

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 公表特許公報(A)

(11) 特許出願公表番号

特表2004-529943

(P2004-529943A)

(43) 公表日 平成16年9月30日(2004.9.30)

(51) Int.Cl.<sup>7</sup>

A O 1 N 43/42

C O 7 D 215/40

C O 7 D 401/12

F I

A O 1 N 43/42

C O 7 D 215/40

C O 7 D 401/12

テーマコード (参考)

4 C O 3 1

4 C O 6 3

4 H O 1 1

審査請求 未請求 予備審査請求 有 (全 168 頁)

(21) 出願番号 特願2002-588757 (P2002-588757)  
 (86) (22) 出願日 平成14年5月14日 (2002.5.14)  
 (85) 翻訳文提出日 平成15年11月13日 (2003.11.13)  
 (86) 国際出願番号 PCT/US2002/018394  
 (87) 国際公開番号 W02002/091830  
 (87) 国際公開日 平成14年11月21日 (2002.11.21)  
 (31) 優先権主張番号 60/290,884  
 (32) 優先日 平成13年5月15日 (2001.5.15)  
 (33) 優先権主張国 米国 (US)

(71) 出願人 390023674  
 イー・アイ・デュポン・ドウ・ヌムール・  
 アンド・カンパニー  
 E. I. DU PONT DE NEMO  
 URS AND COMPANY  
 アメリカ合衆国、デラウェア州、ウイルミ  
 ントン、マーケット・ストリート 100  
 7  
 (74) 代理人 100060782  
 弁理士 小田島 平吉  
 (72) 発明者 ソング, イング  
 アメリカ合衆国デラウェア州19707ホ  
 ッケシン・トンブソンドライブ161  
 Fターム(参考) 4C031 KA03  
 4C063 AA01 BB09 CC14 DD12 EE03  
 最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 殺菌・殺カビ剤としてのピリジニル縮合二環式アミド

## (57) 【要約】

本発明は、植物もしくはその一部に、または植物の種子もしくは実生に、殺菌・殺カビ的に有効な量の式 I (式中、A は N - C = C と一緒になって置換された縮合ピリジニル環を形成し、B は置換されたフェニルまたはピリジニル環であり、J は少なくとも 1 つの炭素構成員を含み、場合により 1 つもしくは 2 つの炭素構成員を C (= O) として含んでいてもよく、かつ場合により窒素および酸素から選択される 1 つの構成員を含んでいてもよく、場合により置換されていてもよい 2 ~ 5 員の連結鎖であり、W は C = L または S O<sub>n</sub> であり、L は O または S であり、R<sup>1</sup> は H ; またはそれぞれ場合により置換されていてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルケニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキニルもしくは C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub> シクロアルキルであり、R<sup>3</sup> は H ; または C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルケニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキニルもしくは C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub> シクロアルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキルカルボニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルコキシカルボニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキルアミノカルボニルもしくは C<sub>3</sub> ~ C<sub>8</sub> ジアルキルアミノカルボニルであり、そして n は 1 または 2 である) で表される化合物 (全ての幾何異性体および立体異性体を含む)、それらの N - オキシド、農業的に適する塩、および組成物を適用することを含んでなる菌・カビ性植物病原体により引き起こされる植物病害の抑制方法に関する。本発明は、また、式 I で表される化合物、それらの N - オキシドおよび農業的に適する塩を含んでなる殺菌・殺カビ性組成物を包含する。本発明は、また、B が置換されたフェニル環であり、W が C = O または S O<sub>2</sub> であり、R<sup>3</sup> が H であり、かつ J が未置換であるかまたはアルキル、アルコキシ、アリールもしくはアラルキルからなる群より選択される 1 ~ 3 つの置換基により置換された炭素数 2 ~ 4 の飽和鎖である場合、化合物

10

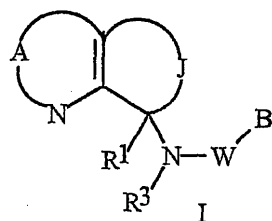
20

## 【特許請求の範囲】

## 【請求項 1】

植物もしくはその一部に、または植物の種子もしくは実生に、殺菌・殺カビ的に有効な量の式 I

## 【化 1】



10

[ 式中、

A は N - C = C と一緒になって置換された縮合ピリジニル環を形成し、

B は置換されたフェニルまたはピリジニル環であり、

J は少なくとも 1 つの炭素構成員を含み、場合により 1 つもしくは 2 つの炭素構成員を C (= O) として含んでいてもよく、かつ場合により窒素および酸素から選択される 1 つの構成員を含んでいてもよい、場合により置換されていてもよい 2 ~ 5 員の連結鎖であり、

W は C = L または S O<sub>n</sub> であり、

20

L は O または S であり、

R<sup>1</sup> は H ; またはそれぞれ場合により置換されていてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルケニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキニルもしくは C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub> シクロアルキルであり、

R<sup>3</sup> は H ; または C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルケニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキニルもしくは C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub> シクロアルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキルカルボニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルコキシカルボニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキルアミノカルボニルもしくは C<sub>3</sub> ~ C<sub>8</sub> ジアルキルアミノカルボニルであり、そして

n は 1 または 2 である ]

で表される化合物、それらの N - オキシド、農業的に適する塩および組成物を適用することを含んでなる菌・カビ性植物病原体により引き起こされる植物病害の抑制方法。

30

## 【請求項 2】

A が N - C = C と一緒になって R<sup>5</sup> から独立して選択される 1 つもしくは 2 つの置換基により置換された縮合ピリジニル環を形成し、

B が R<sup>6</sup> から独立して選択される 1 ~ 3 つの置換基により置換され、

J が少なくとも 1 つの炭素構成員を含み、場合により 1 つもしくは 2 つの炭素構成員を C (= O) として含んでいてもよく、かつ場合により窒素または酸素から選択される 1 つの構成員を含んでいてもよく、場合により C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub> アルキル、ハロゲン、CN、NO<sub>2</sub> および C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub> アルコキシからなる群より選択される 1 つもしくはそれ以上の置換基により置換されていてもよい 2 ~ 5 員の連結鎖であり、

R<sup>1</sup> が H ; またはそれぞれ場合によりハロゲン、CN、NO<sub>2</sub>、ヒドロキシ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルコキシ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルチオ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルスルホニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>4</sub> アルコキシカルボニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルアミノ、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> ジアルキルアミノおよび C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub> シクロアルキルアミノからなる群より選択される 1 つもしくはそれ以上の置換基により置換されていてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルケニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキニルもしくは C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub> シクロアルキルであり、

40

各 R<sup>5</sup> および各 R<sup>6</sup> が、独立して、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルケニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキニル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub> シクロアルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> ハロアルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> ハロアルケニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> ハロアルキニル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub> ハロシクロアルキル、ハロゲン、CN、CO<sub>2</sub>H、CONH<sub>2</sub>、NO<sub>2</sub>、ヒドロキシ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルコキシ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ハロアルコキシ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルチオ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルスルホニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ハ

50

ロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ ジアルキルアミノ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルアミノ、 $C_2 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_8$ ジアルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_6$ トリアルキルシリルであるか、あるいは

各 $R^5$ および各 $R^6$ が、独立して、それぞれの環が場合により $R^7$ から独立して選択される1～3つの基により置換されていてもよいフェニル環、5員もしくは6員芳香族複素環、ベンジル環またはフェノキシ環であり、そして

各 $R^7$ が、独立して、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_2 \sim C_4$ アルケニル、 $C_2 \sim C_4$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_4$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_4$ ハロアルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルキル、ハロゲン、CN、NO<sub>2</sub>、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ ジアルキルアミノ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルアミノ、 $C_3 \sim C_6$ (アルキル)シクロアルキルアミノ、 $C_2 \sim C_4$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_8$ ジアルキルアミノカルボニルまたは $C_3 \sim C_6$ トリアルキルシリルである、

請求項1に記載の方法。

#### 【請求項3】

WがC=Oであり、

Jが-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-、-OCH<sub>2</sub>-、-OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-、-OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>NHCH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>N( $C_1 \sim C_2$ アルキル)CH<sub>2</sub>-、-CONHCO-および-CON( $C_1 \sim C_2$ アルキル)CO-から選択され、そして

各 $R^5$ および各 $R^6$ が、独立して、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルキル、ハロゲン、CN、NO<sub>2</sub>、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニルまたは $C_3 \sim C_8$ ジアルキルアミノカルボニルである、

請求項2に記載の方法。

#### 【請求項4】

Bが場合により $R^6$ から独立して選択される1～3つの置換基により置換されていてもよいフェニル環であり、

Jが-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-または-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-であり、

各 $R^5$ が、独立して、CH<sub>3</sub>、Cl、Br、I、CN、NO<sub>2</sub>、CF<sub>3</sub>、OCF<sub>3</sub>、OCHF<sub>2</sub>、SCF<sub>3</sub>、SCHF<sub>2</sub>、CO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>またはCONHCH<sub>3</sub>であり、そして

各 $R^6$ が、独立して、 $C_1 \sim C_2$ アルキル、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルキル、ハロゲン、CN、 $C_1 \sim C_2$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_2$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_2$ アルキルスルフィニルまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルスルホニルであり、かつ少なくとも1つの $R^6$ がWとの結合に対してオルト位に位置する、

請求項3に記載の方法。

#### 【請求項5】

Bが場合により $R^6$ から独立して選択される1～3つの置換基により置換されていてもよい3-ピリジニルまたは4-ピリジニル環であり、

Jが-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-または-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-であり、

各 $R^5$ が、独立して、CH<sub>3</sub>、Cl、Br、I、CN、NO<sub>2</sub>、CF<sub>3</sub>、OCF<sub>3</sub>、OCHF<sub>2</sub>、SCF<sub>3</sub>、SCHF<sub>2</sub>、CO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>またはCONHCH<sub>3</sub>であり、そして

10

20

30

40

50

各  $R^6$  が、独立して、 $C_1 \sim C_2$  アルキル、 $C_1 \sim C_2$  ハロアルキル、ハロゲン、 $CN$ 、 $C_1 \sim C_2$  アルコキシ、 $C_1 \sim C_2$  ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_2$  アルキルチオ、 $C_1 \sim C_2$  アルキルスルフィニルまたは  $C_1 \sim C_2$  アルキルスルホニルであり、かつ少なくとも 1 つの  $R^6$  が  $W$  との結合に対してオルト位に位置する、  
請求項 3 に記載の方法。

【請求項 6】

$B$  が 3 - ピリジニル環であり、ここで 1 つの  $R^6$  が  $C=O$  との結合に対して 2 位オルトに位置する  $C1$  であり、もう 1 つの  $R^6$  が  $C1$  またはメチルから選択されかつ  $C=O$  との結合に対して 4 位オルトに位置し、そして第三の場合により存在する  $R^6$  が 6 位におけるメチルである、請求項 5 に記載の方法。

10

【請求項 7】

$R^1$  が  $H$  であり、そして  $R^3$  が  $H$  である、請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 8】

2 - クロロ - 6 - メトキシ -  $N$  - (5, 6, 7, 8 - テトラヒドロ - 3 - メチル - 8 - キノリニル) - 4 - ピリジンカルボキサミド、  
2, 6 - ジクロロ -  $N$  - (5, 6, 7, 8 - テトラヒドロ - 3 - メチル - 8 - キノリニル) ベンズアミド、および  
2, 3, 6 - トリフルオロ -  $N$  - (5, 6, 7, 8 - テトラヒドロ - 3 - メチル - 8 - キノリニル) ベンズアミド

からなる群より選択される化合物を含んでなる、請求項 1 に記載の方法。

20

【請求項 9】

請求項 1 に記載の式 I で表される化合物、それらの  $N$  - オキシド、農業的に適する塩、ただし、 $B$  が置換されたフェニル環であり、 $W$  が  $C=O$  または  $SO_2$  であり、 $R^3$  が  $H$  であり、そして  $J$  が未置換であるかまたはアルキル、アルコキシ、アリールもしくはアラールキルからなる群より選択される 1 ~ 3 つの置換基により置換された炭素数 2 ~ 4 の飽和鎖である場合、該化合物は  $N$  - オキシドである。

【請求項 10】

$A$  が  $N-C=C$  と一緒になって  $R^5$  から独立して選択される 1 つもしくは 2 つの置換基により置換された縮合ピリジニル環を形成し、

$B$  が  $R^6$  から独立して選択される 1 ~ 3 つの置換基により置換され、

30

$J$  が少なくとも 1 つの炭素構成員を含み、場合により 1 つもしくは 2 つの炭素構成員を  $C(=O)$  として含んでいてもよく、かつ場合により窒素または酸素から選択される 1 つの構成員を含んでいてもよく、場合により  $C_1 \sim C_2$  アルキル、ハロゲン、 $CN$ 、 $NO_2$  および  $C_1 \sim C_2$  アルコキシからなる群より選択される 1 つもしくはそれ以上の置換基により置換されていてもよい 2 ~ 5 員の連結鎖であり、

$R^1$  が  $H$ ；またはそれぞれ場合によりハロゲン、 $CN$ 、 $NO_2$ 、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_4$  アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$  アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$  アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$  アルキルスルホニル、 $C_2 \sim C_4$  アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_4$  アルキルアミノ、 $C_2 \sim C_8$  ジアルキルアミノおよび  $C_3 \sim C_6$  シクロアルキルアミノからなる群より選択される 1 つもしくはそれ以上の置換基により置換されていてもよい  $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_2 \sim C_6$  アルケニル、 $C_2$

40

$\sim C_6$  アルキニルもしくは  $C_3 \sim C_6$  シクロアルキルであり、  
各  $R^5$  および各  $R^6$  が、独立して、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_2 \sim C_6$  アルケニル、 $C_2 \sim C_6$  アルキニル、 $C_3 \sim C_6$  シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$  ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$  ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$  ハロアルキニル、 $C_3 \sim C_6$  ハロシクロアルキル、ハロゲン、 $CN$ 、 $CO_2H$ 、 $CONH_2$ 、 $NO_2$ 、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_4$  アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$  ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$  アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$  アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$  アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$  ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$  ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$  ハロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$  アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_4$  アルキルアミノ、 $C_2 \sim C_8$  ジアルキルアミノ、 $C_3 \sim C_6$  シクロアルキルアミノ、 $C_2 \sim C_6$  アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_6$  アルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_6$  アルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_8$  ジアルキルアミノカルボニル、

50

C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>トリアルキルシリルであるか、あるいは

各R<sup>5</sup>および各R<sup>6</sup>が、独立して、それぞれの環が場合によりR<sup>7</sup>から独立して選択される1 ~ 3つの基により置換されていてよいフェニル環、5員もしくは6員芳香族複素環、ベンジル環またはフェノキシ環であり、そして

各R<sup>7</sup>が、独立して、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>4</sub>アルケニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>4</sub>アルキニル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>ハロアルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>4</sub>ハロアルケニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>4</sub>ハロアルキニル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>ハロシクロアルキル、ハロゲン、CN、NO<sub>2</sub>、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>ハロアルコキシ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>アルキルチオ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>アルキルスルホニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>アルコキシカルボニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>アルキルアミノ、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub>ジアルキルアミノ、C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>シクロアルキルアミノ、C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>(アルキル)シクロアルキルアミノ、C<sub>2</sub> ~ C<sub>4</sub>アルキルカルボニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub>アルキルアミノカルボニル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>8</sub>ジアルキルアミノカルボニルまたはC<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>トリアルキルシリルである、

請求項9に記載の化合物。

#### 【請求項11】

WがC=Oであり、

Jが -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-、-OCH<sub>2</sub>-、-OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-、-OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>NHCH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>N(C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>アルキル)CH<sub>2</sub>-、-CONHCO- および -CON(C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>アルキル)CO- から選択され、そして

各R<sup>5</sup>および各R<sup>6</sup>が、独立して、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub>アルキニル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub>ハロアルケニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub>ハロアルキニル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>ハロシクロアルキル、ハロゲン、CN、NO<sub>2</sub>、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>ハロアルコキシ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>アルキルチオ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>アルキルスルホニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>ハロアルキルチオ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>ハロアルキルスルフィニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>ハロアルキルスルホニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>アルコキシカルボニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub>アルキルカルボニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub>アルキルアミノカルボニルまたはC<sub>3</sub> ~ C<sub>8</sub>ジアルキルアミノカルボニルである、

請求項10に記載の化合物。

#### 【請求項12】

Bが場合によりR<sup>6</sup>から独立して選択される1 ~ 3つの置換基により置換されていてよいフェニル環であり、

Jが -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>- または -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>- であり、

各R<sup>5</sup>が、独立して、CH<sub>3</sub>、Cl、Br、I、CN、NO<sub>2</sub>、CF<sub>3</sub>、OCF<sub>3</sub>、OCHF<sub>2</sub>、SCF<sub>3</sub>、SCHF<sub>2</sub>、CO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>またはCONHCH<sub>3</sub>であり、そして

各R<sup>6</sup>が、独立して、C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>アルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>ハロアルキル、ハロゲン、CN、C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>ハロアルコキシ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>アルキルチオ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>アルキルスルフィニルまたはC<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>アルキルスルホニルであり、かつ少なくとも1つのR<sup>6</sup>がWとの結合に対してオルト位に位置する、

請求項11に記載の化合物。

#### 【請求項13】

Bが場合によりR<sup>6</sup>から独立して選択される1 ~ 3つの置換基により置換されていてよい3 - ピリジニルまたは4 - ピリジニル環であり、

Jが -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>- または -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>- であり、

各R<sup>5</sup>が、独立して、CH<sub>3</sub>、Cl、Br、I、CN、NO<sub>2</sub>、CF<sub>3</sub>、OCF<sub>3</sub>、OCHF<sub>2</sub>、SCF<sub>3</sub>、SCHF<sub>2</sub>、CO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>またはCONHCH<sub>3</sub>であり、そして

各R<sup>6</sup>が、独立して、C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>アルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>ハロアルキル、ハロゲン、CN、C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>ハロアルコキシ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>アルキルチオ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>アルキルスルフィニルまたはC<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>アルキルスルホニルであり、かつ少なくとも1つのR<sup>6</sup>がWとの結合に対してオルト位に位置する、

10

20

30

40

50

請求項 1 1 に記載の化合物。

【請求項 1 4】

B が 3 - ピリジニル環であり、ここで 1 つの  $R^6$  が  $C = O$  との結合に対して 2 位オルトに位置する C 1 であり、もう 1 つの  $R^6$  が C 1 またはメチルから選択されかつ  $C = O$  との結合に対して 4 位オルトに位置し、そして第三の場合により存在する  $R^6$  が 6 位におけるメチルである、請求項 1 3 に記載の化合物。

【請求項 1 5】

$R^1$  が H であり、そして  $R^3$  が H である、請求項 9 ~ 1 4 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 1 6】

2 - クロロ - 6 - メトキシ - N - ( 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - 3 - メチル - 8 - キノリニル ) - 4 - ピリジンカルボキサミドである、請求項 9 に記載の化合物。 10

【請求項 1 7】

( a ) 少なくとも 1 種の請求項 1 に記載の式 I で表される化合物 ; および

( b ) ( b 1 ) アルキレンビス ( ジチオカルバメート ) 殺菌・殺カビ剤、( b 2 ) 菌・カビ性ミトコンドリア呼吸電子移動部位の  $b c_1$  錯体で作用する化合物、( b 3 ) シモキサニル ( c y m o x a n i l )、( b 4 ) ステロール生合成経路のデメチラーゼ酵素で作用する化合物、( b 5 ) ステロール生合成経路に作用するモルホリンおよびピペリジン化合物、( b 6 ) フェニルアミド殺菌・殺カビ剤、( b 7 ) ピリミジノン殺菌・殺カビ剤、( b 8 ) フタルイミド類および ( b 9 ) ホセチル - アルミニウム ( f o s e t y l - a l u m i n u m ) からなる群より選択される少なくとも 1 種の化合物、 20  
を含んでなる組成物。

【請求項 1 8】

成分 ( b ) が、( b 1 )、( b 2 )、( b 3 )、( b 4 )、( b 5 )、( b 6 )、( b 7 )、( b 8 ) および ( b 9 ) より選択される 2 つの異なる群の各々からの少なくとも 1 種の化合物を含んでなる請求項 1 9 に記載の組成物。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、2 つの隣接炭素原子を介して第 2 の環に縮合したピリジニル環を有する、ある種の二環式アミド、それらの N - オキシド、農業的に適する塩および組成物、ならびに殺菌・殺カビ剤 ( f u n g i c i d e s ) としてのそれらの使用方法に関する。 30

【背景技術】

【0002】

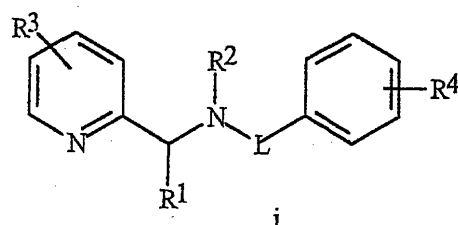
高い収穫効率を達成するために、菌・カビ性 ( f u n g a l ) 植物病原体により引き起こされる植物病害の抑制は極めて重要である。装飾用、野菜、圃場、穀類および果実作物に及ぼす植物病害による損害は、著しい生産性の減少を引き起こす可能性があり、それによって消費者にコスト増加をもたらす可能性がある。これらの目的のための多くの製品が市販品として入手可能であるが、より有効であり、コストが低く、毒性が低く、環境的に安全であるか、または異なる作用様式を有する新規化合物に関する必要性が存続している。

【0003】

特許文献 1 は、殺菌・殺カビ剤として式 i

【0004】

【化 1】



【 0 0 0 5 】

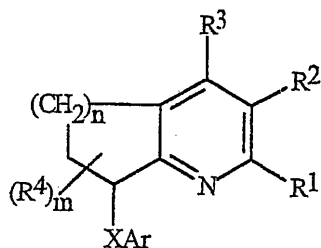
[ 式中、( 中でも )  $R^1$  は H、アルキルまたはアシルであり、 $R^2$  は H またはアルキルであり、そして L は - ( C = O ) -、- S O<sub>2</sub> - または - ( C = S ) - である ]  
で表されるある種のベンズアミドを開示している。

【 0 0 0 6 】

特許文献 2 は、式 i i

【 0 0 0 7 】

【 化 2 】



ii

10

【 0 0 0 8 】

[ 式中、( 中でも ) X は N H C O または N H S O<sub>2</sub> であり、A r は場合により置換されていてもよいフェニルであり、 $R^4$  はアルキル、アルコキシ、アリールまたはアラルキルであり、m は 1、2 または 3 であり、そして n は 1、2 または 3 である ]  
で表されるある種の縮合ピリジニル化合物を開示している。

20

【 0 0 0 9 】

植物の菌・カビ類、特に、フィトフトラ属 ( *Phytophthora* spp. ) およびプラズモパラ属 ( *Plasmopara* spp. ) のような卵菌綱の菌・カビ類を有効に抑制する薬剤は、栽培者によって絶えず必要とされている。殺菌・殺カビ剤の組み合わせは、病害抑制を促進し、かつ抵抗発生を遅らせるためにしばしば使用されている。植物病原体の治療的、全体的および予防的抑制の組み合わせを提供する活性成分の混合物を使用することにより、活性範囲および病害抑制の効能を強化することが望ましい。また、より  
大きい残留抑制を提供して拡大された噴霧間隔を可能にする組み合わせも望ましい。また、  
菌・カビ性病原体における異なる生化学的経路を抑制する殺菌・殺カビ剤を組み合わせ  
て、いずれか 1 つの特定の植物病害抑制剤への抵抗の発生を遅らせることも非常に望ましい  
。

30

【 0 0 1 0 】

全ての場合において、植物病原体によって引き起こされる病害からの作物の有効な保護を保証しながら、その環境で放出される化学薬剤の量を減少させることができることは特に有利である。殺菌・殺カビ剤の混合物は、個々の成分の活性に基づいて予測され得るものよりも著しく良好な病害抑制を提供することができる。この相乗作用は、「独立して現れる 2 つ ( 以上 ) の効果の合計より全体的効果が大きい、またはより拡大されているよう  
な、混合物の 2 つの成分の協力作用」として記載されている ( 非特許文献 1 を参照のこと ) 。

40

【 0 0 1 1 】

【 特許文献 1 】

W O 9 9 / 4 2 4 4 7 号明細書

【 特許文献 2 】

G B 2 2 1 9 7 9 7 号明細書

【 非特許文献 1 】

テームズ, P. M. L. ( T a m e s , P. M. L. ), ネーデルランズ ジャーナル  
オブ プラント パソロジー ( N e t h . J . P l a n t P a t h o l o g y ), ( 1

50

9 6 4 ) , 7 0 , 7 3 - 8 0

【発明の開示】

【発明が解決しようとする課題】

【0012】

前記目的の1つもしくはそれ以上を達成するために特に有利である殺菌・殺カビ剤を発見することが望まれている。

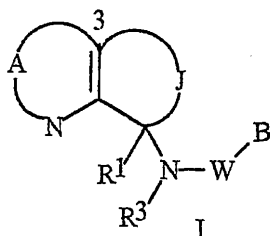
【課題を解決するための手段】

【0013】

本発明は、式 I

【0014】

【化3】



【0015】

[ 式中、

A は N - C = C と一緒になって置換された縮合ピリジニル環を形成し、

B は置換されたフェニルまたはピリジニル環であり、

J は少なくとも1つの炭素構成員を含み、場合により1つもしくは2つの炭素構成員を C ( = O ) として含んでいてもよく、かつ場合により窒素および酸素から選択される1つの構成員を含んでいてもよい、場合により置換されていてもよい2 ~ 5 員の連結鎖であり、

W は C = L または S O<sub>n</sub> であり、

L は O または S であり、

R<sup>1</sup> は H ; またはそれぞれ場合により置換されていてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルケニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキニルもしくは C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub> シクロアルキルであり、

R<sup>3</sup> は H ; または C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルケニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキニルもしくは C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub> シクロアルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキルカルボニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルコキシカルボニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキルアミノカルボニルもしくは C<sub>3</sub> ~ C<sub>8</sub> ジアルキルアミノカルボニルであり、そして

n は 1 または 2 である ]

で表される化合物 ( 全ての幾何異性体および立体異性体を含む ) 、それらの N - オキシド、農業的に適する塩および組成物に関する。

【0016】

特に、本発明は、植物もしくはその一部に、または植物の種子もしくは実生に、殺菌・殺カビ的に有効な量の式 I で表される化合物 ( 全ての幾何異性体および立体異性体、それらの N - オキシドおよび農業的に適する塩を含む ) 、または前記化合物を含んでなる組成物を適用することを含んでなる菌・カビ性植物病原体により引き起こされる植物病害の抑制方法を含む。

【0017】

また本発明は、式 I で表される化合物 ( 全ての幾何異性体および立体異性体を含む ) 、それらの N - オキシドおよび農業的に適する塩、ただし、B が置換されたフェニル環であり、W が C = O または S O<sub>2</sub> であり、R<sup>3</sup> が H であり、そして J が未置換であるかまたはアルキル、アルコキシ、アリールもしくはアラルキルからなる群より選択される1 ~ 3 つの置換基により置換された炭素数 2 ~ 4 の飽和鎖である場合、該化合物は N - オキシドであることを条件とする、も含む。



## 【0018】

また本発明は、(1)式Iで表される化合物(全ての幾何異性体および立体異性体、それらのN-オキシドおよび農業的に適する塩を含む)の殺菌・殺カビ的に有効な量と、(2)(i)少なくとも1種の他の殺虫剤、殺菌・殺カビ剤、殺線虫剤、殺細菌剤、殺ダニ剤、成長調整剤、不妊化剤、信号化学剤、忌避剤、誘引剤、フェロモン、摂食刺激剤もしくは他の生物学的に活性な化合物、ならびに/または(ii)界面活性剤、固体希釈剤および液体希釈剤からなる群より選択される少なくとも1種の追加成分とを含んでなる殺菌・殺カビ性組成物も含む。

## 【0019】

本発明は、例えば、

10

- (a) 少なくとも1種の式Iで表される化合物；および
- (b) (b1) アルキレンビス(ジチオカルバメート)殺菌・殺カビ剤、
- (b2) 菌・カビ性ミトコンドリア呼吸電子移動部位の $bc_1$ 錯体で作用する化合物、
- (b3) シモキサニル(cymoxanil)、
- (b4) ステロール生合成経路のデメチラーゼ酵素で作用する化合物、
- (b5) ステロール生合成経路に作用するモルホリンおよびピペリジン化合物、
- (b6) フェニルアミド殺菌・殺カビ剤、
- (b7) ピリミジノン殺菌・殺カビ剤、
- (b8) フタルイミド類および
- (b9) ホセチル-アルミニウム(fosetyl-aluminum)

20

からなる群より選択される少なくとも1種の化合物、  
を含んでなる組成物を提供する。

## 【0020】

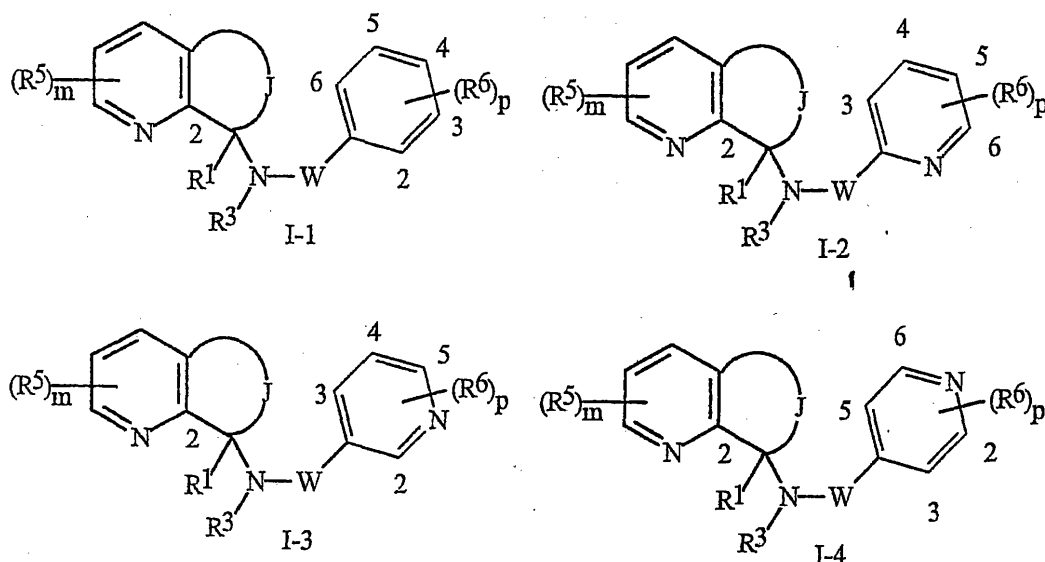
上記の通り、Aは置換された縮合ピリジニル環であり、かつBは置換されたフェニルまたはピリジニル環である。用語「置換された」は、これらのAまたはB環に関して、殺菌・殺カビ活性を失活させない少なくとも1つの水素以外の置換基を有する基を指す。Aが、 $R^5$ から選択される1つもしくは2つの置換基により置換され、かつBが、 $R^6$ から選択される1~3つの置換基により置換された、前記AおよびB環を組み入れた式Iの例を表示1に図示する。ここで、mは1から2の整数であり、かつpは1から3の整数である。 $(R^5)_m$ とAと、および $(R^6)_p$ とBとの結合点は固定されていない状態で図示され、かつ $(R^5)_m$ および $(R^6)_p$ は、フェニルまたはピリジニル環のいずれかの利用可能な炭素原子に結合可能であることが特記される。

30

## 【0021】

## 【化4】

## 提示1



10

## 【0022】

20

Aに結合している場合の $R^5$ およびBに結合している場合の $R^6$ の例としては、以下のものが挙げられる。

各 $R^5$ および各 $R^6$ が、独立して、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルキル、ハロゲン、CN、 $CO_2H$ 、 $CONH_2$ 、 $NO_2$ 、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ ジアルキルアミノ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルアミノ、 $C_2 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_8$ ジアルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_6$ トリアルキルシリルであるか、あるいは

30

各 $R^5$ および各 $R^6$ が、独立して、それぞれの環が場合により $R^7$ から独立して選択される1～3つの基により置換されていてもよいフェニル環、5員もしくは6員芳香族複素環、ベンジル環またはフェノキシ環であり、そして

各 $R^7$ が、独立して、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_2 \sim C_4$ アルケニル、 $C_2 \sim C_4$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_4$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_4$ ハロアルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルキル、ハロゲン、CN、 $NO_2$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ ジアルキルアミノ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルアミノ、 $C_3 \sim C_6$ (アルキル)シクロアルキルアミノ、 $C_2 \sim C_4$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_8$ ジアルキルアミノカルボニルまたは $C_3 \sim C_6$ トリアルキルシリルである。

40

## 【0023】

上記の通り、 $R^1$ は(中でも)、それぞれ場合により置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニルまたは $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルである。用語「場合により置換されていてもよい」は、これらの $R^1$ 基に関して、未置換であるか、または未置換類似体が有する殺菌・殺カビ活性を失活させない少なくとも1つの水素以外の置換基を有する $R^1$ 基を指す。場合により置換されていてもよい $R^1$ 基の例は、ハロゲ

50

ン、CN、NO<sub>2</sub>、ヒドロキシ、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルチオ、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルスルホニル、C<sub>2</sub>~C<sub>4</sub>アルコシカルボニル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルアミノ、C<sub>2</sub>~C<sub>8</sub>ジアルキルアミノおよびC<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>シクロアルキルアミノからなる群より独立して選択される1つもしくはそれ以上(いずれかの特定のR<sup>1</sup>基での置換に利用可能な水素の総数まで)の置換基によりR<sup>1</sup>基の炭素原子上の水素を置換することにより場合により置換されていてもよいものである。これらの置換基は上記例に列挙されるが、それらは場合により存在する置換基であるため、存在する必要はないことが特記される。1つから5つの置換基により場合により置換されていてもよいR<sup>1</sup>基が特記される。

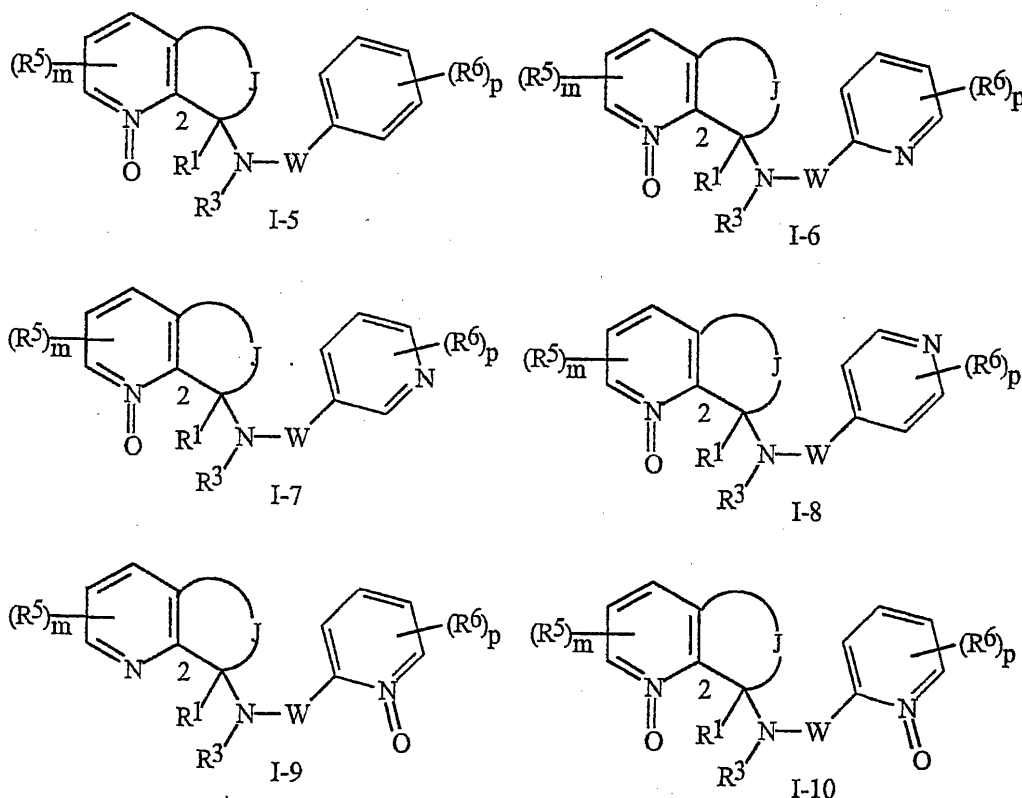
#### 【0024】

式IのN-オキシドの例を、表示2にI-5からI-10として図示する。ここで、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、W、mおよびpは上記で定義された通りである。

#### 【0025】

#### 【化5】

提示2



#### 【0026】

上記の通り、各R<sup>5</sup>および各R<sup>6</sup>は(中でも)、それぞれの環が場合によりR<sup>7</sup>から独立して選択される1~3つの基により置換されていてもよいフェニル環、5員もしくは6員芳香族複素環、ベンジル環またはフェノキシ環であり得る。用語「場合により置換されていてもよい」は、これらの基に関して、未置換であるか、または未置換類似体が有する生物学的活性を失活させない少なくとも1つの水素以外の置換基を有する基を指す。R<sup>7</sup>から独立して選択される1~3つの基により場合により置換されていてもよいフェニル環の例は、表示3にR<sup>x</sup>-56として図示される環であり、ここではxは5または6のいずれかであり、かつrは1から3の整数である。R<sup>7</sup>から独立して選択される1~3つの基により場合により置換されていてもよい5員または6員芳香族複素環の例は、表示3にR<sup>x</sup>-1からR<sup>x</sup>-55として図示される環であり、ここではxは5または6のいずれかであり、かつrは1から3の整数である。R<sup>7</sup>から独立して選択される1~3つの基により場合により置換されていてもよいベンジル環の例は、表示3にR<sup>x</sup>-57として図示される環

であり、ここでは  $x$  は 5 または 6 のいずれかであり、かつ  $r$  は 1 から 3 の整数である。  $R^7$  から独立して選択される 1 ~ 3 つの基により場合により置換されていてもよいフェノキシ環の例は、表示 3 に  $R^x - 58$  として図示される環であり、ここでは  $x$  は 5 または 6 のいずれかであり、かつ  $r$  は 1 から 3 の整数である。

【 0 0 2 7 】

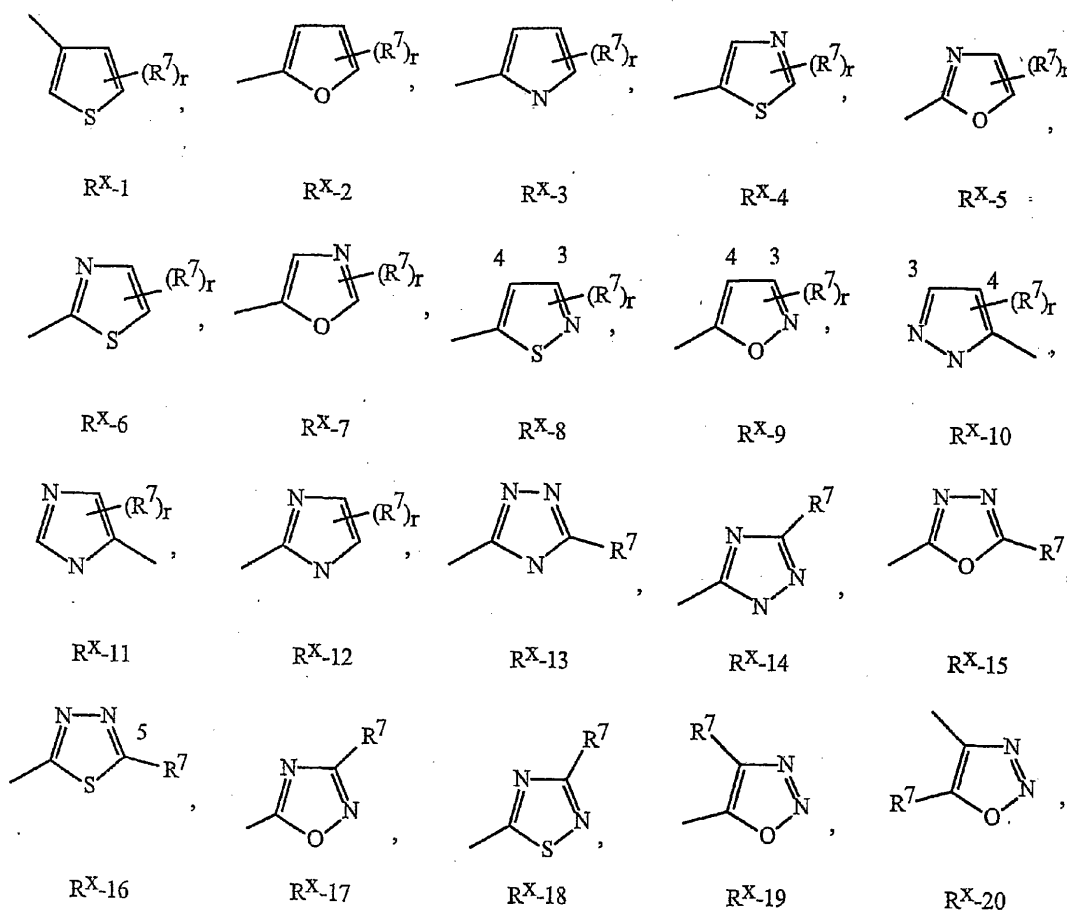
$R^x - 1$  から  $R^x - 58$  の構造に、1 ~ 3 つの  $R^7$  基 (  $(R^7)_r$  として表される ) が示されているが、それらは場合により存在する置換基であるため、存在する必要はないことが特記される。それらの原子価を充填するための置換を必要とする窒素原子は、H または  $R^7$  により置換される。いくつかの  $R^x$  基は、3 つ未満の  $R^7$  基でのみ置換され得ることが特記される (例えば、 $R^x - 15$ 、 $R^x - 16$ 、 $R^x - 17$  から  $R^x - 20$  および  $R^x - 31$  から  $R^x - 33$  は 1 つの  $R^7$  基でのみ置換され得る)。  $(R^7)_r$  と  $R^x$  基との間の結合点が固定されていない状態で図示される場合、  $(R^7)_r$  は  $R^x$  基のいずれかの利用可能な炭素原子に結合可能であることが特記される。

10

【 0 0 2 8 】

【 化 6 】

提示 3



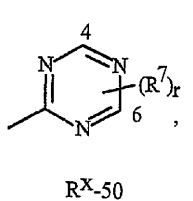
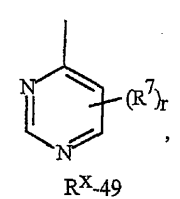
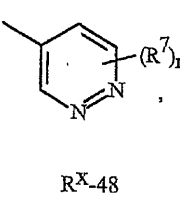
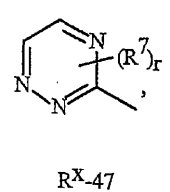
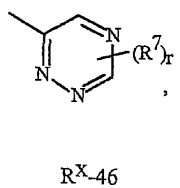
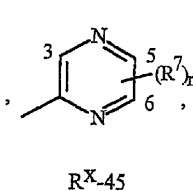
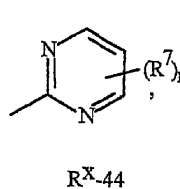
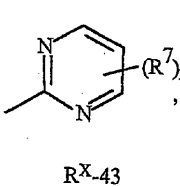
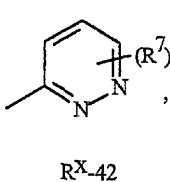
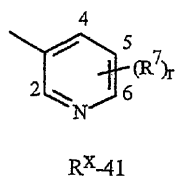
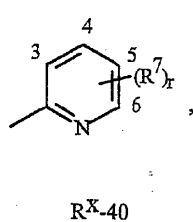
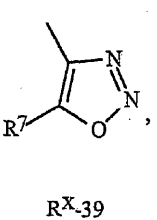
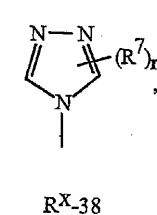
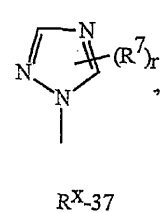
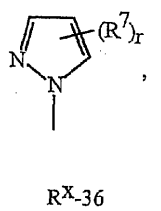
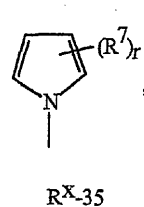
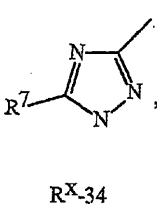
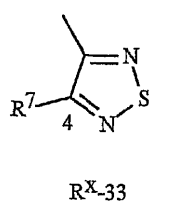
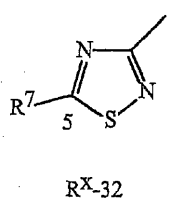
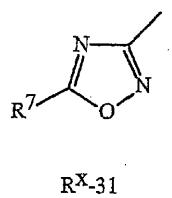
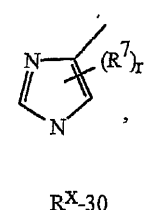
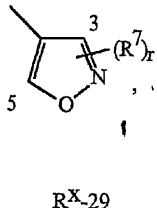
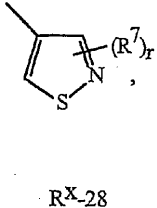
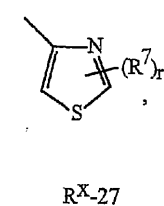
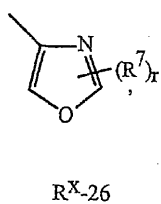
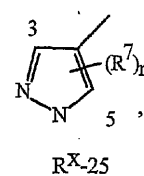
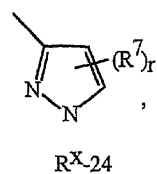
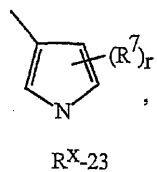
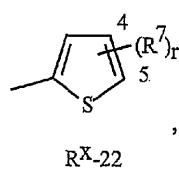
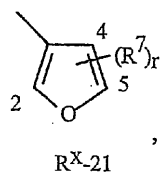
20

30

40

【 0 0 2 9 】

【 化 7 】



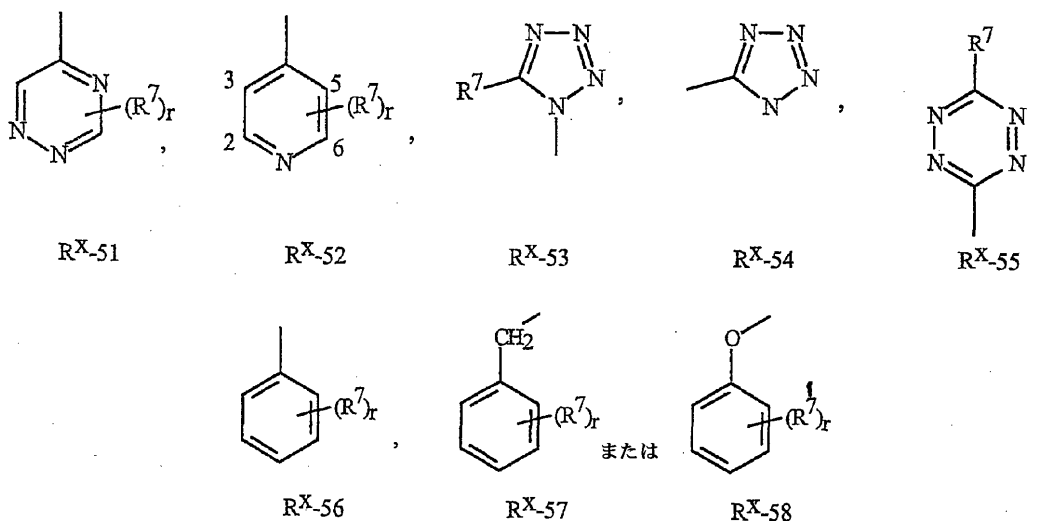
10

20

30

【 0 0 3 0 】

【 化 8 】



10

## 【0031】

上記の通り「J」は、少なくとも1つの炭素構成員を含み、場合により1つもしくは2つの炭素構成員をC(=O)として含んでもよく、かつ場合により窒素および酸素から選択される1つの構成員を含んでもよい、場合により置換されていてもよい2～5員の連結鎖である。用語「場合により置換されていてもよい」は、この連結鎖「J」に関して、未置換であるか、または未置換類似体が有する生物学的活性を失活させない少なくとも1つの水素以外の置換基を有する「J」基を指す。場合により置換されていてもよい「J」基の例としては、表示4に図示される「J」基が挙げられる。表示4中の「J」基は、「J」基の左端が3位でA環に結合するように、かつ「J」基の右端が、N(R<sup>3</sup>)WB部分を有する炭素原子に結合するように図示される。

20

## 【0032】

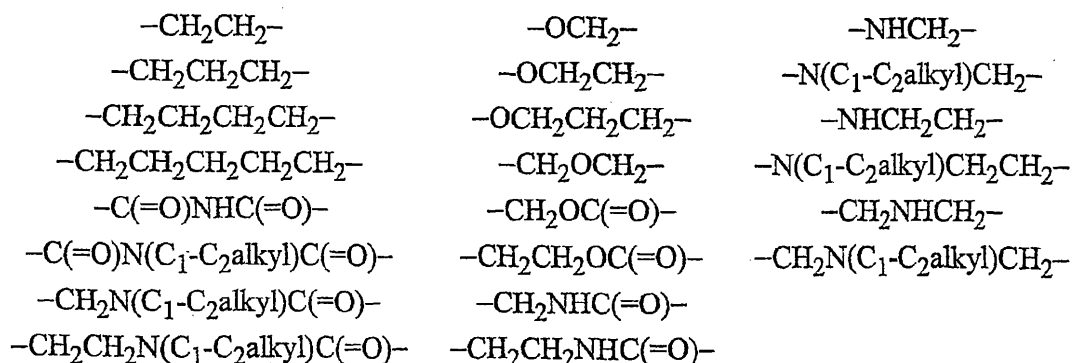
表示4中の「J」基は、C<sub>1</sub>～C<sub>2</sub>アルキル、ハロゲン、CN、NO<sub>2</sub>およびC<sub>1</sub>～C<sub>2</sub>アルコキシからなる群より独立して選択される1つもしくはそれ以上（いずれかの特定の「J」基での置換に利用可能な水素の総数まで）の置換基により「J」基の炭素原子または窒素原子上の水素を置換することにより場合により置換されていてもよい。これらの置換基は列挙されるが、それらは場合により存在する置換基であるため、存在する必要はないことが特記される。上記群から選択される1つから4つの置換基により場合により置換されていてもよい「J」基が特記される。

30

## 【0033】

## 【化9】

## 提示4



40

## 【0034】

以上の記載において、単独または「アルキルチオ」もしくは「ハロアルキル」のような組み合わせられた単語のいずれかで使用される用語「アルキル」としては、メチル、エチル

50

、*n* - プロピル、*i* - プロピルまたは種々のブチル、ペンチルもしくはヘキシル異性体のような直鎖または分枝鎖アルキルが挙げられる。「アルケニル」としては、エテニル、1 - プロペニル、2 - プロペニル、ならびに種々のブテニル、ペンテニルおよびヘキセニル異性体のような直鎖または分枝鎖アルケンが挙げられる。「アルケニル」としては、1, 2 - プロパジエニルおよび 2, 4 - ヘキサジエニルのようなポリエンも挙げられる。「アルキニル」としては、エチニル、1 - プロピニル、2 - プロピニル、ならびに種々のブチニル、ペンチニルおよびヘキシニル異性体のような直鎖または分枝鎖アルキンが挙げられる。「アルキニル」としては、2, 5 - ヘキサジイニルのような複数の三重結合から構成される部分も挙げることができる。「アルコキシ」としては、例えば、メトキシ、エトキシ、*n* - プロピルオキシ、イソプロピルオキシ、ならびに種々のブトキシ、ペントキシおよびヘキシルオキシ異性体が挙げられる。「アルキルチオ」としては、メチルチオ、エチルチオ、ならびに種々のプロピルチオ、ブチルチオ、ペンチルチオおよびヘキシルチオ異性体のような分枝鎖または直鎖アルキルチオ部分が挙げられる。「アルキルスルフィニル」としては、アルキルスルフィニル基の両エナンチオマーが挙げられる。「アルキルスルフィニル」の例としては、 $\text{CH}_3\text{S}(\text{O})$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHS}(\text{O})$ 、ならびに種々のブチルスルフィニル、ペンチルスルフィニルおよびヘキシルスルフィニル異性体が挙げられる。「アルキルスルホニル」の例としては、 $\text{CH}_3\text{S}(\text{O})_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHS}(\text{O})_2$ 、ならびに種々のブチルスルホニル、ペンチルスルホニルおよびヘキシルスルホニル異性体が挙げられる。「アルキルアミノ」、「ジアルキルアミノ」等は、上記例と同様に定義される。「シクロアルキル」としては、例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチルおよびシクロヘキシルが挙げられる。

10

20

30

40

50

#### 【0035】

用語「ハロゲン」としては、単独または「ハロアルキル」のような組み合わせられた単語のいずれかで、フッ素、塩素、臭素またはヨウ素が挙げられる。さらに、「ハロアルキル」のような組み合わせられた単語で使用される場合、前記アルキルは、同一であっても、または異なってもよいハロゲン原子により部分的または完全に置換されていてよい。「ハロアルキル」の例としては、 $\text{F}_3\text{C}$ 、 $\text{ClCH}_2$ 、 $\text{CF}_3\text{CH}_2$ および $\text{CF}_3\text{CCl}_2$ が挙げられる。用語「ハロアルケニル」、「ハロアルキニル」、「ハロアルコキシ」、「ハロアルキルチオ」等は、用語「ハロアルキル」と同様に定義される。「ハロアルケニル」の例としては、 $(\text{Cl})_2\text{C}=\text{CHCH}_2$ および $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2$ が挙げられる。「ハロアルキニル」の例としては、 $\text{HC}(\text{Cl})\text{CHCl}$ 、 $\text{CF}_3\text{C}(\text{Cl})_2$ 、 $\text{CCl}_3\text{C}(\text{Cl})_2$ および $\text{FCH}_2\text{C}(\text{Cl})\text{CH}_2$ が挙げられる。「ハロアルコキシ」の例としては、 $\text{CF}_3\text{O}$ 、 $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{O}$ 、 $\text{HCF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}$ および $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{O}$ が挙げられる。「ハロアルキルチオ」の例としては、 $\text{CCl}_3\text{S}$ 、 $\text{CF}_3\text{S}$ 、 $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{S}$ および $\text{ClCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}$ が挙げられる。「ハロアルキルスルフィニル」の例としては、 $\text{CF}_3\text{S}(\text{O})$ 、 $\text{CCl}_3\text{S}(\text{O})$ 、 $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})$ および $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{S}(\text{O})$ が挙げられる。「ハロアルキルスルホニル」の例としては、 $\text{CF}_3\text{S}(\text{O})_2$ 、 $\text{CCl}_3\text{S}(\text{O})_2$ 、 $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2$ および $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{S}(\text{O})_2$ が挙げられる。

#### 【0036】

「アルキルカルボニル」の例としては、 $\text{CH}_3\text{C}(=\text{O})$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})$ および $(\text{CH}_3)_2\text{CHC}(=\text{O})$ が挙げられる。「アルコキシカルボニル」の例としては、 $\text{CH}_3\text{OC}(=\text{O})$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHOC}(=\text{O})$ および種々のブトキシ - またはペントキシカルボニル異性体が挙げられる。「アルキルアミノカルボニル」の例としては、 $\text{CH}_3\text{NHC}(=\text{O})$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{NHC}(=\text{O})$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHC}(=\text{O})$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHNHC}(=\text{O})$ および種々のブチルアミノ - またはペンチルアミノカルボニル異性体が挙げられる。「ジアルキルアミノカルボニル」の例としては、 $(\text{CH}_3)_2\text{NC}(=\text{O})$ 、 $(\text{CH}_3\text{CH}_2)_2\text{NC}(=\text{O})$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2(\text{CH}_3)\text{NC}(=\text{O})$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2(\text{CH}_3)\text{NC}(=\text{O})$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHN}(\text{CH}_3)\text{C}(=\text{O})$ および種々のブチルアミ

【 0 0 3 7 】

10

【 0 0 3 8 】

20

30

40

【 0 0 3 9 】

50



$\text{CH}_3)_\text{N}$ または $(\text{CH}_3)_2\text{CHN}(\text{CH}_3)$ を示す。

【0040】

置換基の数が1以上であり得ることを表す下付き文字を有する置換基により化合物が置換されている場合、前記置換基は(1以上である場合)、定義された置換基の群より独立して選択される。さらに、下付き文字が範囲、例えば $(\text{R})_{i-j}$ を表す場合、置換基の数は*i*と*j*との間を全て含む整数から選択されてよい。

