

(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2017-522268

(P2017-522268A)

(43) 公表日 平成29年8月10日 (2017.8.10)

(51) Int.Cl.	F I	テーマコード (参考)
C O 7 D 237/16 (2006.01)	C O 7 D 237/16	4 H O 1 1
A O 1 N 43/58 (2006.01)	A O 1 N 43/58	C
A O 1 P 13/02 (2006.01)	A O 1 P 13/02	D
	A O 1 N 43/58	

審査請求 未請求 予備審査請求 未請求 (全 99 頁)

(21) 出願番号	特願2016-568390 (P2016-568390)	(71) 出願人	507203353
(86) (22) 出願日	平成27年5月19日 (2015.5.19)		バイエル・クロップサイエンス・アクチェンゲゼルシャフト
(85) 翻訳文提出日	平成29年1月13日 (2017.1.13)		ドイツ国、40789・モンハイム・アム・ライン、アルフレート・ノベール・シュトラッセ・50
(86) 国際出願番号	PCT/EP2015/060934	(74) 代理人	100114188
(87) 国際公開番号	W02015/177108		弁理士 小野 誠
(87) 国際公開日	平成27年11月26日 (2015.11.26)	(74) 代理人	100119253
(31) 優先権主張番号	14169229.3		弁理士 金山 賢敦
(32) 優先日	平成26年5月21日 (2014.5.21)	(74) 代理人	100124855
(33) 優先権主張国	欧州特許庁 (EP)		弁理士 坪倉 道明
		(74) 代理人	100129713
			弁理士 重森 一輝

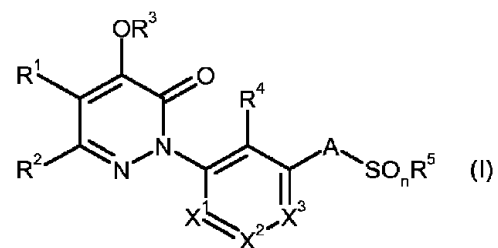
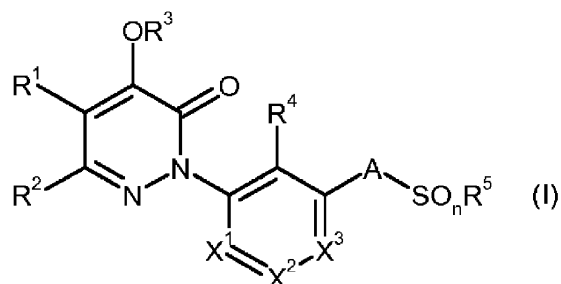
最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 2- (ヘテロ) アリール-ピリダジノン類及び除草剤としてのそれらの使用

(57) 【要約】

本発明は、除草剤としての、一般式 (I) で表される 2- (ヘテロ) アリール-ピリダジノンに関する。式 (I) において、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 及び R^5 は、水素、有機基 (例えば、アルキル) 及び別の基 (例えば、ハロゲン) などの基を表す。 X^1 、 X^2 及び X^3 は、窒素又は置換されていてもよい炭素原子を表す。

【化1】

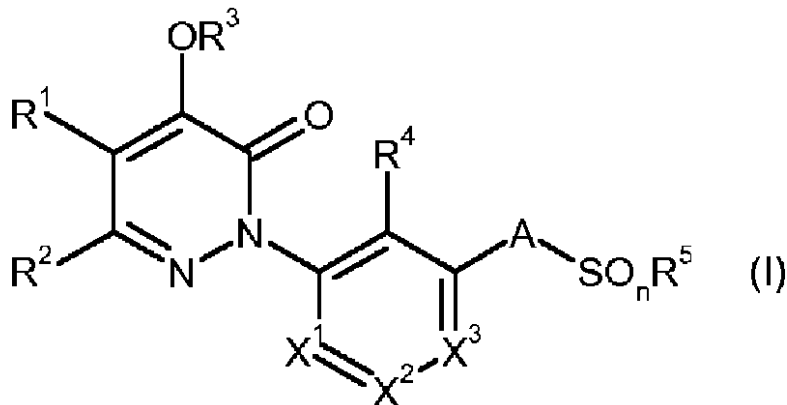


【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I)

【化 1】



〔式中、

R^1 は、水素、ハロゲン、シアノ、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル、 $(C_3 - C_6)$ - シクロアルキル、 $(C_2 - C_6)$ - アルケニル、 $(C_4 - C_6)$ - シクロアルケニル、 $(C_2 - C_6)$ - アルキニル、ハロ- $(C_1 - C_6)$ - アルキル、 $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ、 $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ- $(C_1 - C_3)$ - アルキル、 $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ- $(C_2 - C_6)$ - アルコキシ、 $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ- $(C_2 - C_6)$ - アルコキシ- $(C_1 - C_3)$ - アルキル、 $(C_3 - C_6)$ - シクロアルキル- $(C_1 - C_3)$ - アルキル、アミノ、 $(C_1 - C_6)$ - アルキルアミノ、ジ- $(C_1 - C_6)$ - アルキルアミノ、 $(C_1 - C_3)$ - アルキル- $(O)C$ -アミノ- $(C_1 - C_4)$ - アルキル、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル- $(O)_nS$ 、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル- $(O)_nS$ - $(C_1 - C_3)$ - アルキル、ハロ- $(C_1 - C_6)$ - アルキル- $(O)_nS$ 又はハロ- $(C_1 - C_6)$ - アルキル- $(O)_nS$ - $(C_1 - C_3)$ - アルキルを表し；

R^2 は、水素、ヒドロキシ、ハロゲン、ニトロ、アミノ、シアノ、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル、 $(C_1 - C_3)$ - アルコキシ、 $(C_3 - C_6)$ - シクロアルキル、 $(C_2 - C_6)$ - アルケニル、 $(C_2 - C_6)$ - アルキニル、ハロ- $(C_1 - C_6)$ - アルキル、 $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ- $(C_1 - C_3)$ - アルキル、 $(C_3 - C_6)$ - シクロアルキル- $(C_1 - C_3)$ - アルキル、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル- $(O)_nS$ 、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル- $(O)_nS$ - $(C_1 - C_3)$ - アルキル、ハロ- $(C_1 - C_6)$ - アルキル- $(O)_nS$ 、ハロ- $(C_1 - C_6)$ - アルキル- $(O)_nS$ - $(C_1 - C_3)$ - アルキル、 $(C_1 - C_3)$ - アルキルアミノ又はジ- $(C_1 - C_3)$ - アルキルアミノを表し；

R^3 は、水素、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル- $(O)C$ 、アリール- $(O)C$ 、 $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ- $(O)C$ 、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル- $(O)_nS$ 、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル- $(O)_nS$ $(O)C$ 又はアリール- $(O)_nS$ を表し、ここで、該アリール基は、いずれの場合にも、 s 個の基 R^9 で置換されており；

R^4 は、ヒドロキシ、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル、 $(C_3 - C_6)$ - シクロアルキル、ハロ- $(C_1 - C_6)$ - アルキル、 $(C_2 - C_6)$ - アルケニル、ハロ- $(C_2 - C_6)$ - アルケニル、 $(C_2 - C_6)$ - アルキニル、 $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ、 $(C_2 - C_6)$ - アルケニルオキシ、 $(C_3 - C_6)$ - シクロアルキル- $(C_1 - C_3)$ - アルキル、 $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ- $(C_1 - C_3)$ - アルキル、 $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ- $(C_2 - C_6)$ - アルコキシ、 $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ- $(C_2 - C_6)$ - アルコキシ- $(C_1 - C_3)$ - アルキル、ハロ- $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ、ハロ- $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ- $(C_1 - C_3)$ - アルキル、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル- $(O)_nS$ 、ハロ- $(C_1 - C_6)$ - アルキル- $(O)_nS$ 、アリール、アリール- $(O)_nS$ 、ヘテロシクリル、ヘテロシクリル- $(O)_nS$ 、アリール

オキシ、アリールー ($C_2 - C_6$) - アルキル、アリールー ($C_1 - C_6$) - アルコキシ、ヘテロシクリルオキシ、ヘテロシクリルー ($C_1 - C_3$) - アルコキシ ($C_1 - C_3$) - アルキル、 $HO(O)C$ 、 $HO(O)C - (C_1 - C_3)$ - アルコキシ、($C_1 - C_3$) - アルコキシ (O) C 、($C_1 - C_3$) - アルコキシ (O) $C - (C_1 - C_3)$ - アルコキシ、($C_1 - C_3$) - アルキルアミノ、ジ ($C_1 - C_3$) - アルキルアミノ、($C_1 - C_3$) - アルキルアミノ (O) $_n S$ 、($C_1 - C_3$) - アルキルアミノ (O) $_n S - (C_1 - C_3)$ - アルキル、ジ ($C_1 - C_3$) - アルキルアミノ (O) $_n S$ 、ジ ($C_1 - C_3$) - アルキルアミノ (O) $_n S - (C_1 - C_3)$ - アルキル、($C_1 - C_3$) - アルキルアミノ (O) C 、($C_1 - C_3$) - アルキルアミノ (O) $C - (C_1 - C_3)$ - アルキル、ジ ($C_1 - C_3$) - アルキルアミノ (O) C 、ジ ($C_1 - C_3$) - アルキルアミノ (O) $C - (C_1 - C_3)$ - アルキル、($C_1 - C_3$) - アルキル (O) $C - アミノ$ 、($C_1 - C_3$) - アルキル (O) $_n S - アミノ$ 、($C_1 - C_3$) - アルキル (O) $_n S - (C_1 - C_3)$ - アルキルアミノ又は ($C_1 - C_3$) - アルキル (O) $_n S - アミノ - (C_1 - C_3)$ - アルキルを表し、ここで、該ヘテロシクリル基及びアリール基は、($C_1 - C_3$) - アルキル、ハロー ($C_1 - C_3$) - アルキル、($C_1 - C_3$) - アルコキシ、ハロー ($C_1 - C_3$) - アルコキシ、フェニル、シアノ、ニトロ及びハロゲンからなる群から選択される s 個の基で置換されており；

A は、直接結合又は ($C_1 - C_4$) - アルキレンを表し、ここで、($C_1 - C_4$) - アルキレンの中のメチレン基は、互いに独立して、ハロゲン、($C_1 - C_4$) - アルキル、ハロー ($C_1 - C_4$) - アルキル、($C_1 - C_4$) - アルコキシ、ハロー ($C_1 - C_4$) - アルコキシ又は ($C_1 - C_4$) - アルコキシ ($C_1 - C_4$) - アルキルからなる群から選択される n 個の基を有することができ；

R^5 は、($C_1 - C_6$) - アルキル、($C_3 - C_6$) - シクロアルキル、($C_3 - C_6$) - シクロアルキル ($C_1 - C_6$) - アルキル、($C_1 - C_6$) - アルコキシ ($C_1 - C_6$) - アルキルを表し；

X^1 は、 N 又は CR^6 を表し；

X^2 は、 N 又は CR^7 を表し；

X^3 は、 N 又は CR^8 を表し；

R^6 は、水素、ハロゲン、($C_1 - C_3$) - アルキル、($C_1 - C_3$) - アルコキシ、($C_2 - C_3$) - アルケニル、($C_2 - C_3$) - アルキニル、ハロー ($C_1 - C_3$) - アルキル、ハロー ($C_1 - C_3$) - アルコキシを表し；

R^7 は、水素、ハロゲン、($C_1 - C_3$) - アルキルを表し；

R^8 は、水素、ヒドロキシ、ハロゲン、シアノ、ニトロ、($C_1 - C_6$) - アルキル、($C_3 - C_6$) - シクロアルキル、ハロー ($C_1 - C_6$) - アルキル、($C_2 - C_6$) - アルケニル、ハロー ($C_2 - C_6$) - アルケニル、($C_2 - C_6$) - アルキニル、($C_1 - C_6$) - アルコキシ、($C_2 - C_6$) - アルケニルオキシ、($C_3 - C_6$) - シクロアルキル ($C_1 - C_3$) - アルキル、($C_1 - C_6$) - アルコキシ ($C_1 - C_3$) - アルキル、($C_1 - C_6$) - アルコキシ ($C_2 - C_6$) - アルコキシ、($C_1 - C_6$) - アルコキシ ($C_2 - C_6$) - アルコキシ ($C_1 - C_3$) - アルキル、ハロー ($C_1 - C_6$) - アルコキシ、ハロー ($C_1 - C_6$) - アルコキシ ($C_1 - C_3$) - アルキル、($C_1 - C_6$) - アルキル (O) $_n S$ 、ハロー ($C_1 - C_6$) - アルキル (O) $_n S$ 、アリール、アリール (O) $_n S$ 、ヘテロシクリル、ヘテロシクリル (O) $_n S$ 、アリールオキシ、アリール ($C_2 - C_6$) - アルキル、アリール ($C_1 - C_6$) - アルコキシ、ヘテロシクリルオキシ、ヘテロシクリル ($C_1 - C_3$) - アルコキシ ($C_1 - C_3$) - アルキル、 $HO(O)C$ 、 $HO(O)C - (C_1 - C_3)$ - アルコキシ、($C_1 - C_3$) - アルコキシ (O) C 、($C_1 - C_3$) - アルコキシ (O) $C - (C_1 - C_3)$ - アルコキシ、($C_1 - C_3$) - アルキルアミノ、ジ ($C_1 - C_3$) - アルキルアミノ、($C_1 - C_3$) - アルキルアミノ (O) $_n S$ 、($C_1 - C_3$) - アルキルアミノ (O) $_n S - (C_1 - C_3)$ - アルキル、ジ ($C_1 - C_3$) - アルキルアミノ (O) $_n S$ 、ジ ($C_1 - C_3$) - アルキルアミノ (O) $_n S - (C_1 - C_3)$ - アルキ

10

20

30

40

50

ル、 $(C_1 - C_3)$ - アルキルアミノ - $(O) C$ 、 $(C_1 - C_3)$ - アルキルアミノ - $(O) C - (C_1 - C_3)$ - アルキル、ジ - $(C_1 - C_3)$ - アルキルアミノ - $(O) C$ 、ジ - $(C_1 - C_3)$ - アルキルアミノ - $(O) C - (C_1 - C_3)$ - アルキル、 $(C_1 - C_3)$ - アルキル - $(O) C$ - アミノ、 $(C_1 - C_3)$ - アルキル - $(O)_n S$ - アミノ、 $(C_1 - C_3)$ - アルキル - $(O)_n S - (C_1 - C_3)$ - アルキルアミノ又は $(C_1 - C_3)$ - アルキル - $(O)_n S$ - アミノ - $(C_1 - C_3)$ - アルキルを表し、ここで、該ヘテロシクリル基及びアリール基は、 $(C_1 - C_3)$ - アルキル、ハロ - $(C_1 - C_3)$ - アルキル、 $(C_1 - C_3)$ - アルコキシ、ハロ - $(C_1 - C_3)$ - アルコキシ、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル - $(O)_n S$ 、フェニル、シアノ、ニトロ及びハロゲンからなる群から選択される s 個の基で置換されており；

10

又は、

R^7 と R^8 は、それらが結合している炭素原子と一緒に、5員又は6員の不飽和環（ここで、該環は、 s 個の窒素原子を含んでおり、及び、 s 個の基 R^{10} で置換されている）を表し；

R^9 は、ハロゲン、 $(C_1 - C_3)$ - アルキル、ハロ - $(C_1 - C_3)$ - アルキル、 $(C_1 - C_6)$ - アルコキシを表し；

R^{10} は、シアノ、ハロゲン、 $(C_1 - C_3)$ - アルキル - $(O)_n S$ 、 $(C_1 - C_3)$ - アルキル、 $(C_2 - C_3)$ - アルケニル、 $(C_2 - C_3)$ - アルキニル、ハロ - $(C_1 - C_3)$ - アルキル又はモルホリニルを表し；

n は、0、1又は2を表し；

20

s は、0、1、2又は3を表す；

但し、 A が直接結合を表す場合、 R^5 は、 $(C_1 - C_6)$ - アルキルを表すことはない] で表される 2 - (ヘテロ) アリールピリダジノン又はその塩。

【請求項 2】

R^1 は、水素、ハロゲン、シアノ、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル、 $(C_3 - C_6)$ - シクロアルキル、 $(C_2 - C_6)$ - アルケニル、 $(C_2 - C_6)$ - アルキニル、ハロ - $(C_1 - C_6)$ - アルキル、 $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ - $(C_1 - C_3)$ - アルキル、 $(C_3 - C_6)$ - シクロアルキル - $(C_1 - C_3)$ - アルキル、アミノ又は $(C_1 - C_6)$ - アルキル - $(O)_n S$ を表し；

R^2 は、水素、ハロゲン、シアノ、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル、 $(C_2 - C_6)$ - アルケニル、 $(C_2 - C_6)$ - アルキニル、ハロ - $(C_1 - C_6)$ - アルキル又は $(C_1 - C_6)$ - アルキル - $(O)_n S$ を表し；

30

R^3 は、水素を表し；

R^4 は、ヒドロキシ、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル、 $(C_3 - C_6)$ - シクロアルキル、ハロ - $(C_1 - C_6)$ - アルキル、 $(C_2 - C_6)$ - アルケニル、 $(C_2 - C_6)$ - アルキニル、 $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ、 $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ - $(C_1 - C_3)$ - アルキル、 $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ - $(C_2 - C_6)$ - アルコキシ、 $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ - $(C_2 - C_6)$ - アルコキシ - $(C_1 - C_3)$ - アルキル、ハロ - $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ、ハロ - $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ - $(C_1 - C_3)$ - アルキル、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル - $(O)_n S$ 、ハロ - $(C_1 - C_6)$ - アルキル - $(O)_n S$ 、アリール、ヘテロシクリル、アリールオキシ、ヘテロシクリル - $(C_1 - C_3)$ - アルコキシ - $(C_1 - C_3)$ - アルキル、 $(C_1 - C_3)$ - アルキルアミノ、ジ - $(C_1 - C_3)$ - アルキルアミノ、 $(C_1 - C_3)$ - アルキルアミノ - $(O)_n S$ 、 $(C_1 - C_3)$ - アルキルアミノ - $(O)_n S - (C_1 - C_3)$ - アルキル、ジ - $(C_1 - C_3)$ - アルキルアミノ - $(O)_n S$ 、ジ - $(C_1 - C_3)$ - アルキルアミノ - $(O)_n S - (C_1 - C_3)$ - アルキル、 $(C_1 - C_3)$ - アルキルアミノ - $(O) C$ 、ジ - $(C_1 - C_3)$ - アルキルアミノ - $(O) C$ 、ジ - $(C_1 - C_3)$ - アルキルアミノ - $(O) C - (C_1 - C_3)$ - アルキル、 $(C_1 - C_3)$ - アルキル - $(O) C$ - アミノ又は $(C_1 - C_3)$ - アルキル - $(O)_n S$ - アミノを表し、ここで、該ヘテロシクリル基及びアリール基は、 $(C_1 - C_3)$ - アルキル、ハロ - $(C_1 - C_3)$ - アル

40

50

キル、 $(C_1 - C_3)$ - アルコキシ、ハロー $(C_1 - C_3)$ - アルコキシ、シアノ、ニトロ及びハロゲンからなる群から選択される s 個の基で置換されており；

A は、直接結合又は $(C_1 - C_4)$ - アルキレンを表し；

R^5 は、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル、 $(C_3 - C_6)$ - シクロアルキル、 $(C_3 - C_6)$ - シクロアルキル - $(C_1 - C_6)$ - アルキル、 $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ - $(C_1 - C_6)$ - アルキルを表し；

X^1 は、 CR^6 表し；

X^2 は、 CR^7 表し；

X^3 は、 CR^8 表し；

R^6 及び R^7 は、互いに独立して、水素、ハロゲン又は $(C_1 - C_3)$ - アルキルを表し；

10

R^8 は、水素、ハロゲン、ニトロ、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル、 $(C_3 - C_6)$ - シクロアルキル、ハロー $(C_1 - C_6)$ - アルキル、 $(C_2 - C_6)$ - アルケニル、ハロー $(C_2 - C_6)$ - アルケニル、 $(C_2 - C_6)$ - アルキニル、 $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ、 $(C_2 - C_6)$ - アルケニルオキシ、 $(C_3 - C_6)$ - シクロアルキル - $(C_1 - C_3)$ - アルキル、 $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ - $(C_1 - C_3)$ - アルキル、 $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ - $(C_2 - C_6)$ - アルコキシ、ハロー $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル - $(O)_n S$ 又はフェニルを表し、ここで、該フェニル基は、 $(C_1 - C_3)$ - アルキル、ハロー $(C_1 - C_3)$ - アルキル、 $(C_1 - C_3)$ - アルコキシ、ハロー $(C_1 - C_3)$ - アルコキシ、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル - $(O)_n S$ 、フェニル、シアノ、ニトロ及びハロゲンからなる群から選択される s 個の基で置換されており；

20

n は、0、1 又は 2 を表し；

s は、0、1、2 又は 3 を表す；

請求項 1 に記載の 2 - (ヘテロ) アリールピリダジノン。

【請求項 3】

R^1 は、水素、アミノ、塩素、臭素、シアノ、メチル、エチル、イソプロピル、シクロプロピル、ビニル、プロパルギル、イソプロペニル又はメチル - $(O)_n S$ を表し；

R^2 は、水素、ハロゲン又は $(C_1 - C_6)$ - アルキルを表し；

R^3 は、水素を表し；

30

R^4 は、フッ素、塩素、シアノ、ニトロ、メチル、トリフルオロメチル、2 - フルオロエチル、メトキシエトキシメチル、トリフルオロメトキシメチル、メチル - $(O)_n S$ 、アリール、イソオキサゾリニル、モルホリニル又はメチル - $(O)_n S$ - アミノを表し、ここで、該ヘテロシクリル基及びアリール基は、メチル、トリフルオロメチル及び塩素からなる群から選択される s 個の基で置換されており；

A は、直接結合又は $(C_1 - C_4)$ - アルキレンを表し；

R^5 は、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル、 $(C_3 - C_6)$ - シクロアルキル、 $(C_3 - C_6)$ - シクロアルキル - $(C_1 - C_6)$ - アルキル、 $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ - $(C_1 - C_6)$ - アルキルを表し；

X^1 は、 CR^6 を表し；

40

X^2 は、 CR^7 を表し；

X^3 は、 CR^8 を表し；

R^6 及び R^7 は、水素を表し；

R^8 は、水素、ハロゲン、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル、ハロー $(C_1 - C_6)$ - アルキル、 $(C_2 - C_6)$ - アルケニル、 $(C_2 - C_6)$ - アルキニル又は $(C_1 - C_6)$ - アルキル - $(O)_n S$ を表し；

n は、0、1 又は 2 を表し；

s は、0、1、2 又は 3 を表す；

請求項 1 又は 2 に記載の 2 - (ヘテロ) アリールピリダジノン。

【請求項 4】

50

R¹ は、メチル又はビニルを表し；

R² は、水素を表し；

R³ は、水素を表し；

R⁴ は、メチル、塩素、トリフルオロメチル又はメチルー（O）_n Sを表し；

A は、直接結合、 $-\text{CH}_2-$ 又は $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ を表し；

R⁵ は、メチル、エチル、シクロプロピル、シクロプロピルメチル、メトキシエチルを表し；

X¹ は、CR⁶を表し；

X² は、CR⁷を表し；

X³ は、CR⁸を表し；

10

R⁶ 及び R⁷ は、水素を表し；

R⁸ は、メチル、エチル、塩素、トリフルオロメチル又はメチルー（O）_n Sを表し；

n は、0、1 又は 2 を表す；

請求項 1～3 のいずれかに記載の 2-（ヘテロ）アリールピリダジノン。

【請求項 5】

除草剤組成物であって、除草活性を示す含有量の請求項 1～4 のいずれかに記載の式（I）で表される少なくとも 1 種類の化合物を含むことを特徴とする、前記除草剤組成物。

【請求項 6】

製剤助剤と混合されている、請求項 5 に記載の除草剤組成物。

【請求項 7】

20

殺虫剤、殺ダニ剤、除草剤、殺菌剤、薬害軽減剤及び成長調節剤からなる群から選択される少なくとも 1 種類のさらなる殺有害生物活性物質を含んでいる、請求項 5 又は 6 に記載の除草剤組成物。

【請求項 8】

望ましくない植物を防除する方法であって、有効量の請求項 1～4 のいずれかに記載の式（I）で表される少なくとも 1 種類の化合物又は請求項 5～7 のいずれかに記載の除草剤組成物を、当該植物に施用すること又は当該望ましくない植物の生育環境に施用することを特徴とする、前記方法。

【請求項 9】

望ましくない植物を防除するための、請求項 1～4 のいずれかに記載の式（I）で表される化合物又は請求項 5～7 のいずれかに記載の除草剤組成物の使用。

30

【請求項 10】

式（I）で表される化合物が有用な植物の作物の中の望ましくない植物を防除するために使用されることを特徴とする、請求項 9 に記載の使用。

【請求項 11】

前記有用な植物が有用なトランスジェニック植物であることを特徴とする、請求項 10 に記載の使用。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

40

本発明は、除草剤の技術分野、特に、有用な植物の作物の中の広葉雑草及びイネ科雑草を選択的に防除するための除草剤の技術分野に関する。

【背景技術】

【0002】

WO 2013/083774A1 には、除草剤としてのピリダジノン類が開示されている。該刊行物に記載されているのは、特に、ヘテロアリール環の特定の位置にとりわけスルホニル基を有しているピリダジノン類である。しかしながら、これらの活性成分は、有害な植物に対して必ずしも十分な活性を示さず、及び／又は、一部の活性成分は、穀類種、トウモロコシ及びイネなどの一部の重要な作物植物との十分な適合性を有していない。

50

【先行技術文献】

【特許文献】

【0003】

【特許文献1】国際特許出願公開第2013/083774A1号

【発明の概要】

【発明が解決しようとする課題】

【0004】

本発明の目的は、代替的な除草活性成分を提供することである。

【課題を解決するための手段】

【0005】

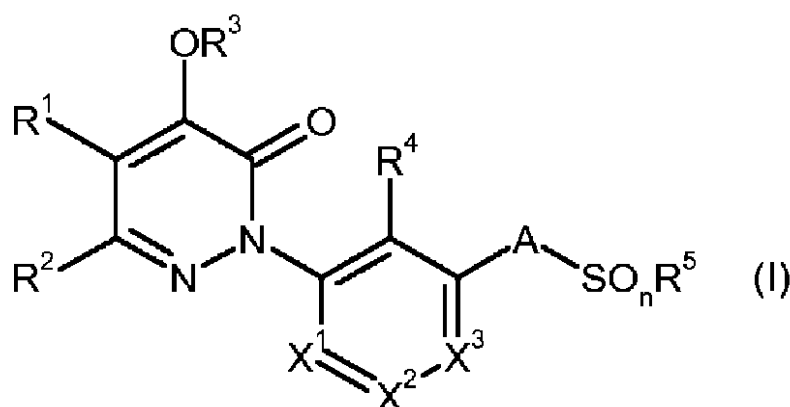
10

この目的は、（ヘテロ）アリール環の特定の位置に硫黄基を有している2-（ヘテロ）アリールピリダジノンを提供することによって達成される。

【0006】

かくして、本発明は、式（I）

【化1】



20

【0007】

30

〔式中、

R^1 は、水素、ハロゲン、シアノ、 (C_1-C_6) -アルキル、 (C_3-C_6) -シクロアルキル、 (C_2-C_6) -アルケニル、 (C_4-C_6) -シクロアルケニル、 (C_2-C_6) -アルキニル、ハロ- (C_1-C_6) -アルキル、 (C_1-C_6) -アルコキシ、 (C_1-C_6) -アルコキシ- (C_1-C_3) -アルキル、 (C_1-C_6) -アルコキシ- (C_2-C_6) -アルコキシ、 (C_1-C_6) -アルコキシ- (C_2-C_6) -アルコキシ- (C_1-C_3) -アルキル、 (C_3-C_6) -シクロアルキル- (C_1-C_3) -アルキル、アミノ、 (C_1-C_6) -アルキルアミノ、ジ- (C_1-C_6) -アルキルアミノ、 (C_1-C_3) -アルキル- $(O)C$ -アミノ- (C_1-C_4) -アルキル、 (C_1-C_6) -アルキル- $(O)_nS$ 、 (C_1-C_6) -アルキル- $(O)_nS$ - (C_1-C_3) -アルキル、ハロ- (C_1-C_6) -アルキル- $(O)_nS$ 又はハロ- (C_1-C_6) -アルキル- $(O)_nS$ - (C_1-C_3) -アルキルを表し；

40

R^2 は、水素、ヒドロキシ、ハロゲン、ニトロ、アミノ、シアノ、 (C_1-C_6) -アルキル、 (C_1-C_3) -アルコキシ、 (C_3-C_6) -シクロアルキル、 (C_2-C_6) -アルケニル、 (C_2-C_6) -アルキニル、ハロ- (C_1-C_6) -アルキル、 (C_1-C_6) -アルコキシ- (C_1-C_3) -アルキル、 (C_3-C_6) -シクロアルキル- (C_1-C_3) -アルキル、 (C_1-C_6) -アルキル- $(O)_nS$ 、 (C_1-C_6) -アルキル- $(O)_nS$ - (C_1-C_3) -アルキル、ハロ- (C_1-C_6) -アルキル- $(O)_nS$ 、ハロ- (C_1-C_6) -アルキル- $(O)_nS$ - (C_1-C_3) -アルキル、 (C_1-C_3) -アルキルアミノ又はジ- (C_1-C_3) -アルキルアミノを表し；

50

R^3 は、水素、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル - $(O)C$ 、アリール - $(O)C$ 、 $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ - $(O)C$ 、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル - $(O)_n S$ 、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル - $(O)_n S (O)C$ 又はアリール - $(O)_n S$ を表し、ここで、該アリール基は、いずれの場合にも、 s 個の基 R^9 で置換されており；

