

(19) 日本国特許庁 (JP)

(12) 特 許 公 報 (B2)

(11) 特許番号

特許第6782774号
(P6782774)

(45) 発行日 令和2年11月11日 (2020. 11. 11)

(24) 登録日 令和2年10月22日 (2020. 10. 22)

(51) Int. Cl.

F I

C O 7 D 237/16 (2006. 01)

C O 7 D 237/16

C O 7 D 213/71 (2006. 01)

C O 7 D 213/71

C S P

C O 7 D 409/04 (2006. 01)

C O 7 D 409/04

C O 7 D 409/14 (2006. 01)

C O 7 D 409/14

C O 7 D 401/12 (2006. 01)

C O 7 D 401/12

請求項の数 13 (全 82 頁)

(21) 出願番号 特願2018-522082 (P2018-522082)
 (86) (22) 出願日 平成28年10月26日 (2016. 10. 26)
 (65) 公表番号 特表2018-533580 (P2018-533580A)
 (43) 公表日 平成30年11月15日 (2018. 11. 15)
 (86) 国際出願番号 PCT/US2016/058755
 (87) 国際公開番号 W02017/074988
 (87) 国際公開日 平成29年5月4日 (2017. 5. 4)
 審査請求日 令和1年10月25日 (2019. 10. 25)
 (31) 優先権主張番号 62/247, 438
 (32) 優先日 平成27年10月28日 (2015. 10. 28)
 (33) 優先権主張国・地域又は機関
 米国 (US)

(73) 特許権者 391022452
 エフ エム シー コーポレーション
 FMC CORPORATION
 アメリカ合衆国 19104 ペンシルベ
 ニア州 フィラデルフィア ウォールナッ
 トストリート2929
 (74) 代理人 100127926
 弁理士 結田 純次
 (74) 代理人 100140132
 弁理士 竹林 則幸
 (72) 発明者 トーマス・ポール・セルビー
 アメリカ合衆国デラウェア州19707.
 ホッケシン. ベンジ・ロード820

最終頁に続く

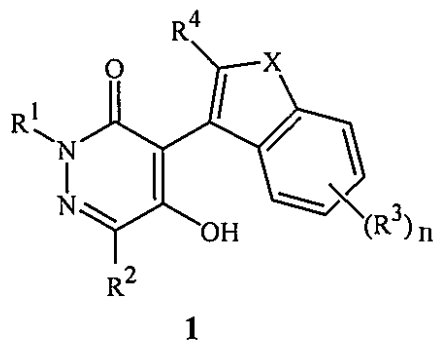
(54) 【発明の名称】 ピリダジノン除草剤を製造するための中間体、およびそれらを製造するための方法

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 1 の化合物

【化 1】



[式中、

R¹ は、H、C₁ ~ C₇ アルキル、C₃ ~ C₈ アルコキシカルボニルアルキル、C₄ ~ C₇ アルキルシクロアルキル、C₃ ~ C₇ アルケニル、C₃ ~ C₇ アルキニル、C₃ ~ C₇ シクロアルキル、C₄ ~ C₇ シクロアルキルアルキル、C₂ ~ C₃ シアノアルキル、C₁ ~ C₄ ニトロアルキル、C₁ ~ C₇ ハロアルキル、C₃ ~ C₇ ハロアルケニル、C₂ ~ C₇ アルコキシアルキルまたは C₃ ~ C₇ アルキルチオアルキルであり；

R^2 は、 $C_1 \sim C_7$ アルキル、 $C_3 \sim C_8$ アルキルカルボニルアルキル、 $C_3 \sim C_8$ アルコキシカルボニルアルキル、 $C_4 \sim C_7$ アルキルシクロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ アルケニル、 $C_3 \sim C_7$ アルキニル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_7$ シクロアルキルアルキル、 $C_2 \sim C_3$ シアノアルキル、 $C_1 \sim C_4$ ニトロアルキル、 $C_2 \sim C_7$ ハロアルコキシアルキル、 $C_1 \sim C_7$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_7$ アルコキシアルキルまたは $C_2 \sim C_3$ アルコキシカルボニルであるか；あるいは、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキルまたは $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルによって、場合により、置換されたフェニルであり；

X は、 O または S であるか；あるいは、

X は、 $-C(R^6)=C(R^7)-$ であり、ここで、 R^6 と結合した炭素原子は、 R^4 と結合した炭素原子とも結合し、 R^7 と結合した炭素原子は、式 1 中のフェニル環部分とも結合し；

それぞれの R^3 は、独立して、ハロゲン、 $-CN$ 、ニトロ、 $C_1 \sim C_5$ アルキル、 $C_2 \sim C_5$ アルケニル、 $C_2 \sim C_5$ アルキニル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_5$ シクロアルキルアルキル、 $C_1 \sim C_5$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_5$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_5$ ハロアルキニル、 $C_2 \sim C_5$ アルコキシアルキル、 $C_1 \sim C_5$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_5$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_5$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_5$ ハロアルキルチオまたは $C_2 \sim C_5$ アルコキシカルボニルであり；

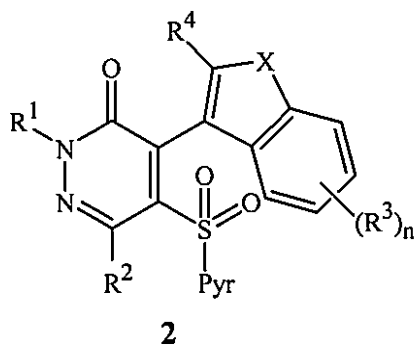
n は、 0 、 1 、 2 または 3 であり；ならびに

R^4 、 R^6 および R^7 は、独立して、 H 、ハロゲン、ニトロ、 $-CN$ 、 $C_1 \sim C_5$ アルキル、 $C_2 \sim C_5$ アルケニル、 $C_2 \sim C_5$ アルキニル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_5$ シクロアルキルアルキル、 $C_1 \sim C_5$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_5$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_5$ ハロアルキニル、 $C_2 \sim C_5$ アルコキシアルキル、 $C_1 \sim C_5$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_5$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_5$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_5$ ハロアルキルチオまたは $C_2 \sim C_5$ アルコキシカルボニルである]

を製造するための方法であって、

式 2 の除草剤の中間体化合物

【化 2】



[式中、

R^1 、 R^2 、 R^3 、 n 、 R^4 、 X 、 R^6 および R^7 は、式 1 について上記に定義され；ならびに

Pyr は、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルで、場合により、置換されたピリジン環である]

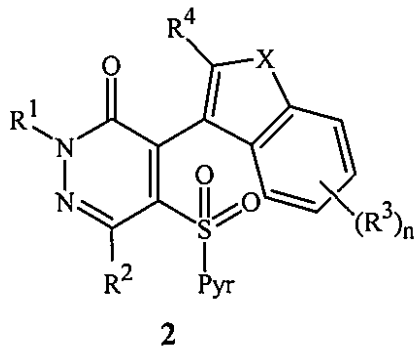
を加水分解すること、

を含む、前記方法。

【請求項 2】

式 2 の除草剤の中間体化合物

【化 3】



10

[式中、

R^1 は、H、 $C_1 \sim C_7$ アルキル、 $C_3 \sim C_8$ アルコキシカルボニルアルキル、 $C_4 \sim C_7$ アルキルシクロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ アルケニル、 $C_3 \sim C_7$ アルキニル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_7$ シクロアルキルアルキル、 $C_2 \sim C_3$ シアノアルキル、 $C_1 \sim C_4$ ニトロアルキル、 $C_1 \sim C_7$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_7$ アルコキシアルキルまたは $C_3 \sim C_7$ アルキルチオアルキルであり；

R^2 は、 $C_1 \sim C_7$ アルキル、 $C_3 \sim C_8$ アルキルカルボニルアルキル、 $C_3 \sim C_8$ アルコキシカルボニルアルキル、 $C_4 \sim C_7$ アルキルシクロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ アルケニル、 $C_3 \sim C_7$ アルキニル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_7$ シクロアルキルアルキル、 $C_2 \sim C_3$ シアノアルキル、 $C_1 \sim C_4$ ニトロアルキル、 $C_2 \sim C_7$ ハロアルコキシアルキル、 $C_1 \sim C_7$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_7$ アルコキシアルキルまたは $C_2 \sim C_3$ アルコキシカルボニルであるか；あるいは、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキルまたは $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルによって、場合により、置換されたフェニルであり；

20

X は、O または S であるか；あるいは、

X は、 $-C(R^6)=C(R^7)-$ であり、ここで、 R^6 と結合した炭素原子は、 R^4 と結合した炭素原子とも結合し、 R^7 と結合した炭素原子は、式 2 中のフェニル環部分とも結合し；

それぞれの R^3 は、独立して、ハロゲン、 $-CN$ 、ニトロ、 $C_1 \sim C_5$ アルキル、 $C_2 \sim C_5$ アルケニル、 $C_2 \sim C_5$ アルキニル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_5$ シクロアルキルアルキル、 $C_1 \sim C_5$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_5$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_5$ ハロアルキニル、 $C_2 \sim C_5$ アルコキシアルキル、 $C_1 \sim C_5$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_5$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_5$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_5$ ハロアルキルチオまたは $C_2 \sim C_5$ アルコキシカルボニルであり；

30

n は、0、1 または 2 であり；

R^4 、 R^6 および R^7 は、独立して、H、ハロゲン、ニトロ、 $-CN$ 、 $C_1 \sim C_5$ アルキル、 $C_2 \sim C_5$ アルケニル、 $C_2 \sim C_5$ アルキニル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_5$ シクロアルキルアルキル、 $C_1 \sim C_5$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_5$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_5$ ハロアルキニル、 $C_2 \sim C_5$ アルコキシアルキル、 $C_1 \sim C_5$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_5$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_5$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_5$ ハロアルキルチオまたは $C_2 \sim C_5$ アルコキシカルボニルであり；ならびに

40

Pyr は、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルで、場合により、置換されたピリジン環である]。

【請求項 3】

R^1 は、H、 $C_1 \sim C_7$ アルキル、 $C_3 \sim C_8$ アルコキシカルボニルアルキル、 $C_4 \sim C_7$ アルキルシクロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ アルケニル、 $C_3 \sim C_7$ アルキニル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_7$ シクロアルキルアルキル、 $C_1 \sim C_7$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_7$ アルコキシアルキルまたは $C_3 \sim C_7$ アルキルチオアルキルであり；

50

R^2 は、 $C_1 \sim C_7$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_7$ シクロアルキルアルキル、 $C_1 \sim C_7$ ハロアルキルまたは $C_2 \sim C_7$ アルコキシアルキルであり；
 それぞれの R^3 は、独立して、ハロゲン、 $C_1 \sim C_5$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_5$ シクロアルキルアルキル、 $C_1 \sim C_5$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_5$ アルコキシアルキル、 $C_1 \sim C_5$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_5$ ハロアルコキシまたは $C_1 \sim C_5$ アルキルチオであり；

R^4 、 R^6 および R^7 は、独立して、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_5$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_5$ シクロアルキルアルキル、 $C_1 \sim C_5$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_5$ アルコキシアルキル、 $C_1 \sim C_5$ アルコキシまたは $C_1 \sim C_5$ アルキルチオであり；
 ならびに

Pyr は、F、Cl、Br または CH_3 で、場合により、置換されたピリジン環である、

請求項 2 に記載の除草剤の中間体化合物。

【請求項 4】

R^1 は、H、 $C_1 \sim C_7$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ アルケニル、 $C_3 \sim C_7$ アルキニル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルまたは $C_4 \sim C_7$ シクロアルキルアルキルであり；

R^2 は、 $C_1 \sim C_7$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_7$ シクロアルキルアルキルまたは $C_2 \sim C_7$ アルコキシアルキルであり；

X は、S であるか；または

X は、 $-C(R^6)=C(R^7)-$ であり、ここで、 R^6 と結合した炭素原子は、 R^4 と結合した炭素原子とも結合し、 R^7 と結合した炭素原子は、式 2 中のフェニル環部分とも結合し；

それぞれの R^3 は、独立して、ハロゲン、 $C_1 \sim C_5$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは $C_1 \sim C_5$ アルコキシであり；

R^4 、 R^6 および R^7 は、独立して、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_5$ アルキルまたは $C_1 \sim C_5$ アルコキシであり；ならびに

Pyr は、F、Cl、Br または CH_3 で、場合により、置換された 2 - ピリジニル環である、

請求項 3 に記載の除草剤の中間体化合物。

【請求項 5】

R^1 は、H または $C_1 \sim C_7$ アルキルであり；

R^2 は、 $C_1 \sim C_7$ アルキルまたは $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルであり；

X は、S であり；

それぞれの R^3 は、独立して、ハロゲン、 $C_1 \sim C_5$ アルキルまたは $C_1 \sim C_5$ アルコキシであり；

R^4 は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_5$ アルキルであり；ならびに

Pyr は、無置換の 2 - ピリジニル環である、

請求項 4 に記載の除草剤の中間体化合物。

【請求項 6】

R^1 は、H または $C_1 \sim C_7$ アルキルであり；

R^2 は、 $C_1 \sim C_7$ アルキルまたは $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルであり；

X は、 $-C(R^6)=C(R^7)-$ であり、ここで、 R^6 と結合した炭素原子は、 R^4 と結合した炭素原子とも結合し、 R^7 と結合した炭素原子は、式 2 中のフェニル環部分とも結合し；

それぞれの R^3 は、独立して、ハロゲン、 $C_1 \sim C_5$ アルキルまたは $C_1 \sim C_5$ アルコキシであり；

R^4 、 R^6 および R^7 は、独立して、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_5$ アルキルであり；
 ならびに

Pyr は、無置換の 2 - ピリジニル環である、

請求項 4 に記載の除草剤の中間体化合物。

10

20

30

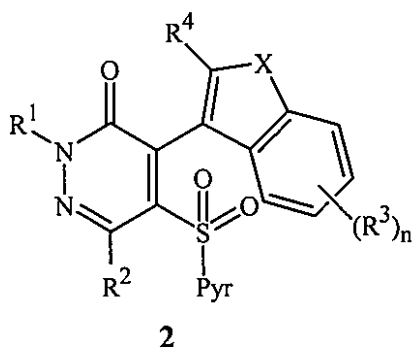
40

50

【請求項 7】

式 2 の除草剤の中間体化合物

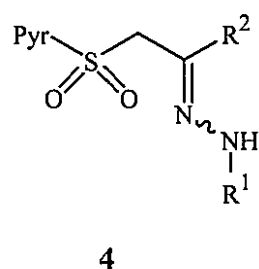
【化 4】



10

を製造するための方法であって、式 4 の除草剤の中間体化合物

【化 5】



20

〔式中、

R¹ は、H、C₁ ~ C₇ アルキル、C₃ ~ C₈ アルコキシカルボニルアルキル、C₄ ~ C₇ アルキルシクロアルキル、C₃ ~ C₇ アルケニル、C₃ ~ C₇ アルキニル、C₃ ~ C₇ シクロアルキル、C₄ ~ C₇ シクロアルキルアルキル、C₂ ~ C₃ シアノアルキル、C₁ ~ C₄ ニトロアルキル、C₁ ~ C₇ ハロアルキル、C₃ ~ C₇ ハロアルケニル、C₂ ~ C₇ アルコキシアルキルまたは C₃ ~ C₇ アルキルチオアルキルであり；

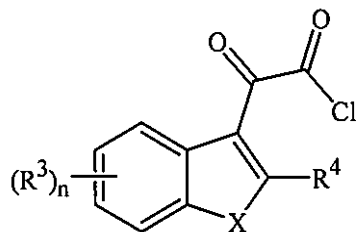
30

R² は、C₁ ~ C₇ アルキル、C₃ ~ C₈ アルキルカルボニルアルキル、C₃ ~ C₈ アルコキシカルボニルアルキル、C₄ ~ C₇ アルキルシクロアルキル、C₃ ~ C₇ アルケニル、C₃ ~ C₇ アルキニル、C₃ ~ C₇ シクロアルキル、C₄ ~ C₇ シクロアルキルアルキル、C₂ ~ C₃ シアノアルキル、C₁ ~ C₄ ニトロアルキル、C₂ ~ C₇ ハロアルコキシアルキル、C₁ ~ C₇ ハロアルキル、C₃ ~ C₇ ハロアルケニル、C₂ ~ C₇ アルコキシアルキルまたは C₂ ~ C₃ アルコキシカルボニルであるか；あるいは、ハロゲン、C₁ ~ C₄ アルキルまたは C₁ ~ C₄ ハロアルキルによって、場合により、置換されたフェニルであり；ならびに

Pyr は、ハロゲンまたは C₁ ~ C₄ アルキルで、場合により、置換されたピリジン環である〕と、式 3 の化合物

40

【化 6】



3

10

[式中、

X は、O または S であるか；あるいは、

X は、 $-C(R^6)=C(R^7)-$ であり、ここで、 R^6 と結合した炭素原子は、 R^4 と結合した炭素原子とも結合し、 R^7 と結合した炭素原子は、式 3 中のフェニル環部分とも結合し；

それぞれの R^3 は、独立して、ハロゲン、 $-CN$ 、ニトロ、 $C_1 \sim C_5$ アルキル、 $C_2 \sim C_5$ アルケニル、 $C_2 \sim C_5$ アルキニル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_5$ シクロアルキルアルキル、 $C_1 \sim C_5$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_5$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_5$ ハロアルキニル、 $C_2 \sim C_5$ アルコキシアルキル、 $C_1 \sim C_5$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_5$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_5$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_5$ ハロアルキルチオまたは $C_2 \sim C_5$ アルコシカルボニルであり；

20

n は、0、1、2 または 3 であり；ならびに

R^4 、 R^6 および R^7 は、独立して、H、ハロゲン、ニトロ、 $-CN$ 、 $C_1 \sim C_5$ アルキル、 $C_2 \sim C_5$ アルケニル、 $C_2 \sim C_5$ アルキニル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_5$ シクロアルキルアルキル、 $C_1 \sim C_5$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_5$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_5$ ハロアルキニル、 $C_2 \sim C_5$ アルコキシアルキル、 $C_1 \sim C_5$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_5$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_5$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_5$ ハロアルキルチオまたは $C_2 \sim C_5$ アルコシカルボニルである]

30

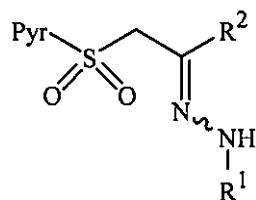
の間の反応の生成物を環化させること、

を含む、前記方法。

【請求項 8】

式 4 の除草剤の中間体化合物

【化 7】



4

40

[式中、

R^1 は、H、 $C_1 \sim C_7$ アルキル、 $C_3 \sim C_8$ アルコシカルボニルアルキル、 $C_4 \sim C_7$ アルキルシクロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ アルケニル、 $C_3 \sim C_7$ アルキニル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_7$ シクロアルキルアルキル、 $C_2 \sim C_3$ シアノアルキル、 $C_1 \sim C_4$ ニトロアルキル、 $C_1 \sim C_7$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_7$ アルコキシアルキルまたは $C_3 \sim C_7$ アルキルチオアルキルであり；

R^2 は、 $C_1 \sim C_7$ アルキル、 $C_3 \sim C_8$ アルキルカルボニルアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ア

50

ルコキシカルボニルアルキル、 $C_4 \sim C_7$ アルキルシクロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ アルケニル、 $C_3 \sim C_7$ アルキニル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_7$ シクロアルキルアルキル、 $C_2 \sim C_3$ シアノアルキル、 $C_1 \sim C_4$ ニトロアルキル、 $C_2 \sim C_7$ ハロアルコキシアルキル、 $C_1 \sim C_7$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_7$ アルコキシアルキルまたは $C_2 \sim C_3$ アルコキシカルボニルであるか；あるいは、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキルまたは $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルによって、場合により、置換されたフェニルであり；ならびに

Pyrは、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルで、場合により、置換されたピリジン環である】。

【請求項 9】

10

R^1 は、H、 $C_1 \sim C_7$ アルキル、 $C_3 \sim C_8$ アルコキシカルボニルアルキル、 $C_4 \sim C_7$ アルキルシクロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ アルケニル、 $C_3 \sim C_7$ アルキニル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_7$ シクロアルキルアルキル、 $C_1 \sim C_7$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_7$ アルコキシアルキルまたは $C_3 \sim C_7$ アルキルチオアルキルであり；

R^2 は、 $C_1 \sim C_7$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_7$ シクロアルキルアルキル、 $C_1 \sim C_7$ ハロアルキルまたは $C_2 \sim C_7$ アルコキシアルキルであり；ならびに

Pyrは、F、Cl、Brまたは CH_3 で、場合により、置換されたピリジン環である、

請求項 8 に記載の除草剤の中間体化合物。

20

【請求項 10】

R^1 は、H、 $C_1 \sim C_7$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ アルケニル、 $C_3 \sim C_7$ アルキニル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルまたは $C_4 \sim C_7$ シクロアルキルアルキルであり；

R^2 は、 $C_1 \sim C_7$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_7$ シクロアルキルアルキルまたは $C_2 \sim C_7$ アルコキシアルキルであり；ならびに

Pyrは、F、Cl、Brまたは CH_3 で、場合により、置換された2 - ピリジニル環である、

請求項 9 に記載の除草剤の中間体化合物。

【請求項 11】

R^1 は、Hまたは $C_1 \sim C_7$ アルキルであり；

30

R^2 は、 $C_1 \sim C_7$ アルキルまたは $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルであり；ならびに

Pyrは、無置換の2 - ピリジニル環である、

請求項 10 に記載の除草剤の中間体化合物。

【請求項 12】

R^1 は、Hまたは CH_3 であり；ならびに

R^2 は、 CH_3 またはc - Prである、

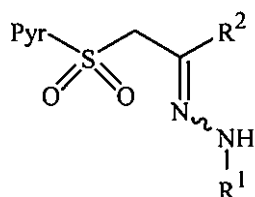
請求項 11 に記載の除草剤の中間体化合物。

【請求項 13】

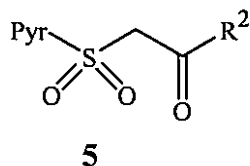
式 4 の除草剤の中間体化合物を製造するための方法であって、

【化 8】

40



【化 9】



[式中、

R^2 は、 $C_1 \sim C_7$ アルキル、 $C_3 \sim C_8$ アルキルカルボニルアルキル、 $C_3 \sim C_8$ アルコキシカルボニルアルキル、 $C_4 \sim C_7$ アルキルシクロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ アルケニル、 $C_3 \sim C_7$ アルキニル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_7$ シクロアルキルアルキル、 $C_2 \sim C_3$ シアノアルキル、 $C_1 \sim C_4$ ニトロアルキル、 $C_2 \sim C_7$ ハロアルコキシアルキル、 $C_1 \sim C_7$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_7$ アルコキシアルキルまたは $C_2 \sim C_3$ アルコキシカルボニルであるか；あるいは、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキルまたは $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルによって、場合により、置換されたフェニルであり；ならびに

10

Pyr は、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルで、場合により、置換されたピリジン環である]

を、式 6 のヒドラジン



20

[式中、

R^1 は、 H 、 $C_1 \sim C_7$ アルキル、 $C_3 \sim C_8$ アルコキシカルボニルアルキル、 $C_4 \sim C_7$ アルキルシクロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ アルケニル、 $C_3 \sim C_7$ アルキニル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_7$ シクロアルキルアルキル、 $C_2 \sim C_3$ シアノアルキル、 $C_1 \sim C_4$ ニトロアルキル、 $C_1 \sim C_7$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_7$ アルコキシアルキル、 $C_3 \sim C_7$ アルキルチオアルキルである]

と接触させること、

を含む、前記方法。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

30

【0001】

本発明は、除草剤として有用な特定のピリダジノン化合物の製造およびそれらの製造のための方法に関する。

【背景技術】

【0002】

本発明は、式 1 の特定のピリダジノン除草剤の製造方法、それらを製造するために使用される新規中間体およびそれらの中間体を製造するための新規な方法に関する。

【発明の概要】

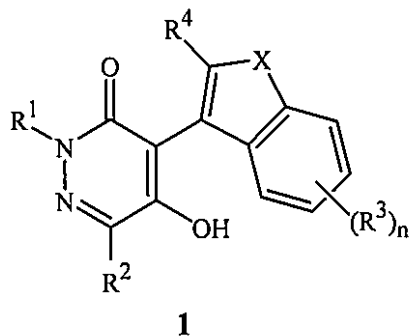
【課題を解決するための手段】

【0003】

40

本発明は、式 1 の化合物

【化 1】



10

[式中、

R^1 は、H、 $C_1 \sim C_7$ アルキル、 $C_3 \sim C_8$ アルコキシカルボニルアルキル、 $C_4 \sim C_7$ アルキルシクロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ アルケニル、 $C_3 \sim C_7$ アルキニル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_7$ シクロアルキルアルキル、 $C_2 \sim C_3$ シアノアルキル、 $C_1 \sim C_4$ ニトロアルキル、 $C_1 \sim C_7$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_7$ アルコキシアルキルまたは $C_3 \sim C_7$ アルキルチオアルキルであり；

R^2 は、 $C_1 \sim C_7$ アルキル、 $C_3 \sim C_8$ アルキルカルボニルアルキル、 $C_3 \sim C_8$ アルコキシカルボニルアルキル、 $C_4 \sim C_7$ アルキルシクロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ アルケニル、 $C_3 \sim C_7$ アルキニル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_7$ シクロアルキルアルキル、 $C_2 \sim C_3$ シアノアルキル、 $C_1 \sim C_4$ ニトロアルキル、 $C_2 \sim C_7$ ハロアルコキシアルキル、 $C_1 \sim C_7$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_7$ アルコキシアルキルまたは $C_2 \sim C_3$ アルコキシカルボニルであるか；あるいは、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキルまたは $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルによって、場合により、置換されたフェニルであり；

20

X は、O または S であるか；あるいは、

X は、 $-C(R^6)=C(R^7)-$ であり、ここで、 R^6 と結合した炭素原子は、 R^4 と結合した炭素原子とも結合し、 R^7 と結合した炭素原子は、式 1 中のフェニル環部分とも結合し；

それぞれの R^3 は、独立して、ハロゲン、 $-CN$ 、ニトロ、 $C_1 \sim C_5$ アルキル、 $C_2 \sim C_5$ アルケニル、 $C_2 \sim C_5$ アルキニル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_5$ シクロアルキルアルキル、 $C_1 \sim C_5$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_5$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_5$ ハロアルキニル、 $C_2 \sim C_5$ アルコキシアルキル、 $C_1 \sim C_5$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_5$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_5$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_5$ ハロアルキルチオまたは $C_2 \sim C_5$ アルコキシカルボニルであり；