【0041】

用語「1～3つの置換基により場合により置換されていてもよい」等は、基の利用可能な位置の1～3つが置換されてよいことを表す。基、例えば $\text{R}^1$ または $\text{R}^2$ が、水素であり得る置換基を含有する場合、次いでこの置換基が水素として見なされる場合、前記基が未置換であることに同等であると認識される。

10

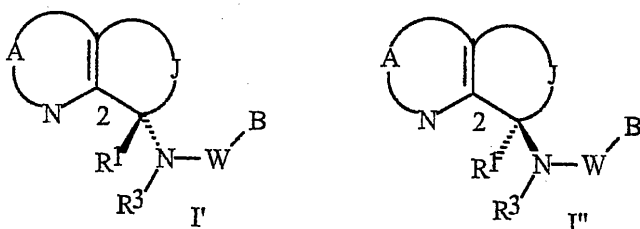
【0042】

本発明に関する化合物は、1以上の立体異性体として存在することも可能である。種々の立体異性体としては、エナンチオマー、ジアステレオマー、アトロプ異性体および幾何異性体が挙げられる。他の立体異性体に関して濃縮された場合、または他の立体異性体から分離された場合、1つの立体異性体により活性であり得、かつ/または有利な効果を示し得ることは当業者に明白であろう。加えて、当業者は前記立体異性体をいかにして分離するか、濃縮するか、そして/または選択的に調製するかを周知である。従って、本発明は、式Iから選択される化合物、それらのN-オキシドおよび農業的に適する塩を含んでなる。この化合物は、立体異性体の混合物として、個々の立体異性体として、または光学的に活性な形態として存在し得る。特に、式Iの $\text{R}^1$ およびJは異なるため、前記式は、それらが共通して結合する炭素においてキラル中心を有する。本発明は、式I'および式I''、

20

【0043】

【化10】



30

【0044】

(式中、A、B、J、W、 $\text{R}^1$ 、 $\text{R}^2$ および $\text{R}^3$ は上記で定義された通りである)の等量部のラセミ混合物を含む。

【0045】

加えて、本発明は、ラセミ混合物と比較して、式I'または式I''のエナンチオマーで濃縮される化合物および組成物を含む。式I'または式I''の本質的に純粋なエナンチオマーを含む化合物および組成物が含まれる。例えば、本発明は、ラセミ混合物と比較して、式I'のエナンチオマーで濃縮される式Iの化合物を含む。式I'の本質的に純粋なエナンチオマーが含まれる。また本発明は、ラセミ混合物と比較して、成分(a)が式I''の成分(a)エナンチオマーで濃縮される組成物を含む。また本発明は、ラセミ混合物と比較して、式I''のエナンチオマーで濃縮される式Iの化合物を含む。式I''の本質的に純粋なエナンチオマーが含まれる。また本発明は、ラセミ混合物と比較して、成分(a)が式I''の成分(a)エナンチオマーで濃縮される組成物を含む。

40

【0046】

エナンチオマー的に濃縮された場合、1つのエナンチオマーが他のものより多い量で存在し、濃縮の程度をエナンチオマー過剰率(「ee」)の表現により定義することができる。これは、 $100(2x-1)$ として定義され、ここではxは混合物中の支配的なエナン

50

チオマーのモル分率である（例えば、20%のeeはエナンチオマー比60:40に相当する）。好ましくは、より活性な異性体が少なくとも50%エナンチオマー過剰率、より好ましくは少なくとも75%エナンチオマー過剰率、より一層好ましくは少なくとも90%エナンチオマー過剰率、そして最も好ましくは少なくとも94%エナンチオマー過剰率で存在する。より活性な異性体のエナンチオマー的に純粋な実施形態が特に特記されるべきである。

#### 【0047】

本発明の化合物の塩としては、臭化水素酸、塩化水素酸、硝酸、リン酸、硫酸、酢酸、酪酸、フマル酸、乳酸、マレイン酸、マロン酸、オキサリ酸、プロピオン酸、サリチル酸、酒石酸、4-トルエンスルホン酸または吉草酸のような無機または有機酸による酸付加塩が挙げられる。化合物がカルボン酸のような酸基またはフェノールを含有する場合、本発明の化合物の塩としては、有機塩基（例えば、ピリジン、アンモニアまたはトリエチルアミン）あるいは無機塩基（例えば、ナトリウム、カリウム、リチウム、カルシウム、マグネシウムまたはバリウムの水素化物、水酸化物または炭酸塩）により形成されたものも挙げられる。

10

#### 【0048】

本発明は、植物もしくはその一部に、または植物の種子もしくは実生に、殺菌・殺カビ的に有効な量の式Iで表される化合物（全ての幾何異性体および立体異性体を含む）、それらのN-オキシドおよび農業的に適する塩を（例えば、本明細書に記載の組成物の成分として）適用することを含んでなる菌・カビ性植物病原体により引き起こされる植物病害の抑制方法を提供する。

20

#### 【0049】

より良好な活性および/または合成の容易さの理由から、好ましい方法は以下のものである。

好ましいもの1. AがN-C=Cと一緒にあってR<sup>5</sup>から独立して選択される1つもしくは2つの置換基により置換された縮合ピリジニル環を形成し、

BがR<sup>6</sup>から独立して選択される1~3つの置換基により置換され、

Jが少なくとも1つの炭素構成員を含み、場合により1つもしくは2つの炭素構成員をC(=O)として含んでもよく、かつ場合により窒素または酸素から選択される1つの構成員を含んでもよく、場合によりC<sub>1</sub>~C<sub>2</sub>アルキル、ハロゲン、CN、NO<sub>2</sub>およびC<sub>1</sub>~C<sub>2</sub>アルコキシからなる群より選択される1つもしくはそれ以上の置換基により置換されていてもよい2~5員の連結鎖であり、

30

R<sup>1</sup>がH；またはそれぞれ場合によりハロゲン、CN、NO<sub>2</sub>、ヒドロキシ、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルチオ、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルスルホニル、C<sub>2</sub>~C<sub>4</sub>アルコキシカルボニル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルアミノ、C<sub>2</sub>~C<sub>8</sub>ジアルキルアミノおよびC<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>シクロアルキルアミノからなる群より選択される1つもしくはそれ以上の置換基により置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルキニルもしくはC<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>シクロアルキルであり、

各R<sup>5</sup>および各R<sup>6</sup>が、独立して、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルキニル、C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルケニル、C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキニル、C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>ハロシクロアルキル、ハロゲン、CN、CO<sub>2</sub>H、CONH<sub>2</sub>、NO<sub>2</sub>、ヒドロキシ、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>ハロアルコキシ、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルチオ、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルスルホニル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>ハロアルキルチオ、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>ハロアルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>ハロアルキルスルホニル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルコキシカルボニル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルアミノ、C<sub>2</sub>~C<sub>8</sub>ジアルキルアミノ、C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>シクロアルキルアミノ、C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルキルカルボニル、C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル、C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルキルアミノカルボニル、C<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>ジアルキルアミノカルボニル、C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>トリアルキルシリルであるか、あるいは

40

各R<sup>5</sup>および各R<sup>6</sup>が、独立して、それぞれの環が場合によりR<sup>7</sup>から独立して選択される1~3つの基により置換されていてもよいフェニル環、5員もしくは6員芳香族複素環、

50

ベンジル環またはフェノキシ環であり、そして

各  $R^7$  が、独立して、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_2 \sim C_4$ アルケニル、 $C_2 \sim C_4$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_4$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_4$ ハロアルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルキル、ハロゲン、 $CN$ 、 $NO_2$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ ジアルキルアミノ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルアミノ、 $C_3 \sim C_6$ (アルキル)シクロアルキルアミノ、 $C_2 \sim C_4$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_8$ ジアルキルアミノカルボニルまたは $C_3 \sim C_6$ トリアルキルシリルである、式 I の化合物を含んでなる方法が好ましい。

10

#### 【0050】

各  $R^5$  および各  $R^6$  が、独立して、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルキル、ハロゲン、 $CN$ 、 $CO_2H$ 、 $CONH_2$ 、 $NO_2$ 、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ ジアルキルアミノ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルアミノ、 $C_2 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_8$ ジアルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_6$ トリアルキルシリルであるか、または

20

各  $R^5$  および各  $R^6$  が、独立して、それぞれ場合により  $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_2 \sim C_4$ アルケニル、 $C_2 \sim C_4$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_4$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_4$ ハロアルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルキル、ハロゲン、 $CN$ 、 $NO_2$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ ジアルキルアミノ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルアミノ、 $C_3 \sim C_6$ (アルキル)シクロアルキルアミノ、 $C_2 \sim C_4$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_8$ ジアルキルアミノカルボニルもしくは $C_3 \sim C_6$ トリアルキルシリルにより置換されていてもよいフェニル、ベンジルまたはフェノキシである、好ましいもの 1 の方法が特記される。

30

#### 【0051】

好ましいもの 2 .  $W$  が  $C=O$  である好ましいもの 1 の方法。

#### 【0052】

好ましいもの 3 .  $J$  が  $-CH_2CH_2-$ 、 $-CH_2CH_2CH_2-$ 、 $-CH_2CH_2CH_2CH_2-$ 、 $-OCH_2-$ 、 $-OCH_2CH_2-$ 、 $-OCH_2CH_2CH_2-$ 、 $-CH_2NHCH_2-$ 、 $-CH_2N(C_1 \sim C_2 \text{アルキル})CH_2-$ 、 $-CONHCO-$  および  $-CON(C_1 \sim C_2 \text{アルキル})CO-$  から選択され、そして

各  $R^5$  および各  $R^6$  が、独立して、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルキル、ハロゲン、 $CN$ 、 $NO_2$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニルまたは $C_3 \sim C_8$ ジアルキルアミノカルボニルである、好ましいもの 2 の方法。

40

#### 【0053】

好ましいもの 4 . 各  $R^5$  が、独立して、ハロゲン、 $CN$ 、 $NO_2$ 、 $C_1 \sim C_2$ アルキル、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_2$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_2$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_2$ アルキルスルフィニルおよび $C_1 \sim C_2$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_2$ ハロ

50

アルキルチオ、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルキルスルホニル、 $C_2 \sim C_4$ アルコキシカルボニルまたは $C_2 \sim C_4$ アルキルアミノカルボニルである、好ましいものの3の方法。

【0054】

$R^5$ が、 $CH_3$ 、 $Cl$ 、 $Br$ 、 $I$ 、 $CN$ 、 $NO_2$ 、 $CF_3$ 、 $CO_2CH_3$ 、 $CONHCH_3CH_3$ 、 $OCF_3$ 、 $OCHF_2$ 、 $OCH_2CF_3$ 、 $OCF_2CF_3$ 、 $OCF_2CF_2H$ 、 $OCHF_2CF_3$ 、 $SCF_3$ 、 $SCHF_2$ 、 $SCH_2CF_3$ 、 $SCF_2CF_3$ 、 $SCF_2CF_2H$ 、 $SCHF_2CF_3$ 、 $SOCF_3$ 、 $SOCCHF_2$ 、 $SOCCH_2CF_3$ 、 $SOCF_2CF_3$ 、 $SOCF_2CF_2H$ 、 $SOCCHF_2CF_3$ 、 $SO_2CF_3$ 、 $SO_2CHF_2$ 、 $SO_2CH_2CF_3$ 、 $SO_2CF_2CF_3$ 、 $SO_2CF_2CF_2H$ または $SO_2CHF_2CF_3$ である、好ましいものの4の方法が特記される。

10

【0055】

好ましいもの5.  $B$ が、 $R^6$ から独立して選択される1~3つの置換基により場合により置換されていてもよいフェニル環である好ましいものの4の方法。

【0056】

好ましいもの6. 各 $R^6$ が、独立して、ハロゲン、 $C_1 \sim C_2$ アルキル、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルキル、 $CN$ 、 $C_1 \sim C_2$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_2$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_2$ アルキルスルフィニルまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルスルホニルであり、かつ少なくとも1つの $R^6$ が $W$ との結合に対してオルト位に位置する、好ましいものの5の方法。

【0057】

$W$ との結合に対してそれぞれオルト位に位置する1つの $R^6$ と、場合により1つから2つの追加の $R^6$ が存在してもよく、そして $R^6$ がハロゲンまたはメチルである好ましいものの6の方法が特記される。

20

【0058】

好ましいもの7.  $J$ が $-CH_2CH_2-$ または $-CH_2CH_2CH_2-$ である、好ましいものの6の方法。

【0059】

好ましいもの8. 各 $R^5$ が、独立して、 $CH_3$ 、 $Cl$ 、 $Br$ 、 $I$ 、 $CN$ 、 $NO_2$ 、 $CF_3$ 、 $OCF_3$ 、 $OCHF_2$ 、 $SCF_3$ 、 $SCHF_2$ 、 $CO_2CH_3$ または $CONHCH_3$ である、好ましいものの7の方法。

【0060】

各 $R^5$ が、 $CH_3$ 、 $Cl$ 、 $Br$ 、 $CN$ 、 $NO_2$ 、 $CF_3$ 、 $CO_2CH_3$ または $CONHCH_3$ である好ましいものの8の方法が特記される。

30

【0061】

好ましいもの9.  $B$ が、 $R^6$ から独立して選択される1~3つの置換基により場合により置換されていてもよい3-ピリジニルまたは4-ピリジニル環である、好ましいものの4の方法。

【0062】

好ましいもの10. 各 $R^6$ が、独立して、 $C_1 \sim C_2$ アルキル、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルキル、ハロゲン、 $CN$ 、 $C_1 \sim C_2$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_2$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_2$ アルキルスルフィニルまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルスルホニルであり、かつ少なくとも1つの $R^6$ が $W$ との結合に対してオルト位に位置する、好ましいものの9の方法。

40

【0063】

好ましいもの11.  $J$ が $-CH_2CH_2-$ または $-CH_2CH_2CH_2-$ である、好ましいものの10の方法。

【0064】

好ましいもの12. 各 $R^5$ が、独立して、 $CH_3$ 、 $Cl$ 、 $Br$ 、 $I$ 、 $CN$ 、 $NO_2$ 、 $CF_3$ 、 $OCF_3$ 、 $OCHF_2$ 、 $SCF_3$ 、 $SCHF_2$ 、 $CO_2CH_3$ または $CONHCH_3$ である、好ましいものの11の方法。

【0065】

各 $R^5$ が、 $CH_3$ 、 $Cl$ 、 $Br$ 、 $CN$ 、 $NO_2$ 、 $CF_3$ 、 $CO_2CH_3$ または $CONHCH_3$ で

50

ある好ましいもの 1 2 の方法が特記される。

【 0 0 6 6 】

好ましいもの 1 3 . B が 3 - ピリジニル環であり、ここで 1 つの  $R^6$  が  $C = O$  との結合に対して 2 位オルトに位置する  $C 1$  であり、もう 1 つの  $R^6$  が  $C 1$  またはメチルから選択されかつ  $C = O$  との結合に対して 4 位オルトに位置し、そして第三の場合により存在する  $R^6$  が 6 位におけるメチルである、好ましいもの 1 2 の方法。

【 0 0 6 7 】

好ましいもの 1 4 .  $R^1$  が H であり、そして  $R^3$  が H である、好ましいもの 2 から好ましいもの 1 3 のいずれか 1 つの方法。

【 0 0 6 8 】

2 - クロロ - 6 - メトキシ - N - ( 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - 3 - メチル - 8 - キノリニル ) - 4 - ピリジンカルボキサミド、  
2 , 6 - ジクロロ - N - ( 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - 3 - メチル - 8 - キノリニル ) ベンズアミド、および  
2 , 3 , 6 - トリフルオロ - N - ( 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - 3 - メチル - 8 - キノリニル ) ベンズアミド  
からなる群より選択される化合物を含んでなる方法が特に好ましい。

【 0 0 6 9 】

本発明は、殺菌・殺力比的に有効な量の式 I で表される化合物を含んでなる殺菌・殺力比的組成物にも関する。本発明の好ましい組成物は、上記好ましいもの 1 から好ましいもの 1 4 に記載された化合物を含んでなるものである。

【 0 0 7 0 】

本発明は、B が置換されたフェニル環であり、W が  $C = O$  または  $SO_2$  であり、 $R^3$  が H であり、かつ J が未置換であるかまたはアルキル、アルコキシ、アリールもしくはアラルキルからなる群より選択される 1 ~ 3 つの置換基により置換された炭素数 2 ~ 4 の飽和鎖である場合、化合物は N - オキシドであることを条件とする、式 I で表される化合物 ( 全ての幾何異性体および立体異性体を含む )、それらの N - オキシドおよび農業的に適する塩も含む。好ましい化合物は、上記ただし書きを条件として、上記好ましいもの 1 から好ましいもの 1 4 に記載のものである。

【 0 0 7 1 】

特に好ましい化合物は、2 - クロロ - 6 - メトキシ - N - ( 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - 3 - メチル - 8 - キノリニル ) - 4 - ピリジンカルボキサミドである。

【 0 0 7 2 】

式 I の化合物を、スキーム 1 ~ 1 9 に記載の以下の方法の 1 つもしくはそれ以上および変法により調製することができる。式 I a、I b および I c の化合物は式 I のサブセットであり、かつ式 I a、I b および I c に関する全ての置換基は式 I に関して上記で定義された通りである。以下の式 1 ~ 1 9 の化合物の A、B、J、L、W、 $R^1$  から  $R^6$  および m の定義は、上記で定義された通りである。式 1 a - e、6 a - c、8 a - f、1 0 a - c、1 1 a - c、1 6 a - b、1 8 a - d および 1 9 a - b の化合物は、それぞれ式 1、6、8、1 0、1 1、1 6、1 8 および 1 9 の化合物のサブセットである。以下の式の  $J^1$  から  $J^6$  は J のサブセットである。

【 0 0 7 3 】

スキーム 1 に図示されるように、2 モル当量の塩基 ( 例えば、トリエチルアミン (  $Et_3N$  )、ポリマー支持ジイソプロピルエチルアミンまたは炭酸カリウム ) が存在する不活性溶媒中で、適切な酸塩化物により式 1 のアミンまたはアミン塩を処理することによって、式 I a の化合物を調製する。同様に、2 モル当量の塩基 ( 例えばトリエチルアミン、ポリマー支持ジイソプロピルエチルアミンまたは炭酸カリウム ) が存在する不活性溶媒中で、適切なスルホニルクロリドにより式 1 のアミンまたはアミン塩を処理することによって、式 I b の化合物を調製する。適切な溶媒は、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタンまたはジエチルエーテルのようなエーテル；トルエンまたはベンゼンのような炭化水素；および

10

20

30

40

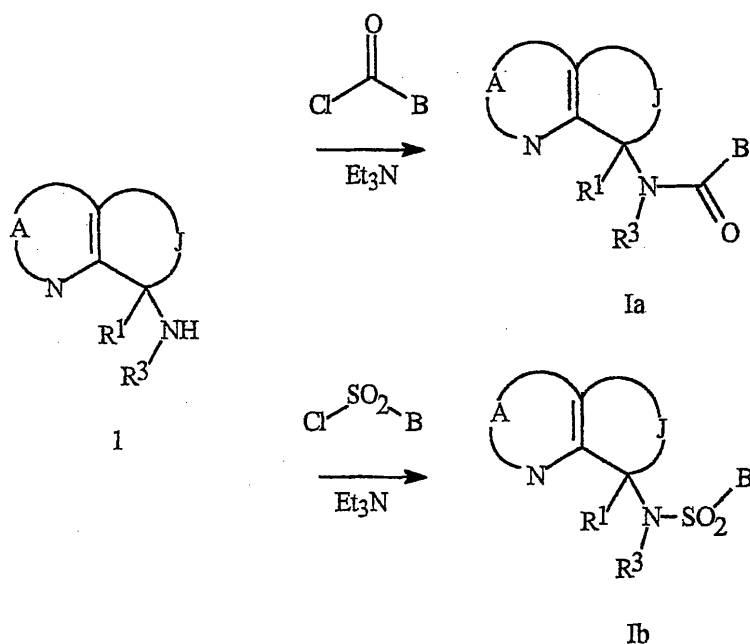
50

ジクロロメタンまたはクロロホルムのようなハロゲン化炭素からなる群より選択される。

【0074】

【化11】

スキーム1



【0075】

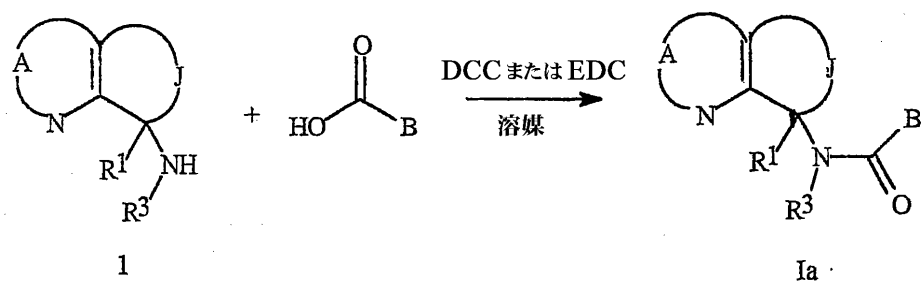
あるいは、スキーム2に描写されるように、1,3-ジシクロヘキシルカルボジイミド(DCC)または1-[3-(ジメチルアミノ)プロピル]-3-エチルカルボジイミド塩酸塩(EDC)のような有機脱水剤の存在下で適切なカルボン酸と式1のアミンまたはアミン塩を反応させることによって、式Iaの化合物を合成することができる。適切な溶媒は、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタンまたはジエチルエーテルのようなエーテル；トルエンまたはベンゼンのような炭化水素；およびジクロロメタンまたはクロロホルムのようなハロゲン化炭素からなる群より選択される。

30

【0076】

【化12】

スキーム2



【0077】

式2の市販品として入手可能なピリジンから、中間体アミン1a(Aが、示された置換基を有する2-ピリジル環であり、J<sup>1</sup>は-(CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>-であり、qは1、2、3または4であり、かつR<sup>1</sup>およびR<sup>3</sup>は両方とも水素である、式1の化合物)を調製することができる(スキーム3)。スキーム3に示されるように、WO00/56729号に見出されるものと同様の手順で過酸化水素酸化、アクリル化、加水分解、塩素化、アジド置換および還元(例えば、H<sub>2</sub>と触媒としての炭素上パラジウムとを使用する触媒水素化)を含んで

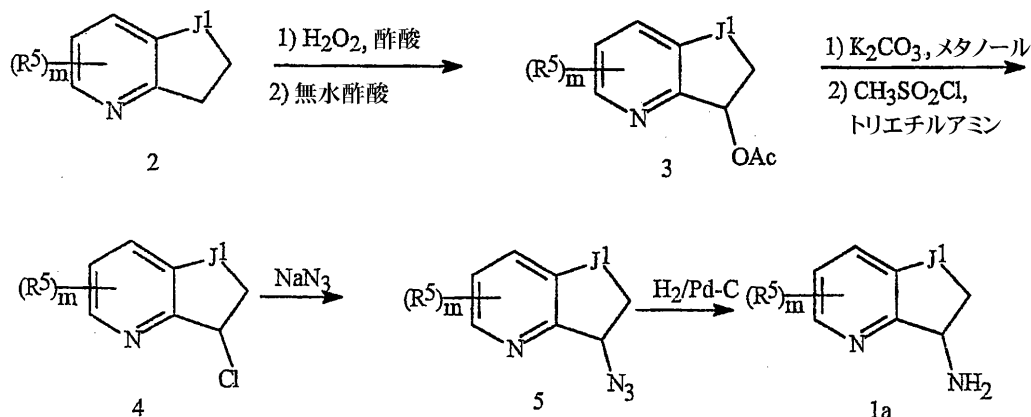
50

なる連続工程により、式2のピリジン窒素原子に対してオルト位で結合したCH<sub>2</sub>をNH<sub>2</sub>で置換して、アミン1aを提供することができる。

【0078】

【化13】

スキーム3



J<sup>1</sup>は(CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>であり、かつqは1、2、3または4

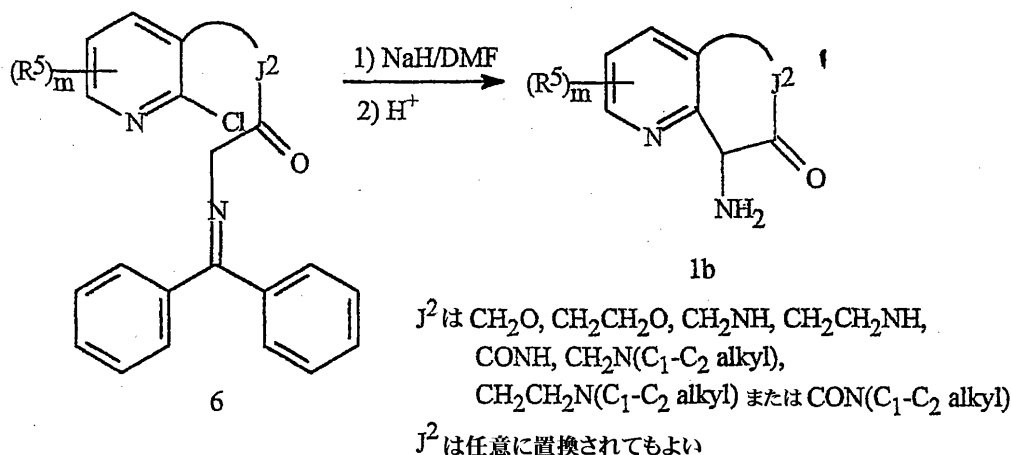
【0079】

スキーム4に示されるように、N,N-ジメチルホルムアミドのような極性非プロトン性溶媒中で水酸化ナトリウムのような強塩基の存在下で式6の化合物を使用して分子内置換し、続いて、酸性媒体中で加熱することにより、J<sup>2</sup>が-CH<sub>2</sub>O-、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O-、-CH<sub>2</sub>NH-、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NH-、-CH<sub>2</sub>N(C<sub>1</sub>~C<sub>2</sub>アルキル)-、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>N(C<sub>1</sub>~C<sub>2</sub>アルキル)-、-CONH-または-CH<sub>2</sub>N(C<sub>1</sub>~C<sub>2</sub>アルキル)-である式1bの化合物を合成することができる。2,3-ジクロロ置換ピリジンによる同様の分子間置換については、WO99/42447号に報告されている。また、J<sup>2</sup>に関して列挙される基は、C<sub>1</sub>~C<sub>2</sub>アルキル（例えば、CH(CH<sub>3</sub>)O、C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>OまたはCH(CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>)O）、ハロゲン、CN、NO<sub>2</sub>およびC<sub>1</sub>~C<sub>2</sub>アルコキシルからなる群より独立して選択される1つもしくはそれ以上の（いずれの特定のJ基における置換に関して利用可能な水素の総数まで）置換基により場合により置換されていてもよい。

【0080】

【化14】

スキーム4



【0081】

10

20

30

40

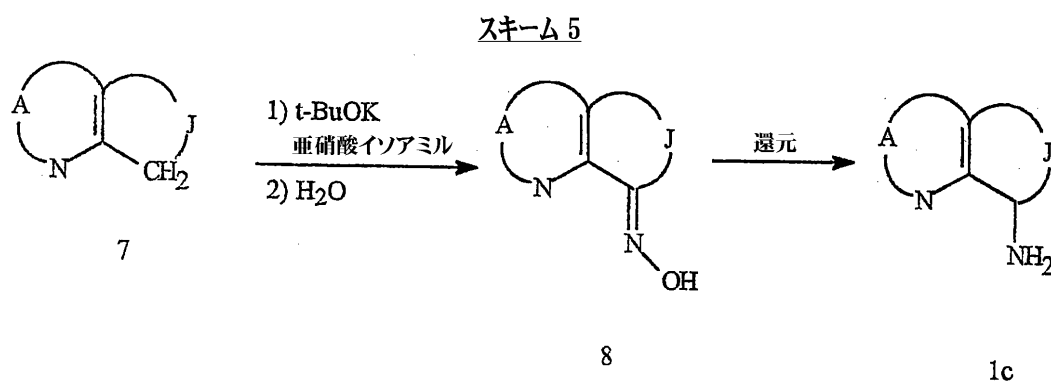
50

あるいは、亜硝酸イソamilおよびカリウム *t*-ブトキシド (*t*-BuOK) のような塩基で式 7 の化合物を処理し、続いて、結果として生じる式 8 のオキシムを還元することにより、式 1c (A および J は前記で定義された通りであり、かつ R<sup>1</sup> は水素である) の化合物を調製することができる (スキーム 5)。例えば、水素化アルミニウムリチウム、亜鉛および酢酸、または触媒水素化により、還元を完了することができる。(オキサムの還元に関する先行参照のために、ジェリー マーチ (Jerry March) 著、先端有機化学：反応、機構および構造 (Advanced Organic Chemistry: Reactions, Mechanism and Structure)、第三版、ジョン ウィリー & サンズ (John Wiley & Sons)、ニューヨーク、1985、第 1105 頁を参照のこと)。

10

【0082】

【化15】



20

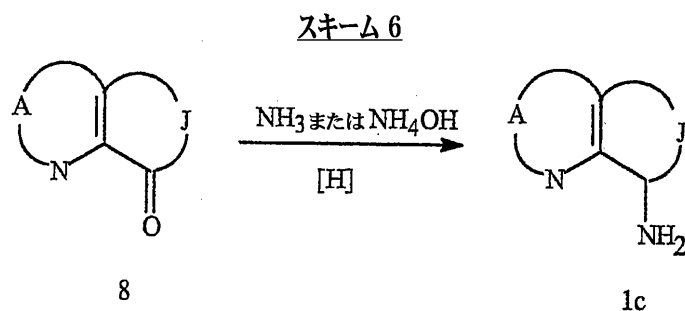
【0083】

あるいは、スキーム 6 に示されるように、式 9 の化合物の還元アミノ化により、式 1c (A および J は定義された通りであり、かつ R<sup>1</sup> は水素である) の化合物を調製することができる。還元アミノ化に関する多くの方法が報告されている。いくつかの先行参照のために、ジェリー マーチ (Jerry March) 著、先端有機化学：反応、機構および構造 (Advanced Organic Chemistry: Reactions, Mechanism and Structure)、第三版、ジョン ウィリー & サンズ (John Wiley & Sons)、ニューヨーク、1985、第 798 ~ 800 頁を参照のこと。

30

【0084】

【化16】



40

【0085】

塩基条件下で、式 10 の相当するアルコールと式 9 の N - (ジフェニルメチレン) グリシンエステルのエステル交換反応によって、J<sup>2</sup> が場合により置換されていてもよい -CH<sub>2</sub>O- または -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O- である式 6a の化合物を調製することができる (スキーム 7)。式 11 の相当するアミンと式 9 の N - (ジフェニルメチレン) グリシンエステルのアミド化によって、J<sup>2</sup> が場合により置換されていてもよい -CH<sub>2</sub>NH-、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>N

50

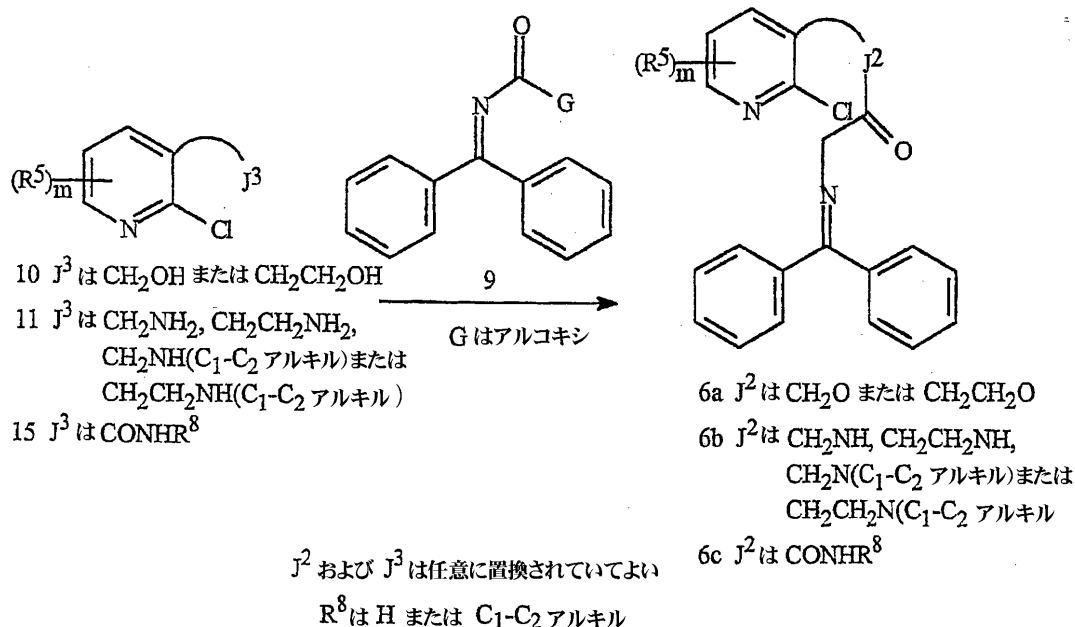


H -、 $-\text{CH}_2\text{N}(\text{C}_1 \sim \text{C}_2 \text{アルキル})-$  または  $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{N}(\text{C}_1 \sim \text{C}_2 \text{アルキル})-$  である式 6 b の化合物を調製することができる。式 15 の相当するアミドと式 9 の N - (ジフェニルメチレン) グリシンエステルのアミド化によって、 $\text{J}^2$  が場合により置換されていてもよい  $-\text{CONH}-$  または  $-\text{CON}(\text{C}_1 \sim \text{C}_2 \text{アルキル})$  である式 6 の化合物を調製することができる。

【0086】

【化17】

スキーム 7



10

20

【0087】

スキーム 8 に図示されるように、式 12 の化合物のオルト - リチウム化、それに続くアルデヒドもしくはアルデヒドシントン (例えば、パラホルムアルデヒド) またはケトンとの反応によって、 $\text{J}^3$  が場合により置換されていてもよい  $-\text{CH}_2\text{OH}$  である式 10 a の化合物を調製することができる。同様に、オルト - リチウム化、それに続くエポキシドとの反応によって、 $\text{J}^3$  が場合により置換されていてもよい  $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OH}$  である式 10 b の化合物を調製することができる。オルト - リチウム化は、リチウムジイソプロピルアミド (LDA) のような強リチウム塩基による基質の処理によって達成され得、典型的に、低温で実行される。適切な溶媒は、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタンまたはジエチルエーテルのようなエーテル、およびヘキサン、ヘプタンまたはエチルベンゼンのような炭化水素からなる群より選択される。

30

【0088】

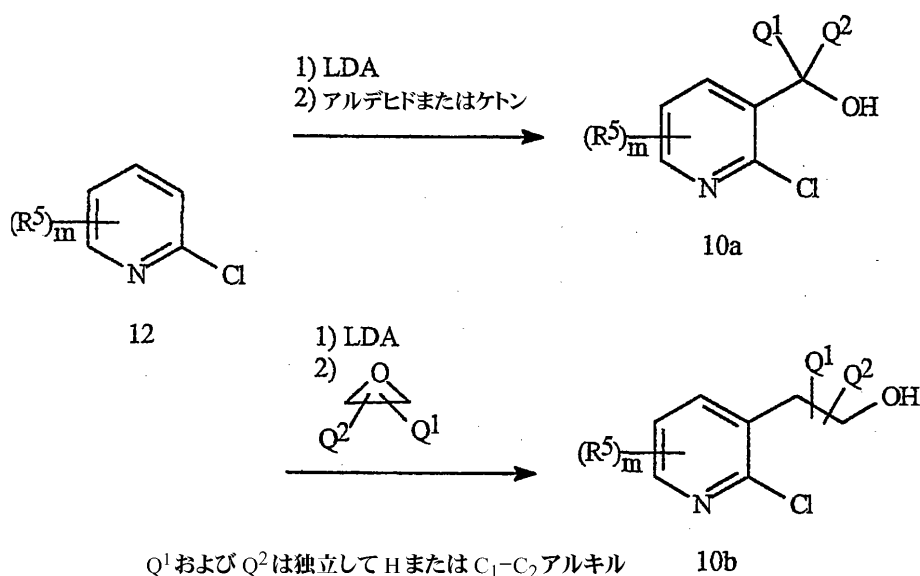
スキーム 9 に図示されるように、トルエンのような適切な溶媒中で、式 12 の化合物のオルト - リチウム化、および二酸化炭素との反応により式 13 の化合物を提供し、それに続いて水素化アルミニウムリチウム (LAH) を使用する還元によって、 $\text{J}^3$  が  $-\text{CH}_2\text{OH}$  である式 10 c の化合物を調製することもできる。式 13 のイソニコチン酸誘導体のいくつかを共通に利用することもできる。

40

【0089】

【化18】

## スキーム 8



10

## 【0090】

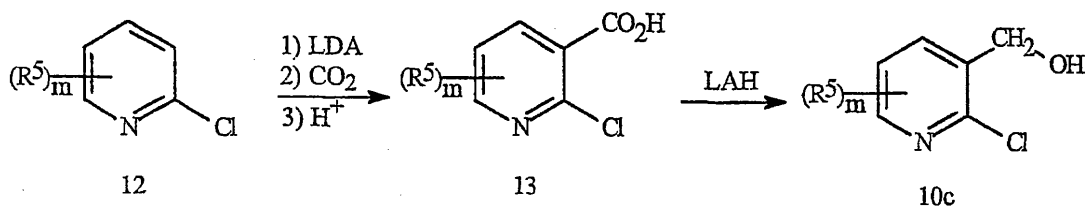
スキーム 9 に図示されるように、トルエンのような適切な溶媒中で、式 12 の化合物のオルト-リチウム化、および二酸化炭素との反応により式 13 の化合物を提供し、それに続いて水素化アルミニウムリチウム (LAH) を使用する還元によって、J<sup>3</sup> が -CH<sub>2</sub>OH である式 10c の化合物を調製することもできる。式 13 のイソニコチン酸誘導体のいくつかを共通に利用することもできる。

20

## 【0091】

## 【化 19】

## スキーム 9



30

## 【0092】

トルエンのような適切な溶媒中で水素化アルミニウムリチウム (LAH) を使用してニトリルを還元し、相当するアミノメチル中間体を与えることによって、式 14 のニトリルから式 11a の化合物を合成することができる (スキーム 10)。また、トルエンのような適切な溶媒中で水素化アルミニウムリチウム (LAH) を使用して還元することによって、R<sup>8</sup> が H である式 15 の第一級アミドから式 11a の化合物を合成することができる。トルエンのような適切な溶媒中で水素化アルミニウムリチウム (LAH) を使用して還元することによって、R<sup>8</sup> が C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub> アルキルである式 15 の第二級アミドから式 11b の化合物を合成することができる。また、式 11a の化合物とホルムアルデヒドまたはアセトアルデヒドの還元アミノ化によって、式 11b の化合物を合成することができる。ホルムアルデヒドによる還元アミノ化は、エシュバイラー-クラーク法で、ギ酸の存在下で達成することができる (ジェリー マーチ (Jerry March) 著、先端有機化学: 反応、機構および構造 (Advanced Organic Chemistry: Reactions, Mechanism and Structure)、第三版、ジョン

40

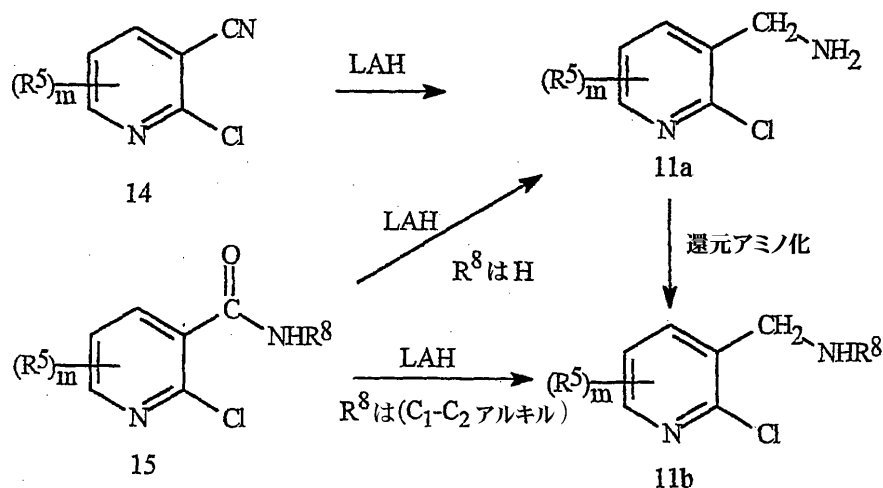
50

ウィリー&サンズ(John Wiley & Sons)、ニューヨーク、1985、第798~800頁およびその中の参考文献を参照のこと)。

【0093】

【化20】

スキーム10



10

【0094】

相当する酸塩化物への変換、およびその後のアンモニアまたは第一級アミンとの反応によって、式15の化合物を式13の化合物から調製することができる(スキーム11)。相当する酸塩化物へとカルボン酸を変換する方法は当該分野で周知であり、例えば、塩化チオニルまたは塩化オキサルによる処理を含む。2モル当量の塩基(例えばトリエチルアミン、ポリマー支持ジイソプロピルエチルアミンまたは炭酸カリウム)が存在する不活性溶媒中で、アミンまたはアミン塩により酸塩化物を処理する。適切な溶媒は、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタンまたはジエチルエーテルのようなエーテル；トルエンまたはベンゼンのような炭化水素；およびジクロロメタンまたはクロロホルムのようなハロゲン化炭素からなる群より選択される。あるいは、1,3-ジシクロヘキシルカルボジイミド(DCC)または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(EDC)のような有機脱水剤の存在下で式13のカルボン酸と適切なアミンまたはアミン塩を反応させることによって、式15の化合物を合成することができる。適切な溶媒は、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタンまたはジエチルエーテルのようなエーテル；トルエンまたはベンゼンのような炭化水素；およびジクロロメタンまたはクロロホルムのようなハロゲン化炭素からなる群より選択される。

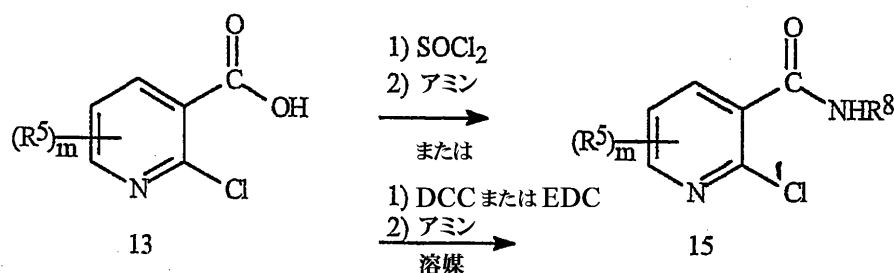
20

30

【0095】

【化21】

スキーム11



40

【0096】

あるいは、メタノールのようなプロトン性溶媒中で、LGがBr、Cl、メタンスルホニル( $-OSO_2Me$ )またはパラ-トルエンスルホニル( $-OSO_2-p-Tol$ )のよう

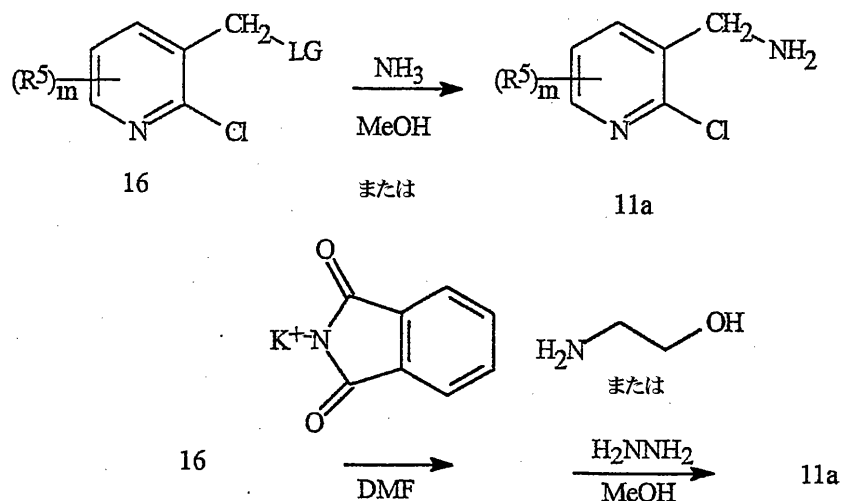
50

な脱離基である式 16 の化合物をアンモニアと反応させることにより、式 11a の化合物を合成することができる (スキーム 12)。また、アルコール溶媒中で、式 16 の化合物をフタルイミドのカリウム塩と反応させ、続いてアミノエタノールまたはヒドラジンのいずれかと反応させて所望のアミノメチル中間体、式 11a を提供することにより、式 11a の化合物を調製することができる。

【 0 0 9 7 】

【 化 2 2 】

スキーム 12



10

20

LG は Cl, Br, -OSO<sub>2</sub>Me, または -OSO<sub>2</sub>-p-Tol

【 0 0 9 8 】

スキーム 13 に図示されるように、トリエチルアミン、ポリマー支持ジイソプロピルエチルアミンまたは炭酸カリウムのような塩基の存在下で式 10c の化合物を相当する塩化スルホニルと反応させることにより、LG が -OSO<sub>2</sub>Me または -OSO<sub>2</sub>-p-Tol (16a) である式 16 の化合物を調製することができる。適切な溶媒は、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタンまたはジエチルエーテルのようなエーテル；トルエンまたはベンゼンのような炭化水素；およびジクロロメタンまたはクロロホルムのようなハロゲン化炭素からなる群より選択される。フリーラジカル条件下で臭素、塩素または N-ハロスクシンイミドのようなハロゲン化剤により式 17 の化合物を処理することによって、LG が Br または Cl (16b) である式 16 の化合物を調製することができる。これらの変換は、典型的に、可視または紫外光 (hν) および過酸化水素による活性化によって行われ、当該分野で周知である。

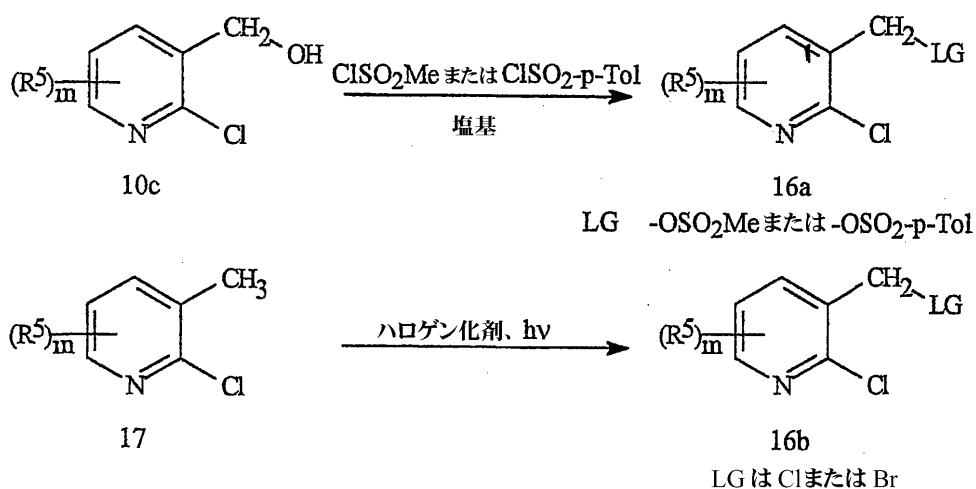
30

【 0 0 9 9 】

【 化 2 3 】

40

## スキーム 13



10

## 【0100】

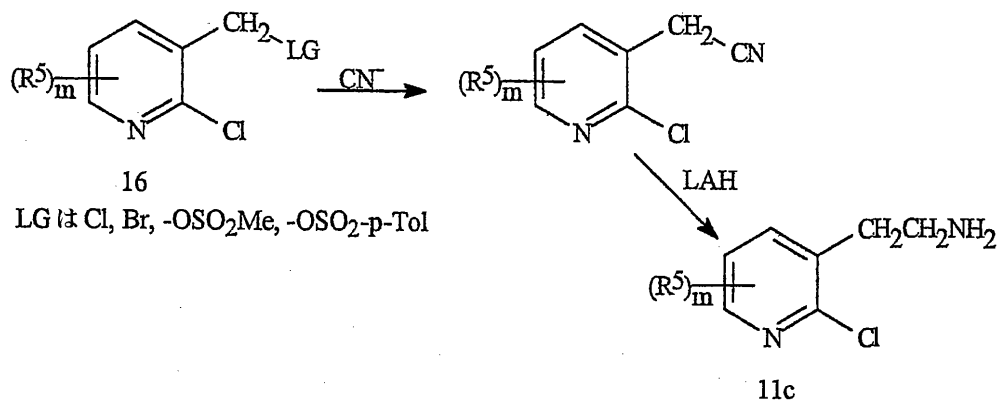
シアニドによる置換、それに続く、例えば水素化アルミニウムリチウムによる還元により、式16の化合物から式11cの化合物を調製することができる(スキーム14)。

## 【0101】

20

## 【化24】

## スキーム 14



30

## 【0102】

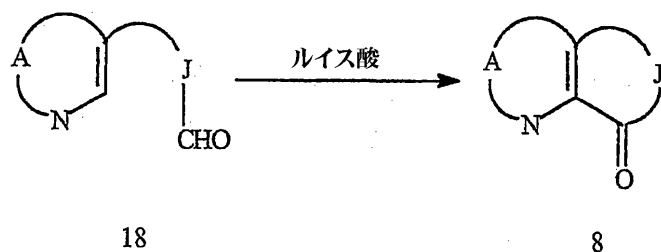
式18の化合物の分子内フリーラジカルアシル化により、式8の化合物を調製することができる(スキーム15)。これらのアシル化は、t-ブチルヒドロペルオキシド、硫酸および硫酸第1鉄の存在下で行われ得る(先行参照に関して、ケミカル コミュニケーションズ(Chem. Communications), 1969, 201およびガゼッタ チミカ イタリアーナ(Gazz. Chim. Ital.) 1977, 107, 491を参照のこと)。

40

## 【0103】

## 【化25】

## スキーム 15



【 0 1 0 4 】

10

式 19 の化合物をプロモアセトアルデヒドジエチルアセタールでアルキル化し、続いてアセタール保護基を酸性加水分解することにより、J が  $\text{OCH}_2$  または  $\text{NHCH}_2$  (それぞれ 18a または 18b) である式 18 の化合物を調製することができる (スキーム 16)。

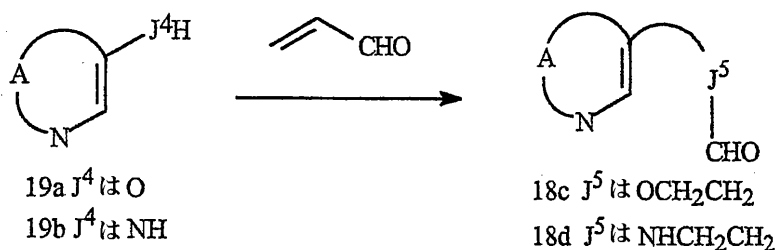
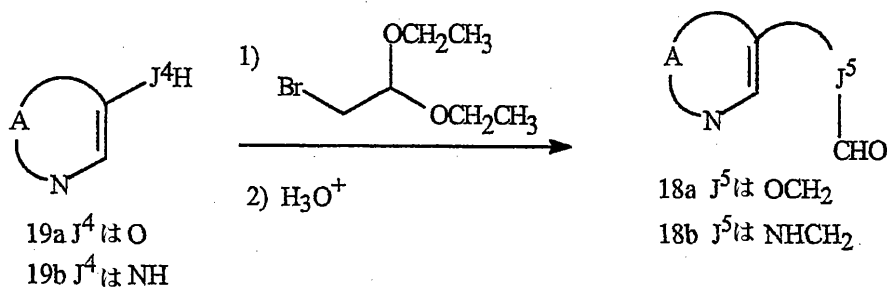
式 19 の化合物をアクロレインでミカエル付加することによって、J が  $\text{OCH}_2\text{CH}_2$  または  $\text{NHCH}_2\text{CH}_2$  (それぞれ 18c または 18d) である式 18 の化合物を調製することができる。

【 0 1 0 5 】

【 化 2 6 】

## スキーム 16

20



30

【 0 1 0 6 】

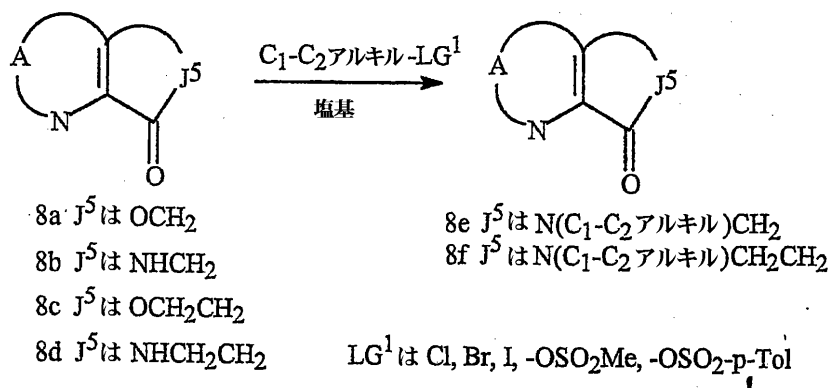
典型的に、炭酸ナトリウムまたはカリウムのような追加の塩基の存在下で、ヨウ化メチルもしくはエチルのようなハロゲン化アルキル、または硫酸ジメチルのような硫酸ジアルキルのようなアルキル化剤による式 8 b または 8 d の化合物のアルキル化により、J が  $\text{N}(\text{C}_1 \sim \text{C}_2 \text{ アルキル})\text{CH}_2$  または  $\text{N}(\text{C}_1 \sim \text{C}_2 \text{ アルキル})\text{CH}_2\text{CH}_2$  (それぞれ 8 e および 8 f) である式 8 の化合物を調製することができる (スキーム 17)。

40

【 0 1 0 7 】

【 化 2 7 】

## スキーム 17



10

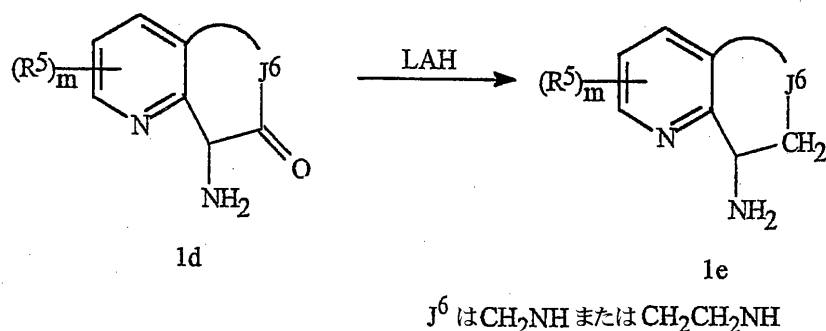
## 【 0 1 0 8 】

水素化アルミニウムリチウムによる式 1 d の化合物の還元により、J<sup>6</sup>が CH<sub>2</sub>NHCH<sub>2</sub> または CH<sub>2</sub>N(C<sub>1</sub>~C<sub>2</sub>アルキル)CH<sub>2</sub>である式 1 e の化合物を調製することができる (スキーム 18)。

## 【 0 1 0 9 】

## 【 化 2 8 】

## スキーム 18



20

30

## 【 0 1 1 0 】

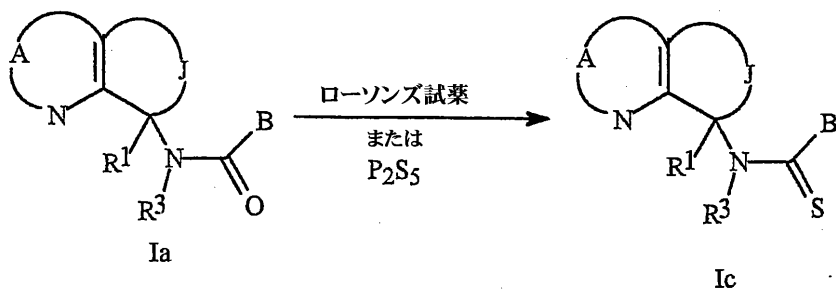
スキーム 19 に概説される通り、式 I c の化合物 (W が C = L であり、かつ L が S である化合物) を合成することができる。適切な溶媒中で、ローソン (Lawesson) 試薬または五硫化リンとアミドを接触させることにより、以下に示される式 I a のアミドを式 I c のチオアミドへと容易に変換することができる (参照のために、ジェリー マーチ (Jerry March) 著、先端有機化学: 反応、機構および構造 (Advanced Organic Chemistry: Reactions, Mechanism and Structure)、第四版、ジョン ウィリー & サンズ (John Wiley & Sons)、ニューヨーク、第 893 ~ 4 頁を参照のこと。 )。