R^4 は、ヒドロキシ、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル、 $(C_3 - C_6)$ - シクロアルキル、ハロ - $(C_1 - C_6)$ - アルキル、 $(C_2 - C_6)$ - アルケニル、ハロ - $(C_2 - C_6)$ - アルケニル、 $(C_2 - C_6)$ - アルキニル、 $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ、 $(C_2 - C_6)$ - アルケニルオキシ、 $(C_3 - C_6)$ - シクロアルキル - $(C_1 - C_3)$ - アルキル、 $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ - $(C_1 - C_3)$ - アルキル、 $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ - $(C_2 - C_6)$ - アルコキシ、 $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ - $(C_2 - C_6)$ - アルコキシ - $(C_1 - C_3)$ - アルキル、ハロ - $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ、ハロ - $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ - $(C_1 - C_3)$ - アルキル、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル - $(O)_n S$ 、ハロ - $(C_1 - C_6)$ - アルキル - $(O)_n S$ 、アリール、アリール - $(O)_n S$ 、ヘテロシクリル、ヘテロシクリル - $(O)_n S$ 、アリールオキシ、アリール - $(C_2 - C_6)$ - アルキル、アリール - $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ、ヘテロシクリルオキシ、ヘテロシクリル - $(C_1 - C_3)$ - アルコキシ - $(C_1 - C_3)$ - アルキル、 $HO(O)C$ 、 $HO(O)C - (C_1 - C_3)$ - アルコキシ、 $(C_1 - C_3)$ - アルコキシ - $(O)C$ 、 $(C_1 - C_3)$ - アルコキシ - $(O)C - (C_1 - C_3)$ - アルコキシ、 $(C_1 - C_3)$ - アルキルアミノ、ジ - $(C_1 - C_3)$ - アルキルアミノ、 $(C_1 - C_3)$ - アルキルアミノ - $(O)_n S$ 、 $(C_1 - C_3)$ - アルキルアミノ - $(O)_n S - (C_1 - C_3)$ - アルキル、ジ - $(C_1 - C_3)$ - アルキルアミノ - $(O)_n S$ 、ジ - $(C_1 - C_3)$ - アルキルアミノ - $(O)_n S - (C_1 - C_3)$ - アルキル、 $(C_1 - C_3)$ - アルキルアミノ - $(O)C$ 、 $(C_1 - C_3)$ - アルキルアミノ - $(O)C - (C_1 - C_3)$ - アルキル、ジ - $(C_1 - C_3)$ - アルキルアミノ - $(O)C$ 、ジ - $(C_1 - C_3)$ - アルキルアミノ - $(O)C - (C_1 - C_3)$ - アルキル、 $(C_1 - C_3)$ - アルキル - $(O)C - アミノ$ 、 $(C_1 - C_3)$ - アルキル - $(O)_n S - アミノ$ 、 $(C_1 - C_3)$ - アルキル - $(O)_n S - (C_1 - C_3)$ - アルキルアミノ又は $(C_1 - C_3)$ - アルキル - $(O)_n S - アミノ - (C_1 - C_3)$ - アルキルを表し、ここで、該ヘテロシクリル基及びアリール基は、 $(C_1 - C_3)$ - アルキル、ハロ - $(C_1 - C_3)$ - アルキル、 $(C_1 - C_3)$ - アルコキシ、ハロ - $(C_1 - C_3)$ - アルコキシ、フェニル、シアノ、ニトロ及びハロゲンからなる群から選択される s 個の基で置換されており；

A は、直接結合又は $(C_1 - C_4)$ - アルキレンを表し、ここで、 $(C_1 - C_4)$ - アルキレンの中のメチレン基は、互いに独立して、ハロゲン、 $(C_1 - C_4)$ - アルキル、ハロ - $(C_1 - C_4)$ - アルキル、 $(C_1 - C_4)$ - アルコキシ、ハロ - $(C_1 - C_4)$ - アルコキシ又は $(C_1 - C_4)$ - アルコキシ - $(C_1 - C_4)$ - アルキルからなる群から選択される n 個の基を有することができ；

R^5 は、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル、 $(C_3 - C_6)$ - シクロアルキル、 $(C_3 - C_6)$ - シクロアルキル - $(C_1 - C_6)$ - アルキル、 $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ - $(C_1 - C_6)$ - アルキルを表し；

X^1 は、 N 又は CR^6 を表し；

X^2 は、 N 又は CR^7 を表し；

X^3 は、 N 又は CR^8 を表し；

R^6 は、水素、ハロゲン、 $(C_1 - C_3)$ - アルキル、 $(C_1 - C_3)$ - アルコキシ、 $(C_2 - C_3)$ - アルケニル、 $(C_2 - C_3)$ - アルキニル、ハロ - $(C_1 - C_3)$ - アルキル、ハロ - $(C_1 - C_3)$ - アルコキシを表し；

R^7 は、水素、ハロゲン、 $(C_1 - C_3)$ - アルキルを表し；

R^8 は、水素、ヒドロキシ、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル、 $(C_3 - C_6)$ - シクロアルキル、ハロ - $(C_1 - C_6)$ - アルキル、 $(C_2 - C_6)$ - アルケニル、ハロ - $(C_2 - C_6)$ - アルケニル、 $(C_2 - C_6)$ - アルキニル、 $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ、 $(C_2 - C_6)$ - アルケニルオキシ、 $(C_3 - C_6)$ - シクロア

10

20

30

40

50

ルキル- (C_1-C_3) -アルキル、 (C_1-C_6) -アルコキシ- (C_1-C_3) -アルキル、 (C_1-C_6) -アルコキシ- (C_2-C_6) -アルコキシ、 (C_1-C_6) -アルコキシ- (C_2-C_6) -アルコキシ- (C_1-C_3) -アルキル、ハロ- (C_1-C_6) -アルコキシ、ハロ- (C_1-C_6) -アルコキシ- (C_1-C_3) -アルキル、 (C_1-C_6) -アルキル- $(O)_nS$ 、ハロ- (C_1-C_6) -アルキル- $(O)_nS$ 、アリール、アリール- $(O)_nS$ 、ヘテロシクリル、ヘテロシクリル- $(O)_nS$ 、アリールオキシ、アリール- (C_2-C_6) -アルキル、アリール- (C_1-C_6) -アルコキシ、ヘテロシクリルオキシ、ヘテロシクリル- (C_1-C_3) -アルコキシ- (C_1-C_3) -アルキル、 $HO(O)C$ 、 $HO(O)C-(C_1-C_3)$ -アルコキシ、 (C_1-C_3) -アルコキシ- $(O)C$ 、 (C_1-C_3) -アルコキシ- $(O)C-(C_1-C_3)$ -アルコキシ、 (C_1-C_3) -アルキルアミノ、ジ- (C_1-C_3) -アルキルアミノ、 (C_1-C_3) -アルキルアミノ- $(O)_nS$ 、 (C_1-C_3) -アルキルアミノ- $(O)_nS-(C_1-C_3)$ -アルキル、ジ- (C_1-C_3) -アルキルアミノ- $(O)_nS$ 、ジ- (C_1-C_3) -アルキルアミノ- $(O)_nS-(C_1-C_3)$ -アルキル、 (C_1-C_3) -アルキルアミノ- $(O)C$ 、 (C_1-C_3) -アルキルアミノ- $(O)C-(C_1-C_3)$ -アルキル、ジ- (C_1-C_3) -アルキルアミノ- $(O)C$ 、ジ- (C_1-C_3) -アルキルアミノ- $(O)C-(C_1-C_3)$ -アルキル、 (C_1-C_3) -アルキル- $(O)C$ -アミノ、 (C_1-C_3) -アルキル- $(O)_nS$ -アミノ、 (C_1-C_3) -アルキル- $(O)_nS-(C_1-C_3)$ -アルキルアミノ又は (C_1-C_3) -アルキル- $(O)_nS$ -アミノ- (C_1-C_3) -アルキルを表し、ここで、該ヘテロシクリル基及びアリール基は、 (C_1-C_3) -アルキル、ハロ- (C_1-C_3) -アルキル、 (C_1-C_3) -アルコキシ、ハロ- (C_1-C_3) -アルコキシ、 (C_1-C_6) -アルキル- $(O)_nS$ 、フェニル、シアノ、ニトロ及びハロゲンからなる群から選択される s 個の基で置換されており；

10

20

又は、

R^7 と R^8 は、それらが結合している炭素原子と一緒に、5員又は6員の不飽和環（ここで、該環は、 s 個の窒素原子を含んでおり、及び、 s 個の基 R^{10} で置換されている）を表し；

R^9 は、ハロゲン、 (C_1-C_3) -アルキル、ハロ- (C_1-C_3) -アルキル、 (C_1-C_6) -アルコキシを表し；

30

R^{10} は、シアノ、ハロゲン、 (C_1-C_3) -アルキル- $(O)_nS$ 、 (C_1-C_3) -アルキル、 (C_2-C_3) -アルケニル、 (C_2-C_3) -アルキニル、ハロ- (C_1-C_3) -アルキル又はモルホリニルを表し；

n は、0、1又は2を表し；

s は、0、1、2又は3を表す；

但し、 A が直接結合を表す場合、 R^5 は、 (C_1-C_6) -アルキルを表すことはない〕で表される2-（ヘテロ）アリールピリダジノン又はその塩を提供する。

【0008】

式(I)及び以下の全ての式において、3個以上の炭素原子を有しているアルキル基は、直鎖又は分枝鎖であることができる。アルキル基は、例えば、メチル、エチル、 n -プロピル、イソプロピル、 n -ブチル、イソブチル、 t -ブチル、2-ブチル、ペンチル類、ヘキシル類、例えば、 n -ヘキシル、イソヘキシル及び1,3-ジメチルブチルなどである。同様に、アルケニルは、例えば、アリル、1-メチルプロパー2-エン-1-イル、2-メチルプロパー2-エン-1-イル、ブター2-エン-1-イル、ブター3-エン-1-イル、1-メチルブター3-エン-1-イル及び1-メチルブター2-エン-1-イルなどである。アルキニルは、例えば、プロパルギル、ブター2-イン-1-イル、ブター3-イン-1-イル、1-メチルブター3-イン-1-イルなどである。多重結合は、各不飽和基の任意の位置に存在し得る。シクロアルキルは、3~6個の炭素原子を有している炭素環式飽和環系、例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル又はシクロヘキシルなどである。同様に、シクロアルケニルは、3~6個の炭素環員を有して

40

50

いる単環式アルケニル基、例えば、シクロプロペニル、シクロブテニル、シクロペンテニル及びシクロヘキセニルなどであり、ここで、二重結合は、任意の位置に存在し得る。

【0009】

ハロゲンは、フッ素、塩素、臭素又はヨウ素を表す。

【0010】

ヘテロシクリルは、3～6個の環原子（ここで、該環原子のうちの1～4個は酸素、窒素及び硫黄からなる群から選択される）を含んでいる飽和、部分的飽和、完全不飽和又は芳香族の環状基であり、ここで、該環状基は、さらに、ベンゾ環によって縮合されていてもよい。例えば、ヘテロシクリルは、ペリリジニル、ピロリジニル、モルホリニル、テトラヒドロフラニル、ジヒドロフラニル、オキセタニル、ベンゾイミダゾール-2-イル、フラニル、イミダゾリル、イソオキサゾリル、イソチアゾリル、オキサゾリル、ピラジニル、ピリミジニル、ピリダジニル、ピリジニル、ベンゾイソオキサゾリル、チアゾリル、ピロリル、ピラゾリル、チオフエニル、1, 2, 3-オキサジアゾリル、1, 2, 4-オキサジアゾリル、1, 2, 5-オキサジアゾリル、1, 3, 4-オキサジアゾリル、1, 2, 4-トリアゾリル、1, 2, 3-トリアゾリル、1, 2, 5-トリアゾリル、1, 3, 4-トリアゾリル、1, 2, 4-トリアゾリル、1, 2, 4-チアジアゾリル、1, 3, 4-チアジアゾリル、1, 2, 3-チアジアゾリル、1, 2, 5-チアジアゾリル、2H-1, 2, 3, 4-テトラゾリル、1H-1, 2, 3, 4-テトラゾリル、1, 2, 3, 4-オキサトリアゾリル、1, 2, 3, 5-オキサトリアゾリル、1, 2, 3, 4-チアトリアゾリル及び1, 2, 3, 5-チアトリアゾリルなどを表す。

10

20

【0011】

アリールは、フェニル又はナフチルである。

【0012】

ある基が複数の基で多置換されている場合、これは、該基が上記基から選択される1以上の同一であるか又は異なっている基で置換されていることを意味する。

【0013】

置換基の種類及びそれらの結合の仕方に応じて、一般式(I)で表される化合物は、立体異性体として存在し得る。例えば、不斉に置換されている1個以上の炭素原子が存在している場合、エナンチオマー及びジアステレオマーが存在し得る。nが1を表す場合（スルホキシド）にも立体異性体が存在し得る。立体異性体は、その調製において得られた混合物から、慣習的な分離方法によって、例えば、クロマトグラフ分離プロセスによって、得ることができる。さらにまた、光学的に活性な出発物質及び／又は補助剤を使用する立体選択的反応を用いることによって、立体異性体を選択的に調製することも可能である。本発明は、一般式(I)には包含されるが具体的には定義されていない全ての立体異性体及びその混合物にも関する。

30

【0014】

式(I)で表される化合物は、塩を形成することができる。塩は、一般式(I)で表される化合物に塩基を作用させることによって、形成させることができる。適切な塩基の例は、以下のものである：有機アミン類、例えば、トリアルキルアミン類、モルホリン、ペリリジン及びピリジン、並びに、アンモニウム、アルカリ金属又はアルカリ土類金属の水酸化物、炭酸塩及び炭酸水素塩、特に、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム及び炭酸水素カリウム。これらの塩は、当該酸性水素が農業上適切なカチオンで置き換えられている化合物、例えば、金属塩、特に、アルカリ金属塩若しくはアルカリ土類金属塩、特に、ナトリウム塩及びカリウム塩、又は、アンモニウム塩、有機アミンとの塩、又は、第4球アンモニウム塩、例えば、式 $[NR^aR^bR^cR^d]^+$ 〔式中、 $R^a \sim R^d$ は、それぞれ独立して、有機基、特に、アルキル、アリール、アラルキル又はアルキルアリールである〕で表されるカチオンとの塩である。同様に、アルキルスルホニウム塩及びアルキルスルホキソニウム塩、例えば、 (C_1-C_4) -トリアルキルスルホニウム塩及び (C_1-C_4) -トリアルキルスルホキソニウム塩なども適している。

40

50

【発明を実施するための形態】

【0015】

好ましいのは、一般式 (I) [式中、

R^1 は、水素、ハロゲン、シアノ、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル、 $(C_3 - C_6)$ - シクロアルキル、 $(C_2 - C_6)$ - アルケニル、 $(C_2 - C_6)$ - アルキニル、ハロ - $(C_1 - C_6)$ - アルキル、 $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ - $(C_1 - C_3)$ - アルキル、 $(C_3 - C_6)$ - シクロアルキル - $(C_1 - C_3)$ - アルキル、アミノ又は $(C_1 - C_6)$ - アルキル - $(O)_n S$ を表し；

R^2 は、水素、ハロゲン、シアノ、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル、 $(C_2 - C_6)$ - アルケニル、 $(C_2 - C_6)$ - アルキニル、ハロ - $(C_1 - C_6)$ - アルキル又は $(C_1 - C_6)$ - アルキル - $(O)_n S$ を表し；

R^3 は、水素を表し；

R^4 は、ヒドロキシ、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル、 $(C_3 - C_6)$ - シクロアルキル、ハロ - $(C_1 - C_6)$ - アルキル、 $(C_2 - C_6)$ - アルケニル、 $(C_2 - C_6)$ - アルキニル、 $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ、 $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ - $(C_1 - C_3)$ - アルキル、 $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ - $(C_2 - C_6)$ - アルコキシ、 $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ - $(C_2 - C_6)$ - アルコキシ - $(C_1 - C_3)$ - アルキル、ハロ - $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ、ハロ - $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ - $(C_1 - C_3)$ - アルキル、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル - $(O)_n S$ 、ハロ - $(C_1 - C_6)$ - アルキル - $(O)_n S$ 、アリール、ヘテロシクリル、アリールオキシ、ヘテロシクリル - $(C_1 - C_3)$ - アルコキシ - $(C_1 - C_3)$ - アルキル、 $(C_1 - C_3)$ - アルキルアミノ、ジ - $(C_1 - C_3)$ - アルキルアミノ、 $(C_1 - C_3)$ - アルキルアミノ - $(O)_n S$ 、 $(C_1 - C_3)$ - アルキルアミノ - $(O)_n S$ - $(C_1 - C_3)$ - アルキル、ジ - $(C_1 - C_3)$ - アルキルアミノ - $(O)_n S$ 、ジ - $(C_1 - C_3)$ - アルキルアミノ - $(O)_n S$ - $(C_1 - C_3)$ - アルキル、 $(C_1 - C_3)$ - アルキルアミノ - $(O)C$ 、ジ - $(C_1 - C_3)$ - アルキルアミノ - $(O)C$ 、ジ - $(C_1 - C_3)$ - アルキルアミノ - $(O)C$ - $(C_1 - C_3)$ - アルキル、 $(C_1 - C_3)$ - アルキル - $(O)C$ - アミノ又は $(C_1 - C_3)$ - アルキル - $(O)_n S$ - アミノを表し、ここで、該ヘテロシクリル基及びアリール基は、 $(C_1 - C_3)$ - アルキル、ハロ - $(C_1 - C_3)$ - アルキル、 $(C_1 - C_3)$ - アルコキシ、ハロ - $(C_1 - C_3)$ - アルコキシ、シアノ、ニトロ及びハロゲンからなる群から選択される s 個の基で置換されており；

A は、直接結合又は $(C_1 - C_4)$ - アルキレンを表し；

R^5 は、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル、 $(C_3 - C_6)$ - シクロアルキル、 $(C_3 - C_6)$ - シクロアルキル - $(C_1 - C_6)$ - アルキル、 $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ - $(C_1 - C_6)$ - アルキルを表し；

X^1 は、 CR^6 表し；

X^2 は、 CR^7 表し；

X^3 は、 CR^8 表し；

R^6 及び R^7 は、互いに独立して、水素、ハロゲン又は $(C_1 - C_3)$ - アルキルを表し；

R^8 は、水素、ハロゲン、ニトロ、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル、 $(C_3 - C_6)$ - シクロアルキル、ハロ - $(C_1 - C_6)$ - アルキル、 $(C_2 - C_6)$ - アルケニル、ハロ - $(C_2 - C_6)$ - アルケニル、 $(C_2 - C_6)$ - アルキニル、 $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ、 $(C_2 - C_6)$ - アルケニルオキシ、 $(C_3 - C_6)$ - シクロアルキル - $(C_1 - C_3)$ - アルキル、 $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ - $(C_1 - C_3)$ - アルキル、 $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ - $(C_2 - C_6)$ - アルコキシ、ハロ - $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル - $(O)_n S$ 又はフェニルを表し、ここで、該フェニル基は、 $(C_1 - C_3)$ - アルキル、ハロ - $(C_1 - C_3)$ - アルキル、 $(C_1 - C_3)$ - アルコキシ、ハロ - $(C_1 - C_3)$ - アルコキシ、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル - $(O)_n S$ 、フェニル、シアノ、ニトロ及びハロゲンからなる群から選択される s 個の基で置換されており

10

20

30

40

50

;

n は、0、1 又は 2 を表し;

s は、0、1、2 又は 3 を表す;

但し、A が直接結合を表す場合、 R^5 は、 $(C_1 - C_6)$ - アルキルを表すことはない] で表される化合物である。

【0016】

特に好ましいのは、一般式 (I) [式中、

R^1 は、水素、アミノ、塩素、臭素、シアノ、メチル、エチル、イソプロピル、シクロプロピル、ビニル、プロパルギル、イソプロペニル又はメチルー (O)_nS を表し;

R^2 は、水素、ハロゲン又は $(C_1 - C_6)$ - アルキルを表し;

10

R^3 は、水素を表し;

R^4 は、フッ素、塩素、シアノ、ニトロ、メチル、トリフルオロメチル、2-フルオロエチル、メトキシエトキシメチル、トリフルオロメトキシメチル、メチルー (O)_nS、アリール、イソオキサゾリニル、モルホリニル又はメチルー (O)_nS-アミノを表し、ここで、該ヘテロシクリル基及びアリール基は、メチル、トリフルオロメチル及び塩素からなる群から選択される s 個の基で置換されており;

A は、直接結合又は $(C_1 - C_4)$ - アルキレンを表し;

R^5 は、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル、 $(C_3 - C_6)$ - シクロアルキル、 $(C_3 - C_6)$ - シクロアルキルー $(C_1 - C_6)$ - アルキル、 $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ- $(C_1 - C_6)$ - アルキルを表し;

20

X^1 は、 CR^6 を表し;

X^2 は、 CR^7 を表し;

X^3 は、 CR^8 を表し;

R^6 及び R^7 は、水素を表し;

R^8 は、水素、ハロゲン、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル、ハロー $(C_1 - C_6)$ - アルキル、 $(C_2 - C_6)$ - アルケニル、 $(C_2 - C_6)$ - アルキニル又は $(C_1 - C_6)$ - アルキルー (O)_nS を表し;

n は、0、1 又は 2 を表し;

s は、0、1、2 又は 3 を表す;

但し、A が直接結合を表す場合、 R^5 は、 $(C_1 - C_6)$ - アルキルを表すことはない] で表される化合物である。

30

【0017】

極めて特に好ましいのは、一般式 (I) [式中、

R^1 は、メチル又はビニルを表し;

R^2 は、水素を表し;

R^3 は、水素を表し;

R^4 は、メチル、塩素、トリフルオロメチル又はメチルー (O)_nS を表し;

A は、直接結合、 $-CH_2-$ 又は $-CH_2CH_2-$ を表し;

R^5 は、メチル、エチル、シクロプロピル、シクロプロピルメチル、メトキシエチルを表し;

40

X^1 は、 CR^6 を表し;

X^2 は、 CR^7 を表し;

X^3 は、 CR^8 を表し;

R^6 及び R^7 は、水素を表し;

R^8 は、メチル、エチル、塩素、トリフルオロメチル又はメチルー (O)_nS を表し;

n は、0、1 又は 2 を表す;

但し、A が直接結合を表す場合、 R^5 は、メチル又はエチルを表すことはない] で表される化合物である。

【0018】

以下で特定されている全ての式において、その置換基及び記号は、異なって定義されて

50

いないかぎり、式 (I) において記載されている意味と同じ意味を有する。

【0019】

本発明による化合物は、例えば、WO 2013/083774 A1 に記載されている方法と同様にして、調製することができる。

【0020】

本発明による化合物の基礎をなしているヒドラジンは、文献においてよく知られている方法で調製することができる。例えば、以下のものの中に、概説を見いだすことができる：
Houben-Weyl, Methoden der Organischen Chemie [Methods of Organic Chemistry], Georg Thieme Verlag Stuttgart, Vol. E 16a, part 1, expanded and supplementary volumes to the fourth edition 1990, p. 648 ff. and p. 678 ff.

10

【0021】

式 (I) [式中、 $n=0$] で表されるチオエーテルを酸化して、対応するスルホキシド又はスルホンを生成させることができる。標的化方式でスルホキシド又はスルホンをもたらす酸化方法は、文献から知られている。多くの種類の酸化系（例えば、過酸、例えば、メタクロロ過安息香酸）が適しており、ここで、該過酸は、場合によりその場で生成させてもよい（例えば、系「酢酸／過酸化水素／タングステン酸 (VI) ナトリウム」における過酢酸）（Houben-Weyl, Methoden der Organischen Chemie [Methods of Organic Chemistry], Georg Thieme Verlag Stuttgart, Vol. E 11, expanded and supplementary volumes to the 4th edition 1985, p. 702 ff., p. 718 ff. and p. 1194 ff.）。当該合成カスケードのどの段階でチオエーテルを酸化するのが適切であるかは、とりわけ、置換パターン及び酸化剤に依存する。

20

【0022】

それぞれの反応混合物の後処理は、一般に、既知方法によって、例えば、結晶化、水性抽出後処理によって、クロマトグラフ法によって、又は、それらの方法を組み合わせたものによって、実施する。

30

【0023】

上記反応によって合成することが可能な式 (I) の化合物及び／又はそれらの塩のコレクションは、並行的に調製することも可能であり、その場合、これは、手動で、部分的に自動化で、又は、完全に自動化で、実施することが可能である。例えば、生成物及び／若しくは中間体の反応、後処理又は精製の実施を自動化することが可能である。概して、これは、例えば、「Combinatorial Chemistry – Synthesis, Analysis, Screening (editor: Gunther Jung), Wiley, 1999」の第1～34頁においてD. Tiebesによって記載された方法を意味するものと理解される。

【0024】

反応及び後処理の並行的な実施に関しては、多くの市販されている機器、例えば、「Barnstead International, Dubuque, Iowa 52004-0797, USA」製の「Calypso reaction blocks」又は「Radleys, Shirehill, Saffron Walden, Essex, CB11 3AZ, England」製の反応ステーション又は「PerkinElmer, Waltham, Massachusetts 02451, USA」製の「MultiPROBE Automated Workstations」などを使用することが可能である。一般式 (I) で表される化合物及びそれらの塩の並行精製又は調製の過程で生じる中間体の並行精製に関しては、利用可能な装置としては、クロマトグラフィー装置、例えば、「ISCO, Inc., 4700 Super

40

50

ior Street, Lincoln, NE 68504, USA」製のクロマトグラフィー装置などがある。

【0025】

上記装置は、個々の作業段階が自動化されているモジュール式方法をもたらすが、作業段階の間では手動による操作を行わなければならない。これは、個々の自動化モジュールが例えばロボットによって操作される部分的に又は完全に一体化された自動化システムを用いて回避することができる。このタイプの自動化システムは、例えば、「Caliper, Hopkinton, MA 01748, USA」から入手することができる。

【0026】

単一又は複数の合成段階の実施は、ポリマー担持試薬／スカベンジャー樹脂を使用することにより補助することができる。専門的な文献（例えば、「ChemFiles, Vol. 4, No. 1, Polymer-Supported Scavengers and Reagents for Solution-Phase Synthesis (Sigma-Aldrich)」）には、一連の実験プロトコルが記載されている。

【0027】

ここに記載されている方法に加えて、一般式（I）で表される化合物及びそれらの塩は、固相担持方法（solid-phase supported method）によって部分的に又は完全に調製することが可能である。この目的のために、当該合成における個々の中間体若しくは全ての中間体、又は、対応する手順に適合させた合成における個々の中間体若しくは全ての中間体を、合成用樹脂に結合させる。固相担持合成方法は、技術文献、例えば、「Barry A. Bunin in “The Combinatorial Index”, Academic Press, 1998」及び「Combinatorial Chemistry - Synthesis, Analysis, Screening (editor: Gunther Jung), Wiley, 1999」に十分に記載されている。固相担持合成方法を使用することで、手動で又は自動化された方法で実施することが可能な文献から知られている多くのプロトコルが可能となる。該反応は、例えば、「Nexus Biosystems, 12140 Community Road, Poway, CA 92064, USA」製のマイクロ反応器の中でI R O R I 技術を用いることによって、実施することができる。

【0028】

固相上においても、及び、液相中においても、単一の合成段階又は複数の合成段階の実施（conduction）は、マイクロ波技術を使用することにより補助することができる。専門的な文献（例えば、「Microwaves in Organic and Medicinal Chemistry (editor: C. O. Kappe and A. Stadler), Verlag Wiley, 2005」）には、一連の実験プロトコルが記載されている。

【0029】

ここに記載されている調製方法で調製することによって、式（I）で表される化合物及びそれらの塩が、ライブラリーと称される物質コレクションの形態で得られる。本発明は、式（I）で表される少なくとも2種類の化合物及びそれらの塩を含んでいるライブラリーも提供する。

【0030】

本発明の化合物は、広範囲の経済的に重要な単子葉及び双子葉の一年生有害植物に対して優れた除草効力を示す。該活性成分は、根茎、根株及び別の多年生器官から苗条を生じる、防除が困難な多年生雑草に対しても効果的に作用する。

【0031】

本発明は、従って、望ましくない植物を防除する方法又は植物の成長を調節する方法、好ましくは作物植物内において、望ましくない植物を防除する方法又は植物の成長を調節

10

20

30

40

50

する方法も提供し、ここで、該方法においては、本発明による１種類以上の化合物を、該植物（例えば、有害植物、例えば、単子葉雑草若しくは双子葉雑草、又は、望ましくない作物植物）に施用するか、又は、種子（例えば、穀粒、種子、又は、栄養繁殖器官、例えば、塊茎、若しくは、芽を有する苗条部分）に施用するか、又は、当該植物がそこで成長している区域（例えば、耕作地）に施用する。本発明の化合物は、例えば、植え付け前（適切な場合には、土壤に混和することによって）、発生前又は発生後に使用することができる。本発明の化合物によって防除することが可能な何種類かの代表的な単子葉雑草植物相及び双子葉雑草植物相の具体的な例は以下のとおりであるが、そのような記載は特定の種に限定することを意図するものではない。

【００３２】

以下の属の単子葉有害植物： アエギロプス属（*Aegilops*）、カモジグサ属（*Agropyron*）、ヌカボ属（*Agrostis*）、スズメノテッポウ属（*Alopecurus*）、セイヨウヌカボ属（*Apera*）、カラスムギ属（*Avena*）、ブロードキビ属（*Brachiaria*）、スズメノチャヒキ属（*Bromus*）、クリノイガ属（*Cenchrus*）、ツユクサ属（*Commelina*）、ギョウギシバ属（*Cynodon*）、カヤツリグサ属（*Cyperus*）、タツノツメガヤ属（*Dactyloctenium*）、メヒシバ属（*Digitaria*）、ヒエ属（*Echinochloa*）、ハリイ属（*Eleocharis*）、オヒシバ属（*Eleusine*）、スズメガヤ属（*Eragrostis*）、ナルコビエ属（*Eriochloa*）、ウシノケグサ属（*Festuca*）、テンツキ属（*Fimbristylis*）、アメリカコナギ属（*Heteranthera*）、チガヤ属（*Imperata*）、カモノハシ属（*Ischaemum*）、アゼガヤ属（*Leptochloa*）、ドクムギ属（*Lolium*）、ミズアオイ属（*Monochoria*）、キビ属（*Panicum*）、スズメノヒエ属（*Paspalum*）、クサヨシ属（*Phalaris*）、アワガエリ属（*Phleum*）、イチゴツナギ属（*Poa*）、ツノアイアシ属（*Rottboellia*）、オモダカ属（*Sagittaria*）、ホタルイ属（*Scirpus*）、エノコログサ属（*Setaria*）、及び、モロコシ属（*Sorghum*）。