30

n は、0、1、2 または 3 であり；ならびに

R^4 、 R^6 および R^7 は、独立して、H、ハロゲン、ニトロ、 $-CN$ 、 $C_1 \sim C_5$ アルキル、 $C_2 \sim C_5$ アルケニル、 $C_2 \sim C_5$ アルキニル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_5$ シクロアルキルアルキル、 $C_1 \sim C_5$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_5$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_5$ ハロアルキニル、 $C_2 \sim C_5$ アルコキシアルキル、 $C_1 \sim C_5$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_5$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_5$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_5$ ハロアルキルチオまたは $C_2 \sim C_5$ アルコキシカルボニルである]

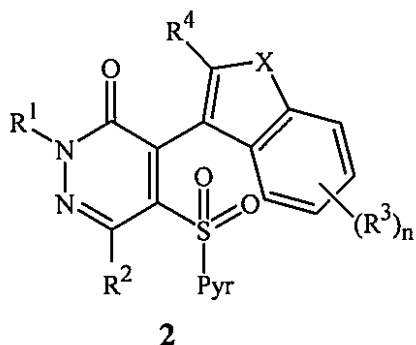
40

を製造するための方法であって、

【0004】

式 2 の除草剤の中間体化合物

【化 2】



10

[式中、

R^1 、 R^2 、 R^3 、 n 、 R^4 、 X 、 R^6 および R^7 は、式 1 について上記に定義された通りであり；ならびに

Pyr は、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルで、場合により、置換されたピリジン環である]

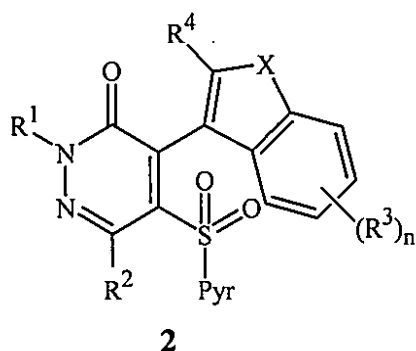
を加水分解すること、
を含む、方法を提供する。

【 0 0 0 5 】

本発明は、式 2 の除草剤の中間体化合物

20

【化 3】



30

[式中、

R^1 は、 H 、 $C_1 \sim C_7$ アルキル、 $C_3 \sim C_8$ アルコキシカルボニルアルキル、 $C_4 \sim C_7$ アルキルシクロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ アルケニル、 $C_3 \sim C_7$ アルキニル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_7$ シクロアルキルアルキル、 $C_2 \sim C_3$ シアノアルキル、 $C_1 \sim C_4$ ニトロアルキル、 $C_1 \sim C_7$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_7$ アルコシアルキルまたは $C_3 \sim C_7$ アルキルチオアルキルであり；

R^2 は、 $C_1 \sim C_7$ アルキル、 $C_3 \sim C_8$ アルキルカルボニルアルキル、 $C_3 \sim C_8$ アルコキシカルボニルアルキル、 $C_4 \sim C_7$ アルキルシクロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ アルケニル、 $C_3 \sim C_7$ アルキニル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_7$ シクロアルキルアルキル、 $C_2 \sim C_3$ シアノアルキル、 $C_1 \sim C_4$ ニトロアルキル、 $C_2 \sim C_7$ ハロアルコシアルキル、 $C_1 \sim C_7$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_7$ アルコシアルキルまたは $C_2 \sim C_3$ アルコキシカルボニルであるか；あるいは、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキルまたは $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルによって、場合により、置換されたフェニルであり；

40

X は、 O または S であるか；あるいは、

X は、 $-C(R^6)=C(R^7)-$ であり、ここで、 R^6 と結合した炭素原子は、 R^4 と結合した炭素原子とも結合し、 R^7 と結合した炭素原子は、式 2 中のフェニル環部分とも結合し；

それぞれの R^3 は、独立して、ハロゲン、 $-CN$ 、ニトロ、 $C_1 \sim C_5$ アルキル、 C_2

50

~ C₅ アルケニル、C₂ ~ C₅ アルキニル、C₃ ~ C₅ シクロアルキル、C₄ ~ C₅ シクロアルキルアルキル、C₁ ~ C₅ ハロアルキル、C₃ ~ C₅ ハロアルケニル、C₃ ~ C₅ ハロアルキニル、C₂ ~ C₅ アルコキシアルキル、C₁ ~ C₅ アルコキシ、C₁ ~ C₅ ハロアルコキシ、C₁ ~ C₅ アルキルチオ、C₁ ~ C₅ ハロアルキルチオまたは C₂ ~ C₅ アルコキシカルボニルであり；

n は、0、1、2 または 3 であり；

R⁴、R⁶ および R⁷ は、独立して、H、ハロゲン、ニトロ、-CN、C₁ ~ C₅ アルキル、C₂ ~ C₅ アルケニル、C₂ ~ C₅ アルキニル、C₃ ~ C₅ シクロアルキル、C₄ ~ C₅ シクロアルキルアルキル、C₁ ~ C₅ ハロアルキル、C₃ ~ C₅ ハロアルケニル、C₃ ~ C₅ ハロアルキニル、C₂ ~ C₅ アルコキシアルキル、C₁ ~ C₅ アルコキシ、C₁ ~ C₅ ハロアルコキシ、C₁ ~ C₅ アルキルチオ、C₁ ~ C₄ アルキルスルフィニル、C₁ ~ C₄ アルキルスルホニル、C₁ ~ C₅ ハロアルキルチオまたは C₂ ~ C₅ アルコキシカルボニルであり；ならびに

Pyr は、ハロゲンまたは C₁ ~ C₄ アルキルで、場合により、置換されたピリジン環である]

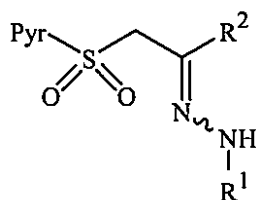
も対象とする。

【0006】

本発明は、式 2 の除草剤の中間体化合物を製造するための方法であって、

式 4 の除草剤の中間体化合物

【化 4】



4

[式中、

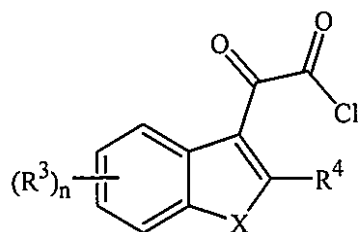
R¹ は、H、C₁ ~ C₇ アルキル、C₃ ~ C₈ アルコキシカルボニルアルキル、C₄ ~ C₇ アルキルシクロアルキル、C₃ ~ C₇ アルケニル、C₃ ~ C₇ アルキニル、C₃ ~ C₇ シクロアルキル、C₄ ~ C₇ シクロアルキルアルキル、C₂ ~ C₃ シアノアルキル、C₁ ~ C₄ ニトロアルキル、C₁ ~ C₇ ハロアルキル、C₃ ~ C₇ ハロアルケニル、C₂ ~ C₇ アルコキシアルキルまたは C₃ ~ C₇ アルキルチオアルキルであり；

R² は、C₁ ~ C₇ アルキル、C₃ ~ C₈ アルキルカルボニルアルキル、C₃ ~ C₈ アルコキシカルボニルアルキル、C₄ ~ C₇ アルキルシクロアルキル、C₃ ~ C₇ アルケニル、C₃ ~ C₇ アルキニル、C₃ ~ C₇ シクロアルキル、C₄ ~ C₇ シクロアルキルアルキル、C₂ ~ C₃ シアノアルキル、C₁ ~ C₄ ニトロアルキル、C₂ ~ C₇ ハロアルコキシアルキル、C₁ ~ C₇ ハロアルキル、C₃ ~ C₇ ハロアルケニル、C₂ ~ C₇ アルコキシアルキルまたは C₂ ~ C₃ アルコキシカルボニルであるか；あるいは、ハロゲン、C₁ ~ C₄ アルキルまたは C₁ ~ C₄ ハロアルキルによって、場合により、置換されたフェニルであり；ならびに

Pyr は、ハロゲンまたは C₁ ~ C₄ アルキルで、場合により、置換されたピリジン環である]

と、式 3 の化合物

【化 5】



3

10

[式中、

X は、O または S であるか；あるいは、

X は、 $-C(R^6)=C(R^7)-$ であり、ここで、 R^6 と結合した炭素原子は、 R^4 と結合した炭素原子とも結合し、 R^7 と結合した炭素原子は、式 3 中のフェニル環部分とも結合し；

それぞれの R^3 は、独立して、ハロゲン、 $-CN$ 、ニトロ、 $C_1 \sim C_5$ アルキル、 $C_2 \sim C_5$ アルケニル、 $C_2 \sim C_5$ アルキニル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_5$ シクロアルキルアルキル、 $C_1 \sim C_5$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_5$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_5$ ハロアルキニル、 $C_2 \sim C_5$ アルコキシアルキル、 $C_1 \sim C_5$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_5$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_5$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_5$ ハロアルキルチオまたは $C_2 \sim C_5$ アルコキシカルボニルであり；

n は、0、1、2 または 3 であり；ならびに

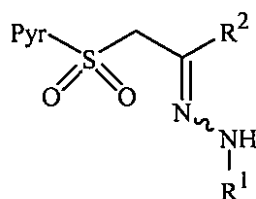
R^4 、 R^6 および R^7 は、独立して、H、ハロゲン、ニトロ、 $-CN$ 、 $C_1 \sim C_5$ アルキル、 $C_2 \sim C_5$ アルケニル、 $C_2 \sim C_5$ アルキニル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_5$ シクロアルキルアルキル、 $C_1 \sim C_5$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_5$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_5$ ハロアルキニル、 $C_2 \sim C_5$ アルコキシアルキル、 $C_1 \sim C_5$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_5$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_5$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_5$ ハロアルキルチオまたは $C_2 \sim C_5$ アルコキシカルボニルである]

の反応の生成物を環化させること、
を含む、方法も提供する。

【0007】

本発明は、式 4 の除草剤の中間体化合物

【化 6】



4

40

[式中、

R^1 は、H、 $C_1 \sim C_7$ アルキル、 $C_3 \sim C_8$ アルコキシカルボニルアルキル、 $C_4 \sim C_7$ アルキルシクロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ アルケニル、 $C_3 \sim C_7$ アルキニル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_7$ シクロアルキルアルキル、 $C_2 \sim C_3$ シアノアルキル、 $C_1 \sim C_4$ ニトロアルキル、 $C_1 \sim C_7$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_7$ アルコキシアルキルまたは $C_3 \sim C_7$ アルキルチオアルキルであり；

R^2 は、 $C_1 \sim C_7$ アルキル、 $C_3 \sim C_8$ アルキルカルボニルアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ア

50

ルコキシカルボニルアルキル、 $C_4 \sim C_7$ アルキルシクロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ アルケニル、 $C_3 \sim C_7$ アルキニル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_7$ シクロアルキルアルキル、 $C_2 \sim C_3$ シアノアルキル、 $C_1 \sim C_4$ ニトロアルキル、 $C_2 \sim C_7$ ハロアルコキシアルキル、 $C_1 \sim C_7$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_7$ アルコキシアルキルまたは $C_2 \sim C_3$ アルコキシカルボニルであるか；あるいは、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキルまたは $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルによって、場合により、置換されたフェニルであり；ならびに

Pyr は、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルで、場合により、置換されたピリジン環である]

も対象とする。

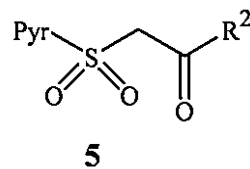
10

【0008】

本発明は、式4の除草剤の中間体化合物を製造するための方法であって、

式5の化合物

【化7】



20

[式中、

R^2 は、 $C_1 \sim C_7$ アルキル、 $C_3 \sim C_8$ アルキルカルボニルアルキル、 $C_3 \sim C_8$ アルコキシカルボニルアルキル、 $C_4 \sim C_7$ アルキルシクロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ アルケニル、 $C_3 \sim C_7$ アルキニル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_7$ シクロアルキルアルキル、 $C_2 \sim C_3$ シアノアルキル、 $C_1 \sim C_4$ ニトロアルキル、 $C_2 \sim C_7$ ハロアルコキシアルキル、 $C_1 \sim C_7$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_7$ アルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_3$ アルコキシカルボニルであるか；あるいは、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキルまたは $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルによって、場合により、置換されたフェニルであり；ならびに

Pyr は、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルで、場合により、置換されたピリジン環である]

30

を、式6のヒドラジン



[式中、

R^1 は、H、 $C_1 \sim C_7$ アルキル、 $C_3 \sim C_8$ アルコキシカルボニルアルキル、 $C_4 \sim C_7$ アルキルシクロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ アルケニル、 $C_3 \sim C_7$ アルキニル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_7$ シクロアルキルアルキル、 $C_2 \sim C_3$ シアノアルキル、 $C_1 \sim C_4$ ニトロアルキル、 $C_1 \sim C_7$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_7$ アルコキシアルキルまたは $C_3 \sim C_7$ アルキルチオアルキルである]

と接触させること

40

を含む、方法も提供する。

【発明を実施するための形態】

【0009】

本明細書において使用する場合、「含む (comprises)」、「含む (comprising)」、「含む (includes)」、「含む (including)」、「有する (has)」、「有する (having)」、「含有する (contains)」、「含有する (containing)」、「を特徴とする (characterized by)」またはこれらの任意の他の変形は、明確に示された任意の限定の下、非排他的な包含物を包含することを意図する。例えば、要素のリストを含む方法 (process) または方法 (method) は、それらの要素に必ずしも限定されるだけでなく、

50

明示的に列挙されていないか、またはそのような方法 (p r o c e s s) または方法 (m e t h o d) に固有の他の要素を含む。

【 0 0 1 0 】

「からなる (c o n s i s t i n g o f) 」という移行句は、特定されていない、任意の要素、工程または成分を排除する。特許請求の範囲中にある場合、このような句は、特許請求の範囲を、通常、それらに関連する不純物を除き、言及されたもの以外の材料の包含に限定するだろう。「からなる (c o n s i s t i n g o f) 」という語句が、ブリアンプルの直後ではなく、特許請求の範囲のボディの一文節中に出てくる場合、これは、その文節中に示された要素のみを限定し、他の要素は、特許請求の範囲から、全体としては排除されない。

10

【 0 0 1 1 】

「から実質的になる (c o n s i s t i n g e s s e n t i a l l y o f) 」という移行句は、文字通り開示されているものに加えて、材料、工程、特徴、成分または要素を含む、組成物または方法を定義するために使用されるが、ただし、これらの追加の材料、工程、特徴、成分または要素は、特許請求の範囲に記載された発明の、主要なおよび新規な特徴に著しい影響を与えない。「から実質的になる (c o n s i s t i n g e s s e n t i a l l y o f) 」という用語は、「含む (c o m p r i s i n g) 」および「からなる (c o n s i s t i n g o f) 」の間の中間の領域を占める。

【 0 0 1 2 】

出願人らが、「含む (c o m p r i s i n g) 」などのオープンエンドの用語で、発明またはその一部分を定義している場合、これは、(別段の定めがある場合を除き)、記載が、「から実質的になる (c o n s i s t i n g e s s e n t i a l l y o f) 」または「からなる (c o n s i s t i n g o f) 」という用語を使用して、このような発明を記載しているとも解釈されるべきであることが容易に理解されるべきである。

20

【 0 0 1 3 】

さらに、明示的に反対する記載がない限り、「または (o r) 」は、包含的なまたは (o r) を指し、排他的なまたは (o r) を指さない。例えば、条件 A または B は、以下のいずれか 1 つによって満たされる：A は、真であり (または存在する)、かつ B は、偽である (または存在しない)；A は、偽であり (または存在しない)、かつ B は、真である (または存在する)；ならびに、A および B の両方は、真である (または存在する)。

30

【 0 0 1 4 】

また、本発明の要素または成分に先行する不定冠詞「a」および「an」は、要素または成分の実例 (すなわち、存在) の数に関して、非制限的であることを意図する。したがって、「a」または「an」は、1 つまたは少なくとも 1 つを含むと読解されるべきであり、要素または成分の単数形の語形は、その数が単数を意味することが明らかでない限り、複数も含む。

【 0 0 1 5 】

本明細書において使用する場合、「アルキル化」という用語は、求核剤が、炭素含有ラジカルから、ハライドまたはスルホネートなどの脱離基と置き換わる反応を指す。別段の指示がない限り、「アルキル化」という用語は、炭素含有ラジカルをアルキルに限定するものではない。

40

【 0 0 1 6 】

上記の記述において、単独または「アルキルチオ」もしくは「ハロアルキル」などの複合語のいずれかにおいて使用される「アルキル」という用語は、メチル、エチル、n - プロピル、i - プロピル、または異なるブチル、ペンチルもしくはヘキシル異性体などの、直鎖状または分枝鎖状のアルキルを含む。「アルケニル」は、エテニル、1 - プロペニル、2 - プロペニル、ならびに異なるブテニル、ペンテニルおよびヘキセニル異性体などの、直鎖状または分枝鎖状のアルケンを含む。「アルケニル」は、1, 2 - プロパジエニルおよび 2, 4 - ヘキサジエニルなどのポリエンも含む。「アルキニル」は、エチニル、1 - プロピニル、2 - プロピニル、ならびに異なるブチニル、ペンチニルおよびヘキシニル

50

異性体などの、直鎖状または分枝鎖状のアルキンを含む。「アルキニル」は、2, 5 - ヘキサジニルなどの、複数の三重結合で構成される部分も含むことができる。

【0017】

「アルコキシ」は、例えば、メトキシ、エトキシ、n - プロピルオキシ、イソプロピルオキシ、ならびに異なるブトキシ、ペントキシおよびヘキシルオキシ異性体を含む。「アルコキシアルキル」は、アルキル上のアルコキシ置換を表す。「アルコキシアルキル」の例としては、 CH_3OCH_2 、 $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2$ および $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2$ が挙げられる。「アルコキシアルコキシ」は、アルコキシ上のアルコキシ置換を表す。「アルキルチオ」は、メチルチオ、エチルチオ、ならびに異なるプロピルチオ、ブチルチオ、ペンチルチオおよびヘキシルチオ異性体などの、分枝鎖状または直鎖状のアルキルチオ部分を含む。「アルキルチオアルキル」は、アルキル上のアルキルチオ置換を表す。「アルキルチオアルキル」の例としては、 CH_3SCH_2 、 $\text{CH}_3\text{SCH}_2\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{SCH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SCH}_2$ および $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{SCH}_2\text{CH}_2$ が挙げられる。「シアノアルキル」は、1つのシアノ基で置換されたアルキル基を表す。「シアノアルキル」の例としては、 NCCCH_2 および $\text{NCCCH}_2\text{CH}_2$ (あるいは、 $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CN}$ として特定される) が挙げられる。「ニトロアルキル」は、1つのニトロ基で置換されたアルキル基を表す。「ニトロアルキル」の例としては、 $-\text{CH}_2\text{NO}_2$ および $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NO}_2$ が挙げられる。

【0018】

「シクロアルキル」は、例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチルおよびシクロヘキシルを含む。「シクロアルキルアルキル」という用語は、アルキル部分上のシクロアルキル置換を表す。「シクロアルキルアルキル」の例としては、シクロプロピルメチル、シクロペンチルエチル、ならびに直鎖状または分枝鎖状のアルキル基と結合した他のシクロアルキル部分が挙げられる。

【0019】

単独または「ハロアルキル」などの複合語のいずれかにおいて、あるいは「ハロゲンで置換されたアルキル」などの記載において使用される場合の「ハロゲン」という用語は、フッ素、塩素、臭素またはヨウ素を含む。さらに、「ハロアルキル」などの複合語において使用される場合、または「ハロゲンで置換されたアルキル」などの記載において使用される場合、前記アルキルは、同一または異なるハロゲン原子で、部分的または完全に置換される。「ハロアルキル」または「ハロゲンで置換されたアルキル」の例としては、 F_3C 、 ClCH_2 、 CF_3CH_2 および CF_3CCl_2 が挙げられる。「ハロアルコキシ」、「ハロアルコキシアルキル」、「ハロアルキルチオ」、「ハロアルケニル」、「ハロアルキニル」などの用語は、「ハロアルキル」という用語と同様に定義される。「ハロアルコキシ」の例としては、 $\text{CF}_3\text{O}-$ 、 $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{O}-$ 、 $\text{HCF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ および $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{O}-$ が挙げられる。「ハロアルコキシアルキル」の例としては、 CF_3OCH_2- 、 $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2-$ 、 $\text{HCF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2-$ および $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2-$ が挙げられる。「ハロアルキルチオ」の例としては、 $\text{CCl}_3\text{S}-$ 、 $\text{CF}_3\text{S}-$ 、 $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{S}-$ および $\text{ClCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}-$ が挙げられる。「ハロアルケニル」の例としては、 $(\text{Cl})_2\text{C}=\text{CHCH}_2-$ および $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2-$ が挙げられる。「ハロアルキニル」の例としては、 $\text{HC}(\text{Cl})\text{CHCl}-$ 、 $\text{CF}_3\text{C}(\text{Cl})\text{C}-$ 、 $\text{CCl}_3\text{C}(\text{Cl})\text{C}-$ および $\text{FCH}_2\text{C}(\text{Cl})\text{CH}_2-$ が挙げられる。

【0020】

「アルコキシカルボニル」は、 $\text{C}(=\text{O})$ 部分と結合した、直鎖状または分枝鎖状のアルコキシ部分を表す。「アルコキシカルボニル」の例としては、 $\text{CH}_3\text{OC}(=\text{O})-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})-$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHOC}(=\text{O})-$ 、および異なるブトキシカルボニルまたはペントキシカルボニル異性体が挙げられる。「アルキルカルボニルアルキル」は、直鎖状または分枝鎖状のアルキル基を通して結合した、直鎖状または分枝鎖状のアルキルカルボニル部分を表す。「アルキルカル

10

20

30

40

50

ボニルアルキル」の例としては、 $\text{CH}_3\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHC}(=\text{O})\text{CH}_2-$ 、および異なるブトキシカルボニルまたはペントキシカルボニル異性体が挙げられる。

【0021】

置換基中の炭素原子の総数は、接頭辞「 $\text{C}_i \sim \text{C}_j$ 」によって示され、ここで、 i および j は 1 ~ 7 の数字である。例えば、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキルスルホニルは、メチルスルホニルからブチルスルホニルを指し； C_2 アルコキシアルキルは、 CH_3OCH_2- を指し； C_3 アルコキシアルキルは、例えば、 $\text{CH}_3\text{CH}(\text{OCH}_3)-$ 、 $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2-$ または $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2-$ を指し； C_4 アルコキシアルキルは、全部で 4 個の炭素原子を含有するアルコキシ基で置換されたアルキル基の様々な異性体を指し、例としては、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2-$ および $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2-$ が挙げられる。

10

【0022】

化合物が、前記置換基の数が 1 を超えることが可能であることを示す下付き文字を有する置換基で置換される場合、前記置換基（置換基が 1 を超える場合）は、定義された置換基、例えば、 $(\text{R}^3)_n$ （式中、 n は、1、2 または 3 である）の群から、独立して、選択される。基が、水素であることが可能な置換基を含有する場合、例えば、 R^4 は、この置換基が、水素である場合、これは、無置換である前記の基と等価であると認識される。可変の基が、場合により、ある位置に結合することを示す場合、例えば、 $(\text{R}^3)_n$ （式中、 n は、0 である）、水素は、可変の基の定義に列挙されなかったとしても、その位置に存在する。基上の 1 つまたはそれ以上の位置が、「置換されていない」または「無置換」という用語は、2 つまたはそれ以上の縮合環を表す。

20

【0023】

本発明の化合物は、1 つまたはそれ以上の立体異性体として存在することができる。種々の立体異性体としては、エナンチオマー、ジアステレオマー、アストロプ異性体および幾何異性体が挙げられる。立体異性体は、構造が同一であるが、空間中におけるそれらの原子の配置が異なる異性体であり、エナンチオマー、ジアステレオマー、シス-トランス異性体（幾何異性体としても知られている）およびアトロプ異性体を含む。アトロプ異性体は、回転障壁が異性体種の単離を可能にするのに十分高い、単結合に関する回転の制限によりもたらされる。当業者は、1 つの立体異性体が、他の立体異性体に対して、富化された場合に、または、他の立体異性体から分離された場合に、より活性であり、および/または有益な効果を発揮することを認識するだろう。さらに、当業者には、前記立体異性体を、分離、富化、および/または選択的に製造する方法は公知である。本発明の化合物は、立体異性体の混合物、個々の立体異性体、または光学的に活性な形態として存在することができる。

30

【0024】

式 2 および 4 の除草剤の中間体化合物は、典型的には、2 つ以上の形態で存在し、したがって、これは、これらが表す化合物のすべての結晶形態および非結晶形態を含む。非結晶形態は、ワックスおよびガムなどの固体である実施形態だけでなく、溶液および熔融物などの液体である実施形態を含む。結晶形態は、実質的に単結晶の種類を表す実施形態、および多形体の混合物を表す実施形態（すなわち、異なる結晶性の種類）を含む。「多形体」という用語は、異なる結晶形態で結晶化が可能である化学化合物の特定の結晶形態を指し、これらの形態は、結晶格子中に分子の異なる配置および/または配座を有する。多形体は、同一の化学的組成を有することが可能であるが、これらは、格子中に、弱くまたは強く結合することが可能である、共結晶した水もしくは他の分子の存在または不在により、組成が異なっていることも可能である。多形体は、結晶形状、密度、硬度、色、化学的安定性、融点、吸湿性、懸濁性、溶解速度および生物学的利用率のような化学的、物理的および生物学的特性が異なっていることが可能である。当業者は、式 2 および 4 の除草剤の中間体化合物の多形体が、式 2 または 4 の除草剤の中間体化合物の同じ化合物の別の多形体または多形体の混合物に対して、有益な効果（例えば、製造方法中での製造のため

40

50

の適性)を発揮することが可能であることを認識するだろう。式2または4の除草剤の中間体化合物の特定の多形体の製造および単離は、例えば、選択された溶媒および温度を使用する結晶化を含む、当業者に公知の方法によって達成することができる。多形についての包括的な考察については、R. Hilfiker 編、Polymorphism in the Pharmaceutical Industry、Wiley-VCH、Weinheim、2006年を参照のこと。

【0025】

当業者は、プロセス条件下のために、化学化合物が、それらの対応する非塩形態または塩形態で単離することができることを認識している。したがって、式1の化合物の広範囲の様々な塩は、本方法、または式1の化合物を製造するための方法において利用される塩基に依存する方法を使用して、単離することができる。同様に、式2の除草剤の中間体化合物は、それらを製造するための方法において使用される塩基に依存して、塩形態または非塩形態として単離することができる。適切な塩としては、臭化水素酸、塩酸、硝酸、リン酸、硫酸、酢酸、酪酸、フマル酸、乳酸、マレイン酸、マロン酸、シュウ酸、プロピオン酸、サリチル酸、酒石酸、4-トルエンスルホン酸または吉草酸などの無機酸または有機酸との酸付加塩が挙げられる。本発明は、式2および4の除草剤の中間体化合物、ならびに、式1の化合物、および式2および4の除草剤の中間体化合物を作るための方法を含む。