## 【 0 1 1 1 】

## 【 化 2 9 】

40

## スキーム 19



10

## 【0112】

式 I の化合物の調製に関する前記いくつかの試薬および反応条件が、中間体に存在するある種の官能性と適合性がないだろうことが認識される。これらの例において、合成物への保護/脱保護配列または官能基相互転換の組み入れによって、所望の生成物を得ることが助けられる。保護基の使用および選択は、化学合成の当業者に明白である（例えば、グリーン、T. W. (Greene, T. W.); ワッツ、P. G. M. (Wuts, P. G. M.); 有機合成における保護基 (Protective Groups in Organic Synthesis) 第二版; ウィリー (Wiley); ニューヨーク (New York), 1991 を参照のこと)。当業者は、いくつかの場合には、いずれかの個々のスキームに記載されるように、与えられた試薬の導入後、式 I の化合物の合成を完了するために、詳細には記載されていない追加の慣例の合成工程を実行することが必須であることを認識するであろう。また、当業者は、式 I の化合物を調製するために提供される特性の配列により含まれるもの以外、順番で上記スキームに図示された工程の組み合わせを実行することが必須であることも認識するだろう。

20

## 【0113】

当業者は、置換基を付加するため、または存在する置換基を変性するために、本明細書に記載の式 I の化合物および中間体に種々の求電子、求核、ラジカル、有機金属、酸化および還元反応を受けさせることができることも認識するだろう。

## 【0114】

さらなる精練をせずに、前記されたものを使用する当業者は、本発明をその最も十分な範囲まで利用することができると考えられる。従って、以下の実施例は単なる実例として解釈され、かついずれかの様式に本開示を制限するものではない。この実施例の各反応工程の出発物質は、他の工程で手順が記載されている特定の調製実施工程によって調製される必要はない。クロマトグラフィー溶媒混合物を除いて、または特記されない限り、パーセントは重量によるものである。特記されない限り、クロマトグラフィー溶媒混合物に関する部およびパーセントは体積によるものである。<sup>1</sup>H NMR スペクトルは、テトラメチルシランからの ppm 低磁場で報告される。s は一重項であり、d は二重項であり、t は三重項であり、q は四重項であり、m は多重項であり、dd は二重項の二重項であり、dt は三重項の二重項であり、br は広域一重項である。

30

## 【実施例 1】

## 【0115】

## 実施例 1

2, 6 - ジクロロ - N - (5, 6, 7, 8 - テトラヒドロ - 3 - メチル - 8 - キノリニル) ベンズアミドの調製

工程 A: 5, 6, 7, 8 - テトラヒドロ - 3 - メチルキノリンの調製

0 で、トリフルオロ酢酸 (80 mL) 中に 3 - メチルキノリン (20 g、140 ミリモル) を溶解し、そして炭素上 10 重量% パラジウム (10 g) を添加した。室温で、345 kPa (50 psi) の H<sub>2</sub> で、パール (parr) 攪拌装置中で 5 時間、混合物を水素で処理した。得られた混合物をセライト (Celite) (登録商標) (SiO<sub>2</sub> 濾過剤) ベッドを通して濾過して触媒を除去した。メタノール (2 x 20 mL) でセライト (

40

50



C e l l i t e ) ( 登 録 商 標 ) / チ ャ コ ー ル ベ ッ ド を 洗 浄 し た 。 次 い で 濾 液 を 真 空 で 濃 縮 し た 。 2 N N a O H 水 溶 液 と ジ エ チ ル エ ー テ ル の 間 で 残 渣 を 分 配 し た 。 集 め た 有 機 抽 出 物 を 乾 燥 し ( N a <sub>2</sub> S O <sub>4</sub> ) 、 そ し て 濃 縮 し て 表 題 の 化 合 物 を 得 た ( 1 9 g ) 。 <sup>1</sup> H N M R ( C D C l <sub>3</sub> ) : 8 . 1 7 ( s , 1 H ) , 7 . 1 5 ( s , 1 H ) , 2 . 8 7 ( t , J = 6 . 2 H z , 2 H ) , 2 . 7 2 ( t , J = 6 . 4 H z , 2 H ) , 2 . 2 5 ( s , 3 H ) , 1 . 8 6 ( m , 2 H ) , 1 . 8 0 ( m , 2 H ) 。

【 0 1 1 6 】

工 程 B : 5 , 6 , 7 , 8 - テ ト ラ ヒ ド ロ - 3 - メ チ ル - 8 - キ ノ リ ニ ル ア セ テ ー ト の 調 製 室 温 で 、 酢 酸 ( 1 3 0 m L ) 中 5 , 6 , 7 , 8 - テ ト ラ ヒ ド ロ - 3 - メ チ ル キ ノ リ ン ( 3 9 . 1 g 、 2 6 6 ミ リ モ ル ) の 溶 液 を 3 0 % H <sub>2</sub> O <sub>2</sub> 水 溶 液 ( 2 6 m L ) で 処 理 し 、 得 ら れ た 反 応 混 合 物 を 6 時 間 、 7 0 まで 加 熱 し た 。 追 加 部 分 の 3 0 % H <sub>2</sub> O <sub>2</sub> 水 溶 液 ( 2 6 m L ) を 添 加 し 、 そ し て 混 合 物 を 一 晩 、 7 0 まで 加 熱 し た 。 反 応 混 合 物 を 室 温 ま で 冷 却 し 、 真 空 下 で 濃 縮 し た 。 残 渣 を ジ ク ロ ロ メ タ ン 中 に 溶 解 し 、 そ し て N a <sub>2</sub> C O <sub>3</sub> ( 8 7 g ) で 処 理 し た 。 1 時 間 後 、 混 合 物 を 濾 過 し 、 そ し て ジ ク ロ ロ メ タ ン で 洗 浄 し た 。 濾 液 を 真 空 下 で 濃 縮 し 、 半 固 体 油 状 物 を 得 た 。

【 0 1 1 7 】

無 水 酢 酸 ( 2 0 0 m L ) 中 、 半 固 体 油 状 物 の 溶 液 を 一 晩 、 9 0 まで 加 熱 し た 。 反 応 混 合 物 を 室 温 ま で 冷 却 し 、 無 水 酢 酸 を 真 空 下 で 除 去 し た 。 減 圧 下 で の 蒸 留 に よ り 、 表 題 の 化 合 物 ( 4 9 g ) を 得 た 。 <sup>1</sup> H N M R ( C D C l <sub>3</sub> ) : 8 . 3 4 ( s , 1 H ) , 7 . 2 8 ( s , 1 H ) , 5 . 9 3 ( t , J = 4 . 4 H z , 1 H ) , 2 . 8 ( m , 2 H ) , 2 . 3 1 ( s , 3 H ) , 2 . 1 0 ( s , 3 H ) , 2 . 1 8 - 1 . 7 7 ( m , 4 H ) 。

【 0 1 1 8 】

工 程 C : 8 - ク ロ ロ - 5 , 6 , 7 , 8 - テ ト ラ ヒ ド ロ - 3 - メ チ ル キ ノ リ ン の 調 製 メ タ ノ ー ル ( 2 5 0 m L ) 中 、 5 , 6 , 7 , 8 - テ ト ラ ヒ ド ロ - 3 - メ チ ル - 8 - キ ノ リ ニ ル ア セ テ ー ト ( 4 9 g 、 1 9 5 ミ リ モ ル ) お よ び K <sub>2</sub> C O <sub>3</sub> ( 1 0 0 g ) の 懸 濁 液 を 一 晩 、 室 温 で 攪 拌 し た 。 混 合 物 を 水 と ジ ク ロ ロ メ タ ン と の 間 に 分 配 し た 。 集 め た 有 機 抽 出 物 を 乾 燥 し ( N a <sub>2</sub> S O <sub>4</sub> ) 、 そ し て 濃 縮 し た 。 残 渣 を シ リ カ ゲ ル 上 フ ラ ッ シ ュ カ ラ ム ク ロ マ ト グ ラ フ ィ ー に よ り 精 製 し ( 溶 出 剤 と し て ヘ キ サ ン 中 1 0 % か ら 6 0 % の 勾 配 の 酢 酸 を 使 用 す る ) 、 明 茶 色 油 状 物 を 得 た ( 2 4 g ) 。

【 0 1 1 9 】

0 で 、 ジ ク ロ ロ メ タ ン ( 1 5 0 m L ) 中 、 油 状 物 ( 2 4 g ) お よ び ト リ エ チ ル ア ミ ン の 溶 液 に 、 メ タ ン ス ル ホ ン ク ロ リ ド ( 2 5 . 6 g ) を ゆ っ く り 添 加 し た 。 反 応 混 合 物 を 室 温 ま で ゆ っ く り 温 め 、 次 い で 加 熱 し て 一 晩 還 流 し た 。 混 合 物 を 室 温 ま で 冷 却 し 、 そ し て 水 と ジ ク ロ ロ メ タ ン と の 間 に 分 配 し た 。 集 め た 有 機 抽 出 物 を 乾 燥 し ( N a <sub>2</sub> S O <sub>4</sub> ) 、 そ し て 濃 縮 し た 。 残 渣 を シ リ カ ゲ ル 上 フ ラ ッ シ ュ カ ラ ム ク ロ マ ト グ ラ フ ィ ー に よ り 精 製 し ( 溶 出 剤 と し て ヘ キ サ ン 中 1 0 % か ら 6 0 % の 勾 配 の 酢 酸 を 使 用 す る ) 、 明 黄 色 油 状 物 と し て 表 題 の 化 合 物 を 得 た ( 2 1 . 8 g ) 。 <sup>1</sup> H N M R ( C D C l <sub>3</sub> ) : 8 . 3 1 ( s , 1 H ) , 7 . 2 4 ( s , 1 H ) , 5 . 2 9 ( t , J = 3 . 0 H z , 1 H ) , 2 . 8 1 ( m , 1 H ) , 2 . 3 7 ( m , 1 H ) , 2 . 3 0 ( s , 3 H ) , 2 . 1 9 ( m , 2 H ) , 1 . 8 8 ( m , 1 H ) 。

【 0 1 2 0 】

工 程 D : 5 , 6 , 7 , 8 - テ ト ラ ヒ ド ロ - 3 - メ チ ル - 8 - キ ノ リ ン ア ミ ン の 調 製 8 - ク ロ ロ - 5 , 6 , 7 , 8 - テ ト ラ ヒ ド ロ - 3 - メ チ ル キ ノ リ ン ( 2 1 . 8 g ) お よ び ア ジ 化 ナ ト リ ウ ム ( 1 5 . 6 g ) の 懸 濁 液 を 4 時 間 、 7 0 まで 加 熱 し た 。 反 応 混 合 物 を 室 温 ま で 冷 却 し 、 そ し て 水 と ジ エ チ ル エ ー テ ル と の 間 に 分 配 し た 。 集 め た 有 機 抽 出 物 を 乾 燥 し ( N a <sub>2</sub> S O <sub>4</sub> ) 、 そ し て 濃 縮 し た 。 残 渣 ( 1 7 . 2 g ) を メ タ ノ ー ル ( 7 0 m L ) 中 に 溶 解 し 、 そ し て 炭 素 上 1 0 重 量 % パ ラ ジ ウ ム ( 1 . 7 3 g ) を 添 加 し た 。 室 温 で 、 2 7 6 k P a ( 4 0 p s i ) の H <sub>2</sub> で 、 パ ー ル ( p a r r ) 攪 拌 装 置 中 で 4 時 間 、 混 合 物 を 水 素 で 処 理 し た 。 得 ら れ た 混 合 物 を セ ラ イ ト ( C e l l i t e ) ( 登 録 商 標 ) ベ ッ ド を 通 し て 濾 過 し た 。 メ タ ノ ー ル ( 2 x 1 0 m L ) で セ ラ イ ト ( C e l l i t e ) ( 登 録 商 標 ) / チ ャ

10

20

30

40

50

コールベッドを洗浄した。次いで濾液を真空で濃縮して表題の化合物を得た(13g)。  
 $^1\text{H}$  NMR (CDCl<sub>3</sub>) : 8.32 (s, 1H), 7.27 (s, 1H), 4.69 (t, J = 4.1 Hz, 1H), 2.75 (m, 2H), 2.31 (s, 3H), 2.01 - 1.78 (m, 4H)。

## 【0121】

工程E: 2, 6-ジクロロ-N-(5, 6, 7, 8-テトラヒドロ-3-メチル-8-キノリニル)ベンズアミドの調製

アセトニトリル(5mL)中、5, 6, 7, 8-テトラヒドロ-3-メチル-8-キノリンアミン(162mg、1ミリモル)、2, 6-ジクロロメンゾイルクロライド(209.5mg、1ミリモル)およびポリマー支持ジイソプロピルエチルアミン(1.0g、3ミリモル/g)の懸濁液を室温で一晩撹拌した。反応混合物を濾過し、そしてアセトニトリル(2×2mL)で固体を洗浄した。濾液を濃縮し、得られた残渣をシリカゲル上フラッシュカラムクロマトグラフィーにより精製し(溶出剤としてヘキサン中10%から60%の勾配の酢酸を使用する)、本発明の化合物である表題の化合物を得た(190mg)。  
 $^1\text{H}$  NMR (CDCl<sub>3</sub>) : 8.22 (s, 1H), 7.30 (s, 1H), 7.36 - 7.23 (m, 3H), 6.99 (bs, 1H), 5.03 (m, 1H), 2.82 (m, 3H), 2.29 (s, 3H), 1.94 (m, 3H)。

10

## 【0122】

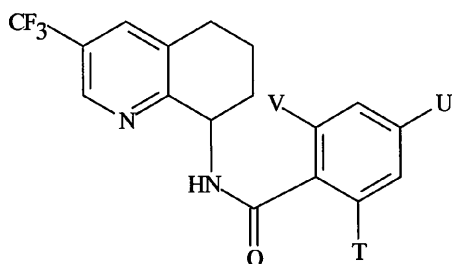
当該分野で既知の方法と一緒に本明細書に記載の手順により、以下の表1~8の化合物を調製することができる。表中では以下の略号を使用する。「Me」はメチルを意味し、「OMe」はメトキシを意味し、「SMe」はメチルチオを意味し、「CN」はシアノを意味し、「NO<sub>2</sub>」はニトロを意味し、「S(O)Me」はメチルスルフィニルを意味し、「S(O)<sub>2</sub>Me」はメチルスルホニルを意味する。置換基MおよびRは、示された位置に位置する独立R<sup>5</sup>置換基と同等である。置換基T、UおよびVは、示された位置に位置する独立R<sup>6</sup>置換基と同等である。

20

## 【0123】

## 【表1】

表 1



30

T	U	V	T	U	V	T	U	V	T	U	V
Me	Me	Me	F	Me	Me	F	F	Me	CF <sub>3</sub>	Me	Me
Me	Me	F	F	Me	F	F	F	F	CF <sub>3</sub>	Me	F
Me	Me	Cl	F	Me	Cl	F	F	Cl	CF <sub>3</sub>	Me	Cl
Me	Me	Br	F	Me	Br	F	F	Br	CF <sub>3</sub>	Me	Br
Me	Me	CF <sub>3</sub>	F	Me	CF <sub>3</sub>	F	F	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	CF <sub>3</sub>
Me	Me	NO <sub>2</sub>	F	Me	NO <sub>2</sub>	F	F	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	NO <sub>2</sub>
Me	Me	OMe	F	Me	OMe	F	F	OMe	CF <sub>3</sub>	Me	OMe

40

## 【0124】

## 【表2】

T	U	V	T	U	V	T	U	V	T	U	V
Me	F	Me	Cl	Me	Me	Cl	F	Me	NO <sub>2</sub>	Me	Me
Me	F	F	Cl	Me	F	Cl	F	F	NO <sub>2</sub>	Me	F
Me	F	Cl	Cl	Me	Cl	Cl	F	Cl	NO <sub>2</sub>	Me	Cl
Me	F	Br	Cl	Me	Br	Cl	F	Br	NO <sub>2</sub>	Me	Br
Me	F	CF <sub>3</sub>	Cl	Me	CF <sub>3</sub>	Cl	F	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	Me	CF <sub>3</sub>
Me	F	NO <sub>2</sub>	Cl	Me	NO <sub>2</sub>	Cl	F	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Me	NO <sub>2</sub>
Me	F	OMe	Cl	Me	OMe	Cl	F	OMe	NO <sub>2</sub>	Me	OMe
Me	Cl	Me	F	Cl	Me	F	Br	Me	CF <sub>3</sub>	F	Me
Me	Cl	F	F	Cl	F	F	Br	F	CF <sub>3</sub>	F	F
Me	Cl	Cl	F	Cl	Cl	F	Br	Cl	CF <sub>3</sub>	F	Cl
Me	Cl	Br	F	Cl	Br	F	Br	Br	CF <sub>3</sub>	F	Br
Me	Cl	CF <sub>3</sub>	F	Cl	CF <sub>3</sub>	F	Br	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	F	CF <sub>3</sub>
Me	Cl	NO <sub>2</sub>	F	Cl	NO <sub>2</sub>	F	Br	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	F	NO <sub>2</sub>
Me	Cl	OMe	F	Cl	OMe	F	Br	OMe	CF <sub>3</sub>	F	OMe
Me	Br	Me	Cl	Cl	Me	Cl	Br	Me	NO <sub>2</sub>	F	Me
Me	Br	F	Cl	Cl	F	Cl	Br	F	NO <sub>2</sub>	F	F
Me	Br	Cl	Cl	Cl	Cl	Cl	Br	Cl	NO <sub>2</sub>	F	Cl
Me	Br	Br	Cl	Cl	Br	Cl	Br	Br	NO <sub>2</sub>	F	Br
Me	Br	CF <sub>3</sub>	Cl	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl	Br	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	F	CF <sub>3</sub>
Me	Br	NO <sub>2</sub>	Cl	Cl	NO <sub>2</sub>	Cl	Br	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	F	NO <sub>2</sub>
Me	Br	OMe	Cl	Cl	OMe	Cl	Br	OMe	NO <sub>2</sub>	F	OMe
Me	CF <sub>3</sub>	Me	F	CF <sub>3</sub>	Me	F	NO <sub>2</sub>	Me	CF <sub>3</sub>	Cl	Me
Me	CF <sub>3</sub>	F	F	CF <sub>3</sub>	F	F	NO <sub>2</sub>	F	CF <sub>3</sub>	Cl	F
Me	CF <sub>3</sub>	Cl	F	CF <sub>3</sub>	Cl	F	NO <sub>2</sub>	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl	Cl
Me	CF <sub>3</sub>	Br	F	CF <sub>3</sub>	Br	F	NO <sub>2</sub>	Br	CF <sub>3</sub>	Cl	Br
Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	F	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	F	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Cl	CF <sub>3</sub>
Me	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	F	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	F	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	Cl	NO <sub>2</sub>
Me	CF <sub>3</sub>	OMe	F	CF <sub>3</sub>	OMe	F	NO <sub>2</sub>	OMe	CF <sub>3</sub>	Cl	OMe
Me	NO <sub>2</sub>	Me	Cl	CF <sub>3</sub>	Me	Cl	NO <sub>2</sub>	Me	NO <sub>2</sub>	Cl	Me
Me	NO <sub>2</sub>	F	Cl	CF <sub>3</sub>	F	Cl	NO <sub>2</sub>	F	NO <sub>2</sub>	Cl	F
Me	NO <sub>2</sub>	Cl	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl	Cl	NO <sub>2</sub>	Cl	NO <sub>2</sub>	Cl	Cl
Me	NO <sub>2</sub>	Br	Cl	CF <sub>3</sub>	Br	Cl	NO <sub>2</sub>	Br	NO <sub>2</sub>	Cl	Br
Me	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Cl	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	Cl	CF <sub>3</sub>
Me	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Cl	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	Cl	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Cl	NO <sub>2</sub>
Me	NO <sub>2</sub>	OMe	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe	Cl	NO <sub>2</sub>	OMe	NO <sub>2</sub>	Cl	OMe
Me	OMe	Me	F	OMe	Me	F	H	Me	CF <sub>3</sub>	Br	Me
Me	OMe	F	F	OMe	F	F	H	F	CF <sub>3</sub>	Br	F

10

20

30

40

【 0 1 2 5 】

【 表 3 】

T	U	V	T	U	V	T	U	V	T	U	V
Me	OMe	Cl	F	OMe	Cl	F	H	Cl	CF <sub>3</sub>	Br	Cl
Me	OMe	Br	F	OMe	Br	F	H	Br	CF <sub>3</sub>	Br	Br
Me	OMe	CF <sub>3</sub>	F	OMe	CF <sub>3</sub>	F	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Br	CF <sub>3</sub>
Me	OMe	NO <sub>2</sub>	F	OMe	NO <sub>2</sub>	F	H	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	Br	NO <sub>2</sub>
Me	OMe	OMe	F	OMe	OMe	F	H	OMe	CF <sub>3</sub>	Br	OMe
Me	H	Me	Cl	OMe	Me	Cl	H	Me	NO <sub>2</sub>	Br	Me
Me	H	F	Cl	OMe	F	Cl	H	F	NO <sub>2</sub>	Br	F
Me	H	Cl	Cl	OMe	Cl	Cl	H	Cl	NO <sub>2</sub>	Br	Cl
Me	H	Br	Cl	OMe	Br	Cl	H	Br	NO <sub>2</sub>	Br	Br
Me	H	CF <sub>3</sub>	Cl	OMe	CF <sub>3</sub>	Cl	H	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	Br	CF <sub>3</sub>
Me	H	NO <sub>2</sub>	Cl	OMe	NO <sub>2</sub>	Cl	H	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Br	NO <sub>2</sub>
Me	H	OMe	Cl	OMe	OMe	Cl	H	OMe	NO <sub>2</sub>	Br	OMe
OMe	Me	Me	Br	Me	Me	Br	F	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me
OMe	Me	F	Br	Me	F	Br	F	F	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	F
OMe	Me	Cl	Br	Me	Cl	Br	F	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Cl
OMe	Me	Br	Br	Me	Br	Br	F	Br	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Br
OMe	Me	CF <sub>3</sub>	Br	Me	CF <sub>3</sub>	Br	F	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
OMe	Me	NO <sub>2</sub>	Br	Me	NO <sub>2</sub>	Br	F	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>
OMe	Me	OMe	Br	Me	OMe	Br	F	OMe	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	OMe
OMe	F	Me	Br	Cl	Me	Br	Br	Me	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	Me
OMe	F	F	Br	Cl	F	Br	Br	F	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	F
OMe	F	Cl	Br	Cl	Cl	Br	Br	Cl	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	Cl
OMe	F	Br	Br	Cl	Br	Br	Br	Br	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	Br
OMe	F	CF <sub>3</sub>	Br	Cl	CF <sub>3</sub>	Br	Br	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
OMe	F	NO <sub>2</sub>	Br	Cl	NO <sub>2</sub>	Br	Br	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>
OMe	F	OMe	Br	Cl	OMe	Br	Br	OMe	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	OMe
OMe	Cl	Me	Br	CF <sub>3</sub>	Me	Br	NO <sub>2</sub>	Me	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	Me
OMe	Cl	F	Br	CF <sub>3</sub>	F	Br	NO <sub>2</sub>	F	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	F
OMe	Cl	Cl	Br	CF <sub>3</sub>	Cl	Br	NO <sub>2</sub>	Cl	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	Cl
OMe	Cl	Br	Br	CF <sub>3</sub>	Br	Br	NO <sub>2</sub>	Br	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	Br
OMe	Cl	CF <sub>3</sub>	Br	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Br	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>
OMe	Cl	NO <sub>2</sub>	Br	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	Br	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>
OMe	Cl	OMe	Br	CF <sub>3</sub>	OMe	Br	NO <sub>2</sub>	OMe	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	OMe
OMe	H	Me	Br	OMe	Me	Br	H	Me	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Me
OMe	H	F	Br	OMe	F	Br	H	F	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	F
OMe	H	Cl	Br	OMe	Cl	Br	H	Cl	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Cl
OMe	H	OMe	Br	OMe	Br	Br	H	Br	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Br

10

20

30

40

【 0 1 2 6 】

【 表 4 】

T	U	V	T	U	V	T	U	V	T	U	V
OMe	OMe	CF <sub>3</sub>	Br	OMe	CF <sub>3</sub>	Br	H	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>
OMe	OMe	NO <sub>2</sub>	Br	OMe	NO <sub>2</sub>	Br	H	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>
OMe	OMe	OMe	Br	OMe	OMe	Br	H	OMe	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	OMe
OMe	Br	Me	OMe	CF <sub>3</sub>	Me	CF <sub>3</sub>	H	Me	CF <sub>3</sub>	OMe	Me
OMe	Br	F	OMe	CF <sub>3</sub>	F	CF <sub>3</sub>	H	F	CF <sub>3</sub>	OMe	F
OMe	Br	Cl	OMe	CF <sub>3</sub>	Cl	CF <sub>3</sub>	H	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe	Cl
OMe	Br	Br	OMe	CF <sub>3</sub>	Br	CF <sub>3</sub>	H	Br	CF <sub>3</sub>	OMe	Br
OMe	Br	CF <sub>3</sub>	OMe	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	OMe	CF <sub>3</sub>
OMe	Br	NO <sub>2</sub>	OMe	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	H	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	OMe	NO <sub>2</sub>
OMe	Br	OMe	OMe	CF <sub>3</sub>	OMe	CF <sub>3</sub>	H	OMe	CF <sub>3</sub>	OMe	OMe
OMe	H	Br	OMe	NO <sub>2</sub>	Me	NO <sub>2</sub>	H	Me	NO <sub>2</sub>	OMe	Me
OMe	H	CF <sub>3</sub>	OMe	NO <sub>2</sub>	F	NO <sub>2</sub>	H	F	NO <sub>2</sub>	OMe	F
OMe	H	NO <sub>2</sub>	OMe	NO <sub>2</sub>	Cl	NO <sub>2</sub>	H	Cl	NO <sub>2</sub>	OMe	Cl
OMe	OMe	Me	OMe	NO <sub>2</sub>	Br	NO <sub>2</sub>	H	Br	NO <sub>2</sub>	OMe	Br
OMe	OMe	F	OMe	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	H	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	OMe	CF <sub>3</sub>
OMe	OMe	Cl	OMe	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	H	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	OMe	NO <sub>2</sub>
OMe	OMe	Br	OMe	NO <sub>2</sub>	OMe	NO <sub>2</sub>	H	OMe	NO <sub>2</sub>	OMe	OMe

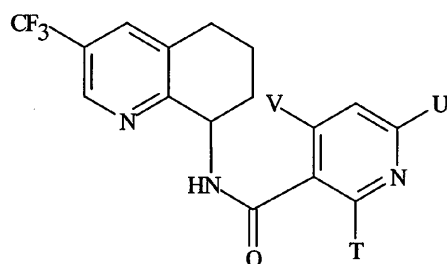
10

20

【 0 1 2 7 】

【 表 5 】

表 2



30

T	U	V	T	U	V	T	U	V	T	U	V
Me	Me	Me	F	Me	Me	F	F	Me	CF <sub>3</sub>	Me	Me
Me	Me	F	F	Me	F	F	F	F	CF <sub>3</sub>	Me	F
Me	Me	Cl	F	Me	Cl	F	F	Cl	CF <sub>3</sub>	Me	Cl
Me	Me	Br	F	Me	Br	F	F	Br	CF <sub>3</sub>	Me	Br
Me	Me	CF <sub>3</sub>	F	Me	CF <sub>3</sub>	F	F	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	CF <sub>3</sub>
Me	Me	NO <sub>2</sub>	F	Me	NO <sub>2</sub>	F	F	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	NO <sub>2</sub>
Me	Me	OMe	F	Me	OMe	F	F	OMe	CF <sub>3</sub>	Me	OMe
Me	F	Me	Cl	Me	Me	Cl	F	Me	NO <sub>2</sub>	Me	Me
Me	F	F	Cl	Me	F	Cl	F	F	NO <sub>2</sub>	Me	F
Me	F	Cl	Cl	Me	Cl	Cl	F	Cl	NO <sub>2</sub>	Me	Cl

40

【 0 1 2 8 】

50

【表 6】

T	U	V	T	U	V	T	U	V	T	U	V
Me	F	Br	Cl	Me	Br	Cl	F	Br	NO <sub>2</sub>	Me	Br
Me	F	CF <sub>3</sub>	Cl	Me	CF <sub>3</sub>	Cl	F	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	Me	CF <sub>3</sub>
Me	F	NO <sub>2</sub>	Cl	Me	NO <sub>2</sub>	Cl	F	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Me	NO <sub>2</sub>
Me	F	OMe	Cl	Me	OMe	Cl	F	OMe	NO <sub>2</sub>	Me	OMe
Me	Cl	Me	F	Cl	Me	F	Br	Me	CF <sub>3</sub>	F	Me
Me	Cl	F	F	Cl	F	F	Br	F	CF <sub>3</sub>	F	F
Me	Cl	Cl	F	Cl	Cl	F	Br	Cl	CF <sub>3</sub>	F	Cl
Me	Cl	Br	F	Cl	Br	F	Br	Br	CF <sub>3</sub>	F	Br
Me	Cl	CF <sub>3</sub>	F	Cl	CF <sub>3</sub>	F	Br	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	F	CF <sub>3</sub>
Me	Cl	NO <sub>2</sub>	F	Cl	NO <sub>2</sub>	F	Br	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	F	NO <sub>2</sub>
Me	Cl	OMe	F	Cl	OMe	F	Br	OMe	CF <sub>3</sub>	F	OMe
Me	Br	Me	Cl	Cl	Me	Cl	Br	Me	NO <sub>2</sub>	F	Me
Me	Br	F	Cl	Cl	F	Cl	Br	F	NO <sub>2</sub>	F	F
Me	Br	Cl	Cl	Cl	Cl	Cl	Br	Cl	NO <sub>2</sub>	F	Cl
Me	Br	Br	Cl	Cl	Br	Cl	Br	Br	NO <sub>2</sub>	F	Br
Me	Br	CF <sub>3</sub>	Cl	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl	Br	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	F	CF <sub>3</sub>
Me	Br	NO <sub>2</sub>	Cl	Cl	NO <sub>2</sub>	Cl	Br	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	F	NO <sub>2</sub>
Me	Br	OMe	Cl	Cl	OMe	Cl	Br	OMe	NO <sub>2</sub>	F	OMe
Me	CF <sub>3</sub>	Me	F	CF <sub>3</sub>	Me	F	NO <sub>2</sub>	Me	CF <sub>3</sub>	Cl	Me
Me	CF <sub>3</sub>	F	F	CF <sub>3</sub>	F	F	NO <sub>2</sub>	F	CF <sub>3</sub>	Cl	F
Me	CF <sub>3</sub>	Cl	F	CF <sub>3</sub>	Cl	F	NO <sub>2</sub>	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl	Cl
Me	CF <sub>3</sub>	Br	F	CF <sub>3</sub>	Br	F	NO <sub>2</sub>	Br	CF <sub>3</sub>	Cl	Br
Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	F	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	F	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Cl	CF <sub>3</sub>
Me	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	F	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	F	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	Cl	NO <sub>2</sub>
Me	CF <sub>3</sub>	OMe	F	CF <sub>3</sub>	OMe	F	NO <sub>2</sub>	OMe	CF <sub>3</sub>	Cl	OMe
Me	NO <sub>2</sub>	Me	Cl	CF <sub>3</sub>	Me	Cl	NO <sub>2</sub>	Me	NO <sub>2</sub>	Cl	Me
Me	NO <sub>2</sub>	F	Cl	CF <sub>3</sub>	F	Cl	NO <sub>2</sub>	F	NO <sub>2</sub>	Cl	F
Me	NO <sub>2</sub>	Cl	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl	Cl	NO <sub>2</sub>	Cl	NO <sub>2</sub>	Cl	Cl
Me	NO <sub>2</sub>	Br	Cl	CF <sub>3</sub>	Br	Cl	NO <sub>2</sub>	Br	NO <sub>2</sub>	Cl	Br
Me	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Cl	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	Cl	CF <sub>3</sub>
Me	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Cl	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	Cl	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Cl	NO <sub>2</sub>
Me	NO <sub>2</sub>	OMe	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe	Cl	NO <sub>2</sub>	OMe	NO <sub>2</sub>	Cl	OMe
Me	OMe	Me	F	OMe	Me	F	H	Me	CF <sub>3</sub>	Br	Me
Me	OMe	F	F	OMe	F	F	H	F	CF <sub>3</sub>	Br	F
Me	OMe	Cl	F	OMe	Cl	F	H	Cl	CF <sub>3</sub>	Br	Cl
Me	OMe	Br	F	OMe	Br	F	H	Br	CF <sub>3</sub>	Br	Br
Me	OMe	CF <sub>3</sub>	F	OMe	CF <sub>3</sub>	F	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Br	CF <sub>3</sub>

10

20

30

40

【 0 1 2 9 】

【表 7】

T	U	V	T	U	V	T	U	V	T	U	V
Me	OMe	NO <sub>2</sub>	F	OMe	NO <sub>2</sub>	F	H	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	Br	NO <sub>2</sub>
Me	OMe	OMe	F	OMe	OMe	F	H	OMe	CF <sub>3</sub>	Br	OMe
Me	H	Me	Cl	OMe	Me	Cl	H	Me	NO <sub>2</sub>	Br	Me
Me	H	F	Cl	OMe	F	Cl	H	F	NO <sub>2</sub>	Br	F
Me	H	Cl	Cl	OMe	Cl	Cl	H	Cl	NO <sub>2</sub>	Br	Cl
Me	H	Br	Cl	OMe	Br	Cl	H	Br	NO <sub>2</sub>	Br	Br
Me	H	CF <sub>3</sub>	Cl	OMe	CF <sub>3</sub>	Cl	H	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	Br	CF <sub>3</sub>
Me	H	NO <sub>2</sub>	Cl	OMe	NO <sub>2</sub>	Cl	H	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Br	NO <sub>2</sub>
Me	H	OMe	Cl	OMe	OMe	Cl	H	OMe	NO <sub>2</sub>	Br	OMe
OMe	Me	Me	Br	Me	Me	Br	F	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me
OMe	Me	F	Br	Me	F	Br	F	F	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	F
OMe	Me	Cl	Br	Me	Cl	Br	F	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Cl
OMe	Me	Br	Br	Me	Br	Br	F	Br	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Br
OMe	Me	CF <sub>3</sub>	Br	Me	CF <sub>3</sub>	Br	F	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
OMe	Me	NO <sub>2</sub>	Br	Me	NO <sub>2</sub>	Br	F	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>
OMe	Me	OMe	Br	Me	OMe	Br	F	OMe	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	OMe
OMe	F	Me	Br	Cl	Me	Br	Br	Me	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	Me
OMe	F	F	Br	Cl	F	Br	Br	F	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	F
OMe	F	Cl	Br	Cl	Cl	Br	Br	Cl	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	Cl
OMe	F	Br	Br	Cl	Br	Br	Br	Br	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	Br
OMe	F	CF <sub>3</sub>	Br	Cl	CF <sub>3</sub>	Br	Br	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
OMe	F	NO <sub>2</sub>	Br	Cl	NO <sub>2</sub>	Br	Br	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>
OMe	F	OMe	Br	Cl	OMe	Br	Br	OMe	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	OMe
OMe	Cl	Me	Br	CF <sub>3</sub>	Me	Br	NO <sub>2</sub>	Me	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	Me
OMe	Cl	F	Br	CF <sub>3</sub>	F	Br	NO <sub>2</sub>	F	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	F
OMe	Cl	Cl	Br	CF <sub>3</sub>	Cl	Br	NO <sub>2</sub>	Cl	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	Cl
OMe	Cl	Br	Br	CF <sub>3</sub>	Br	Br	NO <sub>2</sub>	Br	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	Br
OMe	Cl	CF <sub>3</sub>	Br	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Br	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>
OMe	Cl	NO <sub>2</sub>	Br	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	Br	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>
OMe	Cl	OMe	Br	CF <sub>3</sub>	OMe	Br	NO <sub>2</sub>	OMe	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	OMe
OMe	H	Me	Br	OMe	Me	Br	H	Me	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Me
OMe	H	F	Br	OMe	F	Br	H	F	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	F
OMe	H	Cl	Br	OMe	Cl	Br	H	Cl	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Cl
OMe	H	OMe	Br	OMe	Br	Br	H	Br	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Br
OMe	OMe	CF <sub>3</sub>	Br	OMe	CF <sub>3</sub>	Br	H	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>

10

20

30

40

【 0 1 3 0 】

【 表 8 】

T	U	V	T	U	V	T	U	V	T	U	V
OMe	OMe	NO <sub>2</sub>	Br	OMe	NO <sub>2</sub>	Br	H	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>
OMe	OMe	OMe	Br	OMe	OMe	Br	H	OMe	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	OMe
OMe	Br	Me	OMe	CF <sub>3</sub>	Me	CF <sub>3</sub>	H	Me	CF <sub>3</sub>	OMe	Me
OMe	Br	F	OMe	CF <sub>3</sub>	F	CF <sub>3</sub>	H	F	CF <sub>3</sub>	OMe	F
OMe	Br	Cl	OMe	CF <sub>3</sub>	Cl	CF <sub>3</sub>	H	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe	Cl
OMe	Br	Br	OMe	CF <sub>3</sub>	Br	CF <sub>3</sub>	H	Br	CF <sub>3</sub>	OMe	Br
OMe	Br	CF <sub>3</sub>	OMe	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	OMe	CF <sub>3</sub>
OMe	Br	NO <sub>2</sub>	OMe	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	H	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	OMe	NO <sub>2</sub>
OMe	Br	OMe	OMe	CF <sub>3</sub>	OMe	CF <sub>3</sub>	H	OMe	CF <sub>3</sub>	OMe	OMe
OMe	H	Br	OMe	NO <sub>2</sub>	Me	NO <sub>2</sub>	H	Me	NO <sub>2</sub>	OMe	Me
OMe	H	CF <sub>3</sub>	OMe	NO <sub>2</sub>	F	NO <sub>2</sub>	H	F	NO <sub>2</sub>	OMe	F
OMe	H	NO <sub>2</sub>	OMe	NO <sub>2</sub>	Cl	NO <sub>2</sub>	H	Cl	NO <sub>2</sub>	OMe	Cl
OMe	OMe	Me	OMe	NO <sub>2</sub>	Br	NO <sub>2</sub>	H	Br	NO <sub>2</sub>	OMe	Br
OMe	OMe	F	OMe	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	H	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	OMe	CF <sub>3</sub>
OMe	OMe	Cl	OMe	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	H	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	OMe	NO <sub>2</sub>
OMe	OMe	Br	OMe	NO <sub>2</sub>	OMe	NO <sub>2</sub>	H	OMe	NO <sub>2</sub>	OMe	OMe

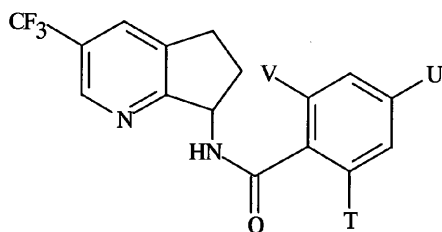
10

20

【 0 1 3 1 】

【 表 9 】

表 3



30

T	U	V	T	U	V	T	U	V	T	U	V
Me	Me	Me	F	Me	Me	F	F	Me	CF <sub>3</sub>	Me	Me
Me	Me	F	F	Me	F	F	F	F	CF <sub>3</sub>	Me	F
Me	Me	Cl	F	Me	Cl	F	F	Cl	CF <sub>3</sub>	Me	Cl
Me	Me	Br	F	Me	Br	F	F	Br	CF <sub>3</sub>	Me	Br
Me	Me	CF <sub>3</sub>	F	Me	CF <sub>3</sub>	F	F	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	CF <sub>3</sub>
Me	Me	NO <sub>2</sub>	F	Me	NO <sub>2</sub>	F	F	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	NO <sub>2</sub>
Me	Me	OMe	F	Me	OMe	F	F	OMe	CF <sub>3</sub>	Me	OMe
Me	F	Me	Cl	Me	Me	Cl	F	Me	NO <sub>2</sub>	Me	Me
Me	F	F	Cl	Me	F	Cl	F	F	NO <sub>2</sub>	Me	F
Me	F	Cl	Cl	Me	Cl	Cl	F	Cl	NO <sub>2</sub>	Me	Cl
Me	F	Br	Cl	Me	Br	Cl	F	Br	NO <sub>2</sub>	Me	Br
Me	F	CF <sub>3</sub>	Cl	Me	CF <sub>3</sub>	Cl	F	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	Me	CF <sub>3</sub>

40

【 0 1 3 2 】

50



【表 1 0】

T	U	V	T	U	V	T	U	V	T	U	V
Me	F	NO <sub>2</sub>	Cl	Me	NO <sub>2</sub>	Cl	F	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Me	NO <sub>2</sub>
Me	F	OMe	Cl	Me	OMe	Cl	F	OMe	NO <sub>2</sub>	Me	OMe
Me	Cl	Me	F	Cl	Me	F	Br	Me	CF <sub>3</sub>	F	Me
Me	Cl	F	F	Cl	F	F	Br	F	CF <sub>3</sub>	F	F
Me	Cl	Cl	F	Cl	Cl	F	Br	Cl	CF <sub>3</sub>	F	Cl
Me	Cl	Br	F	Cl	Br	F	Br	Br	CF <sub>3</sub>	F	Br
Me	Cl	CF <sub>3</sub>	F	Cl	CF <sub>3</sub>	F	Br	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	F	CF <sub>3</sub>
Me	Cl	NO <sub>2</sub>	F	Cl	NO <sub>2</sub>	F	Br	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	F	NO <sub>2</sub>
Me	Cl	OMe	F	Cl	OMe	F	Br	OMe	CF <sub>3</sub>	F	OMe
Me	Br	Me	Cl	Cl	Me	Cl	Br	Me	NO <sub>2</sub>	F	Me
Me	Br	F	Cl	Cl	F	Cl	Br	F	NO <sub>2</sub>	F	F
Me	Br	Cl	Cl	Cl	Cl	Cl	Br	Cl	NO <sub>2</sub>	F	Cl
Me	Br	Br	Cl	Cl	Br	Cl	Br	Br	NO <sub>2</sub>	F	Br
Me	Br	CF <sub>3</sub>	Cl	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl	Br	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	F	CF <sub>3</sub>
Me	Br	NO <sub>2</sub>	Cl	Cl	NO <sub>2</sub>	Cl	Br	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	F	NO <sub>2</sub>
Me	Br	OMe	Cl	Cl	OMe	Cl	Br	OMe	NO <sub>2</sub>	F	OMe
Me	CF <sub>3</sub>	Me	F	CF <sub>3</sub>	Me	F	NO <sub>2</sub>	Me	CF <sub>3</sub>	Cl	Me
Me	CF <sub>3</sub>	F	F	CF <sub>3</sub>	F	F	NO <sub>2</sub>	F	CF <sub>3</sub>	Cl	F
Me	CF <sub>3</sub>	Cl	F	CF <sub>3</sub>	Cl	F	NO <sub>2</sub>	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl	Cl
Me	CF <sub>3</sub>	Br	F	CF <sub>3</sub>	Br	F	NO <sub>2</sub>	Br	CF <sub>3</sub>	Cl	Br
Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	F	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	F	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Cl	CF <sub>3</sub>
Me	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	F	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	F	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	Cl	NO <sub>2</sub>
Me	CF <sub>3</sub>	OMe	F	CF <sub>3</sub>	OMe	F	NO <sub>2</sub>	OMe	CF <sub>3</sub>	Cl	OMe
Me	NO <sub>2</sub>	Me	Cl	CF <sub>3</sub>	Me	Cl	NO <sub>2</sub>	Me	NO <sub>2</sub>	Cl	Me
Me	NO <sub>2</sub>	F	Cl	CF <sub>3</sub>	F	Cl	NO <sub>2</sub>	F	NO <sub>2</sub>	Cl	F
Me	NO <sub>2</sub>	Cl	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl	Cl	NO <sub>2</sub>	Cl	NO <sub>2</sub>	Cl	Cl
Me	NO <sub>2</sub>	Br	Cl	CF <sub>3</sub>	Br	Cl	NO <sub>2</sub>	Br	NO <sub>2</sub>	Cl	Br
Me	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Cl	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	Cl	CF <sub>3</sub>
Me	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Cl	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	Cl	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Cl	NO <sub>2</sub>
Me	NO <sub>2</sub>	OMe	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe	Cl	NO <sub>2</sub>	OMe	NO <sub>2</sub>	Cl	OMe
Me	OMe	Me	F	OMe	Me	F	H	Me	CF <sub>3</sub>	Br	Me
Me	OMe	F	F	OMe	F	F	H	F	CF <sub>3</sub>	Br	F
Me	OMe	Cl	F	OMe	Cl	F	H	Cl	CF <sub>3</sub>	Br	Cl
Me	OMe	Br	F	OMe	Br	F	H	Br	CF <sub>3</sub>	Br	Br
Me	OMe	CF <sub>3</sub>	F	OMe	CF <sub>3</sub>	F	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Br	CF <sub>3</sub>
Me	OMe	NO <sub>2</sub>	F	OMe	NO <sub>2</sub>	F	H	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	Br	NO <sub>2</sub>
Me	OMe	OMe	F	OMe	OMe	F	H	OMe	CF <sub>3</sub>	Br	OMe

10

20

30

40

【 0 1 3 3 】

【表 1 1】

T	U	V	T	U	V	T	U	V	T	U	V
Me	H	Me	Cl	OMe	Me	Cl	H	Me	NO <sub>2</sub>	Br	Me
Me	H	F	Cl	OMe	F	Cl	H	F	NO <sub>2</sub>	Br	F
Me	H	Cl	Cl	OMe	Cl	Cl	H	Cl	NO <sub>2</sub>	Br	Cl
Me	H	Br	Cl	OMe	Br	Cl	H	Br	NO <sub>2</sub>	Br	Br
Me	H	CF <sub>3</sub>	Cl	OMe	CF <sub>3</sub>	Cl	H	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	Br	CF <sub>3</sub>
Me	H	NO <sub>2</sub>	Cl	OMe	NO <sub>2</sub>	Cl	H	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Br	NO <sub>2</sub>
Me	H	OMe	Cl	OMe	OMe	Cl	H	OMe	NO <sub>2</sub>	Br	OMe
OMe	Me	Me	Br	Me	Me	Br	F	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me
OMe	Me	F	Br	Me	F	Br	F	F	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	F
OMe	Me	Cl	Br	Me	Cl	Br	F	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Cl
OMe	Me	Br	Br	Me	Br	Br	F	Br	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Br
OMe	Me	CF <sub>3</sub>	Br	Me	CF <sub>3</sub>	Br	F	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
OMe	Me	NO <sub>2</sub>	Br	Me	NO <sub>2</sub>	Br	F	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>
OMe	Me	OMe	Br	Me	OMe	Br	F	OMe	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	OMe
OMe	F	Me	Br	Cl	Me	Br	Br	Me	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	Me
OMe	F	F	Br	Cl	F	Br	Br	F	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	F
OMe	F	Cl	Br	Cl	Cl	Br	Br	Cl	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	Cl
OMe	F	Br	Br	Cl	Br	Br	Br	Br	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	Br
OMe	F	CF <sub>3</sub>	Br	Cl	CF <sub>3</sub>	Br	Br	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
OMe	F	NO <sub>2</sub>	Br	Cl	NO <sub>2</sub>	Br	Br	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>
OMe	F	OMe	Br	Cl	OMe	Br	Br	OMe	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	OMe
OMe	Cl	Me	Br	CF <sub>3</sub>	Me	Br	NO <sub>2</sub>	Me	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	Me
OMe	Cl	F	Br	CF <sub>3</sub>	F	Br	NO <sub>2</sub>	F	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	F
OMe	Cl	Cl	Br	CF <sub>3</sub>	Cl	Br	NO <sub>2</sub>	Cl	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	Cl
OMe	Cl	Br	Br	CF <sub>3</sub>	Br	Br	NO <sub>2</sub>	Br	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	Br
OMe	Cl	CF <sub>3</sub>	Br	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Br	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>
OMe	Cl	NO <sub>2</sub>	Br	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	Br	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>
OMe	Cl	OMe	Br	CF <sub>3</sub>	OMe	Br	NO <sub>2</sub>	OMe	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	OMe
OMe	H	Me	Br	OMe	Me	Br	H	Me	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Me
OMe	H	F	Br	OMe	F	Br	H	F	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	F
OMe	H	Cl	Br	OMe	Cl	Br	H	Cl	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Cl
OMe	H	OMe	Br	OMe	Br	Br	H	Br	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Br
OMe	OMe	CF <sub>3</sub>	Br	OMe	CF <sub>3</sub>	Br	H	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>
OMe	OMe	NO <sub>2</sub>	Br	OMe	NO <sub>2</sub>	Br	H	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>
OMe	OMe	OMe	Br	OMe	OMe	Br	H	OMe	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	OMe
OMe	Br	Me	OMe	CF <sub>3</sub>	Me	CF <sub>3</sub>	H	Me	CF <sub>3</sub>	OMe	Me
OMe	Br	F	OMe	CF <sub>3</sub>	F	CF <sub>3</sub>	H	F	CF <sub>3</sub>	OMe	F

10

20

30

40

【 0 1 3 4 】

【 表 1 2 】

T	U	V	T	U	V	T	U	V	T	U	V
OMe	Br	Cl	OMe	CF <sub>3</sub>	Cl	CF <sub>3</sub>	H	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe	Cl
OMe	Br	Br	OMe	CF <sub>3</sub>	Br	CF <sub>3</sub>	H	Br	CF <sub>3</sub>	OMe	Br
OMe	Br	CF <sub>3</sub>	OMe	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	OMe	CF <sub>3</sub>
OMe	Br	NO <sub>2</sub>	OMe	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	H	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	OMe	NO <sub>2</sub>
OMe	Br	OMe	OMe	CF <sub>3</sub>	OMe	CF <sub>3</sub>	H	OMe	CF <sub>3</sub>	OMe	OMe
OMe	H	Br	OMe	NO <sub>2</sub>	Me	NO <sub>2</sub>	H	Me	NO <sub>2</sub>	OMe	Me
OMe	H	CF <sub>3</sub>	OMe	NO <sub>2</sub>	F	NO <sub>2</sub>	H	F	NO <sub>2</sub>	OMe	F
OMe	H	NO <sub>2</sub>	OMe	NO <sub>2</sub>	Cl	NO <sub>2</sub>	H	Cl	NO <sub>2</sub>	OMe	Cl
OMe	OMe	Me	OMe	NO <sub>2</sub>	Br	NO <sub>2</sub>	H	Br	NO <sub>2</sub>	OMe	Br
OMe	OMe	F	OMe	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	H	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	OMe	CF <sub>3</sub>
OMe	OMe	Cl	OMe	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	H	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	OMe	NO <sub>2</sub>
OMe	OMe	Br	OMe	NO <sub>2</sub>	OMe	NO <sub>2</sub>	H	OMe	NO <sub>2</sub>	OMe	OMe

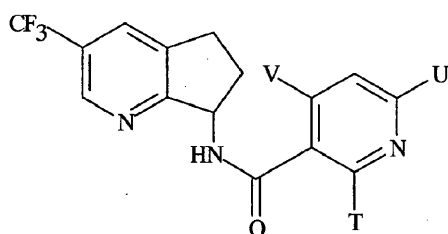
10

【 0 1 3 5 】

【 表 1 3 】

表 4

20



T	U	V	T	U	V	T	U	V	T	U	V
Me	Me	Me	F	Me	Me	F	F	Me	CF <sub>3</sub>	Me	Me
Me	Me	F	F	Me	F	F	F	F	CF <sub>3</sub>	Me	F
Me	Me	Cl	F	Me	Cl	F	F	Cl	CF <sub>3</sub>	Me	Cl
Me	Me	Br	F	Me	Br	F	F	Br	CF <sub>3</sub>	Me	Br
Me	Me	CF <sub>3</sub>	F	Me	CF <sub>3</sub>	F	F	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	CF <sub>3</sub>
Me	Me	NO <sub>2</sub>	F	Me	NO <sub>2</sub>	F	F	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	NO <sub>2</sub>
Me	Me	OMe	F	Me	OMe	F	F	OMe	CF <sub>3</sub>	Me	OMe
Me	F	Me	Cl	Me	Me	Cl	F	Me	NO <sub>2</sub>	Me	Me
Me	F	F	Cl	Me	F	Cl	F	F	NO <sub>2</sub>	Me	F
Me	F	Cl	Cl	Me	Cl	Cl	F	Cl	NO <sub>2</sub>	Me	Cl
Me	F	Br	Cl	Me	Br	Cl	F	Br	NO <sub>2</sub>	Me	Br
Me	F	CF <sub>3</sub>	Cl	Me	CF <sub>3</sub>	Cl	F	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	Me	CF <sub>3</sub>
Me	F	NO <sub>2</sub>	Cl	Me	NO <sub>2</sub>	Cl	F	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Me	NO <sub>2</sub>
Me	F	OMe	Cl	Me	OMe	Cl	F	OMe	NO <sub>2</sub>	Me	OMe
Me	Cl	Me	F	Cl	Me	F	Br	Me	CF <sub>3</sub>	F	Me
Me	Cl	F	F	Cl	F	F	Br	F	CF <sub>3</sub>	F	F

30

40

【 0 1 3 6 】

【 表 1 4 】

50

T	U	V	T	U	V	T	U	V	T	U	V
Me	Cl	Cl	F	Cl	Cl	F	Br	Cl	CF <sub>3</sub>	F	Cl
Me	Cl	Br	F	Cl	Br	F	Br	Br	CF <sub>3</sub>	F	Br
Me	Cl	CF <sub>3</sub>	F	Cl	CF <sub>3</sub>	F	Br	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	F	CF <sub>3</sub>
Me	Cl	NO <sub>2</sub>	F	Cl	NO <sub>2</sub>	F	Br	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	F	NO <sub>2</sub>
Me	Cl	OMe	F	Cl	OMe	F	Br	OMe	CF <sub>3</sub>	F	OMe
Me	Br	Me	Cl	Cl	Me	Cl	Br	Me	NO <sub>2</sub>	F	Me
Me	Br	F	Cl	Cl	F	Cl	Br	F	NO <sub>2</sub>	F	F
Me	Br	Cl	Cl	Cl	Cl	Cl	Br	Cl	NO <sub>2</sub>	F	Cl
Me	Br	Br	Cl	Cl	Br	Cl	Br	Br	NO <sub>2</sub>	F	Br
Me	Br	CF <sub>3</sub>	Cl	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl	Br	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	F	CF <sub>3</sub>
Me	Br	NO <sub>2</sub>	Cl	Cl	NO <sub>2</sub>	Cl	Br	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	F	NO <sub>2</sub>
Me	Br	OMe	Cl	Cl	OMe	Cl	Br	OMe	NO <sub>2</sub>	F	OMe
Me	CF <sub>3</sub>	Me	F	CF <sub>3</sub>	Me	F	NO <sub>2</sub>	Me	CF <sub>3</sub>	Cl	Me
Me	CF <sub>3</sub>	F	F	CF <sub>3</sub>	F	F	NO <sub>2</sub>	F	CF <sub>3</sub>	Cl	F
Me	CF <sub>3</sub>	Cl	F	CF <sub>3</sub>	Cl	F	NO <sub>2</sub>	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl	Cl
Me	CF <sub>3</sub>	Br	F	CF <sub>3</sub>	Br	F	NO <sub>2</sub>	Br	CF <sub>3</sub>	Cl	Br
Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	F	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	F	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Cl	CF <sub>3</sub>
Me	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	F	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	F	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	Cl	NO <sub>2</sub>
Me	CF <sub>3</sub>	OMe	F	CF <sub>3</sub>	OMe	F	NO <sub>2</sub>	OMe	CF <sub>3</sub>	Cl	OMe
Me	NO <sub>2</sub>	Me	Cl	CF <sub>3</sub>	Me	Cl	NO <sub>2</sub>	Me	NO <sub>2</sub>	Cl	Me
Me	NO <sub>2</sub>	F	Cl	CF <sub>3</sub>	F	Cl	NO <sub>2</sub>	F	NO <sub>2</sub>	Cl	F
Me	NO <sub>2</sub>	Cl	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl	Cl	NO <sub>2</sub>	Cl	NO <sub>2</sub>	Cl	Cl
Me	NO <sub>2</sub>	Br	Cl	CF <sub>3</sub>	Br	Cl	NO <sub>2</sub>	Br	NO <sub>2</sub>	Cl	Br
Me	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Cl	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	Cl	CF <sub>3</sub>
Me	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Cl	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	Cl	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Cl	NO <sub>2</sub>
Me	NO <sub>2</sub>	OMe	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe	Cl	NO <sub>2</sub>	OMe	NO <sub>2</sub>	Cl	OMe
Me	OMe	Me	F	OMe	Me	F	H	Me	CF <sub>3</sub>	Br	Me
Me	OMe	F	F	OMe	F	F	H	F	CF <sub>3</sub>	Br	F
Me	OMe	Cl	F	OMe	Cl	F	H	Cl	CF <sub>3</sub>	Br	Cl
Me	OMe	Br	F	OMe	Br	F	H	Br	CF <sub>3</sub>	Br	Br
Me	OMe	CF <sub>3</sub>	F	OMe	CF <sub>3</sub>	F	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Br	CF <sub>3</sub>
Me	OMe	NO <sub>2</sub>	F	OMe	NO <sub>2</sub>	F	H	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	Br	NO <sub>2</sub>
Me	OMe	OMe	F	OMe	OMe	F	H	OMe	CF <sub>3</sub>	Br	OMe
Me	H	Me	Cl	OMe	Me	Cl	H	Me	NO <sub>2</sub>	Br	Me
Me	H	F	Cl	OMe	F	Cl	H	F	NO <sub>2</sub>	Br	F
Me	H	Cl	Cl	OMe	Cl	Cl	H	Cl	NO <sub>2</sub>	Br	Cl
Me	H	Br	Cl	OMe	Br	Cl	H	Br	NO <sub>2</sub>	Br	Br

