

(12) 特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局



(43) 国際公開日
2010 年 3 月 11 日(11.03.2010)

(10) 国際公開番号
WO 2010/026989 A1

PCT

(51) 国際特許分類:

C07D 205/08 (2006.01)	C07D 213/64 (2006.01)
A01N 43/36 (2006.01)	C07D 221/20 (2006.01)
A01N 43/40 (2006.01)	C07D 223/10 (2006.01)
A01N 43/44 (2006.01)	C07D 239/06 (2006.01)
A01P 13/02 (2006.01)	C07D 239/10 (2006.01)
C07D 207/27 (2006.01)	C07D 243/04 (2006.01)
C07D 211/72 (2006.01)	C07D 491/044 (2006.01)
C07D 211/76 (2006.01)	

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 日産化学工業株式会社 (NISSAN CHEMICAL INDUSTRIES, LTD.) [JP/JP]; 〒1010054 東京都千代田区神田錦町3丁目7番地1 Tokyo (JP).

(72) 発明者: および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 工藤 隆生 (KUDOU, Takao) [JP/JP]; 〒2748507 千葉県船橋市坪井町722番地1 日産化学工業株式会社物質科学研究所内 Chiba (JP). 谷間 大輔 (TANI-MA, Daisuke) [JP/JP]; 〒2748507 千葉県船橋市坪井町722番地1 日産化学工業株式会社物質科学研究所内 Chiba (JP). 舩沢 禎英 (MA-SUZAWA, Yoshihide) [JP/JP]; 〒2748507 千葉県船橋市坪井町722番地1 日産化学工業株式会社物質科学研究所内 Chiba (JP). 矢野 哲彦 (YANO, Tetsuhiko) [JP/JP]; 〒3490294 埼玉県南埼玉郡白岡町大字白岡1470 日産化学工業株式会社 生物科学研究所内 Saitama (JP).

(21) 国際出願番号: PCT/JP2009/065343

(22) 国際出願日: 2009 年 9 月 2 日(02.09.2009)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:

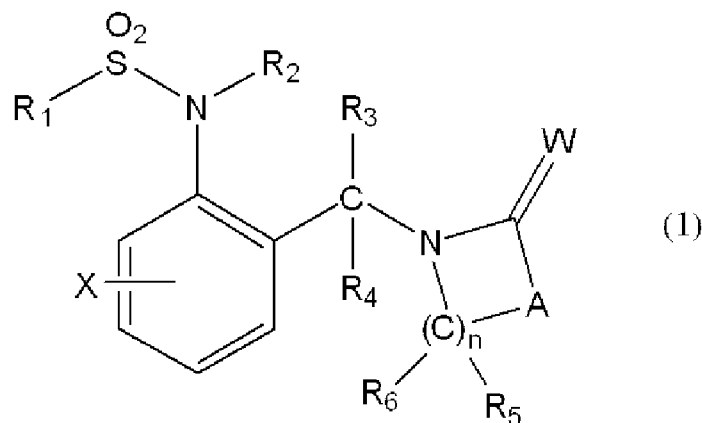
特願 2008-225137	2008 年 9 月 2 日(02.09.2008)	JP
特願 2008-260652	2008 年 10 月 7 日(07.10.2008)	JP
特願 2009-031818	2009 年 2 月 13 日(13.02.2009)	JP
特願 2009-066161	2009 年 3 月 18 日(18.03.2009)	JP
特願 2009-066163	2009 年 3 月 18 日(18.03.2009)	JP
特願 2009-149403	2009 年 6 月 24 日(24.06.2009)	JP

(74) 代理人: 泉名 謙治, 外 (SENMYO, Kenji et al.); 〒1010035 東京都千代田区神田紺屋町17番地 S I A 神田スクエア4階 Tokyo (JP).

[続葉有]

(54) Title: ORTHO-SUBSTITUTED HALOALKYLSULFONANILIDE DERIVATIVE AND HERBICIDE

(54) 発明の名称: オルト置換ハロアルキルスルホンアニリド誘導体及び除草剤



(57) Abstract: Disclosed is a novel herbicide. Specifically disclosed is a haloalkylsulfonanilide derivative represented by general formula (1) [wherein A represents $-\text{C}(\text{R}_7)(\text{R}_8)-$ or $-\text{N}(\text{R}_9)-$; W represents an oxygen atom or a sulfur atom; n represents an integer of 1 to 4; R_1 represents a halo- $\text{C}_1\text{-C}_6$ alkyl; R_2 represents a hydrogen atom, a $\text{C}_1\text{-C}_6$ alkyl, or the like; R_3 and R_4 independently represent a hydrogen atom, a $\text{C}_1\text{-C}_6$ alkyl, or the like; R_5 , R_6 , R_7 and R_8 independently represent a hydrogen atom, a halogen, a $\text{C}_1\text{-C}_6$ alkyl, or the like; R_9 represents a hydrogen atom, a $\text{C}_1\text{-C}_6$ alkyl, or the like; and X represents a halogen, a $\text{C}_1\text{-C}_6$ alkyl, or the like] or an agrichemically acceptable salt thereof.

(57) 要約: 新規除草剤を提供すること 一般式 (1): [〔式中、A は $-\text{C}(\text{R}_7)(\text{R}_8)-$ 又は $-\text{N}(\text{R}_9)-$ を表し、W は酸素原子又は硫黄原子を表し、n は 1 乃至 4 の整数を表し、 R_1 はハロ $\text{C}_1\text{-C}_6$ アルキルを表し、 R_2 は水素原子、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ アルキル等を表し、 R_3 及び R_4 はそれぞれ独立に、水素原子、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ アルキル等を表し、 R_5 、 R_6 、 R_7 及び R_8 はそれぞれ独立に、水素原子、ハロゲン、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ アルキル、等を表し、 R_9 は水素原子、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ アルキル等を表し、X は、ハロゲン、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ アルキル等を表す。〕で表されるハロアルキルスルホンアニリド誘導体又は農薬として許容されるその塩類。



WO 2010/026989 A1



(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PE, PG, PH, PL, PT, RO, RS, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.

(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ,

NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:

— 国際調査報告 (条約第 21 条(3))

明 細 書

発明の名称：

オルト置換ハロアルキルスルホンアニリド誘導体及び除草剤

技術分野

[0001] 本発明は、ハロアルキルスルホンアニリド誘導体、及びそれらを有効成分とする農薬、特に除草剤に関するものである。

背景技術

[0002] ある種のハロアルキルスルホンアニリド誘導体が除草活性を有することが知られている（例えば、特許文献1乃至3参照。）が、本発明に関わる4乃至7員環ラクタム-N-アルキル置換ハロアルキルスルホンアニリド構造、及び4乃至7員環ウレア-N-アルキル置換ハロアルキルスルホンアニリド構造に関しては、何ら開示されていない。

先行技術文献

特許文献

- [0003] 特許文献1：国際公開第04／011429号パンフレット
特許文献2：特開2008-74840号公報
特許文献3：国際公開第08／059948号パンフレット

発明の概要

発明が解決しようとする課題

[0004] 本発明の目的は、ハロアルキルスルホンアニリド誘導体、及び該化合物を有効成分とし、優れた効力を有する農薬、特に除草剤を提供することにある。

課題を解決するための手段

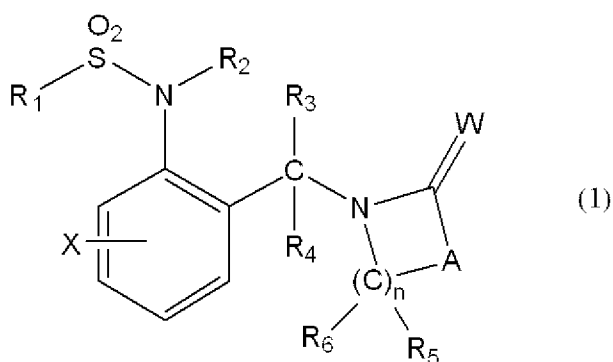
[0005] 本発明者は、上記の課題を解決すべく鋭意検討した結果、新規なハロアルキルスルホンアニリド誘導体を見出し、該化合物が除草活性及び作物への選択性を有することを見い出し、本発明を完成させた。

すなわち、本発明は、下記〔１〕～〔８〕に記載の化合物（以下、本発明化合物とも称する。）、下記〔９〕に記載の農薬、下記〔１０〕に記載の除草剤、並びに、下記〔１１〕及び〔１２〕に記載の製造中間体に関するものである。

[0006] 〔１〕一般式（１）で表されるハロアルキルスルホンアニリド誘導体又は農薬として許容されるその塩類

一般式（１）：

[0007] [化1]



〔式中、Aは—C(R₇)(R₈)—又は—N(R₉)—を表し、

Wは酸素原子又は硫黄原子を表し、

nは1乃至4の整数を表し、

R₁はハロC₁–C₆アルキルを表し、

R₂は水素原子、C₁–C₆アルキル、ハロC₁–C₆アルキル、C₂–C₆アルケニル、ハロC₂–C₆アルケニル、C₂–C₆アルキニル、ハロC₂–C₆アルキニル、C₁–C₆アルコキシC₁–C₆アルキル、ハロC₁–C₆アルコキシC₁–C₆アルキル、C₁–C₆アルコキシC₁–C₆アルコキシC₁–C₆アルキル、トリC₁–C₆アルキルシリルC₁–C₆アルコキシC₁–C₆アルキル、フェニルC₁–C₆アルキル、Yから選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニルC₁–C₆アルキル、C₁–C₁₂アルキルカルボニル、ハロC₁–C₁₂アルキルカルボニル、シクロC₃–C₆アルキルカルボニル、シクロC₃–C₆アルキルC₁–C₆アルキルカルボニル、C₂–C₆アルケニルカルボニル、フェニルカルボニル、Yから選択される1以上の置換基を有する置換フェニルカルボニル、複素環

カルボニル、Yから選択される1以上の置換基を有する置換複素環カルボニル、 C_1-C_{12} アルコキシカルボニル、ハロ C_1-C_{12} アルコキシカルボニル、 C_1-C_6 アルコキシ C_1-C_6 アルコキシカルボニル、 C_1-C_6 アルキルチオ C_1-C_6 アルコキシカルボニル、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル C_1-C_6 アルコキシカルボニル、 C_1-C_6 アルキルスルホニル C_1-C_6 アルコキシカルボニル、 C_2-C_6 アルケニルオキシカルボニル、ハロ C_2-C_6 アルケニルオキシカルボニル、 C_2-C_6 アルキニルオキシカルボニル、フェノキシカルボニル、Yから選択される1以上の置換基を有する置換フェノキシカルボニル、フェニル C_1-C_6 アルコキシカルボニル、Yから選択される1以上の置換基を有する置換フェニル C_1-C_6 アルコキシカルボニル、フェノキシ C_1-C_6 アルキルカルボニル、Yから選択される1以上の置換基を有する置換フェノキシ C_1-C_6 アルキルカルボニル、モノ(C_1-C_6 アルキル)アミノカルボニル、モノ(ハロ C_1-C_6 アルキル)アミノカルボニル、同一又は異なっても良いジ(C_1-C_6 アルキル)アミノカルボニル、同一又は異なっても良いハロジ(C_1-C_6 アルキル)アミノカルボニル、 C_1-C_6 アルキルチオカルボニル、ハロ C_1-C_6 アルキルチオカルボニル、 C_1-C_6 アルキルスルホニル、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル、フェニルスルホニル、Yから選択される1以上の置換基を有する置換フェニルスルホニル、 C_1-C_6 アルキルチオ C_1-C_6 アルキル、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ C_1-C_6 アルキル、フェニル C_1-C_6 アルコキシ C_1-C_6 アルキル、Yから選択される1以上の置換基を有する置換フェニル C_1-C_6 アルコキシ C_1-C_6 アルキル、フェニルチオ C_1-C_6 アルキル、Yから選択される1以上の置換基を有する置換フェニルチオ C_1-C_6 アルキル、フェニル C_1-C_6 アルキルチオ C_1-C_6 アルキル、Yから選択される1以上の置換基を有する置換フェニル C_1-C_6 アルキルチオ C_1-C_6 アルキル、フェニルスルホニル C_1-C_6 アルキル、Yから選択される1以上の置換基を有する置換フェニルスルホニル C_1-C_6 アルキル、フェニル C_1-C_6 アルキルスルホニル C_1-C_6 アルキル、Yから選択される1以上の置換基を有する置換フェニル C_1-C_6 アルキルスルホニル C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルキルカルボニルオキシ

C₁-C₆アルキル、フェニルカルボニルオキシC₁-C₆アルキル、Yから選択される1以上の置換基を有する置換フェニルカルボニルオキシC₁-C₆アルキル、フェニルカルボニルC₁-C₆アルキル、Yから選択される1以上の置換基を有する置換フェニルカルボニルC₁-C₆アルキル、C₁-C₆アルコキシカルボニルオキシC₁-C₆アルキル、フェニルカルボニルオキシC₁-C₆アルコキシC₁-C₆アルキル、Yから選択される1以上の置換基を有する置換フェニルカルボニルオキシC₁-C₆アルコキシC₁-C₆アルキル、モノC₁-C₆アルキルアミノカルボニルオキシC₁-C₆アルキル、同一又は異なっても良いジ(C₁-C₆アルキル)アミノカルボニルオキシC₁-C₆アルキル、フェニルアミノカルボニルオキシC₁-C₆アルキル、Yから選択される1以上の置換基を有する置換フェニルアミノカルボニルオキシC₁-C₆アルキル、C₁-C₆アルキル(フェニル)アミノカルボニルオキシC₁-C₆アルキル、Yから選択される1以上の置換基を有する置換C₁-C₆アルキル(フェニル)アミノカルボニルオキシC₁-C₆アルキル、C₁-C₆アルキルカルボニルC₁-C₆アルキル、C₁-C₆アルコキシカルボニルC₁-C₆アルキル、ハロC₁-C₆アルキルチオ、同一又は異なっても良いジ(C₁-C₆アルキル)アミノチオ又はシアノを表し、

R₃及びR₄はそれぞれ独立に、水素原子、C₁-C₆アルキル、ハロC₁-C₆アルキル、シクロC₃-C₆アルキル、ハロシクロC₃-C₆アルキル、C₁-C₆アルコキシ、ハロC₁-C₆アルコキシ、ハロゲン又はシアノを表し、又、R₃とR₄はお互い結合して3~7員環を形成することができ、

R₅、R₆、R₇及びR₈はそれぞれ独立に、水素原子、ハロゲン、C₁-C₆アルキル、ハロC₁-C₆アルキル、C₂-C₆アルケニル、C₂-C₆アルキニル、シクロC₃-C₆アルキル、ハロシクロC₃-C₆アルキル、C₁-C₆アルコキシC₁-C₆アルキル、ハロC₁-C₆アルコキシC₁-C₆アルキル、ヒドロキシC₁-C₆アルキル、C₁-C₆アルキルチオC₁-C₆アルキル、ハロC₁-C₆アルキルチオC₁-C₆アルキル、モノ(C₁-C₆アルキル)アミノC₁-C₆アルキル、同一又は異なっても良いジ(C₁-C₆アルキル)アミノC₁-C₆ア

ルキル、フェニル、Yから選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニル、複素環、Yから選択される1以上の置換基を環上に有する置換複素環、フェニルC₁-C₆アルキル、Yから選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニルC₁-C₆アルキル、フェノキシC₁-C₆アルキル、Yから選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェノキシC₁-C₆アルキル、C₁-C₆アルキルカルボニル、ハロC₁-C₆アルキルカルボニル、フェニルカルボニル、Yから選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニルカルボニル、C₁-C₆アルコキシカルボニル、ハロC₁-C₆アルコキシカルボニル、カルボキシル、モノ(C₁-C₆アルキル)アミノカルボニル、同一又は異なっているいても良いジ(C₁-C₆アルキル)アミノカルボニル、フェニルアミノカルボニル、Yから選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニルアミノカルボニル、フェニルC₁-C₆アルキルアミノカルボニル、Yから選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニルC₁-C₆アルキルアミノカルボニル、C₁-C₆アルコキシ、ハロC₁-C₆アルコキシ、フェノキシ、Yから選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェノキシ、C₁-C₆アルキルチオ、ハロC₁-C₆アルキルチオ、フェニルチオ、Yから選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニルチオ、C₁-C₆アルキルスルホニル、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル、モノ(C₁-C₆アルキル)アミノ、ジ(C₁-C₆アルキル)アミノ、C₁-C₆アルキルカルボニルオキシ、水酸基、アミノ、シアノ又はニトロを表し、

R₉は水素原子、C₁-C₆アルキル、ハロC₁-C₆アルキル、シクロC₃-C₆アルキル、ハロシクロC₃-C₆アルキル、C₂-C₆アルケニル、ハロC₂-C₆アルケニル、C₂-C₆アルキニル、C₁-C₆アルコキシC₁-C₆アルキル、ハロC₁-C₆アルコキシC₁-C₆アルキル、ヒドロキシC₁-C₆アルキル、シクロC₃-C₆アルキルC₁-C₆アルキル、フェニルC₁-C₆アルキル、Yから選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニルC₁-C₆アルキル、フェニル、Yから選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニル、フェノキシC₁-C₆アルキル、Yから選択される1以上の置換基を環上に有する置

換フェノキシC₁-C₆アルキル、C₁-C₆アルキルカルボニルC₁-C₆アルキル、ハロC₁-C₆アルキルカルボニルC₁-C₆アルキル、C₁-C₆アルコキシカルボニルC₁-C₆アルキル、ハロC₁-C₆アルコキシカルボニルC₁-C₆アルキル、C₁-C₆アルキルカルボニル、ハロC₁-C₆アルキルカルボニル、シクロC₃-C₆アルキルカルボニル、シクロC₃-C₆アルキルC₁-C₆アルキルカルボニル、C₂-C₆アルケニルカルボニル、フェニルカルボニル、Yから選択される1以上の置換基を有する置換フェニルカルボニル、複素環カルボニル、Yから選択される1以上の置換基を有する置換複素環カルボニル、C₁-C₆アルコキシカルボニル、ハロC₁-C₆アルコキシカルボニル、フェノキシカルボニル、Yから選択される1以上の置換基を有する置換フェノキシカルボニル、アミノカルボニル、モノ(C₁-C₆アルキル)アミノカルボニル、モノハロ(C₁-C₆アルキル)アミノカルボニル、同一又は異なっても良いジ(C₁-C₆アルキル)アミノカルボニル、同一又は異なっても良いハロジ(C₁-C₆アルキル)アミノカルボニル、C₁-C₆アルキルチオカルボニル、ハロC₁-C₆アルキルチオカルボニル、C₁-C₆アルキルスルホニル、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル、フェニルスルホニル、Yから選択される1以上の置換基を有する置換フェニルスルホニル、C₁-C₆アルキルチオC₁-C₆アルキル、ハロC₁-C₆アルキルチオC₁-C₆アルキル、フェニルチオC₁-C₆アルキル、Yから選択される1以上の置換基を有する置換フェニルチオC₁-C₆アルキル、C₁-C₆アルキルスルフィニルC₁-C₆アルキル、ハロC₁-C₆アルキルスルフィニルC₁-C₆アルキル、フェニルスルフィニルC₁-C₆アルキル、Yから選択される1以上の置換基を有する置換フェニルスルフィニルC₁-C₆アルキル、C₁-C₆アルキルスルホニルC₁-C₆アルキル、ハロC₁-C₆アルキルスルホニルC₁-C₆アルキル、フェニルスルホニルC₁-C₆アルキル、Yから選択される1以上の置換基を有する置換フェニルスルホニルC₁-C₆アルキル、シアノ、アミノ又は水酸基を表し、

又、同一炭素上のR₅、R₆、R₇及びR₈はお互い結合して、酸素原子、硫黄原子又は窒素原子(該窒素原子はC₁-C₆アルキル、C₂-C₆アルケニル、

C₂-C₆アルキニル又はシクロC₃-C₆アルキルによって置換されていても良い。)から選択される1又は2のヘテロ原子により中断されていても良く、任意に置換されていても良い3~7員環を形成すること、及びオレフィン又はカルボニルを形成することができ、

さらにR₅、R₆、R₇、R₈及びR₉は異なった炭素上のR₅、R₆、R₇又はR₈と結合して、酸素原子、硫黄原子又は窒素原子(該窒素原子はC₁-C₆アルキル、C₂-C₆アルケニル、C₂-C₆アルキニル又はシクロC₃-C₆アルキルによって置換されていても良い。)から選択される1又は2のヘテロ原子により中断されていても良く、任意に置換されていても良い3~8員環を形成することができ、

またR₅及びR₆は隣り合った炭素上のR₅又はR₆と一緒に結合を表すことができ、

n=2乃至4の場合、R₅及びR₆は隣り合ったR₅又はR₆と同一でも異なっても良く、

Xは、ハロゲン、C₁-C₆アルキル、C₂-C₆アルケニル、C₂-C₆アルキニル、シクロC₃-C₆アルキル、ハロC₁-C₆アルキル、ハロシクロC₃-C₆アルキル、C₁-C₆アルコキシ、ハロC₁-C₆アルコキシ、C₁-C₆アルキルチオ、ハロC₁-C₆アルキルチオ、C₁-C₆アルキルスルフィニル、ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル、C₁-C₆アルキルスルホニル、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル、フェニル、Yから選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニル、複素環、Yから選択される1以上の置換基を環上に有する置換複素環、フェノキシ、Yから選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェノキシ、フェニルチオ、Yから選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニルチオ、フェニルスルフィニル、Yから選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニルスルフィニル、フェニルスルホニル、Yから選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニルスルホニル、C₁-C₆アルキルカルボニル、ハロC₁-C₆アルキルカルボニル、フェニルカルボニル、Yから選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニルカル

ルボニル、 C_1-C_6 アルコキシカルボニル、ハロ C_1-C_6 アルコキシカルボニル、カルボキシル、モノ (C_1-C_6 アルキル) アミノカルボニル、モノハロ (C_1-C_6 アルキル) アミノカルボニル、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6 アルキル) アミノカルボニル、同一又は異なっても良いハロジ (C_1-C_6 アルキル) アミノカルボニル、フェニルアミノカルボニル、 Y から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニルアミノカルボニル、フェニル C_1-C_6 アルキルアミノカルボニル、 Y から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニル C_1-C_6 アルキルアミノカルボニル、水酸基、アミノ、シアノ又はニトロを表し、

前記 Y はハロゲン、 C_1-C_6 アルキル、 C_2-C_6 アルケニル、 C_2-C_6 アルキニル、シクロ C_3-C_6 アルキル、ハロ C_1-C_6 アルキル、ハロシクロ C_3-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルコキシ、ハロ C_1-C_6 アルコキシ、 C_1-C_6 アルキルチオ、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル、 C_1-C_6 アルキルスルホニル、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル、フェニル、(ハロゲン、 C_1-C_6 アルキル、 C_2-C_6 アルケニル、 C_2-C_6 アルキニル、シクロ C_3-C_6 アルキル、ハロ C_1-C_6 アルキル、ハロシクロ C_3-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルコキシ、ハロ C_1-C_6 アルコキシ、 C_1-C_6 アルキルチオ、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル、 C_1-C_6 アルキルスルホニル、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル、 C_1-C_6 アルキルカルボニル、ハロ C_1-C_6 アルキルカルボニル、 C_1-C_6 アルコキシカルボニル、カルボキシル、モノ (C_1-C_6 アルキル) アミノカルボニル、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6 アルキル) アミノカルボニル、水酸基、アミノ、シアノ及びニトロ) からなる群から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル、複素環、(ハロゲン、 C_1-C_6 アルキル、 C_2-C_6 アルケニル、 C_2-C_6 アルキニル、シクロ C_3-C_6 アルキル、ハロ C_1-C_6 アルキル、ハロシクロ C_3-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルコキシ、ハロ C_1-C_6 アルコキシ、 C_1-C_6 アルキルチオ、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル、ハロ C_1-C_6

アルキルスルフィニル、 C_1-C_6 アルキルスルホニル、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル、 C_1-C_6 アルキルカルボニル、ハロ C_1-C_6 アルキルカルボニル、 C_1-C_6 アルコキシカルボニル、カルボキシル、モノ (C_1-C_6 アルキル) アミノカルボニル、同一又は異なっているいても良いジ (C_1-C_6 アルキル) アミノカルボニル、水酸基、アミノ、シアノ及びニトロ) からなる群から選択される 1 以上の置換基を有する置換複素環、フェノキシ、(ハロゲン、 C_1-C_6 アルキル、 C_2-C_6 アルケニル、 C_2-C_6 アルキニル、シクロ C_3-C_6 アルキル、ハロ C_1-C_6 アルキル、ハロシクロ C_3-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルコキシ、ハロ C_1-C_6 アルコキシ、 C_1-C_6 アルキルチオ、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル、 C_1-C_6 アルキルスルホニル、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル、 C_1-C_6 アルキルカルボニル、ハロ C_1-C_6 アルキルカルボニル、 C_1-C_6 アルコキシカルボニル、カルボキシル、モノ (C_1-C_6 アルキル) アミノカルボニル、同一又は異なっているいても良いジ (C_1-C_6 アルキル) アミノカルボニル、水酸基、アミノ、シアノ及びニトロ) からなる群から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェノキシ、フェニルチオ、(ハロゲン、 C_1-C_6 アルキル、 C_2-C_6 アルケニル、 C_2-C_6 アルキニル、シクロ C_3-C_6 アルキル、ハロ C_1-C_6 アルキル、ハロシクロ C_3-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルコキシ、ハロ C_1-C_6 アルコキシ、 C_1-C_6 アルキルチオ、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル、 C_1-C_6 アルキルスルホニル、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル、 C_1-C_6 アルキルカルボニル、ハロ C_1-C_6 アルキルカルボニル、 C_1-C_6 アルコキシカルボニル、カルボキシル、モノ (C_1-C_6 アルキル) アミノカルボニル、同一又は異なっているいても良いジ (C_1-C_6 アルキル) アミノカルボニル、水酸基、アミノ、シアノ及びニトロ) からなる群から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニルチオ、フェニルスルフィニル、(ハロゲン、 C_1-C_6 アルキル、 C_2-C_6 アルケニル、 C_2-C_6 アルキニル、シクロ C_3-C_6 アルキル、ハロ C_1-C_6 アルキル、ハロシクロ C_3-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルコキシ、ハロ C_1-C_6 アルコキシ

シ、 C_1-C_6 アルキルチオ、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル、 C_1-C_6 アルキルスルホニル、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル、 C_1-C_6 アルキルカルボニル、ハロ C_1-C_6 アルキルカルボニル、 C_1-C_6 アルコキシカルボニル、カルボキシル、モノ（ C_1-C_6 アルキル）アミノカルボニル、同一又は異なっても良いジ（ C_1-C_6 アルキル）アミノカルボニル、水酸基、アミノ、シアノ及びニトロ）からなる群から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルスルフィニル、フェニルスルホニル、（ハロゲン、 C_1-C_6 アルキル、 C_2-C_6 アルケニル、 C_2-C_6 アルキニル、シクロ C_3-C_6 アルキル、ハロ C_1-C_6 アルキル、ハロシクロ C_3-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルコキシ、ハロ C_1-C_6 アルコキシ、 C_1-C_6 アルキルチオ、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル、 C_1-C_6 アルキルスルホニル、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル、 C_1-C_6 アルキルカルボニル、ハロ C_1-C_6 アルキルカルボニル、 C_1-C_6 アルコキシカルボニル、カルボキシル、モノ（ C_1-C_6 アルキル）アミノカルボニル、同一又は異なっても良いジ（ C_1-C_6 アルキル）アミノカルボニル、水酸基、アミノ、シアノ及びニトロ）からなる群から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルスルホニル、 C_1-C_6 アルキルカルボニル、ハロ C_1-C_6 アルキルカルボニル、フェニルカルボニル、（ハロゲン、 C_1-C_6 アルキル、 C_2-C_6 アルケニル、 C_2-C_6 アルキニル、シクロ C_3-C_6 アルキル、ハロ C_1-C_6 アルキル、ハロシクロ C_3-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルコキシ、ハロ C_1-C_6 アルコキシ、 C_1-C_6 アルキルチオ、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル、 C_1-C_6 アルキルスルホニル、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル、 C_1-C_6 アルキルカルボニル、ハロ C_1-C_6 アルキルカルボニル、 C_1-C_6 アルコキシカルボニル、カルボキシル、モノ（ C_1-C_6 アルキル）アミノカルボニル、同一又は異なっても良いジ（ C_1-C_6 アルキル）アミノカルボニル、水酸基、アミノ、シアノ及びニトロ）からなる群から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルカルボニル、

C₁-C₆アルコキシカルボニル、カルボキシル、モノ (C₁-C₆アルキル) アミノカルボニル、同一又は異なっても良いジ (C₁-C₆アルキル) アミノカルボニル、フェニルアミノカルボニル、(ハロゲン、C₁-C₆アルキル、C₂-C₆アルケニル、C₂-C₆アルキニル、シクロC₃-C₆アルキル、ハロC₁-C₆アルキル、ハロシクロC₃-C₆アルキル、C₁-C₆アルコキシ、ハロC₁-C₆アルコキシ、C₁-C₆アルキルチオ、ハロC₁-C₆アルキルチオ、C₁-C₆アルキルスルフィニル、ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル、C₁-C₆アルキルスルホニル、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル、C₁-C₆アルキルカルボニル、ハロC₁-C₆アルキルカルボニル、C₁-C₆アルコキシカルボニル、カルボキシル、モノ (C₁-C₆アルキル) アミノカルボニル、同一又は異なっても良いジ (C₁-C₆アルキル) アミノカルボニル、水酸基、アミノ、シアノ及びニトロ) からなる群から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニルアミノカルボニル、フェニルC₁-C₆アルキルアミノカルボニル、(ハロゲン、C₁-C₆アルキル、C₂-C₆アルケニル、C₂-C₆アルキニル、シクロC₃-C₆アルキル、ハロC₁-C₆アルキル、ハロシクロC₃-C₆アルキル、C₁-C₆アルコキシ、ハロC₁-C₆アルコキシ、C₁-C₆アルキルチオ、ハロC₁-C₆アルキルチオ、C₁-C₆アルキルスルフィニル、ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル、C₁-C₆アルキルスルホニル、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル、C₁-C₆アルキルカルボニル、ハロC₁-C₆アルキルカルボニル、C₁-C₆アルコキシカルボニル、カルボキシル、モノ (C₁-C₆アルキル) アミノカルボニル、同一又は異なっても良いジ (C₁-C₆アルキル) アミノカルボニル、水酸基、アミノ、シアノ及びニトロ) からなる群から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニルC₁-C₆アルキルアミノカルボニル、水酸基、アミノ、シアノ又はニトロを表すか、又は、

Y は、ベンゼン環又は複素環上の隣接する炭素原子若しくは窒素原子と一緒にあって、酸素原子、硫黄原子及び窒素原子 (該窒素原子はC₁-C₆アルキル、C₂-C₆アルケニル、C₂-C₆アルキニル又はシクロC₃-C₆アルキルによって置換されていても良い。) から選択される 1 又は 2 のヘテロ原子によ

り中断されていても良い C_1-C_4 アルキレン、ハロ C_1-C_4 アルキレン、 C_2-C_4 アルケニレン又はハロ C_2-C_4 アルケニレンにより5又は6員環を形成していても良く、

前記複素環はチエニル、フリル、ピロリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、イソオキサゾリニル、チアゾリル、イソチアゾリル、ピラゾリル、イミダゾリル、1, 3, 4-オキサジアゾリル、1, 2, 4-オキサジアゾリル、1, 3, 4-チアジアゾリル、1, 2, 4-チアジアゾリル、1, 2, 4-トリアゾリル、1, 2, 3-チアジアゾリル、1, 2, 3-トリアゾリル、1, 2, 3, 4-テトラゾリル、ピリジル、ピリミジニル、ピラジニル、ピリダジニル、1, 3, 5-トリアジニル、1, 2, 4-トリアジニル、ベンゾチエニル、ベンゾフリル、インドリル、ベンゾチアゾリル、ベンゾイミダゾリル、ベンゾイソオキサゾリル、ベンゾイソチアゾリル、インダゾリル、ベンゾオキサゾリル、キノリル、イソキノリル、キノキサリニル、フタラジニル、シンノリニル又はキナゾリニルであり、

尚、上記のいずれかの基が2以上の置換基を有する場合には、これらの置換基は、同一でも又は異なっても良い。]

[2] n が3又は4である前記[1]に記載のハロアルキルスルホンアニリド誘導体又は農薬として許容されるその塩類。

[3] A が $-C(R_7)(R_8)-$ である前記[1]に記載のハロアルキルスルホンアニリド誘導体又は農薬として許容されるその塩類。

[4] n が1である前記[3]に記載のハロアルキルスルホンアニリド誘導体又は農薬として許容されるその塩類。

[5] n が2である前記[3]に記載のハロアルキルスルホンアニリド誘導体又は農薬として許容されるその塩類。

[6] n が3である前記[3]に記載のハロアルキルスルホンアニリド誘導体又は農薬として許容されるその塩類。

[7] n が4である前記[3]に記載のハロアルキルスルホンアニリド誘導体又は農薬として許容されるその塩類。

〔 8 〕 R_3 及び R_4 が水素原子である前記〔 1 〕～〔 7 〕のいずれかに記載のハロアルキルスルホンアニリド誘導体又は農薬として許容されるその塩類。

〔 9 〕 前記〔 1 〕～〔 8 〕のいずれかに記載のハロアルキルスルホンアニリド誘導体又は農薬として許容されるその塩を有効成分として含有する農薬。

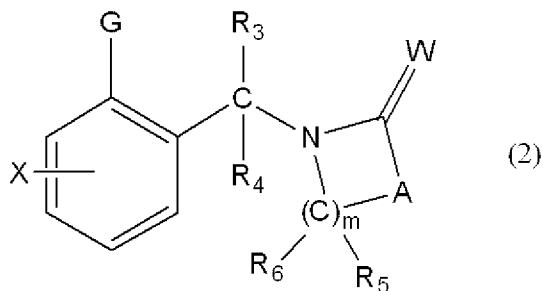
〔 10 〕 前記〔 1 〕～〔 8 〕のいずれかに記載のハロアルキルスルホンアニリド誘導体又は農薬として許容されるその塩を有効成分として含有する除草剤。

〔 11 〕

一般式（ 2 ）で表される製造中間体。

一般式（ 2 ）：

[0008] [化2]



〔式中、 A 、 W 、 R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 及び X は上記と同じ意味を表し、 m は3又は4の整数を表し、

G はアミノ又はニトロを表し、

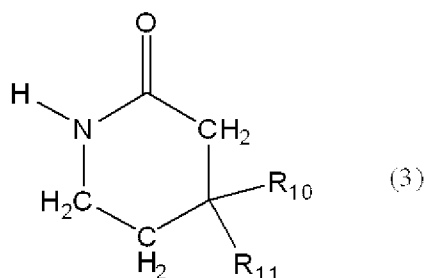
尚、 A が $-C(R_7)(R_8)-$ の場合、 R_5 、 R_6 、 R_7 及び R_8 の中の少なくとも1つは水素原子ではない。〕

〔 12 〕 一般式（ 3 ）で表される製造中間体。

一般式（ 3 ）：

[0009]

[化3]



〔式中、 R_{10} 及び R_{11} はお互い結合して、酸素原子、硫黄原子又は窒素原子（該窒素原子は C_1-C_6 アルキル、 C_2-C_6 アルケニル、 C_2-C_6 アルキニル又はシクロ C_3-C_6 アルキルによって置換されていても良い。）から選択される1又は2のヘテロ原子により中断されていても良く、任意に置換されていても良い3～7員環を形成する C_1-C_6 アルキレン。〕

[0010] また、本発明化合物及び農薬として許容されるその塩は、ある種の除草剤との混合剤の形態で使用するにより、その除草剤との相乗的除草効果を奏する。

発明の効果

[0011] 本発明のハロアルキルスルホンアニリド誘導体は、優れた除草効果を奏し、水田、畑地及び果樹園等の農園芸分野において有用である。

発明を実施するための形態

[0012] 本発明化合物が1個又は2個以上の不斉炭素原子を有する場合には、本発明は全ての光学活性体、ラセミ体又はジアステレオマーを包含する。

[0013] 次にA、W、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 、 R_7 、 R_8 、 R_9 、n及びXの範囲を例示する。

Aの範囲として、例えば下記の各群が挙げられる。

即ち、A I : $-C(R_7)(R_8)-$ 、

A II : $-N(R_9)-$ 。

Wの範囲として、例えば下記の各群が挙げられる。

即ち、W I : 酸素原子、

WII : 硫黄原子。

R_1 の範囲として、例えば下記の各群が挙げられる。

即ち、 R_{1I} : トリフルオロメチル、

R_{1II} : ハロ C_1-C_6 アルキル。

R_2 の範囲として、例えば下記の各群が挙げられる。

即ち、 R_{2I} : 水素原子、 C_1-C_{12} アルキルカルボニル、ハロ C_1-C_{12} アルキルカルボニル、 C_2-C_6 アルケニルカルボニル、フェニルカルボニル、 Y から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニルカルボニル、 C_1-C_{12} アルコキシカルボニル、ハロ C_1-C_{12} アルコキシカルボニル、 C_2-C_6 アルケニルオキシカルボニル、フェノキシカルボニル、 C_1-C_6 アルキルチオカルボニル又はハロ C_1-C_6 アルキルチオカルボニル、

R_{2II} : C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルコキシ C_1-C_6 アルキル、フェニル C_1-C_6 アルキル、 Y から選択される 1 以上の置換基を環上に有する置換フェニル C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルキルチオ C_1-C_6 アルキル、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ C_1-C_6 アルキル、フェノキシ C_1-C_6 アルキル又は C_1-C_6 アルキルカルボニルオキシ C_1-C_6 アルキル、

R_{2III} : C_1-C_6 アルキルスルホニル、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル、フェニルスルホニル又は Y から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニルスルホニル。

[0014] R_3 の範囲として、例えば下記の各群が挙げられる。

即ち、 R_{3I} : 水素原子、

R_{3II} : C_1-C_6 アルキル、ハロ C_1-C_6 アルキル、 C_3-C_6 シクロアルキル、ハロ C_3-C_6 シクロアルキル、 C_1-C_6 アルコキシ、ハロ C_1-C_6 アルコキシ、ハロゲン又はシアノ。

[0015] R_4 の範囲として、例えば下記の各群が挙げられる。

即ち、 R_{4I} : 水素原子、

R_{4II} : C_1-C_6 アルキル、ハロ C_1-C_6 アルキル、 C_3-C_6 シクロアルキル、ハロ C_3-C_6 シクロアルキル、 C_1-C_6 アルコキシ、ハロ C_1-C_6 アルコキシ

、ハロゲン又はシアノ。

[0016] R_5 、 R_6 、 R_7 及び R_8 の範囲として、例えば下記の各群が挙げられる。

即ち、 R_5 I、 R_6 I、 R_7 I又は R_8 I：水素原子、 C_1-C_6 アルキル、 C_2-C_6 アルケニル、 C_2-C_6 アルキニル、シクロ C_3-C_6 アルキル、ハロ C_1-C_6 アルキル、ハロシクロ C_3-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルコキシ C_1-C_6 アルキル、ハロ C_1-C_6 アルコキシ C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルキルチオ C_1-C_6 アルキル又はハロ C_1-C_6 アルキルチオ C_1-C_6 アルキル、

R_5 II、 R_6 II、 R_7 II又は R_8 II：フェニル又はYから選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニル、

R_5 III、 R_6 III、 R_7 III又は R_8 III：ハロゲン、 C_1-C_6 アルコキシ、 C_1-C_6 アルキルチオ、水酸基、アミノ、シアノ又はニトロ、

R_5 IV、 R_6 IV、 R_7 IV又は R_8 IV： C_1-C_6 アルキルカルボニル、ハロ C_1-C_6 アルキルカルボニル、フェニルカルボニル、Yから選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニルカルボニル又は C_1-C_6 アルコキシカルボニル。

[0017] R_9 の範囲として、例えば下記の各群が挙げられる。

即ち、 R_9 I：水素原子、 C_1-C_6 アルキル、ハロ C_1-C_6 アルキル、シクロ C_3-C_6 アルキル、ハロシクロ C_3-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルコキシ C_1-C_6 アルキル、ハロ C_1-C_6 アルコキシ C_1-C_6 アルキル、フェニル C_1-C_6 アルキル、Yから選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニル C_1-C_6 アルキル、フェニル又はYから選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニル、

R_9 II： C_1-C_6 アルキルカルボニル、ハロ C_1-C_6 アルキルカルボニル、シクロ C_3-C_6 アルキルカルボニル、シクロ C_3-C_6 アルキル C_1-C_6 アルキルカルボニル、フェニルカルボニル、Yから選択される1以上の置換基を有する置換フェニルカルボニル、 C_1-C_6 アルコキシカルボニル、ハロ C_1-C_6 アルコキシカルボニル、フェノキシカルボニル又はYから選択される1以上の置換基を有する置換フェノキシカルボニル、 R_9 III： C_1-C_6 アルキルスルホ

ニル、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル、フェニルスルホニル、 Y から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニルスルホニル。

[0018] n の範囲として、例えば下記の各群が挙げられる。

即ち、 nI : 3 又は 4、

nII : 1 又は 2。

[0019] X の範囲として、例えば下記の各群が挙げられる。

即ち、 XI : 水素原子、 XII : ハロゲン、 C_1-C_6 アルコキシ、ハロ C_1-C_6 アルコキシ、 C_1-C_6 アルキルチオ、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ、フェノキシ、同一又は異なっても良く、 Y から選択される 1 以上の置換基を環上に有する置換フェノキシ、フェニルチオ、同一又は異なっても良く、 Y から選択される 1 以上の置換基を環上に有する置換フェニルチオ、水酸基、アミノ、シアノ又はニトロ、

$XIII$: C_1-C_6 アルキル、シクロ C_3-C_6 アルキル、ハロ C_1-C_6 アルキル、ハロシクロ C_3-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルコキシ C_1-C_6 アルキル又はハロ C_1-C_6 アルコキシ C_1-C_6 アルキル、

XIV : C_1-C_6 アルキルカルボニル、ハロ C_1-C_6 アルキルカルボニル、フェニルカルボニル、同一又は異なっても良く、 Y から選択される 1 以上の置換基を環上に有する置換フェニルカルボニル又は C_1-C_6 アルコキシカルボニル

XV : フェニル、同一又は異なっても良く、 Y から選択される 1 以上の置換基を環上に有する置換フェニル、複素環又は同一又は異なっても良く、 Y から選択される 1 以上の置換基を環上に有する置換複素環。

[0020] 上記の各置換基の範囲を示す各群は、それぞれ任意に組み合わせることができ、それぞれ本発明化合物の範囲を表す。各置換基の範囲の組み合わせの例を、第 1 表に示す。但し、第 1 表の組み合わせは例示のためのものであって、本発明はこれらのみ限定されるものではない。

[0021] [第 1 表]

$R_3=R_3I$ 、 $R_4=R_4I$ 、 $R_6=R_6I$ 、 $R_8=R_8I$

W	A	R ₁	R ₂	R ₅	R ₇	R ₉	X	n
W	A	R ₁	R ₂	R ₅	R ₇	—	X	n
W	A	R ₁	R ₂	R ₅	R ₇	—	X	n
W	A	R ₁	R ₂	R ₅	R ₇	—	X	n
W	A	R ₁	R ₂	R ₅	R ₇	—	X V	n
W	A	R ₁	R ₂	R ₅	R ₇	—	XV	n
W	A	R ₁	R ₂	R ₅	R ₇	—	X	n
W	A	R ₁	R ₂	R ₅	R ₇	—	X	n
W	A	R ₁	R ₂	R ₅	R ₇	—	X	n
W	A	R ₁	R ₂	R ₅	R ₇ IV	—	X	n
W	A	R ₁	R ₂	R ₅	R ₇	—	X	n
W	A	R ₁	R ₂	R ₅	R ₇	—	X	n
W	A	R ₁	R ₂	R ₅ IV	R ₇	—	X	n
W	A	R ₁	R ₂	R ₅	R ₇	—	X	n
W	A	R ₁	R ₂	R ₅	R ₇	—	X	n
W	A	R ₁	R ₂	R ₅	R ₇	—	X	n
W	A	R ₁	R ₂	R ₅	—	R ₉	X	n
W	A	R ₁	R ₂	R ₅	—	R ₉	X	n
W	A	R ₁	R ₂	R ₅	—	R ₉	X	n
W	A	R ₁	R ₂	R ₅	—	R ₉	X	n
W	A	R ₁	R ₂	R ₅	—	R ₉	X	n
W	A	R ₁	R ₂	R ₅	—	R ₉	X	n
W	A	R ₁	R ₂	R ₅	—	R ₉	X	n
W	A	R ₁	R ₂	R ₅	R ₇	—	X	n
W	A	R ₁	R ₂	R ₅	—	R ₉	X	n

[0022] 次に R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 、 R_7 、 R_8 、 R_9 、 R_{10} 、 R_{11} 、 X 及び Y の定義における各原子及び基の例を示す。

尚、本明細書における以下の記号は下記の意味を表す。

i : イソ、s : セカンダリー、t : ターシャリー、c : シクロ、p : パラ。

[0023] 複素環基は以下の意味を表す。即ち、チエニルとしてはチオフェン-2-イル又はチオフェン-3-イルであり、フリルはフラン-2-イル又はフラン-3-イルであり、ピロリルはピロール-1-イル、ピロール-2-イル又はピロール-3-イルであり、オキサゾリルはオキサゾール-2-イル、オキサゾール-4-イル又はオキサゾール-5-イルであり、イソオキサゾリルはイソオキサゾール-3-イル、イソオキサゾール-4-イル又はイソオキサゾール-5-イルであり、イソオキサゾリニルはイソオキサゾリン-3-イル、イソオキサゾリン-4-イル又はイソオキサゾリン-5-イルであり、チアゾリルはチアゾール-2-イル、チアゾール-4-イル又はチアゾール-5-イルであり、イソチアゾリルはイソチアゾール-3-イル、イソチアゾール-4-イル又はイソチアゾール-5-イルであり、ピラゾリルはピラゾール-1-イル、ピラゾール-3-イル、ピラゾール-4-イル又はピラゾール-5-イルであり、イミダゾリルはイミダゾール-1-イル、イミダゾール-2-イル又はイミダゾール-4-イルであり、1, 3, 4-オキサジアゾリルは1, 3, 4-オキサジアゾール-2-イルであり、1, 2, 4-オキサジアゾリルは1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル又は1, 2, 4-オキサジアゾール-5-イルであり、1, 3, 4-チアジアゾリルは1, 3, 4-チアジアゾール-2-イルであり、1, 2, 4-チアジアゾリルは1, 2, 4-チアジアゾール-3-イル又は1, 2, 4-チアジアゾール-5-イルであり、1, 2, 4-トリアゾリルは1, 2, 4-トリアゾール-1-イル、1, 2, 4-トリアゾール-3-イル又は1, 2, 4-トリアゾール-5-イルであり、1, 2, 3-チアジアゾリルは1, 2, 3-チアジアゾール-4-イル又は1, 2, 3-チアジアゾール-5-イルであり、1, 2, 3-トリアゾリルは1, 2, 3-トリアゾール-1-イル

、1, 2, 3-トリアゾール-2-イル又は1, 2, 3-トリアゾール-4-イルであり、1, 2, 3, 4-テトラゾリルは1, 2, 3, 4-テトラゾール-1-イル、1, 2, 3, 4-テトラゾール-2-イル又は1, 2, 3, 4-テトラゾール-5-イルであり、ピリジルはピリジン-2-イル、ピリジン-3-イル又はピリジン-4-イルであり、ピリミジニルはピリミジン-2-イル、ピリミジン-4-イル又はピリミジン-5-イルであり、ピラジニルはピラジン-2-イルであり、ピリダジニルはピリダジン-3-イル又はピリダジン-4-イルであり、1, 3, 5-トリアジニルは1, 3, 5-トリアジン-2-イルであり、1, 2, 4-トリアジニルは1, 2, 4-トリアジン-3-イル、1, 2, 4-トリアジン-5-イル又は1, 2, 4-トリアジン-6-イルであり、ベンゾチエニルはベンゾチオフェン-2-イル、ベンゾチオフェン-3-イル、ベンゾチオフェン-4-イル、ベンゾチオフェン-5-イル、ベンゾチオフェン-6-イル又はベンゾチオフェン-7-イルであり、ベンゾフリルはベンゾフラン-2-イル、ベンゾフラン-3-イル、ベンゾフラン-4-イル、ベンゾフラン-5-イル、ベンゾフラン-6-イル又はベンゾフラン-7-イルであり、インドリルはインドール-1-イル、インドール-2-イル、インドール-3-イル、インドール-4-イル、インドール-5-イル、インドール-6-イル又はインドール-7-イルであり、ベンゾチアゾリルはベンゾチアゾール-2-イル、ベンゾチアゾール-4-イル、ベンゾチアゾール-5-イル、ベンゾチアゾール-6-イル又はベンゾチアゾール-7-イルであり、ベンゾイミダゾリルはベンゾイミダゾール-1-イル、ベンゾイミダゾール-2-イル、ベンゾイミダゾール-4-イル、ベンゾイミダゾール-5-イル、ベンゾイミダゾール-6-イル又はベンゾイミダゾール-7-イルであり、ベンゾイソオキサゾリルはベンゾイソオキサゾール-3-イル、ベンゾイソオキサゾール-4-イル、ベンゾイソオキサゾール-5-イル、ベンゾイソオキサゾール-6-イル又はベンゾイソオキサゾール-7-イルであり、ベンゾイソチアゾリルはベンゾイソチアゾール-3-イル、ベンゾイソチアゾール-4-イル

、ベンゾイソチアゾールー５－イル、ベンゾイソチアゾールー６－イル又はベンゾイソチアゾールー７－イルであり、インダゾリルはインダゾールー１－イル、インダゾールー３－イル、インダゾールー４－イル、インダゾールー５－イル、インダゾールー６－イル又はインダゾールー７－イルであり、ベンゾオキサゾリルはベンゾオキサゾールー２－イル、ベンゾオキサゾールー４－イル、ベンゾオキサゾールー５－イル、ベンゾオキサゾールー６－イル又はベンゾオキサゾールー７－イルであり、キノリルはキノリンー２－イル、キノリンー３－イル、キノリンー４－イル、キノリンー５－イル、キノリンー６－イル、キノリンー７－イル又はキノリンー８－イルであり、イソキノリルはイソキノリンー１－イル、イソキノリンー３－イル、イソキノリンー４－イル、イソキノリンー５－イル、イソキノリンー６－イル、イソキノリンー７－イル又はイソキノリンー８－イルであり、キノキサリニルはキノキサリンー２－イル、キノキサリンー３－イル、キノキサリンー５－イル、キノキサリンー６－イル、キノキサリンー７－イル又はキノキサリンー８－イルであり、フタラジニルはフタラジンー１－イル、フタラジンー４－イル、フタラジンー５－イル、フタラジンー６－イル、フタラジンー７－イル又はフタラジンー８－イルであり、シンノリニルはシンノリンー３－イル、シンノリンー４－イル、シンノリンー５－イル、シンノリンー６－イル、シンノリンー７－イル又はシンノリンー８－イルであり、キナゾリニルはキナゾリンー２－イル、キナゾリンー４－イル、キナゾリンー５－イル、キナゾリンー６－イル、キナゾリンー７－イル又はキナゾリンー８－イルである。尚、本明細書中の「複素環カルボニル」の表記は、上記それぞれにカルボニルが結合していることを表す。

[0024] ハロゲンとしては、フッ素原子、塩素原子、臭素原子及びヨウ素原子が挙げられる。尚、本明細書中「ハロ」の表記もこれらのハロゲンを表す。

[0025] アルキルとしては、メチル、エチル、プロピル、*i*－プロピル、ブチル、*i*－ブチル、*t*－ブチル、*s*－ブチル、ペンチル、１－メチルブチル、２－メチルブチル、３－メチルブチル、１－エチルプロピル、１，１－ジメチル

プロピル、1, 2-ジメチルプロピル、ネオペンチル、ヘキシル、1-メチルペンチル、2-メチルペンチル、3-メチルペンチル、4-メチルペンチル、1-エチルブチル、2-エチルブチル、1, 1-ジメチルブチル、1, 2-ジメチルブチル、1, 3-ジメチルブチル、2, 2-ジメチルブチル、2, 3-ジメチルブチル、3, 3-ジメチルブチル、1, 1, 2-トリメチルプロピル、1-エチル-1-メチルプロピル及び1-エチル-2-メチルプロピル等が挙げられ、各々の指定の炭素数の範囲で選択される。

[0026] ハロアルキルとしては、フルオロメチル、クロロメチル、ブロモメチル、2-フルオロエチル、2-クロロエチル、2-ブロモエチル、3-フルオロプロピル、3-クロロプロピル、ジフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、トリフルオロメチル、ジクロロメチル、トリクロロメチル、2, 2-ジフルオロエチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、2, 2, 2-トリクロロエチル、クロロジフルオロメチル、ブロモジフルオロメチル、ペンタフルオロエチル、ヘプタフルオロプロピル、ヘプタフルオロイソプロピル、4-クロロブチル及び4-フルオロブチル等が挙げられ、各々の指定の炭素数の範囲から選択される。

[0027] シクロアルキルとしては、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル及びシクロヘキシル等が挙げられ、各々の指定の炭素数の範囲から選択される。

[0028] ハロシクロアルキルとしては、2-フルオロシクロプロピル、1-クロロシクロプロピル、2-ブロモ-1-メチルシクロプロピル、2, 2-ジフルオロシクロプロピル及び1, 2-ジクロロシクロプロピル等が挙げられ、各々の指定の炭素数の範囲から選択される。

[0029] シクロアルキルアルキルとしては、シクロプロピルメチル、2-シクロプロピルエチル、シクロペンチルメチル及びシクロヘキシルメチル等が挙げられ、各々の指定の炭素数の範囲から選択される。

[0030] アルケニルとしては、エテニル、1-プロペニル、2-プロペニル、1-ブテニル、2-ブテニル、3-ブテニル、1-メチル-2-プロペニル、2

ーメチルー2-プロピニル、1-ペンテニル、2-ペンテニル、3-ペンテニル、4-ペンテニル、1, 1-ジメチルー2-プロピニル、1, 2-ジメチルー2-プロピニル、1-ヘキセニル、1, 1-ジメチルー2-ブテニル、1, 2-ジメチルー2-ブテニル、1, 3-ジメチルー2-ブテニル、2, 3-ジメチルー2-ブテニル、1-エチルー2-ブテニル、2-エチルー2-ブテニル、1, 1, 2-トリメチルー2-プロピニル及び1-エチルー1-メチルー2-プロピニル等が挙げられ、各々の指定の炭素数の範囲から選択される。

[0031] ハロアルケニルとしては、1-クロロエテニル、2-クロロエテニル、2-フルオロエテニル、2, 2-ジクロロエテニル、3-クロロ-2-プロピニル、3-フルオロ-2-プロピニル、2-クロロ-2-プロピニル及び4-クロロ-3-ブテニル等が挙げられ、各々の指定の炭素数の範囲から選択される。

[0032] アルキニルとしては、エチニル、1-プロピニル、2-プロピニル、1-ブチニル、2-ブチニル、3-ブチニル、1-メチルー2-プロピニル、1-ペンチニル、1-メチルー2-ブチニル、2-メチルー3-ブチニル、1-ヘキシニル、1-メチルー3-ペンチニル、2-メチルー3-ペンチニル、3-メチルー4-ペンチニル、4-メチルー2-ペンチニル、1, 1-ジメチルー2-ブチニル、1, 2-ジメチルー3-ブチニル、2, 2-ジメチルー3-ブチニル、1-エチルー2-ブチニル及び2-エチルー3-ブチニル等が挙げられ、各々の指定の炭素数の範囲から選択される。

[0033] ハロアルキニルとしては、クロロエチニル、フルオロエチニル、ブロモエチニル、3-クロロ-2-プロピニル及び4-クロロ-2-ブチニル等が挙げられ、各々の指定の炭素数の範囲から選択される。

[0034] Yから選択される1以上の置換基を環上に有するフェニルとしては、2-フルオロフェニル、3-フルオロフェニル、4-フルオロフェニル、2-クロロフェニル、3-ブロモフェニル、4-ヨードフェニル、2, 3-ジフルオロフェニル、2, 4-ジフルオロフェニル、2, 6-ジフルオロフェニル

、3, 4-ジフルオロフェニル、3, 5-ジフルオロフェニル、2, 4-ジクロロフェニル、2-フルオロ-4-クロロフェニル、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニル、2-メチルフェニル、2, 5-ジメチルフェニル、4-エテニルフェニル、2-エチニルフェニル、3-シクロプロピルフェニル、2-シクロペンチルフェニル、4-シクロヘキシルフェニル、2-メトキシフェニル、3, 4-ジメトキシフェニル、3, 4, 5-トリメトキシフェニル、4-メトキシメチルフェニル、2-アミノフェニル、4-ジメチルアミノフェニル、2-アミノカルボニルフェニル、2-ジメチルアミノカルボニルフェニル、4-トリフルオロメトキシフェニル、2-ジフルオロメトキシフェニル、2-エテニルオキシフェニル、3-シクロプロピルオキシフェニル、2-ビフェニル、4-アセチルフェニル、3-メトキシカルボニルフェニル、2-メチルチオフェニル、3-トリフルオロメチルチオフェニル、4-ジフルオロメチルチオフェニル、2-メチルスルフィニルフェニル、3-トリフルオロメチルスルフィニルフェニル、4-ジフルオロメチルスルフィニルフェニル、2-メチルスルホニルフェニル、3-トリフルオロメチルスルホニルフェニル、4-ジフルオロメチルスルホニルフェニル、2-シアノフェニル、3-ニトロフェニル、4-トリフルオロメチルフェニル、2-ジフルオロメチルフェニル、2, 3-メチレンジオキシフェニル及び3, 4-メチレンジオキシフェニル等が挙げられる。

[0035] アルコキシとしては、メトキシ、エトキシ、プロピルオキシ、i-プロピルオキシ、ブチルオキシ、i-ブチルオキシ、s-ブチルオキシ、t-ブチルオキシ、ペンチルオキシ、1-メチルブチルオキシ、2-メチルブチルオキシ、3-メチルブチルオキシ、1, 1-ジメチルプロピルオキシ、1, 2-ジメチルプロピルオキシ、2, 2-ジメチルプロピルオキシ、1-エチルプロピルオキシ、ヘキシルオキシ、1-メチルペンチルオキシ、2-メチルペンチルオキシ、3-メチルペンチルオキシ、4-メチルペンチルオキシ、1, 1-ジメチルブチルオキシ、1, 2-ジメチルブチルオキシ、1, 3-ジメチルブチルオキシ、2, 2-ジメチルブチルオキシ、2, 3-ジメチル

ブチルオキシ、3, 3-ジメチルブチルオキシ、1-エチルブチルオキシ、2-エチルブチルオキシ、1, 1, 2-トリメチルプロピルオキシ、1, 2, 2-トリメチルプロピルオキシ、1-エチル-1-メチルプロピルオキシ及び1-エチル-2-メチルプロピルオキシ等が挙げられ、各々の指定の炭素数の範囲から選択される。

[0036] ハロアルコキシとしては、フルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、ブロモジフルオロメトキシ、ジクロロフルオロメトキシ、クロロメトキシ、ジクロロメトキシ、トリクロロメトキシ、ブロモメトキシ、1-フルオロエトキシ、2-フルオロエトキシ、2-クロロエトキシ、2-ブロモエトキシ、2, 2-ジフルオロエトキシ、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ、1, 1, 2, 2-テトラフルオロエトキシ、ペンタフルオロエトキシ、2, 2, 2-トリクロロエトキシ、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ、1-フルオロプロピルオキシ、2-フルオロプロピルオキシ、3-フルオロプロピルオキシ、3-クロロプロピルオキシ、3-ブロモプロピルオキシ、1-フルオロブチルオキシ、2-フルオロブチルオキシ、3-フルオロブチルオキシ、4-フルオロブチルオキシ及び4-クロロブチルオキシ等が挙げられ、各々の指定の炭素数の範囲から選択される。

[0037] フェニルアルキル及びYから選択される1以上の置換基を環上に有するフェニルアルキルとしては、ベンジル、2-フルオロベンジル、3-フルオロベンジル、4-フルオロベンジル、2-クロロベンジル、3-ブロモベンジル、4-ヨードベンジル、2, 4-ジフルオロベンジル、2-メチルベンジル、3-メチルベンジル、4-メチルベンジル、2-メトキシベンジル、4-アミノベンジル、4-トリフルオロメトキシベンジル、2-メチルチオベンジル、3-トリフルオロメチルチオベンジル、2-シアノベンジル、4-ニトロベンジル、2-トリフルオロメチルベンジル及び2-フェネチル等が挙げられ、各々の指定の炭素数の範囲から選択される。

[0038] フェニルカルボニルアルキル及びYから選択される1以上の置換基を環上

に有するフェニルカルボニルアルキルとしては、フェニルカルボニルメチル、2-フルオロフェニルカルボニルメチル、2-クロロフェニルカルボニルメチル、3-ブロモフェニルカルボニルメチル、4-ヨードフェニルカルボニルメチル、4-メチルフェニルカルボニルメチル、2-メトキシフェニルカルボニルメチル、4-アミノフェニルカルボニルメチル、4-トリフルオロメトキシフェニルカルボニルメチル、2-メチルチオフェニルカルボニルメチル、3-トリフルオロメチルチオフェニルカルボニルメチル、2-シアノフェニルカルボニルメチル、4-ニトロフェニルカルボニルメチル、2-トリフルオロメチルフェニルカルボニルメチル及び2-フェニルカルボニルエチル等が挙げられ、各々の指定の炭素数の範囲から選択される。

[0039] Yから選択される1以上の置換基を環上に有するフェノキシとしては、2-フルオロフェノキシ、2-クロロフェノキシ、4-ブロモフェノキシ、4-メチルフェノキシ、2-メトキシフェノキシ、3-アミノフェノキシ、4-トリフルオロメトキシフェノキシ、2-メチルチオフェノキシ、3-トリフルオロメチルチオフェノキシ、4-シアノフェノキシ、2-ニトロフェノキシ及び4-トリフルオロメチルフェノキシ等が挙げられる。

[0040] アルキルチオとしては、メチルチオ、エチルチオ、プロピルチオ、i-プロピルチオ、ブチルチオ、i-ブチルチオ、s-ブチルチオ及びt-ブチルチオ等が挙げられ、各々の指定の炭素数の範囲から選択される。

[0041] ハロアルキルチオとしては、フルオロメチルチオ、クロロメチルチオ、クロロジフルオロメチルチオ、ブロモジフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、トリクロロメチルチオ、2, 2, 2-トリフルオロエチルチオ、1, 1, 2, 2-テトラフルオロエチルチオ、2-フルオロエチルチオ及びペンタフルオロエチルチオ等が挙げられ、各々の指定の炭素数の範囲から選択される。

[0042] Yから選択される1以上の置換基を環上に有するフェニルチオとしては、2-フルオロフェニルチオ、2-クロロフェニルチオ、4-ブロモフェニルチオ、4-メチルフェニルチオ、2-メトキシフェニルチオ、3-アミノフ

ェニルチオ、4-トリフルオロメトキシフェニルチオ、2-メチルチオフェニルチオ、3-トリフルオロメチルチオフェニルチオ、4-シアノフェニルチオ、2-ニトロフェニルチオ及び4-トリフルオロメチルフェニルチオ等が挙げられる。

[0043] アルキルスルフィニルとしては、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、プロピルスルフィニル、i-プロピルスルフィニル、ブチルスルフィニル、i-ブチルスルフィニル、s-ブチルスルフィニル及びt-ブチルスルフィニル等が挙げられ、各々の指定の炭素数の範囲から選択される。

[0044] ハロアルキルスルフィニルとしては、フルオロメチルスルフィニル、クロロメチルスルフィニル、クロロジフルオロメチルスルフィニル、ブロモジフルオロメチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルフィニル、トリクロロメチルスルフィニル、2, 2, 2-トリフルオロエチルスルフィニル、1, 1, 2, 2-テトラフルオロエチルスルフィニル、2-フルオロエチルスルフィニル及びペンタフルオロエチルスルフィニル等が挙げられ、各々の指定の炭素数の範囲から選択される。

[0045] Yから選択される1以上の置換基を環上に有するフェニルスルフィニルとしては、2-フルオロフェニルスルフィニル、2-クロロフェニルスルフィニル、4-ブロモフェニルスルフィニル、4-メチルフェニルスルフィニル、2-メトキシフェニルスルフィニル、3-アミノフェニルスルフィニル、4-トリフルオロメトキシフェニルスルフィニル、2-メチルチオフェニルスルフィニル、3-トリフルオロメチルチオフェニルスルフィニル、4-シアノフェニルスルフィニル、2-ニトロフェニルスルフィニル及び4-トリフルオロメチルフェニルスルフィニル等が挙げられる。

[0046] アルキルスルホニルとしては、メチルスルホニル、エチルスルホニル、プロピルスルホニル、i-プロピルスルホニル、ブチルスルホニル、i-ブチルスルホニル、s-ブチルスルホニル及びt-ブチルスルホニル等が挙げられ、各々の指定の炭素数の範囲から選択される。

[0047] ハロアルキルスルホニルとしては、フルオロメチルスルホニル、クロロメ

チルスルホニル、クロロジフルオロメチルスルホニル、ブロモジフルオロメチルスルホニル、トリフルオロメチルスルホニル、トリクロロメチルスルホニル、2, 2, 2-トリフルオロエチルスルホニル、1, 1, 2, 2-テトラフルオロエチルスルホニル、2-フルオロエチルスルホニル及びペンタフルオロエチルスルホニル等が挙げられ、各々の指定の炭素数の範囲から選択される。

[0048] Yから選択される1以上の置換基を環上に有するフェニルスルホニルとしては、2-フルオロフェニルスルホニル、2-クロロフェニルスルホニル、4-ブロモフェニルスルホニル、4-メチルフェニルスルホニル、2-メトキシフェニルスルホニル、3-アミノフェニルスルホニル、4-トリフルオロメトキシフェニルスルホニル、2-メチルチオフェニルスルホニル、3-トリフルオロメチルチオフェニルスルホニル、4-シアノフェニルスルホニル、2-ニトロフェニルスルホニル及び4-トリフルオロメチルフェニルスルホニル等が挙げられる。

[0049] アルキルカルボニルとしては、アセチル、プロピオニル、ブチリル、i-ブチリル、バレロイル、i-バレロイル、2-メチルブチリル、ピバロイル、ヘキサノイル、2-エチルブチリル、2-メチルバレロイル、4-メチルバレロイル、ヘプタノイル、2, 2-ジメチルバレロイル、2-エチルヘキサノイル、2-プロピル-バレロイル、オクタノイル、ノナノイル、3, 5, 5-トリメチルヘキサノイル及びデカノイル等が挙げられ、各々の指定の炭素数の範囲から選択される。