【0026】

発明の概要に記載する本発明の実施形態は以下を含む。

【0027】

実施形態A1

発明の概要に記載する式1の化合物を調製するための方法であって、式2の除草剤の中間体化合物の加水分解が、適切な溶媒中、適切な有機塩基または無機塩基の存在中で行われる、方法。

【0028】

実施形態A2

加水分解が、N-メチルピロリジノン、H₂O、N,N-ジメチルホルムアミドおよびジメチルスルホキシドから選択される溶媒中で行われ、塩基が、水酸化ナトリウム、水酸化カリウムまたは炭酸カリウムから選択される、実施形態A1の方法。

【0029】

実施形態A3

加水分解が、N-メチルピロリジノンおよび水から選択される溶媒中で行われ、塩基が、水酸化ナトリウムまたは水酸化カリウムから選択される無機塩基である、実施形態A2の方法。

【0030】

実施形態A4

加水分解が、N-メチルピロリジノンおよびH₂Oの混合物中で行われ、塩基が、水酸化ナトリウムである、実施形態A1の方法。

【0031】

実施形態A5

式1の化合物において、

R¹は、H、C₁~C₇アルキル、C₃~C₈アルコキシカルボニルアルキル、C₄~C₇アルキルシクロアルキル、C₃~C₇アルケニル、C₃~C₇アルキニル、C₃~C₇シクロアルキル、C₄~C₇シクロアルキルアルキル、C₁~C₇ハロアルキル、C₂~C₇アルコキシアルキルまたはC₃~C₇アルキルチオアルキルであり；

R²は、C₁~C₇アルキル、C₃~C₇シクロアルキル、C₄~C₇シクロアルキルアルキル、C₁~C₇ハロアルキルまたはC₂~C₇アルコキシアルキルであり；

それぞれのR³は、独立して、ハロゲン、C₁~C₅アルキル、C₃~C₅シクロアルキル、C₄~C₅シクロアルキルアルキル、C₁~C₅ハロアルキル、C₂~C₅アルコ

10

20

30

40

50

キシアルキル、 $C_1 \sim C_5$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_5$ ハロアルコキシまたは $C_1 \sim C_5$ アルキルチオであり；

n は、0、1 または 2 であり；

R^4 、 R^6 および R^7 は、独立して、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_5$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_5$ シクロアルキルアルキル、 $C_1 \sim C_5$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_5$ アルコキシアルキル、 $C_1 \sim C_5$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_5$ アルキルチオであり；

式 2 の化合物において、

R^1 、 R^2 、 R^3 、 n 、 R^4 、 X 、 R^6 および R^7 は、式 1 について上記に定義された通りであり；ならびに

Pyr は、F、Cl、Br または CH_3 で、場合により、置換されたピリジン環である

10

実施形態 A 1 から A 4 のいずれか 1 つの方法。

【0032】

実施形態 A 6

式 1 の化合物において、

R^1 は、H、 $C_1 \sim C_7$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ アルケニル、 $C_3 \sim C_7$ アルキニル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルまたは $C_4 \sim C_7$ シクロアルキルアルキルであり；

R^2 は、 $C_1 \sim C_7$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_7$ シクロアルキルアルキルまたは $C_2 \sim C_7$ アルコキシアルキルであり；

X は、S であるか；または

20

X は、 $-C(R^6) = C(R^7)-$ であり、ここで、 R^6 と結合した炭素原子は、 R^4 と結合した炭素原子とも結合し、 R^7 と結合した炭素原子は、式 2 中のフェニル環部分とも結合し；

それぞれの R^3 は、独立して、ハロゲン、 $C_1 \sim C_5$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは $C_1 \sim C_5$ アルコキシであり；

R^4 、 R^6 および R^7 は、独立して、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_5$ アルキルまたは $C_1 \sim C_5$ アルコキシであり；

式 2 の化合物において、

R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 X 、 R^6 および R^7 は、式 1 について上記に定義された通りであり；ならびに

30

Pyr は、F、Cl、Br または CH_3 で、場合により、置換された 2 - ピリジニル環である、

実施形態 A 5 の方法。

【0033】

実施形態 A 7

式 1 の化合物において、

R^1 は、H または $C_1 \sim C_7$ アルキルであり；

R^2 は、 $C_1 \sim C_7$ アルキルまたは $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルであり；

X は、S であり；

それぞれの R^3 は、独立して、ハロゲン、 $C_1 \sim C_5$ アルキルまたは $C_1 \sim C_5$ アルコキシであり；

40

R^4 は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_5$ アルキルであり；ならびに

式 2 の化合物において、

R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 および X は、式 1 について上記に定義された通りであり；ならびに

Pyr は、無置換の 2 - ピリジニル環である、

実施形態 A 6 の方法。

【0034】

実施形態 A 8

式 1 の化合物において、

50

R^1 は、H または $C_1 \sim C_7$ アルキルであり；

R^2 は、 $C_1 \sim C_7$ アルキルまたは $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルであり；

X は、 $-C(R^6) = C(R^7)-$ であり、ここで、 R^6 と結合した炭素原子は、 R^4 と結合した炭素原子とも結合し、 R^7 と結合した炭素原子は、式 2 中のフェニル環部分とも結合し；

それぞれの R^3 は、独立して、ハロゲン、 $C_1 \sim C_5$ アルキルまたは $C_1 \sim C_5$ アルコキシであり；

R^4 、 R^6 および R^7 は、独立して、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_5$ アルキルであり；
ならびに

式 2 の化合物において、

R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、X、 R^6 および R^7 は、式 1 について上記に定義された通りであり；ならびに

Py r は、無置換の 2 - ピリジニル環である、
実施形態 A 6 の方法。

【0035】

実施形態 A 9

R^1 は、H または CH_3 であり；ならびに

R^2 は、 CH_3 または $c-Pr$ である、

実施形態 A 1 から A 8 のいずれか 1 つの方法。

【0036】

実施形態 A 10

R^1 は、 CH_3 であり；ならびに

R^2 は、 CH_3 である、

実施形態 A 9 の方法。

【0037】

実施形態 A 11

「加水分解」という用語が、「脱保護」に置き換えられる、実施形態 A 1 から A 10 のいずれか 1 つの方法。

【0038】

実施形態 B 1

発明の概要に記載する式 2 の除草剤の中間体化合物であって、

R^1 は、H、 $C_1 \sim C_7$ アルキル、 $C_3 \sim C_8$ アルコキシカルボニルアルキル、 $C_4 \sim C_7$ アルキルシクロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ アルケニル、 $C_3 \sim C_7$ アルキニル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_7$ シクロアルキルアルキル、 $C_1 \sim C_7$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_7$ アルコキシアルキルまたは $C_3 \sim C_7$ アルキルチオアルキルであり；

R^2 は、 $C_1 \sim C_7$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_7$ シクロアルキルアルキル、 $C_1 \sim C_7$ ハロアルキルまたは $C_2 \sim C_7$ アルコキシアルキルであり；

それぞれの R^3 は、独立して、ハロゲン、 $C_1 \sim C_5$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_5$ シクロアルキルアルキル、 $C_1 \sim C_5$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_5$ アルコキシアルキル、 $C_1 \sim C_5$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_5$ ハロアルコキシまたは $C_1 \sim C_5$ アルキルチオであり；

n は、0、1 または 2 であり；

R^4 、 R^6 および R^7 は、独立して、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_5$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_5$ シクロアルキルアルキル、 $C_1 \sim C_5$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_5$ アルコキシアルキル、 $C_1 \sim C_5$ アルコキシまたは $C_1 \sim C_5$ アルキルチオであり；
ならびに

Py r は、F、Cl、Br または CH_3 で、場合により、置換されたピリジン環である、
除草剤の中間体化合物。

【0039】

実施形態 B 2

R^1 は、H、 $C_1 \sim C_7$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ アルケニル、 $C_3 \sim C_7$ アルキニル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルまたは $C_4 \sim C_7$ シクロアルキルアルキルであり；

R^2 は、 $C_1 \sim C_7$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_7$ シクロアルキルアルキルまたは $C_2 \sim C_7$ アルコキシアルキルであり；

X は、S であるか；または

X は、 $-C(R^6) = C(R^7)-$ であり、ここで、 R^6 と結合した炭素原子は、 R^4 と結合した炭素原子とも結合し、 R^7 と結合した炭素原子は、式 2 中のフェニル環部分とも結合し；

それぞれの R^3 は、独立して、ハロゲン、 $C_1 \sim C_5$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは $C_1 \sim C_5$ アルコキシであり； 10

R^4 、 R^6 および R^7 は、独立して、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_5$ アルキルまたは $C_1 \sim C_5$ アルコキシであり；ならびに

Py r は、F、Cl、Br または CH_3 で、場合により、置換された 2 - ピリジニル環である、

実施形態 B 1 の除草剤の中間体化合物。

【0040】

実施形態 B 3

R^1 は、H または $C_1 \sim C_7$ アルキルであり；

R^2 は、 $C_1 \sim C_7$ アルキルまたは $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルであり； 20

X は、S であり；

それぞれの R^3 は、独立して、ハロゲン、 $C_1 \sim C_5$ アルキルまたは $C_1 \sim C_5$ アルコキシであり；

R^4 は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_5$ アルキルであり；ならびに

Py r は、無置換の 2 - ピリジニル環である、

実施形態 B 2 の除草剤の中間体化合物。

【0041】

実施形態 B 4

R^1 は、H または $C_1 \sim C_7$ アルキルであり；

R^2 は、 $C_1 \sim C_7$ アルキルまたは $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルであり； 30

X は、 $-C(R^6) = C(R^7)-$ であり、ここで、 R^6 と結合した炭素原子は、 R^4 と結合した炭素原子とも結合し、 R^7 と結合した炭素原子は、式 2 中のフェニル環部分とも結合し；

それぞれの R^3 は、独立して、ハロゲン、 $C_1 \sim C_5$ アルキルまたは $C_1 \sim C_5$ アルコキシであり；

R^4 、 R^6 および R^7 は、独立して、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_5$ アルキルであり；ならびに

Py r は、無置換の 2 - ピリジニル環である、

実施形態 B 2 の除草剤の中間体化合物。

【0042】

実施形態 B 5

R^1 は、H または CH_3 であり；ならびに

R^2 は、 CH_3 または c - Pr である、

実施形態 B 1 から B 4 のいずれか 1 つの除草剤の中間体化合物。

【0043】

実施形態 B 6

R^1 は、 CH_3 であり；ならびに

R^2 は、 CH_3 である、

実施形態 B 5 の除草剤の中間体化合物。

【0044】

10

20

30

40

50

実施形態 C 1

発明の概要に記載する式 2 の除草剤の中間体化合物を製造するための方法であって、式 4 の除草剤の中間体化合物と式 3 の化合物の反応の生成物の環化が、適切な有機塩基または無機塩基の存在中で行われ、

式 4 において、

R^1 は、H、 $C_1 \sim C_7$ アルキル、 $C_3 \sim C_8$ アルコキシカルボニルアルキル、 $C_4 \sim C_7$ アルキルシクロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ アルケニル、 $C_3 \sim C_7$ アルキニル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_7$ シクロアルキルアルキル、 $C_1 \sim C_7$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_7$ アルコキシアルキルまたは $C_3 \sim C_7$ アルキルチオアルキルであり；

R^2 は、 $C_1 \sim C_7$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_7$ シクロアルキルアルキル、 $C_1 \sim C_7$ ハロアルキルまたは $C_2 \sim C_7$ アルコキシアルキルであり；

式 3 の化合物において、

それぞれの R^3 は、独立して、ハロゲン、 $C_1 \sim C_5$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_5$ シクロアルキルアルキル、 $C_1 \sim C_5$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_5$ アルコキシアルキル、 $C_1 \sim C_5$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_5$ ハロアルコキシまたは $C_1 \sim C_5$ アルキルチオであり；

n は、0、1 または 2 であり；ならびに

R^4 、 R^6 および R^7 は、独立して、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_5$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_5$ シクロアルキルアルキル、 $C_1 \sim C_5$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_5$ アルコキシアルキル、 $C_1 \sim C_5$ アルコキシまたは $C_1 \sim C_5$ アルキルチオである、

【0045】

実施形態 C 2

式 4 の除草剤の中間体化合物と式 3 の化合物の反応の生成物の環化が、適切な有機塩基の存在中で行われ、

式 4 において、

R^1 は、H または $C_1 \sim C_7$ アルキルであり；

R^2 は、 $C_1 \sim C_7$ アルキルまたは $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルであり；

式 3 の化合物において、

X は、S であるか；または

X は、 $-C(R^6)=C(R^7)-$ であり、ここで、 R^6 と結合した炭素原子は、 R^4 と結合した炭素原子とも結合し、 R^7 と結合した炭素原子は、式 3 中のフェニル環部分とも結合し；

それぞれの R^3 は、独立して、ハロゲン、 $C_1 \sim C_5$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは $C_1 \sim C_5$ アルコキシであり；ならびに

R^4 、 R^6 および R^7 は、独立して、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_5$ アルキルまたは $C_1 \sim C_5$ アルコキシである、

実施形態 C 1 の方法。

【0046】

実施形態 C 3

式 4 の除草剤の中間体化合物と式 3 の化合物の反応の生成物の環化が、トリメチルアミン、トリエチルアミンおよびトリブチルアミンから選択される適切な塩基の存在中で行われ、

式 4 の化合物において、

R^1 は、H または $C_1 \sim C_7$ アルキルであり；

R^2 は、 $C_1 \sim C_7$ アルキルまたは $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルであり；

式 3 の化合物において、

X は、S であり；

それぞれの R^3 は、独立して、ハロゲン、 $C_1 \sim C_5$ アルキルまたは $C_1 \sim C_5$ アルコキシであり；ならびに

10

20

30

40

50

R^4 は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_5$ アルキルである、
実施形態 C 2 の方法。

【 0 0 4 7 】

実施形態 C 4

式 4 の除草剤の中間体化合物と式 3 の化合物の反応の生成物の環化が、トリメチルアミン、トリエチルアミンおよびトリブチルアミンから選択される適切な塩基の存在中で行われ、

式 4 の化合物において、

R^1 は、H または $C_1 \sim C_7$ アルキルであり；

R^2 は、 $C_1 \sim C_7$ アルキルまたは $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルであり；

10

式 3 の化合物において、

X は、 $-C(R^6) = C(R^7)-$ であり、ここで、 R^6 と結合した炭素原子は、 R^4 と結合した炭素原子とも結合し、 R^7 と結合した炭素原子は、式 3 中のフェニル環部分とも結合し；

それぞれの R^3 は、独立して、ハロゲン、 $C_1 \sim C_5$ アルキルまたは $C_1 \sim C_5$ アルコキシであり；ならびに

R^4 、 R^6 および R^7 は、独立して、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_5$ アルキルである、
実施形態 C 2 の方法。

【 0 0 4 8 】

実施形態 C 5

20

R^1 は、H または CH_3 であり；ならびに

R^2 は、 CH_3 または $c-Pr$ である、

実施形態 C 1 から C 4 のいずれか 1 つの方法。

【 0 0 4 9 】

実施形態 C 6

R^1 は、 CH_3 であり；ならびに

R^2 は、 CH_3 である、

実施形態 C 5 の方法。

【 0 0 5 0 】

実施形態 C 7

30

式 2 の化合物を使用して、実施形態 A 1 から A 10 のいずれか 1 つの方法によって製造された式 1 の化合物であって、実施形態 C 1 から C 6 のいずれか 1 つの方法によって式 2 の化合物を製造することを特徴とする、化合物。

【 0 0 5 1 】

実施形態 C 8

実施形態 C 1 から C 6 のいずれか 1 つの方法によって製造された式 2 の化合物。

【 0 0 5 2 】

実施形態 C 9

「式 4 の除草剤の中間体化合物と式 3 の化合物の反応の生成物の環化」という語句が、「式 4 の除草剤の中間体化合物と式 3 の化合物の環化」と置き換えられる、実施形態 C 1 から C 8 のいずれか 1 つの方法。

40

【 0 0 5 3 】

実施形態 D 1

R^1 は、H、 $C_1 \sim C_7$ アルキル、 $C_3 \sim C_8$ アルコキシカルボニルアルキル、 $C_4 \sim C_7$ アルキルシクロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ アルケニル、 $C_3 \sim C_7$ アルキニル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_7$ シクロアルキルアルキル、 $C_1 \sim C_7$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_7$ アルコキシアルキルまたは $C_3 \sim C_7$ アルキルチオアルキルであり；

R^2 は、 $C_1 \sim C_7$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_7$ シクロアルキルアルキル、 $C_1 \sim C_7$ ハロアルキルまたは $C_2 \sim C_7$ アルコキシアルキルであり；ならびに

50

Pyr は、F、Cl、Br または CH₃ で、場合により、置換されたピリジン環である、
式 4 の除草剤の中間体化合物。

【0054】

実施形態 D 2

R¹ は、H、C₁ ~ C₇ アルキル、C₃ ~ C₇ アルケニル、C₃ ~ C₇ アルキニル、C₃ ~ C₇ シクロアルキルまたは C₄ ~ C₇ シクロアルキルアルキルであり；

R² は、C₁ ~ C₇ アルキル、C₃ ~ C₇ シクロアルキル、C₄ ~ C₇ シクロアルキルアルキルまたは C₂ ~ C₇ アルコキシアルキルであり；ならびに

Pyr は、F、Cl、Br または CH₃ で、場合により、置換された 2 - ピリジニル環である、

10

実施形態 D 1 の除草剤の中間体化合物。

【0055】

実施形態 D 3

R¹ は、H または C₁ ~ C₇ アルキルであり；

R² は、C₁ ~ C₇ アルキルまたは C₃ ~ C₇ シクロアルキルであり；ならびに

Pyr は、無置換の 2 - ピリジニル環である、

実施形態 D 2 の除草剤の中間体化合物。

【0056】

実施形態 D 4

R¹ は、H または CH₃ であり；ならびに

R² は、CH₃ または c - Pr である、

実施形態 D 1 から D 3 のいずれか 1 つの除草剤の中間体化合物。

20

【0057】

実施形態 D 5

R¹ は、CH₃ であり；ならびに

R² は、CH₃ である、

実施形態 D 4 の除草剤の中間体化合物。

【0058】

実施形態 E 1

発明の概要に記載する式 4 の除草剤の中間体化合物を製造するための方法であって、
式 5 の化合物において、

R² は、C₁ ~ C₇ アルキル、C₃ ~ C₇ シクロアルキル、C₄ ~ C₇ シクロアルキルアルキル、C₁ ~ C₇ ハロアルキルまたは C₂ ~ C₇ アルコキシアルキルであり；

式 6 の化合物において、

R¹ は、H、C₁ ~ C₇ アルキル、C₃ ~ C₈ アルコキシカルボニルアルキル、C₄ ~ C₇ アルキルシクロアルキル、C₃ ~ C₇ アルケニル、C₃ ~ C₇ アルキニル、C₃ ~ C₇ シクロアルキル、C₄ ~ C₇ シクロアルキルアルキル、C₁ ~ C₇ ハロアルキル、C₂ ~ C₇ アルコキシアルキルまたは C₃ ~ C₇ アルキルチオアルキルである、

方法。

40

【0059】

実施形態 E 2

式 5 の化合物において、

R² は、C₁ ~ C₇ アルキルまたは C₃ ~ C₇ シクロアルキルであり；

式 6 の化合物において、

R¹ は、H または C₁ ~ C₇ アルキルである、

実施形態 E 1 の方法。

【0060】

実施形態 E 3

式 5 の化合物において、

50

R^2 は、 CH_3 または $c-Pr$ であり；

式 6 の化合物において、

R^1 は、 H または CH_3 である、

実施形態 E 3 の方法。

【0061】

実施形態 E 4

式 5 の化合物において、

R^2 は、 CH_3 であり；

式 6 の化合物において、

R^1 は、 CH_3 である、

実施形態 E 3 の方法。

【0062】

実施形態 E 5

式 4 の化合物を使用して、実施形態 C 2 から C 4 のいずれか 1 つの方法によって製造された式 2 の化合物であって、実施形態 E 1 から E 4 のいずれか 1 つの方法によって式 4 の化合物を製造することを特徴とする、化合物。

【0063】

実施形態 E 6

実施形態 E 1 から E 4 のいずれか 1 つの方法によって製造された式 4 の化合物。

【0064】

上記の実施形態 A 1 から A 11、B 1 から B 6、C 1 から C 9、D 1 から D 5 および E 1 から E 6 を含む、本発明の実施形態、ならびに本明細書に記載する任意の他の実施形態は、任意の様式で組み合わせることができ、実施形態における可変要素の説明は、式 1 の化合物だけでなく、式 1 の化合物を製造するために有用な、式 2、4、5 および 6 の出発の中間体化合物にも関連する。加えて、上記の実施形態 A 1 から A 11、B 1 から B 6、C 1 から C 9、D 1 から D 5 および E 1 から E 6 を含む、本発明の実施形態、ならびに本明細書に記載する任意の他の実施形態、ならびにこれらの任意の組み合わせは、本発明の化合物および方法に関連する。

【0065】

式 1 の化合物は、合成有機化学の分野において公知の一般的な方法によって製造することができる。芳香族および非芳香族の複素環および環系の製造を可能にする、幅広い種類の合成方法が、本分野において、公知であり；広範な概説については、全 8 巻の *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*、A. R. Katritzky および C. W. Rees editors-in-chief、Pergamon Press、Oxford、1984 年、ならびに、全 12 巻の *Comprehensive Heterocyclic Chemistry II*、A. R. Katritzky、C. W. Rees および E. F. V. Scriven editors-in-chief、Pergamon Press、Oxford、1996 年を参照のこと。

【0066】

式 1 のヒドロキシピリダジノン、スキーム 1 に示すように、塩基性水性条件下、式 2 のピリジニルスルホニルピリダジノンの加水分解（すなわち、「加水分解」、または代替として「脱保護」）によって作ることができる。適切な塩基（「加水分解の塩基」または代替として「脱保護の塩基」）の例としては、限定されないが、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、他のアルカリまたはアルカリ金属の水酸化物、およびアルカリまたはアルカリ金属の炭酸塩が挙げられる。この反応のための有用な共溶媒は、限定されないが、メタノール、エタノール、イソプロパノール、アセトン、アセトニトリル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメチルスルホキシド、N, N - ジメチルホルムアミドまたは N - メチルピロリジノン（またはこれらの混合物）が挙げられる。加水分解反応は、通常、約 0 ~ 120 の範囲の温度で実施される。溶媒、塩基、温度および添加時間の効果は、すべて

10

20

30

40

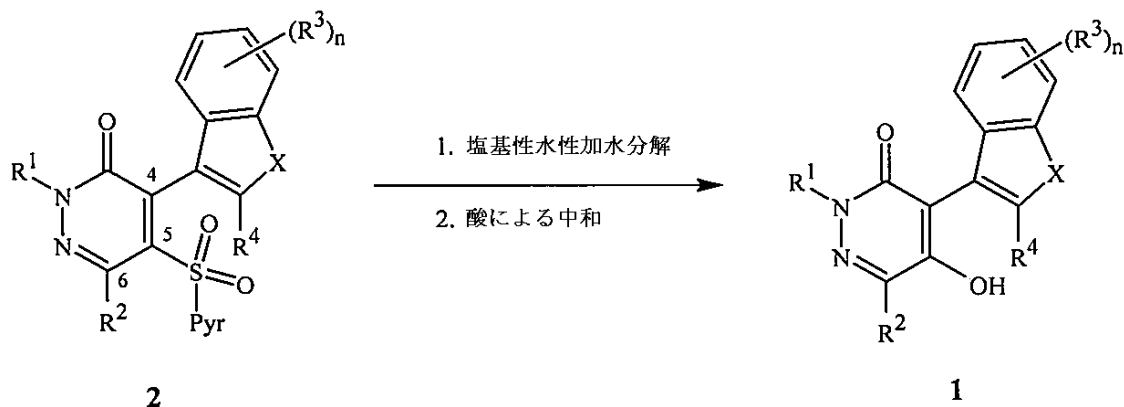
50

互いに依存し、反応条件の選択は、副生成物の形成を最小化するために重要である。塩基が媒介するピリジニルスルホニル基の加水分解は、得られた式 1 のヒドロキシピリダジノンのイオン化形態を含む水性混合物をもたらす。適切な酸、例えば、塩酸、硫酸または酢酸による酸性化は、遊離のヒドロキシピリダジノン 1 をもたらし、これは、沈殿、抽出、結晶化または蒸留方法を含む、当業者に公知の方法によって、単離することができる。場合によっては、クロマトグラフィーによる精製が必要である。

【 0 0 6 7 】

【 化 8 】

スキーム 1



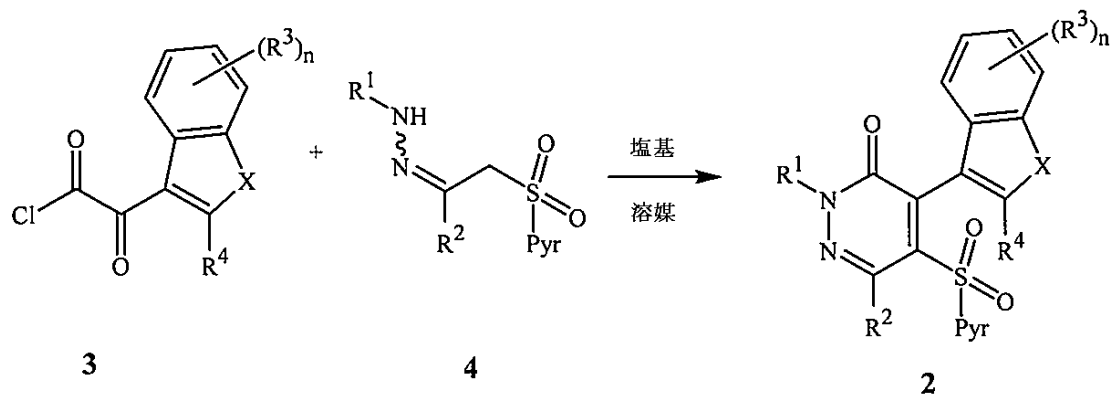
【 0 0 6 8 】

式 2 のピリジニルスルホニルピリダジノンは、スキーム 2 に示すように、適切な塩基および溶媒の存在中、式 3 の置換アリールまたはヘテロアリールオキサリルクロリドと、式 4 のピリジニルスルホニルメチルヒドラゾンの環化によって製造することができる。好ましい塩基（すなわち「環化の塩基」）は、限定されないが、トリアルキルアミン（例えば、トリエチルアミンまたは H u n i g s 塩基）、1, 8 - ジアザビシクロ [5 . 4 . 0] ウンデカ - 7 - エン (D B U) などのアミジン塩基、ピリジンまたは金属炭酸塩が挙げられる。この環化反応のための溶媒は、非プロトン性またはプロトン性であり、限定されないが、メタノール、エタノール、イソプロパノール、ジメトキシエタン、アセトン、アセトニトリル、ジオキサン、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメチルスルホキシド、N, N - ジメチルホルムアミドまたは N - メチルピロリジノン（またはこれらの混合物）が挙げられる。環化反応は、典型的には、0 ~ 溶媒の還流温度の温度範囲の下、行うことができる。環化反応は、無水条件下、または S c h o t t e n - B a u m a n n 条件下で水性混合物として、行うことができる。