10

20

30

40

【 0 1 3 7 】

【 表 1 5 】

T	U	V	T	U	V	T	U	V	T	U	V
Me	H	CF <sub>3</sub>	Cl	OMe	CF <sub>3</sub>	Cl	H	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	Br	CF <sub>3</sub>
Me	H	NO <sub>2</sub>	Cl	OMe	NO <sub>2</sub>	Cl	H	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Br	NO <sub>2</sub>
Me	H	OMe	Cl	OMe	OMe	Cl	H	OMe	NO <sub>2</sub>	Br	OMe
OMe	Me	Me	Br	Me	Me	Br	F	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me
OMe	Me	F	Br	Me	F	Br	F	F	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	F
OMe	Me	Cl	Br	Me	Cl	Br	F	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Cl
OMe	Me	Br	Br	Me	Br	Br	F	Br	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Br
OMe	Me	CF <sub>3</sub>	Br	Me	CF <sub>3</sub>	Br	F	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
OMe	Me	NO <sub>2</sub>	Br	Me	NO <sub>2</sub>	Br	F	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>
OMe	Me	OMe	Br	Me	OMe	Br	F	OMe	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	OMe
OMe	F	Me	Br	Cl	Me	Br	Br	Me	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	Me
OMe	F	F	Br	Cl	F	Br	Br	F	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	F
OMe	F	Cl	Br	Cl	Cl	Br	Br	Cl	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	Cl
OMe	F	Br	Br	Cl	Br	Br	Br	Br	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	Br
OMe	F	CF <sub>3</sub>	Br	Cl	CF <sub>3</sub>	Br	Br	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
OMe	F	NO <sub>2</sub>	Br	Cl	NO <sub>2</sub>	Br	Br	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>
OMe	F	OMe	Br	Cl	OMe	Br	Br	OMe	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	OMe
OMe	Cl	Me	Br	CF <sub>3</sub>	Me	Br	NO <sub>2</sub>	Me	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	Me
OMe	Cl	F	Br	CF <sub>3</sub>	F	Br	NO <sub>2</sub>	F	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	F
OMe	Cl	Cl	Br	CF <sub>3</sub>	Cl	Br	NO <sub>2</sub>	Cl	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	Cl
OMe	Cl	Br	Br	CF <sub>3</sub>	Br	Br	NO <sub>2</sub>	Br	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	Br
OMe	Cl	CF <sub>3</sub>	Br	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Br	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>
OMe	Cl	NO <sub>2</sub>	Br	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	Br	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>
OMe	Cl	OMe	Br	CF <sub>3</sub>	OMe	Br	NO <sub>2</sub>	OMe	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	OMe
OMe	H	Me	Br	OMe	Me	Br	H	Me	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Me
OMe	H	F	Br	OMe	F	Br	H	F	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	F
OMe	H	Cl	Br	OMe	Cl	Br	H	Cl	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Cl
OMe	H	OMe	Br	OMe	Br	Br	H	Br	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Br
OMe	OMe	CF <sub>3</sub>	Br	OMe	CF <sub>3</sub>	Br	H	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>
OMe	OMe	NO <sub>2</sub>	Br	OMe	NO <sub>2</sub>	Br	H	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>
OMe	OMe	OMe	Br	OMe	OMe	Br	H	OMe	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	OMe
OMe	Br	Me	OMe	CF <sub>3</sub>	Me	CF <sub>3</sub>	H	Me	CF <sub>3</sub>	OMe	Me
OMe	Br	F	OMe	CF <sub>3</sub>	F	CF <sub>3</sub>	H	F	CF <sub>3</sub>	OMe	F
OMe	Br	Cl	OMe	CF <sub>3</sub>	Cl	CF <sub>3</sub>	H	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe	Cl
OMe	Br	Br	OMe	CF <sub>3</sub>	Br	CF <sub>3</sub>	H	Br	CF <sub>3</sub>	OMe	Br
OMe	Br	CF <sub>3</sub>	OMe	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	OMe	CF <sub>3</sub>
OMe	Br	NO <sub>2</sub>	OMe	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	H	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	OMe	NO <sub>2</sub>

10

20

30

40

【 0 1 3 8 】

【 表 1 6 】

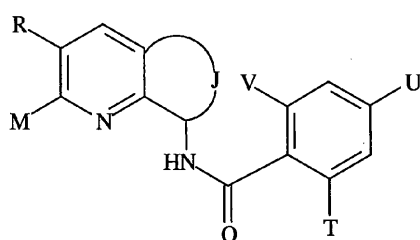
T	U	V	T	U	V	T	U	V	T	U	V
OMe	Br	OMe	OMe	CF <sub>3</sub>	OMe	CF <sub>3</sub>	H	OMe	CF <sub>3</sub>	OMe	OMe
OMe	H	Br	OMe	NO <sub>2</sub>	Me	NO <sub>2</sub>	H	Me	NO <sub>2</sub>	OMe	Me
OMe	H	CF <sub>3</sub>	OMe	NO <sub>2</sub>	F	NO <sub>2</sub>	H	F	NO <sub>2</sub>	OMe	F
OMe	H	NO <sub>2</sub>	OMe	NO <sub>2</sub>	Cl	NO <sub>2</sub>	H	Cl	NO <sub>2</sub>	OMe	Cl
OMe	OMe	Me	OMe	NO <sub>2</sub>	Br	NO <sub>2</sub>	H	Br	NO <sub>2</sub>	OMe	Br
OMe	OMe	F	OMe	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	H	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	OMe	CF <sub>3</sub>
OMe	OMe	Cl	OMe	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	H	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	OMe	NO <sub>2</sub>
OMe	OMe	Br	OMe	NO <sub>2</sub>	OMe	NO <sub>2</sub>	H	OMe	NO <sub>2</sub>	OMe	OMe

10

【 0 1 3 9 】

【 表 1 7 】

表 5



20

T および V は両方とも Cl であり、かつ U は H

J	R	M	J	R	M
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me

30

40

【 0 1 4 0 】

50

【表 18】

T および V は両方とも Cl であり、かつ U は H

J	R	M	J	R	M
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CN	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CN	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SMe	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SMe	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O)Me	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O)Me	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O) <sub>2</sub> Me	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O) <sub>2</sub> Me	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me

10

20

30

40

【0141】

【表 19】

T および V は両方とも Cl であり、かつ U は H

J	R	M	J	R	M
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CN	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CN	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SMe	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SMe	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O)Me	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O)Me	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O) <sub>2</sub> Me	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O) <sub>2</sub> Me	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Me

10

【 0 1 4 2 】

【 表 2 0 】

T および V は両方とも Cl であり、かつ U は Me

J	R	M	J	R	M
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me

20

30

40

【 0 1 4 3 】

【 表 2 1 】

50



CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CN	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CN	Me	
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SMe	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SMe	Me	
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O)Me	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O)Me	Me	
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O) <sub>2</sub> Me	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O) <sub>2</sub> Me	Me	
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Me	
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl	Me	
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br	Me	
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	Me	10
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	Me	
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me	
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me	
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me	
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me	
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>3</sub>	Me	
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	Me	
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me	
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me	20
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me	
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me	
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>3</sub>	Me	
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub>	Me	
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me	
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me	
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me	
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me	30
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me	
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	Me	
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me	
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me	
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me	
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me	
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CN	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CN	Me	
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SMe	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SMe	Me	40
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O)Me	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O)Me	Me	
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O) <sub>2</sub> Me	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O) <sub>2</sub> Me	Me	
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Me	

【 0 1 4 4 】

【 表 2 2 】

T は Cl であり、かつ V および U は両方とも Me

J	R	M	J	R	M
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CN	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CN	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SMe	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SMe	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O)Me	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O)Me	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O) <sub>2</sub> Me	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O) <sub>2</sub> Me	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me

10

20

30

40

【 0 1 4 5 】

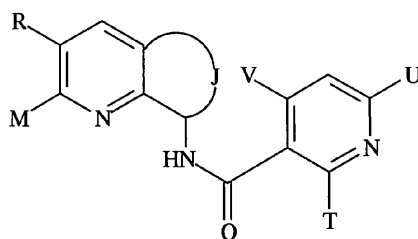
【 表 2 3 】

CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me	
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me	
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me	
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>3</sub>	Me	
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	Me	
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me	
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me	
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me	10
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me	
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>3</sub>	Me	
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub>	Me	
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me	
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me	
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me	
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me	
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me	20
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	Me	
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me	
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me	
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me	
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me	
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CN	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CN	Me	
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SMe	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SMe	Me	
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O)Me	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O)Me	Me	30
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O) <sub>2</sub> Me	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O) <sub>2</sub> Me	Me	
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Me	

【 0 1 4 6 】

【 表 2 4 】

表 6



T および V は両方とも Cl であり、かつ U は H

J	R	M	J	R	M
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CN	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CN	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SMe	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SMe	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O)Me	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O)Me	Me

10

20

30

40

【 0 1 4 7 】

【 表 2 5 】

T および V は両方とも Cl であり、かつ U は H

J	R	M	J	R	M
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O) <sub>2</sub> Me	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O) <sub>2</sub> Me	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CN	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CN	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SMe	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SMe	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O)Me	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O)Me	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O) <sub>2</sub> Me	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O) <sub>2</sub> Me	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Me

10

20

30

40

【 0 1 4 8 】

【 表 2 6 】

T および V は両方とも Cl であり、かつ U は H

J	R	M	J	R	M
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CN	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CN	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SMe	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SMe	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O)Me	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O)Me	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O) <sub>2</sub> Me	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O) <sub>2</sub> Me	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me

10

20

30

40

【 0 1 4 9 】

【 表 2 7 】

T および V は両方とも Cl であり、かつ U は H

J	R	M	J	R	M
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO CHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO CHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO CHF CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO CHF CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CN	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CN	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SMe	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SMe	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O)Me	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O)Me	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O) <sub>2</sub> Me	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O) <sub>2</sub> Me	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Me

10

20

30

【 0 1 5 0 】

【 表 2 8 】

T および V は両方とも Cl であり、かつ U は Me

J	R	M	J	R	M
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me

40

【 0 1 5 1 】

【 表 2 9 】

T および V は両方とも Cl であり、かつ U は Me

J	R	M	J	R	M
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO CHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO CHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO CHF CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO CHF CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CN	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CN	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SMe	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SMe	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O)Me	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O)Me	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O) <sub>2</sub> Me	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O) <sub>2</sub> Me	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me

10

20

30

40

【 0 1 5 2 】

【 表 3 0 】



T および V は両方とも Cl であり、かつ U は Me

J	R	M	J	R	M
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHFCF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHFCF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHFCF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHFCF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHFCF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHFCF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CN	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CN	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SMe	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SMe	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O)Me	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O)Me	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O) <sub>2</sub> Me	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O) <sub>2</sub> Me	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Me

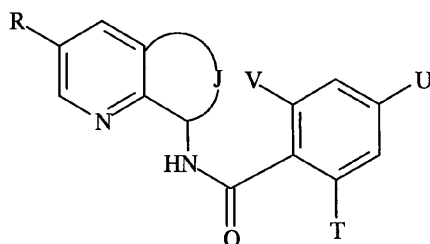
10

20

【 0 1 5 3 】

【 表 3 1 】

表 7



30

T および V は両方とも Cl であり、かつ U は H

J	R	J	R	J	R
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl	OCH <sub>2</sub>	Cl	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br	OCH <sub>2</sub>	Br	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	I	OCH <sub>2</sub>	I	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	I
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>

40

【 0 1 5 4 】

【 表 3 2 】

50

T および V は両方とも Cl であり、かつ U は H

J	R	J	R	J	R
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	Cl	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	Cl
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	Br	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	Br
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	I	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	I	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	I
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	Cl	CONHCO	Cl	CONMeCO	Cl
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	Br	CONHCO	Br	CONMeCO	Br
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	CONHCO	CF <sub>3</sub>	CONMeCO	CF <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CONHCO	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CONMeCO	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>	CONHCO	CONHCH <sub>3</sub>	CONMeCO	CONHCH <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	I	CONHCO	I	CONMeCO	I
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CONHCO	CH <sub>3</sub>	CONMeCO	CH <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	CONHCO	OCF <sub>3</sub>	CONMeCO	OCF <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	CONHCO	OCHF <sub>2</sub>	CONMeCO	OCHF <sub>2</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	CONHCO	OCF <sub>3</sub>	CONMeCO	OCF <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	CONHCO	SCHF <sub>2</sub>	CONMeCO	SCHF <sub>2</sub>

10

20

30

【 0 1 5 5 】

【 表 3 3 】

T および V は両方とも Cl であり、かつ U は Me

J	R	J	R	J	R
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl	OCH <sub>2</sub>	Cl	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br	OCH <sub>2</sub>	Br	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	I	OCH <sub>2</sub>	I	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	I
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>

40

50

【 0 1 5 6 】

【 表 3 4 】

T および V は両方とも Cl であり、かつ U は Me

J	R	J	R	J	R
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	Cl	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	Cl
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	Br	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	Br
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	I	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	I	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	I
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	Cl	CONHCO	Cl	CONMeCO	Cl
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	Br	CONHCO	Br	CONMeCO	Br
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	CONHCO	CF <sub>3</sub>	CONMeCO	CF <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CONHCO	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CONMeCO	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>	CONHCO	CONHCH <sub>3</sub>	CONMeCO	CONHCH <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	I	CONHCO	I	CONMeCO	I
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CONHCO	CH <sub>3</sub>	CONMeCO	CH <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	CONHCO	OCF <sub>3</sub>	CONMeCO	OCF <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	CONHCO	OCHF <sub>2</sub>	CONMeCO	OCHF <sub>2</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	CONHCO	OCF <sub>3</sub>	CONMeCO	OCF <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	CONHCO	SCHF <sub>2</sub>	CONMeCO	SCHF <sub>2</sub>

10

20

30

【 0 1 5 7 】

【 表 3 5 】

TはClであり、かつVおよびUは両方ともMe

J	R	J	R	J	R
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl	OCH <sub>2</sub>	Cl	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br	OCH <sub>2</sub>	Br	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	I	OCH <sub>2</sub>	I	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	I
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	Cl	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	Cl
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	Br	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	Br
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	I	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	I	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	I
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	Cl	CONHCO	Cl	CONMeCO	Cl
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	Br	CONHCO	Br	CONMeCO	Br
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	CONHCO	CF <sub>3</sub>	CONMeCO	CF <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CONHCO	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CONMeCO	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>	CONHCO	CONHCH <sub>3</sub>	CONMeCO	CONHCH <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	I	CONHCO	I	CONMeCO	I
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CONHCO	CH <sub>3</sub>	CONMeCO	CH <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	CONHCO	OCF <sub>3</sub>	CONMeCO	OCF <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	CONHCO	OCHF <sub>2</sub>	CONMeCO	OCHF <sub>2</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	CONHCO	OCF <sub>3</sub>	CONMeCO	OCF <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	CONHCO	SCHF <sub>2</sub>	CONMeCO	SCHF <sub>2</sub>

10

20

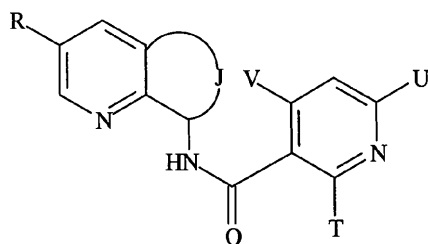
30

40

【 0 1 5 8 】

【 表 3 6 】

表 8



T および V は両方とも Cl であり、かつ U は H

J	R	J	R	J	R
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl	OCH <sub>2</sub>	Cl	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br	OCH <sub>2</sub>	Br	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	I	OCH <sub>2</sub>	I	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	I
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	Cl	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	Cl
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	Br	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	Br
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	I	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	I	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	I
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	Cl	CONHCO	Cl	CONMeCO	Cl
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	Br	CONHCO	Br	CONMeCO	Br
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	CONHCO	CF <sub>3</sub>	CONMeCO	CF <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CONHCO	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CONMeCO	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>	CONHCO	CONHCH <sub>3</sub>	CONMeCO	CONHCH <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	I	CONHCO	I	CONMeCO	I
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CONHCO	CH <sub>3</sub>	CONMeCO	CH <sub>3</sub>

10

20

30

40

【 0 1 5 9 】

【 表 3 7 】

T および V は両方とも Cl であり、かつ U は H

J	R	J	R	J	R
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	CONHCO	OCF <sub>3</sub>	CONMeCO	OCF <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	CONHCO	OCHF <sub>2</sub>	CONMeCO	OCHF <sub>2</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	CONHCO	OCF <sub>3</sub>	CONMeCO	OCF <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	CONHCO	SCHF <sub>2</sub>	CONMeCO	SCHF <sub>2</sub>

【 0 1 6 0 】

【 表 3 8 】

T および V は両方とも Cl であり、かつ U は Me

J	R	J	J	R	J
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl	OCH <sub>2</sub>	Cl	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br	OCH <sub>2</sub>	Br	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	I	OCH <sub>2</sub>	I	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	I
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	Cl	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	Cl
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	Br	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	Br
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	I	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	I	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	I
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	Cl	CONHCO	Cl	CONMeCO	Cl
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	Br	CONHCO	Br	CONMeCO	Br
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	CONHCO	CF <sub>3</sub>	CONMeCO	CF <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CONHCO	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CONMeCO	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>	CONHCO	CONHCH <sub>3</sub>	CONMeCO	CONHCH <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	I	CONHCO	I	CONMeCO	I
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CONHCO	CH <sub>3</sub>	CONMeCO	CH <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	CONHCO	OCF <sub>3</sub>	CONMeCO	OCF <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	CONHCO	OCHF <sub>2</sub>	CONMeCO	OCHF <sub>2</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	CONHCO	OCF <sub>3</sub>	CONMeCO	OCF <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	CONHCO	SCHF <sub>2</sub>	CONMeCO	SCHF <sub>2</sub>

10

20

30

40

【 0 1 6 1 】

【 表 3 9 】

TはClであり、かつVおよびUは両方ともMe

J	R	J	R	J	R	
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl	OCH <sub>2</sub>	Cl	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl	
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br	OCH <sub>2</sub>	Br	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br	
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>	
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	I	OCH <sub>2</sub>	I	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	I	10
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	Cl	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	Cl	
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	Br	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	Br	
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	20
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>	
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	I	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	I	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	I	
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	Cl	CONHCO	Cl	CONMeCO	Cl	30
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	Br	CONHCO	Br	CONMeCO	Br	
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	CONHCO	CF <sub>3</sub>	CONMeCO	CF <sub>3</sub>	
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CONHCO	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CONMeCO	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>	CONHCO	CONHCH <sub>3</sub>	CONMeCO	CONHCH <sub>3</sub>	
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	I	CONHCO	I	CONMeCO	I	
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CONHCO	CH <sub>3</sub>	CONMeCO	CH <sub>3</sub>	
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	CONHCO	OCF <sub>3</sub>	CONMeCO	OCF <sub>3</sub>	
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	CONHCO	OCHF <sub>2</sub>	CONMeCO	OCHF <sub>2</sub>	
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	CONHCO	OCF <sub>3</sub>	CONMeCO	OCF <sub>3</sub>	40
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	CONHCO	SCHF <sub>2</sub>	CONMeCO	SCHF <sub>2</sub>	

## 【 0 1 6 2 】

## 組成物

本発明は、(1)式Iで表される化合物(全ての幾何異性体および立体異性体、それらのN-オキシドおよび農業的に適する塩を含む)の殺菌・殺力ピ的に有効な量と、(2)(i)少なくとも1種の他の殺虫剤、殺菌・殺力ピ剤、殺線虫剤、殺細菌剤、殺ダニ剤、成長調整剤、不妊化剤、信号化学剤、忌避剤、誘引剤、フェロモン、摂食刺激剤もしくは他の生物学的に活性な化合物、ならびに/または(ii)界面活性剤、固体希釈剤および液体希釈剤からなる群より選択される少なくとも1種の追加成分とを含んでなる殺菌・殺力



ビ性組成物も含む。

【0163】

- (a) 少なくとも1種の式Iで表される化合物；および
- (b) (b1) アルキレンビス(ジチオカルバメート)殺菌・殺カビ剤、
- (b2) 菌・カビ性ミトコンドリア呼吸電子移動部位の $bc_1$ 錯体で作用する化合物、
- (b3) シモキサニル、
- (b4) ステロール生合成経路のデメチラーゼ酵素で作用する化合物、
- (b5) ステロール生合成経路に作用するモルホリンおよびピペリジン化合物、
- (b6) フェニルアミド殺菌・殺カビ剤、
- (b7) ピリミジノン殺菌・殺カビ剤、
- (b8) フタルイミド類および
- (b9) ホセチル-アルミニウム

からなる群より選択される少なくとも1種の化合物と、  
を含んでなる組成物が特記される。

【0164】

成分(b)と成分(a)との重量比は典型的に、100:1から1:100であり、好ましくは30:1から1:30であり、より好ましくは10:1から1:10である。成分(b)と成分(a)の重量比が10:1から1:1である組成物が特記される。

【0165】

$bc_1$ 錯体殺菌・殺カビ剤(成分(b2))

アゾキシストロビン、クレソキン(kresoxim)-メチル、メトミノストロビン/フェノミノストロビン(SSF-126)、ピコキシストロビン、ピラクロストロビンおよびトリフロキシストロビンのようなストロビルリン(Strobilurin)殺菌・殺カビ剤が、ミトコンドリア呼吸鎖の $bc_1$ 錯体を抑制する殺菌・殺カビ作用様式を有することは既知である(アンゲヴァント ヒュミー インターナショナル エディション(Angew. Chem. Int. Ed.), 1999, 38, 1328-1349)。メチル(E)-2-[[6-(2-シアノフェノキシ)-4-ピリジニル]オキシ]-(メトキシイミノ)ベンゼンアセテート(アゾキシストロビンとしても知られている)は、バイオケミカル ソサエティー トランスアクションズ(Biochemical Society Transactions)1993, 22, 68Sに $bc_1$ 錯体抑制剤として記載されている。メチル(E)-2-[(2-メチルフェノキシ)メチル]ベンゼンアセテート(クレソキン-メチルとしても知られている)は、バイオケミカル ソサエティー トランスアクションズ(Biochemical Society Transactions)1993, 22, 64Sに $bc_1$ 錯体抑制剤として記載されている。(E)-2-[(2,5-ジメチルフェノキシ)メチル]-(メトキシイミノ)-N-メチルベンゼンアセトアミドは、バイオケミストリー アンド セル バイオロジー(Biochemistry and Cell Biology)1995, 85(3), 306-311に $bc_1$ 錯体抑制剤として記載されている。ミトコンドリア呼吸鎖の $bc_1$ 錯体を抑制する他の化合物としては、ファモキサドンフェナミドンが挙げられる。

【0166】

$bc_1$ 錯体は生化学系文献において、時々、電子移動鎖の錯体III、およびユビヒドロキノン:チトクロームcオキシドリダクターゼを含む他の名称で称される。それは、酵素委託番号EC1.10.2.2のより、独自に同定される。 $bc_1$ 錯体は、例えば、ジャーナル オブ バイオロジカル ケミストリー(J. Biol. Chem.)1989, 264, 14543-38;メソッズ イン エンザイモロジー(Methods Enzymol.)1986, 126, 253-71;およびその中に引用される参考文献に記載されている。

【0167】

ステロール生合成抑制殺菌・殺カビ剤(成分(b4)または(b5))

ステロール生合成抑制剤の種類としては、ステロール生合成経路の酵素を抑制することにより菌・カビ類を抑制するDM Iおよび非DM I化合物が挙げられる。DM I殺菌・殺カビ剤は、菌・カビ性ステロール生合成経路内で共通の作用部位を有し、すなわち、菌・カビ類のステロールの前駆体であるラノステロールまたは24-メチレンジヒドロラノステロールの14位で脱メチル化を抑制する。この部位で作用する化合物は、しばしば、デメチラーゼ抑制剤、DM I殺菌・殺カビ剤またはDM Iと称される。デメチラーゼ酵素は生化学系文献において、時々、チトクロームP-450(14DM)を含む他の名称で称される。デメチラーゼ酵素は、例えば、ジャーナル オブ バイオロジカル ケミストリー (J. Biol. Chem.) 1992, 267, 13175-79およびその中に引用される参考文献に記載されている。DM I殺菌・殺カビ剤は、幾つかの種類に分類される：アゾール(トリアゾールおよびイミダゾールを含む)、ピリミジン、ピペラジンおよびピリジン。トリアゾールとしては、ブロムコナゾール、シプロコナゾール、ジフェノコナゾール、ジニコナゾール、エポキシコナゾール、フェンブコナゾール、フルキンコナゾール、フルシラゾール、フルトリアホル、ヘキサコナゾール、イブコナゾール、メトコナゾール、ペンコナゾール、プロピコナゾール、テブコナゾール、テトラコナゾール、トリアジメホン、トリアジメノール、トリチコナゾールおよびユニコナゾールが挙げられる。イミダゾールとしては、クロトリマゾール、エコナゾール、イマザリル、イソコナゾール、ミコナゾールおよびプロクロラズが挙げられる。ピリミジンとしては、フェナリモル、ヌアリモルおよびトリアリモルが挙げられる。ピペラジンとしては、トリホリンが挙げられる。ピリジンとしては、ブチオベートおよびピリフェノックスが挙げられる。K. H. クック (K. H. Kuck) ら、最新の選択的殺菌・殺カビ剤 - 特性、用途および作用機構 (Modern Selective Fungicides - Properties, Applications and Mechanisms of Action), ライア, H. (Lyr, H.) 編; グスタフ フィッシャー フェアラーク (Gustav Fischer Verlag): ニューヨーク, 1995, 205-258に記載される通り、生化学的調査により、全ての上記殺菌・殺カビ剤がDM I殺菌・殺カビ剤であることが示されている。

10

20

30

40

#### 【0168】

モルホリンおよびピペリジン殺菌・殺カビ剤のような他のステロール生合成抑制剤から識別するために、DM I殺菌・殺カビ剤と一緒にグループ化されている。モルホリンおよびピペリジンもステロール生合成抑制剤であるが、ステロール生合成経路の、より後期の工程を抑制することが示されている。モルホリンとしては、アルジモルフ、ドデモルフ、フェンプロピモルフ、トリデモルフおよびトリモルフアミドが挙げられる。ピペリジンとしてはフェンプロピジンが挙げられる。K. H. クック (K. H. Kuck) ら、最新の選択的殺菌・殺カビ剤 - 特性、用途および作用機構 (Modern Selective Fungicides - Properties, Applications and Mechanisms of Action), ライア, H. (Lyr, H.) 編; グスタフ フィッシャー フェアラーク (Gustav Fischer Verlag): ニューヨーク, 1995, 185-204に記載される通り、生化学的調査により、全ての上記モルホリンおよびピペリジン殺菌・殺カビ剤がステロール生合成抑制殺菌・殺カビ剤であることが示されている。

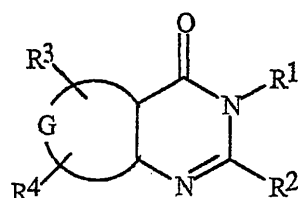
#### 【0169】

ピリミジノン殺菌・殺カビ剤 (成分 (b7))

ピリミジン殺菌・殺カビ剤としては、式 I I

#### 【0170】

#### 【化30】



II

## 【 0 1 7 1 】

( 式中、

10

G は縮合フェニル、チオフェンまたはピリジン環であり、

R<sup>1</sup> は C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキルであり、R<sup>2</sup> は C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキルまたは C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルコキシであり、R<sup>3</sup> はハロゲンであり、かつR<sup>4</sup> は水素またはハロゲンである ) で表される化合物が挙げられる。

## 【 0 1 7 2 】

ピリミジノン殺菌・殺カビ剤は、国際特許出願 WO 94 / 26722 号、米国特許第 6,066,638 号、米国特許第 6,245,770 号、米国特許第 6,262,058 号および米国特許第 6,277,858 号に記載されている。

## 【 0 1 7 3 】

20

6 - プロモ - 3 - プロピル - 2 - プロピルオキシ - 4 ( 3 H ) - キナゾリノン、

6, 8 - ジヨード - 3 - プロピル - 2 - プロピルオキシ - 4 ( 3 H ) - キナゾリノン、

6 - ヨード - 3 - プロピル - 2 - プロピルオキシ - 4 ( 3 H ) - キナゾリノン、

6 - クロロ - 2 - プロポキシ - 3 - プロピルチエノ [ 2,3 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

6 - プロモ - 2 - プロポキシ - 3 - プロピルチエノ [ 2,3 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

7 - プロモ - 2 - プロポキシ - 3 - プロピルチエノ [ 3,2 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

6 - プロモ - 2 - プロポキシ - 3 - プロピルピリド [ 2,3 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

30

6, 7 - ジプロモ - 2 - プロポキシ - 3 - プロピルチエノ [ 3,2 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、および

3 - ( シクロプロピルメチル ) - 6 - ヨード - 2 - ( プロピルチオ ) ピリド [ 2,3 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン

からなる群より選択されるピリミジノン殺菌・殺カビ剤が特記される。

## 【 0 1 7 4 】

## 【 表 4 0 】

表9

40

## 成分(b)の例

- |      |   |
|------|---|
| (b1) | マンコゼブ、マネブ、プロピネブおよびジネブのようなアルキレンビス(ジチオカルバメート) |
| (b3) | シモザニル                                       |
| (b6) | メタラキシル、ベナラキシルおよびオキサジキシルのようなフェニルアミド          |
| (b8) | ホルベトまたはカプタンのようなフタルイミド                       |
| (b9) | ホセチルーアルミニウム                                 |

## 【 0 1 7 5 】

式 I の化合物との組み合わせで、または成分 ( a ) と成分 ( b ) との組み合わせの追加成

50

分として本発明の組成物に含まれ得る他の殺菌・殺カビ剤は、アシベンゾラー、ベナラキシル、ベノミル、プラスチサイジン - S、ボルドー混合物（三塩基性硫酸銅）、カルプロパミド、カプタホール、カプタン、カルペンダジム、クロロネブ、クロロタロニル、酸塩化銅、硫酸銅および水酸化銅のような銅塩、シアゾファミド、シモキサニル、シプロジニル、（S）- 3, 5 - ジクロロ - N - （3 - クロロ - 1 - エチル - 1 - メチル - 2 - オキソプロピル）- 4 - メチルベンズアミド（RH7281）、ジクロシメト（S - 2900）、ジクロメジン、ジクロラン、ジメトモルフ、ジニコナゾール - M、ドデモルフ、ドジン、エジフェンホス、フェンカルアミド（SZX0722）、フェンピクロニル、フェンチンアセテート、フェンチンヒドロキシド、フルアジナム、フルジオキサニル、フルメトバー（RPA403397）、フルトラニル、ホルベット、ホセチル - アルミニウム、フララキシル、フラメタピル（S - 82658）、イプロベンホス、イプロジオン、イソプロチオラン、イプロバリカルブ、カスガマイシン、マンコゼブ、マネブ、メフェノキサム、メプロニル、メタラキシル、メチラン - 亜鉛、ミクロブタニル、ネオ - アソジン（メタンアルソネート第二鉄）、オキサジキシル、ペンシクロン、プロクロラゾ、プロシミドン、プロパモカルブ、プロピネブ、ピリフェノックス、ピリメタニル、ピロキロン、キノキシフェン、スピロキサミン、イオウ、チフルズアミド、チオフアナート - メチル、チラム、トリアジメホン、トリシクラゾール、バリダマイシン、ピンクロゾリン、ジネブおよびゾキサミドである。

10

#### 【0176】

上記列挙された市販品として入手可能な化合物の記載は、殺虫剤マニュアル（The Pesticide Manual）第12版、C. D. S. トムリン（C. D. S. Tomlin）編、英国作物保護評議会（British Crop Protection Council）、英国、サリー州、ファーマム、2000に見出される。

20

#### 【0177】

異なる生化学的作用様式（例えば、ミトコンドリア呼吸抑制、リボソームRNAの合成干渉によるタンパク質合成の抑制、または - チューリピン合成の抑制）を有する殺菌・殺カビ剤と、式Iの化合物との組み合わせが特記される。これは抵抗処理に関して特に有利であり得る。例としては、式Iの化合物（例えば、化合物1）と、アゾキシストロビン、クレソキン - メチル、ピラクロストロビンおよびトリフロキシストロビンのようなストロビルリン、カルペンダジム、ファモキサドンおよびフェナミドンのようなミトコンドリア呼吸抑制剤、ベノミル、シアモキサニル、ジメトモルフ、ホルベット、ホセチル - アルミニウム、メタラキシル、マンコゼブならびにマネブとの組み合わせが挙げられる。これらの組み合わせは、特に、殺菌・殺カビ剤の組み合わせが同一または類似の病害を抑制する場合、抵抗処理に関して特に有利であり得る。

30

#### 【0178】

マンコゼブ、マネブ、プロピネブおよびジネブのようなアルキレンビス（ジチオカルバメート）、ホルベットのようなフタルイミド、硫酸銅および水酸化銅のような銅塩、アゾキシストロビン、ピラクロストロビンおよびトリフロキシストロビンのようなストロビルリン、ファモキサドンおよびフェナミドンのようなミトコンドリア呼吸抑制剤、メタラキシルのようなフェニルアミド、ホセチル - Alのようなホスホネート、ジメトモルフ、6 - ヨード - 3 - プロピル - 2 - プロピルオキシ - 4（3H）- キナゾリノンおよび6 - クロロ - 2 - プロポキシ - 3 - プロピルチエノ[2, 3 - d]ピリミジン - 4（3H）- オンのようなピリミジノン殺菌・殺カビ剤、ならびにシモキサニルのような他の殺菌・殺カビ剤を含むブドウ病害（例えば、Plasmopara viticola、Botrytis cinereaおよびUncinula necator）を抑制するための殺菌・殺カビ剤と、式Iとの組み合わせが特記される。

40

#### 【0179】

マンコゼブ、マネブ、プロピネブおよびジネブのようなアルキレンビス（ジチオカルバメート）、硫酸銅および水酸化銅のような銅塩、ピラクロストロビンおよびトリフロキシストロビンのようなストロビルリン、ファモキサドンおよびフェナミドンのようなミトコン

50

ドリア呼吸抑制剤、メタラキシルのようなフェニルアミド、プロパモカルブのようなカルバメート、フルアジナンのようなフェニルピリジルアミン、ならびにクロロタロニル、シモキサニル、シモキサニル、ジメトモルフ、ゾキサミドおよびイプロバリカルブのような他の殺菌・殺カビ剤を含むジャガイモ病害（例えば、*Phytophthora infestans*、*Alternaria solani*および*Rhizoctonia solani*）を抑制するための殺菌・殺カビ剤と、式 I との組み合わせが特記される。

#### 【0180】

成分 (b) が、(b1)、(b2)、(b3)、(b4)、(b5)、(b6)、(b7)、(b8) および (b9) より選択される 2 つの異なる群の各々からの少なくとも 1 種の化合物を含んでなる組成物が特記される。これら 2 つの成分 (b) 群の第 1 の化合物とこれらの成分 (b) 群の第 2 の化合物との重量比は典型的に、100 : 1 から 1 : 100 であり、より典型的には 30 : 1 から 1 : 30 であり、そして最も典型的には 10 : 1 から 1 : 10 である。

10

#### 【0181】

成分 (b) が、少なくとも 1 種の (b1) から選択される化合物、例えば、マンコゼブと、第 2 の成分 (b) 群、例えば、(b2)、(b3)、(b6)、(b7)、(b8) または (b9) から選択される少なくとも 1 種の化合物とを含んでなる組成物が特記される。成分 (b) と成分 (a) との全体的重量比が 30 : 1 から 1 : 30 であり、かつ成分 (b1) と成分 (a) との重量比が 10 : 1 から 1 : 1 である、かかる組成物が特に特記される。これらの組成物の例としては、成分 (a)（好ましくは、索引表 A、B または C からの化合物）とマンコゼブ、およびファモキサドン、フェナミドン、アゾキシストロビン、クレソキン・メチル、ピラクロストロビン、トリフロキシストロビン、シモキサニル、メタラキシル、ベナラキシル、オキサジキシル、6 - ヨード - 3 - プロピル - 2 - プロピルオキシ - 4 (3H) - キナゾリノン、6 - クロロ - 2 - プロポキシ - 3 - プロピルチエノ [2, 3 - d] ピリミジン - 4 (3H) - オン、ホルベット、カプタンおよびホセチル - アルミニウムからなる群より選択される化合物の混合物を含んでなる組成物が挙げられる。

20

#### 【0182】

成分 (b) が、少なくとも 1 種の (b2) から選択される化合物、例えば、ファモキサドンと、第 2 の成分 (b) 群、例えば、(b1)、(b3)、(b6)、(b7)、(b8) または (b9) から選択される少なくとも 1 種の化合物とを含んでなる組成物も特記される。成分 (b) と成分 (a) との全体的重量比が 30 : 1 から 1 : 30 であり、かつ成分 (b2) と成分 (a) との重量比が 10 : 1 から 1 : 1 である、かかる組成物が特に特記される。これらの組成物の例としては、成分 (a)（好ましくは、索引表 A、B または C からの化合物）とファモキサドン、およびマンコゼブ、マネブ、プロピネブ、ジネブ、シモキサニル、メタラキシル、ベナラキシル、オキサジキシル、6 - ヨード - 3 - プロピル - 2 - プロピルオキシ - 4 (3H) - キナゾリノン、6 - クロロ - 2 - プロポキシ - 3 - プロピルチエノ [2, 3 - d] ピリミジン - 4 (3H) - オン、ホルベット、カプタンおよびホセチル - アルミニウムからなる群より選択される化合物の混合物を含んでなる組成物が挙げられる。

30

40

#### 【0183】

成分 (b) が、少なくとも 1 種の (b3) から選択される化合物、例えば、シモキサニルと、第 2 の成分 (b) 群、例えば、(b1)、(b2)、(b6)、(b7)、(b8) または (b9) から選択される少なくとも 1 種の化合物とを含んでなる組成物も特記される。成分 (b) と成分 (a) との全体的重量比が 30 : 1 から 1 : 30 であり、かつ成分 (b3) と成分 (a) との重量比が 10 : 1 から 1 : 1 である、かかる組成物が特に特記される。これらの組成物の例としては、成分 (a)（好ましくは、索引表 A、B または C からの化合物）とシモキサニル、およびファモキサドン、フェナミドン、アゾキシストロビン、クレソキン・メチル、ピラクロストロビン、トリフロキシストロビン、マンコゼブ、マネブ、プロピネブ、ジネブ、メタラキシル、ベナラキシル、オキサジキシル、6 - ヨ

50

ード - 3 - プロピル - 2 - プロピルオキシ - 4 ( 3 H ) - キナゾリノン、6 - クロロ - 2 - プロポキシ - 3 - プロピルチエノ [ 2 , 3 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、ホルペット、カプタンおよびホセチル - アルミニウムからなる群より選択される化合物の混合物を含んでなる組成物が挙げられる。

【 0 1 8 4 】

成分 ( b ) が、少なくとも 1 種の ( b 6 ) から選択される化合物、例えば、メタラキシルと、第 2 の成分 ( b ) 群、例えば、( b 1 )、( b 2 )、( b 3 )、( b 7 )、( b 8 ) または ( b 9 ) から選択される少なくとも 1 種の化合物とを含んでなる組成物も特記される。成分 ( b ) と成分 ( a ) との全体的重量比が 30 : 1 から 1 : 30 であり、かつ成分 ( b 6 ) と成分 ( a ) との重量比が 10 : 1 から 1 : 3 である、かかる組成物が特に特記 10  
される。これらの組成物の例としては、成分 ( a ) ( 好ましくは、索引表 A、B または C からの化合物 ) とメタラキシルまたはオキサジキシル、およびファモキサドン、フェナミドン、アゾキシストロビン、クレソキン - メチル、ピラクロストロビン、トリフロキシストロビン、シモキサニル、マンコゼブ、マネブ、プロピネブ、ジネブ、6 - ヨード - 3 - プロピル - 2 - プロピルオキシ - 4 ( 3 H ) - キナゾリノン、6 - クロロ - 2 - プロポキシ - 3 - プロピルチエノ [ 2 , 3 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、ホルペット、カプタンおよびホセチル - アルミニウムからなる群より選択される化合物の混合物を含んでなる組成物が挙げられる。

【 0 1 8 5 】

成分 ( b ) が、少なくとも 1 種の ( b 7 ) から選択される化合物、例えば、6 - ヨード - 20  
3 - プロピル - 2 - プロピルオキシ - 4 ( 3 H ) - キナゾリノンまたは 6 - クロロ - 2 - プロポキシ - 3 - プロピルチエノ [ 2 , 3 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オンと、第 2 の成分 ( b ) 群、例えば、( b 1 )、( b 2 )、( b 3 )、( b 6 )、( b 8 ) または ( b 9 ) から選択される少なくとも 1 種の化合物とを含んでなる組成物も特記される。成分 ( b ) と成分 ( a ) との全体的重量比が 30 : 1 から 1 : 30 であり、かつ成分 ( b 7 ) と成分 ( a ) との重量比が 1 : 1 から 1 : 20 である、かかる組成物が特に特記される。成分 ( b 6 ) と成分 ( a ) の重量比が 1 : 4 . 5 から 1 : 9 である組成物が含まれる。こ 30  
れらの組成物の例としては、成分 ( a ) ( 好ましくは、索引表 A、B または C からの化合物 ) と 6 - ヨード - 3 - プロピル - 2 - プロピルオキシ - 4 ( 3 H ) - キナゾリノンまたは 6 - クロロ - 2 - プロポキシ - 3 - プロピルチエノ [ 2 , 3 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、およびファモキサドン、フェナミドン、アゾキシストロビン、クレソキン - メチル、ピラクロストロビン、トリフロキシストロビン、シモキサニル、マンコゼブ、マネブ、プロピネブ、ジネブ、メタラキシル、ベナラキシル、オキサジキシル、ホルペット、カプタンおよびホセチル - アルミニウムからなる群より選択される化合物の混合物を含んでなる組成物が挙げられる。

【 0 1 8 6 】

成分 ( b ) が、少なくとも 1 種の ( b 9 ) から選択される化合物、例えば、メタラキシルと、第 2 の成分 ( b ) 群、例えば、( b 1 )、( b 2 )、( b 3 )、( b 6 ) または ( b 7 ) から選択される少なくとも 1 種の化合物とを含んでなる組成物も特記される。成分 ( b ) と成分 ( a ) との全体的重量比が 30 : 1 から 1 : 30 であり、かつ成分 ( b 9 ) と 40  
成分 ( a ) との重量比が 10 : 1 から 1 : 1 である、かかる組成物が特に特記される。これらの組成物の例としては、成分 ( a ) ( 好ましくは、索引表 A、B または C からの化合物 ) とホセチル - アルミニウム、およびファモキサドン、フェナミドン、アゾキシストロビン、クレソキン - メチル、ピラクロストロビン、トリフロキシストロビン、マンコゼブ、マネブ、プロピネブ、ジネブ、メタラキシル、ベナラキシル、オキサジキシル、6 - ヨード - 3 - プロピル - 2 - プロピルオキシ - 4 ( 3 H ) - キナゾリノン、6 - クロロ - 2 - プロポキシ - 3 - プロピルチエノ [ 2 , 3 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、ホルペット、カプタンおよびシモキサニルからなる群より選択される化合物の混合物を含んでなる組成物が挙げられる。

【 0 1 8 7 】

式 I の化合物と、アゾキシストロピン、クレソキン - メチル、ピラクロストロピンおよびトルフロキシストロピンのようなストロビルリン、フェンプロピジンおよびフェンプロピモルフのようなモルホリン、プロムコナゾール、シプロコナゾール、ジフェノコナゾール、エポキシコナゾール、フルシラゾール、イブコナゾール、メトコナゾール、プロピコナゾール、テブコナゾールおよびトリチコナゾールのようなトリアゾール、ピリミジノン殺菌・殺カビ剤、ベノミル、カルベンダジム、クロロタロニル、ジメトモルフ、ホルベット、マンコゼブ、マネブ、キノキシフェン、バリダマイシンおよびピンクロゾリンを含む、より広範囲の農業的保護を与える殺菌・殺カビ剤との組み合わせが特記される。

【0188】

アゾキシストロピン、クレソキン - メチル、ピラクロストロピン、トルフロキシストロピン、ベノミル、カルベンダジム、クロロタロニル、ジメトモルフ、ホルベット、マンコゼブ、マネブ、キノキシフェン、バリダマイシン、ピンクロゾリン、フェンプロピジン、フェンプロピモルフ、プロムコナゾール、シプロコナゾール、ジフェノコナゾール、エポキシコナゾール、フルシラゾール、イブコナゾール、メトコナゾール、プロピコナゾール、テブコナゾールおよびトリチコナゾールを含む、より広範囲の農業的保護を与える他の殺菌・殺カビ剤との組み合わせが特記される。

10

【0189】

異なる作用様式（例えば、ミトコンドリア呼吸抑制、リボソーム RNA の合成干渉によるタンパク質合成の抑制、または - チューリピン合成の抑制）の他の殺菌・殺カビ剤との組み合わせが特記される。これは抵抗処理に関して特に有利であり得る。例としては、式 I の化合物（例えば、化合物 A 1）と、アゾキシストロピン、クレソキン - メチル、ピラクロストロピン、トリフロキシストロピン、カルベンダジム、ファモキサドン、フェナミドン、ベノミル、シアモキサニル、ジメトモルフ、ホルベット、ホセチル - アルミニウム、メタラキシル、マンコゼブ、マネブとの組み合わせが挙げられる。これらの組み合わせは、特に、殺菌・殺カビ剤の組み合わせが同一または類似の病害を抑制する場合、抵抗処理に関して特に有利であり得る。

20

【0190】

マンコゼブ、マネブ、プロピネブおよびジネブのようなジチオカルバメート、ホルベットのようなフタルイミド、硫酸銅および水酸化銅のような銅塩、アゾキシストロピン、ピラクロストロピンおよびトリフロキシストロピンのようなストロビルリン、メタラキシルのようなフェニルアミド、ホセチル - アルミニウムのようなホスホネート、ジメトモルフのようなモルホリン、ならびにシモキサニル、ファモキサドンおよびフェナミドンのような他の殺菌・殺カビ剤を含むブドウ病害を抑制するための他の殺菌・殺カビ剤との組み合わせが特記される。

30

【0191】

マンコゼブ、マネブ、プロピネブおよびジネブのようなジチオカルバメート、ホルベットのようなフタルイミド、硫酸銅および水酸化銅のような銅塩、アゾキシストロピン、ピラクロストロピンおよびトリフロキシストロピンのようなストロビルリン、メタラキシルのようなフェニルアミド、プロパモカルブのようなカルバメート、フルアジナンのようなフェニルピリールアミン、ジメトモルフのようなモルホリン、ならびにクロロタロニル、シアゾファミド、シモキサニル、ファモキサドン、フェナミドン、ゾキサミドおよびイプロバリカルブのような他の殺菌・殺カビ剤を含むジャガイモ病害を抑制するための他の殺菌・殺カビ剤との組み合わせが特記される。

40

【0192】

化合物 A 1 とアゾキシストロピンの組み合わせ、化合物 A 1 とクレソキン - メチルの組み合わせ、化合物 A 1 とピラクロストロピンの組み合わせ、化合物 1 とトリフロキシストロピンの組み合わせ、化合物 1 とカルベンダジムの組み合わせ、化合物 A 1 とクロロタロニルの組み合わせ、化合物 A 1 とジメトモルフの組み合わせ、化合物 A 1 とホルベットの組み合わせ、化合物 A 1 とマンコゼブの組み合わせ、化合物 A 1 とマネブの組み合わせ、化合物 A 1 とキノキシフェンの組み合わせ、化合物 A 1 とバリダマイシンの組み合わせ、化

50

化合物 A 1 とピンクロゾリンの組み合わせ、化合物 A 1 とフェンプロピジン、化合物 A 1 とフェンプロピモルフ、化合物 A 1 とブロムコナゾール、化合物 A 1 とシプロコナゾール、化合物 A 1 とジフェノコナゾール、化合物 A 1 とエポキシコナゾール、化合物 A 1 とフルシラゾール、化合物 A 1 とイブコナゾール、化合物 A 1 とメトコナゾール、化合物 A 1 とプロピコナゾール、化合物 A 1 とテブコナゾール、化合物 A 1 とトリチコナゾール、化合物 A 1 とファモキサドン、化合物 A 1 とフェナミドン、化合物 A 1 とベノミル、化合物 A 1 とシアモキサニル、化合物 A 1 とジメトモルフ、化合物 A 1 とホルベット、化合物 A 1 とホセチル - アルミニウム、化合物 A 1 とメタラキシル、化合物 A 1 とプロピネブ、化合物 A 1 とジネブ、化合物 A 1 と硫酸銅、化合物 A 1 と水酸化銅、化合物 A 1 とプロパモカルブ、化合物 A 1 とシアゾファミド、化合物 A 1 とゾキサミド、および化合物 A 1 とイブ  
ロバリカルブが特に特記される。化合物番号については、索引表 A ~ D の化合物を参照のこと。

10

## 【 0 1 9 3 】

好ましいもの 1 5 . 好ましい組成物は、シモキサニルと混合された成分 ( a ) の化合物を含んでなる。

## 【 0 1 9 4 】

好ましいもの 1 6 . 好ましい組成物は、( b 1 ) から選択される化合物と混合された成分 ( a ) の化合物を含んでなる。より好ましくは、( b 1 ) の化合物がマンコゼブである組成物である。

## 【 0 1 9 5 】

好ましいもの 1 7 . 好ましい組成物は、( b 2 ) から選択される化合物と混合された成分 ( a ) の化合物を含んでなる。より好ましくは、( b 2 ) の化合物がファモキサドンである組成物である。

20

## 【 0 1 9 6 】

好ましい組成物は、( b 1 )、( b 2 )、( b 3 )、( b 4 )、( b 5 )、( b 6 )、( b 7 )、( b 8 ) および ( b 9 ) から選択される 2 つの異なる群より選択される 2 つの化合物と混合された成分 ( a ) の化合物を含んでなる。

## 【 0 1 9 7 】

好ましい組成物は、成分 ( a ) が、上記好ましいもの 1 から好ましいもの 1 4 に示された式 I の化合物から選択されるものである。

30

## 【 0 1 9 8 】

本発明の化合物を、1 以上の殺虫剤、殺線虫剤、殺細菌剤、殺ダニ剤、成長調整剤、不妊化剤、信号化学剤、忌避剤、誘引剤、フェロモン、摂食刺激剤、または他の生物学的に活性な化合物と混合して、一層広範囲の農業的保護を与える多成分殺虫剤を形成することもできる。本発明の組成物を配合することができるかかる農業的保護剤の例は、アバメクチン、アセフェート、アジンホス - メチル、ピフェントリン、ブプロフェジン、カルボフラン、クロルフェナピル、クロルフルアズロン、クロルピリホス、クロルピリホス - メチル、シフルトリン、  
- シフルトリン、シハロトリン、  
- シハロトリン、デルタメトリン、ジアフェンチウロン、ダイアジノン、ジフルベンズロン、ジメトエート、エスフェンバレート、フェノキシカルブ、フェンプロパトリン、フェンバレート、フィプロニル、フル  
シトリネート、  
- フルバリネート、ホノホス、イミダクロプリド、イソフェンホス、マ  
ラチオン、メタアルデヒド、メタミドホス、メチダチオン、メトミル、メトプレン、メト  
キシクロル、メチル  
7 - クロロ - 2 , 5 - ジヒドロ - 2 - [ [ N - (メトキシカルボニル) - N - [ 4 - (トリフルオロメトキシ) フェニル ] アミノ ] カルボニル ] インデノ [ 1 , 2 - e ] [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアジン - 4 a ( 3 H ) - カルボキシレート (インド  
キサカルブ)、モノクロトホス、オキサミル、パラチオン、パラチオン - メチル、ペルメ  
トリン、ホレート、ホサロン、ホスメト、ホスファミドン、ピリミカルブ、プロフェノホ  
ス、ロテノン、スルプロホス、テブフェノジド、テフルトリン、テルブホス、テトラクロ  
ルピンホス、チオジカルブ、トラロメトリン、トリクロルホンおよびトリフルムロンのよ  
うな殺虫剤 ; ストレプトマイシンのような殺細菌剤 ; アミトラズ、チノメチオナト、クロ

40

50



ロベンジレート、シヘキサチン、ジコホール、ジエノクロル、エトキサゾール、フェナザキン、フェンブタチンオキシド、フェンプロパトリン、フェンピロキシメート、ヘキシチアゾクス、プロパルギット、ピリダベンおよびテブフェンピラドのような殺ダニ剤；アルドキシカルブおよびフェナミホスのような殺線虫剤；ならびにバシラス・ツリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*)、バシラス・ツリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*)・デルタエンドトキシン、バクロウィルス、および昆虫病原性バクテリア、ウィルスおよび真菌類のような生物剤である。これらの様々な混合の組み合わせと、本発明の式 I の化合物との重量比は典型的に、100 : 1 と 1 : 100 との間であり、好ましくは 30 : 1 と 1 : 30 との間であり、より好ましくは 10 : 1 と 1 : 10 との間であり、最も好ましくは 4 : 1 と 1 : 4 との間である。

10

#### 【0199】

上記列挙された市販品として入手可能な化合物の記載は、殺虫剤マニュアル (*The Pesticide Manual*) 第 12 版、C. D. S. トムリン (*C. D. S. Tomlin*) 編、英国作物保護評議会 (*British Crop Protection Council*)、2000 に見出される。

#### 【0200】

##### 製剤

本発明の化合物は一般的に、少なくとも 1 種の液体希釈剤、固体希釈剤または界面活性剤を含んでなる農業的に適する担体とともに製剤または組成物として使用される。製剤または組成物成分は、活性成分の物性、適用形態、ならびに土壌タイプ、湿度および温度のような環境要因に適合するように選択される。有用な製剤は、場合によりゲルへと濃厚化されてもよい、溶液 (乳化可能な濃縮物を含む)、懸濁液、乳液 (ミクロエマルジョンおよび / またはサスポエマルジョンを含む) 等のような液体を含む。有用な製剤はさらに、水分散性 (「水和」) または水溶性であり得る、ダスト、粉末、顆粒、ペレット、タブレット、フィルム等のような固体を含む。活性成分を (マイクロ) カプセル化することができ、さらに懸濁液または固体製剤へと形成することができ、あるいは活性成分の全製剤をカプセル化 (または「オーバーコート」) することができる。カプセル化により、活性成分放出を抑制することができるか、または遅らせることができる。噴霧可能な製剤を適切な培地に施すことができ、1 ヘクタールあたり約 1 ~ 数百リットルの噴霧量で使用する事ができる。さらなる製剤の中間体として、最初に高強度組成物を使用する。

20

30

#### 【0201】

製剤は典型的に、以下の 100 重量%まで加算される適切な範囲内で、希釈剤および / または界面活性剤と一緒に有効量 (例えば、0.01 ~ 99.99 重量%) の活性成分を含む。

#### 【0202】

#### 【表 41】

	重量%			
	活性成分	希釈剤	界面活性剤	
水分散性および水溶性 顆粒、タブレットおよび粉末	5-90	0-94	1-15	10
懸濁液、乳液、溶液 (乳化可能濃縮物を含む)	5-50	40-95	0-15	
ダスト	1-25	70-99	0-5	
顆粒およびペレット	0.01-99	5-99.99	0-15	
高強度組成物	90-99	0-10	0-2	

## 【0203】

20

典型的な固体希釈剤は、ワトキンス (Watkins) ら、殺虫剤ダスト希釈剤および担体ハンドブック (Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers) 第2版、ドーランド ブックス (Dorland Books)、コールドウェル、ニュージャージーに記載されている。典型的な液体希釈剤は、マルスデン (Marsden)、溶媒ガイド (Solvents Guide) 第2版、インターサイエンス (Interscience)、ニューヨーク、1950に記載されている。マクカットチェオンの洗浄剤および乳化剤年報 (McCutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual)、アルレッド出版社 (Allured Publ. Corp.)、リッジウッド (Ridgewood)、ニュージャージー、ならびにシスレー (Sisely) およびウッド (Wood)、界面活性剤百科事典 (Encyclopedia of Surface Active Agents)、ケミカル出版社 (Chemical Publ. Co., Inc.)、ニューヨーク1964は界面活性剤および推奨される使用を記載している。全ての製剤は、発泡、ケーキング、腐食、微生物の増殖等を低下させるための添加剤、または粘度を増加させるための増粘剤を少量含有することが可能である。

