph	5-CF ₃	0	H	Me	197-199
2-064	3, 5-(Cl) ₂ -Ph	5-CF ₃	0	H	Me	269-271
2-065	CH ₂ (4-MeO-Ph)	5-CF ₃	0	H	Me	167-168
2-066	NHCH(CH ₃) ₂	5-CF ₃	0	H	Me	104-107
2-067	S(O)Me	5-CF ₃	0	H	Me	228-229
2-068	S(CH ₂) ₂ CH ₃	5-CF ₃	0	H	Me	136-138
2-069	S(O)(CH ₂) ₂ CH ₃	5-CF ₃	0	H	Me	155-157
2-070	S(O) ₂ (CH ₂) ₂ CH ₃	5-CF ₃	0	H	Me	203-205
2-071	SCH ₂ CH(CH ₃) ₂	5-CF ₃	0	H	Me	159-160
2-072	SCH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	5-CF ₃	0	H	Me	170-173
2-073	i-Pr	5-CF ₃	0	H	Ph	133-136
2-074	NH(CH ₂) ₂ OMe	5-CF ₃	0	H	Me	111-115
2-075	D-14	5-CF ₃	0	H	Me	240-245
2-076	SCH ₂ Ph	5-CF ₃	0	H	Me	179-181
2-077	SCH ₂ (4-MeO-Ph)	5-CF ₃	0	H	Me	190-192
2-078	D-17	5-CF ₃	0	H	Me	285-290
2-079	N(Me)(CH ₂) ₂ OMe	5-CF ₃	0	H	Me	168-169
2-080	NH(CH ₂) ₂ SMe	5-CF ₃	0	H	Me	*1
2-081	NHCH ₂ CF ₃	5-CF ₃	0	H	Me	*1
2-082	N(Me)CH(CH ₃) ₂	5-CF ₃	0	H	Me	171-172
2-083	N(Me)(c-Hex)	5-CF ₃	0	H	Me	144-145
2-084	SCH ₂ (c-Pr)	5-CF ₃	0	H	Me	168-169
2-085	SCH ₂ (D-15)	5-CF ₃	0	H	Me	139-141
2-086	SCH ₂ CN	5-CF ₃	0	H	Me	144-145
2-087	SCH ₂ CF ₃	5-CF ₃	0	H	Me	160-161
2-088	N(Me)Et	5-CF ₃	0	H	Me	110-112
2-089	N(Et) ₂	5-CF ₃	0	H	Me	159-160
2-090	i-Pr	5-CF ₃	0	H	n-Pr	111-112
2-091	i-Pr	5-CF ₃	0	H	CH ₂ CH=CH ₂	118-119
2-092	i-Pr	5-CF ₃	0	H	CH ₂ C(O)OEt	104-105
2-093	i-Pr	5-CF ₃	0	H	CH ₂ (4-Cl-Ph)	147-148
2-094	N(Me)CH ₂ C≡CH	5-CF ₃	0	H	Me	176-178
2-095	N(Me)(CH ₂) ₂ CN	5-CF ₃	0	H	Me	125-128
2-096	S(c-Pen)	5-CF ₃	0	H	Me	192-194

[表33]

No.	R ^{1a}	(R ^{2a}) _n	X	R ³	R ^{6a}	融点 (°C)
2-097	SCH ₂ (D-8a)	5-CF ₃	0	H	Me	175-178
2-098	SEt	5-CF ₃	0	H	CH ₂ CH ₂ OMe	130-131
2-099	N (Me) (4-MeO-Ph)	5-CF ₃	0	H	Me	141-142
2-100	N (Me) CH ₂ CH=CH ₂	5-CF ₃	0	H	Me	183-184
2-101	S (CH ₂) ₂ OMe	5-CF ₃	0	H	Me	144-145
2-102	SCH ₂ CH=CH ₂	5-CF ₃	0	H	Me	172-174
2-103	SCH ₂ C≡CH	5-CF ₃	0	H	Me	190-191
2-104	i-Pr	5-CF ₃	0	H	H	276-280
2-105	CH ₂ CH=CH ₂	5-CF ₃	0	H	Me	164-167 (*5)
2-105*	CH=CHMe	5-CF ₃	0	H	Me	164-167 (*5)
2-106	C≡CMe	5-CF ₃	0	H	Me	244-246
2-107	CH ₂ OC (O) Me	5-CF ₃	0	H	Me	176-178
2-108	CH ₂ OH	5-CF ₃	0	H	Me	155-158
2-109	CHO	5-CF ₃	0	H	Me	250-252
2-110	D-16a	5-CF ₃	0	H	Me	194-201

[0251] [第6表]

[化46]

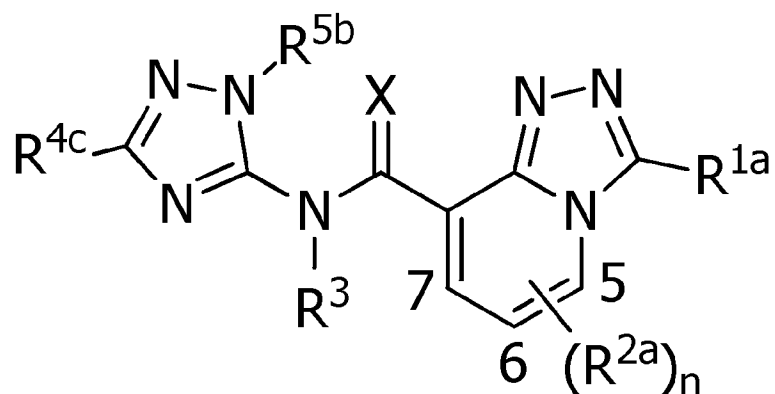


[表34]

No.	R ^{1a}	(R ^{2a}) _n	X	R ³	R ^{4b}	融点 (°C)
3-001	i-Pr	5-CF ₃	0	H	Me	185-186
3-002	SCH ₂ CH (CH ₃) ₂	5-CF ₃	0	H	Me	136-137

[0252] [第7表]

[化47]

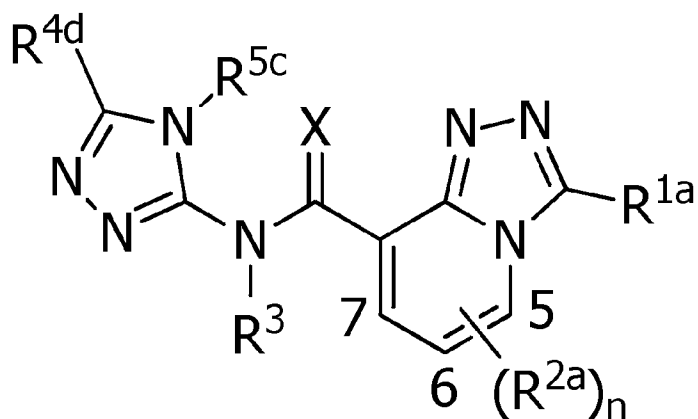


[表35]

No.	R ^{1a}	(R ^{2a}) _n	X	R ³	R ^{4c}	R ^{5b}	融点 (°C)
4-001	i-Pr	5-CF ₃	0	H	H	Me	182-185
4-002	i-Pr	5-CF ₃	0	H	H	Et	*1
4-003	SEt	5-CF ₃	0	H	H	Me	119-120
4-004	i-Pr	5-CF ₃	0	H	H	H	250-255

[0253] [第8表]

[化48]

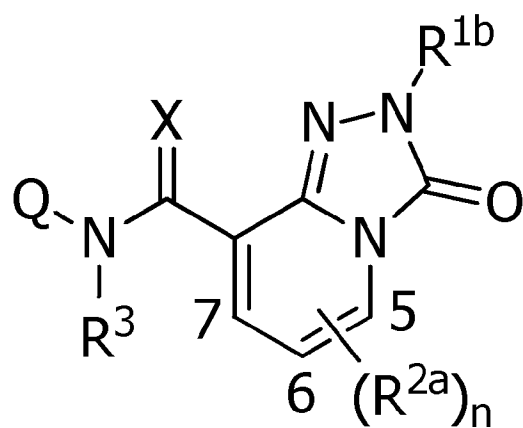


[表36]

No.	R ^{1a}	(R ^{2a}) _n	X	R ³	R ^{4d}	R ^{5c}	融点 (°C)
5-001	i-Pr	5-CF ₃	0	H	Me	Me	215-220
5-002	i-Pr	5-CF ₃	0	H	-CH=CH-CH=CH-		219-223
5-003	i-Pr	5-CF ₃	0	H		-(CH ₂) ₄ -	130-135

[0254] [第9表]

[化49]

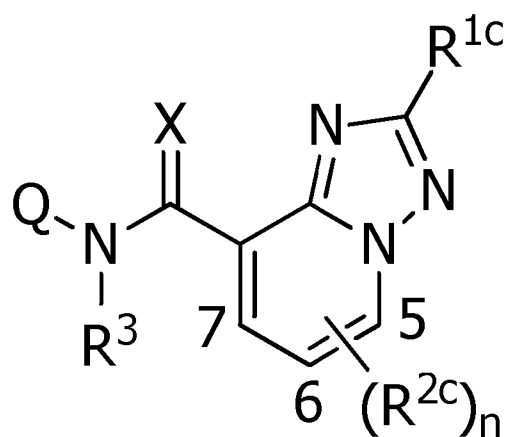


[表37]

No.	Q	R ^{1b}	(R ^{2a}) _n	X	R ³	融点 (°C)
6-001	D-6a	Me	5-CF ₃	0	H	250-260
6-002	D-7a	Me	5-CF ₃	0	H	245-246
6-003	D-6a	Et	5-CF ₃	0	H	234-236
6-004	D-7a	Et	5-CF ₃	0	H	176-178
6-005	D-6a	i-Pr	5-CF ₃	0	H	184-190
6-006	D-6a	CH ₂ Ph	5-CF ₃	0	H	155-162
6-007	D-20a	Et	5-CF ₃	0	H	182-185
6-008	D-23a	Et	5-CF ₃	0	H	162-164

[0255] [第10表]

[化50]



[表38]

No.	Q	R ^{1c}	(R ^{2c}) _n	X	R ³	融点 (°C)
7-001	D-6a	i-Pr	5-CF ₃	0	H	252-255
7-002	D-7a	i-Pr	5-CF ₃	0	H	168-170

[0256] 本発明化合物のうち、融点の記載のない化合物及び「* 3」、「* 4」及び「* 5」記載の異性体混合物の¹H-NMRデータを第11表に示す。

尚、プロトン核磁気共鳴ケミカルシフト値は、基準物質としてMe₄Si（テトラメチルシラン）を用い、重クロロホルム溶媒中で、300MHzにて測定した。また、第4表の記号は下記の意味を表す。s：シングレット、brs：ブロードシングレット、d：ダブレット、dd：ダブルダブレット、t：トリプレット、q：カルテット、m：マルチプレット。

[0257] [第11表]

[表39]

No.	¹ H-NMR (CDCl ₃ , Me ₄ Si, 300MHz)
1-003	δ 8.21 (d, 1H, J=7.2Hz), 6.77 (d, 1H, J=7.2Hz), 3.85-3.70 (m, 1H), 2.97 (s, 3H), 2.55 (s, 3H), 1.58 (d, 6H, J=7.2Hz)。
1-009	δ 8.24 (d, 1H, J=7.5Hz), 6.67 (d, 1H, J=7.5Hz), 4.92 (brs, 1H), 4.25-4.10 (m, 1H), 2.75 (s, 3H), 2.55 (s, 3H), 1.60 (d, 6H, J=6.9Hz)。
1-037	δ 8.51 (d, 1H, J=6.9Hz), 7.72 (d, 1H, J=6.9Hz), 5.05 (s, 2H), 3.26 (s, 3H), 2.60 (s, 3H)。(CONHのプロトンピークは観測されなかった。)
1-039	δ 8.54 (d, 1H, J=7.5Hz), 7.76 (d, 1H, J=7.5Hz), 5.17 (s, 2H), 4.36 (q, 2H, J=9.0Hz), 2.60 (s, 3H)。(CONHのプロトンピークは観測されなかった。)
1-040	δ 8.54 (d, 1H, J=7.2Hz), 7.79 (d, 1H, J=7.2Hz), 3.78 (s, 3H), 2.60 (s, 3H)。(CONHのプロトンピークは観測されなかった。)
1-041	δ 8.53 (d, 1H, J=7.5Hz), 7.78 (d, 1H, J=7.5Hz), 4.00 (q, 2H, J=7.5Hz), 2.60 (s, 3H), 1.59 (t, 3H, J=7.5Hz)。(CONHのプロトンピークは観測されなかった。)
1-098	δ 8.34 (d, 1H, J=7.5Hz), 7.59 (d, 1H, J=7.5Hz), 3.82 (t, 4H, J=4.9Hz), 3.79-3.68 (m, 1H), 3.54 (t, 4H, J=4.9Hz), 1.56 (d, 6H, J=6.5Hz)。(CONHのプロトンピークは観測されなかった。)
1-118	δ 12.68 (brs, 1H), 8.39 (d, 1H, J=7.4Hz), 7.59 (d, 1H, J=7.4Hz), 3.59-3.39 (m, 4H), 3.05-2.78 (m, 4H), 2.59 (s, 3H)。
1-158	δ 13.1 (brs, 1H), 8.44 (d, 1H, J=7.5Hz), 8.30 (s, 1H), 7.64 (d, 1H, J=7.5Hz), 6.38-6.25 (m, 1H), 5.38-5.24 (m, 2H), 4.04 (dd, 2H, J=3.9Hz, 1.2Hz)。
1-158*	δ 13.0 (brs, 1H), 8.43 (d, 1H, J=6.6Hz), 8.30 (s, 1H), 7.62 (d, 1H, J=6.6Hz), 7.11-7.01 (m, 1H), 6.71-6.61 (m, 1H), 2.10 (d, 3H, J=6.6Hz)。
1-159	δ 12.9 (brs, 1H), 8.42 (d, 1H, J=7.5Hz), 7.63 (d, 1H, J=7.5Hz), 6.38-6.24 (m, 1H), 5.36-5.23 (m, 2H), 4.03 (dd, 2H, J=6.9Hz, 1.2Hz), 2.59 (s, 3H)。
1-159*	δ 12.9 (brs, 1H), 8.38 (d, 1H, J=6.9Hz), 7.60 (d, 1H, J=6.9Hz), 7.12-7.00 (m, 1H), 6.69-6.62 (m, 1H), 2.60 (s, 3H), 2.09 (dd, 3H, J=6.6Hz, 1.8Hz)。
1-160	δ 12.8 (brs, 1H), 8.46 (d, 1H, J=7.2Hz), 8.31 (s, 1H), 7.65 (d, 1H, J=7.2Hz), 2.27 (s, 3H)。
1-161	δ 12.6 (brs, 1H), 8.44 (d, 1H, J=7.2Hz), 7.64 (d, 1H, J=7.2Hz), 2.59 (s, 3H), 2.27 (s, 3H)。
1-174	δ 7.72 (d, 1H, J=7.8Hz), 7.53 (d, 1H, J=7.8Hz), 4.15 (q, 2H, J=7.2Hz), 2.78 (d, 1H, J=7.8Hz), 2.38 (s, 3H), 1.83 (d, 1H, J=7.8Hz), 1.80 (s, 3H), 1.43 (t, 3H, J=7.2Hz)。
2-037	δ 12.08 (brs, 1H), 8.62 (d, 1H, J=7.5Hz), 7.86 (d, 1H, J=7.5Hz), 4.12 (s, 3H), 3.80 (s, 3H)。
2-038	δ 12.11 (brs, 1H), 8.62 (d, 1H, J=7.2Hz), 7.86 (d, 1H, J=7.2Hz), 4.12 (s, 3H), 4.01 (q, 2H, J=7.2Hz), 1.60 (t, 3H, J=7.2Hz)。
2-041	δ 12.49 (brs, 1H), 8.35 (d, 1H, J=7.5Hz), 7.62 (d, 1H, J=7.5Hz), 4.65-4.55 (m, 2H), 3.90-3.80 (m, 2H), 3.75-3.65 (m, 1H), 3.38 (s, 3H), 1.60-1.50 (m, 6H)。

[表40]

No.	¹ H-NMR (CDCl ₃ , Me ₄ Si, 300MHz)
2-048	δ 12.6 (brs, 1H), 8.35 (d, 1H, J=7.5Hz), 7.64 (d, 1H, J=7.5Hz), 4.60 (t, 2H, J=7.2Hz), 3.80-3.65 (m, 1H), 3.09 (t, 2H, J=7.2Hz), 2.11 (s, 3H), 1.56 (d, 6H, J=6.9Hz)。
2-080	δ 12.4 (brs, 1H), 8.14 (d, 1H, J=6.6Hz), 7.40 (d, 1H, J=6.6Hz), 5.24 (brs, 1H), 4.11 (s, 3H), 3.88-3.80 (m, 2H), 2.99-2.91 (m, 2H), 2.16 (s, 3H)。
2-081	δ 12.3 (brs, 1H), 8.23 (d, 1H, J=7.2Hz), 7.49 (d, 1H, J=7.2Hz), 4.78 (brs, 1H), 4.45-4.32 (m, 2H), 4.11 (s, 3H)。
2-105	δ 12.5 (brs, 1H), 8.40 (d, 1H, J=7.5Hz), 7.65 (d, 1H, J=7.5Hz), 6.37-6.24 (m, 1H), 5.37-5.24 (m, 2H), 4.13 (s, 3H), 4.06 (dd, 2H, J=6.6Hz, 1.2Hz)。
2-105*	δ 12.5 (brs, 1H), 8.36 (d, 1H, J=7.2Hz), 7.62 (d, 1H, J=7.2Hz), 7.13-7.01 (m, 1H), 6.70-6.62 (m, 1H), 4.13 (s, 3H), 2.10 (dd, 3H, J=6.6Hz, 1.5Hz)。
4-002	δ 12.3 (brs, 1H), 8.37 (d, 1H, J=7.5Hz), 7.88 (s, 1H), 7.61 (d, 1H, J=7.5Hz), 4.23 (q, 2H, J=7.5Hz), 3.80-3.60 (m, 1H), 1.60-1.50 (m, 9H)。

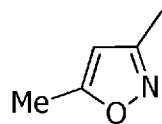
[0258] 参考例

[参考例 1]

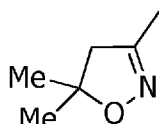
合成例 7 の工程 1 と同様の方法で、第 12 表に示す化合物を合成した。尚、表中 Me との記載はメチル基を表し、以下同様に Et はエチル基を、Pr はプロピル基を、Pen はペンチル基を、Ph はフェニル基を、Bn はベンジル基を、n- はノルマルを、i- はイソを、c- はシクロ及び t- はターシャリーを各々意味する。

また、表中 D-3a、D-4a、D-5、D-8a、D-9a、D-10a、D-11、D-12、D-13a、D-14、D-16a 及び D-16m で表される置換基は、以下の構造を表す。

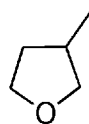
[化51]



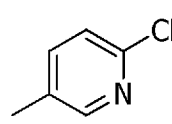
D-3a



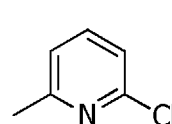
D-4a



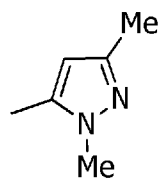
D-5



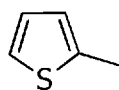
D-8a



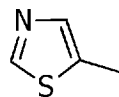
D-9a



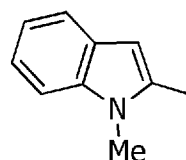
D-10a



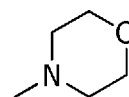
D-11



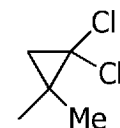
D-12



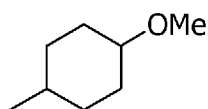
D-13a



D-14



D-16a

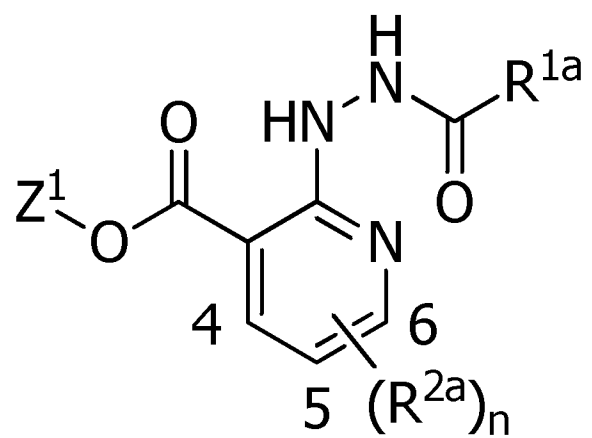


D-16m

[0259] 尚、表中、「*1」は「樹脂状」を表す。融点の記載のない化合物の¹H-NMRデータを第16表に示す。尚、第16表におけるプロトン核磁気共鳴ケミカルシフト値は、基準物質としてMe₄Si（テトラメチルシラン）を用い、重クロロホルム溶媒中で、300MHzにて測定した。また、第16表の記号は下記の意味を表す。s：シングレット、brs：ブロードシングレット、d：ダブレット、dd：ダブルダブレット、t：トリプレット、q：カルテット、m：マルチプレット。