[0050] ハロアルキルカルボニルとしては、フルオロアセチル、クロロアセチル、ジフルオロアセチル、ジクロロアセチル、トリフルオロアセチル、クロロジフルオロアセチル、ブロモジフルオロアセチル、トリクロロアセチル、ペンタフルオロプロピオニル、4-クロロブチリル、ヘプタフルオロブチリル及び3-クロロ-2, 2-ジメチルプロピオニル等が挙げられ、各々の指定の炭素数の範囲から選択される。

[0051] シクロアルキルカルボニルとしては、シクロプロパンカルボニル、シクロ

ブタンカルボニル、シクロペンタンカルボニル及びシクロヘキサンカルボニル等が挙げられ、各々の指定の炭素数の範囲から選択される。

[0052] シクロアルキルアルキルカルボニルとしては、シクロプロピルメチルカルボニル、2-シクロプロピルエチルカルボニル、シクロペンチルメチルカルボニル及びシクロヘキシルメチルカルボニル等が挙げられ、各々の指定の炭素数の範囲から選択される。

[0053] アルケニルカルボニルとしては、エテニルカルボニル、1-プロペニルカルボニル、2-プロペニルカルボニル、1-ブテニルカルボニル、1-メチル-2-プロペニルカルボニル、2-メチル-2-プロペニルカルボニル及び1-ヘキセニルカルボニル等が挙げられ、各々の指定の炭素数の範囲から選択される。

[0054] Yから選択される1以上の置換基を環上に有するフェニルカルボニルとしては、2-フルオロフェニルカルボニル、2-クロロフェニルカルボニル、4-ブromoフェニルカルボニル、4-メチルフェニルカルボニル、2-メトキシフェニルカルボニル、3-アミノフェニルカルボニル、4-トリフルオロメトキシフェニルカルボニル、2-メチルチオフェニルカルボニル、3-トリフルオロメチルチオフェニルカルボニル、4-シアノフェニルカルボニル、2-ニトロフェニルカルボニル及び4-トリフルオロメチルフェニルカルボニル等が挙げられる。

[0055] アルコキシカルボニルとしては、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、プロピルオキシカルボニル、i-プロピルオキシカルボニル、ブチルオキシカルボニル、s-ブチルオキシカルボニル、i-ブチルオキシカルボニル、t-ブチルオキシカルボニル、ペンチルオキシカルボニル及びヘキシルオキシカルボニル等が挙げられ、各々の指定の炭素数の範囲から選択される。

[0056] ハロアルコキシカルボニルとしては、フルオロメトキシカルボニル、ジフルオロメトキシカルボニル、トリフルオロメトキシカルボニル、1-フルオロエトキシカルボニル、2-フルオロエトキシカルボニル、2-クロロエト

キシカルボニル、2-ブロモエトキシカルボニル、2, 2-ジフルオロエトキシカルボニル、2, 2, 2-トリフルオロエトキシカルボニル、1-フルオロプロピルオキシカルボニル、2-フルオロプロピルオキシカルボニル、3-フルオロプロピルオキシカルボニル、3-クロロプロピルオキシカルボニル、3-ブロモプロピルオキシカルボニル、4-フルオロブチルオキシカルボニル及び4-クロロブチルオキシカルボニル等が挙げられ、各々の指定の炭素数の範囲から選択される。

[0057] アルコキシアルコキシカルボニルとしては、メトキシメトキシカルボニル、エトキシメトキシカルボニル、プロピルオキシメトキシカルボニル、i-プロピルオキシメトキシカルボニル、ブチルオキシメトキシカルボニル、2-メトキシエトキシカルボニル及び1-メトキシエトキシカルボニル等が挙げられ、各々の指定の炭素数の範囲から選択される。

[0058] アルキルチオアルコキシカルボニルとしては、メチルチオメトキシカルボニル、エチルチオメトキシカルボニル、プロピルチオメトキシカルボニル、i-プロピルチオメトキシカルボニル、ブチルチオメトキシカルボニル、2-メチルチオエトキシカルボニル及び1-メチルチオエトキシカルボニル等が挙げられ、各々の指定の炭素数の範囲から選択される。

[0059] アルキルスルフィニルアルコキシカルボニルとしては、メチルスルフィニルメトキシカルボニル、エチルスルフィニルメトキシカルボニル、プロピルスルフィニルメトキシカルボニル、i-プロピルスルフィニルメトキシカルボニル、ブチルスルフィニルメトキシカルボニル、2-メチルスルフィニルエトキシカルボニル及び1-メチルスルフィニルエトキシカルボニル等が挙げられ、各々の指定の炭素数の範囲から選択される。

[0060] アルキルスルホニルアルコキシカルボニルとしては、メチルスルホニルメトキシカルボニル、エチルスルホニルメトキシカルボニル、プロピルスルホニルメトキシカルボニル、i-プロピルスルホニルメトキシカルボニル、ブチルスルホニルメトキシカルボニル、2-メチルスルホニルエトキシカルボニル及び1-メチルスルホニルエトキシカルボニル等が挙げられ、各々の指

定の炭素数の範囲から選択される。

- [0061] アルケニルオキシカルボニルとしては、エテニルオキシカルボニル、1-プロペニルオキシカルボニル、2-プロペニルオキシカルボニル、1-ブテニルオキシカルボニル、1-メチル-2-プロペニルオキシカルボニル、2-メチル-2-プロペニルオキシカルボニル及び1-ヘキセニルオキシカルボニル等が挙げられ、各々の指定の炭素数の範囲から選択される。
- [0062] ハロアルケニルオキシカルボニルとしては、1-クロロエテニルオキシカルボニル、2-クロロエテニルオキシカルボニル、2-フルオロエテニルオキシカルボニル、2, 2-ジクロロエテニルオキシカルボニル、3-クロロ-2-プロペニルオキシカルボニル、3-フルオロ-2-プロペニルオキシカルボニル、2-クロロ-2-プロペニルオキシカルボニル及び4-クロロ-3-ブテニルオキシカルボニル等が挙げられ、各々の指定の炭素数の範囲から選択される。
- [0063] アルキニルオキシカルボニルとしては、エチニルオキシカルボニル、1-プロピニルオキシカルボニル、2-プロピニルオキシカルボニル、1-ブチニルオキシカルボニル、1-メチル-2-プロピニルオキシカルボニル、2-メチル-2-プロピニルオキシカルボニル及び1-ヘキシニルオキシカルボニル等が挙げられ、各々の指定の炭素数の範囲から選択される。
- [0064] Yから選択される1以上の置換基を環上に有するフェノキシカルボニルとしては、2-フルオロフェノキシカルボニル、2-クロロフェノキシカルボニル、4-ブロモフェノキシカルボニル、4-メチルフェノキシカルボニル、2-メトキシフェノキシカルボニル、3-アミノフェノキシカルボニル、4-トリフルオロメトキシフェノキシカルボニル、2-メチルチオフェノキシカルボニル、3-トリフルオロメチルチオフェノキシカルボニル、4-シアノフェノキシカルボニル、2-ニトロフェノキシカルボニル及び4-トリフルオロメチルフェノキシカルボニル等が挙げられる。
- [0065] フェニルアルコキシカルボニル及びYから選択される1以上の置換基を環上に有するフェニルアルコキシカルボニルとしては、ベンジルオキシカルボ

ニル、2-フルオロベンジルオキシカルボニル、2-クロロベンジルオキシカルボニル、3-ブロモベンジルオキシカルボニル、4-ヨードベンジルオキシカルボニル、4-メチルベンジルオキシカルボニル、2-メトキシベンジルオキシカルボニル、4-アミノベンジルオキシカルボニル、4-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル、2-メチルチオベンジルオキシカルボニル、3-トリフルオロメチルチオベンジルオキシカルボニル、2-シアノベンジルオキシカルボニル、4-ニトロベンジルオキシカルボニル、2-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル及び2-フェネチルオキシカルボニル等が挙げられる。

[0066] フェノキシアルキルカルボニル及びYから選択される1以上の置換基を環上に有するフェノキシアルキルカルボニルとしては、フェノキシメチルカルボニル、2-フェノキシエチルカルボニル、2-フルオロフェノキシメチルカルボニル、2-クロロフェノキシメチルカルボニル、4-ブロモフェノキシメチルカルボニル、4-メチルフェノキシメチルカルボニル、2-メトキシフェノキシメチルカルボニル、3-アミノフェノキシメチルカルボニル、4-トリフルオロメトキシフェノキシメチルカルボニル、2-メチルチオフェノキシメチルカルボニル、3-トリフルオロメチルチオフェノキシメチルカルボニル、4-シアノフェノキシメチルカルボニル、2-ニトロフェノキシメチルカルボニル及び4-トリフルオロメチルフェノキシメチルカルボニル等が挙げられる。

[0067] アルキルチオカルボニルとしては、メチルチオカルボニル、エチルチオカルボニル、プロピルチオカルボニル、i-プロピルチオカルボニル、ブチルチオカルボニル、i-ブチルチオカルボニル、s-ブチルチオカルボニル及びt-ブチルチオカルボニル等が挙げられ、各々の指定の炭素数の範囲から選択される。

[0068] ハロアルキルチオカルボニルとしては、フルオロメチルチオカルボニル、クロロジフルオロメチルチオカルボニル、ブロモジフルオロメチルチオカルボニル、トリフルオロメチルチオカルボニル、トリクロロメチルチオカルボ

ニル、2, 2, 2-トリフルオロエチルチオカルボニル、1, 1, 2, 2-テトラフルオロエチルチオカルボニル、2-フルオロエチルチオカルボニル及びペンタフルオロエチルチオカルボニル等が挙げられ、各々の指定の炭素数の範囲から選択される。

[0069] モノアルキルアミノカルボニルとしては、メチルアミノカルボニル、エチルアミノカルボニル、プロピルアミノカルボニル、i-プロピルアミノカルボニル、ブチルアミノカルボニル、s-ブチルアミノカルボニル、i-ブチルアミノカルボニル、t-ブチルアミノカルボニル、ペンチルアミノカルボニル及びヘキシルアミノカルボニル等が挙げられ、各々の指定の炭素数の範囲から選択される。

[0070] モノハロアルキルアミノカルボニルとしては、フルオロメチルアミノカルボニル、ジフルオロメチルアミノカルボニル、トリフルオロメチルアミノカルボニル、クロロメチルアミノカルボニル、ブロモメチルアミノカルボニル、ヨードメチルアミノカルボニル、2-フルオロエチルアミノカルボニル、2-クロロエチルアミノカルボニル、3-フルオロプロピルアミノカルボニル、2-フルオロプロピルアミノカルボニル及び1-フルオロプロピルアミノカルボニル等が挙げられ、各々の指定の炭素数の範囲から選択される。

[0071] ジアルキルアミノカルボニルとしては、ジメチルアミノカルボニル、ジエチルアミノカルボニル、ジプロピルアミノカルボニル、ジ(i-プロピル)アミノカルボニル、ジブチルアミノカルボニル、ジ(s-ブチル)アミノカルボニル、ジ(i-ブチル)アミノカルボニル、ジ(t-ブチル)アミノカルボニル、ジペンチルアミノカルボニル、ジヘキシルアミノカルボニル、エチル(メチル)アミノカルボニル及びメチル(プロピル)アミノカルボニル等が挙げられ、各々の指定の炭素数の範囲から選択される。

[0072] ジ(ハロアルキル)アミノカルボニルとしては、ジ(フルオロメチル)アミノカルボニル、ジ(クロロメチル)アミノカルボニル、ジ(ブロモメチル)アミノカルボニル、フルオロメチル(メチル)アミノカルボニル、クロロメチル(メチル)アミノカルボニル、クロロメチル(エチル)アミノカルボ

ニル、ジ（２－フルオロエチル）アミノカルボニル及び（２－フルオロエチル）メチルアミノカルボニル等が挙げられ、各々の指定の炭素数の範囲から選択される。

[0073] Yから選択される１以上の置換基を環上に有するフェニルアミノカルボニルとしては、２－フルオロフェニルアミノカルボニル、２－クロロフェニルアミノカルボニル、４－ブロモフェニルアミノカルボニル、４－メチルフェニルアミノカルボニル、２－メトキシフェニルアミノカルボニル、３－アミノフェニルアミノカルボニル、４－トリフルオロメトキシフェニルアミノカルボニル、２－メチルチオフェニルアミノカルボニル、３－トリフルオロメチルチオフェニルアミノカルボニル、４－シアノフェニルアミノカルボニル、２－ニトロフェニルアミノカルボニル及び４－トリフルオロメチルフェニルアミノカルボニル等が挙げられる。

[0074] フェニルアルキルアミノカルボニル及びYから選択される１以上の置換基を環上に有するフェニルアルキルアミノカルボニルとしては、ベンジルアミノカルボニル、２－フルオロベンジルアミノカルボニル、２－クロロベンジルアミノカルボニル、３－ブロモベンジルアミノカルボニル、４－ヨードベンジルアミノカルボニル、４－メチルベンジルアミノカルボニル、２－メトキシベンジルアミノカルボニル、４－アミノベンジルアミノカルボニル、４－トリフルオロメトキシベンジルアミノカルボニル、２－メチルチオベンジルアミノカルボニル、３－トリフルオロメチルチオベンジルアミノカルボニル、２－シアノベンジルアミノカルボニル、４－ニトロベンジルアミノカルボニル、２－トリフルオロメチルベンジルアミノカルボニル及び２－フェネチルアミノカルボニル等が挙げられる。

[0075] アルコキシアルキルとしては、メトキシメチル、エトキシメチル、プロピルオキシメチル、i－プロピルオキシメチル、ブチルオキシメチル、i－ブチルオキシメチル、s－ブチルオキシメチル、t－ブチルオキシメチル、ペンチルオキシメチル、１－メトキシエチル、２－メトキシエチル、２－エトキシエチル及び３－メトキシプロピル等が挙げられ、各々指定の炭素数の範

囲から選択される。

- [0076] ハロアルコキシアルキルとしては、フルオロメトキシメチル、クロロメトキシメチル、ブロモメトキシメチル、2, 2, 2-トリフルオロエトキシメチル及び2-(クロロメトキシ)エチル等が挙げられ、各々指定の炭素数の範囲から選択される。
- [0077] アルコキシアルコキシアルキルとしては、メトキシメトキシメチル、エトキシメトキシメチル、プロピルオキシメトキシメチル、i-プロピルオキシメトキシメチル、ブチルオキシメトキシメチル、1-(メトキシメトキシ)エチル、2-(メトキシメトキシ)エチル、2-(エトキシメトキシ)エチル及び2-(エトキシ)エトキシメチル等が挙げられ、各々指定の炭素数の範囲から選択される。
- [0078] トリアルキルシリルアルコキシアルキルとしては、トリメチルシリルメトキシメチル、2-(トリメチルシリル)エトキシメチル、2-(トリメチルシリルメトキシ)エチル及び2-[2-(トリメチルシリル)エトキシ]エチル等が挙げられ、各々指定の炭素数の範囲から選択される。
- [0079] ヒドロキシアルキルとしては、ヒドロキシメチル、1-ヒドロキシエチル、2-ヒドロキシエチル、1-ヒドロキシプロピル、2-ヒドロキシプロピル、3-ヒドロキシプロピル、1-ヒドロキシ-1-メチルエチル、2-ヒドロキシ-1-メチルエチル及び2-ヒドロキシ-1, 1-ジメチルエチル等が挙げられ、各々の指定の炭素数の範囲から選択される。
- [0080] フェノキシアルキル及びYから選択される1以上の置換基を環上に有するフェノキシアルキルとしては、フェノキシメチル、2-フルオロフェノキシメチル、2-クロロフェノキシメチル、3-ブロモフェノキシメチル、4-ヨードフェノキシメチル、4-メチルフェノキシメチル、2-メトキシフェノキシメチル、4-アミノフェノキシメチル、4-トリフルオロメトキシフェノキシメチル、2-メチルチオフェノキシメチル、3-トリフルオロメチルチオフェノキシメチル、2-シアノフェノキシメチル、4-ニトロフェノキシメチル、2-トリフルオロメチルフェノキシメチル及び2-(フェノキ

シ) エチル等が挙げられ、各々の指定の炭素数の範囲から選択される。

[0081] フェニルカルボニルオキシアルコキシアルキル及びYから選択される1以上の置換基を環上に有するフェニルカルボニルオキシアルコキシアルキルとしては、フェニルカルボニルオキシメトキシメチル、2-フルオロフェニルカルボニルオキシメトキシメチル、2-クロロフェニルカルボニルオキシメトキシメチル、3-ブロモフェニルカルボニルオキシメトキシメチル、4-ヨードフェニルカルボニルオキシメトキシメチル、4-メチルフェニルカルボニルオキシメトキシメチル、2-メトキシフェニルカルボニルオキシメトキシメチル、4-アミノフェニルカルボニルオキシメトキシメチル、4-トリフルオロメトキシフェニルカルボニルオキシメトキシメチル、2-メチルチオフェニルカルボニルオキシメトキシメチル、3-トリフルオロメチルチオフェニルカルボニルオキシメトキシメチル、2-シアノフェニルカルボニルオキシメトキシメチル、4-ニトロフェニルカルボニルオキシメトキシメチル、2-トリフルオロメチルフェニルカルボニルオキシメトキシメチル、2-(フェニルカルボニルオキシ)エトキシメチル及び2-(フェニルカルボニルオキシメトキシ)エチル等が挙げられる。

[0082] アルキルチオアルキルとしては、メチルチオメチル、エチルチオメチル、プロピルチオメチル、i-プロピルチオメチル、ブチルチオメチル、i-ブチルチオメチル、s-ブチルチオメチル、t-ブチルチオメチル、ペンチルチオメチル、1-メチルチオエチル、2-メチルチオエチル、2-エチルチオエチル及び3-メチルチオプロピル等が挙げられ、各々の指定の炭素数の範囲から選択される。

[0083] ハロアルキルチオアルキルとしては、フルオロメチルチオメチル、クロロメチルチオメチル、ブロモメチルチオメチル、2, 2, 2-トリフルオロエチルチオメチル及び2-(クロロメチルチオ)エチル等が挙げられ、各々指定の炭素数の範囲から選択される。

[0084] フェニルチオアルキル及びYから選択される1以上の置換基を環上に有するフェニルチオアルキルとしては、フェニルチオメチル、2-フルオロフェ

ニルチオメチル、2-クロロフェニルチオメチル、3-ブロモフェニルチオメチル、4-ヨードフェニルチオメチル、4-メチルフェニルチオメチル、2-メトキシフェニルチオメチル、4-アミノフェニルチオメチル、4-トリフルオロメトキシフェニルチオメチル、2-メチルチオフェニルチオメチル、3-トリフルオロメチルチオフェニルチオメチル、2-シアノフェニルチオメチル、4-ニトロフェニルチオメチル、2-トリフルオロメチルフェニルチオメチル及び2-(フェニルチオ)エチル等が挙げられ、各々の指定の炭素数の範囲から選択される。

[0085] フェニルアルキルチオアルキル及びYから選択される1以上の置換基を環上に有するフェニルアルキルチオアルキルとしては、ベンジルチオメチル、2-フルオロベンジルチオメチル、2-クロロベンジルチオメチル、3-ブロモベンジルチオメチル、4-ヨードベンジルチオメチル、4-メチルベンジルチオメチル、2-メトキシベンジルチオメチル、4-アミノベンジルチオメチル、4-トリフルオロメトキシベンジルチオメチル、2-メチルチオベンジルチオメチル、3-トリフルオロメチルチオベンジルチオメチル、2-シアノベンジルチオメチル、4-ニトロベンジルチオメチル、2-トリフルオロメチルベンジルチオメチル、フェネチルチオメチル及び2-(ベンジルチオ)エチル等が挙げられ、各々の指定の炭素数の範囲から選択される。

[0086] アルキルカルボニルアルキルとしては、メチルカルボニルメチル、エチルカルボニルメチル、プロピルカルボニルメチル、i-プロピルカルボニルメチル、ブチルカルボニルメチル、i-ブチルカルボニルメチル、s-ブチルカルボニルメチル、t-ブチルカルボニルメチル、ペンチルカルボニルメチル、1-(メチルカルボニル)エチル、2-(メチルカルボニル)エチル、2-(エチルカルボニル)エチル及び3-(メチルカルボニル)プロピル等が挙げられ、各々の指定の炭素数の範囲から選択される。

[0087] ハロアルキルカルボニルアルキルとしては、フルオロメチルカルボニルメチル、クロロメチルカルボニルメチル、ブロモメチルカルボニルメチル、2, 2, 2-トリフルオロエチルカルボニルメチル及び2-(クロロメチルカ

ルボニル) エチル等が挙げられ、各々指定の炭素数の範囲から選択される。

[0088] アルコキシカルボニルアルキルとしては、メトキシカルボニルメチル、エトキシカルボニルメチル、プロピルオキシカルボニルメチル、*i*-プロピルオキシカルボニルメチル、ブチルオキシカルボニルメチル、2-(メトキシカルボニル) エチル、2-(エトキシカルボニル) エチル及び3-(メトキシカルボニル) プロピル等が挙げられ、各々の指定の炭素数の範囲から選択される。

[0089] ハロアルコキシカルボニルアルキルとしては、フルオロメトキシカルボニルメチル、クロロメトキシカルボニルメチル、ブロモメトキシカルボニルメチル、2, 2, 2-トリフルオロエトキシカルボニルメチル及び2-(クロロメトキシカルボニル) エチル等が挙げられ、各々指定の炭素数の範囲から選択される。

[0090] アルコキシカルボニルオキシアルキルとしては、メトキシカルボニルオキシメチル、エトキシカルボニルオキシメチル、プロピルオキシカルボニルオキシメチル、*i*-プロピルオキシカルボニルオキシメチル、ブチルオキシカルボニルオキシメチル、2-メトキシカルボニルオキシエチル、2-(エトキシカルボニルオキシ) エチル及び3-(メトキシカルボニルオキシ) プロピル等が挙げられ、各々の指定の炭素数の範囲から選択される。

[0091] モノアルキルアミノカルボニルオキシアルキルとしては、メチルアミノカルボニルオキシメチル、エチルアミノカルボニルオキシメチル、プロピルアミノカルボニルオキシメチル、*i*-プロピルアミノカルボニルオキシメチル、ブチルアミノカルボニルオキシメチル、2-(メチルアミノカルボニルオキシ) エチル、2-(エチルアミノカルボニルオキシ) エチル及び3-(メチルアミノカルボニルオキシ) プロピル等が挙げられ、各々の指定の炭素数の範囲から選択される。

[0092] ジアルキルアミノカルボニルオキシアルキルとしては、ジメチルアミノカルボニルオキシメチル、ジエチルアミノカルボニルオキシメチル、エチル(メチル) アミノカルボニルオキシメチル、メチル(プロピル) アミノカルボ

ニルオキシメチル、ブチル（メチル）アミノカルボニルオキシメチル、2-（ジエチルアミノカルボニルオキシ）エチル及び2-〔エチル（メチル）アミノカルボニルオキシ〕プロピル等が挙げられ、各々の指定の炭素数の範囲から選択される。

[0093] フェニルアミノカルボニルオキシアルキル及びYから選択される1以上の置換基を環上に有するフェニルアミノカルボニルオキシアルキルとしては、フェニルアミノカルボニルオキシメチル、2-フルオロフェニルアミノカルボニルオキシメチル、2-クロロフェニルアミノカルボニルオキシメチル、3-ブromoフェニルアミノカルボニルオキシメチル、4-ヨードフェニルアミノカルボニルオキシメチル、4-メチルフェニルアミノカルボニルオキシメチル、2-メトキシフェニルアミノカルボニルオキシメチル、4-アミノフェニルアミノカルボニルオキシメチル、4-トリフルオロメトキシフェニルアミノカルボニルオキシメチル、2-メチルチオフェニルアミノカルボニルオキシメチル、3-トリフルオロメチルフェニルアミノカルボニルオキシメチル、2-シアノフェニルアミノカルボニルオキシメチル、4-ニトロフェニルアミノカルボニルオキシメチル、2-トリフルオロメチルフェニルアミノカルボニルオキシメチル及び2-（フェニルアミノカルボニルオキシ）エチル等が挙げられ、各々の指定の炭素数の範囲から選択される。

[0094] アルキル（フェニル）アミノカルボニルオキシアルキル及びYから選択される1以上の置換基を環上に有するアルキル（フェニル）アミノカルボニルオキシアルキルとしては、メチル（フェニル）アミノカルボニルオキシメチル、メチル（2-フルオロフェニル）アミノカルボニルオキシメチル、メチル（2-クロロフェニル）アミノカルボニルオキシメチル、メチル（3-ブromoフェニル）アミノカルボニルオキシメチル、メチル（4-ヨードフェニル）アミノカルボニルオキシメチル、メチル（4-メチルフェニル）アミノカルボニルオキシメチル、メチル（2-メトキシフェニル）アミノカルボニルオキシメチル、メチル（4-アミノフェニル）アミノカルボニルオキシメチル、メチル（4-トリフルオロメトキシ）フェニルアミノカルボニルオキシ

シメチル、メチル（2-メチルチオフェニル）アミノカルボニルオキシメチル、メチル（3-トリフルオロメチルフェニル）アミノカルボニルオキシメチル、メチル（2-シアノフェニル）アミノカルボニルオキシメチル、メチル（4-ニトロフェニル）アミノカルボニルオキシメチル、エチル（フェニル）アミノカルボニルオキシメチル及び2-〔メチル（フェニル）アミノカルボニルオキシ〕エチル等が挙げられ、各々の指定の炭素数の範囲から選択される。

[0095] アルキルスルフィニルアルキルとしては、メチルスルフィニルメチル、エチルスルフィニルメチル、プロピルスルフィニルメチル、i-プロピルスルフィニルメチル、ブチルスルフィニルメチル、i-ブチルスルフィニルメチル、s-ブチルスルフィニルメチル、t-ブチルスルフィニルメチル、ペンチルスルフィニルメチル、1-（メチルスルフィニル）エチル、2-（メチルスルフィニル）エチル、2-（エチルスルフィニル）エチル及び3-（メチルスルフィニル）プロピル等が挙げられ、各々の指定の炭素数の範囲から選択される。

[0096] ハロアルキルスルフィニルアルキルとしては、フルオロメチルスルフィニルメチル、クロロメチルスルフィニルメチル、ブロモメチルスルフィニルメチル、2, 2, 2-トリフルオロエチルスルフィニルメチル及び2-（クロロメチルスルフィニル）エチル等が挙げられ、各々指定の炭素数の範囲から選択される。

[0097] フェニルスルフィニルアルキル及びYから選択される1以上の置換基を環上に有するフェニルスルフィニルアルキルとしては、フェニルスルフィニルメチル、2-フルオロフェニルスルフィニルメチル、2-クロロフェニルスルフィニルメチル、3-ブロモフェニルスルフィニルメチル、4-ヨードフェニルスルフィニルメチル、4-メチルフェニルスルフィニルメチル、2-メトキシフェニルスルフィニルメチル、4-アミノフェニルスルフィニルメチル、4-トリフルオロメトキシフェニルスルフィニルメチル、2-メチルチオフェニルスルフィニルメチル、3-トリフルオロメチルチオフェニルス

ルフィニルメチル、2-シアノフェニルスルフィニルメチル、4-ニトロフェニルスルフィニルメチル、2-トリフルオロメチルフェニルスルフィニルメチル及び2-(フェニルスルフィニル)エチル等が挙げられ、各々の指定の炭素数の範囲から選択される。

[0098] アルキルスルホニルアルキルとしては、メチルスルホニルメチル、エチルスルホニルメチル、プロピルスルホニルメチル、i-プロピルスルホニルメチル、ブチルスルホニルメチル、i-ブチルスルホニルメチル、s-ブチルスルホニルメチル、t-ブチルスルホニルメチル、ペンチルスルホニルメチル、1-(メチルスルホニル)エチル、2-(メチルスルホニル)エチル、2-(エチルスルホニル)エチル及び3-(メチルスルホニル)プロピル等が挙げられ、各々の指定の炭素数の範囲から選択される。

[0099] ハロアルキルスルホニルアルキルとしては、フルオロメチルスルホニルメチル、クロロメチルスルホニルメチル、ブromoメチルスルホニルメチル、2, 2, 2-トリフルオロエチルスルホニルメチル及び2-(クロロメチルスルホニル)エチル等が挙げられ、各々指定の炭素数の範囲から選択される。

[0100] フェニルスルホニルアルキル及びYから選択される1以上の置換基を環上に有するフェニルスルホニルアルキルとしては、フェニルスルホニルメチル、2-フルオロフェニルスルホニルメチル、2-クロロフェニルスルホニルメチル、3-ブromoフェニルスルホニルメチル、4-ヨードフェニルスルホニルメチル、4-メチルフェニルスルホニルメチル、2-メトキシフェニルスルホニルメチル、4-アミノフェニルスルホニルメチル、4-トリフルオロメトキシフェニルスルホニルメチル、2-メチルチオフェニルスルホニルメチル、3-トリフルオロメチルチオフェニルスルホニルメチル、2-シアノフェニルスルホニルメチル、4-ニトロフェニルスルホニルメチル、2-トリフルオロメチルフェニルスルホニルメチル及び2-(フェニルスルホニル)エチル等が挙げられ、各々の指定の炭素数の範囲から選択される。

[0101] フェニルアルキルスルホニルアルキル及びYから選択される1以上の置換基を環上に有するフェニルアルキルスルホニルアルキルとしては、ベンジル

スルホニルメチル、2-フルオロベンジルスルホニルメチル、2-クロロベンジルスルホニルメチル、3-ブロモベンジルスルホニルメチル、4-ヨードベンジルスルホニルメチル、4-メチルベンジルスルホニルメチル、2-メトキシベンジルスルホニルメチル、4-アミノベンジルスルホニルメチル、4-トリフルオロメトキシベンジルスルホニルメチル、2-メチルチオベンジルスルホニルメチル、3-トリフルオロメチルチオベンジルスルホニルメチル、2-シアノベンジルスルホニルメチル、4-ニトロベンジルスルホニルメチル、2-トリフルオロメチルベンジルスルホニルメチル、フェネチルスルホニルメチル及び2-（ベンジルスルホニル）エチル等が挙げられ、各々の指定の炭素数の範囲から選択される。

[0102] フェニルアルコキシアルキル及びYから選択される1以上の置換基を環上に有するフェニルアルコキシアルキルとしては、ベンジルオキシメチル、2-フルオロベンジルオキシメチル、2-クロロベンジルオキシメチル、3-ブロモベンジルオキシメチル、4-ヨードベンジルオキシメチル、4-メチルベンジルオキシメチル、2-メトキシベンジルオキシメチル、4-アミノベンジルオキシメチル、4-トリフルオロメトキシベンジルオキシメチル、2-メチルチオベンジルオキシメチル、3-トリフルオロメチルチオベンジルオキシメチル、2-シアノベンジルオキシメチル、4-ニトロベンジルオキシメチル、2-トリフルオロメチルベンジルオキシメチル、2-フェネチルオキシメチル、1-（ベンジルオキシ）エチル及び2-（ベンジルオキシ）エチル等が挙げられ、各々の指定の炭素数の範囲から選択される。

[0103] アルキルカルボニルオキシアルキルとしては、アセトキシメチル、プロピオニルオキシメチル、ブチリルオキシメチル、i-ブチリルオキシメチル、バレロイルオキシメチル、i-バレロイルオキシメチル、2-メチルブチリルオキシメチル、ピバロイルオキシメチル、ヘプタノイルオキシメチル、1-（アセトキシ）エチル、2-（アセトキシ）エチル、2-（プロピオニルオキシ）エチル及び3-（アセトキシ）プロピル等が挙げられ、各々の指定の炭素数の範囲から選択される。

[0104] フェニルカルボニルオキシアルキル及びYから選択される1以上の置換基を環上に有するフェニルカルボニルオキシアルキルとしては、フェニルカルボニルオキシメチル、2-フルオロフェニルカルボニルオキシメチル、2-クロロフェニルカルボニルオキシメチル、3-ブロモフェニルカルボニルオキシメチル、4-ヨードフェニルカルボニルオキシメチル、4-メチルフェニルカルボニルオキシメチル、2-メトキシフェニルカルボニルオキシメチル、4-アミノフェニルカルボニルオキシメチル、4-トリフルオロメトキシフェニルカルボニルオキシメチル、2-メチルチオフェニルカルボニルオキシメチル、3-トリフルオロメチルチオフェニルカルボニルオキシメチル、2-シアノフェニルカルボニルオキシメチル、4-ニトロフェニルカルボニルオキシメチル、2-トリフルオロメチルフェニルカルボニルオキシメチル及び2-(フェニルカルボニルオキシ)エチル等が挙げられ、各々の指定の炭素数の範囲から選択される。

[0105] ジアルキルアミノチオとしては、ジメチルアミノチオ、ジエチルアミノチオ、ジプロピルアミノチオ、ジ(i-プロピル)アミノチオ、ジブチルアミノチオ、ジ(s-ブチル)アミノチオ、ジ(i-ブチル)アミノチオ、ジ(t-ブチル)アミノチオ、ジペンチルアミノチオ、ジヘキシルアミノチオ、エチル(メチル)アミノチオ及びメチル(プロピル)アミノチオ等が挙げられ、各々の指定の炭素数の範囲から選択される。

[0106] モノアルキルアミノアルキルとしては、メチルアミノメチル、エチルアミノメチル、プロピルアミノメチル、i-プロピルアミノメチル、ブチルアミノメチル、2-(メチルアミノ)エチル、2-(エチルアミノ)エチル及び3-(メチルアミノ)プロピル等が挙げられ、各々の指定の炭素数の範囲から選択される。

ジアルキルアミノアルキルとしては、ジメチルアミノメチル、ジエチルアミノメチル、エチル(メチル)アミノメチル、メチル(プロピル)アミノメチル、ブチル(メチル)アミノメチル、2-(ジエチルアミノ)エチル及び2-[エチル(メチル)アミノ]プロピル等が挙げられ、各々の指定の炭素

数の範囲から選択される。

モノアルキルアミノとしては、メチルアミノ、エチルアミノ、プロピルアミノ、*i*-プロピルアミノ、ブチルアミノ、*s*-ブチルアミノ、*i*-ブチルアミノ、*t*-ブチルアミノ、ペンチルアミノ及びヘキシルアミノ等が挙げられ、各々の指定の炭素数の範囲から選択される。

[0107] ジ（アルキル）アミノとしては、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、ジプロピルアミノ、ジ（*i*-プロピル）アミノ、ジブチルアミノ、ジ（*s*-ブチル）アミノ、ジ（*i*-ブチル）アミノ、ジ（*t*-ブチル）アミノ、ジペンチルアミノ、ジヘキシルアミノ、エチル（メチル）アミノ及びメチル（プロピル）アミノ等が挙げられ、各々の指定の炭素数の範囲から選択される。

[0108] アルキルカルボニルオキシとしては、アセトキシ、プロピオニルオキシ、ブチリルオキシ、*i*-ブチリルオキシ、バレロイルオキシ、*i*-バレロイルオキシ、2-メチルブチリルオキシ、ピバロイルオキシ、ヘキサノイルオキシ、2-エチルブチリルオキシ、2-メチルバレロイルオキシ、4-メチルバレロイルオキシ、ヘプタノイルオキシ、2, 2-ジメチルバレロイルオキシ、2-エチルヘキサノイルオキシ、2-プロピル-バレロイルオキシ、オクタノイルオキシ、ノナノイルオキシ、3, 5, 5-トリメチルヘキサノイルオキシ及びデカノイルオキシ等が挙げられ、各々の指定の炭素数の範囲から選択される。

[0109] “ R_3 と R_4 はお互い結合して3～7員環を形成することができ、”とは、 R_3 と R_4 が結合した炭素を含むシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、エポキシ、テトラヒドロフラン、テトラヒドロピラン、テトラヒドロチオフェン、テトラヒドロチオピラン、ピロリジン及びピペリジン等を形成することができることを表す。

[0110] “同一炭素上の R_5 、 R_6 、 R_7 及び R_8 はお互い結合して、酸素原子、硫黄原子及び窒素原子（該窒素原子は C_1 - C_6 アルキル、 C_2 - C_6 アルケニル、 C_2 - C_6 アルキニル又はシクロ C_3 - C_6 アルキルによって置換されていても良い。）から選択される1又は2のヘテロ原子により中断されていても良く、任

意に置換されていても良い3～7員環を形成することができ、”とは、同一炭素上の R_5 、 R_6 、 R_7 及び R_8 が R_5 、 R_6 、 R_7 及び R_8 が結合した炭素を含むシクロプロピル、ジクロロシクロプロピル、ジメチルシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、エポキシ、テトラヒドロフラン、テトラヒドロピラン、テトラヒドロチオフェン、テトラヒドロチオピラン、ピロリジン及びピペリジン等を形成することができることを表す。

[0111] “ R_5 、 R_6 、 R_7 、 R_8 及び R_9 は異なった炭素上の R_5 、 R_6 、 R_7 又は R_8 と結合して、酸素原子、硫黄原子又は窒素原子（該窒素原子は C_1-C_6 アルキル、 C_2-C_6 アルケニル、 C_2-C_6 アルキニル又はシクロ C_3-C_6 アルキルによって置換されていても良い。）から選択される1又は2のヘテロ原子により中断されていても良く、任意に置換されていても良い3～8員環を形成することができ”とは、 R_5 、 R_6 、 R_7 、 R_8 又は R_9 が異なる炭素上の R_5 、 R_6 、 R_7 又は R_8 と一緒に、 $-CH_2-$ 、 $-CH_2-CH_2-$ 、 $-CH_2-CCl_2-$ 、 $-O-$ 、 $-O-CH_2-$ 、 $-S-$ 、 $-S-CH_2-$ 、 $-NR_{12}-$ （ R_{12} は C_1-C_6 アルキル、 C_2-C_6 アルケニル、 C_2-C_6 アルキニル又はシクロ C_3-C_6 アルキル。）及び $-NR_{12}-CH_2-$ （ R_{12} は前記に同じ。）のような結合を形成することができることを表す。

“ R_5 及び R_6 は隣り合った炭素上の R_5 又は R_6 と一緒に結合を表すことができ”とは、 R_5 及び R_6 の結合した炭素と隣り合った R_5 及び R_6 の結合した炭素との間に二重結合を形成することができることを表す。

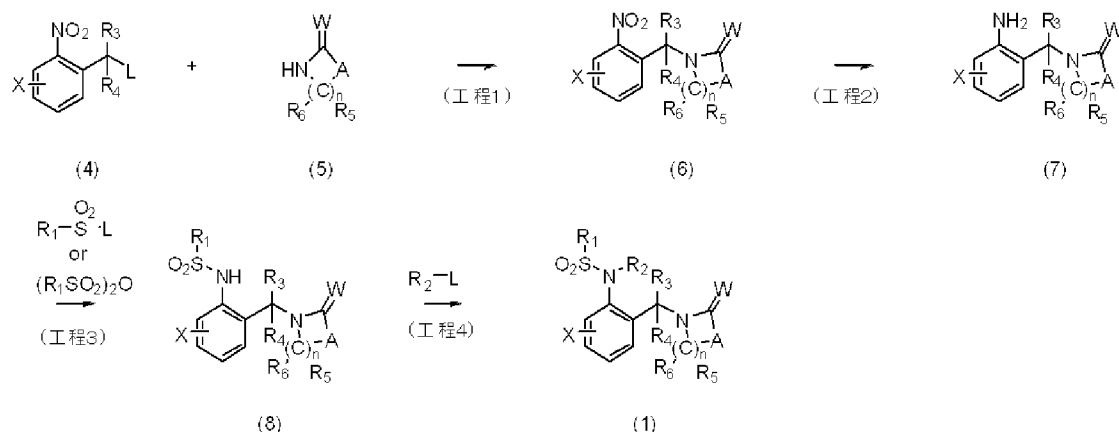
[0112] “ Y はベンゼン環又は複素環上の隣接する炭素原子若しくは窒素原子と一緒に、酸素原子、硫黄原子及び窒素原子（該窒素原子は C_1-C_6 アルキル、 C_2-C_6 アルケニル、 C_2-C_6 アルキニル又は C_3-C_6 シクロアルキルによって置換されていても良い。）から選択される1又は2のヘテロ原子により中断されていても良い C_1-C_4 アルキレン、ハロ C_1-C_4 アルキレン、 C_2-C_4 アルケニレン又はハロ C_2-C_4 アルケニレンにより5又は6員環を形成していても良い”とは、 Y が結合したベンゼン環又は複素環を含んだインデン

、ジヒドロインデン、ナフタレン、ジヒドロナフタレン、テトラヒドロナフタレン、ベンゾフラン、ジヒドロベンゾフラン、クロメン、クロマン、ベンゾチオフェン、ジヒドロベンゾチオフェン、チオクロメン、チオクロマン、インドール、インドリン、キノリン、ジヒドロキノリン、テトラヒドロキノリン、シクロペンタピリジン、ピロロピリジン、ナフチリジン、ピラゾロピリジン及びトリアゾロピリミジン等を形成することができることを表す。

[0113] 本発明化合物は、例えば下記の反応式 1 乃至反応式 7 に示す方法により製造できるが、これらの方法に限定されるものではない。

〔反応式 1〕

[0114] [化4]



〔式中、R₁、R₂、R₃、R₄、R₅、R₆、A、W、X 及び n は前記と同様の意味を表し、L はハロゲン原子等の脱離基を表す。〕

[0115] 反応式 1 に示すように、一般式 (4) で表される化合物と一般式 (5) で表される化合物を反応させることにより、一般式 (6) で表される化合物を製造することができ、一般式 (6) で表される化合物を単離し又は単離せずに、ニトロ基を還元することにより一般式 (7) で表される化合物を製造することができ、一般式 (7) で表される化合物を単離し又は単離せずに、一般式 R₁SO₂L あるいは (R₁SO₂)₂O で表されるハロアルキルスルホニル誘導体と反応させることにより一般式 (8) で表される本発明化合物を製造することができる。更に、一般式 (8) で表される本発明化合物を単離し又は単離せずに、一般式 R₂-L で表される化合物を反応させることにより一般

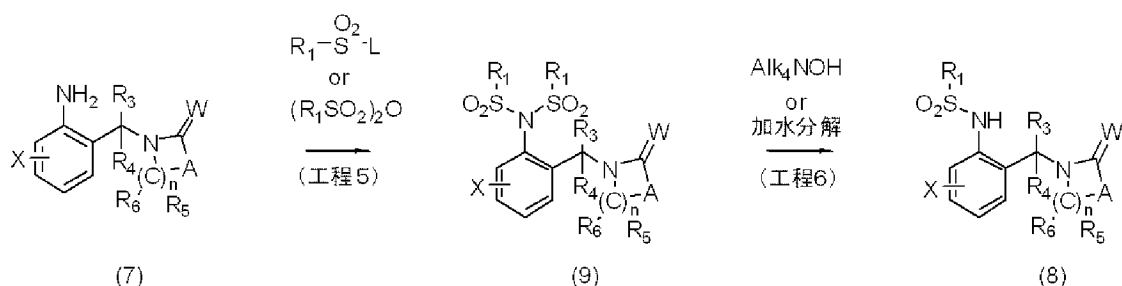
式（１）で表される本発明化合物を製造することができる。

[0116] 反応に用いられる中間体（４）は、市販されているか、もしくは *Journal of Organic Chemistry* 73 (15), 5989-5992 (2008)、*Bioorganic & Medicinal Chemistry* 15 (20), 6574-6595 (2007) 等に記載されている方法に準じて合成することができる。

[0117] 反応に用いられる中間体（５）は、市販されているか、もしくは *Journal of the American Chemical Society* 102 (25), 7578-7579 (1980)、*Journal of Organic Chemistry* 72 (12), 4536-4538 (2007)、*Journal of the American Chemical Society* 109 (12), 3789-3790 (1987)、*Tetrahedron* 43 (10), 2343-2348 (1987)、*Tetrahedron Letters* 32 (34), 4393-4396 (1991) 及び *Tetrahedron* 57, 8647-8651 (2001) 等に記載されている方法に準じて、又は本明細書中に参考例として示した方法などにより合成することができる。

〔反応式２〕

[0118] [化5]



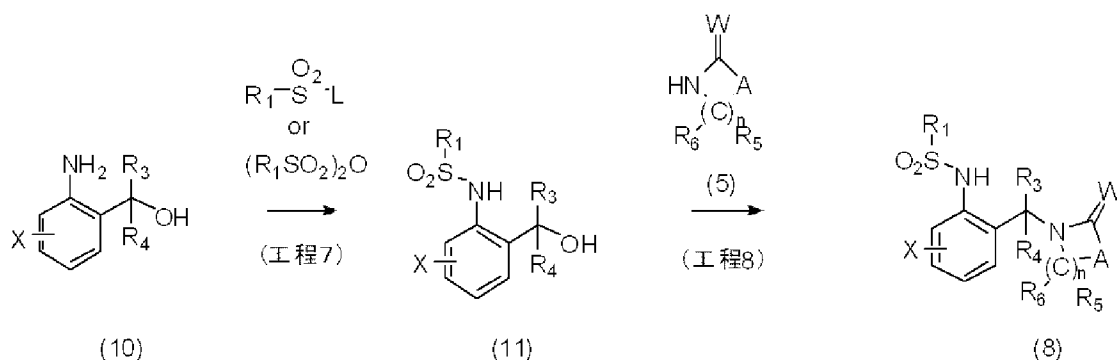
〔式中、R₁、R₃、R₄、R₅、R₆、A、W、X及びnは前記と同様の意味を表し、Lはハロゲン原子等の脱離基を表し、Alkはアルキル基を表す。〕

反応式２に示すように、一般式（７）で表される化合物に過剰の一般式R₁

SO₂Lあるいは(R₁SO₂)₂Oで表されるハロアルキルスルホニル誘導体を反応させることにより、一般式(9)で表される本発明化合物を製造することができる。更に一般式(9)で表される化合物を単離し又は単離せずに、一般式A I k₄NOHで表される化合物を反応させるか、又は水酸化ナトリウム、水酸化カリウムなどを用いて加水分解反応を行うことにより一般式(8)で表される本発明化合物を製造することができる。

〔反応式3〕

[0119] [化6]



〔式中、R₁、R₃、R₄、R₅、R₆、A、W、X及びnは前記と同様の意味を表し、Lはハロゲン原子等の脱離基を表す。〕

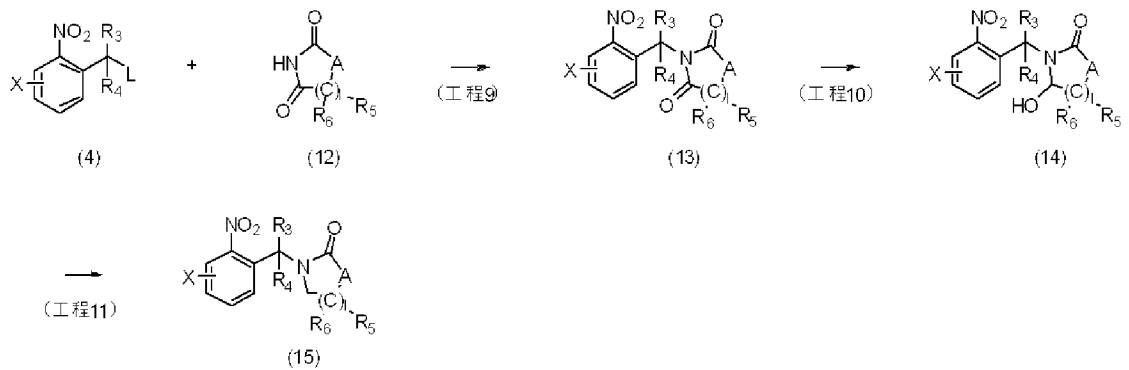
反応式3に示すように、一般式(10)で表される化合物に一般式R₁SO₂Lあるいは(R₁SO₂)₂Oで表されるハロアルキルスルホニル誘導体を反応させることにより一般式(11)で表される化合物を製造することができる。更に一般式(11)で表される化合物を単離し又は単離せずに、一般式(5)で表される化合物を反応させることにより、一般式(8)で表される本発明化合物を製造することができる。

反応に用いられる中間体(10)は、市販されているか、もしくはMedicinal Chemistry 4(4), 298-308(2008)及び国際公開2006/113432号パンフレット等に記載されている方法に準じて合成することができる。

〔反応式4〕

[0120]

[化7]



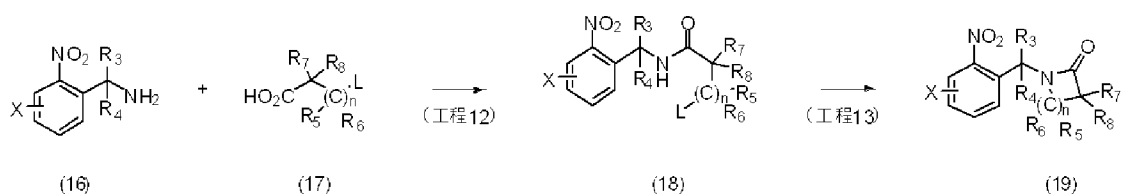
〔式中、R₃、R₄、R₅、R₆、A及びXは前記と同様の意味を表し、lは1乃至3の整数を表す。〕

反応式4に示すように、一般式(4)で表される化合物と一般式(12)で表される化合物を反応させることにより、一般式(13)で表される化合物を製造することができ、一般式(13)で表される化合物を単離し又は単離せずに、カルボニル基を還元することにより一般式(14)で表される化合物を製造することができる。さらに、一般式(14)で表される化合物を単離し又は単離せずに、ヒドロキシル基を還元することにより一般式(15)で表される化合物を製造することができる。

反応に用いられる中間体(12)は、市販されているか、もしくは *Heterocycles* 65(1), 9-22(2005)、*Journal de Pharmacie de Belgique* 17(1-2), 3-13(1962)、*Australian Journal of Chemistry* 13, 127-144(1960)などに記載されている方法に準じて合成することができる。

〔反応式5〕

[0121] [化8]



〔式中、 R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 、 R_7 、 R_8 、 X 及び n は前記と同様の意味を表し、 L はハロゲン原子等の脱離基を表す。〕

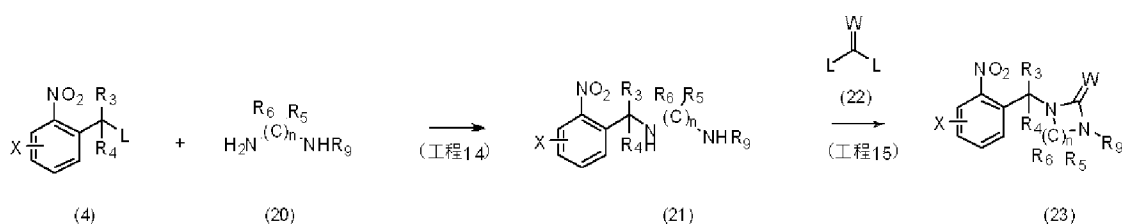
反応式5に示すように、一般式(16)で表される化合物と一般式(17)で表される化合物を縮合剤等を用いて反応させることにより、一般式(18)で表される化合物とし、更に一般式(18)で表される化合物を単離し又は単離せずに、環化反応を行うことにより一般式(19)で表される化合物を製造することができる。

反応に用いられる中間体(16)は、市販されているか、もしくは国際公開2006/113432号パンフレット、Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters 16(13), 3463-3468(2006)、Chemical Communications(14), 1557-1559(2006)等に記載されている方法に準じて合成することができる。

反応に用いられる中間体(17)は、市販されているか、もしくはJournal of the Chemical Society 4286-4288(1962)、Tetrahedron Letters 46(41), 7007-7009(2005)、Canadian Journal of Chemistry 64(3), 457-463(1986)、Synthesis(11), 963-965(1982)等に記載されている方法に準じて合成することができる。

〔反応式6〕

[0122] [化9]



〔式中、 R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 、 R_9 、 W 、 X 及び n は前記と同様の意味を表し、 L はハロゲン原子等の脱離基を表す。〕

反応式 6 に示すように、一般式 (4) で表される化合物と一般式 (20) で表される化合物を反応させることにより、一般式 (21) で表される化合物とし、更に一般式 (21) で表される化合物を単離し又は単離せずに、一般式 (22) で表される化合物と環化反応を行うことにより一般式 (23) で表される化合物を製造することができる。

反応に用いられる中間体 (20) は、市販されているか、もしくは *Journal of Organic Chemistry* 74 (6), 2571-2574 (2009)、*Journal of Organic Chemistry* 67 (12), 4086-4092 (2002) 等に記載されている方法に準じて合成することができる。

〔反応式 7〕

[0123] [化10]



〔式中、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 、 A 、 X 及び n は前記と同様の意味を表す。〕

反応式 7 に示すように、一般式 (24) で表される化合物をチオ化することにより一般式 (25) で表される本発明化合物を製造することができる。

[0124] 反応式 1 乃至反応式 7 において、工程 1、工程 3 乃至工程 5、工程 7、工程 9 及び工程 12 乃至工程 15 の反応は塩基存在下で実施してもよく、使用される塩基としては水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム及び水素化ナトリウム等の無機塩基類、ピリジン、4-ジメチルアミノピリジン、トリエチルアミン、トリブチルアミン、 N,N -ジメチルアニリン及び 1,8-ジアザビシクロ [5.4.0] -7-ウンデセン等の有機塩基類、ブチルリチウム及

び α -ブチルリチウム等の有機リチウム類、リチウムジイソプロピルアミド及びリチウムビス（トリメチルシリル）アミド等の有機リチウムアミド類、並びにナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド及びカリウム t -ブトキシド等の金属アルコキシド類等が挙げられる。塩基は反応する化合物 1 当量に対して通常 0 乃至 10 当量、好ましくは 0 乃至 2 当量使用される。

[0125] 反応式 1 乃至反応式 7 の反応は必要に応じて溶媒を使用できる。溶媒は反応に不活性なものであれば特に制限はないが、例えば、ヘキサン、シクロヘキサン、ベンゼン及びトルエン等の炭化水素類、四塩化炭素、クロロホルム及び 1, 2-ジクロロエタン等のハロゲン系炭化水素類、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、1, 4-ジオキサン及びテトラヒドロフラン等のエーテル類、アセトン、メチルエチルケトン及びメチルイソブチルケトン等のケトン類、アセトニトリル及びプロピオニトリル等のニトリル類、酢酸エチル及びプロピオン酸エチル等のカルボン酸エステル類、N, N-ジメチルホルムアミド、N, N-ジメチルアセトアミド、N-メチル-2-ピロリドン及び 1, 3-ジメチル-2-イミダゾリジノン等の含窒素非プロトン性極性溶媒、ジメチルスルホキシド及びスルホラン等の含硫黄非プロトン性極性溶媒、ピリジン及びピコリン等のピリジン類等が挙げられる。これらの溶媒は単独で用いても、これらのうちの 2 種類以上を混合して用いても良い。

[0126] また、反応式 1 乃至反応式 7 の反応は、均一系でも二相系でも行うことができ、二相系の場合は相間移動触媒を用いると効果的な場合もある。用いる相間移動触媒としては、例えば、テトラブチルアンモニウムクロリド及びテトラブチルアンモニウムブロミド等の 4 級アンモニウム塩、18-クラウン-6 等のクラウンエーテル等が挙げられる。

[0127] 反応式 1 乃至反応式 7 の反応温度は、通常 -90 乃至 200℃、好ましくは 0 乃至 120℃である。

反応式 1 乃至反応式 7 の反応時間は、通常 0.05 乃至 100 時間、好ましくは 0.5 乃至 10 時間である。

[0128] 反応式 3 の工程 8 の反応は、酸触媒存在下で実施してもよく、使用される

酸触媒としては塩酸、硫酸及び硝酸等の鉱酸類、ギ酸、酢酸、トリフルオロ酢酸、メタンスルホン酸及びp-トルエンスルホン酸等の有機酸類、塩化亜鉛、四塩化チタン及び三フッ化ホウ素-エーテル錯体等のルイス酸類等が挙げられる。酸触媒は反応する化合物1当量に対して通常0乃至10当量、好ましくは0乃至2当量使用される。

[0129] 反応式4の工程10の反応におけるカルボニル基の還元法に特に制限はないが、例えば鉄、塩化亜鉛及び塩化スズ等の金属還元、パラジウム触媒存在下で水素添加による還元、又は水素化ホウ素ナトリウム、水素化ホウ素リチウム及び水素化アルミニウムリチウム等の金属ヒドリド類による還元等を用いることができる。

反応式4の工程11の反応のヒドロキシル基の還元法に特に制限はないが、例えばトリエチルシラン/トリフルオロ酢酸による反応、酸触媒による脱水とそれに引き続くパラジウムなどの金属触媒存在下の水素添加反応等を用いることができる。

[0130] 反応式5の工程12の反応に使用する縮合剤としては、特に制限はないが、例えばWSC (Water Soluble Carbodiimide)、N, N'-ジシクロヘキシルカルボジイミド、塩化オキサリル、塩化チオニル等が挙げられる。

[0131] 反応式7で使用されるチオ化剤に特に制限はないが、例えば、ローソン試薬、横山試薬、 PSCl_3 、 P_2S_5 等が挙げられる。

以上の反応によって得られる目的物は、反応終了後、濾取、抽出、洗浄、カラムクロマトグラフィー、再結晶及び蒸留等の操作により、単離及び精製することができる。

[0132] 次に、本発明に含まれるハロアルキルスルホンアニリド化合物の例を、第2表乃至第4表に、その製造中間体の例を第5表乃至第9表に示すが、本発明化合物はこれらに限定されるものではない。

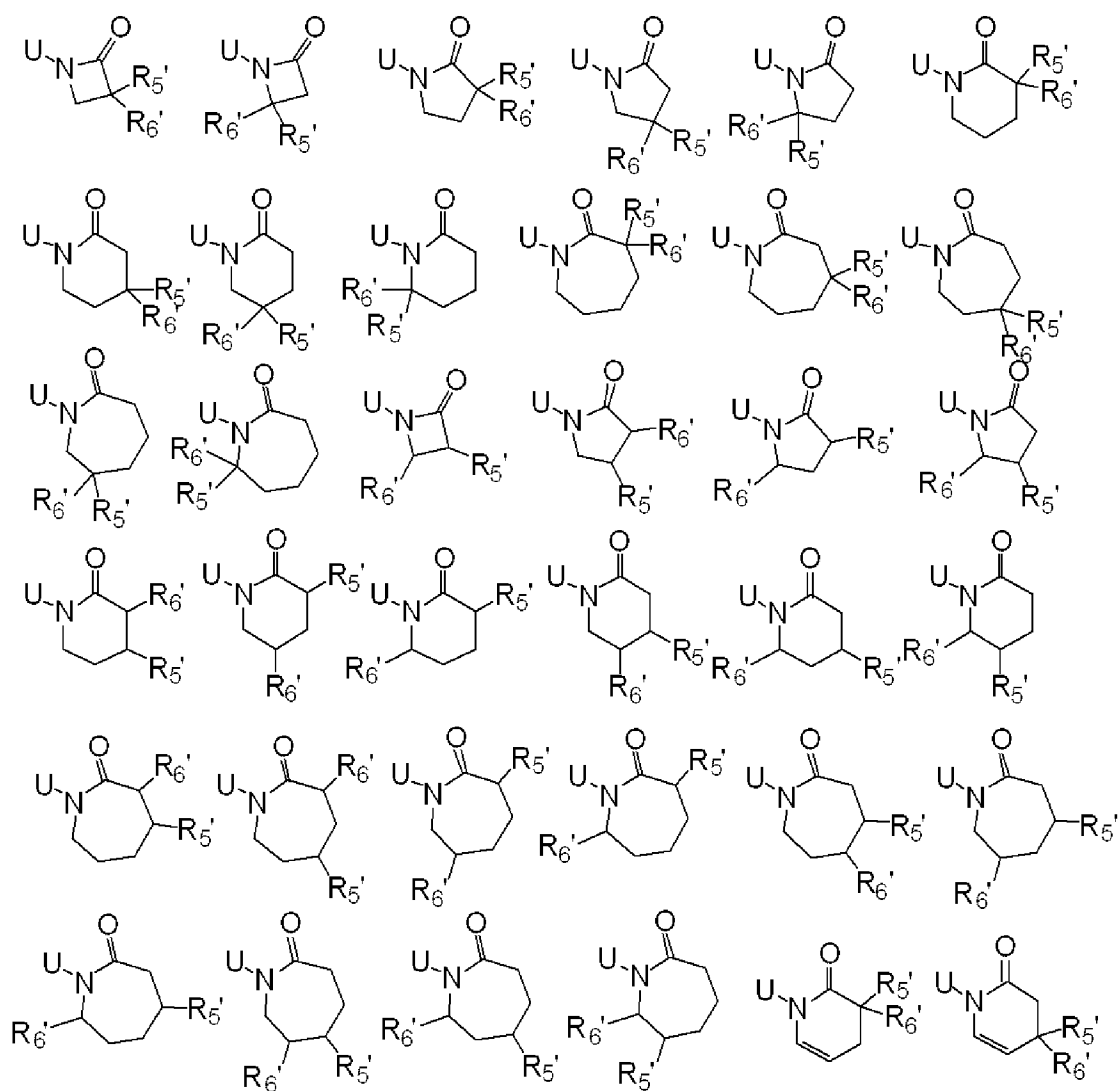
但し、表中の記号は下記の意味を表し、また、例えば、 $\text{Ph}-2-\text{Cl}$ は2-クロロフェニルを表す。

Me: メチル基、Et: エチル基、Pr: プロピル基、Bu: ブチル基、

Pen : ペンチル基、Hex : ヘキシル基、Ph : フェニル基、

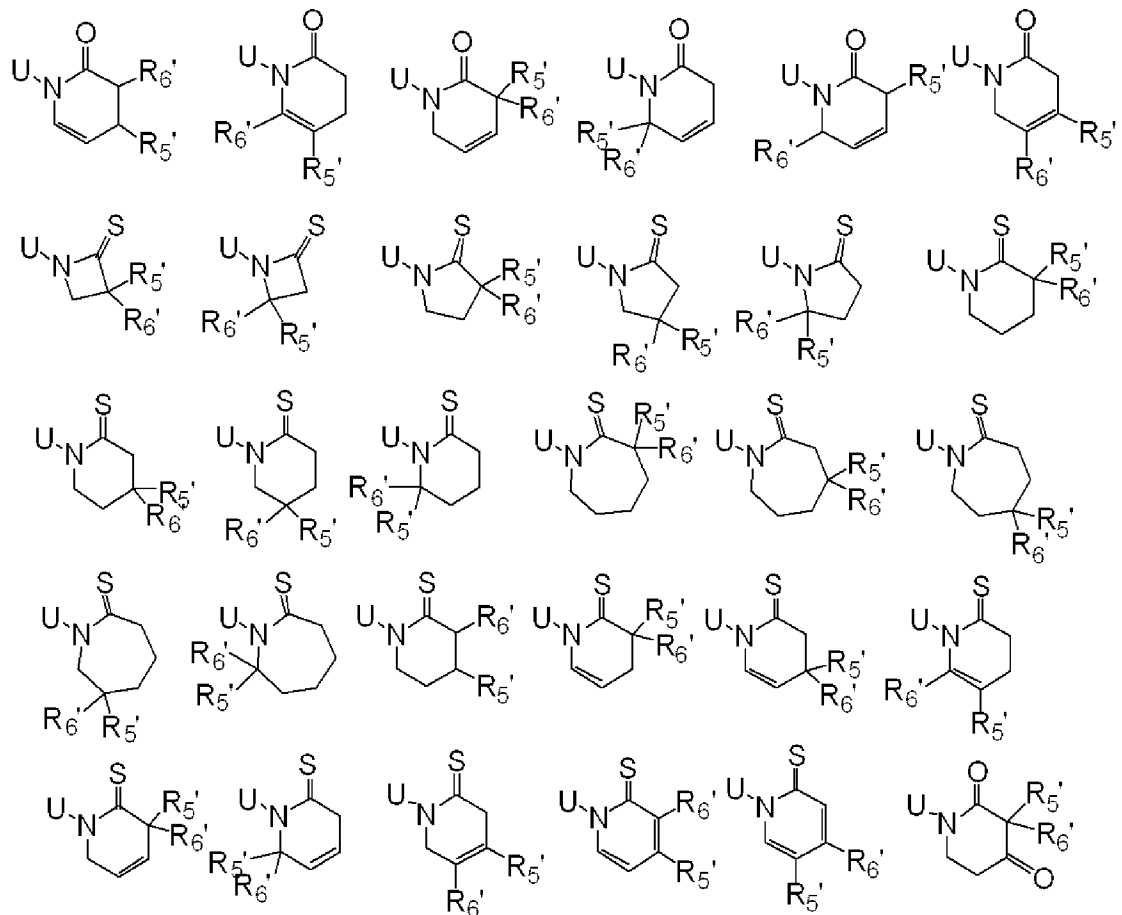
[0133] [第2表]

[0134] [化11]



[0135]

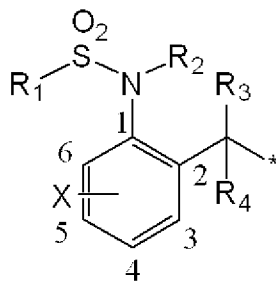
[化12]



[0136] Uは、以下の一般式（26）で表される。

一般式（26）

[0137] [化13]



表中、Xの置換位置は、一般式（26）中の数字の位置を表し、例えば、3-Fはベンゼン環の3と示した炭素がFで置換されていることを表す。

[0138] $R_3 = R_4 = H$

R_1	R_2	R_5'	R_6'	X
CF_3	H	H	H	H
CF_3	H	Me	H	H
CF_3	H	Me	Me	H
CF_3	H	Me	Cl	H
CF_3	H	Me	CO_2Et	H
CF_3	H	Et	H	H
CF_3	H	Et	Me	H
CF_3	H	Et	CO_2Et	H
CF_3	H	Pr-n	H	H
CF_3	H	Pr-n	Me	H
CF_3	H	Pr-i	H	H
CF_3	H	Pr-i	Me	H
CF_3	H	Pr-c	H	H
CF_3	H	Pr-c	Me	H
CF_3	H	Bu-n	H	H
CF_3	H	Bu-n	Me	H
CF_3	H	Bu-i	H	H
CF_3	H	Bu-i	Me	H
CF_3	H	Bu-s	H	H
CF_3	H	Bu-s	Me	H
CF_3	H	Bu-t	H	H
CF_3	H	Bu-t	Me	H
CF_3	H	Bu-c	H	H
CF_3	H	Bu-c	Me	H
CF_3	H	Pen-n	H	H
CF_3	H	Pen-n	Me	H

CF_3	H	P e n - c	H	H
CF_3	H	P e n - c	M e	H
CF_3	H	H e x - n	H	H
CF_3	H	H e x - n	M e	H
CF_3	H	H e x - c	H	H
CF_3	H	H e x - c	M e	H
CF_3	H	C l	H	H
CF_3	H	C l	C l	H
CF_3	H	B r	H	H
CF_3	H	B r	B r	H
CF_3	H	I	H	H
CF_3	H	F	H	H
CF_3	H	$\text{CH}=\text{CH}_2$	H	H
CF_3	H	$\text{CH}=\text{CH}_2$	M e	H
CF_3	H	$\text{C}\equiv\text{CH}$	H	H
CF_3	H	$\text{C}\equiv\text{CH}$	M e	H
CF_3	H	$\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	H	H
CF_3	H	$\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	M e	H
CF_3	H	$\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	H	H
CF_3	H	$\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	M e	H
CF_3	H	$\text{CH}_2\text{C l}$	H	H
CF_3	H	$\text{CH}_2\text{C l}$	M e	H
CF_3	H	$\text{CH}_2\text{C l}$	$\text{CH}_2\text{C l}$	H
CF_3	H	CHC l_2	H	H
CF_3	H	CC l_3	H	H
CF_3	H	CH_2F	H	H
CF_3	H	CHF_2	H	H
CF_3	H	CF_3	H	H