30

## 【0204】

界面活性剤としては、例えば、ポリエトキシ化アルコール、ポリエトキシ化アルキルフェノール、ポリエトキシ化ソルビタン脂肪酸エステル、ジアルキルスルホスクシネート、アルキルスルフェート、アルキルベンゼンスルホネート、オルガノシリコン、N, N - ジアルキルタウレート、リグニンスルホネート、ナフタレンスルホネートホルムアルデヒド縮合物、ポリカルボキシレートおよび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が挙げられる。固体希釈剤としては、例えば、ベントナイト、モンモリロナイト、アタパルジャイトおよびカオリンのような粘土、澱粉、糖、シリカ、タルク、珪藻土、土類、尿素、炭酸カルシウム、炭酸ナトリウムおよび重炭酸ナトリウム、ならびに硫酸ナトリウムが挙げられる。液体希釈剤としては、例えば、水、N, N - ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、N - アルキルピロリドン、エチレングリコール、プロピレングリコール、パラフィン、アルキルベンゼン、アルキルナフタレン、オリーブ油、ひまし油、亜麻仁油、桐油、ゴマ油、コーン油、ピーナッツ油、綿実油、大豆油、菜種油およびココナッツ油、脂肪酸エステル、シクロヘキサノン、2 - ヘプタノン、イソホロンおよび4 - ヒドロキシ - 4 - メチル - 2 - ペンタノンのようなケトン、ならびにメタ

40

50

ノール、シクロヘキサノール、デカノール、およびテトラヒドロフルフリルアルコールのようなアルコールが挙げられる。

#### 【0205】

成分を単純に混合することにより、乳化可能濃縮物を含む溶液を調製することができる。ブレンドおよび通常、ハンマーミルまたは流体エネルギーミルにおいて粉碎することにより、ダストおよび粉末を調製することができる。懸濁液は通常、湿式粉碎により調製される。例えば、米国特許第3,060,084号を参照のこと。好ましい懸濁液濃縮物としては、活性成分に加えて、場合により50~65%の液体希釈剤と組み合わせられてもよい5~20%の非イオン性界面活性剤(例えば、ポリエトキシ化脂肪族アルコール)と、5%までのアニオン性界面活性剤とを含有するものが挙げられる。予備形成された顆粒担体上に活性材料を噴霧することにより、または凝集技術により、顆粒およびペレットを調製することができる。ブローニング(Browning)、「アグロメーション(Agglomeration)」、ケミカルエンジニアリング(Chemical Engineering)、1967年12月4日、第147~48頁、ペリーの化学エンジニアのハンドブック(Perry's Chemical Engineer's Handbook)、第4版、マクグロウ・ヒル(McGraw-Hill)、ニューヨーク、1963、第8~57頁以下、およびWO91/13546号を参照のこと。米国特許第4,172,714号に記載されるようにペレットを調製することができる。米国特許第4,144,050号、米国特許第3,920,442号およびDE3,246,493号に教示されるように水分散性および水溶性顆粒を調製することができる。米国特許第5,180,587号、米国特許第5,232,701号および米国特許第5,208,030号に教示されるようにタブレットを調製することができる。GB2,095,558号および米国特許第3,299,566号に教示されるようにフィルムを調製することができる。

#### 【0206】

製剤の分野に関するさらなる情報に関しては、T.S.ウッズ(T.S.Woods)、殺虫剤化学および生物剤、食品・環境課題(Pesticide Chemistry and Bioscience, The Food-Environment Challenge)における「製剤者のツールボックス-近代農業の製品形態(The Formulator's Toolbox - Product Forms for Modern Agriculture)」、T.ブルックス(T.Brooks)およびT.R.ロバーツ(T.R.Roberts)編、第9回殺虫剤化学国際会議の手続き(Proceedings of the 9th International Congress on Pesticide Chemistry)、王立化学協会(The Royal Society of Chemistry)、ケンブリッジ、1999、第120~133を参照のこと。米国特許第3,235,361号、第6欄、第16行~第7欄、第19行および実施例10~41;米国特許第3,309,192号、第5欄、第43行~第7欄、第62行および実施例8、12、15、39、41、52、53、58、132、138~140、162~164、166、167および169~182;米国特許第2,891,855号、第3欄、第66行~第5欄、第17行および実施例1~4;クリングマン(Klingman)、科学としての除草(Weed Control as a Science)、ジョン・ウィリー・アンド・サンズ社(John Wiley and Sons, Inc)、ニューヨーク、1961、第81~96頁;ならびにハンス(Hance)ら、除草ハンドブック(Weed Control Handbook)、第8版、ブラックウェルサイエンティフィック出版(Blackwell Scientific Publications)、オックスフォード、1989も参照のこと。

#### 【0207】

以下の実施例において、全てのパーセントは重量によるものであり、全ての製剤は従来法で調製される。化合物の番号は、索引表A~Dの化合物を指す。

【 0 2 0 8 】

【 表 4 2 】

水和粉末

化合物1	65.0%
ドデシルフェノールポリエチレングリコールエーテル	2.0%
リグニンスルホン酸ナトリウム	4.0%
アルミノケイ酸ナトリウム	6.0%
モンモリロナイト(煅焼物)	23.0%

10

【 0 2 0 9 】

【 表 4 3 】

実施例B顆粒

化合物1	10.0%
アタパルジャイト顆粒	
(低揮発性素材、0.71/0.30mm;U.S.S.No.25~50シープ)	90.0%

20

【 0 2 1 0 】

【 表 4 4 】

実施例C押出ベレット

化合物1	25.0%
無水硫酸ナトリウム	10.0%
粗製リグニンスルホン酸カルシウム	5.0%
アルキルナフタレンスルホン酸ナトリウム	1.0%
カルシウム/マグネシウムベントナイト	59.0%

30

【 0 2 1 1 】

【 表 4 5 】

実施例D押出ベレット

化合物1	20.0%
油溶性スルホネートとポリオキシエチレンエーテルとのブレンド	10.0%
イソホロン	70.0%

40

【 0 2 1 2 】

【 表 4 6 】

実施例E

化合物 A1		20.0%
ポリエトキシル化脂肪族アルコール	非イオン性界面活性剤	15.0%
モンタンワックスのエステル誘導体		3.0%
リグニンスルホン酸カルシウム	アニオン性界面活性剤	2.0%
ポリエトキシル化／ポリプロポキシル化 ポリグリコールブロックコポリマー	界面活性剤	1.0%
プロピレングリコール	希釈剤	6.4%
ポリ(ジメチルシロキサン)	消泡剤	0.6%
抗菌剤		0.1%
水	希釈剤	51.9%

10

## 【0213】

製剤成分をシロップとして一緒に混合し、化合物A1を添加し、そして混合物をブレンダー中で均質化した。次いで、得られたスラリーを湿式粉碎して懸濁濃縮物を形成する。

## 【0214】

効用

20

式Iで表される化合物および組成物は、植物病害抑制剤として有用である。従って、本発明は、保護されるべき植物もしくはその一部に、または保護されるべき植物の種子もしくは実生に、有効量の本発明の化合物または前記化合物を含有する殺菌・殺カビ性組成物を適用することを含んでなる菌・カビ性植物病原体により引き起こされる植物病害の抑制方法を含んでなる。

## 【0215】

好ましい使用方法は、上記好ましい化合物または組成物を含むものである。

## 【0216】

式Iの化合物および組成物は、子囊菌類、子囊菌類、卵菌類および不完全菌類の広範囲の菌・カビ性植物病原体により引き起こされる病害の抑制を提供する。それらは広範囲の植物病害の抑制に有効であり、特に、装飾用、野菜、圃場、穀類および果実作物の葉の病原体に有効である。これらの病原体としては、*Plasmopara viticola*、*Phytophthora infestans*、*Peronospora tabacina*、*Pseudoperonospora cubensis*、*Pythium aphanidermatum*、*Alternaria brassicae*、*Septoria nodorum*、*Septoria tritici*、*Cercosporidium personatum*、*Cercospora arachidicola*、*Pseudocercospora herpotrichoides*、*Cercospora beticola*、*Botrytis cinerea*、*Monilinia fructicola*、*Pyricularia oryzae*、*Podosphera leucotricha*、*Venturia inaequalis*、*Erysiphe graminis*、*Uncinula necator*、*Puccinia recondita*、*Puccinia graminis*、*Hemileia vastatrix*、*Puccinia striiformis*、*Puccinia arachidis*、*Rhizoctonia solani*、*Sphaerotheca fuliginea*、*Fusarium oxysporum*、*Verticillium dahliae*、*Pythium aphanidermatum*、*Phytophthora megasperma*、*Sclerotinia sclerotiorum*、*Sclerotium rolfsii*、*Erysiphe polygoni*、*Pyrenophora teres*、*Gaeumannomyces graminis*、

30

40

50

*Rynchosporium secalis*、*Fusarium roseum*、*Bremia lactucae*、ならびにこれらの病原体に非常に関連のある他の属および種が挙げられる。本発明の組成物は特に、ブドウ類上の *Plasmopara viticola* ならびにジャガイモ類およびトマト類上の *Phytophthora infestans* の抑制に有効である。

#### 【0217】

植物病害抑制は通常、病害の前または後のいずれかに、根、茎、葉、果実、種子、塊茎または球根のような保護されるべき植物の一部に、あるいは保護されるべき植物が成長している培地（土壌または砂）に、式 I の化合物の有効量を適用することにより達成される。種子および実生を保護するために、化合物を種子に適用することもできる。

10

#### 【0218】

これらの化合物の適用率は環境の多くの要因により影響され得、かつ実際の使用条件下で決定されなければならない。通常、活性成分 1 g / ha から 5,000 g / ha の率で処理された場合、葉を保護することができる。通常、種子 1 キログラムに対して活性成分 0.1 g から 10 g の率で処理された場合、種子を保護することができる。

#### 【0219】

以下の試験は、特定の病原体における本発明の適切な化合物の抑制効能を論証する。しかしながら、化合物により得られる病原体抑制保護はこれらの種類に制限されない。特定の病原体における本発明の組成物の抑制効能を論証するためにも、これらの試験を使用することができる。単一活性成分を含んでなる試験懸濁液を噴霧し、個々の活性成分の抑制効能を論証する。組み合わせの抑制効能を論証するために、(a) 単一試験懸濁液において適切な量で活性成分を組み合わせることができ、(b) 個々の活性成分の貯蔵溶液を調製し、次いで適切な比率で組み合わせ、最終的な所望の濃度まで希釈して試験懸濁液を形成することができ、または (c) 単一活性成分を含んでなる試験懸濁液を所望の比率で連続的に噴霧することができる。

20

#### 【0220】

相乗作用は「独立して現れる 2 つ（以上）の効果の合計より全体的効果が大きい、またはより拡大されているような、混合物の 2 つの成分 [例えば、成分 (a) および成分 (b)] の協力作用」として記載されている（テームズ、P. M. L. (Tames, P. M. L.)、ネーデルランズ ジャーナル オブ プラント パソロジー (Neth. J. Plant Pathology)、(1964)、70、73-80 を参照のこと）。2 つの活性成分間の相乗作用効果のパーセントは、コルビー (Colby) 等式の助けにより確立される（コルビー、S. R. (Colby, S. R.)、除草剤組み合わせの相乗および拮抗応答 (Calculating Synergistic and Antagonistic Responses of Herbicide Combinations) ウィーズ (Weeds)、1967、15、20-22 を参照のこと）。

30

#### 【0221】

##### 【数 1】

$$p = A + B - \left[ \frac{A \times B}{100} \right]$$

40

#### 【0222】

コルビー (Colby) の方法を使用して、単独で適用された 2 成分の活性を基準として、混合物の予測される活性  $p$  を最初に計算することによって、2 つの活性成分間の相乗相互作用の存在を確立する。 $p$  が実験的に確立された効果より低い場合、相乗作用は生じる。上記等式において、 $A$  は率  $x$  で単独で適用された 1 成分の抑制率の殺菌・殺力活性である。用語  $B$  は、率  $y$  で適用された第 2 の成分の抑制率の殺菌・殺力活性である。それらの効果が厳密に付加的であり、かつ相乗作用が生じない場合、この等式は  $p$ 、率  $x$  での  $A$  と率  $y$  での  $B$  の混合物の殺菌・殺力活性を推定する。

50

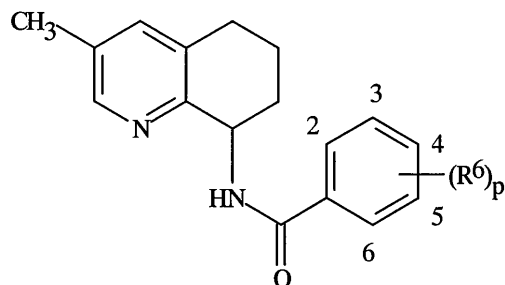
【 0 2 2 3 】

本発明での使用に適切な化合物の記述に関しては索引表 A ~ D を参照のこと。索引表において以下の略号が使用される。Me はメチルであり、Et はエチルであり、Ph はフェニルであり、OMe はメトキシであり、OEt はエトキシである。略号「Ex .」は「実施例」を表し、その後ろに化合物が調製される実施例を示す数字が続く。

【 0 2 2 4 】

【 表 4 7 】

索引表A



10

化合物番号	$(R^6)_p$	
<u>A1(実施例1)</u>	2,6-Cl <sub>2</sub>	
A2	4-Br	*
A3	2-CF <sub>3</sub>	*
A4	2,6-F <sub>2</sub>	*
A5	2-Cl	*
A6	2,4,6-Cl <sub>3</sub>	*
A7	2-Me	*
A8	2,3,6-F <sub>3</sub>	*
A9	2-Cl,6-F	*
A10	2,6-(OMe) <sub>2</sub>	*

20

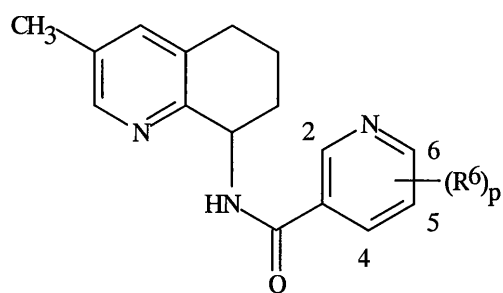
30

\* <sup>1</sup>H NMR スペクトルデータに関しては索引表 D を参照のこと

【 0 2 2 5 】

【 表 4 8 】

## 索引表 B



10

化合物番号	(R <sup>6</sup> ) <sub>p</sub>	
B1	2-NH(3-CF <sub>3</sub> -Ph)	*
B2	2-SPh	*
B3	2-SMe	*
B4	6-Cl	*
B5	2-OPh	*
B6	2-OEt	*
B7	2,4-Cl <sub>2</sub>	*
B8	2-OH	*

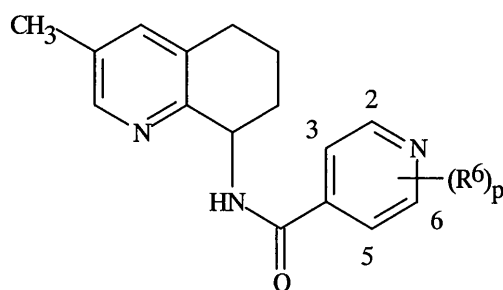
20

\* H<sup>1</sup> NMR スペクトルデータに関しては索引表 D を参照のこと

【 0 2 2 6 】

【 表 4 9 】

## 索引表 C



30

化合物番号	(R <sup>6</sup> ) <sub>p</sub>	
C1	2-Cl	*
C2	2-Cl-6-OMe	*

40

\* H<sup>1</sup> NMR スペクトルデータに関しては索引表 D を参照のこと

【 0 2 2 7 】

【 表 5 0 】

50



## 索引表 D

化合物番号	<sup>1</sup> H NMR データ (300MHz; 特記されない限り CDCl <sub>3</sub> 溶液) <sup>a</sup>
A1	δ 8.22 (s, 1H), 7.30 (s, 1H), 7.36-7.23 (m, 3H), 6.99 (bs, 1H), 5.03 (m, 1H), 2.82 (m, 3H), 2.29 (s, 3H), 1.94 (m, 3H)
A2	δ 8.24 (s, 1H), 7.71 (d, J=8.7 Hz, 2H), 7.58 (d, J = 8.6 Hz, 2H), 7.33 (bs, 1H), 7.27 (s, 1H), 4.97 (m, 1H), 2.82 (m, 3H), 2.31 (s, 3H), 1.95 (m, 2H), 1.69 (m, 1H)
A3	δ 8.20 (s, 1H), 7.68 (m, 2H), 7.55 (m, 2H), 7.25 (s, 1H), 6.87 (bs, 1H), 5.02 (m, 1H), 2.81 (t, J=6.4 Hz, 2H), 2.70 (m, 1H), 2.29 (s, 3H), 1.94 (m, 2H), 1.79 (m, 1H)
A4	δ 8.23 (s, 1H), 7.35 (m, 1H), 7.26 (s, 1H), 7.08 (bs, 1H), 6.69 (d, J=8.1 Hz, 1H), 6.91 (d, J=8.3 Hz, 1H), 5.02 (m, 1H), 2.81 (m, 2H), 2.74 (m, 1H), 2.29 (s, 3H), 1.95 (m, 2H), 1.82 (m, 1H)
A5	δ 8.24 (s, 1H), 7.74 (m, 1H), 7.34 (m, 3H), 7.26 (s, 1H), 7.15 (bs, 1H), 5.10 (m, 1H), 2.82 (m, 2H), 2.70 (m, 1H), 2.29 (s, 3H), 1.95 (m, 3H)
A6	δ 8.21 (s, 1H), 7.35 (s, 2H), 7.24 (s, 1H), 6.98 (bs, 1H), 4.98 (m, 1H), 2.80 (m, 3H), 2.29 (s, 3H), 1.95 (m, 2H), 1.83 (m, 1H)
A7	δ 8.22 (s, 1H), 7.48 (d, J=7.7 Hz, 1H), 7.22 (m, 4H), 6.82 (bs, 1H), 5.03 (m, 1H), 2.81 (t, J=6.41 Hz, 2H), 2.71 (m, 1H), 2.52 (s, 3H), 2.29 (s, 3H), 1.94 (m, 2H), 1.78 (m, 1H)
A8	δ 8.22 (s, 1H), 7.26 (s, 1H), 7.19 (m, 1H), 7.13 (bs, 1H), 6.87 (m, 1H), 5.02 (m, 1H), 2.82 (t, J=6.4 Hz, 2H), 2.76 (m, 1H), 2.30 (s, 3H), 1.95 (m, 2H), 1.78 (m, 1H)
A9	δ 8.22 (s, 1H), 7.25 (m, 3H), 7.04 (t, J=8.4 Hz, 1H), 7.00 (bs, 1H), 5.02 (m, 1H), 2.82 (m, 3H), 2.27 (s, 3H), 1.95 (m, 2H), 1.82 (m, 1H)
A10	δ 8.23 (s, 1H), 7.24 (m, 2H), 6.79 (bs, 1H), 6.55 (m, 2H), 5.03 (m, 1H), 3.82 (s, 6H), 2.79 (m, 2H), 2.71 (m, 1H), 2.28 (s, 3H), 1.92 (m, 3H)
B1	δ 10.8 (s, 1H), 8.35 (m, 1H), 8.25 (s, 1H), 8.07 (s, 1H), 7.86 (m, 2H), 7.41 (m, 2H), 7.29 (m, 1H), 6.77 (m, 1H), 4.98 (m, 1H), 2.85 (m, 2H), 2.72 (m, 1H), 2.32 (s, 3H), 1.98 (m, 2H), 1.72 (m, 1H)
B2	δ 8.37 (m, 1H), 8.24 (s, 1H), 7.91 (m, 1H), 7.52 (m, 2H), 7.37 (m, 4H), 7.27 (s, 1H), 7.07 (m, 1H), 5.07 (m, 1H), 2.82 (m, 3H), 2.31 (s, 3H), 1.98 (m, 2H), 1.80 (m, 1H)

10

20

30

【 0 2 2 8 】

【 表 5 1 】

- B3  $\delta$  9.07 (bs, 1H), 8.51 (m, 1H), 8.24 (s, 1H), 7.90 (m, 1H), 7.28 (s, 1H), 7.05 (m, 1H), 5.03 (m, 1H), 2.83 (m, 2H), 2.72 (m, 1H), 2.55 (s, 3H), 2.30 (s, 3H), 1.97 (m, 2H), 1.86 (m, 1H)
- B4  $\delta$  8.81 (d, J=2.6 Hz, 1H), 8.24 (s, 1H), 8.12 (dd, J=2.6, 8.3 Hz, 1H), 7.56 (bs, 1H), 7.37 (d, J=8.3 Hz, 1H), 7.32 (s, 1H), 5.02 (m, 1H), 2.85 (m, 2H), 2.72 (m, 1H), 2.33 (s, 3H), 1.97 (m, 2H), 1.78 (m, 1H)
- B5  $\delta$  9.36 (bs, 1H), 8.67 (dd, J=1.9, 7.5 Hz, 1H), 8.21 (m, 1H), 8.15 (s, 1H), 7.44 (m, 1H), 7.23 (m, 6H), 5.12 (m, 1H), 2.80 (m, 3H), 2.25 (s, 3H), 1.95 (m, 2H), 1.74 (m, 1H)
- B6  $\delta$  9.03 (bs, 1H), 8.58 (dd, J=2.1, 7.5 Hz, 1H), 8.29 (s, 1H), 8.23 (dd, J=2.1, 4.9 Hz, 1H), 7.28 (s, 1H), 7.03 (dd, J=4.9, 7.5 Hz, 1H), 5.10 (m, 1H), 4.51 (m, 2H), 2.83 (m, 2H), 2.70 (m, 1H), 2.32 (s, 3H), 1.95 (m, 2H), 1.78 (m, 1H), 1.39 (t, J=7.1 Hz, 3H)
- B7  $\delta$  8.29 (d, J=5.4 Hz, 1H), 8.21 (s, 1H), 7.31 (d, J=5.4 Hz, 1H), 7.26 (s, 1H), 7.12 (bs, 1H), 5.02 (m, 1H), 2.82 (m, 3H), 2.29 (s, 3H), 1.97 (m, 2H), 1.84 (m, 1H)
- C1  $\delta$  8.50 (d, J=5.0 Hz, 1H), 8.24 (s, 1H), 7.73 (s, 1H), 7.61 (dd, J=1.5, 5.0 Hz, 1H), 7.50 (bs, 1H), 7.29 (s, 1H), 4.95 (m, 1H), 2.83 (t, J=6.5 Hz, 2H), 2.75 (m, 1H), 2.32 (s, 3H), 1.97 (m, 2H), 1.69 (m, 1H)
- C2  $\delta$  8.24 (s, 1H), 7.37 (bs, 1H), 7.29 (m, 2H), 7.05 (s, 1H), 4.91 (m, 1H), 3.96 (s, 3H), 2.82 (t, J=6.4 Hz, 2H), 2.73 (m, 1H), 2.32 (s, 3H), 1.95 (m, 2H), 1.65 (m, 1H)

10

20

(d)二重項、(t)三重項、(q)四重項、(m)多重項、(dd)二重項の二重項、(dt)三重項の二重項、(br s)広域一重項により示される

## 【 0 2 2 9 】

本発明の生物学的試験

試験懸濁液調製のための一般手順：最初に、試験化合物を最終体積の3%に等しい量でアセトン中に溶解し、次いで、250ppmの界面活性剤テレム(Trem)(登録商標)014(多価アルコールエステル)を含有するアセトンおよび精製水(50/50混合)中で所望の濃度(ppm)で懸濁する。次いで、得られた試験懸濁液を以下の試験で使用する。試験植物上の流出点に200ppmの試験懸濁液を噴霧することは、500g/h aの率に等しい。

## 【 0 2 3 0 】

試験 A

コムギ実生上の流出点に試験懸濁液を噴霧した。翌日、実生に孢子塵のErysiphe graminis f. sp. tritici(コムギうどんこ病の原因因子)を接種し、20で7日間、グロースチャンバー中で培養し、その後、病害評価を行った。

## 【 0 2 3 1 】

試験 B

コムギ実生上の流出点に試験懸濁液を噴霧した。翌日、実生に孢子懸濁液のPuccinia recondita(コムギ赤さび病の原因因子)を接種し、20で24時間、飽和雰囲気中で培養し、次いで20で6日間、グロースチャンバー中に移し、その後、病害評価を行った。

## 【 0 2 3 2 】

試験 C

トマト実生上の流出点に試験懸濁液を噴霧した。翌日、実生に孢子懸濁液のPhytophthora infestans(ジャガイモおよびトマト葉枯れ病の原因因子)を接種し、20で24時間、飽和雰囲気中で培養し、次いで20で5日間、グロースチャンバー中に移し、その後、病害評価を行った。

## 【 0 2 3 3 】

試験 D

50

トマト実生上の流出点に試験懸濁液を噴霧した。翌日、実生に孢子懸濁液の *Plasmopara viticola* (ブドウドンコ病の原因因子) を接種し、20 で24時間、飽和雰囲気中で培養し、20 で6日間、グロースチャンバー中に移し、次いで20 で24時間、飽和雰囲気中で培養し、その後、病害評価を行った。

【0234】

試験A～Dの結果を表Aに示す。表中、評価100は100%の病害抑制を示し、そして評価0は病害抑制がないことを示す(参照に対して)。ダッシュ(-)は、試験結果がないことを示す。NDは、薬害のため、病害抑制が決定されないことを示す。

【0235】

【表52】

10

表A

化合物	試験A	試験B	試験C	試験D
A1	0	84	100	-
A2	0	18	5	-
A3	0	41	47	-
A4	0	0	90	-
A5	0	55	46	-
A6	0	9	82	-
A7	0	45	75	-
A8	0	55	100	-
A9	0	38	97	-
A10	-	-	-	-
B1	0	19	16	-
B2	-	-	-	-
B3	0	23	56	-
B4	0	9	32	-
B5	-	-	-	-
B6	-	-	-	-
B7	-	-	-	-
B8	0	19	47	-
C1	0	55	84	-
C2	95	28	18	-

20

30

## 【国際公開パンフレット】

(12) INTERNATIONAL APPLICATION PUBLISHED UNDER THE PATENT COOPERATION TREATY (PCT)

(19) World Intellectual Property Organization  
International Bureau(43) International Publication Date  
21 November 2002 (21.11.2002)

PCT

(10) International Publication Number  
WO 02/091830 A1(51) International Patent Classification: A01N 43/42,  
43/50, C07D 215/40, 401/12, 221/04, 471/04, 491/04

(21) International Application Number: PCT/US02/18394

(22) International Filing Date: 14 May 2002 (14.05.2002)

(25) Filing Language: English

(26) Publication Language: English

(30) Priority Data: 60/290,884 15 May 2001 (15.05.2001) US

(71) Applicant (for all designated States except US): E.I. DU  
PONT DE NEMOURS AND COMPANY [US/US]; 1007  
Market Street, Wilmington, DE 19898 (US).(72) Inventor; and  
(75) Inventor/Applicant (for US only): SONG, Ying [US/US];  
161 Thompson Drive, Hockessin, DE 19707 (US).(74) Agent: HEISER, David, E.; E.I. du Pont de Nemours and  
Company, 4417 Lancaster Pike, Wilmington, DE 19805  
(US).(81) Designated States (national): AE, AG, AL, AM, AT, AU,  
AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU,  
CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH,  
GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KG, KP, KR, KZ, LC,  
LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW,  
MX, MY, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG,  
SI, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ,  
VN, YU, ZA, ZM, ZW.(84) Designated States (regional): ARIPO patent (GI, GM,  
KI, LS, MW, MZ, SD, SI, SZ, TZ, UG, ZM, ZW),  
Eurasian patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM),

## Declarations under Rule 4.17:

as to the identity of the inventor (Rule 4.17(i)) for the fol-  
lowing designations AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB,  
BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK,  
DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU,  
ID, IL, IN, IS, JP, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT,  
LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MY, NZ, OM,  
PH, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM,  
TN, TR, TT, TZ, UA, UG, UZ, VN, YU, ZA, ZM, ZW, ARIPO  
patent (GI, GM, KI, LS, MW, MZ, SD, SI, SZ, TZ, UG,  
ZM, ZW), Eurasian patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU,  
TJ, TM), European patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES,  
FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, TR), OAPI  
patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML,  
MR, NE, SN, TD, TG).

as to applicant's entitlement to apply for and be granted  
a patent (Rule 4.17(ii)) for the following designations AE,  
AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA,  
CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES,  
FI, FR, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KG,  
KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG,  
MK, MN, MW, MX, MY, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU,  
SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG,  
UZ, VN, YU, ZA, ZM, ZW, ARIPO patent (GI, GM, KI, LS,  
MW, MZ, SD, SI, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), Eurasian patent  
(AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), European patent  
(AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU,  
MC, NL, PT, SE, TR), OAPI patent (BF, BJ, CF, CG, CI,  
CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

## Published:

— with international search report

[Continued on next page]

(54) Title: PYRIDINYL FUSED BICYCLIC AMIDE AS FUNGICIDES

WO 02/091830 A1

(57) Abstract: This invention involves a method for controlling plant diseases caused by fungal plant pathogens comprising applying to the plant or portion thereof, or to the plant seed or seedling, a fungicidally effective amount of a compound of Formula I (including all geometric and stereoisomers), N-oxides, agriculturally suitable salts and compositions thereof, wherein A is taken together with N-C= to form a substituted fused pyridinyl ring; B is a substituted phenyl or pyridinyl ring; J is an optionally substituted linking chain of 2 to 5 members including at least one carbon member, optionally including one or two carbon members as C(=O), and optionally including one member selected from nitrogen and oxygen; W is C=O or SO<sub>2</sub>; L is O or S; R<sub>1</sub> is H, or C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alkynyl or C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> cycloalkyl, each optionally substituted; R<sub>2</sub> is H, or C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alkynyl or C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> cycloalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkoxycarbonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkylaminocarbonyl or C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> dialkylaminocarbonyl; and n is 1 or 2. This invention also includes fungicidal compositions comprising a compound of Formula I, N-oxides, and agriculturally suitable salts thereof. This invention also includes compounds of Formula I, N-oxides and agriculturally suitable salts thereof, provided that when B is a substituted phenyl ring, W is C=O or SO<sub>2</sub>, R<sub>1</sub> is H and J is a saturated chain of from 2 to 4 carbons that is either unsubstituted or substituted with one to three substituents selected from the group consisting of alkyl, alkoxy, aryl or aralkyl, then the compounds are N-oxides.

---

**WO 02/091830 A1** 

*before the expiration of the time limit for amending the claims and to be republished in the event of receipt of amendments* For two-letter codes and other abbreviations, refer to the "Guidance Notes on Codes and Abbreviations" appearing at the beginning of each regular issue of the PCT Gazette.

WO 02/091830

PCT/US02/18394

I

TITLE

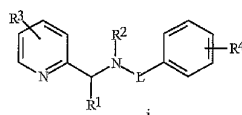
PYRIDINYL FUSED BICYCLIC AMIDE AS FUNGICIDES

BACKGROUND OF THE INVENTION

This invention relates to certain bicyclic amides having a pyridinyl ring fused through two adjacent carbon atoms to a second ring, their *N*-oxides, agriculturally suitable salts and compositions, and methods of their use as fungicides.

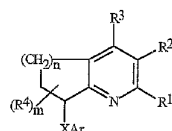
The control of plant diseases caused by fungal plant pathogens is extremely important in achieving high crop efficiency. Plant disease damage to ornamental, vegetable, field, cereal, and fruit crops can cause significant reduction in productivity and thereby result in increased costs to the consumer. Many products are commercially available for these purposes, but the need continues for new compounds, which are more effective, less costly, less toxic, environmentally safer or have different modes of action.

WO 99/42447 discloses certain benzamides of formula i as fungicides



wherein (among others) R<sup>1</sup> is H, alkyl, or acyl; R<sup>2</sup> is H or alkyl; and L is  $-(C=O)-$ ,  $-SO_2-$  or  $-(C=S)-$ .

GB 2219797 discloses certain fused pyridinyl compounds of Formula ii



wherein (among others) X is NHCO or NHSO<sub>2</sub>; Ar is an optionally substituted phenyl; R<sup>4</sup> is alkyl, alkoxy, aryl or aralkyl; m is 1, 2 or 3 and n is 1, 2 or 3.

Agents that effectively control plant fungi, particularly of the class Oomycetes, such as *Phytophthora* spp. and *Plasmopara* spp., are in constant demand by growers. Combinations of fungicides are often used to facilitate disease control and to retard resistance development. It is desirable to enhance the activity spectrum and the efficacy of disease control by using mixtures of active ingredients that provide a combination of curative, systemic and

WO 02/091830

PCT/US02/18394

2

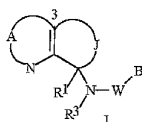
preventative control of plant pathogens. Also desirable are combinations that provide greater residual control to allow for extended spray intervals. It is also very desirable to combine fungicidal agents that inhibit different biochemical pathways in the fungal pathogens to retard development of resistance to any one particular plant disease control agent.

It is in all cases particularly advantageous to be able to decrease the quantity of chemical agents released in the environment while ensuring effective protection of crops from diseases caused by plant pathogens. Mixtures of fungicides may provide significantly better disease control than could be predicted based on the activity of the individual components. This synergism has been described as "the cooperative action of two components of a mixture, such that the total effect is greater or more prolonged than the sum of the effects of the two (or more) taken independently" (see Tames, P. M. L., *Neth. J. Plant Pathology*, (1964), 70, 73-80).

There is a desire to find fungicidal agents that are particularly advantageous in achieving one or more of the preceding objectives.

#### SUMMARY OF THE INVENTION

This invention involves compounds of Formula I (including all geometric and stereoisomers), *N*-oxides, agriculturally suitable salts and compositions thereof:



wherein

A is taken together with N-C=C to form a substituted fused pyridinyl ring;

B is a substituted phenyl or pyridinyl ring;

J is an optionally substituted linking chain of 2 to 5 members including at least one carbon member, optionally including one or two carbon members as C(=O), and optionally including one member selected from nitrogen and oxygen;

W is C=L or SO<sub>n</sub>;

L is O or S;

R<sup>1</sup> is H; or C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkynyl or C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> cycloalkyl, each optionally substituted;

R<sup>3</sup> is H; or C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkynyl or C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> cycloalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkylcarbonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkoxy carbonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkylaminocarbonyl or C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> dialkylaminocarbonyl; and

n is 1 or 2.

WO 02/091830

PCT/US02/18394

3

In particular, this invention includes a method for controlling plant diseases caused by fungal plant pathogens comprising applying to the plant or portion thereof, or to the plant seed or seedling, a fungicidally effective amount of a compound of Formula I (including all geometric and stereoisomers, *N*-oxides and agriculturally suitable salts thereof) or a composition comprising said compound.

This invention also includes compounds of Formula I (including all geometric and stereoisomers), *N*-oxides and agriculturally suitable salts thereof, provided that when B is a substituted phenyl ring, W is C=O or SO<sub>2</sub>, R<sup>3</sup> is H and J is a saturated chain of from 2 to 4 carbons that is either unsubstituted or substituted with from one to three substituents selected from the group consisting of alkyl, alkoxy, aryl or aralkyl, then the compounds are *N*-oxides.

This invention also includes fungicidal compositions comprising (1) a fungicidally effective amount of a compound of Formula I (including all geometric and stereoisomers, *N*-oxides and agriculturally suitable salts thereof); and (2) (i) at least one other insecticide, fungicide, nematocide, bactericide, acaricide, growth regulator, chemosterilant, semiochemical, repellent, attractant, pheromone, feeding stimulant or other biologically active compound; and/or (ii) at least one additional component selected from the group consisting of surfactants, solid diluents and liquid diluents.

This invention provides, for example, compositions comprising (a) at least one compound of Formula I; and

- (b) at least one compound selected from the group consisting of
  - (b1) alkylenebis(dithiocarbamate) fungicides;
  - (b2) compounds acting at the *bc*<sub>1</sub> complex of the fungal mitochondrial respiratory electron transfer site;
  - (b3) cymoxanil;
  - (b4) compounds acting at the demethylase enzyme of the sterol biosynthesis pathway;
  - (b5) morpholine and piperidine compounds that act on the sterol biosynthesis pathway;
  - (b6) phenylamide fungicides;
  - (b7) pyrimidinone fungicides;
  - (b8) phthalimides; and
  - (b9) fosetyl-aluminum.

#### DETAILS OF THE INVENTION

As noted above, A is a substituted fused pyridinyl ring and B is a substituted phenyl or pyridinyl ring. The term "substituted" in connection with these A or B rings refers to groups that have at least one non-hydrogen substituent that does not extinguish the fungicidal activity. Examples of Formula I incorporating said A and B rings in which A is substituted with one or two substituents selected from R<sup>5</sup> and B is substituted with from one to three substituents selected from R<sup>6</sup> include the rings illustrated in Exhibit 1 wherein m is an integer from 1 to 2 and p is an integer from 1 to 3. Note that the attachment point between



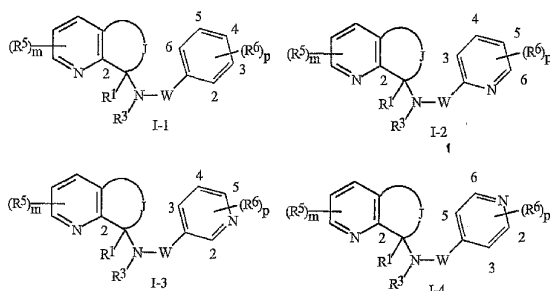
WO 02/091830

PCT/US02/18394

4

(R<sup>5</sup>)<sub>m</sub> and A and (R<sup>6</sup>)<sub>p</sub> and B is illustrated as floating, and (R<sup>5</sup>)<sub>m</sub> and (R<sup>6</sup>)<sub>p</sub> can be attached to any available carbon atom of the phenyl or pyridinyl rings.

Exhibit 1



Examples of R<sup>5</sup> when attached to A and R<sup>6</sup> when attached to B include

each R<sup>5</sup> and each R<sup>6</sup> is independently C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkynyl,

- 5 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> cycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> haloalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> haloalkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> haloalkynyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> halocycloalkyl, halogen, CN, CO<sub>2</sub>H, CONH<sub>2</sub>, NO<sub>2</sub>, hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkylsulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalkylsulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkoxy carbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkylamino, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> dialkylamino, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> cycloalkylamino, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkylcarbonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkoxy carbonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkylaminocarbonyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> dialkylaminocarbonyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> trialkylsilyl; or

each R<sup>5</sup> and each R<sup>6</sup> is independently a phenyl ring, a 5- or 6-membered

- 15 heteroaromatic ring, a benzyl ring or a phenoxy ring, each ring optionally substituted with from one to three groups independently selected from R<sup>7</sup>;

each R<sup>7</sup> is independently C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alkynyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>

- 20 cycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalkynyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> halocycloalkyl, halogen, CN, NO<sub>2</sub>, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkylsulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkoxy carbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkylamino, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> dialkylamino, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> cycloalkylamino, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> (alkyl)cycloalkylamino, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alkylcarbonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkoxy carbonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkylaminocarbonyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> dialkylaminocarbonyl or C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> trialkylsilyl.

As noted above, R<sup>1</sup> can be (among others) C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkynyl

or C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> cycloalkyl, each optionally substituted. The term "optionally substituted" in

- 25 connection with these R<sup>1</sup> groups refers to R<sup>1</sup> groups that are unsubstituted or have at least

WO 02/091830

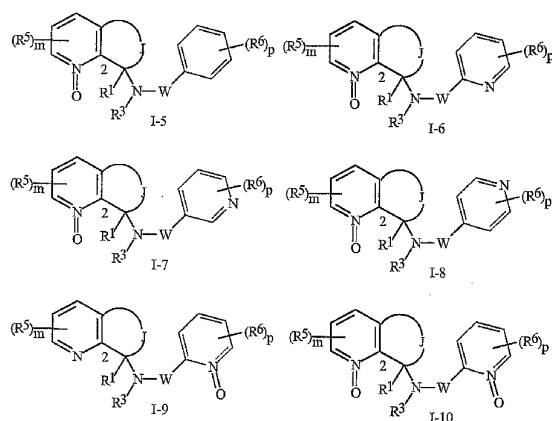
PCT/US02/18394

5

- one non-hydrogen substituent that does not extinguish the fungicidal activity possessed by the unsubstituted analog. Examples of optionally substituted  $R^1$  groups are those that are optionally substituted by replacement of a hydrogen on a carbon atom of the  $R^1$  group with one or more (up to the total number of hydrogens available for replacement in any specific
- 5  $R^1$  group) substituents independently selected from the group consisting of halogen, CN,  $NO_2$ , hydroxy,  $C_1$ - $C_4$  alkoxy,  $C_1$ - $C_4$  alkylthio,  $C_1$ - $C_4$  alkylsulfinyl,  $C_1$ - $C_4$  alkylsulfonyl,  $C_2$ - $C_4$  alkoxycarbonyl,  $C_1$ - $C_4$  alkylamino,  $C_2$ - $C_8$  dialkylamino and  $C_3$ - $C_6$  cycloalkylamino. Although these substituents are listed in the examples above, it is noted that they do not need to be present since they are optional substituents. Of note are  $R^1$  groups optionally
- 10 substituted with from one to five substituents.

Examples of *N*-oxides of Formula I are illustrated as I-5 through I-10 in Exhibit 2, wherein  $R^1$ ,  $R^3$ ,  $R^5$ ,  $R^6$ , W, m and p are as defined above.

## Exhibit 2



- As noted above, each  $R^5$  and each  $R^6$  can be (among others) a phenyl ring, a 5- or
- 15 6-membered heteroaromatic ring, a benzyl ring or a phenoxy ring, each ring optionally substituted with from one to three groups independently selected from  $R^7$ . The term "optionally substituted" in connection with these groups refers to groups which are unsubstituted or have at least one non-hydrogen substituent that does not extinguish the biological activity possessed by the unsubstituted analog. An example of a phenyl ring
- 20 optionally substituted with one to three groups independently selected from  $R^7$  is the ring illustrated as  $R^X$ -56 in Exhibit 3, wherein x is either 5 or 6 and r is an integer from one to

WO 02/091830

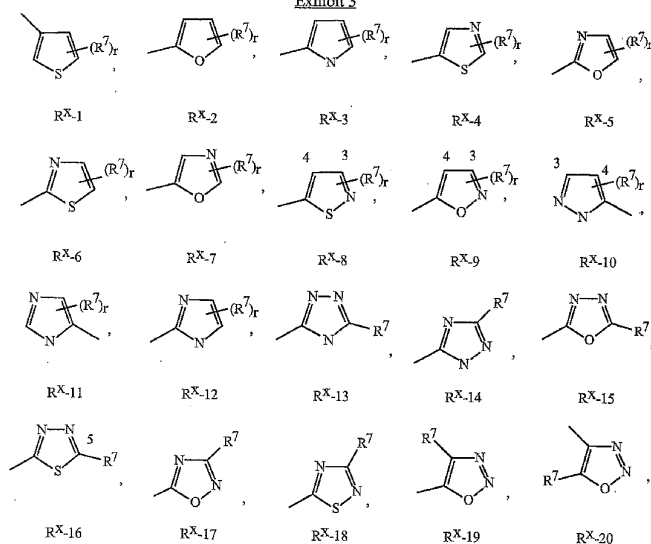
PCT/US02/18394

6

three. Examples of 5- or 6-membered heteroaromatic rings optionally substituted with one to three groups independently selected from  $R^7$  include the rings  $R^X$ -1 through  $R^X$ -55 illustrated in Exhibit 3, wherein  $x$  is either 5 or 6 and  $r$  is an integer from one to three. An example of a benzyl ring optionally substituted with one to three groups independently selected from  $R^7$  is the ring illustrated as  $R^X$ -57 in Exhibit 3, wherein  $x$  is either 5 or 6 and  $r$  is an integer from one to three. An example of a phenoxy ring optionally substituted with one to three groups independently selected from  $R^7$  is the ring illustrated as  $R^X$ -58 in Exhibit 3, wherein  $x$  is either 5 or 6 and  $r$  is an integer from one to three.

Although one to three  $R^7$  groups (represented as  $(R^7)_r$ ) are shown in the structures of  $R^X$ -1 through  $R^X$ -58, it is noted that they do not need to be present since they are optional substituents. The nitrogen atoms that require substitution to fill their valence are substituted with H or  $R^7$ . Note that some  $R^X$  groups can only be substituted with less than three  $R^7$  groups (e.g.  $R^X$ -15,  $R^X$ -16,  $R^X$ -17 through  $R^X$ -20 and  $R^X$ -31 through  $R^X$ -33 can only be substituted with one  $R^7$ ). Note that when the attachment point between  $(R^7)_r$  and the  $R^X$  group is illustrated as floating,  $(R^7)_r$  can be attached to any available carbon atom of the  $R^X$  group.

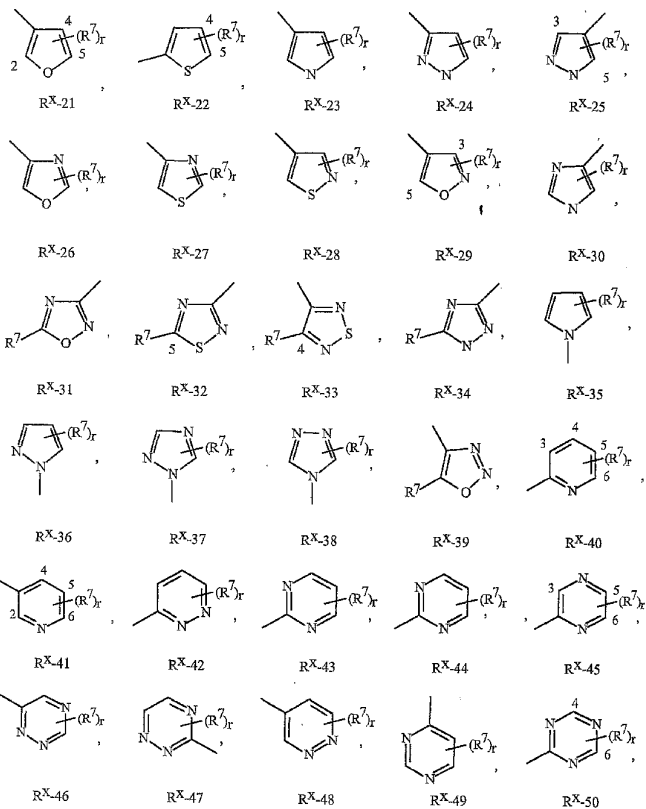
Exhibit 3



WO 02/091830

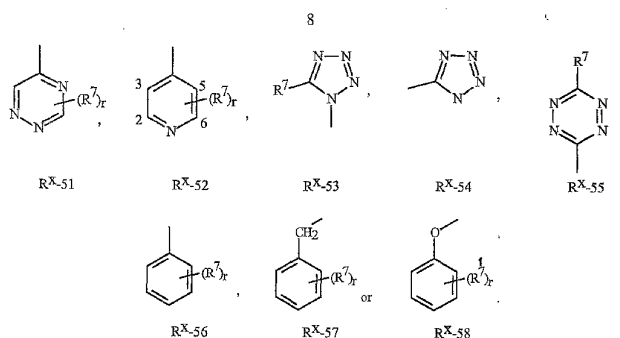
PCT/US02/18394

7



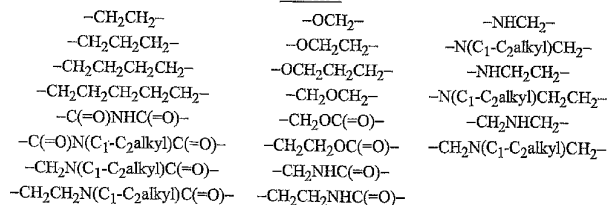
WO 02/091830

PCT/US02/18394



- As noted above, J is an optionally substituted linking chain of 2 to 5 members including at least one carbon member, optionally including one or two carbon members as C(=O), and optionally including one member selected from nitrogen and oxygen. The term "optionally substituted" in connection with the linking chain J refers to J-groups which are
- 5 unsubstituted or have at least one non-hydrogen substituent that does not extinguish the biological activity possessed by the unsubstituted analog. Examples of optionally substituted J-groups include the J-groups illustrated in Exhibit 4. The J-groups in Exhibit 4 are illustrated such that the left end of the J-group is attached to the A-ring at the 3-position and the right end of the J-group is attached to the carbon atom bearing the N(R<sup>3</sup>)WB moiety.
- 10 The J-groups in Exhibit 4 can be optionally substituted by replacement of a hydrogen on a carbon atom or nitrogen atom of the J-group with one or more (up to the total number of hydrogens available for replacement in any specific J-group) substituents independently selected from the group consisting of C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> alkyl, halogen, CN, NO<sub>2</sub> and C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> alkoxy. Although these substituents are listed, it is noted that they do not need to be present since
- 15 they are optional substituents. Of note are J-groups optionally substituted with from one to four substituents selected from the group above.

## Exhibit 4



WO 02/091830

PCT/US02/18394

9

- In the above recitations, the term "alkyl", used either alone or in compound words such as "alkylthio" or "haloalkyl" includes straight-chain or branched alkyl, such as methyl, ethyl, *n*-propyl, *i*-propyl, or the different butyl, pentyl or hexyl isomers. "Alkenyl" includes straight chain or branched alkenes such as ethenyl, 1-propenyl, 2-propenyl, and the different
- 5 butenyl, pentenyl and hexenyl isomers. "Alkenyl" also includes polyenes such as 1,2-propadienyl and 2,4-hexadienyl. "Alkynyl" includes straight chain or branched alkynes such as ethynyl, 1-propynyl, 2-propynyl and the different butynyl, pentynyl and hexynyl isomers. "Alkynyl" can also include moieties comprised of multiple triple bonds such as 2,5-hexadiynyl. "Alkoxy" includes, for example, methoxy, ethoxy, *n*-propyloxy,
- 10 isopropyloxy and the different butoxy, pentoxy and hexyloxy isomers. "Alkylthio" includes branched or straight chain alkylthio moieties such as methylthio, ethylthio, and the different propylthio, butylthio, pentylthio and hexylthio isomers. "Alkylsulfinyl" includes both enantiomers of an alkylsulfinyl group. Examples of "alkylsulfinyl" include  $\text{CH}_3\text{S(O)}$ ,  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S(O)}$ ,  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S(O)}$ ,  $(\text{CH}_3)_2\text{CHS(O)}$  and the different butylsulfinyl,
- 15 pentylsulfinyl and hexylsulfinyl isomers. Examples of "alkylsulfonyl" include  $\text{CH}_3\text{S(O)}_2$ ,  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S(O)}_2$ ,  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S(O)}_2$ ,  $(\text{CH}_3)_2\text{CHS(O)}_2$  and the different butylsulfonyl, pentylsulfonyl and hexylsulfonyl isomers. "Alkylamino", "dialkylamino" and the like, are defined analogously to the above examples. "Cycloalkyl" includes, for example, cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl and cyclohexyl.
- 20 The term "halogen", either alone or in compound words such as "haloalkyl", includes fluorine, chlorine, bromine or iodine. Further, when used in compound words such as "haloalkyl", said alkyl may be partially or fully substituted with halogen atoms which may be the same or different. Examples of "haloalkyl" include  $\text{F}_3\text{C}$ ,  $\text{ClCH}_2$ ,  $\text{CF}_3\text{CH}_2$  and  $\text{CF}_3\text{CCl}_2$ . The terms "haloalkenyl", "haloalkynyl", "haloalkoxy", "haloalkylthio", and the
- 25 like, are defined analogously to the term "haloalkyl". Examples of "haloalkenyl" include  $(\text{Cl})_2\text{C}=\text{CHCH}_2$  and  $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2$ . Examples of "haloalkynyl" include  $\text{HC}\equiv\text{CCHCl}$ ,  $\text{CF}_3\text{C}\equiv\text{C}$ ,  $\text{CCl}_3\text{C}\equiv\text{C}$  and  $\text{FCH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2$ . Examples of "haloalkoxy" include  $\text{CF}_3\text{O}$ ,  $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{O}$ ,  $\text{HCF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}$  and  $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{O}$ . Examples of "haloalkylthio" include  $\text{CCl}_3\text{S}$ ,  $\text{CF}_3\text{S}$ ,  $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{S}$  and  $\text{ClCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}$ . Examples of "haloalkylsulfinyl" include  $\text{CF}_3\text{S(O)}$ ,
- 30  $\text{CCl}_3\text{S(O)}$ ,  $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{S(O)}$  and  $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{S(O)}$ . Examples of "haloalkylsulfonyl" include  $\text{CF}_3\text{S(O)}_2$ ,  $\text{CCl}_3\text{S(O)}_2$ ,  $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{S(O)}_2$  and  $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{S(O)}_2$ .
- Examples of "alkylcarbonyl" include  $\text{CH}_3\text{C(=O)}$ ,  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{C(=O)}$ ,  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C(=O)}$  and  $(\text{CH}_3)_2\text{CHC(=O)}$ . Examples of "alkoxycarbonyl" include  $\text{CH}_3\text{OC(=O)}$ ,  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OC(=O)}$ ,  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OC(=O)}$ ,  $(\text{CH}_3)_2\text{CHOC(=O)}$  and the different butoxy- or
- 35 pentoxy-carbonyl isomers. Examples of "alkylaminocarbonyl" include  $\text{CH}_3\text{NHC(=O)}$ ,  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{NHC(=O)}$ ,  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHC(=O)}$ ,  $(\text{CH}_3)_2\text{CHNHC(=O)}$  and the different butylamino- or pentylaminocarbonyl isomers. Examples of "dialkylaminocarbonyl" include

WO 02/091830

PCT/US02/18394

10

$(\text{CH}_3)_2\text{NC}(=\text{O})$ ,  $(\text{CH}_3\text{CH}_2)_2\text{NC}(=\text{O})$ ,  $\text{CH}_3\text{CH}_2(\text{CH}_3)\text{NC}(=\text{O})$ ,  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2(\text{CH}_3)\text{NC}(=\text{O})$ ,  $(\text{CH}_3)_2\text{CHN}(\text{CH}_3)\text{C}(=\text{O})$  and the different butylamino- or pentylaminocarbonyl isomers.

"Aromatic" indicates that each of the ring atoms is essentially in the same plane and has a *p*-orbital perpendicular to the ring plane, and in which  $(4n + 2)$   $\pi$  electrons, when *n* is 0 or a positive integer, are associated with the ring to comply with Hückel's rule. The term "hetero" in connection with rings refers to a ring in which at least one ring atom is not carbon and which can contain 1 to 4 heteroatoms independently selected from the group consisting of nitrogen, oxygen and sulfur, provided that each ring contains no more than 4 nitrogens, no more than 2 oxygens and no more than 2 sulfurs. The terms "heteroaromatic ring" includes fully aromatic heterocycles. The heterocyclic ring can be attached through any available carbon or nitrogen by replacement of a hydrogen on said carbon or nitrogen. The term "aryl" refers to aromatic hydrocarbon moieties including phenyl, tolyl and naphthalenyl which may be optionally substituted. The term "aralkyl" is an alkyl moiety substituted with an aryl moiety including phenylalkyls such as benzyl (which may be optionally substituted).

One skilled in the art will appreciate that not all nitrogen containing heterocycles can form *N*-oxides since the nitrogen requires an available lone pair for oxidation to the oxide; one skilled in the art will recognize those nitrogen containing heterocycles which can form *N*-oxides. One skilled in the art will also recognize that tertiary amines can form *N*-oxides. Synthetic methods for the preparation of *N*-oxides of heterocycles and tertiary amines are very well known by one skilled in the art including the oxidation of heterocycles and tertiary amines with peroxy acids such as peracetic and *m*-chloroperbenzoic acid (MCPBA), hydrogen peroxide, alkyl hydroperoxides such as *t*-butyl hydroperoxide, sodium perborate, and dioxiranes such as dimethyldioxirane. These methods for the preparation of *N*-oxides have been extensively described and reviewed in the literature, see for example: T. L. Gilchrist in *Comprehensive Organic Synthesis*, vol. 7, pp 748-750, S. V. Ley, Ed., Pergamon Press; M. Tisler and B. Stanovnik in *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*, vol. 3, pp 18-20, A. J. Boulton and A. McKillop, Eds., Pergamon Press; M. R. Grimmett and B. R. T. Keene in *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 43, pp 149-161, A. R. Katritzky, Ed., Academic Press; M. Tisler and B. Stanovnik in *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 9, pp 285-291, A. R. Katritzky and A. J. Boulton, Eds., Academic Press; and G. W. H. Cheeseman and E. S. G. Werstiuk in *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 22, pp 390-392, A. R. Katritzky and A. J. Boulton, Eds., Academic Press.

The total number of carbon atoms in a substituent group is indicated by the " $\text{C}_i\text{-C}_j$ " prefix where *i* and *j* are numbers from 1 to 8. For example,  $\text{C}_1\text{-C}_3$  alkylsulfonyl designates methylsulfonyl through propylsulfonyl;  $\text{C}_2\text{-C}_8$  dialkylamino designates, for example,  $(\text{CH}_3)_2\text{N}$ ,  $(\text{CH}_3\text{CH}_2)_2\text{N}$ ,  $\text{CH}_3\text{CH}_2(\text{CH}_3)\text{N}$ ,  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2(\text{CH}_3)\text{N}$  or  $(\text{CH}_3)_2\text{CHN}(\text{CH}_3)$  containing a total of from 2 to 8 carbon atoms.