[0260] [第12表]

[化52]



[表41]

No.	R ^{1a}	(R ^{2a}) _n	Z ¹	融点 (°C)
A1-01a	H	6-CF ₃	Me	*1
A1-02a	c-Pr	6-CF ₃	Me	143-144
A1-03a	3-Pen	6-CF ₃	Me	125-126
A1-04a	Ph	6-CF ₃	Me	*1
A1-05a	CH ₂ OMe	6-CF ₃	Me	76-77
A1-06a	4-MeO-Ph	6-CF ₃	Me	116-120
A1-07a	4-Cl-Ph	6-CF ₃	Me	163-165
A1-08a	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	6-CF ₃	Me	*1
A1-09a	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	6-CF ₃	Me	82-85
A1-10a	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	6-CF ₃	Me	148-149
A1-11a	D-3a	6-CF ₃	Me	121-122
A1-12a	i-Pr	5-CF ₃	Me	130-131
A1-13a	n-Pr	6-CF ₃	Me	119-120
A1-14a	CH ₂ OPh	6-CF ₃	Me	95-97
A1-15a	c-Pen	6-CF ₃	Me	158-159
A1-16a	D-5	6-CF ₃	Me	155-156
A1-17a	CH ₂ OEt	6-CF ₃	Me	55-57
A1-18a	t-Bu	6-CF ₃	Me	144-146
A1-19a	D-4a	6-CF ₃	Me	99-100
A1-20a	CH ₂ SMe	6-CF ₃	Me	127-129
A1-21a	CH ₂ SCH ₂ CF ₃	6-CF ₃	Me	114-116
A1-22b	CH ₂ C(O)OEt	6-CF ₃	Bn	110-112
A1-23a	4-Me-Ph	6-CF ₃	Me	183-185
A1-24a	4-F-Ph	6-CF ₃	Me	117-119
A1-25a	4-CF ₃ -Ph	6-CF ₃	Me	160-162
A1-26a	3-MeO-Ph	6-CF ₃	Me	103-106
A1-27a	2-MeO-Ph	6-CF ₃	Me	160-164
A1-28a	i-Pr	6-CF ₂ H	Me	140-141
A1-29a	D-8a	6-CF ₃	Me	172-175
A1-30a	D-9a	6-CF ₃	Me	160-170
A1-31a	D-10a	6-CF ₃	Me	161-163
A1-32a	D-11	6-CF ₃	Me	45-50
A1-33a	D-12	6-CF ₃	Me	40-45
A1-34a	D-13a	6-CF ₃	Me	183-184
A1-35b	CH ₂ OC(O)Me	6-CF ₃	Bn	89-91
A1-36a	CH ₂ (4-MeO-Ph)	6-CF ₃	Me	121-122
A1-37c	i-Pr	6-CF ₂ CF ₃	Et	120-121
A1-38a	3,5-(MeO) ₂ -Ph	6-CF ₃	Me	106-107
A1-39a	3,5-(Cl) ₂ -Ph	6-CF ₃	Me	178-179
A1-40a	i-Pr	5-Me-6-CF ₃	Me	169-174
A1-41c	i-Pr	4-Me-6-CF ₃	Et	140-141
A1-42a	(CH ₂) ₂ SMe	6-CF ₃	Me	90-91
A1-43a	CH(Me)SMe	6-CF ₃	Me	166-167
A1-44c	i-Pr	6-Ph	Et	144-146
A1-45c	i-Pr	6-{3,5-(F) ₂ -Ph}	Et	144-146
A1-46a	NMe ₂	6-CF ₃	Me	134-137
A1-47c	D-14	6-CF ₃	Et	101-105
A1-48a	CH ₂ (c-Pr)	6-CF ₃	Me	119-122

[表42]

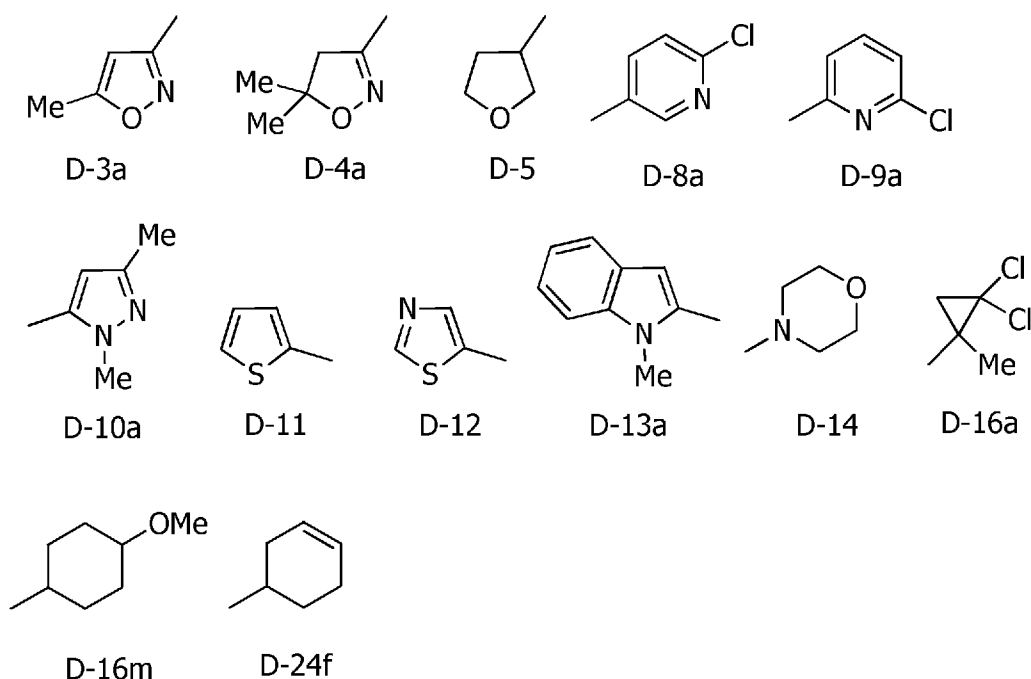
No.	R ^{1 a}	(R ^{2 a}) _n	Z ¹	融点 (°C)
A1-49a	D-16a	6-CF ₃	Me	70-75
A1-50a	C≡CMe	6-CF ₃	Me	151-153
A1-51a	CH ₂ CF ₃	6-CF ₃	Me	170-172
A1-52a	CH ₂ CN	6-CF ₃	Me	163-165
A1-53c	D-16m	6-CF ₃	Et	120-125
A1-55c	(CH ₂) ₂ OMe	6-CF ₃	Et	96-98

[0261] [参考例2]

合成例7の工程2と同様の方法で、第13表に示す化合物を合成した。尚、表中Meとの記載はメチル基を表し、以下同様にEtはエチル基を、Prはプロピル基を、Penはペンチル基を、Phはフェニル基を、Bnはベンジル基を、n-はノルマルを、i-はイソを、c-はシクロ及びt-はターシャリーを各々意味する。

また、表中D-3a、D-4a、D-5、D-8a、D-9a、D-10a、D-11、D-12、D-13a、D-14、D-16a、D-16m及びD-24fで表される置換基は、以下の構造を表す。

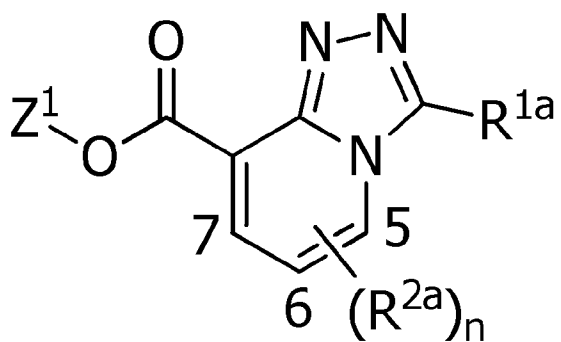
[化53]



[0262] 尚、表中、「* 1」は「樹脂状」を表す。融点の記載のない化合物の¹H-NMRデータを第16表に示す。

[0263] [第13表]

[化54]



[表43]

No.	R ^{1 a}	(R ^{2 a}) _n	Z ¹	融点 (°C)
B1-01a	H	5-CF ₃	Me	*1
B1-02a	c-Pr	5-CF ₃	Me	*1
B1-04a	Ph	5-CF ₃	Me	*1
B1-05a	CH ₂ OMe	5-CF ₃	Me	95-97
B1-06a	4-MeO-Ph	5-CF ₃	Me	160-162
B1-07a	4-Cl-Ph	5-CF ₃	Me	148-152
B1-08a	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	5-CF ₃	Me	*1
B1-09a	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	5-CF ₃	Me	87-89
B1-10a	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	5-CF ₃	Me	86-94
B1-11a	D-3a	5-CF ₃	Me	140-141
B1-12a	i-Pr	6-CF ₃	Me	105-107
B1-13a	n-Pr	5-CF ₃	Me	129-130
B1-14a	CH ₂ OPh	5-CF ₃	Me	102-103
B1-15a	c-Pen	5-CF ₃	Me	130-134
B1-17a	CH ₂ OEt	5-CF ₃	Me	87-89
B1-18a	t-Bu	5-CF ₃	Me	75-77
B1-19a	D-4a	5-CF ₃	Me	137-139
B1-20a	CH ₂ SMe	5-CF ₃	Me	97-99
B1-21a	CH ₂ SCH ₂ CF ₃	5-CF ₃	Me	125-126
B1-22b	CH ₂ C(O)OEt	5-CF ₃	Bn	72-73
B1-23a	4-Me-Ph	5-CF ₃	Me	142-145
B1-24a	4-F-Ph	5-CF ₃	Me	133-135
B1-25a	4-CF ₃ -Ph	5-CF ₃	Me	170-171
B1-26a	3-MeO-Ph	5-CF ₃	Me	135-142
B1-27a	2-MeO-Ph	5-CF ₃	Me	*1
B1-28a	i-Pr	5-CF ₂ H	Me	142-145
B1-29a	D-8a	5-CF ₃	Me	*1
B1-30a	D-9a	5-CF ₃	Me	140-145
B1-31a	D-10a	5-CF ₃	Me	126-129
B1-32a	D-11	5-CF ₃	Me	122-124
B1-33a	D-12	5-CF ₃	Me	171-172
B1-34a	D-13a	5-CF ₃	Me	*1
B1-35b	CH ₂ OC(O)Me	5-CF ₃	Bn	88-89
B1-36a	CH ₂ (4-MeO-Ph)	5-CF ₃	Me	92-110
B1-37c	i-Pr	5-CF ₂ CF ₃	Et	57-58
B1-38a	3, 5-(MeO) ₂ -Ph	5-CF ₃	Me	150-161
B1-39a	3, 5-(Cl) ₂ -Ph	5-CF ₃	Me	157-164
B1-40a	i-Pr	5-CF ₃ -6-Me	Me	58-59
B1-41c	i-Pr	5-CF ₃ -7-Me	Et	76-77
B1-42a	(CH ₂) ₂ SMe	5-CF ₃	Me	126-127
B1-43a	CH(Me)SMe	5-CF ₃	Me	103-104
B1-44c	i-Pr	5-Ph	Et	133-134
B1-45c	i-Pr	5-{3, 5-(F) ₂ -Ph}	Et	125-127
B1-46a	NMe ₂	5-CF ₃	Me	135-137
B1-47c	D-14	5-CF ₃	Et	138-139
B1-48a	CH ₂ (c-Pr)	5-CF ₃	Me	130-135
B1-49a	D-16a	5-CF ₃	Me	*1
B1-50a	C≡CMe	5-CF ₃	Me	163-168

[表44]

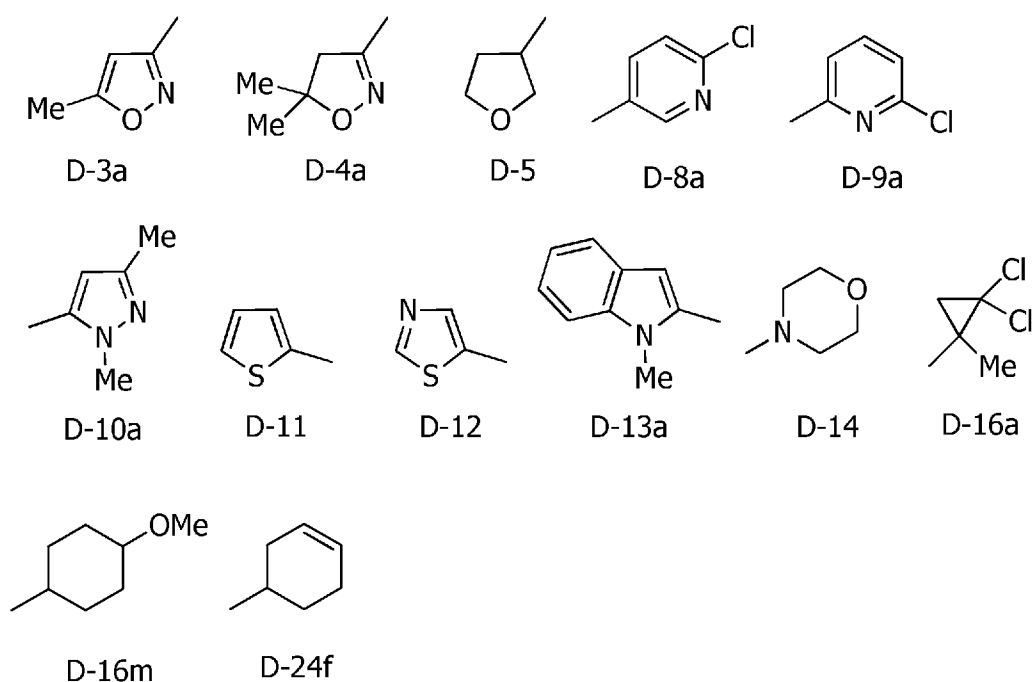
No.	R ^{1a}	(R ^{2a}) _n	Z ¹	融点 (°C)
B1-51a	CH ₂ CF ₃	5-CF ₃	Me	150-154
B1-52a	CH ₂ CN	5-CF ₃	Me	165-170
B1-53c	D-16m	5-CF ₃	Et	95-102
B1-54c	D-24f	5-CF ₃	Et	101-110
B1-55c	(CH ₂) ₂ OMe	5-CF ₃	Et	82-83

[0264] [参考例3]

合成例7の工程3と同様の方法で、第14表に示す化合物を合成した。尚、表中Meとの記載はメチル基を表し、以下同様にEtはエチル基を、Prはプロピル基を、Penはペンチル基を、Phはフェニル基を、Bnはベンジル基を、n-はノルマルを、i-はイソを、c-はシクロ及びt-はターシャリーを各々意味する。

また、表中D-3a、D-4a、D-5、D-8a、D-9a、D-10a、D-11、D-12、D-13a、D-14、D-16a、D-16m及びD-24fで表される置換基は、以下の構造を表す。

[化55]

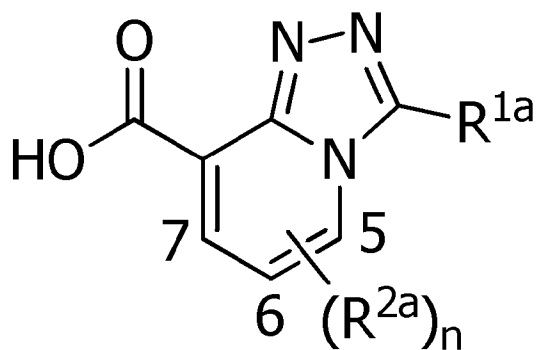


[0265] 尚、表中、「*1」は「樹脂状」を表す。融点の記載のない化合物の¹H-

NMRデータを第16表に示す。

[0266] [第14表]

[化56]



[表45]

No.	R ^{1a}	(R ^{2a}) _n	融点 (°C)
C1-01	H	5-CF ₃	*1
C1-02	c-Pr	5-CF ₃	*1
C1-03	3-Pen	5-CF ₃	137-139
C1-04	Ph	5-CF ₃	*1
C1-05	CH ₂ OMe	5-CF ₃	111-112
C1-06	4-MeO-Ph	5-CF ₃	215-218
C1-07	4-Cl-Ph	5-CF ₃	241-247
C1-08	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	5-CF ₃	47-49
C1-09	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	5-CF ₃	67-70
C1-10	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	5-CF ₃	137-140
C1-11	D-3a	5-CF ₃	197-201
C1-12	i-Pr	6-CF ₃	224-226
C1-13	n-Pr	5-CF ₃	134-135
C1-14	CH ₂ OPh	5-CF ₃	136-140
C1-15	c-Pen	5-CF ₃	156-158
C1-16	D-5	5-CF ₃	195-200
C1-17	CH ₂ OEt	5-CF ₃	96-97
C1-18	t-Bu	5-CF ₃	125-131
C1-19	D-4a	5-CF ₃	184-186
C1-20	CH ₂ SMe	5-CF ₃	110-111
C1-21	CH ₂ SCH ₂ CF ₃	5-CF ₃	56-59
C1-22	CH ₂ C(O)OEt	5-CF ₃	124-126
C1-23	4-Me-Ph	5-CF ₃	250-253
C1-24	4-F-Ph	5-CF ₃	249-251
C1-25	4-CF ₃ -Ph	5-CF ₃	199-201
C1-26	3-MeO-Ph	5-CF ₃	179-181
C1-27	2-MeO-Ph	5-CF ₃	85-90
C1-28	i-Pr	5-CF ₂ H	193-195
C1-29	D-8a	5-CF ₃	237-240
C1-30	D-9a	5-CF ₃	231-234
C1-31	D-10a	5-CF ₃	215-220
C1-32	D-11	5-CF ₃	190-195
C1-33	D-12	5-CF ₃	218-223
C1-34	D-13a	5-CF ₃	185-188
C1-35	CH ₂ OC(O)Me	5-CF ₃	126-128
C1-36	CH ₂ (4-MeO-Ph)	5-CF ₃	73-75
C1-37	i-Pr	5-CF ₂ CF ₃	170-175
C1-38	3, 5-(MeO) ₂ -Ph	5-CF ₃	158-160
C1-39	3, 5-(Cl) ₂ -Ph	5-CF ₃	250-252
C1-40	i-Pr	5-CF ₃ -6-Me	153-154
C1-41	i-Pr	5-CF ₃ -7-Me	190-192
C1-42	(CH ₂) ₂ SMe	5-CF ₃	149-151
C1-43	CH(Me)SMe	5-CF ₃	145-146
C1-44	i-Pr	5-Ph	218-219
C1-45	i-Pr	5-{3, 5-(F) ₂ -Ph}	210-220
C1-46	NMe ₂	5-CF ₃	181-183
C1-47	D-14	5-CF ₃	210-213
C1-48	CH ₂ (c-Pr)	5-CF ₃	109-114

[表46]

No.	R ^{1a}	(R ^{2a}) _n	融点 (°C)
C1-49	D-16a	5-CF ₃	159-164
C1-50	C≡CMe	5-CF ₃	234-238
C1-51	CH ₂ CF ₃	5-CF ₃	168-171
C1-52	CH ₂ CN	5-CF ₃	227-231
C1-53	D-16m	5-CF ₃	118-120
C1-54	D-24f	5-CF ₃	169-170
C1-55	(CH ₂) ₂ OMe	5-CF ₃	104-105

[0267] [参考例4]

3-(エチルチオ)-5-(トリフルオロメチル)-[1, 2, 4]トリアゾロ[4, 3-a]ピリジン-8-カルボン酸

工程1; 3-(チオキソ)-5-(トリフルオロメチル)-2, 3-ジヒドロ-[1, 2, 4]トリアゾロ[4, 3-a]ピリジン-8-カルボン酸の合成

合成例8の工程1と同様にして合成したイミダゾールを含む3-チオキソ-5-(トリフルオロメチル)-2, 3-ジヒドロ-[1, 2, 4]トリアゾロ[4, 3-a]ピリジン-8-カルボン酸メチル2.0gのメタノール20ml溶液に、0.5mol/Lの水酸化ナトリウム水溶液を氷冷下にて17ml添加した。添加終了後、該反応溶液を室温にて3.5時間攪拌した。反応終了後、該反応溶液に1mol/L塩酸20mlを添加し、該反応溶液中に析出した固体をろ別した。得られた個体を1mol/L塩酸、水、ジイソプロピルエーテルの順で洗浄し、濾取することにより目的物1.1gを黄色固体として得た。