【 0 0 6 9 】

【化 9】

スキーム 2



10

【0070】

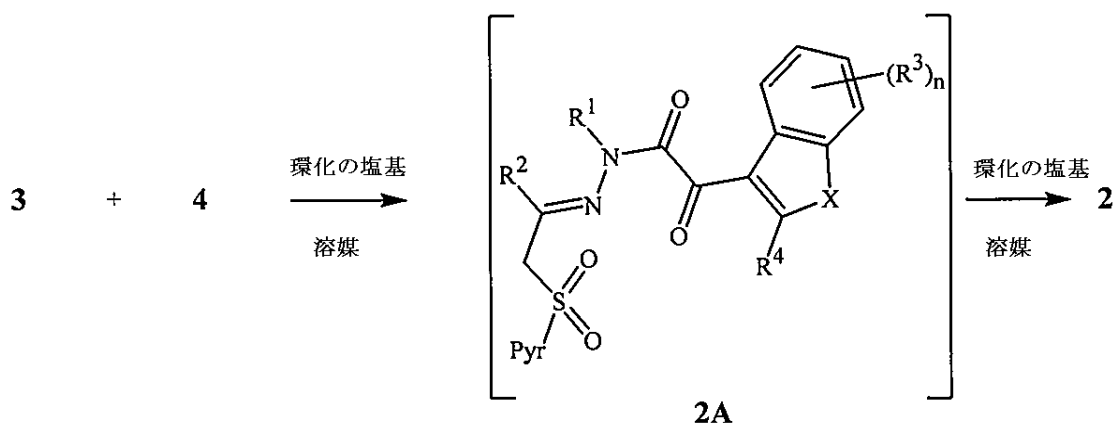
式 2 の除草剤の中間体化合物（ピリジニルスルホニルピリダジノン）は、式 4 の（ピリジニルスルホニルメチルヒドラゾン）除草剤の中間体化合物と式 3 の（置換アリールまたはヘテロアリールオキサリルクロリド）化合物の反応の生成物を環化することによって製造することができる。本明細書で使用する場合、「反応の生成物」という語句は、式 2 A のケト - アミド化合物を指す。式 2 A の化合物は、中間体として単離することができるが、通常、式 4 の化合物と式 3 の化合物を反応させるために使用される同じ環化の塩基の存在中、インサイチュで環化する。スキーム 2 A に示すように、式 2 A のケト - アミド化合物は、適切な塩基および溶媒の存在中、環化する。式 2 A の化合物の環化のための好ましい塩基は、通常、スキーム 2 について上記に定義した「環化の塩基」と同様であるが、水素化ナトリウム、ナトリウムアルコキシドまたは他の金属アルコキシドも挙げられる。適切な「環化の塩基」としては、メチルアミン、ジエチルアミン、N, N - ジイソプロピルエチルアミンなどのモノ、ジまたはトリアルキルアミン塩基も挙げられる。

20

【0071】

【化 10】

スキーム 2A



30

40

【0072】

式 4 のヒドラゾンは、スキーム 3 に示すように、式 6 の置換ヒドラジン（すなわち、 $\text{R}^1 \text{NHNH}_2$ ）と、式 5 のピリジニルスルホニルケトン化合物の反応によって、合成的に入手可能である。この反応のための適切な溶媒としては、メタノール、エタノール、イソプロパノール、ジメトキシエタン、アセトン、アセトニトリル、ジオキサン、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメチルスルホキシド、N, N - ジメチルホルムアミドま

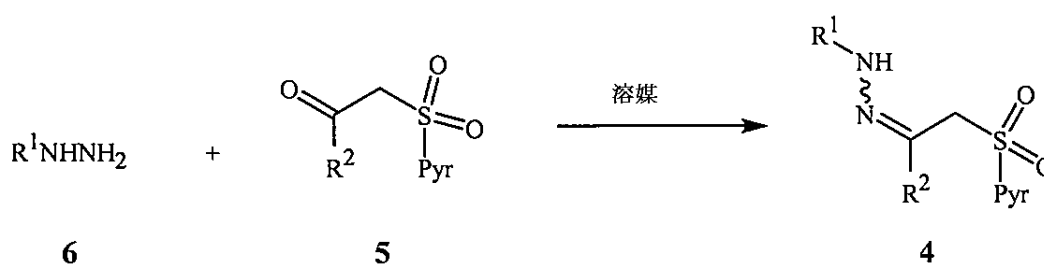
50

たはN - メチルピロリジノン（またはこれらの混合物）が挙げられる。場合によっては、当量またはそれ以上の塩基を反応混合物に添加して、インサイチュでヒドラジンの遊離塩基に変換することを可能にする、ヒドラジンの塩（すなわち、塩酸塩または硫酸塩）を、使用することができる。遊離のヒドラジンを製造するために使用される有効な塩基の例としては、金属酢酸塩（すなわち、酢酸カリウムまたは酢酸ナトリウム）、金属炭酸塩または重炭酸塩（すなわち、炭酸カリウム）およびピリジンが挙げられる。この反応の温度は、典型的には、0 ~ 室温の範囲である。式4のいくつかのヒドラゾンは、次の工程で、混合物として使用することができる幾何異性体として単離されるか、または続く環化において、いずれかを使用することができる、synおよびanti異性体に（結晶化またはクロマトグラフィーによって）分離される。

【0073】

【化11】

スキーム3



【0074】

式5のピリジニルスルホニルケトン、文献（Tetrahedron 2010年、66巻（48号）、9445～9449頁；Asian Journal of Organic Chemistry、2014年、3巻（7号）、766～768頁および国際公開第WO2009106817号パンフレット）に以前に報告された方法によって作ることができる。通常、式Pyr-SHのピリジニルメルカプタン（これは、部分的に、またはもっぱら、チオピリドン互変異性体として、存在することができる）は、式XCH₂COR²（式中、Xは、ハロゲンである）のα-ハロケトンと、炭酸カリウム、水酸化カリウム、水酸化ナトリウムまたはピリジンなどの塩基の存在中、適切な溶媒において、好ましくは、アセトン、アセトニトリル、エタノール、ジメチルスルホキシド、N、N - ジメチルホルムアミドまたはN - メチルピロリジノン（またはこれらの混合物）中、0 ~ 100 °Cの範囲の温度で、反応させる。

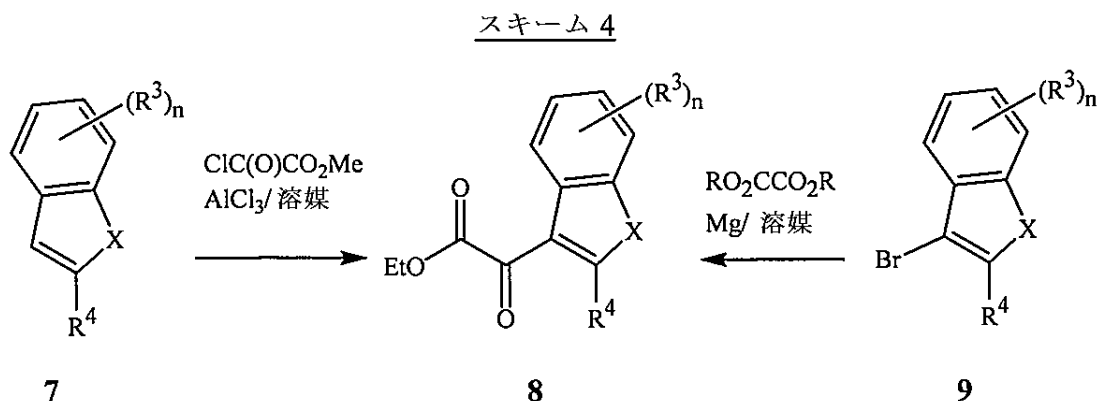
【0075】

場合によっては、式3の置換アリールまたはヘテロアリールオキサリルクロリドは、三塩化アルミニウムなどのルイス酸の存在中、塩素化溶媒（すなわち、ジクロロメタン）において、トルエンまたはキシレン中、0 ~ 溶媒の還流温度の範囲の温度で、適切な式7の置換アリールまたはヘテロアリール化合物と、エチルまたはメチルオキサリルクロリドのフリーデル - クラフツアシル化によって作ることができる。得られた式8のオキサレート化合物は、次いで、遊離酸または遊離酸のナトリウム塩に加水分解することができる。次いで、得られた遊離酸は、トルエン、ジクロロメタンまたはジクロロエタンなどの溶媒中、オキサリルクロリドまたはスルホニルクロリドと反応させることによって、対応する式3の酸塩化物に変換することができる。アリールオキサリルクロリドの製造についてのいくつかの文献参照としては、国際公開第WO2015035051号パンフレット；Tetrahedron 2015年、71巻（35号）、5776～5780頁；J. A. C. S. 2015年、137巻（14号）、4626～4629頁および国際公開第2012033225号パンフレットが挙げられる。あるいは、式8のオキサレートは、テトラヒドロフランなどの溶媒中、マグネシウムとの反応によるグリニャール試薬の最初

の形成、続くエチルまたはメチルオキサレート (CO_2Et_2 または CO_2Me_2) の添加によって、式 9 の置換プロモアリールおよびプロモヘテロアリールから作ることができる (国際公開第 WO 2012033225 号パンフレットおよび Chem. Comm. 2014 年、50 巻 (100 号)、15987~15990 頁を参照のこと)。

【0076】

【化12】



10

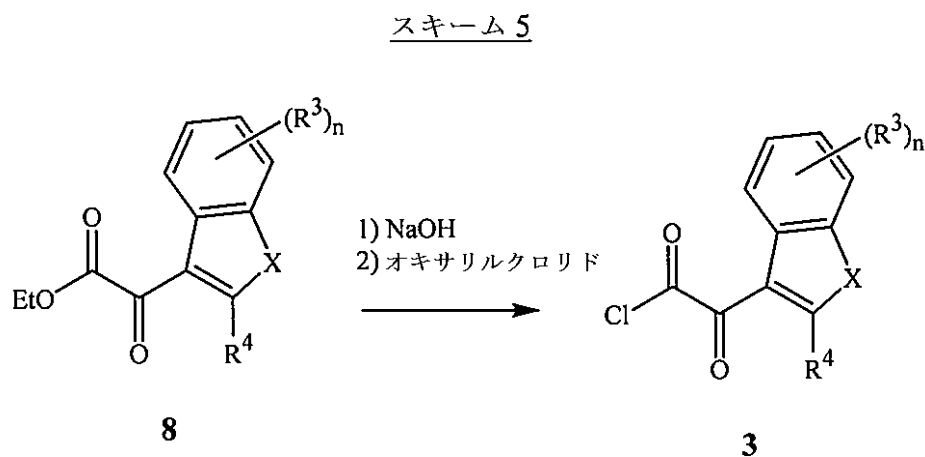
【0077】

式 3 の化合物は、スキーム 5 に示すように、式 8 のアシルクロリドを得るために、カルボン酸へのエステルの加水分解、続くオキサリルクロリドでの処理によって製造することができる。式 8 の化合物は、市販品を入手でき、または本分野において公知の方法によって製造することができる。

20

【0078】

【化13】



30

【0079】

記載した方法を使用して、式 1、2 および 4 の化合物を製造するための上記に記載したいくつかの試薬および反応条件は、中間体中に存在する特定の官能基には適合しない場合があることが認識されている。これらの事例では、保護/脱保護手順または官能基の相互変換を合成に組み込むことが、所望の生成物を得る助けとなるだろう。保護基の使用および選択は化学合成の当業者には明らかであろう (例えば、Greene, T. W.; Wuts, P. G. M. Protective Groups in Organic Synthesis、第 2 版; Wiley: New York、1991 年を参照のこと)。当業者は、場合によっては、任意の個々のスキームにおいて示されているような所与の試薬の導入後、式 1、2 および 4 の化合物の合成を完了させるために、詳細には説明されていない、追加の日常的な合成工程を実施する必要がある場合があることを認識するだろう。当業者は、上記のスキームに例示されている工程の組み合わせを、式 1、2 および

40

50

4の化合物を製造するための具体的な記載によって暗示される順番以外の順番で、実施する必要がある場合があることも認識するだろう。当業者は、式1、2および4の化合物ならびに本明細書に記載する中間体を、置換基を追加または存在する置換基を修飾するために、様々な求電子反応、求核反応、ラジカル反応、有機金属反応、酸化反応および還元反応に付すことができることも認識するだろう。

【0080】

以下の非限定的な実施例は、式1、2および4の化合物を製造するため、ならびに式2および4の中間体を製造するための本方法の例示であることを意味する。すべてのNMRスペクトルは、特に指示がない限り、CDCl₃中、500MHzで、テトラメチルシランより低磁場側に報告される。

【0081】

合成例1

4-(4-フルオロ-1-ナフタレニル)-5-ヒドロキシ-2,6-ジメチル-3(2H)-ピリダジノンの製造

【0082】

工程A: 1-(2-ピリジニルスルホニル)-2-プロパノンの製造

1-(2-ピリジニルチオ)-2-プロパノン(例えば、Bradsher, C. K. および Lohr, D. F., J. Het. Chem. 1966年、3巻、27~32頁)(9.26g、55.44mmol)を、水(150mL)、テトラヒドロフラン(150mL)およびメタノール(150mL)の溶媒混合物に溶解し、Oxone(登録商標)(モノ過硫酸カリウム)(66g、292mmol)を、添加した。2相の反応混合物を、室温で24時間撹拌した。反応混合物を、1/3容積まで濃縮し、酢酸エチル(3x50mL)で抽出した。有機層を、水(2x20mL)およびブライン(30mL)で洗浄した。有機層を、集め、MgSO₄で乾燥し、減圧下濃縮して、表題化合物を、褐色油状物(8.00g)として得た。

¹H NMR 8.75 (m, 1H), 8.12 (m, 1H), 8.00 (t, 1H), 7.64 (m, 1H), 4.48 (s, 2H), 2.41 (s, 3H).

【0083】

工程B: 1-(2-ピリジニルスルホニル)-2-プロパノン2-メチルヒドラゾン(化合物3)の製造

1-(2-ピリジニルスルホニル)-2-プロパノンの化合物(すなわち、合成例1、工程Aの生成物)(8.00g、44.00mmol)のクロロホルム(30mL)溶液に、硫酸マグネシウム(8.00g、66.46mmol)を添加した。混合物を、室温で撹拌し、メチルヒドラジン(2.62mL、50.00mmol)を、5分で滴下添加した。反応混合物を、室温で3時間撹拌した。反応混合物を、Celite(登録商標)珪藻土ろ過助剤を通してろ過し、クロロホルム(30mL)で洗浄した。ろ液を、減圧下濃縮して、表題化合物を、粘性の褐色油状物(9.00g)として得た。

¹H NMR 8.82 (m, 1H), 8.00 (m, 1H), 7.92 (t, 1H), 7.62 (m, 1H), 4.82 (bs, 1H), 4.22 (s, 2H), 2.78 (s, 3H), 1.89 (d, 3H). 28%の第2の異性体の存在が、NMRによって明らかになった。

【0084】

工程C: 4-フルオロ-1-オキソ-1-ナフタレン酢酸エチルエステルの製造

塩化アルミニウム(30.2g、226mmol)のジクロロメタン(200mL)懸濁液を、0℃に冷却した。懸濁液を、撹拌し、1-フルオロナフタレン(25.1g、172mmol)およびクロロオキソ酢酸エチル(25.2g、184mmol)を含有するジクロロメタン(150mL)の溶液を、30分かけて滴下添加した(わずかに発熱、反応混合物の最高温度は約7℃であった)。混合物を、15分撹拌し、室温で4時間撹拌した。反応混合物を、氷水(300mL)および1N塩酸水溶液(50mL)の溶液に、ゆっくりと添加した。二相の混合物を、30分間撹拌し、有機層を、分離した。有機層を、水(2x25mL)およびブライン(30mL)で洗浄し、乾燥し(MgSO₄)、減

10

20

30

40

50

圧下濃縮して、黄色油状物（42 g）を得た。この物質を、ヘキサン（150 mL）で希釈し、攪拌した。形成した得られた沈殿物を、ろ過によって集め、ヘキサン（15 mL）で洗浄し、乾燥して、表題化合物を、オフホワイト固体（34 g）として得た。

$^1\text{H NMR}$ 9.21 (m, 1H), 8.21 (m, 1H), 8.00 (m, 1H), 7.77 (m, 1H), 7.63 (m, 1H) 7.34 (m, 1H), 4.52 (q, 2H), 1.50 (t, 3H).

【0085】

工程D：4 - フルオロ - - オキソ - 1 - ナフタレン酢酸の製造

4 - フルオロ - - オキソ - 1 - ナフタレン酢酸エチルエステル（すなわち、合成例1、工程Cの生成物）（21 g、85 mmol）を、テトラヒドロフラン（35 mL）に溶解し、1 N 水酸化ナトリウム水溶液（112 mL、101 mmol）を添加し、反応混合物を、2時間攪拌した。固体が、反応混合物から沈殿した。混合物を、水（100 mL）で希釈した。1 N 塩酸水溶液を、反応混合物のpHが3になるまで、添加した。得られた固体を、ろ過によって集め、水（2 × 20 mL）、ヘキサン（1 × 20 mL）で洗浄し、真空下乾燥して、表題化合物を、白色固体（15 g）として得た。

$^1\text{H NMR}$ 9.21 (m, 1H), 8.21 (m, 1H), 8.00 (m, 1H), 7.77 (m, 1H), 7.63 (m, 1H), 7.34 (m, 1H).

【0086】

工程E：4 - フルオロ - - オキソ - 1 - ナフタレンアセチルククロリドの製造

4 - フルオロ - - オキソ - 1 - ナフタレン酢酸（すなわち、合成例1、工程Dの生成物）（2.18 g、10 mmol）を、ジクロロメタン（20 mL）に懸濁させ、オキサリルククロリド（3.81 g、30 mmol）を、一度に添加し、続いて、3滴のN, N - ジメチルホルムアミドを添加し、反応混合物を、室温で、3時間攪拌した。反応混合物を、減圧下濃縮して、表題化合物を、黄色固体（2.4 g）として得た。

$^1\text{H NMR}$ 9.21 (m, 1H), 8.21 (m, 1H), 8.10 (m, 1H), 7.80 (m, 1H), 7.77 (m, 1H), 7.34 (m, 1H).

【0087】

工程F：4 - (4 - フルオロ - 1 - ナフタレニル) - 2, 6 - ジメチル - 5 - (2 - ピリジニルスルホニル) - 3 (2H) - ピリダジノン（化合物1）の製造

1 - (2 - ピリジニルスルホニル) - 2 - プロパノン 2 - メチルヒドラゾン（すなわち、合成例1、工程Bで得られた生成物）（2.5 g、11 mmol）を、ジクロロメタン（20 mL）に溶解し、トリエチルアミン（2.6 g、26 mmol）を、添加した。反応混合物を、氷水で5 に冷却し、4 - フルオロ - - オキソ - 1 - ナフタレンアセチルククロリド（すなわち、合成例1、工程Eで得られた生成物）のジクロロメタン（2.4 g、10 mmol）懸濁液を、5分間で添加した。反応混合物を、室温で、さらに18時間攪拌した。反応混合物を、水（50 mL）で希釈し、ジクロロメタン（3 × 30 mL）で抽出した。有機層を、水（2 × 20 mL）およびブライン（20 mL）で、さらに洗浄し、乾燥した（MgSO₄）。有機層を、ろ過し、減圧下濃縮して、固体生成物を得た。固体生成物を、ジクロロメタン：ジエチルエーテル（2：8）（30 mL）に懸濁させ、得られた固体を集め、真空下乾燥して、表題化合物を、淡黄色固体（2.2 g）として得た。

$^1\text{H NMR}$ 8.21 (m, 1H), 7.91 (m, 1H), 7.42 (m, 1H), 7.30 (m, 1H), 7.23 (m, 2H), 7.12 (m, 3H), 6.8 (m, 1H), 3.84 (s, 3H), 2.88 (s, 3H).

【0088】

工程G：4 - (4 - フルオロ - 1 - ナフタレニル) - 5 - ヒドロキシ - 2, 6 - ジメチル - 3 (2H) - ピリダジノンの製造

4 - (4 - フルオロ - 1 - ナフタレニル) - 2, 6 - ジメチル - 5 - (2 - ピリジニルスルホニル) - 3 (2H) - ピリダジノン（すなわち、合成例1、工程Fで得られた生成物）（0.41 g、1 mmol）を、1, 4 - ジオキサン（5 mL）に溶解し、水酸化ナトリウム（0.100 g、2.5 mmol）を添加し、続いて水（0.5 mL）を添加し、反応混合物を、90 で1時間加熱した。反応混合物を、減圧下濃縮し、残留固体を、

水 (5 m L) に懸濁させた。混合物を、 1 N 塩酸水溶液を添加することによって、p H 3 に酸性化した。得られた固体を、室温で 1 5 分攪拌し、ろ過によって集め、水 (2 × 5 m L)、ヘキサン (2 × 5 m L) で洗浄し、真空下乾燥して、表題化合物を、オフホワイト固体 (0 . 2 6 5 g) として得た。

¹H NMR (dms_o-d₆) 10.21 (bs, 1H), 8.15 (d, 1H), 7.70 (m, 1H), 7.55 (m, 2H), 7.40 (m, 1H), 7.30 (m, 1H).

【 0 0 8 9 】

合成例 2

4 - (2 , 5 - ジメチルベンゾ [b] チエン - 3 - イル) - 5 - ヒドロキシ - 2 , 6 - ジメチル - 3 (2 H) - ピリダジノンの製造

10

【 0 0 9 0 】

工程 A : 1 - [(2 - クロロ - 2 - プロペン - 1 - イル) チオ] - 4 - メチル - ベンゼンの製造

2 , 3 - ジクロロ - 1 - プロペン (2 0 . 5 g、1 8 5 m m o l) を、4 - メチルベンゼンチオール (2 2 . 0 g、1 7 7 m m o l) のアセトン (1 5 0 m L) 溶液に添加した。混合物を、1 2 に冷却し、炭酸カリウム (2 6 g、1 8 8 m m o l) の水 (7 5 m L) 溶液を、1 5 分かけて滴下添加した。反応混合物を、2 0 で 1 8 時間攪拌した。混合物を、水 (4 0 0 m L) およびヘキサン (5 0 0 m L) で希釈した。混合物を、抽出し、有機層を、集めた。有機層を、水 (2 × 5 0 m L) およびブライン (5 0 m L) で洗浄し、減圧下濃縮して、表題化合物を、透明なオレンジ色油状物 (3 4 . 7 g) として得た。

20

¹H NMR 7.29 (m, 2H), 7.24 (m, 2H), 5.23 (m, 2H), 3.66 (m, 2H), 2.32 (s, 3H).

【 0 0 9 1 】

工程 B : 2 , 5 - ジメチル - ベンゾ [b] チオフェンの製造

1 - [(2 - クロロ - 2 - プロペン - 1 - イル) チオ] - 4 - メチル - ベンゼン (すなわち、合成例 2、工程 A の化合物) (3 4 . 7 g、1 7 5 m m o l) を、N , N - ジメチルアニリン (2 0 0 m L、9 4 7 m m o l) に添加し、得られた混合物に、1 0 分間、窒素を流した。反応混合物を、1 9 5 まで 2 4 時間ゆっくりと加熱した。反応混合物を、減圧下濃縮して、N , N - ジメチルアニリンを除去した。残留物を、ヘキサン (5 0 0 m L) で希釈し、ろ過して、すべての不溶固体を除去した。ろ液を、1 N 塩酸水溶液 (2 × 5 0 m L)、水 (2 × 5 0 m L) で洗浄し、有機層を集めた。有機層を、減圧下濃縮して、琥珀色油状物 (2 0 . 9 5 g) を得た。この物質を、ヘキサンで溶出する、シリカゲルカラムクロマトグラフィーによってさらに精製して、表題化合物を、結晶性の黄色固体 (1 7 g) として得た。

30

¹H NMR 7.79 (d, 1H), 7.41 (s, 1H), 7.23 (d, 1H), 6.80 (d, 1H), 2.57 (s, 3H), 2.43 (s, 3H).

【 0 0 9 2 】

工程 C : エチル 2 , 5 - ジメチル - オキシベンゾ [b] チオフェン - 3 - アセテートの製造

窒素雰囲気下、2 , 5 - ジメチル - ベンゾ [b] チオフェン (すなわち、合成例 2、工程 B の化合物) (2 3 g、1 4 0 m m o l) を、ジクロロメタン (2 8 0 m L) に溶解し、0 に冷却し、クロロオキシ酢酸エチル (1 8 m L、1 6 0 m m o l) を、2 分かけて添加した。反応混合物を、攪拌し、塩化アルミニウム (2 4 g、1 8 0 m m o l) を、1 時間かけて、小分けにして、添加した。反応混合物を、周囲温度で 1 8 時間攪拌した。反応混合物を、氷水 (3 0 0 m L) および 1 N 塩酸 (5 0 m L) の混合物上に注いだ。混合物を、1 時間攪拌し、有機層を、分離した。有機層を、水 (2 × 2 0 m L) およびブライン (2 0 m L) で洗浄した。有機層を、M g S O₄ で乾燥し、減圧下濃縮して、表題化合物を、琥珀色油状物 (3 7 . 6 g) として得た。

40

¹H NMR 8.20 (s, 1H), 7.64 (d, 1H), 7.23 (d, 1H), 4.45 (q, 2H), 2.73 (s, 3H), 2.47 (s, 3H), 1.43 (t, 3H).

【 0 0 9 3 】

50

工程 D : 2, 5 - ジメチル - - オキシベンゾ [b] チオフェン - 3 - 酢酸の製造

エチル 2, 5 - ジメチル - - オキシベンゾ [b] チオフェン - 3 - アセテート (すなわち、合成例 2、工程 C で得られた生成物) (30.25 g、115 mmol) を、テトラヒドロフランに溶解し、1 N 水酸化ナトリウム水 (150 mL、150 mmol) を添加した。反応混合物を、68 °C で 2 時間加熱した。反応混合物を、室温に戻し、減圧下濃縮して、固体残留物を得た。固体残留物を、水 (100 mL) で希釈し、6 N 塩酸で pH 3 に酸性化し、ジクロロメタン (3 × 50 mL) で抽出した。有機層を、集め、水 (2 × 20 mL)、ブライン (20 mL) で洗浄し、MgSO₄ で乾燥し、ろ過した。ろ液を、減圧下濃縮して、表題化合物を、淡黄色固体 (26 g) として得た。

¹H NMR 10.4 (bs, 1H), 8.12 (s, 1H), 7.65 (d, 1H), 7.21 (d, 1H), 2.79 (s, 3H), 2.47 (s, 3H).