WO 02/091830

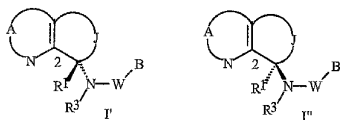
PCT/US02/18394

11

When a compound is substituted with a substituent bearing a subscript that indicates the number of said substituents can exceed 1, said substituents (when they exceed 1) are independently selected from the group of defined substituents. Further, when the subscript indicates a range, e.g.  $(R)_{i-j}$ , then the number of substituents may be selected from the integers between  $i$  and  $j$  inclusive.

The term "optionally substituted with from one to three substituents" and the like indicates that from one to three of the available positions on the group may be substituted. When a group contains a substituent which can be hydrogen, for example  $R^1$  or  $R^2$  then, when this substituent is taken as hydrogen, it is recognized that this is equivalent to said group being unsubstituted.

Compounds involved in this invention can exist as one or more stereoisomers. The various stereoisomers include enantiomers, diastereomers, atropisomers and geometric isomers. One skilled in the art will appreciate that one stereoisomer may be more active and/or may exhibit beneficial effects when enriched relative to the other stereoisomer(s) or when separated from the other stereoisomer(s). Additionally, the skilled artisan knows how to separate, enrich, and/or to selectively prepare said stereoisomers. Accordingly, the present invention comprises compounds selected from Formula I, *N*-oxides and agriculturally suitable salts thereof. The compounds may be present as a mixture of stereoisomers, individual stereoisomers, or as an optically active form. In particular, since  $R^1$  and  $J$  of Formula I are different, then said formula possesses a chiral center at the carbon to which they are commonly bonded. This invention comprises racemic mixtures of equal parts of Formula I' and Formula I''.



wherein A, B, J, W,  $R^1$ ,  $R^2$ , and  $R^3$  are as defined above.

In addition, this invention includes compounds and compositions that are enriched in an enantiomer of the Formula I' or Formula I'' compared to the racemic mixture. Included are compounds and compositions involving the essentially pure enantiomers of Formula I' or Formula I''. For example, this invention includes compounds of Formula I that are enriched in an enantiomer of the Formula I' compared to the racemic mixture. Included are the essentially pure enantiomers of Formula I'. This invention also includes compositions wherein component (a) is enriched in a component (a) enantiomer of Formula I'' compared to the racemic mixture. This invention also includes compounds of Formula I that are enriched in an enantiomer of the Formula I'' compared to the racemic mixture. Included are



WO 02/091830

PCT/US02/18394

12

the essentially pure enantiomers of Formula I". This invention also includes compositions wherein component (a) is enriched in a component (a) enantiomer of Formula I" compared to the racemic mixture.

When enantiomerically enriched, one enantiomer is present in greater amounts than the other and the extent of enrichment can be defined by an expression of enantiomer excess ("ee"), which is defined as  $100(2x-1)$  where x is the mole fraction of the dominant enantiomer in the mixture. (e.g., an ee of 20% corresponds to a 60:40 ratio of enantiomers). Preferably there is at least a 50 % enantiomeric excess; more preferably at least a 75 % enantiomeric excess; still more preferably at least a 90 % enantiomeric excess; and the most preferably at least a 94 % enantiomeric excess of the more active isomer. Of particular note are enantiomerically pure embodiments of the more active isomer.

The salts of the compounds of the invention include acid-addition salts with inorganic or organic acids such as hydrobromic, hydrochloric, nitric, phosphoric, sulfuric, acetic, butyric, fumaric, lactic, maleic, malonic, oxalic, propionic, salicylic, tartaric, 4-toluenesulfonic or valeric acids. The salts of the compounds of the invention also include those formed with organic bases (e.g., pyridine, ammonia, or triethylamine) or inorganic bases (e.g., hydrides, hydroxides, or carbonates of sodium, potassium, lithium, calcium, magnesium or barium) when the compound contains an acidic group such as a carboxylic acid or phenol.

This invention provides a method for controlling plant diseases caused by fungal plant pathogens comprising applying to the plant or portion thereof, or to the plant seed or seedling, a fungicidally effective amount of a compound of Formula I including all geometric and stereoisomers, N-oxides and agriculturally suitable salts thereof (e.g. as a component of a composition described herein).

Preferred methods for reasons of better activity and/or ease of synthesis are:

Preferred 1. Preferred are methods comprising compounds of Formula I wherein

A is taken together with N-C=C to form a fused pyridinyl ring substituted with one or two substituents independently selected from R<sup>5</sup>;

B is substituted with from one to three substituents independently selected from R<sup>6</sup>;

J is a linking chain of 2 to 5 members including at least one carbon member, optionally including one or two carbon members as C(=O), and optionally including one member selected from nitrogen or oxygen, optionally substituted with one or more substituents selected from the group consisting of C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> alkyl, halogen, CN, NO<sub>2</sub> and C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> alkoxy;

R<sup>1</sup> is H; or C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkynyl or C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> cycloalkyl, each optionally substituted with one or more substituents selected from the group consisting of halogen, CN, NO<sub>2</sub>, hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkoxy,

WO 02/091830

PCT/US02/18394

13

- C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkylsulfonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alkoxy carbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkylamino, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> dialkylamino and C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> cycloalkylamino;
- 5 each R<sup>5</sup> and each R<sup>6</sup> is independently C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkynyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> cycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> haloalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> haloalkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> haloalkynyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> halocycloalkyl, halogen, CN, CO<sub>2</sub>H, CONH<sub>2</sub>, NO<sub>2</sub>, hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkylsulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalkylsulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkoxy carbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkylamino, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> dialkylamino, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> cycloalkylamino, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkyl carbonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkoxy carbonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkylaminocarbonyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> dialkylaminocarbonyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> trialkylsilyl; or
- 10 each R<sup>5</sup> and each R<sup>6</sup> is independently a phenyl ring, a 5- or 6-membered heteroaromatic ring, a benzyl ring or a phenoxy ring, each ring optionally substituted with from one to three groups independently selected from R<sup>7</sup>; and
- 15 each R<sup>7</sup> is independently C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alkynyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> cycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalkynyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> halocycloalkyl, halogen, CN, NO<sub>2</sub>, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkylsulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkoxy carbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkylamino, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> dialkylamino, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> cycloalkylamino, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> (alkyl)cycloalkylamino, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alkyl carbonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkoxy carbonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkylaminocarbonyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> dialkylaminocarbonyl or C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> trialkylsilyl.
- 20 Of note are methods of Preferred 1 wherein
- 25 each R<sup>5</sup> and each R<sup>6</sup> is independently C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkynyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> cycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> haloalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> haloalkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> haloalkynyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> halocycloalkyl, halogen, CN, CO<sub>2</sub>H, CONH<sub>2</sub>, NO<sub>2</sub>, hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkylsulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalkylsulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkoxy carbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkylamino, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> dialkylamino, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> cycloalkylamino, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> (alkyl)cycloalkylamino, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alkyl carbonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkoxy carbonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkylaminocarbonyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> dialkylaminocarbonyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> trialkylsilyl; or
- 30 each R<sup>5</sup> and each R<sup>6</sup> is independently phenyl, benzyl or phenoxy, each optionally substituted with C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alkynyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> cycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalkynyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> halocycloalkyl, halogen, CN, NO<sub>2</sub>, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>
- 35

WO 02/091830

PCT/US02/18394

14

alkylsulfanyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkylsulfonyl C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkoxycarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkylamino, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> dialkylamino, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> cycloalkylamino, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> (alkyl)cycloalkylamino, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alkylcarbonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkoxycarbonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkylaminocarbonyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> dialkylaminocarbonyl or C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> trialkylsilyl.

5 Preferred 2. Methods of Preferred 1 wherein W is C=O.

Preferred 3. Methods of Preferred 2 wherein

J is selected from -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-,  
-OCH<sub>2</sub>-, -OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-, -OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-, -CH<sub>2</sub>NHCH<sub>2</sub>-,  
-CH<sub>2</sub>N(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> alkyl)CH<sub>2</sub>-, -CONHCO- and -CON(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> alkyl)CO-;  
10 and

each R<sup>5</sup> and each R<sup>6</sup> is independently C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkynyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> cycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> haloalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> haloalkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> haloalkynyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> halocycloalkyl, halogen, CN, NO<sub>2</sub>, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkylsulfanyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkylsulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalkylsulfanyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalkylsulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkoxycarbonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkylcarbonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkoxycarbonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkylaminocarbonyl or C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> dialkylaminocarbonyl.

Preferred 4. Methods of Preferred 3 wherein each R<sup>5</sup> is independently halogen, CN, NO<sub>2</sub>, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> haloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> haloalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> alkylsulfanyl and C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> alkylsulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> haloalkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> haloalkylsulfanyl C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> haloalkylsulfonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alkoxycarbonyl or C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alkylaminocarbonyl.

Of note are methods of Preferred 4 wherein R<sup>5</sup> is CH<sub>3</sub>, Cl, Br, I, CN, NO<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, CO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CONHCH<sub>3</sub>CH<sub>3</sub>, OCF<sub>3</sub>, OCHF<sub>2</sub>, OCH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, OCF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, OCF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>H, OCHF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, SCF<sub>3</sub>, SCH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, SCH<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>H, SCF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, SCF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>H, SCH<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>H, SOCF<sub>3</sub>, SOCHF<sub>2</sub>, SOCH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, SOCF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, SOCF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>H, SOCHF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, SO<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, SO<sub>2</sub>CHF<sub>2</sub>, SO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, SO<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, SO<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>H or SO<sub>2</sub>CHF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>.

Preferred 5. Methods of Preferred 4 wherein B is a phenyl ring optionally substituted with from one to three substituents independently selected from R<sup>6</sup>.

Preferred 6. Methods of Preferred 5 wherein each R<sup>6</sup> is independently C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> haloalkyl, halogen, CN, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> haloalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> alkylsulfanyl or C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> alkylsulfonyl and at least one R<sup>6</sup> is located in a position *ortho* to the link with W.

Of note are methods of Preferred 6 wherein there is an R<sup>6</sup> at each position *ortho* to the link with W, and optionally 1 to 2 additional R<sup>6</sup> and R<sup>6</sup> is either halogen or methyl.

Preferred 7. Methods of Preferred 6 wherein J is -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>- or -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-.

WO 02/091830

PCT/US02/18394

15

Preferred 8. Methods of Preferred 7 wherein each R<sup>5</sup> is independently CH<sub>3</sub>, Cl, Br, I, CN, NO<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, OCF<sub>3</sub>, OCHF<sub>2</sub>, SCF<sub>3</sub>, SCHF<sub>2</sub>, CO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub> or CONHCH<sub>3</sub>.

Of note are methods of Preferred 8 wherein R<sup>5</sup> is CH<sub>3</sub>, Cl, Br, CN, NO<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, CO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub> or CONHCH<sub>3</sub>.

5 Preferred 9. Methods of Preferred 4 wherein B is a 3-pyridinyl or a 4-pyridinyl ring optionally substituted with from one to three substituents independently selected from R<sup>6</sup>.

Preferred 10. Methods of Preferred 9 wherein each R<sup>6</sup> is independently C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> haloalkyl, halogen, CN, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> haloalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> alkylsulfinyl or C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> alkylsulfonyl and at least one R<sup>6</sup> is located in a position *ortho* to the link with W.

Preferred 11. Methods of Preferred 10 wherein J is -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>- or -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-.

Preferred 12. Methods of Preferred 11 wherein each R<sup>5</sup> is independently CH<sub>3</sub>, Cl, Br, I, CN, NO<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, OCF<sub>3</sub>, OCHF<sub>2</sub>, SCF<sub>3</sub>, SCHF<sub>2</sub>, CO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub> or CONHCH<sub>3</sub>.

15 Of note are methods of Preferred 12 wherein R<sup>5</sup> is CH<sub>3</sub>, Cl, Br, CN, NO<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, CO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub> or CONHCH<sub>3</sub>.

Preferred 13. Methods of Preferred 12 wherein B is a 3-pyridinyl ring wherein one R<sup>6</sup> is Cl located at the 2-position *ortho* to the link with C=O, another R<sup>6</sup> is selected from Cl or methyl and is located at the 4-position *ortho* to the link with C=O and a third optional R<sup>6</sup> is methyl at the 6-position.

20 Preferred 14. Methods of any of Preferred 2 through Preferred 13 wherein R<sup>1</sup> is H and R<sup>3</sup> is H.

Specifically preferred are the methods comprising a compound selected from the group consisting of

25 2-chloro-6-methoxy-N-(5,6,7,8-tetrahydro-3-methyl-8-quinolinyl)-4-pyridinecarboxamide,  
2,6-dichloro-N-(5,6,7,8-tetrahydro-3-methyl-8-quinolinyl)benzamide and  
2,3,6-trifluoro-N-(5,6,7,8-tetrahydro-3-methyl-8-quinolinyl)benzamide.

30 This invention also relates to fungicidal compositions comprising fungicidally effective amounts of the compounds of Formula I. The preferred compositions of the present invention are those which comprise the compounds recited in Preferred 1 through Preferred 14 above.

35 This invention also includes compounds of Formula I including all geometric and stereoisomers, N-oxides and agriculturally suitable salts thereof, provided that when B is a substituted phenyl ring, W is C=O or SO<sub>2</sub>, R<sup>3</sup> is H and J is a saturated chain of from 2 to 4 carbons that is either unsubstituted or substituted with from one to three substituents selected from the group consisting of alkyl, alkoxy, aryl or aralkyl, then the compounds are N-oxides.

WO 02/091830

PCT/US02/18394

16

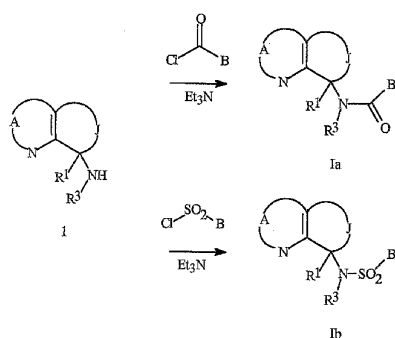
Preferred compounds are those recited in Preferred 1 through Preferred 14 above, subject to the proviso above.

A specifically preferred compound is 2-chloro-6-methoxy-*N*-(5,6,7,8-tetrahydro-3-methyl-8-quinoliny)-4-pyridinecarboxamide.

- 5 The compounds of Formula I can be prepared by one or more of the following methods and variations as described in Schemes 1-19. Compounds of Formulae Ia, Ib and Ic are subsets of the compounds of Formula I, and all substituents for Formulae Ia, Ib and Ic are as defined above for Formula I. The definitions of A, B, J, L, W, R<sup>1</sup> through R<sup>6</sup> and m in the compounds of Formulae 1-19 below are as defined above. Compounds of Formula 1a-e, 10 6a-c, 8a-f, 10a-c, 11a-c, 16a-b, 18a-d and 19a-b are subsets of Formula 1, 6, 8, 10, 11, 16, 18 and 19 respectively. J<sup>1</sup> through J<sup>6</sup> in the formulae below are subsets of J.

- As illustrated in Scheme 1, the compounds of Formula Ia are prepared by treating amine or amine salts of Formula 1 with an appropriate acid chloride in an inert solvent with two molar equivalents of a base (e.g. triethylamine (Et<sub>3</sub>N), polymer supported diisopropylethylamine or potassium carbonate) present. Similarly, compounds of 15 Formula Ib are prepared by treating amine or amine salts of Formula 1 with an appropriate sulfonyl chloride in an inert solvent with two molar equivalents of a base (e.g. triethylamine, polymer supported diisopropylethylamine or potassium carbonate) present. Suitable solvents are selected from the group consisting of ethers such as tetrahydrofuran, dimethoxyethane, or diethyl ether; hydrocarbons such as toluene or benzene; and halocarbons such as 20 dichloromethane or chloroform.

Scheme 1



Alternatively, compounds of Formula Ia can be synthesized by reacting the amine or amine salts of Formula 1 with an appropriate carboxylic acid in the presence of an organic

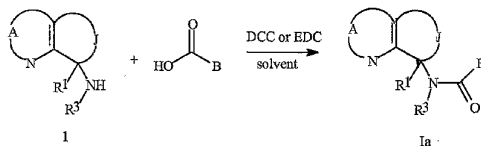
WO 02/091830

PCT/US02/18394

17

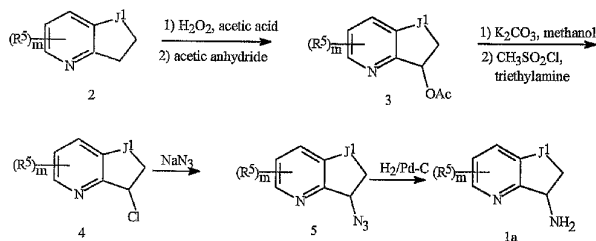
dehydrating reagent such as 1,3-dicyclohexylcarbodiimide (DCC) or 1-[3-(Dimethylamino)propyl]-3-ethylcarbodiimide hydrochloride (EDC) as depicted in Scheme 2. Suitable solvents are selected from the group consisting of ethers such as tetrahydrofuran, dimethoxyethane, or diethyl ether; hydrocarbons such as toluene or benzene; and halocarbons such as dichloromethane or chloroform.

Scheme 2



Intermediate amine 1a, a compound of Formula 1 wherein A is a 2-pyridyl ring bearing the indicated substituents, J<sup>1</sup> is -(CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>, q is 1, 2, 3 or 4 and R<sup>1</sup> and R<sup>3</sup> are both hydrogen, can be prepared from the commercially available pyridines of Formula 2 (Scheme 3). As shown in Scheme 3, the CH<sub>2</sub> attached ortho to the pyridine nitrogen atom of Formula 2 can be substituted with NH<sub>2</sub> by a sequence of steps comprising hydrogen peroxide oxidation, acylation, hydrolysis, chlorination, azide displacement and reduction (e.g. catalytic hydrogenation using H<sub>2</sub> and palladium on carbon as catalyst) in procedures analogous to those found in WO00/56729 to provide the amine 1a.

Scheme 3



J<sup>1</sup> is (CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub> and q is 1, 2, 3 or 4

Compounds of Formula 1b wherein J<sup>2</sup> is -CH<sub>2</sub>O-, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O-, -CH<sub>2</sub>NH-, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NH-, -CH<sub>2</sub>N(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> alkyl)-, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>N(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> alkyl)-, -CONH- or -CH<sub>2</sub>N(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>alkyl)- can be synthesized by intramolecular displacement using compounds of Formula 6 in the presence of a strong base such as sodium hydride in a polar, aprotic solvent

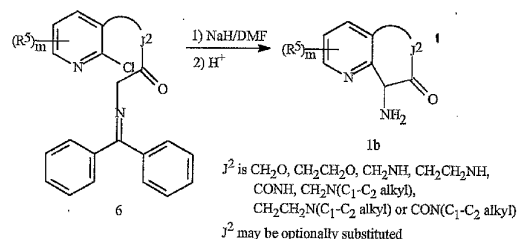
WO 02/091830

PCT/US02/18394

18

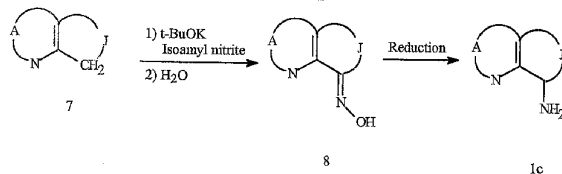
such as *N,N*-dimethylformamide followed by heating in acidic medium as shown in Scheme 4. Similar intermolecular displacements with 2,3-dichloro-substituted pyridines are reported in WO99/42447. The groups enumerated for  $J^2$  may also be optionally substituted with one or more (up to the total number of hydrogens available for replacement in any specific  $J$ -group) substituents independently selected from the group consisting of  $C_1$ - $C_2$  alkyl (e.g.  $CH(CH_3)O$ ,  $C(CH_3)_2O$ , or  $CH(CH_2CH_3)O$ ), halogen, CN,  $NO_2$  and  $C_1$ - $C_2$  alkoxy.

Scheme 4



Alternatively, compounds of Formula 1c (wherein A and J are as previously defined and  $R^1$  is hydrogen) can be prepared by treating compounds of Formula 7 with isoamyl nitrite and a base such as potassium *t*-butoxide (*t*-BuOK) followed by reduction of the resulting oximes of Formula 8 (Scheme 5). The reduction can be accomplished, for example, with lithium aluminum hydride, zinc and acetic acid, or catalytic hydrogenation. (See Jerry March, *Advanced Organic Chemistry: Reactions, Mechanism and Structure*, Third Edition, John Wiley & Sons, New York, 1985, p 1105 for leading references for reduction of oximes).

Scheme 5



Alternatively, compounds of Formula 1c (wherein A and J are defined and  $R^1$  is hydrogen) can be prepared by reductive amination of compounds of Formula 9 as shown in Scheme 6. Many methods for reductive amination have been reported. For some leading

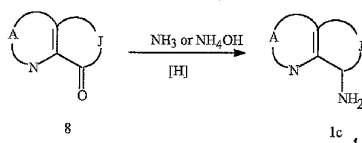
WO 02/091830

PCT/US02/18394

19

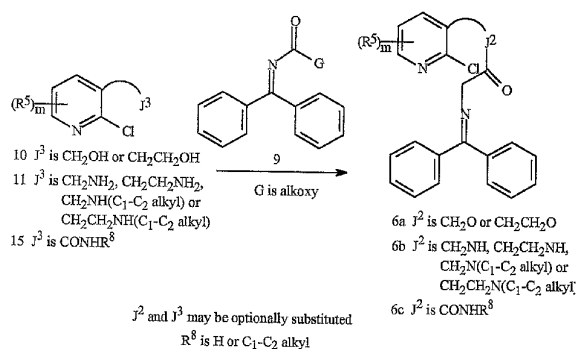
references, see Jerry March, *Advanced Organic Chemistry: Reactions, Mechanism and Structure*, Third Edition, John Wiley & Sons, New York, 1985, pp. 798-800.

Scheme 6



- Compounds of Formula 6a wherein  $J^2$  is optionally substituted  $-\text{CH}_2\text{O}-$  or  $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-$  can be prepared by transesterification of *N*-(diphenylmethylene)glycine esters of Formula 9 with the corresponding alcohols of Formula 10 under basic conditions (Scheme 7).
- Compounds of Formula 6b wherein  $J^2$  is optionally substituted  $-\text{CH}_2\text{NH}-$ ,  $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}-$ ,  $-\text{CH}_2\text{N}(\text{C}_1\text{-C}_2\text{alkyl})-$  or  $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{N}(\text{C}_1\text{-C}_2\text{alkyl})-$  can be prepared by amidation of *N*-(diphenylmethylene)glycine esters of Formula 9 with the corresponding amines of Formula 11. Compounds of Formula 6c wherein  $J^2$  is optionally substituted  $-\text{CONH}-$  or  $-\text{CON}(\text{C}_1\text{-C}_2\text{alkyl})-$  can be prepared by amidation of *N*-(diphenylmethylene)glycine esters of Formula 9 with the corresponding amides of Formula 15.

Scheme 7



- As illustrated in Scheme 8, compounds of Formula 10a wherein  $J^3$  is optionally substituted  $-\text{CH}_2\text{OH}$  can be prepared by ortho-lithiation of a compound of Formula 12 followed by reaction with an aldehyde or aldehyde synthon (e.g. paraformaldehyde) or



WO 02/091830

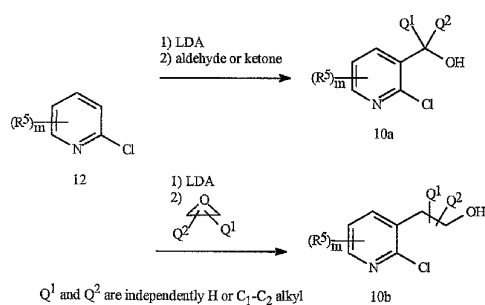
PCT/US02/18394

20

ketone. Similarly, compounds of Formula 10b wherein J<sup>3</sup> is optionally substituted -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OH can be prepared by ortho-lithiation followed by reaction with an epoxide. Ortho-lithiations can be accomplished by treatment of the substrate with a strong lithium base such as lithium diisopropylamide (LDA) and are typically carried out at reduced temperatures. Suitable solvents are selected from the group consisting of ethers such as tetrahydrofuran, dimethoxyethane, or diethyl ether and hydrocarbons such as hexane, heptane or ethylbenzene.

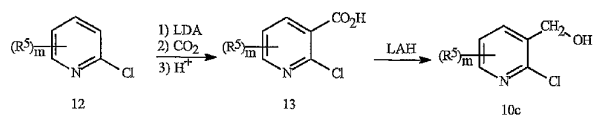
As illustrated in Scheme 9, compounds of Formula 10c wherein J<sup>3</sup> is -CH<sub>2</sub>OH also can be prepared by ortho-lithiation of a compound of Formula 12 and reaction with carbon dioxide to provide a compound of Formula 13, followed by reduction using lithium aluminum hydride (LAH) in a suitable solvent such as toluene. Some isonicotinic acids of Formula 13 may be available commercially.

Scheme 8



As illustrated in Scheme 9, compounds of Formula 10c wherein J<sup>3</sup> is -CH<sub>2</sub>OH also can be prepared by ortho-lithiation of a compound of Formula 12 and reaction with carbon dioxide to provide a compound of Formula 13, followed by reduction using lithium aluminum hydride (LAH) in a suitable solvent such as toluene. Some isonicotinic acids of Formula 13 may be available commercially.

Scheme 9



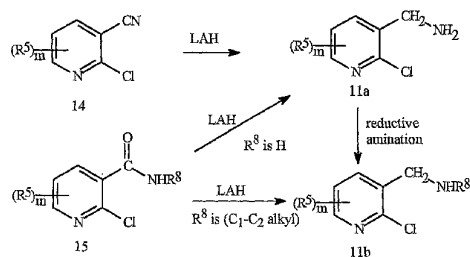
WO 02/091830

PCT/US02/18394

21

Compounds of Formula 11a can be synthesized from nitriles of Formula 14 by reduction of the nitrile using lithium aluminum hydride (LAH) in a suitable solvent such as toluene to give the corresponding aminomethyl intermediates (Scheme 10). Compounds of Formula 11a can also be synthesized from primary amides of Formula 15 wherein  $R^8$  is H by reduction using lithium aluminum hydride (LAH) in a suitable solvent such as toluene. Compounds of Formula 11b can be synthesized from secondary amides of Formula 15 wherein  $R^8$  is  $C_1$ - $C_2$  alkyl by reduction using lithium aluminum hydride (LAH) in a suitable solvent such as toluene. Compounds of Formula 11b can also be synthesized by reductive amination of formaldehyde or acetaldehyde with compounds of Formula 11a. Reductive amination with formaldehyde can be accomplished in the presence of formic acid under Eschweiler-Clarke procedures (see Jerry March, *Advanced Organic Chemistry: Reactions, Mechanism and Structure*, Third Edition, John Wiley & Sons, New York, 1985, pp. 798-800 and references therein).

Scheme 10



15

Compounds of Formula 15 may be prepared from compounds of Formula 13 by conversion to the corresponding acid chloride and subsequent reaction with ammonia or a primary amine (Scheme 11). Methods of converting carboxylic acids to the corresponding acid chloride are well-known in the art and include, for example, treatment with thionyl chloride or oxalyl chloride. The acid chloride is treated with the amine or amine salt in an inert solvent with two molar equivalents of a base (e.g. triethylamine, polymer supported diisopropylethylamine or potassium carbonate) present. Suitable solvents are selected from the group consisting of ethers such as tetrahydrofuran, dimethoxyethane, or diethyl ether; hydrocarbons such as toluene or benzene; and halocarbons such as dichloromethane or chloroform. Alternatively, compounds of Formula 15 can be synthesized by reacting the appropriate amine or amine salt with a carboxylic acid of Formula 13 in the presence of an organic dehydrating reagent such as 1,3-dicyclohexylcarbodiimide (DCC) or 1-[3-

WO 02/091830

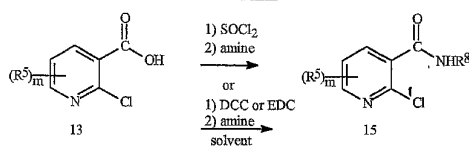
PCT/US02/18394

22

(Dimethylamino)propyl]-3-ethylcarbodiimide hydrochloride (EDC). Suitable solvents are selected from the group consisting of ethers such as tetrahydrofuran, dimethoxyethane, or diethyl ether; hydrocarbons such as toluene or benzene; and halocarbons such as dichloromethane or chloroform.

5

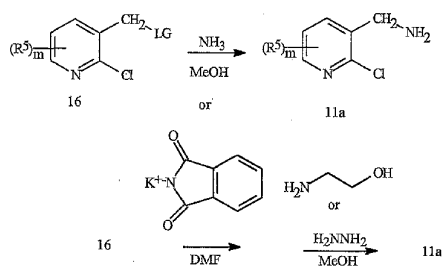
Scheme 11



Alternatively, compounds of Formula 11a can be synthesized by reacting compounds of Formula 16, wherein LG is a leaving group such as Br, Cl, methanesulfonyl ( $-\text{OSO}_2\text{Me}$ ) or para-toluenesulfonyl ( $-\text{OSO}_2\text{-p-Tol}$ ), with ammonia in a protic solvent such as methanol (Scheme 12). Compounds of Formula 11a can also be prepared by reacting compounds of Formula 16 with a potassium salt of phthalimide followed by reaction with either aminoethanol or hydrazine in an alcohol solvent to provide the desired aminomethyl intermediates Formula 11a.

10

Scheme 12



LG is Cl, Br,  $-\text{OSO}_2\text{Me}$ ,  $-\text{OSO}_2\text{-p-Tol}$

15

As illustrated in Scheme 13, compounds of Formula 16 wherein LG is  $-\text{OSO}_2\text{Me}$  or  $-\text{OSO}_2\text{-p-Tol}$  (16a) can be prepared by reacting a compound of Formula 10c with the corresponding sulfonyl chloride in the presence of a base such as triethylamine, polymer supported diisopropylethylamine or potassium carbonate. Suitable solvents are selected from the group consisting of ethers such as tetrahydrofuran, dimethoxyethane, or diethyl

20

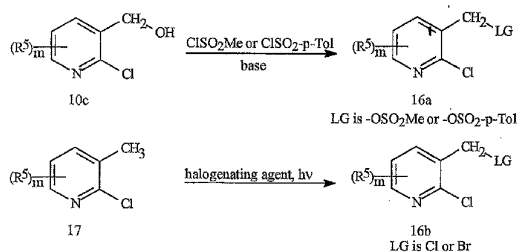
WO 02/091830

PCT/US02/18394

23

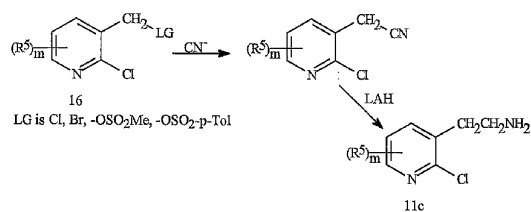
ether; hydrocarbons such as toluene or benzene; and halocarbons such as dichloromethane or chloroform. Compounds of Formula 16 wherein LG is Br or Cl (16b) can be prepared by treatment of compounds of Formula 17 with halogenating agents such as bromine, chlorine, or *N*-halosuccinimides under free radical conditions. These transformations are typically carried out with activation by visible or ultraviolet light (hv) and peroxides and are well known in the art.

Scheme 13



Compounds of Formula 11c can be prepared from compounds of Formula 16 by displacement with cyanide followed by reduction with, for example, lithium aluminum hydride (Scheme 14).

Scheme 14



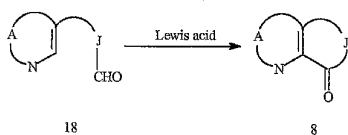
Compounds of Formula 8 can be prepared by intramolecular free-radical acylation of compounds of Formula 18 (Scheme 15). These acylations can be carried out in the presence of *t*-butyl hydroperoxide, sulfuric acid and ferrous sulfate (see *Chem. Communications*, 1969, 201 and *Gazz. Chim. Ital.* 1977, 107, 491 for leading references).

WO 02/091830

PCT/US02/18394

24

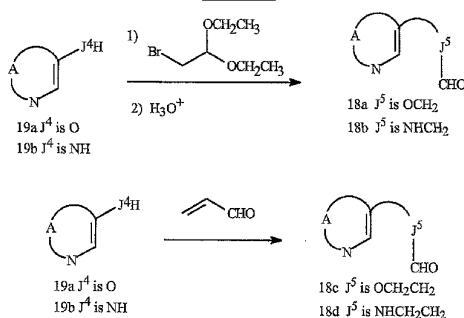
Scheme 15



Compounds of Formula 18 wherein J is  $\text{OCH}_2$  or  $\text{NHCH}_2$  (18a or 18b respectively) can be prepared by alkylation of compounds of Formula 19 with bromoacetaldehyde diethyl acetal followed by acidic hydrolysis of the acetal protecting group (Scheme 16).

Compounds of Formula 18 wherein J is  $\text{OCH}_2\text{CH}_2$  or  $\text{NHCH}_2\text{CH}_2$  (18c or 18d respectively) can be prepared by Michael addition of acrolein by compounds of Formula 19.

Scheme 16



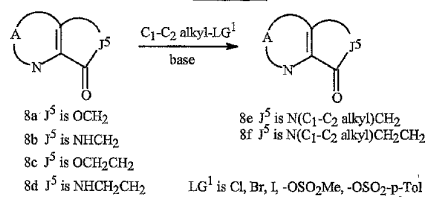
Compounds of Formula 8 wherein J is  $\text{N}(\text{C}_1\text{-C}_2 \text{ alkyl})\text{CH}_2$  or  $\text{N}(\text{C}_1\text{-C}_2 \text{ alkyl})\text{CH}_2\text{CH}_2$  (8e and 8f respectively) can be prepared by alkylation of compounds of Formula 8b or 8d (Scheme 17) with alkylating agents such as alkyl halides such as methyl or ethyl iodide or dialkylsulfonates such as dimethylsulfate, typically in the presence of additional base such as sodium or potassium carbonate.

WO 02/091830

PCT/US02/18394

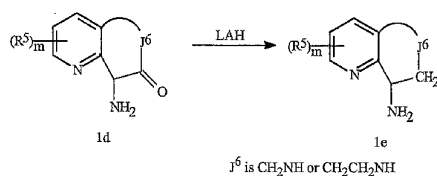
25

Scheme 17



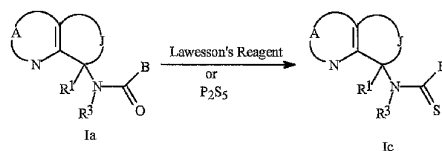
Compounds of Formula 1e wherein  $J^6$  is  $\text{CH}_2\text{NHCH}_2$  or  $\text{CH}_2\text{N}(\text{C}_1\text{-C}_2 \text{ alkyl})\text{CH}_2$  can be prepared by reduction of compounds of Formula 1d by lithium aluminum hydride (Scheme 18).

Scheme 18



Compounds of Formula 1c (compounds in which W is C=L and L is S) can be synthesized as outlined in Scheme 19. Amides of Formula 1a shown below can be converted to thioamides of Formula 1c by contacting the amide with Lawesson's reagent or phosphorus pentasulfide in an appropriate solvent (for references, see Jerry March, *Advanced Organic Chemistry: Reactions, Mechanism and Structure*, Fourth Edition, John Wiley & Sons, New York, pp. 893-4).

Scheme 19



It is recognized that some reagents and reaction conditions described above for preparing compounds of Formula I may not be compatible with certain functionalities present in the intermediates. In these instances, the incorporation of protection/deprotection

WO 02/091830

PCT/US02/18394

26

sequences or functional group interconversions into the synthesis will aid in obtaining the desired products. The use and choice of the protecting groups will be apparent to one skilled in chemical synthesis (see, for example, Greene, T. W.; Wuts, P. G. M. *Protective Groups in Organic Synthesis*, 2nd ed.; Wiley: New York, 1991). One skilled in the art will recognize that, in some cases, after the introduction of a given reagent as it is depicted in any individual scheme, it may be necessary to perform additional routine synthetic steps not described in detail to complete the synthesis of compounds of Formula I. One skilled in the art will also recognize that it may be necessary to perform a combination of the steps illustrated in the above schemes in an order other than that implied by the particular sequence presented to prepare the compounds of Formula I.

One skilled in the art will also recognize that compounds of Formula I and the intermediates described herein can be subjected to various electrophilic, nucleophilic, radical, organometallic, oxidation, and reduction reactions to add substituents or modify existing substituents.

Without further elaboration, it is believed that one skilled in the art using the preceding description can utilize the present invention to its fullest extent. The following Example is, therefore, to be construed as merely illustrative, and not limiting of the disclosure in any way whatsoever. The starting material for each of the reaction steps of this Example may not have necessarily been prepared by a particular preparative run whose procedure is described in other steps. Percentages are by weight except for chromatographic solvent mixtures or where otherwise indicated. Parts and percentages for chromatographic solvent mixtures are by volume unless otherwise indicated. <sup>1</sup>H NMR spectra are reported in ppm downfield from tetramethylsilane; s is singlet, d is doublet, t is triplet, q is quartet, m is multiplet, dd is doublet of doublets, dt is doublet of triplets, br s is broad singlet.

#### Example 1

##### Preparation of 2,6-dichloro-N-(5,6,7,8-tetrahydro-3-methyl-8-quinolinyl)benzamide

##### Step A: Preparation of 5,6,7,8-tetrahydro-3-methylquinoline

At 0 °C, 3-methyl quinoline (20 g, 140 mmol) was dissolved in trifluoroacetic acid (80 mL) and 10 weight % palladium on carbon (10 g) was added. The mixture was treated with hydrogen at room temperature at 345 kPa (50 psi) of H<sub>2</sub> in a Parr shaker apparatus for 5 hours. The resulting mixture was filtered through a Celite® (SiO<sub>2</sub> filter agent) bed to remove the catalyst. The Celite®/charcoal bed was washed with methanol (2 x 20 mL). The filtrates were then concentrated *in vacuo*. The residue was partitioned between 2 N aqueous NaOH and diethyl ether. The combined organic extracts were dried (Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>) and concentrated to give the title compound (19 g). <sup>1</sup>H NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ: 8.17 (s, 1H), 7.15 (s, 1H), 2.87 (t, J = 6.2 Hz, 2H), 2.72 (t, J = 6.4 Hz, 2H), 2.25 (s, 3H), 1.86 (m, 2H), 1.80 (m, 2H).

WO 02/091830

PCT/US02/18394

27

**Step B: Preparation of 5,6,7,8-tetrahydro-3-methyl-8-quinolinyl acetate**

A solution of 5,6,7,8-tetrahydro-3-methylquinoline (39.1 g, 266 mmol) in acetic acid (130 mL) was treated with 30% aqueous H<sub>2</sub>O<sub>2</sub> (26 mL) at room temperature, and the resulting reaction mixture was heated to 70 °C for 6 hours. An additional portion of 30% H<sub>2</sub>O<sub>2</sub> (26 mL) was added, and the mixture was heated to 70 °C overnight. The reaction mixture was cooled to room temperature and concentrated *in vacuo*. The residue was dissolved in dichloromethane and treated with Na<sub>2</sub>CO<sub>3</sub> (87 g). After 1 hour, the mixture was filtered and washed with dichloromethane. The filtrate was concentrated *in vacuo* to give a semi-solid oil.

A solution of the semi-solid oil in acetic anhydride (200 mL) was heated to 90 °C overnight. The reaction mixture was cooled to room temperature and the acetic anhydride was removed *in vacuo*. Distillation of the residue under reduced pressure provided the title compound (49 g). <sup>1</sup>H NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ: 8.34 (s, 1H), 7.28 (s, 1H), 5.93 (t, J = 4.4 Hz, 1H), 2.8 (m, 2H), 2.31 (s, 3H), 2.10 (s, 3H), 2.18 – 1.77 (m, 4H).

**Step C: Preparation of 8-chloro-5,6,7,8-tetrahydro-3-methylquinoline**

A suspension of 5,6,7,8-tetrahydro-3-methyl-8-quinolinyl acetate (49 g, 195 mmol) and K<sub>2</sub>CO<sub>3</sub> (100 g) in methanol (250 mL) was stirred at room temperature overnight. The mixture was partitioned between water and dichloromethane. The combined organic extract was dried (Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>) and concentrated. The residue was purified by flash chromatography on silica gel (using a gradient of 10% to 60% ethyl acetate in hexanes as eluent) to give a light brownish oil (24 g).

Methanesulfonyl chloride (25.6 g) was added slowly to a solution of the oil (24 g) and triethylamine in dichloromethane (150 mL) at 0 °C. The reaction mixture was slowly warmed up to room temperature and then heated to reflux overnight. The mixture was cooled to room temperature and partitioned between water and dichloromethane. The combined organic extract was dried (Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>) and concentrated. The residue was purified by flash chromatography on silica gel (using a gradient of 10% to 60% ethyl acetate in hexanes as eluent) to give the title compound as a light yellowish oil (21.8 g). <sup>1</sup>H NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ: 8.31 (s, 1H), 7.24 (s, 1H), 5.29 (t, J = 3.0 Hz, 1H), 2.81 (m, 1H), 2.37 (m, 1H), 2.30 (s, 3H), 2.19 (m, 2H), 1.88 (m, 1H).

**Step D: Preparation of 5,6,7,8-tetrahydro-3-methyl-8-quinolinamine**

A suspension of 8-chloro-5,6,7,8-tetrahydro-3-methylquinoline (21.8 g) and sodium azide (15.6 g) was heated to 70 °C for 4 hours. The reaction mixture was cooled to room temperature and partitioned between water and diethyl ether. The combined organic extract was dried (Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>) and concentrated. The residue (17.2 g) was dissolved in methanol (170 mL) and 10 weight % palladium on carbon (1.73 g) was added. The mixture was treated with hydrogen at room temperature at 276 kPa (40 psi) H<sub>2</sub> in a Parr shaker apparatus for 4 hours. The resulting mixture was filtered through a Celite® bed. The Celite®/charcoal



WO 02/091830

PCT/US02/18394

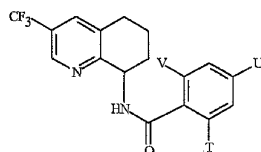
28

bed was washed with methanol (2 x 10 mL). The filtrates were then concentrated *in vacuo* to give (13 g) of the title compound. <sup>1</sup>H NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ: 8.32 (s,1H), 7.27 (s,1H), 4.69 (t, J = 4.1 Hz,1H), 2.75 (m,2H), 2.31 (s,3H), 2.01-1.78 (m,4H).

Step E: Preparation of 2,6-dichloro-N-(5,6,7,8-tetrahydro-3-methyl-8-quinolinyl)benzamide

- 5 A suspension of 5,6,7,8-tetrahydro-3-methyl-8-quinolinamine (162 mg, 1 mmol), 2,6-dichlorobenzoyl chloride (209.5 mg, 1 mmol) and polymer-supported diisopropylethylamine (1.0 g, 3 mmol/g) in acetonitrile (5 mL) was shaken at room temperature overnight. The reaction mixture was filtered and the solids washed with
- 10 acetonitrile (2 x 2 mL). The filtrate was concentrated and the resulting residue was purified by flash chromatography on silica gel (using a gradient of 10% to 60% ethyl acetate in hexanes as eluent) to give the title compound, a compound of the invention (190 mg). <sup>1</sup>H NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ: 8.22 (s,1H), 7.30 (s,1H), 7.36-7.23 (m,3H), 6.99 (bs,1H), 5.03 (m,1H), 2.82 (m,3H), 2.29 (s,3H), 1.94 (m,3H).
- 15 By the procedures described herein together with methods known in the art, the following compounds of Tables 1-8 can be prepared. The following abbreviations are used in the Tables that follow: "Me" means methyl, "OMe" means methoxy, "SMe" means methylthio, "CN" means cyano, "NO<sub>2</sub>" means nitro, "S(O)Me" means methylsulfinyl, and "S(O)<sub>2</sub>Me" means methylsulfonyl. The substituents M and R are equivalent to independent
- 20 R<sup>5</sup> substituents that have been located in the positions indicated. The substituents T, U and V are equivalent to independent R<sup>6</sup> substituents that have been located in the positions indicated.

Table 1



T	U	V	T	U	V	T	U	V	T	U	V
Me	Me	Me	F	Me	Me	F	F	Me	CF <sub>3</sub>	Me	Me
Me	Me	F	F	Me	F	F	F	F	CF <sub>3</sub>	Me	F
Me	Me	Cl	F	Me	Cl	F	F	Cl	CF <sub>3</sub>	Me	Cl
Me	Me	Br	F	Me	Br	F	F	Br	CF <sub>3</sub>	Me	Br
Me	Me	CF <sub>3</sub>	F	Me	CF <sub>3</sub>	F	F	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	CF <sub>3</sub>
Me	Me	NO <sub>2</sub>	F	Me	NO <sub>2</sub>	F	F	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	NO <sub>2</sub>
Me	Me	OMe	F	Me	OMe	F	F	OMe	CF <sub>3</sub>	Me	OMe

WO 02/091830

PCT/US02/18394

29

T	U	V	T	U	V	T	U	V	T	U	V
Me	F	Me	Cl	Me	Me	Cl	F	Me	NO <sub>2</sub>	Me	Me
Me	F	F	Cl	Me	F	Cl	F	F	NO <sub>2</sub>	Me	F
Me	F	Cl	Cl	Me	Cl	Cl	F	Cl	NO <sub>2</sub>	Me	Cl
Me	F	Br	Cl	Me	Br	Cl	F	Br	NO <sub>2</sub>	Me	Br
Me	F	CF <sub>3</sub>	Cl	Me	CF <sub>3</sub>	Cl	F	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	Me	CF <sub>3</sub>
Me	F	NO <sub>2</sub>	Cl	Me	NO <sub>2</sub>	Cl	F	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Me	NO <sub>2</sub>
Me	F	OMe	Cl	Me	OMe	Cl	F	OMe	NO <sub>2</sub>	Me	OMe
Me	Cl	Me	F	Cl	Me	F	Br	Me	CF <sub>3</sub>	F	Me
Me	Cl	F	F	Cl	F	F	Br	F	CF <sub>3</sub>	F	F
Me	Cl	Cl	F	Cl	Cl	F	Br	Cl	CF <sub>3</sub>	F	Cl
Me	Cl	Br	F	Cl	Br	F	Br	Br	CF <sub>3</sub>	F	Br
Me	Cl	CF <sub>3</sub>	F	Cl	CF <sub>3</sub>	F	Br	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	F	CF <sub>3</sub>
Me	Cl	NO <sub>2</sub>	F	Cl	NO <sub>2</sub>	F	Br	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	F	NO <sub>2</sub>
Me	Cl	OMe	F	Cl	OMe	F	Br	OMe	CF <sub>3</sub>	F	OMe
Me	Br	Me	Cl	Cl	Me	Cl	Br	Me	NO <sub>2</sub>	F	Me
Me	Br	F	Cl	Cl	F	Cl	Br	F	NO <sub>2</sub>	F	F
Me	Br	Cl	Cl	Cl	Cl	Cl	Br	Cl	NO <sub>2</sub>	F	Cl
Me	Br	Br	Cl	Cl	Br	Cl	Br	Br	NO <sub>2</sub>	F	Br
Me	Br	CF <sub>3</sub>	Cl	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl	Br	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	F	CF <sub>3</sub>
Me	Br	NO <sub>2</sub>	Cl	Cl	NO <sub>2</sub>	Cl	Br	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	F	NO <sub>2</sub>
Me	Br	OMe	Cl	Cl	OMe	Cl	Br	OMe	NO <sub>2</sub>	F	OMe
Me	CF <sub>3</sub>	Me	F	CF <sub>3</sub>	Me	F	NO <sub>2</sub>	Me	CF <sub>3</sub>	Cl	Me
Me	CF <sub>3</sub>	F	F	CF <sub>3</sub>	F	F	NO <sub>2</sub>	F	CF <sub>3</sub>	Cl	F
Me	CF <sub>3</sub>	Cl	F	CF <sub>3</sub>	Cl	F	NO <sub>2</sub>	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl	Cl
Me	CF <sub>3</sub>	Br	F	CF <sub>3</sub>	Br	F	NO <sub>2</sub>	Br	CF <sub>3</sub>	Cl	Br
Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	F	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	F	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Cl	CF <sub>3</sub>
Me	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	F	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	F	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	Cl	NO <sub>2</sub>
Me	CF <sub>3</sub>	OMe	F	CF <sub>3</sub>	OMe	F	NO <sub>2</sub>	OMe	CF <sub>3</sub>	Cl	OMe
Me	NO <sub>2</sub>	Me	Cl	CF <sub>3</sub>	Me	Cl	NO <sub>2</sub>	Me	NO <sub>2</sub>	Cl	Me
Me	NO <sub>2</sub>	F	Cl	CF <sub>3</sub>	F	Cl	NO <sub>2</sub>	F	NO <sub>2</sub>	Cl	F
Me	NO <sub>2</sub>	Cl	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl	Cl	NO <sub>2</sub>	Cl	NO <sub>2</sub>	Cl	Cl
Me	NO <sub>2</sub>	Br	Cl	CF <sub>3</sub>	Br	Cl	NO <sub>2</sub>	Br	NO <sub>2</sub>	Cl	Br
Me	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Cl	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	Cl	CF <sub>3</sub>
Me	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Cl	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	Cl	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Cl	NO <sub>2</sub>
Me	NO <sub>2</sub>	OMe	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe	Cl	NO <sub>2</sub>	OMe	NO <sub>2</sub>	Cl	OMe
Me	OMe	Me	F	OMe	Me	F	H	Me	CF <sub>3</sub>	Br	Me
Me	OMe	F	F	OMe	F	F	H	F	CF <sub>3</sub>	Br	F

WO 02/091830

PCT/US02/18394

30

T	U	V	T	U	V	T	U	V	T	U	V
Me	OMe	Cl	F	OMe	Cl	F	H	Cl	CF <sub>3</sub>	Br	Cl
Me	OMe	Br	F	OMe	Br	F	H	Br	CF <sub>3</sub>	Br	Br
Me	OMe	CF <sub>3</sub>	F	OMe	CF <sub>3</sub>	F	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Br	CF <sub>3</sub>
Me	OMe	NO <sub>2</sub>	F	OMe	NO <sub>2</sub>	F	H	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	Br	NO <sub>2</sub>
Me	OMe	OMe	F	OMe	OMe	F	H	OMe	CF <sub>3</sub>	Br	OMe
Me	H	Me	Cl	OMe	Me	Cl	H	Me	NO <sub>2</sub>	Br	Me
Me	H	F	Cl	OMe	F	Cl	H	F	NO <sub>2</sub>	Br	F
Me	H	Cl	Cl	OMe	Cl	Cl	H	Cl	NO <sub>2</sub>	Br	Cl
Me	H	Br	Cl	OMe	Br	Cl	H	Br	NO <sub>2</sub>	Br	Br
Me	H	CF <sub>3</sub>	Cl	OMe	CF <sub>3</sub>	Cl	H	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	Br	CF <sub>3</sub>
Me	H	NO <sub>2</sub>	Cl	OMe	NO <sub>2</sub>	Cl	H	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Br	NO <sub>2</sub>
Me	H	OMe	Cl	OMe	OMe	Cl	H	OMe	NO <sub>2</sub>	Br	OMe
OMe	Me	Me	Br	Me	Me	Br	F	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me
OMe	Me	F	Br	Me	F	Br	F	F	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	F
OMe	Me	Cl	Br	Me	Cl	Br	F	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Cl
OMe	Me	Br	Br	Me	Br	Br	F	Br	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Br
OMe	Me	CF <sub>3</sub>	Br	Me	CF <sub>3</sub>	Br	F	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
OMe	Me	NO <sub>2</sub>	Br	Me	NO <sub>2</sub>	Br	F	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>
OMe	Me	OMe	Br	Me	OMe	Br	F	OMe	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	OMe
OMe	F	Me	Br	Cl	Me	Br	Br	Me	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	Me
OMe	F	F	Br	Cl	F	Br	Br	F	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	F
OMe	F	Cl	Br	Cl	Cl	Br	Br	Cl	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	Cl
OMe	F	Br	Br	Cl	Br	Br	Br	Br	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	Br
OMe	F	CF <sub>3</sub>	Br	Cl	CF <sub>3</sub>	Br	Br	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
OMe	F	NO <sub>2</sub>	Br	Cl	NO <sub>2</sub>	Br	Br	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>
OMe	F	OMe	Br	Cl	OMe	Br	Br	OMe	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	OMe
OMe	Cl	Me	Br	CF <sub>3</sub>	Me	Br	NO <sub>2</sub>	Me	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	Me
OMe	Cl	F	Br	CF <sub>3</sub>	F	Br	NO <sub>2</sub>	F	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	F
OMe	Cl	Cl	Br	CF <sub>3</sub>	Cl	Br	NO <sub>2</sub>	Cl	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	Cl
OMe	Cl	Br	Br	CF <sub>3</sub>	Br	Br	NO <sub>2</sub>	Br	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	Br
OMe	Cl	CF <sub>3</sub>	Br	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Br	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>
OMe	Cl	NO <sub>2</sub>	Br	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	Br	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>
OMe	Cl	OMe	Br	CF <sub>3</sub>	OMe	Br	NO <sub>2</sub>	OMe	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	OMe
OMe	H	Me	Br	OMe	Me	Br	H	Me	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Me
OMe	H	F	Br	OMe	F	Br	H	F	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	F
OMe	H	Cl	Br	OMe	Cl	Br	H	Cl	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Cl
OMe	H	OMe	Br	OMe	Br	Br	H	Br	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Br

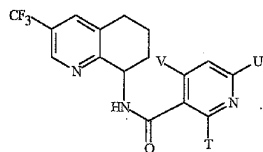
WO 02/091830

PCT/US02/18394

31

T	U	V	T	U	V	T	U	V	T	U	V
OMe	OMe	CF <sub>3</sub>	Br	OMe	CF <sub>3</sub>	Br	H	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>
OMe	OMe	NO <sub>2</sub>	Br	OMe	NO <sub>2</sub>	Br	H	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>
OMe	OMe	OMe	Br	OMe	OMe	Br	H	OMe	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	OMe
OMe	Br	Me	OMe	CF <sub>3</sub>	Me	CF <sub>3</sub>	H	Me	CF <sub>3</sub>	OMe	Me
OMe	Br	F	OMe	CF <sub>3</sub>	F	CF <sub>3</sub>	H	F	CF <sub>3</sub>	OMe	F
OMe	Br	Cl	OMe	CF <sub>3</sub>	Cl	CF <sub>3</sub>	H	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe	Cl
OMe	Br	Br	OMe	CF <sub>3</sub>	Br	CF <sub>3</sub>	H	Br	CF <sub>3</sub>	OMe	Br
OMe	Br	CF <sub>3</sub>	OMe	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	OMe	CF <sub>3</sub>
OMe	Br	NO <sub>2</sub>	OMe	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	H	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	OMe	NO <sub>2</sub>
OMe	Br	OMe	OMe	CF <sub>3</sub>	OMe	CF <sub>3</sub>	H	OMe	CF <sub>3</sub>	OMe	OMe
OMe	H	Br	OMe	NO <sub>2</sub>	Me	NO <sub>2</sub>	H	Me	NO <sub>2</sub>	OMe	Me
OMe	H	CF <sub>3</sub>	OMe	NO <sub>2</sub>	F	NO <sub>2</sub>	H	F	NO <sub>2</sub>	OMe	F
OMe	H	NO <sub>2</sub>	OMe	NO <sub>2</sub>	Cl	NO <sub>2</sub>	H	Cl	NO <sub>2</sub>	OMe	Cl
OMe	OMe	Me	OMe	NO <sub>2</sub>	Br	NO <sub>2</sub>	H	Br	NO <sub>2</sub>	OMe	Br
OMe	OMe	F	OMe	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	H	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	OMe	CF <sub>3</sub>
OMe	OMe	Cl	OMe	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	H	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	OMe	NO <sub>2</sub>
OMe	OMe	Br	OMe	NO <sub>2</sub>	OMe	NO <sub>2</sub>	H	OMe	NO <sub>2</sub>	OMe	OMe

Table 2



T	U	V	T	U	V	T	U	V	T	U	V
Me	Me	Me	F	Me	Me	F	F	Me	CF <sub>3</sub>	Me	Me
Me	Me	F	F	Me	F	F	F	F	CF <sub>3</sub>	Me	F
Me	Me	Cl	F	Me	Cl	F	F	Cl	CF <sub>3</sub>	Me	Cl
Me	Me	Br	F	Me	Br	F	F	Br	CF <sub>3</sub>	Me	Br
Me	Me	CF <sub>3</sub>	F	Me	CF <sub>3</sub>	F	F	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	CF <sub>3</sub>
Me	Me	NO <sub>2</sub>	F	Me	NO <sub>2</sub>	F	F	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	NO <sub>2</sub>
Me	Me	OMe	F	Me	OMe	F	F	OMe	CF <sub>3</sub>	Me	OMe
Me	F	Me	Cl	Me	Me	Cl	F	Me	NO <sub>2</sub>	Me	Me
Me	F	F	Cl	Me	F	Cl	F	F	NO <sub>2</sub>	Me	F
Me	F	Cl	Cl	Me	Cl	Cl	F	Cl	NO <sub>2</sub>	Me	Cl