融点: 235~240°C

[0268] 工程2; 3-(エチルチオ)-5-(トリフルオロメチル)-[1, 2, 4]トリアゾロ[4, 3-a]ピリジン-8-カルボン酸の合成

3-(チオキソ)-5-(トリフルオロメチル)-2, 3-ジヒドロ-[1, 2, 4]トリアゾロ[4, 3-a]ピリジン-8-カルボン酸700mg (2.66mmol)のN, N-ジメチルホルムアミド10ml溶液に、

室温にてヨウ化エチル 898 mg (5.76 mmol) を添加した。添加終了後、該反応溶液を室温にて4日間攪拌した。反応終了後、該反応溶液中の溶媒を減圧下にて留去した。得られた残渣に、水 5 ml、1 mol/l 塩酸 5 ml を添加し、析出した固体をろ別した。得られた固体を水、ジイソプロピルエーテルの順で洗浄することにより、目的物 486 mg を黄色固体として得た。

融点：113～114℃

[0269] [参考例5]

合成例8の工程2及び工程3、または参考例4と同様の方法で以下の化合物を合成した。

3-(イソプロピルチオ)-5-(トリフルオロメチル)-[1, 2, 4] トリアゾロ[4, 3-a] ピリジン-8-カルボン酸メチル

融点：120～122℃

3-(イソプロピルチオ)-5-(トリフルオロメチル)-[1, 2, 4] トリアゾロ[4, 3-a] ピリジン-8-カルボン酸

融点：135～136℃

3-((2-メトキシエチル)チオ)-5-(トリフルオロメチル)-[1, 2, 4] トリアゾロ[4, 3-a] ピリジン-8-カルボン酸

融点：106～111℃

3-(アリルチオ)-5-(トリフルオロメチル)-[1, 2, 4] トリアゾロ[4, 3-a] ピリジン-8-カルボン酸

融点：96～99℃

3-(プロペ-2-イン-1-イルチオ)-5-(トリフルオロメチル)-[1, 2, 4] トリアゾロ[4, 3-a] ピリジン-8-カルボン酸

融点：179～181℃

3-(n-プロピルチオ)-5-(トリフルオロメチル)-[1, 2, 4] トリアゾロ[4, 3-a] ピリジン-8-カルボン酸メチル

融点：87～88℃

3-(n-プロピルチオ)-5-(トリフルオロメチル)-[1, 2, 4]
] トリアゾロ[4, 3-a] ピリジン-8-カルボン酸

融点: 106~108℃

3-(イソブチルチオ)-5-(トリフルオロメチル)-[1, 2, 4]
トリアゾロ[4, 3-a] ピリジン-8-カルボン酸メチル

融点: 105~106℃

3-(イソブチルチオ)-5-(トリフルオロメチル)-[1, 2, 4]
トリアゾロ[4, 3-a] ピリジン-8-カルボン酸

融点: 110~112℃

3-(s-ブチルチオ)-5-(トリフルオロメチル)-[1, 2, 4]
トリアゾロ[4, 3-a] ピリジン-8-カルボン酸メチル

融点: 88~90℃

3-(s-ブチルチオ)-5-(トリフルオロメチル)-[1, 2, 4]
トリアゾロ[4, 3-a] ピリジン-8-カルボン酸

融点: 107~109℃

3-(ベンジルチオ)-5-(トリフルオロメチル)-[1, 2, 4] ト
リアゾロ[4, 3-a] ピリジン-8-カルボン酸メチル

融点: 130~135℃

3-(ベンジルチオ)-5-(トリフルオロメチル)-[1, 2, 4] ト
リアゾロ[4, 3-a] ピリジン-8-カルボン酸

融点: 153~156℃

3-((4-メトキシベンジル)チオ)-5-(トリフルオロメチル)-
[1, 2, 4] トリアゾロ[4, 3-a] ピリジン-8-カルボン酸メチル

融点: 119~121℃

3-((4-メトキシベンジル)チオ)-5-(トリフルオロメチル)-
[1, 2, 4] トリアゾロ[4, 3-a] ピリジン-8-カルボン酸

融点: 180~182℃

3-((シクロプロピルメチル)チオ)-5-(トリフルオロメチル)-

[1, 2, 4] トリアゾロ [4, 3-a] ピリジン-8-カルボン酸メチル

融点: 122~123℃

3-((シクロプロピルメチル)チオ)-5-(トリフルオロメチル)-
[1, 2, 4] トリアゾロ [4, 3-a] ピリジン-8-カルボン酸

融点: 127~129℃

3-(((テトラヒドロフラン-2-イル)メチル)チオ)-5-(トリ
フルオロメチル)-[1, 2, 4] トリアゾロ [4, 3-a] ピリジン-8
-カルボン酸メチル

¹H NMR (CDCl₃, Me₄Si, 300MHz) δ 7.95 (d, 1H, J=7.2Hz), 7.42 (d, 1H, J
=7.2Hz), 4.34-4.25 (m, 1H), 4.09 (s, 3H), 3.92-3.84 (m, 1H), 3.79-3.6
8 (m, 2H), 3.56-3.49 (m, 1H), 2.17-2.06 (m, 1H), 1.99-1.87 (m, 2H), 1
.76-1.68 (m, 1H)。

3-(((テトラヒドロフラン-2-イル)メチル)チオ)-5-(トリ
フルオロメチル)-[1, 2, 4] トリアゾロ [4, 3-a] ピリジン-8
-カルボン酸

融点: 108~112℃

3-((シアノメチル)チオ)-5-(トリフルオロメチル)-[1, 2
, 4] トリアゾロ [4, 3-a] ピリジン-8-カルボン酸メチル

融点: 146~148℃

3-((シアノメチル)チオ)-5-(トリフルオロメチル)-[1, 2
, 4] トリアゾロ [4, 3-a] ピリジン-8-カルボン酸

融点: 138~140℃

3-((2-オキソプロピル)チオ)-5-(トリフルオロメチル)-[
1, 2, 4] トリアゾロ [4, 3-a] ピリジン-8-カルボン酸メチル

融点: 84~87℃

3-((2-オキソプロピル)チオ)-5-(トリフルオロメチル)-[
1, 2, 4] トリアゾロ [4, 3-a] ピリジン-8-カルボン酸

融点: 121~124℃

3-((1,3-ジオキサラン-2-イル)メチル)チオ)-5-(トリフルオロメチル)-[1,2,4]トリアゾロ[4,3-a]ピリジン-8-カルボン酸メチル

融点：99～102℃

3-((1,3-ジオキサラン-2-イル)メチル)チオ)-5-(トリフルオロメチル)-[1,2,4]トリアゾロ[4,3-a]ピリジン-8-カルボン酸

融点：110～112℃

3-((2,2,2-トリフルオロエチル)チオ)-5-(トリフルオロメチル)-[1,2,4]トリアゾロ[4,3-a]ピリジン-8-カルボン酸

融点：150～151℃

3-((2-メトキシ-2-オキソエチル)チオ)-5-(トリフルオロメチル)-[1,2,4]トリアゾロ[4,3-a]ピリジン-8-カルボン酸

融点：143～144℃

3-(シクロペンチルチオ)-5-(トリフルオロメチル)-[1,2,4]トリアゾロ[4,3-a]ピリジン-8-カルボン酸メチル

融点：92～94℃

3-(シクロペンチルチオ)-5-(トリフルオロメチル)-[1,2,4]トリアゾロ[4,3-a]ピリジン-8-カルボン酸

融点：143～146℃

3-((6-クロロピリジン-3-イル)メチル)チオ)-5-(トリフルオロメチル)-[1,2,4]トリアゾロ[4,3-a]ピリジン-8-カルボン酸メチル

融点：99～100℃

3-((6-クロロピリジン-3-イル)メチル)チオ)-5-(トリフルオロメチル)-[1,2,4]トリアゾロ[4,3-a]ピリジン-8

ーカルボン酸

融点：159～160℃

[0270] [参考例6]

2-メチル-3-オキソ-5-(トリフルオロメチル)-2,3-ジヒドロ-[1,2,4]トリアゾロ[4,3-a]ピリジン-8-カルボン酸メチルの合成

3-オキソ-5-(トリフルオロメチル)-2,3-ジヒドロ-[1,2,4]トリアゾロ[4,3-a]ピリジン-8-カルボン酸メチル500mg (1.91mmol)、炭酸カリウム525mg (3.82mmol)及びアセトニトリル10mlの混合物に、室温にてヨウ化メチル298mg (2.10mmol)を添加した。添加終了後、該反応溶液を室温にて5時間攪拌した。反応終了後、該反応溶液にクロロホルム20mlを添加した後、析出した固体をろ別した。ろ別により得られた溶液を減圧下にて溶媒を留去した。溶媒を留去した後に得られた残渣をn-ヘキサン-酢酸エチル(17:3~2:3のグラジエント)にて溶出する中圧分取液体クロマトグラフィーにて精製し、目的物312mgを黄色固体として得た。

融点：189～190℃

[0271] 同様の方法で以下の化合物を合成した。

2-エチル-3-オキソ-5-(トリフルオロメチル)-2,3-ジヒドロ-[1,2,4]トリアゾロ[4,3-a]ピリジン-8-カルボン酸メチル

融点：135～137℃

2-イソプロピル-3-オキソ-5-(トリフルオロメチル)-2,3-ジヒドロ-[1,2,4]トリアゾロ[4,3-a]ピリジン-8-カルボン酸メチル

融点：124～125℃

2-ベンジル-3-オキソ-5-(トリフルオロメチル)-2,3-ジヒドロ-[1,2,4]トリアゾロ[4,3-a]ピリジン-8-カルボン酸

メチル

融点：99～100℃

[0272] [参考例7]

2-メチル-3-オキソ-5-(トリフルオロメチル)-2,3-ジヒドロ-[1,2,4]トリアゾロ[4,3-a]ピリジン-8-カルボン酸の合成

2-メチル-3-オキソ-5-(トリフルオロメチル)-2,3-ジヒドロ-[1,2,4]トリアゾロ[4,3-a]ピリジン-8-カルボン酸メチル312mg (1.13mmol)のエタノール3ml溶液に、水酸化ナトリウム50mg (1.25mmol)の3ml水溶液を氷冷下にて添加した。添加終了後、該反応溶液を同温度にて1時間攪拌した。反応終了後、1mol/L塩酸3mlを加え、ジクロロメタンにて抽出(10ml×3回)した。得られた有機層を飽和食塩水、無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥し、減圧下にて溶媒を留去した。析出した固体をジイソプロピルエーテルで洗浄することにより、目的物250mgを黄色固体として得た。

融点：155～160℃

[0273] 同様の方法で以下の化合物を合成した。

2-エチル-3-オキソ-5-(トリフルオロメチル)-2,3-ジヒドロ-[1,2,4]トリアゾロ[4,3-a]ピリジン-8-カルボン酸

融点：160～163℃

2-イソプロピル-3-オキソ-5-(トリフルオロメチル)-2,3-ジヒドロ-[1,2,4]トリアゾロ[4,3-a]ピリジン-8-カルボン酸

融点：160～162℃

2-ベンジル-3-オキソ-5-(トリフルオロメチル)-2,3-ジヒドロ-[1,2,4]トリアゾロ[4,3-a]ピリジン-8-カルボン酸

融点：84～86℃

[0274] [参考例8]

3-チオキソ-5-(トリフルオロメチル)-2,3-ジヒドロ-[1,2,4]トリアゾロ[4,3-a]ピリジン-8-カルボン酸メチルの合成
合成例8の工程1記載の方法で合成した3-チオキソ-5-(トリフルオロメチル)-2,3-ジヒドロ-[1,2,4]トリアゾロ[4,3-a]ピリジン-8-カルボン酸メチルとイミダゾールの混合物100mgを酢酸エチル50mlに溶かし、1mol/L塩酸20mlで洗浄した。得られた有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下にて溶媒を留去することで、目的物63mgを橙黄色固体として得た。

融点：218～220℃

[0275] [参考例9]

3-(フェニルアミノ)-5-(トリフルオロメチル)-[1,2,4]トリアゾロ[4,3-a]ピリジン-8-カルボン酸

工程1；2-(2-(フェニルカルバモイル)ヒドラジニル)-6-(トリフルオロメチル)ニコチン酸メチルの合成

2-ヒドラジニル-6-(トリフルオロメチル)ニコチン酸メチル500mg(2.13mmol)のテトラヒドロフラン13ml溶液に、イソシアン酸フェニル255mg(2.14mmol)を氷冷下にて添加した。添加終了後、該反応溶液を同温度にて14時間攪拌した。反応終了後、該反応溶液中の溶媒を減圧下にて留去した。得られた固体をジイソプロピルエーテルで洗浄することにより、目的物740mgを白色固体として得た。

融点：190～195℃

[0276] 工程2；3-(フェニルアミノ)-5-(トリフルオロメチル)-[1,2,4]トリアゾロ[4,3-a]ピリジン-8-カルボン酸メチルの合成

2-(2-(フェニルカルバモイル)ヒドラジニル)-6-(トリフルオロメチル)ニコチン酸メチル730mg(2.06mmol)及びトルエン15mlの混合溶液に、室温にて塩化ホスホリル940mg(6.11mmol)を添加した。添加終了後、該反応混合物を加熱還流下にて3時間攪拌した。攪拌終了後、該反応混合物を室温まで冷却した後、氷水に添加し反応

を停止させ、該反応液を酢酸エチルにて抽出（30 ml × 2回）した。得られた有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下にて溶媒を留去した。得られた残渣をn-ヘキサン-酢酸エチル-メタノール（90：10：0～0：100：0～0：90：10のグラジエント）にて溶出する中圧分取液体クロマトグラフィーにて精製し、目的物480 mgを黄色固体として得た。

融点：225～230℃

[0277] 工程3；3-（フェニルアミノ）-5-（トリフルオロメチル）-[1, 2, 4] トリアゾロ[4, 3-a] ピリジン-8-カルボン酸の合成

3-（フェニルアミノ）-5-（トリフルオロメチル）-[1, 2, 4] トリアゾロ[4, 3-a] ピリジン-8-カルボン酸メチル470 mg（1.40 mmol）及びメタノール10 mlの混合溶液に、氷冷下にて1 mol/Lの水酸化ナトリウム水溶液8.0 ml（8.0 mmol）を添加した。添加終了後、該反応溶液を氷冷下にて3時間攪拌した。反応終了後、該反応溶液中の溶媒を減圧下にて留去した後、1 N塩酸を添加し、pHを5～6とした。該反応混合液を酢酸エチルにて抽出（30 ml × 2回）し、得られた有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下にて溶媒を留去した。析出した固体をジイソプロピルエーテルで洗浄することにより、目的物250 mgを橙色固体として得た。

融点：125～130℃

[0278] [参考例10]

3-（（2-メトキシエチル）（メチル）アミノ）-5-（トリフルオロメチル）-[1, 2, 4] トリアゾロ[4, 3-a] ピリジン-8-カルボン酸

工程1；2-（2-（（2-メトキシエチル）（メチル）カルバモイル）ヒドラジニル）-6-（トリフルオロメチル）ニコチン酸エチルの合成

3-オキソ-5-（トリフルオロメチル）-2, 3-ジヒドロ-[1, 2, 4] トリアゾロ[4, 3-a] ピリジン-8-カルボン酸エチル500 mg（1.82 mmol）、N-（2-メトキシエチル）メチルアミン320

mg (3.59 mmol) 及びテトラヒドロフラン 10 ml の混合物を加熱還流下にて 3 時間攪拌した。反応終了後、該反応溶液中の溶媒を減圧下にて留去した。得られた残渣を n-ヘキサン-酢酸エチル (90:10~0:100 のグラジエント) にて溶出する中圧分取液体クロマトグラフィーにて精製し、目的物 610 mg を淡黄色固体として得た。

融点: 65~66 °C

[0279] 工程 2 ; 3-((2-メトキシエチル)(メチル)アミノ)-5-(トリフルオロメチル)-[1,2,4]トリアゾロ[4,3-a]ピリジン-8-カルボン酸エチルの合成

2-((2-((2-メトキシエチル)(メチル)カルバモイル)ヒドラジニル)-6-(トリフルオロメチル)ニコチン酸エチル 595 mg (1.63 mmol) 及びトルエン 10 ml の混合溶液に、室温にて塩化ホスホリル 750 mg (4.94 mmol) を添加した。添加終了後、該反応混合物を加熱還流下にて 1.5 時間攪拌した。攪拌終了後、該反応混合物を室温まで冷却した後、氷水に添加し反応を停止させ、炭酸水素ナトリウム水溶液を加えて pH を 8~9 とした後、酢酸エチルにて抽出 (30 ml × 2 回) した。得られた有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下にて溶媒を留去した。得られた残渣を n-ヘキサン-酢酸エチル (90:10~0:100 のグラジエント) にて溶出する中圧分取液体クロマトグラフィーにて精製し、目的物 520 mg を橙色液体として得た。

^1H NMR (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 7.91 (d, 1H, $J=7.2\text{Hz}$), 7.80 (d, 1H, $J=7.2\text{Hz}$), 4.55 (q, 2H, $J=6.9\text{Hz}$), 3.75-3.41 (m, 4H), 3.27 (s, 3H), 2.87 (s, 3H), 1.48 (t, 3H, $J=6.9\text{Hz}$)。

[0280] 工程 3 ; 3-((2-メトキシエチル)(メチル)アミノ)-5-(トリフルオロメチル)-[1,2,4]トリアゾロ[4,3-a]ピリジン-8-カルボン酸の合成

3-((2-メトキシエチル)(メチル)アミノ)-5-(トリフルオロメチル)-[1,2,4]トリアゾロ[4,3-a]ピリジン-8-カルボ

ン酸エチル 500 mg (1.44 mmol) 及びエタノール 10 ml の混合溶液に、氷冷下にて 1 mol/L の水酸化ナトリウム水溶液 4.5 ml (4.5 mmol) を添加した。添加終了後、該反応溶液を氷冷下にて 1 時間攪拌した。反応終了後、該反応溶液中の溶媒を減圧下にて留去した後、1 mol/L 塩酸を添加し、pH を 4 とした。該反応混合液を酢酸エチルにて抽出 (30 ml × 2 回) し、得られた有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下にて溶媒を留去することにより、目的物 470 mg を淡黄色固体として得た。

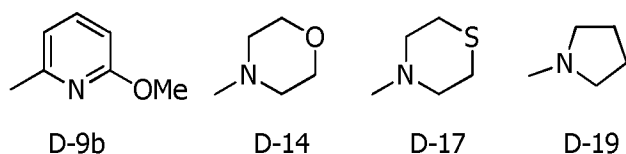
融点：115～120℃

[0281] [参考例 11]

参考例 9 又は参考例 10 と同様の方法で、第 15 表に示す化合物を合成した。尚、表中 Me との記載はメチル基を表し、以下同様に Et はエチル基を、Ph はフェニル基及び *c* はシクロを各々意味する。

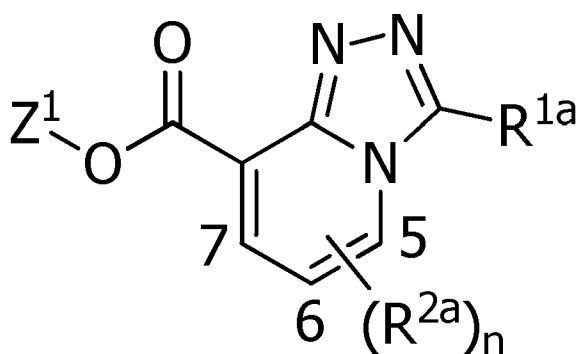
また、表中 D-9b、D-14、D-17 及び D-19 で表される置換基は、以下の構造を表す。

[化57]



[0282] [第 15 表]

[化58]



[表47]