【００３３】

以下の属の双子葉雑草： イチビ属（*Abutilon*）、ヒユ属（*Amaranthus*）、ブタクサ属（*Ambrosia*）、アノダ属（*Anoda*）、カミツレ属（*Anthemis*）、アフアネス属（*Aphanes*）、ヨモギ属（*Artemisia*）、ハマアカザ属（*Atriplex*）、ヒナギク属（*Bellis*）、センダングサ属（*Bidens*）、ナズナ属（*Capsella*）、ヒレアザミ属（*Carduus*）、カワラケツメイ属（*Cassia*）、ヤグルマギク属（*Centaurea*）、アカザ属（*Chenopodium*）、アザミ属（*Cirsium*）、セイヨウヒルガオ属（*Convolvulus*）、チョウセンアサガオ属（*Datura*）、ヌスビトハギ属（*Desmodium*）、エメキス属（*Emex*）、エゾスズシロ属（*Erysimum*）、トウダイグサ属（*Euphorbia*）、チシマオドリコソウ属（*Galeopsis*）、コゴメギク属（*Galinsoga*）、ヤエムグラ属（*Galium*）、フヨウ属（*Hibiscus*）、サツマイモ属（*Ipomoea*）、ホウキギ属（*Kochia*）、オドリコソウ属（*Lamium*）、マメグンバイナズナ属（*Lepidium*）、アゼトウガラシ属（*Lindernia*）、シカギク属（*Matricaria*）、ハッカ属（*Mentha*）、ヤマアイ属（*Mercurialis*）、ザクロソウ属（*Mullugo*）、ワスレナグサ属（*Myosotis*）、ケシ属（*Papaver*）、アサガオ属（*Pharbitis*）、オオバコ属（*Plantago*）、タデ属（*Polygonum*）、スベリヒユ属（*Portulaca*）、キンボウゲ属（*Ranunculus*）、ダイコン属（*Raphanus*）、イヌガラシ属（*Rorippa*）、キカシグサ属（*Rotala*）、ギシギシ属（*Rumex*）、オカヒジキ属（*Salsola*）、キオン属（*Senecio*）、セスバニア属（*Sesbania*）、キンゴジカ属（*Sida*）、シロガラシ属（*Sinapis*）、ナス属（*Solanum*）、ノゲシ属（*Sonchus*）、ナガ

ボノウルシ属 (Sphenoclea)、ハコベ属 (Stellaria)、タンポポ属 (Taraxacum)、グンバイナズナ属 (Thlaspi)、シャジクソウ属 (Trifolium)、イラクサ属 (Urtica)、クワガタソウ属 (Veronica)、スミレ属 (Viola)、及び、オナモミ属 (Xanthium)。

【0034】

本発明の化合物が発芽前に土壌表面に施用される場合、雑草の実生の出芽が完全に防止されるか、又は、雑草は、子葉期に達するまで成長するが、その後成長を停止し、そして最終的には、3～4週間経過した後、完全に枯死する。

【0035】

該活性成分が植物の緑色の部分に発生後施用される場合は、その処理の後で成長は停止し、そして、当該有害植物は、施用時点における成長段階にとどまるか、又は、一定期間の後、完全に枯死し、その結果、作物植物にとって有害である雑草との競合が、極めて早期に持続的に排除される。

【0036】

本発明の化合物は単子葉雑草及び双子葉雑草に対して優れた除草活性を示すが、経済的に重要な作物の作物植物、例えば、ラッカセイ属 (Arachis)、フダンソウ属 (Beta)、アブラナ属 (Brassica)、キュウリ属 (Cucumis)、カボチャ属 (Cucurbita)、ヒマワリ属 (Helianthus)、ニンジン属 (Daucus)、ダイズ属 (Glycine)、ワタ属 (Gossypium)、サツマイモ属 (Ipomoea)、アキノノゲシ属 (Lactuca)、アマ属 (Linum)、トマト属 (Lycopersicon)、ススキ属 (Miscanthus)、タバコ属 (Nicotiana)、インゲンマメ属 (Phaseolus)、エンドウ属 (Pisum)、ナス属 (Solanum)、ソラマメ属 (Vicia) の双子葉作物の作物植物、又は、ネギ属 (Allium)、アナナス属 (Ananas)、クサスギカズラ属 (Asparagus)、カラスムギ属 (Avena)、オオムギ属 (Hordeum)、イネ属 (Oryza)、キビ属 (Panicum)、サトウキビ属 (Saccharum)、ライムギ属 (Secale)、モロコシ属 (Sorghum)、ライコムギ属 (Triticale)、コムギ属 (Triticum)、トウモロコシ属 (Zea) [特に、トウモロコシ属 (Zea)、及び、コムギ属 (Triticum)] の単子葉植物の作物植物は、本発明の個々の化合物の構造及びその施用量に応じて、仮に損傷を受けるとしても、ほんの僅かにしか損傷をうけない。このようなわけで、本発明化合物は、農業上有用な植物などの作物植物又は観賞植物における望ましくない植物の成長を選択的に制御するのに非常に適している。

【0037】

さらに、本発明の化合物は、それらの個々の化学構造及び使用される施用量に応じて、作物植物において優れた成長調節特性を有する。それらは、調節的な効果を伴って植物自体の代謝に介入し、従って、植物の成分に対して制御された影響を及ぼすために本発明の化合物を使用して、例えば乾燥及び成長阻害を誘発することによって、収穫を促進することができる。さらに、それらは、植物を枯死させることなく植物の望ましくない成長を全体的に制御及び阻害するのにも適している。植物の成長を阻害することは、例えばそれによって倒伏が低減され得るか又は完全に防止され得るので、多くの種類の単子葉作物及び双子葉作物に対して重要な役割を果たしている。

【0038】

本発明の活性成分は、その除草特性及び植物成長調節特性によって、遺伝子組換え植物又は慣習的な突然変異誘発によって改質された植物の作物の中の有害な植物を防除するために用いることもできる。一般に、トランスジェニック植物は、特定の有利な特性によって、例えば、特定の殺有害生物剤 (特に、特定の除草剤) に対する抵抗性、植物病害又は植物病害の病原体 (例えば、特定の昆虫類又は微生物、例えば、菌類、細菌類若しくはウイルス類) に対する抵抗性などによって、特徴付けられる。別の特定の特性は、例えば、収穫物の、量、質、貯蔵性、組成及び特定の成分などに関する。例えば、デンプン含有量が

増大されているか若しくはデンプンの質が変性されている既知トランスジェニック植物、又は、収穫物内の脂肪酸組成が異なっている既知トランスジェニック植物が存在している。

【0039】

トランスジェニック作物に関して、有用な植物及び観賞植物〔例えば、穀類、例えば、コムギ、オオムギ、ライムギ、カラスムギ、アワ、イネ及びトウモロコシ、又は、テンサイ、ワタ、ダイズ、ナタネ、ジャガイモ、キャッサバ、トマト、エンドウ及び他の野菜類の作物〕の経済的に重要なトランスジェニック作物において、本発明の化合物を使用するのが好ましい。

【0040】

好ましくは、本発明の化合物は、除草剤として、当該除草剤の植物毒性効果に対して抵抗性であるか又は遺伝子工学によって抵抗性にされた有用な植物の作物において、使用することができる。

【0041】

既存の植物と比較して改質された特性を有する新規植物を生成させる慣習的な方法は、例えば、従来の栽培法及び突然変異体の生成である。別法として、改質された特性を有する新規植物は、組換え法を用いて生成させることができる（例えば、EP-A-0221044、EP-A-0131624を参照されたい）。例えば、以下の幾つかの場合において記述が成されている：

- ・ 植物体内で合成されるデンプンを改質することを目的とする作物植物の遺伝子組換え（例えば、WO 92/11376、WO 92/14827、WO 91/19806）；

- ・ グルホシネートタイプの特定の除草剤に対して抵抗性を示すトランスジェニック作物植物（cf. 例えば、EP-A-0242236、EP-A-0242246）、又は、グリホセートタイプの特定の除草剤に対して抵抗性を示すトランスジェニック作物植物（WO 92/00377）、又は、スルホニル尿素タイプの特定の除草剤に対して抵抗性を示すトランスジェニック作物植物（EP-A-0257993、US A 5013659）；

- ・ 植物を特定の害虫に対して抵抗性を示すようにするバシルス・ツリンギエンシス毒素（Bt毒素）を産生することが可能なトランスジェニック作物植物（例えば、ワタ）（EP-A-0142924、EP-A-0193259）；

- ・ 改変された脂肪酸組成を有するトランスジェニック作物植物（WO 91/13972）；

- ・ 耐病性を向上させる新規成分又は二次代謝産物（例えば、新規フィトアレキシンなど）を有する遺伝子組換え作物植物（EPA 309862、EPA 0464461）；

- ・ より多い収穫量及びより高いストレス耐性を有する、光呼吸が低下した遺伝子組換え植物（EPA 0305398）；

- ・ 薬学的に又は診断的に重要なタンパク質を産生するトランスジェニック作物植物（「分子ファーミング（molecular pharming）」）；

- ・ より多い収穫量又はより優れた品質を特徴とする、トランスジェニック作物植物；

- ・ 例えば上記で記載した新規特性の組み合わせを特徴とする、トランスジェニック作物（「遺伝子スタッキング」）。

【0042】

改質された特性を有する新規トランスジェニック植物を産生させるために使用することが可能な多くの分子生物学的技術が、原則として知られている；例えば、以下のものを参照されたい：「I. Potrykus and G. Spangenberg (eds.), Gene Transfer to Plants, Springer Lab Manual (1995), Springer Verlag Berlin, Heidelberg」、又は、「Christou, “Trends in Pla

10

20

30

40

50

nt Science” 1 (1996) 423-431」。

【0043】

そのような組換え操作に関して、突然変異誘発又はDNA配列の組換えによる配列変更を可能にする核酸分子をプラスミドの中に導入することができる。標準的な方法を用いて、例えば、塩基交換を実施することが可能であり、配列の一部を除去することが可能であり、又は、天然配列若しくは合成配列を加えることが可能である。DNA断片を互いに連結させるために、その断片にアダプター又はリンカーを加えることができる；例えば、以下のものを参照されたい：「Sambrook et al., 1989, Molecular Cloning, A Laboratory Manual, 2nd edition Cold Spring Harbor Laboratory Press, Cold Spring Harbor, NY」、又は、「Winnaker “Gene und Klone [Genes and clones]”, VCH Weinheim, 2nd edition, 1996」。

【0044】

例えば、遺伝子産物の活性が低下した植物細胞の生成は、少なくとも1の対応するアンチセンスRNAを発現させることによって、又は、コサプレッション効果を達成するためのセンスRNAを発現させることによって、又は、前記遺伝子産物の転写産物を特異的に切断する少なくとも1の適切に構築されたりボザイムを発現させることによって、達成することができる。この目的のために、第1に、存在し得る全てのフランキング配列を含む、遺伝子産物の全コード配列を含んでいるDNA分子を使用することが可能であり、及び、さらに、コード配列の一部分だけを含んでいるDNA分子を使用することも可能である（この場合、これらの部分は、細胞内においてアンチセンス効果を有するのに十分なほど長いことが必要である）。さらにまた、遺伝子産物のコード配列と高度に相同性を有するが、それらと完全に同一なわけではないDNA配列を用いることも可能である。

【0045】

植物体内で核酸分子を発現させる場合、合成されたタンパク質は、植物細胞の任意の望ましい区画内に局在化させ得る。しかしながら、特定の区画内に局在化させるためには、例えば、特定の区画内に局在化することを保証するDNA配列にコード領域を連結させることが可能である。そのような配列は、当業者に知られている（例えば、以下のものを参照されたい：「Braun et al., EMBO J. 11 (1992), 3219-3227」、「Wolter et al., Proc. Natl. Acad. Sci. USA 85 (1988), 846-850」、「Sonnwald et al., Plant J. 1 (1991), 95-106」。さらにまた、そのような核酸分子は、植物細胞の細胞小器官内で発現させることもできる。

【0046】

トランスジェニック植物細胞は、完全な植物を生じさせるための既知技術によって再生させることができる。原則として、トランスジェニック植物は、任意の望ましい植物種の植物であることができる、即ち、単子葉植物のみではなく双子葉植物であることもできる。

【0047】

かくして、相同性の（＝天然の）遺伝子若しくは遺伝子配列の過剰発現、抑制若しくは阻害又は非相同性の（＝外来の）遺伝子若しくは遺伝子配列の発現によってその特性が変更されているトランスジェニック植物を得ることができる。

【0048】

本発明の化合物は、好ましくは、成長調節剤（例えば、ジカンバ）に対して抵抗性を示すトランスジェニック作物の中で、又は、必須植物酵素（例えば、アセト乳酸シンターゼ（ALS）、EPSPシンターゼ、グルタミンシンターゼ（GS）又はヒドロキシフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼ（HPPD））を阻害する除草剤に対して抵抗性を示すトランスジェニック作物の中で、又は、スルホニル尿素類、グリホセート類、グルホシネー

ト類若しくはベンゾイルイソオキサゾール類及び類似した活性成分からなる群から選択される除草剤に対して抵抗性を示すトランスジェニック作物の中で、使用することができる。

【0049】

トランスジェニック作物の中で本発明の活性成分を使用する場合、別の作物の中で観察される有害な植物に対する効果が生じるのみではなく、多くの場合、特定のトランスジェニック作物の中における施用に特異的な効果、例えば、防除可能な雑草の改変されたスペクトル又は特に拡大されたスペクトル、当該施用に使用し得る改変された施用量、好ましくは、そのトランスジェニック作物が抵抗性を示す除草剤との良好な組合せ可能性、並びに、そのトランスジェニック作物植物の成長及び収穫量に対する影響なども生じる。

10

【0050】

従って、本発明は、さらにまた、トランスジェニック作物植物の中で有害な植物を防除するための除草剤としての、本発明の化合物の使用も提供する。

【0051】

本発明の化合物は、慣習的な製剤における水和剤、乳剤、散布可能溶液剤、散粉性製品 (dusting product) 又は顆粒剤の形態で 사용할ことができる。従って、本発明は、さらにまた、本発明の化合物を含んでいる除草剤組成物及び植物成長調節性組成物も提供する。

【0052】

本発明の化合物は、必要とされる生物学的及び／又は物理化学的パラメータに応じて、さまざまな方法で製剤することができる。可能な製剤としては、例えば、以下のものを挙げることができる：水和剤 (WP)、水溶剤 (water-soluble powders) (SP)、水溶性濃厚剤 (water-soluble concentrates)、乳剤 (EC)、エマルジョン剤 (EW)、例えば、水中油型エマルジョン剤及び油中水型エマルジョン剤、散布可能溶液剤 (sprayable solutions)、懸濁製剤 (SC)、油又は水に基づく分散液剤、油混和性溶液剤、カプセル懸濁製剤 (capsule suspensions) (CS)、散粉性製品 (dusting products) (DP)、粉衣剤 (dressings)、ばらまき用顆粒剤及び土壌施用用顆粒剤、微粒剤の形態にある顆粒剤 (GR)、噴霧粒剤 (spray granules)、吸収粒剤 (absorption granules) 及び含浸粒剤 (adsorption granules)、顆粒水和剤 (WG)、水溶性粒剤 (SG)、微量散布製剤、マイクロカプセル剤、並びに、蠟剤 (waxes)。

20

30

【0053】

これらの個々の製剤の型は原則として知られており、そして、例えば、以下のものに記載されている：「Winnacker-Kuchler, “Chemische Technologie” [Chemical Technology], volume 7, C. Hanser Verlag Munich, 4th Ed. 1986」、 「Wade van Valkenburg, “Pesticide Formulations”, Marcel Dekker, N. Y., 1973」、 「K. Martens, “Spray Drying” Handbook, 3rd Ed. 1979, G. Goodwin Ltd. London」。

40

【0054】

不活性物質、界面活性剤、溶媒及びさらなる添加剤などの必要とされる製剤助剤も同様に知られており、そして、例えば、以下のものに記載されている：「Watkins, “Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers”, 2nd ed., Darland Books, Caldwell N. J.」、 「H. v. Olphen, “Introduction to Clay Colloid Chemistry”, 2nd ed., J. Wiley & Sons, N. Y.」、 「C. Marsden, “Solvents Guide”, 2nd ed., Interscience, N. Y. 196

50

3」、「McCUTCHEON'S "Detergents and Emulsifiers Annual", MC Publ. Corp., Ridgewood N. J.」、「Sisley and Wood, "Encyclopedia of Surface Active Agents", Chem. Publ. Co. Inc., N. Y. 1964」、「Schonfeldt, "Grenzflächenaktive Äthylenoxidaddukte" [Interface-active Ethylene Oxide Adducts], Wiss. Verlagsgesellschaft, Stuttgart 1976」、「Winnacker-Kuchler, "Chemische Technologie" [Chemical Engineering], volume 7, C. Hanser Verlag Munich, 4th Ed. 1986」。

【0055】

これらの製剤に基づいて、別の殺有害生物活性物質（例えば、殺虫剤、殺ダニ剤、除草剤、殺菌剤）との組合せ物や、さらにまた、薬害軽減剤、肥料及び／若しくは成長調節剤との組合せ物を、例えば、完成した製剤の形態で又はタンクミックスとして、製造することも可能である。

【0056】

水和剤は、水中で均質に分散させることが可能な調製物であり、そして、活性成分に加えて、希釈剤又は不活性物質とは別に、さらに、イオン性及び／又は非イオン性のタイプの界面活性剤（湿潤剤、分散剤）、例えば、ポリエトキシ化アルキルフェノール、ポリエトキシ化脂肪族アルコール、ポリエトキシ化脂肪族アミン、脂肪族アルコールポリグリコールエーテルスルフェート、アルカンスルホネート、アルキルベンゼンスルホネート、リグノスルホン酸ナトリウム、2, 2'-ジナフチルメタン-6, 6'-ジスルホン酸ナトリウム、ジブチルナフタレンスルホン酸ナトリウム又はオレオイルメチルタウリンナトリウムなども含んでいる。水和剤を製造するためには、例えば、ハンマーミル、ブロワミル及びエアージェットミルなどの慣習的な装置の中で、該除草活性成分を微粉碎し、そして、同時に又はその後で、製剤補助剤と混合させる。

【0057】

乳剤は、該活性成分を有機溶媒（例えば、ブタノール、シクロヘキサノン、ジメチルホルムアミド、キシレン又は比較的沸点が高い芳香族物質若しくは炭化水素など）又はそのような有機溶媒の混合物の中に溶解させ、イオン性及び／又は非イオン性の1種類以上の界面活性剤（乳化剤）を添加することによって製造する。使用し得る乳化剤の例は、以下のものである：アルキルアリアルスルホン酸カルシウム、例えば、ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム、又は、非イオン性乳化剤、例えば、脂肪酸ポリグリコールエステル、アルキルアリアルポリグリコールエーテル、脂肪族アルコールポリグリコールエーテル、プロピレンオキシド-エチレンオキシド縮合物、アルキルポリエーテル、ソルビタンエステル、例えば、ソルビタン脂肪酸エステル、又は、ポリオキシエチレンソルビタンエステル、例えば、ポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル。

【0058】

散粉性粉末（dustable powders）は、該活性成分を微粉碎された（finely distributed）固形物質（例えば、タルク、自然粘土、例えば、カオリン、ベントナイト及び葉ろう石、又は、珪藻土など）と一緒に粉碎することによって得られる。

【0059】

懸濁製剤は、水性又は油性であることができる。それらは、例えば、商業用ビーズミルを用いて、そして、場合により界面活性剤（例えば、別の製剤型に関して既に上記で挙げられている界面活性剤）を添加して、湿式粉碎することによって調製することができる。

【0060】

エマルション剤、例えば、水中油型エマルション剤（EW）は、例えば、水性有機溶媒を使用し、そして、場合により界面活性剤（例えば、別の製剤型に関して既に上記で挙げ

られている界面活性剤)を使用して、攪拌機、コロイドミル及び／又はスタティックミキサーを用いて調製することができる。

【0061】

顆粒剤は、顆粒状の吸着性不活性物質の表面上に該活性成分を噴霧することによって、又は、担体(例えば、砂、カオリナイト又は顆粒状の不活性物質)の表面上に接着剤(例えば、ポリビニルアルコール、ポリアクリル酸ナトリウム)若しくは鉱油を用いて活性成分濃厚物を塗布することによって、調製することができる。さらにまた、肥料顆粒を製造するための慣習的な方法で(必用に応じて、肥料との混合物として)、適切な活性成分を造粒することも可能である。

【0062】

顆粒水和剤は、一般に、噴霧乾燥、流動床造粒、パン造粒、高速ミキサーを用いた混合、及び、固形不活性物質を用いない押出などの、慣習的な方法によって調製する。

【0063】

パン粒剤、流動床粒剤、押出粒剤及び噴霧粒剤の製造に関しては、例えば、「“Spray Drying Handbook” 3rd Ed. 1979, G. Goodwin Ltd., London」、「J. E. Browning, “Agglomeration”, Chemical and Engineering 1967, pages 147 ff」、「“Perry’s Chemical Engineer’s Handbook”, 5th ed., McGraw-Hill, New York 1973, pp. 8-57」に記載されている方法を参照されたい。

【0064】

作物保護組成物の製剤に関するさらなる詳細については、例えば、「G. C. Klingman, “Weed Control as a Science”, John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, pages 81-96」及び「J. D. Freyer, S. A. Evans, “Weed Control Handbook”, 5th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1968, pages 101-103」を参照されたい。

【0065】

該農薬調製物は、一般に、0.1～99重量%、特に、0.1～95重量%の本発明化合物を含有する。

【0066】

水和剤では、該活性成分の濃度は、例えば、約10重量%～90重量%であり、100重量%までの残余は、慣習的な製剤成分からなる。乳剤では、該活性成分の濃度は、約1重量%～90重量%、好ましくは5重量%～80重量%であり得る。粉剤のタイプの製剤は、1重量%～30重量%の活性成分、好ましくは、通常、5重量%～20重量%の活性成分を含み；散布可能溶液剤は、約0.05重量%～80重量%、好ましくは、2重量%～50重量%の活性成分を含む。顆粒水和剤の場合は、該活性成分の含有量は、当該活性化合物が液体形態で存在しているか又は固体形態で存在しているかに部分的に依存し、及び、どのような造粒助剤、増量剤などが使用されるかに部分的に左右される。水中で分散可能な顆粒剤では、活性成分の含有量は、例えば、1重量%～95重量%、好ましくは10～80重量%である。

【0067】

さらに、活性成分の上記製剤は、場合により、それぞれの慣習的な粘着剤、湿潤剤、分散剤、乳化剤、浸透剤、防腐剤、不凍剤、並びに、溶媒、増量剤、担体、並びに、色素、消泡剤、蒸発抑制剤、並びに、pH及び粘度に影響を及ぼす作用剤を含有する。

【0068】

施用するために、商業用の形態にある製剤は、適切な場合には、慣習的な方法で希釈し、例えば、水和剤、乳剤、分散液剤及び顆粒水和剤の場合には、水で希釈する。粉剤のタイプの製剤、土壌施用用顆粒剤又はばらまき用顆粒剤及び散布可能溶液剤は、通常、施用

10

20

30

40

50

前に別の不活性物質でさらに希釈することはない。

【0069】

式(I)で表される化合物の必要とされる施用量は、外部条件(例えば、温度、湿度及び使用する除草剤の種類など)に応じて変わる。それは、広い範囲内で、例えば、0.001~1.0kg/ha又はそれ以上の活性物質の範囲内で、変わり得る。しかしながら、それは、好ましくは、0.005~750g/haである。

【0070】

以下の表に記載されている実施例は、極めて特に好ましい。

【0071】

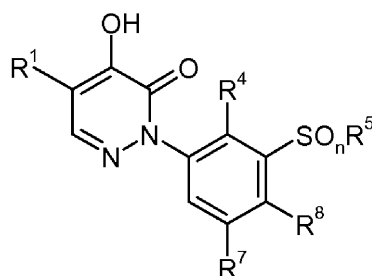
使用されている略語は、下記意味を有する：

Me = メチル

c-Pr = シクロプロピル

【表1】

表1： 一般式(I)〔式中、R²及びR³は、それぞれ、水素を表し、Aは直接結合を表し、X¹はCHを表し、X²はCR⁷を表し、及び、X³はCR⁸を表す〕で表される本発明化合物



Nr.	R ¹	R ⁴	n	R ⁵	R ⁷	R ⁸
1-1	Me	Me	0	c-Pr	H	H
1-2	Me	Me	1	c-Pr	H	H
1-3	Me	Me	2	c-Pr	H	H
1-4	Me	Cl	0	c-Pr	H	H
1-5	Me	Cl	1	c-Pr	H	H
1-6	Me	Cl	2	c-Pr	H	H
1-7	Me	Me	0	c-Pr	H	Me
1-8	Me	Me	1	c-Pr	H	Me
1-9	Me	Me	2	c-Pr	H	Me
1-10	Me	Cl	0	c-Pr	H	Me
1-11	Me	Cl	1	c-Pr	H	Me
1-12	Me	Cl	2	c-Pr	H	Me
1-13	Me	Me	0	c-Pr	H	Cl
1-14	Me	Me	1	c-Pr	H	Cl
1-15	Me	Me	2	c-Pr	H	Cl
1-16	Me	Cl	0	c-Pr	H	Cl
1-17	Me	Cl	1	c-Pr	H	Cl

Nr.	R ¹	R ⁴	n	R ⁵	R ⁷	R ⁸
1-18	Me	Cl	2	c-Pr	H	Cl
1-19	Me	Me	0	c-Pr	H	CF ₃
1-20	Me	Me	1	c-Pr	H	CF ₃
1-21	Me	Me	2	c-Pr	H	CF ₃
1-22	Me	Cl	0	c-Pr	H	CF ₃
1-23	Me	Cl	1	c-Pr	H	CF ₃
1-24	Me	Cl	2	c-Pr	H	CF ₃
1-25	Me	Me	0	c-Pr	H	SO ₂ Me
1-26	Me	Me	1	c-Pr	H	SO ₂ Me
1-27	Me	Me	2	c-Pr	H	SO ₂ Me
1-28	Me	Cl	0	c-Pr	H	SO ₂ Me
1-29	Me	Cl	1	c-Pr	H	SO ₂ Me
1-30	Me	Cl	2	c-Pr	H	SO ₂ Me
1-31	Me	Me	0	c-Pr	Me	H
1-32	Me	Me	1	c-Pr	Me	H
1-33	Me	Me	2	c-Pr	Me	H
1-34	Me	Cl	0	c-Pr	Me	H
1-35	Me	Cl	1	c-Pr	Me	H
1-36	Me	Cl	2	c-Pr	Me	H
1-37	Me	Me	0	c-Pr	Me	Me
1-38	Me	Me	1	c-Pr	Me	Me
1-39	Me	Me	2	c-Pr	Me	Me
1-40	Me	Cl	0	c-Pr	Me	Me
1-41	Me	Cl	1	c-Pr	Me	Me
1-42	Me	Cl	2	c-Pr	Me	Me
1-43	Me	Me	0	c-Pr	Me	Cl
1-44	Me	Me	1	c-Pr	Me	Cl
1-45	Me	Me	2	c-Pr	Me	Cl
1-46	Me	Cl	0	c-Pr	Me	Cl
1-47	Me	Cl	1	c-Pr	Me	Cl
1-48	Me	Cl	2	c-Pr	Me	Cl
1-49	Me	Me	0	c-Pr	Me	CF ₃
1-50	Me	Me	1	c-Pr	Me	CF ₃
1-51	Me	Me	2	c-Pr	Me	CF ₃
1-52	Me	Cl	0	c-Pr	Me	CF ₃
1-53	Me	Cl	1	c-Pr	Me	CF ₃

10

20

30

40

Nr.	R ¹	R ⁴	n	R ⁵	R ⁷	R ⁸
1-54	Me	Cl	2	c-Pr	Me	CF ₃
1-55	Me	Me	0	c-Pr	Me	SO ₂ Me
1-56	Me	Me	1	c-Pr	Me	SO ₂ Me
1-57	Me	Me	2	c-Pr	Me	SO ₂ Me
1-58	Me	Cl	0	c-Pr	Me	SO ₂ Me
1-59	Me	Cl	1	c-Pr	Me	SO ₂ Me
1-60	Me	Cl	2	c-Pr	Me	SO ₂ Me
1-61	c-Pr	Me	0	c-Pr	H	H
1-62	c-Pr	Me	1	c-Pr	H	H
1-63	c-Pr	Me	2	c-Pr	H	H
1-64	c-Pr	Cl	0	c-Pr	H	H
1-65	c-Pr	Cl	1	c-Pr	H	H
1-66	c-Pr	Cl	2	c-Pr	H	H
1-67	c-Pr	Me	0	c-Pr	H	Me
1-68	c-Pr	Me	1	c-Pr	H	Me
1-69	c-Pr	Me	2	c-Pr	H	Me
1-70	c-Pr	Cl	0	c-Pr	H	Me
1-71	c-Pr	Cl	1	c-Pr	H	Me
1-72	c-Pr	Cl	2	c-Pr	H	Me
1-73	c-Pr	Me	0	c-Pr	H	Cl
1-74	c-Pr	Me	1	c-Pr	H	Cl
1-75	c-Pr	Me	2	c-Pr	H	Cl
1-76	c-Pr	Cl	0	c-Pr	H	Cl
1-77	c-Pr	Cl	1	c-Pr	H	Cl
1-78	c-Pr	Cl	2	c-Pr	H	Cl
1-79	c-Pr	Me	0	c-Pr	H	CF ₃
1-80	c-Pr	Me	1	c-Pr	H	CF ₃
1-81	c-Pr	Me	2	c-Pr	H	CF ₃
1-82	c-Pr	Cl	0	c-Pr	H	CF ₃
1-83	c-Pr	Cl	1	c-Pr	H	CF ₃
1-84	c-Pr	Cl	2	c-Pr	H	CF ₃
1-85	c-Pr	Me	0	c-Pr	H	SO ₂ Me
1-86	c-Pr	Me	1	c-Pr	H	SO ₂ Me
1-87	c-Pr	Me	2	c-Pr	H	SO ₂ Me
1-88	c-Pr	Cl	0	c-Pr	H	SO ₂ Me
1-89	c-Pr	Cl	1	c-Pr	H	SO ₂ Me