CF_3	H	CF_3	Me	H
CF_3	H	CF_3	Et	H
CF_3	H	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$	H	H
CF_3	H	CH_2OH	H	H
CF_3	H	CH_2SMe	H	H
CF_3	H	$\text{CH}_2\text{SCH}_2\text{Cl}$	H	H
CF_3	H	Ph	H	H
CF_3	H	Ph	Me	H
CF_3	H	Ph-2-Cl	H	H
CF_3	H	Ph-2-Cl	Me	H
CF_3	H	Ph-3-Cl	H	H
CF_3	H	Ph-3-Cl	Me	H
CF_3	H	Ph-4-Cl	H	H
CF_3	H	Ph-4-Cl	Me	H
CF_3	H	Ph-3-I	H	H
CF_3	H	Ph-4-F	H	H
CF_3	H	Ph-2-Me	H	H
CF_3	H	Ph-3-OMe	H	H
CF_3	H	Ph-4-SMe	H	H
CF_3	H	Ph-3-CN	H	H
CF_3	H	Ph-4-NO ₂	H	H
CF_3	H	Ph-2-CO ₂ Me	H	H
CF_3	H	Ph-3-NH ₂	H	H
CF_3	H	Ph-4-Ph	H	H
CF_3	H	Ph-2-OPh	H	H
CF_3	H	Ph-3-SPh	H	H
CF_3	H	Ph-4-CONMe ₂	H	H
CF_3	H	Ph-2-OH	H	H

CF_3	H	COMe	H	H
CF_3	H	COEt	H	H
CF_3	H	COCH ₂ Cl	H	H
CF_3	H	CO ₂ H	H	H
CF_3	H	CO ₂ Me	H	H
CF_3	H	CO ₂ Me	Me	H
CF_3	H	CO ₂ Et	H	H
CF_3	H	CO ₂ Bu-i	H	H
CF_3	H	CONH ₂	H	H
CF_3	H	CONHMe	H	H
CF_3	H	CONMe ₂	H	H
CF_3	H	CH ₂ Ph	H	H
CF_3	H	CH ₂ Ph-2-Cl	H	H
CF_3	H	CH ₂ Ph-3-Cl	H	H
CF_3	H	CH ₂ Ph-4-Cl	H	H
CF_3	H	COPh	H	H
CF_3	H	COPh-2-Cl	H	H
CF_3	H	COPh-3-Cl	H	H
CF_3	H	COPh-4-Cl	H	H
CF_3	H	OH	H	H
CF_3	H	OMe	H	H
CF_3	H	OMe	Me	H
CF_3	H	OEt	H	H
CF_3	H	OEt	Me	H
CF_3	H	SMe	H	H
CF_3	H	SMe	Me	H
CF_3	H	SPh	H	H
CF_3	H	CN	H	H

CF_3	H	NH_2	H	H
CF_3	H	NHMe	H	H
CF_3	H	NHMe	Me	H
CF_3	H	NMe_2	H	H
CF_3	H	NMe_2	Me	H
CF_3	H	$-\text{CH}_2-\text{O}-\text{CH}_2-$		H
CF_3	H	$-(\text{CH}_2)_2-$		H
CF_3	H	$-\text{CH}_2\text{CCl}_2-$		H
CF_3	H	$-\text{CH}_2\text{CF}_2-$		H
CF_3	H	$-(\text{CH}_2)_3-$		H
CF_3	H	$-(\text{CH}_2)_4-$		H
CF_3	H	$-(\text{CH}_2)_5-$		H
CF_3	H	H	H	3-F
CF_3	H	H	H	4-F
CF_3	H	H	H	5-F
CF_3	H	H	H	6-F
CF_3	H	H	H	4-Cl
CF_3	H	H	H	5-Cl
CF_3	H	H	H	4-Br
CF_3	H	H	H	4-I
CF_3	H	H	H	4-Me
CF_3	H	H	H	5-Me
CF_3	H	H	H	4-OMe
CF_3	H	H	H	4-SMe
CF_3	H	Me	H	3-F
CF_3	H	Me	H	4-F
CF_3	H	Me	H	5-F
CF_3	H	Me	H	6-F

CF ₃	H	Me	H	4-Cl
CF ₃	H	Me	H	5-Cl
CF ₃	H	Me	H	4-Br
CF ₃	H	Me	H	4-I
CF ₃	H	Me	H	4-Me
CF ₃	H	Me	H	5-Me
CF ₃	H	Me	H	4-OMe
CF ₃	H	Me	H	4-SMe
CF ₃	H	Me	Me	3-F
CF ₃	H	Me	Me	4-F
CF ₃	H	Me	Me	5-F
CF ₃	H	Me	Me	6-F
CF ₃	H	Me	Me	4-Cl
CF ₃	H	Me	Me	5-Cl
CF ₃	H	Me	Me	4-Br
CF ₃	H	Me	Me	4-I
CF ₃	H	Me	Me	4-Me
CF ₃	H	Me	Me	5-Me
CF ₃	H	Me	Me	4-OMe
CF ₃	H	Me	Me	4-SMe
CF ₃	Me	H	H	H
CF ₃	Me	Me	H	H
CF ₃	Me	Me	Me	H
CF ₃	Et	H	H	H
CF ₃	Et	Me	H	H
CF ₃	Et	Me	Me	H
CF ₃	COMe	H	H	H
CF ₃	COMe	Me	H	H

CF_3	COMe	Me	Me	H
CF_3	COMe	Et	H	H
CF_3	COMe	Et	Me	H
CF_3	COMe	Pr-n	H	H
CF_3	COMe	Pr-n	Me	H
CF_3	COMe	Cl	H	H
CF_3	COMe	$\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	H	H
CF_3	COMe	CH_2Cl	H	H
CF_3	COMe	CF_3	H	H
CF_3	COMe	CF_3	Me	H
CF_3	COMe	Ph	H	H
CF_3	COMe	Ph	Me	H
CF_3	COMe	Ph-2-Cl	H	H
CF_3	COMe	Ph-3-Cl	H	H
CF_3	COMe	Ph-4-Cl	H	H
CF_3	COMe	COMe	H	H
CF_3	COMe	CO_2H	H	H
CF_3	COMe	CO_2Me	H	H
CF_3	COMe	CONH_2	H	H
CF_3	COMe	CONHMe	H	H
CF_3	COMe	CONMe_2	H	H
CF_3	COMe	OH	H	H
CF_3	COMe	OMe	H	H
CF_3	COMe	OMe	Me	H
CF_3	COMe	SMe	H	H
CF_3	COMe	SMe	Me	H
CF_3	COMe	NHMe	H	H
CF_3	COMe	NHMe	Me	H

CF ₃	COMe	CH ₂ Ph	H	H
CF ₃	COMe	CH ₂ Ph-2-Cl	H	H
CF ₃	COMe	CH ₂ Ph-3-Cl	H	H
CF ₃	COMe	CH ₂ Ph-4-Cl	H	H
CF ₃	COMe	COPh	H	H
CF ₃	COMe	COPh-2-Cl	H	H
CF ₃	COMe	COPh-3-Cl	H	H
CF ₃	COMe	COPh-4-Cl	H	H
CF ₃	COMe	-CH ₂ -O-CH ₂ -		H
CF ₃	COMe	-(CH ₂) ₂ -		H
CF ₃	COMe	-(CH ₂) ₃ -		H
CF ₃	COMe	-(CH ₂) ₄ -		H
CF ₃	COMe	-(CH ₂) ₅ -		H
CF ₃	COEt	H	H	H
CF ₃	COEt	Me	H	H
CF ₃	COEt	Me	Me	H
CF ₃	COEt	Me	Cl	H
CF ₃	COEt	Me	CO ₂ Et	H
CF ₃	COEt	Et	H	H
CF ₃	COEt	Et	Me	H
CF ₃	COEt	Et	CO ₂ Et	H
CF ₃	COEt	Pr-n	H	H
CF ₃	COEt	Pr-n	Me	H
CF ₃	COEt	Pr-i	H	H
CF ₃	COEt	Pr-i	Me	H
CF ₃	COEt	Pr-c	H	H
CF ₃	COEt	Pr-c	Me	H
CF ₃	COEt	Bu-n	H	H

CF_3	COEt	Bu-n	Me	H
CF_3	COEt	Bu-i	H	H
CF_3	COEt	Bu-i	Me	H
CF_3	COEt	Bu-s	H	H
CF_3	COEt	Bu-s	Me	H
CF_3	COEt	Bu-t	H	H
CF_3	COEt	Bu-t	Me	H
CF_3	COEt	Bu-c	H	H
CF_3	COEt	Bu-c	Me	H
CF_3	COEt	Pen-n	H	H
CF_3	COEt	Pen-n	Me	H
CF_3	COEt	Pen-c	H	H
CF_3	COEt	Pen-c	Me	H
CF_3	COEt	Hex-n	H	H
CF_3	COEt	Hex-n	Me	H
CF_3	COEt	Hex-c	H	H
CF_3	COEt	Hex-c	Me	H
CF_3	COEt	Cl	H	H
CF_3	COEt	Cl	Cl	H
CF_3	COEt	Cl	Me	H
CF_3	COEt	Br	H	H
CF_3	COEt	Br	Br	H
CF_3	COEt	I	H	H
CF_3	COEt	F	H	H
CF_3	COEt	$\text{CH}=\text{CH}_2$	H	H
CF_3	COEt	$\text{CH}=\text{CH}_2$	Me	H
CF_3	COEt	$\text{C}\equiv\text{CH}$	H	H
CF_3	COEt	$\text{C}\equiv\text{CH}$	Me	H

CF_3	COE t	$\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	H	H
CF_3	COE t	$\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	Me	H
CF_3	COE t	$\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	H	H
CF_3	COE t	$\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	Me	H
CF_3	COE t	$\text{CH}_2\text{C I}$	H	H
CF_3	COE t	$\text{CH}_2\text{C I}$	Me	H
CF_3	COE t	$\text{CH}_2\text{C I}$	$\text{CH}_2\text{C I}$	H
CF_3	COE t	CHCl_2	H	H
CF_3	COE t	CCl_3	H	H
CF_3	COE t	CH_2F	H	H
CF_3	COE t	CHF_2	H	H
CF_3	COE t	CF_3	H	H
CF_3	COE t	CF_3	Me	H
CF_3	COE t	CF_3	Et	H
CF_3	COE t	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C I}$	H	H
CF_3	COE t	CH_2OH	H	H
CF_3	COE t	CH_2SMe	H	H
CF_3	COE t	$\text{CH}_2\text{SCH}_2\text{C I}$	H	H
CF_3	COE t	Ph	H	H
CF_3	COE t	Ph	Me	H
CF_3	COE t	Ph-2-C I	H	H
CF_3	COE t	Ph-2-C I	Me	H
CF_3	COE t	Ph-3-C I	H	H
CF_3	COE t	Ph-3-C I	Me	H
CF_3	COE t	Ph-4-C I	H	H
CF_3	COE t	Ph-4-C I	Me	H
CF_3	COE t	Ph-2-Br	H	H
CF_3	COE t	Ph-3-I	H	H

CF ₃	COEt	Ph-4-F	H	H
CF ₃	COEt	Ph-2-Me	H	H
CF ₃	COEt	Ph-3-OMe	H	H
CF ₃	COEt	Ph-4-SMe	H	H
CF ₃	COEt	Ph-2-SO ₂ Me	H	H
CF ₃	COEt	Ph-3-CN	H	H
CF ₃	COEt	Ph-4-NO ₂	H	H
CF ₃	COEt	Ph-2-CO ₂ Me	H	H
CF ₃	COEt	Ph-3-NH ₂	H	H
CF ₃	COEt	Ph-4-Ph	H	H
CF ₃	COEt	Ph-2-OPh	H	H
CF ₃	COEt	Ph-3-SPh	H	H
CF ₃	COEt	Ph-4-CONMe ₂ H		H
CF ₃	COEt	Ph-2-OH	H	H
CF ₃	COEt	COMe	H	H
CF ₃	COEt	COEt	H	H
CF ₃	COEt	COCH ₂ Cl	H	H
CF ₃	COEt	CO ₂ H	H	H
CF ₃	COEt	CO ₂ Me	H	H
CF ₃	COEt	CO ₂ Me	Me	H
CF ₃	COEt	CO ₂ Et	H	H
CF ₃	COEt	CO ₂ Bu-i	H	H
CF ₃	COEt	CONH ₂	H	H
CF ₃	COEt	CONHMe	H	H
CF ₃	COEt	CONMe ₂	H	H
CF ₃	COEt	CH ₂ Ph	H	H
CF ₃	COEt	CH ₂ Ph-2-Cl	H	H
CF ₃	COEt	CH ₂ Ph-3-Cl	H	H

CF_3	COEt	$\text{CH}_2\text{Ph}-4-\text{Cl}$	H	H
CF_3	COEt	COPh	H	H
CF_3	COEt	$\text{COPh}-2-\text{Cl}$	H	H
CF_3	COEt	$\text{COPh}-3-\text{Cl}$	H	H
CF_3	COEt	$\text{COPh}-4-\text{Cl}$	H	H
CF_3	COEt	OH	H	H
CF_3	COEt	OMe	H	H
CF_3	COEt	OMe	Me	H
CF_3	COEt	OEt	H	H
CF_3	COEt	OEt	Me	H
CF_3	COEt	SMe	H	H
CF_3	COEt	SMe	Me	H
CF_3	COEt	SPh	H	H
CF_3	COEt	CN	H	H
CF_3	COEt	NH_2	H	H
CF_3	COEt	NHMe	H	H
CF_3	COEt	NHMe	Me	H
CF_3	COEt	NMe_2	H	H
CF_3	COEt	NMe_2	Me	H
CF_3	COEt	$-\text{CH}_2-\text{O}-\text{CH}_2-$	H	
CF_3	COEt	$-(\text{CH}_2)_2-$	H	
CF_3	COEt	$-\text{CH}_2\text{CCl}_2-$	H	
CF_3	COEt	$-\text{CH}_2\text{CF}_2-$	H	
CF_3	COEt	$-(\text{CH}_2)_3-$	H	
CF_3	COEt	$-(\text{CH}_2)_4-$	H	
CF_3	COEt	$-(\text{CH}_2)_5-$	H	
CF_3	COEt	H	H	3-F
CF_3	COEt	H	H	4-F

CF ₃	COEt	H	H	5-F
CF ₃	COEt	H	H	6-F
CF ₃	COEt	H	H	4-Cl
CF ₃	COEt	H	H	5-Cl
CF ₃	COEt	H	H	4-Br
CF ₃	COEt	H	H	4-I
CF ₃	COEt	H	H	4-Me
CF ₃	COEt	H	H	5-Me
CF ₃	COEt	H	H	4-OMe
CF ₃	COEt	H	H	4-SMe
CF ₃	COEt	Me	H	3-F
CF ₃	COEt	Me	H	4-F
CF ₃	COEt	Me	H	5-F
CF ₃	COEt	Me	H	6-F
CF ₃	COEt	Me	H	4-Cl
CF ₃	COEt	Me	H	5-Cl
CF ₃	COEt	Me	H	4-Br
CF ₃	COEt	Me	H	4-I
CF ₃	COEt	Me	H	4-Me
CF ₃	COEt	Me	H	5-Me
CF ₃	COEt	Me	H	4-OMe
CF ₃	COEt	Me	H	4-SMe
CF ₃	COEt	Me	Me	3-F
CF ₃	COEt	Me	Me	4-F
CF ₃	COEt	Me	Me	5-F
CF ₃	COEt	Me	Me	6-F
CF ₃	COEt	Me	Me	4-Cl
CF ₃	COEt	Me	Me	5-Cl

CF ₃	COEt	Me	Me	6-Cl
CF ₃	COEt	Me	Me	3-Br
CF ₃	COEt	Me	Me	4-Br
CF ₃	COEt	Me	Me	5-Br
CF ₃	COEt	Me	Me	4-I
CF ₃	COEt	Me	Me	4-Me
CF ₃	COEt	Me	Me	5-Me
CF ₃	COEt	Me	Me	4-OMe
CF ₃	COEt	Me	Me	4-SMe
CF ₃	COPr-n	H	H	H
CF ₃	COPr-n	Me	H	H
CF ₃	COPr-n	Me	Me	H
CF ₃	COPr-n	Et	H	H
CF ₃	COPr-n	Et	Me	H
CF ₃	COPr-n	Pr-n	H	H
CF ₃	COPr-n	Pr-n	Me	H
CF ₃	COPr-n	Cl	H	H
CF ₃	COPr-n	CH ₂ CH=CH ₂	H	H
CF ₃	COPr-n	CH ₂ Cl	H	H
CF ₃	COPr-n	CF ₃	H	H
CF ₃	COPr-n	CF ₃	Me	H
CF ₃	COPr-n	Ph	H	H
CF ₃	COPr-n	Ph	Me	H
CF ₃	COPr-n	Ph-2-Cl	H	H
CF ₃	COPr-n	Ph-3-Cl	H	H
CF ₃	COPr-n	Ph-4-Cl	H	H
CF ₃	COPr-n	COMe	H	H
CF ₃	COPr-n	CO ₂ H	H	H

CF ₃	COP r - n	CO ₂ Me	H	H
CF ₃	COP r - n	CONH ₂	H	H
CF ₃	COP r - n	CONHMe	H	H
CF ₃	COP r - n	CONMe ₂	H	H
CF ₃	COP r - n	OH	H	H
CF ₃	COP r - n	OMe	H	H
CF ₃	COP r - n	OMe	Me	H
CF ₃	COP r - n	SMe	H	H
CF ₃	COP r - n	SMe	Me	H
CF ₃	COP r - n	NHMe	H	H
CF ₃	COP r - n	NHMe	Me	H
CF ₃	COP r - n	CH ₂ Ph	H	H
CF ₃	COP r - n	CH ₂ Ph-2-Cl	H	H
CF ₃	COP r - n	CH ₂ Ph-3-Cl	H	H
CF ₃	COP r - n	CH ₂ Ph-4-Cl	H	H
CF ₃	COP r - n	COPh	H	H
CF ₃	COP r - n	COPh-2-Cl	H	H
CF ₃	COP r - n	COPh-3-Cl	H	H
CF ₃	COP r - n	COPh-4-Cl	H	H
CF ₃	COP r - n	-CH ₂ -O-CH ₂ -		H
CF ₃	COP r - n	-(CH ₂) ₂ -		H
CF ₃	COP r - n	-(CH ₂) ₃ -		H
CF ₃	COP r - n	-(CH ₂) ₄ -		H
CF ₃	COP r - n	-(CH ₂) ₅ -		H
CF ₃	COP r - i	H	H	H
CF ₃	COP r - i	Me	H	H
CF ₃	COP r - i	Me	Me	H
CF ₃	COP r - i	Et	H	H

CF_3	COP r - i	Et	Me	H
CF_3	COP r - i	Pr - n	H	H
CF_3	COP r - i	Pr - n	Me	H
CF_3	COP r - i	Cl	H	H
CF_3	COP r - i	$\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	H	H
CF_3	COP r - i	CH_2Cl	H	H
CF_3	COP r - i	CF_3	H	H
CF_3	COP r - i	CF_3	Me	H
CF_3	COP r - i	Ph	H	H
CF_3	COP r - i	Ph	Me	H
CF_3	COP r - i	Ph - 2 - Cl	H	H
CF_3	COP r - i	Ph - 3 - Cl	H	H
CF_3	COP r - i	Ph - 4 - Cl	H	H
CF_3	COP r - i	COMe	H	H
CF_3	COP r - i	CO_2H	H	H
CF_3	COP r - i	CO_2Me	H	H
CF_3	COP r - i	CONH_2	H	H
CF_3	COP r - i	CONHMe	H	H
CF_3	COP r - i	CONMe ₂	H	H
CF_3	COP r - i	OH	H	H
CF_3	COP r - i	OMe	H	H
CF_3	COP r - i	OMe	Me	H
CF_3	COP r - i	SMe	H	H
CF_3	COP r - i	SMe	Me	H
CF_3	COP r - i	NHMe	H	H
CF_3	COP r - i	NHMe	Me	H
CF_3	COP r - i	CH_2Ph	H	H
CF_3	COP r - i	$\text{CH}_2\text{Ph} - 2 - \text{Cl}$	H	H

CF ₃	COP r - i	CH ₂ Ph-3-Cl	H	H
CF ₃	COP r - i	CH ₂ Ph-4-Cl	H	H
CF ₃	COP r - i	COPh	H	H
CF ₃	COP r - i	COPh-2-Cl	H	H
CF ₃	COP r - i	COPh-3-Cl	H	H
CF ₃	COP r - i	COPh-4-Cl	H	H
CF ₃	COP r - i	-CH ₂ -O-CH ₂ -		H
CF ₃	COP r - i	-(CH ₂) ₂ -		H
CF ₃	COP r - i	-(CH ₂) ₃ -		H
CF ₃	COP r - i	-(CH ₂) ₄ -		H
CF ₃	COP r - i	-(CH ₂) ₅ -		H
CF ₃	COP r - c	H	H	H
CF ₃	COP r - c	Me	H	H
CF ₃	COP r - c	Me	Me	H
CF ₃	COP r - c	Et	H	H
CF ₃	COP r - c	Et	Me	H
CF ₃	COP r - c	Pr-n	H	H
CF ₃	COP r - c	Pr-n	Me	H
CF ₃	COP r - c	Cl	H	H
CF ₃	COP r - c	CH ₂ CH=CH ₂	H	H
CF ₃	COP r - c	CH ₂ Cl	H	H
CF ₃	COP r - c	CF ₃	H	H
CF ₃	COP r - c	CF ₃	Me	H
CF ₃	COP r - c	Ph	H	H
CF ₃	COP r - c	Ph	Me	H
CF ₃	COP r - c	Ph-2-Cl	H	H
CF ₃	COP r - c	Ph-3-Cl	H	H
CF ₃	COP r - c	Ph-4-Cl	H	H

CF ₃	COP r - c	COMe	H	H
CF ₃	COP r - c	CO ₂ H	H	H
CF ₃	COP r - c	CO ₂ Me	H	H
CF ₃	COP r - c	CONH ₂	H	H
CF ₃	COP r - c	CONHMe	H	H
CF ₃	COP r - c	CONMe ₂	H	H
CF ₃	COP r - c	OH	H	H
CF ₃	COP r - c	OMe	H	H
CF ₃	COP r - c	OMe	Me	H
CF ₃	COP r - c	SMe	H	H
CF ₃	COP r - c	SMe	Me	H
CF ₃	COP r - c	NHMe	H	H
CF ₃	COP r - c	NHMe	Me	H
CF ₃	COP r - c	CH ₂ Ph	H	H
CF ₃	COP r - c	CH ₂ Ph-2-Cl	H	H
CF ₃	COP r - c	CH ₂ Ph-3-Cl	H	H
CF ₃	COP r - c	CH ₂ Ph-4-Cl	H	H
CF ₃	COP r - c	COPh	H	H
CF ₃	COP r - c	COPh-2-Cl	H	H
CF ₃	COP r - c	COPh-3-Cl	H	H
CF ₃	COP r - c	COPh-4-Cl	H	H
CF ₃	COP r - c	-CH ₂ -O-CH ₂ -		H
CF ₃	COP r - c	-(CH ₂) ₂ -		H
CF ₃	COP r - c	-(CH ₂) ₃ -		H
CF ₃	COP r - c	-(CH ₂) ₄ -		H
CF ₃	COP r - c	-(CH ₂) ₅ -		H
CF ₃	COBu-n	H	H	H
CF ₃	COBu-n	Me	H	H

CF ₃	COBu-n	Me	Me	H
CF ₃	COBu-n	—(CH ₂) ₂ —		H
CF ₃	COBu-n	—(CH ₂) ₃ —		H
CF ₃	COBu-c	H	H	H
CF ₃	COBu-c	Me	H	H
CF ₃	COBu-c	Me	Me	H
CF ₃	COBu-c	—(CH ₂) ₂ —		H
CF ₃	COBu-c	—(CH ₂) ₃ —		H
CF ₃	COBu-t	H	H	H
CF ₃	COBu-t	Me	H	H
CF ₃	COBu-t	Me	Me	H
CF ₃	COBu-t	—CH ₂ —O—CH ₂ —		H
CF ₃	COBu-t	—(CH ₂) ₂ —		H
CF ₃	COBu-t	—(CH ₂) ₃ —		H
CF ₃	COPen-n	H	H	H
CF ₃	COPen-n	Me	H	H
CF ₃	COPen-n	Me	Me	H
CF ₃	COPen-n	—(CH ₂) ₂ —		H
CF ₃	COPen-n	—(CH ₂) ₃ —		H
CF ₃	COHex-n	H	H	H
CF ₃	COHex-n	Me	H	H
CF ₃	COHex-n	Me	Me	H
CF ₃	COHex-n	—(CH ₂) ₂ —		H
CF ₃	COHex-n	—(CH ₂) ₃ —		H
CF ₃	COCH=CH ₂	H	H	H
CF ₃	COCH=CH ₂	Me	H	H
CF ₃	COCH=CH ₂	Me	Me	H
CF ₃	COCH=CH ₂	—(CH ₂) ₂ —		H

CF_3	COCH=CH_2	$-(\text{CH}_2)_3-$		H
CF_3	COPh	H	H	H
CF_3	COPh	Me	H	H
CF_3	COPh	Me	Me	H
CF_3	COPh	Et	H	H
CF_3	COPh	Et	Me	H
CF_3	COPh	Pr-n	H	H
CF_3	COPh	Pr-n	Me	H
CF_3	COPh	Cl	H	H
CF_3	COPh	$\text{CH}_2\text{CH=CH}_2$	H	H
CF_3	COPh	CH_2Cl	H	H
CF_3	COPh	CF_3	H	H
CF_3	COPh	CF_3	Me	H
CF_3	COPh	Ph	H	H
CF_3	COPh	Ph	Me	H
CF_3	COPh	Ph-2-Cl	H	H
CF_3	COPh	Ph-3-Cl	H	H
CF_3	COPh	Ph-4-Cl	H	H
CF_3	COPh	COMe	H	H
CF_3	COPh	CO_2H	H	H
CF_3	COPh	CO_2Me	H	H
CF_3	COPh	CONH_2	H	H
CF_3	COPh	CONHMe	H	H
CF_3	COPh	CONMe_2	H	H
CF_3	COPh	OH	H	H
CF_3	COPh	OMe	H	H
CF_3	COPh	OMe	Me	H
CF_3	COPh	SMe	H	H

CF ₃	COPh	SMe	Me	H
CF ₃	COPh	NHMe	H	H
CF ₃	COPh	NHMe	Me	H
CF ₃	COPh	CH ₂ Ph	H	H
CF ₃	COPh	CH ₂ Ph-2-Cl	H	H
CF ₃	COPh	CH ₂ Ph-3-Cl	H	H
CF ₃	COPh	CH ₂ Ph-4-Cl	H	H
CF ₃	COPh	COPh	H	H
CF ₃	COPh	COPh-2-Cl	H	H
CF ₃	COPh	COPh-3-Cl	H	H
CF ₃	COPh	COPh-4-Cl	H	H
CF ₃	COPh	-CH ₂ -O-CH ₂ -		H
CF ₃	COPh	-(CH ₂) ₂ -		H
CF ₃	COPh	-(CH ₂) ₃ -		H
CF ₃	COPh	-(CH ₂) ₄ -		H
CF ₃	COPh	-(CH ₂) ₅ -		H
CF ₃	CO ₂ Me	H	H	H
CF ₃	CO ₂ Me	Me	H	H
CF ₃	CO ₂ Me	Me	Me	H
CF ₃	CO ₂ Me	Et	H	H
CF ₃	CO ₂ Me	Et	Me	H
CF ₃	CO ₂ Me	Pr-n	H	H
CF ₃	CO ₂ Me	Pr-n	Me	H
CF ₃	CO ₂ Me	Cl	H	H
CF ₃	CO ₂ Me	CH ₂ CH=CH ₂	H	H
CF ₃	CO ₂ Me	CH ₂ Cl	H	H
CF ₃	CO ₂ Me	CF ₃	H	H
CF ₃	CO ₂ Me	CF ₃	Me	H

CF ₃	CO ₂ Me	Ph	H	H
CF ₃	CO ₂ Me	Ph	Me	H
CF ₃	CO ₂ Me	Ph-2-Cl	H	H
CF ₃	CO ₂ Me	Ph-3-Cl	H	H
CF ₃	CO ₂ Me	Ph-4-Cl	H	H
CF ₃	CO ₂ Me	COMe	H	H
CF ₃	CO ₂ Me	CO ₂ H	H	H
CF ₃	CO ₂ Me	CO ₂ Me	H	H
CF ₃	CO ₂ Me	CONH ₂	H	H
CF ₃	CO ₂ Me	CONHMe	H	H
CF ₃	CO ₂ Me	CONMe ₂	H	H
CF ₃	CO ₂ Me	OH	H	H
CF ₃	CO ₂ Me	OMe	H	H
CF ₃	CO ₂ Me	OMe	Me	H
CF ₃	CO ₂ Me	SMe	H	H
CF ₃	CO ₂ Me	SMe	Me	H
CF ₃	CO ₂ Me	NHMe	H	H
CF ₃	CO ₂ Me	NHMe	Me	H
CF ₃	CO ₂ Me	CH ₂ Ph	H	H
CF ₃	CO ₂ Me	CH ₂ Ph-2-Cl	H	H
CF ₃	CO ₂ Me	CH ₂ Ph-3-Cl	H	H
CF ₃	CO ₂ Me	CH ₂ Ph-4-Cl	H	H
CF ₃	CO ₂ Me	COPh	H	H
CF ₃	CO ₂ Me	COPh-2-Cl	H	H
CF ₃	CO ₂ Me	COPh-3-Cl	H	H
CF ₃	CO ₂ Me	COPh-4-Cl	H	H
CF ₃	CO ₂ Me	-CH ₂ -O-CH ₂ -		H
CF ₃	CO ₂ Me	-(CH ₂) ₂ -		H

CF_3	CO_2Me	$-(\text{CH}_2)_3-$	H	
CF_3	CO_2Me	$-(\text{CH}_2)_4-$	H	
CF_3	CO_2Me	$-(\text{CH}_2)_5-$	H	
CF_3	CO_2Et	H	H	H
CF_3	CO_2Et	Me	H	H
CF_3	CO_2Et	Me	Me	H
CF_3	CO_2Et	Me	Cl	H
CF_3	CO_2Et	Me	CO_2Et	H
CF_3	CO_2Et	Et	H	H
CF_3	CO_2Et	Et	Me	H
CF_3	CO_2Et	Et	CO_2Et	H
CF_3	CO_2Et	Pr-n	H	H
CF_3	CO_2Et	Pr-n	Me	H
CF_3	CO_2Et	Pr-i	H	H
CF_3	CO_2Et	Pr-i	Me	H
CF_3	CO_2Et	Pr-c	H	H
CF_3	CO_2Et	Pr-c	Me	H
CF_3	CO_2Et	Bu-n	H	H
CF_3	CO_2Et	Bu-n	Me	H
CF_3	CO_2Et	Bu-i	H	H
CF_3	CO_2Et	Bu-i	Me	H
CF_3	CO_2Et	Bu-s	H	H
CF_3	CO_2Et	Bu-s	Me	H
CF_3	CO_2Et	Bu-t	H	H
CF_3	CO_2Et	Bu-t	Me	H
CF_3	CO_2Et	Bu-c	H	H
CF_3	CO_2Et	Bu-c	Me	H
CF_3	CO_2Et	Pen-n	H	H

CF ₃	CO ₂ Et	Pen-n	Me	H
CF ₃	CO ₂ Et	Pen-c	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Pen-c	Me	H
CF ₃	CO ₂ Et	Hex-n	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Hex-n	Me	H
CF ₃	CO ₂ Et	Hex-c	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Hex-c	Me	H
CF ₃	CO ₂ Et	Cl	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Cl	Cl	H
CF ₃	CO ₂ Et	Br	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Br	Br	H
CF ₃	CO ₂ Et	I	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	F	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	CH=CH ₂	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	CH=CH ₂	Me	H
CF ₃	CO ₂ Et	C≡CH	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	C≡CH	Me	H
CF ₃	CO ₂ Et	CH ₂ CH=CH ₂	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	CH ₂ CH=CH ₂	Me	H
CF ₃	CO ₂ Et	CH ₂ C≡CH	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	CH ₂ C≡CH	Me	H
CF ₃	CO ₂ Et	CH ₂ Cl	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	CH ₂ Cl	Me	H
CF ₃	CO ₂ Et	CH ₂ Cl	CH ₂ Cl	H
CF ₃	CO ₂ Et	CHCl ₂	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	CCl ₃	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	CH ₂ F	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	CHF ₂	H	H

CF ₃	CO ₂ Et	CF ₃	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	CF ₃	Me	H
CF ₃	CO ₂ Et	CF ₃	Et	H
CF ₃	CO ₂ Et	CH ₂ CH ₂ Cl	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	CH ₂ OH	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	CH ₂ SMe	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	CH ₂ SCH ₂ Cl	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Ph	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Ph	Me	H
CF ₃	CO ₂ Et	Ph-2-Cl	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Ph-3-Cl	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Ph-4-Cl	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Ph-2-Br	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Ph-3-I	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Ph-4-F	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Ph-2-Me	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Ph-3-OMe	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Ph-4-SMe	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Ph-2-SO ₂ Me	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Ph-3-CN	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Ph-4-NO ₂	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Ph-2-CO ₂ Me	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Ph-3-NH ₂	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Ph-4-Ph	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Ph-2-OPh	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Ph-3-SPh	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Ph-4-CONMe ₂	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Ph-2-OH	H	H

CF ₃	CO ₂ Et	COMe	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	COEt	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	COCH ₂ Cl	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	CO ₂ H	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	CO ₂ Me	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	CO ₂ Me	Me	H
CF ₃	CO ₂ Et	CO ₂ Et	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	CO ₂ Bu-i	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	CONH ₂	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	CONHMe	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	CONMe ₂	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	CH ₂ Ph	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	CH ₂ Ph-2-Cl	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	CH ₂ Ph-3-Cl	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	CH ₂ Ph-4-Cl	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	COPh	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	COPh-2-Cl	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	COPh-3-Cl	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	COPh-4-Cl	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	OH	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	OMe	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	OMe	Me	H
CF ₃	CO ₂ Et	OEt	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	OEt	Me	H
CF ₃	CO ₂ Et	SMe	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	SMe	Me	H
CF ₃	CO ₂ Et	SPh	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	CN	H	H

CF_3	CO_2Et	NH_2	H	H
CF_3	CO_2Et	NHMe	H	H
CF_3	CO_2Et	NHMe	Me	H
CF_3	CO_2Et	NMe_2	H	H
CF_3	CO_2Et	NMe_2	Me	H
CF_3	CO_2Et	$-\text{CH}_2-\text{O}-\text{CH}_2-$	H	
CF_3	CO_2Et	$-(\text{CH}_2)_2-$	H	
CF_3	CO_2Et	$-\text{CH}_2\text{CCl}_2-$	H	
CF_3	CO_2Et	$-\text{CH}_2\text{CF}_2-$	H	
CF_3	CO_2Et	$-(\text{CH}_2)_3-$	H	
CF_3	CO_2Et	$-(\text{CH}_2)_4-$	H	
CF_3	CO_2Et	$-(\text{CH}_2)_5-$	H	
CF_3	CO_2Et	H	H	3-F
CF_3	CO_2Et	H	H	4-F
CF_3	CO_2Et	H	H	5-F
CF_3	CO_2Et	H	H	6-F
CF_3	CO_2Et	H	H	4-Cl
CF_3	CO_2Et	H	H	5-Cl
CF_3	CO_2Et	H	H	4-Br
CF_3	CO_2Et	H	H	4-I
CF_3	CO_2Et	H	H	4-Me
CF_3	CO_2Et	H	H	5-Me
CF_3	CO_2Et	H	H	4-OMe
CF_3	CO_2Et	H	H	4-SMe
CF_3	CO_2Et	Me	H	3-F
CF_3	CO_2Et	Me	H	4-F
CF_3	CO_2Et	Me	H	5-F
CF_3	CO_2Et	Me	H	6-F

CF ₃	CO ₂ Et	Me	H	4-Cl
CF ₃	CO ₂ Et	Me	H	5-Cl
CF ₃	CO ₂ Et	Me	H	4-Br
CF ₃	CO ₂ Et	Me	H	4-I
CF ₃	CO ₂ Et	Me	H	4-Me
CF ₃	CO ₂ Et	Me	H	5-Me
CF ₃	CO ₂ Et	Me	H	4-OMe
CF ₃	CO ₂ Et	Me	H	4-SMe
CF ₃	CO ₂ Et	Me	Me	3-F
CF ₃	CO ₂ Et	Me	Me	4-F
CF ₃	CO ₂ Et	Me	Me	5-F
CF ₃	CO ₂ Et	Me	Me	6-F
CF ₃	CO ₂ Et	Me	Me	4-Cl
CF ₃	CO ₂ Et	Me	Me	5-Cl
CF ₃	CO ₂ Et	Me	Me	4-Br
CF ₃	CO ₂ Et	Me	Me	4-I
CF ₃	CO ₂ Et	Me	Me	4-Me
CF ₃	CO ₂ Et	Me	Me	5-Me
CF ₃	CO ₂ Et	Me	Me	4-OMe
CF ₃	CO ₂ Et	Me	Me	4-SMe
CF ₃	CO ₂ Pr-n	H	H	H
CF ₃	CO ₂ Pr-n	Me	H	H
CF ₃	CO ₂ Pr-n	Me	Me	H
CF ₃	CO ₂ Pr-n	Et	H	H
CF ₃	CO ₂ Pr-n	Et	Me	H
CF ₃	CO ₂ Pr-n	Pr-n	H	H
CF ₃	CO ₂ Pr-n	Pr-n	Me	H
CF ₃	CO ₂ Pr-n	Cl	H	H

CF ₃	CO ₂ Pr-n	CH ₂ CH=CH ₂	H	H
CF ₃	CO ₂ Pr-n	CH ₂ Cl	H	H
CF ₃	CO ₂ Pr-n	CF ₃	H	H
CF ₃	CO ₂ Pr-n	CF ₃	Me	H
CF ₃	CO ₂ Pr-n	Ph	H	H
CF ₃	CO ₂ Pr-n	Ph	Me	H
CF ₃	CO ₂ Pr-n	Ph-2-Cl	H	H
CF ₃	CO ₂ Pr-n	Ph-3-Cl	H	H
CF ₃	CO ₂ Pr-n	Ph-4-Cl	H	H
CF ₃	CO ₂ Pr-n	COMe	H	H
CF ₃	CO ₂ Pr-n	CO ₂ H	H	H
CF ₃	CO ₂ Pr-n	CO ₂ Me	H	H
CF ₃	CO ₂ Pr-n	CONH ₂	H	H
CF ₃	CO ₂ Pr-n	CONHMe	H	H
CF ₃	CO ₂ Pr-n	CONMe ₂	H	H
CF ₃	CO ₂ Pr-n	OH	H	H
CF ₃	CO ₂ Pr-n	OMe	H	H
CF ₃	CO ₂ Pr-n	OMe	Me	H
CF ₃	CO ₂ Pr-n	SMe	H	H
CF ₃	CO ₂ Pr-n	SMe	Me	H
CF ₃	CO ₂ Pr-n	NHMe	H	H
CF ₃	CO ₂ Pr-n	NHMe	Me	H
CF ₃	CO ₂ Pr-n	CH ₂ Ph	H	H
CF ₃	CO ₂ Pr-n	CH ₂ Ph-2-Cl	H	H
CF ₃	CO ₂ Pr-n	CH ₂ Ph-3-Cl	H	H
CF ₃	CO ₂ Pr-n	CH ₂ Ph-4-Cl	H	H
CF ₃	CO ₂ Pr-n	COPh	H	H
CF ₃	CO ₂ Pr-n	COPh-2-Cl	H	H

CF ₃	CO ₂ Pr-n	COPh-3-Cl	H	H
CF ₃	CO ₂ Pr-n	COPh-4-Cl	H	H
CF ₃	CO ₂ Pr-n	-CH ₂ -O-CH ₂ -		H
CF ₃	CO ₂ Pr-n	-(CH ₂) ₂ -		H
CF ₃	CO ₂ Pr-n	-(CH ₂) ₃ -		H
CF ₃	CO ₂ Pr-n	-(CH ₂) ₄ -		H
CF ₃	CO ₂ Pr-n	-(CH ₂) ₅ -		H
CF ₃	CO ₂ Pr-i	H	H	H
CF ₃	CO ₂ Pr-i	Me	H	H
CF ₃	CO ₂ Pr-i	Me	Me	H
CF ₃	CO ₂ Pr-i	Et	H	H
CF ₃	CO ₂ Pr-i	Et	Me	H
CF ₃	CO ₂ Pr-i	Pr-n	H	H
CF ₃	CO ₂ Pr-i	Pr-n	Me	H
CF ₃	CO ₂ Pr-i	Cl	H	H
CF ₃	CO ₂ Pr-i	CH ₂ CH=CH ₂	H	H
CF ₃	CO ₂ Pr-i	CH ₂ Cl	H	H
CF ₃	CO ₂ Pr-i	CF ₃	H	H
CF ₃	CO ₂ Pr-i	CF ₃	Me	H
CF ₃	CO ₂ Pr-i	Ph	H	H
CF ₃	CO ₂ Pr-i	Ph	Me	H
CF ₃	CO ₂ Pr-i	Ph-2-Cl	H	H
CF ₃	CO ₂ Pr-i	Ph-3-Cl	H	H
CF ₃	CO ₂ Pr-i	Ph-4-Cl	H	H
CF ₃	CO ₂ Pr-i	COMe	H	H
CF ₃	CO ₂ Pr-i	CO ₂ H	H	H
CF ₃	CO ₂ Pr-i	CO ₂ Me	H	H
CF ₃	CO ₂ Pr-i	CONH ₂	H	H

CF ₃	CO ₂ Pr-i	CONHMe	H	H
CF ₃	CO ₂ Pr-i	CONMe ₂	H	H
CF ₃	CO ₂ Pr-i	OH	H	H
CF ₃	CO ₂ Pr-i	OMe	H	H
CF ₃	CO ₂ Pr-i	OMe	Me	H
CF ₃	CO ₂ Pr-i	SMe	H	H
CF ₃	CO ₂ Pr-i	SMe	Me	H
CF ₃	CO ₂ Pr-i	NHMe	H	H
CF ₃	CO ₂ Pr-i	NHMe	Me	H
CF ₃	CO ₂ Pr-i	CH ₂ Ph	H	H
CF ₃	CO ₂ Pr-i	CH ₂ Ph-2-Cl	H	H
CF ₃	CO ₂ Pr-i	CH ₂ Ph-3-Cl	H	H
CF ₃	CO ₂ Pr-i	CH ₂ Ph-4-Cl	H	H
CF ₃	CO ₂ Pr-i	COPh	H	H
CF ₃	CO ₂ Pr-i	COPh-2-Cl	H	H
CF ₃	CO ₂ Pr-i	COPh-3-Cl	H	H
CF ₃	CO ₂ Pr-i	COPh-4-Cl	H	H
CF ₃	CO ₂ Pr-i	-CH ₂ -O-CH ₂ -		H
CF ₃	CO ₂ Pr-i	-(CH ₂) ₂ -		H
CF ₃	CO ₂ Pr-i	-(CH ₂) ₃ -		H
CF ₃	CO ₂ Pr-i	-(CH ₂) ₄ -		H
CF ₃	CO ₂ Pr-i	-(CH ₂) ₅ -		H
CF ₃	CO ₂ Bu-n	H	H	H
CF ₃	CO ₂ Bu-n	Me	H	H
CF ₃	CO ₂ Bu-n	Me	Me	H
CF ₃	CO ₂ Bu-n	-(CH ₂) ₂ -		H
CF ₃	CO ₂ Bu-n	-(CH ₂) ₃ -		H
CF ₃	CO ₂ Bu-i	H	H	H

CF ₃	CO ₂ Bu-i	Me	H	H
CF ₃	CO ₂ Bu-i	Me	Me	H
CF ₃	CO ₂ Bu-i	Et	H	H
CF ₃	CO ₂ Bu-i	Et	Me	H
CF ₃	CO ₂ Bu-i	Pr-n	H	H
CF ₃	CO ₂ Bu-i	Pr-n	Me	H
CF ₃	CO ₂ Bu-i	Cl	H	H
CF ₃	CO ₂ Bu-i	CH ₂ CH=CH ₂	H	H
CF ₃	CO ₂ Bu-i	CH ₂ Cl	H	H
CF ₃	CO ₂ Bu-i	CF ₃	H	H
CF ₃	CO ₂ Bu-i	CF ₃	Me	H
CF ₃	CO ₂ Bu-i	Ph	H	H
CF ₃	CO ₂ Bu-i	Ph	Me	H
CF ₃	CO ₂ Bu-i	Ph-2-Cl	H	H
CF ₃	CO ₂ Bu-i	Ph-3-Cl	H	H
CF ₃	CO ₂ Bu-i	Ph-4-Cl	H	H
CF ₃	CO ₂ Bu-i	COMe	H	H
CF ₃	CO ₂ Bu-i	CO ₂ H	H	H
CF ₃	CO ₂ Bu-i	CO ₂ Me	H	H
CF ₃	CO ₂ Bu-i	CONH ₂	H	H
CF ₃	CO ₂ Bu-i	CONHMe	H	H
CF ₃	CO ₂ Bu-i	CONMe ₂	H	H
CF ₃	CO ₂ Bu-i	OH	H	H
CF ₃	CO ₂ Bu-i	OMe	H	H
CF ₃	CO ₂ Bu-i	OMe	Me	H
CF ₃	CO ₂ Bu-i	SMe	H	H
CF ₃	CO ₂ Bu-i	SMe	Me	H
CF ₃	CO ₂ Bu-i	NHMe	H	H

CF ₃	CO ₂ Bu-i	NHMe	Me	H
CF ₃	CO ₂ Bu-i	CH ₂ Ph	H	H
CF ₃	CO ₂ Bu-i	CH ₂ Ph-2-Cl	H	H
CF ₃	CO ₂ Bu-i	CH ₂ Ph-3-Cl	H	H
CF ₃	CO ₂ Bu-i	CH ₂ Ph-4-Cl	H	H
CF ₃	CO ₂ Bu-i	COPh	H	H
CF ₃	CO ₂ Bu-i	COPh-2-Cl	H	H
CF ₃	CO ₂ Bu-i	COPh-3-Cl	H	H
CF ₃	CO ₂ Bu-i	COPh-4-Cl	H	H
CF ₃	CO ₂ Bu-i	-CH ₂ -O-CH ₂ -		H
CF ₃	CO ₂ Bu-i	-(CH ₂) ₂ -		H
CF ₃	CO ₂ Bu-i	-(CH ₂) ₃ -		H
CF ₃	CO ₂ Bu-i	-(CH ₂) ₄ -		H
CF ₃	CO ₂ Bu-i	-(CH ₂) ₅ -		H
CF ₃	CO ₂ Bu-t	H	H	H
CF ₃	CO ₂ Bu-t	Me	H	H
CF ₃	CO ₂ Bu-t	Me	Me	H
CF ₃	CO ₂ Bu-t	-(CH ₂) ₂ -		H
CF ₃	CO ₂ Bu-t	-(CH ₂) ₃ -		H
CF ₃	CO ₂ Pen-n	H	H	H
CF ₃	CO ₂ Pen-n	Me	H	H
CF ₃	CO ₂ Pen-n	Me	Me	H
CF ₃	CO ₂ Pen-n	-(CH ₂) ₂ -		H
CF ₃	CO ₂ Pen-n	-(CH ₂) ₃ -		H
CF ₃	E-1	H	H	H
CF ₃	E-1	Me	H	H
CF ₃	E-1	Me	Me	H
CF ₃	E-1	-(CH ₂) ₂ -		H

CF_3	E-1	$-(\text{CH}_2)_3-$	H	
CF_3	$\text{CO}_2\text{Hex}-n$	H	H	H
CF_3	$\text{CO}_2\text{Hex}-n$	Me	H	H
CF_3	$\text{CO}_2\text{Hex}-n$	Me	Me	H
CF_3	$\text{CO}_2\text{Hex}-n$	$-(\text{CH}_2)_2-$		H
CF_3	$\text{CO}_2\text{Hex}-n$	$-(\text{CH}_2)_3-$		H
CF_3	CO_2Ph	H	H	H
CF_3	CO_2Ph	Me	H	H
CF_3	CO_2Ph	Me	Me	H
CF_3	CO_2Ph	$-(\text{CH}_2)_2-$		H
CF_3	CO_2Ph	$-(\text{CH}_2)_3-$		H
CF_3	$\text{CO}_2\text{CH}_2\text{Ph}$	H	H	H
CF_3	$\text{CO}_2\text{CH}_2\text{Ph}$	Me	H	H
CF_3	$\text{CO}_2\text{CH}_2\text{Ph}$	Me	Me	H
CF_3	$\text{CO}_2\text{CH}_2\text{Ph}$	$-(\text{CH}_2)_2-$		H
CF_3	$\text{CO}_2\text{CH}_2\text{Ph}$	$-(\text{CH}_2)_3-$		H
CF_3	E-2	H	H	H
CF_3	E-2	Me	H	H
CF_3	E-2	Me	Me	H
CF_3	E-2	$-(\text{CH}_2)_2-$		H
CF_3	E-2	$-(\text{CH}_2)_3-$		H
CF_3	E-3	H	H	H
CF_3	E-3	Me	H	H
CF_3	E-3	Me	Me	H
CF_3	E-3	Et	H	H
CF_3	E-3	Et	Me	H
CF_3	E-3	Pr-n	H	H
CF_3	E-3	Pr-n	Me	H

CF_3	E-3	Cl	H	H
CF_3	E-3	$\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	H	H
CF_3	E-3	CH_2Cl	H	H
CF_3	E-3	CF_3	H	H
CF_3	E-3	CF_3	Me	H
CF_3	E-3	Ph	H	H
CF_3	E-3	Ph	Me	H
CF_3	E-3	Ph-2-Cl	H	H
CF_3	E-3	Ph-3-Cl	H	H
CF_3	E-3	Ph-4-Cl	H	H
CF_3	E-3	COMe	H	H
CF_3	E-3	CO_2H	H	H
CF_3	E-3	CO_2Me	H	H
CF_3	E-3	CONH_2	H	H
CF_3	E-3	CONHMe	H	H
CF_3	E-3	CONMe_2	H	H
CF_3	E-3	OH	H	H
CF_3	E-3	OMe	H	H
CF_3	E-3	OMe	Me	H
CF_3	E-3	SMe	H	H
CF_3	E-3	SMe	Me	H
CF_3	E-3	NHMe	H	H
CF_3	E-3	NHMe	Me	H
CF_3	E-3	CH_2Ph	H	H
CF_3	E-3	$\text{CH}_2\text{Ph}-2-\text{Cl}$	H	H
CF_3	E-3	$\text{CH}_2\text{Ph}-3-\text{Cl}$	H	H
CF_3	E-3	$\text{CH}_2\text{Ph}-4-\text{Cl}$	H	H
CF_3	E-3	COPh	H	H

CF_3	E-3	COPh-2-Cl	H	H
CF_3	E-3	COPh-3-Cl	H	H
CF_3	E-3	COPh-4-Cl	H	H
CF_3	E-3	$-\text{CH}_2-\text{O}-\text{CH}_2-$		H
CF_3	E-3	$-(\text{CH}_2)_2-$		H
CF_3	E-3	$-(\text{CH}_2)_3-$		H
CF_3	E-3	$-(\text{CH}_2)_4-$		H
CF_3	E-3	$-(\text{CH}_2)_5-$		H
CF_3	CH_2OMe	H	H	H
CF_3	CH_2OMe	Me	H	H
CF_3	CH_2OMe	Me	Me	H
CF_3	CH_2OMe	$-(\text{CH}_2)_2-$		H
CF_3	CH_2OMe	$-(\text{CH}_2)_3-$		H
CF_3	COCH_2Cl	H	H	H
CF_3	COCH_2Cl	Me	H	H
CF_3	COCH_2Cl	Me	Me	H
CF_3	COCH_2Cl	$-(\text{CH}_2)_2-$		H
CF_3	COCH_2Cl	$-(\text{CH}_2)_3-$		H
CF_3	E-4	H	H	H
CF_3	E-4	Me	H	H
CF_3	E-4	Me	Me	H
CF_3	E-4	$-(\text{CH}_2)_2-$		H
CF_3	E-4	$-(\text{CH}_2)_3-$		H
CF_3	E-5	H	H	H
CF_3	E-5	Me	H	H
CF_3	E-5	Me	Me	H
CF_3	E-5	$-(\text{CH}_2)_2-$		H
CF_3	E-5	$-(\text{CH}_2)_3-$		H

CF_3	E-6	H	H	H
CF_3	E-6	Me	H	H
CF_3	E-6	Me	Me	H
CF_3	E-6	$-(\text{CH}_2)_2-$		H
CF_3	E-6	$-(\text{CH}_2)_3-$		H
CF_3	E-7	H	H	H
CF_3	E-7	Me	H	H
CF_3	E-7	Me	Me	H
CF_3	E-7	$-(\text{CH}_2)_2-$		H
CF_3	E-7	$-(\text{CH}_2)_3-$		H
CF_3	E-8	H	H	H
CF_3	E-8	Me	H	H
CF_3	E-8	Me	Me	H
CF_3	E-8	$-(\text{CH}_2)_2-$		H
CF_3	E-8	$-(\text{CH}_2)_3-$		H
CF_3	E-9	H	H	H
CF_3	E-9	Me	H	H
CF_3	E-9	Me	Me	H
CF_3	E-9	$-(\text{CH}_2)_2-$		H
CF_3	E-9	$-(\text{CH}_2)_3-$		H
CF_3	E-10	H	H	H
CF_3	E-10	Me	H	H
CF_3	E-10	Me	Me	H
CF_3	E-10	$-(\text{CH}_2)_2-$		H
CF_3	E-10	$-(\text{CH}_2)_3-$		H
CF_3	E-11	H	H	H
CF_3	E-11	Me	H	H
CF_3	E-11	Me	Me	H

CF_3	E-11	$-(\text{CH}_2)_2-$	H	
CF_3	E-11	$-(\text{CH}_2)_3-$	H	
CF_3	E-12	H	H	H
CF_3	E-12	Me	H	H
CF_3	E-12	Me	Me	H
CF_3	E-12	$-(\text{CH}_2)_2-$	H	
CF_3	E-12	$-(\text{CH}_2)_3-$	H	
CF_3	CH_2SMe	H	H	H
CF_3	CH_2SMe	Me	H	H
CF_3	CH_2SMe	Me	Me	H
CF_3	CH_2SMe	$-(\text{CH}_2)_2-$	H	
CF_3	CH_2SMe	$-(\text{CH}_2)_3-$	H	
CF_3	$\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{Ph}$	H	H	H
CF_3	$\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{Ph}$	Me	H	H
CF_3	$\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{Ph}$	Me	Me	H
CF_3	$\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{Ph}$	$-(\text{CH}_2)_2-$	H	
CF_3	$\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{Ph}$	$-(\text{CH}_2)_3-$	H	
CF_3	CH_2OCOMe	H	H	H
CF_3	CH_2OCOMe	Me	H	H
CF_3	CH_2OCOMe	Me	Me	H
CF_3	CH_2OCOMe	$-(\text{CH}_2)_2-$	H	
CF_3	CH_2OCOMe	$-(\text{CH}_2)_3-$	H	
CF_3	CH_2OCOEt	H	H	H
CF_3	CH_2OCOEt	Me	H	H
CF_3	CH_2OCOEt	Me	Me	H
CF_3	CH_2OCOEt	$-(\text{CH}_2)_2-$	H	
CF_3	CH_2OCOEt	$-(\text{CH}_2)_3-$	H	
CF_3	COSMe	H	H	H

CF_3	COSMe	Me	H	H
CF_3	COSMe	Me	Me	H
CF_3	COSMe	$-(\text{CH}_2)_2-$		H
CF_3	COSMe	$-(\text{CH}_2)_3-$		H
CF_3	COSEt	H	H	H
CF_3	COSEt	Me	H	H
CF_3	COSEt	Me	Me	H
CF_3	COSEt	$-(\text{CH}_2)_2-$		H
CF_3	COSEt	$-(\text{CH}_2)_3-$		H
CF_3	$\text{CH}_2\text{SO}_2\text{Me}$	H	H	H
CF_3	$\text{CH}_2\text{SO}_2\text{Me}$	Me	H	H
CF_3	$\text{CH}_2\text{SO}_2\text{Me}$	Me	Me	H
CF_3	$\text{CH}_2\text{SO}_2\text{Me}$	$-(\text{CH}_2)_2-$		H
CF_3	$\text{CH}_2\text{SO}_2\text{Me}$	$-(\text{CH}_2)_3-$		H
CF_3	CH_2SOMe	H	H	H
CF_3	CH_2SOMe	Me	H	H
CF_3	CH_2SOMe	Me	Me	H
CF_3	CH_2SOMe	$-(\text{CH}_2)_2-$		H
CF_3	CH_2SOMe	$-(\text{CH}_2)_3-$		H
CF_3	CH_2Ph	H	H	H
CF_3	CH_2Ph	Me	H	H
CF_3	CH_2Ph	Me	Me	H
CF_3	CH_2Ph	$-(\text{CH}_2)_2-$		H
CF_3	CH_2Ph	$-(\text{CH}_2)_3-$		H
CF_3	SO_2CF_3	H	H	H
CF_3	SO_2CF_3	Me	H	H
CF_3	SO_2CF_3	Me	Me	H
CF_3	SO_2CF_3	$-(\text{CH}_2)_2-$		H

CF_3	SO_2CF_3	$-(\text{CH}_2)_3-$	H	
CHF_2	H	H	H	H
CHF_2	H	Me	H	H
CHF_2	H	Me	Me	H
CHF_2	H	Et	H	H
CHF_2	H	Et	Me	H
CHF_2	H	Pr-n	H	H
CHF_2	H	Cl	H	H
CHF_2	H	CF_3	H	H
CHF_2	H	CF_3	Me	H
CHF_2	H	Ph	H	H
CHF_2	H	Ph	Me	H
CHF_2	H	Ph-2-Cl	H	H
CHF_2	H	Ph-3-Cl	H	H
CHF_2	H	Ph-4-Cl	H	H
CHF_2	H	COMe	H	H
CHF_2	H	CO_2Me	H	H
CHF_2	H	OMe	H	H
CHF_2	H	OMe	Me	H
CHF_2	H	SMe	H	H
CHF_2	H	NHMe	H	H
CHF_2	H	CH_2Ph	H	H
CHF_2	H	$\text{CH}_2\text{Ph}-2-\text{Cl}$	H	H
CHF_2	H	$\text{CH}_2\text{Ph}-3-\text{Cl}$	H	H
CHF_2	H	$\text{CH}_2\text{Ph}-4-\text{Cl}$	H	H
CHF_2	H	COPh	H	H
CHF_2	H	$\text{COPh}-2-\text{Cl}$	H	H
CHF_2	H	$\text{COPh}-3-\text{Cl}$	H	H

CHF_2	H	COPh-4-Cl	H	H
CHF_2	H	$-\text{CH}_2-\text{O}-\text{CH}_2-$		H
CHF_2	H	$-(\text{CH}_2)_2-$		H
CHF_2	H	$-(\text{CH}_2)_3-$		H
CHF_2	H	$-(\text{CH}_2)_4-$		H
CHF_2	H	$-(\text{CH}_2)_5-$		H
CHF_2	COEt	H	H	H
CHF_2	COEt	Me	H	H
CHF_2	COEt	Me	Me	H
CHF_2	COEt	Et	H	H
CHF_2	COEt	Et	Me	H
CHF_2	COEt	Pr-n	H	H
CHF_2	COEt	Cl	H	H
CHF_2	COEt	CF_3	H	H
CHF_2	COEt	CF_3	Me	H
CHF_2	COEt	Ph	H	H
CHF_2	COEt	Ph	Me	H
CHF_2	COEt	Ph-2-Cl	H	H
CHF_2	COEt	Ph-3-Cl	H	H
CHF_2	COEt	Ph-4-Cl	H	H
CHF_2	COEt	COMe	H	H
CHF_2	COEt	CO_2Me	H	H
CHF_2	COEt	OMe	H	H
CHF_2	COEt	OMe	Me	H
CHF_2	COEt	SMe	H	H
CHF_2	COEt	NHMe	H	H
CHF_2	COEt	CH_2Ph	H	H
CHF_2	COEt	$\text{CH}_2\text{Ph-2-Cl}$	H	H

CH _F ₂	COE t	CH ₂ Ph-3-Cl	H	H
CH _F ₂	COE t	CH ₂ Ph-4-Cl	H	H
CH _F ₂	COE t	COPh	H	H
CH _F ₂	COE t	COPh-2-Cl	H	H
CH _F ₂	COE t	COPh-3-Cl	H	H
CH _F ₂	COE t	COPh-4-Cl	H	H
CH _F ₂	COE t	-CH ₂ -O-CH ₂ -		H
CH _F ₂	COE t	-(CH ₂) ₂ -		H
CH _F ₂	COE t	-(CH ₂) ₃ -		H
CH _F ₂	COE t	-(CH ₂) ₄ -		H
CH _F ₂	COE t	-(CH ₂) ₅ -		H
CH _F ₂	CO ₂ E t	H	H	H
CH _F ₂	CO ₂ E t	Me	H	H
CH _F ₂	CO ₂ E t	Me	Me	H
CH _F ₂	CO ₂ E t	E t	H	H
CH _F ₂	CO ₂ E t	E t	Me	H
CH _F ₂	CO ₂ E t	Pr-n	H	H
CH _F ₂	CO ₂ E t	Cl	H	H
CH _F ₂	CO ₂ E t	CF ₃	H	H
CH _F ₂	CO ₂ E t	CF ₃	Me	H
CH _F ₂	CO ₂ E t	Ph	H	H
CH _F ₂	CO ₂ E t	Ph	Me	H
CH _F ₂	CO ₂ E t	Ph-2-Cl	H	H
CH _F ₂	CO ₂ E t	Ph-3-Cl	H	H
CH _F ₂	CO ₂ E t	Ph-4-Cl	H	H
CH _F ₂	CO ₂ E t	COMe	H	H
CH _F ₂	CO ₂ E t	CO ₂ Me	H	H
CH _F ₂	CO ₂ E t	OMe	H	H

CHF ₂	CO ₂ Et	OMe	Me	H
CHF ₂	CO ₂ Et	SM e	H	H
CHF ₂	CO ₂ Et	NHMe	H	H
CHF ₂	CO ₂ Et	CH ₂ Ph	H	H
CHF ₂	CO ₂ Et	CH ₂ Ph-2-Cl	H	H
CHF ₂	CO ₂ Et	CH ₂ Ph-3-Cl	H	H
CHF ₂	CO ₂ Et	CH ₂ Ph-4-Cl	H	H
CHF ₂	CO ₂ Et	COPh	H	H
CHF ₂	CO ₂ Et	COPh-2-Cl	H	H
CHF ₂	CO ₂ Et	COPh-3-Cl	H	H
CHF ₂	CO ₂ Et	COPh-4-Cl	H	H
CHF ₂	CO ₂ Et	-CH ₂ -O-CH ₂ -		H
CHF ₂	CO ₂ Et	-(CH ₂) ₂ -		H
CHF ₂	CO ₂ Et	-(CH ₂) ₃ -		H
CHF ₂	CO ₂ Et	-(CH ₂) ₄ -		H
CHF ₂	CO ₂ Et	-(CH ₂) ₅ -		H
CHF ₂	CO ₂ Bu-i	H	H	H
CHF ₂	CO ₂ Bu-i	Me	H	H
CHF ₂	CO ₂ Bu-i	Me	Me	H
CHF ₂	CO ₂ Bu-i	Et	H	H
CHF ₂	CO ₂ Bu-i	Et	Me	H
CHF ₂	CO ₂ Bu-i	Pr-n	H	H
CHF ₂	CO ₂ Bu-i	Cl	H	H
CHF ₂	CO ₂ Bu-i	CF ₃	H	H
CHF ₂	CO ₂ Bu-i	CF ₃	Me	H
CHF ₂	CO ₂ Bu-i	Ph	H	H
CHF ₂	CO ₂ Bu-i	Ph	Me	H
CHF ₂	CO ₂ Bu-i	Ph-2-Cl	H	H

CHF ₂	CO ₂ Bu-i	Ph-3-Cl	H	H
CHF ₂	CO ₂ Bu-i	Ph-4-Cl	H	H
CHF ₂	CO ₂ Bu-i	COMe	H	H
CHF ₂	CO ₂ Bu-i	CO ₂ Me	H	H
CHF ₂	CO ₂ Bu-i	OMe	H	H
CHF ₂	CO ₂ Bu-i	OMe	Me	H
CHF ₂	CO ₂ Bu-i	SMe	H	H
CHF ₂	CO ₂ Bu-i	NHMe	H	H
CHF ₂	CO ₂ Bu-i	CH ₂ Ph	H	H
CHF ₂	CO ₂ Bu-i	CH ₂ Ph-2-Cl	H	H
CHF ₂	CO ₂ Bu-i	CH ₂ Ph-3-Cl	H	H
CHF ₂	CO ₂ Bu-i	CH ₂ Ph-4-Cl	H	H
CHF ₂	CO ₂ Bu-i	COPh	H	H
CHF ₂	CO ₂ Bu-i	COPh-2-Cl	H	H
CHF ₂	CO ₂ Bu-i	COPh-3-Cl	H	H
CHF ₂	CO ₂ Bu-i	COPh-4-Cl	H	H
CHF ₂	CO ₂ Bu-i	-CH ₂ -O-CH ₂ -		H
CHF ₂	CO ₂ Bu-i	-(CH ₂) ₂ -		H
CHF ₂	CO ₂ Bu-i	-(CH ₂) ₃ -		H
CHF ₂	CO ₂ Bu-i	-(CH ₂) ₄ -		H
CHF ₂	CO ₂ Bu-i	-(CH ₂) ₅ -		H
CClF ₂	H	H	H	H
CClF ₂	H	Me	H	H
CClF ₂	H	Me	Me	H
CClF ₂	H	Et	H	H
CClF ₂	H	Et	Me	H
CClF ₂	H	Pr-n	H	H
CClF ₂	H	Cl	H	H