No.	R ^{1a}	(R ^{2a}) _n	Z ¹	融点 (°C)
C2-01	N(Me)Ph	5-CF ₃	H	160-170
C2-02	NHCH(CH ₃) ₂	5-CF ₃	H	145-146
C2-03	D-14	5-CF ₃	H	210-213
C2-04	NH(D-9b)	5-CF ₃	H	170-174
C2-05	NH(CH ₂) ₂ OMe	5-CF ₃	H	150-155
C2-06	NHSO ₂ Ph	5-CF ₃	H	>290
C2-07	D-17	5-CF ₃	H	160-165
C2-08	NH(CH ₂) ₂ SMe	5-CF ₃	H	173-176
C2-09	NHCH ₂ CF ₃	5-CF ₃	H	180-183
C2-10	N(Me)CH(CH ₃) ₂	5-CF ₃	H	135-137
C2-11	N(Me)Hex-c	5-CF ₃	H	184-186
C2-12	N(Me)Et	5-CF ₃	H	140-141
C2-13	N(Et) ₂	5-CF ₃	H	126-127
C2-14	D-19	5-CF ₃	H	150-151
C2-15	N(Me)CH ₂ C≡CH	5-CF ₃	H	133-134
C2-16	N(Me)(CH ₂) ₂ CN	5-CF ₃	H	136-137
C2-17	N(Me)(4-MeO-Ph)	5-CF ₃	H	168-171
C2-18	N(Me)CH ₂ CH=CH ₂	5-CF ₃	H	117-118
C2-19	N(Me)CH ₂ (4-MeO-Ph)	5-CF ₃	H	105-110

[0283] [第16表]

[表48]

No.	¹ H-NMR (CDCl ₃ , Me ₄ Si, 300MHz)
A1-01a	δ 10.02 (brs, 1H), 8.34 (d, 1H, J=7.8Hz), 8.26 (s, 1H), 8.23 (brs, 1H), 7.11 (d, 1H, J=7.8Hz), 3.96 (s, 3H)。
A1-04a	δ 10.21 (d, 1H, J=6.0Hz), 8.84 (d, 1H, J=5.7Hz), 8.35 (dd, 1H, J=7.2Hz, 0.9Hz), 7.88-7.85 (m, 2H), 7.56-7.46 (m, 3H), 7.08 (d, 1H, J=7.8Hz), 3.98 (s, 3H)。
A1-08a	δ 9.70 (brs, 1H), 9.26 (brs, 1H), 8.32 (d, 1H, J=7.8Hz), 7.07 (d, 1H, J=7.8Hz), 4.21 (s, 2H), 3.95 (s, 3H), 3.89-3.86 (m, 2H), 3.65-3.62 (m, 2H), 3.40 (s, 3H)。
B1-01a	δ 9.04 (d, 1H, J=1.8Hz), 8.14 (d, 1H, J=6.6Hz), 7.41 (d, 1H, J=6.6Hz), 4.13 (s, 3H)。
B1-02a	δ 7.95 (d, 1H, J=7.5Hz), 7.44 (d, 1H, J=7.5Hz), 4.09 (s, 3H), 2.32-2.25 (m, 1H), 1.38-1.33 (m, 2H), 1.22-1.16 (m, 2H)。
B1-04a	δ 8.04 (dd, 1H, J=7.2Hz, 0.6Hz), 7.60-7.42 (m, 6H), 4.14 (s, 3H)。
B1-08a	δ 8.04 (d, 1H, J=7.2Hz), 7.49 (d, 1H, J=7.2Hz), 5.21 (d, 2H, J=0.9Hz), 4.11 (s, 3H), 3.75-3.72 (m, 2H), 3.54-3.51 (m, 2H), 3.33 (s, 3H)。
B1-27a	δ 8.04 (d, 1H, J=7.5Hz), 7.45-7.60 (m, 1H), 7.35-7.45 (m, 2H), 7.00-7.15 (m, 1H), 6.90-7.00 (m, 1H), 4.13 (s, 3H), 3.65 (s, 3H)。
B1-29a	δ 8.49 (s, 1H), 8.00-8.15 (m, 1H), 7.75-7.85 (m, 1H), 7.40-7.60 (m, 2H), 4.13 (s, 3H)。
B1-34a	δ 8.17 (d, 1H, J=7.2Hz), 7.70 (d, 1H, J=8.1Hz), 7.54 (d, 1H, J=7.2Hz), 7.35-7.45 (m, 2H), 7.20-7.30 (m, 2H), 4.17 (s, 3H), 3.54 (s, 3H)。
B1-49a	δ 8.00 (d, 1H, J=7.5Hz), 7.54 (d, 1H, J=7.5Hz), 4.10 (s, 3H), 2.91 (d, 1H, J=7.5Hz), 1.91 (d, 1H, J=7.5Hz), 1.85 (s, 3H)。
C1-01	δ 9.06 (d, 1H, J=1.5Hz), 8.33 (d, 1H, J=7.2Hz), 7.57 (d, 1H, J=6.9Hz)。(C O ₂ Hのプロトンピークは観測されなかった。)
C1-02	δ 8.38 (d, 1H, J=7.5Hz), 7.60 (d, 1H, H=7.5Hz), 2.39-2.28 (m, 1H), 1.42-1.35 (m, 2H), 1.29-1.23 (m, 2H)。(C O ₂ Hのプロトンピークは観測されなかった。)
C1-04	δ 8.30 (d, 1H, J=6.9Hz), 7.60-7.49 (m, 6H)。(C O ₂ Hのプロトンピークは観測されなかった。)

[0284] 試験例

次に、本発明化合物の除草剤としての有用性について、以下の試験例において具体的に説明するが、本発明はこれらのみに限定されるものではない。

〔試験例1〕湛水条件における雑草発生前処理による除草効果試験

1 / 10000 アールのワグネルポットに沖積土壌を入れた後、水を入れて混和し、水深4 cmの湛水条件とした。ノビエ、ホタルイ及びコナギの種子を上記カップに混播した後、2.5葉期のイネ苗を移植した。播種当日、配合例2に準じて調製した本発明化合物の乳剤を所定の薬量になるように水で希釈し、水面に処理した。カップを25乃至30℃の温室内に置いて植物を育成し、薬剤処理3週間後に、各種植物に対する影響を下記の判定基準に従

い調査した。結果を第 17 表に示す。

判定基準

- 5 … 殺草率 90%以上 (ほとんど完全枯死)
- 4 … 殺草率 70%以上90%未満
- 3 … 殺草率 40%以上70%未満
- 2 … 殺草率 20%以上40%未満
- 1 … 殺草率 5%以上20%未満
- 0 … 殺草率 5%以下 (ほとんど効力なし)

[0285] [試験例 2] 湛水条件における雑草生育期処理による除草効果試験

1 / 10000 アールのワグネルポットに沖積土壌を入れた後、水を入れて混和し、水深 4 cm の湛水条件とした。ノビエ、ホタルイ及びコナギの種子を上記カップに混播し、25 乃至 30℃ の温室内に置いて植物を育成した。ノビエ、ホタルイ及びコナギが 1 乃至 2 葉期に達したとき、配合例 2 に準じて調製した本発明化合物の乳剤を所定の薬量になるように水で希釈し、水面に処理した。薬剤処理 3 週間後に、各種植物に対する影響を試験例 1 の判定基準に従って調査した。結果を第 18 表に示す。

[0286] [試験例 3] 茎葉処理による除草効果試験

1 / 10000 アールのワグネルポットに沖積土壌を入れた後、水を入れて混和し、水深 0.1 乃至 0.5 cm の条件とした。イヌビエ、アゼガヤ、タマガヤツリ及びイネの種子を播種し、25 乃至 30℃ の温室内に置いて植物を育成した。14 日間育成したのち、配合例 2 に準じて調製した本発明化合物の乳剤を所定の薬量になるように水で希釈し、茎葉部へ小型スプレーで均一に処理した。薬剤処理 3 週間後に、各種植物に対する影響を試験例 1 の判定基準に従って調査した。結果を第 19 表に示す。

[0287] [試験例 4] 茎葉処理による除草効果試験

縦 21 cm、横 13 cm、深さ 7 cm のプラスチック製箱に殺菌した洪積土壌を入れ、メヒシバ、エノコログサ、イヌビエ、カラスムギ、ブラックグラス、イタリアンライグラス、セイヨウヌカボ、イチビ、アオゲイトウ、シロザ、

ハコベ、ヤエムグラ、オオイヌノフグリ、トウモロコシ、ダイズ、イネ、コムギ、ビート及びナタネの種子をそれぞれスポット状に播種し、約 1.5 cm 覆土した後、25 乃至 30℃の温室内において植物を育成した。14 日間育成したのち、配合例 2 に準じて調製した本発明化合物の乳剤を所定の薬量になるように水で希釈し、茎葉部へ小型スプレーで均一に処理した。薬剤処理 3 週間後に、各種植物に対する影響を試験例 1 の判定基準に従って調査した。結果を第 20 表に示す。

[0288] 尚、第 17 表乃至第 20 表中の記号は以下の意味を表す。

A : ノビエ、B : ホタルイ、C : コナギ、D : アゼガヤ、E : タマガヤツリ、F : メヒシバ、G : エノコログサ、H : イヌビエ、I : カラスムギ、J : ブラックグラス、K : イタリアンライグラス、L : セイヨウヌカボ、M : イチビ、N : アオゲイトウ、O : シロザ、P : ハコベ、Q : ヤエムグラ、R : オオイヌノフグリ、a : 移植イネ、b : 直播イネ、c : トウモロコシ、d : ダイズ、e : コムギ、f : ビート、g : ナタネ

また処理薬量 (g / ha) とは、1 ヘクタール (1 ha) 当たりに換算したときに、記載した数値のグラム (g) 数だけ処理されるように濃度を調整したことを表す。

[0289] [第 17 表]

[表49]

N o .	处 理 薬 量 (g / h a)	A	B	C	a
1-001	320	3	2	2	0
1-002	320	2	1	0	0
1-004	320	5	4	4	1
1-005	320	5	4	4	0
1-010	320	5	3		0
1-011	320	5	4	5	1
1-012	320	5	3	4	0
1-014	320	5	4	3	0
1-015	320	2	3	3	0
1-016	320	4	0	0	0
1-017	320	3	2	0	0
1-018	320	1	3	5	0
1-019	320	5	3	4	2
1-020	320	4	3	2	0
1-021	320	5	4	4	2
1-022	320	2	2	0	0
1-024	320	5	2	0	0
1-026	320	5	4	4	2
1-027	320	5	3	4	1
1-029	320	5	3	4	2
1-030	320	5	3	3	0
1-031	320	4	3	3	0
1-032	320	5	3	2	2
1-033	320	5	4	3	0
1-034	320	4	4	4	3
1-035	320	5	4	4	2
1-036	320	4	3	3	4
1-037	320	0	2	3	0
1-038	320	2	2	1	0
1-040	320	3	3	3	1
1-041	320	3	3	3	0
1-042	320	2	2	2	0
1-043	320	5	3	3	3
1-044	320	5	3	3	1
1-046	320	5	3	3	2
1-047	320	4	3	2	1
1-048	320	3	0	0	1
1-049	320	5	2	0	0
1-050	320	5	5	4	2
1-051	320	5	4	4	0
1-052	320	3	3	2	0
1-053	320	2	3	2	0
1-054	320	5	3	4	2
1-055	320	4	4	4	1
1-056	320	5	5	4	3
1-057	320	5	5	4	2
1-058	320	5	5	4	4

[表50]

N o .	处 理 薬 量 (g / h a)	A	B	C	a
1-059	320	2	3	2	0
1-060	320	4	4	3	2
1-062	320	3	2	1	0
1-063	320	5	4	3	0
1-064	320	5	4	3	0
1-065	320	5	3	2	0
1-066	320	5	4	2	2
1-067	320	3	0	0	0
1-068	320	2	3	3	0
1-069	320	5	4	3	0
1-070	320	5	5	5	3
1-071	320	4	5	4	0
1-073	320	4	3	2	3
1-074	320	2	2	0	0
1-075	320	2	0	2	0
1-076	320	5	4	4	3
1-077	320	0	0	2	0
1-078	320	4	4	3	4
1-079	320	4	4	3	4
1-080	320	5	4	4	4
1-082	320	3	2	2	0
1-083	320	2	3	3	0
1-084	320	2	3	2	0
1-085	320	3	4	3	3
1-086	320	5	4	4	5
1-087	320	5		3	0
1-090	320	3	4	2	0
1-091	320	5	5	5	0
1-092	320	5	5	4	3
1-093	320	5	4	3	0
1-094	320	5	5	3	0
1-095	320	5	5	5	1
1-096	320	5	4	4	3
1-100	320	4	3	3	0
1-102	320	3	2	2	2
1-103	320	5	4	4	3
1-104	320	4	3	2	0
1-105	320	5	5	4	0
1-106	320	5	5	4	1
1-107	320	5	4	5	2
1-108	320	5	5	5	0
1-109	320	0	2	0	0
1-110	320	5	4	4	4
1-112	320	3	3	2	0
1-113	320	4	3	2	0
1-114	320	3	2	0	0
1-115	320	5	4	3	0

[表51]

N o .	处 理 薬 量 (g / h a)	A	B	C	a
1-116	320	5	4	2	0
1-118	320	3	2	0	2
1-119	320	2	1	0	3
1-120	320	5	3	1	3
1-121	320	5	4	4	3
1-122	320	5	5	5	3
1-123	320	5	4	4	1
1-124	320	3	3	1	0
1-125	320	0	3	1	0
1-126	320	3	4	2	0
1-128	288	5	4	2	0
1-129	320	5	4	3	1
1-130	320	1	0	0	1
1-131	320	2	1	0	0
1-132	320	5	4	4	2
1-133	320	5	3	4	0
1-134	320	3	3	2	0
1-135	320	3	4	4	1
1-136	320	5	3	3	1
1-137	320	5	5	5	3
1-138	320	5	5	4	2
1-139	320	5	4	3	2
1-143	320	0	0	2	0
1-144	320	5	3	3	1
1-145	320	5	5	5	4
1-146	320	5	5	5	3
1-147	320	5	5	5	2
1-148	320	5	5	5	4
1-149	320	5	4	3	3
1-150	320	5	5	5	4
1-151	320	5	5	3	0
1-152	320	5	4	3	2
1-153	320	3	3	4	2
1-154	320		3	2	0
1-155	320		4	3	0
1-156	320		2	0	0
1-157	320		3	2	2
1-158	320		4	0	0
1-159	320		3	0	0
1-161	320		2	0	0
1-162	320		2	0	0
1-163	320		4	4	2
1-164	320		5	4	3
1-165	320	4	3	4	0
1-166	320		3	2	0
1-167	320	4	2	0	0
1-169	320	5	4	4	0

[表52]

N o .	处 理 菜 量 (g / h a)	A	B	C	a
1-171	320	5	4	4	1
1-172	320	5	4	3	1
2-001	320	2	3	4	0
2-002	320	2	3	3	0
2-003	320	5	5	5	4
2-005	320	5	5	5	0
2-006	320	5	5	5	4
2-007	320	5	5	5	3
2-008	320	4	4	4	1
2-009	320	3	3	4	0
2-010	320	5	5	4	4
2-011	320	5	5	5	2
2-012	320	5	4	3	1
2-013	320	5	4	5	3
2-014	320	5	5	5	4
2-015	320	5	5	5	1
2-016	320	5	5	5	4
2-017	320	5	3	4	4
2-019	320	5	5	4	2
2-020	320	3	2	2	1
2-021	320	5	5	5	4
2-022	320	5	5	5	5
2-023	320	2	1	0	3
2-024	320	5	5	5	5
2-025	320	5	5	5	5
2-026	320	5	5	4	4
2-027	320	5	5	5	4
2-028	320	5	5	5	5
2-029	320	5	5	5	5
2-030	320	5	4	4	3
2-031	320	5	5	5	5
2-032	320	5	5	5	5
2-033	320	5	4	5	4
2-034	320	5	4	4	4
2-035	320	4	3	3	4
2-037	320	5	5	5	4
2-038	320	5	5	5	4
2-039	320	5	5	5	4
2-040	320	4	4	4	4
2-041	320	5	5	4	0
2-042	320	5	4	4	5
2-043	320	5	5	5	4
2-044	320	5	5	5	4
2-045	320	5	5	5	5
2-046	320	4	0	0	0
2-047	320	5	4	5	4
2-048	320	5	5	4	4

[表53]

N o .	处 理 薬 量 (g / h a)	A	B	C	a
2-049	320	5	5	4	3
2-050	192	4	2	3	2
2-051	320	5	5	5	4
2-052	320	5	5	5	5
2-053	320	5	5	4	5
2-054	320	5	5	5	5
2-056	320	4	4	3	1
2-057	320	4	4	4	4
2-058	320	4	4	5	5
2-059	320	4	4	4	5
2-060	320	5	5	5	5
2-061	320	5	5	5	4
2-062	320	5	5	5	5
2-063	320	5		5	4
2-064	320	5		2	3
2-065	320	5	4	4	2
2-066	320	5	5	4	3
2-067	320	5	4	4	5
2-068	320	5	5	4	5
2-069	320	5	5	5	5
2-070	320	5	5	5	4
2-071	320	5	5	5	4
2-072	320	5	5	5	3
2-073	320	4	3	4	2
2-074	320	4	4	3	3
2-075	320	5	5	5	5
2-076	320	5	4	3	2
2-077	320	5	3	3	1
2-078	320	5	4	2	4
2-079	320	5	5	5	4
2-080	320	3	0	0	2
2-081	320	4	3	4	3
2-082	320	5	5	5	5
2-083	320	5	5	4	2
2-084	320	5	5	4	4
2-085	320	5	5	4	1
2-086	320	3	2	3	0
2-087	320	5	5	4	3
2-088	141	5	5	5	3
2-089	320	5	5	5	4
2-090	320	5	5	5	4
2-091	320	5	5	5	0
2-093	320	5	5	4	2
2-094	320	5	5	5	4
2-095	320	5	5	5	5
2-096	320		5	4	3
2-097	320		4	3	1

[表54]

N o .	处 理 薬 量 (g / h a)	A	B	C	a
2-098	320		5	4	2
2-099	320	5	4	5	4
2-100	320	5	5	5	3
2-101	320	5	5	5	3
2-102	320	5	5	4	1
2-103	320	5	4	5	3
2-105	320	5	5	5	4
2-106	320	5	3	4	2
2-107	320	2	3	2	1
2-108	320	4	3	2	0
2-109	260	2	3		0
2-110	320	5	5	5	4
4-003	320		2	0	0
6-002	320	4	3	2	0
6-004	320	0	0	2	0
7-001	320	0	2	4	0
7-002	320	3	3	4	1

[0290] [第 1 8 表]

[表55]

N o .	处 理 薬 量 (g / h a)	A	B	C
1-001	320	4	4	2
1-002	320	3	0	0
1-004	320	4	3	4
1-005	320	5	1	0
1-010	320	4	1	4
1-011	320	5	3	3
1-012	320	2	2	2
1-014	280	2	3	0
1-015	320	4	2	1
1-016	320	3	0	0
1-017	320	2	2	0
1-018	320	0	2	0
1-019	320	4	3	3
1-020	320	2	2	2
1-021	320	4	4	3
1-022	320	2	2	0
1-024	320	4	1	0
1-026	320	3	1	0
1-027	320	4	3	3
1-029	320	3	2	3
1-030	320	4	3	3
1-031	320	3	2	2
1-032	320	4	3	3
1-033	320	4	4	3
1-034	320	4	3	4
1-035	320	5	4	4
1-036	320	3	2	4
1-037	320	2	2	
1-038	320	1	1	0
1-040	320	3	2	
1-041	320	2	3	
1-042	320	1	2	3
1-043	320	3	3	3
1-044	320	2	3	2
1-046	320	4		
1-047	320	3	2	3
1-048	320	0	1	0
1-049	320	4	2	2
1-050	320	5	4	3
1-051	320	4	3	4
1-052	320	1	1	0
1-053	320	1	2	0
1-054	320	4	3	3
1-055	320	3	3	3
1-056	320	5	4	4
1-057	320	2	3	3
1-058	320	4	5	4

[表56]