10

20

30

40

No.	R1	R4	n	R5	R7	R8
1-90	c-Pr	Cl	2	c-Pr	H	SO ₂ Me
1-91	c-Pr	Me	0	c-Pr	Me	H
1-92	c-Pr	Me	1	c-Pr	Me	H
1-93	c-Pr	Me	2	c-Pr	Me	H
1-94	c-Pr	Cl	0	c-Pr	Me	H
1-95	c-Pr	Cl	1	c-Pr	Me	H
1-96	c-Pr	Cl	2	c-Pr	Me	H
1-97	c-Pr	Me	0	c-Pr	Me	Me
1-98	c-Pr	Me	1	c-Pr	Me	Me
1-99	c-Pr	Me	2	c-Pr	Me	Me
1-100	c-Pr	Cl	0	c-Pr	Me	Me
1-101	c-Pr	Cl	1	c-Pr	Me	Me
1-102	c-Pr	Cl	2	c-Pr	Me	Me
1-103	c-Pr	Me	0	c-Pr	Me	Cl
1-104	c-Pr	Me	1	c-Pr	Me	Cl
1-105	c-Pr	Me	2	c-Pr	Me	Cl
1-106	c-Pr	Cl	0	c-Pr	Me	Cl
1-107	c-Pr	Cl	1	c-Pr	Me	Cl
1-108	c-Pr	Cl	2	c-Pr	Me	Cl
1-109	c-Pr	Me	0	c-Pr	Me	CF ₃
1-110	c-Pr	Me	1	c-Pr	Me	CF ₃
1-111	c-Pr	Me	2	c-Pr	Me	CF ₃
1-112	c-Pr	Cl	0	c-Pr	Me	CF ₃
1-113	c-Pr	Cl	1	c-Pr	Me	CF ₃
1-114	c-Pr	Cl	2	c-Pr	Me	CF ₃
1-115	c-Pr	Me	0	c-Pr	Me	SO ₂ Me
1-116	c-Pr	Me	1	c-Pr	Me	SO ₂ Me
1-117	c-Pr	Me	2	c-Pr	Me	SO ₂ Me
1-118	c-Pr	Cl	0	c-Pr	Me	SO ₂ Me
1-119	c-Pr	Cl	1	c-Pr	Me	SO ₂ Me
1-120	c-Pr	Cl	2	c-Pr	Me	SO ₂ Me
1-121	プロペン-2-イル	Me	0	c-Pr	H	H
1-122	プロペン-2-イル	Me	1	c-Pr	H	H
1-123	プロペン-2-イル	Me	2	c-Pr	H	H
1-124	プロペン-2-イル	Cl	0	c-Pr	H	H
1-125	プロペン-2-イル	Cl	1	c-Pr	H	H

10

20

30

40

No.	R ¹	R ⁴	n	R ⁵	R ⁷	R ⁸
1-126	プロペン-2-イル	Cl	2	c-Pr	H	H
1-127	プロペン-2-イル	Me	0	c-Pr	H	Me
1-128	プロペン-2-イル	Me	1	c-Pr	H	Me
1-129	プロペン-2-イル	Me	2	c-Pr	H	Me
1-130	プロペン-2-イル	Cl	0	c-Pr	H	Me
1-131	プロペン-2-イル	Cl	1	c-Pr	H	Me
1-132	プロペン-2-イル	Cl	2	c-Pr	H	Me
1-133	プロペン-2-イル	Me	0	c-Pr	H	Cl
1-134	プロペン-2-イル	Me	1	c-Pr	H	Cl
1-135	プロペン-2-イル	Me	2	c-Pr	H	Cl
1-136	プロペン-2-イル	Cl	0	c-Pr	H	Cl
1-137	プロペン-2-イル	Cl	1	c-Pr	H	Cl
1-138	プロペン-2-イル	Cl	2	c-Pr	H	Cl
1-139	プロペン-2-イル	Me	0	c-Pr	H	CF ₃
1-140	プロペン-2-イル	Me	1	c-Pr	H	CF ₃
1-141	プロペン-2-イル	Me	2	c-Pr	H	CF ₃
1-142	プロペン-2-イル	Cl	0	c-Pr	H	CF ₃
1-143	プロペン-2-イル	Cl	1	c-Pr	H	CF ₃
1-144	プロペン-2-イル	Cl	2	c-Pr	H	CF ₃
1-145	プロペン-2-イル	Me	0	c-Pr	H	SO ₂ Me
1-146	プロペン-2-イル	Me	1	c-Pr	H	SO ₂ Me
1-147	プロペン-2-イル	Me	2	c-Pr	H	SO ₂ Me
1-148	プロペン-2-イル	Cl	0	c-Pr	H	SO ₂ Me
1-149	プロペン-2-イル	Cl	1	c-Pr	H	SO ₂ Me
1-150	プロペン-2-イル	Cl	2	c-Pr	H	SO ₂ Me
1-151	プロペン-2-イル	Me	0	c-Pr	Me	H
1-152	プロペン-2-イル	Me	1	c-Pr	Me	H
1-153	プロペン-2-イル	Me	2	c-Pr	Me	H
1-154	プロペン-2-イル	Cl	0	c-Pr	Me	H
1-155	プロペン-2-イル	Cl	1	c-Pr	Me	H
1-156	プロペン-2-イル	Cl	2	c-Pr	Me	H
1-157	プロペン-2-イル	Me	0	c-Pr	Me	Me
1-158	プロペン-2-イル	Me	1	c-Pr	Me	Me
1-159	プロペン-2-イル	Me	2	c-Pr	Me	Me
1-160	プロペン-2-イル	Cl	0	c-Pr	Me	Me
1-161	プロペン-2-イル	Cl	1	c-Pr	Me	Me

10

20

30

40

No.	R ¹	R ⁴	n	R ⁵	R ⁷	R ⁸
1-162	プロペン-2-イル	Cl	2	c-Pr	Me	Me
1-163	プロペン-2-イル	Me	0	c-Pr	Me	Cl
1-164	プロペン-2-イル	Me	1	c-Pr	Me	Cl
1-165	プロペン-2-イル	Me	2	c-Pr	Me	Cl
1-166	プロペン-2-イル	Cl	0	c-Pr	Me	Cl
1-167	プロペン-2-イル	Cl	1	c-Pr	Me	Cl
1-168	プロペン-2-イル	Cl	2	c-Pr	Me	Cl
1-169	プロペン-2-イル	Me	0	c-Pr	Me	CF ₃
1-170	プロペン-2-イル	Me	1	c-Pr	Me	CF ₃
1-171	プロペン-2-イル	Me	2	c-Pr	Me	CF ₃
1-172	プロペン-2-イル	Cl	0	c-Pr	Me	CF ₃
1-173	プロペン-2-イル	Cl	1	c-Pr	Me	CF ₃
1-174	プロペン-2-イル	Cl	2	c-Pr	Me	CF ₃
1-175	プロペン-2-イル	Me	0	c-Pr	Me	SO ₂ Me
1-176	プロペン-2-イル	Me	1	c-Pr	Me	SO ₂ Me
1-177	プロペン-2-イル	Me	2	c-Pr	Me	SO ₂ Me
1-178	プロペン-2-イル	Cl	0	c-Pr	Me	SO ₂ Me
1-179	プロペン-2-イル	Cl	1	c-Pr	Me	SO ₂ Me
1-180	プロペン-2-イル	Cl	2	c-Pr	Me	SO ₂ Me
1-181	Cl	Me	0	c-Pr	H	H
1-182	Cl	Me	1	c-Pr	H	H
1-183	Cl	Me	2	c-Pr	H	H
1-184	Cl	Cl	0	c-Pr	H	H
1-185	Cl	Cl	1	c-Pr	H	H
1-186	Cl	Cl	2	c-Pr	H	H
1-187	Cl	Me	0	c-Pr	H	Me
1-188	Cl	Me	1	c-Pr	H	Me
1-189	Cl	Me	2	c-Pr	H	Me
1-190	Cl	Cl	0	c-Pr	H	Me
1-191	Cl	Cl	1	c-Pr	H	Me
1-192	Cl	Cl	2	c-Pr	H	Me
1-193	Cl	Me	0	c-Pr	H	Cl
1-194	Cl	Me	1	c-Pr	H	Cl
1-195	Cl	Me	2	c-Pr	H	Cl
1-196	Cl	Cl	0	c-Pr	H	Cl
1-197	Cl	Cl	1	c-Pr	H	Cl

10

20

30

40

Nr.	R ¹	R ⁴	n	R ⁵	R ⁷	R ⁸
1-198	Cl	Cl	2	c-Pr	H	Cl
1-199	Cl	Me	0	c-Pr	H	CF ₃
1-200	Cl	Me	1	c-Pr	H	CF ₃
1-201	Cl	Me	2	c-Pr	H	CF ₃
1-202	Cl	Cl	0	c-Pr	H	CF ₃
1-203	Cl	Cl	1	c-Pr	H	CF ₃
1-204	Cl	Cl	2	c-Pr	H	CF ₃
1-205	Cl	Me	0	c-Pr	H	SO ₂ Me
1-206	Cl	Me	1	c-Pr	H	SO ₂ Me
1-207	Cl	Me	2	c-Pr	H	SO ₂ Me
1-208	Cl	Cl	0	c-Pr	H	SO ₂ Me
1-209	Cl	Cl	1	c-Pr	H	SO ₂ Me
1-210	Cl	Cl	2	c-Pr	H	SO ₂ Me
1-211	Cl	Me	0	c-Pr	Me	H
1-212	Cl	Me	1	c-Pr	Me	H
1-213	Cl	Me	2	c-Pr	Me	H
1-214	Cl	Cl	0	c-Pr	Me	H
1-215	Cl	Cl	1	c-Pr	Me	H
1-216	Cl	Cl	2	c-Pr	Me	H
1-217	Cl	Me	0	c-Pr	Me	Me
1-218	Cl	Me	1	c-Pr	Me	Me
1-219	Cl	Me	2	c-Pr	Me	Me
1-220	Cl	Cl	0	c-Pr	Me	Me
1-221	Cl	Cl	1	c-Pr	Me	Me
1-222	Cl	Cl	2	c-Pr	Me	Me
1-223	Cl	Me	0	c-Pr	Me	Cl
1-224	Cl	Me	1	c-Pr	Me	Cl
1-225	Cl	Me	2	c-Pr	Me	Cl
1-226	Cl	Cl	0	c-Pr	Me	Cl
1-227	Cl	Cl	1	c-Pr	Me	Cl
1-228	Cl	Cl	2	c-Pr	Me	Cl
1-229	Cl	Me	0	c-Pr	Me	CF ₃
1-230	Cl	Me	1	c-Pr	Me	CF ₃
1-231	Cl	Me	2	c-Pr	Me	CF ₃
1-232	Cl	Cl	0	c-Pr	Me	CF ₃
1-233	Cl	Cl	1	c-Pr	Me	CF ₃

10

20

30

40

Nr.	R ¹	R ⁴	n	R ⁵	R ⁷	R ⁸
1-234	Cl	Cl	2	c-Pr	Me	CF ₃
1-235	Cl	Me	0	c-Pr	Me	SO ₂ Me
1-236	Cl	Me	1	c-Pr	Me	SO ₂ Me
1-237	Cl	Me	2	c-Pr	Me	SO ₂ Me
1-238	Cl	Cl	0	c-Pr	Me	SO ₂ Me
1-239	Cl	Cl	1	c-Pr	Me	SO ₂ Me
1-240	Cl	Cl	2	c-Pr	Me	SO ₂ Me
1-241	SO ₂ Me	Me	0	c-Pr	H	H
1-242	SO ₂ Me	Me	1	c-Pr	H	H
1-243	SO ₂ Me	Me	2	c-Pr	H	H
1-244	SO ₂ Me	Cl	0	c-Pr	H	H
1-245	SO ₂ Me	Cl	1	c-Pr	H	H
1-246	SO ₂ Me	Cl	2	c-Pr	H	H
1-247	SO ₂ Me	Me	0	c-Pr	H	Me
1-248	SO ₂ Me	Me	1	c-Pr	H	Me
1-249	SO ₂ Me	Me	2	c-Pr	H	Me
1-250	SO ₂ Me	Cl	0	c-Pr	H	Me
1-251	SO ₂ Me	Cl	1	c-Pr	H	Me
1-252	SO ₂ Me	Cl	2	c-Pr	H	Me
1-253	SO ₂ Me	Me	0	c-Pr	H	Cl
1-254	SO ₂ Me	Me	1	c-Pr	H	Cl
1-255	SO ₂ Me	Me	2	c-Pr	H	Cl
1-256	SO ₂ Me	Cl	0	c-Pr	H	Cl
1-257	SO ₂ Me	Cl	1	c-Pr	H	Cl
1-258	SO ₂ Me	Cl	2	c-Pr	H	Cl
1-259	SO ₂ Me	Me	0	c-Pr	H	CF ₃
1-260	SO ₂ Me	Me	1	c-Pr	H	CF ₃
1-261	SO ₂ Me	Me	2	c-Pr	H	CF ₃
1-262	SO ₂ Me	Cl	0	c-Pr	H	CF ₃
1-263	SO ₂ Me	Cl	1	c-Pr	H	CF ₃
1-264	SO ₂ Me	Cl	2	c-Pr	H	CF ₃
1-265	SO ₂ Me	Me	0	c-Pr	H	SO ₂ Me
1-266	SO ₂ Me	Me	1	c-Pr	H	SO ₂ Me
1-267	SO ₂ Me	Me	2	c-Pr	H	SO ₂ Me
1-268	SO ₂ Me	Cl	0	c-Pr	H	SO ₂ Me
1-269	SO ₂ Me	Cl	1	c-Pr	H	SO ₂ Me

10

20

30

40

Nr.	R ¹	R ⁴	n	R ⁵	R ⁷	R ⁸
1-270	SO ₂ Me	Cl	2	c-Pr	H	SO ₂ Me
1-271	SO ₂ Me	Me	0	c-Pr	Me	H
1-272	SO ₂ Me	Me	1	c-Pr	Me	H
1-273	SO ₂ Me	Me	2	c-Pr	Me	H
1-274	SO ₂ Me	Cl	0	c-Pr	Me	H
1-275	SO ₂ Me	Cl	1	c-Pr	Me	H
1-276	SO ₂ Me	Cl	2	c-Pr	Me	H
1-277	SO ₂ Me	Me	0	c-Pr	Me	Me
1-278	SO ₂ Me	Me	1	c-Pr	Me	Me
1-279	SO ₂ Me	Me	2	c-Pr	Me	Me
1-280	SO ₂ Me	Cl	0	c-Pr	Me	Me
1-281	SO ₂ Me	Cl	1	c-Pr	Me	Me
1-282	SO ₂ Me	Cl	2	c-Pr	Me	Me
1-283	SO ₂ Me	Me	0	c-Pr	Me	Cl
1-284	SO ₂ Me	Me	1	c-Pr	Me	Cl
1-285	SO ₂ Me	Me	2	c-Pr	Me	Cl
1-286	SO ₂ Me	Cl	0	c-Pr	Me	Cl
1-287	SO ₂ Me	Cl	1	c-Pr	Me	Cl
1-288	SO ₂ Me	Cl	2	c-Pr	Me	Cl
1-289	SO ₂ Me	Me	0	c-Pr	Me	CF ₃
1-290	SO ₂ Me	Me	1	c-Pr	Me	CF ₃
1-291	SO ₂ Me	Me	2	c-Pr	Me	CF ₃
1-292	SO ₂ Me	Cl	0	c-Pr	Me	CF ₃
1-293	SO ₂ Me	Cl	1	c-Pr	Me	CF ₃
1-294	SO ₂ Me	Cl	2	c-Pr	Me	CF ₃
1-295	SO ₂ Me	Me	0	c-Pr	Me	SO ₂ Me
1-296	SO ₂ Me	Me	1	c-Pr	Me	SO ₂ Me
1-297	SO ₂ Me	Me	2	c-Pr	Me	SO ₂ Me
1-298	SO ₂ Me	Cl	0	c-Pr	Me	SO ₂ Me
1-299	SO ₂ Me	Cl	1	c-Pr	Me	SO ₂ Me
1-300	SO ₂ Me	Cl	2	c-Pr	Me	SO ₂ Me
1-301	Me	Me	0	CH ₂ -c-Pr	H	H
1-302	Me	Me	1	CH ₂ -c-Pr	H	H
1-303	Me	Me	2	CH ₂ -c-Pr	H	H
1-304	Me	Cl	0	CH ₂ -c-Pr	H	H
1-305	Me	Cl	1	CH ₂ -c-Pr	H	H

10

20

30

40

Nr.	R ¹	R ⁴	n	R ⁵	R ⁷	R ⁸
1-306	Me	Cl	2	CH ₂ -c-Pr	H	H
1-307	Me	Me	0	CH ₂ -c-Pr	H	Me
1-308	Me	Me	1	CH ₂ -c-Pr	H	Me
1-309	Me	Me	2	CH ₂ -c-Pr	H	Me
1-310	Me	Cl	0	CH ₂ -c-Pr	H	Me
1-311	Me	Cl	1	CH ₂ -c-Pr	H	Me
1-312	Me	Cl	2	CH ₂ -c-Pr	H	Me
1-313	Me	Me	0	CH ₂ -c-Pr	H	Cl
1-314	Me	Me	1	CH ₂ -c-Pr	H	Cl
1-315	Me	Me	2	CH ₂ -c-Pr	H	Cl
1-316	Me	Cl	0	CH ₂ -c-Pr	H	Cl
1-317	Me	Cl	1	CH ₂ -c-Pr	H	Cl
1-318	Me	Cl	2	CH ₂ -c-Pr	H	Cl
1-319	Me	Me	0	CH ₂ -c-Pr	H	CF ₃
1-320	Me	Me	1	CH ₂ -c-Pr	H	CF ₃
1-321	Me	Me	2	CH ₂ -c-Pr	H	CF ₃
1-322	Me	Cl	0	CH ₂ -c-Pr	H	CF ₃
1-323	Me	Cl	1	CH ₂ -c-Pr	H	CF ₃
1-324	Me	Cl	2	CH ₂ -c-Pr	H	CF ₃
1-325	Me	Me	0	CH ₂ -c-Pr	H	SO ₂ Me
1-326	Me	Me	1	CH ₂ -c-Pr	H	SO ₂ Me
1-327	Me	Me	2	CH ₂ -c-Pr	H	SO ₂ Me
1-328	Me	Cl	0	CH ₂ -c-Pr	H	SO ₂ Me
1-329	Me	Cl	1	CH ₂ -c-Pr	H	SO ₂ Me
1-330	Me	Cl	2	CH ₂ -c-Pr	H	SO ₂ Me
1-331	Me	Me	0	CH ₂ -c-Pr	Me	H
1-332	Me	Me	1	CH ₂ -c-Pr	Me	H
1-333	Me	Me	2	CH ₂ -c-Pr	Me	H
1-334	Me	Cl	0	CH ₂ -c-Pr	Me	H
1-335	Me	Cl	1	CH ₂ -c-Pr	Me	H
1-336	Me	Cl	2	CH ₂ -c-Pr	Me	H
1-337	Me	Me	0	CH ₂ -c-Pr	Me	Me
1-338	Me	Me	1	CH ₂ -c-Pr	Me	Me
1-339	Me	Me	2	CH ₂ -c-Pr	Me	Me
1-340	Me	Cl	0	CH ₂ -c-Pr	Me	Me
1-341	Me	Cl	1	CH ₂ -c-Pr	Me	Me

10

20

30

40

Nr.	R ¹	R ⁴	n	R ⁵	R ⁷	R ⁸
1-342	Me	Cl	2	CH ₂ -c-Pr	Me	Me
1-343	Me	Me	0	CH ₂ -c-Pr	Me	Cl
1-344	Me	Me	1	CH ₂ -c-Pr	Me	Cl
1-345	Me	Me	2	CH ₂ -c-Pr	Me	Cl
1-346	Me	Cl	0	CH ₂ -c-Pr	Me	Cl
1-347	Me	Cl	1	CH ₂ -c-Pr	Me	Cl
1-348	Me	Cl	2	CH ₂ -c-Pr	Me	Cl
1-349	Me	Me	0	CH ₂ -c-Pr	Me	CF ₃
1-350	Me	Me	1	CH ₂ -c-Pr	Me	CF ₃
1-351	Me	Me	2	CH ₂ -c-Pr	Me	CF ₃
1-352	Me	Cl	0	CH ₂ -c-Pr	Me	CF ₃
1-353	Me	Cl	1	CH ₂ -c-Pr	Me	CF ₃
1-354	Me	Cl	2	CH ₂ -c-Pr	Me	CF ₃
1-355	Me	Me	0	CH ₂ -c-Pr	Me	SO ₂ Me
1-356	Me	Me	1	CH ₂ -c-Pr	Me	SO ₂ Me
1-357	Me	Me	2	CH ₂ -c-Pr	Me	SO ₂ Me
1-358	Me	Cl	0	CH ₂ -c-Pr	Me	SO ₂ Me
1-359	Me	Cl	1	CH ₂ -c-Pr	Me	SO ₂ Me
1-360	Me	Cl	2	CH ₂ -c-Pr	Me	SO ₂ Me
1-361	c-Pr	Me	0	CH ₂ -c-Pr	H	H
1-362	c-Pr	Me	1	CH ₂ -c-Pr	H	H
1-363	c-Pr	Me	2	CH ₂ -c-Pr	H	H
1-364	c-Pr	Cl	0	CH ₂ -c-Pr	H	H
1-365	c-Pr	Cl	1	CH ₂ -c-Pr	H	H
1-366	c-Pr	Cl	2	CH ₂ -c-Pr	H	H
1-367	c-Pr	Me	0	CH ₂ -c-Pr	H	Me
1-368	c-Pr	Me	1	CH ₂ -c-Pr	H	Me
1-369	c-Pr	Me	2	CH ₂ -c-Pr	H	Me
1-370	c-Pr	Cl	0	CH ₂ -c-Pr	H	Me
1-371	c-Pr	Cl	1	CH ₂ -c-Pr	H	Me
1-372	c-Pr	Cl	2	CH ₂ -c-Pr	H	Me
1-373	c-Pr	Me	0	CH ₂ -c-Pr	H	Cl
1-374	c-Pr	Me	1	CH ₂ -c-Pr	H	Cl
1-375	c-Pr	Me	2	CH ₂ -c-Pr	H	Cl
1-376	c-Pr	Cl	0	CH ₂ -c-Pr	H	Cl
1-377	c-Pr	Cl	1	CH ₂ -c-Pr	H	Cl

10

20

30

40

Nr.	R ¹	R ⁴	n	R ⁵	R ⁷	R ⁸
1-378	c-Pr	Cl	2	CH ₂ -c-Pr	H	Cl
1-379	c-Pr	Me	0	CH ₂ -c-Pr	H	CF ₃
1-380	c-Pr	Me	1	CH ₂ -c-Pr	H	CF ₃
1-381	c-Pr	Me	2	CH ₂ -c-Pr	H	CF ₃
1-382	c-Pr	Cl	0	CH ₂ -c-Pr	H	CF ₃
1-383	c-Pr	Cl	1	CH ₂ -c-Pr	H	CF ₃
1-384	c-Pr	Cl	2	CH ₂ -c-Pr	H	CF ₃
1-385	c-Pr	Me	0	CH ₂ -c-Pr	H	SO ₂ Me
1-386	c-Pr	Me	1	CH ₂ -c-Pr	H	SO ₂ Me
1-387	c-Pr	Me	2	CH ₂ -c-Pr	H	SO ₂ Me
1-388	c-Pr	Cl	0	CH ₂ -c-Pr	H	SO ₂ Me
1-389	c-Pr	Cl	1	CH ₂ -c-Pr	H	SO ₂ Me
1-390	c-Pr	Cl	2	CH ₂ -c-Pr	H	SO ₂ Me
1-391	c-Pr	Me	0	CH ₂ -c-Pr	Me	H
1-392	c-Pr	Me	1	CH ₂ -c-Pr	Me	H
1-393	c-Pr	Me	2	CH ₂ -c-Pr	Me	H
1-394	c-Pr	Cl	0	CH ₂ -c-Pr	Me	H
1-395	c-Pr	Cl	1	CH ₂ -c-Pr	Me	H
1-396	c-Pr	Cl	2	CH ₂ -c-Pr	Me	H
1-397	c-Pr	Me	0	CH ₂ -c-Pr	Me	Me
1-398	c-Pr	Me	1	CH ₂ -c-Pr	Me	Me
1-399	c-Pr	Me	2	CH ₂ -c-Pr	Me	Me
1-400	c-Pr	Cl	0	CH ₂ -c-Pr	Me	Me
1-401	c-Pr	Cl	1	CH ₂ -c-Pr	Me	Me
1-402	c-Pr	Cl	2	CH ₂ -c-Pr	Me	Me
1-403	c-Pr	Me	0	CH ₂ -c-Pr	Me	Cl
1-404	c-Pr	Me	1	CH ₂ -c-Pr	Me	Cl
1-405	c-Pr	Me	2	CH ₂ -c-Pr	Me	Cl
1-406	c-Pr	Cl	0	CH ₂ -c-Pr	Me	Cl
1-407	c-Pr	Cl	1	CH ₂ -c-Pr	Me	Cl
1-408	c-Pr	Cl	2	CH ₂ -c-Pr	Me	Cl
1-409	c-Pr	Me	0	CH ₂ -c-Pr	Me	CF ₃
1-410	c-Pr	Me	1	CH ₂ -c-Pr	Me	CF ₃
1-411	c-Pr	Me	2	CH ₂ -c-Pr	Me	CF ₃
1-412	c-Pr	Cl	0	CH ₂ -c-Pr	Me	CF ₃
1-413	c-Pr	Cl	1	CH ₂ -c-Pr	Me	CF ₃

10

20

30

40

No.	R1	R4	n	R5	R7	R8
1-414	c-Pr	Cl	2	CH ₂ -c-Pr	Me	CF ₃
1-415	c-Pr	Me	0	CH ₂ -c-Pr	Me	SO ₂ Me
1-416	c-Pr	Me	1	CH ₂ -c-Pr	Me	SO ₂ Me
1-417	c-Pr	Me	2	CH ₂ -c-Pr	Me	SO ₂ Me
1-418	c-Pr	Cl	0	CH ₂ -c-Pr	Me	SO ₂ Me
1-419	c-Pr	Cl	1	CH ₂ -c-Pr	Me	SO ₂ Me
1-420	c-Pr	Cl	2	CH ₂ -c-Pr	Me	SO ₂ Me
1-421	プロペン-2-イル	Me	0	CH ₂ -c-Pr	H	H
1-422	プロペン-2-イル	Me	1	CH ₂ -c-Pr	H	H
1-423	プロペン-2-イル	Me	2	CH ₂ -c-Pr	H	H
1-424	プロペン-2-イル	Cl	0	CH ₂ -c-Pr	H	H
1-425	プロペン-2-イル	Cl	1	CH ₂ -c-Pr	H	H
1-426	プロペン-2-イル	Cl	2	CH ₂ -c-Pr	H	H
1-427	プロペン-2-イル	Me	0	CH ₂ -c-Pr	H	Me
1-428	プロペン-2-イル	Me	1	CH ₂ -c-Pr	H	Me
1-429	プロペン-2-イル	Me	2	CH ₂ -c-Pr	H	Me
1-430	プロペン-2-イル	Cl	0	CH ₂ -c-Pr	H	Me
1-431	プロペン-2-イル	Cl	1	CH ₂ -c-Pr	H	Me
1-432	プロペン-2-イル	Cl	2	CH ₂ -c-Pr	H	Me
1-433	プロペン-2-イル	Me	0	CH ₂ -c-Pr	H	Cl
1-434	プロペン-2-イル	Me	1	CH ₂ -c-Pr	H	Cl
1-435	プロペン-2-イル	Me	2	CH ₂ -c-Pr	H	Cl
1-436	プロペン-2-イル	Cl	0	CH ₂ -c-Pr	H	Cl
1-437	プロペン-2-イル	Cl	1	CH ₂ -c-Pr	H	Cl
1-438	プロペン-2-イル	Cl	2	CH ₂ -c-Pr	H	Cl
1-439	プロペン-2-イル	Me	0	CH ₂ -c-Pr	H	CF ₃
1-440	プロペン-2-イル	Me	1	CH ₂ -c-Pr	H	CF ₃
1-441	プロペン-2-イル	Me	2	CH ₂ -c-Pr	H	CF ₃
1-442	プロペン-2-イル	Cl	0	CH ₂ -c-Pr	H	CF ₃
1-443	プロペン-2-イル	Cl	1	CH ₂ -c-Pr	H	CF ₃
1-444	プロペン-2-イル	Cl	2	CH ₂ -c-Pr	H	CF ₃
1-445	プロペン-2-イル	Me	0	CH ₂ -c-Pr	H	SO ₂ Me
1-446	プロペン-2-イル	Me	1	CH ₂ -c-Pr	H	SO ₂ Me
1-447	プロペン-2-イル	Me	2	CH ₂ -c-Pr	H	SO ₂ Me
1-448	プロペン-2-イル	Cl	0	CH ₂ -c-Pr	H	SO ₂ Me
1-449	プロペン-2-イル	Cl	1	CH ₂ -c-Pr	H	SO ₂ Me

10

20

30

40

No.	R1	R4	n	R5	R7	R8
1-450	プロペン-2-イル	Cl	2	CH ₂ -c-Pr	H	SO ₂ Me
1-451	プロペン-2-イル	Me	0	CH ₂ -c-Pr	Me	H
1-452	プロペン-2-イル	Me	1	CH ₂ -c-Pr	Me	H
1-453	プロペン-2-イル	Me	2	CH ₂ -c-Pr	Me	H
1-454	プロペン-2-イル	Cl	0	CH ₂ -c-Pr	Me	H
1-455	プロペン-2-イル	Cl	1	CH ₂ -c-Pr	Me	H
1-456	プロペン-2-イル	Cl	2	CH ₂ -c-Pr	Me	H
1-457	プロペン-2-イル	Me	0	CH ₂ -c-Pr	Me	Me
1-458	プロペン-2-イル	Me	1	CH ₂ -c-Pr	Me	Me
1-459	プロペン-2-イル	Me	2	CH ₂ -c-Pr	Me	Me
1-460	プロペン-2-イル	Cl	0	CH ₂ -c-Pr	Me	Me
1-461	プロペン-2-イル	Cl	1	CH ₂ -c-Pr	Me	Me
1-462	プロペン-2-イル	Cl	2	CH ₂ -c-Pr	Me	Me
1-463	プロペン-2-イル	Me	0	CH ₂ -c-Pr	Me	Cl
1-464	プロペン-2-イル	Me	1	CH ₂ -c-Pr	Me	Cl
1-465	プロペン-2-イル	Me	2	CH ₂ -c-Pr	Me	Cl
1-466	プロペン-2-イル	Cl	0	CH ₂ -c-Pr	Me	Cl
1-467	プロペン-2-イル	Cl	1	CH ₂ -c-Pr	Me	Cl
1-468	プロペン-2-イル	Cl	2	CH ₂ -c-Pr	Me	Cl
1-469	プロペン-2-イル	Me	0	CH ₂ -c-Pr	Me	CF ₃
1-470	プロペン-2-イル	Me	1	CH ₂ -c-Pr	Me	CF ₃
1-471	プロペン-2-イル	Me	2	CH ₂ -c-Pr	Me	CF ₃
1-472	プロペン-2-イル	Cl	0	CH ₂ -c-Pr	Me	CF ₃
1-473	プロペン-2-イル	Cl	1	CH ₂ -c-Pr	Me	CF ₃
1-474	プロペン-2-イル	Cl	2	CH ₂ -c-Pr	Me	CF ₃
1-475	プロペン-2-イル	Me	0	CH ₂ -c-Pr	Me	SO ₂ Me
1-476	プロペン-2-イル	Me	1	CH ₂ -c-Pr	Me	SO ₂ Me
1-477	プロペン-2-イル	Me	2	CH ₂ -c-Pr	Me	SO ₂ Me
1-478	プロペン-2-イル	Cl	0	CH ₂ -c-Pr	Me	SO ₂ Me
1-479	プロペン-2-イル	Cl	1	CH ₂ -c-Pr	Me	SO ₂ Me
1-480	プロペン-2-イル	Cl	2	CH ₂ -c-Pr	Me	SO ₂ Me
1-481	Cl	Me	0	CH ₂ -c-Pr	H	H
1-482	Cl	Me	1	CH ₂ -c-Pr	H	H
1-483	Cl	Me	2	CH ₂ -c-Pr	H	H
1-484	Cl	Cl	0	CH ₂ -c-Pr	H	H
1-485	Cl	Cl	1	CH ₂ -c-Pr	H	H