CCIF ₂	H	CF ₃	H	H
CCIF ₂	H	CF ₃	Me	H
CCIF ₂	H	Ph	H	H
CCIF ₂	H	Ph	Me	H
CCIF ₂	H	Ph-2-Cl	H	H
CCIF ₂	H	Ph-3-Cl	H	H
CCIF ₂	H	Ph-4-Cl	H	H
CCIF ₂	H	COMe	H	H
CCIF ₂	H	CO ₂ Me	H	H
CCIF ₂	H	OMe	H	H
CCIF ₂	H	OMe	Me	H
CCIF ₂	H	SMe	H	H
CCIF ₂	H	NHMe	H	H
CCIF ₂	H	CH ₂ Ph	H	H
CCIF ₂	H	CH ₂ Ph-2-Cl	H	H
CCIF ₂	H	CH ₂ Ph-3-Cl	H	H
CCIF ₂	H	CH ₂ Ph-4-Cl	H	H
CCIF ₂	H	COPh	H	H
CCIF ₂	H	COPh-2-Cl	H	H
CCIF ₂	H	COPh-3-Cl	H	H
CCIF ₂	H	COPh-4-Cl	H	H
CCIF ₂	H	-CH ₂ -O-CH ₂ -		H
CCIF ₂	H	-(CH ₂) ₂ -		H
CCIF ₂	H	-(CH ₂) ₃ -		H
CCIF ₂	H	-(CH ₂) ₄ -		H
CCIF ₂	H	-(CH ₂) ₅ -		H
CCIF ₂	COEt	H	H	H
CCIF ₂	COEt	Me	H	H

CClF ₂	COEt	Me	Me	H
CClF ₂	COEt	Et	H	H
CClF ₂	COEt	Et	Me	H
CClF ₂	COEt	Pr-n	H	H
CClF ₂	COEt	Cl	H	H
CClF ₂	COEt	CF ₃	H	H
CClF ₂	COEt	CF ₃	Me	H
CClF ₂	COEt	Ph	H	H
CClF ₂	COEt	Ph	Me	H
CClF ₂	COEt	Ph-2-Cl	H	H
CClF ₂	COEt	Ph-3-Cl	H	H
CClF ₂	COEt	Ph-4-Cl	H	H
CClF ₂	COEt	COMe	H	H
CClF ₂	COEt	CO ₂ Me	H	H
CClF ₂	COEt	OMe	H	H
CClF ₂	COEt	OMe	Me	H
CClF ₂	COEt	SMe	H	H
CClF ₂	COEt	NHMe	H	H
CClF ₂	COEt	CH ₂ Ph	H	H
CClF ₂	COEt	CH ₂ Ph-2-Cl	H	H
CClF ₂	COEt	CH ₂ Ph-3-Cl	H	H
CClF ₂	COEt	CH ₂ Ph-4-Cl	H	H
CClF ₂	COEt	COPh	H	H
CClF ₂	COEt	COPh-2-Cl	H	H
CClF ₂	COEt	COPh-3-Cl	H	H
CClF ₂	COEt	COPh-4-Cl	H	H
CClF ₂	COEt	-CH ₂ -O-CH ₂ -		H
CClF ₂	COEt	-(CH ₂) ₂ -		H

CClF ₂	COEt	—(CH ₂) ₃ —	H	
CClF ₂	COEt	—(CH ₂) ₄ —	H	
CClF ₂	COEt	—(CH ₂) ₅ —	H	
CClF ₂	CO ₂ Et	H	H	H
CClF ₂	CO ₂ Et	Me	H	H
CClF ₂	CO ₂ Et	Me	Me	H
CClF ₂	CO ₂ Et	Et	H	H
CClF ₂	CO ₂ Et	Et	Me	H
CClF ₂	CO ₂ Et	Pr—n	H	H
CClF ₂	CO ₂ Et	Cl	H	H
CClF ₂	CO ₂ Et	CF ₃	H	H
CClF ₂	CO ₂ Et	CF ₃	Me	H
CClF ₂	CO ₂ Et	Ph	H	H
CClF ₂	CO ₂ Et	Ph	Me	H
CClF ₂	CO ₂ Et	Ph—2—Cl	H	H
CClF ₂	CO ₂ Et	Ph—3—Cl	H	H
CClF ₂	CO ₂ Et	Ph—4—Cl	H	H
CClF ₂	CO ₂ Et	COMe	H	H
CClF ₂	CO ₂ Et	CO ₂ Me	H	H
CClF ₂	CO ₂ Et	OMe	H	H
CClF ₂	CO ₂ Et	OMe	Me	H
CClF ₂	CO ₂ Et	SMe	H	H
CClF ₂	CO ₂ Et	NHMe	H	H
CClF ₂	CO ₂ Et	CH ₂ Ph	H	H
CClF ₂	CO ₂ Et	CH ₂ Ph—2—Cl	H	H
CClF ₂	CO ₂ Et	CH ₂ Ph—3—Cl	H	H
CClF ₂	CO ₂ Et	CH ₂ Ph—4—Cl	H	H
CClF ₂	CO ₂ Et	COPh	H	H

CClF ₂	CO ₂ Et	COPh-2-Cl	H	H
CClF ₂	CO ₂ Et	COPh-3-Cl	H	H
CClF ₂	CO ₂ Et	COPh-4-Cl	H	H
CClF ₂	CO ₂ Et	-CH ₂ -O-CH ₂ -		H
CClF ₂	CO ₂ Et	-(CH ₂) ₂ -		H
CClF ₂	CO ₂ Et	-(CH ₂) ₃ -		H
CClF ₂	CO ₂ Et	-(CH ₂) ₄ -		H
CClF ₂	CO ₂ Et	-(CH ₂) ₅ -		H
CClF ₂	CO ₂ Bu-i	H	H	H
CClF ₂	CO ₂ Bu-i	Me	H	H
CClF ₂	CO ₂ Bu-i	Me	Me	H
CClF ₂	CO ₂ Bu-i	Et	H	H
CClF ₂	CO ₂ Bu-i	Et	Me	H
CClF ₂	CO ₂ Bu-i	Pr-n	H	H
CClF ₂	CO ₂ Bu-i	Cl	H	H
CClF ₂	CO ₂ Bu-i	CF ₃	H	H
CClF ₂	CO ₂ Bu-i	CF ₃	Me	H
CClF ₂	CO ₂ Bu-i	Ph	H	H
CClF ₂	CO ₂ Bu-i	Ph	Me	H
CClF ₂	CO ₂ Bu-i	Ph-2-Cl	H	H
CClF ₂	CO ₂ Bu-i	Ph-3-Cl	H	H
CClF ₂	CO ₂ Bu-i	Ph-4-Cl	H	H
CClF ₂	CO ₂ Bu-i	COMe	H	H
CClF ₂	CO ₂ Bu-i	CO ₂ Me	H	H
CClF ₂	CO ₂ Bu-i	OMe	H	H
CClF ₂	CO ₂ Bu-i	OMe	Me	H
CClF ₂	CO ₂ Bu-i	SMe	H	H
CClF ₂	CO ₂ Bu-i	NHMe	H	H

CClF ₂	CO ₂ Bu-i	CH ₂ Ph	H	H
CClF ₂	CO ₂ Bu-i	CH ₂ Ph-2-Cl	H	H
CClF ₂	CO ₂ Bu-i	CH ₂ Ph-3-Cl	H	H
CClF ₂	CO ₂ Bu-i	CH ₂ Ph-4-Cl	H	H
CClF ₂	CO ₂ Bu-i	COPh	H	H
CClF ₂	CO ₂ Bu-i	COPh-2-Cl	H	H
CClF ₂	CO ₂ Bu-i	COPh-3-Cl	H	H
CClF ₂	CO ₂ Bu-i	COPh-4-Cl	H	H
CClF ₂	CO ₂ Bu-i	-CH ₂ -O-CH ₂ -		H
CClF ₂	CO ₂ Bu-i	-(CH ₂) ₂ -		H
CClF ₂	CO ₂ Bu-i	-(CH ₂) ₃ -		H
CClF ₂	CO ₂ Bu-i	-(CH ₂) ₄ -		H
CClF ₂	CO ₂ Bu-i	-(CH ₂) ₅ -		H
CB r F ₂	H	H	H	H
CB r F ₂	H	Me	H	H
CB r F ₂	H	Me	Me	H
CB r F ₂	H	Cl	H	H
CB r F ₂	H	Ph	H	H
CB r F ₂	H	Ph	Me	H
CB r F ₂	H	COMe	H	H
CB r F ₂	H	CO ₂ Me	H	H
CB r F ₂	H	OMe	H	H
CB r F ₂	H	OMe	Me	H
CB r F ₂	H	CH ₂ Ph	H	H
CB r F ₂	H	COPh	H	H
CB r F ₂	H	-CH ₂ -O-CH ₂ -		H
CB r F ₂	H	-(CH ₂) ₂ -		H
CB r F ₂	H	-(CH ₂) ₃ -		H

CB r F ₂	COE t	H	H	H
CB r F ₂	COE t	Me	H	H
CB r F ₂	COE t	Me	Me	H
CB r F ₂	COE t	Cl	H	H
CB r F ₂	COE t	Ph	H	H
CB r F ₂	COE t	Ph	Me	H
CB r F ₂	COE t	COMe	H	H
CB r F ₂	COE t	CO ₂ Me	H	H
CB r F ₂	COE t	OMe	H	H
CB r F ₂	COE t	OMe	Me	H
CB r F ₂	COE t	CH ₂ Ph	H	H
CB r F ₂	COE t	COPh	H	H
CB r F ₂	COE t	—CH ₂ —O—CH ₂ —		H
CB r F ₂	COE t	—(CH ₂) ₂ —		H
CB r F ₂	COE t	—(CH ₂) ₃ —		H
CB r F ₂	CO ₂ E t	H	H	H
CB r F ₂	CO ₂ E t	Me	H	H
CB r F ₂	CO ₂ E t	Me	Me	H
CB r F ₂	CO ₂ E t	Cl	H	H
CB r F ₂	CO ₂ E t	Ph	H	H
CB r F ₂	CO ₂ E t	Ph	Me	H
CB r F ₂	CO ₂ E t	COMe	H	H
CB r F ₂	CO ₂ E t	CO ₂ Me	H	H
CB r F ₂	CO ₂ E t	OMe	H	H
CB r F ₂	CO ₂ E t	OMe	Me	H
CB r F ₂	CO ₂ E t	CH ₂ Ph	H	H
CB r F ₂	CO ₂ E t	COPh	H	H
CB r F ₂	CO ₂ E t	—CH ₂ —O—CH ₂ —		H

CB r F ₂	CO ₂ E t	— (CH ₂) ₂ —	H	
CB r F ₂	CO ₂ E t	— (CH ₂) ₃ —	H	
CB r F ₂	CO ₂ B u— i	H	H	H
CB r F ₂	CO ₂ B u— i	M e	H	H
CB r F ₂	CO ₂ B u— i	M e	M e	H
CB r F ₂	CO ₂ B u— i	C l	H	H
CB r F ₂	CO ₂ B u— i	P h	H	H
CB r F ₂	CO ₂ B u— i	P h	M e	H
CB r F ₂	CO ₂ B u— i	CO M e	H	H
CB r F ₂	CO ₂ B u— i	CO ₂ M e	H	H
CB r F ₂	CO ₂ B u— i	OM e	H	H
CB r F ₂	CO ₂ B u— i	OM e	M e	H
CB r F ₂	CO ₂ B u— i	CH ₂ P h	H	H
CB r F ₂	CO ₂ B u— i	CO P h	H	H
CB r F ₂	CO ₂ B u— i	—CH ₂ —O—CH ₂ —	H	
CB r F ₂	CO ₂ B u— i	— (CH ₂) ₂ —	H	
CB r F ₂	CO ₂ B u— i	— (CH ₂) ₃ —	H	
CC l ₂ F	H	H	H	H
CC l ₂ F	H	M e	H	H
CC l ₂ F	H	M e	M e	H
CC l ₂ F	H	C l	H	H
CC l ₂ F	H	P h	H	H
CC l ₂ F	H	P h	M e	H
CC l ₂ F	H	CO M e	H	H
CC l ₂ F	H	CO ₂ M e	H	H
CC l ₂ F	H	OM e	H	H
CC l ₂ F	H	OM e	M e	H
CC l ₂ F	H	CH ₂ P h	H	H

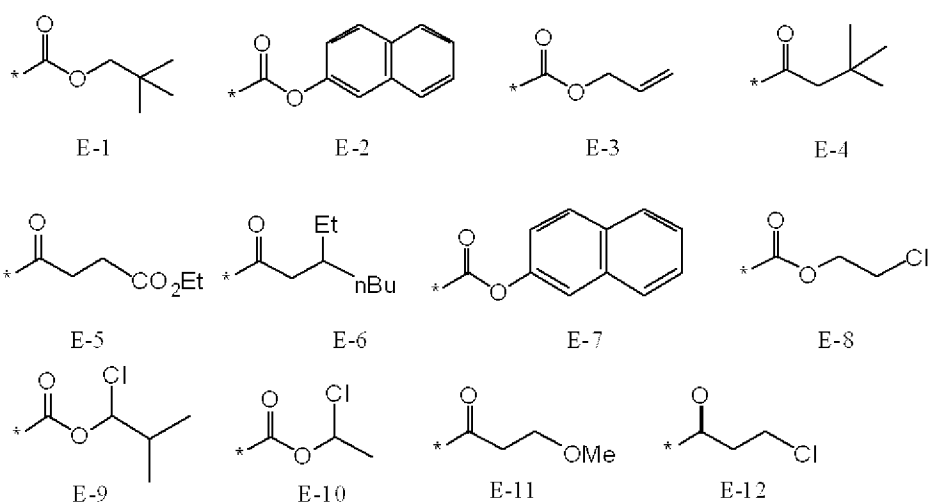
CCl ₂ F	H	COPh	H	H
CCl ₂ F	H	—CH ₂ —O—CH ₂ —		H
CCl ₂ F	H	—(CH ₂) ₂ —		H
CCl ₂ F	H	—(CH ₂) ₃ —		H
CCl ₂ F	COEt	H	H	H
CCl ₂ F	COEt	Me	H	H
CCl ₂ F	COEt	Me	Me	H
CCl ₂ F	COEt	Cl	H	H
CCl ₂ F	COEt	Ph	H	H
CCl ₂ F	COEt	Ph	Me	H
CCl ₂ F	COEt	COMe	H	H
CCl ₂ F	COEt	CO ₂ Me	H	H
CCl ₂ F	COEt	OMe	H	H
CCl ₂ F	COEt	OMe	Me	H
CCl ₂ F	COEt	CH ₂ Ph	H	H
CCl ₂ F	COEt	COPh	H	H
CCl ₂ F	COEt	—CH ₂ —O—CH ₂ —		H
CCl ₂ F	COEt	—(CH ₂) ₂ —		H
CCl ₂ F	COEt	—(CH ₂) ₃ —		H
CCl ₂ F	CO ₂ Et	H	H	H
CCl ₂ F	CO ₂ Et	Me	H	H
CCl ₂ F	CO ₂ Et	Me	Me	H
CCl ₂ F	CO ₂ Et	Cl	H	H
CCl ₂ F	CO ₂ Et	Ph	H	H
CCl ₂ F	CO ₂ Et	Ph	Me	H
CCl ₂ F	CO ₂ Et	COMe	H	H
CCl ₂ F	CO ₂ Et	CO ₂ Me	H	H
CCl ₂ F	CO ₂ Et	OMe	H	H

CCl ₂ F	CO ₂ Et	OMe	Me	H
CCl ₂ F	CO ₂ Et	CH ₂ Ph	H	H
CCl ₂ F	CO ₂ Et	COPh	H	H
CCl ₂ F	CO ₂ Et	—CH ₂ —O—CH ₂ —		H
CCl ₂ F	CO ₂ Et	—(CH ₂) ₂ —		H
CCl ₂ F	CO ₂ Et	—(CH ₂) ₃ —		H
CCl ₂ F	CO ₂ Bu-i	H	H	H
CCl ₂ F	CO ₂ Bu-i	Me	H	H
CCl ₂ F	CO ₂ Bu-i	Me	Me	H
CCl ₂ F	CO ₂ Bu-i	Cl	H	H
CCl ₂ F	CO ₂ Bu-i	Ph	H	H
CCl ₂ F	CO ₂ Bu-i	Ph	Me	H
CCl ₂ F	CO ₂ Bu-i	COMe	H	H
CCl ₂ F	CO ₂ Bu-i	CO ₂ Me	H	H
CCl ₂ F	CO ₂ Bu-i	OMe	H	H
CCl ₂ F	CO ₂ Bu-i	OMe	Me	H
CCl ₂ F	CO ₂ Bu-i	CH ₂ Ph	H	H
CCl ₂ F	CO ₂ Bu-i	COPh	H	H
CCl ₂ F	CO ₂ Bu-i	—CH ₂ —O—CH ₂ —		H
CCl ₂ F	CO ₂ Bu-i	—(CH ₂) ₂ —		H
CCl ₂ F	CO ₂ Bu-i	—(CH ₂) ₃ —		H
CBr ₂ F	H	H	H	H
CBr ₂ F	H	Me	H	H
CBr ₂ F	H	Me	Me	H
CBr ₂ F	H	—(CH ₂) ₂ —		H
CBr ₂ F	H	—(CH ₂) ₃ —		H
CBr ₂ F	CO ₂ Et	H	H	H
CBr ₂ F	CO ₂ Et	Me	H	H

CB r ₂ F	CO ₂ E t	Me	Me	H
CB r ₂ F	CO ₂ E t	— (CH ₂) ₂ —		H
CB r ₂ F	CO ₂ E t	— (CH ₂) ₃ —		H
CC l ₃	H	H	H	H
CC l ₃	H	Me	H	H
CC l ₃	H	Me	Me	H
CC l ₃	H	— (CH ₂) ₂ —		H
CC l ₃	H	— (CH ₂) ₃ —		H
CC l ₃	CO ₂ E t	H	H	H
CC l ₃	CO ₂ E t	Me	H	H
CC l ₃	CO ₂ E t	Me	Me	H
CC l ₃	CO ₂ E t	— (CH ₂) ₂ —		H
CC l ₃	CO ₂ E t	— (CH ₂) ₃ —		H

[0139] 第2表中、E-1乃至E-12は、それぞれ下記構造で表される。

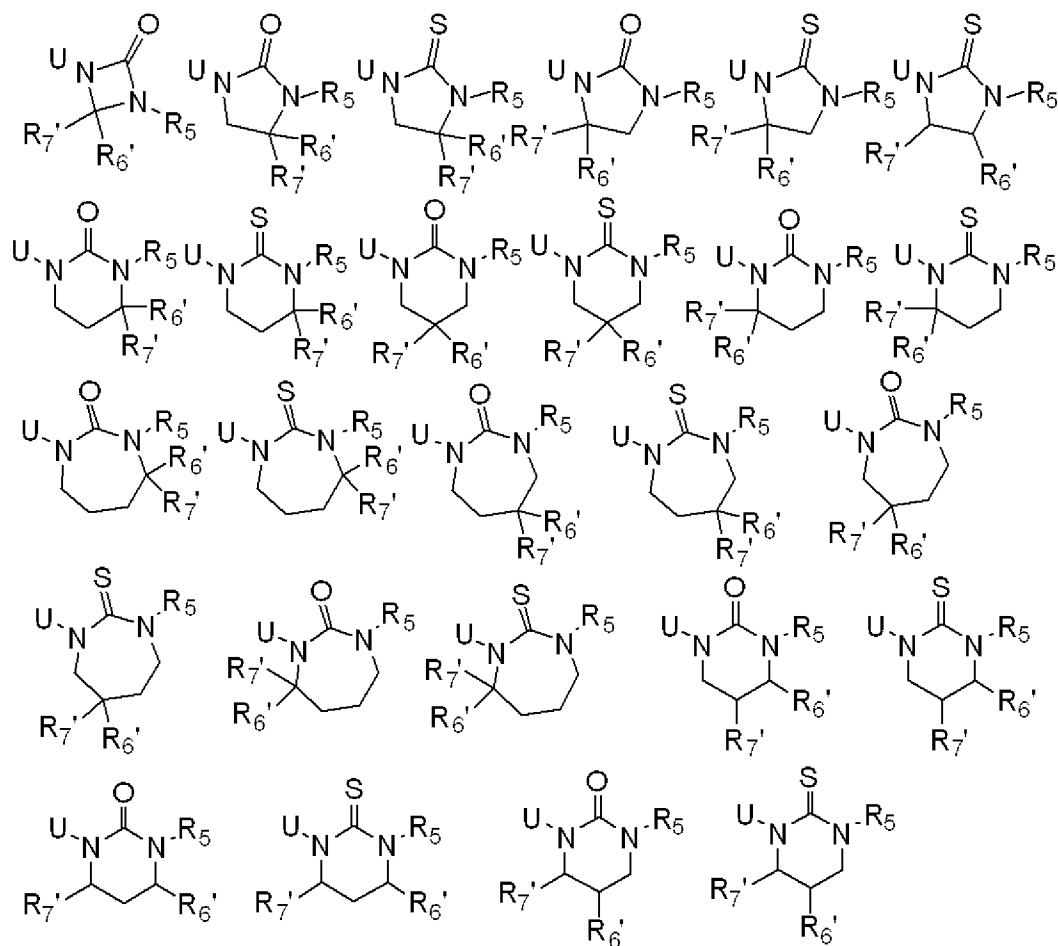
[0140] [化14]



[0141] [第3表]

[0142]

[化15]



[0143] Uは、前記一般式（26）と同じである。

[0144] $R_3 = R_4 = H$

R_1	R_2	R_5	$R_{6'}$	$R_{7'}$	X
CF_3	H	H	H	H	H
CF_3	H	Me	H	H	H
CF_3	H	Et	H	H	H
CF_3	H	Pr-c	H	H	H
CF_3	H	CH_2Pr-i	H	H	H
CF_3	H	CH_2Pr-c	H	H	H
CF_3	H	$CH_2CH=CH_2$	H	H	H

CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	H	H	H
CF ₃	H	CH ₂ OMe	H	H	H
CF ₃	H	CH ₂ SM e	H	H	H
CF ₃	H	CH ₂ CO ₂ Me	H	H	H
CF ₃	H	CH ₂ Ph	H	H	H
CF ₃	H	CH ₂ Ph-2-Cl	H	H	H
CF ₃	H	CH ₂ Ph-3-Cl	H	H	H
CF ₃	H	CH ₂ Ph-4-Cl	H	H	H
CF ₃	H	Ph	H	H	H
CF ₃	H	Ph-2-Cl	H	H	H
CF ₃	H	Ph-3-Cl	H	H	H
CF ₃	H	Ph-4-Cl	H	H	H
CF ₃	H	COMe	H	H	H
CF ₃	H	COPr-c	H	H	H
CF ₃	H	CONMe ₂	H	H	H
CF ₃	H	SO ₂ Me	H	H	H
CF ₃	H	SO ₂ CF ₃	H	H	H
CF ₃	H	CO ₂ Et	H	H	H
CF ₃	H	H	Me	H	H
CF ₃	H	Me	Me	H	H
CF ₃	H	Et	Me	H	H
CF ₃	H	Pr-c	Me	H	H
CF ₃	H	CH ₂ Pr-i	Me	H	H
CF ₃	H	CH ₂ Pr-c	Me	H	H
CF ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂	Me	H	H
CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	Me	H	H
CF ₃	H	CH ₂ OMe	Me	H	H
CF ₃	H	CH ₂ SM e	Me	H	H

CF ₃	H	CH ₂ CO ₂ Me	Me	H	H
CF ₃	H	CH ₂ Ph	Me	H	H
CF ₃	H	CH ₂ Ph-2-Cl	Me	H	H
CF ₃	H	CH ₂ Ph-3-Cl	Me	H	H
CF ₃	H	CH ₂ Ph-4-Cl	Me	H	H
CF ₃	H	Ph	Me	H	H
CF ₃	H	Ph-2-Cl	Me	H	H
CF ₃	H	Ph-3-Cl	Me	H	H
CF ₃	H	Ph-4-Cl	Me	H	H
CF ₃	H	COMe	Me	H	H
CF ₃	H	COPr-c	Me	H	H
CF ₃	H	CONMe ₂	Me	H	H
CF ₃	H	SO ₂ Me	Me	H	H
CF ₃	H	SO ₂ CF ₃	Me	H	H
CF ₃	H	CO ₂ Et	Me	H	H
CF ₃	H	H	Me	Me	H
CF ₃	H	Me	Me	Me	H
CF ₃	H	Et	Me	Me	H
CF ₃	H	Pr-c	Me	Me	H
CF ₃	H	CH ₂ Pr-i	Me	Me	H
CF ₃	H	CH ₂ Pr-c	Me	Me	H
CF ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂	Me	Me	H
CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	Me	Me	H
CF ₃	H	CH ₂ OMe	Me	Me	H
CF ₃	H	CH ₂ SMe	Me	Me	H
CF ₃	H	CH ₂ CO ₂ Me	Me	Me	H
CF ₃	H	CH ₂ Ph	Me	Me	H
CF ₃	H	CH ₂ Ph-2-Cl	Me	Me	H

CF ₃	H	CH ₂ Ph-3-Cl	Me	Me	H
CF ₃	H	CH ₂ Ph-4-Cl	Me	Me	H
CF ₃	H	Ph	Me	Me	H
CF ₃	H	Ph-2-Cl	Me	Me	H
CF ₃	H	Ph-3-Cl	Me	Me	H
CF ₃	H	Ph-4-Cl	Me	Me	H
CF ₃	H	COMe	Me	Me	H
CF ₃	H	COPr-c	Me	Me	H
CF ₃	H	CONMe ₂	Me	Me	H
CF ₃	H	SO ₂ Me	Me	Me	H
CF ₃	H	SO ₂ CF ₃	Me	Me	H
CF ₃	H	CO ₂ Et	Me	Me	H
CF ₃	H	H	Me	Et	H
CF ₃	H	Me	Me	Et	H
CF ₃	H	H	Me	Pr-n	H
CF ₃	H	Me	Me	Pr-n	H
CF ₃	H	H	Me	Pr-i	H
CF ₃	H	Me	Me	Pr-i	H
CF ₃	H	H	Me	Pr-c	H
CF ₃	H	Me	Me	Pr-c	H
CF ₃	H	H	Me	CF ₃	H
CF ₃	H	Me	Me	CF ₃	H
CF ₃	H	H	Me	Ph	H
CF ₃	H	Me	Me	Ph	H
CF ₃	H	H	Et	H	H
CF ₃	H	Me	Et	H	H
CF ₃	H	H	Et	Et	H
CF ₃	H	Me	Et	Et	H

CF ₃	H	H	Pr-n	H	H
CF ₃	H	Me	Pr-n	H	H
CF ₃	H	H	Pr-i	H	H
CF ₃	H	Me	Pr-i	H	H
CF ₃	H	H	Pr-c	H	H
CF ₃	H	Me	Pr-c	H	H
CF ₃	H	H	Bu-n	H	H
CF ₃	H	Me	Bu-n	H	H
CF ₃	H	H	Bu-i	H	H
CF ₃	H	Me	Bu-i	H	H
CF ₃	H	H	Bu-s	H	H
CF ₃	H	Me	Bu-s	H	H
CF ₃	H	H	Bu-t	H	H
CF ₃	H	Me	Bu-t	H	H
CF ₃	H	H	Bu-c	H	H
CF ₃	H	Me	Bu-c	H	H
CF ₃	H	H	Pen-n	H	H
CF ₃	H	Me	Pen-n	H	H
CF ₃	H	H	Pen-c	H	H
CF ₃	H	Me	Pen-c	H	H
CF ₃	H	H	Hex-n	H	H
CF ₃	H	Me	Hex-n	H	H
CF ₃	H	H	Hex-c	H	H
CF ₃	H	Me	Hex-c	H	H
CF ₃	H	H	Cl	H	H
CF ₃	H	Me	Cl	H	H
CF ₃	H	Et	Cl	H	H
CF ₃	H	H	Cl	Cl	H

CF_3	H	Me	Cl	Cl	H
CF_3	H	H	Br	H	H
CF_3	H	Me	Br	H	H
CF_3	H	H	I	H	H
CF_3	H	Me	I	H	H
CF_3	H	H	F	H	H
CF_3	H	Me	F	H	H
CF_3	H	H	F	F	H
CF_3	H	Me	F	F	H
CF_3	H	H	$\text{CH}=\text{CH}_2$	H	H
CF_3	H	Me	$\text{CH}=\text{CH}_2$	H	H
CF_3	H	H	$\text{CH}=\text{CH}_2$	Me	H
CF_3	H	Me	$\text{CH}=\text{CH}_2$	Me	H
CF_3	H	H	$\text{C}\equiv\text{CH}$	H	H
CF_3	H	Me	$\text{C}\equiv\text{CH}$	H	H
CF_3	H	H	$\text{C}\equiv\text{CH}$	Me	H
CF_3	H	Me	$\text{C}\equiv\text{CH}$	Me	H
CF_3	H	H	$\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	H	H
CF_3	H	Me	$\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	H	H
CF_3	H	H	$\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	Me	H
CF_3	H	Me	$\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	Me	H
CF_3	H	H	$\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	H	H
CF_3	H	Me	$\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	H	H
CF_3	H	H	$\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	Me	H
CF_3	H	Me	$\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	Me	H
CF_3	H	H	CH_2Cl	H	H
CF_3	H	Me	CH_2Cl	H	H
CF_3	H	H	CH_2Cl	Me	H

CF_3	H	Me	CH_2Cl	Me	H
CF_3	H	H	CHCl_2	H	H
CF_3	H	Me	CHCl_2	H	H
CF_3	H	H	CCl_3	H	H
CF_3	H	Me	CCl_3	H	H
CF_3	H	H	CH_2F	H	H
CF_3	H	Me	CH_2F	H	H
CF_3	H	H	CHF_2	H	H
CF_3	H	Me	CHF_2	H	H
CF_3	H	H	CF_3	H	H
CF_3	H	Me	CF_3	H	H
CF_3	H	H	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$	H	H
CF_3	H	Me	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$	H	H
CF_3	H	H	CH_2OH	H	H
CF_3	H	Me	CH_2OH	H	H
CF_3	H	H	CH_2SMe	H	H
CF_3	H	Me	CH_2SMe	H	H
CF_3	H	H	$\text{CH}_2\text{SCH}_2\text{Cl}$	H	H
CF_3	H	Me	$\text{CH}_2\text{SCH}_2\text{Cl}$	H	H
CF_3	H	H	Ph	H	H
CF_3	H	Me	Ph	H	H
CF_3	H	H	Ph-2-Cl	H	H
CF_3	H	Me	Ph-2-Cl	H	H
CF_3	H	H	Ph-3-Cl	H	H
CF_3	H	Me	Ph-3-Cl	H	H
CF_3	H	H	Ph-4-Cl	H	H
CF_3	H	Me	Ph-4-Cl	H	H
CF_3	H	Me	Ph-2-Br	H	H

CF ₃	H	Me	Ph-3-I	H	H
CF ₃	H	Me	Ph-4-F	H	H
CF ₃	H	Me	Ph-2-Me	H	H
CF ₃	H	Me	Ph-3-OMe	H	H
CF ₃	H	Me	Ph-4-SMe	H	H
CF ₃	H	Me	Ph-2-SO ₂ Me	H	H
CF ₃	H	Me	Ph-3-CN	H	H
CF ₃	H	Me	Ph-4-NO ₂	H	H
CF ₃	H	Me	Ph-2-CO ₂ Me	H	H
CF ₃	H	Me	Ph-3-NH ₂	H	H
CF ₃	H	Me	Ph-4-Ph	H	H
CF ₃	H	Me	Ph-2-OPh	H	H
CF ₃	H	Me	Ph-3-SPh	H	H
CF ₃	H	Me	Ph-4-OH	H	H
CF ₃	H	H	COMe	H	H
CF ₃	H	Me	COMe	H	H
CF ₃	H	H	COEt	H	H
CF ₃	H	Me	COEt	H	H
CF ₃	H	H	COCH ₂ Cl	H	H
CF ₃	H	Me	COCH ₂ Cl	H	H
CF ₃	H	H	CO ₂ H	H	H
CF ₃	H	Me	CO ₂ H	H	H
CF ₃	H	H	CO ₂ Me	H	H
CF ₃	H	Me	CO ₂ Me	H	H
CF ₃	H	H	CO ₂ Et	H	H
CF ₃	H	Me	CO ₂ Et	H	H
CF ₃	H	H	CONHMe	H	H
CF ₃	H	Me	CONHMe	H	H

CF_3	H	H	CONMe_2	H	H
CF_3	H	Me	CONMe_2	H	H
CF_3	H	H	OH	H	H
CF_3	H	Me	OH	H	H
CF_3	H	H	OMe	H	H
CF_3	H	Me	OMe	H	H
CF_3	H	H	SMe	H	H
CF_3	H	Me	SMe	H	H
CF_3	H	H	CN	H	H
CF_3	H	Me	CN	H	H
CF_3	H	H	NH_2	H	H
CF_3	H	Me	NH_2	H	H
CF_3	H	H	NHMe	H	H
CF_3	H	Me	NHMe	H	H
CF_3	H	H	NMe_2	H	H
CF_3	H	Me	NMe_2	H	H
CF_3	H	H	$-\text{CH}_2-\text{O}-$		H
CF_3	H	Me	$-\text{CH}_2-\text{O}-$		H
CF_3	H	H	$-\text{CH}_2-\text{O}-$		H
CF_3	H	Me	$-\text{CH}_2-\text{O}-$		H
CF_3	H	H	$-(\text{CH}_2)_2-$		H
CF_3	H	Me	$-(\text{CH}_2)_2-$		H
CF_3	H	H	$-(\text{CH}_2)_3-$		H
CF_3	H	Me	$-(\text{CH}_2)_3-$		H
CF_3	H	Me	H	H	3-F
CF_3	H	Me	H	H	4-F
CF_3	H	Me	H	H	5-F
CF_3	H	Me	H	H	6-F

CF_3	H	Me	H	H 4 - Cl
CF_3	H	Me	H	H 5 - Cl
CF_3	H	Me	H	H 4 - Br
CF_3	H	Me	H	H 4 - I
CF_3	H	Me	H	H 4 - Me
CF_3	H	Me	H	H 5 - Me
CF_3	H	Me	H	H 4 - OM
e				
CF_3	H	Me	H	H 4 - SM
e				
CF_3	Me	H	H	H H
CF_3	Me	H	Me	H H
CF_3	Me	H	Me	Me H
CF_3	Me	Me	H	H H
CF_3	Me	Me	Me	H H
CF_3	Me	Me	Me	Me H
CF_3	COMe	H	H	H H
CF_3	COMe	H	Me	H H
CF_3	COMe	H	Me	Me H
CF_3	COMe	Me	H	H H
CF_3	COMe	Me	Me	H H
CF_3	COMe	Me	Me	Me H
CF_3	COMe	H	$-\text{CH}_2-\text{O}-$	H
CF_3	COMe	Me	$-\text{CH}_2-\text{O}-$	H
CF_3	COMe	H	$-(\text{CH}_2)_2-$	H
CF_3	COMe	Me	$-(\text{CH}_2)_2-$	H
CF_3	COMe	H	$-(\text{CH}_2)_3-$	H
CF_3	COMe	Me	$-(\text{CH}_2)_3-$	H

CF ₃	COEt	H	H	H	H
CF ₃	COEt	H	Me	H	H
CF ₃	COEt	H	Me	Me	H
CF ₃	COEt	Me	H	H	H
CF ₃	COEt	Me	Me	H	H
CF ₃	COEt	Me	Me	Me	H
CF ₃	COEt	SO ₂ CF ₃	H	H	H
CF ₃	COEt	H	Et	H	H
CF ₃	COEt	Me	Et	H	H
CF ₃	COEt	H	Et	Me	H
CF ₃	COEt	Me	Et	Me	H
CF ₃	COEt	H	Pr-n	H	H
CF ₃	COEt	Me	Pr-n	H	H
CF ₃	COEt	H	Pr-n	Me	H
CF ₃	COEt	Me	Pr-n	Me	H
CF ₃	COEt	H	Cl	H	H
CF ₃	COEt	Me	Cl	H	H
CF ₃	COEt	H	CH ₂ CH=CH ₂	H	H
CF ₃	COEt	Me	CH ₂ CH=CH ₂	H	H
CF ₃	COEt	H	CH ₂ Cl	H	H
CF ₃	COEt	Me	CH ₂ Cl	H	H
CF ₃	COEt	H	CF ₃	H	H
CF ₃	COEt	Me	CF ₃	H	H
CF ₃	COEt	H	CF ₃	Me	H
CF ₃	COEt	Me	CF ₃	Me	H
CF ₃	COEt	H	Ph	H	H
CF ₃	COEt	Me	Ph	H	H
CF ₃	COEt	H	Ph	Me	H

CF ₃	COEt	Me	Ph	Me	H
CF ₃	COEt	H	Ph-2-Cl	H	H
CF ₃	COEt	Me	Ph-2-Cl	H	H
CF ₃	COEt	H	Ph-3-Cl	H	H
CF ₃	COEt	Me	Ph-3-Cl	H	H
CF ₃	COEt	H	Ph-4-Cl	H	H
CF ₃	COEt	Me	Ph-4-Cl	H	H
CF ₃	COEt	H	COMe	H	H
CF ₃	COEt	Me	COMe	H	H
CF ₃	COEt	H	CO ₂ H	H	H
CF ₃	COEt	Me	CO ₂ H	H	H
CF ₃	COEt	H	CO ₂ Me	H	H
CF ₃	COEt	Me	CO ₂ Me	H	H
CF ₃	COEt	H	CONH ₂	H	H
CF ₃	COEt	Me	CONH ₂	H	H
CF ₃	COEt	H	CONHMe	H	H
CF ₃	COEt	Me	CONHMe	H	H
CF ₃	COEt	H	CONMe ₂	H	H
CF ₃	COEt	Me	CONMe ₂	H	H
CF ₃	COEt	H	OH	H	H
CF ₃	COEt	Me	OH	H	H
CF ₃	COEt	H	OMe	H	H
CF ₃	COEt	Me	OMe	H	H
CF ₃	COEt	H	OMe	Me	H
CF ₃	COEt	Me	OMe	Me	H
CF ₃	COEt	H	SMe	H	H
CF ₃	COEt	Me	SMe	H	H
CF ₃	COEt	H	SMe	Me	H

CF ₃	COEt	Me	SMe	Me	H
CF ₃	COEt	H	NHMe	H	H
CF ₃	COEt	Me	NHMe	H	H
CF ₃	COEt	H	NHMe	Me	H
CF ₃	COEt	Me	NHMe	Me	H
CF ₃	COEt	H	CH ₂ Ph	H	H
CF ₃	COEt	Me	CH ₂ Ph	H	H
CF ₃	COEt	H	CH ₂ Ph-2-Cl	H	H
CF ₃	COEt	Me	CH ₂ Ph-2-Cl	H	H
CF ₃	COEt	H	CH ₂ Ph-3-Cl	H	H
CF ₃	COEt	Me	CH ₂ Ph-3-Cl	H	H
CF ₃	COEt	H	CH ₂ Ph-4-Cl	H	H
CF ₃	COEt	Me	CH ₂ Ph-4-Cl	H	H
CF ₃	COEt	H	COPh	H	H
CF ₃	COEt	Me	COPh	H	H
CF ₃	COEt	H	COPh-2-Cl	H	H
CF ₃	COEt	Me	COPh-2-Cl	H	H
CF ₃	COEt	H	COPh-3-Cl	H	H
CF ₃	COEt	Me	COPh-3-Cl	H	H
CF ₃	COEt	H	COPh-4-Cl	H	H
CF ₃	COEt	Me	COPh-4-Cl	H	H
CF ₃	COEt	H	-CH ₂ -O-		H
CF ₃	COEt	Me	-CH ₂ -O-		H
CF ₃	COEt	H	-(CH ₂) ₂ -		H
CF ₃	COEt	Me	-(CH ₂) ₂ -		H
CF ₃	COEt	H	-(CH ₂) ₃ -		H
CF ₃	COEt	Me	-(CH ₂) ₃ -		H
CF ₃	COEt	Me	H	H	3-F

CF ₃	COEt	Me	H	H 4-F
CF ₃	COEt	Me	H	H 5-F
CF ₃	COEt	Me	H	H 6-F
CF ₃	COEt	Me	H	H 4-Cl
CF ₃	COEt	Me	H	H 5-Cl
CF ₃	COEt	Me	H	H 4-Br
CF ₃	COEt	Me	H	H 4-I
CF ₃	COEt	Me	H	H 4-Me
CF ₃	COEt	Me	H	H 5-Me
CF ₃	COEt	Me	H	H 4-OMe
e				
CF ₃	COEt	Me	H	H 4-SMe
e				
CF ₃	COPr-n	H	H	H H
CF ₃	COPr-n	H	Me	H H
CF ₃	COPr-n	H	Me	Me H
CF ₃	COPr-n	Me	H	H H
CF ₃	COPr-n	Me	Me	H H
CF ₃	COPr-n	Me	Me	Me H
CF ₃	COPr-n	H	-CH ₂ -O-	H
CF ₃	COPr-n	Me	-CH ₂ -O-	H
CF ₃	COPr-n	H	-(CH ₂) ₂ -	H
CF ₃	COPr-n	Me	-(CH ₂) ₂ -	H
CF ₃	COPr-n	H	-(CH ₂) ₃ -	H
CF ₃	COPr-n	Me	-(CH ₂) ₃ -	H
CF ₃	COPr-i	H	H	H H
CF ₃	COPr-i	H	Me	H H
CF ₃	COPr-i	H	Me	Me H

CF ₃	COPr-i	Me	H	H	H
CF ₃	COPr-i	Me	Me	H	H
CF ₃	COPr-i	Me	Me	Me	H
CF ₃	COPr-i	H	-CH ₂ -O-		H
CF ₃	COPr-i	Me	-CH ₂ -O-		H
CF ₃	COPr-i	H	-(CH ₂) ₂ -		H
CF ₃	COPr-i	Me	-(CH ₂) ₂ -		H
CF ₃	COPr-i	H	-(CH ₂) ₃ -		H
CF ₃	COPr-i	Me	-(CH ₂) ₃ -		H
CF ₃	COPr-c	H	H	H	H
CF ₃	COPr-c	H	Me	H	H
CF ₃	COPr-c	H	Me	Me	H
CF ₃	COPr-c	Me	H	H	H
CF ₃	COPr-c	Me	Me	H	H
CF ₃	COPr-c	Me	Me	Me	H
CF ₃	COPr-c	H	-CH ₂ -O-		H
CF ₃	COPr-c	Me	-CH ₂ -O-		H
CF ₃	COPr-c	H	-(CH ₂) ₂ -		H
CF ₃	COPr-c	Me	-(CH ₂) ₂ -		H
CF ₃	COPr-c	H	-(CH ₂) ₃ -		H
CF ₃	COPr-c	Me	-(CH ₂) ₃ -		H
CF ₃	COBu-n	H	H	H	H
CF ₃	COBu-n	H	Me	H	H
CF ₃	COBu-n	H	Me	Me	H
CF ₃	COBu-n	Me	H	H	H
CF ₃	COBu-n	Me	Me	H	H
CF ₃	COBu-n	Me	Me	Me	H
CF ₃	COBu-n	H	-CH ₂ -O-		H

CF ₃	COBu-n	Me	-CH ₂ -O-	H
CF ₃	COBu-n	H	-(CH ₂) ₂ -	H
CF ₃	COBu-n	Me	-(CH ₂) ₂ -	H
CF ₃	COBu-n	H	-(CH ₂) ₃ -	H
CF ₃	COBu-n	Me	-(CH ₂) ₃ -	H
CF ₃	COBu-c	H	H	H H
CF ₃	COBu-c	H	Me	H H
CF ₃	COBu-c	H	Me	Me H
CF ₃	COBu-c	Me	H	H H
CF ₃	COBu-c	Me	Me	H H
CF ₃	COBu-c	Me	Me	Me H
CF ₃	COBu-c	H	-CH ₂ -O-	H
CF ₃	COBu-c	Me	-CH ₂ -O-	H
CF ₃	COBu-c	H	-(CH ₂) ₂ -	H
CF ₃	COBu-c	Me	-(CH ₂) ₂ -	H
CF ₃	COBu-c	H	-(CH ₂) ₃ -	H
CF ₃	COBu-c	Me	-(CH ₂) ₃ -	H
CF ₃	COBu-t	H	H	H H
CF ₃	COBu-t	H	Me	H H
CF ₃	COBu-t	H	Me	Me H
CF ₃	COBu-t	Me	H	H H
CF ₃	COBu-t	Me	Me	H H
CF ₃	COBu-t	Me	Me	Me H
CF ₃	COBu-t	H	-CH ₂ -O-	H
CF ₃	COBu-t	Me	-CH ₂ -O-	H
CF ₃	COBu-t	H	-(CH ₂) ₂ -	H
CF ₃	COBu-t	Me	-(CH ₂) ₂ -	H
CF ₃	COBu-t	H	-(CH ₂) ₃ -	H

CF ₃	COBu-t	Me	—(CH ₂) ₃ —	H
CF ₃	COPen-n	H	H	H
CF ₃	COPen-n	H	Me	H
CF ₃	COPen-n	H	Me	Me H
CF ₃	COPen-n	Me	H	H
CF ₃	COPen-n	Me	Me	H
CF ₃	COPen-n	Me	Me	Me H
CF ₃	COPen-n	H	—CH ₂ —O—	H
CF ₃	COPen-n	Me	—CH ₂ —O—	H
CF ₃	COPen-n	H	—(CH ₂) ₂ —	H
CF ₃	COPen-n	Me	—(CH ₂) ₂ —	H
CF ₃	COPen-n	H	—(CH ₂) ₃ —	H
CF ₃	COPen-n	Me	—(CH ₂) ₃ —	H
CF ₃	COHex-n	H	H	H
CF ₃	COHex-n	H	Me	H
CF ₃	COHex-n	H	Me	Me H
CF ₃	COHex-n	Me	H	H
CF ₃	COHex-n	Me	Me	H
CF ₃	COHex-n	Me	Me	Me H
CF ₃	COHex-n	H	—CH ₂ —O—	H
CF ₃	COHex-n	Me	—CH ₂ —O—	H
CF ₃	COHex-n	H	—(CH ₂) ₂ —	H
CF ₃	COHex-n	Me	—(CH ₂) ₂ —	H
CF ₃	COHex-n	H	—(CH ₂) ₃ —	H
CF ₃	COHex-n	Me	—(CH ₂) ₃ —	H
CF ₃	COPh	H	H	H
CF ₃	COPh	H	Me	H
CF ₃	COPh	H	Me	Me H

CF ₃	COPh	Me	H	H	H
CF ₃	COPh	Me	Me	H	H
CF ₃	COPh	Me	Me	Me	H
CF ₃	COPh	H	—CH ₂ —O—		H
CF ₃	COPh	Me	—CH ₂ —O—		H
CF ₃	COPh	H	—(CH ₂) ₂ —		H
CF ₃	COPh	Me	—(CH ₂) ₂ —		H
CF ₃	COPh	H	—(CH ₂) ₃ —		H
CF ₃	COPh	Me	—(CH ₂) ₃ —		H
CF ₃	CO ₂ Me	H	H	H	H
CF ₃	CO ₂ Me	H	Me	H	H
CF ₃	CO ₂ Me	H	Me	Me	H
CF ₃	CO ₂ Me	Me	H	H	H
CF ₃	CO ₂ Me	Me	Me	H	H
CF ₃	CO ₂ Me	Me	Me	Me	H
CF ₃	CO ₂ Me	H	—CH ₂ —O—		H
CF ₃	CO ₂ Me	Me	—CH ₂ —O—		H
CF ₃	CO ₂ Me	H	—(CH ₂) ₂ —		H
CF ₃	CO ₂ Me	Me	—(CH ₂) ₂ —		H
CF ₃	CO ₂ Me	H	—(CH ₂) ₃ —		H
CF ₃	CO ₂ Me	Me	—(CH ₂) ₃ —		H
CF ₃	CO ₂ Et	H	H	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	H	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Et	H	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Pr—c	H	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	CH ₂ Pr—i	H	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	CH ₂ Pr—c	H	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	CH ₂ CH=CH ₂	H	H	H

CF ₃	CO ₂ Et	CH ₂ C≡CH	H	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	CH ₂ OMe	H	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	CH ₂ SM e	H	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	CH ₂ CO ₂ Me	H	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	CH ₂ Ph	H	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	CH ₂ Ph-2-Cl	H	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	CH ₂ Ph-3-Cl	H	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	CH ₂ Ph-4-Cl	H	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Ph	H	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Ph-2-Cl	H	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Ph-3-Cl	H	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Ph-4-Cl	H	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	COMe	H	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	COPr-c	H	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	CONMe ₂	H	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	SO ₂ Me	H	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	SO ₂ CF ₃	H	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	CO ₂ Et	H	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	H	Me	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	Me	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Et	Me	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Pr-c	Me	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	CH ₂ Pr-i	Me	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	CH ₂ Pr-c	Me	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	CH ₂ CH=CH ₂	Me	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	CH ₂ C≡CH	Me	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	CH ₂ OMe	Me	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	CH ₂ SM e	Me	H	H

CF ₃	CO ₂ Et	CH ₂ CO ₂ Me	Me	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	CH ₂ Ph	Me	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	CH ₂ Ph-2-Cl	Me	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	CH ₂ Ph-3-Cl	Me	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	CH ₂ Ph-4-Cl	Me	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Ph	Me	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Ph-2-Cl	Me	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Ph-3-Cl	Me	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Ph-4-Cl	Me	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	COMe	Me	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	COPr-c	Me	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	CONMe ₂	Me	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	SO ₂ Me	Me	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	SO ₂ CF ₃	Me	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	CO ₂ Et	Me	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	H	Me	Me	H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	Me	Me	H
CF ₃	CO ₂ Et	Et	Me	Me	H
CF ₃	CO ₂ Et	Pr-c	Me	Me	H
CF ₃	CO ₂ Et	CH ₂ Pr-i	Me	Me	H
CF ₃	CO ₂ Et	CH ₂ Pr-c	Me	Me	H
CF ₃	CO ₂ Et	CH ₂ CH=CH ₂	Me	Me	H
CF ₃	CO ₂ Et	CH ₂ C≡CH	Me	Me	H
CF ₃	CO ₂ Et	CH ₂ OMe	Me	Me	H
CF ₃	CO ₂ Et	CH ₂ SMe	Me	Me	H
CF ₃	CO ₂ Et	CH ₂ CO ₂ Me	Me	Me	H
CF ₃	CO ₂ Et	CH ₂ Ph	Me	Me	H
CF ₃	CO ₂ Et	CH ₂ Ph-2-Cl	Me	Me	H

CF ₃	CO ₂ Et	CH ₂ Ph-3-Cl	Me	Me	H
CF ₃	CO ₂ Et	CH ₂ Ph-4-Cl	Me	Me	H
CF ₃	CO ₂ Et	Ph	Me	Me	H
CF ₃	CO ₂ Et	Ph-2-Cl	Me	Me	H
CF ₃	CO ₂ Et	Ph-3-Cl	Me	Me	H
CF ₃	CO ₂ Et	Ph-4-Cl	Me	Me	H
CF ₃	CO ₂ Et	COMe	Me	Me	H
CF ₃	CO ₂ Et	COPr-c	Me	Me	H
CF ₃	CO ₂ Et	CONMe ₂	Me	Me	H
CF ₃	CO ₂ Et	SO ₂ Me	Me	Me	H
CF ₃	CO ₂ Et	SO ₂ CF ₃	Me	Me	H
CF ₃	CO ₂ Et	CO ₂ Et	Me	Me	H
CF ₃	CO ₂ Et	H	Me	Et	H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	Me	Et	H
CF ₃	CO ₂ Et	H	Me	Pr-n	H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	Me	Pr-n	H
CF ₃	CO ₂ Et	H	Me	Pr-i	H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	Me	Pr-i	H
CF ₃	CO ₂ Et	H	Me	Pr-c	H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	Me	Pr-c	H
CF ₃	CO ₂ Et	H	Me	CF ₃	H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	Me	CF ₃	H
CF ₃	CO ₂ Et	H	Me	Ph	H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	Me	Ph	H
CF ₃	CO ₂ Et	H	Et	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	Et	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	H	Et	Et	H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	Et	Et	H

CF ₃	CO ₂ Et	H	Pr-n	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	Pr-n	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	H	Pr-i	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	Pr-i	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	H	Pr-c	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	Pr-c	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	H	Bu-n	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	Bu-n	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	H	Bu-i	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	Bu-i	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	H	Bu-s	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	Bu-s	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	H	Bu-t	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	Bu-t	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	H	Bu-c	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	Bu-c	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	H	Pen-n	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	Pen-n	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	H	Pen-c	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	Pen-c	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	H	Hex-n	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	Hex-n	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	H	Hex-c	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	Hex-c	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	H	Cl	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	Cl	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Et	Cl	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	H	Cl	Cl	H

CF ₃	CO ₂ Et	Me	Cl	Cl	H
CF ₃	CO ₂ Et	H	Br	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	Br	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	H	I	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	I	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	H	F	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	F	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	H	F	F	H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	F	F	H
CF ₃	CO ₂ Et	H	CH=CH ₂	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	CH=CH ₂	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	H	CH=CH ₂	Me	H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	CH=CH ₂	Me	H
CF ₃	CO ₂ Et	H	C≡CH	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	C≡CH	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	H	C≡CH	Me	H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	C≡CH	Me	H
CF ₃	CO ₂ Et	H	CH ₂ CH=CH ₂	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	CH ₂ CH=CH ₂	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	H	CH ₂ CH=CH ₂	Me	H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	CH ₂ CH=CH ₂	Me	H
CF ₃	CO ₂ Et	H	CH ₂ C≡CH	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	CH ₂ C≡CH	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	H	CH ₂ C≡CH	Me	H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	CH ₂ C≡CH	Me	H
CF ₃	CO ₂ Et	H	CH ₂ Cl	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	CH ₂ Cl	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	H	CH ₂ Cl	Me	H

CF ₃	CO ₂ Et	Me	CH ₂ Cl	Me	H
CF ₃	CO ₂ Et	H	CHCl ₂	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	CHCl ₂	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	H	CCl ₃	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	CCl ₃	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	H	CH ₂ F	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	CH ₂ F	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	H	CHF ₂	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	CHF ₂	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	H	CF ₃	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	CF ₃	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	H	CH ₂ CH ₂ Cl	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	CH ₂ CH ₂ Cl	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	H	CH ₂ OH	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	CH ₂ OH	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	H	CH ₂ SMe	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	CH ₂ SMe	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	H	CH ₂ SCH ₂ Cl	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	CH ₂ SCH ₂ Cl	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	H	Ph	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	Ph	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	H	Ph-2-Cl	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	Ph-2-Cl	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	H	Ph-3-Cl	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	Ph-3-Cl	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	H	Ph-4-Cl	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	Ph-4-Cl	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	Ph-2-Br	H	H

CF ₃	CO ₂ Et	Me	Ph-3-I	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	Ph-4-F	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	Ph-2-Me	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	Ph-3-OMe	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	Ph-4-SMe	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	Ph-2-SO ₂ Me	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	Ph-3-CN	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	Ph-4-NO ₂	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	Ph-2-CO ₂ Me	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	Ph-3-NH ₂	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	Ph-4-Ph	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	Ph-2-OPh	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	Ph-3-SPh	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	Ph-4-OH	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	H	COMe	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	COMe	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	H	COEt	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	COEt	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	H	COCH ₂ Cl	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	COCH ₂ Cl	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	H	CO ₂ H	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	CO ₂ H	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	H	CO ₂ Me	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	CO ₂ Me	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	H	CO ₂ Et	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	CO ₂ Et	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	H	CONHMe	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	CONHMe	H	H

CF ₃	CO ₂ Et	H	CONMe ₂	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	CONMe ₂	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	H	OH	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	OH	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	H	OMe	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	OMe	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	H	SMe	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	SMe	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	H	CN	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	CN	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	H	NH ₂	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	NH ₂	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	H	NHMe	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	NHMe	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	H	NMe ₂	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	NMe ₂	H	H
CF ₃	CO ₂ Et	H	—CH ₂ —O—		H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	—CH ₂ —O—		H
CF ₃	CO ₂ Et	H	—CH ₂ —O—		H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	—CH ₂ —O—		H
CF ₃	CO ₂ Et	H	—(CH ₂) ₂ —		H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	—(CH ₂) ₂ —		H
CF ₃	CO ₂ Et	H	—(CH ₂) ₃ —		H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	—(CH ₂) ₃ —		H
CF ₃	CO ₂ Et	Me	H	H	3—F
CF ₃	CO ₂ Et	Me	H	H	4—F
CF ₃	CO ₂ Et	Me	H	H	5—F
CF ₃	CO ₂ Et	Me	H	H	6—F

CF ₃	CO ₂ Et	Me	H	H 4-Cl
CF ₃	CO ₂ Et	Me	H	H 5-Cl
CF ₃	CO ₂ Et	Me	H	H 4-Br
CF ₃	CO ₂ Et	Me	H	H 4-I
CF ₃	CO ₂ Et	Me	H	H 4-Me
CF ₃	CO ₂ Et	Me	H	H 5-Me
CF ₃	CO ₂ Et	Me	H	H 4-OMe
e				
CF ₃	CO ₂ Et	Me	H	H 4-SMe
e				
CF ₃	CO ₂ Pr-n	H	H	H
CF ₃	CO ₂ Pr-n	H	Me	H
CF ₃	CO ₂ Pr-n	H	Me	Me H
CF ₃	CO ₂ Pr-n	Me	H	H
CF ₃	CO ₂ Pr-n	Me	Me	H
CF ₃	CO ₂ Pr-n	Me	Me	Me H
CF ₃	CO ₂ Pr-n	H	-CH ₂ -O-	H
CF ₃	CO ₂ Pr-n	Me	-CH ₂ -O-	H
CF ₃	CO ₂ Pr-n	H	-(CH ₂) ₂ -	H
CF ₃	CO ₂ Pr-n	Me	-(CH ₂) ₂ -	H
CF ₃	CO ₂ Pr-n	H	-(CH ₂) ₃ -	H
CF ₃	CO ₂ Pr-n	Me	-(CH ₂) ₃ -	H
CF ₃	CO ₂ Pr-i	H	H	H
CF ₃	CO ₂ Pr-i	H	Me	H
CF ₃	CO ₂ Pr-i	H	Me	Me H
CF ₃	CO ₂ Pr-i	Me	H	H
CF ₃	CO ₂ Pr-i	Me	Me	H
CF ₃	CO ₂ Pr-i	Me	Me	Me H

CF_3	$\text{CO}_2\text{Pr}-\text{i H}$	$-\text{CH}_2-\text{O}-$	H
CF_3	$\text{CO}_2\text{Pr}-\text{i Me}$	$-\text{CH}_2-\text{O}-$	H
CF_3	$\text{CO}_2\text{Pr}-\text{i H}$	$-(\text{CH}_2)_2-$	H
CF_3	$\text{CO}_2\text{Pr}-\text{i Me}$	$-(\text{CH}_2)_2-$	H
CF_3	$\text{CO}_2\text{Pr}-\text{i H}$	$-(\text{CH}_2)_3-$	H
CF_3	$\text{CO}_2\text{Pr}-\text{i Me}$	$-(\text{CH}_2)_3-$	H
CF_3	$\text{CO}_2\text{Bu}-\text{n H}$	H	H H
CF_3	$\text{CO}_2\text{Bu}-\text{n H}$	Me	H H
CF_3	$\text{CO}_2\text{Bu}-\text{n H}$	Me	Me H
CF_3	$\text{CO}_2\text{Bu}-\text{n Me}$	H	H H
CF_3	$\text{CO}_2\text{Bu}-\text{n Me}$	Me	H H
CF_3	$\text{CO}_2\text{Bu}-\text{n Me}$	Me	Me H
CF_3	$\text{CO}_2\text{Bu}-\text{n H}$	$-\text{CH}_2-\text{O}-$	H
CF_3	$\text{CO}_2\text{Bu}-\text{n Me}$	$-\text{CH}_2-\text{O}-$	H
CF_3	$\text{CO}_2\text{Bu}-\text{n H}$	$-(\text{CH}_2)_2-$	H
CF_3	$\text{CO}_2\text{Bu}-\text{n Me}$	$-(\text{CH}_2)_2-$	H
CF_3	$\text{CO}_2\text{Bu}-\text{n H}$	$-(\text{CH}_2)_3-$	H
CF_3	$\text{CO}_2\text{Bu}-\text{n Me}$	$-(\text{CH}_2)_3-$	H
CF_3	$\text{CO}_2\text{Bu}-\text{i H}$	H	H H
CF_3	$\text{CO}_2\text{Bu}-\text{i H}$	Me	H H
CF_3	$\text{CO}_2\text{Bu}-\text{i H}$	Me	Me H
CF_3	$\text{CO}_2\text{Bu}-\text{i Me}$	H	H H
CF_3	$\text{CO}_2\text{Bu}-\text{i Me}$	Me	H H
CF_3	$\text{CO}_2\text{Bu}-\text{i Me}$	Me	Me H
CF_3	$\text{CO}_2\text{Bu}-\text{i H}$	$-\text{CH}_2-\text{O}-$	H
CF_3	$\text{CO}_2\text{Bu}-\text{i Me}$	$-\text{CH}_2-\text{O}-$	H
CF_3	$\text{CO}_2\text{Bu}-\text{i H}$	$-(\text{CH}_2)_2-$	H
CF_3	$\text{CO}_2\text{Bu}-\text{i Me}$	$-(\text{CH}_2)_2-$	H

CF ₃	CO ₂ Bu-i	H	—(CH ₂) ₃ —	H
CF ₃	CO ₂ Bu-i	Me	—(CH ₂) ₃ —	H
CF ₃	CO ₂ Bu-t	H	H	H H
CF ₃	CO ₂ Bu-t	H	Me	H H
CF ₃	CO ₂ Bu-t	H	Me	Me H
CF ₃	CO ₂ Bu-t	Me	H	H H
CF ₃	CO ₂ Bu-t	Me	Me	H H
CF ₃	CO ₂ Bu-t	Me	Me	Me H
CF ₃	CO ₂ Bu-t	H	—CH ₂ —O—	H
CF ₃	CO ₂ Bu-t	Me	—CH ₂ —O—	H
CF ₃	CO ₂ Bu-t	H	—(CH ₂) ₂ —	H
CF ₃	CO ₂ Bu-t	Me	—(CH ₂) ₂ —	H
CF ₃	CO ₂ Bu-t	H	—(CH ₂) ₃ —	H
CF ₃	CO ₂ Bu-t	Me	—(CH ₂) ₃ —	H
CF ₃	CO ₂ Pen-n	H	H	H H
CF ₃	CO ₂ Pen-n	H	Me	H H
CF ₃	CO ₂ Pen-n	H	Me	Me H
CF ₃	CO ₂ Pen-n	Me	H	H H
CF ₃	CO ₂ Pen-n	Me	Me	H H
CF ₃	CO ₂ Pen-n	Me	Me	Me H
CF ₃	CO ₂ Pen-n	H	—CH ₂ —O—	H
CF ₃	CO ₂ Pen-n	Me	—CH ₂ —O—	H
CF ₃	CO ₂ Pen-n	H	—(CH ₂) ₂ —	H
CF ₃	CO ₂ Pen-n	Me	—(CH ₂) ₂ —	H
CF ₃	CO ₂ Pen-n	H	—(CH ₂) ₃ —	H
CF ₃	CO ₂ Pen-n	Me	—(CH ₂) ₃ —	H
CF ₃	E-1	H	H	H H
CF ₃	E-1	H	Me	H H

CF_3	E-1	H	Me	Me	H
CF_3	E-1	Me	H	H	H
CF_3	E-1	Me	Me	H	H
CF_3	E-1	Me	Me	Me	H
CF_3	E-1	H	$-\text{CH}_2-\text{O}-$		H
CF_3	E-1	Me	$-\text{CH}_2-\text{O}-$		H
CF_3	E-1	H	$-(\text{CH}_2)_2-$		H
CF_3	E-1	Me	$-(\text{CH}_2)_2-$		H
CF_3	E-1	H	$-(\text{CH}_2)_3-$		H
CF_3	E-1	Me	$-(\text{CH}_2)_3-$		H
CF_3	$\text{CO}_2\text{Hex}-n$	H	H	H	H
CF_3	$\text{CO}_2\text{Hex}-n$	H	Me	H	H
CF_3	$\text{CO}_2\text{Hex}-n$	H	Me	Me	H
CF_3	$\text{CO}_2\text{Hex}-n$	Me	H	H	H
CF_3	$\text{CO}_2\text{Hex}-n$	Me	Me	H	H
CF_3	$\text{CO}_2\text{Hex}-n$	Me	Me	Me	H
CF_3	$\text{CO}_2\text{Hex}-n$	H	$-\text{CH}_2-\text{O}-$		H
CF_3	$\text{CO}_2\text{Hex}-n$	Me	$-\text{CH}_2-\text{O}-$		H
CF_3	$\text{CO}_2\text{Hex}-n$	H	$-(\text{CH}_2)_2-$		H
CF_3	$\text{CO}_2\text{Hex}-n$	Me	$-(\text{CH}_2)_2-$		H
CF_3	$\text{CO}_2\text{Hex}-n$	H	$-(\text{CH}_2)_3-$		H
CF_3	$\text{CO}_2\text{Hex}-n$	Me	$-(\text{CH}_2)_3-$		H
CF_3	CO_2Ph	H	H	H	H
CF_3	CO_2Ph	H	Me	H	H
CF_3	CO_2Ph	H	Me	Me	H
CF_3	CO_2Ph	Me	H	H	H
CF_3	CO_2Ph	Me	Me	H	H
CF_3	CO_2Ph	Me	Me	Me	H

CF_3	CO_2Ph	H	$-\text{CH}_2-\text{O}-$	H
CF_3	CO_2Ph	Me	$-\text{CH}_2-\text{O}-$	H
CF_3	CO_2Ph	H	$-(\text{CH}_2)_2-$	H
CF_3	CO_2Ph	Me	$-(\text{CH}_2)_2-$	H
CF_3	CO_2Ph	H	$-(\text{CH}_2)_3-$	H
CF_3	CO_2Ph	Me	$-(\text{CH}_2)_3-$	H
CF_3	$\text{CO}_2\text{CH}_2\text{Ph}$	H	H	H H
CF_3	$\text{CO}_2\text{CH}_2\text{Ph}$	H	Me	H H
CF_3	$\text{CO}_2\text{CH}_2\text{Ph}$	H	Me	Me H
CF_3	$\text{CO}_2\text{CH}_2\text{Ph}$	Me	H	H H
CF_3	$\text{CO}_2\text{CH}_2\text{Ph}$	Me	Me	H H
CF_3	$\text{CO}_2\text{CH}_2\text{Ph}$	Me	Me	Me H
CF_3	$\text{CO}_2\text{CH}_2\text{Ph}$	H	$-\text{CH}_2-\text{O}-$	H
CF_3	$\text{CO}_2\text{CH}_2\text{Ph}$	Me	$-\text{CH}_2-\text{O}-$	H
CF_3	$\text{CO}_2\text{CH}_2\text{Ph}$	H	$-(\text{CH}_2)_2-$	H
CF_3	$\text{CO}_2\text{CH}_2\text{Ph}$	Me	$-(\text{CH}_2)_2-$	H
CF_3	$\text{CO}_2\text{CH}_2\text{Ph}$	H	$-(\text{CH}_2)_3-$	H
CF_3	$\text{CO}_2\text{CH}_2\text{Ph}$	Me	$-(\text{CH}_2)_3-$	H
CF_3	E-2	H	H	H H
CF_3	E-2	H	Me	H H
CF_3	E-2	H	Me	Me H
CF_3	E-2	Me	H	H H
CF_3	E-2	Me	Me	H H
CF_3	E-2	Me	Me	Me H
CF_3	E-2	H	$-\text{CH}_2-\text{O}-$	H
CF_3	E-2	Me	$-\text{CH}_2-\text{O}-$	H
CF_3	E-2	H	$-(\text{CH}_2)_2-$	H
CF_3	E-2	Me	$-(\text{CH}_2)_2-$	H