N o .	处 理 薬 量 (g / h a)	A	B	C
1-059	320	2	3	2
1-060	320	2	3	2
1-061	320	0	1	1
1-062	320	2	2	2
1-063	320	4	3	2
1-064	320	2	3	2
1-065	320	1	2	2
1-066	320	2	3	2
1-068	320	2	2	2
1-069	320	4	4	4
1-070	320	5	5	5
1-071	320	3	5	4
1-073	320	2	2	1
1-074	320	2	0	0
1-076	320	2	0	4
1-078	320	4	3	3
1-079	320	4	3	4
1-080	320	5	3	4
1-083	320	2	2	2
1-084	320	2	1	0
1-085	320	3	2	2
1-086	320	4	4	4
1-087	320	4		3
1-090	320	2	1	3
1-091	320	5	5	5
1-092	320	4	4	3
1-093	320	3	3	3
1-094	320	4	3	3
1-095	320	4	5	4
1-096	320	4	3	4
1-100	320	4	3	4
1-102	320	1	1	1
1-103	320	4	5	4
1-104	320	4	3	3
1-105	320	3	4	3
1-106	320	5	5	4
1-107	320	5	4	4
1-108	320	4	4	3
1-109	320	0	1	0
1-110	320	4	3	4
1-112	320	1	2	0
1-113	320	2	0	0
1-114	320	0	1	0
1-115	320	3	3	
1-116	320	3	4	0
1-118	320	2	3	0
1-119	320	4	1	0

[表57]

N o .	处 理 薬 量 (g / h a)	A	B	C
1-120	320	3	3	2
1-121	320	4	4	4
1-122	320	4	3	3
1-123	320	3	2	3
1-124	320	3	3	1
1-125	320	0	2	1
1-126	320	1	3	3
1-128	288	1	3	0
1-129	320	3	4	3
1-131	320	0	1	0
1-132	320	4	4	4
1-133	320	2	2	3
1-134	320	1	3	3
1-135	320	2	2	3
1-136	320	0	2	2
1-137	320	3	3	3
1-138	320	3	3	3
1-139	320	4	3	3
1-144	320	4	4	3
1-145	320	4	4	4
1-146	320	3	3	3
1-147	320	4	2	3
1-148	320	5	5	4
1-149	320	3	3	2
1-150	320	5	5	4
1-151	320	4	4	2
1-152	320	3	3	3
1-153	320	3	3	3
1-154	320	0	2	0
1-155	320	1	2	0
1-156	320	0	3	2
1-157	320	0	1	0
1-158	320	2	3	0
1-159	320	3		
1-162	320	3	1	0
1-163	320	4		
1-164	320	4	4	4
1-165	320	2	2	
1-166	320	2	3	
1-168	320	2	2	
1-169	320	3	4	4
1-171	320	4		
1-172	320	3	4	3
1-173	320	3	2	2
2-001	320	2	2	3
2-002	320	2	1	2
2-003	320	5	3	4

[表58]

N o .	处 理 薬 量 (g / h a)	A	B	C
2-005	320	5	3	4
2-006	320	5	5	5
2-007	320	4	4	4
2-008	320	3	2	3
2-009	320	3	2	3
2-010	320	5	4	4
2-011	320	4	3	4
2-012	320	4	5	5
2-013	320	5	3	2
2-014	320	5	5	5
2-015	320	4	5	4
2-016	320	5	5	5
2-017	320	5	4	4
2-019	320	4	3	4
2-020	320	2	2	0
2-021	320	5	4	4
2-022	320	5	5	4
2-023	320	0	1	1
2-024	320	5	4	4
2-025	320	5	4	5
2-026	320	5	5	4
2-027	320	5	4	4
2-028	320	5	4	4
2-029	320	5	4	4
2-030	320	4	3	4
2-031	320	5	4	4
2-032	320	5	5	5
2-033	320	4	3	4
2-034	320	5	4	4
2-035	320	2	2	3
2-037	320	5	5	5
2-038	320	5	4	5
2-039	320	5	5	5
2-040	320	4	3	4
2-041	320	5	4	3
2-042	320	4	3	4
2-043	320	5	4	4
2-044	320	5	4	4
2-045	320	5	3	4
2-047	320	3	5	4
2-048	320	3	4	3
2-049	320	5	5	4
2-050	192	1	0	2
2-051	320	5	5	5
2-052	320	5	4	4
2-053	320	5	4	4
2-054	320	5	4	5

[表59]

N o .	处 理 薬 量 (g / h a)	A	B	C
2-056	320	3	3	3
2-057	320	4	4	4
2-058	320	4	4	4
2-059	320	4	3	4
2-060	320	5	3	5
2-061	320	4	5	5
2-062	320	5	4	5
2-060	320	5	4	5
2-061	320	4	5	5
2-062	320	5	4	5
2-063	320	5	4	5
2-064	320	3	4	3
2-065	320	5	4	4
2-066	320	3		3
2-067	320	5	4	5
2-068	320	5	5	4
2-069	320	5	5	5
2-070	320	5	5	5
2-071	320	3	5	5
2-072	320	5	5	5
2-073	320	2	2	3
2-074	320	4	4	3
2-075	320	5	5	5
2-076	320	2	3	2
2-077	320	2	2	2
2-078	320	4	4	3
2-079	320	5	5	5
2-080	320	2	1	0
2-081	320	2	2	2
2-082	320	5	4	3
2-083	320	3	3	3
2-084	320	4	4	3
2-085	320	4	4	3
2-086	320	0	2	1
2-087	320	4	4	3
2-088	141	4	3	4
2-089	320	4	4	5
2-090	320	5	5	4
2-091	320	4	5	4
2-093	320	2	4	3
2-094	320	5	5	4
2-095	320	4	5	5
2-096	320	3	3	3
2-097	320	0	2	2
2-098	320	5	4	3
2-099	320	5	5	4
2-100	320	4	3	4

[表60]

N o .	处 理 薬 量 (g / h a)	A	B	C
2-101	320	4	4	5
2-102	320	4	4	4
2-103	320	4	3	4
2-105	320	4	4	4
2-106	320	1	2	3
2-107	320	2	1	2
2-108	320	0	1	
2-109	260	1	1	
2-110	320	5	5	4
6-002	320	3	2	3
6-004	320	3	0	2
7-002	320	4	2	2

[0291] [第 1 9 表]

[表61]

N o .	处 理 薬 量 (g / h a)	H	D	E	b
1-001	320	5	5	4	0
1-002	400	4	4		0
1-004	400	4	5	5	0
1-005	400	2	5	5	0
1-008	320	3	0		0
1-010	400	5	5	4	0
1-011	400	5	5	5	0
1-012	400	3	5		0
1-013	320	3	4	3	0
1-014	320	5	2	4	1
1-015	320	5	5	4	1
1-016	320	5	5	5	1
1-017	320	4	3	4	0
1-018	320	4	4	4	2
1-019	320	5	5	5	4
1-020	320	5	4	4	2
1-021	320	5	5	5	3
1-022	320	5	5	4	2
1-024	320	5	4	4	2
1-025	320	4	3	2	2
1-026	320	5	4	4	4
1-027	320	5	5	5	3
1-029	320	4	5	4	4
1-030	320	5	5	5	4
1-031	320	5	4	3	2
1-032	320	5	5	5	2
1-033	320	5	5	5	1
1-034	320	5	5	5	5
1-035	320	5	5	5	4
1-036	320	5	5	5	4
1-037	320	5	5	5	2
1-038	320	5	5	4	2
1-039	320	3	3	3	2
1-040	320	4	5	4	3
1-041	320	4	5	5	2
1-042	320	5		4	1
1-043	320	5	4	5	5
1-044	320	5	4	4	3
1-045	320	1	3	4	0
1-046	320	5	3	3	3
1-047	320	5	5	4	3
1-048	320	5	4	3	0
1-049	320	5	4	4	1
1-050	320	5	5	5	1
1-051	320	4	5	4	0
1-052	320	4	5	5	0
1-053	320	4	4	4	0

[表62]

N o .	处 理 薬 量 (g / h a)	H	D	E	b
1-054	320	5	5	5	3
1-055	320	5	4	5	2
1-056	320	5	5	5	4
1-057	320	5	5	5	3
1-058	320	5	5	5	4
1-059	320	0	3	3	0
1-060	320	5	4	3	2
1-061	320	5	4	3	1
1-062	320	5	4	4	2
1-063	320	5	5	5	2
1-064	320	5	4	4	2
1-065	320	3	1	3	0
1-066	320	1	4	3	0
1-067	320	5	5	5	2
1-068	320	5	5	5	1
1-069	320	5	5	5	1
1-070	320	4	5	5	0
1-071	320	0	3	5	0
1-072	320	2	1	0	0
1-073	320	5	5	5	4
1-074	320	5	4	3	0
1-075	320	5	4	4	1
1-076	320	5	5	5	3
1-077	320	5	4	3	0
1-078	320	5	5	5	5
1-079	320	5	5	5	5
1-080	320	5	5	5	5
1-081	320	2	0	0	0
1-082	320	4	4	4	0
1-083	320	5	5	5	2
1-084	320	5	5	5	2
1-085	320	5	5	5	3
1-086	320	5	5	5	0
1-087	320	5	5	5	1
1-089	224	3	3	2	0
1-090	320	5	5	5	0
1-091	320	5	5	5	0
1-092	320	5	5	5	4
1-093	320	4	5	4	1
1-094	320	5	4	4	1
1-095	320	4	4	4	1
1-096	320	5	5	4	4
1-100	320	5	5	4	0
1-101	320	1	0	0	0
1-102	320	4	5	4	2
1-103	320	5	5	5	4
1-104	320	5	5	4	0

[表63]

N o .	处 理 薬 量 (g / h a)	H	D	E	b
1-105	320	5	5	5	0
1-106	320	5	5	5	3
1-107	320	5	5	5	3
1-108	320	5	5	5	1
1-109	320	5	5	3	2
1-110	320	5	5	5	5
1-112	320	3	2	1	0
1-113	320	4	3	3	0
1-114	320	4	4	2	0
1-115	320	5	4	4	0
1-116	320	4	4	0	0
1-117	320	4	4	2	0
1-118	320	5	5	3	3
1-119	320	5	5	2	3
1-120	320	5	5	5	3
1-121	320	5	5	5	3
1-122	320	5	5	5	3
1-123	320	4	4	4	1
1-124	320	4	4	4	0
1-125	320	5	4	3	1
1-126	320	4	4	4	0
1-127	320	4	4	3	0
1-128	288	4	3	3	0
1-129	320	5	5	4	3
1-130	320	5	4	2	2
1-131	320	4	4	3	2
1-132	320	5	5	4	3
1-133	320	4	2	0	0
1-134	320	5	4	2	2
1-135	320	5	4	2	1
1-136	320	4	4	0	2
1-137	320	5	5	4	3
1-138	320	5	5	4	3
1-139	320	4	5	5	1
1-141	320	4	2	3	1
1-142	320	3	1	0	0
1-143	320	4	2	4	0
1-144	320	5	4	2	
1-145	320	5	5	5	
1-146	320	5	5	4	
1-147	320	5	5	3	
1-148	320	5	5	5	
1-149	320	5	5	5	
1-150	320	5	5	5	
1-151	320	5	4	4	
1-152	320	5	5	4	
1-153	320	5	5	3	

[表64]

N o .	処 理 薬 量 (g / h a)	H	D	E	b
1-154	320	3	2	4	
1-155	320	1	2	5	
1-156	320	3	2	2	
1-157	320	4	3	4	
1-158	320	5	4	4	
1-159	320	5	3	0	
1-162	320	4	4	2	
1-163	320	5	5	4	
1-164	320	5	5	4	
1-165	320	5	4		0
1-166	320	4	3		2
1-167	320	1	2		
1-168	320	4	3		3
1-169	320	5	4		1
1-170	320	2	4		1
1-171	320	4	4		0
1-172	320	5	5		3
1-173	320	5	4		2
1-174	320	2	2		0
2-001	320	4	4	3	1
2-002	320	5	4	2	2
2-003	200	5	5	5	0
2-005	320	5	5	4	2
2-006	320	5	5	5	5
2-007	320	5	5	5	4
2-008	320	4	5	4	0
2-009	320	5	4	3	4
2-010	320	5	5	5	5
2-011	320	5	5	5	5
2-012	320	4	5	5	2
2-013	320	5	5	5	5
2-014	320	5	5	5	5
2-015	320	5	5	5	4
2-016	320	5	5	5	5
2-017	320	5	5	5	5
2-019	320	5	5	5	5
2-020	320	4	4	4	4
2-021	320	5	5	5	5
2-022	320	5	5	5	5
2-023	320	4	1	0	1
2-024	320	5	5	5	5
2-025	320	5	5	5	5
2-026	320	5	5	5	5
2-027	320	5	5	5	5
2-028	320	5	5	5	5
2-029	320	5	5	5	5
2-030	320	4	5	4	5

[表65]

N o .	处 理 薬 量 (g / h a)	H	D	E	b
2-031	320	5	5	5	5
2-032	320	5	5	5	5
2-033	320	5	5	5	5
2-034	320	5	5	5	5
2-035	320	5	5	4	5
2-036	320	4	5	4	1
2-037	320	5	5	5	5
2-038	320	5	5	5	5
2-039	320	5		5	4
2-040	320	4		5	4
2-041	320	5	5	5	3
2-042	320	5	5	5	5
2-043	320	5	5	5	5
2-044	320	5	5	5	5
2-045	320	5	5	5	5
2-046	320	2	3	3	0
2-047	320	4	5	5	3
2-048	320	5	5	5	3
2-049	320	5	5	5	1
2-050	192	4	3	3	0
2-051	320	5	5	5	4
2-052	320	5	5	5	5
2-053	320	5	5	5	5
2-054	320	5	5	5	5
2-055	131	2	0	0	0
2-056	320	4	5	4	4
2-057	320	5	5	5	5
2-058	320	5	5	5	5
2-059	320	5	5	5	5
2-060	320	5	5	5	5
2-061	320	5	5	5	5
2-062	320	5	5	5	5
2-063	320	5	5	5	3
2-064	320	1	4	5	0
2-065	320	5	5	5	3
2-066	320	5	5	5	3
2-067	320	5	5	5	5
2-068	320	5	5	5	5
2-069	320	5	5	5	5
2-070	320	5	5	5	3
2-071	320	4	5	5	3
2-072	320	4	5	5	1
2-073	320	4	3	5	2
2-074	320	5	5	4	5
2-075	320	5	5	5	5
2-076	320	5	4	4	1
2-077	320	2	4	3	0

[表66]

N o .	处 理 薬 量 (g / h a)	H	D	E	b
2-078	320	5	5	3	4
2-079	320	5	5	5	5
2-080	320	4	5	5	3
2-081	320	5	5	5	4
2-082	320	5	5	5	5
2-083	320	4	4	5	0
2-084	320	5	5	5	5
2-085	320	5	5	4	4
2-086	320	5	5	4	3
2-087	320	5	5	5	3
2-088	141	5	5	4	3
2-089	320	4	5	4	2
2-090	320	5	4	5	
2-091	320	5	3	4	
2-092	320	2	3	2	
2-093	320	1	2	5	
2-094	320	5	5	5	
2-095	320	5	5	5	
2-096	320	0	0	5	
2-097	320	2	3	4	
2-098	320	5	5	5	
2-099	320	5	5		4
2-100	320	5	5		3
2-101	320	5	5		4
2-102	320	5	4		1
2-103	320	5	5		1
2-105	320	5	4		5
2-106	320	1	2		0
2-107	320	4	5		4
2-108	320	4	5		4
2-109	260	3	5		2
2-110	320	5	5		3
3-002	320	0	3		0
4-002	320	0	4	0	0
4-003	320	4	3	0	
5-001	320	1	0	0	0
6-002	320	5	5	4	0
6-003	320	1	5	0	0
6-004	320	4	5	2	3
7-001	320	1	2		
7-002	320	4	4	4	0

[0292] [第20表]

[表67]

N o .	处理薬量 (g / ha)	F	G	H	I	J	K	L	M	N	O	P	Q	R	b	c	d	e	f	g
1-001	320	4	3	4	1	1	1	1	3	3	5	4	4	4	0	0	3	1	4	4
1-002	320	4	2	5	3	1	2	1	3	3	5	5	4		0	0	3	1	5	4
1-004	320	5	4	5	2	2	2	3	4	4	5	5	1	4	0	4	4	2	4	3
1-005	320	3	3	4	1	0	0	0	4	3	5	1	0	3	0	1	0	0	0	0
1-008	320	3	1	5	0	0	0	0	0	2	3	0	0	0	0	0	0	0	0	0
1-010	320	3	3	4	3	2	1	2	5	5	5	5	1	5	0	1	4	1	5	3
1-011	320	5	4	5	1	1	1	2	5	5	5	5	2	5	0	3	4	0	5	3
1-012	320	3	4	4	0	0	1	1	3	3	5	4	2	4	0	1	2	0	3	4
1-013	320	3	1	4	0	1	1	0	3	3	5	4	1	3	0	0	0	1	3	0
1-014	320	3	3	4	1	1	1	0	4	5	5	5	3	4	1	0	3	1	5	2
1-015	320	4	3	5	3	1	1	3	5	5	5	5	3	5	0	1	4	2	5	4
1-016	320	4	2	5	1	1	1	0	5	5	5	5	2	4	0	0	0	0	5	3
1-017	320	3	0	5	0	0	0	0	5	5	5	4	0	4	0	0	3	0	5	3
1-018	320	0	2	1	0	0	0	0	3	4	5	4	0	4	0	0	0	0	1	0
1-019	320	5	4	5	3	2	2	4	4	5	5	5	4	4	2	2	4	3	5	4
1-020	320	4	3	5	1	1	1	1	2	4	5	4	3	3	0	1	0	1	5	3
1-021	320	4	3	4	1	1	1	1	5	5	5	5	3	4	1	0	3	1	5	3
1-022	320	4	3	5	1	1	1	1	5	5	5	4	2	4	0	2	3	1	4	2
1-024	320	4	3	4	1	0	0	1	4	5	5	4	3	4	0	2	4	0	4	4
1-025	320	3	2	4	0	0	0	0	5	3	5	4	3	3	0	0	3	0	5	2
1-026	320	3	3	3	1	1	1	2	3	4	5	5	2	5	0	0	3	1	5	3
1-027	320	5	4	5	2	2	1	3	5	5	5	5	3	5	0	1	5	2	5	4
1-029	320	5	4	5	1	1	1	1	5	5	5	5	0	5	3	1	3	1	5	1
1-030	320	5	5	5	4	3	3	4	5	5	5	5	4	4	3	2	5	3	5	4
1-031	320	4	4	5	2	1	1	1	5	4	5	4	3	4	0	1	3	1	3	3
1-032	320	5	5	5	2	1	1	2	5	5	5	5	2	4	0	0	4	1	5	4
1-033	320	5	5	5	2	1	1	2	5	5	5	5	3	5	0	2	3	1	5	4
1-034	320	5	5	5	3	1	3	3	5	5	5	5	3	5	5	1	4	2	5	4
1-035	320	5	5	5	2	2	2	3	5	5	5	5	2	5	4	3	4	2	5	3
1-036	320	5	5	5	4	3	3	4	5	5	5	5	4	5	3	3	4	3	5	5
1-037	320	5	4	4	3	2	2	3	5	5	5	4	4	5	0	1	3	3	5	4
1-038	320	5	5	5	3	1	1	2	5	5	5	5	3	5	0	0	4	1	5	4
1-039	320	2	0	4	0	0	0	0	0	1	4	0	0	0	0	0	0	0	2	0
1-040	320	5	4	4	3	3	3	4	5	5	5	5	3	5	0	0	1	3	5	1
1-041	320	5	4	5	3	1	2	4	5	5	5	5	3	4	0	0	2	3	5	0
1-042	320	4	3	5	2	0	0	2	4	4	5	4	3	4	0	1	3	0	5	3
1-043	320	4	3	5	2	1	1	1	5	5	5	4	3	4	4	2	2	0	5	3
1-044	320	4	4	5	1	1	2	4	5	5	5	4	3	5	0	0	3	0	5	4
1-045	320	3	1	2	0	0	0	0	4	4	5	2	2	3	0	0	1	0	3	3
1-046	320	5	5	5	1	0	0	1	5	5	5	4	2	4	1	2	3	0	5	4
1-047	320	4	4	5	1	0	0	1	5	5	5	4	2	4	0	1	3	0	5	4
1-048	320	5	3	5	2	1	1	2	5	4	5	4	3	4	0	0	4	1	5	4
1-049	320	5	4	5	0	2	2	3	5	5	5	4	3	4	0	4	3	1	5	4
1-050	320	5	4	5	3	2	3	3	5	5	5	5	2	5	1	3	4	3	5	5
1-051	320	3	3	4	1	0	1	1	5	3	5	3	2	3	0	0	1	1	3	1
1-052	320	3	1	2	0	1	1	3	4	4	5	2	1	3	0	0	2	0	3	3
1-053	320	3	2	3	1	0	0	0	4	4	5	2	2	4	0	0	3	0	3	1

[表68]