WO 02/091830

PCT/US02/18394

32

T	U	V	T	U	V	T	U	V	T	U	V
Me	F	Br	Cl	Me	Br	Cl	F	Br	NO <sub>2</sub>	Me	Br
Me	F	CF <sub>3</sub>	Cl	Me	CF <sub>3</sub>	Cl	F	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	Me	CF <sub>3</sub>
Me	F	NO <sub>2</sub>	Cl	Me	NO <sub>2</sub>	Cl	F	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Me	NO <sub>2</sub>
Me	F	OMe	Cl	Me	OMe	Cl	F	OMe	NO <sub>2</sub>	Me	OMe
Me	Cl	Me	F	Cl	Me	F	Br	Me	CF <sub>3</sub>	F	Me
Me	Cl	F	F	Cl	F	F	Br	F	CF <sub>3</sub>	F	F
Me	Cl	Cl	F	Cl	Cl	F	Br	Cl	CF <sub>3</sub>	F	Cl
Me	Cl	Br	F	Cl	Br	F	Br	Br	CF <sub>3</sub>	F	Br
Me	Cl	CF <sub>3</sub>	F	Cl	CF <sub>3</sub>	F	Br	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	F	CF <sub>3</sub>
Me	Cl	NO <sub>2</sub>	F	Cl	NO <sub>2</sub>	F	Br	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	F	NO <sub>2</sub>
Me	Cl	OMe	F	Cl	OMe	F	Br	OMe	CF <sub>3</sub>	F	OMe
Me	Br	Me	Cl	Cl	Me	Cl	Br	Me	NO <sub>2</sub>	F	Me
Me	Br	F	Cl	Cl	F	Cl	Br	F	NO <sub>2</sub>	F	F
Me	Br	Cl	Cl	Cl	Cl	Cl	Br	Cl	NO <sub>2</sub>	F	Cl
Me	Br	Br	Cl	Cl	Br	Cl	Br	Br	NO <sub>2</sub>	F	Br
Me	Br	CF <sub>3</sub>	Cl	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl	Br	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	F	CF <sub>3</sub>
Me	Br	NO <sub>2</sub>	Cl	Cl	NO <sub>2</sub>	Cl	Br	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	F	NO <sub>2</sub>
Me	Br	OMe	Cl	Cl	OMe	Cl	Br	OMe	NO <sub>2</sub>	F	OMe
Me	CF <sub>3</sub>	Me	F	CF <sub>3</sub>	Me	F	NO <sub>2</sub>	Me	CF <sub>3</sub>	Cl	Me
Me	CF <sub>3</sub>	F	F	CF <sub>3</sub>	F	F	NO <sub>2</sub>	F	CF <sub>3</sub>	Cl	F
Me	CF <sub>3</sub>	Cl	F	CF <sub>3</sub>	Cl	F	NO <sub>2</sub>	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl	Cl
Me	CF <sub>3</sub>	Br	F	CF <sub>3</sub>	Br	F	NO <sub>2</sub>	Br	CF <sub>3</sub>	Cl	Br
Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	F	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	F	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Cl	CF <sub>3</sub>
Me	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	F	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	F	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	Cl	NO <sub>2</sub>
Me	CF <sub>3</sub>	OMe	F	CF <sub>3</sub>	OMe	F	NO <sub>2</sub>	OMe	CF <sub>3</sub>	Cl	OMe
Me	NO <sub>2</sub>	Me	Cl	CF <sub>3</sub>	Me	Cl	NO <sub>2</sub>	Me	NO <sub>2</sub>	Cl	Me
Me	NO <sub>2</sub>	F	Cl	CF <sub>3</sub>	F	Cl	NO <sub>2</sub>	F	NO <sub>2</sub>	Cl	F
Me	NO <sub>2</sub>	Cl	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl	Cl	NO <sub>2</sub>	Cl	NO <sub>2</sub>	Cl	Cl
Me	NO <sub>2</sub>	Br	Cl	CF <sub>3</sub>	Br	Cl	NO <sub>2</sub>	Br	NO <sub>2</sub>	Cl	Br
Me	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Cl	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	Cl	CF <sub>3</sub>
Me	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Cl	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	Cl	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Cl	NO <sub>2</sub>
Me	NO <sub>2</sub>	OMe	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe	Cl	NO <sub>2</sub>	OMe	NO <sub>2</sub>	Cl	OMe
Me	OMe	Me	F	OMe	Me	F	H	Me	CF <sub>3</sub>	Br	Me
Me	OMe	F	F	OMe	F	F	H	F	CF <sub>3</sub>	Br	F
Me	OMe	Cl	F	OMe	Cl	F	H	Cl	CF <sub>3</sub>	Br	Cl
Me	OMe	Br	F	OMe	Br	F	H	Br	CF <sub>3</sub>	Br	Br
Me	OMe	CF <sub>3</sub>	F	OMe	CF <sub>3</sub>	F	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Br	CF <sub>3</sub>

WO 02/091830

PCT/US02/18394

33

T	U	V	T	U	V	T	U	V	T	U	V
Me	OMe	NO <sub>2</sub>	F	OMe	NO <sub>2</sub>	F	H	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	Br	NO <sub>2</sub>
Me	OMe	OMe	F	OMe	OMe	F	H	OMe	CF <sub>3</sub>	Br	OMe
Me	H	Me	Cl	OMe	Me	Cl	H	Me	NO <sub>2</sub>	Br	Me
Me	H	F	Cl	OMe	F	Cl	H	F	NO <sub>2</sub>	Br	F
Me	H	Cl	Cl	OMe	Cl	Cl	H	Cl	NO <sub>2</sub>	Br	Cl
Me	H	Br	Cl	OMe	Br	Cl	H	Br	NO <sub>2</sub>	Br	Br
Me	H	CF <sub>3</sub>	Cl	OMe	CF <sub>3</sub>	Cl	H	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	Br	CF <sub>3</sub>
Me	H	NO <sub>2</sub>	Cl	OMe	NO <sub>2</sub>	Cl	H	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Br	NO <sub>2</sub>
Me	H	OMe	Cl	OMe	OMe	Cl	H	OMe	NO <sub>2</sub>	Br	OMe
OMe	Me	Me	Br	Me	Me	Br	F	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me
OMe	Me	F	Br	Me	F	Br	F	F	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	F
OMe	Me	Cl	Br	Me	Cl	Br	F	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Cl
OMe	Me	Br	Br	Me	Br	Br	F	Br	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Br
OMe	Me	CF <sub>3</sub>	Br	Me	CF <sub>3</sub>	Br	F	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
OMe	Me	NO <sub>2</sub>	Br	Me	NO <sub>2</sub>	Br	F	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>
OMe	Me	OMe	Br	Me	OMe	Br	F	OMe	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	OMe
OMe	F	Me	Br	Cl	Me	Br	Br	Me	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	Me
OMe	F	F	Br	Cl	F	Br	Br	F	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	F
OMe	F	Cl	Br	Cl	Cl	Br	Br	Cl	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	Cl
OMe	F	Br	Br	Cl	Br	Br	Br	Br	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	Br
OMe	F	CF <sub>3</sub>	Br	Cl	CF <sub>3</sub>	Br	Br	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
OMe	F	NO <sub>2</sub>	Br	Cl	NO <sub>2</sub>	Br	Br	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>
OMe	F	OMe	Br	Cl	OMe	Br	Br	OMe	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	OMe
OMe	Cl	Me	Br	CF <sub>3</sub>	Me	Br	NO <sub>2</sub>	Me	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	Me
OMe	Cl	F	Br	CF <sub>3</sub>	F	Br	NO <sub>2</sub>	F	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	F
OMe	Cl	Cl	Br	CF <sub>3</sub>	Cl	Br	NO <sub>2</sub>	Cl	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	Cl
OMe	Cl	Br	Br	CF <sub>3</sub>	Br	Br	NO <sub>2</sub>	Br	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	Br
OMe	Cl	CF <sub>3</sub>	Br	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Br	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>
OMe	Cl	NO <sub>2</sub>	Br	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	Br	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>
OMe	Cl	OMe	Br	CF <sub>3</sub>	OMe	Br	NO <sub>2</sub>	OMe	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	OMe
OMe	H	Me	Br	OMe	Me	Br	H	Me	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Me
OMe	H	F	Br	OMe	F	Br	H	F	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	F
OMe	H	Cl	Br	OMe	Cl	Br	H	Cl	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Cl
OMe	H	OMe	Br	OMe	Br	Br	H	Br	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Br
OMe	OMe	CF <sub>3</sub>	Br	OMe	CF <sub>3</sub>	Br	H	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>

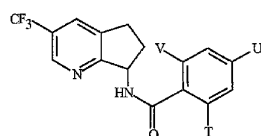
WO 02/091830

PCT/US02/18394

34

T	U	V	T	U	V	T	U	V	T	U	V
OMe	OMe	NO <sub>2</sub>	Br	OMe	NO <sub>2</sub>	Br	H	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>
OMe	OMe	OMe	Br	OMe	OMe	Br	H	OMe	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	OMe
OMe	Br	Me	OMe	CF <sub>3</sub>	Me	CF <sub>3</sub>	H	Me	CF <sub>3</sub>	OMe	Me
OMe	Br	F	OMe	CF <sub>3</sub>	F	CF <sub>3</sub>	H	F	CF <sub>3</sub>	OMe	F
OMe	Br	Cl	OMe	CF <sub>3</sub>	Cl	CF <sub>3</sub>	H	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe	Cl
OMe	Br	Br	OMe	CF <sub>3</sub>	Br	CF <sub>3</sub>	H	Br	CF <sub>3</sub>	OMe	Br
OMe	Br	CF <sub>3</sub>	OMe	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	OMe	CF <sub>3</sub>
OMe	Br	NO <sub>2</sub>	OMe	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	H	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	OMe	NO <sub>2</sub>
OMe	Br	OMe	OMe	CF <sub>3</sub>	OMe	CF <sub>3</sub>	H	OMe	CF <sub>3</sub>	OMe	OMe
OMe	H	Br	OMe	NO <sub>2</sub>	Me	NO <sub>2</sub>	H	Me	NO <sub>2</sub>	OMe	Me
OMe	H	CF <sub>3</sub>	OMe	NO <sub>2</sub>	F	NO <sub>2</sub>	H	F	NO <sub>2</sub>	OMe	F
OMe	H	NO <sub>2</sub>	OMe	NO <sub>2</sub>	Cl	NO <sub>2</sub>	H	Cl	NO <sub>2</sub>	OMe	Cl
OMe	OMe	Me	OMe	NO <sub>2</sub>	Br	NO <sub>2</sub>	H	Br	NO <sub>2</sub>	OMe	Br
OMe	OMe	F	OMe	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	H	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	OMe	CF <sub>3</sub>
OMe	OMe	Cl	OMe	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	H	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	OMe	NO <sub>2</sub>
OMe	OMe	Br	OMe	NO <sub>2</sub>	OMe	NO <sub>2</sub>	H	OMe	NO <sub>2</sub>	OMe	OMe

Table 3



T	U	V	T	U	V	T	U	V	T	U	V
Me	Me	Me	F	Me	Me	F	F	Me	CF <sub>3</sub>	Me	Me
Me	Me	F	F	Me	F	F	F	F	CF <sub>3</sub>	Me	F
Me	Me	Cl	F	Me	Cl	F	F	Cl	CF <sub>3</sub>	Me	Cl
Me	Me	Br	F	Me	Br	F	F	Br	CF <sub>3</sub>	Me	Br
Me	Me	CF <sub>3</sub>	F	Me	CF <sub>3</sub>	F	F	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	CF <sub>3</sub>
Me	Me	NO <sub>2</sub>	F	Me	NO <sub>2</sub>	F	F	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	NO <sub>2</sub>
Me	Me	OMe	F	Me	OMe	F	F	OMe	CF <sub>3</sub>	Me	OMe
Me	F	Me	Cl	Me	Me	Cl	F	Me	NO <sub>2</sub>	Me	Me
Me	F	F	Cl	Me	F	Cl	F	F	NO <sub>2</sub>	Me	F
Me	F	Cl	Cl	Me	Cl	Cl	F	Cl	NO <sub>2</sub>	Me	Cl
Me	F	Br	Cl	Me	Br	Cl	F	Br	NO <sub>2</sub>	Me	Br
Me	F	CF <sub>3</sub>	Cl	Me	CF <sub>3</sub>	Cl	F	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	Me	CF <sub>3</sub>

WO 02/091830

PCT/US02/18394

35

T	U	V	T	U	V	T	U	V	T	U	V
Me	F	NO <sub>2</sub>	Cl	Me	NO <sub>2</sub>	Cl	F	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Me	NO <sub>2</sub>
Me	F	OMe	Cl	Me	OMe	Cl	F	OMe	NO <sub>2</sub>	Me	OMe
Me	Cl	Me	F	Cl	Me	F	Br	Me	CF <sub>3</sub>	F	Me
Me	Cl	F	F	Cl	F	F	Br	F	CF <sub>3</sub>	F	F
Me	Cl	Cl	F	Cl	Cl	F	Br	Cl	CF <sub>3</sub>	F	Cl
Me	Cl	Br	F	Cl	Br	F	Br	Br	CF <sub>3</sub>	F	Br
Me	Cl	CF <sub>3</sub>	F	Cl	CF <sub>3</sub>	F	Br	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	F	CF <sub>3</sub>
Me	Cl	NO <sub>2</sub>	F	Cl	NO <sub>2</sub>	F	Br	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	F	NO <sub>2</sub>
Me	Cl	OMe	F	Cl	OMe	F	Br	OMe	CF <sub>3</sub>	F	OMe
Me	Br	Me	Cl	Cl	Me	Cl	Br	Me	NO <sub>2</sub>	F	Me
Me	Br	F	Cl	Cl	F	Cl	Br	F	NO <sub>2</sub>	F	F
Me	Br	Cl	Cl	Cl	Cl	Cl	Br	Cl	NO <sub>2</sub>	F	Cl
Me	Br	Br	Cl	Cl	Br	Cl	Br	Br	NO <sub>2</sub>	F	Br
Me	Br	CF <sub>3</sub>	Cl	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl	Br	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	F	CF <sub>3</sub>
Me	Br	NO <sub>2</sub>	Cl	Cl	NO <sub>2</sub>	Cl	Br	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	F	NO <sub>2</sub>
Me	Br	OMe	Cl	Cl	OMe	Cl	Br	OMe	NO <sub>2</sub>	F	OMe
Me	CF <sub>3</sub>	Me	F	CF <sub>3</sub>	Me	F	NO <sub>2</sub>	Me	CF <sub>3</sub>	Cl	Me
Me	CF <sub>3</sub>	F	F	CF <sub>3</sub>	F	F	NO <sub>2</sub>	F	CF <sub>3</sub>	Cl	F
Me	CF <sub>3</sub>	Cl	F	CF <sub>3</sub>	Cl	F	NO <sub>2</sub>	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl	Cl
Me	CF <sub>3</sub>	Br	F	CF <sub>3</sub>	Br	F	NO <sub>2</sub>	Br	CF <sub>3</sub>	Cl	Br
Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	F	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	F	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Cl	CF <sub>3</sub>
Me	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	F	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	F	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	Cl	NO <sub>2</sub>
Me	CF <sub>3</sub>	OMe	F	CF <sub>3</sub>	OMe	F	NO <sub>2</sub>	OMe	CF <sub>3</sub>	Cl	OMe
Me	NO <sub>2</sub>	Me	Cl	CF <sub>3</sub>	Me	Cl	NO <sub>2</sub>	Me	NO <sub>2</sub>	Cl	Me
Me	NO <sub>2</sub>	F	Cl	CF <sub>3</sub>	F	Cl	NO <sub>2</sub>	F	NO <sub>2</sub>	Cl	F
Me	NO <sub>2</sub>	Cl	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl	Cl	NO <sub>2</sub>	Cl	NO <sub>2</sub>	Cl	Cl
Me	NO <sub>2</sub>	Br	Cl	CF <sub>3</sub>	Br	Cl	NO <sub>2</sub>	Br	NO <sub>2</sub>	Cl	Br
Me	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Cl	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	Cl	CF <sub>3</sub>
Me	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Cl	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	Cl	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Cl	NO <sub>2</sub>
Me	NO <sub>2</sub>	OMe	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe	Cl	NO <sub>2</sub>	OMe	NO <sub>2</sub>	Cl	OMe
Me	OMe	Me	F	OMe	Me	F	H	Me	CF <sub>3</sub>	Br	Me
Me	OMe	F	F	OMe	F	F	H	F	CF <sub>3</sub>	Br	F
Me	OMe	Cl	F	OMe	Cl	F	H	Cl	CF <sub>3</sub>	Br	Cl
Me	OMe	Br	F	OMe	Br	F	H	Br	CF <sub>3</sub>	Br	Br
Me	OMe	CF <sub>3</sub>	F	OMe	CF <sub>3</sub>	F	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Br	CF <sub>3</sub>
Me	OMe	NO <sub>2</sub>	F	OMe	NO <sub>2</sub>	F	H	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	Br	NO <sub>2</sub>
Me	OMe	OMe	F	OMe	OMe	F	H	OMe	CF <sub>3</sub>	Br	OMe



WO 02/091830

PCT/US02/18394

36

T	U	V	T	U	V	T	U	V	T	U	V
Me	H	Me	Cl	OMe	Me	Cl	H	Me	NO <sub>2</sub>	Br	Me
Me	H	F	Cl	OMe	F	Cl	H	F	NO <sub>2</sub>	Br	F
Me	H	Cl	Cl	OMe	Cl	Cl	H	Cl	NO <sub>2</sub>	Br	Cl
Me	H	Br	Cl	OMe	Br	Cl	H	Br	NO <sub>2</sub>	Br	Br
Me	H	CF <sub>3</sub>	Cl	OMe	CF <sub>3</sub>	Cl	H	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	Br	CF <sub>3</sub>
Me	H	NO <sub>2</sub>	Cl	OMe	NO <sub>2</sub>	Cl	H	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Br	NO <sub>2</sub>
Me	H	OMe	Cl	OMe	OMe	Cl	H	OMe	NO <sub>2</sub>	Br	OMe
OMe	Me	Me	Br	Me	Me	Br	F	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me
OMe	Me	F	Br	Me	F	Br	F	F	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	F
OMe	Me	Cl	Br	Me	Cl	Br	F	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Cl
OMe	Me	Br	Br	Me	Br	Br	F	Br	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Br
OMe	Me	CF <sub>3</sub>	Br	Me	CF <sub>3</sub>	Br	F	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
OMe	Me	NO <sub>2</sub>	Br	Me	NO <sub>2</sub>	Br	F	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>
OMe	Me	OMe	Br	Me	OMe	Br	F	OMe	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	OMe
OMe	F	Me	Br	Cl	Me	Br	Br	Me	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	Me
OMe	F	F	Br	Cl	F	Br	Br	F	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	F
OMe	F	Cl	Br	Cl	Cl	Br	Br	Cl	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	Cl
OMe	F	Br	Br	Cl	Br	Br	Br	Br	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	Br
OMe	F	CF <sub>3</sub>	Br	Cl	CF <sub>3</sub>	Br	Br	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
OMe	F	NO <sub>2</sub>	Br	Cl	NO <sub>2</sub>	Br	Br	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>
OMe	F	OMe	Br	Cl	OMe	Br	Br	OMe	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	OMe
OMe	Cl	Me	Br	CF <sub>3</sub>	Me	Br	NO <sub>2</sub>	Me	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	Me
OMe	Cl	F	Br	CF <sub>3</sub>	F	Br	NO <sub>2</sub>	F	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	F
OMe	Cl	Cl	Br	CF <sub>3</sub>	Cl	Br	NO <sub>2</sub>	Cl	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	Cl
OMe	Cl	Br	Br	CF <sub>3</sub>	Br	Br	NO <sub>2</sub>	Br	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	Br
OMe	Cl	CF <sub>3</sub>	Br	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Br	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>
OMe	Cl	NO <sub>2</sub>	Br	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	Br	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>
OMe	Cl	OMe	Br	CF <sub>3</sub>	OMe	Br	NO <sub>2</sub>	OMe	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	OMe
OMe	H	Me	Br	OMe	Me	Br	H	Me	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Me
OMe	H	F	Br	OMe	F	Br	H	F	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	F
OMe	H	Cl	Br	OMe	Cl	Br	H	Cl	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Cl
OMe	H	OMe	Br	OMe	Br	Br	H	Br	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Br
OMe	OMe	CF <sub>3</sub>	Br	OMe	CF <sub>3</sub>	Br	H	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>
OMe	OMe	NO <sub>2</sub>	Br	OMe	NO <sub>2</sub>	Br	H	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>
OMe	OMe	OMe	Br	OMe	OMe	Br	H	OMe	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	OMe
OMe	Br	Me	OMe	CF <sub>3</sub>	Me	CF <sub>3</sub>	H	Me	CF <sub>3</sub>	OMe	Me
OMe	Br	F	OMe	CF <sub>3</sub>	F	CF <sub>3</sub>	H	F	CF <sub>3</sub>	OMe	F

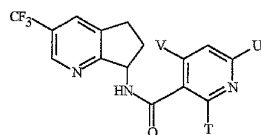
WO 02/091830

PCT/US02/18394

37

T	U	V	T	U	V	T	U	V	T	U	V
OMe	Br	Cl	OMe	CF <sub>3</sub>	Cl	CF <sub>3</sub>	H	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe	Cl
OMe	Br	Br	OMe	CF <sub>3</sub>	Br	CF <sub>3</sub>	H	Br	CF <sub>3</sub>	OMe	Br
OMe	Br	CF <sub>3</sub>	OMe	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	OMe	CF <sub>3</sub>
OMe	Br	NO <sub>2</sub>	OMe	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	H	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	OMe	NO <sub>2</sub>
OMe	Br	OMe	OMe	CF <sub>3</sub>	OMe	CF <sub>3</sub>	H	OMe	CF <sub>3</sub>	OMe	OMe
OMe	H	Br	OMe	NO <sub>2</sub>	Me	NO <sub>2</sub>	H	Me	NO <sub>2</sub>	OMe	Me
OMe	H	CF <sub>3</sub>	OMe	NO <sub>2</sub>	F	NO <sub>2</sub>	H	F	NO <sub>2</sub>	OMe	F
OMe	H	NO <sub>2</sub>	OMe	NO <sub>2</sub>	Cl	NO <sub>2</sub>	H	Cl	NO <sub>2</sub>	OMe	Cl
OMe	OMe	Me	OMe	NO <sub>2</sub>	Br	NO <sub>2</sub>	H	Br	NO <sub>2</sub>	OMe	Br
OMe	OMe	F	OMe	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	H	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	OMe	CF <sub>3</sub>
OMe	OMe	Cl	OMe	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	H	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	OMe	NO <sub>2</sub>
OMe	OMe	Br	OMe	NO <sub>2</sub>	OMe	NO <sub>2</sub>	H	OMe	NO <sub>2</sub>	OMe	OMe

Table 4



T	U	V	T	U	V	T	U	V	T	U	V
Me	Me	Me	F	Me	Me	F	F	Me	CF <sub>3</sub>	Me	Me
Me	Me	F	F	Me	F	F	F	F	CF <sub>3</sub>	Me	F
Me	Me	Cl	F	Me	Cl	F	F	Cl	CF <sub>3</sub>	Me	Cl
Me	Me	Br	F	Me	Br	F	F	Br	CF <sub>3</sub>	Me	Br
Me	Me	CF <sub>3</sub>	F	Me	CF <sub>3</sub>	F	F	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	CF <sub>3</sub>
Me	Me	NO <sub>2</sub>	F	Me	NO <sub>2</sub>	F	F	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	NO <sub>2</sub>
Me	Me	OMe	F	Me	OMe	F	F	OMe	CF <sub>3</sub>	Me	OMe
Me	F	Me	Cl	Me	Me	Cl	F	Me	NO <sub>2</sub>	Me	Me
Me	F	F	Cl	Me	F	Cl	F	F	NO <sub>2</sub>	Me	F
Me	F	Cl	Cl	Me	Cl	Cl	F	Cl	NO <sub>2</sub>	Me	Cl
Me	F	Br	Cl	Me	Br	Cl	F	Br	NO <sub>2</sub>	Me	Br
Me	F	CF <sub>3</sub>	Cl	Me	CF <sub>3</sub>	Cl	F	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	Me	CF <sub>3</sub>
Me	F	NO <sub>2</sub>	Cl	Me	NO <sub>2</sub>	Cl	F	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Me	NO <sub>2</sub>
Me	F	OMe	Cl	Me	OMe	Cl	F	OMe	NO <sub>2</sub>	Me	OMe
Me	Cl	Me	F	Cl	Me	F	Br	Me	CF <sub>3</sub>	F	Me
Me	Cl	F	F	Cl	F	F	Br	F	CF <sub>3</sub>	F	F

WO 02/091830

PCT/US02/18394

38

T	U	V	T	U	V	T	U	V	T	U	V
Me	Cl	Cl	F	Cl	Cl	F	Br	Cl	CF <sub>3</sub>	F	Cl
Me	Cl	Br	F	Cl	Br	F	Br	Br	CF <sub>3</sub>	F	Br
Me	Cl	CF <sub>3</sub>	F	Cl	CF <sub>3</sub>	F	Br	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	F	CF <sub>3</sub>
Me	Cl	NO <sub>2</sub>	F	Cl	NO <sub>2</sub>	F	Br	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	F	NO <sub>2</sub>
Me	Cl	OMe	F	Cl	OMe	F	Br	OMe	CF <sub>3</sub>	F	OMe
Me	Br	Me	Cl	Cl	Me	Cl	Br	Me	NO <sub>2</sub>	F	Me
Me	Br	F	Cl	Cl	F	Cl	Br	F	NO <sub>2</sub>	F	F
Me	Br	Cl	Cl	Cl	Cl	Cl	Br	Cl	NO <sub>2</sub>	F	Cl
Me	Br	Br	Cl	Cl	Br	Cl	Br	Br	NO <sub>2</sub>	F	Br
Me	Br	CF <sub>3</sub>	Cl	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl	Br	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	F	CF <sub>3</sub>
Me	Br	NO <sub>2</sub>	Cl	Cl	NO <sub>2</sub>	Cl	Br	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	F	NO <sub>2</sub>
Me	Br	OMe	Cl	Cl	OMe	Cl	Br	OMe	NO <sub>2</sub>	F	OMe
Me	CF <sub>3</sub>	Me	F	CF <sub>3</sub>	Me	F	NO <sub>2</sub>	Me	CF <sub>3</sub>	Cl	Me
Me	CF <sub>3</sub>	F	F	CF <sub>3</sub>	F	F	NO <sub>2</sub>	F	CF <sub>3</sub>	Cl	F
Me	CF <sub>3</sub>	Cl	F	CF <sub>3</sub>	Cl	F	NO <sub>2</sub>	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl	Cl
Me	CF <sub>3</sub>	Br	F	CF <sub>3</sub>	Br	F	NO <sub>2</sub>	Br	CF <sub>3</sub>	Cl	Br
Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	F	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	F	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Cl	CF <sub>3</sub>
Me	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	F	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	F	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	Cl	NO <sub>2</sub>
Me	CF <sub>3</sub>	OMe	F	CF <sub>3</sub>	OMe	F	NO <sub>2</sub>	OMe	CF <sub>3</sub>	Cl	OMe
Me	NO <sub>2</sub>	Me	Cl	CF <sub>3</sub>	Me	Cl	NO <sub>2</sub>	Me	NO <sub>2</sub>	Cl	Me
Me	NO <sub>2</sub>	F	Cl	CF <sub>3</sub>	F	Cl	NO <sub>2</sub>	F	NO <sub>2</sub>	Cl	F
Me	NO <sub>2</sub>	Cl	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl	Cl	NO <sub>2</sub>	Cl	NO <sub>2</sub>	Cl	Cl
Me	NO <sub>2</sub>	Br	Cl	CF <sub>3</sub>	Br	Cl	NO <sub>2</sub>	Br	NO <sub>2</sub>	Cl	Br
Me	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Cl	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	Cl	CF <sub>3</sub>
Me	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Cl	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	Cl	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Cl	NO <sub>2</sub>
Me	NO <sub>2</sub>	OMe	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe	Cl	NO <sub>2</sub>	OMe	NO <sub>2</sub>	Cl	OMe
Me	OMe	Me	F	OMe	Me	F	H	Me	CF <sub>3</sub>	Br	Me
Me	OMe	F	F	OMe	F	F	H	F	CF <sub>3</sub>	Br	F
Me	OMe	Cl	F	OMe	Cl	F	H	Cl	CF <sub>3</sub>	Br	Cl
Me	OMe	Br	F	OMe	Br	F	H	Br	CF <sub>3</sub>	Br	Br
Me	OMe	CF <sub>3</sub>	F	OMe	CF <sub>3</sub>	F	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Br	CF <sub>3</sub>
Me	OMe	NO <sub>2</sub>	F	OMe	NO <sub>2</sub>	F	H	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	Br	NO <sub>2</sub>
Me	OMe	OMe	F	OMe	OMe	F	H	OMe	CF <sub>3</sub>	Br	OMe
Me	H	Me	Cl	OMe	Me	Cl	H	Me	NO <sub>2</sub>	Br	Me
Me	H	F	Cl	OMe	F	Cl	H	F	NO <sub>2</sub>	Br	F
Me	H	Cl	Cl	OMe	Cl	Cl	H	Cl	NO <sub>2</sub>	Br	Cl
Me	H	Br	Cl	OMe	Br	Cl	H	Br	NO <sub>2</sub>	Br	Br

WO 02/091830

PCT/US02/18394

39

T	U	V	T	U	V	T	U	V	T	U	V
Me	H	CF <sub>3</sub>	Cl	OMe	CF <sub>3</sub>	Cl	H	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	Br	CF <sub>3</sub>
Me	H	NO <sub>2</sub>	Cl	OMe	NO <sub>2</sub>	Cl	H	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Br	NO <sub>2</sub>
Me	H	OMe	Cl	OMe	OMe	Cl	H	OMe	NO <sub>2</sub>	Br	OMe
OMe	Me	Me	Br	Me	Me	Br	F	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me
OMe	Me	F	Br	Me	F	Br	F	F	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	F
OMe	Me	Cl	Br	Me	Cl	Br	F	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Cl
OMe	Me	Br	Br	Me	Br	Br	F	Br	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Br
OMe	Me	CF <sub>3</sub>	Br	Me	CF <sub>3</sub>	Br	F	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
OMe	Me	NO <sub>2</sub>	Br	Me	NO <sub>2</sub>	Br	F	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>
OMe	Me	OMe	Br	Me	OMe	Br	F	OMe	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	OMe
OMe	F	Me	Br	Cl	Me	Br	Br	Me	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	Me
OMe	F	F	Br	Cl	F	Br	Br	F	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	F
OMe	F	Cl	Br	Cl	Cl	Br	Br	Cl	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	Cl
OMe	F	Br	Br	Cl	Br	Br	Br	Br	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	Br
OMe	F	CF <sub>3</sub>	Br	Cl	CF <sub>3</sub>	Br	Br	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
OMe	F	NO <sub>2</sub>	Br	Cl	NO <sub>2</sub>	Br	Br	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>
OMe	F	OMe	Br	Cl	OMe	Br	Br	OMe	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	OMe
OMe	Cl	Me	Br	CF <sub>3</sub>	Me	Br	NO <sub>2</sub>	Me	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	Me
OMe	Cl	F	Br	CF <sub>3</sub>	F	Br	NO <sub>2</sub>	F	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	F
OMe	Cl	Cl	Br	CF <sub>3</sub>	Cl	Br	NO <sub>2</sub>	Cl	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	Cl
OMe	Cl	Br	Br	CF <sub>3</sub>	Br	Br	NO <sub>2</sub>	Br	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	Br
OMe	Cl	CF <sub>3</sub>	Br	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Br	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>
OMe	Cl	NO <sub>2</sub>	Br	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	Br	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>
OMe	Cl	OMe	Br	CF <sub>3</sub>	OMe	Br	NO <sub>2</sub>	OMe	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	OMe
OMe	H	Me	Br	OMe	Me	Br	H	Me	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Me
OMe	H	F	Br	OMe	F	Br	H	F	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	F
OMe	H	Cl	Br	OMe	Cl	Br	H	Cl	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Cl
OMe	H	OMe	Br	OMe	Br	Br	H	Br	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Br
OMe	OMe	CF <sub>3</sub>	Br	OMe	CF <sub>3</sub>	Br	H	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>
OMe	OMe	NO <sub>2</sub>	Br	OMe	NO <sub>2</sub>	Br	H	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>
OMe	OMe	OMe	Br	OMe	OMe	Br	H	OMe	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	OMe
OMe	Br	Me	OMe	CF <sub>3</sub>	Me	CF <sub>3</sub>	H	Me	CF <sub>3</sub>	OMe	Me
OMe	Br	F	OMe	CF <sub>3</sub>	F	CF <sub>3</sub>	H	F	CF <sub>3</sub>	OMe	F
OMe	Br	Cl	OMe	CF <sub>3</sub>	Cl	CF <sub>3</sub>	H	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe	Cl
OMe	Br	Br	OMe	CF <sub>3</sub>	Br	CF <sub>3</sub>	H	Br	CF <sub>3</sub>	OMe	Br
OMe	Br	CF <sub>3</sub>	OMe	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	OMe	CF <sub>3</sub>
OMe	Br	NO <sub>2</sub>	OMe	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	H	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	OMe	NO <sub>2</sub>

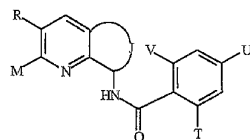
WO 02/091830

PCT/US02/18394

40

T	U	V	T	U	V	T	U	V	T	U	V
OMe	Br	OMe	OMe	CF <sub>3</sub>	OMe	CF <sub>3</sub>	H	OMe	CF <sub>3</sub>	OMe	OMe
OMe	H	Br	OMe	NO <sub>2</sub>	Me	NO <sub>2</sub>	H	Me	NO <sub>2</sub>	OMe	Me
OMe	H	CF <sub>3</sub>	OMe	NO <sub>2</sub>	F	NO <sub>2</sub>	H	F	NO <sub>2</sub>	OMe	F
OMe	H	NO <sub>2</sub>	OMe	NO <sub>2</sub>	Cl	NO <sub>2</sub>	H	Cl	NO <sub>2</sub>	OMe	Cl
OMe	OMe	Me	OMe	NO <sub>2</sub>	Br	NO <sub>2</sub>	H	Br	NO <sub>2</sub>	OMe	Br
OMe	OMe	F	OMe	NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	H	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	OMe	CF <sub>3</sub>
OMe	OMe	Cl	OMe	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	H	NO <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	OMe	NO <sub>2</sub>
OMe	OMe	Br	OMe	NO <sub>2</sub>	OMe	NO <sub>2</sub>	H	OMe	NO <sub>2</sub>	OMe	OMe

Table 5



T and V are both Cl and U is H

J	R	M	J	R	M
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me

WO 02/091830

PCT/US02/18394

41

T and V are both Cl and U is H

J	R	M	J	R	M
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CN	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CN	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SMe	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SMe	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O)Me	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O)Me	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O) <sub>2</sub> Me	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O) <sub>2</sub> Me	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me

WO 02/091830

PCT/US02/18394

42

T and V are both Cl and U is H

J	R	M	J	R	M
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CN	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CN	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SMe	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SMe	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O)Me	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O)Me	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O) <sub>2</sub> Me	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O) <sub>2</sub> Me	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Me

T and V are both Cl and U is Me

J	R	M	J	R	M
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me

WO 02/091830

PCT/US02/18394

43

CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CN	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CN	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SMe	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SMe	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O)Me	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O)Me	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O) <sub>2</sub> Me	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O) <sub>2</sub> Me	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CN	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CN	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SMe	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SMe	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O)Me	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O)Me	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O) <sub>2</sub> Me	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O) <sub>2</sub> Me	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Me



WO 02/091830

PCT/US02/18394

44

T is Cl and V and U are both Me

J	R	M	J	R	M
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CN	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CN	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SMe	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SMe	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O)Me	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O)Me	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O) <sub>2</sub> Me	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O) <sub>2</sub> Me	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me

WO 02/091830

PCT/US02/18394

45

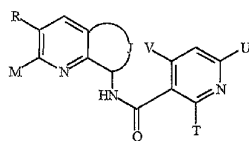
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CN	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CN	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SMe	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SMe	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O)Me	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O)Me	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O) <sub>2</sub> Me	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O) <sub>2</sub> Me	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Me

WO 02/091830

PCT/US02/18394

46

Table 6



T and V are both Cl and U is H

J	R	M	J	R	M
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CN	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CN	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SMe	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SMe	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O)Me	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O)Me	Me

WO 02/091830

PCT/US02/18394

47

T and V are both Cl and U is H

J	R	M	J	R	M
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O) <sub>2</sub> Me	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O) <sub>2</sub> Me	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CN	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CN	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SMe	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SMe	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O)Me	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O)Me	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O) <sub>2</sub> Me	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O) <sub>2</sub> Me	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Me

WO 02/091830

PCT/US02/18394

48

T and V are both Cl and U is Me

J	R	M	J	R	M
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CN	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CN	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SMe	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SMe	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O)Me	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O)Me	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O) <sub>2</sub> Me	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O) <sub>2</sub> Me	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me

WO 02/091830

PCT/US02/18394

49

T and V are both Cl and U is Me

J	R	M	J	R	M
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CN	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CN	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SMe	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SMe	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O)Me	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O)Me	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O) <sub>2</sub> Me	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O) <sub>2</sub> Me	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Me

T is Cl and V and U are both Me

J	R	M	J	R	M
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me

WO 02/091830

PCT/US02/18394

50

T is Cl and V and U are both Me

J	R	M	J	R	M
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CN	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CN	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SMe	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SMe	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O)Me	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O)Me	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O) <sub>2</sub> Me	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O) <sub>2</sub> Me	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me

WO 02/091830

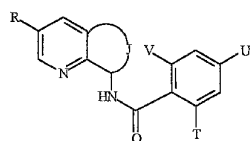
PCT/US02/18394

51

T is Cl and V and U are both Me

J	R	M	J	R	M
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SOCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CN	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CN	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SMe	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SMe	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O)Me	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O)Me	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O) <sub>2</sub> Me	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S(O) <sub>2</sub> Me	Me
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	Me

Table 7



T and V are both Cl and U is H

J	R	J	R	J	R
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl	OCH <sub>2</sub>	Cl	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br	OCH <sub>2</sub>	Br	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	I	OCH <sub>2</sub>	I	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	I
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>



WO 02/091830

PCT/US02/18394

52

T and V are both Cl and U is H

J	R	J	R	J	R
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	Cl	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	Cl
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	Br	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	Br
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	I	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	I	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	I
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	Cl	CONHCO	Cl	CONMeCO	Cl
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	Br	CONHCO	Br	CONMeCO	Br
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	CONHCO	CF <sub>3</sub>	CONMeCO	CF <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CONHCO	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CONMeCO	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>	CONHCO	CONHCH <sub>3</sub>	CONMeCO	CONHCH <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	I	CONHCO	I	CONMeCO	I
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CONHCO	CH <sub>3</sub>	CONMeCO	CH <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	CONHCO	OCF <sub>3</sub>	CONMeCO	OCF <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	CONHCO	OCHF <sub>2</sub>	CONMeCO	OCHF <sub>2</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	CONHCO	OCF <sub>3</sub>	CONMeCO	OCF <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	CONHCO	SCHF <sub>2</sub>	CONMeCO	SCHF <sub>2</sub>

T and V are both Cl and U is Me

J	R	J	R	J	R
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl	OCH <sub>2</sub>	Cl	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br	OCH <sub>2</sub>	Br	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	I	OCH <sub>2</sub>	I	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	I
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>

WO 02/091830

PCT/US02/18394

53

T and V are both Cl and U is Me

J	R	J	R	J	R
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	Cl	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	Cl
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	Br	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	Br
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	I	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	I	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	I
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	Cl	CONHCO	Cl	CONMeCO	Cl
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	Br	CONHCO	Br	CONMeCO	Br
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	CONHCO	CF <sub>3</sub>	CONMeCO	CF <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CONHCO	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CONMeCO	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>	CONHCO	CONHCH <sub>3</sub>	CONMeCO	CONHCH <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	I	CONHCO	I	CONMeCO	I
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CONHCO	CH <sub>3</sub>	CONMeCO	CH <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	CONHCO	OCF <sub>3</sub>	CONMeCO	OCF <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	CONHCO	OCHF <sub>2</sub>	CONMeCO	OCHF <sub>2</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	CONHCO	OCF <sub>3</sub>	CONMeCO	OCF <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	CONHCO	SCHF <sub>2</sub>	CONMeCO	SCHF <sub>2</sub>

T is Cl and V and U are both Me

J	R	J	R	J	R
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl	OCH <sub>2</sub>	Cl	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br	OCH <sub>2</sub>	Br	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	I	OCH <sub>2</sub>	I	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	I
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>

WO 02/091830

PCT/US02/18394

54

T is Cl and V and U are both Me

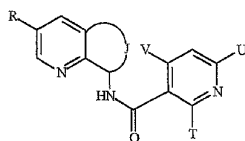
J	R	J	R	J	R
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	Cl	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	Cl
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	Br	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	Br
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	I	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	I	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	I
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	Cl	CONHCO	Cl	CONMeCO	Cl
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	Br	CONHCO	Br	CONMeCO	Br
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	CONHCO	CF <sub>3</sub>	CONMeCO	CF <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CONHCO	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CONMeCO	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>	CONHCO	CONHCH <sub>3</sub>	CONMeCO	CONHCH <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	I	CONHCO	I	CONMeCO	I
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CONHCO	CH <sub>3</sub>	CONMeCO	CH <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	CONHCO	OCF <sub>3</sub>	CONMeCO	OCF <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	CONHCO	OCHF <sub>2</sub>	CONMeCO	OCHF <sub>2</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	CONHCO	OCF <sub>3</sub>	CONMeCO	OCF <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	CONHCO	SCHF <sub>2</sub>	CONMeCO	SCHF <sub>2</sub>

WO 02/091830

PCT/US02/18394

55

Table 8



T and V are both Cl and U is H

J	R	J	R	J	R
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl	OCH <sub>2</sub>	Cl	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br	OCH <sub>2</sub>	Br	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	I	OCH <sub>2</sub>	I	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	I
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	Cl	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	Cl
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	Br	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	Br
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	I	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	I	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	I
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	Cl	CONHCO	Cl	CONMeCO	Cl
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	Br	CONHCO	Br	CONMeCO	Br
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	CONHCO	CF <sub>3</sub>	CONMeCO	CF <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CONHCO	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CONMeCO	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>	CONHCO	CONHCH <sub>3</sub>	CONMeCO	CONHCH <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	I	CONHCO	I	CONMeCO	I
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CONHCO	CH <sub>3</sub>	CONMeCO	CH <sub>3</sub>

WO 02/091830

PCT/US02/18394

56

T and V are both Cl and U is H

J	R	J	R	J	R
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	CONHCO	OCF <sub>3</sub>	CONMeCO	OCF <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	CONHCO	OCHF <sub>2</sub>	CONMeCO	OCHF <sub>2</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	CONHCO	OCF <sub>3</sub>	CONMeCO	OCF <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	CONHCO	SCHF <sub>2</sub>	CONMeCO	SCHF <sub>2</sub>

T and V are both Cl and U is Me

J	R	J	R	J	R
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl	OCH <sub>2</sub>	Cl	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br	OCH <sub>2</sub>	Br	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	I	OCH <sub>2</sub>	I	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	I
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	Cl	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	Cl
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	Br	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	Br
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	I	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	I	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	I
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	Cl	CONHCO	Cl	CONMeCO	Cl
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	Br	CONHCO	Br	CONMeCO	Br
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	CONHCO	CF <sub>3</sub>	CONMeCO	CF <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CONHCO	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CONMeCO	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>	CONHCO	CONHCH <sub>3</sub>	CONMeCO	CONHCH <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	I	CONHCO	I	CONMeCO	I
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CONHCO	CH <sub>3</sub>	CONMeCO	CH <sub>3</sub>

WO 02/091830

PCT/US02/18394

57

T and V are both Cl and U is Me

J	R	J	R	J	R
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	CONHCO	OCF <sub>3</sub>	CONMeCO	OCF <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	CONHCO	OCHF <sub>2</sub>	CONMeCO	OCHF <sub>2</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	CONHCO	OCF <sub>3</sub>	CONMeCO	OCF <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	CONHCO	SCHF <sub>2</sub>	CONMeCO	SCHF <sub>2</sub>

T is Cl and V and U are both Me

J	R	J	R	J	R
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl	OCH <sub>2</sub>	Cl	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br	OCH <sub>2</sub>	Br	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	I	OCH <sub>2</sub>	I	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	I
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	Cl	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	Cl
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Br	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	Br	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	Br
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	I	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	I	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	I
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	Cl	CONHCO	Cl	CONMeCO	Cl
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	Br	CONHCO	Br	CONMeCO	Br
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	CONHCO	CF <sub>3</sub>	CONMeCO	CF <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CONHCO	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CONMeCO	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	CONHCH <sub>3</sub>	CONHCO	CONHCH <sub>3</sub>	CONMeCO	CONHCH <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	I	CONHCO	I	CONMeCO	I
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CONHCO	CH <sub>3</sub>	CONMeCO	CH <sub>3</sub>

WO 02/091830

PCT/US02/18394

58

T is Cl and V and U are both Me

J	R	J	R	J	R
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	CONHCO	OCF <sub>3</sub>	CONMeCO	OCF <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	CONHCO	OCHF <sub>2</sub>	CONMeCO	OCHF <sub>2</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	CONHCO	OCF <sub>3</sub>	CONMeCO	OCF <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> NEtCH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	CONHCO	SCHF <sub>2</sub>	CONMeCO	SCHF <sub>2</sub>

Compositions

This invention also includes fungicidal compositions comprising (1) a fungicidally effective amount of a compound of Formula I (including all geometric and stereoisomers, *N*-oxides and agriculturally suitable salts thereof); and (2) (i) at least one other insecticide, fungicide, nematocide, bactericide, acaricide, growth regulator, chemosterilant, semiochemical, repellent, attractant, pheromone, feeding stimulant or other biologically active compound; and/or (ii) at least one additional component selected from the group consisting of surfactants, solid diluents and liquid diluents.

- Of note are compositions comprising (a) at least one compound of Formula I; and (b) at least one compound selected from the group consisting of
- (b1) alkylenebis(dithiocarbamate) fungicides;
  - (b2) compounds acting at the *bc*<sub>1</sub> complex of the fungal mitochondrial respiratory electron transfer site;
  - (b3) cymoxanil;
  - (b4) compounds acting at the demethylase enzyme of the sterol biosynthesis pathway;
  - (b5) morpholine and piperidine compounds that act on the sterol biosynthesis pathway;
  - (b6) phenylamide fungicides;
  - (b7) pyrimidinone fungicides;
  - (b8) phthalimides; and
  - (b9) fosetyl-aluminum.

The weight ratios of component (b) to component (a) typically is from 100:1 to 1:100, preferably is from 30:1 to 1:30, and more preferably is from 10:1 to 1:10. Of note are compositions wherein the weight ratio of component (b) to component (a) is from 10:1 to 1:1.

25 The *bc*<sub>1</sub> Complex Fungicides (component (b2))

Strobilurin fungicides such as azoxystrobin, kresoxim-methyl, metominostrobin/fenominostrobin (SSF-126), picoxystrobin, pyraclostrobin and trifloxystrobin are known to have a fungicidal mode of action which inhibits the *bc*<sub>1</sub> complex in the mitochondrial respiration chain (*Angew. Chem. Int. Ed.*, **1999**, *38*, 1328-1349). Methyl (*E*)-2-[[6-(2-cyanophenoxy)-4-pyrimidinyl]oxy]- $\alpha$ -(methoxyimino)benzeneacetate (also known as azoxystrobin) is described as a *bc*<sub>1</sub> complex

WO 02/091830

PCT/US02/18394

59

inhibitor in *Biochemical Society Transactions* **1993**, 22, 68S. Methyl (*E*)- $\alpha$ -(methoxyimino)-2-[(2-methylphenoxy)methyl]benzeneacetate (also known as kresoxim-methyl) is described as a  $bc_1$  complex inhibitor in *Biochemical Society Transactions* **1993**, 22, 64S. (*E*)-2-[(2,5-Dimethylphenoxy)methyl]- $\alpha$ -(methoxyimino)-*N*-methylbenzeneacetamide is described as a  $bc_1$  complex inhibitor in *Biochemistry and Cell Biology* **1995**, 85(3), 306-311. Other compounds that inhibit the  $bc_1$  complex in the mitochondrial respiration chain include famoxadone and fenamidone.

The  $bc_1$  complex is sometimes referred to by other names in the biochemical literature, including complex III of the electron transfer chain, and ubiquinol:cytochrome c oxidoreductase. It is uniquely identified by the Enzyme Commission number EC1.10.2.2. The  $bc_1$  complex is described in, for example, *J. Biol. Chem.* **1989**, 264, 14543-38; *Methods Enzymol.* **1986**, 126, 253-71; and references cited therein.

The Sterol Biosynthesis Inhibitor Fungicides (component (b4) or (b5))

The class of sterol biosynthesis inhibitors includes DMI and non-DMI compounds, that control fungi by inhibiting enzymes in the sterol biosynthesis pathway. DMI fungicides have a common site of action within the fungal sterol biosynthesis pathway; that is, an inhibition of demethylation at position 14 of lanosterol or 24-methylene dihydrolanosterol, which are precursors to sterols in fungi. Compounds acting at this site are often referred to as demethylase inhibitors, DMI fungicides, or DMIs. The demethylase enzyme is sometimes referred to by other names in the biochemical literature, including cytochrome P-450 (14DM). The demethylase enzyme is described in, for example, *J. Biol. Chem.* **1992**, 267, 13175-79 and references cited therein. DMI fungicides fall into several classes: azoles (including triazoles and imidazoles), pyrimidines, piperazines and pyridines. The triazoles includes bromuconazole, cyproconazole, difenoconazole, dimiconazole, epoxiconazole, febuconazole, fluquinconazole, flusilazole, flutriafol, hexaconazole, ipconazole, metconazole, penconazole, propiconazole, tebuconazole, tetraconazole, triadimefon, triadimenol, triticonazole and uniconazole. The imidazoles include clotrimazole, econazole, imazalil, isoconazole, miconazole and prochloraz. The pyrimidines include fenarimol, nuarimol and triarimol. The piperazines include triforine. The pyridines include buthiobate and pyrifenoxy. Biochemical investigations have shown that all of the above mentioned fungicides are DMI fungicides as described by K. H. Kuck, et al. in *Modern Selective Fungicides - Properties, Applications and Mechanisms of Action*, Lyr, H., Ed.; Gustav Fischer Verlag: New York, **1995**, 205-258.

The DMI fungicides have been grouped together to distinguish them from other sterol biosynthesis inhibitors, such as, the morpholine and piperidine fungicides. The morpholines and piperidines are also sterol biosynthesis inhibitors but have been shown to inhibit later steps in the sterol biosynthesis pathway. The morpholines include aldimorph, dodemorph, fenpropimorph, tridemorph and trimorphamide. The piperidines include fenpropidin.



WO 02/091830

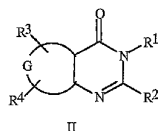
PCT/US02/18394

60

Biochemical investigations have shown that all of the above mentioned morpholine and piperidine fungicides are sterol biosynthesis inhibitor fungicides as described by K. H. Kuck, et al. in *Modern Selective Fungicides - Properties, Applications and Mechanisms of Action*, Lyr, H., Ed.; Gustav Fischer Verlag: New York, 1995, 185-204.

5 Pyrimidinone Fungicides (component (b7))

Pyrimidinone fungicides include compounds of Formula II



wherein

G is a fused phenyl, thiophene or pyridine ring;

10 R<sup>1</sup> is C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkyl;

R<sup>2</sup> is C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkyl or C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkoxy;

R<sup>3</sup> is halogen; and

R<sup>4</sup> is hydrogen or halogen.

Pyrimidinone fungicides are described in International Patent Application

15 WO94/26722, U.S. Patent No. 6,066,638, U.S. Patent No. 6,245,770, U.S. Patent No. 6,262,058 and U.S. Patent No. 6,277,858.

Of note are pyrimidinone fungicides selected from the group:

6-bromo-3-propyl-2-propyloxy-4(3H)-quinazolinone,

6,8-diiodo-3-propyl-2-propyloxy-4(3H)-quinazolinone,

20 6-iodo-3-propyl-2-propyloxy-4(3H)-quinazolinone,

6-chloro-2-propoxy-3-propylthieno[2,3-d]pyrimidin-4(3H)-one,

6-bromo-2-propoxy-3-propylthieno[2,3-d]pyrimidin-4(3H)-one,

7-bromo-2-propoxy-3-propylthieno[3,2-d]pyrimidin-4(3H)-one,

6-bromo-2-propoxy-3-propylpyrido[2,3-d]pyrimidin-4(3H)-one,

25 6,7-dibromo-2-propoxy-3-propylthieno[3,2-d]pyrimidin-4(3H)-one, and

3-(cyclopropylmethyl)-6-iodo-2-(propylthio)pyrido[2,3-d]pyrimidin-4(3H)-one.

Table 2

Examples of component (b)

(b1)	Alkylenebis(dithiocarbamate)s such as mancozeb, maneb, propineb and zineb
(b3)	Cymoxanil
(b6)	Phenylamides such as metalaxyl, benalaxyl and oxadixyl
(b8)	Phthalimids such as folpet or captan

WO 02/091830

PCT/US02/18394

61

## Examples of component (b)

## (b9) Fosetyl-aluminum

Other fungicides that can be included in compositions of this invention in combination with a Formula I compound or as an additional component in combination with component (a) and component (b) are acibenzolar, benalaxyl, benomyl, blasticidin-S, Bordeaux mixture (tribasic copper sulfate), carpropamid, captafol, captan, carbendazim, chloroneb, chlorothalonil, copper oxychloride, copper salts such as copper sulfate and copper hydroxide, cyazofamid, cymoxanil, cyprodinil, (S)-3,5-dichloro-N-(3-chloro-1-ethyl-1-methyl-2-oxopropyl)-4-methylbenzamide (RH 7281), diclocymet (S-2900), diclomezine, dicloran, dimethomorph, diniconazole-M, dodemorph, dodine, edifenphos, fenacaramid (SZX0722), fenpiclonil, fentin acetate, fentin hydroxide, fluazinam, fludioxonil, flumetover (RPA 403397), flutolanil, folpet, fosetyl-aluminum, furalaxyl, furametapyr (S-82658), iprobenfos, iprodione, isoprothiolane, iprovalicarb, kasugamycin, mancozeb, maneb, mefenoxam, mepronil, metalaxyl, metiram-zinc, myclobutanil, neo-asozin (ferric methanearsonate), oxadixyl, penicucuron, prochloraz, procymidone, propamocarb, propineb, pyrifenoxy, pyrimethanil, pyroquilon, quinoxifen, spiroxamine, sulfur, thifluzamide, thiophanate-methyl, thiram, triadimefon, tricyclazole, validamycin, vinclozolin, zineb and zoaxamid.

Descriptions of the commercially available compounds listed above may be found in *The Pesticide Manual, Twelfth Edition*, C.D.S. Tomlin, ed., British Crop Protection Council, 2000.

- Of note are combinations of Formula I with fungicides of a different biochemical mode of action (e.g. mitochondrial respiration inhibition, inhibition of protein synthesis by interference of the synthesis of ribosomal RNA or inhibition of beta-tubulin synthesis) that can be particularly advantageous for resistance management. Examples include combinations of compounds of Formula I (e.g. Compound 1) with strobilurins such as azoxystrobin, kresoxim-methyl, pyraclostrobin and trifloxystrobin; carbendazim, mitochondrial respiration inhibitors such as famoxadone and fenamidone; benomyl, cymoxanil; dimethomorph; folpet; fosetyl-aluminum; metalaxyl; mancozeb and maneb. These combinations can be particularly advantageous for resistance management, especially where the fungicides of the combination control the same or similar diseases.
- Of note are combinations of Formula I with fungicides for controlling grape diseases (e.g. *Plasmopara viticola*, *Botrytis cinerea* and *Uncinula necator*) including alkylenebis(dithiocarbamate)s such as mancozeb, maneb, propineb and zineb, phthalimids such as folpet, copper salts such as copper sulfate and copper hydroxide, strobilurins such as azoxystrobin, pyraclostrobin and trifloxystrobin, mitochondrial respiration inhibitors such as famoxadone and fenamidone, phenylamides such as metalaxyl, phosphonates such as fosetyl-Al, dimethomorph, pyrimidinone fungicides such as

WO 02/091830

PCT/US02/18394

62

6-iodo-3-propyl-2-propyloxy-4(3*H*)-quinazolinone and 6-chloro-2-propoxy-3-propylthieno[2,3-*d*]pyrimidin-4(3*H*)-one, and other fungicides such as cymoxanil.