CF_3	E-2	H	$-(\text{CH}_2)_3-$	H
CF_3	E-2	Me	$-(\text{CH}_2)_3-$	H
CF_3	E-3	H	H	H H
CF_3	E-3	H	Me	H H
CF_3	E-3	H	Me	Me H
CF_3	E-3	Me	H	H H
CF_3	E-3	Me	Me	H H
CF_3	E-3	Me	Me	Me H
CF_3	E-3	H	$-\text{CH}_2-\text{O}-$	H
CF_3	E-3	Me	$-\text{CH}_2-\text{O}-$	H
CF_3	E-3	H	$-(\text{CH}_2)_2-$	H
CF_3	E-3	Me	$-(\text{CH}_2)_2-$	H
CF_3	E-3	H	$-(\text{CH}_2)_3-$	H
CF_3	E-3	Me	$-(\text{CH}_2)_3-$	H
CF_3	CH_2OMe	H	H	H H
CF_3	CH_2OMe	H	Me	H H
CF_3	CH_2OMe	H	Me	Me H
CF_3	CH_2OMe	Me	H	H H
CF_3	CH_2OMe	Me	Me	H H
CF_3	CH_2OMe	Me	Me	Me H
CF_3	CH_2OMe	H	$-\text{CH}_2-\text{O}-$	H
CF_3	CH_2OMe	Me	$-\text{CH}_2-\text{O}-$	H
CF_3	CH_2OMe	H	$-(\text{CH}_2)_2-$	H
CF_3	CH_2OMe	Me	$-(\text{CH}_2)_2-$	H
CF_3	CH_2OMe	H	$-(\text{CH}_2)_3-$	H
CF_3	CH_2OMe	Me	$-(\text{CH}_2)_3-$	H
CF_3	COCH_2Cl	H	H	H H
CF_3	COCH_2Cl	H	Me	H H

CF_3	COCH_2Cl	H	Me	Me	H
CF_3	COCH_2Cl	Me	H	H	H
CF_3	COCH_2Cl	Me	Me	H	H
CF_3	COCH_2Cl	Me	Me	Me	H
CF_3	COCH_2Cl	H	$-\text{CH}_2-\text{O}-$		H
CF_3	COCH_2Cl	Me	$-\text{CH}_2-\text{O}-$		H
CF_3	COCH_2Cl	H	$-(\text{CH}_2)_2-$		H
CF_3	COCH_2Cl	Me	$-(\text{CH}_2)_2-$		H
CF_3	COCH_2Cl	H	$-(\text{CH}_2)_3-$		H
CF_3	COCH_2Cl	Me	$-(\text{CH}_2)_3-$		H
CF_3	E-4	H	H	H	H
CF_3	E-4	H	Me	H	H
CF_3	E-4	H	Me	Me	H
CF_3	E-4	Me	H	H	H
CF_3	E-4	Me	Me	H	H
CF_3	E-4	Me	Me	Me	H
CF_3	E-4	H	$-\text{CH}_2-\text{O}-$		H
CF_3	E-4	Me	$-\text{CH}_2-\text{O}-$		H
CF_3	E-4	H	$-(\text{CH}_2)_2-$		H
CF_3	E-4	Me	$-(\text{CH}_2)_2-$		H
CF_3	E-4	H	$-(\text{CH}_2)_3-$		H
CF_3	E-4	Me	$-(\text{CH}_2)_3-$		H
CF_3	E-5	H	H	H	H
CF_3	E-5	H	Me	H	H
CF_3	E-5	H	Me	Me	H
CF_3	E-5	Me	H	H	H
CF_3	E-5	Me	Me	H	H
CF_3	E-5	Me	Me	Me	H

CF_3	E-5	H	$-\text{CH}_2-\text{O}-$	H
CF_3	E-5	Me	$-\text{CH}_2-\text{O}-$	H
CF_3	E-5	H	$-(\text{CH}_2)_2-$	H
CF_3	E-5	Me	$-(\text{CH}_2)_2-$	H
CF_3	E-5	H	$-(\text{CH}_2)_3-$	H
CF_3	E-5	Me	$-(\text{CH}_2)_3-$	H
CF_3	E-6	H	H	H H
CF_3	E-6	H	Me	H H
CF_3	E-6	H	Me	Me H
CF_3	E-6	Me	H	H H
CF_3	E-6	Me	Me	H H
CF_3	E-6	Me	Me	Me H
CF_3	E-6	H	$-\text{CH}_2-\text{O}-$	H
CF_3	E-6	Me	$-\text{CH}_2-\text{O}-$	H
CF_3	E-6	H	$-(\text{CH}_2)_2-$	H
CF_3	E-6	Me	$-(\text{CH}_2)_2-$	H
CF_3	E-6	H	$-(\text{CH}_2)_3-$	H
CF_3	E-6	Me	$-(\text{CH}_2)_3-$	H
CF_3	E-7	H	H	H H
CF_3	E-7	H	Me	H H
CF_3	E-7	H	Me	Me H
CF_3	E-7	Me	H	H H
CF_3	E-7	Me	Me	H H
CF_3	E-7	Me	Me	Me H
CF_3	E-7	H	$-\text{CH}_2-\text{O}-$	H
CF_3	E-7	Me	$-\text{CH}_2-\text{O}-$	H
CF_3	E-7	H	$-(\text{CH}_2)_2-$	H
CF_3	E-7	Me	$-(\text{CH}_2)_2-$	H

CF_3	E-7	H	$-(\text{CH}_2)_3-$	H
CF_3	E-7	Me	$-(\text{CH}_2)_3-$	H
CF_3	E-8	H	H	H H
CF_3	E-8	H	Me	H H
CF_3	E-8	H	Me	Me H
CF_3	E-8	Me	H	H H
CF_3	E-8	Me	Me	H H
CF_3	E-8	Me	Me	Me H
CF_3	E-8	H	$-\text{CH}_2-\text{O}-$	H
CF_3	E-8	Me	$-\text{CH}_2-\text{O}-$	H
CF_3	E-8	H	$-(\text{CH}_2)_2-$	H
CF_3	E-8	Me	$-(\text{CH}_2)_2-$	H
CF_3	E-8	H	$-(\text{CH}_2)_3-$	H
CF_3	E-8	Me	$-(\text{CH}_2)_3-$	H
CF_3	E-9	H	H	H H
CF_3	E-9	H	Me	H H
CF_3	E-9	H	Me	Me H
CF_3	E-9	Me	H	H H
CF_3	E-9	Me	Me	H H
CF_3	E-9	Me	Me	Me H
CF_3	E-9	H	$-\text{CH}_2-\text{O}-$	H
CF_3	E-9	Me	$-\text{CH}_2-\text{O}-$	H
CF_3	E-9	H	$-(\text{CH}_2)_2-$	H
CF_3	E-9	Me	$-(\text{CH}_2)_2-$	H
CF_3	E-9	H	$-(\text{CH}_2)_3-$	H
CF_3	E-9	Me	$-(\text{CH}_2)_3-$	H
CF_3	E-10	H	H	H H
CF_3	E-10	H	Me	H H

CF_3	E-10	H	Me	Me	H
CF_3	E-10	Me	H	H	H
CF_3	E-10	Me	Me	H	H
CF_3	E-10	Me	Me	Me	H
CF_3	E-10	H	$-\text{CH}_2-\text{O}-$		H
CF_3	E-10	Me	$-\text{CH}_2-\text{O}-$		H
CF_3	E-10	H	$-(\text{CH}_2)_2-$		H
CF_3	E-10	Me	$-(\text{CH}_2)_2-$		H
CF_3	E-10	H	$-(\text{CH}_2)_3-$		H
CF_3	E-10	Me	$-(\text{CH}_2)_3-$		H
CF_3	E-11	H	H	H	H
CF_3	E-11	H	Me	H	H
CF_3	E-11	H	Me	Me	H
CF_3	E-11	Me	H	H	H
CF_3	E-11	Me	Me	H	H
CF_3	E-11	Me	Me	Me	H
CF_3	E-11	H	$-\text{CH}_2-\text{O}-$		H
CF_3	E-11	Me	$-\text{CH}_2-\text{O}-$		H
CF_3	E-11	H	$-(\text{CH}_2)_2-$		H
CF_3	E-11	Me	$-(\text{CH}_2)_2-$		H
CF_3	E-11	H	$-(\text{CH}_2)_3-$		H
CF_3	E-11	Me	$-(\text{CH}_2)_3-$		H
CF_3	E-12	H	H	H	H
CF_3	E-12	H	Me	H	H
CF_3	E-12	H	Me	Me	H
CF_3	E-12	Me	H	H	H
CF_3	E-12	Me	Me	H	H
CF_3	E-12	Me	Me	Me	H

CF_3	$\text{E}-12$	H	$-\text{CH}_2-\text{O}-$	H
CF_3	$\text{E}-12$	Me	$-\text{CH}_2-\text{O}-$	H
CF_3	$\text{E}-12$	H	$-(\text{CH}_2)_2-$	H
CF_3	$\text{E}-12$	Me	$-(\text{CH}_2)_2-$	H
CF_3	$\text{E}-12$	H	$-(\text{CH}_2)_3-$	H
CF_3	$\text{E}-12$	Me	$-(\text{CH}_2)_3-$	H
CF_3	CH_2SMe	H	H	H H
CF_3	CH_2SMe	H	Me	H H
CF_3	CH_2SMe	H	Me	Me H
CF_3	CH_2SMe	Me	H	H H
CF_3	CH_2SMe	Me	Me	H H
CF_3	CH_2SMe	Me	Me	Me H
CF_3	CH_2SMe	H	$-\text{CH}_2-\text{O}-$	H
CF_3	CH_2SMe	Me	$-\text{CH}_2-\text{O}-$	H
CF_3	CH_2SMe	H	$-(\text{CH}_2)_2-$	H
CF_3	CH_2SMe	Me	$-(\text{CH}_2)_2-$	H
CF_3	CH_2SMe	H	$-(\text{CH}_2)_3-$	H
CF_3	CH_2SMe	Me	$-(\text{CH}_2)_3-$	H
CF_3	$\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{Ph}$	H	H	H H
CF_3	$\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{Ph}$	H	Me	H H
CF_3	$\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{Ph}$	H	Me	Me H
CF_3	$\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{Ph}$	Me	H	H H
CF_3	$\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{Ph}$	Me	Me	H H
CF_3	$\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{Ph}$	Me	Me	Me H
CF_3	$\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{Ph}$	H	$-\text{CH}_2-\text{O}-$	H
CF_3	$\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{Ph}$	Me	$-\text{CH}_2-\text{O}-$	H
CF_3	$\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{Ph}$	H	$-(\text{CH}_2)_2-$	H
CF_3	$\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{Ph}$	Me	$-(\text{CH}_2)_2-$	H

CF_3	$\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{Ph}$	H	$-(\text{CH}_2)_3-$	H
CF_3	$\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{Ph}$	Me	$-(\text{CH}_2)_3-$	H
CF_3	CH_2OCOMe	H	H	H
CF_3	CH_2OCOMe	H	Me	H
CF_3	CH_2OCOMe	H	Me	Me
CF_3	CH_2OCOMe	Me	H	H
CF_3	CH_2OCOMe	Me	H	H
CF_3	CH_2OCOMe	Me	Me	H
CF_3	CH_2OCOMe	H	$-\text{CH}_2-\text{O}-$	H
CF_3	CH_2OCOMe	Me	$-\text{CH}_2-\text{O}-$	H
CF_3	CH_2OCOMe	H	$-(\text{CH}_2)_2-$	H
CF_3	CH_2OCOMe	Me	$-(\text{CH}_2)_2-$	H
CF_3	CH_2OCOMe	H	$-(\text{CH}_2)_3-$	H
CF_3	CH_2OCOMe	Me	$-(\text{CH}_2)_3-$	H
CF_3	CH_2OCOEt	H	H	H
CF_3	CH_2OCOEt	H	Me	H
CF_3	CH_2OCOEt	H	Me	Me
CF_3	CH_2OCOEt	Me	H	H
CF_3	CH_2OCOEt	Me	Me	H
CF_3	CH_2OCOEt	Me	Me	H
CF_3	CH_2OCOEt	H	$-\text{CH}_2-\text{O}-$	H
CF_3	CH_2OCOEt	Me	$-\text{CH}_2-\text{O}-$	H
CF_3	CH_2OCOEt	H	$-(\text{CH}_2)_2-$	H
CF_3	CH_2OCOEt	Me	$-(\text{CH}_2)_2-$	H
CF_3	CH_2OCOEt	H	$-(\text{CH}_2)_3-$	H
CF_3	CH_2OCOEt	Me	$-(\text{CH}_2)_3-$	H
CF_3	COSMe	H	H	H
CF_3	COSMe	H	Me	H

CF_3	COSMe	H	Me	Me	H
CF_3	COSMe	Me	H	H	H
CF_3	COSMe	Me	Me	H	H
CF_3	COSMe	Me	Me	Me	H
CF_3	COSMe	H	$-\text{CH}_2-\text{O}-$		H
CF_3	COSMe	Me	$-\text{CH}_2-\text{O}-$		H
CF_3	COSMe	H	$-(\text{CH}_2)_2-$		H
CF_3	COSMe	Me	$-(\text{CH}_2)_2-$		H
CF_3	COSMe	H	$-(\text{CH}_2)_3-$		H
CF_3	COSMe	Me	$-(\text{CH}_2)_3-$		H
CF_3	COSEt	H	H	H	H
CF_3	COSEt	H	Me	H	H
CF_3	COSEt	H	Me	Me	H
CF_3	COSEt	Me	H	H	H
CF_3	COSEt	Me	Me	H	H
CF_3	COSEt	Me	Me	Me	H
CF_3	COSEt	H	$-\text{CH}_2-\text{O}-$		H
CF_3	COSEt	Me	$-\text{CH}_2-\text{O}-$		H
CF_3	COSEt	H	$-(\text{CH}_2)_2-$		H
CF_3	COSEt	Me	$-(\text{CH}_2)_2-$		H
CF_3	COSEt	H	$-(\text{CH}_2)_3-$		H
CF_3	COSEt	Me	$-(\text{CH}_2)_3-$		H
CF_3	$\text{CH}_2\text{SO}_2\text{Me}$	H	H	H	H
CF_3	$\text{CH}_2\text{SO}_2\text{Me}$	H	Me	H	H
CF_3	$\text{CH}_2\text{SO}_2\text{Me}$	H	Me	Me	H
CF_3	$\text{CH}_2\text{SO}_2\text{Me}$	Me	H	H	H
CF_3	$\text{CH}_2\text{SO}_2\text{Me}$	Me	Me	H	H
CF_3	$\text{CH}_2\text{SO}_2\text{Me}$	Me	Me	Me	H

CF ₃	CH ₂ SO ₂ Me	H	—CH ₂ —O—	H
CF ₃	CH ₂ SO ₂ Me	Me	—CH ₂ —O—	H
CF ₃	CH ₂ SO ₂ Me	H	—(CH ₂) ₂ —	H
CF ₃	CH ₂ SO ₂ Me	Me	—(CH ₂) ₂ —	H
CF ₃	CH ₂ SO ₂ Me	H	—(CH ₂) ₃ —	H
CF ₃	CH ₂ SO ₂ Me	Me	—(CH ₂) ₃ —	H
CF ₃	CH ₂ Ph	H	H	H H
CF ₃	CH ₂ Ph	H	Me	H H
CF ₃	CH ₂ Ph	H	Me	Me H
CF ₃	CH ₂ Ph	Me	H	H H
CF ₃	CH ₂ Ph	Me	Me	H H
CF ₃	CH ₂ Ph	Me	Me	Me H
CF ₃	CH ₂ Ph	H	—CH ₂ —O—	H
CF ₃	CH ₂ Ph	Me	—CH ₂ —O—	H
CF ₃	CH ₂ Ph	H	—(CH ₂) ₂ —	H
CF ₃	CH ₂ Ph	Me	—(CH ₂) ₂ —	H
CF ₃	CH ₂ Ph	H	—(CH ₂) ₃ —	H
CF ₃	CH ₂ Ph	Me	—(CH ₂) ₃ —	H
CF ₃	SO ₂ CF ₃	H	H	H H
CF ₃	SO ₂ CF ₃	H	Me	H H
CF ₃	SO ₂ CF ₃	H	Me	Me H
CF ₃	SO ₂ CF ₃	Me	H	H H
CF ₃	SO ₂ CF ₃	Me	Me	H H
CF ₃	SO ₂ CF ₃	Me	Me	Me H
CF ₃	SO ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	H	H H
CF ₃	SO ₂ CF ₃	H	Et	H H
CF ₃	SO ₂ CF ₃	Me	Et	H H
CF ₃	SO ₂ CF ₃	H	Et	Me H

CF ₃	SO ₂ CF ₃	Me	Et	Me	H
CF ₃	SO ₂ CF ₃	H	Pr-n	H	H
CF ₃	SO ₂ CF ₃	Me	Pr-n	H	H
CF ₃	SO ₂ CF ₃	H	Cl	H	H
CF ₃	SO ₂ CF ₃	Me	Cl	H	H
CF ₃	SO ₂ CF ₃	H	CF ₃	H	H
CF ₃	SO ₂ CF ₃	Me	CF ₃	H	H
CF ₃	SO ₂ CF ₃	H	Ph	H	H
CF ₃	SO ₂ CF ₃	Me	Ph	H	H
CF ₃	SO ₂ CF ₃	H	Ph-2-Cl	H	H
CF ₃	SO ₂ CF ₃	Me	Ph-2-Cl	H	H
CF ₃	SO ₂ CF ₃	H	Ph-3-Cl	H	H
CF ₃	SO ₂ CF ₃	Me	Ph-3-Cl	H	H
CF ₃	SO ₂ CF ₃	H	Ph-4-Cl	H	H
CF ₃	SO ₂ CF ₃	Me	Ph-4-Cl	H	H
CF ₃	SO ₂ CF ₃	H	COMe	H	H
CF ₃	SO ₂ CF ₃	Me	COMe	H	H
CF ₃	SO ₂ CF ₃	H	CO ₂ Me	H	H
CF ₃	SO ₂ CF ₃	Me	CO ₂ Me	H	H
CF ₃	SO ₂ CF ₃	H	OMe	H	H
CF ₃	SO ₂ CF ₃	Me	OMe	H	H
CF ₃	SO ₂ CF ₃	H	OMe	Me	H
CF ₃	SO ₂ CF ₃	Me	OMe	Me	H
CF ₃	SO ₂ CF ₃	H	SMe	H	H
CF ₃	SO ₂ CF ₃	Me	SMe	H	H
CF ₃	SO ₂ CF ₃	H	NHMe	H	H
CF ₃	SO ₂ CF ₃	Me	NHMe	H	H
CF ₃	SO ₂ CF ₃	H	CH ₂ Ph	H	H

CF ₃	SO ₂ CF ₃	Me	CH ₂ Ph	H	H
CF ₃	SO ₂ CF ₃	H	CH ₂ Ph-2-Cl	H	H
CF ₃	SO ₂ CF ₃	Me	CH ₂ Ph-2-Cl	H	H
CF ₃	SO ₂ CF ₃	H	CH ₂ Ph-3-Cl	H	H
CF ₃	SO ₂ CF ₃	Me	CH ₂ Ph-3-Cl	H	H
CF ₃	SO ₂ CF ₃	H	CH ₂ Ph-4-Cl	H	H
CF ₃	SO ₂ CF ₃	Me	CH ₂ Ph-4-Cl	H	H
CF ₃	SO ₂ CF ₃	H	COPh	H	H
CF ₃	SO ₂ CF ₃	Me	COPh	H	H
CF ₃	SO ₂ CF ₃	H	COPh-2-Cl	H	H
CF ₃	SO ₂ CF ₃	Me	COPh-2-Cl	H	H
CF ₃	SO ₂ CF ₃	H	COPh-3-Cl	H	H
CF ₃	SO ₂ CF ₃	Me	COPh-3-Cl	H	H
CF ₃	SO ₂ CF ₃	H	COPh-4-Cl	H	H
CF ₃	SO ₂ CF ₃	Me	COPh-4-Cl	H	H
CF ₃	SO ₂ CF ₃	H	-CH ₂ -O-		H
CF ₃	SO ₂ CF ₃	Me	-CH ₂ -O-		H
CF ₃	SO ₂ CF ₃	H	-(CH ₂) ₂ -		H
CF ₃	SO ₂ CF ₃	Me	-(CH ₂) ₂ -		H
CF ₃	SO ₂ CF ₃	H	-(CH ₂) ₃ -		H
CF ₃	SO ₂ CF ₃	Me	-(CH ₂) ₃ -		H
CHF ₂	H	H	H	H	H
CHF ₂	H	H	Me	H	H
CHF ₂	H	H	Me	Me	H
CHF ₂	H	Me	H	H	H
CHF ₂	H	Me	Me	H	H
CHF ₂	H	Me	Me	Me	H
CHF ₂	H	H	-(CH ₂) ₂ -		H

CHF ₂	H	Me	— (CH ₂) ₂ —	H
CHF ₂	H	H	— (CH ₂) ₃ —	H
CHF ₂	H	Me	— (CH ₂) ₃ —	H
CHF ₂	COEt	H	H	H H
CHF ₂	COEt	H	Me	H H
CHF ₂	COEt	H	Me	Me H
CHF ₂	COEt	Me	H	H H
CHF ₂	COEt	Me	Me	H H
CHF ₂	COEt	Me	Me	Me H
CHF ₂	COEt	H	— (CH ₂) ₂ —	H
CHF ₂	COEt	Me	— (CH ₂) ₂ —	H
CHF ₂	COEt	H	— (CH ₂) ₃ —	H
CHF ₂	COEt	Me	— (CH ₂) ₃ —	H
CHF ₂	CO ₂ Et	H	H	H H
CHF ₂	CO ₂ Et	H	Me	H H
CHF ₂	CO ₂ Et	H	Me	Me H
CHF ₂	CO ₂ Et	Me	H	H H
CHF ₂	CO ₂ Et	Me	Me	H H
CHF ₂	CO ₂ Et	Me	Me	Me H
CHF ₂	CO ₂ Et	H	— (CH ₂) ₂ —	H
CHF ₂	CO ₂ Et	Me	— (CH ₂) ₂ —	H
CHF ₂	CO ₂ Et	H	— (CH ₂) ₃ —	H
CHF ₂	CO ₂ Et	Me	— (CH ₂) ₃ —	H
CHF ₂	CO ₂ Bu-i	H	H	H H
CHF ₂	CO ₂ Bu-i	H	Me	H H
CHF ₂	CO ₂ Bu-i	H	Me	Me H
CHF ₂	CO ₂ Bu-i	Me	H	H H
CHF ₂	CO ₂ Bu-i	Me	Me	H H

CH F ₂	CO ₂ Bu-i	Me	Me	H
CH F ₂	CO ₂ Bu-i	H	— (CH ₂) ₂ —	H
CH F ₂	CO ₂ Bu-i	Me	— (CH ₂) ₂ —	H
CH F ₂	CO ₂ Bu-i	H	— (CH ₂) ₃ —	H
CH F ₂	CO ₂ Bu-i	Me	— (CH ₂) ₃ —	H
CCl F ₂	H	H	H	H
CCl F ₂	H	H	Me	H
CCl F ₂	H	H	Me	Me
CCl F ₂	H	Me	H	H
CCl F ₂	H	Me	Me	H
CCl F ₂	H	Me	Me	Me
CCl F ₂	H	H	— (CH ₂) ₂ —	H
CCl F ₂	H	Me	— (CH ₂) ₂ —	H
CCl F ₂	H	H	— (CH ₂) ₃ —	H
CCl F ₂	H	Me	— (CH ₂) ₃ —	H
CCl F ₂	COEt	H	H	H
CCl F ₂	COEt	H	Me	H
CCl F ₂	COEt	H	Me	Me
CCl F ₂	COEt	Me	H	H
CCl F ₂	COEt	Me	Me	H
CCl F ₂	COEt	Me	Me	Me
CCl F ₂	COEt	H	— (CH ₂) ₂ —	H
CCl F ₂	COEt	Me	— (CH ₂) ₂ —	H
CCl F ₂	COEt	H	— (CH ₂) ₃ —	H
CCl F ₂	COEt	Me	— (CH ₂) ₃ —	H
CCl F ₂	CO ₂ Et	H	H	H
CCl F ₂	CO ₂ Et	H	Me	H
CCl F ₂	CO ₂ Et	H	Me	Me

CClF ₂ CO ₂ Et	Me	H	H	H
CClF ₂ CO ₂ Et	Me	Me	H	H
CClF ₂ CO ₂ Et	Me	Me	Me	H
CClF ₂ CO ₂ Et	H	—(CH ₂) ₂ —		H
CClF ₂ CO ₂ Et	Me	—(CH ₂) ₂ —		H
CClF ₂ CO ₂ Et	H	—(CH ₂) ₃ —		H
CClF ₂ CO ₂ Et	Me	—(CH ₂) ₃ —		H
CClF ₂ CO ₂ Bu-i	H	H	H	H
CClF ₂ CO ₂ Bu-i	H	Me	H	H
CClF ₂ CO ₂ Bu-i	H	Me	Me	H
CClF ₂ CO ₂ Bu-i	Me	H	H	H
CClF ₂ CO ₂ Bu-i	Me	Me	H	H
CClF ₂ CO ₂ Bu-i	Me	Me	Me	H
CClF ₂ CO ₂ Bu-i	H	—(CH ₂) ₂ —		H
CClF ₂ CO ₂ Bu-i	Me	—(CH ₂) ₂ —		H
CClF ₂ CO ₂ Bu-i	H	—(CH ₂) ₃ —		H
CClF ₂ CO ₂ Bu-i	Me	—(CH ₂) ₃ —		H
CBrF ₂ H	H	H	H	H
CBrF ₂ H	H	Me	H	H
CBrF ₂ H	H	Me	Me	H
CBrF ₂ H	Me	H	H	H
CBrF ₂ H	Me	Me	H	H
CBrF ₂ H	Me	Me	Me	H
CBrF ₂ H	H	—(CH ₂) ₂ —		H
CBrF ₂ H	Me	—(CH ₂) ₂ —		H
CBrF ₂ H	H	—(CH ₂) ₃ —		H
CBrF ₂ H	Me	—(CH ₂) ₃ —		H
CBrF ₂ COEt	H	H	H	H

CB r F ₂ COE t	H	Me	H	H
CB r F ₂ COE t	H	Me	Me	H
CB r F ₂ COE t	Me	H	H	H
CB r F ₂ COE t	Me	Me	H	H
CB r F ₂ COE t	Me	Me	Me	H
CB r F ₂ COE t	H	— (CH ₂) ₂ —		H
CB r F ₂ COE t	Me	— (CH ₂) ₂ —		H
CB r F ₂ COE t	H	— (CH ₂) ₃ —		H
CB r F ₂ COE t	Me	— (CH ₂) ₃ —		H
CB r F ₂ CO ₂ E t	H	H	H	H
CB r F ₂ CO ₂ E t	H	Me	H	H
CB r F ₂ CO ₂ E t	H	Me	Me	H
CB r F ₂ CO ₂ E t	Me	H	H	H
CB r F ₂ CO ₂ E t	Me	Me	H	H
CB r F ₂ CO ₂ E t	Me	Me	Me	H
CB r F ₂ CO ₂ E t	H	— (CH ₂) ₂ —		H
CB r F ₂ CO ₂ E t	Me	— (CH ₂) ₂ —		H
CB r F ₂ CO ₂ E t	H	— (CH ₂) ₃ —		H
CB r F ₂ CO ₂ E t	Me	— (CH ₂) ₃ —		H
CB r F ₂ CO ₂ Bu—i	H	H	H	H
CB r F ₂ CO ₂ Bu—i	H	Me	H	H
CB r F ₂ CO ₂ Bu—i	H	Me	Me	H
CB r F ₂ CO ₂ Bu—i	Me	H	H	H
CB r F ₂ CO ₂ Bu—i	Me	Me	H	H
CB r F ₂ CO ₂ Bu—i	Me	Me	Me	H
CB r F ₂ CO ₂ Bu—i	H	— (CH ₂) ₂ —		H
CB r F ₂ CO ₂ Bu—i	Me	— (CH ₂) ₂ —		H
CB r F ₂ CO ₂ Bu—i	H	— (CH ₂) ₃ —		H

CBrF ₂ CO ₂ Bu-i	Me	—(CH ₂) ₃ —	H
CCl ₂ FH	H	H	H
CCl ₂ FH	H	Me	H
CCl ₂ FH	H	Me	Me
CCl ₂ FH	Me	H	H
CCl ₂ FH	Me	Me	H
CCl ₂ FH	Me	Me	H
CCl ₂ FH	H	—(CH ₂) ₂ —	H
CCl ₂ FH	Me	—(CH ₂) ₂ —	H
CCl ₂ FH	H	—(CH ₂) ₃ —	H
CCl ₂ FH	Me	—(CH ₂) ₃ —	H
CCl ₂ F COEt	H	H	H
CCl ₂ F COEt	H	Me	H
CCl ₂ F COEt	H	Me	Me
CCl ₂ F COEt	Me	H	H
CCl ₂ F COEt	Me	Me	H
CCl ₂ F COEt	Me	Me	H
CCl ₂ F COEt	H	—(CH ₂) ₂ —	H
CCl ₂ F COEt	Me	—(CH ₂) ₂ —	H
CCl ₂ F COEt	H	—(CH ₂) ₃ —	H
CCl ₂ F COEt	Me	—(CH ₂) ₃ —	H
CCl ₂ F CO ₂ Et	H	H	H
CCl ₂ F CO ₂ Et	H	Me	H
CCl ₂ F CO ₂ Et	H	Me	Me
CCl ₂ F CO ₂ Et	Me	H	H
CCl ₂ F CO ₂ Et	Me	Me	H
CCl ₂ F CO ₂ Et	Me	Me	H
CCl ₂ F CO ₂ Et	H	—(CH ₂) ₂ —	H

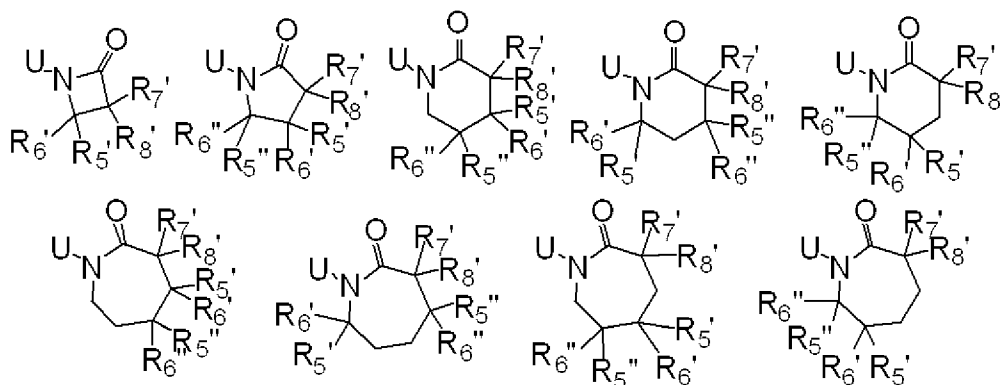
CCl ₂ F CO ₂ Et	Me	— (CH ₂) ₂ —	H
CCl ₂ F CO ₂ Et	H	— (CH ₂) ₃ —	H
CCl ₂ F CO ₂ Et	Me	— (CH ₂) ₃ —	H
CCl ₂ F CO ₂ Bu-i	H	H	H
CCl ₂ F CO ₂ Bu-i	H	Me	H
CCl ₂ F CO ₂ Bu-i	H	Me	Me
CCl ₂ F CO ₂ Bu-i	Me	H	H
CCl ₂ F CO ₂ Bu-i	Me	Me	H
CCl ₂ F CO ₂ Bu-i	Me	Me	H
CCl ₂ F CO ₂ Bu-i	H	— (CH ₂) ₂ —	H
CCl ₂ F CO ₂ Bu-i	Me	— (CH ₂) ₂ —	H
CCl ₂ F CO ₂ Bu-i	H	— (CH ₂) ₃ —	H
CCl ₂ F CO ₂ Bu-i	Me	— (CH ₂) ₃ —	H
CBr ₂ F H	H	H	H
CBr ₂ F H	H	Me	H
CBr ₂ F H	H	Me	Me
CBr ₂ F H	Me	H	H
CBr ₂ F H	Me	Me	H
CBr ₂ F H	Me	Me	Me
CBr ₂ F H	H	— (CH ₂) ₂ —	H
CBr ₂ F H	Me	— (CH ₂) ₂ —	H
CBr ₂ F H	H	— (CH ₂) ₃ —	H
CBr ₂ F H	Me	— (CH ₂) ₃ —	H
CBr ₂ F CO ₂ Et	H	H	H
CBr ₂ F CO ₂ Et	H	Me	H
CBr ₂ F CO ₂ Et	H	Me	Me
CBr ₂ F CO ₂ Et	Me	H	H
CBr ₂ F CO ₂ Et	Me	Me	H

C B r ₂ F	C O ₂ E t	M e	M e	M e	H
C B r ₂ F	C O ₂ E t	H	— (C H ₂) ₂ —		H
C B r ₂ F	C O ₂ E t	M e	— (C H ₂) ₂ —		H
C B r ₂ F	C O ₂ E t	H	— (C H ₂) ₃ —		H
C B r ₂ F	C O ₂ E t	M e	— (C H ₂) ₃ —		H
C C l ₃	H	H	H	H	H
C C l ₃	H	H	M e	H	H
C C l ₃	H	H	M e	M e	H
C C l ₃	H	M e	H	H	H
C C l ₃	H	M e	M e	H	H
C C l ₃	H	M e	M e	M e	H
C C l ₃	H	H	— (C H ₂) ₂ —		H
C C l ₃	H	M e	— (C H ₂) ₂ —		H
C C l ₃	H	H	— (C H ₂) ₃ —		H
C C l ₃	H	M e	— (C H ₂) ₃ —		H
C C l ₃	C O ₂ E t	H	H	H	H
C C l ₃	C O ₂ E t	H	M e	H	H
C C l ₃	C O ₂ E t	H	M e	M e	H
C C l ₃	C O ₂ E t	M e	H	H	H
C C l ₃	C O ₂ E t	M e	M e	H	H
C C l ₃	C O ₂ E t	M e	M e	M e	H
C C l ₃	C O ₂ E t	H	— (C H ₂) ₂ —		H
C C l ₃	C O ₂ E t	M e	— (C H ₂) ₂ —		H
C C l ₃	C O ₂ E t	H	— (C H ₂) ₃ —		H
C C l ₃	C O ₂ E t	M e	— (C H ₂) ₃ —		H

[0145] 第3表中、E-1乃至E-12は、前記に同じである。

[0146] [第4表]

[0147] [化16]



[0148] Uは、前記一般式（26）と同じである。

[0149] $R_1 = CF_3$ 、 $R_3 = R_4 = H$ 、 $X = H$

R_2	$R_{5'}$	$R_{6'}$	$R_{5''}$	$R_{6''}$	$R_{7'}$	$R_{8'}$
H	Me	H	H	H	Me	Me
H	Me	Me	H	H	Me	H
H	Me	H	Me	H	Me	H
H	Me	Me	Me	H	H	H
H	Me	Me	H	H	Me	Me
H	Me	H	Me	H	Me	Me
H	Me	Me	Me	H	H	Me
H	Me	Me	Me	Me	H	H
H	Me	H	H	H	Me	Et
H	Me	Et	H	H	Me	H
H	Et	H	H	H	Me	Me
H	Me	Me	H	H	Et	H
H	Me	Me	OH	H	H	H
H	H	bond		H	H	H

H	H	$-\text{CH}_2-$	H	H	H
H	H	$-(\text{CH}_2)_2-$	H	H	H
H	H	$-\text{O}-$	H	H	H
H	Me	b o n d	H	H	H
H	Me	$-\text{CH}_2-$	H	H	H
H	Me	$-(\text{CH}_2)_2-$	H	H	H
H	Me	$-\text{O}-$	H	H	H
CO Me	Me	H	H	H	Me Me
CO Me	Me	Me	H	H	Me H
CO Me	Me	H	Me	H	Me H
CO Me	Me	Me	Me	H	H H
CO Me	Me	Me	H	H	Me Me
CO Me	Me	H	Me	H	Me Me
CO Me	Me	Me	Me	H	H Me
CO Me	Me	Me	Me	Me	H H
CO Me	H	b o n d	H	H	H
CO Me	H	$-\text{CH}_2-$	H	H	H
CO Me	H	$-(\text{CH}_2)_2-$	H	H	H
CO Me	H	$-\text{O}-$	H	H	H
CO Et	Me	H	H	H	Me Me
CO Et	Me	Me	H	H	Me H
CO Et	Me	H	Me	H	Me H
CO Et	Me	Me	Me	H	H H
CO Et	Me	Me	H	H	Me Me
CO Et	Me	H	Me	H	Me Me
CO Et	Me	Me	Me	H	H Me
CO Et	Me	Me	Me	Me	H H
CO Et	Me	H	H	H	Me E t

COEt	Me	Et	H	H	Me	H
COEt	Et	H	H	H	Me	Me
COEt	Me	Me	H	H	Et	H
COEt	Me	Me	OH	H	H	H
COEt	H	bond	H	H	H	H
COEt	H	-CH ₂ -	H	H	H	H
COEt	H	-(CH ₂) ₂ -	H	H	H	H
COEt	H	-O-	H	H	H	H
COEt	Me	bond	H	H	H	H
COEt	Me	-CH ₂ -	H	H	H	H
COEt	Me	-(CH ₂) ₂ -	H	H	H	H
COEt	Me	-O-	H	H	H	H
COPr-n	Me	H	H	H	Me	Me
COPr-n	Me	Me	H	H	Me	H
COPr-n	Me	Me	Me	H	H	H
COPr-n	Me	H	Me	H	Me	H
COPr-n	Me	Me	H	H	Me	Me
COPr-n	Me	H	Me	H	Me	Me
COPr-n	Me	Me	Me	H	H	Me
COPr-n	Me	Me	Me	Me	H	H
COPr-n	H	bond	H	H	H	H
COPr-n	H	-CH ₂ -	H	H	H	H
COPr-n	H	-(CH ₂) ₂ -	H	H	H	H
COPr-n	H	-O-	H	H	H	H
COPr-i	Me	H	H	H	Me	Me
COPr-i	Me	Me	H	H	Me	H
COPr-i	Me	Me	Me	H	H	H
COPr-i	Me	H	Me	H	Me	H

COP _{r-i}	Me	Me	H	H	Me	Me
COP _{r-i}	Me	H	Me	H	Me	Me
COP _{r-i}	Me	Me	Me	H	H	Me
COP _{r-i}	Me	Me	Me	Me	H	H
COP _{r-i}	H	bond		H	H	H
COP _{r-i}	H	-CH ₂ -		H	H	H
COP _{r-i}	H	-(CH ₂) ₂ -		H	H	H
COP _{r-i}	H	-O-		H	H	H
COP _{r-c}	Me	H	H	H	Me	Me
COP _{r-c}	Me	Me	H	H	Me	H
COP _{r-c}	Me	Me	Me	H	H	H
COP _{r-c}	Me	H	Me	H	Me	H
COP _{r-c}	Me	Me	H	H	Me	Me
COP _{r-c}	Me	H	Me	H	Me	Me
COP _{r-c}	Me	Me	Me	H	H	Me
COP _{r-c}	Me	Me	Me	Me	H	H
COP _{r-c}	H	bond		H	H	H
COP _{r-c}	H	-CH ₂ -		H	H	H
COP _{r-c}	H	-(CH ₂) ₂ -		H	H	H
COP _{r-c}	H	-O-		H	H	H
COB _{u-t}	Me	H	H	H	Me	Me
COB _{u-t}	Me	Me	H	H	Me	H
COB _{u-t}	Me	Me	Me	H	H	H
COB _{u-t}	Me	H	Me	H	Me	H
COB _{u-t}	Me	Me	H	H	Me	Me
COB _{u-t}	Me	H	Me	H	Me	Me
COB _{u-t}	Me	Me	Me	H	H	Me
COB _{u-t}	Me	Me	Me	Me	H	H

COBu-t	H		b o n d	H	H	H
COBu-t	H		-CH ₂ -	H	H	H
COBu-t	H		-(CH ₂) ₂ -	H	H	H
COBu-t	H		-O-	H	H	H
COPr-c	H		-(CH ₂) ₂ -	H	H	H
COPr-c	H		-O-	H	H	H
COPh	Me	H	H	H	Me	Me
COPh	Me	Me	H	H	Me	H
COPh	Me	Me	Me	H	H	H
COPh	Me	H	Me	H	Me	H
COPh	Me	Me	H	H	Me	Me
COPh	Me	H	Me	H	Me	Me
COPh	Me	Me	Me	H	H	Me
COPh	Me	Me	Me	Me	H	H
COPh	H		b o n d	H	H	H
COPh	H		-CH ₂ -	H	H	H
COPh	H		-(CH ₂) ₂ -	H	H	H
COPh	H		-O-	H	H	H
CO ₂ Me	Me	H	H	H	Me	Me
CO ₂ Me	Me	Me	H	H	Me	H
CO ₂ Me	Me	Me	Me	H	H	H
CO ₂ Me	Me	H	Me	H	Me	H
CO ₂ Me	Me	Me	H	H	Me	Me
CO ₂ Me	Me	H	Me	H	Me	Me
CO ₂ Me	Me	Me	Me	H	H	Me
CO ₂ Me	Me	Me	Me	Me	H	H
CO ₂ Me	H		b o n d	H	H	H
CO ₂ Me	H		-CH ₂ -	H	H	H

CO ₂ Me	H	— (CH ₂) ₂ —	H	H	H
CO ₂ Me	H	— O —	H	H	H
CO ₂ Et	Me	H	H	Me	Me
CO ₂ Et	Me	Me	H	Me	H
CO ₂ Et	Me	H	Me	Me	H
CO ₂ Et	Me	Me	Me	H	H
CO ₂ Et	Me	Me	H	Me	Me
CO ₂ Et	Me	H	Me	Me	Me
CO ₂ Et	Me	Me	Me	H	Me
CO ₂ Et	Me	Me	Me	Me	H
CO ₂ Et	Me	H	H	Me	Et
CO ₂ Et	Me	Et	H	Me	H
CO ₂ Et	Et	H	H	Me	Me
CO ₂ Et	Me	Me	H	Et	H
CO ₂ Et	Me	Me	OH	H	H
CO ₂ Et	H	b o n d	H	H	H
CO ₂ Et	H	— CH ₂ —	H	H	H
CO ₂ Et	H	— (CH ₂) ₂ —	H	H	H
CO ₂ Et	H	— O —	H	H	H
CO ₂ Et	Me	b o n d	H	H	H
CO ₂ Et	Me	— CH ₂ —	H	H	H
CO ₂ Et	Me	— (CH ₂) ₂ —	H	H	H
CO ₂ Et	Me	— O —	H	H	H
CO ₂ Pr — n	Me	H	H	Me	Me
CO ₂ Pr — n	Me	Me	H	Me	H
CO ₂ Pr — n	Me	Me	Me	H	H
CO ₂ Pr — n	Me	H	Me	Me	H
CO ₂ Pr — n	Me	Me	H	Me	Me

CO ₂ Pr-n	Me	H	Me	H	Me	Me
CO ₂ Pr-n	Me	Me	Me	H	H	Me
CO ₂ Pr-n	Me	Me	Me	Me	H	H
CO ₂ Pr-n	H	bond		H	H	H
CO ₂ Pr-n	H	-CH ₂ -		H	H	H
CO ₂ Pr-n	H	-(CH ₂) ₂ -		H	H	H
CO ₂ Pr-n	H	-O-		H	H	H
CO ₂ Pr-i	Me	H	H	H	Me	Me
CO ₂ Pr-i	Me	Me	H	H	Me	H
CO ₂ Pr-i	Me	Me	Me	H	H	H
CO ₂ Pr-i	Me	H	Me	H	Me	H
CO ₂ Pr-i	Me	Me	H	H	Me	Me
CO ₂ Pr-i	Me	H	Me	H	Me	Me
CO ₂ Pr-i	Me	Me	Me	H	H	Me
CO ₂ Pr-i	Me	Me	Me	Me	H	H
CO ₂ Pr-i	H	bond		H	H	H
CO ₂ Pr-i	H	-CH ₂ -		H	H	H
CO ₂ Pr-i	H	-(CH ₂) ₂ -		H	H	H
CO ₂ Pr-i	H	-O-		H	H	H
CO ₂ Bu-i	Me	H	H	H	Me	Me
CO ₂ Bu-i	Me	Me	H	H	Me	H
CO ₂ Bu-i	Me	Me	Me	H	H	H
CO ₂ Bu-i	Me	H	Me	H	Me	H
CO ₂ Bu-i	Me	Me	H	H	Me	Me
CO ₂ Bu-i	Me	H	Me	H	Me	Me
CO ₂ Bu-i	Me	Me	Me	H	H	Me
CO ₂ Bu-i	Me	Me	Me	Me	H	H
CO ₂ Bu-i	H	bond		H	H	H

$\text{CO}_2\text{Bu}-i$	H		$-\text{CH}_2-$	H	H	H
$\text{CO}_2\text{Bu}-i$	H		$-(\text{CH}_2)_2-$	H	H	H
$\text{CO}_2\text{Bu}-i$	H		$-\text{O}-$	H	H	H
E-1	Me	H	H	H	Me	Me
E-1	Me	Me	H	H	Me	H
E-1	Me	Me	Me	H	H	H
E-1	Me	H	Me	H	Me	H
E-1	Me	Me	H	H	Me	Me
E-1	Me	H	Me	H	Me	Me
E-1	Me	Me	Me	H	H	Me
E-1	Me	Me	Me	Me	H	H
E-1	H		b o n d	H	H	H
E-1	H		$-\text{CH}_2-$	H	H	H
E-1	H		$-(\text{CH}_2)_2-$	H	H	H
E-1	H		$-\text{O}-$	H	H	H
$\text{CO}_2\text{Bu}-t$	Me	H	H	H	Me	Me
$\text{CO}_2\text{Bu}-t$	Me	Me	H	H	Me	H
$\text{CO}_2\text{Bu}-t$	Me	Me	Me	H	H	H
$\text{CO}_2\text{Bu}-t$	Me	H	Me	H	Me	H
$\text{CO}_2\text{Bu}-t$	Me	Me	H	H	Me	Me
$\text{CO}_2\text{Bu}-t$	Me	H	Me	H	Me	Me
$\text{CO}_2\text{Bu}-t$	Me	Me	Me	H	H	Me
$\text{CO}_2\text{Bu}-t$	Me	Me	Me	Me	H	H
$\text{CO}_2\text{Bu}-t$	H		b o n d	H	H	H
$\text{CO}_2\text{Bu}-t$	H		$-\text{CH}_2-$	H	H	H
$\text{CO}_2\text{Bu}-t$	H		$-(\text{CH}_2)_2-$	H	H	H
$\text{CO}_2\text{Bu}-t$	H		$-\text{O}-$	H	H	H
CO_2Ph	Me	H	H	H	Me	Me

CO ₂ Ph	Me	Me	H	H	Me	H
CO ₂ Ph	Me	Me	Me	H	H	H
CO ₂ Ph	Me	H	Me	H	Me	H
CO ₂ Ph	Me	Me	H	H	Me	Me
CO ₂ Ph	Me	H	Me	H	Me	Me
CO ₂ Ph	Me	Me	Me	H	H	Me
CO ₂ Ph	Me	Me	Me	Me	H	H
CO ₂ Ph	H	bond		H	H	H
CO ₂ Ph	H	-CH ₂ -		H	H	H
CO ₂ Ph	H	-(CH ₂) ₂ -		H	H	H
CO ₂ Ph	H	-O-		H	H	H
E-2	Me	H	H	H	Me	Me
E-2	Me	Me	H	H	Me	H
E-2	Me	Me	Me	H	H	H
E-2	Me	H	Me	H	Me	H
E-2	Me	Me	H	H	Me	Me
E-2	Me	H	Me	H	Me	Me
E-2	Me	Me	Me	H	H	Me
E-2	Me	Me	Me	Me	H	H
E-2	H	bond		H	H	H
E-2	H	-CH ₂ -		H	H	H
E-2	H	-(CH ₂) ₂ -		H	H	H
E-2	H	-O-		H	H	H
E-3	Me	H	H	H	Me	Me
E-3	Me	Me	H	H	Me	H
E-3	Me	Me	Me	H	H	H
E-3	Me	H	Me	H	Me	H
E-3	Me	Me	H	H	Me	Me

E-3	Me	H	Me	H	Me	Me
E-3	Me	Me	Me	H	H	Me
E-3	Me	Me	Me	Me	H	H
E-3	H	bond		H	H	H
E-3	H	-CH ₂ -		H	H	H
E-3	H	-(CH ₂) ₂ -		H	H	H
E-3	H	-O-		H	H	H
CH ₂ OMe	Me	H	H	H	Me	Me
CH ₂ OMe	Me	Me	H	H	Me	H
CH ₂ OMe	Me	Me	Me	H	H	H
CH ₂ OMe	Me	H	Me	H	Me	H
CH ₂ OMe	Me	Me	H	H	Me	Me
CH ₂ OMe	Me	H	Me	H	Me	Me
CH ₂ OMe	Me	Me	Me	H	H	Me
CH ₂ OMe	Me	Me	Me	Me	H	H
CH ₂ OMe	H	bond		H	H	H
CH ₂ OMe	H	-CH ₂ -		H	H	H
CH ₂ OMe	H	-(CH ₂) ₂ -		H	H	H
CH ₂ OMe	H	-O-		H	H	H
COCH ₂ Cl	Me	H	H	H	Me	Me
COCH ₂ Cl	Me	Me	H	H	Me	H
COCH ₂ Cl	Me	Me	Me	H	H	H
COCH ₂ Cl	Me	H	Me	H	Me	H
COCH ₂ Cl	Me	Me	H	H	Me	Me
COCH ₂ Cl	Me	H	Me	H	Me	Me
COCH ₂ Cl	Me	Me	Me	H	H	Me
COCH ₂ Cl	Me	Me	Me	Me	H	H
COCH ₂ Cl	H	bond		H	H	H

COCH_2Cl	H		$-\text{CH}_2-$	H	H	H
COCH_2Cl	H		$-(\text{CH}_2)_2-$	H	H	H
COCH_2Cl	H		$-\text{O}-$	H	H	H
E-4	Me	H	H	H	Me	Me
E-4	Me	Me	H	H	Me	H
E-4	Me	Me	Me	H	H	H
E-4	Me	H	Me	H	Me	H
E-4	Me	Me	H	H	Me	Me
E-4	Me	H	Me	H	Me	Me
E-4	Me	Me	Me	H	H	Me
E-4	Me	Me	Me	Me	H	H
E-4	H		b o n d	H	H	H
E-4	H		$-\text{CH}_2-$	H	H	H
E-4	H		$-(\text{CH}_2)_2-$	H	H	H
E-4	H		$-\text{O}-$	H	H	H
E-5	Me	H	H	H	Me	Me
E-5	Me	Me	H	H	Me	H
E-5	Me	Me	Me	H	H	H
E-5	Me	H	Me	H	Me	H
E-5	Me	Me	H	H	Me	Me
E-5	Me	H	Me	H	Me	Me
E-5	Me	Me	Me	H	H	Me
E-5	Me	Me	Me	Me	H	H
E-5	H		b o n d	H	H	H
E-5	H		$-\text{CH}_2-$	H	H	H
E-5	H		$-(\text{CH}_2)_2-$	H	H	H
E-5	H		$-\text{O}-$	H	H	H
E-6	Me	H	H	H	Me	Me

E-6	Me	Me	H	H	Me	H
E-6	Me	Me	Me	H	H	H
E-6	Me	H	Me	H	Me	H
E-6	Me	Me	H	H	Me	Me
E-6	Me	H	Me	H	Me	Me
E-6	Me	Me	Me	H	H	Me
E-6	Me	Me	Me	Me	H	H
E-6	H	bond		H	H	H
E-6	H	$-\text{CH}_2-$		H	H	H
E-6	H	$-(\text{CH}_2)_2-$		H	H	H
E-6	H	$-\text{O}-$		H	H	H
E-7	Me	H	H	H	Me	Me
E-7	Me	Me	H	H	Me	H
E-7	Me	Me	Me	H	H	H
E-7	Me	H	Me	H	Me	H
E-7	Me	Me	H	H	Me	Me
E-7	Me	H	Me	H	Me	Me
E-7	Me	Me	Me	H	H	Me
E-7	Me	Me	Me	Me	H	H
E-7	H	bond		H	H	H
E-7	H	$-\text{CH}_2-$		H	H	H
E-7	H	$-(\text{CH}_2)_2-$		H	H	H
E-7	H	$-\text{O}-$		H	H	H
E-8	Me	H	H	H	Me	Me
E-8	Me	Me	H	H	Me	H
E-8	Me	Me	Me	H	H	H
E-8	Me	H	Me	H	Me	H
E-8	Me	Me	H	H	Me	Me

E-8	Me	H	Me	H	Me	Me
E-8	Me	Me	Me	H	H	Me
E-8	Me	Me	Me	Me	H	H
E-8	H	bond		H	H	H
E-8	H	-CH ₂ -		H	H	H
E-8	H	-(CH ₂) ₂ -		H	H	H
E-8	H	-O-		H	H	H
E-9	Me	H	H	H	Me	Me
E-9	Me	Me	H	H	Me	H
E-9	Me	Me	Me	H	H	H
E-9	Me	H	Me	H	Me	H
E-9	Me	Me	H	H	Me	Me
E-9	Me	H	Me	H	Me	Me
E-9	Me	Me	Me	H	H	Me
E-9	Me	Me	Me	Me	H	H
E-9	H	bond		H	H	H
E-9	H	-CH ₂ -		H	H	H
E-9	H	-(CH ₂) ₂ -		H	H	H
E-9	H	-O-		H	H	H
E-10	Me	H	H	H	Me	Me
E-10	Me	Me	H	H	Me	H
E-10	Me	Me	Me	H	H	H
E-10	Me	H	Me	H	Me	H
E-10	Me	Me	H	H	Me	Me
E-10	Me	H	Me	H	Me	Me
E-10	Me	Me	Me	H	H	Me
E-10	Me	Me	Me	Me	H	H
E-10	H	bond		H	H	H

E-10	H		$-\text{CH}_2-$	H	H	H
E-10	H		$-(\text{CH}_2)_2-$	H	H	H
E-10	H		$-\text{O}-$	H	H	H
E-11	Me	H	H	H	Me	Me
E-11	Me	Me	H	H	Me	H
E-11	Me	Me	Me	H	H	H
E-11	Me	H	Me	H	Me	H
E-11	Me	Me	H	H	Me	Me
E-11	Me	H	Me	H	Me	Me
E-11	Me	Me	Me	H	H	Me
E-11	Me	Me	Me	Me	H	H
E-11	H		bond	H	H	H
E-11	H		$-\text{CH}_2-$	H	H	H
E-11	H		$-(\text{CH}_2)_2-$	H	H	H
E-11	H		$-\text{O}-$	H	H	H
E-12	Me	H	H	H	Me	Me
E-12	Me	Me	H	H	Me	H
E-12	Me	Me	Me	H	H	H
E-12	Me	H	Me	H	Me	H
E-12	Me	Me	H	H	Me	Me
E-12	Me	H	Me	H	Me	Me
E-12	Me	Me	Me	H	H	Me
E-12	Me	Me	Me	Me	H	H
E-12	H		bond	H	H	H
E-12	H		$-\text{CH}_2-$	H	H	H
E-12	H		$-(\text{CH}_2)_2-$	H	H	H
E-12	H		$-\text{O}-$	H	H	H
CH_2SMe	Me	H	H	H	Me	Me

CH ₂ SMe	Me	Me	H	H	Me	H
CH ₂ SMe	Me	Me	Me	H	H	H
CH ₂ SMe	Me	H	Me	H	Me	H
CH ₂ SMe	Me	Me	H	H	Me	Me
CH ₂ SMe	Me	H	Me	H	Me	Me
CH ₂ SMe	Me	Me	Me	H	H	Me
CH ₂ SMe	Me	Me	Me	Me	H	H
CH ₂ SMe	H	bond		H	H	H
CH ₂ SMe	H	-CH ₂ -		H	H	H
CH ₂ SMe	H	-(CH ₂) ₂ -		H	H	H
CH ₂ SMe	H	-O-		H	H	H
CH ₂ OPh	Me	H	H	H	Me	Me
CH ₂ OPh	Me	Me	H	H	Me	H
CH ₂ OPh	Me	Me	Me	H	H	H
CH ₂ OPh	Me	H	Me	H	Me	H
CH ₂ OPh	Me	Me	H	H	Me	Me
CH ₂ OPh	Me	H	Me	H	Me	Me
CH ₂ OPh	Me	Me	Me	H	H	Me
CH ₂ OPh	Me	Me	Me	Me	H	H
CH ₂ OPh	H	bond		H	H	H
CH ₂ OPh	H	-CH ₂ -		H	H	H
CH ₂ OPh	H	-(CH ₂) ₂ -		H	H	H
CH ₂ OPh	H	-O-		H	H	H
CH ₂ OCOMe	Me	H	H	H	Me	Me
CH ₂ OCOMe	Me	Me	H	H	Me	H
CH ₂ OCOMe	Me	Me	Me	H	H	H
CH ₂ OCOMe	Me	H	Me	H	Me	H
CH ₂ OCOMe	Me	Me	H	H	Me	Me

CH ₂ OCOMe	Me	H	Me	H	Me	Me
CH ₂ OCOMe	Me	Me	Me	H	H	Me
CH ₂ OCOMe	Me	Me	Me	Me	H	H
CH ₂ OCOMe	H	bond		H	H	H
CH ₂ OCOMe	H	-CH ₂ -		H	H	H
CH ₂ OCOMe	H	-(CH ₂) ₂ -		H	H	H
CH ₂ OCOMe	H	-O-		H	H	H
CH ₂ OCOEt	Me	H	H	H	Me	Me
CH ₂ OCOEt	Me	Me	H	H	Me	H
CH ₂ OCOEt	Me	Me	Me	H	H	H
CH ₂ OCOEt	Me	H	Me	H	Me	H
CH ₂ OCOEt	Me	Me	H	H	Me	Me
CH ₂ OCOEt	Me	H	Me	H	Me	Me
CH ₂ OCOEt	Me	Me	Me	H	H	Me
CH ₂ OCOEt	Me	Me	Me	Me	H	H
CH ₂ OCOEt	H	bond		H	H	H
CH ₂ OCOEt	H	-CH ₂ -		H	H	H
CH ₂ OCOEt	H	-(CH ₂) ₂ -		H	H	H
CH ₂ OCOEt	H	-O-		H	H	H
COSMe	Me	H	H	H	Me	Me
COSMe	Me	Me	H	H	Me	H
COSMe	Me	Me	Me	H	H	H
COSMe	Me	H	Me	H	Me	H
COSMe	Me	Me	H	H	Me	Me
COSMe	Me	H	Me	H	Me	Me
COSMe	Me	Me	Me	H	H	Me
COSMe	Me	Me	Me	Me	H	H
COSMe	H	bond		H	H	H

COSMe	H		$-\text{CH}_2-$	H	H	H
COSMe	H		$-(\text{CH}_2)_2-$	H	H	H
COSMe	H		$-\text{O}-$	H	H	H
COSEt	Me	H	H	H	Me	Me
COSEt	Me	Me	H	H	Me	H
COSEt	Me	Me	Me	H	H	H
COSEt	Me	H	Me	H	Me	H
COSEt	Me	Me	H	H	Me	Me
COSEt	Me	H	Me	H	Me	Me
COSEt	Me	Me	Me	H	H	Me
COSEt	Me	Me	Me	Me	H	H
COSEt	H		bond	H	H	H
COSEt	H		$-\text{CH}_2-$	H	H	H
COSEt	H		$-(\text{CH}_2)_2-$	H	H	H
COSEt	H		$-\text{O}-$	H	H	H
$\text{CH}_2\text{SO}_2\text{Me}$	Me	H	H	H	Me	Me
$\text{CH}_2\text{SO}_2\text{Me}$	Me	Me	H	H	Me	H
$\text{CH}_2\text{SO}_2\text{Me}$	Me	Me	Me	H	H	H
$\text{CH}_2\text{SO}_2\text{Me}$	Me	H	Me	H	Me	H
$\text{CH}_2\text{SO}_2\text{Me}$	Me	Me	H	H	Me	Me
$\text{CH}_2\text{SO}_2\text{Me}$	Me	H	Me	H	Me	Me
$\text{CH}_2\text{SO}_2\text{Me}$	Me	Me	Me	H	H	Me
$\text{CH}_2\text{SO}_2\text{Me}$	Me	Me	Me	Me	H	H
$\text{CH}_2\text{SO}_2\text{Me}$	H		bond	H	H	H
$\text{CH}_2\text{SO}_2\text{Me}$	H		$-\text{CH}_2-$	H	H	H
$\text{CH}_2\text{SO}_2\text{Me}$	H		$-(\text{CH}_2)_2-$	H	H	H
$\text{CH}_2\text{SO}_2\text{Me}$	H		$-\text{O}-$	H	H	H
CH_2SOMe	Me	H	H	H	Me	Me

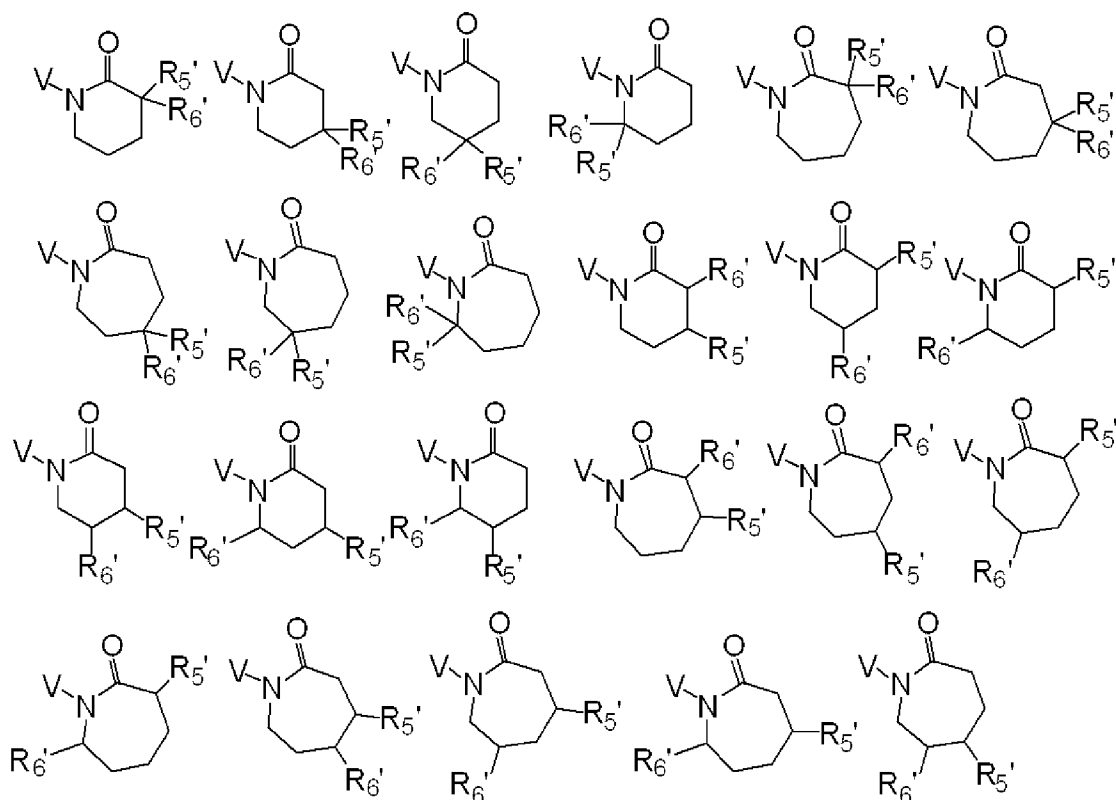
CH ₂ SOMe	Me	Me	H	H	Me	H
CH ₂ SOMe	Me	Me	Me	H	H	H
CH ₂ SOMe	Me	H	Me	H	Me	H
CH ₂ SOMe	Me	Me	H	H	Me	Me
CH ₂ SOMe	Me	H	Me	H	Me	Me
CH ₂ SOMe	Me	Me	Me	H	H	Me
CH ₂ SOMe	Me	Me	Me	Me	H	H
CH ₂ SOMe	H	bond		H	H	H
CH ₂ SOMe	H	-CH ₂ -		H	H	H
CH ₂ SOMe	H	-(CH ₂) ₂ -		H	H	H
CH ₂ SOMe	H	-O-		H	H	H
CH ₂ Ph	Me	H	H	H	Me	Me
CH ₂ Ph	Me	Me	H	H	Me	H
CH ₂ Ph	Me	Me	Me	H	H	H
CH ₂ Ph	Me	H	Me	H	Me	H
CH ₂ Ph	Me	Me	H	H	Me	Me
CH ₂ Ph	Me	H	Me	H	Me	Me
CH ₂ Ph	Me	Me	Me	H	H	Me
CH ₂ Ph	Me	Me	Me	Me	H	H
CH ₂ Ph	H	bond		H	H	H
CH ₂ Ph	H	-CH ₂ -		H	H	H
CH ₂ Ph	H	-(CH ₂) ₂ -		H	H	H
CH ₂ Ph	H	-O-		H	H	H
SO ₂ CF ₃	Me	H	H	H	Me	Me
SO ₂ CF ₃	Me	Me	H	H	Me	H
SO ₂ CF ₃	Me	Me	Me	H	H	H
SO ₂ CF ₃	Me	H	Me	H	Me	H
SO ₂ CF ₃	Me	Me	H	H	Me	Me

SO_2CF_3	Me	H	Me	H	Me	Me
SO_2CF_3	Me	Me	Me	H	H	Me
SO_2CF_3	Me	Me	Me	Me	H	H

[0150] 第4表中、E-1乃至E-12は、前記に同じであり、「bond」とは、該当する置換基の結合した2つの炭素が結合を形成していることを表し、2つの炭素が隣り合っている場合は、2重結合を表し、隣り合っていない場合は単結合を表す。