10

20

30

40

Nr.	R ¹	R ⁴	n	R ⁵	R ⁷	R ⁸
1-486	Cl	Cl	2	CH ₂ -c-Pr	H	H
1-487	Cl	Me	0	CH ₂ -c-Pr	H	Me
1-488	Cl	Me	1	CH ₂ -c-Pr	H	Me
1-489	Cl	Me	2	CH ₂ -c-Pr	H	Me
1-490	Cl	Cl	0	CH ₂ -c-Pr	H	Me
1-491	Cl	Cl	1	CH ₂ -c-Pr	H	Me
1-492	Cl	Cl	2	CH ₂ -c-Pr	H	Me
1-493	Cl	Me	0	CH ₂ -c-Pr	H	Cl
1-494	Cl	Me	1	CH ₂ -c-Pr	H	Cl
1-495	Cl	Me	2	CH ₂ -c-Pr	H	Cl
1-496	Cl	Cl	0	CH ₂ -c-Pr	H	Cl
1-497	Cl	Cl	1	CH ₂ -c-Pr	H	Cl
1-498	Cl	Cl	2	CH ₂ -c-Pr	H	Cl
1-499	Cl	Me	0	CH ₂ -c-Pr	H	CF ₃
1-500	Cl	Me	1	CH ₂ -c-Pr	H	CF ₃
1-501	Cl	Me	2	CH ₂ -c-Pr	H	CF ₃
1-502	Cl	Cl	0	CH ₂ -c-Pr	H	CF ₃
1-503	Cl	Cl	1	CH ₂ -c-Pr	H	CF ₃
1-504	Cl	Cl	2	CH ₂ -c-Pr	H	CF ₃
1-505	Cl	Me	0	CH ₂ -c-Pr	H	SO ₂ Me
1-506	Cl	Me	1	CH ₂ -c-Pr	H	SO ₂ Me
1-507	Cl	Me	2	CH ₂ -c-Pr	H	SO ₂ Me
1-508	Cl	Cl	0	CH ₂ -c-Pr	H	SO ₂ Me
1-509	Cl	Cl	1	CH ₂ -c-Pr	H	SO ₂ Me
1-510	Cl	Cl	2	CH ₂ -c-Pr	H	SO ₂ Me
1-511	Cl	Me	0	CH ₂ -c-Pr	Me	H
1-512	Cl	Me	1	CH ₂ -c-Pr	Me	H
1-513	Cl	Me	2	CH ₂ -c-Pr	Me	H
1-514	Cl	Cl	0	CH ₂ -c-Pr	Me	H
1-515	Cl	Cl	1	CH ₂ -c-Pr	Me	H
1-516	Cl	Cl	2	CH ₂ -c-Pr	Me	H
1-517	Cl	Me	0	CH ₂ -c-Pr	Me	Me
1-518	Cl	Me	1	CH ₂ -c-Pr	Me	Me
1-519	Cl	Me	2	CH ₂ -c-Pr	Me	Me
1-520	Cl	Cl	0	CH ₂ -c-Pr	Me	Me
1-521	Cl	Cl	1	CH ₂ -c-Pr	Me	Me

10

20

30

40

Nr.	R ¹	R ⁴	n	R ⁵	R ⁷	R ⁸
1-522	Cl	Cl	2	CH ₂ -c-Pr	Me	Me
1-523	Cl	Me	0	CH ₂ -c-Pr	Me	Cl
1-524	Cl	Me	1	CH ₂ -c-Pr	Me	Cl
1-525	Cl	Me	2	CH ₂ -c-Pr	Me	Cl
1-526	Cl	Cl	0	CH ₂ -c-Pr	Me	Cl
1-527	Cl	Cl	1	CH ₂ -c-Pr	Me	Cl
1-528	Cl	Cl	2	CH ₂ -c-Pr	Me	Cl
1-529	Cl	Me	0	CH ₂ -c-Pr	Me	CF ₃
1-530	Cl	Me	1	CH ₂ -c-Pr	Me	CF ₃
1-531	Cl	Me	2	CH ₂ -c-Pr	Me	CF ₃
1-532	Cl	Cl	0	CH ₂ -c-Pr	Me	CF ₃
1-533	Cl	Cl	1	CH ₂ -c-Pr	Me	CF ₃
1-534	Cl	Cl	2	CH ₂ -c-Pr	Me	CF ₃
1-535	Cl	Me	0	CH ₂ -c-Pr	Me	SO ₂ Me
1-536	Cl	Me	1	CH ₂ -c-Pr	Me	SO ₂ Me
1-537	Cl	Me	2	CH ₂ -c-Pr	Me	SO ₂ Me
1-538	Cl	Cl	0	CH ₂ -c-Pr	Me	SO ₂ Me
1-539	Cl	Cl	1	CH ₂ -c-Pr	Me	SO ₂ Me
1-540	Cl	Cl	2	CH ₂ -c-Pr	Me	SO ₂ Me
1-541	SO ₂ Me	Me	0	CH ₂ -c-Pr	H	H
1-542	SO ₂ Me	Me	1	CH ₂ -c-Pr	H	H
1-543	SO ₂ Me	Me	2	CH ₂ -c-Pr	H	H
1-544	SO ₂ Me	Cl	0	CH ₂ -c-Pr	H	H
1-545	SO ₂ Me	Cl	1	CH ₂ -c-Pr	H	H
1-546	SO ₂ Me	Cl	2	CH ₂ -c-Pr	H	H
1-547	SO ₂ Me	Me	0	CH ₂ -c-Pr	H	Me
1-548	SO ₂ Me	Me	1	CH ₂ -c-Pr	H	Me
1-549	SO ₂ Me	Me	2	CH ₂ -c-Pr	H	Me
1-550	SO ₂ Me	Cl	0	CH ₂ -c-Pr	H	Me
1-551	SO ₂ Me	Cl	1	CH ₂ -c-Pr	H	Me
1-552	SO ₂ Me	Cl	2	CH ₂ -c-Pr	H	Me
1-553	SO ₂ Me	Me	0	CH ₂ -c-Pr	H	Cl
1-554	SO ₂ Me	Me	1	CH ₂ -c-Pr	H	Cl
1-555	SO ₂ Me	Me	2	CH ₂ -c-Pr	H	Cl
1-556	SO ₂ Me	Cl	0	CH ₂ -c-Pr	H	Cl
1-557	SO ₂ Me	Cl	1	CH ₂ -c-Pr	H	Cl

10

20

30

40

Nr.	R ¹	R ⁴	n	R ⁵	R ⁷	R ⁸
1-558	SO ₂ Me	Cl	2	CH ₂ -c-Pr	H	Cl
1-559	SO ₂ Me	Me	0	CH ₂ -c-Pr	H	CF ₃
1-560	SO ₂ Me	Me	1	CH ₂ -c-Pr	H	CF ₃
1-561	SO ₂ Me	Me	2	CH ₂ -c-Pr	H	CF ₃
1-562	SO ₂ Me	Cl	0	CH ₂ -c-Pr	H	CF ₃
1-563	SO ₂ Me	Cl	1	CH ₂ -c-Pr	H	CF ₃
1-564	SO ₂ Me	Cl	2	CH ₂ -c-Pr	H	CF ₃
1-565	SO ₂ Me	Me	0	CH ₂ -c-Pr	H	SO ₂ Me
1-566	SO ₂ Me	Me	1	CH ₂ -c-Pr	H	SO ₂ Me
1-567	SO ₂ Me	Me	2	CH ₂ -c-Pr	H	SO ₂ Me
1-568	SO ₂ Me	Cl	0	CH ₂ -c-Pr	H	SO ₂ Me
1-569	SO ₂ Me	Cl	1	CH ₂ -c-Pr	H	SO ₂ Me
1-570	SO ₂ Me	Cl	2	CH ₂ -c-Pr	H	SO ₂ Me
1-571	SO ₂ Me	Me	0	CH ₂ -c-Pr	Me	H
1-572	SO ₂ Me	Me	1	CH ₂ -c-Pr	Me	H
1-573	SO ₂ Me	Me	2	CH ₂ -c-Pr	Me	H
1-574	SO ₂ Me	Cl	0	CH ₂ -c-Pr	Me	H
1-575	SO ₂ Me	Cl	1	CH ₂ -c-Pr	Me	H
1-576	SO ₂ Me	Cl	2	CH ₂ -c-Pr	Me	H
1-577	SO ₂ Me	Me	0	CH ₂ -c-Pr	Me	Me
1-578	SO ₂ Me	Me	1	CH ₂ -c-Pr	Me	Me
1-579	SO ₂ Me	Me	2	CH ₂ -c-Pr	Me	Me
1-580	SO ₂ Me	Cl	0	CH ₂ -c-Pr	Me	Me
1-581	SO ₂ Me	Cl	1	CH ₂ -c-Pr	Me	Me
1-582	SO ₂ Me	Cl	2	CH ₂ -c-Pr	Me	Me
1-583	SO ₂ Me	Me	0	CH ₂ -c-Pr	Me	Cl
1-584	SO ₂ Me	Me	1	CH ₂ -c-Pr	Me	Cl
1-585	SO ₂ Me	Me	2	CH ₂ -c-Pr	Me	Cl
1-586	SO ₂ Me	Cl	0	CH ₂ -c-Pr	Me	Cl
1-587	SO ₂ Me	Cl	1	CH ₂ -c-Pr	Me	Cl
1-588	SO ₂ Me	Cl	2	CH ₂ -c-Pr	Me	Cl
1-589	SO ₂ Me	Me	0	CH ₂ -c-Pr	Me	CF ₃
1-590	SO ₂ Me	Me	1	CH ₂ -c-Pr	Me	CF ₃
1-591	SO ₂ Me	Me	2	CH ₂ -c-Pr	Me	CF ₃
1-592	SO ₂ Me	Cl	0	CH ₂ -c-Pr	Me	CF ₃
1-593	SO ₂ Me	Cl	1	CH ₂ -c-Pr	Me	CF ₃

10

20

30

40

Nr.	R ¹	R ⁴	n	R ⁵	R ⁷	R ⁸
1-594	SO ₂ Me	Cl	2	CH ₂ -c-Pr	Me	CF ₃
1-595	SO ₂ Me	Me	0	CH ₂ -c-Pr	Me	SO ₂ Me
1-596	SO ₂ Me	Me	1	CH ₂ -c-Pr	Me	SO ₂ Me
1-597	SO ₂ Me	Me	2	CH ₂ -c-Pr	Me	SO ₂ Me
1-598	SO ₂ Me	Cl	0	CH ₂ -c-Pr	Me	SO ₂ Me
1-599	SO ₂ Me	Cl	1	CH ₂ -c-Pr	Me	SO ₂ Me
1-600	SO ₂ Me	Cl	2	CH ₂ -c-Pr	Me	SO ₂ Me
1-601	Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H
1-602	Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H
1-603	Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H
1-604	Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H
1-605	Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H
1-606	Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H
1-607	Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me
1-608	Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me
1-609	Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me
1-610	Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me
1-611	Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me
1-612	Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me
1-613	Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl
1-614	Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl
1-615	Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl
1-616	Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl
1-617	Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl
1-618	Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl
1-619	Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃
1-620	Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃
1-621	Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃
1-622	Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃
1-623	Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃
1-624	Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃
1-625	Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	SO ₂ Me
1-626	Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	SO ₂ Me
1-627	Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	SO ₂ Me
1-628	Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	SO ₂ Me
1-629	Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	SO ₂ Me

10

20

30

40

Nr.	R ¹	R ⁴	n	R ⁵	R ⁷	R ⁸
1-630	Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	SO ₂ Me
1-631	Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	H
1-632	Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	H
1-633	Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	H
1-634	Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	H
1-635	Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	H
1-636	Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	H
1-637	Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me
1-638	Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me
1-639	Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me
1-640	Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me
1-641	Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me
1-642	Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me
1-643	Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Cl
1-644	Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Cl
1-645	Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Cl
1-646	Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Cl
1-647	Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Cl
1-648	Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Cl
1-649	Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	CF ₃
1-650	Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	CF ₃
1-651	Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	CF ₃
1-652	Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	CF ₃
1-653	Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	CF ₃
1-654	Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	CF ₃
1-655	Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me
1-656	Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me
1-657	Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me
1-658	Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me
1-659	Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me
1-660	Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me
1-661	c-Pr	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H
1-662	c-Pr	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H
1-663	c-Pr	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H
1-664	c-Pr	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H
1-665	c-Pr	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H

10

20

30

40

Nr.	R ¹	R ⁴	n	R ⁵	R ⁷	R ⁸
1-666	c-Pr	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H
1-667	c-Pr	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me
1-668	c-Pr	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me
1-669	c-Pr	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me
1-670	c-Pr	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me
1-671	c-Pr	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me
1-672	c-Pr	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me
1-673	c-Pr	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl
1-674	c-Pr	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl
1-675	c-Pr	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl
1-676	c-Pr	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl
1-677	c-Pr	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl
1-678	c-Pr	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl
1-679	c-Pr	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃
1-680	c-Pr	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃
1-681	c-Pr	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃
1-682	c-Pr	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃
1-683	c-Pr	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃
1-684	c-Pr	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃
1-685	c-Pr	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	SO ₂ Me
1-686	c-Pr	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	SO ₂ Me
1-687	c-Pr	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	SO ₂ Me
1-688	c-Pr	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	SO ₂ Me
1-689	c-Pr	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	SO ₂ Me
1-690	c-Pr	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	SO ₂ Me
1-691	c-Pr	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	H
1-692	c-Pr	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	H
1-693	c-Pr	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	H
1-694	c-Pr	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	H
1-695	c-Pr	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	H
1-696	c-Pr	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	H
1-697	c-Pr	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me
1-698	c-Pr	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me
1-699	c-Pr	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me
1-700	c-Pr	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me
1-701	c-Pr	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me

10

20

30

40

No.	R1	R4	n	R5	R7	R8
1-702	c-Pr	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me
1-703	c-Pr	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Cl
1-704	c-Pr	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Cl
1-705	c-Pr	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Cl
1-706	c-Pr	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Cl
1-707	c-Pr	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Cl
1-708	c-Pr	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Cl
1-709	c-Pr	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	CF ₃
1-710	c-Pr	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	CF ₃
1-711	c-Pr	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	CF ₃
1-712	c-Pr	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	CF ₃
1-713	c-Pr	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	CF ₃
1-714	c-Pr	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	CF ₃
1-715	c-Pr	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me
1-716	c-Pr	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me
1-717	c-Pr	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me
1-718	c-Pr	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me
1-719	c-Pr	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me
1-720	c-Pr	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me
1-721	プロペン-2-イル	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H
1-722	プロペン-2-イル	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H
1-723	プロペン-2-イル	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H
1-724	プロペン-2-イル	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H
1-725	プロペン-2-イル	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H
1-726	プロペン-2-イル	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H
1-727	プロペン-2-イル	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me
1-728	プロペン-2-イル	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me
1-729	プロペン-2-イル	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me
1-730	プロペン-2-イル	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me
1-731	プロペン-2-イル	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me
1-732	プロペン-2-イル	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me
1-733	プロペン-2-イル	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl
1-734	プロペン-2-イル	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl
1-735	プロペン-2-イル	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl
1-736	プロペン-2-イル	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl
1-737	プロペン-2-イル	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl

10

20

30

40

No.	R1	R4	n	R5	R7	R8
1-738	プロペン-2-イル	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl
1-739	プロペン-2-イル	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃
1-740	プロペン-2-イル	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃
1-741	プロペン-2-イル	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃
1-742	プロペン-2-イル	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃
1-743	プロペン-2-イル	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃
1-744	プロペン-2-イル	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃
1-745	プロペン-2-イル	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	SO ₂ Me
1-746	プロペン-2-イル	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	SO ₂ Me
1-747	プロペン-2-イル	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	SO ₂ Me
1-748	プロペン-2-イル	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	SO ₂ Me
1-749	プロペン-2-イル	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	SO ₂ Me
1-750	プロペン-2-イル	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	SO ₂ Me
1-751	プロペン-2-イル	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	H
1-752	プロペン-2-イル	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	H
1-753	プロペン-2-イル	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	H
1-754	プロペン-2-イル	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	H
1-755	プロペン-2-イル	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	H
1-756	プロペン-2-イル	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	H
1-757	プロペン-2-イル	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me
1-758	プロペン-2-イル	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me
1-759	プロペン-2-イル	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me
1-760	プロペン-2-イル	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me
1-761	プロペン-2-イル	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me
1-762	プロペン-2-イル	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me
1-763	プロペン-2-イル	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Cl
1-764	プロペン-2-イル	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Cl
1-765	プロペン-2-イル	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Cl
1-766	プロペン-2-イル	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Cl
1-767	プロペン-2-イル	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Cl
1-768	プロペン-2-イル	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Cl
1-769	プロペン-2-イル	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	CF ₃
1-770	プロペン-2-イル	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	CF ₃
1-771	プロペン-2-イル	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	CF ₃
1-772	プロペン-2-イル	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	CF ₃
1-773	プロペン-2-イル	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	CF ₃

10

20

30

40

No.	R1	R4	n	R5	R7	R8
1-774	プロペン-2-イル	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	CF ₃
1-775	プロペン-2-イル	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me
1-776	プロペン-2-イル	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me
1-777	プロペン-2-イル	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me
1-778	プロペン-2-イル	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me
1-779	プロペン-2-イル	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me
1-780	プロペン-2-イル	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me
1-781	Cl	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H
1-782	Cl	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H
1-783	Cl	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H
1-784	Cl	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H
1-785	Cl	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H
1-786	Cl	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H
1-787	Cl	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me
1-788	Cl	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me
1-789	Cl	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me
1-790	Cl	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me
1-791	Cl	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me
1-792	Cl	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me
1-793	Cl	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl
1-794	Cl	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl
1-795	Cl	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl
1-796	Cl	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl
1-797	Cl	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl
1-798	Cl	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl
1-799	Cl	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃
1-800	Cl	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃
1-801	Cl	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃
1-802	Cl	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃
1-803	Cl	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃
1-804	Cl	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃
1-805	Cl	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	SO ₂ Me
1-806	Cl	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	SO ₂ Me
1-807	Cl	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	SO ₂ Me
1-808	Cl	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	SO ₂ Me
1-809	Cl	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	SO ₂ Me

10

20

30

40

Nr.	R ¹	R ⁴	n	R ⁵	R ⁷	R ⁸
1-810	Cl	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	SO ₂ Me
1-811	Cl	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	H
1-812	Cl	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	H
1-813	Cl	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	H
1-814	Cl	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	H
1-815	Cl	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	H
1-816	Cl	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	H
1-817	Cl	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me
1-818	Cl	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me
1-819	Cl	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me
1-820	Cl	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me
1-821	Cl	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me
1-822	Cl	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me
1-823	Cl	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Cl
1-824	Cl	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Cl
1-825	Cl	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Cl
1-826	Cl	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Cl
1-827	Cl	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Cl
1-828	Cl	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Cl
1-829	Cl	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	CF ₃
1-830	Cl	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	CF ₃
1-831	Cl	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	CF ₃
1-832	Cl	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	CF ₃
1-833	Cl	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	CF ₃
1-834	Cl	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	CF ₃
1-835	Cl	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me
1-836	Cl	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me
1-837	Cl	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me
1-838	Cl	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me
1-839	Cl	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me
1-840	Cl	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me
1-841	SO ₂ Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H
1-842	SO ₂ Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H
1-843	SO ₂ Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H
1-844	SO ₂ Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H
1-845	SO ₂ Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H

10

20

30

40

Nr.	R ¹	R ⁴	n	R ⁵	R ⁷	R ⁸
1-846	SO ₂ Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H
1-847	SO ₂ Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me
1-848	SO ₂ Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me
1-849	SO ₂ Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me
1-850	SO ₂ Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me
1-851	SO ₂ Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me
1-852	SO ₂ Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me
1-853	SO ₂ Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl
1-854	SO ₂ Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl
1-855	SO ₂ Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl
1-856	SO ₂ Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl
1-857	SO ₂ Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl
1-858	SO ₂ Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl
1-859	SO ₂ Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃
1-860	SO ₂ Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃
1-861	SO ₂ Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃
1-862	SO ₂ Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃
1-863	SO ₂ Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃
1-864	SO ₂ Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃
1-865	SO ₂ Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	SO ₂ Me
1-866	SO ₂ Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	SO ₂ Me
1-867	SO ₂ Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	SO ₂ Me
1-868	SO ₂ Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	SO ₂ Me
1-869	SO ₂ Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	SO ₂ Me
1-870	SO ₂ Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	SO ₂ Me
1-871	SO ₂ Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	H
1-872	SO ₂ Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	H
1-873	SO ₂ Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	H
1-874	SO ₂ Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	H
1-875	SO ₂ Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	H
1-876	SO ₂ Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	H
1-877	SO ₂ Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me
1-878	SO ₂ Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me
1-879	SO ₂ Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me
1-880	SO ₂ Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me
1-881	SO ₂ Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me

10

20

30

40

Nr.	R ¹	R ⁴	n	R ⁵	R ⁷	R ⁸
1-882	SO ₂ Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me
1-883	SO ₂ Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Cl
1-884	SO ₂ Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Cl
1-885	SO ₂ Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Cl
1-886	SO ₂ Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Cl
1-887	SO ₂ Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Cl
1-888	SO ₂ Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Cl
1-889	SO ₂ Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	CF ₃
1-890	SO ₂ Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	CF ₃
1-891	SO ₂ Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	CF ₃
1-892	SO ₂ Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	CF ₃
1-893	SO ₂ Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	CF ₃
1-894	SO ₂ Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	CF ₃
1-895	SO ₂ Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me
1-896	SO ₂ Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me
1-897	SO ₂ Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me
1-898	SO ₂ Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me
1-899	SO ₂ Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me
1-900	SO ₂ Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me

10

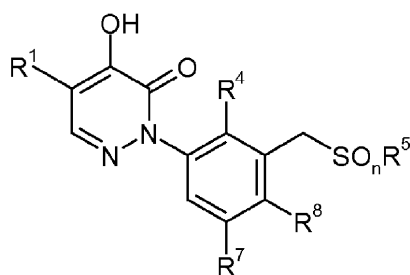
20

【 0 0 7 2 】

【表 2】

表 2 : 一般式 (I) [式中、R²及びR³は、それぞれ、水素を表し、Aは -CH₂-を表し、X¹はCHを表し、X²はCR⁷を表し、及び、X³はCR⁸を表す] で表される本発明化合物

30



Nr.	R ¹	R ⁴	n	R ⁵	R ⁷	R ⁸
2-1	Me	Me	0	Me	H	H
2-2	Me	Me	1	Me	H	H
2-3	Me	Me	2	Me	H	H

40

Nr.	R ¹	R ⁴	n	R ⁵	R ⁷	R ⁸
2-4	Me	Cl	0	Me	H	H
2-5	Me	Cl	1	Me	H	H
2-6	Me	Cl	2	Me	H	H
2-7	Me	Me	0	Me	H	Me
2-8	Me	Me	1	Me	H	Me
2-9	Me	Me	2	Me	H	Me
2-10	Me	Cl	0	Me	H	Me
2-11	Me	Cl	1	Me	H	Me
2-12	Me	Cl	2	Me	H	Me
2-13	Me	Me	0	Me	H	Cl
2-14	Me	Me	1	Me	H	Cl
2-15	Me	Me	2	Me	H	Cl
2-16	Me	Cl	0	Me	H	Cl
2-17	Me	Cl	1	Me	H	Cl
2-18	Me	Cl	2	Me	H	Cl
2-19	Me	Me	0	Me	H	CF ₃
2-20	Me	Me	1	Me	H	CF ₃
2-21	Me	Me	2	Me	H	CF ₃
2-22	Me	Cl	0	Me	H	CF ₃
2-23	Me	Cl	1	Me	H	CF ₃
2-24	Me	Cl	2	Me	H	CF ₃
2-25	Me	Me	0	Me	H	SO ₂ Me
2-26	Me	Me	1	Me	H	SO ₂ Me
2-27	Me	Me	2	Me	H	SO ₂ Me
2-28	Me	Cl	0	Me	H	SO ₂ Me
2-29	Me	Cl	1	Me	H	SO ₂ Me
2-30	Me	Cl	2	Me	H	SO ₂ Me
2-31	Me	Me	0	Me	Me	H
2-32	Me	Me	1	Me	Me	H
2-33	Me	Me	2	Me	Me	H
2-34	Me	Cl	0	Me	Me	H
2-35	Me	Cl	1	Me	Me	H
2-36	Me	Cl	2	Me	Me	H
2-37	Me	Me	0	Me	Me	Me
2-38	Me	Me	1	Me	Me	Me
2-39	Me	Me	2	Me	Me	Me

10

20

30

40

Nr.	R ¹	R ⁴	n	R ⁵	R ⁷	R ⁸
2-40	Me	Cl	0	Me	Me	Me
2-41	Me	Cl	1	Me	Me	Me
2-42	Me	Cl	2	Me	Me	Me
2-43	Me	Me	0	Me	Me	Cl
2-44	Me	Me	1	Me	Me	Cl
2-45	Me	Me	2	Me	Me	Cl
2-46	Me	Cl	0	Me	Me	Cl
2-47	Me	Cl	1	Me	Me	Cl
2-48	Me	Cl	2	Me	Me	Cl
2-49	Me	Me	0	Me	Me	CF ₃
2-50	Me	Me	1	Me	Me	CF ₃
2-51	Me	Me	2	Me	Me	CF ₃
2-52	Me	Cl	0	Me	Me	CF ₃
2-53	Me	Cl	1	Me	Me	CF ₃
2-54	Me	Cl	2	Me	Me	CF ₃
2-55	Me	Me	0	Me	Me	SO ₂ Me
2-56	Me	Me	1	Me	Me	SO ₂ Me
2-57	Me	Me	2	Me	Me	SO ₂ Me
2-58	Me	Cl	0	Me	Me	SO ₂ Me
2-59	Me	Cl	1	Me	Me	SO ₂ Me
2-60	Me	Cl	2	Me	Me	SO ₂ Me
2-61	c-Pr	Me	0	Me	H	H
2-62	c-Pr	Me	1	Me	H	H
2-63	c-Pr	Me	2	Me	H	H
2-64	c-Pr	Cl	0	Me	H	H
2-65	c-Pr	Cl	1	Me	H	H
2-66	c-Pr	Cl	2	Me	H	H
2-67	c-Pr	Me	0	Me	H	Me
2-68	c-Pr	Me	1	Me	H	Me
2-69	c-Pr	Me	2	Me	H	Me
2-70	c-Pr	Cl	0	Me	H	Me
2-71	c-Pr	Cl	1	Me	H	Me
2-72	c-Pr	Cl	2	Me	H	Me
2-73	c-Pr	Me	0	Me	H	Cl
2-74	c-Pr	Me	1	Me	H	Cl
2-75	c-Pr	Me	2	Me	H	Cl

10

20

30

40

Nr.	R ¹	R ⁴	n	R ⁵	R ⁷	R ⁸
2-76	c-Pr	Cl	0	Me	H	Cl
2-77	c-Pr	Cl	1	Me	H	Cl
2-78	c-Pr	Cl	2	Me	H	Cl
2-79	c-Pr	Me	0	Me	H	CF ₃
2-80	c-Pr	Me	1	Me	H	CF ₃
2-81	c-Pr	Me	2	Me	H	CF ₃
2-82	c-Pr	Cl	0	Me	H	CF ₃
2-83	c-Pr	Cl	1	Me	H	CF ₃
2-84	c-Pr	Cl	2	Me	H	CF ₃
2-85	c-Pr	Me	0	Me	H	SO ₂ Me
2-86	c-Pr	Me	1	Me	H	SO ₂ Me
2-87	c-Pr	Me	2	Me	H	SO ₂ Me
2-88	c-Pr	Cl	0	Me	H	SO ₂ Me
2-89	c-Pr	Cl	1	Me	H	SO ₂ Me
2-90	c-Pr	Cl	2	Me	H	SO ₂ Me
2-91	c-Pr	Me	0	Me	Me	H
2-92	c-Pr	Me	1	Me	Me	H
2-93	c-Pr	Me	2	Me	Me	H
2-94	c-Pr	Cl	0	Me	Me	H
2-95	c-Pr	Cl	1	Me	Me	H
2-96	c-Pr	Cl	2	Me	Me	H
2-97	c-Pr	Me	0	Me	Me	Me
2-98	c-Pr	Me	1	Me	Me	Me
2-99	c-Pr	Me	2	Me	Me	Me
2-100	c-Pr	Cl	0	Me	Me	Me
2-101	c-Pr	Cl	1	Me	Me	Me
2-102	c-Pr	Cl	2	Me	Me	Me
2-103	c-Pr	Me	0	Me	Me	Cl
2-104	c-Pr	Me	1	Me	Me	Cl
2-105	c-Pr	Me	2	Me	Me	Cl
2-106	c-Pr	Cl	0	Me	Me	Cl
2-107	c-Pr	Cl	1	Me	Me	Cl
2-108	c-Pr	Cl	2	Me	Me	Cl
2-109	c-Pr	Me	0	Me	Me	CF ₃
2-110	c-Pr	Me	1	Me	Me	CF ₃
2-111	c-Pr	Me	2	Me	Me	CF ₃

10

20

30

40

Nr.	R ¹	R ⁴	n	R ⁵	R ⁷	R ⁸
2-112	c-Pr	Cl	0	Me	Me	CF ₃
2-113	c-Pr	Cl	1	Me	Me	CF ₃
2-114	c-Pr	Cl	2	Me	Me	CF ₃
2-115	c-Pr	Me	0	Me	Me	SO ₂ Me
2-116	c-Pr	Me	1	Me	Me	SO ₂ Me
2-117	c-Pr	Me	2	Me	Me	SO ₂ Me
2-118	c-Pr	Cl	0	Me	Me	SO ₂ Me
2-119	c-Pr	Cl	1	Me	Me	SO ₂ Me
2-120	c-Pr	Cl	2	Me	Me	SO ₂ Me
2-121	Cl	Me	0	Me	H	H
2-122	Cl	Me	1	Me	H	H
2-123	Cl	Me	2	Me	H	H
2-124	Cl	Cl	0	Me	H	H
2-125	Cl	Cl	1	Me	H	H
2-126	Cl	Cl	2	Me	H	H
2-127	Cl	Me	0	Me	H	Me
2-128	Cl	Me	1	Me	H	Me
2-129	Cl	Me	2	Me	H	Me
2-130	Cl	Cl	0	Me	H	Me
2-131	Cl	Cl	1	Me	H	Me
2-132	Cl	Cl	2	Me	H	Me
2-133	Cl	Me	0	Me	H	Cl
2-134	Cl	Me	1	Me	H	Cl
2-135	Cl	Me	2	Me	H	Cl
2-136	Cl	Cl	0	Me	H	Cl
2-137	Cl	Cl	1	Me	H	Cl
2-138	Cl	Cl	2	Me	H	Cl
2-139	Cl	Me	0	Me	H	CF ₃
2-140	Cl	Me	1	Me	H	CF ₃
2-141	Cl	Me	2	Me	H	CF ₃
2-142	Cl	Cl	0	Me	H	CF ₃
2-143	Cl	Cl	1	Me	H	CF ₃
2-144	Cl	Cl	2	Me	H	CF ₃
2-145	Cl	Me	0	Me	H	SO ₂ Me
2-146	Cl	Me	1	Me	H	SO ₂ Me
2-147	Cl	Me	2	Me	H	SO ₂ Me