N o .	処理薬量 (g / h a)	F	G	H	I	J	K	L	M	N	O	P	Q	R	b	c	d	e	f	g
1-054	320	5	4	5	3	3	3	3	5	5	5	4	4	5	0	1	3	3	4	4
1-055	320	4	3	4	1	3	2	3	5	5	5	5	2	4	0	0	3	1	5	4
1-056	320	5	5	5	3	2	2	3	5	5	5	5	4	5	4	4	4	1	5	5
1-057	320	4	4	4	3	2	2	2	5	5	5	5	1	5	0	1	3	0	5	3
1-058	320	5	5	5	3	3	3	2	5	5	5	5	2	5	5	4	4	1	5	4
1-059	320	0	0	2	0	0	0	0	4	2	5	2	0	2	0	0	0	0	0	0
1-060	320	5	3	5	3	2	2	1	4	4	5	4	3	5	3	0	4	3	5	4
1-061	320	3	3	4	3	1	1	1	5	5	5	4	4	5	1	1	4	0	4	4
1-062	320	5	3	5	3	1	0	1	5	4	5	4	4	4	3	0	3	2	4	4
1-063	320	5	5	5	2	2	2	3	4	4	5	4	3	5	0	3	4	2	5	3
1-064	320	5	4	5	1	1	1	1	3	4			3	3	0	0	3	0	4	3
1-065	320	4	1	1	1	0	0	0	3	3	5	4	0	3	0	0	3	0	4	2
1-066	320	3	1	4	1	0	0	0	3	1	5	4	1	4	0	0	3	0	4	0
1-067	320	5	4	5	1	0	0	0	4	1	5	4	3	4	2	0	3	0	4	4
1-068	320	5	4	5	1	1	1	1	3	3	5	4	3	4	2	0	3	1	4	4
1-069	320	5	5	5	2	2	2	4	3	3	5		3		0	1	3	1	5	3
1-070	320	4	4	5	1	0	0	0	4	4	5	5	3		0	0	4	0	4	3
1-071	320	1	0	0	0	0	0	0	3	2	5		1	3	0	0	0	0	2	0
1-072	320	0	0	3	0	0	0	0	1	0	4	2	0	1	0	0	0	0	0	0
1-073	320	5	5	5	3	2	3	3	5	5	5	5	2		5	0	4	3	5	3
1-074	320	4	4	5	1	0	0	0		4	5	4	3	3	0	0	3	0	4	3
1-075	320	3	1	3	0	0	0	0	1	2	5	3	0	3	0	0	0	0	1	1
1-076	320	5	5	5	3	3	3	4	4	4	5	5	2	4	0	3	3	3	5	4
1-077	320	4	2	4	0	0	0	0	2	3	5	4	1	3	0	0	3	0	3	3
1-078	320	5	5	5	4	3	3	4	5	5	5	4			4	4	4	4	5	4
1-079	320	5	5	5	4	2	3		5	5	5	5	4		4	1	5	4	5	5
1-080	320	5	5	5	4	5	4	5	5	5	5		5		4	4	5	5	5	5
1-081	320	0	0	0	0	0	0	0	0	0	4	2		0	0	0	0	0	1	0
1-082	320	4	3	4	0	0	1	1	4	3	5		0	4	0	0	3	0		0
1-083	320	5	5	5	3	0	1	0	5	5	5	4	4	4	1	1	4	1	5	4
1-084	320	5	5	5	3	0	0	0	5	5	5	4	4	5	3	1	4	0	4	4
1-085	320	5	5	5		3	3	3	5	5	5	4	4	5	3	3	4	3	4	4
1-086	320	5	4	5	0	0	0	0	5	4	5	5	1	4	1	1	1	0	5	4
1-087	320	5	5	5	3	3	1	2	5	5	5	4	1	4	0	4	4	2	5	4
1-088	320	0	0	0	0	0	0	0	0	1	2	0	0	0	0	0	0	0	0	0
1-089	224	1	0	3	2	0	0	0	2	1	4	4	0	3	0	0	1	0	3	1
1-090	320	5	3	5	3	1	1	1	3		5	4	1	5	0	1	4	0	5	4
1-091	320	5	5	5	4	2	3	3	5	5	5	5	4	5	0	2	4	3	5	5
1-092	320	5	5	5	2	1	1	1	4	4	5	5	3	5	5	1	4	0	5	3
1-093	320	5	3	5	1	0	1	1	4	4	5	4	1	4	0	4	3	0	5	3
1-094	320	5	4	5	2	1	1	1	4	4	5	5	0	4	0	4	3	1	5	3
1-095	320	5	3	5	1	1	2	1	4	4	5	5	3	5	0	2	3	1	5	3
1-096	320	5	5	5	2	1	2	3	4	5	5	4	4	5	4	4	4	1	5	5
1-100	320	3	1	4	1	0	0	0	3	1	5	3	0	1	0	0	1	0	3	0
1-102	320	3	3	4	0	0	0	0	3	4	5	4	2	4	0	0	1	0	4	2
1-103	320	5	5	5	4	2	3	3	4	5	5	5	4	5	1	2	4	3	5	5
1-104	320	5	5	5	4	1	1	2	4	4	5	5	3	4	0	3	4	2	4	4

[表69]

N o .	处理菜量 (g / ha)	F	G	H	I	J	K	L	M	N	O	P	Q	R	b	c	d	e	f	g
1-105	320	4	1	4	1	1	1	1	3	3	5	4	1	3	0	1	2	1	4	3
1-106	320	5	5	5	4	1	3	3	4	5	5	5	4	5	3	1	3	3	5	4
1-107	320	5	5	5	4	3	3	3	4	5	5	5	4	5	4	1	5	3	5	5
1-108	320	5	5	5	2	1	2	2	4	5	5	5	3	5	1	1	4	1	5	3
1-109	320	4	3	5	1	0	0	0	4	4	5	4	2	4	0	1	3	0	4	4
1-110	320	5	5	5	4	3	3	3	4	5	5	5	4	5	4	4	4	3	5	5
1-112	320	1	0	2	0	0	0	0	3	4	5	4	0	5	0	0	3	0	5	3
1-113	320	1	0	2	0	0	0	0	1	3	5	4	0	3	0	0	0	0	3	0
1-114	320	1	0	3	0	0	0	0	2	3	5	4	1	3	0	0	0	0	4	0
1-115	320	5	5	5	2	2	1	2	3	4	5	4	3	4	0	0	2	2	5	1
1-116	320	5	4	5	3	1	1	1	4	4	5	5	3	4	0	0	3	2	5	4
1-117	320	1	1	4	0	0	0	0	3	3	5	3	1	3	0	0	3	0	3	1
1-118	320	5	5	5	3	1	1	3	4	4	5	4	4	5	4	0	4	1	5	5
1-119	320	5	4	5	3	3	2	3	5	5	5	4	4	5	3	2	4	3	5	5
1-120	320	5	5	5	3	3	3	5	4	5	5	5	5	5	2	0	4	3	5	5
1-121	320	5	4	5	3	3	3	3	4	5	5	5	3	5	2	2	4	3	5	5
1-122	320	5	5	5	2	3	3	4	5	5	5	5	4	5	2	5	2	5	5	5
1-123	320	4	3	4	1	0	0	0	4	4	5	4	2	3	0	3	0	4	3	0
1-124	320	5	3	5	2	0	0	1	5	4	5	3	2	2	1	3	0	3	0	0
1-125	320	4	1	4	1	0	0	0	3	3	5	4	0	0	2	3	1	5	3	0
1-126	320	4	3	5	0	0	0	1	3	3	5	5	1	4	1	2	0	5	3	0
1-127	320	1	1	4	0	0	0	0	2	1	5	3	0	1	0	1	0	2	0	0
1-128	288	5	2	5	0	1	1	1	3	3	5	5	1	5	0	3	1	5	3	0
1-129	320	4	4	5	2	1	1	1	3	4	5	5	0	2	4	1	5	3	0	0
1-130	320	4	4	5	1	1	1	1	3	3	5	3	4	3	0	3	0	5	4	0
1-131	320	4	3	4	0	0	0	0	3	3	5	3	0	3	0	3	0	3	0	0
1-132	320	4	3	5	1	1	1	2	4	3	5	2	4	2	3	1	5	4	0	0
1-133	320	3	0	4	0	0	0	0	3	3	4	4	1	2	0	3	0	3	0	0
1-134	320	4	3	5	0	1	1	1	4	3	5	4	3	4	0	3	1	5	4	0
1-135	320	4	3	4	1	1	1	1	3	3	5	4	0	1	0	3	0	4	0	0
1-136	320	4	2	4	0	0	0	1	3	2	5	4	0	3	1	3	0	4	0	0
1-137	320	4	5	5	3	2	2	4	3	4	5	5	3	5	0	4	2	5	5	0
1-138	320	4	3	5	2	1	1	3	3	4	5	5	2	5	0	3	1	5	4	0
1-139	320	5	3	5	1	0	1	0	3	4	5	5	2	5	0	3	1	5	4	0
1-141	320	3	1	4	0	0	0	0	3	3	4	3	1	3	0	1	0	4	4	0
1-142	320	1	0	3	0	0	0	0	0	1	4	2	1	0	0	0	0	3	0	0
1-143	320	2	0	4	0	0	0	0	2	2	4	3	2	3	0	1	0	2	3	0
1-144	320	3	2	5	2	1	1	0	2	4	5	5	3	4	0	0	4	1	5	4
1-145	320	5	4	5	3	1	2	3	3	4	5	5	1	5	3	0	3	2	5	3
1-146	320	5	5	5	4	2	4	4	4	5	5	5	5	5	5	0	5	3	5	5
1-147	320	4	3	4	3	2	3	3	3	4	5	5	3	5	0	0	3	3	5	5
1-148	320	4	3	5	1	1	3	2	3	5	5	5	4	5	3	0	3	0	5	4
1-149	320	4	3	4	1	1	1	2	3	3	5	5	3	5	1	0	3	0	5	5
1-150	320	4	3	5	3	1	3	3	3	5	5	5	4	5	3	0	4	3	5	5
1-151	320	5	3	5	3	1	3	2	3	5	5	5	4	5	0	0	4	3	5	5
1-152	320	4	3	4	2	0	1	1	3	4	5	4	1	3	0	0	3	0	4	1
1-153	320	4	4	5	3	1	1	2	3	4	5	5	4	4	3	0	5	2	5	3

[表70]

N o .	处理薬量 (g / h a)	F	G	H	I	J	K	L	M	N	O	P	Q	R	b	c	d	e	f	g
1-154	320	3	2	3	0	0	0	0	2	2	5	4	0	0	0	0	2	0	4	0
1-155	320	3	1	3	0	0	0	0	3	3	5		0	2	0	0	3	0	5	0
1-156	320	2	1	4	1	1	1	2	3	3	5	4	1	3	0	0	3	1	3	0
1-157	320	3	1	3	1	1	1	1	3	3	5		1	2	0	0	3	1	4	2
1-158	320	5	4	5	3	1	2	3	4	4	5	5	3	4	0	0	4	2	5	3
1-159	320	4	4	5	2	1	2	2	3	3	5	5	2	3	0	0	3	1	4	1
1-160	320	1	0	2	0	0	0	0	3	1	4	3	0	1	0	0	2	0	2	0
1-161	320	3	0	3	0	0	0	0	1	0	4	0	0	1	0	0	1	0	1	0
1-162	320	3	1	4	1	1	1	0	3	4	4	3	2	3	0	0	3	0	3	1
1-163	320	4	3	5	2	1	1	1	4	4	5	4	3	2	0	0	4	1	4	3
1-164	320	5	5	5	3	1	1	3	4	5	5		4		4	0	5	3	5	4
1-165	320	3	1	4	0	0	0	2	3	4	5	4	2	4	0	0	1	0	5	4
1-166	320	5	4	5	1	0	1	1	3	4	5	4	1		0	0	4	0	5	4
1-167	320	0	0	2	1	0	1	1	2	2	5	5	2	4	0	0	1	0	5	0
1-168	320	5	4	5	1	0	1	0	3	3	5	5	1	5	3	0	3	1	5	3
1-169	320	4	3	5	1	1	1	1	3		5	5	1	4	0	1	5	1	5	0
1-170	320	4	3	4	1	0	1	1	3	3	5	4	2	4	0	0	2	0	5	3
1-171	320	3	3	5	0	0	0	1	4	4	5	5	2	3	0	0	3	0	5	3
1-172	320	5	4	5	2	1	1	1	5	5	5	5	4	4	3	0	4	1	5	4
1-173	320	4	3	5	2	1	1	1	5	5	5	5	4	4	3	0	4	1	5	4
1-174	320	0	0	0	0	0	0	0	0	4	5	3	3	3	0	0	0	0	4	0
2-001	320	3	0	4	1	0	1	0	5	5	5	5	4	5	0	0	2	0	5	4
2-002	320	4	3	5	3	1	1	1	5	5	5	5	4	5	2	0	3	1	5	4
2-003	320	5	5	5	3	3	3	5	5	5	5	5	4	5	4	1	4	3	5	5
2-005	320	5	4	5	3	3	2	4	5	5	5	5	4	5	0	1	3	3	5	4
2-006	320	5	5	5	3	2	1	4	5	5	5	5	3	5	5	1	4	3	5	4
2-007	320	5	4	5	3	2	2	4	5	5	5	5	1	5	2	0	3	2	5	4
2-008	320	3	2	4	3	1	2	1	5	5	5	5	3	4	1	0	3	2	5	3
2-009	320	4	3	5	3	1	2	1	5	5	5	5	4	4	2	1	4	1	5	4
2-010	320	4	3	5	4	3	3	2	5	5	5	5	4	5	5	3	4	3	5	5
2-011	320	5	3	5	3	3	2	3	5	5	5	5	3	5	5	1	4	1	5	1
2-012	320	4	1	4	3	2	2	2	5	5	5	5	4	4	5	3	4	4	5	4
2-013	320	5	5	5	4	3	3	4	5	5	5	5	4	4	5	3	4	4	5	4
2-014	320	5	5	5	4	4	4	4	5	5	5	5	4	5	5	3	4	4	5	4
2-015	320	5	4	5	2	2	2	2	5	5	5	4	3	3	4	2	2	2	4	3
2-016	320	5	5	5	4	4	4	4	5	5	5	5	3	5	5	1	4	4	5	4
2-017	320	5	5	5	4	3	2	4	5	5	5	5	1	5	5	1	4	3	5	4
2-018	320	2	1	1	0	0	0	0	3	3	3	0	1	2	0	0	0	0	1	0
2-019	320	5	5	5	3	2	2	4	5	5	5	5	3	5	4	0	4	3	5	4
2-020	320	3	3	3	1	0	1	1	5	4	5	4	2	4	2	0	3	1	5	3
2-021	320	5	5	5	3	3	3	4	5	5	5	5	4	5	4	0	4	3	5	4
2-022	320	4	5	5	4	3	3	5	5	5	5	5	4	5	5	1	5	3	5	5
2-023	320	1	1	4	0	0	0	0	3	5	4	3		4	0	0	1	0	4	1
2-024	320	5	5	5	4	3	4	5	5	5	5	5	4	5	5	5	5	4	5	5
2-025	320	5	5	5	4	3	3	4	5	5	5	5	4	5	5	1	4	3	5	4
2-026	320	5	4	5	3	4	3	3	5	5	5	5	4	5	5	2	5	3	5	5
2-027	320	5	5	5	3	4	3	4	5	5	5	5	4	5	4	0	1	3	5	4

[表71]

N o .	处理薬量 (g / h a)	F	G	H	I	J	K	L	M	N	O	P	Q	R	b	c	d	e	f	g
2-028	320	5	5	5	4	4	4	5	5	5	5	5	4	5	5	3	4	4	5	5
2-029	320	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	5	4	5	5	5	5
2-030	320	5	5	5	4	3	3	5	5	5	5	5	3	5	5	0	4	3	5	5
2-031	320	5	5	5	5	4	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
2-032	320	5	5	5	5	3	4	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
2-033	320	5	5	5	5	4	4	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	4	5	5
2-034	320	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	3	5	5	5	5
2-035	320	5	5	5	4	3	4	4	5	5	5	5	2	5	5	2	4	4	5	5
2-036	320	5	4	5	1	0	0	3	5	5	5	5	4	4	0	0	2	0	5	3
2-037	320	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	5	5
2-038	320	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
2-039	320	5	5	5	4	3	3	4	5	5	5	5	4	5	4	3	4	3	5	5
2-040	320	5	3	5	3	1	1	3	5	5	5	5	4	5	4	1	4	2	5	3
2-041	320	4	3	5	3	3	3	4	5	4	5	5	4	4	2	0	4	3	5	4
2-042	320	5	5	5	2	2	1	0	5	5	5	3	1	5	4	0	3	0	4	2
2-043	320	5	4	5	4	3	2	4	5	5	5	5	4	5	3	1	4	3	5	4
2-044	320	5	4	5	2	2	2	3	5	5	5	4	3	5	3	2	4	1	5	3
2-045	320	5	4	5	2	1	1	3	5	5	5	5	3	5	4	3	4	1	5	5
2-046	320	0	1	3	0	0	0	0	4	4	4	2	1	1	0	0	0	0	2	0
2-047	320	5	3	5	3	1	1	3	5	5	5	4	3	5	3	0	3	3	5	3
2-048	320	5	5	5	4	3	4	4	5	5	5	4	4		4	4	5	4	5	5
2-049	320	5	5	5	3	1	3	4	4	3	5		3	4	2	1	4	0	4	3
2-050	192	3	1	3	2	0	0	0	3	2	5	3	0	3	0	0	3	0	3	0
2-051	320	5	5	5	5	4	4	5	5	5	5	5	5	5	4	2	4	4	5	4
2-052	320	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5		5	4	5	5	5	5	
2-053	320	5	5	5	5	5	4	5	5	5	5	5	5		5	4	5	5	5	5
2-054	320	5	5	5	5	4	5	5	5	5	5	5	4		5	5	5	5	5	5
2-055	131	0	0	0	0	0	0	0	4	3	5	4	0		0	0	1	0	1	0
2-056	320	5	3	4	1	1	1	1	4	4	5	5	4		0	1	3	1	5	3
2-057	320	5	5	5	4	4	4	4	5	5	5	5	4	5	4	2	5	4	5	5
2-058	320	5	5	5	5	4	4	4	5	5	5	5	5	5	5	3	5	5	5	5
2-059	320	5	5	5	4	4	4	4	5	5	5	5	5	5	5	3	5	4	5	5
2-060	320	5	5	5	4	3	3	4	5	5	5	5	4	5	5	2	4	4	5	5
2-061	320	5	5	5	4	3	4	3	4	5	5	5	3	5	5	3	4	3	5	4
2-062	320	5	5	5	5	4	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	5
2-063	320	5	5	5	4	3	3	3	5	5	5	5	4	5	4	3	4	3	5	4
2-064	320	3	2	3	0	0	0	0	5	5	5	5	1	5	0	0	3	0	4	3
2-065	320	5	5	5	4	3	3	4	5	5	5	5	3	5	3	4	4	3	5	4
2-066	320	5	5	5	2	3	3	3	4	5	5	5	3	5	4	1	4	3	5	4
2-067	320	5	5	5	5	4	4	3	5	5	5	5	4	5	5	4	5	4	5	5
2-068	320	5	5	5	3	2	2	3	5	5	5	5	4	5	5	3	4	2	5	4
2-069	320	5	5	5	5	3	3	4	5	5	5	5	4	5	5	4	4	3	5	5
2-070	320	5	5	5	5	4	4	4	4	5	5	5	4	5	3	4	3	4	5	5
2-071	320	5	4	5	2	1	1	1	4	5	5	5	3	5	1	2	3	1	5	4
2-072	320	5	5	5	1	1	1	3	5	5	5	5	3	5	1	3	4	1	5	4
2-073	320	1	1	4	1	0	1	0	3	3	5	4	0	2	0	0	2	0	3	0
2-074	320	5	4	5	4	3	3	3	4	5	5	4	3	5	5	3	4	3	5	4

[表72]