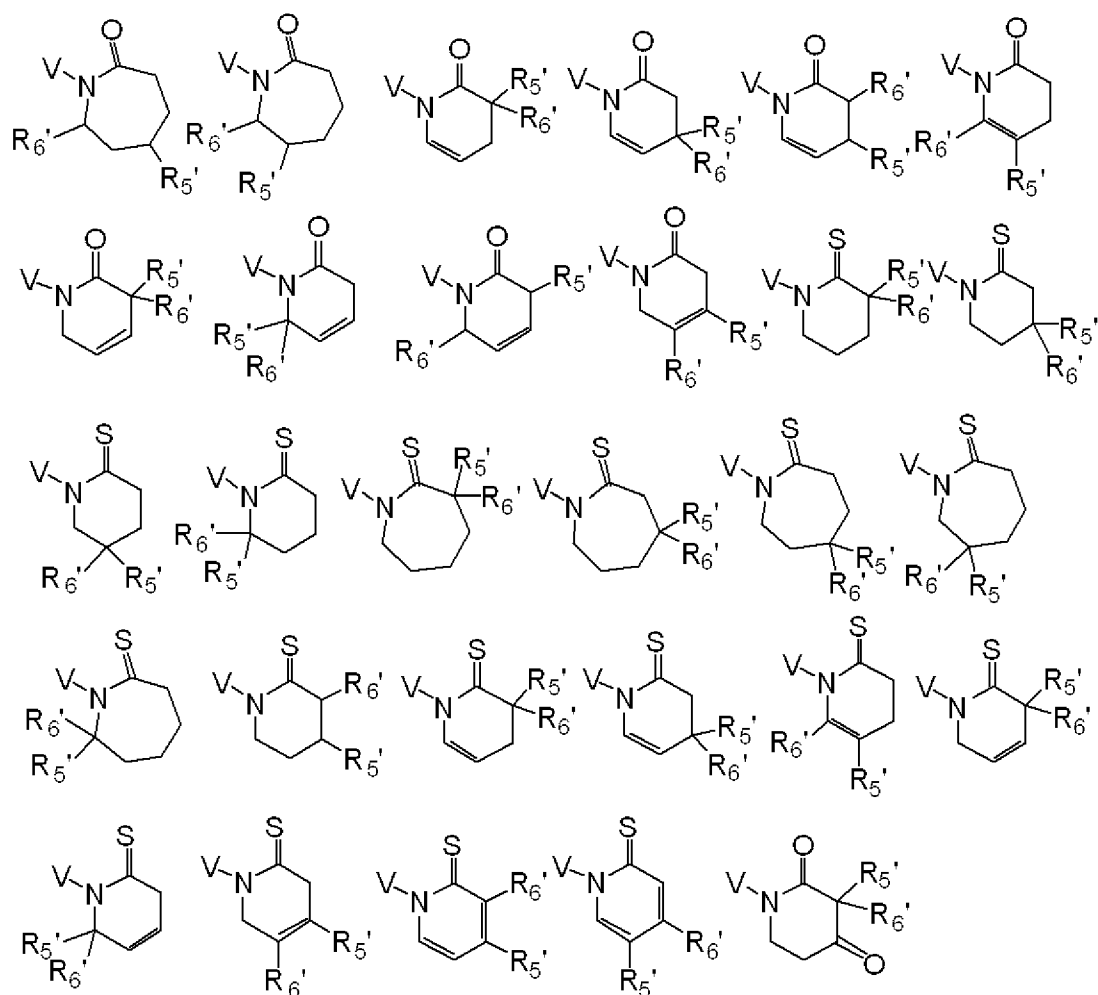
[0151] [第5表]

[0152] [化17]



[0153]

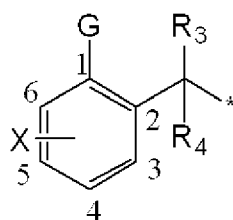
[化18]



[0154] Vは、以下の一般式（27）で表される。

一般式 (27)

[0155] [化19]



表中、Xの置換位置は一般式(27)中の数字の位置を表し、例えば、3-Fはベンゼン環の3と示した炭素がFで置換されていることを表す。

[0156] $R_3 = R_4 = H$

G	R ₅ '	R ₆ '	X
NO ₂	Me	H	H
NO ₂	Me	Me	H
NO ₂	Et	H	H
NO ₂	Et	Me	H
NO ₂	Pr-n	H	H
NO ₂	Pr-n	Me	H
NO ₂	Pr-i	H	H
NO ₂	Pr-i	Me	H
NO ₂	Pr-c	H	H
NO ₂	Pr-c	Me	H
NO ₂	Bu-n	H	H
NO ₂	Bu-n	Me	H
NO ₂	Bu-i	H	H
NO ₂	Bu-i	Me	H
NO ₂	Bu-s	H	H
NO ₂	Bu-s	Me	H
NO ₂	Bu-t	H	H
NO ₂	Bu-t	Me	H
NO ₂	Bu-c	H	H
NO ₂	Bu-c	Me	H
NO ₂	Pen-n	H	H
NO ₂	Pen-n	Me	H
NO ₂	Pen-c	H	H
NO ₂	Pen-c	Me	H
NO ₂	Hex-n	H	H

NO ₂	Hex-n	Me	H
NO ₂	Hex-c	H	H
NO ₂	Hex-c	Me	H
NO ₂	Cl	H	H
NO ₂	Cl	Cl	H
NO ₂	Br	H	H
NO ₂	I	H	H
NO ₂	F	H	H
NO ₂	CH=CH ₂	H	H
NO ₂	CH=CH ₂	Me	H
NO ₂	C≡CH	H	H
NO ₂	C≡CH	Me	H
NO ₂	CH ₂ CH=CH ₂	H	H
NO ₂	CH ₂ CH=CH ₂	Me	H
NO ₂	CH ₂ C≡CH	H	H
NO ₂	CH ₂ C≡CH	Me	H
NO ₂	CH ₂ Cl	H	H
NO ₂	CH ₂ Cl	Me	H
NO ₂	CH ₂ Cl	CH ₂ Cl	H
NO ₂	CHCl ₂	H	H
NO ₂	CCl ₃	H	H
NO ₂	CH ₂ F	H	H
NO ₂	CHF ₂	H	H
NO ₂	CF ₃	H	H
NO ₂	CF ₃	Me	H
NO ₂	CF ₃	Et	H
NO ₂	CH ₂ CH ₂ Cl	H	H
NO ₂	CH ₂ OH	H	H

NO ₂	CH ₂ SM e	H	H
NO ₂	CH ₂ SCH ₂ Cl	H	H
NO ₂	Ph	H	H
NO ₂	Ph	Me	H
NO ₂	Ph-2-Cl	H	H
NO ₂	Ph-2-Cl	Me	H
NO ₂	Ph-3-Cl	H	H
NO ₂	Ph-3-Cl	Me	H
NO ₂	Ph-4-Cl	H	H
NO ₂	Ph-4-Cl	Me	H
NO ₂	Ph-3-I	H	H
NO ₂	Ph-4-F	H	H
NO ₂	Ph-2-Me	H	H
NO ₂	Ph-3-OMe	H	H
NO ₂	Ph-4-SMe	H	H
NO ₂	Ph-3-CN	H	H
NO ₂	Ph-4-NO ₂	H	H
NO ₂	Ph-2-CO ₂ Me	H	H
NO ₂	Ph-3-NH ₂	H	H
NO ₂	Ph-4-Ph	H	H
NO ₂	Ph-2-OPh	H	H
NO ₂	Ph-3-SPh	H	H
NO ₂	Ph-4-CONMe ₂	H	H
NO ₂	COMe	H	H
NO ₂	COEt	H	H
NO ₂	COCH ₂ Cl	H	H
NO ₂	CO ₂ H	H	H
NO ₂	CO ₂ Me	H	H

NO ₂	CO ₂ Me	Me	H
NO ₂	CO ₂ Et	H	H
NO ₂	CO ₂ Bu-i	H	H
NO ₂	CONH ₂	H	H
NO ₂	CONHMe	H	H
NO ₂	CONMe ₂	H	H
NO ₂	CH ₂ Ph	H	H
NO ₂	CH ₂ Ph-2-Cl	H	H
NO ₂	CH ₂ Ph-3-Cl	H	H
NO ₂	CH ₂ Ph-4-Cl	H	H
NO ₂	COPh	H	H
NO ₂	COPh-2-Cl	H	H
NO ₂	COPh-3-Cl	H	H
NO ₂	COPh-4-Cl	H	H
NO ₂	OH	H	H
NO ₂	OMe	H	H
NO ₂	OMe	Me	H
NO ₂	SMe	H	H
NO ₂	SMe	Me	H
NO ₂	SPh	H	H
NO ₂	CN	H	H
NO ₂	NH ₂	H	H
NO ₂	NHMe	H	H
NO ₂	NHMe	Me	H
NO ₂	NMe ₂	H	H
NO ₂	NMe ₂	Me	H
NO ₂	-CH ₂ -O-CH ₂ -		H
NO ₂	-(CH ₂) ₂ -		H

NO_2		$-(\text{CH}_2)_3-$	H
NO_2	Me	H	3-F
NO_2	Me	H	4-F
NO_2	Me	H	5-F
NO_2	Me	H	6-F
NO_2	Me	H	4-Cl
NO_2	Me	H	5-Cl
NO_2	Me	H	4-Br
NO_2	Me	H	4-I
NO_2	Me	H	4-Me
NO_2	Me	H	5-Me
NO_2	Me	H	4-OMe
NO_2	Me	H	4-SMe
NO_2	Me	Me	3-F
NO_2	Me	Me	4-F
NO_2	Me	Me	5-F
NO_2	Me	Me	6-F
NO_2	Me	Me	4-Cl
NO_2	Me	Me	5-Cl
NO_2	Me	Me	4-Br
NO_2	Me	Me	4-I
NO_2	Me	Me	4-Me
NO_2	Me	Me	5-Me
NO_2	Me	Me	4-OMe
NO_2	Me	Me	4-SMe
NH_2	Me	H	H
NH_2	Me	Me	H
NH_2	Et	H	H

NH ₂	Et	Me	H
NH ₂	Pr-n	H	H
NH ₂	Pr-n	Me	H
NH ₂	Pr-i	H	H
NH ₂	Pr-i	Me	H
NH ₂	Pr-c	H	H
NH ₂	Pr-c	Me	H
NH ₂	Bu-n	H	H
NH ₂	Bu-n	Me	H
NH ₂	Bu-i	H	H
NH ₂	Bu-i	Me	H
NH ₂	Bu-s	H	H
NH ₂	Bu-s	Me	H
NH ₂	Bu-t	H	H
NH ₂	Bu-t	Me	H
NH ₂	Bu-c	H	H
NH ₂	Bu-c	Me	H
NH ₂	Pen-n	H	H
NH ₂	Pen-n	Me	H
NH ₂	Pen-c	H	H
NH ₂	Pen-c	Me	H
NH ₂	Hex-n	H	H
NH ₂	Hex-n	Me	H
NH ₂	Hex-c	H	H
NH ₂	Hex-c	Me	H
NH ₂	Cl	H	H
NH ₂	Cl	Cl	H
NH ₂	Br	H	H

NH ₂	I	H	H
NH ₂	F	H	H
NH ₂	CH=CH ₂	H	H
NH ₂	CH=CH ₂	Me	H
NH ₂	C≡CH	H	H
NH ₂	C≡CH	Me	H
NH ₂	CH ₂ CH=CH ₂	H	H
NH ₂	CH ₂ CH=CH ₂	Me	H
NH ₂	CH ₂ C≡CH	H	H
NH ₂	CH ₂ C≡CH	Me	H
NH ₂	CH ₂ CI	H	H
NH ₂	CH ₂ CI	Me	H
NH ₂	CH ₂ CI	CH ₂ CI	H
NH ₂	CHCI ₂	H	H
NH ₂	CCI ₃	H	H
NH ₂	CH ₂ F	H	H
NH ₂	CHF ₂	H	H
NH ₂	CF ₃	H	H
NH ₂	CF ₃	Me	H
NH ₂	CF ₃	Et	H
NH ₂	CH ₂ CH ₂ CI	H	H
NH ₂	CH ₂ OH	H	H
NH ₂	CH ₂ SMe	H	H
NH ₂	CH ₂ SCH ₂ CI	H	H
NH ₂	Ph	H	H
NH ₂	Ph	Me	H
NH ₂	Ph-2-CI	H	H
NH ₂	Ph-2-CI	Me	H

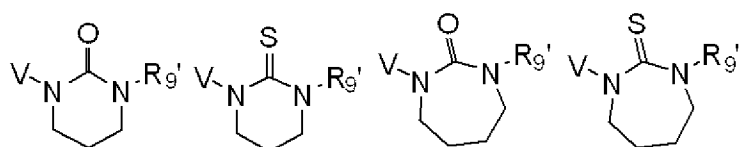
NH ₂	Ph-3-Cl	H	H
NH ₂	Ph-3-Cl	Me	H
NH ₂	Ph-4-Cl	H	H
NH ₂	Ph-4-Cl	Me	H
NH ₂	Ph-3-I	H	H
NH ₂	Ph-4-F	H	H
NH ₂	Ph-2-Me	H	H
NH ₂	Ph-3-OMe	H	H
NH ₂	Ph-4-SMe	H	H
NH ₂	Ph-3-CN	H	H
NH ₂	Ph-4-NO ₂	H	H
NH ₂	Ph-2-CO ₂ Me	H	H
NH ₂	Ph-3-NH ₂	H	H
NH ₂	Ph-4-Ph	H	H
NH ₂	Ph-2-OPh	H	H
NH ₂	Ph-3-SPh	H	H
NH ₂	Ph-4-CONMe ₂	H	H
NH ₂	COMe	H	H
NH ₂	COEt	H	H
NH ₂	COCH ₂ Cl	H	H
NH ₂	CO ₂ H	H	H
NH ₂	CO ₂ Me	H	H
NH ₂	CO ₂ Me	Me	H
NH ₂	CO ₂ Et	H	H
NH ₂	CO ₂ Bu-i	H	H
NH ₂	CONH ₂	H	H
NH ₂	CONHMe	H	H
NH ₂	CONMe ₂	H	H

NH ₂	CH ₂ Ph	H	H
NH ₂	CH ₂ Ph-2-Cl	H	H
NH ₂	CH ₂ Ph-3-Cl	H	H
NH ₂	CH ₂ Ph-4-Cl	H	H
NH ₂	COPh	H	H
NH ₂	COPh-2-Cl	H	H
NH ₂	COPh-3-Cl	H	H
NH ₂	COPh-4-Cl	H	H
NH ₂	OH	H	H
NH ₂	OMe	H	H
NH ₂	OMe	Me	H
NH ₂	SMe	H	H
NH ₂	SMe	Me	H
NH ₂	SPh	H	H
NH ₂	CN	H	H
NH ₂	NH ₂	H	H
NH ₂	NHMe	H	H
NH ₂	NHMe	Me	H
NH ₂	NMe ₂	H	H
NH ₂	NMe ₂	Me	H
NH ₂	-CH ₂ -O-CH ₂ -		H
NH ₂	-(CH ₂) ₂ -		H
NH ₂	-(CH ₂) ₃ -		H
NH ₂	Me	H	3-F
NH ₂	Me	H	4-F
NH ₂	Me	H	5-F
NH ₂	Me	H	6-F
NH ₂	Me	H	4-Cl

NH ₂	Me	H	5-Cl
NH ₂	Me	H	4-Br
NH ₂	Me	H	4-I
NH ₂	Me	H	4-Me
NH ₂	Me	H	5-Me
NH ₂	Me	H	4-OMe
NH ₂	Me	H	4-SMe
NH ₂	Me	Me	3-F
NH ₂	Me	Me	4-F
NH ₂	Me	Me	5-F
NH ₂	Me	Me	6-F
NH ₂	Me	Me	4-Cl
NH ₂	Me	Me	5-Cl
NH ₂	Me	Me	4-Br
NH ₂	Me	Me	4-I
NH ₂	Me	Me	4-Me
NH ₂	Me	Me	5-Me
NH ₂	Me	Me	4-OMe
NH ₂	Me	Me	4-SMe

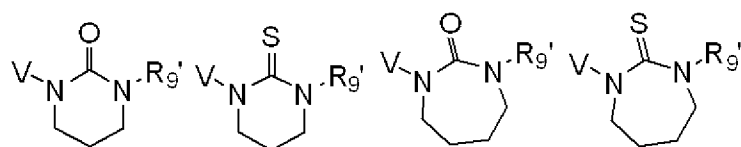
[0157] [第6表]

[0158]



[0159]

[化20]



[0160] Vは、前記一般式（27）と同じである。

[0161] $R_3 = R_4 = H$

G	R ₉ '
NO ₂	H
NO ₂	Me
NO ₂	Et
NO ₂	Pr-c
NO ₂	CH ₂ Pr-i
NO ₂	CH ₂ Pr-c
NO ₂	CH ₂ CH=CH ₂
NO ₂	CH ₂ C≡CH
NO ₂	CH ₂ OMe
NO ₂	CH ₂ SMe
NO ₂	CH ₂ CO ₂ Me
NO ₂	CH ₂ CO ₂ Me
NO ₂	CH ₂ Ph
NO ₂	CH ₂ Ph-2-Cl
NO ₂	CH ₂ Ph-3-Cl
NO ₂	CH ₂ Ph-4-Cl

NO ₂	Ph
NO ₂	Ph-2-Cl
NO ₂	Ph-3-Cl
NO ₂	Ph-4-Cl
NO ₂	COMe
NO ₂	COPr-c
NO ₂	CONMe ₂
NO ₂	SO ₂ Me
NO ₂	SO ₂ CF ₃
NO ₂	CO ₂ Et
NH ₂	H
NH ₂	Me
NH ₂	Et
NH ₂	Pr-c
NH ₂	CH ₂ Pr-i
NH ₂	CH ₂ Pr-c
NH ₂	CH ₂ CH=CH ₂
NH ₂	CH ₂ C≡CH
NH ₂	CH ₂ OMe
NH ₂	CH ₂ SMe
NH ₂	CH ₂ CO ₂ Me
NH ₂	CH ₂ CO ₂ Me
NH ₂	CH ₂ Ph
NH ₂	CH ₂ Ph-2-Cl
NH ₂	CH ₂ Ph-3-Cl
NH ₂	CH ₂ Ph-4-Cl
NH ₂	Ph
NH ₂	Ph-2-Cl

NO ₂	H	Me	H	H
NO ₂	Me	Me	H	H
NO ₂	Et	Me	H	H
NO ₂	Pr-c	Me	H	H
NO ₂	CH ₂ Pr-i	Me	H	H
NO ₂	CH ₂ Pr-c	Me	H	H
NO ₂	CH ₂ CH=CH ₂	Me	H	H
NO ₂	CH ₂ C≡CH	Me	H	H
NO ₂	CH ₂ OMe	Me	H	H
NO ₂	CH ₂ SMe	Me	H	H
NO ₂	CH ₂ CO ₂ Me	Me	H	H
NO ₂	CH ₂ CO ₂ Me	Me	H	H
NO ₂	CH ₂ Ph	Me	H	H
NO ₂	CH ₂ Ph-2-Cl	Me	H	H
NO ₂	CH ₂ Ph-3-Cl	Me	H	H
NO ₂	CH ₂ Ph-4-Cl	Me	H	H
NO ₂	Ph	Me	H	H
NO ₂	Ph-2-Cl	Me	H	H
NO ₂	Ph-3-Cl	Me	H	H
NO ₂	Ph-4-Cl	Me	H	H
NO ₂	COMe	Me	H	H
NO ₂	COPr-c	Me	H	H
NO ₂	CONMe ₂	Me	H	H
NO ₂	SO ₂ Me	Me	H	H
NO ₂	SO ₂ CF ₃	Me	H	H
NO ₂	CO ₂ Et	Me	H	H
NO ₂	H	Me	Me	H

NO ₂	Me	Me	Me	H
NO ₂	Et	Me	Me	H
NO ₂	Pr-c	Me	Me	H
NO ₂	CH ₂ Pr-i	Me	Me	H
NO ₂	CH ₂ Pr-c	Me	Me	H
NO ₂	CH ₂ CH=CH ₂	Me	Me	H
NO ₂	CH ₂ C≡CH	Me	Me	H
NO ₂	CH ₂ OMe	Me	Me	H
NO ₂	CH ₂ SMe	Me	Me	H
NO ₂	CH ₂ CO ₂ Me	Me	Me	H
NO ₂	CH ₂ CO ₂ Me	Me	Me	H
NO ₂	CH ₂ Ph	Me	Me	H
NO ₂	CH ₂ Ph-2-Cl	Me	Me	H
NO ₂	CH ₂ Ph-3-Cl	Me	Me	H
NO ₂	CH ₂ Ph-4-Cl	Me	Me	H
NO ₂	Ph	Me	Me	H
NO ₂	Ph-2-Cl	Me	Me	H
NO ₂	Ph-3-Cl	Me	Me	H
NO ₂	Ph-4-Cl	Me	Me	H
NO ₂	COMe	Me	Me	H
NO ₂	COPr-c	Me	Me	H
NO ₂	CONMe ₂	Me	Me	H
NO ₂	SO ₂ Me	Me	Me	H
NO ₂	SO ₂ CF ₃	Me	Me	H
NO ₂	CO ₂ Et	Me	Me	H
NO ₂	H	Me	Et	H
NO ₂	Me	Me	Et	H
NO ₂	H	Et	H	H

NO ₂	Me	Et	H	H
NO ₂	H	Pr-n	H	H
NO ₂	Me	Pr-n	H	H
NO ₂	H	Pr-i	H	H
NO ₂	Me	Pr-i	H	H
NO ₂	H	Pr-c	H	H
NO ₂	Me	Pr-c	H	H
NO ₂	H	Bu-n	H	H
NO ₂	Me	Bu-n	H	H
NO ₂	H	Bu-i	H	H
NO ₂	Me	Bu-i	H	H
NO ₂	H	Bu-s	H	H
NO ₂	Me	Bu-s	H	H
NO ₂	H	Bu-t	H	H
NO ₂	Me	Bu-t	H	H
NO ₂	H	Bu-c	H	H
NO ₂	Me	Bu-c	H	H
NO ₂	H	Pen-n	H	H
NO ₂	Me	Pen-n	H	H
NO ₂	H	Pen-c	H	H
NO ₂	Me	Pen-c	H	H
NO ₂	H	Hex-n	H	H
NO ₂	Me	Hex-n	H	H
NO ₂	H	Hex-c	H	H
NO ₂	Me	Hex-c	H	H
NO ₂	H	Cl	H	H
NO ₂	Me	Cl	H	H
NO ₂	Et	Cl	H	H

NO ₂	H	Cl	Cl	H
NO ₂	Me	Cl	Cl	H
NO ₂	H	Br	H	H
NO ₂	Me	Br	H	H
NO ₂	H	I	H	H
NO ₂	Me	I	H	H
NO ₂	H	F	H	H
NO ₂	Me	F	H	H
NO ₂	H	F	F	H
NO ₂	Me	F	F	H
NO ₂	H	CH=CH ₂	H	H
NO ₂	Me	CH=CH ₂	H	H
NO ₂	H	C≡CH	H	H
NO ₂	Me	C≡CH	H	H
NO ₂	H	CH ₂ CH=CH ₂	H	H
NO ₂	Me	CH ₂ CH=CH ₂	H	H
NO ₂	H	CH ₂ C≡CH	H	H
NO ₂	Me	CH ₂ C≡CH	H	H
NO ₂	H	CH ₂ Cl	H	H
NO ₂	Me	CH ₂ Cl	H	H
NO ₂	H	CHCl ₂	H	H
NO ₂	Me	CHCl ₂	H	H
NO ₂	H	CCl ₃	H	H
NO ₂	Me	CCl ₃	H	H
NO ₂	H	CH ₂ F	H	H
NO ₂	Me	CH ₂ F	H	H
NO ₂	H	CHF ₂	H	H
NO ₂	Me	CHF ₂	H	H

NO ₂	H	CF ₃	H	H
NO ₂	Me	CF ₃	H	H
NO ₂	H	CH ₂ CH ₂ Cl	H	H
NO ₂	Me	CH ₂ CH ₂ Cl	H	H
NO ₂	H	CH ₂ OH	H	H
NO ₂	Me	CH ₂ OH	H	H
NO ₂	H	CH ₂ SM e	H	H
NO ₂	Me	CH ₂ SM e	H	H
NO ₂	H	CH ₂ SCH ₂ Cl	H	H
NO ₂	Me	CH ₂ SCH ₂ Cl	H	H
NO ₂	H	Ph	H	H
NO ₂	Me	Ph	H	H
NO ₂	H	Ph-2-Cl	H	H
NO ₂	Me	Ph-2-Cl	H	H
NO ₂	H	Ph-3-Cl	H	H
NO ₂	Me	Ph-3-Cl	H	H
NO ₂	H	Ph-4-Cl	H	H
NO ₂	Me	Ph-4-Cl	H	H
NO ₂	Me	Ph-2-Br	H	H
NO ₂	Me	Ph-3-I	H	H
NO ₂	Me	Ph-4-F	H	H
NO ₂	Me	Ph-2-Me	H	H
NO ₂	Me	Ph-3-OMe	H	H
NO ₂	Me	Ph-4-SMe	H	H
NO ₂	Me	Ph-2-SO ₂ Me	H	H
NO ₂	Me	Ph-3-CN	H	H
NO ₂	Me	Ph-4-NO ₂	H	H
NO ₂	Me	Ph-2-CO ₂ Me	H	H

NO ₂	Me	Ph-3-NH ₂	H	H
NO ₂	Me	Ph-4-Ph	H	H
NO ₂	Me	Ph-2-OPh	H	H
NO ₂	Me	Ph-3-SPh	H	H
NO ₂	Me	Ph-4-OH	H	H
NO ₂	H	COMe	H	H
NO ₂	Me	COMe	H	H
NO ₂	H	COEt	H	H
NO ₂	Me	COEt	H	H
NO ₂	H	COCH ₂ Cl	H	H
NO ₂	Me	COCH ₂ Cl	H	H
NO ₂	H	CO ₂ H	H	H
NO ₂	Me	CO ₂ H	H	H
NO ₂	H	CO ₂ Me	H	H
NO ₂	Me	CO ₂ Me	H	H
NO ₂	H	CO ₂ Et	H	H
NO ₂	Me	CO ₂ Et	H	H
NO ₂	H	CONHMe	H	H
NO ₂	Me	CONHMe	H	H
NO ₂	H	CONMe ₂	H	H
NO ₂	Me	CONMe ₂	H	H
NO ₂	H	OH	H	H
NO ₂	Me	OH	H	H
NO ₂	H	OMe	H	H
NO ₂	Me	OMe	H	H
NO ₂	H	SMe	H	H
NO ₂	Me	SMe	H	H
NO ₂	H	CN	H	H

NO ₂	Me	CN	H	H
NO ₂	H	NH ₂	H	H
NO ₂	Me	NH ₂	H	H
NO ₂	H	NHMe	H	H
NO ₂	Me	NHMe	H	H
NO ₂	H	NMe ₂	H	H
NO ₂	Me	NMe ₂	H	H
NO ₂	H	—CH ₂ —O—		H
NO ₂	Me	—CH ₂ —O—		H
NO ₂	H	—(CH ₂) ₂ —		H
NO ₂	Me	—(CH ₂) ₂ —		H
NO ₂	H	—(CH ₂) ₃ —		H
NO ₂	Me	—(CH ₂) ₃ —		H
NO ₂	Me	H	H	3—F
NO ₂	Me	H	H	4—F
NO ₂	Me	H	H	5—F
NO ₂	Me	H	H	6—F
NO ₂	Me	H	H	4—Cl
NO ₂	Me	H	H	5—Cl
NO ₂	Me	H	H	4—Br
NO ₂	Me	H	H	4—I
NO ₂	Me	H	H	4—Me
NO ₂	Me	H	H	5—Me
NO ₂	Me	H	H	4—OMe
e				
NO ₂	Me	H	H	4—SM
e				
NH ₂	H	Me	H	H

NH ₂	Me	Me	H	H
NH ₂	Et	Me	H	H
NH ₂	Pr-c	Me	H	H
NH ₂	CH ₂ Pr-i	Me	H	H
NH ₂	CH ₂ Pr-c	Me	H	H
NH ₂	CH ₂ CH=CH ₂	Me	H	H
NH ₃	CH ₂ C≡CH	Me	H	H
NH ₂	CH ₂ OMe	Me	H	H
NH ₂	CH ₂ SM e	Me	H	H
NH ₂	CH ₂ CO ₂ Me	Me	H	H
NH ₂	CH ₂ CO ₂ Me	Me	H	H
NH ₂	CH ₂ Ph	Me	H	H
NH ₂	CH ₂ Ph-2-Cl	Me	H	H
NH ₂	CH ₂ Ph-3-Cl	Me	H	H
NH ₂	CH ₂ Ph-4-Cl	Me	H	H
NH ₂	Ph	Me	H	H
NH ₂	Ph-2-Cl	Me	H	H
NH ₂	Ph-3-Cl	Me	H	H
NH ₂	Ph-4-Cl	Me	H	H
NH ₂	COMe	Me	H	H
NH ₂	COPr-c	Me	H	H
NH ₂	CONMe ₂	Me	H	H
NH ₂	SO ₂ Me	Me	H	H
NH ₂	SO ₂ CF ₃	Me	H	H
NH ₂	CO ₂ Et	Me	H	H
NH ₂	H	Me	Me	H
NH ₂	Me	Me	Me	H
NH ₂	Et	Me	Me	H

NH ₂	Pr - c	Me	Me	H
NH ₂	CH ₂ Pr - i	Me	Me	H
NH ₂	CH ₂ Pr - c	Me	Me	H
NH ₂	CH ₂ CH=CH ₂	Me	Me	H
NH ₂	CH ₂ C≡CH	Me	Me	H
NH ₂	CH ₂ OMe	Me	Me	H
NH ₂	CH ₂ SMe	Me	Me	H
NH ₂	CH ₂ CO ₂ Me	Me	Me	H
NH ₂	CH ₂ CO ₂ Me	Me	Me	H
NH ₂	CH ₂ Ph	Me	Me	H
NH ₂	CH ₂ Ph - 2 - Cl	Me	Me	H
NH ₂	CH ₂ Ph - 3 - Cl	Me	Me	H
NH ₂	CH ₂ Ph - 4 - Cl	Me	Me	H
NH ₂	Ph	Me	Me	H
NH ₂	Ph - 2 - Cl	Me	Me	H
NH ₂	Ph - 3 - Cl	Me	Me	H
NH ₂	Ph - 4 - Cl	Me	Me	H
NH ₂	COMe	Me	Me	H
NH ₂	COPr - c	Me	Me	H
NH ₂	CONMe ₂	Me	Me	H
NH ₂	SO ₂ Me	Me	Me	H
NH ₂	SO ₂ CF ₃	Me	Me	H
NH ₂	CO ₂ Et	Me	Me	H
NH ₂	H	Me	Et	H
NH ₂	Me	Me	Et	H
NH ₂	H	Et	H	H
NH ₂	Me	Et	H	H
NH ₂	H	Pr - n	H	H

NH ₂	Me	Pr-n	H	H
NH ₂	H	Pr-i	H	H
NH ₂	Me	Pr-i	H	H
NH ₂	H	Pr-c	H	H
NH ₂	Me	Pr-c	H	H
NH ₂	H	Bu-n	H	H
NH ₂	Me	Bu-n	H	H
NH ₂	H	Bu-i	H	H
NH ₂	Me	Bu-i	H	H
NH ₂	H	Bu-s	H	H
NH ₂	Me	Bu-s	H	H
NH ₂	H	Bu-t	H	H
NH ₂	Me	Bu-t	H	H
NH ₂	H	Bu-c	H	H
NH ₂	Me	Bu-c	H	H
NH ₂	H	Pen-n	H	H
NH ₂	Me	Pen-n	H	H
NH ₂	H	Pen-c	H	H
NH ₂	Me	Pen-c	H	H
NH ₂	H	Hex-n	H	H
NH ₂	Me	Hex-n	H	H
NH ₂	H	Hex-c	H	H
NH ₂	Me	Hex-c	H	H
NH ₂	H	Cl	H	H
NH ₂	Me	Cl	H	H
NH ₂	Et	Cl	H	H
NH ₂	H	Cl	Cl	H
NH ₂	Me	Cl	Cl	H

NH ₂	H	Br	H	H
NH ₂	Me	Br	H	H
NH ₂	H	I	H	H
NH ₂	Me	I	H	H
NH ₂	H	F	H	H
NH ₂	Me	F	H	H
NH ₂	H	F	F	H
NH ₂	Me	F	F	H
NH ₂	H	CH=CH ₂	H	H
NH ₂	Me	CH=CH ₂	H	H
NH ₂	H	C≡CH	H	H
NH ₂	Me	C≡CH	H	H
NH ₂	H	CH ₂ CH=CH ₂	H	H
NH ₂	Me	CH ₂ CH=CH ₂	H	H
NH ₂	H	CH ₂ C≡CH	H	H
NH ₂	Me	CH ₂ C≡CH	H	H
NH ₂	H	CH ₂ Cl	H	H
NH ₂	Me	CH ₂ Cl	H	H
NH ₂	H	CHCl ₂	H	H
NH ₂	Me	CHCl ₂	H	H
NH ₂	H	CCl ₃	H	H
NH ₂	Me	CCl ₃	H	H
NH ₂	H	CH ₂ F	H	H
NH ₂	Me	CH ₂ F	H	H
NH ₂	H	CHF ₂	H	H
NH ₂	Me	CHF ₂	H	H
NH ₂	H	CF ₃	H	H
NH ₂	Me	CF ₃	H	H

NH ₂	H	CH ₂ CH ₂ Cl	H	H
NH ₂	Me	CH ₂ CH ₂ Cl	H	H
NH ₂	H	CH ₂ OH	H	H
NH ₂	Me	CH ₂ OH	H	H
NH ₂	H	CH ₂ SM e	H	H
NH ₂	Me	CH ₂ SM e	H	H
NH ₂	H	CH ₂ SCH ₂ Cl	H	H
NH ₂	Me	CH ₂ SCH ₂ Cl	H	H
NH ₂	H	Ph	H	H
NH ₂	Me	Ph	H	H
NH ₂	H	Ph-2-Cl	H	H
NH ₂	Me	Ph-2-Cl	H	H
NH ₂	H	Ph-3-Cl	H	H
NH ₂	Me	Ph-3-Cl	H	H
NH ₂	H	Ph-4-Cl	H	H
NH ₂	Me	Ph-4-Cl	H	H
NH ₂	Me	Ph-2-Br	H	H
NH ₂	Me	Ph-3-I	H	H
NH ₂	Me	Ph-4-F	H	H
NH ₂	Me	Ph-2-M e	H	H
NH ₂	Me	Ph-3-OM e	H	H
NH ₂	Me	Ph-4-SM e	H	H
NH ₂	Me	Ph-2-SO ₂ M e	H	H
NH ₂	Me	Ph-3-CN	H	H
NH ₂	Me	Ph-4-NO ₂	H	H
NH ₂	Me	Ph-2-CO ₂ M e	H	H
NH ₂	Me	Ph-3-NH ₂	H	H
NH ₂	Me	Ph-4-Ph	H	H

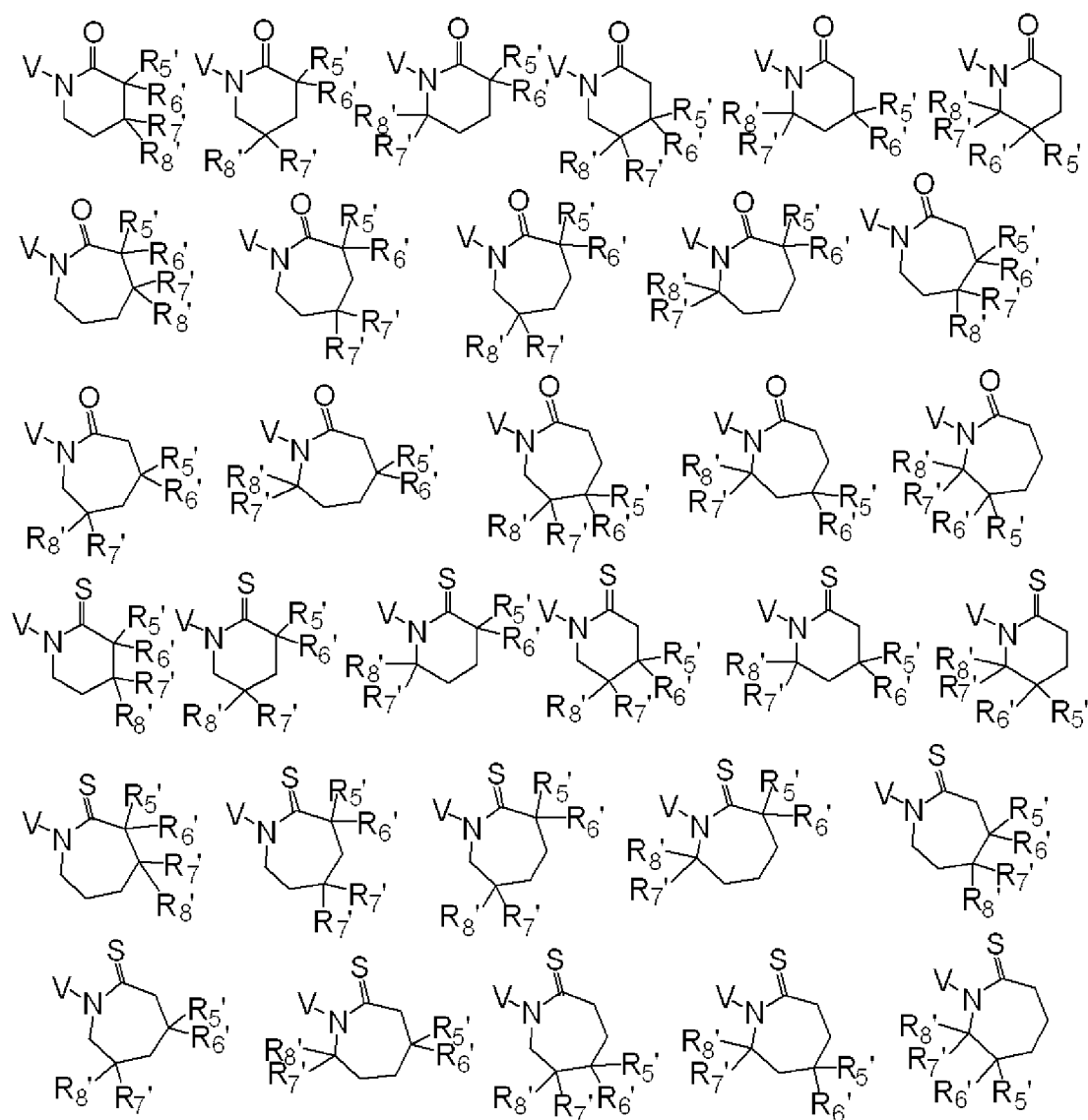
NH ₂	Me	Ph-2-OPh	H	H
NH ₂	Me	Ph-3-SPh	H	H
NH ₂	Me	Ph-4-OH	H	H
NH ₂	H	COMe	H	H
NH ₂	Me	COMe	H	H
NH ₂	H	COEt	H	H
NH ₂	Me	COEt	H	H
NH ₂	H	COCH ₂ Cl	H	H
NH ₂	Me	COCH ₂ Cl	H	H
NH ₂	H	CO ₂ H	H	H
NH ₂	Me	CO ₂ H	H	H
NH ₂	H	CO ₂ Me	H	H
NH ₂	Me	CO ₂ Me	H	H
NH ₂	H	CO ₂ Et	H	H
NH ₂	Me	CO ₂ Et	H	H
NH ₂	H	CONHMe	H	H
NH ₂	Me	CONHMe	H	H
NH ₂	H	CONMe ₂	H	H
NH ₂	Me	CONMe ₂	H	H
NH ₂	H	OH	H	H
NH ₂	Me	OH	H	H
NH ₂	H	OMe	H	H
NH ₂	Me	OMe	H	H
NH ₂	H	SMe	H	H
NH ₂	Me	SMe	H	H
NH ₂	H	CN	H	H
NH ₂	Me	CN	H	H
NH ₂	H	NH ₂	H	H

NH ₂	Me	NH ₂	H	H
NH ₂	H	NHMe	H	H
NH ₂	Me	NHMe	H	H
NH ₂	H	NMe ₂	H	H
NH ₂	Me	NMe ₂	H	H
NH ₂	H		—CH ₂ —O—	H
NH ₂	Me		—CH ₂ —O—	H
NH ₂	H		—(CH ₂) ₂ —	H
NH ₂	Me		—(CH ₂) ₂ —	H
NH ₂	H		—(CH ₂) ₃ —	H
NH ₂	Me		—(CH ₂) ₃ —	H
NH ₂	Me	H	H	3—F
NH ₂	Me	H	H	4—F
NH ₂	Me	H	H	5—F
NH ₂	Me	H	H	6—F
NH ₂	Me	H	H	4—Cl
NH ₂	Me	H	H	5—Cl
NH ₂	Me	H	H	4—Br
NH ₂	Me	H	H	4—I
NH ₂	Me	H	H	4—Me
NH ₂	Me	H	H	5—Me
NH ₂	Me	H	H	4—OMe
NH ₂	Me	H	H	4—SMe

[0166] [第8表]

[0167]

[化22]



[0168] Vは、前記一般式(27)と同じである。

[0169] $R_1 = CF_3$ 、 $R_3 = R_4 = H$ 、 $X = H$

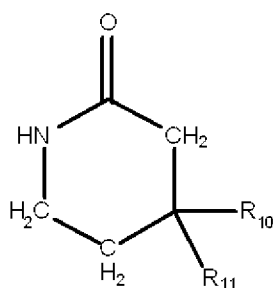
G	$R_{5'}$	$R_{6'}$	$R_{7'}$	$R_{8'}$
NO_2	Me	Me	Me	H
NO_2	Me	H	Me	Me
NO_2	Me	Me	Me	Me

NO ₂	Me	Et	Me	H
NO ₂	Me	Me	Et	H
NO ₂	Me	H	Me	Et
NO ₂	Et	H	Me	Me
NO ₂	Me	Et	Me	Me
NO ₂	Me	Me	Me	Et
NH ₂	Me	Me	Me	H
NH ₂	Me	H	Me	Me
NH ₂	Me	Me	Me	Me
NH ₂	Me	Et	Me	H
NH ₂	Me	Me	Et	H
NH ₂	Me	H	Me	Et
NH ₂	Et	H	Me	Me
NH ₂	Me	Et	Me	Me
NH ₂	Me	Me	Me	Et

[0170] 〔第9表〕

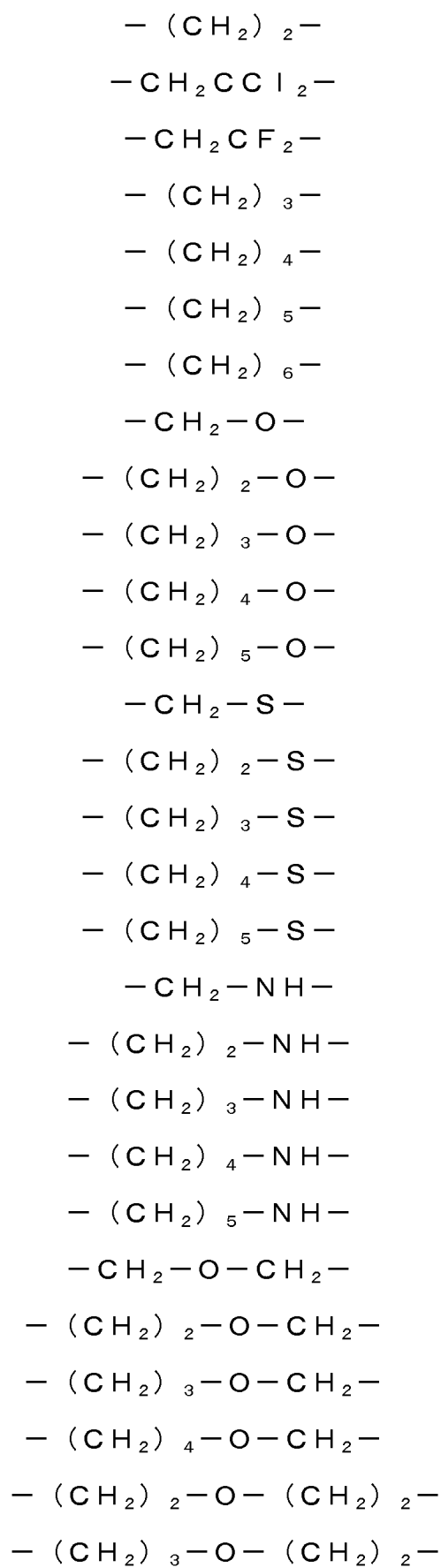
[0171] 一般式 (3)

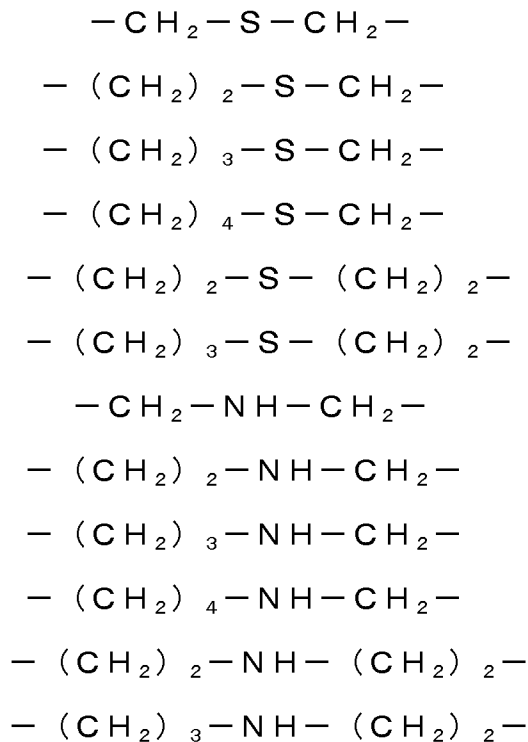
[0172] 〔化23〕



[0173] _____

R₁₀R₁₁





[0174] 本発明化合物の除草剤としての施用薬量は、適用場面、施用時期、施用方法、対象雑草及び栽培作物等により差異はあるが、一般には有効成分量としてヘクタール（ha）当たり0.001乃至50kg程度、好ましくは0.01乃至10kg程度が適当である。

本発明化合物は水田用の除草剤として、湛水下の土壌処理及び茎葉処理のいずれの処理方法においても使用できる。

[0175] 水田雑草としては、例えば、ヒルムシロ（*Potamogeton distinctus*）等に代表されるヒルムシロ科（*Potamogetonaceae*）雑草、ヘラオモダカ（*Alisma canaliculatum*）、ウリカワ（*Sagittaria pygmaea*）及びオモダカ（*Sagittaria trifolia*）等に代表されるオモダカ科（*Alismataceae*）雑草、アゼガヤ（*Leptochloa chinensis*）、イヌビエ（*Echinochloa crus-galli*）、タイヌビエ（*Echinochloa oryzicola*）、アシカキ（*Homalocenchrus japonicus*）及びキシユ

ウスズメノヒエ (*Paspalum distichum*) 等に代表されるイネ科 (*Gramineae*) 雑草、クログワイ (*Eleocharis kuroguwai*)、ホタルイ (*Scirpus juncooides*)、シズイ (*Scirpus nipponicus*)、ミズガヤツリ (*Cyperus serotinus*)、タマガヤツリ (*Cyperus difformis*) 及びヒナガヤツリ (*Cyperus hakonensis*) 等に代表されるカヤツリグサ科 (*Cyperaceae*) 雑草、ウキクサ (*Spirodela polyrhiza*) 及びアオウキクサ (*Lemna paucicostata*) 等に代表されるウキクサ科 (*Lemnaceae*) 雑草、イボクサ (*Murdannia keisak*) 等に代表されるツユクサ科 (*Commelinaceae*) 雑草、ミズアオイ (*Monochoria korsakowii*) 及びコナギ (*Monochoria vaginalis*) 等に代表されるミズアオイ科 (*Pontederiaceae*) 雑草、ミゾハコベ (*Elatine triandra*) 等に代表されるミゾハコベ科 (*Elatinaceae*) 雑草、ヒメミソハギ (*Ammannia multiflora*) 及びキカシグサ (*Rotala indica*) 等に代表されるミソハギ科 (*Lythraceae*) 雑草、チョウジタデ (*Lidwigia epilobioides*) 等に代表されるアカバナ科 (*Oenotheraceae*) 雑草、アブノメ (*Dopatrium junceum*)、オオアブノメ (*Gratiola japonica*)、キクモ (*Limnophila sessilifolia*)、アゼナ (*Lindernia pyxidaria*) 及びアメリカアゼナ (*Lindernia dubia*) 等に代表されるゴマノハグサ科 (*Scrophulariaceae*) 雑草、クサネム (*Aeschynomene indica*) 等に代表されるマメ科 (*Leguminosae*) 雑草、並びにアメリカセンダングサ (*Bidens frondosa*) 及びタウコギ (*Bidens tripartita*) 等に代表されるキク科 (*Compositae*) 雑草等が挙げられる。

[0176] また、本発明化合物は、畑地用の除草剤として、土壌処理、土壌混和处理及び茎葉処理のいずれの処理方法においても使用できる。

畑地雑草としては、例えば、イヌホウズキ (*Solanum nigrum*) 及びチヨウセンアサガオ (*Datura stramonium*) 等に代表されるナス科 (*Solanaceae*) 雑草、イチビ (*Abutilon theophrasti*) 及びアメリカキンゴジカ (*Sida spinosa*) 等に代表されるアオイ科 (*Malvaceae*) 雑草、マルバアサガオ (*Ipomoea purpurea*) 等のアサガオ類 (*Ipomoea* spp.) 及びヒルガオ類 (*Calystegia* spp.) 等に代表されるヒルガオ科 (*Convolvulaceae*) 雑草、イヌビユ (*Amaranthus lividus*) 及びアオビユ (*Amaranthus retroflexus*) 等に代表されるヒユ科 (*Amaranthaceae*) 雑草、オナモミ (*Xanthium pensylvanicum*)、ブタクサ (*Ambrosia artemisiaefolia*)、ヒマワリ (*Helianthus annuus*)、ハキダメギク (*Galinsoga ciliata*)、セイヨウトゲアザミ (*Cirsium arvense*)、ノボロギク (*Senecio vulgaris*) 及びヒメジョオン (*Erigeron annuus*) 等に代表されるキク科 (*Compositae*) 雑草、イヌガラシ (*Rorippa indica*)、ノハラガラシ (*Sinapis arvensis*) 及びナズナ (*Capsella Bursapastoris*) 等に代表されるアブラナ科 (*Cruciferae*) 雑草、イヌタデ (*Polygonum Blumei*) 及びソバカズラ (*Polygonum convolvulus*) 等に代表されるタデ科 (*Polygonaceae*) 雑草、スベリヒユ (*Portulaca oleracea*) 等に代表されるスベリヒユ科 (*Portulacaceae*) 雑草、シロザ (*Chenopodium album*)、コアカザ (*Chenopodium ficifolium*) 及びホウキギ (*Kochia scoparia*) 等に代表されるアカザ科 (*Ch*

enopodiaceae) 雑草、ハコベ (*Stellaria media*) 等に代表されるナデシコ科 (*Caryophyllaceae*) 雑草、オオイヌノフグリ (*Veronica persica*) 等に代表されるゴマノハグサ科 (*Scrophulariaceae*) 雑草、ツユクサ (*Commelina communis*) 等に代表されるツユクサ科 (*Commelinaceae*) 雑草、ホトケノザ (*Lamium amplexicaule*) 及びヒメオドリコソウ (*Lamium purpureum*) 等に代表されるシソ科 (*Labiatae*) 雑草、コニシキソウ (*Euphorbia supina*) 及びオオニシキソウ (*Euphorbia maculata*) 等に代表されるトウダイグサ科 (*Euphorbiaceae*) 雑草、ヤエムグラ (*Galium spurium*) 及びアカネ (*Rubia akane*) 等に代表されるアカネ科 (*Rubiaceae*) 雑草、スミレ (*Viola mandshurica*) 等に代表されるスミレ科 (*Violaceae*) 雑草並びにアメリカツノクサネム (*Sesbania exaltata*) 及びエビスグサ (*Cassia obtusifolia*) 等に代表されるマメ科 (*Leguminosae*) 雑草、カタバミ (*Oxalis corniculata*) に代表されるカタバミ科 (*Oxalidaceae*) 雑草等の広葉 (*Broad-leaved weeds*) 雑草。野生ソルガム (*Sorghum bicolor*)、オオクサキビ (*Panicum dichotomiflorum*)、ジョンソングラス (*Sorghum halepense*)、イヌビエ (*Echinochloa crus-galli* var. *crus-galli*)、ヒメイヌビエ (*Echinochloa crus-galli* var. *pratensis*)、栽培ビエ (*Echinochloa utilis*)、メヒシバ (*Digitaria ciliaris*)、カラスムギ (*Avena fatua*)、ブラックグラス (*Alopecurus myosuroides*)、オヒシバ (*Eleusine indica*)、エノコログサ (*Setaria viridis*)、アキノエノコログサ (*S*

etaria faberi) 及びスズメノテッポウ (Alopecurus aequalis) 等に代表されるイネ科 (Graminaceous weeds) 雑草並びにハマスゲ (Cyperus rotundus, Cyperus esculentus) 等に代表されるカヤツリグサ科 (Cyperaceous weeds) 雑草等が挙げられる。

- [0177] また、本発明化合物は、水田、畑地及び果樹園等の農園芸分野以外に芝地、運動場、空地、道路脇及び線路端等非農耕地において、土壌処理、土壌混和処理及び茎葉処理のいずれの処理方法においても使用できる。その雑草としては、畑地及び果樹園用雑草で述べたものに加えて、スズメノカタビラ (Poa annua)、セイヨウタンポポ (Taraxacum officinale)、オオアレチノギク (Conyza sumatrensis)、タネツケバナ (Cardamine flexuosa)、シロツメクサ (Trifolium repens)、チドメグサ (Hydrocotyle sibthorpioides)、オオバコ (Plantago asiatica)、ヒメクグ (Cyperus brevifolius, Kyllinga brevifolia) 及びスギナ (Equisetum arvense) 等が挙げられる。

本発明化合物は、通常の田植え前及び田植え後の処理に加えて、田植え同時処理に供しても良い。

- [0178] 本発明化合物は必要に応じて製剤又は散布時に他種の除草剤、各種殺虫剤、殺菌剤、植物生長調節剤又は共力剤等と混合施用しても良い。

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

- [0179] 本発明化合物と混合使用されるのに好ましい除草剤としては、例えば、ピラゾスルフロンエチル (pyrazosulfuron-ethyl/一般名)、ベンスルフロンメチル (bensulfuron-methyl/一

般名)、シノスルフロン(cinosulfuron/一般名)、イマゾスルフロン(imazosulfuron/一般名)、アジムスルフロン(azimsulfuron/一般名)、ハロスルフロンメチル(halosulfuron-methyl/一般名)、プレチラクロール(pretilachlor/一般名)、エスプロカルブ(esprocarb/一般名)、ピラゾリネート(pyrazolinate/一般名)、ピラゾキシフェン(pyrazoxyfen/一般名)、ベンゾフェナップ(benzofenap/一般名)、ダイムロン(daimuron/一般名)、ブロモブチド(bromobutide/一般名)、ナプロアニリド(naproanilide/一般名)、クロメプロップ(clomeprop/一般名)、CNP(一般名)、クロメトキシニル(chlomethoxyinil/一般名)、ビフェノックス(bifenox/一般名)、オキサジアゾン(oxadiazon/一般名)、オキサジアルギル(oxadiargyl/一般名)、カルフェントラゾンエチル(Carfentrazone-ethyl)、カフェンストロール(cafenstrole/一般名)、オキサジクロメホン(oxaziclomefone/一般名)、インダノファン(indanofan/一般名)、ペントキサゾン(pentoxazone/一般名)、ピリミノバックメチル(pyriminobac-methyl/一般名)、シハロホップブチル(cyhalofop-butyl/一般名)、フェントラザミド(fentrazamide/一般名)、メフェナセット(mefenacet/一般名)、ブタクロール(butachlor/一般名)、ブテナクロール(butenachlor/一般名)、ジチオピル(dithiopyl/一般名)、ベンフレセート(benfuresate/一般名)、ピリブチカルブ(pyributicarb/一般名)、ベンチオカーブ(benthiocarb/一般名)、ジメピペレート(dimepiperate/一般名)、モリネート(molinate/一般名)、ブタミフォス(butamifos/一般名)、キンクロラック(quinclorac/一般名)、シンメスリン(cinmet

hylin／一般名)、シメトリン(simetryn／一般名)、ベンスリド(bensulide／一般名)、ジメタメトリン(dimethametryn／一般名)、2,4-D、MCPA、MCPB、エトベンズアニド(etobenzanid)、クミルロン(cumyluron／一般名)、テニルクロール(thenylchlor／一般名)、エトキシスルフロン(ethoxysulfuron／一般名)、キノクラミン(quinoclamine／一般名)、ベンタゾン(Bentazone／一般名)、ベンゾビシクロン(benzobicyclon／一般名)、ピリフタリド(pyriфтаlid／一般名)、ビスピリバック(bispyribac)、ピラクロニル(pyraclonil／一般名)、アニロホス(anilofos／一般名)、OK-701(試験名)、シクロスルフアムロン(cyclosulfamuron／一般名)、ペノキススラム(penoxsulam／一般名)、テフリルトリオン(tefuryltrione／一般名)、ピリミスルファン(pyrimisulfan／一般名)、プロピリスルフロン(propyrisulfuron／一般名)、NC-620(試験名)、メソトリオン(mesotrion／一般名)、フルセトスルフロン(flucetosulfuron／一般名)、オルソスルフアムロン(orthosulfamuron／一般名)、プロパニル(propanil／一般名)、メタミホップ(metamifop／一般名)、エトベンザニド(etobenzanide／一般名)、KUH-071(試験名)及びイプフェンカルバゾン(ipfencarbazone／一般名)等が挙げられる。

[0180] 本発明化合物を除草剤として施用するにあたっては、一般には適当な固体担体又は液体担体と混合して、更に所望により界面活性剤、浸透剤、展着剤、増粘剤、凍結防止剤、結合剤、固結防止剤又は分解防止剤等を添加し、液剤、乳剤、水和剤、ドライフロアブル剤、フロアブル剤、粉剤又は粒剤等の任意の剤型にて実用に供することができる。

また、省力化及び安全性向上の観点から、上記任意の剤型の製剤を水溶性

包装体に封入して供することもできる。

[0181] 固体担体としては、例えばカオリナイト、パイロフィライト、セリサイト、タルク、ベントナイト、酸性白土、アタパルジャイト、ゼオライト及び珪藻土等の天然鉱物質類、炭酸カルシウム、硫酸アンモニウム、硫酸ナトリウム及び塩化カリウム等の無機塩類、合成珪酸、並びに合成珪酸塩等が挙げられる。

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

これら固体及び液体担体は、単独で用いても2種以上を併用してもよい。

[0182] 界面活性剤としては、例えばポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル、ポリオキシエチレンステリルフェニルエーテル、ポリオキシエチレンポリオキシプロピレンブロックコポリマー、ポリオキシエチレン脂肪酸エステル、ソルビタン脂肪酸エステル及びポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル等の非イオン性界面活性剤、並びにアルキルベンゼンスルホン酸塩、リグニンスルホン酸塩、アルキルスルホコハク酸塩、ナフタレンスルホン酸塩、アルキルナフタレンスルホン酸塩、ナフタレンスルホン酸のホルマリン縮合物の塩、アルキルナフタレンスルホン酸のホルマリン縮合物の塩、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル硫酸又は燐酸塩、ポリオキシエチレンステリルフェニルエーテル硫酸又は燐酸塩及びアルキルアミン塩等のイオン性界面活性剤が挙げられる。

これら界面活性剤の含有量は、特に限定されるものではないが、本発明の製剤100重量部に対し、通常0.05乃至20重量部の範囲が望ましい。

また、これら界面活性剤は、単独で用いても2種以上を併用してもよい。

[0183] 次に本発明化合物を用いる場合の製剤の配合例を示す。但し本発明の配合

例は、これらのみに限定されるものではない。尚、以下の配合例において「部」は重量部を意味する。

水和剤

本発明化合物	0.1 乃至 80 部
固体担体	5 乃至 98.9 部
界面活性剤	1 乃至 10 部
その他	0 乃至 5 部

その他として、例えば固結防止剤、分解防止剤等が挙げられる。

[0184] 乳 剤

本発明化合物	0.1 乃至 30 部
液体担体	5.5 乃至 95 部
界面活性剤	4.9 乃至 15 部

[0185] フロアブル (flowable) 剤

本発明化合物	0.1 乃至 70 部
液体担体	1.5 乃至 98.89 部
界面活性剤	1 乃至 12 部
その他	0.01 乃至 30 部

その他として、例えば凍結防止剤、増粘剤等が挙げられる。

[0186] ドライフロアブル (dry flowable) 剤

本発明化合物	0.1 乃至 90 部
固体担体	0 乃至 98.9 部
界面活性剤	1 乃至 20 部
その他	0 乃至 10 部

その他として、例えば結合剤、分解防止剤等が挙げられる。

[0187] 液 剤

本発明化合物	0.01 乃至 30 部
液体担体	0.1 乃至 50 部
水	50 乃至 99.89 部

その他 0 乃至 10 部

その他として、例えば凍結防止剤等、展着剤等が挙げられる。

[0188] 粒 剤

本発明化合物 0.01 乃至 10 部

固体担体 90 乃至 99.99 部

その他 0 乃至 10 部

その他として、例えば結合剤、分解防止剤等が挙げられる。

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

[0189] 製剤例

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

〔配合例 1〕水和剤

本発明化合物 I-1 20 部

パイロフィライト 76 部

ソルポール 5039 2 部

(非イオン性界面活性剤とアニオン性界面活性剤との混合物：東邦化学工業社製、商品名)

カープレックス #80 2 部

(合成含水珪酸：塩野義製薬社製、商品名)

以上を均一に混合粉碎して水和剤とする。

[0190] 〔配合例 2〕乳 剤

本発明化合物 I-1 5 部

キシレン 75 部

N-メチルピロリドン 15 部

ソルポール 2680 5 部

(非イオン性界面活性剤とアニオン性界面活性剤との混合物：東邦化学工業

社製、商品名)

以上を均一に混合して乳剤とする。

[0191] 〔配合例3〕フロアブル剤

本発明化合物 I-1 25部

アグリゾールS-710 10部

(非イオン性界面活性剤：花王社製、商品名)

ルノックス1000C 0.5部

(アニオン性界面活性剤：東邦化学工業社製、商品名)

キサンタンガム 0.02部

水 64.48部

以上を均一に混合した後、湿式粉碎してフロアブル剤とする。

[0192] 〔配合例4〕ドライフロアブル剤

本発明化合物 I-1 75部

ハイテノールNE-15 5部

(アニオン性界面活性剤：第一工業製薬社製、商品名)

バニレックスN 10部

(アニオン性界面活性剤：日本製紙社製、商品名)

カープレックス#80 10部

(合成含水珪酸：塩野義製薬社製、商品名)

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

[0193] 〔配合例5〕粒剤

本発明化合物 I-1 1部

ベントナイト 55部

タルク 44部

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

[0194] 〔配合例6〕粒剤

本発明化合物 I - 1	1 部
化合物 (A)	0. 07 部
DBSN	3 部
エポキシ化大豆油	1 部
ベントナイト	30 部
タルク	64. 93 部

尚、上記のDBSNはドデシルベンゼンスルホン酸ナトリウムを意味する。

[0195] 以下に本発明化合物の合成例を実施例として具体的に述べるが、本発明はこれらに限定して解釈されるものではない。

実施例

[0196] 〔実施例 1〕

1 - [2 - (N - エトキシカルボニル - N - トリフルオロメタンスルホニル) アミノベンジル] ピペリジン - 2 - オン (本発明化合物 III - 9) の合成工程 1 ;

1, 1, 1 - トリフルオロ - N - [2 - (ヒドロキシメチル) フェニル] メタンスルホンアミドの合成

[1, 1, 1-trifluoro-N-[2-(hydroxymethyl)phenyl]methanesulfonamid] の合成

2 - アミノベンジルアルコール (4. 0 g、32. 5 mmol) をクロロホルム 60 ml に溶解し、0℃に冷却した中に、トリエチルアミン (3. 94 g、39. 0 mmol) を加え、トリフルオロメタンスルホン酸無水物 (11. 0 g、39. 0 mmol) を攪拌下滴下した。反応液を徐々に室温まで上昇させながら、さらに 4 時間攪拌した。反応終了後、クロロホルムと水を加え、有機層を分離した後、有機層を水洗、飽和食塩水、無水硫酸ナトリウムの順で乾燥後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n - ヘキサン / 酢酸エチル = 9 / 1 ~ 1 / 1 (体積比、以下同じである。)) で精製し、目的物 5. 13 g を得た。

[0197] 工程 2 ;

1- (2-トリフルオロメタンスルホニルアミノベンジル) ピペリジン-2-オン (本発明化合物III-1) の合成

[1-(2-trifluoromethanesulfonylaminobenzyl)piperidine-2-one] の合成

1, 1, 1-トリフルオロ-N- [2- (ヒドロキシメチル) フェニル] メタンスルホンアミド (500 mg、1.96 mmol) をトルエン10 ml に溶解した中に、2-ピペリジノン (232 mg、2.35 mmol)、及びp-トルエンスルホン酸一水和物 (169 mg、0.98 mmol) を加え、Dean-Stark反応装置を用いて共沸脱水しながら、加熱還流下6時間撹拌した。反応終了後、クロロホルムと水を加え、有機層を分離した後、有機層を水洗、飽和食塩水、無水硫酸ナトリウムの順で乾燥後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル=9/1~1/1) で精製し、目的物 (本発明化合物III-1) 70 mg を淡黄色固体として得た。

[0198] 工程3 ;

1- [2- (N-エトキシカルボニル-N-トリフルオロメタンスルホニル) アミノベンジル] ピペリジン-2-オン (本発明化合物III-9) の合成
[1-[2-(N-ethoxycarbonyl-N-trifluoromethanesulfonyl)aminobenzyl]piperidine-2-one] の合成

63重量%水素化ナトリウム (鉱油中に分散、7 mg、0.18 mmol) をテトラヒドロフラン5 ml に懸濁させ、氷冷撹拌下1- (2-トリフルオロメタンスルホニルアミノベンジル) ピペリジン-2-オン (40 mg、0.12 mmol) を加えて室温にて5分間撹拌した。次に、クロロギ酸エチル (20 mg、0.18 mmol) を氷冷撹拌下ゆっくりと滴下し、徐々に室温まで上昇させながら、さらに16時間撹拌した。反応終了後、クロロホルムと水を加え、有機層を分離した後、有機層を飽和食塩水、無水硫酸ナトリウムの順で乾燥後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル=9/1~4/1) で精製し、目的物 (本発明化合物III-9) 35 mg を白色固体として得た。

[0199] 〔実施例 2〕

1- [2- (N-エトキシカルボニル-N-トリフルオロメタンスルホニル) アミノベンジル] -4, 4-ジメチルピペリジン-2-オン (本発明化合物III-58) の合成

工程 1 ;

4, 4-ジメチル-1- (2-ニトロベンジル) ピペリジン-2, 6-ジオンの合成

[4, 4-dimethyl-1-(2-nitrobenzyl)piperidine-2, 6-dione] の合成

3, 3-ジメチルグルタルイミド (3. 0 g、21. 3 mmol) をジメチルホルムアミド 20 ml に溶解し、炭酸カリウム (4. 41 g、31. 9 mmol) と 2-ニトロベンジルブロミド (4. 59 g、21. 3 mmol) を加えて、70℃で2時間攪拌した。反応終了後、酢酸エチルと飽和塩化アンモニウム水溶液を加え、有機層を分離した後、有機層を水洗し、飽和食塩水、無水硫酸ナトリウムの順で乾燥後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル=9/1~1/1) で精製し、目的物 4. 80 g を淡黄色固体として得た。

[0200] 工程 2 ;