10

20

30

40

Nr.	R ¹	R ⁴	n	R ⁵	R ⁷	R ⁸
2-148	Cl	Cl	0	Me	H	SO ₂ Me
2-149	Cl	Cl	1	Me	H	SO ₂ Me
2-150	Cl	Cl	2	Me	H	SO ₂ Me
2-151	Cl	Me	0	Me	Me	H
2-152	Cl	Me	1	Me	Me	H
2-153	Cl	Me	2	Me	Me	H
2-154	Cl	Cl	0	Me	Me	H
2-155	Cl	Cl	1	Me	Me	H
2-156	Cl	Cl	2	Me	Me	H
2-157	Cl	Me	0	Me	Me	Me
2-158	Cl	Me	1	Me	Me	Me
2-159	Cl	Me	2	Me	Me	Me
2-160	Cl	Cl	0	Me	Me	Me
2-161	Cl	Cl	1	Me	Me	Me
2-162	Cl	Cl	2	Me	Me	Me
2-163	Cl	Me	0	Me	Me	Cl
2-164	Cl	Me	1	Me	Me	Cl
2-165	Cl	Me	2	Me	Me	Cl
2-166	Cl	Cl	0	Me	Me	Cl
2-167	Cl	Cl	1	Me	Me	Cl
2-168	Cl	Cl	2	Me	Me	Cl
2-169	Cl	Me	0	Me	Me	CF ₃
2-170	Cl	Me	1	Me	Me	CF ₃
2-171	Cl	Me	2	Me	Me	CF ₃
2-172	Cl	Cl	0	Me	Me	CF ₃
2-173	Cl	Cl	1	Me	Me	CF ₃
2-174	Cl	Cl	2	Me	Me	CF ₃
2-175	Cl	Me	0	Me	Me	SO ₂ Me
2-176	Cl	Me	1	Me	Me	SO ₂ Me
2-177	Cl	Me	2	Me	Me	SO ₂ Me
2-178	Cl	Cl	0	Me	Me	SO ₂ Me
2-179	Cl	Cl	1	Me	Me	SO ₂ Me
2-180	Cl	Cl	2	Me	Me	SO ₂ Me
2-181	SO ₂ Me	Me	0	Me	H	H
2-182	SO ₂ Me	Me	1	Me	H	H
2-183	SO ₂ Me	Me	2	Me	H	H

10

20

30

40

Nr.	R ¹	R ⁴	n	R ⁵	R ⁷	R ⁸
2-184	SO ₂ Me	Cl	0	Me	H	H
2-185	SO ₂ Me	Cl	1	Me	H	H
2-186	SO ₂ Me	Cl	2	Me	H	H
2-187	SO ₂ Me	Me	0	Me	H	Me
2-188	SO ₂ Me	Me	1	Me	H	Me
2-189	SO ₂ Me	Me	2	Me	H	Me
2-190	SO ₂ Me	Cl	0	Me	H	Me
2-191	SO ₂ Me	Cl	1	Me	H	Me
2-192	SO ₂ Me	Cl	2	Me	H	Me
2-193	SO ₂ Me	Me	0	Me	H	Cl
2-194	SO ₂ Me	Me	1	Me	H	Cl
2-195	SO ₂ Me	Me	2	Me	H	Cl
2-196	SO ₂ Me	Cl	0	Me	H	Cl
2-197	SO ₂ Me	Cl	1	Me	H	Cl
2-198	SO ₂ Me	Cl	2	Me	H	Cl
2-199	SO ₂ Me	Me	0	Me	H	CF ₃
2-200	SO ₂ Me	Me	1	Me	H	CF ₃
2-201	SO ₂ Me	Me	2	Me	H	CF ₃
2-202	SO ₂ Me	Cl	0	Me	H	CF ₃
2-203	SO ₂ Me	Cl	1	Me	H	CF ₃
2-204	SO ₂ Me	Cl	2	Me	H	CF ₃
2-205	SO ₂ Me	Me	0	Me	H	SO ₂ Me
2-206	SO ₂ Me	Me	1	Me	H	SO ₂ Me
2-207	SO ₂ Me	Me	2	Me	H	SO ₂ Me
2-208	SO ₂ Me	Cl	0	Me	H	SO ₂ Me
2-209	SO ₂ Me	Cl	1	Me	H	SO ₂ Me
2-210	SO ₂ Me	Cl	2	Me	H	SO ₂ Me
2-211	SO ₂ Me	Me	0	Me	Me	H
2-212	SO ₂ Me	Me	1	Me	Me	H
2-213	SO ₂ Me	Me	2	Me	Me	H
2-214	SO ₂ Me	Cl	0	Me	Me	H
2-215	SO ₂ Me	Cl	1	Me	Me	H
2-216	SO ₂ Me	Cl	2	Me	Me	H
2-217	SO ₂ Me	Me	0	Me	Me	Me
2-218	SO ₂ Me	Me	1	Me	Me	Me
2-219	SO ₂ Me	Me	2	Me	Me	Me

10

20

30

40

Nr.	R ¹	R ⁴	n	R ⁵	R ⁷	R ⁸
2-220	SO ₂ Me	Cl	0	Me	Me	Me
2-221	SO ₂ Me	Cl	1	Me	Me	Me
2-222	SO ₂ Me	Cl	2	Me	Me	Me
2-223	SO ₂ Me	Me	0	Me	Me	Cl
2-224	SO ₂ Me	Me	1	Me	Me	Cl
2-225	SO ₂ Me	Me	2	Me	Me	Cl
2-226	SO ₂ Me	Cl	0	Me	Me	Cl
2-227	SO ₂ Me	Cl	1	Me	Me	Cl
2-228	SO ₂ Me	Cl	2	Me	Me	Cl
2-229	SO ₂ Me	Me	0	Me	Me	CF ₃
2-230	SO ₂ Me	Me	1	Me	Me	CF ₃
2-231	SO ₂ Me	Me	2	Me	Me	CF ₃
2-232	SO ₂ Me	Cl	0	Me	Me	CF ₃
2-233	SO ₂ Me	Cl	1	Me	Me	CF ₃
2-234	SO ₂ Me	Cl	2	Me	Me	CF ₃
2-235	SO ₂ Me	Me	0	Me	Me	SO ₂ Me
2-236	SO ₂ Me	Me	1	Me	Me	SO ₂ Me
2-237	SO ₂ Me	Me	2	Me	Me	SO ₂ Me
2-238	SO ₂ Me	Cl	0	Me	Me	SO ₂ Me
2-239	SO ₂ Me	Cl	1	Me	Me	SO ₂ Me
2-240	SO ₂ Me	Cl	2	Me	Me	SO ₂ Me
2-241	Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H
2-242	Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H
2-243	Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H
2-244	Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H
2-245	Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H
2-246	Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H
2-247	Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me
2-248	Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me
2-249	Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me
2-250	Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me
2-251	Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me
2-252	Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me
2-253	Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl
2-254	Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl
2-255	Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl

10

20

30

40

Nr.	R ¹	R ⁴	n	R ⁵	R ⁷	R ⁸
2-256	Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl
2-257	Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl
2-258	Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl
2-259	Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃
2-260	Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃
2-261	Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃
2-262	Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃
2-263	Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃
2-264	Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃
2-265	Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	SO ₂ Me
2-266	Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	SO ₂ Me
2-267	Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	SO ₂ Me
2-268	Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	SO ₂ Me
2-269	Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	SO ₂ Me
2-270	Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	SO ₂ Me
2-271	Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	H
2-272	Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	H
2-273	Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	H
2-274	Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	H
2-275	Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	H
2-276	Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	H
2-277	Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me
2-278	Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me
2-279	Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me
2-280	Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me
2-281	Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me
2-282	Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me
2-283	Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Cl
2-284	Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Cl
2-285	Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Cl
2-286	Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Cl
2-287	Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Cl
2-288	Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Cl
2-289	Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	CF ₃
2-290	Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	CF ₃
2-291	Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	CF ₃

10

20

30

40

Nr.	R ¹	R ⁴	n	R ⁵	R ⁷	R ⁸
2-292	Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	CF ₃
2-293	Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	CF ₃
2-294	Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	CF ₃
2-295	Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me
2-296	Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me
2-297	Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me
2-298	Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me
2-299	Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me
2-300	Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me
2-301	c-Pr	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H
2-302	c-Pr	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H
2-303	c-Pr	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H
2-304	c-Pr	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H
2-305	c-Pr	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H
2-306	c-Pr	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H
2-307	c-Pr	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me
2-308	c-Pr	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me
2-309	c-Pr	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me
2-310	c-Pr	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me
2-311	c-Pr	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me
2-312	c-Pr	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me
2-313	c-Pr	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl
2-314	c-Pr	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl
2-315	c-Pr	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl
2-316	c-Pr	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl
2-317	c-Pr	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl
2-318	c-Pr	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl
2-319	c-Pr	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃
2-320	c-Pr	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃
2-321	c-Pr	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃
2-322	c-Pr	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃
2-323	c-Pr	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃
2-324	c-Pr	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃
2-325	c-Pr	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	SO ₂ Me
2-326	c-Pr	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	SO ₂ Me
2-327	c-Pr	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	SO ₂ Me

10

20

30

40

Nr.	R ¹	R ⁴	n	R ⁵	R ⁷	R ⁸
2-328	c-Pr	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	SO ₂ Me
2-329	c-Pr	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	SO ₂ Me
2-330	c-Pr	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	SO ₂ Me
2-331	c-Pr	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	H
2-332	c-Pr	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	H
2-333	c-Pr	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	H
2-334	c-Pr	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	H
2-335	c-Pr	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	H
2-336	c-Pr	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	H
2-337	c-Pr	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me
2-338	c-Pr	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me
2-339	c-Pr	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me
2-340	c-Pr	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me
2-341	c-Pr	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me
2-342	c-Pr	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me
2-343	c-Pr	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Cl
2-344	c-Pr	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Cl
2-345	c-Pr	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Cl
2-346	c-Pr	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Cl
2-347	c-Pr	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Cl
2-348	c-Pr	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Cl
2-349	c-Pr	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	CF ₃
2-350	c-Pr	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	CF ₃
2-351	c-Pr	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	CF ₃
2-352	c-Pr	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	CF ₃
2-353	c-Pr	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	CF ₃
2-354	c-Pr	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	CF ₃
2-355	c-Pr	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me
2-356	c-Pr	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me
2-357	c-Pr	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me
2-358	c-Pr	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me
2-359	c-Pr	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me
2-360	c-Pr	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me
2-361	Cl	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H
2-362	Cl	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H
2-363	Cl	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H

10

20

30

40

Nr.	R ¹	R ⁴	n	R ⁵	R ⁷	R ⁸
2-364	Cl	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H
2-365	Cl	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H
2-366	Cl	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H
2-367	Cl	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me
2-368	Cl	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me
2-369	Cl	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me
2-370	Cl	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me
2-371	Cl	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me
2-372	Cl	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me
2-373	Cl	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl
2-374	Cl	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl
2-375	Cl	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl
2-376	Cl	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl
2-377	Cl	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl
2-378	Cl	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl
2-379	Cl	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃
2-380	Cl	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃
2-381	Cl	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃
2-382	Cl	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃
2-383	Cl	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃
2-384	Cl	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃
2-385	Cl	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	SO ₂ Me
2-386	Cl	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	SO ₂ Me
2-387	Cl	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	SO ₂ Me
2-388	Cl	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	SO ₂ Me
2-389	Cl	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	SO ₂ Me
2-390	Cl	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	SO ₂ Me
2-391	Cl	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	H
2-392	Cl	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	H
2-393	Cl	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	H
2-394	Cl	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	H
2-395	Cl	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	H
2-396	Cl	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	H
2-397	Cl	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me
2-398	Cl	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me
2-399	Cl	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me

10

20

30

40

Nr.	R ¹	R ⁴	n	R ⁵	R ⁷	R ⁸
2-400	Cl	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me
2-401	Cl	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me
2-402	Cl	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me
2-403	Cl	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Cl
2-404	Cl	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Cl
2-405	Cl	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Cl
2-406	Cl	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Cl
2-407	Cl	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Cl
2-408	Cl	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Cl
2-409	Cl	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	CF ₃
2-410	Cl	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	CF ₃
2-411	Cl	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	CF ₃
2-412	Cl	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	CF ₃
2-413	Cl	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	CF ₃
2-414	Cl	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	CF ₃
2-415	Cl	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me
2-416	Cl	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me
2-417	Cl	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me
2-418	Cl	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me
2-419	Cl	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me
2-420	Cl	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me
2-421	SO ₂ Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H
2-422	SO ₂ Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H
2-423	SO ₂ Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H
2-424	SO ₂ Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H
2-425	SO ₂ Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H
2-426	SO ₂ Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H
2-427	SO ₂ Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me
2-428	SO ₂ Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me
2-429	SO ₂ Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me
2-430	SO ₂ Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me
2-431	SO ₂ Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me
2-432	SO ₂ Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me
2-433	SO ₂ Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl
2-434	SO ₂ Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl
2-435	SO ₂ Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl

10

20

30

40

Nr.	R ¹	R ⁴	n	R ⁵	R ⁷	R ⁸
2-436	SO ₂ Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl
2-437	SO ₂ Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl
2-438	SO ₂ Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl
2-439	SO ₂ Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃
2-440	SO ₂ Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃
2-441	SO ₂ Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃
2-442	SO ₂ Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃
2-443	SO ₂ Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃
2-444	SO ₂ Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃
2-445	SO ₂ Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	SO ₂ Me
2-446	SO ₂ Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	SO ₂ Me
2-447	SO ₂ Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	SO ₂ Me
2-448	SO ₂ Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	SO ₂ Me
2-449	SO ₂ Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	SO ₂ Me
2-450	SO ₂ Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	SO ₂ Me
2-451	SO ₂ Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	H
2-452	SO ₂ Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	H
2-453	SO ₂ Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	H
2-454	SO ₂ Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	H
2-455	SO ₂ Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	H
2-456	SO ₂ Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	H
2-457	SO ₂ Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me
2-458	SO ₂ Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me
2-459	SO ₂ Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me
2-460	SO ₂ Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me
2-461	SO ₂ Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me
2-462	SO ₂ Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me
2-463	SO ₂ Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Cl
2-464	SO ₂ Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Cl
2-465	SO ₂ Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Cl
2-466	SO ₂ Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Cl
2-467	SO ₂ Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Cl
2-468	SO ₂ Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Cl
2-469	SO ₂ Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	CF ₃
2-470	SO ₂ Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	CF ₃
2-471	SO ₂ Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	CF ₃

10

20

30

40

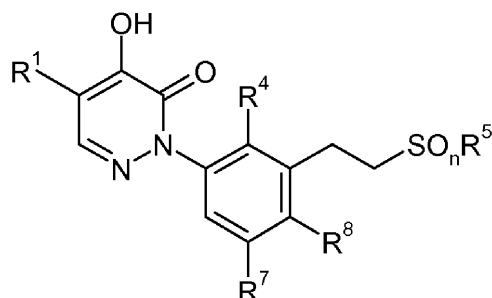
Nr.	R ¹	R ⁴	n	R ⁵	R ⁷	R ⁸
2-472	SO ₂ Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	CF ₃
2-473	SO ₂ Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	CF ₃
2-474	SO ₂ Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	CF ₃
2-475	SO ₂ Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me
2-476	SO ₂ Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me
2-477	SO ₂ Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me
2-478	SO ₂ Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me
2-479	SO ₂ Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me
2-480	SO ₂ Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me

10

【 0 0 7 3 】

【表 3】

表 3 : 一般式 (I) [式中、R²及びR³は、それぞれ、水素を表し、Aは -CH₂CH₂-を表し、X¹はCHを表し、X²はCR⁷を表し、及び、X³は CR⁸を表す] で表される本発明化合物



20

Nr.	R ¹	R ⁴	n	R ⁵	R ⁷	R ⁸
3-1	Me	Me	0	Me	H	H
3-2	Me	Me	1	Me	H	H
3-3	Me	Me	2	Me	H	H
3-4	Me	Cl	0	Me	H	H
3-5	Me	Cl	1	Me	H	H
3-6	Me	Cl	2	Me	H	H
3-7	Me	Me	0	Me	H	Me
3-8	Me	Me	1	Me	H	Me
3-9	Me	Me	2	Me	H	Me
3-10	Me	Cl	0	Me	H	Me
3-11	Me	Cl	1	Me	H	Me
3-12	Me	Cl	2	Me	H	Me

30

40

Nr.	R ¹	R ⁴	n	R ⁵	R ⁷	R ⁸
3-13	Me	Me	0	Me	H	Cl
3-14	Me	Me	1	Me	H	Cl
3-15	Me	Me	2	Me	H	Cl
3-16	Me	Cl	0	Me	H	Cl
3-17	Me	Cl	1	Me	H	Cl
3-18	Me	Cl	2	Me	H	Cl
3-19	Me	Me	0	Me	H	CF ₃
3-20	Me	Me	1	Me	H	CF ₃
3-21	Me	Me	2	Me	H	CF ₃
3-22	Me	Cl	0	Me	H	CF ₃
3-23	Me	Cl	1	Me	H	CF ₃
3-24	Me	Cl	2	Me	H	CF ₃
3-25	Me	Me	0	Me	H	SO ₂ Me
3-26	Me	Me	1	Me	H	SO ₂ Me
3-27	Me	Me	2	Me	H	SO ₂ Me
3-28	Me	Cl	0	Me	H	SO ₂ Me
3-29	Me	Cl	1	Me	H	SO ₂ Me
3-30	Me	Cl	2	Me	H	SO ₂ Me
3-31	Me	Me	0	Me	Me	H
3-32	Me	Me	1	Me	Me	H
3-33	Me	Me	2	Me	Me	H
3-34	Me	Cl	0	Me	Me	H
3-35	Me	Cl	1	Me	Me	H
3-36	Me	Cl	2	Me	Me	H
3-37	Me	Me	0	Me	Me	Me
3-38	Me	Me	1	Me	Me	Me
3-39	Me	Me	2	Me	Me	Me
3-40	Me	Cl	0	Me	Me	Me
3-41	Me	Cl	1	Me	Me	Me
3-42	Me	Cl	2	Me	Me	Me
3-43	Me	Me	0	Me	Me	Cl
3-44	Me	Me	1	Me	Me	Cl
3-45	Me	Me	2	Me	Me	Cl
3-46	Me	Cl	0	Me	Me	Cl
3-47	Me	Cl	1	Me	Me	Cl
3-48	Me	Cl	2	Me	Me	Cl

10

20

30

40

Nr.	R ¹	R ⁴	n	R ⁵	R ⁷	R ⁸
3-49	Me	Me	0	Me	Me	CF ₃
3-50	Me	Me	1	Me	Me	CF ₃
3-51	Me	Me	2	Me	Me	CF ₃
3-52	Me	Cl	0	Me	Me	CF ₃
3-53	Me	Cl	1	Me	Me	CF ₃
3-54	Me	Cl	2	Me	Me	CF ₃
3-55	Me	Me	0	Me	Me	SO ₂ Me
3-56	Me	Me	1	Me	Me	SO ₂ Me
3-57	Me	Me	2	Me	Me	SO ₂ Me
3-58	Me	Cl	0	Me	Me	SO ₂ Me
3-59	Me	Cl	1	Me	Me	SO ₂ Me
3-60	Me	Cl	2	Me	Me	SO ₂ Me
3-61	c-Pr	Me	0	Me	H	H
3-62	c-Pr	Me	1	Me	H	H
3-63	c-Pr	Me	2	Me	H	H
3-64	c-Pr	Cl	0	Me	H	H
3-65	c-Pr	Cl	1	Me	H	H
3-66	c-Pr	Cl	2	Me	H	H
3-67	c-Pr	Me	0	Me	H	Me
3-68	c-Pr	Me	1	Me	H	Me
3-69	c-Pr	Me	2	Me	H	Me
3-70	c-Pr	Cl	0	Me	H	Me
3-71	c-Pr	Cl	1	Me	H	Me
3-72	c-Pr	Cl	2	Me	H	Me
3-73	c-Pr	Me	0	Me	H	Cl
3-74	c-Pr	Me	1	Me	H	Cl
3-75	c-Pr	Me	2	Me	H	Cl
3-76	c-Pr	Cl	0	Me	H	Cl
3-77	c-Pr	Cl	1	Me	H	Cl
3-78	c-Pr	Cl	2	Me	H	Cl
3-79	c-Pr	Me	0	Me	H	CF ₃
3-80	c-Pr	Me	1	Me	H	CF ₃
3-81	c-Pr	Me	2	Me	H	CF ₃
3-82	c-Pr	Cl	0	Me	H	CF ₃
3-83	c-Pr	Cl	1	Me	H	CF ₃
3-84	c-Pr	Cl	2	Me	H	CF ₃

10

20

30

40

Nr.	R ¹	R ⁴	n	R ⁵	R ⁷	R ⁸
3-85	c-Pr	Me	0	Me	H	SO ₂ Me
3-86	c-Pr	Me	1	Me	H	SO ₂ Me
3-87	c-Pr	Me	2	Me	H	SO ₂ Me
3-88	c-Pr	Cl	0	Me	H	SO ₂ Me
3-89	c-Pr	Cl	1	Me	H	SO ₂ Me
3-90	c-Pr	Cl	2	Me	H	SO ₂ Me
3-91	c-Pr	Me	0	Me	Me	H
3-92	c-Pr	Me	1	Me	Me	H
3-93	c-Pr	Me	2	Me	Me	H
3-94	c-Pr	Cl	0	Me	Me	H
3-95	c-Pr	Cl	1	Me	Me	H
3-96	c-Pr	Cl	2	Me	Me	H
3-97	c-Pr	Me	0	Me	Me	Me
3-98	c-Pr	Me	1	Me	Me	Me
3-99	c-Pr	Me	2	Me	Me	Me
3-100	c-Pr	Cl	0	Me	Me	Me
3-101	c-Pr	Cl	1	Me	Me	Me
3-102	c-Pr	Cl	2	Me	Me	Me
3-103	c-Pr	Me	0	Me	Me	Cl
3-104	c-Pr	Me	1	Me	Me	Cl
3-105	c-Pr	Me	2	Me	Me	Cl
3-106	c-Pr	Cl	0	Me	Me	Cl
3-107	c-Pr	Cl	1	Me	Me	Cl
3-108	c-Pr	Cl	2	Me	Me	Cl
3-109	c-Pr	Me	0	Me	Me	CF ₃
3-110	c-Pr	Me	1	Me	Me	CF ₃
3-111	c-Pr	Me	2	Me	Me	CF ₃
3-112	c-Pr	Cl	0	Me	Me	CF ₃
3-113	c-Pr	Cl	1	Me	Me	CF ₃
3-114	c-Pr	Cl	2	Me	Me	CF ₃
3-115	c-Pr	Me	0	Me	Me	SO ₂ Me
3-116	c-Pr	Me	1	Me	Me	SO ₂ Me
3-117	c-Pr	Me	2	Me	Me	SO ₂ Me
3-118	c-Pr	Cl	0	Me	Me	SO ₂ Me
3-119	c-Pr	Cl	1	Me	Me	SO ₂ Me
3-120	c-Pr	Cl	2	Me	Me	SO ₂ Me

10

20

30

40

Nr.	R ¹	R ⁴	n	R ⁵	R ⁷	R ⁸
3-121	Cl	Me	0	Me	H	H
3-122	Cl	Me	1	Me	H	H
3-123	Cl	Me	2	Me	H	H
3-124	Cl	Cl	0	Me	H	H
3-125	Cl	Cl	1	Me	H	H
3-126	Cl	Cl	2	Me	H	H
3-127	Cl	Me	0	Me	H	Me
3-128	Cl	Me	1	Me	H	Me
3-129	Cl	Me	2	Me	H	Me
3-130	Cl	Cl	0	Me	H	Me
3-131	Cl	Cl	1	Me	H	Me
3-132	Cl	Cl	2	Me	H	Me
3-133	Cl	Me	0	Me	H	Cl
3-134	Cl	Me	1	Me	H	Cl
3-135	Cl	Me	2	Me	H	Cl
3-136	Cl	Cl	0	Me	H	Cl
3-137	Cl	Cl	1	Me	H	Cl
3-138	Cl	Cl	2	Me	H	Cl
3-139	Cl	Me	0	Me	H	CF ₃
3-140	Cl	Me	1	Me	H	CF ₃
3-141	Cl	Me	2	Me	H	CF ₃
3-142	Cl	Cl	0	Me	H	CF ₃
3-143	Cl	Cl	1	Me	H	CF ₃
3-144	Cl	Cl	2	Me	H	CF ₃
3-145	Cl	Me	0	Me	H	SO ₂ Me
3-146	Cl	Me	1	Me	H	SO ₂ Me
3-147	Cl	Me	2	Me	H	SO ₂ Me
3-148	Cl	Cl	0	Me	H	SO ₂ Me
3-149	Cl	Cl	1	Me	H	SO ₂ Me
3-150	Cl	Cl	2	Me	H	SO ₂ Me
3-151	Cl	Me	0	Me	Me	H
3-152	Cl	Me	1	Me	Me	H
3-153	Cl	Me	2	Me	Me	H
3-154	Cl	Cl	0	Me	Me	H
3-155	Cl	Cl	1	Me	Me	H
3-156	Cl	Cl	2	Me	Me	H

10

20

30

40

Nr.	R ¹	R ⁴	n	R ⁵	R ⁷	R ⁸
3-157	Cl	Me	0	Me	Me	Me
3-158	Cl	Me	1	Me	Me	Me
3-159	Cl	Me	2	Me	Me	Me
3-160	Cl	Cl	0	Me	Me	Me
3-161	Cl	Cl	1	Me	Me	Me
3-162	Cl	Cl	2	Me	Me	Me
3-163	Cl	Me	0	Me	Me	Cl
3-164	Cl	Me	1	Me	Me	Cl
3-165	Cl	Me	2	Me	Me	Cl
3-166	Cl	Cl	0	Me	Me	Cl
3-167	Cl	Cl	1	Me	Me	Cl
3-168	Cl	Cl	2	Me	Me	Cl
3-169	Cl	Me	0	Me	Me	CF ₃
3-170	Cl	Me	1	Me	Me	CF ₃
3-171	Cl	Me	2	Me	Me	CF ₃
3-172	Cl	Cl	0	Me	Me	CF ₃
3-173	Cl	Cl	1	Me	Me	CF ₃
3-174	Cl	Cl	2	Me	Me	CF ₃
3-175	Cl	Me	0	Me	Me	SO ₂ Me
3-176	Cl	Me	1	Me	Me	SO ₂ Me
3-177	Cl	Me	2	Me	Me	SO ₂ Me
3-178	Cl	Cl	0	Me	Me	SO ₂ Me
3-179	Cl	Cl	1	Me	Me	SO ₂ Me
3-180	Cl	Cl	2	Me	Me	SO ₂ Me
3-181	SO ₂ Me	Me	0	Me	H	H
3-182	SO ₂ Me	Me	1	Me	H	H
3-183	SO ₂ Me	Me	2	Me	H	H
3-184	SO ₂ Me	Cl	0	Me	H	H
3-185	SO ₂ Me	Cl	1	Me	H	H
3-186	SO ₂ Me	Cl	2	Me	H	H
3-187	SO ₂ Me	Me	0	Me	H	Me
3-188	SO ₂ Me	Me	1	Me	H	Me
3-189	SO ₂ Me	Me	2	Me	H	Me
3-190	SO ₂ Me	Cl	0	Me	H	Me
3-191	SO ₂ Me	Cl	1	Me	H	Me
3-192	SO ₂ Me	Cl	2	Me	H	Me

10

20

30

40

Nr.	R ¹	R ⁴	n	R ⁵	R ⁷	R ⁸
3-193	SO ₂ Me	Me	0	Me	H	Cl
3-194	SO ₂ Me	Me	1	Me	H	Cl
3-195	SO ₂ Me	Me	2	Me	H	Cl
3-196	SO ₂ Me	Cl	0	Me	H	Cl
3-197	SO ₂ Me	Cl	1	Me	H	Cl
3-198	SO ₂ Me	Cl	2	Me	H	Cl
3-199	SO ₂ Me	Me	0	Me	H	CF ₃
3-200	SO ₂ Me	Me	1	Me	H	CF ₃
3-201	SO ₂ Me	Me	2	Me	H	CF ₃
3-202	SO ₂ Me	Cl	0	Me	H	CF ₃
3-203	SO ₂ Me	Cl	1	Me	H	CF ₃
3-204	SO ₂ Me	Cl	2	Me	H	CF ₃
3-205	SO ₂ Me	Me	0	Me	H	SO ₂ Me
3-206	SO ₂ Me	Me	1	Me	H	SO ₂ Me
3-207	SO ₂ Me	Me	2	Me	H	SO ₂ Me
3-208	SO ₂ Me	Cl	0	Me	H	SO ₂ Me
3-209	SO ₂ Me	Cl	1	Me	H	SO ₂ Me
3-210	SO ₂ Me	Cl	2	Me	H	SO ₂ Me
3-211	SO ₂ Me	Me	0	Me	Me	H
3-212	SO ₂ Me	Me	1	Me	Me	H
3-213	SO ₂ Me	Me	2	Me	Me	H
3-214	SO ₂ Me	Cl	0	Me	Me	H
3-215	SO ₂ Me	Cl	1	Me	Me	H
3-216	SO ₂ Me	Cl	2	Me	Me	H
3-217	SO ₂ Me	Me	0	Me	Me	Me
3-218	SO ₂ Me	Me	1	Me	Me	Me
3-219	SO ₂ Me	Me	2	Me	Me	Me
3-220	SO ₂ Me	Cl	0	Me	Me	Me
3-221	SO ₂ Me	Cl	1	Me	Me	Me
3-222	SO ₂ Me	Cl	2	Me	Me	Me
3-223	SO ₂ Me	Me	0	Me	Me	Cl
3-224	SO ₂ Me	Me	1	Me	Me	Cl
3-225	SO ₂ Me	Me	2	Me	Me	Cl
3-226	SO ₂ Me	Cl	0	Me	Me	Cl
3-227	SO ₂ Me	Cl	1	Me	Me	Cl
3-228	SO ₂ Me	Cl	2	Me	Me	Cl