Of note are combinations of Formula I with fungicides for controlling potato diseases (e.g. *Phytophthora infestans*, *Alternaria solani* and *Rhizoctonia solani*) including alkylenebis(dithiocarbamate)s such as mancozeb, maneb, propineb and zineb; copper salts such as copper sulfate and copper hydroxide; strobilurins such as pyraclostrobin and trifloxystrobin; mitochondrial respiration inhibitors such as famoxadone and fenamidone; phenylamides such as metalaxyl; carbamates such as propamocarb; phenylpyridylamines such as fluazinam and other fungicides such as chlorothalonil, cyazofamid, cymoxanil, dimethomorph, zoxamid and iprovalicarb.

Of note are compositions wherein component (b) comprises at least one compound from each of two different groups selected from (b1), (b2), (b3), (b4), (b5), (b6), (b7), (b8) and (b9). The weight ratio of the compound(s) of the first of these two component (b) groups to the compound(s) of the second of these component (b) groups typically is from 100:1 to 1:100, more typically from 30:1 to 1:30 and most typically from 10:1 to 1:10.

Of note are compositions wherein component (b) comprises at least one compound selected from (b1), for example mancozeb, and at least one compound selected from a second component (b) group, for example, from (b2), (b3), (b6), (b7), (b8) or (b9). Of particular note are such compositions wherein the overall weight ratio of component (b) to component (a) is from 30:1 to 1:30 and the weight ratio of component (b1) to component (a) is from 10:1 to 1:1. Examples of these compositions include compositions comprising mixtures of component (a) (preferably a compound from Index Table A, B or C) with mancozeb and a compound selected from the group consisting of famoxadone, fenamidone, azoxystrobin, kresoxim-methyl, pyraclostrobin, trifloxystrobin, cymoxanil, metalaxyl, benalaxyl, oxadixyl, 6-iodo-3-propyl-2-propyloxy-4(3*H*)-quinazolinone, 6-chloro-2-propoxy-3-propylthieno[2,3-*d*]pyrimidin-4(3*H*)-one, folpet, captan and fosetyl-aluminum.

Also of note are compositions wherein component (b) comprises at least one compound selected from (b2), for example famoxadone, and at least one compound selected from a second component (b) group, for example, from (b1), (b3), (b6), (b7), (b8) or (b9). Of particular note are such compositions wherein the overall weight ratio of component (b) to component (a) is from 30:1 to 1:30 and the weight ratio of component (b2) to component (a) is from 10:1 to 1:1. Examples of these compositions include compositions comprising mixtures of component (a) (preferably a compound from Index Table A, B or C) with famoxadone and a compound selected from the group consisting of mancozeb, maneb, propineb, zineb, cymoxanil, metalaxyl, benalaxyl, oxadixyl, 6-iodo-3-propyl-2-propyloxy-4(3*H*)-quinazolinone, 6-chloro-2-propoxy-3-propylthieno[2,3-*d*]pyrimidin-4(3*H*)-one, folpet, captan and fosetyl-aluminum.

WO 02/091830

PCT/US02/18394

63

Also of note are compositions wherein component (b) comprises the compound of (b3), in other words cymoxanil, and at least one compound selected from a second component (b) group, for example, from (b1), (b2), (b6), (b7), (b8) or (b9). Of particular note are such compositions wherein the overall weight ratio of component (b) to component (a) is from 30:1 to 1:30 and the weight ratio of component (b3) to component (a) is from 10:1 to 1:1. Examples of these compositions include compositions comprising mixtures of component (a) (preferably a compound from Index Table A, B or C) with cymoxanil and a compound selected from the group consisting of famoxadone, fenamidone, azoxystrobin, kresoxim-methyl, pyraclostrobin, trifloxystrobin, mancozeb, maneb, propineb, zineb, metalaxyl, benalaxyl, oxadixyl, 6-iodo-3-propyl-2-propyloxy-4(3*H*)-quinazolinone, 6-chloro-2-propoxy-3-propylthieno[2,3-*d*]pyrimidin-4(3*H*)-one, folpet, captan and fosetyl-aluminum.

Also of note are compositions wherein component (b) comprises at least one compound selected from (b6), for example metalaxyl, and at least one compound selected from a second component (b) group, for example, from (b1), (b2), (b3), (b7), (b8) or (b9). Of particular note are such compositions wherein the overall weight ratio of component (b) to component (a) is from 30:1 to 1:30 and the weight ratio of component (b6) to component (a) is from 10:1 to 1:3. Examples of these compositions include compositions comprising mixtures of component (a) (preferably a compound from Index Table A, B or C) with metalaxyl or oxadixyl and a compound selected from the group consisting of famoxadone, fenamidone, azoxystrobin, kresoxim-methyl, pyraclostrobin, trifloxystrobin, cymoxanil, mancozeb, maneb, propineb, zineb, 6-iodo-3-propyl-2-propyloxy-4(3*H*)-quinazolinone, 6-chloro-2-propoxy-3-propylthieno[2,3-*d*]pyrimidin-4(3*H*)-one, folpet, captan and fosetyl-aluminum.

Also of note are compositions wherein component (b) comprises at least one compound selected from (b7), for example 6-iodo-3-propyl-2-propyloxy-4(3*H*)-quinazolinone or 6-chloro-2-propoxy-3-propylthieno[2,3-*d*]pyrimidin-4(3*H*)-one, and at least one compound selected from a second component (b) group, for example, from (b1), (b2), (b3), (b6), (b8) or (b9). Of particular note are such compositions wherein the overall weight ratio of component (b) to component (a) is from 30:1 to 1:30 and the weight ratio of component (b7) to component (a) is from 1:1 to 1:20. Included are compositions wherein the weight ratio of component (b6) to component (a) is from 1:4.5 to 1:9. Examples of these compositions include compositions comprising mixtures of component (a) (preferably a compound from Index Table A, B or C) with 6-iodo-3-propyl-2-propyloxy-4(3*H*)-quinazolinone or 6-chloro-2-propoxy-3-propylthieno[2,3-*d*]pyrimidin-4(3*H*)-one and a compound selected from the group consisting of famoxadone, fenamidone, azoxystrobin, kresoxim-methyl, pyraclostrobin, trifloxystrobin, cymoxanil, mancozeb, maneb, propineb, zineb, metalaxyl, benalaxyl, oxadixyl, folpet, captan and fosetyl-aluminum.

WO 02/091830

PCT/US02/18394

64

Also of note are compositions wherein component (b) comprises the compound of (b9), in other words fosetyl-aluminum, and at least one compound selected from a second component (b) group, for example, from (b1), (b2), (b3), (b6) or (b7). Of particular note are such compositions wherein the overall weight ratio of component (b) to component (a) is from 30:1 to 1:30 and the weight ratio of component (b9) to component (a) is from 10:1 to 1:1. Examples of these compositions include compositions comprising mixtures of component (a) (preferably a compound from Index Table A, B or C) with fosetyl-aluminum and a compound selected from the group consisting of famoxadone, fenamidone, azoxystrobin, kresoxim-methyl, pyraclostrobin, trifloxystrobin, mancozeb, maneb, propineb, zineb, metalaxyl, benalaxyl, oxadixyl, 6-iodo-3-propyl-2-propyloxy-4(3*H*)-quinazolinone, 6-chloro-2-propoxy-3-propylthieno[2,3-*d*]pyrimidin-4(3*H*)-one, folpet, captan and cymoxanil.

Of note are combinations of compounds of Formula I with fungicides giving an even broader spectrum of agricultural protection including strobilurins such as azoxystrobin, kresoxim-methyl, pyraclostrobin and trifloxystrobin; morpholines such as fenpropidine and fenpropimorph; triazoles such as bromuconazole, cyproconazole, difenoconazole, epoxyconazole, flusilazole, ipconazole, metconazole, propiconazole, tebuconazole and triticonazole; pyrimidinone fungicides, benomyl; carbendazim; chlorothalonil; dimethomorph; folpet; mancozeb; maneb; quinoxifen; validamycin and vinclozolin.

Of note are combinations with other fungicides giving an even broader spectrum of agricultural protection including azoxystrobin, kresoxim-methyl, pyraclostrobin, trifloxystrobin, benomyl, carbendazim, chlorothalonil, dimethomorph, folpet, mancozeb, maneb, quinoxifen, validamycin, vinclozolin, fenpropidine, fenpropimorph, bromuconazole, cyproconazole, difenoconazole, epoxyconazole, flusilazole, ipconazole, metconazole, propiconazole, tebuconazole and triticonazole.

Of note are combinations with other fungicides of a different mode of action (e.g. mitochondrial respiration inhibition, inhibition of protein synthesis by interference of the synthesis of ribosomal RNA or inhibition of beta-tubulin synthesis) that can be particularly advantageous for resistance management. Examples include combinations of compounds of Formula I (e.g. Compound A1) with azoxystrobin, kresoxim-methyl, pyraclostrobin, trifloxystrobin, carbendazim, famoxadone, fenamidone, benomyl, cymoxanil, dimethomorph, folpet, fosetyl-aluminum, metalaxyl, mancozeb, maneb. These combinations can be particularly advantageous for resistance management, especially where the fungicides of the combination control the same or similar diseases.

Of note are combinations with other fungicides for controlling grape diseases including dithiocarbamates such as mancozeb, maneb, propineb and zineb, phthalimids such as folpet, copper salts such as copper sulfate and copper hydroxide, strobilurins such as azoxystrobin, pyraclostrobin and trifloxystrobin, phenylamides such as metalaxyl, phosphonates such as

WO 02/091830

PCT/US02/18394

65

fosetyl-aluminum, morpholines such as dimethomorph, and other fungicides such as cymoxanil, famoxadone and fenamidone.

- Of note are combinations with other fungicides for controlling potato diseases including dithiocarbamates such as mancozeb, maneb, propineb and zineb, copper salts such as copper sulfate and copper hydroxide, strobilurins such as pyrelostrobin and trifloxystrobin, phenylamides such as metalaxyl, carbamates such as propamocarb, phenylpyridylamines such as fluazinam, morpholines such as dimethomorph, and other fungicides such as chlorothalonil, cyazofamid, cymoxanil, famoxadone, fenamidone, zoxamid and iprovalicarb.
- Of particular note are combinations of Compound A1 with azoxystrobin, combinations of Compound A1 with kresoxim-methyl, combinations of Compound A1 with pyrelostrobin, combinations of Compound A1 with trifloxystrobin, combinations of Compound A1 with carbendazim, combinations of Compound A1 with chlorothalonil, combinations of Compound A1 with dimethomorph, combinations of Compound A1 with folpet, combinations of Compound A1 with mancozeb, combinations of Compound A1 with maneb, combinations of Compound A1 with quinoxifen, combinations of Compound A1 with validamycin, combinations of Compound A1 with vinclozolin, Compound A1 with fenpropidine, Compound A1 with fenpropimorph, Compound A1 with bromuconazole, Compound A1 with cyproconazole, Compound A1 with difenoconazole, Compound A1 with epoxyconazole, Compound A1 with flusilazole, Compound A1 with ipconazole, Compound A1 with metconazole, Compound A1 with propiconazole, Compound A1 with tebuconazole, Compound A1 with triticonazole, Compound A1 with famoxadone, Compound A1 with fenamidone, Compound A1 with benomyl, Compound A1 with cymoxanil, Compound A1 with dimethomorph, Compound A1 with folpet, Compound A1 with fosetyl-aluminum, Compound A1 with metalaxyl, Compound A1 with Compound A1 with propineb, Compound A1 with zineb, Compound A1 with copper sulfate, Compound A1 with copper hydroxide, Compound A1 with propamocarb, Compound A1 with cyazofamid, Compound A1 with zoxamid and Compound A1 with iprovalicarb. Compound numbers refer to compounds in Index Tables A-D.
- Preferred 15. Preferred compositions comprise a compound of component (a) mixed with cymoxanil.
- Preferred 16. Preferred compositions comprise a compound of component (a) mixed with a compound selected from (b1). More preferred is a composition wherein the compound of (b1) is mancozeb.
- Preferred 17. Preferred compositions comprise a compound of component (a) mixed with a compound selected from (b2). More preferred is a composition wherein the compound of (b2) is famoxadone.

WO 02/091830

PCT/US02/18394

66

Preferred compositions comprise a compound of component (a) mixed with two compounds selected from two different groups selected from (b1), (b2), (b3), (b4), (b5), (b6), (b7), (b8) and (b9).

Preferred compositions are those wherein component (a) is selected from the compounds of Formula I indicated in Preferred 1 through 14 above.

Compounds of this invention can also be mixed with one or more insecticides, nematocides, bactericides, acaricides, growth regulators, chemosterilants, semiochemicals, repellents, attractants, pheromones, feeding stimulants or other biologically active compounds to form a multi-component pesticide giving an even broader spectrum of agricultural protection. Examples of such agricultural protectants with which compositions of this invention can be formulated are: insecticides such as abamectin, acephate, azinphos-methyl, bifenthrin, buprofezin, carbofuran, chlorfenapyr, chlorpyrifos, chlorpyrifos-methyl, cyfluthrin, beta-cyfluthrin, cyhalothrin, lambda-cyhalothrin, deltamethrin, diafenthiuron, diazinon, diflubenzuron, dimethoate, esfenvalerate, fenoxycarb, fenpropathrin, fenvalerate, fipronil, flucythrinate, tau-fluvalinate, fonophos, imidacloprid, isofenphos, malathion, metaldehyde, methamidophos, methidathion, methomyl, methoprene, methoxychlor, methyl 7-chloro-2,5-dihydro-2-[[N-(methoxycarbonyl)-N-[4-(trifluoromethoxy)phenyl]amino]carbonyl]indeno[1,2-e][1,3,4]oxadiazine-4a(3H)-carboxylate (indoxacarb), monocrotophos, oxamyl, parathion, parathion-methyl, permethrin, phorate, phosalone, phosmet, phosphamidon, pirimicarb, profenofos, rotenone, sulprofos, tebufenozide, tefluthrin, terbufos, tetrachlorvinphos, thiodicarb, tralomethrin, trichlorfon and triflumuron; bactericides such as streptomycin; acaricides such as amitraz, chinomethionat, chlorobenzilate, cyhexatin, dicofol, dienochlor, etoxazole, fenazaquin, fenbutatin oxide, fenpropathrin, fenpyroximate, hexythiazox, propargite, pyridaben and tebufenpyrad; nematocides such as aldoxycarb and fenamiphos; and biological agents such as *Bacillus thuringiensis*, *Bacillus thuringiensis* delta endotoxin, baculovirus, and entomopathogenic bacteria, virus and fungi. The weight ratios of these various mixing partners to compounds of Formula I of this invention typically are between 100:1 and 1:100, preferably between 30:1 and 1:30, more preferably between 10:1 and 1:10 and most preferably between 4:1 and 1:4.

Descriptions of the commercially available compounds listed above may be found in *The Pesticide Manual, Twelfth Edition*, C.D.S. Tomlin, ed., British Crop Protection Council, 2000.

#### Formulation

Compounds of this invention will generally be used as a formulation or composition with an agriculturally suitable carrier comprising at least one of a liquid diluent, a solid diluent or a surfactant. The formulation or composition ingredients are selected to be consistent with the physical properties of the active ingredient, mode of application and

WO 02/091830

PCT/US02/18394

67

- environmental factors such as soil type, moisture and temperature. Useful formulations include liquids such as solutions (including emulsifiable concentrates), suspensions, emulsions (including microemulsions and/or suspoemulsions) and the like which optionally can be thickened into gels. Useful formulations further include solids such as dusts, powders, granules, pellets, tablets, films, and the like which can be water-dispersible ("wettable") or water-soluble. Active ingredient can be (micro)encapsulated and further formed into a suspension or solid formulation; alternatively the entire formulation of active ingredient can be encapsulated (or "overcoated"). Encapsulation can control or delay release of the active ingredient. Sprayable formulations can be extended in suitable media and used at spray volumes from about one to several hundred liters per hectare. High-strength compositions are primarily used as intermediates for further formulation.

The formulations will typically contain effective amounts (e.g. from 0.01-99.99 weight percent) of active ingredient together with diluent and/or surfactant within the following approximate ranges which add up to 100 percent by weight.

	Weight Percent		
	Active Ingredient	Diluent	Surfactant
Water-Dispersible and Water-soluble Granules, Tablets and Powders.	5-90	0-94	1-15
Suspensions, Emulsions, Solutions (including Emulsifiable Concentrates)	5-50	40-95	0-25
Dusts	1-25	70-99	0-5
Granules and Pellets	0.01-99	5-99.99	0-15
High Strength Compositions	90-99	0-10	0-2

Typical solid diluents are described in Watkins, et al., *Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers*, 2nd Ed., Dorland Books, Caldwell, New Jersey. Typical liquid diluents are described in Marsden, *Solvents Guide*, 2nd Ed., Interscience, New York, 1950. *McCutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual*, Allured Publ. Corp., Ridgewood, New Jersey, as well as Sisely and Wood, *Encyclopedia of Surface Active Agents*, Chemical Publ. Co., Inc., New York, 1964, list surfactants and recommended uses. All formulations can contain minor amounts of additives to reduce foam, caking, corrosion, microbiological growth and the like, or thickeners to increase viscosity.

Surfactants include, for example, polyethoxylated alcohols, polyethoxylated alkylphenols, polyethoxylated sorbitan fatty acid esters, dialkyl sulfosuccinates, alkyl sulfates, alkylbenzene sulfonates, organosilicones, *N,N*-dialkyltaurates, lignin sulfonates, naphthalene sulfonate formaldehyde condensates, polycarboxylates, and polyoxyethylene/polyoxypropylene block copolymers. Solid diluents include, for example, clays such as bentonite, montmorillonite, attapulgite and kaolin, starch, sugar, silica, talc,



WO 02/091830

PCT/US02/18394

68

diatomaceous earth, urea, calcium carbonate, sodium carbonate and bicarbonate, and sodium sulfate. Liquid diluents include, for example, water, *N,N*-dimethylformamide, dimethyl sulfoxide, *N*-alkylpyrrolidone, ethylene glycol, polypropylene glycol, paraffins, alkylbenzenes, alkylnaphthalenes, oils of olive, castor, linseed, tung, sesame, corn, peanut, cotton-seed, soybean, rape-seed and coconut, fatty acid esters, ketones such as cyclohexanone, 2-heptanone, isophorone and 4-hydroxy-4-methyl-2-pentanone, and alcohols such as methanol, cyclohexanol, decanol and tetrahydrofurfuryl alcohol.

Solutions, including emulsifiable concentrates, can be prepared by simply mixing the ingredients. Dusts and powders can be prepared by blending and, usually, grinding as in a hammer mill or fluid-energy mill. Suspensions are usually prepared by wet-milling; see, for example, U.S. 3,060,084. Preferred suspension concentrates include those containing, in addition to the active ingredient, from 5 to 20% nonionic surfactant (for example, polyethoxylated fatty alcohols) optionally combined with 50-65% liquid diluents and up to 5% anionic surfactants. Granules and pellets can be prepared by spraying the active material upon preformed granular carriers or by agglomeration techniques. See Browning, "Agglomeration", *Chemical Engineering*, December 4, 1967, pp 147-48, *Perry's Chemical Engineer's Handbook*, 4th Ed., McGraw-Hill, New York, 1963, pages 8-57 and following, and WO 91/13546. Pellets can be prepared as described in U.S. 4,172,714. Water-dispersible and water-soluble granules can be prepared as taught in U.S. 4,144,050, U.S. 3,920,442 and DE 3,246,493. Tablets can be prepared as taught in U.S. 5,180,587, U.S. 5,232,701 and U.S. 5,208,030. Films can be prepared as taught in GB 2,095,558 and U.S. 3,299,566.

For further information regarding the art of formulation, see T. S. Woods, "The Formulator's Toolbox - Product Forms for Modern Agriculture" in *Pesticide Chemistry and Bioscience, The Food-Environment Challenge*, T. Brooks and T. R. Roberts, Eds., Proceedings of the 9th International Congress on Pesticide Chemistry, The Royal Society of Chemistry, Cambridge, 1999, pp. 120-133. See also U.S. 3,235,361, Col. 6, line 16 through Col. 7, line 19 and Examples 10-41; U.S. 3,309,192, Col. 5, line 43 through Col. 7, line 62 and Examples 8, 12, 15, 39, 41, 52, 53, 58, 132, 138-140, 162-164, 166, 167 and 169-182; U.S. 2,891,855, Col. 3, line 66 through Col. 5, line 17 and Examples 1-4; Klingman, *Weed Control as a Science*, John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, pp 81-96; and Hance et al., *Weed Control Handbook*, 8th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989.

In the following Examples, all percentages are by weight and all formulations are prepared in conventional ways. Compound numbers refer to compounds in Index Tables A-D.

WO 02/091830

PCT/US02/18394

69

Example AWettable Powder

	Compound A1	65.0%
	dodecylphenol polyethylene glycol ether	2.0%
5	sodium ligninsulfonate	4.0%
	sodium silicoaluminate	6.0%
	montmorillonite (calcined)	23.0%

Example BGranule

10	Compound A1	10.0%
	attapulgite granules (low volatile matter, 0.71/0.30 mm; U.S.S. No. 25-50 sieves)	90.0%

Example CExtruded Pellet

15	Compound A1	25.0%
	anhydrous sodium sulfate	10.0%
	crude calcium ligninsulfonate	5.0%
	sodium alkyl naphthalenesulfonate	1.0%
	calcium/magnesium bentonite	59.0%

Example DEmulsifiable Concentrate

	Compound A1	20.0%
	blend of oil soluble sulfonates and polyoxyethylene ethers	10.0%
25	isophorone	70.0%

Example E

	Compound A1	20.0%
	polyethoxylated fatty alcohol	15.0%
	ester derivative of montan wax	3.0%
30	calcium lignosulfonate	2.0%
	polyethoxylated/polypropoxylated polyglycol block copolymer	1.0%
	propylene glycol	6.4%
	poly(dimethylsiloxane)	0.6%
35	antimicrobial agent	0.1%
	water	51.9%

WO 02/091830

PCT/US02/18394

70

The formulation ingredients are mixed together as a syrup, Compound A1 is added and the mixture is homogenized in a blender. The resulting slurry is then wet-milled to form a suspension concentrate.

#### Utility

5 The compounds and compositions of Formula I are useful as plant disease control agents. The present invention therefore comprises a method for controlling plant diseases caused by fungal plant pathogens comprising applying to the plant or portion thereof to be protected, or to the plant seed or seedling to be protected, an effective amount of a compound of the invention or a fungicidal composition containing said compound.

10 The preferred methods of use are those involving the compounds or compositions preferred above.

The compounds and compositions of Formula I provide control of diseases caused by a broad spectrum of fungal plant pathogens in the Basidiomycete, Ascomycete, Oomycete and Deuteromycete classes. They are effective in controlling a broad spectrum of plant diseases, particularly foliar pathogens of ornamental, vegetable, field, cereal, and fruit crops. These pathogens include *Plasmopara viticola*, *Phytophthora infestans*, *Peronospora tabacina*, *Pseudoperonospora cubensis*, *Pythium aphanidermatum*, *Alternaria brassicae*, *Septoria nodorum*, *Septoria tritici*, *Cercosporidium personatum*, *Cercospora arachidicola*, *Pseudocercospora herpotrichoides*, *Cercospora beticola*, *Botrytis cinerea*, *Monilinia fructicola*, *Pyricularia oryzae*, *Podosphaera leucotricha*, *Venturia inaequalis*, *Erysiphe graminis*, *Uncinula necator*, *Puccinia recondita*, *Puccinia graminis*, *Hemileia vastatrix*, *Puccinia striiformis*, *Puccinia arachidis*, *Rhizoctonia solani*, *Sphaerotheca fuliginea*, *Fusarium oxysporum*, *Verticillium dahliae*, *Pythium aphanidermatum*, *Phytophthora megasperma*, *Sclerotinia sclerotiorum*, *Sclerotium rolfsii*, *Erysiphe polygoni*, *Pyrenophora teres*, *Gaeumannomyces graminis*, *Rhynchosporium secalis*, *Fusarium roseum*, *Bremia lactucae* and other genera and species closely related to these pathogens. The compositions of the invention are especially effective in controlling *Plasmopara viticola* on grapes and *Phytophthora infestans* on potatoes and tomatoes.

Plant disease control is ordinarily accomplished by applying an effective amount of a compound of Formula I either pre- or post-infection, to the portion of the plant to be protected such as the roots, stems, foliage, fruit, seeds, tubers or bulbs, or to the media (soil or sand) in which the plants to be protected are growing. The compounds can also be applied to the seed to protect the seed and seedling.

Rates of application for these compounds can be influenced by many factors of the environment and should be determined under actual use conditions. Foliage can normally be protected when treated at a rate of from less than 1 g/ha to 5,000 g/ha of active ingredient. Seed and seedlings can normally be protected when seed is treated at a rate of from 0.1 to 10 g per kilogram of seed.

WO 02/091830

PCT/US02/18394

71

The following TESTS demonstrate the control efficacy of compounds suitable for use in accordance with this invention on specific pathogens. The pathogen control protection afforded by the compounds is not limited, however, to these species. These TESTS can also be used to demonstrate the control efficacy of compositions of this invention on specific pathogens. Test suspensions comprising a single active ingredient are sprayed to demonstrate the control efficacy of the active ingredient individually. To demonstrate the control efficacy of a combination, (a) the active ingredients can be combined in the appropriate amounts in a single test suspension, (b) stock solutions of individual active ingredients can be prepared and then combined in the appropriate ratio and diluted to the final desired concentration to form a test suspension or (c) test suspensions comprising single active ingredients can be sprayed sequentially in the desired ratio.

Synergism has been described as "the cooperative action of two components [e.g. component (a) and component (b)] of a mixture, such that the total effect is greater or more prolonged than the sum of the effects of the two (or more) taken independently" (see Tames, P. M. L., *Neth. J. Plant Pathology*, 1964, 70, 73-80). The presence of a synergistic effect between two active ingredients is established with the aid of the Colby equation (see Colby, S. R. In *Calculating Synergistic and Antagonistic Responses of Herbicide Combinations*, Weeds, 1967, 15, 20-22):

$$p = A + B - \left[ \frac{A \times B}{100} \right]$$

Using the methods of Colby, the presence of a synergistic interaction between two active ingredients is established by first calculating the predicted activity, p, of the mixture based on activities of the two components applied alone. If p is lower than the experimentally established effect, synergism has occurred. In the equation above, A is the fungicidal activity in percentage control of one component applied alone at rate x. The B term is the fungicidal activity in percentage control of the second component applied at rate y. The equation estimates p, the fungicidal activity of the mixture of A at rate x with B at rate y if their effects are strictly additive and no interaction has occurred.

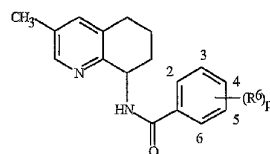
See Index Tables A-D for descriptions of compound suitable for use in this invention. The following abbreviations are used in the Index Tables that follow: Me is methyl, Et is ethyl, Ph is phenyl, OMe is methoxy, OEt is ethoxy. The abbreviation "Ex." stands for "Example" and is followed by a number indicating in which example the compound is prepared.

WO 02/091830

PCT/US02/18394

72

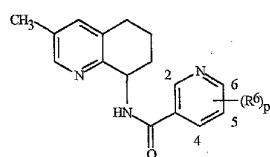
INDEX TABLE A



Compound Number	(R <sup>6</sup> ) <sub>p</sub>	
A1 (Ex. 1)	2,6-Cl <sub>2</sub>	*
A2	4-Br	*
A3	2-CF <sub>3</sub>	*
A4	2,6-F <sub>2</sub>	*
A5	2-Cl	*
A6	2,4,6-Cl <sub>3</sub>	*
A7	2-Me	*
A8	2,3,6-F <sub>3</sub>	*
A9	2-Cl,6-F	*
A10	2,6-(OMe) <sub>2</sub>	*

\* See Index Table D for <sup>1</sup>H NMR spectral data

INDEX TABLE B



Compound Number	(R <sup>6</sup> ) <sub>p</sub>	
B1	2-NH(3-CF <sub>3</sub> -Ph)	*
B2	2-SPh	*
B3	2-SMe	*
B4	6-Cl	*
B5	2-OPh	*
B6	2-OEt	*
B7	2,4-Cl <sub>2</sub>	*
B8	2-OH	*

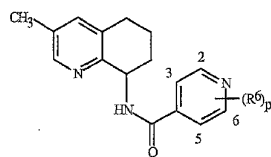
\* See Index Table D for <sup>1</sup>H NMR spectral data

WO 02/091830

PCT/US02/18394

73

INDEX TABLE C



Compound Number	(R <sup>6</sup> ) <sub>p</sub>	
C1	2-Cl	*
C2	2-Cl-6-OMe	*

\* See Index Table D for <sup>1</sup>H NMR spectral data

INDEX TABLE D

Cmpd No.	<sup>1</sup> H NMR Data (300MHz; CDCl <sub>3</sub> solution unless indicated otherwise) <sup>a</sup>
A1	δ 8.22 (s, 1H), 7.30 (s, 1H), 7.36-7.23 (m, 3H), 6.99 (bs, 1H), 5.03 (m, 1H), 2.82 (m, 3H), 2.29 (s, 3H), 1.94 (m, 3H)
A2	δ 8.24 (s, 1H), 7.71 (d, J=8.7 Hz, 2H), 7.58 (d, J=8.6 Hz, 2H), 7.33 (bs, 1H), 7.27 (s, 1H), 4.97 (m, 1H), 2.82 (m, 3H), 2.31 (s, 3H), 1.95 (m, 2H), 1.69 (m, 1H)
A3	δ 8.20 (s, 1H), 7.68 (m, 2H), 7.55 (m, 2H), 7.25 (s, 1H), 6.87 (bs, 1H), 5.02 (m, 1H), 2.81 (t, J=6.4 Hz, 2H), 2.70 (m, 1H), 2.29 (s, 3H), 1.94 (m, 2H), 1.79 (m, 1H)
A4	δ 8.23 (s, 1H), 7.35 (m, 1H), 7.26 (s, 1H), 7.08 (bs, 1H), 6.69 (d, J=8.1 Hz, 1H), 6.91 (d, J=8.3 Hz, 1H), 5.02 (m, 1H), 2.81 (m, 2H), 2.74 (m, 1H), 2.29 (s, 3H), 1.95 (m, 2H), 1.82 (m, 1H)
A5	δ 8.24 (s, 1H), 7.74 (m, 1H), 7.34 (m, 3H), 7.26 (s, 1H), 7.15 (bs, 1H), 5.10 (m, 1H), 2.82 (m, 2H), 2.70 (m, 1H), 2.29 (s, 3H), 1.95 (m, 3H)
A6	δ 8.21 (s, 1H), 7.35 (s, 2H), 7.24 (s, 1H), 6.98 (bs, 1H), 4.98 (m, 1H), 2.80 (m, 3H), 2.29 (s, 3H), 1.95 (m, 2H), 1.83 (m, 1H)
A7	δ 8.22 (s, 1H), 7.48 (d, J=7.7 Hz, 1H), 7.22 (m, 4H), 6.82 (bs, 1H), 5.03 (m, 1H), 2.81 (t, J=6.41 Hz, 2H), 2.71 (m, 1H), 2.52 (s, 3H), 2.29 (s, 3H), 1.94 (m, 2H), 1.78 (m, 1H)
A8	δ 8.22 (s, 1H), 7.26 (s, 1H), 7.19 (m, 1H), 7.13 (bs, 1H), 6.87 (m, 1H), 5.02 (m, 1H), 2.82 (t, J=6.4 Hz, 2H), 2.76 (m, 1H), 2.30 (s, 3H), 1.95 (m, 2H), 1.78 (m, 1H)
A9	δ 8.22 (s, 1H), 7.25 (m, 3H), 7.04 (t, J=8.4 Hz, 1H), 7.00 (bs, 1H), 5.02 (m, 1H), 2.82 (m, 3H), 2.27 (s, 3H), 1.95 (m, 2H), 1.82 (m, 1H)
A10	δ 8.23 (s, 1H), 7.24 (m, 2H), 6.79 (bs, 1H), 6.55 (m, 2H), 5.03 (m, 1H), 3.82 (s, 6H), 2.79 (m, 2H), 2.71 (m, 1H), 2.28 (s, 3H), 1.92 (m, 3H)
B1	δ 10.8 (s, 1H), 8.35 (m, 1H), 8.25 (s, 1H), 8.07 (s, 1H), 7.86 (m, 2H), 7.41 (m, 2H), 7.29 (m, 1H), 6.77 (m, 1H), 4.98 (m, 1H), 2.85 (m, 2H), 2.72 (m, 1H), 2.32 (s, 3H), 1.98 (m, 2H), 1.72 (m, 1H)
B2	δ 8.37 (m, 1H), 8.24 (s, 1H), 7.91 (m, 1H), 7.52 (m, 2H), 7.37 (m, 4H), 7.27 (s, 1H), 7.07 (m, 1H), 5.07 (m, 1H), 2.82 (m, 3H), 2.31 (s, 3H), 1.98 (m, 2H), 1.80 (m, 1H)

WO 02/091830

PCT/US02/18394

74

- B3  $\delta$  9.07 (bs, 1H), 8.51 (m, 1H), 8.24 (s, 1H), 7.90 (m, 1H), 7.28 (s, 1H), 7.05 (m, 1H), 5.03 (m, 1H), 2.83 (m, 2H), 2.72 (m, 1H), 2.55 (s, 3H), 2.30 (s, 3H), 1.97 (m, 2H), 1.86 (m, 1H)
- B4  $\delta$  8.81 (d, J=2.6 Hz, 1H), 8.24 (s, 1H), 8.12 (dd, J=2.6, 8.3 Hz, 1H), 7.56 (bs, 1H), 7.37 (d, J=8.3 Hz, 1H), 7.32 (s, 1H), 5.02 (m, 1H), 2.85 (m, 2H), 2.72 (m, 1H), 2.33 (s, 3H), 1.97 (m, 2H), 1.78 (m, 1H)
- B5  $\delta$  9.36 (bs, 1H), 8.67 (dd, J=1.9, 7.5 Hz, 1H), 8.21 (m, 1H), 8.15 (s, 1H), 7.44 (m, 1H), 7.23 (m, 6H), 5.12 (m, 1H), 2.80 (m, 3H), 2.25 (s, 3H), 1.95 (m, 2H), 1.74 (m, 1H)
- B6  $\delta$  9.03 (bs, 1H), 8.58 (dd, J=2.1, 7.5 Hz, 1H), 8.29 (s, 1H), 8.23 (dd, J=2.1, 4.9 Hz, 1H), 7.28 (s, 1H), 7.03 (dd, J=4.9, 7.5 Hz, 1H), 5.10 (m, 1H), 4.51 (m, 2H), 2.83 (m, 2H), 2.70 (m, 1H), 2.32 (s, 3H), 1.95 (m, 2H), 1.78 (m, 1H), 1.39 (t, J=7.1 Hz, 3H)
- B7  $\delta$  8.29 (d, J=5.4 Hz, 1H), 8.21 (s, 1H), 7.31 (d, J=5.4 Hz, 1H), 7.26 (s, 1H), 7.12 (bs, 1H), 5.02 (m, 1H), 2.82 (m, 3H), 2.29 (s, 3H), 1.97 (m, 2H), 1.84 (m, 1H)
- C1  $\delta$  8.50 (d, J=5.0 Hz, 1H), 8.24 (s, 1H), 7.73 (s, 1H), 7.61 (dd, J=1.5, 5.0 Hz, 1H), 7.50 (bs, 1H), 7.29 (s, 1H), 4.95 (m, 1H), 2.83 (t, J=6.5 Hz, 2H), 2.75 (m, 1H), 2.32 (s, 3H), 1.97 (m, 2H), 1.69 (m, 1H)
- C2  $\delta$  8.24 (s, 1H), 7.37 (bs, 1H), 7.29 (m, 2H), 7.05 (s, 1H), 4.91 (m, 1H), 3.96 (s, 3H), 2.82 (t, J=6.4 Hz, 2H), 2.73 (m, 1H), 2.32 (s, 3H), 1.95 (m, 2H), 1.65 (m, 1H)
- (d)-doublet, (t)-triplet, (q)-quartet, (m)-multiplet, (dd)-doublet of doublets, (dt)-doublet of triplets, (br s)-broad singlet.

#### BIOLOGICAL EXAMPLES OF THE INVENTION

- General protocol for preparing test suspensions: Test compounds are first dissolved in acetone in an amount equal to 3% of the final volume and then suspended at the desired concentration (in ppm) in acetone and purified water (50/50 mix) containing 250 ppm of the surfactant Trem® 014 (polyhydric alcohol esters). The resulting test suspensions are then used in the following tests. Spraying a 200 ppm test suspension to the point of run-off on the test plants is the equivalent of a rate of 500 g/ha.

#### TEST A

The test suspension was sprayed to the point of run-off on wheat seedlings. The following day the seedlings were inoculated with a spore dust of *Erysiphe graminis* f. sp. *tritici*, (the causal agent of wheat powdery mildew) and incubated in a growth chamber at 20 °C for 7 days, after which disease ratings were made.

#### TEST B

The test suspension was sprayed to the point of run-off on wheat seedlings. The following day the seedlings were inoculated with a spore suspension of *Puccinia recondita* (the causal agent of wheat leaf rust) and incubated in a saturated atmosphere at 20 °C for 24 hours, and then moved to a growth chamber at 20 °C for 6 days, after which disease ratings were made.

WO 02/091830

PCT/US02/18394

75

TEST C

The test suspension was sprayed to the point of run-off on tomato seedlings. The following day the seedlings were inoculated with a spore suspension of *Phytophthora infestans* (the causal agent of potato and tomato late blight) and incubated in a saturated atmosphere at 20 °C for 24 hours, and then moved to a growth chamber at 20 °C for 5 days, after which disease ratings were made.

TEST D

The test suspension was sprayed to the point of run-off on grape seedlings. The following day the seedlings were inoculated with a spore suspension of *Plasmopara viticola* (the causal agent of grape downy mildew) and incubated in a saturated atmosphere at 20 °C for 24 hours, moved to a growth chamber at 20 °C for 6 days, and then incubated in a saturated atmosphere at 20 °C for 24 hours, after which disease ratings were made.

Results for Tests A-D are given in Table A. In the table, a rating of 100 indicates 100% disease control and a rating of 0 indicates no disease control (relative to the controls). A dash (-) indicates no test results. ND indicates disease control not determined due to phytotoxicity.

Table A

Compound	Test A	Test B	Test C	Test D
A1	0	84	100	-
A2	0	18	5	-
A3	0	41	47	-
A4	0	0	90	-
A5	0	55	46	-
A6	0	9	82	-
A7	0	45	75	-
A8	0	55	100	-
A9	0	38	97	-
A10	-	-	-	-
B1	0	19	16	-
B2	-	-	-	-
B3	0	23	56	-
B4	0	9	32	-
B5	-	-	-	-
B6	-	-	-	-
B7	-	-	-	-
B8	0	19	47	-
C1	0	55	84	-
C2	95	28	18	-



WO 02/091830

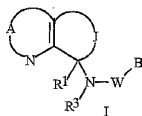
PCT/US02/18394

76

CLAIMS

What is claimed is:

1. A method for controlling plant diseases caused by fungal plant pathogens comprising applying to the plant or portion thereof, or to the plant seed or seedling, a fungicidally effective amount of a compound of Formula I, *N*-oxides, agriculturally suitable salts and compositions thereof:



wherein

- A is taken together with N-C=C to form a substituted fused pyridinyl ring;  
 B is a substituted phenyl or pyridinyl ring;  
 J is an optionally substituted linking chain of 2 to 5 members including at least one carbon member, optionally including one or two carbon members as C(=O), and optionally including one member selected from nitrogen and oxygen;  
 W is C=L or SO<sub>n</sub>;  
 L is O or S;  
 R<sup>1</sup> is H; or C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkynyl or C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> cycloalkyl, each optionally substituted;  
 R<sup>3</sup> is H; or C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkynyl or C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> cycloalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkylcarbonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkoxycarbonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkylaminocarbonyl or C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> dialkylaminocarbonyl; and  
 n is 1 or 2.
2. The method of Claim 1 wherein  
 A is taken together with N-C=C to form a fused pyridinyl ring substituted with one or two substituents independently selected from R<sup>5</sup>;  
 B is substituted with from one to three substituents independently selected from R<sup>6</sup>;  
 J is a linking chain of 2 to 5 members including at least one carbon member, optionally including one or two carbon members as C(=O), and optionally including one member selected from nitrogen or oxygen, optionally substituted with one or more substituents selected from the group consisting of C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> alkyl, halogen, CN, NO<sub>2</sub> and C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> alkoxy;  
 R<sup>1</sup> is H; or C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkynyl or C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> cycloalkyl, each optionally substituted with one or more substituents selected from the group

WO 02/091830

PCT/US02/18394

77

- consisting of halogen, CN, NO<sub>2</sub>, hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkylsulfonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkoxycarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkylamino, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> dialkylamino and C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> cycloalkylamino;
- 5 each R<sup>5</sup> and each R<sup>6</sup> is independently C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkynyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> cycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> haloalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> haloalkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> haloalkynyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> halocycloalkyl, halogen, CN, CO<sub>2</sub>H, CONH<sub>2</sub>, NO<sub>2</sub>, hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkylsulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalkylsulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkoxycarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkylamino, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> dialkylamino, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> cycloalkylamino, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkylcarbonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkoxycarbonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkylaminocarbonyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> dialkylaminocarbonyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> trialkylsilyl; or
- 10 each R<sup>5</sup> and each R<sup>6</sup> is independently a phenyl ring, a 5- or 6-membered heteroaromatic ring, a benzyl ring or a phenoxy ring, each ring optionally substituted with from one to three groups independently selected from R<sup>7</sup>; and
- 15 each R<sup>7</sup> is independently C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alkynyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> cycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalkynyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> halocycloalkyl, halogen, CN, NO<sub>2</sub>, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkylsulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkoxycarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkylamino, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> dialkylamino, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> cycloalkylamino, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> (alkyl)cycloalkylamino, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alkylcarbonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkoxycarbonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkylaminocarbonyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> dialkylaminocarbonyl or C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> trialkylsilyl.
- 20 3. The method of Claim 2 wherein
- W is C=O;
- 25 J is selected from -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-, -OCH<sub>2</sub>-, -OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-, -OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-, -CH<sub>2</sub>NHCH<sub>2</sub>-, -CH<sub>2</sub>N(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>alkyl)CH<sub>2</sub>-, -CONHCO- and -CON(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>alkyl)CO-; and
- 30 each R<sup>5</sup> and each R<sup>6</sup> is independently C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkynyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> cycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> haloalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> haloalkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> haloalkynyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> halocycloalkyl, halogen, CN, NO<sub>2</sub>, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkylsulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalkylsulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkoxycarbonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkylcarbonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkoxycarbonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkylaminocarbonyl or C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> dialkylaminocarbonyl.
- 35 4. The method of Claim 3 wherein
- B is a phenyl ring optionally substituted with from one to three substituents independently selected from R<sup>6</sup>;
- J is -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>- or -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-;

WO 02/091830

PCT/US02/18394

78

- each  $R^5$  is independently  $CH_3$ ,  $Cl$ ,  $Br$ ,  $I$ ,  $CN$ ,  $NO_2$ ,  $CF_3$ ,  $OCF_3$ ,  $OCHF_2$ ,  $SCF_3$ ,  $SCHF_2$ ,  $CO_2CH_3$  or  $CONHCH_3$ ; and
- each  $R^6$  is independently  $C_1-C_2$  alkyl,  $C_1-C_2$  haloalkyl, halogen,  $CN$ ,  $C_1-C_2$  alkoxy,  $C_1-C_2$  haloalkoxy,  $C_1-C_2$  alkylthio,  $C_1-C_2$  alkylsulfinyl or  $C_1-C_2$  alkylsulfonyl and at least one  $R^6$  is located in a position *ortho* to the link with  $W$ .
- 5     5. The method of Claim 3 wherein
- $B$  is a 3-pyridinyl or a 4-pyridinyl ring optionally substituted with from one to three substituents independently selected from  $R^6$ ;
- $J$  is  $-CH_2CH_2-$  or  $-CH_2CH_2CH_2-$ ;
- 10     each  $R^5$  is independently  $CH_3$ ,  $Cl$ ,  $Br$ ,  $I$ ,  $CN$ ,  $NO_2$ ,  $CF_3$ ,  $OCF_3$ ,  $OCHF_2$ ,  $SCF_3$ ,  $SCHF_2$ ,  $CO_2CH_3$  or  $CONHCH_3$ ; and
- each  $R^6$  is independently  $C_1-C_2$  alkyl,  $C_1-C_2$  haloalkyl, halogen,  $CN$ ,  $C_1-C_2$  alkoxy,  $C_1-C_2$  haloalkoxy,  $C_1-C_2$  alkylthio,  $C_1-C_2$  alkylsulfinyl or  $C_1-C_2$  alkylsulfonyl and at least one  $R^6$  is located in a position *ortho* to the link with  $W$ .
- 15     6. The method of Claim 5 wherein  $B$  is a 3-pyridinyl ring wherein one  $R^6$  is  $Cl$  located at the 2-position *ortho* to the link with  $C=O$ , another  $R^6$  is selected from  $Cl$  or methyl and is located at the 4-position *ortho* to the link with  $C=O$  and a third optional  $R^6$  is methyl at the 6-position.
7. The method of any of Claims 1 through 6 wherein  $R^1$  is  $H$  and  $R^3$  is  $H$ .
- 20     8. The method of Claim 1 comprising a compound selected from the group consisting of
- 2-chloro-6-methoxy-*N*-(5,6,7,8-tetrahydro-3-methyl-8-quinolinyl)-4-pyridinecarboxamide,
- 2,6-dichloro-*N*-(5,6,7,8-tetrahydro-3-methyl-8-quinolinyl)benzamide and
- 25     2,3,6-trifluoro-*N*-(5,6,7,8-tetrahydro-3-methyl-8-quinolinyl)benzamide.
9. A compound of Formula I of Claim 1, *N*-oxides, agriculturally suitable salts thereof, provided that when  $B$  is a substituted phenyl ring,  $W$  is  $C=O$  or  $SO_2$ ,  $R^3$  is  $H$  and  $J$  is a saturated chain of from 2 to 4 carbons that is either unsubstituted or substituted with from one to three substituents selected from the group consisting of alkyl, alkoxy, aryl or aralkyl,
- 30     then the compound is an *N*-oxide.
10. The compound of Claim 9 wherein
- $A$  is taken together with  $N-C=C$  to form a fused pyridinyl ring substituted with one or two substituents independently selected from  $R^5$ ;
- $B$  is substituted with from one to three substituents independently selected from  $R^6$ ;
- 35      $J$  is a linking chain of 2 to 5 members including at least one carbon member, optionally including one or two carbon members as  $C(=O)$ , and optionally including one member selected from nitrogen or oxygen, optionally substituted with one or

WO 02/091830

PCT/US02/18394

79

more substituents selected from the group consisting of C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> alkyl, halogen, CN, NO<sub>2</sub> and C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> alkoxy;

R<sup>1</sup> is H; or C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkynyl or C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> cycloalkyl, each optionally substituted with one or more substituents selected from the group consisting of halogen, CN, NO<sub>2</sub>, hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkylsulfonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alkoxycarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkylamino, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> dialkylamino and C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> cycloalkylamino;

each R<sup>5</sup> and each R<sup>6</sup> is independently C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkynyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> cycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> haloalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> haloalkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> haloalkynyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> halocycloalkyl, halogen, CN, CO<sub>2</sub>H, CONH<sub>2</sub>, NO<sub>2</sub>, hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkylsulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalkylsulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkoxycarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkylamino, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> dialkylamino, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> cycloalkylamino, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkylcarbonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkoxycarbonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkylaminocarbonyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> dialkylaminocarbonyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> trialkylsilyl; or

each R<sup>5</sup> and each R<sup>6</sup> is independently a phenyl ring, a 5- or 6-membered heteroaromatic ring, a benzyl ring or a phenoxy ring, each ring optionally substituted with from one to three groups independently selected from R<sup>7</sup>; and

each R<sup>7</sup> is independently C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alkynyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> cycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalkynyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> halocycloalkyl, halogen, CN, NO<sub>2</sub>, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkylsulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkoxycarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkylamino, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> dialkylamino, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> cycloalkylamino, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> (alkyl)cycloalkylamino, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alkylcarbonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkoxycarbonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkylaminocarbonyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> dialkylaminocarbonyl or C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> trialkylsilyl.

11. The compound of Claim 10 wherein

W is C=O;

J is selected from -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-, -OCH<sub>2</sub>-, -OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-, -OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-, -CH<sub>2</sub>NHCH<sub>2</sub>-,

-CH<sub>2</sub>N(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>alkyl)CH<sub>2</sub>-, -CONHCO- and -CON(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> alkyl)CO-; and

each R<sup>5</sup> and each R<sup>6</sup> is independently C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkynyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> cycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> haloalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> haloalkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> haloalkynyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> halocycloalkyl, halogen, CN, NO<sub>2</sub>, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkylsulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalkylsulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkoxycarbonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkylcarbonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkoxycarbonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkylaminocarbonyl or C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> dialkylaminocarbonyl.

WO 02/091830

PCT/US02/18394

80

12. The compound of Claim 11 wherein  
 B is a phenyl ring optionally substituted with from one to three substituents  
 independently selected from R<sup>6</sup>;  
 J is -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>- or -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-;  
 each R<sup>5</sup> is independently CH<sub>3</sub>, Cl, Br, I, CN, NO<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, OCF<sub>3</sub>, OCHF<sub>2</sub>, SCF<sub>3</sub>,  
 SCHF<sub>2</sub>, CO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub> or CONHCH<sub>3</sub>; and  
 each R<sup>6</sup> is independently C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> haloalkyl, halogen, CN, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> alkoxy,  
 C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> haloalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> alkylsulfinyl or C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> alkylsulfonyl  
 and at least one R<sup>6</sup> is located in a position *ortho* to the link with W.
13. The compound of Claim 11 wherein  
 B is a 3-pyridinyl or a 4-pyridinyl ring optionally substituted with from one to three  
 substituents independently selected from R<sup>6</sup>;  
 J is -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>- or -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-;  
 each R<sup>5</sup> is independently CH<sub>3</sub>, Cl, Br, I, CN, NO<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, OCF<sub>3</sub>, OCHF<sub>2</sub>, SCF<sub>3</sub>,  
 SCHF<sub>2</sub>, CO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub> or CONHCH<sub>3</sub>; and  
 each R<sup>6</sup> is independently C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> haloalkyl, halogen, CN, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> alkoxy,  
 C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> haloalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> alkylsulfinyl or C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> alkylsulfonyl  
 and at least one R<sup>6</sup> is located in a position *ortho* to the link with W.
14. The compound of Claim 13 wherein B is a 3-pyridinyl ring wherein one R<sup>6</sup> is Cl  
 located at the 2-position *ortho* to the link with C=O, another R<sup>6</sup> is selected from Cl or methyl  
 and is located at the 4-position *ortho* to the link with C=O and a third optional R<sup>6</sup> is methyl  
 at the 6-position.
15. The compound of any of Claims 9 through 14 wherein R<sup>1</sup> is H and R<sup>3</sup> is H.
16. The compound of Claim 9 that is  
 2-chloro-6-methoxy-N-(5,6,7,8-tetrahydro-3-methyl-8-quinoliny)-4-pyridinecarboxamide.
17. A composition comprising (a) at least one compound of Formula I of Claim 1;  
 and  
 (b) at least one compound selected from the group consisting of  
 (b1) alkylenebis(dithiocarbamate) fungicides; (b2) compounds acting at the *bc*<sub>1</sub> complex of  
 the fungal mitochondrial respiratory electron transfer site; (b3) cymoxanil; (b4) compounds  
 acting at the demethylase enzyme of the sterol biosynthesis pathway; (b5) morpholine and  
 piperidine compounds that act on the sterol biosynthesis pathway; (b6) phenylamide  
 fungicides; (b7) pyrimidinone fungicides; (b8) phthalimides; and (b9) fosetyl-aluminum.
18. The composition of Claim 19 wherein component (b) comprises at least one  
 compound from each of two different groups selected from (b1), (b2), (b3), (b4), (b5), (b6),  
 (b7), (b8) and (b9).

## 【国際調査報告】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT		Inter. I Application No. PCT/US 02/18394
<b>A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER</b> IPC 7 A01N43/42 A01N43/90 C07D215/40 C07D401/12 C07D221/04 C07D471/04 C07D491/04		
According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC		
<b>B. FIELDS SEARCHED</b> Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) IPC 7 A01N C07D		
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 practical, search terms used) EPO-Internal, WPI Data		
<b>C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT</b>		
Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	WO 96 37473 A (HOECHST SCHERING AGREVO GMBH ; JAKOBI HARALD (DE); SCHAPER WOLFGANG) 28 November 1996 (1996-11-28) claim 1	1,9
A	EP 0 378 308 A (SCHERING AGROCHEMICALS LTD) 18 July 1990 (1990-07-18) page 8 -page 13 claim 1	1,9
A	WO 99 42447 A (MOLONEY BRIAN ANTHONY ; SAVILLE STONES ELIZABETH ANNE (GB); AGREVO) 26 August 1999 (1999-08-26) cited in the application page 15 -page 25; table 1 claim 1	1
<input type="checkbox"/> Further documents are listed in the continuation of box C. <input checked="" type="checkbox"/> Patent family members are listed in 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 document 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 26 September 2002		Date of mailing of the international search report 07/10/2002
Name and mailing address of the ISA European Patent Office, P.B. 5818 Patentkan 2 NL - 2280 LV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl Fax: (+31-70) 340-3016		Authorized officer Fanni, S

INTERNATIONAL SEARCH REPORT				Inter. Application No. PCT/US 02/18394	
Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)		Publication date
WO 9637473	A	28-11-1996	WO AU	9637473 A1 2616595 A	28-11-1996 11-12-1996
EP 0378308	A	18-07-1990	AT AU AU BR CA CN DD DE DK EP ES FI GR HU IE IL JP JP PT TR US US ZA	136543 T 628469 B2 4780090 A 9000089 A 2007607 A1 1044097 A ,B 291467 A5 69026395 D1 378308 T3 0378308 A1 2088410 T3 900146 A ,B 3020140 T3 52915 A2 72965 B1 92992 A 2288806 A 2846911 B2 92824 A ,B 24332 A 5510344 A 5332752 A 9000138 A	15-04-1996 17-09-1992 19-07-1990 16-10-1990 11-07-1990 25-07-1990 04-07-1991 15-05-1996 05-08-1996 18-07-1990 16-08-1996 12-07-1990 31-08-1996 28-09-1990 07-05-1997 24-06-1994 28-11-1990 13-01-1999 31-07-1990 01-09-1991 23-04-1996 26-07-1994 30-10-1991
WO 9942447	A	26-08-1999	AU AU BR CA CN CZ EP WO HU JP NO PL SI SK TR TR ZA	751032 B2 2527199 A 9908007 A 2319005 A1 1291187 T 20002993 A3 1056723 A1 9942447 A1 0100817 A2 2002503723 T 20004159 A 342376 A1 20356 A 12392000 A3 200002395 T2 200101071 T2 9901292 A	08-08-2002 06-09-1999 30-01-2001 26-08-1999 11-04-2001 14-11-2001 06-12-2000 26-08-1999 30-07-2001 05-02-2002 17-10-2000 04-06-2001 30-04-2001 12-03-2001 21-11-2000 21-06-2002 13-09-1999

---

フロントページの続き

(81)指定国 AP(GH,GM,KE,LS,MW,MZ,SD,SL,SZ,TZ,UG,ZM,ZW),EA(AM,AZ,BY,KG,KZ,MD,RU,TJ,TM),EP(AT, BE,CH,CY,DE,DK,ES,FI,FR,GB,GR,IE,IT,LU,MC,NL,PT,SE,TR),OA(BF,BJ,CF,CG,CI,CM,GA,GN,GQ,GW,ML,MR,NE,SN, TD,TG),AE,AG,AL,AM,AT,AU,AZ,BA,BB,BG,BR,BY,BZ,CA,CH,CN,CO,CR,CU,CZ,DE,DK,DM,DZ,EC,EE,ES,FI,GB,GD,GE, GH,GM,HR,HU,ID,IL,IN,IS,JP,KE,KG,KP,KR,KZ,LC,LK,LR,LS,LT,LU,LV,MA,MD,MG,MK,MN,MW,MX,MZ,NO,NZ,OM,PH,P L,PT,RO,RU,SD,SE,SG,SI,SK,SL,TJ,TM,TN,TR,TT,TZ,UA,UG,US,UZ,VN,YU,ZA,ZM,ZW

Fターム(参考) 4H011 AA01 BA01 BB09 BC03 BC05 BC07 BC18 BC19 BC20 DA02  
DA03 DA15 DH03 DH07 DH10 DH13

## 【要約の続き】

はN - オキシドであることを条件とする、式Iで表される化合物、それらのN - オキシドおよび農業的に適する塩も包含する。