【0094】

工程 E : 2, 5 - ジメチル - - オキシベンゾ [b] チオフェン - 3 - アセチルクロリドの製造

2, 5 - ジメチル - - オキシベンゾ [b] チオフェン - 3 - 酢酸 (すなわち、合成例 2、工程 D で得られた生成物) (12.55 g、および 53.6 mmol) を、ジクロロメタン (50 mL) に溶解し、3 滴の N, N - ジメチルホルムアミドを添加した。混合物を、室温で攪拌し、オキサリルクロリド (13.6 mL、160 mmol) を、滴下添加した。反応混合物を、室温で 2 時間攪拌した。混合物を、減圧下濃縮して、表題化合物を、淡黄色固体 (13.56 g) として得た。

¹H NMR 8.15 (s, 1H), 7.70 (d, 1H), 7.31 (d, 1H), 2.81 (s, 3H), 2.50 (s, 3H).

【0095】

工程 F : 4 - (2, 5 - ジメチルベンゾ [b] チエン - 3 - イル) - 2, 6 - ジメチル - 5 - (2 - ピリジニルスルホニル) - 3 (2H) - ピリダジノン (化合物 2) の製造

1 - (2 - ピリジニルスルホニル) - 2 - プロパノン 2 - メチルヒドラゾン (すなわち、合成例 1、工程 B で得られた化合物) (2.5 g、11 mmol) を、ジクロロメタン (20 mL) に溶解し、トリエチルアミン (2.6 g、26 mmol) を、添加した。反応混合物を、氷水で 5 °C に冷却し、2, 5 - ジメチル - - オキシベンゾ [b] チオフェン - 3 - アセチルクロリド (すなわち、合成例 3、工程 E で得られた生成物) (2.53 g、10 mmol) の懸濁液を、5 分間で添加した。反応混合物を、室温にあたため、室温で、さらに 18 時間攪拌した。反応混合物を、水 (50 mL) で希釈し、ジクロロメタン (3 × 30 mL) で抽出した。有機層を、水 (2 × 20 mL) およびブライン (20 mL) で、さらに洗浄し、MgSO₄ で乾燥した。有機層を、ろ過し、減圧下濃縮して、固体を得た。固体を、ヘキサン中の酢酸エチルの勾配で溶出する、シリカゲルカラムクロマトグラフィーによってさらに精製して、表題化合物を、淡黄色固体 (3.25 g) として得た。

¹H NMR 8.25 (s, 1H), 7.40 (d, 1H), 7.31 (m, 2H), 6.91 (m, 1H), 6.81 (m, 1H), 6.63 (m, 1H), 3.83 (s, 3H), 2.91 (s, 3H), 2.35 (s, 3H), 2.27 (s, 3H).

【0096】

工程 G : 4 - (2, 5 - ジメチルベンゾ [b] チエン - 3 - イル) - 5 - ヒドロキシ - 2, 6 - ジメチル - 3 (2H) - ピリダジノンの製造

4 - (2, 5 - ジメチルベンゾ [b] チエン - 3 - イル) - 2, 6 - ジメチル - 5 - (2 - ピリジニルスルホニル) - 3 (2H) - ピリダジノン (すなわち、合成例 2、工程 F で得られた生成物) (1.65 g、3.88 mmol) を、N - メチルピロリドンに溶解し、水酸化ナトリウム (0.40 g、10 mmol) を添加し、続いて水 (1 mL) を添加し、反応混合物を、90 °C で 2 時間加熱した。反応混合物を、周囲温度にあたため、次いで、水 (10 mL) およびトルエン (15 mL) を添加した。混合物を、分液漏斗に移し、トルエン層を除去した。水層を、1 N 塩酸水溶液で pH 3 に酸性化し、混合物を、ジクロロメタン (2 × 20 mL) で抽出した。有機層を、集め、MgSO₄ で乾燥し、減圧下濃縮して、半固体生成物を得た。この固体を、ヘキサン中の酢酸エチルの勾配で溶出す

10

20

30

40

50

る、シリカゲルカラムクロマトグラフィーによってさらに精製して、表題化合物を、オフホワイト固体 (0.70 g) として得た。

^1H NMR 7.68 (d, 1H), 7.14 (d, 1H), 7.07 (s, 1H), 5.65 (s, 1H), 3.77 (s, 3H), 2.4 (s, 6H), 2.36 (s, 3H).

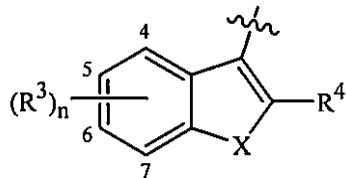
【0097】

本発明の化合物の製造において有用で、本方法において使用される中間体の例を、第1表から第5表に示す。第I-1a表から第I-3d表における R^3 基の位置は、以下に示すロカントによる番号付けに基づく。

【0098】

【化14】

10



【0099】

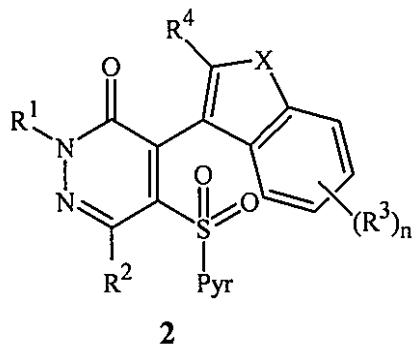
以下の略号は、次の表において使用される。Meは、メチルを意味し、Etは、エチルを意味し、Prは、プロピルを意味し、Phを、フェニルを意味する。

【0100】

20

第1表

【化15】



30

【0101】

Xは、Sであり、 R^1 は、Meであり、 R^2 は、Meであり、Pyrは、2-ピリジニルである。

【0102】

【表 1】

| $(R^3)_n$ | R^4 | $(R^3)_n$ | R^4 | $(R^3)_n$ | R^4 | |
|-------------------|-------|---------------------|-------|---------------------|-------|----|
| — | H | 5-Br | H | 5-Et | Pr | |
| 4-Me | H | 6-Br | H | 6-Et | Pr | |
| 5-Me | H | 7-Br | H | 7-Et | Pr | |
| 6-Me | H | 4-OCHF ₂ | H | 4-Pr | Pr | |
| 7-Me | H | 5OCHF ₂ | H | 5-Pr | Pr | |
| 4-Et | H | 6-OCHF ₂ | H | 6-Pr | Pr | 10 |
| 5-Et | H | 7-OCHF ₂ | H | 7-Pr | Pr | |
| 6-Et | H | 4-(C≡CH) | H | 4-OMe | Pr | |
| 7-Et | H | 5-(C≡CH) | H | 5-OMe | Pr | |
| 4-Pr | H | 6-(C≡CH) | H | 6-OMe | Pr | |
| 5-Pr | H | 7-(C≡CH) | H | 7-OMe | Pr | |
| 6-Pr | H | 4,5-di-Me | H | 4-CN | Pr | |
| 7-Pr | H | 4,6-di-Me | H | 5-CN | Pr | |
| 4-OMe | H | 4,7-di-Me | H | 6-CN | Pr | 20 |
| 5-OMe | H | 5,6-di-Me | H | 7-CN | Pr | |
| 6-OMe | H | 5,7-di-Me | H | 4-CF ₃ | Pr | |
| 7-OMe | H | 5-Cl, 7-Me | H | 5-CF ₃ | Pr | |
| 4-CN | H | 5-Cl, 7-OMe | H | 6-CF ₃ | Pr | |
| 5-CN | H | 5-F, 7-Me | H | 7-CF ₃ | Pr | |
| 6-CN | H | 5-Me, 7-F | H | 4-F | Pr | |
| 7-CN | H | 5-Me, 7-Cl | H | 5-F | Pr | |
| 4-CF ₃ | H | 5-Me, 7-CN | H | 6-F | Pr | |
| 5-CF ₃ | H | 5-Me, 7-OMe | H | 7-F | Pr | 30 |
| 6-CF ₃ | H | 5-(C≡CH), 7-Me | H | 4-Cl | Pr | |
| 7-CF ₃ | H | 5,7-di-F | H | 5-Cl | Pr | |
| 4-F | H | 5,7-di-Cl | H | 6-Cl | Pr | |
| 5-F | H | 5,7-di-Br | H | 7-Cl | Pr | |
| 6-F | H | | | 4-Br | Pr | |
| 7-F | H | — | Pr | 5-Br | Pr | |
| 4-Cl | H | 4-Me | Pr | 6-Br | Pr | |
| 5-Cl | H | 5-Me | Pr | 7-Br | Pr | 40 |
| 6-Cl | H | 6-Me | Pr | 4-OCHF ₂ | Pr | |
| 7-Cl | H | 7-Me | Pr | 5OCHF ₂ | Pr | |
| 4-Br | H | 4-Et | Pr | 6-OCHF ₂ | Pr | |

【 0 1 0 3 】

【表 2】

| $(R^3)_n$ | R^4 | $(R^3)_n$ | R^4 | $(R^3)_n$ | R^4 | |
|---------------------|-------|---------------------|-------|-------------------|-------|----|
| 7-OCHF ₂ | Pr | 6-OMe | Br | 5-F, 7-Me | Br | |
| 4-(C≡CH) | Pr | 7-OMe | Br | 5-Me, 7-F | Br | |
| 5-(C≡CH) | Pr | 4-CN | Br | 5-Me, 7-Cl | Br | |
| 6-(C≡CH) | Pr | 5-CN | Br | 5-Me, 7-CN | Br | |
| 7-(C≡CH) | Pr | 6-CN | Br | 5-Me, 7-OMe | Br | |
| 4,5-di-Me | Pr | 7-CN | Br | 5-(C≡CH), 7-Me | Br | 10 |
| 4,6-di-Me | Pr | 4-CF ₃ | Br | 5,7-di-F | Br | |
| 4,7-di-Me | Pr | 5-CF ₃ | Br | 5,7-di-Cl | Br | |
| 5,6-di-Me | Pr | 6-CF ₃ | Br | 5,7-di-Br | Br | |
| 5,7-di-Me | Pr | 7-CF ₃ | Br | | | |
| 5-Cl, 7-Me | Pr | 4-F | Br | — | OMe | |
| 5-Cl, 7-OMe | Pr | 5-F | Br | 4-Me | OMe | |
| 5-F, 7-Me | Pr | 6-F | Br | 5-Me | OMe | |
| 5-Me, 7-F | Pr | 7-F | Br | 6-Me | OMe | |
| 5-Me, 7-Cl | Pr | 4-Cl | Br | 7-Me | OMe | 20 |
| 5-Me, 7-CN | Pr | 5-Cl | Br | 4-Et | OMe | |
| 5-Me, 7-OMe | Pr | 6-Cl | Br | 5-Et | OMe | |
| 5-(C≡CH), 7-Me | Pr | 7-Cl | Br | 6-Et | OMe | |
| 5,7-di-F | Pr | 4-Br | Br | 7-Et | OMe | |
| 5,7-di-Cl | Pr | 5-Br | Br | 4-Pr | OMe | |
| 5,7-di-Br | Pr | 6-Br | Br | 5-Pr | OMe | |
| | | 7-Br | Br | 6-Pr | OMe | |
| — | Br | 4-OCHF ₂ | Br | 7-Pr | OMe | 30 |
| 4-Me | Br | 5OCHF ₂ | Br | 4-OMe | OMe | |
| 5-Me | Br | 6-OCHF ₂ | Br | 5-OMe | OMe | |
| 6-Me | Br | 7-OCHF ₂ | Br | 6-OMe | OMe | |
| 7-Me | Br | 4-(C≡CH) | Br | 7-OMe | OMe | |
| 4-Et | Br | 5-(C≡CH) | Br | 4-CN | OMe | |
| 5-Et | Br | 6-(C≡CH) | Br | 5-CN | OMe | |
| 6-Et | Br | 7-(C≡CH) | Br | 6-CN | OMe | |
| 7-Et | Br | 4,5-di-Me | Br | 7-CN | OMe | |
| 4-Pr | Br | 4,6-di-Me | Br | 4-CF ₃ | OMe | 40 |
| 5-Pr | Br | 4,7-di-Me | Br | 5-CF ₃ | OMe | |
| 6-Pr | Br | 5,6-di-Me | Br | 6-CF ₃ | OMe | |
| 7-Pr | Br | 5,7-di-Me | Br | 7-CF ₃ | OMe | |
| 4-OMe | Br | 5-Cl, 7-Me | Br | 4-F | OMe | |
| 5-OMe | Br | 5-Cl, 7-OMe | Br | 5-F | OMe | |

【表 3】

| $(R^3)_n$ | R^4 | $(R^3)_n$ | R^4 | $(R^3)_n$ | R^4 | |
|---------------------|-------------------|---------------------|-------------------|---------------------|-------------------|----|
| 6-F | OMe | 5-Me | SCHF ₂ | 6-OCHF ₂ | SCHF ₂ | |
| 7-F | OMe | 6-Me | SCHF ₂ | 7-OCHF ₂ | SCHF ₂ | |
| 4-Cl | OMe | 7-Me | SCHF ₂ | 4-(C≡CH) | SCHF ₂ | |
| 5-Cl | OMe | 4-Et | SCHF ₂ | 5-(C≡CH) | SCHF ₂ | |
| 6-Cl | OMe | 5-Et | SCHF ₂ | 6-(C≡CH) | SCHF ₂ | |
| 7-Cl | OMe | 6-Et | SCHF ₂ | 7-(C≡CH) | SCHF ₂ | 10 |
| 4-Br | OMe | 7-Et | SCHF ₂ | 4,5-di-Me | SCHF ₂ | |
| 5-Br | OMe | 4-Pr | SCHF ₂ | 4,6-di-Me | SCHF ₂ | |
| 6-Br | OMe | 5-Pr | SCHF ₂ | 4,7-di-Me | SCHF ₂ | |
| 7-Br | OMe | 6-Pr | SCHF ₂ | 5,6-di-Me | SCHF ₂ | |
| 4-OCHF ₂ | OMe | 7-Pr | SCHF ₂ | 5,7-di-Me | SCHF ₂ | |
| 5OCHF ₂ | OMe | 4-OMe | SCHF ₂ | 5-Cl, 7-Me | SCHF ₂ | |
| 6-OCHF ₂ | OMe | 5-OMe | SCHF ₂ | 5-Cl, 7-OMe | SCHF ₂ | |
| 7-OCHF ₂ | OMe | 6-OMe | SCHF ₂ | 5-F, 7-Me | SCHF ₂ | |
| 4-(C≡CH) | OMe | 7-OMe | SCHF ₂ | 5-Me, 7-F | SCHF ₂ | 20 |
| 5-(C≡CH) | OMe | 4-CN | SCHF ₂ | 5-Me, 7-Cl | SCHF ₂ | |
| 6-(C≡CH) | OMe | 5-CN | SCHF ₂ | 5-Me, 7-CN | SCHF ₂ | |
| 7-(C≡CH) | OMe | 6-CN | SCHF ₂ | 5-Me, 7-OMe | SCHF ₂ | |
| 4,5-di-Me | OMe | 7-CN | SCHF ₂ | 5-(C≡CH), 7-Me | SCHF ₂ | |
| 4,6-di-Me | OMe | 4-CF ₃ | SCHF ₂ | 5,7-di-F | SCHF ₂ | |
| 4,7-di-Me | OMe | 5-CF ₃ | SCHF ₂ | 5,7-di-Cl | SCHF ₂ | |
| 5,6-di-Me | OMe | 6-CF ₃ | SCHF ₂ | 5,7-di-Br | SCHF ₂ | |
| 5,7-di-Me | OMe | 7-CF ₃ | SCHF ₂ | | | 30 |
| 5-Cl, 7-Me | OMe | 4-F | SCHF ₂ | — | Me | |
| 5-Cl, 7-OMe | OMe | 5-F | SCHF ₂ | 4-Me | Me | |
| 5-F, 7-Me | OMe | 6-F | SCHF ₂ | 5-Me | Me | |
| 5-Me, 7-F | OMe | 7-F | SCHF ₂ | 6-Me | Me | |
| 5-Me, 7-Cl | OMe | 4-Cl | SCHF ₂ | 7-Me | Me | |
| 5-Me, 7-CN | OMe | 5-Cl | SCHF ₂ | 4-Et | Me | |
| 5-Me, 7-OMe | OMe | 6-Cl | SCHF ₂ | 5-Et | Me | |
| 5-(C≡CH), 7-Me | OMe | 7-Cl | SCHF ₂ | 6-Et | Me | |
| 5,7-di-F | OMe | 4-Br | SCHF ₂ | 7-Et | Me | 40 |
| 5,7-di-Cl | OMe | 5-Br | SCHF ₂ | 4-Pr | Me | |
| 5,7-di-Br | OMe | 6-Br | SCHF ₂ | 5-Pr | Me | |
| | | 7-Br | SCHF ₂ | 6-Pr | Me | |
| — | SCHF ₂ | 4-OCHF ₂ | SCHF ₂ | 7-Pr | Me | |
| 4-Me | SCHF ₂ | 5OCHF ₂ | SCHF ₂ | 4-OMe | Me | |

【 0 1 0 5 】

【表 4】

| $(R^3)_n$ | R^4 | $(R^3)_n$ | R^4 | $(R^3)_n$ | R^4 | |
|---------------------|-------|-------------------|-------|---------------------|-------|----|
| 5-OMe | Me | 5-Cl, 7-OMe | Me | 5-F | F | |
| 6-OMe | Me | 5-F, 7-Me | Me | 6-F | F | |
| 7-OMe | Me | 5-Me, 7-F | Me | 7-F | F | |
| 4-CN | Me | 5-Me, 7-Cl | Me | 4-Cl | F | |
| 5-CN | Me | 5-Me, 7-CN | Me | 5-Cl | F | |
| 6-CN | Me | 5-Me, 7-OMe | Me | 6-Cl | F | 10 |
| 7-CN | Me | 5-(C≡CH), 7-Me | Me | 7-Cl | F | |
| 4-CF ₃ | Me | 5,7-di-F | Me | 4-Br | F | |
| 5-CF ₃ | Me | 5,7-di-Cl | Me | 5-Br | F | |
| 6-CF ₃ | Me | 5,7-di-Br | Me | 6-Br | F | |
| 7-CF ₃ | Me | | | 7-Br | F | |
| 4-F | Me | — | F | 4-OCHF ₂ | F | |
| 5-F | Me | 4-Me | F | 5OCHF ₂ | F | |
| 6-F | Me | 5-Me | F | 6-OCHF ₂ | F | 20 |
| 7-F | Me | 6-Me | F | 7-OCHF ₂ | F | |
| 4-Cl | Me | 7-Me | F | 4-(C≡CH) | F | |
| 5-Cl | Me | 4-Et | F | 5-(C≡CH) | F | |
| 6-Cl | Me | 5-Et | F | 6-(C≡CH) | F | |
| 7-Cl | Me | 6-Et | F | 7-(C≡CH) | F | |
| 4-Br | Me | 7-Et | F | 4,5-di-Me | F | |
| 5-Br | Me | 4-Pr | F | 4,6-di-Me | F | |
| 6-Br | Me | 5-Pr | F | 4,7-di-Me | F | 30 |
| 7-Br | Me | 6-Pr | F | 5,6-di-Me | F | |
| 4-OCHF ₂ | Me | 7-Pr | F | 5,7-di-Me | F | |
| 5OCHF ₂ | Me | 4-OMe | F | 5-Cl, 7-Me | F | |
| 6-OCHF ₂ | Me | 5-OMe | F | 5-Cl, 7-OMe | F | |
| 7-OCHF ₂ | Me | 6-OMe | F | 5-F, 7-Me | F | |
| 4-(C≡CH) | Me | 7-OMe | F | 5-Me, 7-F | F | |
| 5-(C≡CH) | Me | 4-CN | F | 5-Me, 7-Cl | F | |
| 6-(C≡CH) | Me | 5-CN | F | 5-Me, 7-CN | F | |
| 7-(C≡CH) | Me | 6-CN | F | 5-Me, 7-OMe | F | 40 |
| 4,5-di-Me | Me | 7-CN | F | 5-(C≡CH), 7-Me | F | |
| 4,6-di-Me | Me | 4-CF ₃ | F | 5,7-di-F | F | |
| 4,7-di-Me | Me | 5-CF ₃ | F | 5,7-di-Cl | F | |
| 5,6-di-Me | Me | 6-CF ₃ | F | 5,7-di-Br | F | |
| 5,7-di-Me | Me | 7-CF ₃ | F | | | |
| 5-Cl, 7-Me | Me | 4-F | F | — | CN | |

【表 5】

| $(R^3)_n$ | R^4 | $(R^3)_n$ | R^4 | $(R^3)_n$ | R^4 | |
|---------------------|-------|---------------------|-------------------|---------------------|-------------------|----|
| 4-Me | CN | 5OCHF ₂ | CN | 4-OMe | OCHF ₂ | |
| 5-Me | CN | 6-OCHF ₂ | CN | 5-OMe | OCHF ₂ | |
| 6-Me | CN | 7-OCHF ₂ | CN | 6-OMe | OCHF ₂ | |
| 7-Me | CN | 4-(C≡CH) | CN | 7-OMe | OCHF ₂ | |
| 4-Et | CN | 5-(C≡CH) | CN | 4-CN | OCHF ₂ | |
| 5-Et | CN | 6-(C≡CH) | CN | 5-CN | OCHF ₂ | 10 |
| 6-Et | CN | 7-(C≡CH) | CN | 6-CN | OCHF ₂ | |
| 7-Et | CN | 4,5-di-Me | CN | 7-CN | OCHF ₂ | |
| 4-Pr | CN | 4,6-di-Me | CN | 4-CF ₃ | OCHF ₂ | |
| 5-Pr | CN | 4,7-di-Me | CN | 5-CF ₃ | OCHF ₂ | |
| 6-Pr | CN | 5,6-di-Me | CN | 6-CF ₃ | OCHF ₂ | |
| 7-Pr | CN | 5,7-di-Me | CN | 7-CF ₃ | OCHF ₂ | |
| 4-OMe | CN | 5-Cl, 7-Me | CN | 4-F | OCHF ₂ | |
| 5-OMe | CN | 5-Cl, 7-OMe | CN | 5-F | OCHF ₂ | 20 |
| 6-OMe | CN | 5-F, 7-Me | CN | 6-F | OCHF ₂ | |
| 7-OMe | CN | 5-Me, 7-F | CN | 7-F | OCHF ₂ | |
| 4-CN | CN | 5-Me, 7-Cl | CN | 4-Cl | OCHF ₂ | |
| 5-CN | CN | 5-Me, 7-CN | CN | 5-Cl | OCHF ₂ | |
| 6-CN | CN | 5-Me, 7-OMe | CN | 6-Cl | OCHF ₂ | |
| 7-CN | CN | 5-(C≡CH), 7-Me | CN | 7-Cl | OCHF ₂ | |
| 4-CF ₃ | CN | 5,7-di-F | CN | 4-Br | OCHF ₂ | |
| 5-CF ₃ | CN | 5,7-di-Cl | CN | 5-Br | OCHF ₂ | |
| 6-CF ₃ | CN | 5,7-di-Br | CN | 6-Br | OCHF ₂ | 30 |
| 7-CF ₃ | CN | | | 7-Br | OCHF ₂ | |
| 4-F | CN | — | OCHF ₂ | 4-OCHF ₂ | OCHF ₂ | |
| 5-F | CN | 4-Me | OCHF ₂ | 5OCHF ₂ | OCHF ₂ | |
| 6-F | CN | 5-Me | OCHF ₂ | 6-OCHF ₂ | OCHF ₂ | |
| 7-F | CN | 6-Me | OCHF ₂ | 7-OCHF ₂ | OCHF ₂ | |
| 4-Cl | CN | 7-Me | OCHF ₂ | 4-(C≡CH) | OCHF ₂ | |
| 5-Cl | CN | 4-Et | OCHF ₂ | 5-(C≡CH) | OCHF ₂ | |
| 6-Cl | CN | 5-Et | OCHF ₂ | 6-(C≡CH) | OCHF ₂ | 40 |
| 7-Cl | CN | 6-Et | OCHF ₂ | 7-(C≡CH) | OCHF ₂ | |
| 4-Br | CN | 7-Et | OCHF ₂ | 4,5-di-Me | OCHF ₂ | |
| 5-Br | CN | 4-Pr | OCHF ₂ | 4,6-di-Me | OCHF ₂ | |
| 6-Br | CN | 5-Pr | OCHF ₂ | 4,7-di-Me | OCHF ₂ | |
| 7-Br | CN | 6-Pr | OCHF ₂ | 5,6-di-Me | OCHF ₂ | |
| 4-OCHF ₂ | CN | 7-Pr | OCHF ₂ | 5,7-di-Me | OCHF ₂ | |