N o .	处理菜量 (g / h a)	F	G	H	I	J	K	L	M	N	O	P	Q	R	b	c	d	e	f	g
2-075	320	5	5	5	5	4	4	4	5	5	5	5	4	5	5	3	5	4	5	5
2-076	320	3	3	5	1	1	1	2	4	5	5	5	3	5	1	0	1	0	5	4
2-077	320	4	2	4	0	0	0	0	4	5	5	4	3	3	0	0	2	0	5	2
2-078	320	5	5	5	3	4	4	5	5	5	5	5	4	5	4	1	4	2	5	5
2-079	320	5	5	5	3	4	2	5	5	5	5	5	4	5	5	2	4	2	5	5
2-080	320	5	3	5	1	1	0	3	5	5	5	4	4	5	3	0	4	0	5	5
2-081	320	4	3	5	3	1	1	1	4	5	5	5	3	4		0	3	2	5	4
2-082	320	5	5	5	2	4	4	4	5	5	5	5	4	4		1	5	4	5	5
2-083	320	5	4	5	2	1	1	1	5	5	5	4	3	4		0	4	0	5	1
2-084	320	5	5	5	4	3	3	4	5	5	5	5	4	3		1	3	3	5	3
2-085	320	5	5	5	4	3	3	4	5	5	5	5	4	4		2	5	3	5	4
2-086	320	5	5	5	3	1	2	4	5	5	5	4	4	5		0	4	2	5	3
2-087	320	5	4	5	4	3	3	4	5	4	5	5	3			0	3	2	5	3
2-088	141	5	5	5	4	3	3	4	5	5	5	5	3	4		0	4	0	5	5
2-089	320	4	4	4	1	2	1	4	4	4	5	5	3	5		0	4	0	5	4
2-090	320	5	4	5	4	3	4	4	3	4		5	4	3	3	1	3	3	5	4
2-091	320	5	5	5	3	2	3	3	4	4	5	5	4	4	2	0	3	3	5	5
2-092	320	0	0	2	1	0	0	0	1	1	3	3	1	1	0	0	1	0	3	0
2-093	320	1	0	1	1	1	1	1	3	2	5	5	2	2	0	0	3	1	2	1
2-094	320	4	4	5	2	1	1	3	5	4	5	5	3	4	3	1	4	1	5	4
2-095	320	5	5	5	4	4	3	5	5	5	5	5	4	4	5	1	5	3	5	5
2-096	320	5	4	5	1	0	0	0	5	5	5	4	3	3	0	0	3	0	5	0
2-097	320	4	3	5	2	1	1	2	3	3	5	4	3	4	0	0	3	0	4	1
2-098	320	5	5	5	4	2	3	4	4	5	5	5	4	4	4	1	4	3	5	4
2-099	320	5	4	5	2	0	1	1	4	4	5	5	4	5	3	0	4	0	5	4
2-100	320	5	4	5	3	2	3	4	5	5	5	5	5	5	5	0	4	0	5	5
2-101	320	5	5	5	3	3	3	4	5	5	5	5	4	5	4	2	5	3	5	5
2-102	320	5	4	5	1	0	1	3	5	5	5	5	3	5	1	0	4	1	5	3
2-103	320	4	3	5	1	0	1	2	4	5	5	5	4	4	2	0	4	0	5	3
2-105	320	5	4	5	4	3	3	4	5	5	5	5	3	5	4	0	4	3	5	5
2-106	320	3	1	3	1	0	0	0	5	4	5	4	3	3	0	0	4	0	5	3
2-107	320	5	3	5	1	0	0	0	5	5	5	5	4	5	3	0	5	0	5	4
2-108	320	4	3	5	1	0	0	0	5	5	5	5	4	5	4	0	4	1	5	5
2-109	256	3	2	4	1	0	1	0	5	5	5	5	3	5	1	0	4	1	5	4
2-110	320	5	4	5	3	2	3	3	5	5	5	5	5	5	4	0	4	3	5	4
3-002	320	0	0	0	0	0	0	0	1	3	4	1	0	0	0	0	0	0	0	0
4-001	320	1	2	3	1	0	0	0	5	5	5	3	3	3	0	0	2	0	2	0
4-002	320	1	1	2	1	0	0	0	5	4	4	3	1	1	0	0	1	0	0	0
4-003	320	2	1	4	0	0	0	1	4	2	5	4	1	2	0	0	4	0	4	1
4-004	320	0	0	0	0	0	0	0	0	0	4	0	0	0	0	0	0	0	0	0
6-001	320	1	2	1	0	0	0	0	3	3	4	4	2	2	0	0	0	0	3	0
6-002	320	4	3	5	1	0	0	0	5	5	5	5	3	4	0	0	3	0	3	3
6-003	320	4	3	3	0	0	0	0	4	2	3	4	1	1	0	0	0	0	1	0
6-004	320	5	4	5	3	1	2	1	5	5	5	4	4	3	0	0	4	1	2	3
6-005	320	3	1	3	0	1	1	1	4	3	3	1	1	1	0	0	0	0	1	0
6-006	320	0	0	0	0	0	0	0	1	0	3	1	0	1	0	0	0	0	0	0
6-007	320	0	0	0	0	0	0	0	2	3	3	0	0	0	0	0	2	0	3	0

[表73]

N o .	処 理 薬 量 (g / h a)	F	G	H	I	J	K	L	M	N	O	P	Q	R	b	c	d	e	f	g
6-008	320	0	0	0	0	0	0	0	1	0	3	1	0	0	0	0	1	0	1	0
7-001	320	0	0	1	0	0	0	0	1	0	2	1	0	0	0	0	0	0	0	0
7-002	320	3	2	4	1	0	0	0	3	4	5	4	3	3	0	0	2	0	4	3

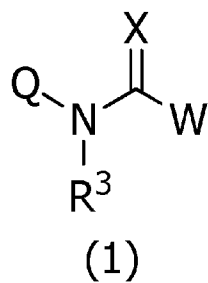
産業上の利用可能性

[0293] 本発明の複素環アミド化合物は新規な化合物であり、イネ用、トウモロコシ用、ダイズ用、麦用、ビート用及びナタネ用の選択性除草剤として有用である。

請求の範囲

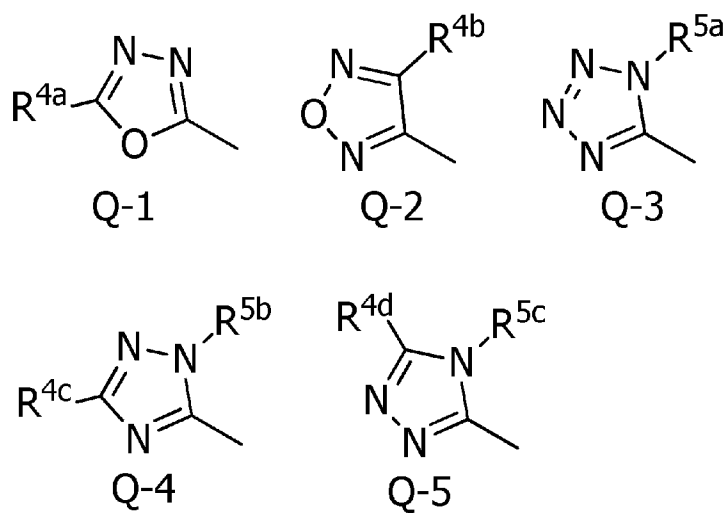
[請求項1] 式(1) :

[化1]



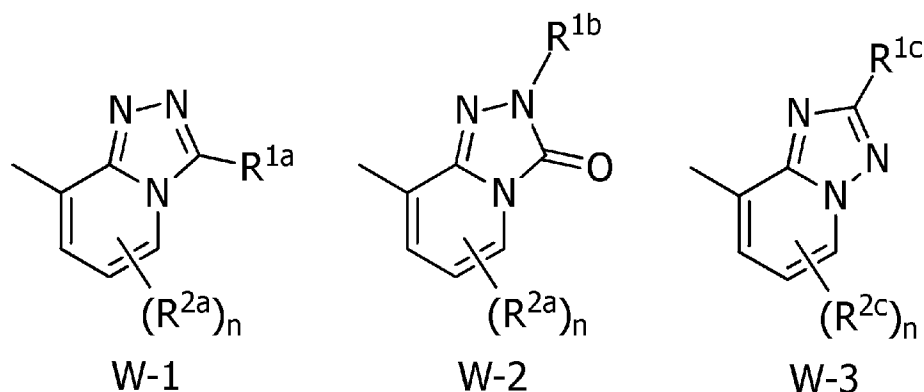
[式中、Qは、Q-1からQ-5の何れかで示される芳香族複素環を表し、

[化2]



Wは、W-1、W-2又はW-3で示される芳香族複素環を表し、

[化3]



Xは、酸素原子又は硫黄原子を表し、

R^{1a} は、水素原子、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^6 によって任意に置換された($C_1 \sim C_6$)アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 R^6 によって任意に置換された($C_3 \sim C_6$)シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルケニル、 $-C(O)R^8$ 、 $-C(O)OR^{16}$ 、シアノ、 $-OR^9$ 、 $-S(O)_{m1}R^{10}$ 、 $-N(R^{11})R^{12}$ 、 $-C(=NR^{12b})R^{8b}$ 、フェニル、 $(R^7)_p$ によって置換されたフェニル、ナフチル又はU-1からU-25の何れかの基を表し、

R^{1b} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^6 によって任意に置換された($C_1 \sim C_6$)アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 R^6 によって任意に置換された($C_3 \sim C_6$)シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、フェニル、 $(R^7)_p$ によって置換されたフェニル、ナフチル、5-6員ヘテロアリール、(R^{28} 及び R^{28a} によって任意に置換された)5-6員ヘテロアリール、3-7員ヘテロシクリル又は(R^{28} 及び R^{28a} によって任意に置換された)3-7員ヘテロシクリルを表し、

R^{1c} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^{2a} は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $-C(O)R^{18}$ 、 $-C(O)OR^{24}$ 、シアノ、ニトロ、 $-OR^{19}$

9 、 $-S(O)_{m3}R^{20}$ 、 $-N(R^{21})R^{22}$ 、フェニル又は $(R^7)_p$ によって置換されたフェニルを表し、 n が2以上の整数を表すとき、各々の R^{2a} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、更に、2つの R^{2a} が隣接する場合には、隣接する2つの R^{2a} は、 $-CH=CH-CH=CH-$ を形成することにより、それぞれの R^{2a} が結合する炭素原子と共に6員環を形成してもよく、

R^{2c} は、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルを表し、

R^3 は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{27} によって任意に置換された $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $-C(O)R^{25}$ 又は $-C(O)OR^{26}$ を表し、

R^{4a} は、水素原子、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{27} によって任意に置換された $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 R^{27} によって任意に置換された $(C_3 \sim C_6)$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルケニル、 $-NH_2$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノ、ジ $(C_1 \sim C_6)$ アルキルアミノ、 $-NHC(O)R^8$ 、フェニル、 $(R^{28})_r$ によって置換されたフェニル、5-6員ヘテロアリール、 $(R^{28}$ 及び R^{28a} によって任意に置換された)5-6員ヘテロアリール、3-7員ヘテロシクリル又は $(R^{28}$ 及び R^{28a} によって任意に置換された)3-7員ヘテロシクリルを表し、

R^{4b} は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{27} によって任意に置換された $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 R^{27} によって任意に置換された $(C_3 \sim C_6)$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロア

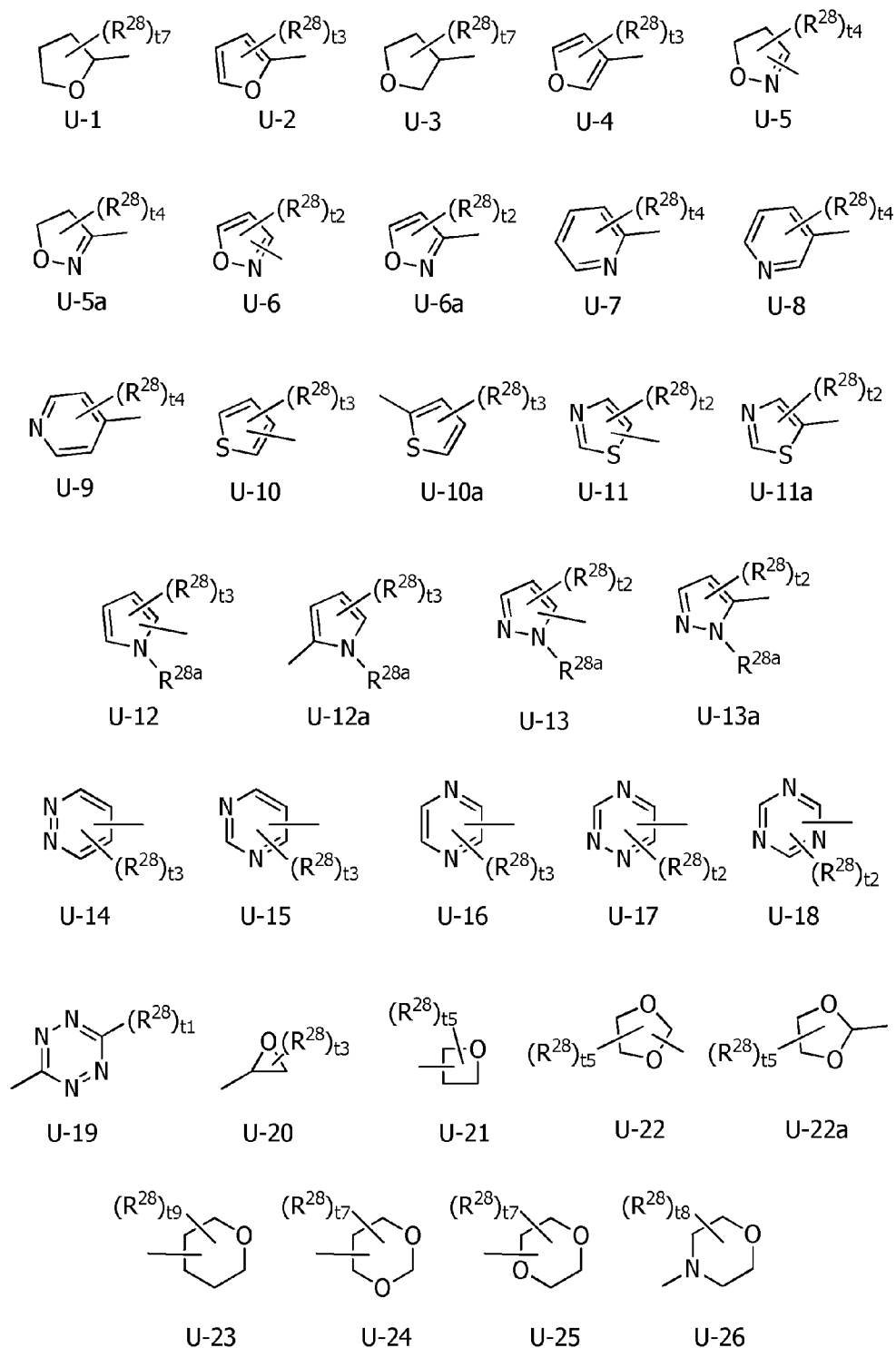
ルケニル、 $-C(O)OR^{16}$ 、 $-OR^{38}$ 、 $-S(O)_{m3}R^{20}$ 、 $-NH_2$ 、 $C_1\sim C_6$ アルキルアミノ、ジ($C_1\sim C_6$ アルキル)アミノ、 $-NHC(O)R^8$ 、フェニル、 $(R^{28})_r$ によって置換されたフェニル、5-6員ヘテロアリール、 $(R^{28}$ 及び R^{28a} によって任意に置換された)5-6員ヘテロアリール、3-7員ヘテロシクリル又は $(R^{28}$ 及び R^{28a} によって任意に置換された)3-7員ヘテロシクリルを表し、

R^{4c} は、水素原子、ハロゲン原子、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 R^{27} によって任意に置換された($C_1\sim C_6$)アルキル、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキル、 R^{27} によって任意に置換された($C_3\sim C_6$)シクロアルキル、フェニル、 $(R^{28})_r$ によって置換されたフェニル、5-6員ヘテロアリール、 $(R^{28}$ 及び R^{28a} によって任意に置換された)5-6員ヘテロアリール、3-7員ヘテロシクリル又は $(R^{28}$ 及び R^{28a} によって任意に置換された)3-7員ヘテロシクリルを表し、

R^{4d} は、水素原子、 $C_1\sim C_6$ アルキル又は R^{35} によって任意に置換された($C_1\sim C_6$)アルキルを表し、

U-1乃至U-6、U-6a、U-7乃至U-10、U-10a、U-11、U-11a、U-12、U-12a、U-13、U-13a、U-14乃至U-22、U-22a、U-23、U-24、U-25、U-26は、それぞれ以下の構造で表される複素環を表し、

[化4]



R^{5a} 及び R^{5b} は、各々独立して水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{27} によって任意に置換された ($C_1 \sim C_6$) アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 C_2

～C₆ハロアルケニル、C₂～C₆アルキニル、C₂～C₆ハロアルキニル、C₃～C₆シクロアルケニル、フェニル又は(R²⁸)_rによって置換されたフェニルを表し、

R^{5c}は、水素原子、C₁～C₆アルキル又はR³⁶によって任意に置換された(C₁～C₆)アルキルを表すか、或いはR^{5c}は、R^{4d}とー(CH₂)₄ー又はーCH=CHーCH=CHーを形成することにより、R^{5c}が結合する窒素原子及びR^{4d}が結合する炭素原子と共に6員環を形成してもよく、

R⁶は、ハロゲン原子、シアノ、C₃～C₆シクロアルキル、ーC(O)R⁸、ーC(O)OR¹⁶、ーOR¹³、ーS(O)_{m2}R¹⁴、フェニル又は(R⁷)_pによって置換されたフェニルを表し、

R⁷は、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、C₁～C₆アルキル、R²⁷によって任意に置換された(C₁～C₆)アルキル、C₃～C₆シクロアルキル、C₃～C₆ハロシクロアルキル、C₂～C₆アルケニル、C₂～C₆ハロアルケニル、C₂～C₆アルキニル、C₂～C₆ハロアルキニル、C₃～C₆シクロアルケニル、C₁～C₆アルキルカルボニル、C₃～C₆シクロアルキルカルボニル、C₁～C₆ハロアルキルカルボニル、C₃～C₆ハロシクロアルキルカルボニル、C₁～C₆アルコキシカルボニル、C₁～C₆ハロアルコキシカルボニル、C₁～C₆アルキルアミノカルボニル、C₁～C₆ハロアルキルアミノカルボニル、ジ(C₁～C₆アルキルアミノ)カルボニル、ーOR¹⁵、ーS(O)_{m3}R²⁰、C₁～C₆アルキルアミノスルホニル、ジ(C₁～C₆アルキル)アミノスルホニル、ーNH₂、C₁～C₆アルキルアミノ、ジ(C₁～C₆アルキル)アミノ、5ー6員ヘテロアリール、(R²⁸及びR^{28a}によって任意に置換された)5ー6員ヘテロアリール、3ー7員ヘテロシクリル又は(R²⁸及びR^{28a}によって任意に置換された)3ー7員ヘテロシクリルを表し、

R⁸は、水素原子、C₁～C₆アルキル又はーN(R^{11a})R^{12a}を

表し、

R^{8b} は、水素原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^9 は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又はフェニルを表し、

R^{10} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{34} によって任意に置換された($C_1 \sim C_6$)アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル又は $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニルを表し、

R^{11} 及び R^{12} は、各々独立して水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{34} によって任意に置換された($C_1 \sim C_6$)アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、フェニルスルホニル、フェニル、 $(R^7)_p$ によって置換されたフェニル、U-7、U-8、U-9又はU-14乃至U-19を表すか、或いは、 R^{11} は R^{12} と一緒に becoming $C_2 \sim C_6$ アルキレン鎖を形成することにより、 R^{11} 及び R^{12} が結合する窒素原子と共に3～7員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖はO、S、S(O)、S(O)₂又はN(R^{33})を1個含んでもよく、且つオキソ基又はチオキソ基によって置換されていてもよく、

R^{11a} 及び R^{12a} は、各々独立して水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又はフェニルを表すか、或いは、 R^{11a} は R^{12a} と一緒に becoming $C_2 \sim C_6$ アルキレン鎖を形成することにより、 R^{11a} 及び R^{12a} が結合する窒素原子と共に3～7員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖はO、S、S(O)、S(O)₂又はN(R^{33})を1個含んでもよく、且つオキソ基又はチオキソ基によって置換されていてもよく、

R^{12b} は、 $-OR^{19b}$ を表し、

R^{13} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{34} によって任意に置換された($C_1 \sim C_6$)アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロ

アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $-C$
(O) R^8 又はフェニルを表し、

R^{14} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{34} によって任意に置換された($C_1 \sim C_6$)アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル又はフェニルを表し、

R^{15} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{27} によって任意に置換された($C_1 \sim C_6$)アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル又は $C_3 \sim C_6$ シクロアルケニルを表し、

R^{16} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は R^{37} によって任意に置換された($C_1 \sim C_6$)アルキルを表し、