6-ヒドロキシ-4, 4-ジメチル-1- (2-ニトロベンジル) ピペリジン-2-オンの合成

[6-hydroxy-4, 4-dimethyl-1-(2-nitrobenzyl)piperidine-2-one] の合成

水素化ホウ素ナトリウム (13. 7 g、362 mmol) をテトラヒドロフラン 150 ml に懸濁させ、0℃で攪拌下、4, 4-ジメチル-1- (2-ニトロベンジル) ピペリジン-2, 6-ジオン (5. 0 g、18. 1 mmol) のテトラヒドロフラン 50 ml 溶液を加え、さらに水 15 ml を加えた。反応液を室温まで昇温して1時間攪拌した。反応終了後、反応液を0℃で攪拌下、ゆっくりと飽和塩化アンモニウム水溶液 100 ml に加えた。減圧下濃縮後、酢酸エチルを加え、有機層を分離した後、有機層を水洗し、飽和食塩水、無水硫酸ナトリウムの順で乾燥後、減圧下濃縮した。得られた残渣

をシリカゲルクロマトグラフィー(*n*-ヘキサン/酢酸エチル=9/1~1/2)で精製し、目的物2.31gを淡黄色固体として得た。

[0201] 工程3；

4,4-ジメチル-1-(2-ニトロベンジル)ピペリジン-2-オン(製造中間体XI-9)の合成

[4,4-dimethyl-1-(2-nitrobenzyl)piperidine-2-one]の合成

6-ヒドロキシ-4,4-ジメチル-1-(2-ニトロベンジル)ピペリジン-2-オン(1.3g、4.67mmol)をトリフルオロ酢酸12mLに溶解し、0℃で攪拌下、トリエチルシラン(815mg、7.01mmol)を加えて、室温で2時間攪拌した。反応終了後、減圧下濃縮し、酢酸エチルと飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、有機層を分離した後、有機層を水洗し、飽和食塩水、無水硫酸ナトリウムの順で乾燥後、減圧下濃縮することにより目的物(製造中間体XI-9)1.20gを黄色固体として得た。

[0202] 工程4；

1-(2-アミノベンジル)-4,4-ジメチルピペリジン-2-オン(製造中間体XI-10)の合成

[1-(2-aminobenzyl)-4,4-dimethylpiperidine-2-one]の合成

4,4-ジメチル-1-(2-ニトロベンジル)ピペリジン-2-オン(1.2g、4.57mmol)をエタノール9mLと水3mLの混合溶媒に溶解し、還元鉄(1.02g、18.3mmol)、及び塩化アンモニウム(122mg、2.29mmol)を加えて、加熱還流下1時間攪拌した。反応終了後、反応液を室温に冷却後セライトろ過し、酢酸エチルで洗浄した。有機層を分離した後、有機層を水洗し、飽和食塩水、無水硫酸ナトリウムの順で乾燥後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(*n*-ヘキサン/酢酸エチル=9/1~1/2)で精製し、目的物(製造中間体XI-10)900mgを得た。

[0203] 工程5；

4,4-ジメチル-1-(2-トリフルオロメタンスルホニルアミノベンジ

ル) ピペリジン-2-オン (本発明化合物III-46) の合成

[4,4-dimethyl-1-(2-trifluoromethanesulfonylaminobenzyl)piperidine-2-one] の合成

1-(2-アミノベンジル)-4,4-ジメチルピペリジン-2-オン (650 mg、2.80 mmol) をジクロロメタン 10 ml に溶解し、0°C に冷却した。該溶液にトリエチルアミン (850 mg、8.40 mmol) を加え、トリフルオロメタンスルホン酸無水物 (1.58 g、5.60 mmol) の 5 ml ジクロロメタン溶液を攪拌下滴下し、徐々に室温まで昇温させながら、1 時間攪拌した。反応終了後、1 N 塩酸、クロロホルムを加えて有機層を分離した後、有機層を水洗し、飽和食塩水、無水硫酸ナトリウムの順で乾燥後、減圧下濃縮して得られた残渣にジオキサン 10 ml を加え、さらにテトラブチルアンモニウムヒドロキシド水溶液 (40%、3.63 g、5.60 mmol) を加え室温で 2 時間攪拌した。反応終了後、酢酸エチルと 1 N 塩酸を加え、有機層を分離した後、有機層を水洗し、飽和食塩水、無水硫酸ナトリウムの順で乾燥後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル=4/1~1/2) で精製し、目的物 (本発明化合物III-46) 650 mg を淡黄色固体として得た。

[0204] 工程 6 ;

1-[2-(N-エトキシカルボニル-N-トリフルオロメタンスルホニル)アミノベンジル]-4,4-ジメチルピペリジン-2-オン (本発明化合物III-58) の合成

[1-[2-(N-ethoxycarbonyl-N-trifluoromethanesulfonyl)aminobenzyl]-4,4-dimethylpiperidine-2-one] の合成

4,4-ジメチル-1-(2-トリフルオロメタンスルホニルアミノベンジル)ピペリジン-2-オン (100 mg、0.27 mmol) をアセトニトリル 5 ml に溶解し、炭酸水素ナトリウム (120 mg、1.43 mmol)、及びクロロギ酸エチル (0.14 g、1.29 mmol) を加え、加

熱還流下2時間撹拌した。反応終了後、酢酸エチルと水を加えて有機層を分離した後、有機層を水洗し、飽和食塩水、無水硫酸ナトリウムの順で乾燥後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（*n*-ヘキサン／酢酸エチル＝9／1～1／1）で精製し、目的物（本発明化合物III-58）90mgを白色固体として得た。

[0205] 〔実施例3〕

1-[2-(*N*-シクロプロピルカルボニル-*N*-トリフルオロメタンスルホニル)アミノベンジル]-4,4-ジメチルピペリジン-2-オン（本発明化合物III-51）の合成

[1-[2-(*N*-cyclopropylcarbonyl-*N*-trifluoromethanesulfonyl)aminobenzyl]-4,4-dimethylpiperidine-2-one]の合成

水素化ナトリウム（63%）（40mg、1.05mmol）をテトラヒドロフラン3mlに懸濁させ、氷冷撹拌下4,4-ジメチル-1-(2-トリフルオロメタンスルホニルアミノベンジル)ピペリジン-2-オン（160mg、0.44mmol）を加えて0℃のまま5分間撹拌した。次に、シクロプロパンカルボニルクロリド（70mg、0.67mmol）を撹拌下ゆっくりと滴下し、徐々に室温まで上昇させながら、さらに一晩撹拌した。反応終了後、酢酸エチルと飽和塩化アンモニウム水溶液を加え、有機層を分離した後、有機層を飽和食塩水、無水硫酸ナトリウムの順で乾燥後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（*n*-ヘキサン／酢酸エチル＝9／1～3／1）で精製し、目的物（本発明化合物III-51）140mgを白色固体として得た。

[0206] 〔実施例4〕

1-[2-(*N*-エトキシカルボニル-*N*-トリフルオロメタンスルホニル)アミノベンジル]-4-メチルピペリジン-2-オン（本発明化合物III-22）の合成

工程1；

4-メチル-1-(2-ニトロベンジル)ピペリジン-2,6-ジオンの合

成

[4-methyl-1-(2-nitrobenzyl)piperidine-2,6-dione]の合成

3-メチルグルタル酸無水物 (2.0 g、15.6 mmol) をテトラヒドロフラン 20 ml に溶解し、2-ニトロベンジルアミン塩酸塩 (2.94 g、15.6 mmol) を加えて、氷冷攪拌下トリエチルアミン (3.32 g、32.8 mmol) を滴下した。反応液を室温にして2時間攪拌した。反応終了後、反応液を減圧下濃縮し、氷冷攪拌下3 N塩酸を注意深く加えて酸性とした。さらに、酢酸エチルを加え、有機層を分離した後、有機層を水洗し、飽和食塩水、無水硫酸ナトリウムの順で乾燥後、減圧下濃縮した。得られた残渣に無水酢酸 10 ml とトリエチルアミン 2 ml を加え、80℃にて2時間攪拌した。反応終了後、反応液を減圧下濃縮し、氷冷攪拌下3 N塩酸を注意深く加えて酸性とした。さらに、酢酸エチルを加え、有機層を分離した後、有機層を水洗し、飽和食塩水、無水硫酸ナトリウムの順で乾燥後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル = 9/1 ~ 1/1) で精製し、目的物 3.42 g を淡黄色固体として得た。

[0207] 工程 2 ;

6-ヒドロキシ-4-メチル-1-(2-ニトロベンジル)ピペリジン-2-オンの合成 [6-hydroxy-4-methyl-1-(2-nitrobenzyl)piperidine-2-one] の合成

水素化ホウ素ナトリウム (1.2 g、31.7 mmol) をテトラヒドロフラン 20 ml に懸濁させ、0℃で攪拌下4-メチル-1-(2-ニトロベンジル)ピペリジン-2,6-ジオン (1.66 g、6.33 mmol) のテトラヒドロフラン 10 ml 溶液を加え、さらに水 3 ml を加えた。0℃に保ったまま6時間攪拌した。反応終了後、反応液を0℃でゆっくりと、1 N塩酸 30 ml に攪拌下加えた。減圧下濃縮後、酢酸エチルを加え、有機層を分離した後、有機層を水洗し、飽和食塩水、無水硫酸ナトリウムの順で乾燥後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (n-ヘキ

サン／酢酸エチル＝9／1～1／2)で精製し、目的物0.82gを淡黄色固体として得た。

[0208] 工程3；

4-メチル-1-(2-ニトロベンジル)ピペリジン-2-オン(製造中間体X I-1)の合成

[4-methyl-1-(2-nitrobenzyl)piperidine-2-one]の合成

6-ヒドロキシ-4-メチル-1-(2-ニトロベンジル)ピペリジン-2-オン(0.52g、1.97mmol)をトリフルオロ酢酸5mlに溶解し、0℃で攪拌下トリエチルシラン(0.35g、3.01mmol)を加えて、室温で1時間攪拌した。反応終了後、減圧下濃縮し、酢酸エチルと飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、有機層を分離した後、有機層を水洗し、飽和食塩水、無水硫酸ナトリウムの順で乾燥後、減圧下濃縮することにより目的物(製造中間体X I-1)0.40gを黄色固体として得た。

[0209] 工程4；

1-(2-アミノベンジル)-4-メチルピペリジン-2-オン(製造中間体X I-2)の合成

[1-(2-aminobenzyl)-4-methylpiperidine-2-one]の合成

4-メチル-1-(2-ニトロベンジル)ピペリジン-2-オン(0.4g、1.61mmol)をエタノール5mlと水2mlの混合溶媒に溶解し、還元鉄(0.4g、7.16mmol)、及び塩化アンモニウム(40mg、0.75mmol)を加えて、加熱還流下2時間攪拌した。反応終了後、反応液を室温に冷却後セライトろ過し、酢酸エチルで洗浄した。有機層を分離した後、有機層を水洗し、飽和食塩水、無水硫酸ナトリウムの順で乾燥後、減圧下濃縮することにより目的物(製造中間体X I-2)350mgを得た。

[0210] 工程5；

4-メチル-1-(2-トリフルオロメタンスルホニルアミノベンジル)ピペリジン-2-オン(本発明化合物III-19)の合成

[4-methyl-1-(2-trifluoromethanesulfonylaminobenzyl)piperidine-2-one]

の合成

1- (2-アミノベンジル) -4-メチルピペリジン-2-オン (350 mg、1.60 mmol) をジクロロメタン 8 ml に溶解し、0°C に冷却した。トリエチルアミン (490 mg、4.84 mmol) を加え、トリフルオロメタンスルホン酸無水物 (0.90 g、3.19 mmol) の 3 ml ジクロロメタン溶液を攪拌下滴下し、徐々に室温まで昇温させながら 1 時間攪拌した。反応終了後、1 N 塩酸、及びクロロホルムを加えて有機層を分離した後、有機層を水洗し、飽和食塩水、無水硫酸ナトリウムの順で乾燥後、減圧下濃縮して得られた残渣に 1, 4-ジオキサン 8 ml を加え、テトラブチルアンモニウムヒドロキシド水溶液 (40%、2.08 g、3.21 mmol) を加え室温で 2 時間攪拌した。反応終了後、酢酸エチルと 1 N 塩酸を加え、有機層を分離した後、有機層を水洗し、飽和食塩水、無水硫酸ナトリウムの順で乾燥後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル=4/1~1/2) で精製し、目的物 (本発明化合物 III-19) 250 mg を得た。

[0211] 工程 6 ;

1- [2- (N-エトキシカルボニル-N-トリフルオロメタンスルホニル) アミノベンジル] -4-メチルピペリジン-2-オン (本発明化合物 III-22) の合成

[1-[2-(N-ethoxycarbonyl-N-trifluoromethanesulfonyl) aminobenzyl]-4-methylpiperidine-2-one] の合成

4-メチル-1- (2-トリフルオロメタンスルホニルアミノベンジル) ピペリジン-2-オン (50 mg、0.14 mmol) をアセトニトリル 5 ml に溶解し、炭酸水素ナトリウム (40 mg、0.48 mmol) 、及びクロロギ酸エチル (30 mg、0.28 mmol) を加え、加熱還流下 2 時間攪拌した。反応終了後、酢酸エチルと水を加えて有機層を分離した後、有機層を水洗し、飽和食塩水、無水硫酸ナトリウムの順で乾燥後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン

／酢酸エチル＝9／1～1／1）で精製し、目的物（本発明化合物III-22）40mgを白色固体として得た。

[0212] 〔実施例5〕

1-[2-(N-エトキシカルボニル-N-トリフルオロメタンスルホニル)アミノベンジル]-3-エチルピペリジン-2-オン（本発明化合物IV-9）の合成

工程1；

3-エチルピペリジン-2-オンの合成

[3-ethylpiperidine-2-one]の合成

2-ピペリジノン（2.25g、22.7mmol）をテトラヒドロフラン50mlに溶解し、窒素雰囲気下、-78℃にてn-ブチルリチウム-ヘキサン溶液（1.54mol/L）（30ml、46mmol）を滴下し、反応液を0℃にして1時間攪拌した。次いで、氷冷攪拌下ヨウ化エチル（5.3g、34.1mmol）を滴下し、1時間攪拌した。反応終了後、飽和塩化アンモニウム水溶液とクロロホルムを加え、有機層を分離した後、有機層を水洗し、飽和食塩水、無水硫酸ナトリウムの順で乾燥後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィー（n-ヘキサン／酢酸エチル＝9／1～1／9）で精製し、目的物2.5gを得た。

[0213] 工程2；

3-エチル-1-(2-トリフルオロメタンスルホニルアミノベンジル)ピペリジン-2-オン（本発明化合物IV-6）の合成

[3-ethyl-1-(2-trifluoromethanesulfonylaminobenzyl)piperidine-2-one]の合成

1,1,1-トリフルオロ-N-[2-(ヒドロキシメチル)フェニル]メタンスルホンアミド（2.5g、9.83mmol）をトルエン50mlに溶解した中に、3-エチルピペリジン-2-オン（2.5g、19.7mmol）、及びp-トルエンスルホン酸一水和物（1.87g、9.83mmol）を加え、Dean-Stark反応装置を用いて共沸脱水しながら

、加熱還流下 14 時間攪拌した。反応終了後、減圧下濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（*n*-ヘキサン／酢酸エチル＝9／1～1／1）で精製し、目的物（本発明化合物Ⅴ-6）0.82 g を得た。

[0214] 工程 3 ；

1-[2-(*N*-エトキシカルボニル-*N*-トリフルオロメタンスルホニル)アミノベンジル]-3-エチルピペリジン-2-オン（本発明化合物Ⅴ-9）の合成

[1-[2-(*N*-ethoxycarbonyl-*N*-trifluoromethanesulfonyl)aminobenzyl]-3-ethylpiperidine-2-one]の合成

3-エチル-1-(2-トリフルオロメタンスルホニルアミノベンジル)ピペリジン-2-オン（200 mg、0.55 mmol）をアセトニトリル 5 ml に溶解し、炭酸水素ナトリウム（130 mg、1.64 mmol）、及びクロロギ酸エチル（180 mg、1.64 mmol）を加え、加熱還流下 2 時間攪拌した。反応終了後、酢酸エチルと水を加えて有機層を分離した後、有機層を水洗し、飽和食塩水、無水硫酸ナトリウムの順で乾燥後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（*n*-ヘキサン／酢酸エチル＝9／1～1／1）で精製し、目的物（本発明化合物Ⅴ-9）113 mg を得た。

[0215] 〔実施例 6〕

1-[2-(*N*-エトキシカルボニル-*N*-トリフルオロメタンスルホニル)アミノベンジル]-3-トリフルオロメタンスルホニルテトラヒドロピリミジン-2(1H)-オン（本発明化合物Ⅵ-4）の合成

工程 1 ；

1-(2-ニトロベンジル)テトラヒドロピリミジン-2(1H)-オン（製造中間体ⅤⅠⅠⅠ-1）の合成

[1-(2-nitrobenzyl)tetrahydropyrimidin-2(1H)-one]の合成

1,3-ジアミノプロパン（4.1 g、55.5 mmol）をジクロロメタン 30 ml に溶解し、氷冷下で 2-ニトロベンジルブロミド（3.0 g、

14. 0 mmol) を加え、室温で一晩攪拌した。反応終了後、クロロホルムと水を加え、有機層を分離した後、有機層を水洗し、飽和食塩水、無水硫酸ナトリウムの順で乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をジクロロメタン 80 ml に溶解し、4-ジメチルアミノピリジン (0.17 g、1.40 mmol)、及び 1, 1'-カルボニルビス-1H-イミダゾール (2.9 g、18.1 mmol) を加え、室温で 7 時間攪拌した。反応終了後、クロロホルムと飽和塩化アンモニウム水溶液を加え、有機層を分離した後、有機層を水洗、飽和食塩水、無水硫酸ナトリウムの順で乾燥後、減圧下濃縮した。得られた固体を酢酸エチルとイソプロピルアルコールで洗浄することにより目的物 (製造中間体 V I I I - 1) 1.57 g を淡黄色固体として得た。

[0216] 工程 2 ;

1-(2-アミノベンジル)テトラヒドロピリミジン-2(1H)-オン (製造中間体 V I I I - 2) の合成

[1-(2-aminobenzyl)tetrahydropyrimidin-2(1H)-one] の合成

1-(2-ニトロベンジル)テトラヒドロピリミジン-2(1H)-オン (1.54 g、6.55 mmol) をエタノール 30 ml に溶解し、水 15 ml、還元鉄 (1.8 g、32.7 mmol)、及び塩化アンモニウム (0.18 mg、3.27 mmol) を加え、80°C に加熱し 45 分間攪拌した。反応終了後、反応液を室温まで冷却し、不溶物をろ別した。ろ液を減圧下濃縮し、得られた残渣に酢酸エチルと水を加え、有機層を分離した後、有機層を水洗、飽和食塩水、無水硫酸ナトリウムの順で乾燥後、減圧下濃縮した。得られた固体をイソプロピルアルコールで洗浄することで目的物 (製造中間体 V I I I - 2) 0.91 g を淡黄色固体として得た。

[0217] 工程 3 ;

1, 1, 1-トリフルオロ-N-[2-[(3-トリフルオロメタンスルホニル)テトラヒドロ-2-ピリミジノン-1-イル)メチル]フェニル]-N-(トリフルオロメタンスルホニル)メタンスルホンアミド (本発明化合物 V I - 5) の合成

[1, 1, 1-trifluoro-N-[2-{(3-trifluoromethanesulfonyl)-tetrahydro-2-pyrimidinone-1-yl)methyl}phenyl]-N-(trifluoromethanesulfonyl)methanesulfonamide]の合成

1-(2-アミノベンジル)テトラヒドロピリミジン-2(1H)-オン(200mg、0.974mmol)をジクロロメタン5mlに溶解し、トリエチルアミン(395mg、3.90mmol)を加え0℃に冷却した。次いでトリフルオロメタンスルホン酸無水物(825mg、2.92mmol)をジクロロメタン1mlに溶解した溶液を攪拌下滴下し、徐々に室温へ昇温させ3時間攪拌した。反応終了後、クロロホルムと水を加え有機層を分離した後、有機層を水洗、飽和食塩水、無水硫酸ナトリウムの順で乾燥後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(n-ヘキサン/酢酸エチル=15/1~1/3)で精製し、目的物(本発明化合物VI-5) 173mgを得た。

[0218] 工程4；

1-(2-トリフルオロメタンスルホニル)アミノベンジル]-3-トリフルオロメタンスルホニルテトラヒドロピリミジン-2(1H)-オン(本発明化合物VI-3)の合成

[1-(2-trifluoromethanesulfonyl)aminobenzyl]-3-trifluoromethanesulfonyl tetrahydropyrimidine-2(1H)-one]の合成

1, 1, 1-トリフルオロ-N-[2-[(3-トリフルオロメタンスルホニル)-テトラヒドロ-2-ピリミジノン-1-イル)メチル]フェニル]-N-(トリフルオロメタンスルホニル)メタンスルホンアミド(173mg、0.288mmol)を1, 4-ジオキサン4mlに溶解させ、テトラブチルアンモニウムヒドロキシド水溶液(40%、373mg、0.575mmol)を加え室温で3時間半攪拌した。反応終了後、酢酸エチルと1N塩酸を加え、有機層を分離した後、有機層を水洗、飽和食塩水、無水硫酸ナトリウムの順で乾燥後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(n-ヘキサン/酢酸エチル=9/1~1/2)で精製し、目的物(本

発明化合物VI-3) 108mgを得た。

[0219] 工程5；

1-[2-(N-エトキシカルボニル-N-トリフルオロメタンスルホニル)アミノベンジル]-3-トリフルオロメタンスルホニルテトラヒドロピリミジン-2(1H)-オン(本発明化合物VI-4)の合成

[1-[2-(N-ethoxycarbonyl-N-trifluoromethanesulfonyl)aminobenzyl]-3-trifluoromethanesulfonyltetrahydropyrimidine-2(1H)-one]の合成

[0220] [1-(2-トリフルオロメタンスルホニル)アミノベンジル]-3-トリフルオロメタンスルホニルテトラヒドロピリミジン-2(1H)-オン(120mg、0.256mmol)をアセトニトリル6mlに溶解し、炭酸水素ナトリウム(43mg、0.511mmol)とクロロギ酸エチル(55mg、0.511mmol)を加えて、加熱還流下6時間攪拌した。反応終了後、酢酸エチルと飽和塩化アンモニウム水溶液を加え、有機層を分離した後、有機層を水洗し、飽和食塩水、無水硫酸ナトリウムの順で乾燥後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(n-ヘキサン/酢酸エチル=9/1~1/3)で精製し、目的物(本発明化合物VI-4) 128mgを白色固体として得た。

[0221] [実施例7]

1-[2-(N-エトキシカルボニル-N-トリフルオロメタンスルホニル)アミノベンジル]-3-エトキシカルボニルテトラヒドロピリミジン-2(1H)-オン(本発明化合物VI-2)の合成

[1-[2-(N-ethoxycarbonyl-N-trifluoromethanesulfonyl)aminobenzyl]-3-ethoxycarbonyltetrahydropyrimidine-2(1H)-one]の合成

[1-(2-トリフルオロメタンスルホニル)アミノベンジル]テトラヒドロピリミジン-2(1H)-オン(30mg、0.089mmol)をアセトニトリル5mlに溶解し、炭酸水素ナトリウム(19mg、0.27mmol)とクロロギ酸エチル(29mg、0.27mmol)を加えて加熱還流下5時間攪拌した。反応終了後、クロロホルムと水を加え、有機層を分

離した後、有機層を飽和食塩水、無水硫酸ナトリウムの順で乾燥後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（*n*-ヘキサン／酢酸エチル＝9／1～4／1）で精製し、目的物（本発明化合物VI-2）30mgを得た。

[0222] 〔実施例8〕

1-（2-トリフルオロメタンスルホニルアミノベンジル）ピペリジン-2-チオン（本発明化合物III-116）の合成

[1-(2-trifluoromethanesulfonylaminobenzyl)-piperidine-2-thione]の合成

1-（2-トリフルオロメタンスルホニルアミノベンジル）ピペリジン-2-チオン（47.6mg、0.142mmol）をトルエン6mlに溶解し、ローソン試薬（65mg、0.16mmol）を加えて加熱還流下、5時間半撈拌した。反応終了後、反応液を減圧下濃縮し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（*n*-ヘキサン／酢酸エチル＝15／1～1／4）で精製し、目的物（本発明化合物III-116）31mgを白色固体として得た。

[0223] 〔参考例1〕

6-メチルピペリジン-2-チオンの合成

工程1；

5-ヒドロキシー-N-（4-メトキシベンジル）ヘキサンアミドの合成

[5-hydroxy-N-(4-methoxybenzyl)hexanamide]の合成

δ-ヘキサノラクトン（2.0g、17.5mmol）をトルエン20mlに溶解し、4-メトキシベンジルアミン（2.5g、18.2mmol）を加えて、加熱還流下3時間撈拌した。反応終了後、反応液を減圧下濃縮した。得られた結晶をろ別し、*n*-ヘキサンで洗浄することにより、目的物4.07gを淡黄色固体として得た。

[0224] 工程2；

5-クロロ-N-（4-メトキシベンジル）ヘキサンアミドの合成

[5-chloro-N-(4-methoxybenzyl)hexanamide]の合成

5-ヒドロキシー-N-(4-メトキシベンジル)ヘキサナムド(1.0 g、3.77 mmol)をクロロホルム10 mlに溶解し、0℃で攪拌下、塩化チオニル(0.9 g、7.56 mmol)を加え、反応液を室温にて2日間攪拌した。反応終了後、反応液を減圧下濃縮後、クロロホルムと飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、有機層を分離した後、有機層を水洗し、飽和食塩水、無水硫酸ナトリウムの順で乾燥後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(n-ヘキサン/酢酸エチル=9/1~1/1)で精製し、目的物0.70 gを淡黄色固体として得た。

[0225] 工程3；

1-(4-メトキシベンジル)-6-メチルピペリジン-2-オンの合成
[1-(4-methoxybenzyl)-6-methylpiperidine-2-one]の合成

5-クロロ-N-(4-メトキシベンジル)ヘキサナムド(0.63 g、2.34 mmol)をテトラヒドロフラン10 mlに溶解し、0℃で攪拌下、t-ブトキシカリウム(280 mg、2.50 mmol)を加えて、加熱還流下15時間攪拌した。反応終了後、酢酸エチルと水を加え、有機層を分離した後、有機層を水洗し、飽和食塩水、無水硫酸ナトリウムの順で乾燥後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(n-ヘキサン/酢酸エチル=9/1~1/2)で精製し、目的物0.39 gを得た。

[0226] 工程4；

6-メチルピペリジン-2-オンの合成
[6-methylpiperidine-2-one]の合成

1-(4-メトキシベンジル)-6-メチルピペリジン-2-オン(0.39 g、1.67 mmol)をトリフルオロ酢酸2 mlに溶解し、マイクロ波反応装置(CEM社製ディスカバー：最大150Wに設定)を用いて、80℃で1時間攪拌した。反応終了後、反応液を減圧下濃縮し、クロロホルムと水を加え、有機層を分離した後、有機層を水洗し、飽和食塩水、無水硫酸ナトリウムの順で乾燥後、減圧下濃縮することにより、目的物150 mgを淡黄色固体として得た。

[0227] [参考例2]

3, 4, 4-トリメチル-1-(2-ニトロベンジル)ピペリジン-2-オン(製造中間体XI-13)及び4, 4, 5-トリメチル-1-(2-ニトロベンジル)ピペリジン-2-オン(製造中間体XI-11)の合成

工程1;

3, 4, 4-トリメチル-1-(2-ニトロベンジル)ピペリジン-2, 6-ジオンの合成

[3, 4, 4-trimethyl-1-(2-nitrobenzyl)piperidine-2, 6-dione]の合成

4, 4-ジメチルピペリジン-2, 6-ジオン(2.0 g、14.2 mmol)をテトラヒドロフラン30 mlに溶解し、窒素雰囲気下、-78℃で攪拌下、リチウムジイソプロピルアミド-ヘキサン、テトラヒドロフラン溶液(1.08 mol/l)(13.2 ml、14.2 mmol)を滴下し、-78℃で10分間攪拌した。ついで二酸化炭素を0℃で2分間吹き込んだ後、再度-78℃に冷却し、リチウムジイソプロピルアミド-ヘキサン、テトラヒドロフラン溶液(1.08 mol/l)(13.2 ml、14.2 mmol)を滴下した。次にヨウ化メチル(1.10 g、7.80 mmol)とヘキサメチルホスホリクトリアミド(2.54 g、14.2 mmol)を滴下し、-20℃で30分間攪拌した。反応終了後、飽和塩化アンモニウム水溶液を滴下し、反応液を減圧下濃縮した。得られた残渣をジメチルホルムアミド20 mlに溶解し、2-ニトロベンジルブロミド(3.06 g、14.2 mmol)、及び炭酸カリウム(1.96 g、14.2 mmol)を加え、80℃で30分間攪拌した。反応終了後、酢酸エチルと水を加え、有機層を分離した後、有機層を水洗し、飽和食塩水、無水硫酸ナトリウムの順で乾燥後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(n-ヘキサン/酢酸エチル=9/1~1/1)で精製し、目的物1.3 gを得た。

[0228] 工程2;

6-ヒドロキシ-3, 4, 4-トリメチル-1-(2-ニトロベンジル)ピペリジン-2-オン及び6-ヒドロキシ-4, 4, 5-トリメチル-1-(

2-ニトロベンジル) ピペリジン-2-オンの合成

[6-hydroxy-3,4,4-trimethyl-1-(2-nitrobenzyl)piperidine-2-one] and [6-hydroxy-4,4,5-trimethyl-1-(2-nitrobenzyl)piperidine-2-one]の合成

3, 4, 4-トリメチル-1-(2-ニトロベンジル) ピペリジン-2, 6-ジオン (2.81 g、9.68 mmol) をテトラヒドロフラン 120 ml に溶解し、水素化ホウ素ナトリウム (4.0 g、96.8 mmol) を加え、水 6 ml を滴下し、室温にて一晩攪拌した。反応終了後、反応液を 0°C でゆっくりと、飽和塩化アンモニウム水溶液に攪拌下加えた。酢酸エチルを加え、有機層を分離した後、有機層を水洗し、飽和食塩水、無水硫酸ナトリウムの順で乾燥後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル=9/1~1/9) で精製し、目的物の混合物 2.0 g を得た。

[0229] 工程 3 ;

3, 4, 4-トリメチル-1-(2-ニトロベンジル) ピペリジン-2-オン (製造中間体 XI-13) 及び 4, 4, 5-トリメチル-1-(2-ニトロベンジル) ピペリジン-2-オン (製造中間体 XI-11) の合成

[3,4,4-trimethyl-1-(2-nitrobenzyl)piperidine-2-one] and [4,4,5-trimethyl-1-(2-nitrobenzyl)piperidine-2-one]の合成

6-ヒドロキシ-3, 4, 4-トリメチル-1-(2-ニトロベンジル) ピペリジン-2-オン及び6-ヒドロキシ-4, 4, 5-トリメチル-1-(2-ニトロベンジル) ピペリジン-2-オンの混合物 (2.0 g、6.84 mmol) を 0°C でトリフルオロ酢酸 20 ml に溶解し、トリエチルシラン (1.19 g、10.3 mmol) を攪拌下滴下し、室温に戻して1時間攪拌した。反応終了後、反応液を減圧下濃縮し、酢酸エチルと飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、有機層を分離した後、有機層を水洗し、飽和食塩水、無水硫酸ナトリウムの順で乾燥後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル=9/1~1/9) で精製し、3, 4, 4-トリメチル-1-(2-ニトロベンジル) ピペリジン

ー２－オン（製造中間体X I－13）0.87 gと4,4,5-トリメチルー１－（２－ニトロベンジル）ピペリジンー２－オン（製造中間体X I－11）0.3 gを得た。

[0230] 〔参考例3〕

5,5-ジメチルアゼパンー２－オンの合成

[5,5-dimethylazepan-2-one]の合成

4,4-ジメチルシクロヘキサノン（1.0 g、7.92 mmol）をギ酸10 mlに溶解し、ヒドロキシルアミン－Ｏ－スルホン酸（1.34 g、11.85 mmol）を加えて、加熱還流下4時間攪拌した。反応終了後、反応液を減圧下濃縮し、2 N水酸化ナトリウム水溶液を加えてpH6～pH8とした。さらに、クロロホルムを加え、有機層を分離した後、有機層を水洗し、飽和食塩水、無水硫酸ナトリウムの順で乾燥後、減圧下濃縮することにより、目的物1.05 gを淡黄色固体として得た。

[0231] 〔参考例4〕

1-メチルテトラヒドロピリミジンー２（1H）－オンの合成

[1-methyltetrahydropyrimidine-2(1H)-one]の合成

N-メチルー1,3-プロパンジアミン（2.3 g、26.1 mmol）、及び尿素（1.57 g、26.1 mmol）をピリジン10 mlに溶解し、加熱還流下8時間攪拌した。反応終了後、反応液を減圧下濃縮し、得られた残渣にクロロホルムと飽和塩化アンモニウム水溶液を加え、有機層を分離した後、有機層を水洗し、飽和食塩水、無水硫酸ナトリウムの順で乾燥後、減圧下濃縮することにより得られた固体をヘキサン、及びジイソプロピルエーテルで洗浄後、ろ過することにより目的物155 mgを淡黄色固体として得た。

[0232] 〔参考例5〕

4,4-ジメチレンピペリジンー２－オン（製造中間体X I V－1）の合成

[4,4-dimethylenepiperidine-2-one]の合成

工程1；

1, 1-ビス(メタンスルホニルオキシメチル)シクロプロパンの合成

[1,1-bis(methanesulfonyloxymethyl)cyclopropane]の合成

1, 1-ビスヒドロキシメチルシクロプロパン(3.0 g、29.4 mmol)をジクロロメタン40 mlに溶解し、トリエチルアミン(11.9 g、118 mmol)を加え、続いてメタンスルホニルクロリド(10.1 g、88.2 mmol)を氷冷攪拌下滴下し、徐々に室温まで昇温させながら2時間攪拌した。反応終了後、クロロホルムと水を加えて有機層を分離した後、有機層を水洗し、飽和食塩水、無水硫酸ナトリウムの順で乾燥後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(n-ヘキサン/酢酸エチル=9/1~1/1)で精製し、目的物2.85 gを白色固体として得た。

[0233] 工程2；

1, 1-ビス(シアノメチル)シクロプロパンの合成

[1,1-bis(cyanomethyl)cyclopropane]の合成

1, 1-ビス(メタンスルホニルオキシメチル)シクロプロパン(1.4 g、5.42 mmol)をジメチルホルムアミド15 mlに溶解し、シアニ化カリウム(1.06 g、16.3 mmol)を加え、室温で2時間攪拌した後、100℃で3時間攪拌した。反応終了後、酢酸エチルと水を加えて有機層を分離した後、有機層を水洗し、飽和食塩水、無水硫酸ナトリウムの順で乾燥後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(n-ヘキサン/酢酸エチル=9/1~1/1)で精製し、目的物450 mgを得た。

[0234] 工程3；

3, 3-ジメチレングルタル酸の合成

[3,3-dimethyleneglutaric acid]の合成

1, 1-ビス(シアノメチル)シクロプロパン(2.2 g、18.3 mmol)をメタノール50 mlに溶解し、35重量%水酸化ナトリウム水溶液(10.5 g、91.7 mmol)を加え、加熱還流下4時間攪拌した。反

応終了後、酢酸エチルと水を加えて水層を分離した後、1 N-塩酸を加えて酸性にした。この水層に酢酸エチルを加えて有機層を分離した後、有機層を水洗し、飽和食塩水、無水硫酸ナトリウムの順で乾燥後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィー（*n*-ヘキサン／酢酸エチル＝9／1～1／1）で精製し、目的物460mgを得た。

[0235] 工程4；

3, 3-ジメチレングルタルイミドの合成

[3, 3-dimethyleneglutarimide]の合成

3, 3-ジメチレングルタル酸（460mg、2.91mmol）と尿素（210mg、3.50mmol）を混合し、175℃で1時間攪拌した。反応終了後、反応液を室温まで冷却して、セライトろ過し、メタノールで洗浄した。ろ液を減圧下濃縮し、得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィー（*n*-ヘキサン／酢酸エチル＝1／1～1／10）で精製し、目的物178mgを得た。

[0236] 工程5；

4, 4-ジメチレンピペリジン-2-オン（製造中間体XIV-1）の合成
[4, 4-dimethylenepiperidine-2-one]の合成

3, 3-ジメチレングルタルイミド（590mg、4.24mmol）をエタノール10mlに溶解し、氷冷攪拌下、水素化ホウ素ナトリウム（480mg、12.7mmol）を加え、0℃で40分間攪拌した。反応終了後、塩化水素-メタノール溶液（5-10重量%）を滴下し、溶液を中性とし、室温で30分間攪拌した後、減圧下濃縮した。得られた残渣をトリフルオロ酢酸8mlに溶解し、トリエチルシラン（740mg、6.36mmol）を加え、室温にて一晩攪拌した。反応終了後、反応液を減圧下濃縮した。得られた残渣に酢酸エチルと飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、有機層を分離した後、有機層を水洗し、飽和食塩水、無水硫酸ナトリウムの順で乾燥後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィー（*n*-ヘキサン／酢酸エチル＝1／1～0／1）で精製し、目的物（製造中間体XIV-1）を得た。

V-1) 110mg を白色固体（融点：94～95℃）として得た。

[0237] [参考例6]

1, 1, 1-トリフルオロ-N-[2-(ヒドロキシメチル)フェニル]メタン
スルホンアミドの合成

[1, 1, 1-trifluoro-N-[2-(hydroxymethyl)phenyl]methanesulfonamid]の合成

2-アミノベンジルアルコール（200mg、1.62mmol）をジクロロメタン10mlに溶解し、0℃に冷却し、N,N-ジイソプロピルエチルアミン（250mg、1.93mmol）を加え、さらにトリフルオロメタンスルホンクロリド（326mg、1.93mmol）を攪拌下滴下した。反応液を徐々に室温まで上昇させながら、さらに4時間攪拌した。反応終了後、クロロホルムと水を加え、有機層を分離した後、有機層を水洗、飽和食塩水、無水硫酸ナトリウムの順で乾燥後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（n-ヘキサン／酢酸エチル＝9／1～1／1）で精製し、目的物200mgを赤褐色固体として得た。

[0238] [参考例7]

1, 1-ジクロロ-6-アザスピロ[2.5]オクタン-5-オン（製造中間体XIV-2）の合成

[1, 1-dichloro-6-azaspiro[2.5]octan-5-one]の合成

工程1；

ターシャリーブチル 1, 1-ジクロロ-6-アザスピロ[2.5]オクタン-6-カルボキシレート
の合成

[tert-butyl 1, 1-dichloro-6-azaspiro[2.5]octan-6-carboxylate]の合成

1-N-ターシャリーブトキシカルボニル-4-メチレンピペリジン（1.5g、7.60mmol）をクロロホルム20mlに溶解し、ベンジルトリエチルアンモニウムクロリド（0.17g、0.76mmol）を加え、攪拌下、反応液を50℃に加熱した。水酸化ナトリウム（3.0g、76.0mmol）を水5mlに別途溶解し、反応液に滴下した。50℃のまま3時間攪拌した後、室温に戻して一晩攪拌した。反応終了後、クロロホルムと

水を加えて有機層を分離した後、有機層を水洗し、飽和食塩水、無水硫酸ナトリウムの順で乾燥後、減圧下濃縮した。得られた固体をヘキサン、及びジイソプロピルエーテルで洗浄し、ろ過することにより、目的物 1.8 g を白色固体（融点：75～76℃）として得た。

[0239] 工程 2；

ターシャリーブチル 1, 1-ジクロロ-5-オキソ-6-アザスピロ [2.5] オクタン-6-カルボキシレート

[tert-butyl 1,1-dichloro-5-oxo-6-azaspiro[2.5]octan-6-carboxylate]の合成

ターシャリーブチル 1, 1-ジクロロ-6-アザスピロ [2.5] オクタン-6-カルボキシレート (300 mg、1.07 mmol) をアセトニトリル 18 ml、四塩化炭素 18 ml、及び水 27 ml に溶解し、過ヨウ素酸ナトリウム (1.8 g、8.57 mmol)、及び塩化ルテニウム水和物 (4.5 mg、0.0214 mmol) を加え、室温で一晩攪拌した。反応終了後、クロロホルムと水を加えて有機層を分離した後、有機層をチオ硫酸ナトリウム水溶液で洗浄した。その後、飽和食塩水、無水硫酸ナトリウムの順で乾燥後、減圧下濃縮した。得られた固体をヘキサン、及びジイソプロピルエーテルで洗浄し、ろ過することにより、目的物 231 mg を淡黄色固体（融点：134～135℃）として得た。

[0240] 工程 3；

1, 1-ジクロロ-6-アザスピロ [2.5] オクタン-5-オン（製造中間体 XIV-2）の合成

[1,1-dichloro-6-azaspiro[2.5]octan-5-one]の合成

ターシャリーブチル 1, 1-ジクロロ-5-オキソ-6-アザスピロ [2.5] オクタン-6-カルボキシレート (220 mg、0.748 mmol) をジクロロメタン 2 ml に溶解し、トリフルオロ酢酸 1 ml を加えて室温で一晩攪拌した。反応終了後、反応液を減圧下濃縮し、得られた残渣に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を pH 7 になるまで加えた。さらにクロロホルム

ムを加えて有機層を分離した後、有機層を飽和食塩水、無水硫酸ナトリウムの順で乾燥後、減圧下濃縮した。得られた固体をヘキサン、及びジイソプロピルエーテルで洗浄し、ろ過することにより、目的物（製造中間体XIV-2）143mgを白色固体（融点：185～186℃）として得た。

本発明化合物は、前記実施例と同様の方法を用いることにより合成することができる。そのようにして合成された化合物の構造式を、前記実施例に記載された化合物とともに第10表乃至第19表に、製造中間体を第20表乃至第23表に、それらの物性値を第24表に示す。

[0241] 本発明は、これらの化合物のみに限定されるものではない。

尚、第10表乃至第23表の記号は下記の意味を表す。

Me：メチル基、Et：エチル基、Pr：プロピル基、Bu：ブチル基、Pen：ペンチル基、Hex：ヘキシル基、Ph：フェニル基。

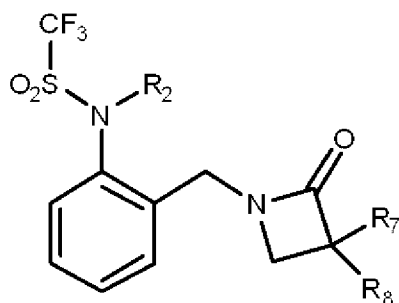
また、第24表の記号は下記の意味を表す。

s：シングレット、d：ダブレット、t：トリプレット、m：マルチプレット。

[0242] [第10表]

[0243] 一般式（28）

[0244] [化24]



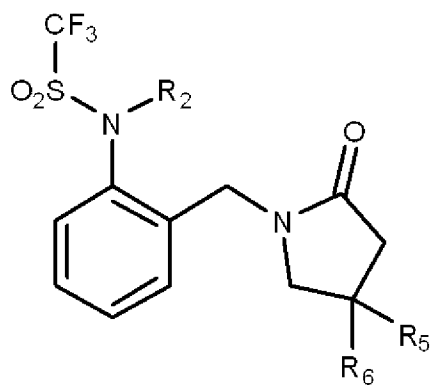
[0245]				
No.	R ₂	R ₇	R ₈	物性値 [融点(℃)]
I-1	H	Me	Me	114-116
I-2	COEt	Me	Me	91-93

I-3	COPr-i	Me	Me	67-68
I-4	CO ₂ Et	Me	Me	50-51
I-5	CO ₂ Bu-i	Me	Me	樹脂状

[0246] 〔第11表〕

[0247] 一般式 (29)

[0248] [化25]



[0249]

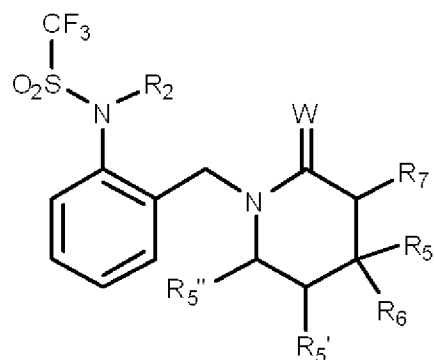
No.	R ₂	R ₅	R ₆	物性値 [融点(°C)]
II-1	H	H	H	樹脂状
II-2	CO ₂ Et	H	H	樹脂状
II-3	CO ₂ Bu-i	H	H	樹脂状

[0250] 〔第12表〕

[0251] 一般式 (30)

[0252]

[化26]



[0253]

No.	R ₂	R ₇	R ₅	R ₆	R _{5'}	R _{5''}	W	物性値 [融点(°C)]
III-1	H	H	H	H	H	H	O	57-59
III-2	COEt	H	H	H	H	H	O	樹脂状
III-3	COPr-n	H	H	H	H	H	O	110-110.5
III-4	COPr-i	H	H	H	H	H	O	樹脂状
III-5	COBu-n	H	H	H	H	H	O	70-71
III-6	E-4	H	H	H	H	H	O	99-100
III-7	COCH=CH ₂	H	H	H	H	H	O	樹脂状
III-8	E-5	H	H	H	H	H	O	樹脂状
III-9	CO ₂ Et	H	H	H	H	H	O	86-87
III-10	CO ₂ Pr-i	H	H	H	H	H	O	樹脂状
III-11	CO ₂ Bu-i	H	H	H	H	H	O	樹脂状
III-12	E-1	H	H	H	H	H	O	樹脂状
III-13	E-3	H	H	H	H	H	O	樹脂状
III-14	CH ₂ OMe	H	H	H	H	H	O	樹脂状
III-15	CH ₂ OCH ₂ Ph	H	H	H	H	H	O	樹脂状
III-16	CH ₂ OCOEt	H	H	H	H	H	O	樹脂状
III-17	E-6	H	H	H	H	H	O	56-58

III-18	CH ₂ Ph	H	H	H	H	H	O	樹脂状
III-19	H	H	Me	H	H	H	O	樹脂状
III-20	COPr-c	H	Me	H	H	H	O	樹脂状
III-21	COPh	H	Me	H	H	H		106-108
III-22	CO ₂ Et	H	Me	H	H	H	O	73-74
III-23	CO ₂ Bu-i	H	Me	H	H	H	O	樹脂状
III-24	CO ₂ Et	H	Et	H	H	H	O	樹脂状
III-25	H	H	Pr-n	H	H	H	O	樹脂状
III-26	COEt	H	Pr-n	H	H	H	O	樹脂状
III-27	COPr-c	H	Pr-n	H	H	H	O	樹脂状
III-28	CO ₂ Et	H	Pr-n	H	H	H	O	61-62
III-29	CO ₂ Bu-i	H	Pr-n	H	H	H	O	89-90
III-30	H	H	Pr-i	H	H	H	O	樹脂状
III-31	CO ₂ Et	H	Pr-i	H	H	H	O	102-105
III-32	COEt	H	Pr-i	H	H	H	O	樹脂状
III-33	COPr-c	H	Pr-i	H	H	H	O	樹脂状
III-34	H	H	Pr-c	H	H	H	O	樹脂状
III-35	COEt	H	Pr-c	H	H	H	O	樹脂状
III-36	COPr-c	H	Pr-c	H	H	H	O	樹脂状
III-37	CO ₂ Et	H	Pr-c	H	H	H	O	樹脂状
III-38	CO ₂ Et	H	CF ₃	H	H	H	O	124-125
III-39	H	H	OMe	H	H	H	O	樹脂状
III-40	CO ₂ Et	H	OMe	H	H	H	O	樹脂状
III-41	H	H	OEt	H	H	H	O	樹脂状
III-42	COEt	H	OEt	H	H	H	O	樹脂状
III-43	CO ₂ Et	H	OEt	H	H	H	O	樹脂状
III-44	H	H	SMe	H	H	H	O	樹脂状
III-45	CO ₂ Et	H	SMe	H	H	H	O	79-81

III-46	H	H	Me	Me	H	H	O	52-53
III-47	COMe	H	Me	Me	H	H	O	130-132
III-48	COEt	H	Me	Me	H	H	O	106-107
III-49	COPr-n	H	Me	Me	H	H	O	110-111
III-50	COPr-i	H	Me	Me	H	H	O	56-58
III-51	COPr-c	H	Me	Me	H	H	O	89-90
III-52	COBu-n	H	Me	Me	H	H	O	樹脂状
III-53	COBu-c	H	Me	Me	H	H	O	樹脂状
III-54	COPen-n	H	Me	Me	H	H	O	樹脂状
III-55	E-4	H	Me	Me	H	H	O	124-125
III-56	COPh	H	Me	Me	H	H	O	樹脂状
III-57	CO ₂ Me	H	Me	Me	H	H	O	樹脂状
III-58	CO ₂ Et	H	Me	Me	H	H	O	86-87
III-59	CO ₂ Pr-n	H	Me	Me	H	H	O	106-107
III-60	CO ₂ Bu-n	H	Me	Me	H	H	O	63-65
III-61	E-1	H	Me	Me	H	H	O	樹脂状
III-62	CO ₂ Bu-i	H	Me	Me	H	H	O	樹脂状
III-63	CO ₂ Hex-n	H	Me	Me	H	H	O	樹脂状
III-64	E-8	H	Me	Me	H	H	O	樹脂状
III-65	E-9	H	Me	Me	H	H	O	樹脂状
III-66	E-10	H	Me	Me	H	H	O	樹脂状
III-67	E-3	H	Me	Me	H	H	O	89-90
III-68	E-11	H	Me	Me	H	H	O	樹脂状
III-69	CO ₂ Ph	H	Me	Me	H	H	O	樹脂状
III-70	CO ₂ CH ₂ Ph	H	Me	Me	H	H	O	84-88
III-71	E-7	H	Me	Me	H	H	O	樹脂状
III-72	SO ₂ CF ₃	H	Me	Me	H	H	O	樹脂状
III-73	H	H	Me	Et	H	H	O	樹脂状

III-74	CO Me	H	Me	Et	H	H	O	樹脂状
III-75	CO Et	H	Me	Et	H	H	O	樹脂状
III-76	CO Pr - c	H	Me	Et	H	H	O	樹脂状
III-77	CO ₂ Me	H	Me	Et	H	H	O	樹脂状
III-78	CO ₂ Et	H	Me	Et	H	H	O	樹脂状
III-79	H	Me	Me	H	H	H	O	樹脂状
III-80	CO ₂ Et	Me	Me	H	H	H	O	樹脂状
III-81	CO ₂ Et	Cl	Cl	H	H	H	O	樹脂状
III-82	CO ₂ Et	Br	Br	H	H	H	O	樹脂状
III-83	H	Cl	Me	H	H	H	O	樹脂状
III-84	CO ₂ Et	Cl	Me	H	H	H	O	樹脂状
III-85	H	CO ₂ Et	Me	H	H	H	O	樹脂状
III-86	H	CO ₂ Et	Et	H	H	H	O	樹脂状
III-87	CO ₂ Et	CO ₂ Et	Et	H	H	H	O	樹脂状
III-88	H	H	Me	Me	Me	H	O	樹脂状
III-89	CO ₂ Et	H	Me	Me	Me	H	O	樹脂状
III-90	H	H	Me	Me	H	Me	O	樹脂状
III-91	CO ₂ Et	H	Me	Me	H	Me	O	樹脂状
III-92	H	H	Me	Me	H	OH	O	93-95
III-93	CO ₂ Et	H	Me	Me	H	OH	O	95-96
III-94	H	Me	Me	Me	H	H	O	樹脂状
III-95	CO ₂ Et	Me	Me	Me	H	H	O	樹脂状
III-96	H	H	Ph	H	H	H	O	樹脂状
III-97	CO ₂ Et	H	Ph	H	H	H	O	樹脂状
III-98	CO Et	H	Ph	H	H	H	O	樹脂状
III-99	H	H	— (CH ₂) ₂ —	H	H	H	O	樹脂状
III-100	CO Et	H	— (CH ₂) ₂ —	H	H	H	O	121-122
III-101	CO Pr - n	H	— (CH ₂) ₂ —	H	H	H	O	119-120

III-102	COPr-c	H	- (CH ₂) ₂ -	H	H	O	127-128
III-103	CO ₂ Et	H	- (CH ₂) ₂ -	H	H	O	69-72
III-104	CO ₂ Pr-n	H	- (CH ₂) ₂ -	H	H	O	樹脂状
III-105	CO ₂ Bu-i	H	- (CH ₂) ₂ -	H	H	O	樹脂状
III-106	E-8	H	- (CH ₂) ₂ -	H	H	O	樹脂状
III-107	H	H	- (CH ₂) ₄ -	H	H	O	樹脂状
III-108	COEt	H	- (CH ₂) ₄ -	H	H	O	102-104
III-109	COPr-c	H	- (CH ₂) ₄ -	H	H	O	樹脂状
III-110	CO ₂ Et	H	- (CH ₂) ₄ -	H	H	O	樹脂状
III-111	CO ₂ Bu-i	H	- (CH ₂) ₄ -	H	H	O	樹脂状
III-112	CO ₂ Et		-CH ₂ -	H	H	H	O 樹脂状
III-113	CO ₂ Et		-O-	H	H	H	O 樹脂状
III-114	H		-O-	Me	H	H	O 樹脂状
III-115	H	H	Me	Me	bond	O	樹脂状
III-116	H	H	H	H	H	S	116-118
III-117	H	H	Me	Me	H	H	S 樹脂状
III-118	CO ₂ Et	H	Me	Me	H	H	S 樹脂状
III-119	H	H	-CH ₂ CCl ₂ -	H	H	O	樹脂状
III-120	CO ₂ Et	H	-CH ₂ CCl ₂ -	H	H	O	樹脂状

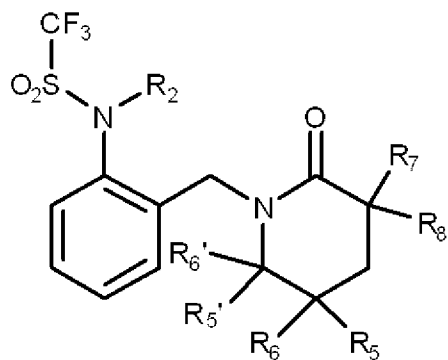
[0254] 第12表中、E-1乃至E-11、及び「bond」は、前記に同じである。

[0255] 〔第13表〕

[0256] 一般式(31)

[0257]

[化27]



[0258]

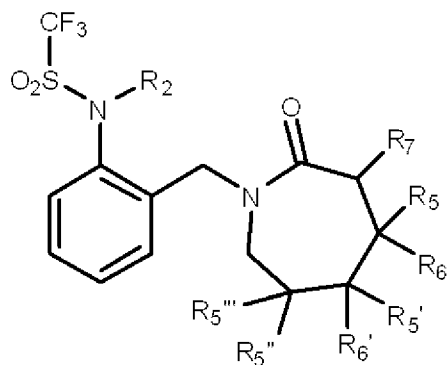
No.	R ₂	R ₅	R ₆	R ₅ '	R ₆ '	R ₇	R ₈	物性値 [融点(°C)]
IV-1	CO ₂ Et	Me	H	H	H	H	H	樹脂状
IV-2	H	Me	Me	H	H	H	H	64-65
IV-3	CO ₂ Et	Me	Me	H	H	H	H	樹脂状
IV-4	H	H	H	H	H	Me	H	樹脂状
IV-5	CO ₂ Et	H	H	H	H	Me	H	樹脂状
IV-6	H	H	H	H	H	Et	H	樹脂状
IV-7	COEt	H	H	H	H	Et	H	樹脂状
IV-8	COPr-c	H	H	H	H	Et	H	樹脂状
IV-9	CO ₂ Et	H	H	H	H	Et	H	樹脂状
IV-10	CO ₂ Bu-i	H	H	H	H	Et	H	樹脂状
IV-11	H	H	H	H	H	Pr-n	H	樹脂状
IV-12	CO ₂ Et	H	H	H	H	Pr-n	H	樹脂状
IV-13	CO ₂ Et	H	H	H	H	OMe	H	樹脂状
IV-14	H	H	H	H	H	SMe	H	樹脂状
IV-15	CO ₂ Et	H	H	H	H	SMe	H	樹脂状
IV-16	H	H	H	H	H	SPh	H	樹脂状

IV-17	CO ₂ Et	H	H	H	H	SP _h	H	樹脂状
IV-18	H	H	H	H	H	Cl	H	樹脂状
IV-19	COEt	H	H	H	H	Cl	H	樹脂状
IV-20	COP _h	H	H	H	H	Cl	H	樹脂状
IV-21	CO ₂ Et	H	H	H	H	Cl	H	樹脂状
IV-22	H	H	H	H	H	Br	H	樹脂状
IV-23	CO ₂ Et	H	H	H	H	CN	H	樹脂状
IV-24	H	H	H	H	H	Me	Me	106-108
IV-25	COEt	H	H	H	H	Me	Me	樹脂状
IV-26	CO ₂ Et	H	H	H	H	Me	Me	樹脂状
IV-27	H	H	H	Me	H	H	H	樹脂状
IV-28	CO ₂ Et	H	H	Me	H	H	H	樹脂状
IV-29	H	H	H	OH	H	H	H	102-106
IV-30	CO ₂ Et	H	H	OMe	H	H	H	樹脂状
IV-31	H	Me	Me	H	H	Me	H	樹脂状
IV-32	CO ₂ Et	Me	Me	H	H	Me	H	樹脂状

[0259] 〔第14表〕

[0260] 一般式(32)

[0261] [化28]



[0262]

No.	R ₂	R ₅	R ₆	R ₅ '	R ₆ '	R ₅ ''	R ₅ '''	R ₇	物性値 [融点(°C)]
V-1	H	H	H	H	H	H	H	H	67-69
V-2	COMe	H	H	H	H	H	H	H	樹脂状
V-3	COEt	H	H	H	H	H	H	H	樹脂状
V-4	COPr-n	H	H	H	H	H	H	H	樹脂状
V-5	COPr-c	H	H	H	H	H	H	H	樹脂状
V-6	E-4	H	H	H	H	H	H	H	117-118
V-7	E-12	H	H	H	H	H	H	H	95-97
V-8	COPh	H	H	H	H	H	H	H	樹脂状
V-9	CO ₂ Me	H	H	H	H	H	H	H	樹脂状
V-10	CO ₂ Et	H	H	H	H	H	H	H	66-67
V-11	E-8	H	H	H	H	H	H	H	102-103
V-12	CO ₂ Bu-i	H	H	H	H	H	H	H	樹脂状
V-13	E-3	H	H	H	H	H	H	H	樹脂状
V-14	H	Me	H	H	H	H	H	H	樹脂状
V-15	COEt	Me	H	H	H	H	H	H	樹脂状
V-16	COPr-c	Me	H	H	H	H	H	H	樹脂状
V-17	CO ₂ Et	Me	H	H	H	H	H	H	樹脂状
V-18	H	H	H	Me	H	H	H	H	樹脂状
V-19	COMe	H	H	Me	H	H	H	H	84-87
V-20	COEt	H	H	Me	H	H	H	H	93-95
V-21	COPr-c	H	H	Me	H	H	H	H	樹脂状
V-22	CO ₂ Me	H	H	Me	H	H	H	H	樹脂状
V-23	CO ₂ Et	H	H	Me	H	H	H	H	66-67
V-24	CO ₂ Bu-i	H	H	Me	H	H	H	H	樹脂状
V-25	COEt	H	H	Bu-t	H	H	H	H	樹脂状

V-26	CO ₂ Et	H	H	Bu-t	H	H	H	H	樹脂状
V-27	CO ₂ Et	H	H	Ph	H	H	H	H	樹脂状
V-28	H	H	H	H	H	Me	H	H	樹脂状
V-29	COEt	H	H	H	H	Me	H	H	樹脂状
V-30	COPr-c	H	H	H	H	Me	H	H	樹脂状
V-31	CO ₂ Et	H	H	H	H	Me	H	H	樹脂状
V-32	H	H	H	Me	Me	H	H	H	106-108
V-33	COMe	H	H	Me	Me	H	H	H	143-145
V-34	COEt	H	H	Me	Me	H	H	H	112-113
V-35	COPr-c	H	H	Me	Me	H	H	H	131-133
V-36	CO ₂ Et	H	H	Me	Me	H	H	H	87-88
V-37	COEt	Me	Me	H	H	Me	Me	H	樹脂状
V-38	CO ₂ Et	Me	Me	H	H	Me	Me	H	樹脂状
V-39	H	H	H	H	H	H	H	Me	樹脂状
V-40	CO ₂ Et	H	H	H	H	H	H	Me	71-72.5

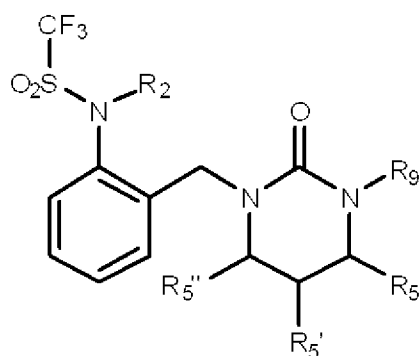
[0263] 第14表中、E-3、E-4、E-8及びE-12は、前記に同じである

。

[0264] [第15表]

[0265] 一般式(33)

[0266] [化29]



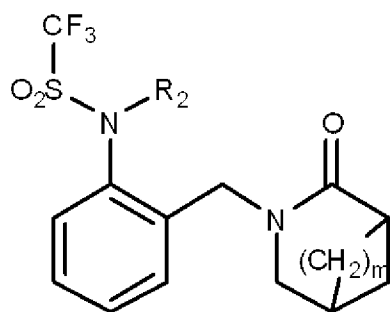
[0267]

No.	R ₂	R ₉	R ₅	R ₅ '	R ₅ ''	物性値 [融点(°C)]
VI-1	H	H	H	H	H	184-186
VI-2	CO ₂ Et	CO ₂ Et	H	H	H	樹脂状
VI-3	H	SO ₂ CF ₃	H	H	H	樹脂状
VI-4	CO ₂ Et	SO ₂ CF ₃	H	H	H	110-111
VI-5	SO ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	H	H	H	樹脂状
VI-6	H	Me	H	H	H	89-91
VI-7	CO ₂ Et	Me	H	H	H	82-83

[0268] [第16表]

[0269] 一般式(34)

[0270] [化30]



[0271]

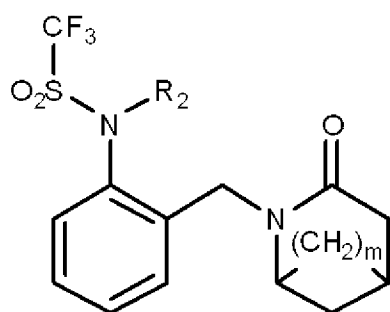
No.	R ₂	m	物性値 [融点(°C)]
VII-1	H	0	樹脂状
VII-2	COEt	0	樹脂状
VII-3	COPr-c	0	樹脂状
VII-4	CO ₂ Et	0	樹脂状

VII-5	$\text{CO}_2\text{Bu-i}$	0	樹脂状
VII-6	H	2	樹脂状
VII-7	COEt	2	樹脂状
VII-8	CO_2Et	2	樹脂状

[0272] 〔第17表〕

[0273] 一般式 (35)

[0274] [化31]



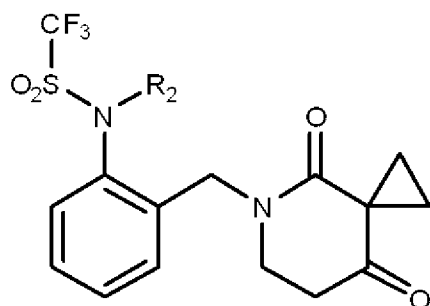
[0275]

No.	R_2	m	物性値 [融点 (°C)]
VIII-1	H	2	樹脂状
VIII-2	CO_2Et	2	樹脂状

[0276] 〔第18表〕

[0277] 一般式 (36)

[0278] [化32]



[0279] _____

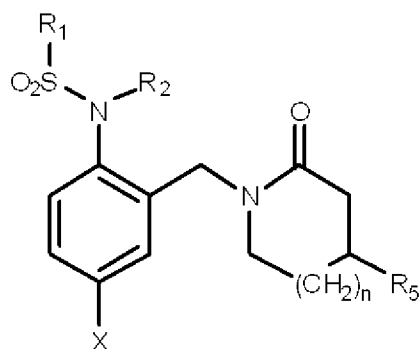
No.	R_2	物性値 [融点 (°C)]

IX-1	CO_2Et	樹脂状

[0280] [第19表]

一般式 (37)

[0281] [化33]



[0282] _____

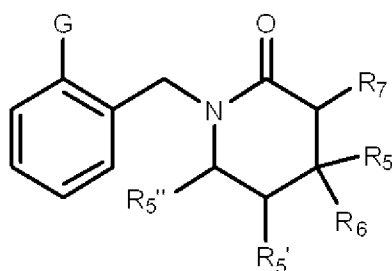
No.	R_1	R_2	R_5	X	n	物性値 [融点 (°C)]

X-1	CF_3	H	H	Cl	1	樹脂状
X-2	CF_3	H	Me	F	1	樹脂状
X-3	CF_3	CO_2Et	Me	F	1	樹脂状
X-4	CHF_2	H	H	H	2	樹脂状
X-5	CCl_3	H	Me	H	1	樹脂状
X-6	$CFCl_2$	H	Me	H	1	樹脂状
X-7	$CFCl_2$	CO_2Et	Me	H	1	樹脂状

[0283] [第20表]

一般式 (38)

[0284] [化34]



[0285]

No.	G	R ₅	R ₆	R ₅ '	R ₅ ''	R ₇	物性値 [融点(°C)]
XI-1	NO ₂	Me	H	H	H	H	92-93
XI-2	NH ₂	Me	H	H	H	H	樹脂状
XI-3	NH ₂	Pr-n	H	H	H	H	樹脂状
XI-4	NH ₂	Pr-i	H	H	H	H	樹脂状
XI-5	NH ₂	Pr-c	H	H	H	H	樹脂状
XI-6	NH ₂	OMe	H	H	H	H	59-61
XI-7	NO ₂	Ph	H	H	H	H	140-141
XI-8	NH ₂	Ph	H	H	H	H	樹脂状
XI-9	NO ₂	Me	Me	H	H	H	94-96
XI-10	NH ₂	Me	Me	H	H	H	樹脂状
XI-11	NO ₂	Me	Me	Me	H	H	樹脂状
XI-12	NH ₂	Me	Me	Me	H	H	樹脂状
XI-13	NO ₂	Me	Me	H	H	Me	樹脂状
XI-14	NH ₂	Me	Me	H	H	Me	樹脂状
XI-15	NO ₂	—(CH ₂) ₄ —	H	H	H	H	樹脂状
XI-16	NH ₂	—(CH ₂) ₄ —	H	H	H	H	樹脂状
XI-17	NO ₂	H	H	H	OMe	H	樹脂状

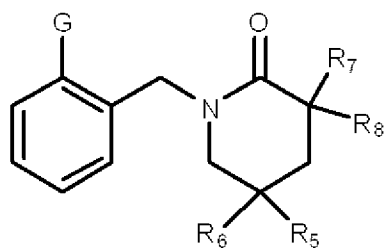
XI-18	NH ₂	H	H	H	OMe	H	樹脂状
XI-19	NO ₂	Me	Me		bond	H	80-82
XI-20	NH ₂	Me	H	H	bond	H	148-150