10

20

30

40

Nr.	R ¹	R ⁴	n	R ⁵	R ⁷	R ⁸
3-229	SO ₂ Me	Me	0	Me	Me	CF ₃
3-230	SO ₂ Me	Me	1	Me	Me	CF ₃
3-231	SO ₂ Me	Me	2	Me	Me	CF ₃
3-232	SO ₂ Me	Cl	0	Me	Me	CF ₃
3-233	SO ₂ Me	Cl	1	Me	Me	CF ₃
3-234	SO ₂ Me	Cl	2	Me	Me	CF ₃
3-235	SO ₂ Me	Me	0	Me	Me	SO ₂ Me
3-236	SO ₂ Me	Me	1	Me	Me	SO ₂ Me
3-237	SO ₂ Me	Me	2	Me	Me	SO ₂ Me
3-238	SO ₂ Me	Cl	0	Me	Me	SO ₂ Me
3-239	SO ₂ Me	Cl	1	Me	Me	SO ₂ Me
3-240	SO ₂ Me	Cl	2	Me	Me	SO ₂ Me
3-241	Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H
3-242	Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H
3-243	Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H
3-244	Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H
3-245	Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H
3-246	Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H
3-247	Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me
3-248	Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me
3-249	Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me
3-250	Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me
3-251	Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me
3-252	Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me
3-253	Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl
3-254	Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl
3-255	Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl
3-256	Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl
3-257	Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl
3-258	Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl
3-259	Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃
3-260	Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃
3-261	Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃
3-262	Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃
3-263	Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃
3-264	Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃

10

20

30

40

Nr.	R ¹	R ⁴	n	R ⁵	R ⁷	R ⁸
3-265	Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	SO ₂ Me
3-266	Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	SO ₂ Me
3-267	Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	SO ₂ Me
3-268	Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	SO ₂ Me
3-269	Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	SO ₂ Me
3-270	Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	SO ₂ Me
3-271	Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	H
3-272	Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	H
3-273	Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	H
3-274	Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	H
3-275	Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	H
3-276	Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	H
3-277	Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me
3-278	Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me
3-279	Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me
3-280	Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me
3-281	Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me
3-282	Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me
3-283	Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Cl
3-284	Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Cl
3-285	Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Cl
3-286	Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Cl
3-287	Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Cl
3-288	Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Cl
3-289	Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	CF ₃
3-290	Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	CF ₃
3-291	Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	CF ₃
3-292	Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	CF ₃
3-293	Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	CF ₃
3-294	Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	CF ₃
3-295	Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me
3-296	Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me
3-297	Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me
3-298	Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me
3-299	Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me
3-300	Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me

10

20

30

40

Nr.	R ¹	R ⁴	n	R ⁵	R ⁷	R ⁸
3-301	c-Pr	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H
3-302	c-Pr	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H
3-303	c-Pr	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H
3-304	c-Pr	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H
3-305	c-Pr	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H
3-306	c-Pr	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H
3-307	c-Pr	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me
3-308	c-Pr	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me
3-309	c-Pr	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me
3-310	c-Pr	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me
3-311	c-Pr	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me
3-312	c-Pr	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me
3-313	c-Pr	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl
3-314	c-Pr	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl
3-315	c-Pr	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl
3-316	c-Pr	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl
3-317	c-Pr	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl
3-318	c-Pr	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl
3-319	c-Pr	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃
3-320	c-Pr	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃
3-321	c-Pr	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃
3-322	c-Pr	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃
3-323	c-Pr	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃
3-324	c-Pr	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃
3-325	c-Pr	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	SO ₂ Me
3-326	c-Pr	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	SO ₂ Me
3-327	c-Pr	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	SO ₂ Me
3-328	c-Pr	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	SO ₂ Me
3-329	c-Pr	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	SO ₂ Me
3-330	c-Pr	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	SO ₂ Me
3-331	c-Pr	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	H
3-332	c-Pr	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	H
3-333	c-Pr	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	H
3-334	c-Pr	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	H
3-335	c-Pr	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	H
3-336	c-Pr	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	H

10

20

30

40

Nr.	R ¹	R ⁴	n	R ⁵	R ⁷	R ⁸
3-337	c-Pr	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me
3-338	c-Pr	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me
3-339	c-Pr	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me
3-340	c-Pr	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me
3-341	c-Pr	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me
3-342	c-Pr	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me
3-343	c-Pr	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Cl
3-344	c-Pr	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Cl
3-345	c-Pr	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Cl
3-346	c-Pr	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Cl
3-347	c-Pr	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Cl
3-348	c-Pr	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Cl
3-349	c-Pr	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	CF ₃
3-350	c-Pr	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	CF ₃
3-351	c-Pr	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	CF ₃
3-352	c-Pr	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	CF ₃
3-353	c-Pr	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	CF ₃
3-354	c-Pr	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	CF ₃
3-355	c-Pr	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me
3-356	c-Pr	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me
3-357	c-Pr	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me
3-358	c-Pr	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me
3-359	c-Pr	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me
3-360	c-Pr	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me
3-361	Cl	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H
3-362	Cl	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H
3-363	Cl	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H
3-364	Cl	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H
3-365	Cl	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H
3-366	Cl	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H
3-367	Cl	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me
3-368	Cl	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me
3-369	Cl	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me
3-370	Cl	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me
3-371	Cl	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me
3-372	Cl	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me

10

20

30

40

Nr.	R ¹	R ⁴	n	R ⁵	R ⁷	R ⁸
3-373	Cl	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl
3-374	Cl	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl
3-375	Cl	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl
3-376	Cl	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl
3-377	Cl	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl
3-378	Cl	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl
3-379	Cl	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃
3-380	Cl	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃
3-381	Cl	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃
3-382	Cl	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃
3-383	Cl	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃
3-384	Cl	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃
3-385	Cl	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	SO ₂ Me
3-386	Cl	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	SO ₂ Me
3-387	Cl	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	SO ₂ Me
3-388	Cl	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	SO ₂ Me
3-389	Cl	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	SO ₂ Me
3-390	Cl	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	SO ₂ Me
3-391	Cl	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	H
3-392	Cl	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	H
3-393	Cl	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	H
3-394	Cl	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	H
3-395	Cl	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	H
3-396	Cl	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	H
3-397	Cl	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me
3-398	Cl	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me
3-399	Cl	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me
3-400	Cl	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me
3-401	Cl	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me
3-402	Cl	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me
3-403	Cl	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Cl
3-404	Cl	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Cl
3-405	Cl	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Cl
3-406	Cl	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Cl
3-407	Cl	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Cl
3-408	Cl	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Cl

10

20

30

40

Nr.	R ¹	R ⁴	n	R ⁵	R ⁷	R ⁸
3-409	Cl	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	CF ₃
3-410	Cl	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	CF ₃
3-411	Cl	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	CF ₃
3-412	Cl	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	CF ₃
3-413	Cl	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	CF ₃
3-414	Cl	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	CF ₃
3-415	Cl	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me
3-416	Cl	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me
3-417	Cl	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me
3-418	Cl	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me
3-419	Cl	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me
3-420	Cl	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me
3-421	SO ₂ Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H
3-422	SO ₂ Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H
3-423	SO ₂ Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H
3-424	SO ₂ Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H
3-425	SO ₂ Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H
3-426	SO ₂ Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H
3-427	SO ₂ Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me
3-428	SO ₂ Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me
3-429	SO ₂ Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me
3-430	SO ₂ Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me
3-431	SO ₂ Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me
3-432	SO ₂ Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me
3-433	SO ₂ Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl
3-434	SO ₂ Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl
3-435	SO ₂ Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl
3-436	SO ₂ Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl
3-437	SO ₂ Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl
3-438	SO ₂ Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl
3-439	SO ₂ Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃
3-440	SO ₂ Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃
3-441	SO ₂ Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃
3-442	SO ₂ Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃
3-443	SO ₂ Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃
3-444	SO ₂ Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃

10

20

30

40

Nr.	R ¹	R ⁴	n	R ⁵	R ⁷	R ⁸
3-445	SO ₂ Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	SO ₂ Me
3-446	SO ₂ Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	SO ₂ Me
3-447	SO ₂ Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	SO ₂ Me
3-448	SO ₂ Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	H	SO ₂ Me
3-449	SO ₂ Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	H	SO ₂ Me
3-450	SO ₂ Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	H	SO ₂ Me
3-451	SO ₂ Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	H
3-452	SO ₂ Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	H
3-453	SO ₂ Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	H
3-454	SO ₂ Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	H
3-455	SO ₂ Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	H
3-456	SO ₂ Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	H
3-457	SO ₂ Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me
3-458	SO ₂ Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me
3-459	SO ₂ Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me
3-460	SO ₂ Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me
3-461	SO ₂ Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me
3-462	SO ₂ Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me
3-463	SO ₂ Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Cl
3-464	SO ₂ Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Cl
3-465	SO ₂ Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Cl
3-466	SO ₂ Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Cl
3-467	SO ₂ Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Cl
3-468	SO ₂ Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Cl
3-469	SO ₂ Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	CF ₃
3-470	SO ₂ Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	CF ₃
3-471	SO ₂ Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	CF ₃
3-472	SO ₂ Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	CF ₃
3-473	SO ₂ Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	CF ₃
3-474	SO ₂ Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	CF ₃
3-475	SO ₂ Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me
3-476	SO ₂ Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me
3-477	SO ₂ Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me
3-478	SO ₂ Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me
3-479	SO ₂ Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me
3-480	SO ₂ Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me

10

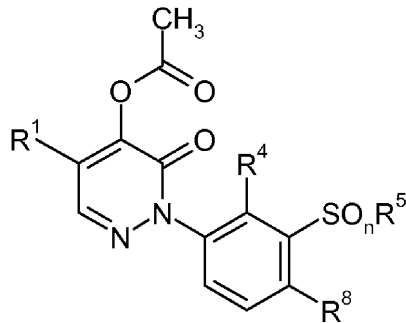
20

30

40

【表 4】

表 4 : 一般式 (I) [式中、R²は水素を表し、R³はアセチルを表し、Aは直接結合を表し、X¹及びX²は、それぞれ、CHを表し、及び、X³はCR⁸を表す] で表される本発明化合物



Nr.	R ¹	R ⁴	n	R ⁵	R ⁸
4-1	Me	Me	0	CH ₂ -c-Pr	CF ₃
4-2	Me	Me	1	CH ₂ -c-Pr	CF ₃
4-3	Me	Me	2	CH ₂ -c-Pr	CF ₃
4-4	Me	Cl	0	CH ₂ -c-Pr	CF ₃
4-5	Me	Cl	1	CH ₂ -c-Pr	CF ₃
4-6	Me	Cl	2	CH ₂ -c-Pr	CF ₃
4-7	Me	Me	0	CH ₂ -c-Pr	SO ₂ Me
4-8	Me	Me	1	CH ₂ -c-Pr	SO ₂ Me
4-9	Me	Me	2	CH ₂ -c-Pr	SO ₂ Me
4-10	Me	Cl	0	CH ₂ -c-Pr	SO ₂ Me
4-11	Me	Cl	1	CH ₂ -c-Pr	SO ₂ Me
4-12	Me	Cl	2	CH ₂ -c-Pr	SO ₂ Me
4-13	Cl	Me	0	CH ₂ -c-Pr	CF ₃
4-14	Cl	Me	1	CH ₂ -c-Pr	CF ₃
4-15	Cl	Me	2	CH ₂ -c-Pr	CF ₃
4-16	Cl	Cl	0	CH ₂ -c-Pr	CF ₃
4-17	Cl	Cl	1	CH ₂ -c-Pr	CF ₃
4-18	Cl	Cl	2	CH ₂ -c-Pr	CF ₃
4-19	Cl	Me	0	CH ₂ -c-Pr	SO ₂ Me
4-20	Cl	Me	1	CH ₂ -c-Pr	SO ₂ Me
4-21	Cl	Me	2	CH ₂ -c-Pr	SO ₂ Me
4-22	Cl	Cl	0	CH ₂ -c-Pr	SO ₂ Me
4-23	Cl	Cl	1	CH ₂ -c-Pr	SO ₂ Me
4-24	Cl	Cl	2	CH ₂ -c-Pr	SO ₂ Me
4-25	SO ₂ Me	Me	0	CH ₂ -c-Pr	CF ₃

Nr.	R ¹	R ⁴	n	R ⁵	R ⁸
4-26	SO ₂ Me	Me	1	CH ₂ -c-Pr	CF ₃
4-27	SO ₂ Me	Me	2	CH ₂ -c-Pr	CF ₃
4-28	SO ₂ Me	Cl	0	CH ₂ -c-Pr	CF ₃
4-29	SO ₂ Me	Cl	1	CH ₂ -c-Pr	CF ₃
4-30	SO ₂ Me	Cl	2	CH ₂ -c-Pr	CF ₃
4-31	SO ₂ Me	Me	0	CH ₂ -c-Pr	SO ₂ Me
4-32	SO ₂ Me	Me	1	CH ₂ -c-Pr	SO ₂ Me
4-33	SO ₂ Me	Me	2	CH ₂ -c-Pr	SO ₂ Me
4-34	SO ₂ Me	Cl	0	CH ₂ -c-Pr	SO ₂ Me
4-35	SO ₂ Me	Cl	1	CH ₂ -c-Pr	SO ₂ Me
4-36	SO ₂ Me	Cl	2	CH ₂ -c-Pr	SO ₂ Me
4-37	Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
4-38	Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
4-39	Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
4-40	Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
4-41	Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
4-42	Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
4-43	Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
4-44	Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
4-45	Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
4-46	Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
4-47	Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
4-48	Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
4-49	Cl	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
4-50	Cl	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
4-51	Cl	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
4-52	Cl	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
4-53	Cl	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
4-54	Cl	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
4-55	Cl	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
4-56	Cl	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
4-57	Cl	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
4-58	Cl	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
4-59	Cl	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
4-60	Cl	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
4-61	SO ₂ Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃

10

20

30

40

Nr.	R ¹	R ⁴	n	R ⁵	R ⁸
4-62	SO ₂ Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
4-63	SO ₂ Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
4-64	SO ₂ Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
4-65	SO ₂ Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
4-66	SO ₂ Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
4-67	SO ₂ Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
4-68	SO ₂ Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
4-69	SO ₂ Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
4-70	SO ₂ Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
4-71	SO ₂ Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
4-72	SO ₂ Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me

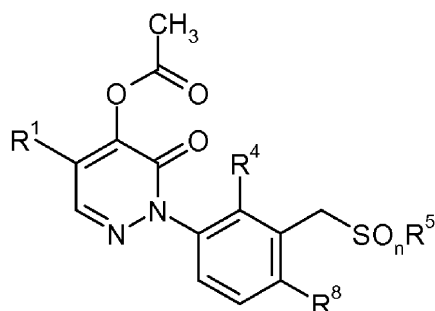
10

【 0 0 7 5 】

【表 5】

表 5 : 一般式 (I) [式中、R²は水素を表し、R³はアセチルを表し、Aは
-CH₂-を表し、X¹及びX²は、それぞれ、CHを表し、及び、X³はCR⁸
を表す] で表される本発明化合物

20



30

Nr.	R ¹	R ⁴	n	R ⁵	R ⁸
5-1	Me	Me	0	Me	CF ₃
5-2	Me	Me	1	Me	CF ₃
5-3	Me	Me	2	Me	CF ₃
5-4	Me	Cl	0	Me	CF ₃
5-5	Me	Cl	1	Me	CF ₃
5-6	Me	Cl	2	Me	CF ₃
5-7	Me	Me	0	Me	SO ₂ Me
5-8	Me	Me	1	Me	SO ₂ Me
5-9	Me	Me	2	Me	SO ₂ Me
5-10	Me	Cl	0	Me	SO ₂ Me

40

Nr.	R ¹	R ⁴	n	R ⁵	R ⁸
5-11	Me	Cl	1	Me	SO ₂ Me
5-12	Me	Cl	2	Me	SO ₂ Me
5-13	Cl	Me	0	Me	CF ₃
5-14	Cl	Me	1	Me	CF ₃
5-15	Cl	Me	2	Me	CF ₃
5-16	Cl	Cl	0	Me	CF ₃
5-17	Cl	Cl	1	Me	CF ₃
5-18	Cl	Cl	2	Me	CF ₃
5-19	Cl	Me	0	Me	SO ₂ Me
5-20	Cl	Me	1	Me	SO ₂ Me
5-21	Cl	Me	2	Me	SO ₂ Me
5-22	Cl	Cl	0	Me	SO ₂ Me
5-23	Cl	Cl	1	Me	SO ₂ Me
5-24	Cl	Cl	2	Me	SO ₂ Me
5-25	SO ₂ Me	Me	0	Me	CF ₃
5-26	SO ₂ Me	Me	1	Me	CF ₃
5-27	SO ₂ Me	Me	2	Me	CF ₃
5-28	SO ₂ Me	Cl	0	Me	CF ₃
5-29	SO ₂ Me	Cl	1	Me	CF ₃
5-30	SO ₂ Me	Cl	2	Me	CF ₃
5-31	SO ₂ Me	Me	0	Me	SO ₂ Me
5-32	SO ₂ Me	Me	1	Me	SO ₂ Me
5-33	SO ₂ Me	Me	2	Me	SO ₂ Me
5-34	SO ₂ Me	Cl	0	Me	SO ₂ Me
5-35	SO ₂ Me	Cl	1	Me	SO ₂ Me
5-36	SO ₂ Me	Cl	2	Me	SO ₂ Me
5-37	Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
5-38	Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
5-39	Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
5-40	Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
5-41	Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
5-42	Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
5-43	Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
5-44	Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
5-45	Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
5-46	Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me

10

20

30

40

Nr.	R ¹	R ⁴	n	R ⁵	R ⁸
5-47	Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
5-48	Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
5-49	Cl	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
5-50	Cl	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
5-51	Cl	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
5-52	Cl	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
5-53	Cl	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
5-54	Cl	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
5-55	Cl	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
5-56	Cl	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
5-57	Cl	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
5-58	Cl	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
5-59	Cl	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
5-60	Cl	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
5-61	SO ₂ Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
5-62	SO ₂ Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
5-63	SO ₂ Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
5-64	SO ₂ Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
5-65	SO ₂ Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
5-66	SO ₂ Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
5-67	SO ₂ Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
5-68	SO ₂ Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
5-69	SO ₂ Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
5-70	SO ₂ Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
5-71	SO ₂ Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
5-72	SO ₂ Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me

10

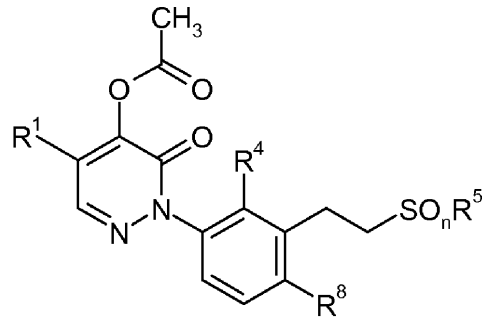
20

30

【 0 0 7 6 】

【表 6】

表 6 : 一般式 (I) [式中、 R^2 は水素を表し、 R^3 はアセチルを表し、Aは
 $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ を表し、 X^1 及び X^2 は、それぞれ、CHを表し、及び、 X^3 は
 CR^8 を表す] で表される本発明化合物



Nr.	R^1	R^4	n	R^5	R^8
6-1	Me	Me	0	Me	CF_3
6-2	Me	Me	1	Me	CF_3
6-3	Me	Me	2	Me	CF_3
6-4	Me	Cl	0	Me	CF_3
6-5	Me	Cl	1	Me	CF_3
6-6	Me	Cl	2	Me	CF_3
6-7	Me	Me	0	Me	SO_2Me
6-8	Me	Me	1	Me	SO_2Me
6-9	Me	Me	2	Me	SO_2Me
6-10	Me	Cl	0	Me	SO_2Me
6-11	Me	Cl	1	Me	SO_2Me
6-12	Me	Cl	2	Me	SO_2Me
6-13	Cl	Me	0	Me	CF_3
6-14	Cl	Me	1	Me	CF_3
6-15	Cl	Me	2	Me	CF_3
6-16	Cl	Cl	0	Me	CF_3
6-17	Cl	Cl	1	Me	CF_3
6-18	Cl	Cl	2	Me	CF_3
6-19	Cl	Me	0	Me	SO_2Me
6-20	Cl	Me	1	Me	SO_2Me
6-21	Cl	Me	2	Me	SO_2Me
6-22	Cl	Cl	0	Me	SO_2Me
6-23	Cl	Cl	1	Me	SO_2Me
6-24	Cl	Cl	2	Me	SO_2Me
6-25	SO_2Me	Me	0	Me	CF_3

Nr.	R ¹	R ⁴	n	R ⁵	R ⁸
6-26	SO ₂ Me	Me	1	Me	CF ₃
6-27	SO ₂ Me	Me	2	Me	CF ₃
6-28	SO ₂ Me	Cl	0	Me	CF ₃
6-29	SO ₂ Me	Cl	1	Me	CF ₃
6-30	SO ₂ Me	Cl	2	Me	CF ₃
6-31	SO ₂ Me	Me	0	Me	SO ₂ Me
6-32	SO ₂ Me	Me	1	Me	SO ₂ Me
6-33	SO ₂ Me	Me	2	Me	SO ₂ Me
6-34	SO ₂ Me	Cl	0	Me	SO ₂ Me
6-35	SO ₂ Me	Cl	1	Me	SO ₂ Me
6-36	SO ₂ Me	Cl	2	Me	SO ₂ Me
6-37	Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
6-38	Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
6-39	Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
6-40	Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
6-41	Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
6-42	Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
6-43	Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
6-44	Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
6-45	Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
6-46	Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
6-47	Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
6-48	Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
6-49	Cl	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
6-50	Cl	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
6-51	Cl	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
6-52	Cl	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
6-53	Cl	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
6-54	Cl	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
6-55	Cl	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
6-56	Cl	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
6-57	Cl	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
6-58	Cl	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
6-59	Cl	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
6-60	Cl	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
6-61	SO ₂ Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃

10

20

30

40

Nr.	R ¹	R ⁴	n	R ⁵	R ⁸
6-62	SO ₂ Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
6-63	SO ₂ Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
6-64	SO ₂ Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
6-65	SO ₂ Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
6-66	SO ₂ Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
6-67	SO ₂ Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
6-68	SO ₂ Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
6-69	SO ₂ Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
6-70	SO ₂ Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
6-71	SO ₂ Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
6-72	SO ₂ Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me

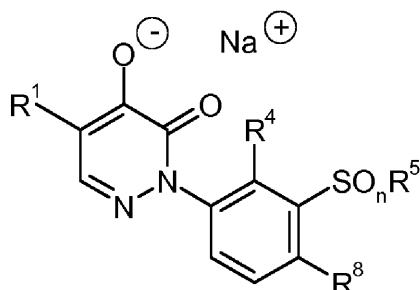
10

【 0 0 7 7 】

【 表 7 】

表 7 : 一般式 (I) [式中、R²は水素を表し、Aは直接結合を表し、
X¹及びX²は、それぞれ、CHを表し、及び、X³はCR⁸を表す]
で表され、ナトリウム塩の形態にある本発明化合物

20



Nr.	R ¹	R ⁴	n	R ⁵	R ⁸
7-1	Me	Me	0	CH ₂ -c-Pr	CF ₃
7-2	Me	Me	1	CH ₂ -c-Pr	CF ₃
7-3	Me	Me	2	CH ₂ -c-Pr	CF ₃
7-4	Me	Cl	0	CH ₂ -c-Pr	CF ₃
7-5	Me	Cl	1	CH ₂ -c-Pr	CF ₃
7-6	Me	Cl	2	CH ₂ -c-Pr	CF ₃
7-7	Me	Me	0	CH ₂ -c-Pr	SO ₂ Me
7-8	Me	Me	1	CH ₂ -c-Pr	SO ₂ Me
7-9	Me	Me	2	CH ₂ -c-Pr	SO ₂ Me
7-10	Me	Cl	0	CH ₂ -c-Pr	SO ₂ Me

30

40

Nr.	R ¹	R ⁴	n	R ⁵	R ⁸
7-11	Me	Cl	1	CH ₂ -c-Pr	SO ₂ Me
7-12	Me	Cl	2	CH ₂ -c-Pr	SO ₂ Me
7-13	SO ₂ Me	Me	0	CH ₂ -c-Pr	CF ₃
7-14	SO ₂ Me	Me	1	CH ₂ -c-Pr	CF ₃
7-15	SO ₂ Me	Me	2	CH ₂ -c-Pr	CF ₃
7-16	SO ₂ Me	Cl	0	CH ₂ -c-Pr	CF ₃
7-17	SO ₂ Me	Cl	1	CH ₂ -c-Pr	CF ₃
7-18	SO ₂ Me	Cl	2	CH ₂ -c-Pr	CF ₃
7-19	SO ₂ Me	Me	0	CH ₂ -c-Pr	SO ₂ Me
7-20	SO ₂ Me	Me	1	CH ₂ -c-Pr	SO ₂ Me
7-21	SO ₂ Me	Me	2	CH ₂ -c-Pr	SO ₂ Me
7-22	SO ₂ Me	Cl	0	CH ₂ -c-Pr	SO ₂ Me
7-23	SO ₂ Me	Cl	1	CH ₂ -c-Pr	SO ₂ Me
7-24	SO ₂ Me	Cl	2	CH ₂ -c-Pr	SO ₂ Me
7-25	Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
7-26	Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
7-27	Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
7-28	Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
7-29	Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
7-30	Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
7-31	Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
7-32	Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
7-33	Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
7-34	Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
7-35	Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
7-36	Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
7-37	SO ₂ Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
7-38	SO ₂ Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
7-39	SO ₂ Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
7-40	SO ₂ Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
7-41	SO ₂ Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
7-42	SO ₂ Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
7-43	SO ₂ Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
7-44	SO ₂ Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
7-45	SO ₂ Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
7-46	SO ₂ Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me

10

20

30

40

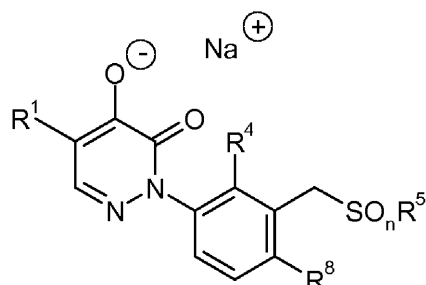
Nr.	R ¹	R ⁴	n	R ⁵	R ⁸
7-47	SO ₂ Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
7-48	SO ₂ Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me

【 0 0 7 8 】

【 表 8 】

表 8 : 一般式 (I) [式中、R²は水素を表し、Aは-CH₂-を表し、X¹及びX²は、それぞれ、CHを表し、及び、X³はCR⁸を表す] で表され、ナトリウム塩の形態にある本発明化合物

10



Nr.	R ¹	R ⁴	n	R ⁵	R ⁸
8-1	Me	Me	0	Me	CF ₃
8-2	Me	Me	1	Me	CF ₃
8-3	Me	Me	2	Me	CF ₃
8-4	Me	Cl	0	Me	CF ₃
8-5	Me	Cl	1	Me	CF ₃
8-6	Me	Cl	2	Me	CF ₃
8-7	Me	Me	0	Me	SO ₂ Me
8-8	Me	Me	1	Me	SO ₂ Me
8-9	Me	Me	2	Me	SO ₂ Me
8-10	Me	Cl	0	Me	SO ₂ Me
8-11	Me	Cl	1	Me	SO ₂ Me
8-12	Me	Cl	2	Me	SO ₂ Me
8-13	SO ₂ Me	Me	0	Me	CF ₃
8-14	SO ₂ Me	Me	1	Me	CF ₃
8-15	SO ₂ Me	Me	2	Me	CF ₃
8-16	SO ₂ Me	Cl	0	Me	CF ₃
8-17	SO ₂ Me	Cl	1	Me	CF ₃
8-18	SO ₂ Me	Cl	2	Me	CF ₃
8-19	SO ₂ Me	Me	0	Me	SO ₂ Me
8-20	SO ₂ Me	Me	1	Me	SO ₂ Me

20

30

40

Nr.	R ¹	R ⁴	n	R ⁵	R ⁸
8-21	SO ₂ Me	Me	2	Me	SO ₂ Me
8-22	SO ₂ Me	Cl	0	Me	SO ₂ Me
8-23	SO ₂ Me	Cl	1	Me	SO ₂ Me
8-24	SO ₂ Me	Cl	2	Me	SO ₂ Me
8-25	Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
8-26	Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
8-27	Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
8-28	Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
8-29	Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
8-30	Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
8-31	Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
8-32	Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
8-33	Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
8-34	Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
8-35	Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
8-36	Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
8-37	SO ₂ Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
8-38	SO ₂ Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
8-39	SO ₂ Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
8-40	SO ₂ Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
8-41	SO ₂ Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
8-42	SO ₂ Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
8-43	SO ₂ Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
8-44	SO ₂ Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
8-45	SO ₂ Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
8-46	SO ₂ Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
8-47	SO ₂ Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
8-48	SO ₂ Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me

10

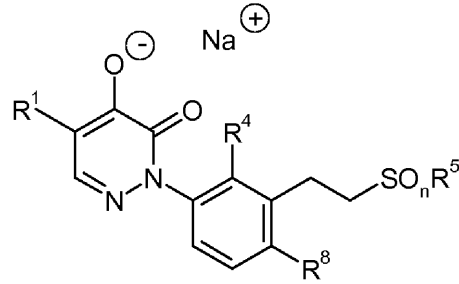
20

30

【 0 0 7 9 】

【表 9】

表 9 : 一般式 (I) [式中、R²は水素を表し、Aは-CH₂CH₂-を表し、X¹及びX²は、それぞれ、CHを表し、及び、X³はCR⁸を表す] で表され、ナトリウム塩の形態にある本発明化合物



Nr.	R ¹	R ⁴	n	R ⁵	R ⁸
9-1	Me	Me	0	Me	CF ₃
9-2	Me	Me	1	Me	CF ₃
9-3	Me	Me	2	Me	CF ₃
9-4	Me	Cl	0	Me	CF ₃
9-5	Me	Cl	1	Me	CF ₃
9-6	Me	Cl	2	Me	CF ₃
9-7	Me	Me	0	Me	SO ₂ Me
9-8	Me	Me	1	Me	SO ₂ Me
9-9	Me	Me	2	Me	SO ₂ Me
9-10	Me	Cl	0	Me	SO ₂ Me
9-11	Me	Cl	1	Me	SO ₂ Me
9-12	Me	Cl	2	Me	SO ₂ Me
9-13	SO ₂ Me	Me	0	Me	CF ₃
9-14	SO ₂ Me	Me	1	Me	CF ₃
9-15	SO ₂ Me	Me	2	Me	CF ₃
9-16	SO ₂ Me	Cl	0	Me	CF ₃
9-17	SO ₂ Me	Cl	1	Me	CF ₃
9-18	SO ₂ Me	Cl	2	Me	CF ₃
9-19	SO ₂ Me	Me	0	Me	SO ₂ Me
9-20	SO ₂ Me	Me	1	Me	SO ₂ Me
9-21	SO ₂ Me	Me	2	Me	SO ₂ Me
9-22	SO ₂ Me	Cl	0	Me	SO ₂ Me
9-23	SO ₂ Me	Cl	1	Me	SO ₂ Me
9-24	SO ₂ Me	Cl	2	Me	SO ₂ Me
9-25	Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
9-26	Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃

Nr.	R ¹	R ⁴	n	R ⁵	R ⁸
9-27	Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
9-28	Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
9-29	Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
9-30	Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
9-31	Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
9-32	Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
9-33	Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
9-34	Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
9-35	Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
9-36	Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
9-37	SO ₂ Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
9-38	SO ₂ Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
9-39	SO ₂ Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
9-40	SO ₂ Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
9-41	SO ₂ Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
9-42	SO ₂ Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
9-43	SO ₂ Me	Me	0	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
9-44	SO ₂ Me	Me	1	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
9-45	SO ₂ Me	Me	2	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
9-46	SO ₂ Me	Cl	0	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
9-47	SO ₂ Me	Cl	1	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me
9-48	SO ₂ Me	Cl	2	CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me