【 0 1 0 7 】

【表 6】

| $(R^3)_n$ | R^4 | $(R^3)_n$ | R^4 | $(R^3)_n$ | R^4 | |
|-------------------|-------------------|---------------------|------------------|-------------------|-------|----|
| 5-Cl, 7-Me | OCHF ₂ | 4-F | SCF ₃ | — | Et | |
| 5-Cl, 7-OMe | OCHF ₂ | 5-F | SCF ₃ | 4-Me | Et | |
| 5-F, 7-Me | OCHF ₂ | 6-F | SCF ₃ | 5-Me | Et | |
| 5-Me, 7-F | OCHF ₂ | 7-F | SCF ₃ | 6-Me | Et | |
| 5-Me, 7-Cl | OCHF ₂ | 4-Cl | SCF ₃ | 7-Me | Et | |
| 5-Me, 7-CN | OCHF ₂ | 5-Cl | SCF ₃ | 4-Et | Et | 10 |
| 5-Me, 7-OMe | OCHF ₂ | 6-Cl | SCF ₃ | 5-Et | Et | |
| 5-(C≡CH), 7-Me | OCHF ₂ | 7-Cl | SCF ₃ | 6-Et | Et | |
| 5,7-di-F | OCHF ₂ | 4-Br | SCF ₃ | 7-Et | Et | |
| 5,7-di-Cl | OCHF ₂ | 5-Br | SCF ₃ | 4-Pr | Et | |
| 5,7-di-Br | OCHF ₂ | 6-Br | SCF ₃ | 5-Pr | Et | |
| | | 7-Br | SCF ₃ | 6-Pr | Et | |
| — | SCF ₃ | 4-OCHF ₂ | SCF ₃ | 7-Pr | Et | |
| 4-Me | SCF ₃ | 5OCHF ₂ | SCF ₃ | 4-OMe | Et | 20 |
| 5-Me | SCF ₃ | 6-OCHF ₂ | SCF ₃ | 5-OMe | Et | |
| 6-Me | SCF ₃ | 7-OCHF ₂ | SCF ₃ | 6-OMe | Et | |
| 7-Me | SCF ₃ | 4-(C≡CH) | SCF ₃ | 7-OMe | Et | |
| 4-Et | SCF ₃ | 5-(C≡CH) | SCF ₃ | 4-CN | Et | |
| 5-Et | SCF ₃ | 6-(C≡CH) | SCF ₃ | 5-CN | Et | |
| 6-Et | SCF ₃ | 7-(C≡CH) | SCF ₃ | 6-CN | Et | |
| 7-Et | SCF ₃ | 4,5-di-Me | SCF ₃ | 7-CN | Et | |
| 4-Pr | SCF ₃ | 4,6-di-Me | SCF ₃ | 4-CF ₃ | Et | 30 |
| 5-Pr | SCF ₃ | 4,7-di-Me | SCF ₃ | 5-CF ₃ | Et | |
| 6-Pr | SCF ₃ | 5,6-di-Me | SCF ₃ | 6-CF ₃ | Et | |
| 7-Pr | SCF ₃ | 5,7-di-Me | SCF ₃ | 7-CF ₃ | Et | |
| 4-OMe | SCF ₃ | 5-Cl, 7-Me | SCF ₃ | 4-F | Et | |
| 5-OMe | SCF ₃ | 5-Cl, 7-OMe | SCF ₃ | 5-F | Et | |
| 6-OMe | SCF ₃ | 5-F, 7-Me | SCF ₃ | 6-F | Et | |
| 7-OMe | SCF ₃ | 5-Me, 7-F | SCF ₃ | 7-F | Et | |
| 4-CN | SCF ₃ | 5-Me, 7-Cl | SCF ₃ | 4-Cl | Et | |
| 5-CN | SCF ₃ | 5-Me, 7-CN | SCF ₃ | 5-Cl | Et | 40 |
| 6-CN | SCF ₃ | 5-Me, 7-OMe | SCF ₃ | 6-Cl | Et | |
| 7-CN | SCF ₃ | 5-(C≡CH), 7-Me | SCF ₃ | 7-Cl | Et | |
| 4-CF ₃ | SCF ₃ | 5,7-di-F | SCF ₃ | 4-Br | Et | |
| 5-CF ₃ | SCF ₃ | 5,7-di-Cl | SCF ₃ | 5-Br | Et | |
| 6-CF ₃ | SCF ₃ | 5,7-di-Br | SCF ₃ | 6-Br | Et | |
| 7-CF ₃ | SCF ₃ | | | 7-Br | Et | |

【表 7】

| $(R^3)_n$ | R^4 | $(R^3)_n$ | R^4 | $(R^3)_n$ | R^4 | |
|---------------------|-------|---------------------|-------|-------------------|-------|----|
| 4-OCHF ₂ | Et | 7-Pr | Cl | 5,7-di-Me | Cl | |
| 5OCHF ₂ | Et | 4-OMe | Cl | 5-Cl, 7-Me | Cl | |
| 6-OCHF ₂ | Et | 5-OMe | Cl | 5-Cl, 7-OMe | Cl | |
| 7-OCHF ₂ | Et | 6-OMe | Cl | 5-F, 7-Me | Cl | |
| 4-(C≡CH) | Et | 7-OMe | Cl | 5-Me, 7-F | Cl | |
| 5-(C≡CH) | Et | 4-CN | Cl | 5-Me, 7-Cl | Cl | 10 |
| 6-(C≡CH) | Et | 5-CN | Cl | 5-Me, 7-CN | Cl | |
| 7-(C≡CH) | Et | 6-CN | Cl | 5-Me, 7-OMe | Cl | |
| 4,5-di-Me | Et | 7-CN | Cl | 5-(C≡CH), 7-Me | Cl | |
| 4,6-di-Me | Et | 4-CF ₃ | Cl | 5,7-di-F | Cl | |
| 4,7-di-Me | Et | 5-CF ₃ | Cl | 5,7-di-Cl | Cl | |
| 5,6-di-Me | Et | 6-CF ₃ | Cl | 5,7-di-Br | Cl | |
| 5,7-di-Me | Et | 7-CF ₃ | Cl | | | |
| 5-Cl, 7-Me | Et | 4-F | Cl | — | C≡CH | |
| 5-Cl, 7-OMe | Et | 5-F | Cl | 4-Me | C≡CH | 20 |
| 5-F, 7-Me | Et | 6-F | Cl | 5-Me | C≡CH | |
| 5-Me, 7-F | Et | 7-F | Cl | 6-Me | C≡CH | |
| 5-Me, 7-Cl | Et | 4-Cl | Cl | 7-Me | C≡CH | |
| 5-Me, 7-CN | Et | 5-Cl | Cl | 4-Et | C≡CH | |
| 5-Me, 7-OMe | Et | 6-Cl | Cl | 5-Et | C≡CH | |
| 5-(C≡CH), 7-Me | Et | 7-Cl | Cl | 6-Et | C≡CH | |
| 5,7-di-F | Et | 4-Br | Cl | 7-Et | C≡CH | |
| 5,7-di-Cl | Et | 5-Br | Cl | 4-Pr | C≡CH | 30 |
| 5,7-di-Br | Et | 6-Br | Cl | 5-Pr | C≡CH | |
| | | 7-Br | Cl | 6-Pr | C≡CH | |
| — | Cl | 4-OCHF ₂ | Cl | 7-Pr | C≡CH | |
| 4-Me | Cl | 5OCHF ₂ | Cl | 4-OMe | C≡CH | |
| 5-Me | Cl | 6-OCHF ₂ | Cl | 5-OMe | C≡CH | |
| 6-Me | Cl | 7-OCHF ₂ | Cl | 6-OMe | C≡CH | |
| 7-Me | Cl | 4-(C≡CH) | Cl | 7-OMe | C≡CH | |
| 4-Et | Cl | 5-(C≡CH) | Cl | 4-CN | C≡CH | 40 |
| 5-Et | Cl | 6-(C≡CH) | Cl | 5-CN | C≡CH | |
| 6-Et | Cl | 7-(C≡CH) | Cl | 6-CN | C≡CH | |
| 7-Et | Cl | 4,5-di-Me | Cl | 7-CN | C≡CH | |
| 4-Pr | Cl | 4,6-di-Me | Cl | 4-CF ₃ | C≡CH | |
| 5-Pr | Cl | 4,7-di-Me | Cl | 5-CF ₃ | C≡CH | |
| 6-Pr | Cl | 5,6-di-Me | Cl | 6-CF ₃ | C≡CH | |

【表 8】

| $(R^3)_n$ | R^4 | $(R^3)_n$ | R^4 | $(R^3)_n$ | R^4 | |
|---------------------|-------|-------------------|-------|---------------------|-------|----|
| 7-CF ₃ | C≡CH | 5,7-di-F | C≡CH | 5-Cl | SMe | |
| 4-F | C≡CH | 5,7-di-Cl | C≡CH | 6-Cl | SMe | |
| 5-F | C≡CH | 5,7-di-Br | C≡CH | 7-Cl | SMe | |
| 6-F | C≡CH | | | 4-Br | SMe | |
| 7-F | C≡CH | — | SMe | 5-Br | SMe | |
| 4-Cl | C≡CH | 4-Me | SMe | 6-Br | SMe | 10 |
| 5-Cl | C≡CH | 5-Me | SMe | 7-Br | SMe | |
| 6-Cl | C≡CH | 6-Me | SMe | 4-OCHF ₂ | SMe | |
| 7-Cl | C≡CH | 7-Me | SMe | 5OCHF ₂ | SMe | |
| 4-Br | C≡CH | 4-Et | SMe | 6-OCHF ₂ | SMe | |
| 5-Br | C≡CH | 5-Et | SMe | 7-OCHF ₂ | SMe | |
| 6-Br | C≡CH | 6-Et | SMe | 4-(C≡CH) | SMe | |
| 7-Br | C≡CH | 7-Et | SMe | 5-(C≡CH) | SMe | |
| 4-OCHF ₂ | C≡CH | 4-Pr | SMe | 6-(C≡CH) | SMe | 20 |
| 5OCHF ₂ | C≡CH | 5-Pr | SMe | 7-(C≡CH) | SMe | |
| 6-OCHF ₂ | C≡CH | 6-Pr | SMe | 4,5-di-Me | SMe | |
| 7-OCHF ₂ | C≡CH | 7-Pr | SMe | 4,6-di-Me | SMe | |
| 4-(C≡CH) | C≡CH | 4-OMe | SMe | 4,7-di-Me | SMe | |
| 5-(C≡CH) | C≡CH | 5-OMe | SMe | 5,6-di-Me | SMe | |
| 6-(C≡CH) | C≡CH | 6-OMe | SMe | 5,7-di-Me | SMe | |
| 7-(C≡CH) | C≡CH | 7-OMe | SMe | 5-Cl, 7-Me | SMe | |
| 4,5-di-Me | C≡CH | 4-CN | SMe | 5-Cl, 7-OMe | SMe | |
| 4,6-di-Me | C≡CH | 5-CN | SMe | 5-F, 7-Me | SMe | 30 |
| 4,7-di-Me | C≡CH | 6-CN | SMe | 5-Me, 7-F | SMe | |
| 5,6-di-Me | C≡CH | 7-CN | SMe | 5-Me, 7-Cl | SMe | |
| 5,7-di-Me | C≡CH | 4-CF ₃ | SMe | 5-Me, 7-CN | SMe | |
| 5-Cl, 7-Me | C≡CH | 5-CF ₃ | SMe | 5-Me, 7-OMe | SMe | |
| 5-Cl, 7-OMe | C≡CH | 6-CF ₃ | SMe | 5-(C≡CH), 7-Me | SMe | |
| 5-F, 7-Me | C≡CH | 7-CF ₃ | SMe | 5,7-di-F | SMe | |
| 5-Me, 7-F | C≡CH | 4-F | SMe | 5,7-di-Cl | SMe | |
| 5-Me, 7-Cl | C≡CH | 5-F | SMe | 5,7-di-Br | SMe | 40 |
| 5-Me, 7-CN | C≡CH | 6-F | SMe | | | |
| 5-Me, 7-OMe | C≡CH | 7-F | SMe | | | |
| 5-(C≡CH), 7-Me | C≡CH | 4-Cl | SMe | | | |

【0110】

第2表は、見出し「Xは、Sであり、R¹は、Meであり、R²は、Meである」を、以下の第2表に挙げる見出し（すなわち、Xは、Sであり、R¹は、Meであり、R²は、Meである）で置き換える以外は、同じ様式で構成される。したがって、第2表の第1行目は、Xは、Sであり、R¹は、Meであり、R²は、Meであり、(R³)_nは、「-」であり（すなわち、nは、0である；R³で置換されていない）、R⁴は、Hである、式1の化合物である。第3表から第643表は、同様に構成される。

【 0 1 1 1 】

【 表 9 】

| 表 | 見出し |
|----|--|
| 2 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Meであり、Pyrは、3-ピリジニルである。 |
| 3 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Meであり、Pyrは、4-ピリジニルである。 |
| 4 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Meであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-CH ₃)である。 |
| 5 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Meであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-CH ₃)である。 |
| 6 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Meであり、Pyrは、3-ピリジニル(2-CH ₃)である。 |
| 7 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Meであり、Pyrは、3-ピリジニル(4-CH ₃)である。 |
| 8 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Meであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-Cl)である。 |
| 9 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Meであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-Cl)である。 |
| 10 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Meであり、Pyrは、3-ピリジニル(5-Cl)である。 |
| 11 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Hであり、Pyrは、2-ピリジニルである。 |
| 12 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Hであり、Pyrは、3-ピリジニルである。 |
| 13 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Hであり、Pyrは、4-ピリジニルである。 |
| 14 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Hであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-CH ₃)である。 |
| 15 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Hであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-CH ₃)である。 |
| 16 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Hであり、Pyrは、3-ピリジニル(2-CH ₃)である。 |
| 17 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Hであり、Pyrは、3-ピリジニル(4-CH ₃)である。 |
| 18 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Hであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-Cl)である。 |
| 19 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Hであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-Cl)である。 |
| 20 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Hであり、Pyrは、3-ピリジニル(5-Cl)である。 |

10

20

30

40

【 0 1 1 2 】

【表 10】

| | |
|----|--|
| 21 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Etであり、Pyrは、2-ピリジニルである。 |
| 22 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Etであり、Pyrは、3-ピリジニルである。 |
| 23 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Etであり、Pyrは、4-ピリジニルである。 |
| 24 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Etであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-CH ₃)である。 |
| 25 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Etであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-CH ₃)である。 |
| 26 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Etであり、Pyrは、3-ピリジニル(2-CH ₃)である。 |
| 27 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Etであり、Pyrは、3-ピリジニル(4-CH ₃)である。 |
| 28 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Etであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-Cl)である。 |
| 29 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Etであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-Cl)である。 |
| 30 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Etであり、Pyrは、3-ピリジニル(5-Cl)である。 |
| 31 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Prであり、Pyrは、2-ピリジニルである。 |
| 32 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Prであり、Pyrは、3-ピリジニルである。 |
| 33 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Prであり、Pyrは、4-ピリジニルである。 |
| 34 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Prであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-CH ₃)である。 |
| 35 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Prであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-CH ₃)である。 |
| 36 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Prであり、Pyrは、3-ピリジニル(2-CH ₃)である。 |
| 37 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Prであり、Pyrは、3-ピリジニル(4-CH ₃)である。 |
| 38 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Prであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-Cl)である。 |
| 39 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Prであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-Cl)である。 |
| 40 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Prであり、Pyrは、3-ピリジニル(5-Cl)である。 |
| 41 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、CF ₃ であり、Pyrは、2-ピリジニルである。 |
| 42 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、CF ₃ であり、Pyrは、3-ピリジニルである。 |
| 43 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、CF ₃ であり、Pyrは、4-ピリジニルである。 |

10

20

30

40

【表 1 1】

| | | |
|----|--|----|
| 44 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、CF ₃ であり、Pyrは、2-ピリジニル(3-CH ₃)である。 | |
| 45 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、CF ₃ であり、Pyrは、2-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | |
| 46 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、CF ₃ であり、Pyrは、3-ピリジニル(2-CH ₃)である。 | |
| 47 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、CF ₃ であり、Pyrは、3-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | 10 |
| 48 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、CF ₃ であり、Pyrは、2-ピリジニル(3-Cl)である。 | |
| 49 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、CF ₃ であり、Pyrは、2-ピリジニル(4-Cl)である。 | |
| 50 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、CF ₃ であり、Pyrは、3-ピリジニル(5-Cl)である。 | |
| 51 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Clであり、Pyrは、2-ピリジニルである。 | 20 |
| 52 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Clであり、Pyrは、3-ピリジニルである。 | |
| 53 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Clであり、Pyrは、4-ピリジニルである。 | |
| 54 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Clであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-CH ₃)である。 | |
| 55 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Clであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | |
| 56 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Clであり、Pyrは、3-ピリジニル(2-CH ₃)である。 | |
| 57 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Clであり、Pyrは、3-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | 30 |
| 58 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Clであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-Cl)である。 | |
| 59 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Clであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-Cl)である。 | |
| 60 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Clであり、Pyrは、3-ピリジニル(5-Cl)である。 | |
| 61 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Brであり、Pyrは、2-ピリジニルである。 | 40 |
| 62 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Brであり、Pyrは、3-ピリジニルである。 | |
| 63 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Brであり、Pyrは、4-ピリジニルである。 | |
| 64 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Brであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-CH ₃)である。 | |
| 65 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Brであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | |

【 0 1 1 4 】

【表 1 2】

| | | |
|----|---|----|
| | ある。 | |
| 66 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Brであり、Pyrは、3-ピリジニル(2-CH ₃)である。 | |
| 67 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Brであり、Pyrは、3-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | |
| 68 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Brであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-Cl)である。 | 10 |
| 69 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Brであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-Cl)である。 | |
| 70 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Brであり、Pyrは、3-ピリジニル(5-Cl)である。 | |
| 71 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Iであり、Pyrは、2-ピリジニルである。 | |
| 72 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Iであり、Pyrは、3-ピリジニルである。 | |
| 73 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Iであり、Pyrは、4-ピリジニルである。 | |
| 74 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Iであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-CH ₃)である。 | 20 |
| 75 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Iであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | |
| 76 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Iであり、Pyrは、3-ピリジニル(2-CH ₃)である。 | |
| 77 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Iであり、Pyrは、3-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | |
| 78 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Iであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-Cl)である。 | 30 |
| 79 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Iであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-Cl)である。 | |
| 80 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Iであり、Pyrは、3-ピリジニル(5-Cl)である。 | |
| 81 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、OMeであり、Pyrは、2-ピリジニルである。 | |
| 82 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、OMeであり、Pyrは、3-ピリジニルである。 | 40 |
| 83 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、OMeであり、Pyrは、4-ピリジニルである。 | |
| 84 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、OMeであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-CH ₃)である。 | |
| 85 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、OMeであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | |

【表 1 3】

| | | |
|-----|---|----|
| | である。 | |
| 86 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、OMeであり、Pyrは、3-ピリジニル(2-CH ₃)である。 | |
| 87 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、OMeであり、Pyrは、3-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | |
| 88 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、OMeであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-Cl)である。 | 10 |
| 89 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、OMeであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-Cl)である。 | |
| 90 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、OMeであり、Pyrは、3-ピリジニル(5-Cl)である。 | |
| 91 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、OEtであり、Pyrは、2-ピリジニルである。 | |
| 92 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、OEtであり、Pyrは、3-ピリジニルである。 | |
| 93 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、OEtであり、Pyrは、4-ピリジニルである。 | |
| 94 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、OEtであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-CH ₃)である。 | 20 |
| 95 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、OEtであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | |
| 96 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、OEtであり、Pyrは、3-ピリジニル(2-CH ₃)である。 | |
| 97 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、OEtであり、Pyrは、3-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | |
| 98 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、OEtであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-Cl)である。 | 30 |
| 99 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、OEtであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-Cl)である。 | |
| 100 | Xは、Sであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、OEtであり、Pyrは、3-ピリジニル(5-Cl)である。 | |
| 101 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Meであり、Pyrは、2-ピリジニルである。 | |
| 102 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Meであり、Pyrは、3-ピリジニルである。 | |
| 103 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Meであり、Pyrは、4-ピリジニルである。 | |
| 104 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Meであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-CH ₃)である。 | 40 |
| 105 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Meであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | |
| 106 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Meであり、Pyrは、3-ピリジニル(2-CH ₃)である。 | |

【 0 1 1 6 】

【表 1 4】

| | | |
|-----|--|----|
| 107 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Meであり、Pyrは、3-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | |
| 108 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Meであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-Cl)である。 | |
| 109 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Meであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-Cl)である。 | |
| 110 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Meであり、Pyrは、3-ピリジニル(5-Cl)である。 | 10 |
| 111 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Hであり、Pyrは、2-ピリジニルである。 | |
| 112 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Hであり、Pyrは、3-ピリジニルである。 | |
| 113 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Hであり、Pyrは、4-ピリジニルである。 | |
| 114 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Hであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-CH ₃)である。 | |
| 115 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Hであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | 20 |
| 116 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Hであり、Pyrは、3-ピリジニル(2-CH ₃)である。 | |
| 117 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Hであり、Pyrは、3-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | |
| 118 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Hであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-Cl)である。 | |
| 119 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Hであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-Cl)である。 | |
| 120 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Hであり、Pyrは、3-ピリジニル(5-Cl)である。 | 30 |
| 121 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Etであり、Pyrは、2-ピリジニルである。 | |
| 122 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Etであり、Pyrは、3-ピリジニルである。 | |
| 123 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Etであり、Pyrは、4-ピリジニルである。 | |
| 124 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Etであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-CH ₃)である。 | |
| 125 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Etであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | 40 |
| 126 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Etであり、Pyrは、3-ピリジニル(2-CH ₃)である。 | |
| 127 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Etであり、Pyrは、3-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | |
| 128 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Etであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-Cl)であ | |

【表 15】

| | | |
|-----|--|----|
| | る。 | |
| 129 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Etであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-Cl)である。 | |
| 130 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Etであり、Pyrは、3-ピリジニル(5-Cl)である。 | |
| 131 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Prであり、Pyrは、2-ピリジニルである。 | |
| 132 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Prであり、Pyrは、3-ピリジニルである。 | 10 |
| 133 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Prであり、Pyrは、4-ピリジニルである。 | |
| 134 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Prであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-CH ₃)である。 | |
| 135 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Prであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | |
| 136 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Prであり、Pyrは、3-ピリジニル(2-CH ₃)である。 | |
| 137 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Prであり、Pyrは、3-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | 20 |
| 138 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Prであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-Cl)である。 | |
| 139 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Prであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-Cl)である。 | |
| 140 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Prであり、Pyrは、3-ピリジニル(5-Cl)である。 | |
| 141 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、CF ₃ であり、Pyrは、2-ピリジニルである。 | |
| 142 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、CF ₃ であり、Pyrは、3-ピリジニルである。 | 30 |
| 143 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、CF ₃ であり、Pyrは、4-ピリジニルである。 | |
| 144 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、CF ₃ であり、Pyrは、2-ピリジニル(3-CH ₃)である。 | |
| 145 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、CF ₃ であり、Pyrは、2-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | |
| 146 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、CF ₃ であり、Pyrは、3-ピリジニル(2-CH ₃)である。 | |
| 147 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、CF ₃ であり、Pyrは、3-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | 40 |
| 148 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、CF ₃ であり、Pyrは、2-ピリジニル(3-Cl)である。 | |
| 149 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、CF ₃ であり、Pyrは、2-ピリジニル(4-Cl)である。 | |

【表 16】

| | | |
|-----|--|----|
| 150 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、CF ₃ であり、Pyrは、3-ピリジニル(5-Cl)である。 | 10 |
| 151 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Clであり、Pyrは、2-ピリジニルである。 | |
| 152 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Clであり、Pyrは、3-ピリジニルである。 | |
| 153 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Clであり、Pyrは、4-ピリジニルである。 | |
| 154 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Clであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-CH ₃)である。 | |
| 155 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Clであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | |
| 156 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Clであり、Pyrは、3-ピリジニル(2-CH ₃)である。 | 20 |
| 157 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Clであり、Pyrは、3-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | |
| 158 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Clであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-Cl)である。 | |
| 159 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Clであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-Cl)である。 | |
| 160 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Clであり、Pyrは、3-ピリジニル(5-Cl)である。 | |
| 161 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Brであり、Pyrは、2-ピリジニルである。 | 30 |
| 162 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Brであり、Pyrは、3-ピリジニルである。 | |
| 163 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Brであり、Pyrは、4-ピリジニルである。 | |
| 164 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Brであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-CH ₃)である。 | |
| 165 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Brであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | |
| 166 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Brであり、Pyrは、3-ピリジニル(2-CH ₃)である。 | |
| 167 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Brであり、Pyrは、3-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | 40 |
| 168 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Brであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-Cl)である。 | |
| 169 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Brであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-Cl)である。 | |
| 170 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Brであり、Pyrは、3-ピリジニル(5-Cl)である。 | |

【表 17】

| | |
|-----|---|
| 171 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Iであり、Pyrは、2-ピリジニルである。 |
| 172 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Iであり、Pyrは、3-ピリジニルである。 |
| 173 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Iであり、Pyrは、4-ピリジニルである。 |
| 174 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Iであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-CH ₃)である。 |
| 175 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Iであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-CH ₃)である。 |
| 176 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Iであり、Pyrは、3-ピリジニル(2-CH ₃)である。 |
| 177 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Iであり、Pyrは、3-ピリジニル(4-CH ₃)である。 |
| 178 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Iであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-Cl)である。 |
| 179 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Iであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-Cl)である。 |
| 180 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Iであり、Pyrは、3-ピリジニル(5-Cl)である。 |
| 181 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、OMeであり、Pyrは、2-ピリジニルである。 |
| 182 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、OMeであり、Pyrは、3-ピリジニルである。 |
| 183 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、OMeであり、Pyrは、4-ピリジニルである。 |
| 184 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、OMeであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-CH ₃)である。 |
| 185 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、OMeであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-CH ₃)である。 |
| 186 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、OMeであり、Pyrは、3-ピリジニル(2-CH ₃)である。 |
| 187 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、OMeであり、Pyrは、3-ピリジニル(4-CH ₃)である。 |
| 188 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、OMeであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-Cl)である。 |
| 189 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、OMeであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-Cl)である。 |
| 190 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、OMeであり、Pyrは、3-ピリジニル(5-Cl)である。 |
| 191 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、OEtであり、Pyrは、2-ピリジニルである。 |
| 192 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、OEtであり、Pyrは、3-ピリジニルである。 |
| 193 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、OEtであり、Pyrは、4-ピリジニルである。 |

10

20

30

40

【表 18】

| | | |
|-----|---|----|
| 194 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、OEtであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-CH ₃)である。 | 10 |
| 195 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、OEtであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | |
| 196 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、OEtであり、Pyrは、3-ピリジニル(2-CH ₃)である。 | |
| 197 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、OEtであり、Pyrは、3-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | |
| 198 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、OEtであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-Cl)である。 | |
| 199 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、OEtであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-Cl)である。 | |
| 200 | Xは、Sであり、R ¹ は、Etであり、R ² は、OEtであり、Pyrは、3-ピリジニル(5-Cl)である。 | 20 |
| 201 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Meであり、Pyrは、2-ピリジニルである。 | |
| 202 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Meであり、Pyrは、3-ピリジニルである。 | |
| 203 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Meであり、Pyrは、4-ピリジニルである。 | |
| 204 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Meであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-CH ₃)である。 | |
| 205 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Meであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | |
| 206 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Meであり、Pyrは、3-ピリジニル(2-CH ₃)である。 | 30 |
| 207 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Meであり、Pyrは、3-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | |
| 208 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Meであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-Cl)である。 | |
| 209 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Meであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-Cl)である。 | |
| 210 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Meであり、Pyrは、3-ピリジニル(5-Cl)である。 | |
| 211 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Hであり、Pyrは、2-ピリジニルである。 | |
| 212 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Hであり、Pyrは、3-ピリジニルである。 | 40 |
| 213 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Hであり、Pyrは、4-ピリジニルである。 | |
| 214 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Hであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-CH ₃)である。 | |
| 215 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Hであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | |

【表 19】

| | | |
|-----|--|----|
| | る。 | |
| 216 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Hであり、Pyrは、3-ピリジニル(2-CH ₃)である。 | |
| 217 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Hであり、Pyrは、3-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | |
| 218 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Hであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-Cl)である。 | 10 |
| 219 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Hであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-Cl)である。 | |
| 220 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Hであり、Pyrは、3-ピリジニル(5-Cl)である。 | |
| 221 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Etであり、Pyrは、2-ピリジニルである。 | |
| 222 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Etであり、Pyrは、3-ピリジニルである。 | |
| 223 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Etであり、Pyrは、4-ピリジニルである。 | |
| 224 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Etであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-CH ₃)である。 | 20 |
| 225 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Etであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | |
| 226 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Etであり、Pyrは、3-ピリジニル(2-CH ₃)である。 | |
| 227 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Etであり、Pyrは、3-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | |
| 228 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Etであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-Cl)である。 | 30 |
| 229 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Etであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-Cl)である。 | |
| 230 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Etであり、Pyrは、3-ピリジニル(5-Cl)である。 | |
| 231 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Prであり、Pyrは、2-ピリジニルである。 | |
| 232 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Prであり、Pyrは、3-ピリジニルである。 | |
| 233 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Prであり、Pyrは、4-ピリジニルである。 | |
| 234 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Prであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-CH ₃)である。 | 40 |
| 235 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Prであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | |
| 236 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Prであり、Pyrは、3-ピリジニル(2-CH ₃)である。 | |

【表 20】

| | | |
|-----|--|----|
| 237 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Prであり、Pyrは、3-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | |
| 238 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Prであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-Cl)である。 | |
| 239 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Prであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-Cl)である。 | |
| 240 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Prであり、Pyrは、3-ピリジニル(5-Cl)である。 | 10 |
| 241 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、CF ₃ であり、Pyrは、2-ピリジニルである。 | |
| 242 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、CF ₃ であり、Pyrは、3-ピリジニルである。 | |
| 243 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、CF ₃ であり、Pyrは、4-ピリジニルである。 | |
| 244 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、CF ₃ であり、Pyrは、2-ピリジニル(3-CH ₃)である。 | |
| 245 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、CF ₃ であり、Pyrは、2-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | |
| 246 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、CF ₃ であり、Pyrは、3-ピリジニル(2-CH ₃)である。 | 20 |
| 247 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、CF ₃ であり、Pyrは、3-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | |
| 248 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、CF ₃ であり、Pyrは、2-ピリジニル(3-Cl)である。 | |
| 249 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、CF ₃ であり、Pyrは、2-ピリジニル(4-Cl)である。 | |
| 250 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、CF ₃ であり、Pyrは、3-ピリジニル(5-Cl)である。 | 30 |
| 251 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Clであり、Pyrは、2-ピリジニルである。 | |
| 252 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Clであり、Pyrは、3-ピリジニルである。 | |
| 253 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Clであり、Pyrは、4-ピリジニルである。 | |
| 254 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Clであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-CH ₃)である。 | |
| 255 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Clであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | |
| 256 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Clであり、Pyrは、3-ピリジニル(2-CH ₃)である。 | 40 |
| 257 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Clであり、Pyrは、3-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | |
| 258 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Clであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-Cl)であ | |

【表 2 1】

| | | |
|-----|--|----|
| | る。 | |
| 259 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Clであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-Cl)である。 | |
| 260 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Clであり、Pyrは、3-ピリジニル(5-Cl)である。 | |
| 261 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Brであり、Pyrは、2-ピリジニルである。 | 10 |
| 262 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Brであり、Pyrは、3-ピリジニルである。 | |
| 263 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Brであり、Pyrは、4-ピリジニルである。 | |
| 264 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Brであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-CH ₃)である。 | |
| 265 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Brであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | |
| 266 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Brであり、Pyrは、3-ピリジニル(2-CH ₃)である。 | |
| 267 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Brであり、Pyrは、3-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | 20 |
| 268 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Brであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-Cl)である。 | |
| 269 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Brであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-Cl)である。 | |
| 270 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Brであり、Pyrは、3-ピリジニル(5-Cl)である。 | |
| 271 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Iであり、Pyrは、2-ピリジニルである。 | 30 |
| 272 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Iであり、Pyrは、3-ピリジニルである。 | |
| 273 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Iであり、Pyrは、4-ピリジニルである。 | |
| 274 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Iであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-CH ₃)である。 | |
| 275 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Iであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | |
| 276 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Iであり、Pyrは、3-ピリジニル(2-CH ₃)である。 | |
| 277 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Iであり、Pyrは、3-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | 40 |
| 278 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Iであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-Cl)である。 | |
| 279 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Iであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-Cl)である。 | |

【表 2 2】

| | | |
|-----|---|----|
| 280 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Iであり、Pyrは、3-ピリジニル(5-Cl)である。 | 10 |
| 281 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、OMeであり、Pyrは、2-ピリジニルである。 | |
| 282 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、OMeであり、Pyrは、3-ピリジニルである。 | |
| 283 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、OMeであり、Pyrは、4-ピリジニルである。 | |
| 284 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、OMeであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-CH ₃)である。 | |
| 285 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、OMeであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | |
| 286 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、OMeであり、Pyrは、3-ピリジニル(2-CH ₃)である。 | 20 |
| 287 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、OMeであり、Pyrは、3-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | |
| 288 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、OMeであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-Cl)である。 | |
| 289 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、OMeであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-Cl)である。 | |
| 290 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、OMeであり、Pyrは、3-ピリジニル(5-Cl)である。 | |
| 291 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、OEtであり、Pyrは、2-ピリジニルである。 | 30 |
| 292 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、OEtであり、Pyrは、3-ピリジニルである。 | |
| 293 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、OEtであり、Pyrは、4-ピリジニルである。 | |
| 294 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、OEtであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-CH ₃)である。 | |
| 295 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、OEtであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | |
| 296 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、OEtであり、Pyrは、3-ピリジニル(2-CH ₃)である。 | |
| 297 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、OEtであり、Pyrは、3-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | 40 |
| 298 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、OEtであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-Cl)である。 | |
| 299 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、OEtであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-Cl)である。 | |
| 300 | Xは、Sであり、R ¹ は、Prであり、R ² は、OEtであり、Pyrは、3-ピリジニル(5-Cl)である。 | |
| 301 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Meであり、Pyrは、2-ピリジニルで | |

【表 2 3】

| | | |
|-----|--|----|
| | ある。 | |
| 302 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Meであり、Pyrは、3-ピリジニルである。 | |
| 303 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Meであり、Pyrは、4-ピリジニルである。 | |
| 304 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Meであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-CH ₃)である。 | 10 |
| 305 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Meであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | |
| 306 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Meであり、Pyrは、3-ピリジニル(2-CH ₃)である。 | |
| 307 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Meであり、Pyrは、3-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | |
| 308 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Meであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-Cl)である。 | 20 |
| 309 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Meであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-Cl)である。 | |
| 310 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Meであり、Pyrは、3-ピリジニル(5-Cl)である。 | |
| 311 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Hであり、Pyrは、2-ピリジニルである。 | |
| 312 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Hであり、Pyrは、3-ピリジニルである。 | |
| 313 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Hであり、Pyrは、4-ピリジニルである。 | 30 |
| 314 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Hであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-CH ₃)である。 | |
| 315 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Hであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | |
| 316 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Hであり、Pyrは、3-ピリジニル(2-CH ₃)である。 | |
| 317 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Hであり、Pyrは、3-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | 40 |
| 318 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Hであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-Cl)である。 | |
| 319 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Hであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-Cl)である。 | |
| 320 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Hであり、Pyrは、3-ピリジニル(5-Cl)である。 | |

【表 2 4】

| | | |
|-----|--|----|
| | である。 | |
| 321 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Etであり、Pyrは、2-ピリジニルである。 | |
| 322 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Etであり、Pyrは、3-ピリジニルである。 | |
| 323 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Etであり、Pyrは、4-ピリジニルである。 | 10 |
| 324 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Etであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-CH ₃)である。 | |
| 325 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Etであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | |
| 326 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Etであり、Pyrは、3-ピリジニル(2-CH ₃)である。 | |
| 327 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Etであり、Pyrは、3-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | 20 |
| 328 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Etであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-Cl)である。 | |
| 329 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Etであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-Cl)である。 | |
| 330 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Etであり、Pyrは、3-ピリジニル(5-Cl)である。 | |
| 331 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Prであり、Pyrは、2-ピリジニルである。 | |
| 332 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Prであり、Pyrは、3-ピリジニルである。 | 30 |
| 333 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Prであり、Pyrは、4-ピリジニルである。 | |
| 334 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Prであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-CH ₃)である。 | |
| 335 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Prであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | |
| 336 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Prであり、Pyrは、3-ピリジニル(2-CH ₃)である。 | 40 |
| 337 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Prであり、Pyrは、3-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | |
| 338 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Prであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-Cl)である。 | |
| 339 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Prであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-Cl)である。 | |

【表 25】

| | | |
|-----|--|----|
| | である。 | |
| 340 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Prであり、Pyrは、3-ピリジニル(5-Cl)である。 | |
| 341 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、CF ₃ であり、Pyrは、2-ピリジニルである。 | |
| 342 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、CF ₃ であり、Pyrは、3-ピリジニルである。 | 10 |
| 343 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、CF ₃ であり、Pyrは、4-ピリジニルである。 | |
| 344 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、CF ₃ であり、Pyrは、2-ピリジニル(3-CH ₃)である。 | |
| 345 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、CF ₃ であり、Pyrは、2-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | |
| 346 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、CF ₃ であり、Pyrは、3-ピリジニル(2-CH ₃)である。 | 20 |
| 347 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、CF ₃ であり、Pyrは、3-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | |
| 348 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、CF ₃ であり、Pyrは、2-ピリジニル(3-Cl)である。 | |
| 349 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、CF ₃ であり、Pyrは、2-ピリジニル(4-Cl)である。 | |
| 350 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、CF ₃ であり、Pyrは、3-ピリジニル(5-Cl)である。 | |
| 351 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Clであり、Pyrは、2-ピリジニルである。 | 30 |
| 352 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Clであり、Pyrは、3-ピリジニルである。 | |
| 353 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Clであり、Pyrは、4-ピリジニルである。 | |
| 354 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Clであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-CH ₃)である。 | |
| 355 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Clであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | 40 |
| 356 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Clであり、Pyrは、3-ピリジニル(2-CH ₃)である。 | |
| 357 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Clであり、Pyrは、3-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | |
| 358 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Clであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-Cl) | |

【表 2 6】

| | | |
|-----|--|----|
| | である。 | |
| 359 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Clであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-Cl)である。 | |
| 360 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Clであり、Pyrは、3-ピリジニル(5-Cl)である。 | |
| 361 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Brであり、Pyrは、2-ピリジニルである。 | 10 |
| 362 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Brであり、Pyrは、3-ピリジニルである。 | |
| 363 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Brであり、Pyrは、4-ピリジニルである。 | |
| 364 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Brであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-CH ₃)である。 | |
| 365 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Brであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | 20 |
| 366 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Brであり、Pyrは、3-ピリジニル(2-CH ₃)である。 | |
| 367 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Brであり、Pyrは、3-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | |
| 368 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Brであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-Cl)である。 | |
| 369 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Brであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-Cl)である。 | 30 |
| 370 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Brであり、Pyrは、3-ピリジニル(5-Cl)である。 | |
| 371 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Iであり、Pyrは、2-ピリジニルである。 | |
| 372 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Iであり、Pyrは、3-ピリジニルである。 | |
| 373 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Iであり、Pyrは、4-ピリジニルである。 | 40 |
| 374 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Iであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-CH ₃)である。 | |
| 375 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Iであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | |
| 376 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Iであり、Pyrは、3-ピリジニル(2-CH ₃)である。 | |
| 377 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Iであり、Pyrは、3-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | |

【表 27】

| | |
|-----|---|
| | である。 |
| 378 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Iであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-Cl)である。 |
| 379 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Iであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-Cl)である。 |
| 380 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Iであり、Pyrは、3-ピリジニル(5-Cl)である。 |
| 381 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、OMeであり、Pyrは、2-ピリジニルである。 |
| 382 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、OMeであり、Pyrは、3-ピリジニルである。 |
| 383 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、OMeであり、Pyrは、4-ピリジニルである。 |
| 384 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、OMeであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-CH ₃)である。 |
| 385 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、OMeであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-CH ₃)である。 |
| 386 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、OMeであり、Pyrは、3-ピリジニル(2-CH ₃)である。 |
| 387 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、OMeであり、Pyrは、3-ピリジニル(4-CH ₃)である。 |
| 388 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、OMeであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-Cl)である。 |
| 389 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、OMeであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-Cl)である。 |
| 390 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、OMeであり、Pyrは、3-ピリジニル(5-Cl)である。 |
| 391 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、OEtであり、Pyrは、2-ピリジニルである。 |
| 392 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、OEtであり、Pyrは、3-ピリジニルである。 |
| 393 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、OEtであり、Pyrは、4-ピリジニルである。 |
| 394 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、OEtであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-CH ₃)である。 |
| 395 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、OEtであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-CH ₃)である。 |
| 396 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、OEtであり、Pyrは、3-ピリジニル |

【表 28】

| | | |
|-----|---|----|
| | (2-CH ₃)である。 | |
| 397 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、OEtであり、Pyrは、3-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | |
| 398 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、OEtであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-Cl)である。 | |
| 399 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、OEtであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-Cl)である。 | 10 |
| 400 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、OEtであり、Pyrは、3-ピリジニル(5-Cl)である。 | |
| 401 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Meであり、Pyrは、2-ピリジニルである。 | |
| 402 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Meであり、Pyrは、3-ピリジニルである。 | |
| 403 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Meであり、Pyrは、4-ピリジニルである。 | 20 |
| 404 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Meであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-CH ₃)である。 | |
| 405 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Meであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | |
| 406 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Meであり、Pyrは、3-ピリジニル(2-CH ₃)である。 | |
| 407 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Meであり、Pyrは、3-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | |
| 408 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Meであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-Cl)である。 | 30 |
| 409 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Meであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-Cl)である。 | |
| 410 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Meであり、Pyrは、3-ピリジニル(5-Cl)である。 | |
| 411 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Hであり、Pyrは、2-ピリジニルである。 | |
| 412 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Hであり、Pyrは、3-ピリジニルである。 | 40 |
| 413 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Hであり、Pyrは、4-ピリジニルである。 | |
| 414 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Hであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-CH ₃)である。 | |
| 415 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Hであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | |

【表 29】

| | | |
|-----|--|----|
| | である。 | |
| 416 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Hであり、Pyrは、3-ピリジニル(2-CH ₃)である。 | |
| 417 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Hであり、Pyrは、3-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | |
| 418 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Hであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-Cl)である。 | 10 |
| 419 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Hであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-Cl)である。 | |
| 420 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Hであり、Pyrは、3-ピリジニル(5-Cl)である。 | |
| 421 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Etであり、Pyrは、2-ピリジニルである。 | |
| 422 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Etであり、Pyrは、3-ピリジニルである。 | 20 |
| 423 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Etであり、Pyrは、4-ピリジニルである。 | |
| 424 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Etであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-CH ₃)である。 | |
| 425 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Etであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | |
| 426 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Etであり、Pyrは、3-ピリジニル(2-CH ₃)である。 | |
| 427 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Etであり、Pyrは、3-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | 30 |
| 428 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Etであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-Cl)である。 | |
| 429 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Etであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-Cl)である。 | |
| 430 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Etであり、Pyrは、3-ピリジニル(5-Cl)である。 | |
| 431 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Prであり、Pyrは、2-ピリジニルである。 | 40 |
| 432 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Prであり、Pyrは、3-ピリジニルである。 | |
| 433 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Prであり、Pyrは、4-ピリジニルである。 | |
| 434 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Prであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-CH ₃)である。 | |

【表 3 0】

| | |
|-----|--|
| | である。 |
| 435 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Prであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-CH ₃)である。 |
| 436 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Prであり、Pyrは、3-ピリジニル(2-CH ₃)である。 |
| 437 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Prであり、Pyrは、3-ピリジニル(4-CH ₃)である。 |
| 438 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Prであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-Cl)である。 |
| 439 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Prであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-Cl)である。 |
| 440 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Prであり、Pyrは、3-ピリジニル(5-Cl)である。 |
| 441 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、CF ₃ であり、Pyrは、2-ピリジニルである。 |
| 442 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、CF ₃ であり、Pyrは、3-ピリジニルである。 |
| 443 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、CF ₃ であり、Pyrは、4-ピリジニルである。 |
| 444 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、CF ₃ であり、Pyrは、2-ピリジニル(3-CH ₃)である。 |
| 445 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、CF ₃ であり、Pyrは、2-ピリジニル(4-CH ₃)である。 |
| 446 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、CF ₃ であり、Pyrは、3-ピリジニル(2-CH ₃)である。 |
| 447 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、CF ₃ であり、Pyrは、3-ピリジニル(4-CH ₃)である。 |
| 448 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、CF ₃ であり、Pyrは、2-ピリジニル(3-Cl)である。 |
| 449 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、CF ₃ であり、Pyrは、2-ピリジニル(4-Cl)である。 |
| 450 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、CF ₃ であり、Pyrは、3-ピリジニル(5-Cl)である。 |
| 451 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Clであり、Pyrは、2-ピリジニルである。 |
| 452 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Clであり、Pyrは、3-ピリジニルである。 |
| 453 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Clであり、Pyrは、4-ピリジニルで |

10

20

30

40

【表 3 1】

| | | |
|-----|--|----|
| | ある。 | |
| 454 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Clであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-CH ₃)である。 | |
| 455 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Clであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | |
| 456 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Clであり、Pyrは、3-ピリジニル(2-CH ₃)である。 | 10 |
| 457 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Clであり、Pyrは、3-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | |
| 458 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Clであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-Cl)である。 | |
| 459 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Clであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-Cl)である。 | |
| 460 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Clであり、Pyrは、3-ピリジニル(5-Cl)である。 | |
| 461 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Brであり、Pyrは、2-ピリジニルである。 | 20 |
| 462 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Brであり、Pyrは、3-ピリジニルである。 | |
| 463 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Brであり、Pyrは、4-ピリジニルである。 | |
| 464 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Brであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-CH ₃)である。 | |
| 465 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Brであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | 30 |
| 466 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Brであり、Pyrは、3-ピリジニル(2-CH ₃)である。 | |
| 467 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Brであり、Pyrは、3-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | |
| 468 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Brであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-Cl)である。 | |
| 469 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Brであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-Cl)である。 | 40 |
| 470 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Brであり、Pyrは、3-ピリジニル(5-Cl)である。 | |
| 471 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Iであり、Pyrは、2-ピリジニルである。 | |
| 472 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Iであり、Pyrは、3-ピリジニルであ | |

【表 3 2】

| | |
|-----|---|
| | る。 |
| 473 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Iであり、Pyrは、4-ピリジニルである。 |
| 474 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Iであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-CH ₃)である。 |
| 475 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Iであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-CH ₃)である。 |
| 476 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Iであり、Pyrは、3-ピリジニル(2-CH ₃)である。 |
| 477 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Iであり、Pyrは、3-ピリジニル(4-CH ₃)である。 |
| 478 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Iであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-Cl)である。 |
| 479 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Iであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-Cl)である。 |
| 480 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、Iであり、Pyrは、3-ピリジニル(5-Cl)である。 |
| 481 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、OMeであり、Pyrは、2-ピリジニルである。 |
| 482 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、OMeであり、Pyrは、3-ピリジニルである。 |
| 483 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、OMeであり、Pyrは、4-ピリジニルである。 |
| 484 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、OMeであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-CH ₃)である。 |
| 485 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、OMeであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-CH ₃)である。 |
| 486 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、OMeであり、Pyrは、3-ピリジニル(2-CH ₃)である。 |
| 487 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、OMeであり、Pyrは、3-ピリジニル(4-CH ₃)である。 |
| 488 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、OMeであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-Cl)である。 |
| 489 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、OMeであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-Cl)である。 |
| 490 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、OMeであり、Pyrは、3-ピリジニル(5-Cl)である。 |
| 491 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、OEtであり、Pyrは、2-ピリジニルで |

【表 3 3】

| | | |
|-----|---|----|
| | ある。 | |
| 492 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、OEtであり、Pyrは、3-ピリジニルである。 | |
| 493 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、OEtであり、Pyrは、4-ピリジニルである。 | |
| 494 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、OEtであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-CH ₃)である。 | 10 |
| 495 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、OEtであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | |
| 496 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、OEtであり、Pyrは、3-ピリジニル(2-CH ₃)である。 | |
| 497 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、OEtであり、Pyrは、3-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | |
| 498 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、OEtであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-Cl)である。 | 20 |
| 499 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、OEtであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-Cl)である。 | |
| 500 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Etであり、R ² は、OEtであり、Pyrは、3-ピリジニル(5-Cl)である。 | |
| 501 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Meであり、Pyrは、2-ピリジニルである。 | |
| 502 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Meであり、Pyrは、3-ピリジニルである。 | |
| 503 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Meであり、Pyrは、4-ピリジニルである。 | 30 |
| 504 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Meであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-CH ₃)である。 | |
| 505 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Meであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | |
| 506 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Meであり、Pyrは、3-ピリジニル(2-CH ₃)である。 | |
| 507 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Meであり、Pyrは、3-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | 40 |
| 508 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Meであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-Cl)である。 | |
| 509 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Meであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-Cl)である。 | |
| 510 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Meであり、Pyrは、3-ピリジニル(5-Cl)である。 | |

【表 3 4】

| | | |
|-----|--|----|
| | である。 | |
| 511 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Hであり、Pyrは、2-ピリジニルである。 | |
| 512 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Hであり、Pyrは、3-ピリジニルである。 | |
| 513 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Hであり、Pyrは、4-ピリジニルである。 | 10 |
| 514 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Hであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-CH ₃)である。 | |
| 515 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Hであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | |
| 516 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Hであり、Pyrは、3-ピリジニル(2-CH ₃)である。 | |
| 517 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Hであり、Pyrは、3-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | 20 |
| 518 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Hであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-Cl)である。 | |
| 519 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Hであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-Cl)である。 | |
| 520 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Hであり、Pyrは、3-ピリジニル(5-Cl)である。 | |
| 521 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Etであり、Pyrは、2-ピリジニルである。 | 30 |
| 522 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Etであり、Pyrは、3-ピリジニルである。 | |
| 523 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Etであり、Pyrは、4-ピリジニルである。 | |
| 524 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Etであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-CH ₃)である。 | |
| 525 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Etであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | |
| 526 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Etであり、Pyrは、3-ピリジニル(2-CH ₃)である。 | 40 |
| 527 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Etであり、Pyrは、3-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | |
| 528 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Etであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-Cl)である。 | |
| 529 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Etであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-Cl)である。 | |

【表 3 5】

| | |
|-----|--|
| | である。 |
| 530 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Etであり、Pyrは、3-ピリジニル(5-Cl)である。 |
| 531 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Prであり、Pyrは、2-ピリジニルである。 |
| 532 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Prであり、Pyrは、3-ピリジニルである。 |
| 533 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Prであり、Pyrは、4-ピリジニルである。 |
| 534 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Prであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-CH ₃)である。 |
| 535 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Prであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-CH ₃)である。 |
| 536 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Prであり、Pyrは、3-ピリジニル(2-CH ₃)である。 |
| 537 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Prであり、Pyrは、3-ピリジニル(4-CH ₃)である。 |
| 538 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Prであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-Cl)である。 |
| 539 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Prであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-Cl)である。 |
| 540 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Prであり、Pyrは、3-ピリジニル(5-Cl)である。 |
| 541 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、CF ₃ であり、Pyrは、2-ピリジニルである。 |
| 542 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、CF ₃ であり、Pyrは、3-ピリジニルである。 |
| 543 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、CF ₃ であり、Pyrは、4-ピリジニルである。 |
| 544 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、CF ₃ であり、Pyrは、2-ピリジニル(3-CH ₃)である。 |
| 545 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、CF ₃ であり、Pyrは、2-ピリジニル(4-CH ₃)である。 |
| 546 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、CF ₃ であり、Pyrは、3-ピリジニル(2-CH ₃)である。 |
| 547 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、CF ₃ であり、Pyrは、3-ピリジニル(4-CH ₃)である。 |
| 548 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、CF ₃ であり、Pyrは、2-ピリジニル(3-Cl) |

【表 3 6】

| | | |
|-----|--|----|
| | である。 | |
| 549 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、CF ₃ であり、Pyrは、2-ピリジニル(4-Cl)である。 | |
| 550 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、CF ₃ であり、Pyrは、3-ピリジニル(5-Cl)である。 | |
| 551 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Clであり、Pyrは、2-ピリジニルである。 | 10 |
| 552 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Clであり、Pyrは、3-ピリジニルである。 | |
| 553 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Clであり、Pyrは、4-ピリジニルである。 | |
| 554 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Clであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-CH ₃)である。 | |
| 555 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Clであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | |
| 556 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Clであり、Pyrは、3-ピリジニル(2-CH ₃)である。 | 20 |
| 557 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Clであり、Pyrは、3-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | |
| 558 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Clであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-Cl)である。 | |
| 559 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Clであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-Cl)である。 | |
| 560 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Clであり、Pyrは、3-ピリジニル(5-Cl)である。 | 30 |
| 561 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Brであり、Pyrは、2-ピリジニルである。 | |
| 562 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Brであり、Pyrは、3-ピリジニルである。 | |
| 563 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Brであり、Pyrは、4-ピリジニルである。 | |
| 564 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Brであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-CH ₃)である。 | 40 |
| 565 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Brであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | |
| 566 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Brであり、Pyrは、3-ピリジニル(2-CH ₃)である。 | |
| 567 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Brであり、Pyrは、3-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | |

【表 3 7】

| | | |
|-----|---|----|
| | である。 | |
| 568 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Brであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-Cl)である。 | |
| 569 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Brであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-Cl)である。 | |
| 570 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Brであり、Pyrは、3-ピリジニル(5-Cl)である。 | 10 |
| 571 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Iであり、Pyrは、2-ピリジニルである。 | |
| 572 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Iであり、Pyrは、3-ピリジニルである。 | |
| 573 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Iであり、Pyrは、4-ピリジニルである。 | |
| 574 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Iであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-CH ₃)である。 | 20 |
| 575 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Iであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | |
| 576 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Iであり、Pyrは、3-ピリジニル(2-CH ₃)である。 | |
| 577 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Iであり、Pyrは、3-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | |
| 578 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Iであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-Cl)である。 | |
| 579 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Iであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-Cl)である。 | 30 |
| 580 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、Iであり、Pyrは、3-ピリジニル(5-Cl)である。 | |
| 581 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、OMeであり、Pyrは、2-ピリジニルである。 | |
| 582 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、OMeであり、Pyrは、3-ピリジニルである。 | |
| 583 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、OMeであり、Pyrは、4-ピリジニルである。 | 40 |
| 584 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、OMeであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-CH ₃)である。 | |
| 585 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、OMeであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | |
| 586 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、OMeであり、Pyrは、3-ピリジニル | |