R^{18} は、水素原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^{19} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又はフェニルを表し、

R^{19b} は、水素原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^{20} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル又は $C_3 \sim C_6$ シクロアルケニルを表し、

R^{21} 及び R^{22} は、各々独立して水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又はフェニルを表すか、或いは、 R^{21} は R^{22} と一緒になって $C_2 \sim C_6$ アルキレン鎖を形成することにより、 R^{21} 及び R^{22} が結合する窒素原子と共に3～7員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖はO、S、S(O)、S(O)₂又はN(R^{39})を1個含んでもよく、且つオキソ基又はチオキソ基によって置換されていてもよく、

R^{24} は、水素原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^{25} 及び R^{26} は、各々独立しては、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルケニル又はフェニルを表し、

R^{27} は、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、フェニル、 $(R^{28})_r$ によって置換されたフェニル、 $-C(O)OR^{16}$ 、 $-OR^{29}$ 、 $-S(O)_{m4}R^{30}$ 、5-6員ヘテロアリール、 $(R^{28}$ 及び R^{28a} によって任意に置換された) 5-6員ヘテロアリール、3-7員ヘテロシクリル又は $(R^{28}$ 及び R^{28a} によって任意に置換された) 3-7員ヘテロシクリルを表し、

R^{28} は、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $(C_1 \sim C_6$ アルコキシ) $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-OR^{31}$ 又は $-S(O)_{m4}R^{30}$ を表し、 t_2 、 t_3 、 t_4 、 t_5 、 t_7 、 t_8 又は t_9 が2以上の整数を表すとき、各々の R^{28} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、更に2つの R^{28} が隣接する場合には、隣接する2つの R^{28} は一緒になって $-CH=CH-CH=CH-$ を形成することにより、それぞれの R^{28} が結合する炭素原子と共に6員環を形成してもよく、

R^{28a} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $(C_1 \sim C_6$ アルコキシ) $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $(C_1 \sim C_6$ アルキルチオ) $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^{29} 、 R^{30} 及び R^{31} は、各々独立して、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シク

ロアルケニル又はフェニルを表し、

R^{33} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し

R^{34} は、ハロゲン原子、シアノ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $-C(O)R^8$ 、 $-C(O)OR^{16}$ 、 $-OR^{33}$ 、 $-S(O)_{m6}R^{33}$ 、フェニル、 $(R^7)_p$ によって置換されたフェニル、 $U-1$ 、 $U-3$ 、 $U-7$ 、 $U-8$ 、 $U-9$ 又は $U-14$ 乃至 $U-25$ を表し、

R^{35} は、ハロゲン原子又は $C_1 \sim C_6$ アルコキシを表し、

R^{36} は、ハロゲン原子又は $C_1 \sim C_6$ アルコキシを表し、

R^{37} は、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシを表し、

R^{38} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{34} によって任意に置換された($C_1 \sim C_6$)アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルケニル又はフェニルを表し、

R^{39} は、水素原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

t_1 は、0又は1の整数を表し

m_1 、 m_2 、 m_3 、 m_4 、 m_6 及び t_2 は、各々独立して0、1又は2の整数を表し、

n 及び t_3 は、各々独立して0、1、2又は3の整数を表し、

p 及び r は、各々独立して1、2、3、4又は5の整数を表し、

t_4 は、0、1、2、3又は4の整数を表し、

t_5 は、0、1、2、3、4又は5の整数を表し、

t_7 は、0、1、2、3、4、5、6又は7の整数を表し、

t_8 は、0、1、2、3、4、5、6、7又は8の整数を表し、

t_9 は、0、1、2、3、4、5、6、7、8又は9の整数を表す

。]で表される複素環アミド化合物又はその塩。

[請求項2]

W は、 $W-1$ 又は $W-2$ で示される芳香族複素環を表し、

R^{2a} は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、

—C(O)R¹⁸、—C(O)OR²⁴、シアノ、ニトロ、—OR¹⁹又は—S(O)_{m3}R²⁰を表し、nが2以上の整数を表すとき、各々のR^{2a}は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよい請求項1記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[請求項3]

R^{1b}は、水素原子、C₁～C₆アルキル、R⁶によって任意に置換された(C₁～C₆)アルキル、C₃～C₆シクロアルキル、R⁶によって任意に置換された(C₃～C₆)シクロアルキル、C₂～C₆アルケニル、C₂～C₆アルキニル、フェニル、(R⁷)_pによって置換されたフェニル、ナフチル又はU-1からU-25の何れかの基を表し、

R^{4a}は、水素原子、ハロゲン原子、C₁～C₆アルキル、R²⁷によって任意に置換された(C₁～C₆)アルキル、C₃～C₆シクロアルキル、R²⁷によって任意に置換された(C₃～C₆)シクロアルキル、C₂～C₆アルケニル、C₂～C₆ハロアルケニル、C₂～C₆アルキニル、C₂～C₆ハロアルキニル、C₃～C₆シクロアルケニル、—NH₂、C₁～C₆アルキルアミノ、ジ(C₁～C₆アルキル)アミノ、—NHC(O)R⁸、フェニル、(R²⁸)_rによって置換されたフェニル又はU-1からU-26の何れかの基を表し、

R⁷は、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、C₁～C₆アルキル、R²⁷によって任意に置換された(C₁～C₆)アルキル、C₃～C₆シクロアルキル、C₃～C₆ハロシクロアルキル、C₂～C₆アルケニル、C₂～C₆ハロアルケニル、C₂～C₆アルキニル、C₂～C₆ハロアルキニル、C₃～C₆シクロアルケニル、C₁～C₆アルキルカルボニル、C₃～C₆シクロアルキルカルボニル、C₁～C₆ハロアルキルカルボニル、C₃～C₆ハロシクロアルキルカルボニル、C₁～C₆アルコキシカルボニル、C₁～C₆ハロアルコキシカルボニル、C₁～C₆アルキルアミノカルボニル、C₁～C₆ハロアルキルアミノカルボニル、ジ(C₁～C₆アルキルアミノ)カルボニル、—OR¹⁵、—S(O)_{m3}R²⁰、C₁～C₆アルキルアミノスルホニル、ジ(C₁～C₆アルキル)ア

ミノスルホニル、 $-NH_2$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノ、ジ($C_1 \sim C_6$ アルキル)アミノ又はU-1からU-26の何れかの基を表し、

R^{27} は、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、フェニル、 $(R^{28})_r$ によって置換されたフェニル、 $-C(O)OR^{16}$ 、 $-OR^{29}$ 、 $-S(O)_{m4}R^{30}$ 又はU-1からU-26の何れかの基を表す請求項2記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[請求項4]

R^{1a} は、水素原子、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^6 によって任意に置換された($C_1 \sim C_6$)アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 R^6 によって任意に置換された($C_3 \sim C_6$)シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルケニル、 $-C(O)R^8$ 、 $-OR^9$ 、 $-S(O)_{m1}R^{10}$ 、 $-N(R^{11})R^{12}$ 、 $-C(=NR^{12b})R^{8b}$ 、フェニル、 $(R^7)_p$ によって置換されたフェニル、U-3、U-5a、U-6a、U-7、U-8、U-10a、U-11a、U-12a、又はU-13aを表し、

R^{1b} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は R^6 によって任意に置換された($C_1 \sim C_6$)アルキルを表し、

R^{2a} は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $-S(O)_{m3}R^{20}$ 、 n が2以上の整数を表すとき、各々の R^{2a} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^3 は、水素原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^{4a} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{27} によって任意に置換された($C_1 \sim C_6$)アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、フェニル、 $(R^{28})_r$ によって置換されたフェニル、U-1、U-2、U-7、U-10a又はU-26で示される複素環を表し、

R^{4b} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^{4c} は、水素原子を表し、

R^{4d} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^{5a} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{27} によって任意に置換

された ($C_1 \sim C_6$) アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル又はフェニルを表し、

R^{5b} は、水素原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^{5c} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルを表すか、或いは R^{5c} は、 R^{4d} と $-(CH_2)_4-$ 又は $-CH=CH-CH=CH-$ を形成することにより、 R^{5c} が結合する窒素原子及び R^{4d} が結合する炭素原子と共に6員環を形成してもよく、

R^7 は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{27} によって任意に置換された ($C_1 \sim C_6$) アルキル又は $-OR^{15}$ を表し、

R^{8b} は、水素原子を表し、

R^9 は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^{10} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{34} によって任意に置換された ($C_1 \sim C_6$) アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル又は $C_2 \sim C_6$ アルキニルを表し、

R^{11} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{34} によって任意に置換された ($C_1 \sim C_6$) アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、フェニルスルホニル、フェニル、 $(R^7)_p$ によって置換されたフェニル又は $U-7$ を表し、

R^{12} は、水素原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^{11} は R^{12} と一緒になって $C_4 \sim C_5$ アルキレン鎖を形成することにより、 R^{11} 及び R^{12} が結合する窒素原子と共に5～6員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖はO、S、S(O)又はS(O)₂を1個含んでもよく、

R^{11a} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^{12a} は、水素原子を表し、

R^{13} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{34} によって任意に置換された ($C_1 \sim C_6$) アルキル、 $-C(O)R^8$ 又はフェニルを表し、

R^{14} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は R^{34} によって任意に置換された (

$C_1 \sim C_6$) アルキルを表し、

R^{15} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^{19b} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^{20} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^{27} は、ハロゲン原子、フェニル、 $(R^{28})_r$ によって置換されたフェニル、 $-OR^{29}$ 、 $-C(O)OR^{16}$ 又は $-S(O)_{m4}R^{30}$ を表し、

R^{28} は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $-OR^{31}$ を表し、
 t_2 、 t_3 、 t_4 、 t_5 又は t_7 が2以上の整数を表すとき、各々の
 R^{28} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、更に2
 つの R^{28} が隣接する場合には、隣接する2つの R^{28} は一緒になって
 $-CH=CH-CH=CH-$ を形成することにより、それぞれの R^{28}
 8 が結合する炭素原子と共に6員環を形成してもよく、

R^{29} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^{30} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^{31} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^{33} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^{34} は、ハロゲン原子、シアノ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $-C(O)R^8$ 、 $-C(O)OR^{16}$ 、 $-OR^{33}$ 、 $-S(O)_{m6}R^{33}$ 、フェニル、 $(R^7)_p$ によって置換されたフェニル、U-1、U-8又はU-22aを表す請求項3記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[請求項5]

Qは、Q-1で示される芳香族複素環を表し、

Wは、W-1で示される芳香族複素環を表す請求項4記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[請求項6]

Xは、酸素原子を表し、

R^{1a} は、水素原子、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^6 によって任意に置換された($C_1 \sim C_6$) アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 R^6 によって任意に置換された($C_3 \sim C_6$) シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$

アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルケニル、 $-C(O)R^8$ 、 $-OR^9$ 、 $-S(O)_{m1}R^{10}$ 、 $-N(R^{11})R^{12}$ 、 $-C(=NR^{12b})R^{8b}$ 、フェニル、 $(R^7)_p$ によって置換されたフェニル、U-5 a、U-6 a、U-7、U-8、U-10 a、U-11 a、U-12 a、又はU-13 aを表し、

R^{2a} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $-S(O)_{m3}R^{20}$ 、 n が2以上の整数を表すとき、各々の R^{2a} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^6 は、ハロゲン原子、シアノ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $-C(O)R^8$ 、 $-C(O)OR^{16}$ 、 $-OR^{13}$ 、 $-S(O)_{m2}R^{14}$ 又は $(R^7)_p$ によって置換されたフェニルを表し、

R^{27} は、ハロゲン原子、フェニル、 $-OR^{29}$ 又は $-S(O)_{m4}R^{30}$ を表す請求項5記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[請求項7] R^{4a} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{27} によって任意に置換された $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルを表し、

R^{27} は、ハロゲン原子、 $-OR^{29}$ を表す請求項6記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[請求項8] Qは、Q-3で示される芳香族複素環を表し、

Wは、W-1で示される芳香族複素環を表す請求項4記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[請求項9] R^{1a} は、水素原子、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^6 によって任意に置換された $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 R^6 によって任意に置換された $(C_3 \sim C_6)$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $-C(O)R^8$ 、 $-S(O)_{m1}R^{10}$ 、 $-N(R^{11})R^{12}$ 、フェニル、 $(R^7)_p$ によって置換されたフェニル、U-3、U-5 a、U-6 a、U-8、U-10 a、又はU-13 aを表し、

R^{2a} は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキ

ルを表し、 n が2以上の整数を表すとき、各々の R^{2a} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^6 は、ハロゲン原子、 $-C(O)OR^{16}$ 、 $-OR^{13}$ 、 $-S(O)_{m2}R^{14}$ 又は $(R^7)_p$ によって置換されたフェニルを表し、

R^7 は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $-OR^{15}$ を表し、

R^8 は、水素原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^{11} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{34} によって任意に置換された($C_1 \sim C_6$)アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、フェニル又は $(R^7)_p$ によって置換されたフェニルを表し、

R^{11} は R^{12} と一緒にあって C_5 アルキレン鎖を形成することにより、 R^{11} 及び R^{12} が結合する窒素原子と共に6員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖はO、S、 $S(O)$ 又は $S(O)_2$ を1個含んでもよく、

R^{16} は、水素原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^{27} は、 $(R^{28})_r$ によって置換されたフェニル、 $-OR^{29}$ 、 $-C(O)OR^{16}$ 又は $-S(O)_{m4}R^{30}$ を表し、

R^{28} は、ハロゲン原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^{34} は、ハロゲン原子、シアノ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $-OR^{33}$ 、 $-S(O)_{m6}R^{33}$ 、フェニル、 $(R^7)_p$ によって置換されたフェニル、U-1又はU-8を表す請求項8記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[請求項10] R^{5a} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{27} によって任意に置換された($C_1 \sim C_6$)アルキル又は $C_2 \sim C_6$ アルケニルを表し、

R^{27} は、 $-OR^{29}$ 又は $-S(O)_{m4}R^{30}$ を表す請求項9記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[請求項11] 請求項1～請求項2記載の複素環アミド化合物及びその塩から選ばれる1種又は2種以上を有効成分として含有する農薬。

[請求項12] 請求項1～請求項2記載の複素環アミド化合物及びその塩から選ばれる1種又は2種以上を有効成分として含有する除草剤。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2014/064492

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

C07D471/04(2006.01)i, A01N43/90(2006.01)i, A01P13/02(2006.01)i

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)

C07D471/04, A01N43/90, A01P13/02

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)

CAPLUS/REGISTRY (STN)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	WO 2012/028579 A1 (BAYER CROPSCIENCE AG), 08 March 2012 (08.03.2012), entire text; particularly, claim 1 & JP 2013-536817 A & US 2012/0058892 A1 & EP 2611785 A & AU 2011298424 A & CA 2809487 A & CN 103282354 A & EA 201390265 A & MX 2013001937 A & KR 10-2013-0101506 A & UY 33583 A & TW 201221059 A & AR 82828 A & CO 6670599 A	1-12
A	WO 2012/123409 A1 (BAYER CROPSCIENCE AG), 20 September 2012 (20.09.2012), entire text; particularly, claim 1 & EP 2686315 A & AU 2012228355 A & CA 2830089 A & MX 2013010395 A & CN 103596945 A & AR 85678 A	1-12

☒ Further documents are listed in the continuation of Box C.

☐ See patent family annex.

* Special categories of cited documents:

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier application or patent but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search
06 August, 2014 (06.08.14)

Date of mailing of the international search report
19 August, 2014 (19.08.14)

Name and mailing address of the ISA/
Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2014/064492

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 2012/123416 A1 (BAYER CROPSCIENCE AG), 20 September 2012 (20.09.2012), entire text; particularly, claim 1 & EP 2686316 A & CN 103459386 A & AR 85811 A	1-12
A	WO 2012/126932 A1 (BAYER CROPSCIENCE AG), 27 September 2012 (27.09.2012), entire text; particularly, claim 1 & EP 2688885 A & AU 2012230388 A & CA 2830773 A & MX 2013010678 A & CN 103596946 A & AR 85469 A	1-12
A	WO 2013/017559 A1 (BAYER INTELLECTUAL PROPERTY GMBH), 07 February 2013 (07.02.2013), entire text; particularly, claim 1 & AR 87385 A1 & CN 103717581 A & EP 2739611 A1	1-12
A	WO 2013/064457 A1 (BAYER INTELLECTUAL PROPERTY GMBH), 10 May 2013 (10.05.2013), entire text; particularly, claim 1 & EP 2589598 A1	1-12
A	WO 2013/072402 A1 (BASF SE), 23 May 2013 (23.05.2013), entire text; particularly, claim 1 (Family: none)	1-12
A	JP 2007-506788 A (Rigel Pharmaceuticals, Inc.), 22 March 2007 (22.03.2007), entire text; particularly, claim 1 & US 2005/0090521 A1 & US 2007/0149520 A1 & EP 1668009 A & WO 2005/030774 A1 & CA 2540021 A	1-12

A. 発明の属する分野の分類（国際特許分類（I P C））

Int.Cl. C07D471/04(2006.01)i, A01N43/90(2006.01)i, A01P13/02(2006.01)i

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料（国際特許分類（I P C））

Int.Cl. C07D471/04, A01N43/90, A01P13/02

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

国際調査で使用した電子データベース（データベースの名称、調査に使用した用語）

CAplus/REGISTRY (STN)

C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求項の番号
A	WO 2012/028579 A1 (BAYER CROPSCIENCE AG) 2012.03.08, 文献全体、特に、請求項 1 参照 & JP 2013-536817 A & US 2012/0058892 A1 & EP 2611785 A & AU 2011298424 A & CA 2809487 A & CN 103282354 A & EA 201390265 A & MX 2013001937 A & KR 10-2013-0101506 A & UY 33583 A & TW 201221059 A & AR 82828 A & CO 6670599 A	1 - 1 2
A	WO 2012/123409 A1 (BAYER CROPSCIENCE AG) 2012.09.20, 文献全体、特に、請求項 1 参照 & EP 2686315 A & AU 2012228355 A & CA 2830089 A & MX 2013010395 A & CN 103596945 A & AR 85678 A	1 - 1 2

☒ C 欄の続きにも文献が列挙されている。☐ パテントファミリーに関する別紙を参照。

* 引用文献のカテゴリー

「A」特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの

「E」国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの

「L」優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献（理由を付す）

「O」口頭による開示、使用、展示等に言及する文献

「P」国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献

「T」国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの

「X」特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの

「Y」特に関連のある文献であって、当該文献と他の 1 以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの

「&」同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日

0 6 . 0 8 . 2 0 1 4

国際調査報告の発送日

1 9 . 0 8 . 2 0 1 4

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁（I S A / J P）

郵便番号 1 0 0 - 8 9 1 5

東京都千代田区霞が関三丁目 4 番 3 号

特許庁審査官（権限のある職員）

谷尾 忍

4 P

9 5 5 0

電話番号 0 3 - 3 5 8 1 - 1 1 0 1 内線 3 4 9 2

C (続き) . 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求項の番号
A	WO 2012/123416 A1 (BAYER CROPSCIENCE AG) 2012. 09. 20, 文献全体、特に、請求項 1 参照 & EP 2686316 A & CN 103459386 A & AR 85811 A	1 - 1 2
A	WO 2012/126932 A1 (BAYER CROPSCIENCE AG) 2012. 09. 27, 文献全体、特に、請求項 1 参照 & EP 2688885 A & AU 2012230388 A & CA 2830773 A & MX 2013010678 A & CN 103596946 A & AR 85469 A	1 - 1 2
A	WO 2013/017559 A1 (BAYER INTELLECTUAL PROPERTY GMBH) 2013. 02. 07, 文献全体、特に、請求項 1 参照 & AR 87385 A1 & CN 103717581 A & EP 2739611 A1	1 - 1 2
A	WO 2013/064457 A1 (BAYER INTELLECTUAL PROPERTY GMBH) 2013. 05. 10, 文献全体、特に、請求項 1 参照 & EP 2589598 A1	1 - 1 2
A	WO 2013/072402 A1 (BASF SE) 2013. 05. 23, 文献全体、特に、請求項 1 参照 (ファミリーなし)	1 - 1 2
A	JP 2007-506788 A (ライジェル ファーマシューティカルズ, インコーポレイテッド) 2007. 03. 22, 文献全体、特に、請求項 1 参照 & US 2005/0090521 A1 & US 2007/0149520 A1 & EP 1668009 A & WO 2005/030774 A1 & CA 2540021 A	1 - 1 2