10

20

30

40

50

【0080】

A. 化学的実施例

5-クロロ-2-〔3-〔(シクロプロピルメチル)スルファニル]-2-メチル-4-(トリフルオロメチル)フェニル〕-4-ヒドロキシピリダジン-3(2H)-オン(実施例No. 1-499)の調製

段階1: 6-プロモ-2-フルオロ-3-(トリフルオロメチル)ベンズアルデヒドの合成

63.9 g (452.7 mmol)の2,2,6,6-テトラメチルピペリジンを833 mLの乾燥THFに溶解させた溶液に、-78℃で、n-ブチルリチウムの2.5 M (452.7 mmol)溶液181.07 mLを滴下して加えた。その混合物をこの温度で30分間攪拌した。次いで、100.0 g (411.5 mmol)の4-プロモ-2-フルオロ-1-(トリフルオロメチル)ベンゼンを-78℃で滴下して加えた。その混合物をこの温度で2時間攪拌した。次いで、33.1 g (452.7 mmol)のDMFを-78℃で滴下して加えた。次いで、その反応混合物を2時間攪拌した。後処理のために、その内容物に300 mLの水を添加した。その混合物を、いずれの場合にも200 mLのジクロロメタンで、3回抽出した。その有機相を合して300 mLの1 M 塩酸で洗浄し、次いで、300 mLの飽和塩化ナトリウム水溶液で洗浄した。その有機相を脱水し、その濾液から溶媒を除去した。96.2 gの所望の生成物が得られた。

【0081】

段階2: 6-プロモ-2-(tert-ブチルスルファニル)-3-(トリフルオロメチル)ベンズアルデヒドの合成

65.0 g (239.8 mmol) の 6-ブロモ-2-フルオロ-3-(トリフルオロメチル)ベンズアルデヒドと 66.3 g (479.7 mmol) の炭酸カリウムを 500 mL の N,N-ジメチルホルムアミドに溶解させた溶液に、0℃で、30.3 g (335.8 mmol) の tert-ブチルメルカプタンを添加した。その混合物をこの温度で 12 時間攪拌した。次いで、15.6 g (48.0 mmol) の炭酸セシウムを添加し、その混合物をさらに 3 時間攪拌した。後処理のために、その内容物に 1 L の水を添加した。その混合物を、いずれの場合にも 300 mL のジクロロメタンで、3 回抽出した。その有機相を合して、いずれの場合にも 300 mL の飽和塩化ナトリウム水溶液で、4 回洗浄した。その有機相を脱水し、その濾液から溶媒を除去して、68 g の所望の生成物が得られた。

10

【0082】

段階 3: [6-ブロモ-2-(tert-ブチルスルファニル)-3-(トリフルオロメチル)フェニル]メタノールの合成

63.0 g (184.7 mmol) の 6-ブロモ-2-(tert-ブチルスルファニル)-3-(トリフルオロメチル)ベンズアルデヒドを 500 mL のメタノールに溶解させた溶液に、-10℃で、3.49 g (92.3 mmol) の水素化ホウ素ナトリウムをゆっくりと添加した。その反応が変換が完了したことを示すのを確認した後、その内容物を後処理するために 3 M 塩酸を添加した。その混合物を濃縮し、その残渣を 400 mL の水の上に注いだ。その混合物を、いずれの場合にも 300 mL のジクロロメタンで、2 回抽出した。その有機相を合して飽和塩化ナトリウム水溶液で洗浄し、脱水し、次いで、その濾液から溶媒を除去した。60.0 g の所望の生成物が得られた。

20

【0083】

段階 4: 6-ブロモ-2-(tert-ブチルスルファニル)-3-(トリフルオロメチル)ベンジルメタンスルホネートの合成

60.0 g (174.8 mmol) の [6-ブロモ-2-(tert-ブチルスルファニル)-3-(トリフルオロメチル)フェニル]メタノールと 44.2 g (437.1 mmol) のトリエチルアミンを 500 mL のジクロロメタンに溶解させた溶液に、0℃で、31.3 g (272.8 mmol) のメタンスルホニルクロリドを滴下して加えた。その反応が変換が完了したことを示すのを確認した後、その溶液を、後処理のために、いずれの場合にも 300 mL の水で、2 回洗浄し、脱水し、その濾液から溶媒を除去した。70.0 g の所望の生成物が得られた。

30

【0084】

段階 5: 1-ブロモ-3-(tert-ブチルスルファニル)-2-メチル-4-(トリフルオロメチル)ベンゼンの合成

6.94 g (182.8 mmol) の水素化アルミニウムリチウムを 500 mL の乾燥 THF に溶解させた溶液に、-10℃で、70.0 g (166.2 mmol) の 6-ブロモ-2-(tert-ブチルスルファニル)-3-(トリフルオロメチル)ベンジルメタンスルホネートを 100 mL の乾燥 THF に溶解させた溶液を滴下して加えた。その内容物を 1 時間攪拌した。後処理のために、ガスの発生を観察することができなくなるまで、硫酸ナトリウム十水和物を添加した。その混合物を濾過し、その濾液を脱水した。次いで、その濾液から溶媒を除去し、その残渣をクロマトグラフィーで精製して、45.0 g の所望の生成物が得られた。

40

【0085】

段階 6: 3-ブロモ-2-メチル-6-(トリフルオロメチル)ベンゼンチオールの合成

45.0 g (137.5 mmol) の 1-ブロモ-3-(tert-ブチルスルファニル)-2-メチル-4-(トリフルオロメチル)ベンゼンを 175 mL のトルエンに溶解させた溶液に、23.7 g (137.5 mmol) の 4-メチルベンゼンスルホン酸を添加した。その混合物を環流しながら 2 時間加熱した。その溶媒をロータリーエバポレーターで除去し、その残渣を 200 mL のジクロロメタンに溶解させた。その溶液を 15% 強

50

度水酸化カリウム水溶液で4回抽出した。その水相を合して濃塩酸で酸性化し、次いで、その生成物をジクロロメタンで抽出した。その有機相を脱水し、濾過し、その濾液から溶媒を除去して、32.0 gの所望の生成物が得られた。

【0086】

段階7： 1-ブロモ-3-[(シクロプロピルメチル)スルファニル]-2-メチル-4-(トリフルオロメチル)ベンゼンの合成

80 mLのアセトニトリルの中の20 g (74.1 mmol)の3-ブロモ-2-メチル-6-(トリフルオロメチル)ベンゼンチオールと36 g (111.1 mmol)の炭酸セシウムの混合物に、14.0 g (103.6 mmol)の(ブロモメチル)シクロプロパンを添加した。その内容物を80℃で2時間攪拌した。後処理のために、その混合物を濾過し、その濾液から溶媒を除去した。その残渣をクロマトグラフィーで精製し、それによって、20.0 gの所望の生成物が得られた。

【0087】

段階8： 1-{3-[(シクロプロピルメチル)スルファニル]-2-メチル-4-(トリフルオロメチル)フェニル}-2-(ジフェニルメチレン)ヒドラジンの合成

50 mg (0.15 mmol)の1-ブロモ-3-[(シクロプロピルメチル)スルファニル]-2-メチル-4-(トリフルオロメチル)ベンゼンを1 mLのトルエンに溶解させた溶液に、20 mg (0.2 mmol)のナトリウムtert-ブトキシドと33 mg (0.17 mmol)のベンゾフェノンヒドラジンの混合物を添加した。酸素を除去するために、次いで、その混合物を10分間脱ガスした。次いで、保護ガス下、1 mg (0.002 mmol)の2,2'-ビス(ジフェニルホスフィノ)-1,1'-ビナフチルを添加した。酸素を除去するために、その混合物を15分間脱ガスした。次いで、保護ガス下、0.22 mg (0.001 mmol)の酢酸パラジウム(II)を添加した。保護ガス下、その内容物を90℃の温度まで3時間加熱した。後処理及び精製に付して、35 mgの所望の生成物が得られた。

【0088】

段階9： {3-[(シクロプロピルメチル)スルファニル]-2-メチル-4-(トリフルオロメチル)フェニル}ヒドラジンの合成

30 mg (0.11 mmol)の1-{3-[(シクロプロピルメチル)スルファニル]-2-メチル-4-(トリフルオロメチル)フェニル}-2-(ジフェニルメチレン)ヒドラジンを2 mLのイソプロピルアルコールと2 mLの濃塩酸に溶解させた溶液を室温で48時間攪拌した。後処理及び精製に付して、10 mgの所望の生成物が得られた。

【0089】

段階10： 4,5-ジクロロ-2-{3-[(シクロプロピルメチル)スルファニル]-2-メチル-4-(トリフルオロメチル)フェニル}ピリダジン-3(2H)-オンの合成

50 mg (0.18 mmol)の{3-[(シクロプロピルメチル)スルファニル]-2-メチル-4-(トリフルオロメチル)フェニル}ヒドラジンを1 mLのエタノールに溶解させた溶液に、34 mg (0.2 mmol、1.1 eq)の3,4-ジクロロ-5-ヒドロキシフラン-2(5H)-オンを添加した。その混合物を室温で3時間攪拌した。次いで、1 mLの酢酸を添加し、その混合物を環流しながら3時間加熱した。後処理及び精製に付して、40 mgの所望の生成物が得られた。

【0090】

段階11： 5-クロロ-2-{3-[(シクロプロピルメチル)スルファニル]-2-メチル-4-(トリフルオロメチル)フェニル}-4-メトキシピリダジン-3(2H)-オンの合成

50 mg (0.12 mmol)の4,5-ジクロロ-2-{3-[(シクロプロピルメチル)スルファニル]-2-メチル-4-(トリフルオロメチル)フェニル}ピリダジン-3(2H)-オンを2 mLの乾燥ジオキサンに溶解させた溶液に、メタノール中のナトリウムメトキシドの溶液0.033 mL (20%、0.12 mmol)を添加した。15

℃の温度で、その混合物を5 mLの乾燥ジオキサンで希釈した。次いで、その反応混合物を15℃の温度でさらに1時間攪拌した。後処理及び精製に付して、23 mgの所望の生成物が得られた。

【0091】

段階12：5-クロロ-2-〔3-〔(シクロプロピルメチル)スルファニル〕-2-メチル-4-(トリフルオロメチル)フェニル〕-4-ヒドロキシピリダジン-3(2H)-オン(実施例No. 1-499)の合成

10 mg (0.02 mmol)の5-クロロ-2-〔3-〔(シクロプロピルメチル)スルファニル〕-2-メチル-4-(トリフルオロメチル)フェニル〕-4-メトキシピリダジン-3(2H)-オンを1 mLのジクロロメタンに溶解させた溶液に、0℃の温度で、18.6 mg (0.074 mmol)の三臭化ホウ素(ジクロロメタン中の1 M溶液として)を添加した。その混合物を室温で1時間攪拌した。後処理及び精製に付して、4 mgの所望の生成物が得られた。

【0092】

選択された実施例のNMRデータ

NMRピークリスト法

選択された実施例の¹H NMRデータは、¹H NMRピークリストの形態で示されている。各シグナルピークに対して、最初にδ値(ppm)が記載され、次に、丸括弧内に、シグナル強度が記載されている。種々のシグナルピークに関するδ値-シグナル強度数の対が、セミコロンで互いに区切られて記載されている。

【0093】

従って、1つの例に対するピークリストは、以下の形態をとる：

δ₁(強度₁)；δ₂(強度₂)；...；δ_i(強度_i)；...；δ_n(強度_n)。

【0094】

先鋭なシグナルの強度は、NMRスペクトルの印刷された例におけるシグナルの高さ(cm)と相関し、シグナル強度の真の比率を示している。幅が広いシグナルの場合、数種類のピーク又は該シグナルの中央及びそれらの相対的強度が、当該スペクトルの中の最も強いシグナルとの比較で示され得る。

【0095】

¹H NMRスペクトルの化学シフトを較正するために、テトラメチルシランを使用するか、及び／又は、特にスペクトルがDMSO中で測定される場合には、その溶媒の化学シフトを使用する。従って、NMRピークリストの中には、テトラメチルシランのピークは存在し得るが、必ずしも存在する必要はない。

【0096】

¹H NMRピークのリストは、従来の¹H NMRのプリントアウトと類似しており、従って、通常、NMRの慣習的な解釈で記載される全てのピークを含んでいる。

【0097】

さらに、それらは、従来の¹H NMRのプリントアウトのように、溶媒のシグナル、目標化合物の立体異性体(これも、同様に、本発明の対象の一部を形成する)のシグナル及び／又は不純物のピークのシグナルも示し得る。

【0098】

溶媒及び／又は水のデルタ範囲内における化合物シグナルを示す場合、¹H NMRピークの本発明者らによるリストにおいては、通常、溶媒のピーク、例えば、DMSO-d₆中のDMSOのピーク及び水のピーク(これらは、通常、平均して高い強度を有している)が示されている。

【0099】

目標化合物の立体異性体のピーク及び／又は不純物のピークは、通常、平均して、目標化合物(例えば、90%を超える純度を有する目標化合物)のピークよりも低い強度を有している。

【0100】

そのような立体異性体及び／又は不純物は、特定の調製方法に対して特有であり得る。従って、それらのピークは、「副産物の指紋 (by-product fingerprint)」に関して、本発明者らの調製方法の再現性を確認するのに役立ち得る。

【0101】

目標化合物のピークを既知方法 (Mestrec、ACDシミュレーション、さらに、経験的に評価された期待値の使用) で計算する専門家は、必用に応じて、場合により付加的な強度フィルターを使用して、目標化合物のピークを分離することができる。この分離は、 ^1H NMRの慣習的な解釈における当該ピークのピーキングに類似しているであろう。

【0102】

^1H NMRピークリストに関するさらなる詳細については、「Research Disclosure Database Number 564025」から入手することができる。

【表10】

実施例 1-499: ^1H -NMR(400,0 MHz, CDCl_3):

$\delta = 7,910(11,2); 7,677(4,9); 7,656(4,8); 7,518(7,4); 7,380(1,2); 7,296(6,0); 7,290(4,4); 7,276(7,9); 7,259(1356,1); 7,226(2,8); 7,209(3,3); 7,140(1,7); 6,995(7,4); 3,731(3,6); 3,487(1,3); 2,629(2,7); 2,540(4,9); 2,314(2,0); 2,160(14,3); 1,679(2,9); 1,284(2,8); 1,254(16,0); 0,978(1,6); 0,877(3,9); 0,861(3,4); 0,503(2,6); 0,345(3,7); 0,146(3,3); 0,120(2,6); 0,008(16,4); 0,000(542,8); -0,009(21,4); -0,033(4,7); -0,150(2,3)$

実施例 2-139: ^1H -NMR(400,0 MHz, CDCl_3):

$\delta = 7,910(2,8); 7,783(2,2); 7,578(3,7); 7,518(5,6); 7,259(785,6); 6,995(4,1); 3,878(4,5); 3,731(2,6); 2,887(1,5); 2,115(16,0); 2,003(6,0); 1,852(4,2); 1,254(3,3); 0,146(1,4); 0,008(12,3); 0,000(389,1); -0,009(13,9); -0,149(1,4)$

【0103】

B. 製剤実施例

(a) 散粉性製品 (dusting product) は、10重量部の式 (I) で表される化合物及び／又はその塩と90重量部の不活性物質としてのタルクを混合させ、並びに、その混合物をハンマーミルの中で粉砕することによって得られる。

【0104】

(b) 水に容易に分散する水和剤は、25重量部の式 (I) で表される化合物及び／又はその塩と64重量部の不活性物質としてのカオリン含有石英と10重量部のリグノスルホン酸カリウムと1重量部の湿潤剤及び分散剤としてのオレオイルメチルタウリンナトリウム (sodium oleoyl methyl taurate) を混合させ、並びに、その混合物をピンディスクミル (pinned-disk mill) の中で摩砕することによって得られる。

【0105】

(c) 水に容易に分散する分散製剤 (dispersion concentrate) は、20重量部の式 (I) で表される化合物及び／又はその塩を6重量部のアルキルフェノールポリグリコールエーテル ((登録商標) Triton X 207) と3重量部のイソトリデカノールポリグリコールエーテル (8EO) と71重量部のパラフィン系鉱油 (沸点範囲: 例えば、約255°C~約277°C) と混合させ、並びに、その混合物をボールミルの中で5ミクロン未満の粉末度になるまで摩砕することによって得られる。

【0106】

(d) 乳剤は、15重量部の式 (I) で表される化合物及び／又はその塩と75重量

部の溶媒としてのシクロヘキサノンと10重量部の乳化剤としてのエトキシ化ノニルフェノールから得られる。

【0107】

(e) 顆粒水和剤は、

75重量部の式(I)で表される化合物及び／又はその塩、

10重量部のリグノスルホン酸カルシウム、

5重量部のラウリル硫酸ナトリウム、

3重量部のポリビニルアルコール、及び、

7重量部のカオリン

を混合させ、その混合物をピンディスクミルの中で摩砕し、並びに、得られた粉末を、流動床の中で造粒液(*granulating liquid*)としての水を噴霧施用することにより、造粒することによって得られる。

10

【0108】

(f) 顆粒水和剤は、さらにまた、コロイドミルの中で、

25重量部の式(I)で表される化合物及び／又はその塩、

5重量部の2, 2'-ジナフチルメタン-6, 6'-ジスルホン酸ナトリウム、

2重量部のオレオイルメチルタウリンナトリウム(*sodium oleoyl methyl taurate*)、

1重量部のポリビニルアルコール、

17重量部の炭酸カルシウム、及び、

50重量部の水

を均質化及び前粉碎し、次いで、その混合物をビーズミルの中で摩砕し、並びに、得られた懸濁液を噴霧糖の中で単一相ノズル(*one-phase nozzle*)を用いて噴霧及び乾燥させることによって得られる。

20

【0109】

C. 生物学的実施例

1. 有害な植物に対する発生前除草作用

木質繊維製ポット内の砂壤土に单子葉及び双子葉の雑草植物及び作物植物の種子を配置し、土壌で被覆する。次いで、その被覆土壌の表面に、水和剤(WP)の形態に又は乳剤(EC)として製剤された本発明の化合物を、0.2%の湿潤剤が添加された600~800L/haに相当するの散布水量の水懸濁液又は水性エマルジョンの形態で施用する。処理後、ポットを温室内に置き、その被験植物にとって良好な成育条件下に維持する。3週間の試験期間の後、処理されていない対照と比較することにより、該被験植物に対する損傷を視覚的に評価する(除草活性(%): 100%の活性=植物の枯死、0%の活性=対照植物と同様)。ここで、例えば、化合物No. 1-499及び化合物No. 2-139は、1ヘクタール当たり0.32kg以下の活性物質の施容量で、アオゲイトウ(*Amaranthus retroflexus*)、イヌビエ(*Echinochloa crus-galli*)、エノコログサ(*Setaria viridis*)及びイチビ(*Abutilon theophrasti*)などの有害な植物に対して、極めて良好な活性(80%~100%の除草活性)を示した。同時に、本発明による化合物は、発生前方法で施用された場合、活性化合物の高い薬量においてさえ、オオムギ、コムギ、ライムギ、アワ、トウモロコシ又はイネなどのイネ科作物を実質的に損傷のない状態に維持する。さらに、一部の物質は、ダイズ、ワタ、ナタネ、テンサイ又はジャガイモなどの双子葉作物に対しても損傷を与えない。

30

40

【0110】

本発明による化合物の一部は、高い選択性を有しており、従って、農作物の中の望ましくない植生を発生前方法によって防除するのに適している。

【0111】

2. 有害な植物に対する発生後除草作用

木質繊維製ポット内の砂壤土に单子葉及び双子葉の雑草植物及び作物植物の種子を配置

50

し、土壌で被覆し、温室内で良好な成育条件下で栽培する。播種後2～3週間経過した後、被験植物を1葉期で処理する。当該植物の緑色の部分に、水和剤（WP）の形態に又は乳剤（EC）として製剤された本発明の化合物を、0.2%の湿潤剤が添加された600～800L/haに相当する散布水量の水性懸濁液又は水性エマルジョンの形態で噴霧する。被験植物を温室内で最適な成育条件下に約3週間静置した後、当該調製物の効果について、処理されていない対照と比較して視覚的に評価する（除草効果（%）：100%の活性＝植物の枯死、0%の活性＝対照植物と同様）。ここで、例えば、化合物No. 1-499及び化合物No. 2-139は、1ヘクタール当たり0.08kg以下の活性物質の施容量で、マルバアサガオ（*Pharbitis purpureum*）、イヌビエ（*Echinochloa crus-galli*）、エノコログサ（*Setaria viridis*）、アオゲイトウ（*Amaranthus retroflexus*）、イチビ（*Abutilon theophrasti*）、サンシキスミレ（*Viola tricolor*）、オオイヌノフグリ（*Veronica persica*）及びハコベ（*Stellaria media*）などの有害な植物に対して、極めて良好な活性（80%～100%の除草活性）を示した。同時に、本発明による化合物は、発生後方法で施用された場合、活性化合物の高い薬量においてさえ、オオムギ、コムギ、ライムギ、アワ、トウモロコシ又はイネなどのイネ科作物を実質的に損傷のない状態に維持する。さらに、一部の物質は、ダイズ、ワタ、ナタネ、テンサイ又はジャガイモなどの双子葉作物に対しても損傷を与えない。

10

【0112】

20

本発明による化合物の一部は、高い選択性を有しており、従って、農作物の中の望ましくない植生を発生後方法によって防除するのに適している。

【国際調査報告】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/EP2015/060934

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

INV. C07D237/16 A01N43/58
ADD.

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

C07D A01N

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)

EPO-Internal, CHEM ABS Data, WPI Data

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	WO 2013/083774 A1 (SYNGENTA LTD [GB]) 13 June 2013 (2013-06-13) cited in the application Verbindungen des Disclaimers; d.h. wenn A ist eine direkte Bindung; Herbicide.; page 52 - page 53; claims 1-15; tables C-1 -----	1-11
A	EP 0 003 805 A1 (BASF AG [DE]) 5 September 1979 (1979-09-05) claims 1-7; tables 4,5; compound 6 -----	1-11
A	EP 0 085 785 A1 (BASF AG [DE]) 17 August 1983 (1983-08-17) claims 1-8 -----	1-11
A	EP 0 128 530 A1 (BASF AG [DE]) 19 December 1984 (1984-12-19) claims 1-9 -----	1-11

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

☒ See patent family annex.

* Special categories of cited documents :

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

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

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

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

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

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

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

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

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

14 July 2015

Date of mailing of the international search report

21/07/2015

Name and mailing address of the ISA/

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040,
Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Rufet, Jacques

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No

PCT/EP2015/060934

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 2013083774	A1	13-06-2013	AR 089120 A1 30-07-2014
			AU 2012350319 A1 12-06-2014
			CA 2854608 A1 13-06-2013
			CN 103974939 A 06-08-2014
			EA 201400671 A1 28-11-2014
			EP 2788331 A1 15-10-2014
			JP 2015500821 A 08-01-2015
			US 2014323300 A1 30-10-2014
			UY 34494 A 31-07-2013
			WO 2013083774 A1 13-06-2013

EP 0003805	A1	05-09-1979	AR 222989 A1 15-07-1981
			AT 363276 B 27-07-1981
			AU 520536 B2 04-02-1982
			AU 4454879 A 20-09-1979
			BR 7900964 A 25-09-1979
			CA 1111426 A1 27-10-1981
			CS 207776 B2 31-08-1981
			DD 141606 A5 14-05-1980
			DE 2808193 A1 06-09-1979
			DK 76279 A 26-08-1979
			EP 0003805 A1 05-09-1979
			ES 478016 A1 01-12-1979
			GR 66793 A1 29-04-1981
			HU 180676 B 29-04-1983
			IL 56493 A 15-06-1983
			IN 150199 A1 14-08-1982
			JP S54130590 A 09-10-1979
			NZ 189755 A 23-01-1981
			PL 213648 A1 19-11-1979
			PT 69185 A 01-03-1979
			TR 19943 A 02-05-1980
			US 4411691 A 25-10-1983
			ZA 7807240 A 30-01-1980

EP 0085785	A1	17-08-1983	CA 1194023 A1 24-09-1985
			DE 3202678 A1 04-08-1983
			EP 0085785 A1 17-08-1983
			HU 189217 B 30-06-1986
			JP S58128381 A 30-07-1983
			US 4523946 A 18-06-1985

EP 0128530	A1	19-12-1984	CA 1240680 A1 16-08-1988
			DE 3321007 A1 13-12-1984
			EP 0128530 A1 19-12-1984
			JP S6011474 A 21-01-1985
			US 4576630 A 18-03-1986
			ZA 8404342 A 27-02-1985

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2015/060934

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES

INV. C07D237/16 A01N43/58
ADD.

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPC) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPC

B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierte Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)
C07D A01N

Recherchierte, aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

EPO-Internal, CHEM ABS Data, WPI Data

C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
A	WO 2013/083774 A1 (SYNGENTA LTD [GB]) 13. Juni 2013 (2013-06-13) in der Anmeldung erwähnt Verbindungen des Disclaimers; d.h. wenn A ist eine direkte Bindung; Herbizide.; Seite 52 - Seite 53; Ansprüche 1-15; Tabellen C-1 -----	1-11
A	EP 0 003 805 A1 (BASF AG [DE]) 5. September 1979 (1979-09-05) Ansprüche 1-7; Tabellen 4,5; Verbindung 6 -----	1-11
A	EP 0 085 785 A1 (BASF AG [DE]) 17. August 1983 (1983-08-17) Ansprüche 1-8 -----	1-11
A	EP 0 128 530 A1 (BASF AG [DE]) 19. Dezember 1984 (1984-12-19) Ansprüche 1-9 -----	1-11

☐ Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen
 ☒ Siehe Anhang Patentfamilie

* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :

A Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist

E frühere Anmeldung oder Patent, die bzw. das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist

L Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)

O Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht

P Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

T Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist

X Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden

Y Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist

Z Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

14. Juli 2015

Absenddatum des internationalen Recherchenberichts

21/07/2015

Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde

Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040,
Fax: (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Bediensteter

Rufet, Jacques

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2015/060934

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO 2013083774 A1	13-06-2013	AR 089120 A1	30-07-2014
		AU 2012350319 A1	12-06-2014
		CA 2854608 A1	13-06-2013
		CN 103974939 A	06-08-2014
		EA 201400671 A1	28-11-2014
		EP 2788331 A1	15-10-2014
		JP 2015500821 A	08-01-2015
		US 2014323300 A1	30-10-2014
		UY 34494 A	31-07-2013
		WO 2013083774 A1	13-06-2013

EP 0003805 A1	05-09-1979	AR 222989 A1	15-07-1981
		AT 363276 B	27-07-1981
		AU 520536 B2	04-02-1982
		AU 4454879 A	20-09-1979
		BR 7900964 A	25-09-1979
		CA 1111426 A1	27-10-1981
		CS 207776 B2	31-08-1981
		DD 141606 A5	14-05-1980
		DE 2808193 A1	06-09-1979
		DK 76279 A	26-08-1979
		EP 0003805 A1	05-09-1979
		ES 478016 A1	01-12-1979
		GR 66793 A1	29-04-1981
		HU 180676 B	29-04-1983
		IL 56493 A	15-06-1983
		IN 150199 A1	14-08-1982
		JP S54130590 A	09-10-1979
		NZ 189755 A	23-01-1981
		PL 213648 A1	19-11-1979
		PT 69185 A	01-03-1979
		TR 19943 A	02-05-1980
		US 4411691 A	25-10-1983
		ZA 7807240 A	30-01-1980

EP 0085785 A1	17-08-1983	CA 1194023 A1	24-09-1985
		DE 3202678 A1	04-08-1983
		EP 0085785 A1	17-08-1983
		HU 189217 B	30-06-1986
		JP S58128381 A	30-07-1983
		US 4523946 A	18-06-1985

EP 0128530 A1	19-12-1984	CA 1240680 A1	16-08-1988
		DE 3321007 A1	13-12-1984
		EP 0128530 A1	19-12-1984
		JP S6011474 A	21-01-1985
		US 4576630 A	18-03-1986
		ZA 8404342 A	27-02-1985

フロントページの続き

(81)指定国 AP(BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SD, SL, ST, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), EA(AM, AZ, BY, KG, KZ, RU, TJ, TM), EP(AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, RS, SE, SI, SK, SM, TR), OA(BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, KM, ML, MR, NE, SN, TD, TG), AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BN, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IR, IS, JP, KE, KG, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PA, PE, PG, PH, PL, PT, QA, RO, RS, RU, RW, SA, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US

- (74)代理人 100137213
弁理士 安藤 健司
- (74)代理人 100143823
弁理士 市川 英彦
- (74)代理人 100151448
弁理士 青木 孝博
- (74)代理人 100183519
弁理士 櫻田 芳恵
- (74)代理人 100196483
弁理士 川寄 洋祐
- (74)代理人 100203035
弁理士 五味渕 琢也
- (74)代理人 100185959
弁理士 今藤 敏和
- (74)代理人 100160749
弁理士 飯野 陽一
- (74)代理人 100160255
弁理士 市川 祐輔
- (74)代理人 100202267
弁理士 森山 正浩
- (74)代理人 100146318
弁理士 岩瀬 吉和
- (74)代理人 100127812
弁理士 城山 康文
- (72)発明者 アーレンス, ハルトムート
ドイツ国、6 3 3 2 9・エーゲルスバハ、アウフ・デア・ヘーエ・1 4
- (72)発明者 ティーベ, ヨルグ
ドイツ国、6 0 4 3 1・フランクフルト、アム・シュバルベンシュヴァンツ・2 5
- (72)発明者 ヴアルドラフ, クリステイアン
ドイツ国、6 1 1 1 8・バート・ファイルベル、フランツ・レハール・ヴェーク・7
- (72)発明者 デイトリヒ, ハンスユルグ
ドイツ国、6 5 8 3 5・リーダーバッハ・アム・タウヌス、ポニファツイウスシュトラッセ・1・
ベー
- (72)発明者 シュムツツラー, デイルク
ドイツ国、6 5 7 9 5・ハツタースハイム、ハウプトマンヴェーク・2
- (72)発明者 ガツツヴァイラー, エルマー
ドイツ国、6 1 2 3 1・バート・ナウハイム、アム・ナウハイマー・バッハ・2 2
- (72)発明者 ロージンガー, クリストファー
ドイツ国、6 5 7 1 9・ホーフハイム、アム・ホーフエルト・3 3
- Fターム(参考) 4H011 AA01 AB01 AB03 AC01 AC04 BA03 BA06 BB09 BC03 BC07

BC19 BC20 DA02 DA15 DC03 DC06 DD04 DH02