【表 3 8】

| | |
|-----|--|
| | (2-CH ₃)である。 |
| 587 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、OMeであり、Pyrは、3-ピリジニル(4-CH ₃)である。 |
| 588 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、OMeであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-Cl)である。 |
| 589 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、OMeであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-Cl)である。 |
| 590 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、OMeであり、Pyrは、3-ピリジニル(5-Cl)である。 |
| 591 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、OEtであり、Pyrは、2-ピリジニルである。 |
| 592 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、OEtであり、Pyrは、3-ピリジニルである。 |
| 593 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、OEtであり、Pyrは、4-ピリジニルである。 |
| 594 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、OEtであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-CH ₃)である。 |
| 595 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、OEtであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-CH ₃)である。 |
| 596 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、OEtであり、Pyrは、3-ピリジニル(2-CH ₃)である。 |
| 597 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、OEtであり、Pyrは、3-ピリジニル(4-CH ₃)である。 |
| 598 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、OEtであり、Pyrは、2-ピリジニル(3-Cl)である。 |
| 599 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、OEtであり、Pyrは、2-ピリジニル(4-Cl)である。 |
| 600 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、Prであり、R ² は、OEtであり、Pyrは、3-ピリジニル(5-Cl)である。 |
| 601 | Xは、Sであり、R ¹ は、CH ₂ CF ₃ であり、R ² は、Meであり、Pyrは、2-ピリジニルである。 |
| 602 | Xは、Sであり、R ¹ は、CH ₂ CF ₃ であり、R ² は、Meであり、Pyrは、3-ピリジニルである。 |
| 603 | Xは、Sであり、R ¹ は、CH ₂ CF ₃ であり、R ² は、Brであり、Pyrは、2-ピリジニルである。 |
| 604 | Xは、Sであり、R ¹ は、CH ₂ CF ₃ であり、R ² は、Brであり、Pyrは、3-ピリジニルである。 |
| 605 | Xは、Sであり、R ¹ は、CH ₂ CH ₂ CNであり、R ² は、Meであり、Pyrは、2-ピリジニル |

【表 3 9】

| | |
|-----|--|
| | である。 |
| 606 | Xは、Sであり、R ¹ は、CH ₂ CH ₂ CNであり、R ² は、Meであり、Pyrは、3-ピリジニルである。 |
| 607 | Xは、Sであり、R ¹ は、CH ₂ CH ₂ CNであり、R ² は、Brであり、Pyrは、2-ピリジニルである。 |
| 608 | Xは、Sであり、R ¹ は、CH ₂ CH ₂ CNであり、R ² は、Brであり、Pyrは、3-ピリジニルである。 |
| 609 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、CH ₂ CF ₃ であり、R ² は、Meであり、Pyrは、2-ピリジニルである。 |
| 610 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、CH ₂ CF ₃ であり、R ² は、Meであり、Pyrは、3-ピリジニルである。 |
| 611 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、CH ₂ CF ₃ であり、R ² は、Brであり、Pyrは、2-ピリジニルである。 |
| 612 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、CH ₂ CF ₃ であり、R ² は、Brであり、Pyrは、3-ピリジニルである。 |
| 613 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、CH ₂ CH ₂ CNであり、R ² は、Meであり、Pyrは、2-ピリジニルである。 |
| 614 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、CH ₂ CH ₂ CNであり、R ² は、Meであり、Pyrは、3-ピリジニルである。 |
| 615 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、CH ₂ CH ₂ CNであり、R ² は、Brであり、Pyrは、2-ピリジニルである。 |
| 616 | Xは、-CH=CH-であり、R ¹ は、CH ₂ CH ₂ CNであり、R ² は、Brであり、Pyrは、3-ピリジニルである。 |
| 617 | Xは、Oであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Meであり、Pyrは、2-ピリジニルである。 |
| 618 | Xは、Oであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Meであり、Pyrは、3-ピリジニル(2-CH ₃)である。 |
| 619 | Xは、Oであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Brであり、Pyrは、2-ピリジニルである。 |
| 620 | Xは、Oであり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Brであり、Pyrは、3-ピリジニル(2-CH ₃)である。 |
| 621 | Xは、-CH=C(Me)-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Meであり、Pyrは、2-ピリジニルである。 |
| 622 | Xは、-CH=C(Me)-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Meであり、Pyrは、3-ピリジニル(2-CH ₃)である。 |
| 623 | Xは、-CH=C(Me)-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Brであり、Pyrは、2-ピリジニルである。 |
| 624 | Xは、-CH=C(Me)-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Brであり、Pyrは、3-ピリジニル(2-CH ₃)である。 |

【表 4 0】

| | | |
|-----|--|----|
| 625 | Xは、N(Me)であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Meであり、Pyrは、2-ピリジニルである。 | 10 |
| 626 | Xは、N(Me)であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Meであり、Pyrは、3-ピリジニルである。 | |
| 627 | Xは、N(Me)であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Brであり、Pyrは、2-ピリジニルである。 | |
| 628 | Xは、N(Me)であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Brであり、Pyrは、3-ピリジニルである。 | |
| 629 | Xは、-CH=C(F)-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Meであり、Pyrは、2-ピリジニルである。 | 20 |
| 630 | Xは、-CH=C(F)-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Meであり、Pyrは、3-ピリジニルである。 | |
| 631 | Xは、-CH=C(F)-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Brであり、Pyrは、2-ピリジニルである。 | |
| 632 | Xは、-CH=C(F)-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Brであり、Pyrは、3-ピリジニルである。 | |
| 632 | Xは、-CH=C(Cl)-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Meであり、Pyrは、2-ピリジニルである。 | 30 |
| 633 | Xは、-CH=C(Cl)-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Meであり、Pyrは、3-ピリジニルである。 | |
| 634 | Xは、-CH=C(Cl)-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Brであり、Pyrは、2-ピリジニルである。 | |
| 635 | Xは、-CH=C(Cl)-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Brであり、Pyrは、3-ピリジニルである。 | |
| 636 | Xは、-CH=C(OMe)-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Meであり、Pyrは、2-ピリジニルである。 | 40 |
| 637 | Xは、-CH=C(OMe)-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Meであり、Pyrは、3-ピリジニルである。 | |
| 638 | Xは、-CH=C(OMe)-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Brであり、Pyrは、2-ピリジニルである。 | |
| 639 | Xは、-CH=C(OMe)-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Brであり、Pyrは、3-ピリジニルである。 | |
| 640 | Xは、-CH=C(CN)-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Meであり、Pyrは、2-ピリジニルである。 | 40 |
| 641 | Xは、-CH=C(CN)-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Meであり、Pyrは、3-ピリジニルである。 | |
| 642 | Xは、-CH=C(CN)-であり、R ¹ は、Meであり、R ² は、Brであり、Pyrは、2-ピリジニルである。 | |

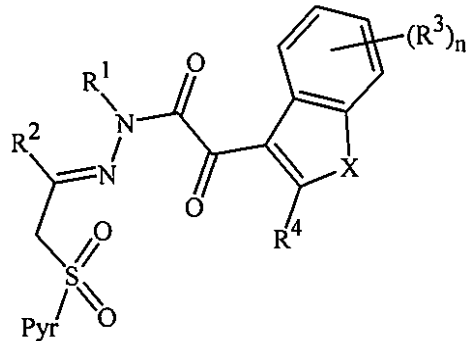
【表 4 1】

| | |
|-----|--|
| 643 | Xは、 $-\text{CH}=\text{C}(\text{CN})-$ であり、 R^1 は、Meであり、 R^2 は、Brであり、Pyrは、3-ピリジニルである。 |
|-----|--|

【0 1 4 4】

第 6 4 4 表

【化 1 6】



10

第 6 4 4 表は、第 1 表中の構造を、第 6 4 4 表についての上記の構造に置き換える以外は、第 1 表と同様に構成される。

20

【0 1 4 5】

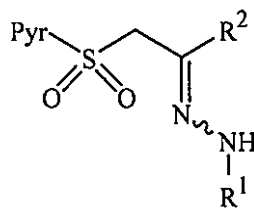
第 6 4 5 表から第 1 2 8 8 表

第 6 4 5 表は、第 2 表中の構造を、第 6 4 4 表についての上記の構造に置き換える以外は、第 2 表と同様に構成される。第 6 4 6 表から第 1 2 8 8 表は、第 3 表から第 6 4 4 表と同様の様式で構成される。

【0 1 4 6】

第 1 2 8 9 表

【化 1 7】



30

P y r は、2 - ピリジニルである。

【0 1 4 7】

【表 4 2】

| R^1 | R^2 |
|--------------------------|--------------------------|
| CH_3 | CH_3 |
| CH_2CH_3 | CH_3 |
| CH_3 | CH_2CH_3 |

40

【0 1 4 8】

本開示は、第 1 2 8 9 表の見出し（すなわち、P y r は、2 - ピリジニルである）を、以下のそれぞれの表について列挙した見出しと置き換えた、第 1 2 8 9 A 表から第 1 2 8 9 I 表に記載する化合物も含む。

50

【 0 1 4 9 】

【 表 4 3 】

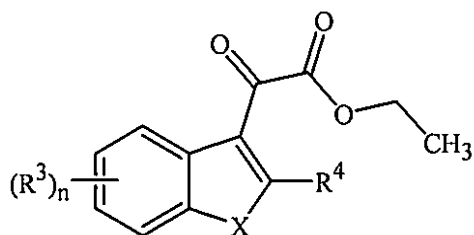
| 表 | 見出し | 表 | 見出し |
|-------|--------------------------------------|-------|--------------------------------------|
| 1289A | Pyrは、3-ピリジニルである。 | 1289F | Pyrは、3-ピリジニル(4-CH ₃)である。 |
| 1289B | Pyrは、4-ピリジニルである。 | 1289G | Pyrは、2-ピリジニル(3-Cl)である。 |
| 1289C | Pyrは、2-ピリジニル(3-CH ₃)である。 | 1289H | Pyrは、2-ピリジニル(4-Cl)である。 |
| 1289D | Pyrは、2-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | 1289I | Pyrは、3-ピリジニル(5-Cl)である。 |
| 1289E | Pyrは、3-ピリジニル(2-CH ₃)である。 | | |

10

【 0 1 5 0 】

第 1 2 9 0 表

【 化 1 8 】



20

【 0 1 5 1 】

【 表 4 4 】

X は、S であり、R¹ は、Me であり、R² は、Me である。

| (R ³) _n | R ⁴ | (R ³) _n | R ⁴ | (R ³) _n | R ⁴ |
|--------------------------------|----------------|--------------------------------|----------------|--------------------------------|----------------|
| — | H | — | Me | — | Et |
| 5-Me | H | 5-Me | Me | 5-Me | Et |
| 4,6-di-Me | H | 4,6-di-Me | Me | 4,6-di-Me | Et |
| 5,7-di-Me | H | 5,7-di-Me | Me | 5,7-di-Me | Et |

30

【 0 1 5 2 】

【 表 4 5 】

X は、S であり、R¹ は、Me であり、R² は、Et である。

| (R ³) _n | R ⁴ | (R ³) _n | R ⁴ | (R ³) _n | R ⁴ |
|--------------------------------|----------------|--------------------------------|----------------|--------------------------------|----------------|
| — | H | — | Me | — | Et |
| 5-Me | H | 5-Me | Me | 5-Me | Et |
| 4,6-di-Me | H | 4,6-di-Me | Me | 4,6-di-Me | Et |
| 5,7-di-Me | H | 5,7-di-Me | Me | 5,7-di-Me | Et |

40

【 0 1 5 3 】

【表 4 6】

X は、S であり、 R^1 は、Et であり、 R^2 は、Me である。

| $(R^3)_n$ | R^4 | $(R^3)_n$ | R^4 | $(R^3)_n$ | R^4 |
|-----------|-------|-----------|-------|-----------|-------|
| — | H | — | Me | — | Et |
| 5-Me | H | 5-Me | Me | 5-Me | Et |
| 4,6-di-Me | H | 4,6-di-Me | Me | 4,6-di-Me | Et |
| 5,7-di-Me | H | 5,7-di-Me | Me | 5,7-di-Me | Et |

10

【 0 1 5 4 】

【表 4 7】

X は、S であり、 R^1 は、Et であり、 R^2 は、Et である。

| $(R^3)_n$ | R^4 | $(R^3)_n$ | R^4 | $(R^3)_n$ | R^4 |
|-----------|-------|-----------|-------|-----------|-------|
| — | H | — | Me | — | Et |
| 5-Me | H | 5-Me | Me | 5-Me | Et |
| 4,6-di-Me | H | 4,6-di-Me | Me | 4,6-di-Me | Et |
| 5,7-di-Me | H | 5,7-di-Me | Me | 5,7-di-Me | Et |

20

【 0 1 5 5 】

【表 4 8】

X は、 $-\text{CH}=\text{CH}-$ であり、 R^1 は、Me であり、 R^2 は、Me である。

| $(R^3)_n$ | R^4 | $(R^3)_n$ | R^4 | $(R^3)_n$ | R^4 |
|-----------|-------|-----------|-------|-----------|-------|
| — | H | — | Me | — | Et |
| 5-Me | H | 5-Me | Me | 5-Me | Et |
| 4,6-di-Me | H | 4,6-di-Me | Me | 4,6-di-Me | Et |
| 5,7-di-Me | H | 5,7-di-Me | Me | 5,7-di-Me | Et |

30

【 0 1 5 6 】

【表 4 9】

X は、 $-\text{CH}=\text{CH}-$ であり、 R^1 は、Me であり、 R^2 は、Et である。

| $(R^3)_n$ | R^4 | $(R^3)_n$ | R^4 | $(R^3)_n$ | R^4 |
|-----------|-------|-----------|-------|-----------|-------|
| — | H | — | Me | — | Et |
| 5-Me | H | 5-Me | Me | 5-Me | Et |
| 4,6-di-Me | H | 4,6-di-Me | Me | 4,6-di-Me | Et |
| 5,7-di-Me | H | 5,7-di-Me | Me | 5,7-di-Me | Et |

40

【 0 1 5 7 】

【表 5 0】

X は、 $-\text{CH}=\text{CH}-$ であり、 R^1 は、Et であり、 R^2 は、Me である。

| $(\text{R}^3)_n$ | R^4 | $(\text{R}^3)_n$ | R^4 | $(\text{R}^3)_n$ | R^4 |
|------------------|--------------|------------------|--------------|------------------|--------------|
| — | H | — | Me | — | Et |
| 5-Me | H | 5-Me | Me | 5-Me | Et |
| 4,6-di-Me | H | 4,6-di-Me | Me | 4,6-di-Me | Et |
| 5,7-di-Me | H | 5,7-di-Me | Me | 5,7-di-Me | Et |

10

【 0 1 5 8 】

【表 5 1】

X は、 $-\text{CH}=\text{CH}-$ であり、 R^1 は、Et であり、 R^2 は、Et である。

| $(\text{R}^3)_n$ | R^4 | $(\text{R}^3)_n$ | R^4 | $(\text{R}^3)_n$ | R^4 |
|------------------|--------------|------------------|--------------|------------------|--------------|
| — | H | — | Me | — | Et |
| 5-Me | H | 5-Me | Me | 5-Me | Et |
| 4,6-di-Me | H | 4,6-di-Me | Me | 4,6-di-Me | Et |
| 5,7-di-Me | H | 5,7-di-Me | Me | 5,7-di-Me | Et |

20

【 0 1 5 9 】

【表 5 2】

X は、 $-\text{CH}=\text{CCl}-$ であり、 R^1 は、Et であり、 R^2 は、Me である。

| $(\text{R}^3)_n$ | R^4 | $(\text{R}^3)_n$ | R^4 | $(\text{R}^3)_n$ | R^4 |
|------------------|--------------|------------------|--------------|------------------|--------------|
| — | H | — | Me | — | Et |
| 5-Me | H | 5-Me | Me | 5-Me | Et |
| 4,6-di-Me | H | 4,6-di-Me | Me | 4,6-di-Me | Et |
| 5,7-di-Me | H | 5,7-di-Me | Me | 5,7-di-Me | Et |

30

【 0 1 6 0 】

【表 5 3】

X は、 $-\text{CH}=\text{CCl}-$ であり、 R^1 は、Et であり、 R^2 は、Et である。

| $(\text{R}^3)_n$ | R^4 | $(\text{R}^3)_n$ | R^4 | $(\text{R}^3)_n$ | R^4 |
|------------------|--------------|------------------|--------------|------------------|--------------|
| — | H | — | Me | — | Et |
| 5-Me | H | 5-Me | Me | 5-Me | Et |
| 4,6-di-Me | H | 4,6-di-Me | Me | 4,6-di-Me | Et |
| 5,7-di-Me | H | 5,7-di-Me | Me | 5,7-di-Me | Et |

40

【 0 1 6 1 】

【表 5 4】

X は、-CH=CF-であり、R¹ は、Me であり、R² は、Me である。

| (R ³) _n | R ⁴ | (R ³) _n | R ⁴ | (R ³) _n | R ⁴ |
|--------------------------------|----------------|--------------------------------|----------------|--------------------------------|----------------|
| — | H | — | Me | — | Et |
| 5-Me | H | 5-Me | Me | 5-Me | Et |
| 4,6-di-Me | H | 4,6-di-Me | Me | 4,6-di-Me | Et |
| 5,7-di-Me | H | 5,7-di-Me | Me | 5,7-di-Me | Et |

10

【 0 1 6 2 】

【表 5 5】

X は、-CH=CF-であり、R¹ は、Me であり、R² は、Et である。

| (R ³) _n | R ⁴ | (R ³) _n | R ⁴ | (R ³) _n | R ⁴ |
|--------------------------------|----------------|--------------------------------|----------------|--------------------------------|----------------|
| — | H | — | Me | — | Et |
| 5-Me | H | 5-Me | Me | 5-Me | Et |
| 4,6-di-Me | H | 4,6-di-Me | Me | 4,6-di-Me | Et |
| 5,7-di-Me | H | 5,7-di-Me | Me | 5,7-di-Me | Et |

20

【 0 1 6 3 】

【表 5 6】

X は、-CH=CF-であり、R¹ は、Et であり、R² は、Me である。

| (R ³) _n | R ⁴ | (R ³) _n | R ⁴ | (R ³) _n | R ⁴ |
|--------------------------------|----------------|--------------------------------|----------------|--------------------------------|----------------|
| — | H | — | Me | — | Et |
| 5-Me | H | 5-Me | Me | 5-Me | Et |
| 4,6-di-Me | H | 4,6-di-Me | Me | 4,6-di-Me | Et |
| 5,7-di-Me | H | 5,7-di-Me | Me | 5,7-di-Me | Et |

30

【 0 1 6 4 】

【表 5 7】

X は、-CH=CF-であり、R¹ は、Et であり、R² は、Et である。

| (R ³) _n | R ⁴ | (R ³) _n | R ⁴ | (R ³) _n | R ⁴ |
|--------------------------------|----------------|--------------------------------|----------------|--------------------------------|----------------|
| — | H | — | Me | — | Et |
| 5-Me | H | 5-Me | Me | 5-Me | Et |
| 4,6-di-Me | H | 4,6-di-Me | Me | 4,6-di-Me | Et |
| 5,7-di-Me | H | 5,7-di-Me | Me | 5,7-di-Me | Et |

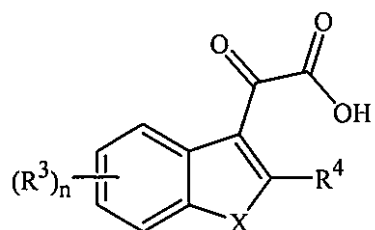
40

【 0 1 6 5 】

第 1 2 9 1 表

第 1 2 9 1 表は、構造を、

【化 19】



と置き換える以外は第 1290 表と同様の方式で構成される。

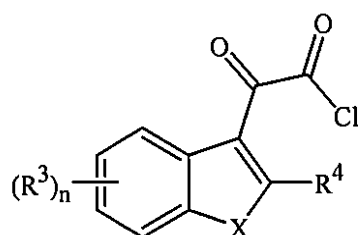
10

【0166】

第 1292 表

第 1292 表は、構造を、

【化 20】



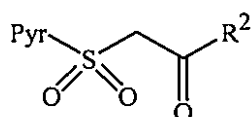
20

と置き換える以外は第 1291 表と同様の方式で構成される。

【0167】

第 1293 表

【化 21】

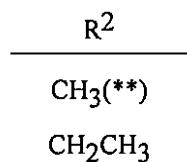


30

P y r は、2 - ピリジニルである。

【0168】

【表 58】



**¹H NMR については、合成例 1、工程 A を参照のこと。

40

【0169】

本開示は、第 1293 表の見出し（すなわち、P y r は、2 - ピリジニルである）を、以下のそれぞれの表について列挙した見出しと置き換えた、第 1293 A 表から第 1293 I 表に列挙する化合物も含む。

【0170】

【表 5 9】

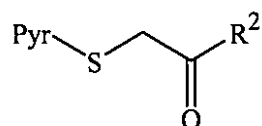
| 表 | 見出し | 表 | 見出し |
|-------|--------------------------------------|-------|--------------------------------------|
| 1293A | Pyrは、3-ピリジニルである。 | 1293F | Pyrは、3-ピリジニル(4-CH ₃)である。 |
| 1293B | Pyrは、4-ピリジニルである。 | 1293G | Pyrは、2-ピリジニル(3-Cl)である。 |
| 1293C | Pyrは、2-ピリジニル(3-CH ₃)である。 | 1293H | Pyrは、2-ピリジニル(4-Cl)である。 |
| 1293D | Pyrは、2-ピリジニル(4-CH ₃)である。 | 1293I | Pyrは、3-ピリジニル(5-Cl)である。 |
| 1293E | Pyrは、3-ピリジニル(2-CH ₃)である。 | | |

10

【0 1 7 1】

第 1 2 9 4 表

【化 2 2】

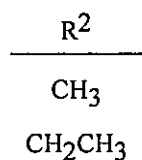


P y r は、2 - ピリジニルである。

【0 1 7 2】

20

【表 6 0】



【0 1 7 3】

本開示は、第 1 2 9 4 表の見出しを、以下のそれぞれの表について列挙した見出しと置き換えた、第 1 2 9 4 A 表から第 1 2 9 4 I 表に列挙する化合物も含む。

30

【0 1 7 4】

【表 6 1】

| 表 | 見出し |
|-------|--------------------------------------|
| 1294A | Pyrは、3-ピリジニルである。 |
| 1294B | Pyrは、4-ピリジニルである。 |
| 1294C | Pyrは、2-ピリジニル(3-CH ₃)である。 |
| 1294D | Pyrは、2-ピリジニル(4-CH ₃)である。 |
| 1294E | Pyrは、3-ピリジニル(2-CH ₃)である。 |
| 1294F | Pyrは、3-ピリジニル(4-CH ₃)である。 |
| 1294G | Pyrは、2-ピリジニル(3-Cl)である。 |
| 1294H | Pyrは、2-ピリジニル(4-Cl)である。 |
| 1294I | Pyrは、3-ピリジニル(5-Cl)である。 |

40

【0 1 7 5】

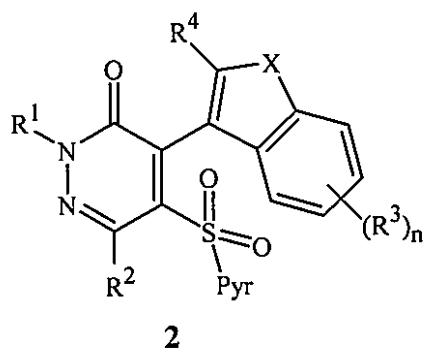
以下の略号は、次の索引表において使用される。M e は、メチルであり、「化合物 N o .」は、「化合物番号」であり、「E x .」は、「実施例」であり、どの実施例において化合物が製造されたかを示す数字が続く。

50

【 0 1 7 6 】

索引表 A

【 化 2 3 】



10

【 0 1 7 7 】

【 表 6 2 】

| 化合物 No. | R ¹ | R ² | (R ³) _n | R ⁴ | X | Pyr | NMR |
|-----------|----------------|----------------|--------------------------------|----------------|---------|---------|-----|
| 1 (Ex. 1) | Me | Me | - | | -CH=CF- | 2-ピリジニル | * |
| 2 (Ex. 2) | Me | Me | 5-Me | Me | S | 2-ピリジニル | ** |

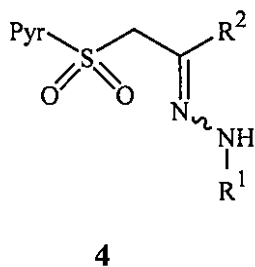
20

* ¹H NMRデータについては、合成例を参照のこと。

【 0 1 7 8 】

索引表 B

【 化 2 4 】



30

【 0 1 7 9 】

【 表 6 3 】

| 化合物 No. | R ¹ | R ² | Pyr | NMR |
|-----------|----------------|----------------|---------|-----|
| 3 (Ex. 1) | Me | Me | 2-ピリジニル | * |

* ¹H NMRデータについては、合成例を参照のこと。

40

フロントページの続き

- (72)発明者 カヌー・マガンバイ・ペテル
アメリカ合衆国テキサス州 77479 . シュガーランド . ラーマ・クリーク・コート 4227
- (72)発明者 トーマス・マーティン・スティーヴンソン
アメリカ合衆国デラウェア州 19702 . ニューアーク . イロクォイコート 103

審査官 早乙女 智美

- (56)参考文献 特開 2013 - 28582 (JP, A)
国際公開第 2012 / 033225 (WO, A1)
特開 2012 - 149044 (JP, A)
国際公開第 2004 / 099163 (WO, A1)
SOTELLO, E. et al., Pyridazines. Part XXIX: Synthesis and Platelet Aggregation Inhibition Activity of 5-Substituted-6-phenyl-3(2H)-pyridazinones. Novel Aspects of Their Biological Actions, Bioorganic & Medicinal Chemistry, 2002年, 10(9), pp. 2873-2882
BABICHEV, F. S. et al., 6-Amino-1-aryl-4-pyridazinones and their derivatives, Ukrainskii Khimicheskii Zhurnal (Russian Edition), 1983年, 49(11), pp. 1197-1202
- (58)調査した分野(Int.Cl., DB名)
C07D
CAPLUS / REGISTRY (STN)
CASREACT (STN)