第20表中、「bond」は、前記に同じである。

[0286] 〔第21表〕

一般式 (39)

[0287] [化35]



[0288]

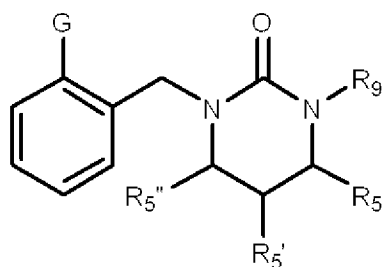
No.	G	R ₅	R ₆	R ₇	R ₈	物性値 [融点(°C)]
XII-1	NO ₂	Me	Me	H	H	樹脂状
XII-2	NH ₂	Me	Me	H	H	樹脂状
XII-3	NO ₂	H	H	Me	Me	樹脂状
XII-4	NH ₂	H	H	Me	Me	樹脂状

[0289] 〔第22表〕

一般式 (40)

[0290]

[化36]



[0291]

No.	G	R ₉	R ₅	R _{5'}	R _{5''}	物性値 [融点(°C)]
XIII-1	NO ₂	H	H	H	H	223-224
XIII-2	NH ₂	H	H	H	H	194-195

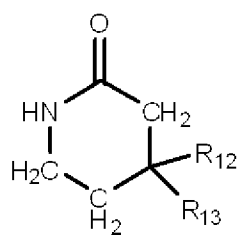
[0292]

〔第23表〕

一般式 (3)

[0293]

[化37]



[0294]

No.	R ₁₂	R ₁₃	物性値 [融点(°C)]
XIV-1	—(CH ₂) ₂ —		94-95
XIV-2	—CH ₂ CCl ₂ —		185-186

[0295] [第24表]

N o. プロトン核磁気共鳴ケミカルシフト値 (CDCl₃中) : δ (ppm)

II-5 : 7.35-7.55 (m, 3H), 7.21 (d, J=7.5Hz, 1H), 4.58 (d, J=15.2Hz, 1H), 4.31 (d, J=15.2Hz, 1H), 3.95-4.15 (m, 2H), 2.90-3.05 (m, 2H), 1.85-2.05 (m, 1H), 1.31 (d, J=4.7Hz, 6H), 0.88 (d, J=6.9Hz, 6H)

II-1 : 10.40 (brs, 1H), 7.58 (d, J=7.2Hz, 1H), 7.36 (dt, J=7.2, 1.8Hz, 1H), 7.15-7.30 (m, 2H), 4.40 (s, 2H), 3.55 (t, J=7.2Hz, 2H), 2.42 (d, J=7.2Hz, 2H), 2.09 (t, J=7.2Hz, 2H)

II-2 : 7.47 (dt, J=7.5, 1.2Hz, 1H), 7.30-7.45 (m, 2H), 7.22 (d, J=7.5Hz, 1H), 4.53 (s, 2H), 4.25-4.45 (m, 2H), 3.25 (t, J=7.5Hz, 2H), 2.45 (dt, J=8.4, 3.6Hz, 2H), 1.90-2.15 (m, 2H), 1.32 (t, J=7.5Hz, 3H)

II-3 : 7.40-7.50 (m, 1H), 7.30-7.40 (m, 2H), 7.15-7.25 (m, 1H), 4.53 (s, 2H), 4.00-4.20 (m, 2H), 3.20-3.35 (m, 2H), 2.35-2.65 (m, 2H), 1.85-2.15 (m, 2H), 1.20-1.30 (m, 1H), 0.88 (ddd, J=6.6, 3.6, 1.8Hz, 6H)

III-2 : 7.50 (dt, J=1.2, 7.5Hz, 1H), 7.40 (dt, J=1.2, 7.5Hz, 1H), 7.32 (dd, J=1.2, 7.5Hz, 1H), 7.21 (d, J=7.5Hz, 1H), 5.07 (d, J=15.6Hz, 1H), 4.21 (d, J=15.6Hz, 1H), 3.30-3.35 (m, 2H), 2.45-2.55 (m, 2H), 2.42 (dq, J=7.5, 18.3Hz, 1H), 2.36 (dq, J=7.5, 18.3Hz, 1H), 1.85-1.90 (m, 4H), 1.11 (t, J=7.2Hz, 3H)

III-4 : 7.51 (t, J=8.8Hz, 1H), 7.40 (t, J=8.8Hz, 1H), 7.33 (d, J=8.8Hz, 1H), 7.22 (d, J=8.8Hz, 1H), 5.07 (d, J=15.9Hz, 1H), 4.27 (d, J=15.9Hz, 1H), 3.25-3.35 (m, 2H), 2.45-2.60 (m, 3H), 1.70-1.90 (m, 4H), 1.21 (d, J=6.6Hz, 3H), 1.08 (d, J=6.6Hz, 3H)

III-7 : 7.52 (t, J=6.8Hz, 1H), 7.35-7.50 (m, 2H), 7.20 (d, J=8.5Hz, 1H), 6.63 (d, J=16.5Hz, 1H), 6.13 (dd, J=16.5, 9.1Hz, 1H), 5.89 (d, J=9.1Hz, 1H), 4.99 (d, J=15.7Hz, 1H), 4.31 (d, J=15.7Hz, 1H), 3.25-3.40 (m, 2H), 2.40-2.55 (m, 2H), 1.70-2.00 (m, 4H)

III-8 : 7.50 (t, J=7.0Hz, 1H), 7.42 (t, J=7.0Hz, 1H), 7.25-7.35 (m, 2H), 5.05 (d, J=15.9Hz, 1H), 4.31 (d, J=15.9Hz, 1H), 4.12 (q, J=5.8Hz, 2H), 3.25-3.40 (m, 2H), 2.55-2.75 (m, 4H), 2.40-2.50 (m, 2H), 1.75-1.90 (m, 4H), 1.24 (t, J=7.1Hz, 3H)

III-10 : 7.45 (t, J=7.5Hz, 1H), 7.30-7.40 (m, 2H), 7.20 (d, J=8.5Hz, 1H), 5.05-5.20 (m, 1H), 4.72 (d, J=16.4Hz, 1H), 4.68 (d, J=16.4Hz, 1H), 3.10-3.25 (m, 2H), 2.40-2.60 (m, 2H), 1.70-1.90 (m, 4H), 1.25-1.40 (m, 6H)

III-11 : 7.40-7.50 (m, 1H), 7.25-7.40 (m, 2H), 7.21 (d, J=7.8Hz, 1H), 4.75 (d, J=15.3Hz, 1H), 4.68 (d, J=15.3Hz, 1H), 3.95-4.20 (m, 2H), 3.10-3.30 (m, 2H), 2.40-2.60 (m, 2H), 1.70-2.05 (m, 5H), 0.87 (d, J=7.8Hz, 6H)

III-12 : 7.45 (t, J=7.8Hz, 1H), 7.30-7.45 (m, 2H), 7.21 (d, J=7.8Hz, 1H), 4.75 (d, J=15.6Hz, 1H), 4.67 (d, J=15.6Hz, 1H), 4.07 (d, J=10.2Hz, 1H), 3.87 (d, J=10.2Hz, 1H), 3.10-3.25 (m, 2H), 2.45-2.65 (m, 2H), 1.70-1.95 (m, 4H), 0.85 (s, 9H)

III-13 : 7.46 (t, J=7.2Hz, 1H), 7.30-7.45 (m, 2H), 7.21 (d, J=7.2Hz, 1H), 5.80-5.95 (m, 1H), 5.20-5.35 (m, 2H), 4.73 (d, J=15.6Hz, 2H), 4.71 (d, J=15.6Hz, 2H), 3.10-3.30 (m, 2H), 2.40-2.65 (m, 2H), 1.70-1.95 (m, 4H)

III-14 : 7.35-7.45 (m, 1H), 7.30-7.35 (m, 2H), 7.25-7.30 (m, 1H), 5.13 (d, J=10.5Hz, 1H), 5.03 (d, J=15.3Hz, 1H), 4.93 (d, J=10.5Hz, 1H), 4.49 (d, J=15.3Hz, 1H), 3.45 (s, 3H), 3.25-3.30 (m, 2H), 2.45-2.55 (m, 2H), 1.75-1.90 (m, 4H)

III-15 : 7.30-7.45 (m, 9H), 5.19 (d, J=10.5Hz, 1H), 5.05 (d, J=10.5Hz, 1H), 4.95 (d, J=15.6Hz, 1H), 4.70 (d, J=12.0Hz, 1H), 4.62 (d, J=12.0Hz, 1H), 4.59 (d, J=15.6Hz, 1H), 3.15-3.20 (m, 2H), 2.45-2.55 (m, 2H), 1.70-1.90 (m, 4H)

III-16 : 7.40-7.50 (m, 1H), 7.20-7.40 (m, 3H), 5.85 (d, J=11.4Hz, 1H), 5.77 (d, J=11.4Hz, 1H), 5.05 (d, J=15.9Hz, 1H), 4.45 (d, J=15.9Hz, 1H), 3.20-3.40 (m, 2H), 2.40-2.60 (m, 2H), 2.40 (q, J=8.1Hz, 2H), 1.70-1.95 (m, 4H), 1.14 (t, J=8.1Hz, 3H)

III-18 : 7.20-7.50 (m, 6H), 7.05-7.20 (m, 3H), 5.11 (d, J=13.8Hz, 1H), 4.62 (d, J=13.8Hz, 1H), 4.44 (d, J=16.2Hz, 1H), 4.07 (d, J=16.2Hz, 1H), 2.55-2.80 (m, 2H), 2.35-2.55 (m, 2H), 1.70-1.90 (m, 2H), 1.55-1.70 (m, 2H)

III-19 : 11.9 (brs, 1H), 7.61 (d, J=8.2Hz, 1H), 7.37 (t, J=8.2Hz, 1H), 7.28 (d, J=8

. 2Hz, 1H), 7. 19 (t, J=8. 2Hz, 1H), 4. 56 (d, J=14. 6Hz, 1H), 4. 40 (d, J=14. 6Hz, 1H), 3. 35-3. 55 (m, 2H), 2. 45-2. 60 (m, 1H), 1. 80-2. 05 (m, 3H), 1. 35-1. 55 (m, 1H), 0. 99 (d, J=6. 3Hz, 3H)

III-20* : 7. 45-7. 55 (m, 1H), 7. 40 (t, J=7. 8Hz, 1H), 7. 25-7. 35 (m, 2H), 5. 24 (d, J=15. 9Hz, 0. 5H), 5. 04 (d, J=15. 6Hz, 0. 5H), 4. 45 (d, J=15. 6Hz, 0. 5H), 4. 23 (d, J=15. 9Hz, 0. 5H), 3. 30-3. 40 (m, 2H), 2. 55-2. 65 (m, 1H), 2. 00-2. 20 (m, 2H), 1. 85-1. 95 (m, 1H), 1. 45-1. 55 (m, 2H), 1. 20-1. 35 (m, 1H), 1. 10-1. 20 (m, 1H), 1. 06 (d, J=6. 0Hz, 3H), 0. 95-1. 05 (m, 1H), 0. 85-0. 95 (m, 1H)

III-23 : 7. 40-7. 50 (m, 1H), 7. 30-7. 40 (m, 2H), 7. 21 (d, J=8. 1Hz, 1H), 4. 87 (t, J=15. 3Hz, 1H), 4. 54 (t, J=16. 5Hz, 1H), 4. 00-4. 15 (m, 2H), 3. 15-3. 25 (m, 2H), 2. 55-2. 65 (m, 1H), 1. 90-2. 20 (m, 3H), 1. 75-1. 90 (m, 1H), 1. 40-1. 55 (m, 1H), 1. 03 (t, J=6. 3Hz, 3H), 0. 85-0. 90 (m, 6H)

III-24 : 7. 35-7. 50 (m, 3H), 7. 21 (d, J=7. 8Hz, 1H), 4. 86 (t, J=15. 3Hz, 1H), 4. 25-4. 60 (m, 3H), 3. 10-3. 25 (m, 2H), 2. 55-2. 70 (m, 1H), 2. 00-2. 20 (m, 1H), 1. 65-1. 95 (m, 2H), 1. 10-1. 55 (m, 6H), 0. 85-0. 95 (m, 3H)

III-25 : 11. 90 (brs, 1H), 7. 62 (d, J=7. 2Hz, 1H), 7. 37 (dt, J=1. 8, 7. 2Hz, 1H), 7. 25-7. 30 (m, 1H), 7. 18 (dt, J=1. 2, 7. 5Hz, 1H), 4. 54 (d, J=14. 7Hz, 1H), 4. 40 (d, J=14. 7Hz, 1H), 3. 35-3. 55 (m, 2H), 2. 57 (ddd, J=2. 1, 5. 1, 18. 0Hz, 1H), 1. 85-2. 00 (m, 2H), 1. 70-1. 85 (m, 1H), 1. 50-1. 60 (m, 2H), 1. 35-1. 50 (m, 1H), 1. 20-1. 35 (m, 2H), 0. 89 (t, J=6. 9Hz, 3H)

III-26 : 7. 49 (t, J=7. 5Hz, 1H), 7. 39 (t, J=7. 8Hz, 1H), 7. 25-7. 35 (m, 1H), 7. 20 (d, J=7. 8Hz, 1H), 5. 06 (dd, J=15. 6, 46. 8Hz, 1H), 4. 21 (dd, J=15. 6, 60. 3Hz, 1H), 3. 33 (dt, J=3. 9, 7. 5Hz, 2H), 2. 55-2. 65 (m, 1H), 2. 25-2. 50 (m, 2H), 2. 00-2. 15 (m, 1H), 1. 80-2. 00 (m, 2H), 1. 50-1. 60 (m, 1H), 1. 25-1. 40 (m, 4H), 1. 11 (dt, J=2. 4, 7. 5Hz, 3H), 0. 92 (t, J=6. 6Hz, 3H)

III-27 : 7. 45-7. 55 (m, 1H), 7. 35-7. 45 (m, 1H), 7. 25-7. 35 (m, 2H), 5. 14 (dd, J=15. 6, 51. 9Hz, 1H), 4. 32 (dd, J=15. 6, 60. 0Hz, 1H), 3. 25-3. 35 (m, 2H), 2. 55-2. 65 (m, 1H), 2. 05-2. 15 (m, 1H), 1. 85-2. 00 (m, 2H), 1. 25-1. 40 (m, 6H), 0. 95-1. 15 (m, 4H), 0. 9

3 (t, J=6.3 Hz, 3H)

III-30 : 11.97 (brs, 1H), 7.55–7.65 (m, 1H), 7.15–7.45 (m, 3H), 4.57 (d, J=14.7 Hz, 1H), 4.38 (d, J=14.7 Hz, 1H), 3.30–3.60 (m, 2H), 2.45–2.65 (m, 1H), 1.85–2.15 (m, 2H), 1.30–1.60 (m, 3H), 0.80–0.95 (m, 6H)

III-32 : 7.20–7.55 (m, 4H), 4.90–5.20 (m, 1H), 4.05–4.40 (m, 1H), 3.25–3.40 (m, 2H), 2.05–2.65 (m, 4H), 1.85–2.00 (m, 1H), 1.40–1.70 (m, 3H), 1.05–1.15 (m, 3H), 0.90 (d, J=7.6 Hz, 6H)

III-33 : 7.20–7.55 (m, 4H), 5.00–5.30 (m, 1H), 4.15–4.50 (m, 1H), 3.25–3.40 (m, 2H), 2.50–2.65 (m, 1H), 2.10–2.30 (m, 1H), 1.85–2.00 (m, 1H), 0.80–1.70 (m, 14H)

III-34 : 11.95 (brs, 1H), 7.55–7.65 (m, 1H), 7.15–7.45 (m, 3H), 4.51 (d, J=14.7 Hz, 1H), 4.43 (d, J=14.7 Hz, 1H), 3.30–3.60 (m, 2H), 2.50–2.70 (m, 1H), 2.15–2.30 (m, 1H), 1.90–2.05 (m, 1H), 1.50–1.70 (m, 1H), 0.95–1.15 (m, 1H), 0.35–0.65 (m, 3H), 0.05–0.20 (m, 2H)

III-35 : 7.15–7.55 (m, 4H), 4.95–5.20 (m, 1H), 4.10–4.35 (m, 1H), 3.20–3.45 (m, 2H), 2.20–2.75 (m, 4H), 1.90–2.10 (m, 1H), 1.55–1.80 (m, 1H), 1.05–1.20 (m, 4H), 0.40–0.70 (m, 3H), 0.05–0.25 (m, 2H)

III-36 : 7.25–7.55 (m, 4H), 5.05–5.25 (m, 1H), 4.15–4.50 (m, 1H), 3.20–3.45 (m, 2H), 2.55–2.75 (m, 1H), 2.20–2.40 (m, 1H), 1.90–2.10 (m, 1H), 0.80–1.85 (m, 7H), 0.35–0.75 (m, 3H), 0.05–0.25 (m, 2H)

III-37 : 7.15–7.55 (m, 4H), 4.75–4.90 (m, 1H), 4.50–4.65 (m, 1H), 4.25–4.50 (m, 2H), 3.15–3.20 (m, 2H), 2.55–2.75 (m, 1H), 2.20–2.40 (m, 1H), 1.85–2.05 (m, 1H), 1.50–1.75 (m, 1H), 1.25–1.40 (m, 3H), 1.05–1.25 (m, 1H), 0.40–0.70 (m, 3H), 0.05–0.25 (m, 2H)

III-39 : 11.75 (brs, 1H), 7.61 (dd, J=0.9, 8.1 Hz, 1H), 7.37 (dt, J=1.8, 8.1 Hz, 1H), 7.25–7.30 (m, 1H), 7.19 (dt, J=0.9, 7.5 Hz, 1H), 4.65 (d, J=14.4 Hz, 1H), 4.31 (d, J=14.4 Hz, 1H), 3.55–3.70 (m, 2H), 3.35–3.45 (m, 1H), 3.33 (s, 3H), 2.59 (d, J=4.5 Hz, 2H), 1.85–2.05 (m, 2H)

III-40 : 7.46 (t, J=7.5 Hz, 1H), 7.30–7.40 (m, 2H), 7.21 (d, J=8.1 Hz, 1H), 4.80 (t,

J=15.0 Hz, 1H), 4.55–4.65 (m, 1H), 4.30–4.45 (m, 2H), 3.65–3.75 (m, 1H), 3.37 (s, 3H), 3.30–3.40 (m, 1H), 3.05–3.15 (m, 1H), 2.73 (dd, J=4.2, 17.1 Hz, 1H), 2.55–2.70 (m, 1H), 1.90–2.00 (m, 2H), 1.32 (dt, J=0.9, 7.2 Hz, 3H)

III-41 : 11.85 (brs, 1H), 7.62 (dd, J=1.2, 8.1 Hz, 1H), 7.38 (dt, J=1.8, 7.5 Hz, 1H), 7.25–7.30 (m, 1H), 7.19 (dt, J=1.2, 7.5 Hz, 1H), 4.67 (d, J=14.7 Hz, 1H), 4.30 (d, J=14.7 Hz, 1H), 3.70–3.80 (m, 1H), 3.35–3.65 (m, 4H), 2.50–2.65 (m, 2H), 1.90–2.00 (m, 2H), 1.17 (t, J=7.2 Hz, 3H)

III-42 : 7.45–7.50 (m, 1H), 7.25–7.40 (m, 2H), 7.20 (d, J=6.9 Hz, 1H), 5.00–5.10 (m, 1H), 4.22 (t, J=16.5 Hz, 1H), 3.80–3.90 (m, 1H), 3.45–3.60 (m, 3H), 3.20–3.30 (m, 1H), 2.60–2.65 (m, 2H), 2.25–2.50 (m, 2H), 1.95–2.05 (m, 2H), 1.20–1.25 (m, 3H), 1.11 (t, J=7.2 Hz, 3H)

III-43 : 7.40–7.50 (m, 1H), 7.30–7.40 (m, 2H), 7.20 (d, J=8.1 Hz, 1H), 4.60–4.75 (m, 2H), 4.25–4.45 (m, 2H), 3.75–3.85 (m, 1H), 3.45–3.60 (m, 2H), 3.30–3.40 (m, 1H), 3.05–3.15 (m, 1H), 2.55–2.75 (m, 2H), 1.85–2.00 (m, 2H), 1.32 (t, J=7.2 Hz, 3H), 1.21 (t, J=7.2 Hz, 3H)

III-44 : 7.61 (d, J=8.1 Hz, 1H), 7.38 (dt, J=2.1, 8.1 Hz, 1H), 7.25–7.30 (m, 1H), 7.15–7.25 (m, 1H), 4.55 (d, J=15.0 Hz, 1H), 4.43 (d, J=14.4 Hz, 1H), 3.55–3.70 (m, 1H), 3.40–3.50 (m, 1H), 2.95–3.25 (m, 1H), 2.75–2.90 (m, 1H), 2.40–2.50 (m, 1H), 2.10–2.20 (m, 1H), 2.10 (s, 3H), 1.75–1.95 (m, 1H)

III-52 : 7.45–7.55 (m, 1H), 7.25–7.40 (m, 2H), 7.20 (d, J=6.9 Hz, 1H), 5.11 (d, J=15.8 Hz, 1H), 4.22 (d, J=15.8 Hz, 1H), 3.33 (t, J=6.3 Hz, 2H), 2.30 (s, 2H), 2.25–2.40 (m, 2H), 1.55–1.70 (m, 5H), 1.20–1.35 (m, 1H), 1.05 (s, 6H), 0.85 (t, J=7.2 Hz, 3H)

III-53 : 7.49 (dt, J=1.2, 7.5 Hz, 1H), 7.30–7.40 (m, 2H), 7.14 (d, J=7.5 Hz, 1H), 5.19 (d, J=15.9 Hz, 1H), 4.12 (d, J=15.9 Hz, 1H), 3.31 (t, J=6.3 Hz, 2H), 3.00–3.15 (m, 1H), 2.40–2.55 (m, 1H), 2.29 (s, 2H), 2.15–2.30 (m, 1H), 1.90–2.05 (m, 1H), 1.70–1.90 (m, 3H), 1.66 (t, J=6.3 Hz, 2H), 1.05 (d, J=1.2 Hz, 6H)

III-54 : 7.50 (t, J=7.5 Hz, 1H), 7.40 (t, J=7.5 Hz, 1H), 7.34 (d, J=7.5 Hz, 1H), 7.20 (d, J=7.5 Hz, 1H), 5.08 (d, J=15.6 Hz, 1H), 4.24 (d, J=15.6 Hz, 1H), 3.32 (t, J=6.3 Hz

, 2H), 2. 20–2. 40 (m, 4H), 1. 50–1. 75 (m, 4H), 1. 15–1. 35 (m, 4H), 1. 05 (s, 6H), 0. 85 (t, J=6. 6Hz, 3H)

III-56 : 8. 10–8. 25 (m, 1H), 7. 45–7. 60 (m, 2H), 7. 30–7. 45 (m, 2H), 7. 20–7. 30 (m, 2H), 7. 10–7. 20 (m, 2H), 5. 20 (d, J=16. 5Hz, 1H), 4. 38 (d, J=16. 5Hz, 1H), 3. 32 (t, J=6. 6Hz, 2H), 2. 31 (s, 2H), 1. 67 (t, J=6. 6Hz, 2H), 1. 06 (s, 6H)

III-57 : 7. 45 (t, J=7. 5Hz, 1H), 7. 25–7. 40 (m, 2H), 7. 20 (d, J=8. 4Hz, 1H), 4. 79 (d, J=15. 6Hz, 1H), 4. 59 (d, J=15. 3Hz, 1H), 3. 89 (s, 3H), 3. 19 (t, J=6. 3Hz, 2H), 2. 30 (s, 2H), 1. 55–1. 65 (m, 2H), 1. 02 (s, 6H)

III-61 : 7. 44 (d, J=7. 5Hz, 1H), 7. 30–7. 40 (m, 2H), 7. 22 (t, J=7. 5Hz, 1H), 4. 83 (d, J=15. 6Hz, 1H), 4. 60 (d, J=15. 6Hz, 1H), 4. 06 (d, J=10. 2Hz, 1H), 3. 86 (d, J=10. 2Hz, 1H), 3. 19 (t, J=6. 6Hz, 2H), 2. 30 (s, 2H), 1. 50–1. 70 (m, 2H), 1. 03 (s, 6H), 0. 85 (s, 9H)

III-62 : 7. 46 (t, J=7. 8Hz, 1H), 7. 30–7. 40 (m, 2H), 7. 21 (d, J=7. 8Hz, 1H), 4. 78 (d, J=15. 6Hz, 1H), 4. 66 (d, J=15. 6Hz, 1H), 4. 00–4. 20 (m, 2H), 3. 20 (t, J=6. 3Hz, 2H), 2. 30 (s, 2H), 1. 85–2. 05 (m, 1H), 1. 50–1. 70 (m, 2H), 1. 02 (s, 6H), 0. 87 (d, J=6. 9Hz, 6H)

III-63 : 7. 40–7. 50 (m, 1H), 7. 30–7. 40 (m, 2H), 7. 20 (d, J=8. 1Hz, 1H), 4. 77 (d, J=15. 3Hz, 1H), 4. 64 (d, J=15. 6Hz, 1H), 4. 28 (t, J=6. 9Hz, 2H), 3. 19 (t, J=6. 6Hz, 2H), 2. 30 (s, 2H), 1. 55–1. 70 (m, 3H), 1. 20–1. 30 (m, 7H), 1. 02 (s, 6H), 0. 86 (t, J=6. 9Hz, 3H)

III-64 : 7. 47 (d, J=7. 5Hz, 1H), 7. 30–7. 40 (m, 2H), 7. 23 (t, J=7. 5Hz, 1H), 4. 71 (s, 2H), 4. 45–4. 60 (m, 2H), 3. 65–3. 75 (m, 2H), 3. 21 (t, J=6. 0Hz, 2H), 2. 33 (d, J=16. 2Hz, 1H), 2. 26 (d, J=16. 2Hz, 1H), 1. 50–1. 70 (m, 2H), 1. 02 (d, J=2. 1Hz, 6H)

III-65 : 7. 46 (d, J=7. 5Hz, 1H), 7. 30–7. 40 (m, 2H), 7. 15–7. 25 (m, 1H), 6. 28 (t, J=5. 2Hz, 1H), 4. 79 (d, J=15. 3Hz, 1H), 4. 61 (d, J=15. 3Hz, 1H), 3. 22 (d, J=6. 3Hz, 1H), 3. 17 (d, J=6. 3Hz, 1H), 2. 25–2. 35 (m, 2H), 2. 05–2. 25 (m, 1H), 1. 45–1. 70 (m, 2H), 1. 02 (d, J=3. 6Hz, 6H), 0. 75–1. 00 (m, 6H) III-66 : 7. 46 (d, J=7. 5Hz, 1H), 7. 30–7. 40 (m, 2H), 7. 15–7. 25 (m, 1H), 6. 26 (quint, J=6. 0Hz, 1H), 4. 79 (d, J=15. 3Hz, 1H), 4. 60 (

d, J=15.3 Hz, 1H), 3.21 (d, J=6.6 Hz, 1H), 3.17 (d, J=6.6 Hz, 1H), 2.30 (s, 2H), 1.80 (dd, J=6.0, 4.5 Hz, 3H), 1.50–1.70 (m, 2H), 1.02 (d, J=3.3 Hz, 6H)

III-68 : 7.40–7.50 (m, 1H), 7.30–7.40 (m, 2H), 7.22 (d, J=8.1 Hz, 1H), 4.71 (dd, J=15.6, 21.0 Hz, 2H), 4.35–4.50 (m, 2H), 3.58 (dt, J=0.9, 4.5 Hz, 2H), 3.30 (s, 3H), 3.19 (t, J=6.3 Hz, 2H), 2.30 (s, 2H), 1.55–1.70 (m, 2H), 1.03 (s, 6H)

III-69 : 7.20–7.55 (m, 9H), 4.91 (d, J=15.6 Hz, 1H), 4.73 (d, J=15.0 Hz, 1H), 3.22 (t, J=6.6 Hz, 2H), 2.32 (dd, J=16.8, 23.4 Hz, 2H), 1.50–1.70 (m, 2H), 1.02 (d, J=4.5 Hz, 6H)

III-71 : 7.65–7.95 (m, 4H), 7.30–7.60 (m, 7H), 4.97 (d, J=15.6 Hz, 1H), 4.76 (d, J=15.6 Hz, 1H), 3.20 (t, J=6.3 Hz, 2H), 2.35 (d, J=17.4 Hz, 1H), 2.27 (d, J=17.4 Hz, 1H), 1.40–1.70 (m, 2H), 0.97 (d, J=6.3 Hz, 6H)

III-72 : 7.55 (d, J=6.9 Hz, 1H), 7.25–7.45 (m, 3H), 4.81 (s, 2H), 3.23 (t, J=6.3 Hz, 2H), 2.35 (s, 2H), 1.55–1.70 (m, 2H), 1.06 (s, 6H)

III-73 : 12.0 (brs, 1H), 7.62 (d, J=8.1 Hz, 1H), 7.38 (t, J=8.1 Hz, 1H), 7.15–7.35 (m, 2H), 4.51 (d, J=14.4 Hz, 1H), 4.45 (d, J=14.7 Hz, 1H), 3.46 (t, J=6.3 Hz, 2H), 2.21 (s, 2H), 1.50–1.70 (m, 2H), 1.28 (q, J=7.6 Hz, 2H), 0.89 (s, 3H), 0.84 (t, J=7.5 Hz, 3H)

III-74 : 7.45–7.55 (m, 1H), 7.30–7.45 (m, 2H), 7.21 (d, J=7.5 Hz, 1H), 5.00 (dd, J=15.6, 18.9 Hz, 1H), 4.28 (dd, J=15.9, 21.0 Hz, 1H), 3.20–3.40 (m, 2H), 2.15–2.35 (m, 5H), 1.55–1.80 (m, 2H), 1.37 (q, J=7.5 Hz, 2H), 0.99 (s, 3H), 0.89 (dt, J=1.8, 7.8 Hz, 3H)

III-75 : 7.50 (d, J=7.8 Hz, 1H), 7.25–7.45 (m, 2H), 7.21 (d, J=7.8 Hz, 1H), 5.11 (t, J=13.2 Hz, 1H), 4.19 (t, J=13.2 Hz, 1H), 3.25–3.45 (m, 2H), 2.20–2.50 (m, 4H), 1.55–1.80 (m, 2H), 1.37 (q, J=7.5 Hz, 2H), 1.11 (t, J=7.5 Hz, 3H), 0.99 (s, 3H), 0.87 (t, J=7.5 Hz, 3H)

III-76 : 7.49 (dt, J=1.5, 7.5 Hz, 1H), 7.30–7.45 (m, 3H), 5.18 (dd, J=10.2, 16.2 Hz, 1H), 4.30 (dd, J=11.4, 16.2 Hz, 1H), 3.25–3.35 (m, 2H), 2.25–2.30 (m, 2H), 1.60–1.75 (m, 1H), 1.50–1.55 (m, 4H), 1.38 (q, J=7.8 Hz, 2H), 1.25–1.35 (m, 1H), 1.10–1.2

0 (m, 1H), 0.99 (s, 3H), 0.85–0.95 (m, 3H)

III-77 : 7.46 (t, J=7.8Hz, 1H), 7.25–7.50 (m, 2H), 7.21 (d, J=7.8Hz, 1H), 5.71 (dd, J=15.2, 18.2Hz, 1H), 4.59 (dd, J=15.2, 18.2Hz, 1H), 3.90 (s, 3H), 3.10–3.25 (m, 2H), 2.20–2.35 (m, 2H), 1.50–1.70 (m, 2H), 1.35 (q, J=7.4Hz, 2H), 0.96 (s, 3H), 0.84 (t, J=7.4Hz, 3H)

III-78 : 7.46 (t, J=7.5Hz, 1H), 7.30–7.40 (m, 2H), 7.21 (d, J=7.8Hz, 1H), 4.55–4.85 (m, 2H), 4.25–4.45 (m, 2H), 3.10–3.25 (m, 2H), 2.20–2.35 (m, 2H), 1.45–1.70 (m, 2H), 1.20–1.40 (m, 5H), 0.96 (s, 3H), 0.87 (t, J=7.5Hz, 3H)

III-79 : 11.94 (brs, 1H), 7.55–7.65 (m, 1H), 7.15–7.40 (m, 3H), 4.56 (d, J=14.4Hz, 1H), 4.35 (d, J=14.4Hz, 1H), 3.35–3.50 (m, 2H), 1.80–2.05 (m, 2H), 1.45–1.65 (m, 2H), 1.20–1.30 (m, 3H), 1.01 (t, J=6.0Hz, 3H)

III-80 : 7.15–7.50 (m, 4H), 4.25–5.05 (m, 4H), 3.10–3.25 (m, 2H), 2.00–2.15 (m, 1H), 1.50–1.90 (m, 3H), 1.25–1.35 (m, 6H), 1.05–1.10 (m, 3H)

III-81 : 7.45–7.55 (m, 1H), 7.35–7.45 (m, 2H), 7.20–7.30 (m, 1H), 4.93 (dd, J=15.3, 31.8Hz, 1H), 4.45–4.65 (m, 3H), 4.30–4.45 (m, 2H), 3.55–3.65 (m, 1H), 3.20–3.30 (m, 1H), 2.65–2.85 (m, 1H), 2.00–2.10 (m, 1H), 1.33 (t, J=7.2Hz, 3H)

III-82* : 7.35–7.55 (m, 3H), 7.22 (d, J=7.8Hz, 1H), 5.07 (d, J=15.9Hz, 0.5H), 4.80–4.90 (m, 1.5H), 4.65–4.75 (m, 1H), 4.62 (d, J=15.6Hz, 0.5H), 4.30–4.45 (m, 2.5H), 3.65–3.75 (m, 1H), 3.25–3.40 (m, 1H), 2.80–2.95 (m, 1H), 2.00–2.15 (m, 1H), 1.33 (dt, J=1.5, 7.2Hz, 3H)

III-83* : 11.14 (brs, 1H), 7.61 (d, J=8.4Hz, 1H), 7.35–7.45 (m, 1H), 7.15–7.30 (m, 2H), 4.55–4.65 (m, 1H), 4.35–4.45 (m, 1.5H), 4.04 (d, J=7.5Hz, 0.5H), 3.40–3.55 (m, 2H), 1.95–2.25 (m, 2H), 1.55–1.75 (m, 1H), 1.12 (dd, J=3.3, 6.6Hz, 3H)

III-84* : 7.45–7.50 (m, 1H), 7.30–7.40 (m, 2H), 7.21 (d, J=7.8Hz, 1H), 4.88 (dd, J=6.0, 15.6Hz, 0.5H), 4.25–4.75 (m, 4H), 4.05–4.20 (m, 0.5H), 3.15–3.30 (m, 2H), 2.20–2.40 (m, 1H), 1.90–2.20 (m, 1H), 1.55–1.65 (m, 1H), 1.25–1.35 (m, 3H), 1.10–1.20 (m, 3H)

III-85 : 11.41 (brs, 1H), 7.61 (d, J=8.3Hz, 1H), 7.39 (t, J=8.3Hz, 1H), 7.15–7.30

(m, 2H), 4.51 (d, J=10.7Hz, 2H), 4.05–4.30 (m, 2H), 3.35–3.55 (m, 2H), 1.85–2.30 (m, 2H), 1.45–1.75 (m, 2H), 1.15–1.30 (m, 3H), 1.02 (dd, J=2.5, 6.9Hz, 3H)

III-86 : 11.25 (brs, 1H), 7.55–7.65 (m, 1H), 7.10–7.40 (m, 3H), 4.49 (q, J=7.8Hz, 2H), 4.19 (q, J=7.8Hz, 2H), 4.12 (q, J=7.8Hz, 2H), 3.40–3.55 (m, 2H), 3.12 (d, J=9.0Hz, 1H), 1.95–2.15 (m, 1H), 1.35–1.65 (m, 2H), 1.20–1.30 (m, 3H), 0.92 (t, J=7.8Hz, 3H)

III-87 : 7.10–7.60 (m, 4H), 4.15–4.90 (m, 8H), 3.10–3.40 (m, 3H), 0.85–2.30 (m, 12H)

III-88 : 11.90 (brs, 1H), 7.60–7.65 (m, 1H), 7.15–7.40 (m, 3H), 4.60 (d, J=14.7Hz, 1H), 4.31 (d, J=14.7Hz, 1H), 3.35–3.40 (m, 1H), 3.00–3.10 (m, 1H), 2.05–2.35 (m, 2H), 1.70–1.85 (m, 1H), 0.90–1.00 (m, 6H), 0.77 (s, 3H)

III-89 : 7.15–7.50 (m, 4H), 4.25–5.10 (m, 4H), 3.00–3.15 (m, 1H), 2.75–2.90 (m, 1H), 2.30–2.40 (m, 2H), 1.75–1.85 (m, 1H), 1.25–1.35 (m, 3H), 0.95–1.05 (m, 3H), 0.80–0.90 (m, 6H)

III-90 : 11.59 (brs, 1H), 7.55–7.60 (m, 1H), 7.15–7.40 (m, 3H), 4.96 (d, J=15.0Hz, 1H), 4.27 (d, J=15.0Hz, 1H), 3.60–3.75 (m, 1H), 2.20–2.25 (m, 2H), 1.70–1.80 (m, 1H), 1.40–1.50 (m, 4H), 0.99 (s, 3H), 0.69 (s, 3H)

III-91 : 7.15–7.45 (m, 4H), 4.25–5.00 (m, 4H), 3.50–3.60 (m, 1H), 2.30–2.40 (m, 2H), 1.70–1.75 (m, 1H), 1.45–1.55 (m, 1H), 1.00–1.40 (m, 12H)

III-94 : 11.92 (brs, 1H), 7.60–7.65 (m, 1H), 7.30–7.40 (m, 1H), 7.15–7.30 (m, 2H), 4.54 (d, J=14.4Hz, 1H), 4.37 (d, J=14.4Hz, 1H), 3.35–3.45 (m, 2H), 2.16 (q, J=7.2Hz, 1H), 1.55–1.75 (m, 2H), 1.16 (q, J=7.2Hz, 3H), 0.96 (s, 3H), 0.83 (s, 3H)

III-95 : 7.15–7.50 (m, 4H), 4.97 (d, J=15.7Hz, 1H), 4.55–4.75 (m, 1H), 4.25–4.45 (m, 2H), 3.10–3.20 (m, 2H), 2.25–2.30 (m, 1H), 1.60–1.70 (m, 2H), 1.20–1.35 (m, 6H), 0.04 (s, 3H), 0.92 (s, 3H)

III-96 : 11.80 (brs, 1H), 7.64 (d, J=8.1Hz, 1H), 7.10–7.45 (m, 8H), 4.60 (d, J=14.4Hz, 1H), 4.46 (d, J=14.4Hz, 1H), 3.55 (dd, J=4.2, 7.8Hz, 2H), 3.00–3.15 (m, 1H), 2.70–2.85 (m, 1H), 2.45–2.60 (m, 1H), 2.05–2.25 (m, 1H), 1.85–2.05 (m, 1H)

III-97* : 7.40–7.50 (m, 1H), 7.25–7.40 (m, 4H), 7.15–7.25 (m, 4H), 4.95 (d, J=15.6Hz, 0.5H), 4.83 (d, J=15.6Hz, 0.5H), 4.66 (d, J=15.6Hz, 0.5H), 4.55 (d, J=15.6Hz, 0.5H), 4.25–4.50 (m, 2H), 3.00–3.40 (m, 3H), 2.75–2.95 (m, 1H), 2.50–2.75 (m, 1H), 1.80–2.20 (m, 2H), 1.32 (dt, J=2.1, 7.2Hz, 3H)

III-98* : 7.45–7.60 (m, 1H), 7.30–7.45 (m, 4H), 7.15–7.30 (m, 4H), 5.15 (d, J=15.6Hz, 0.5H), 5.00 (d, J=15.6Hz, 0.5H), 4.42 (d, J=15.6Hz, 0.5H), 4.22 (d, J=15.6Hz, 0.5H), 3.25–3.55 (m, 2H), 3.10–3.25 (m, 1H), 2.75–2.90 (m, 1H), 2.55–2.70 (m, 1H), 2.25–2.55 (m, 2H), 1.95–2.25 (m, 2H), 1.13 (dt, J=3.0, 6.9Hz, 3H)

III-99 : 11.70 (bs, 1H), 7.60–7.65 (m, 1H), 7.15–7.45 (m, 3H), 4.52 (s, 2H), 3.52 (t, J=6.0Hz, 2H), 2.33 (s, 2H), 1.63 (t, J=6.0Hz, 2H), 0.48 (s, 4H)

III-104 : 7.46 (dt, J=1.5, 7.5Hz, 1H), 7.30–7.40 (m, 2H), 7.21 (d, J=7.5Hz, 1H), 4.78 (d, J=15.6Hz, 1H), 4.69 (d, J=15.6Hz, 1H), 4.26 (t, J=6.3Hz, 2H), 3.25 (t, J=6.3Hz, 2H), 2.44 (d, J=18.0Hz, 1H), 2.36 (d, J=18.0Hz, 1H), 1.50–1.75 (m, 4H), 0.89 (t, J=7.5Hz, 3H), 0.40–0.50 (m, 4H)

III-105 : 7.45–7.50 (m, 1H), 7.30–7.40 (m, 2H), 7.20–7.25 (m, 1H), 4.80 (d, J=15.6Hz, 1H), 4.69 (d, J=15.6Hz, 1H), 4.00–4.15 (m, 2H), 3.26 (t, J=6.0Hz, 2H), 2.44 (d, J=18.0Hz, 1H), 2.36 (d, J=18.0Hz, 1H), 1.90–2.00 (m, 1H), 1.55–1.70 (m, 2H), 0.87 (d, J=6.6Hz, 6H), 0.40–0.45 (m, 4H)

III-106 : 7.48 (dt, J=1.2, 7.8Hz, 1H), 7.30–7.40 (m, 2H), 7.20–7.25 (m, 1H), 4.83 (d, J=15.6Hz, 1H), 4.67 (d, J=15.6Hz, 1H), 4.45–4.60 (m, 2H), 3.70 (t, J=5.7Hz, 2H), 3.27 (t, J=5.7Hz, 2H), 2.47 (d, J=18.0Hz, 1H), 2.32 (d, J=18.0Hz, 1H), 1.60–1.75 (m, 1H), 1.50–1.60 (m, 1H), 0.40–0.45 (m, 4H)

III-107 : 11.91 (brs, 1H), 7.62 (d, J=8.1Hz, 1H), 7.38 (t, J=8.4Hz, 1H), 7.25–7.30 (m, 1H), 7.19 (t, J=7.2Hz, 1H), 4.48 (s, 2H), 3.47 (t, J=6.3Hz, 2H), 2.31 (s, 2H), 1.60–1.75 (m, 6H), 1.40–1.45 (m, 4H)

III-109 : 7.49 (dt, J=1.5, 7.5Hz, 1H), 7.40 (dt, J=1.8, 8.1Hz, 1H), 7.25–7.35 (m, 2H), 5.19 (d, J=15.9Hz, 1H), 4.29 (d, J=15.9Hz, 1H), 3.30–3.40 (m, 2H), 2.39 (s, 2H), 1.65–1.80 (m, 6H), 1.45–1.55 (m, 5H), 1.25–1.35 (m, 1H), 1.10–1.20 (m, 1H), 0.9

5-1.05 (m, 1H), 0.85-0.95 (m, 1H)

III-110 : 7.45 (dt, J=1.2, 7.8Hz, 1H), 7.30-7.40 (m, 2H), 7.20 (d, J=8.1Hz, 1H), 4.78 (d, J=15.3Hz, 1H), 4.60 (d, J=15.6Hz, 1H), 4.25-4.45 (m, 2H), 3.19 (t, J=6.6Hz, 2H), 2.40 (s, 2H), 1.60-1.80 (m, 6H), 1.45-1.50 (m, 4H), 1.32 (t, J=7.2Hz, 3H)

III-111 : 7.46 (dt, J=1.5, 7.8Hz, 1H), 7.30-7.40 (m, 2H), 7.21 (d, J=7.8Hz, 1H), 4.81 (d, J=15.3Hz, 1H), 4.60 (d, J=15.6Hz, 1H), 4.00-4.15 (m, 2H), 3.19 (t, J=6.3Hz, 2H), 2.40 (s, 2H), 1.90-2.00 (m, 1H), 1.60-1.75 (m, 6H), 1.45-1.50 (m, 4H), 0.87 (dd, J=1.5, 6.9Hz, 6H)

III-112* : 7.40-7.50 (m, 1H), 7.20-7.40 (m, 2H), 7.10-7.20 (m, 1H), 4.96 (d, J=15.8Hz, 0.5H), 4.71 (d, J=14.7Hz, 0.5H), 4.58 (d, J=14.7Hz, 0.5H), 4.20-4.45 (m, 2.5H), 2.90-3.10 (m, 2H), 1.90-2.05 (m, 2H), 1.80-1.90 (m, 1H), 1.60-1.70 (m, 1H), 1.25-1.35 (m, 3H), 1.15-1.25 (m, 1H), 0.95-1.10 (m, 1H)

III-113 : 7.15-7.50 (m, 4H), 4.82 (d, J=15.6Hz, 1H), 4.50 (d, J=15.6Hz, 1H), 4.25-4.45 (m, 2H), 3.50-3.70 (m, 2H), 3.25-3.45 (m, 1H), 2.85-2.95 (m, 1H), 2.20-2.35 (m, 1H), 1.95-2.15 (m, 1H), 1.25-1.40 (m, 3H)

III-114 : 7.55-7.65 (m, 1H), 7.15-7.45 (m, 3H), 4.60 (d, J=14.7Hz, 1H), 4.27 (d, J=14.7Hz, 1H), 3.45-3.60 (m, 1H), 3.35 (s, 1H), 3.15-3.30 (m, 1H), 1.95-2.20 (m, 2H), 1.47 (s, 3H)

III-115 : 7.57 (d, J=8.1Hz, 1H), 7.37 (t, J=8.1Hz, 1H), 7.20-7.35 (m, 2H), 6.13 (d, J=7.5Hz, 1H), 5.15 (d, J=7.5Hz, 1H), 4.58 (s, 2H), 2.38 (s, 2H), 0.97 (s, 6H)

III-117 : 10.54 (brs, 1H), 7.60 (d, J=8.4Hz, 1H), 7.35-7.45 (m, 2H), 7.20-7.35 (m, 1H), 5.26 (s, 2H), 3.60 (t, J=6.6Hz, 2H), 2.84 (s, 2H), 1.69 (t, J=6.6Hz, 2H), 0.97 (s, 6H)

III-118 : 7.48 (t, J=7.2Hz, 1H), 7.30-7.45 (m, 2H), 7.24 (d, J=7.2Hz, 1H), 5.72 (d, J=15.0Hz, 1H), 5.16 (d, J=15.0Hz, 1H), 4.25-4.50 (m, 2H), 3.38 (t, J=6.3Hz, 2H), 2.94 (s, 2H), 1.50-1.80 (m, 2H), 1.26 (t, J=7.2Hz, 3H), 1.02 (s, 6H)

III-119 : 11.50 (brs, 1H), 7.66 (dd, J=0.9, 7.8Hz, 1H), 7.41 (dt, J=1.5, 7.8Hz, 1H), 7.25-7.35 (m, 1H), 7.20-7.25 (m, 1H), 4.68 (d, J=14.4Hz, 1H), 4.43 (d, J=14.4Hz

, 1H), 3.60–3.75 (m, 1H), 3.50–3.60 (m, 1H), 2.87 (d, J=18.6 Hz, 1H), 2.52 (d, J=18.6 Hz, 1H), 2.05–2.15 (m, 1H), 1.90–2.00 (m, 1H), 1.43 (d, J=7.2 Hz, 1H), 1.40 (d, J=7.2 Hz, 1H)

III-120 : 7.49 (tt, J=1.5, 7.5 Hz, 1H), 7.30–7.45 (m, 2H), 7.20–7.25 (m, 1H), 4.87 (dd, J=15.6, 15.9 Hz, 1H), 4.65 (dd, J=15.6, 24.0 Hz, 1H), 4.30–4.45 (m, 2H), 3.35–3.45 (m, 1H), 3.20–3.30 (m, 1H), 2.92 (dd, J=17.7, 27.0 Hz, 1H), 2.60 (d, J=17.7, 27.0 Hz, 1H), 2.10–2.20 (m, 1H), 1.85–1.95 (m, 1H), 1.40–1.45 (m, 2H), 1.33 (dt, J=1.2, 7.2 Hz, 3H)

IV-1 : 7.40–7.50 (m, 1H), 7.30–7.40 (m, 2H), 7.15–7.25 (m, 1H), 4.87 (d, J=15.3 Hz, 1H), 4.45–4.55 (m, 1H), 4.25–4.45 (m, 2H), 3.10–3.20 (m, 1H), 2.75–2.90 (m, 1H), 2.40–2.60 (m, 2H), 1.80–2.05 (m, 2H), 1.40–1.55 (m, 1H), 1.32 (dd, J=2.4, 7.2 Hz, 3H), 0.96 (dd, J=3.3, 6.6 Hz, 3H)

IV-3 : 7.40–7.50 (m, 1H), 7.30–7.40 (m, 2H), 7.20 (d, J=7.8 Hz, 1H), 4.80 (d, J=15.6 Hz, 1H), 4.54 (d, J=15.6 Hz, 1H), 4.25–4.45 (m, 2H), 2.91 (d, J=14.4 Hz, 1H), 2.88 (d, J=14.4 Hz, 1H), 2.53 (t, J=6.3 Hz, 2H), 1.64 (dt, J=3.0, 6.3 Hz, 2H), 1.31 (t, J=7.2 Hz, 3H), 0.99 (d, J=3.0 Hz, 6H)

IV-4 : 11.95 (brs, 1H), 7.62 (d, J=8.4 Hz, 1H), 7.10–7.45 (m, 3H), 4.52 (d, J=12.3 Hz, 1H), 4.40 (d, J=12.3 Hz, 1H), 3.35–3.50 (m, 2H), 2.35–2.60 (m, 1H), 1.40–2.00 (m, 4H), 1.23 (d, J=7.2 Hz, 3H)

IV-5 : 7.46 (t, J=8.4 Hz, 1H), 7.37 (t, J=8.4 Hz, 1H), 7.31 (d, J=8.4 Hz, 1H), 7.20 (d, J=8.4 Hz, 1H), 4.20–5.00 (m, 4H), 3.10–3.30 (m, 2H), 2.45–2.65 (m, 1H), 1.45–2.10 (m, 4H), 1.15–1.45 (m, 6H)

IV-6 : 12.00 (brs, 1H), 7.05–7.65 (m, 4H), 4.51 (d, J=14.6 Hz, 1H), 4.41 (d, J=14.6 Hz, 1H), 3.40–3.45 (m, 2H), 2.20–2.30 (m, 1H), 1.80–2.05 (m, 3H), 1.65–1.80 (m, 1H), 1.40–1.60 (m, 2H), 0.85–0.95 (m, 3H)

IV-7 : 7.45–7.50 (m, 1H), 7.35–7.40 (m, 1H), 7.20–7.30 (m, 2H), 5.00–5.25 (m, 1H), 4.00–4.25 (m, 1H), 3.30–3.35 (m, 2H), 2.20–2.45 (m, 3H), 1.55–2.05 (m, 6H), 1.05–1.15 (m, 3H), 0.95–1.00 (m, 3H)

IV-8 : 7.45–7.55 (m, 1H), 7.35–7.40 (m, 1H), 7.25–7.35 (m, 2H), 5.10–5.30 (m, 1H), 4.15–4.40 (m, 1H), 3.25–3.40 (m, 2H), 2.30–2.40 (m, 1H), 0.85–2.10 (m, 14H)

IV-9 : 7.15–7.45 (m, 4H), 4.30–5.00 (m, 4H), 3.15–3.20 (m, 2H), 2.30–2.45 (m, 1H), 1.55–2.05 (m, 6H), 1.25–1.35 (m, 3H), 0.95–1.05 (m, 3H)

IV-10 : 7.40–7.50 (m, 1H), 7.25–7.40 (m, 2H), 7.15–7.20 (m, 1H), 4.35–5.00 (m, 2H), 3.95–4.15 (m, 2H), 3.15–3.20 (m, 2H), 2.30–2.40 (m, 1H), 1.50–2.10 (m, 7H), 0.95–1.00 (m, 3H), 0.80–0.90 (m, 6H)

IV-11 : 12.01 (brs, 1H), 7.60–7.65 (m, 1H), 7.35–7.40 (m, 1H), 7.25–7.30 (m, 1H), 7.15–7.20 (m, 1H), 4.46 (dd, J=14.7, 32.4 Hz, 2H), 3.40–3.45 (m, 2H), 2.30–2.40 (m, 1H), 1.80–2.00 (m, 3H), 1.65–1.80 (m, 1H), 1.25–1.55 (m, 4H), 0.90 (t, J=7.2 Hz, 3H)

IV-12* : 7.40–7.50 (m, 1H), 7.25–7.40 (m, 2H), 7.19 (d, J=8.1 Hz, 1H), 4.95 (d, J=15.6 Hz, 0.5H), 4.68 (dd, J=15.6, 18.0 Hz, 1H), 4.25–4.45 (m, 2.5H), 3.15–3.20 (m, 2H), 2.35–2.50 (m, 1H), 1.90–2.05 (m, 2H), 1.80–1.90 (m, 1H), 1.65–1.80 (m, 1H), 1.35–1.65 (m, 4H), 1.20–1.35 (m, 3H), 0.96 (t, J=7.2 Hz, 3H)

IV-13 : 7.46 (dt, J=0.9, 7.5 Hz, 1H), 7.30–7.40 (m, 2H), 7.20 (d, J=7.2 Hz, 1H), 4.50–4.80 (m, 2H), 4.30–4.45 (m, 2H), 3.75–3.85 (m, 1H), 3.62 (s, 3H), 3.10–3.20 (m, 2H), 1.90–2.00 (m, 3H), 1.70–1.80 (m, 1H), 1.31 (t, J=7.2 Hz, 3H)

IV-14 : 11.57 (brs, 1H), 7.61 (t, J=9.0 Hz, 1H), 7.35–7.40 (m, 1H), 7.15–7.25 (m, 2H), 4.53 (d, J=14.1 Hz, 1H), 4.44 (d, J=14.1 Hz, 1H), 3.40–3.50 (m, 2H), 3.35–3.40 (m, 1H), 2.34 (s, 3H), 1.90–2.15 (m, 3H), 1.75–1.85 (m, 1H)

IV-15 : 7.45–7.50 (m, 1H), 7.35–7.40 (m, 2H), 7.20 (d, J=8.4 Hz, 1H), 4.91 (d, J=16.2 Hz, 1H), 4.47 (d, J=16.2 Hz, 1H), 4.30–4.40 (m, 2H), 3.45 (t, J=4.8 Hz, 1H), 3.15–3.25 (m, 2H), 2.39 (s, 3H), 2.20–2.25 (m, 1H), 1.95–2.20 (m, 2H), 1.70–1.80 (m, 1H), 1.31 (t, J=6.9 Hz, 3H)

IV-16 : 11.50 (brs, 1H), 7.10–7.80 (m, 9H), 4.40–4.70 (m, 2H), 3.75–3.95 (m, 1H), 3.30–3.65 (m, 2H), 1.70–2.30 (m, 4H)

IV-17 : 7.55–7.65 (m, 3H), 7.40–7.55 (m, 2H), 7.25–7.40 (m, 3H), 7.15–7.25 (m, 1H)

, 4.85 (d, J=15.6 Hz, 1H), 4.58 (d, J=15.6 Hz, 1H), 4.25–4.50 (m, 2H), 3.95–4.10 (m, 1H), 3.20 (d, J=6.0 Hz, 2H), 1.95–2.30 (m, 2H), 1.70–1.90 (m, 2H), 1.30 (dt, J=0.9, 7.2 Hz, 3H)

IV-18 : 11.12 (brs, 1H), 7.15–7.65 (m, 4H), 4.40–4.85 (m, 3H), 3.40–3.60 (m, 2H), 1.75–2.30 (m, 4H)

IV-19 : 7.45–7.60 (m, 1H), 7.30–7.45 (m, 2H), 7.15–7.25 (m, 1H), 5.06 (d, J=16.2 Hz, 1H), 4.45–4.55 (m, 1H), 4.15–4.30 (m, 1H), 3.30–3.45 (m, 2H), 2.20–2.50 (m, 5H), 1.80–1.95 (m, 1H), 1.08 (t, J=7.2 Hz, 3H)

IV-20 : 7.50–7.60 (m, 2H), 7.35–7.45 (m, 2H), 7.20–7.35 (m, 3H), 7.10–7.20 (m, 2H), 5.20 (d, J=16.2 Hz, 1H), 4.50–4.65 (m, 1H), 4.34 (d, J=16.2 Hz, 1H), 3.30–3.45 (m, 2H), 2.20–2.50 (m, 3H), 1.75–1.93 (m, 1H)

IV-21 : 7.20–7.50 (m, 4H), 4.25–4.80 (m, 5H), 3.20–3.30 (m, 2H), 2.10–2.40 (m, 3H), 1.75–1.85 (m, 1H), 1.25–1.35 (m, 3H)

IV-22 : 11.12 (brs, 1H), 7.62 (d, J=8.0 Hz, 1H), 7.39 (t, J=8.0 Hz, 1H), 7.15–7.30 (m, 2H), 4.64 (d, J=14.8 Hz, 1H), 4.55–4.60 (m, 1H), 4.38 (d, J=14.8 Hz, 1H), 3.40–3.60 (m, 2H), 2.10–2.40 (m, 3H), 1.80–1.95 (m, 1H)

IV-23 : 7.48 (dd, J=1.8, 7.5 Hz, 1H), 7.43 (dt, J=1.8, 7.8 Hz, 1H), 7.30–7.40 (m, 1H), 7.20–7.25 (m, 1H), 5.06 (d, J=15.3 Hz, 1H), 4.35–4.50 (m, 3H), 3.71 (dd, J=5.7, 8.4 Hz, 1H), 3.20 (t, J=5.7 Hz, 2H), 2.10–2.30 (m, 2H), 1.80–2.00 (m, 2H), 1.34 (t, J=7.2 Hz, 3H)

IV-25 : 7.45–7.55 (m, 1H), 7.35–7.45 (m, 1H), 7.15–7.30 (m, 2H), 5.14 (d, J=16.2 Hz, 1H), 4.07 (d, J=16.2 Hz, 1H), 3.34 (t, J=6.0 Hz, 2H), 2.15–2.40 (m, 2H), 1.75–2.00 (m, 4H), 1.30 (s, 3H), 1.27 (s, 3H), 1.10 (t, J=7.2 Hz, 3H)

IV-26 : 7.40–7.50 (m, 1H), 7.30–7.40 (m, 1H), 7.15–7.30 (m, 2H), 4.89 (d, J=15.9 Hz, 1H), 4.25–4.45 (m, 3H), 3.20 (t, J=6.0 Hz, 2H), 1.70–1.90 (m, 4H), 1.25–1.35 (m, 9H)

IV-27 : 7.59 (d, J=8.4 Hz, 1H), 7.37 (t, J=8.4 Hz, 1H), 7.15–7.35 (m, 2H), 4.97 (d, J=14.7 Hz, 1H), 4.04 (d, J=14.7 Hz, 1H), 3.70–3.90 (m, 1H), 2.30–2.60 (m, 2H), 1.60–

2. 00 (m, 4H) , 1. 37 (d, J=8. 1Hz, 3H)

IV-28 : 7. 44 (t, J=8. 4Hz, 1H) , 7. 10-7. 40 (m, 3H) , 5. 10-5. 35 (m, 1H) , 4. 10-4. 50 (m, 3H) , 3. 35-3. 60 (m, 1H) , 2. 40-2. 60 (m, 2H) , 1. 55-2. 10 (m, 4H) , 1. 10-1. 40 (m, 6H)

IV-30* : 7. 30-7. 45 (m, 3H) , 7. 20-7. 25 (m, 1H) , 5. 40 (dd, J=15. 3, 26. 7Hz, 1H) , 4. 74 (t, J=15. 0Hz, 0. 5H) , 4. 52 (t, J=15. 0Hz, 0. 5H) , 4. 10-4. 45 (m, 3H) , 3. 27 (d, J=18. 3Hz, 3H) , 2. 30-2. 60 (m, 2H) , 1. 85-2. 10 (m, 2H) , 1. 65-1. 75 (m, 2H) , 1. 32 (dt, J=7. 2, 12. 9Hz, 3H)

IV-31 : 11. 88 (brs, 1H) , 7. 15-7. 65 (m, 4H) , 4. 40-4. 50 (m, 2H) , 3. 00-3. 25 (m, 2H) , 2. 40-2. 50 (m, 1H) , 1. 60-1. 70 (m, 1H) , 1. 20-1. 40 (m, 4H) , 0. 99 (s, 3H) , 0. 93 (s, 3H)

IV-32 : 7. 15-7. 50 (m, 4H) , 4. 20-5. 10 (m, 4H) , 3. 00-3. 10 (m, 1H) , 2. 75-2. 85 (m, 1H) , 2. 55-2. 60 (m, 1H) , 1. 65-1. 75 (m, 1H) , 1. 40-1. 50 (m, 1H) , 1. 25-1. 35 (m, 6H) , 1. 03 (s, 3H) , 0. 95 (s, 3H)

V-2 : 7. 15-7. 50 (m, 4H) , 5. 01 (d, J=15. 6Hz, 1H) , 4. 29 (d, J=15. 6Hz, 1H) , 3. 30-3. 50 (m, 2H) , 2. 55-2. 70 (m, 2H) , 2. 23 (s, 3H) , 1. 65-1. 85 (m, 6H)

V-3 : 7. 15-7. 50 (m, 4H) , 5. 08 (d, J=15. 9Hz, 1H) , 4. 22 (d, J=15. 9Hz, 1H) , 3. 30-3. 55 (m, 2H) , 2. 55-2. 70 (m, 2H) , 2. 20-2. 50 (m, 2H) , 1. 65-1. 85 (m, 6H) , 1. 05-1. 15 (m, 3H)

V-4 : 7. 15-7. 50 (m, 4H) , 4. 73 (d, J=15. 9Hz, 1H) , 4. 63 (d, J=15. 9Hz, 1H) , 4. 25 (t, J=6. 3Hz, 2H) , 3. 25-3. 30 (m, 2H) , 2. 60-2. 65 (m, 2H) , 1. 55-1. 75 (m, 8H) , 0. 89 (t, J=7. 8Hz, 3H)

V-5 : 7. 25-7. 50 (m, 4H) , 5. 12 (d, J=16. 2Hz, 1H) , 4. 36 (d, J=16. 2Hz, 1H) , 3. 30-3. 55 (m, 2H) , 2. 60-2. 70 (m, 2H) , 1. 65-1. 85 (m, 6H) , 0. 85-1. 55 (m, 5H)

V-8 : 7. 15-7. 60 (m, 9H) , 5. 12 (d, J=16. 2Hz, 1H) , 4. 47 (d, J=16. 2Hz, 1H) , 3. 30-3. 35 (m, 2H) , 2. 60-2. 70 (m, 2H) , 1. 65-1. 85 (m, 6H)

V-9 : 7. 15-7. 50 (m, 4H) , 4. 74 (d, J=15. 6Hz, 1H) , 4. 60 (d, J=15. 6Hz, 1H) , 3. 89 (s, 3H) , 3. 25-3. 30 (m, 2H) , 2. 60-2. 70 (m, 2H) , 1. 70-1. 75 (m, 6H)

V-12 : 7. 48 (t, J=8. 0Hz, 1H) , 7. 30-7. 40 (m, 2H) , 7. 19 (d, J=8. 0Hz, 1H) , 4. 74 (d, J=15. 7Hz, 1H) , 4. 64 (d, J=15. 7Hz, 1H) , 3. 95-4. 15 (m, 2H) , 3. 20-3. 30 (m, 2H) , 2. 55-2

. 70 (m, 2H), 1. 80–2. 00 (m, 1H), 1. 65–1. 80 (m, 4H), 1. 50–1. 60 (m, 2H), 0. 86 (d, J=5. 0Hz, 6H)

V-13 : 7. 15–7. 50 (m, 4H), 5. 80–5. 95 (m, 1H), 5. 25–5. 35 (m, 2H), 4. 65–4. 75 (m, 4H), 3. 25–3. 30 (m, 2H), 2. 60–2. 65 (m, 2H), 1. 55–1. 75 (m, 6H)

V-14 (V-28との3:2混合物) : 11. 70 (brs, 1H), 7. 61 (d, J=8. 1Hz, 1H), 7. 25–7. 40 (m, 2H), 7. 15–7. 25 (m, 1H), 4. 40–4. 55 (m, 2H), 3. 40–3. 55 (m, 1. 2H), 3. 25–3. 40 (m, 0. 8H), 2. 40–2. 60 (m, 2H), 1. 50–1. 90 (m, 3H), 1. 25–1. 45 (m, 2H), 0. 97 (d, J=6. 3Hz, 1. 8H), 0. 92 (d, J=6. 9Hz, 1. 2H)

V-15* : 7. 45–7. 50 (m, 1H), 7. 30–7. 45 (m, 2H), 7. 19 (d, J=7. 8Hz, 1H), 5. 20 (d, J=15. 9Hz, 0. 6H), 4. 91 (d, J=15. 9Hz, 0. 4H), 4. 38 (d, J=16. 2Hz, 0. 4H), 4. 05–4. 15 (m, 0. 6H), 3. 25–3. 60 (m, 2H), 2. 15–2. 65 (m, 4H), 1. 75–2. 00 (m, 3H), 1. 50–1. 70 (m, 1H), 1. 25–1. 50 (m, 1H), 1. 00–1. 15 (m, 6H)

V-16* : 7. 25–7. 50 (m, 4H), 5. 26 (d, J=15. 9Hz, 0. 6H), 4. 94 (d, J=15. 9Hz, 0. 4H), 4. 52 (d, J=15. 9Hz, 0. 4H), 4. 24 (d, J=16. 5Hz, 0. 6H), 3. 40–3. 60 (m, 1H), 3. 25–3. 35 (m, 1H), 2. 45–2. 65 (m, 2H), 1. 75–1. 95 (m, 3H), 1. 55–1. 65 (m, 1H), 1. 40–1. 55 (m, 1H), 1. 25–1. 45 (m, 2H), 1. 10–1. 20 (m, 1H), 0. 85–1. 10 (m, 5H)

V-17 : 7. 40–7. 50 (m, 1H), 7. 30–7. 40 (m, 2H), 7. 19 (d, J=7. 8Hz, 1H), 4. 91 (dd, J=16. 2, 26. 4Hz, 1H), 4. 25–4. 50 (m, 3H), 3. 30–3. 40 (m, 1H), 3. 10–3. 20 (m, 1H), 2. 50–2. 65 (m, 2H), 1. 80–1. 95 (m, 2H), 1. 65–1. 80 (m, 1H), 1. 45–1. 65 (m, 1H), 1. 25–1. 35 (m, 4H), 1. 04 (dd, J=2. 7, 6. 6Hz, 3H)

V-18 : 11. 68 (brs, 1H), 7. 62 (d, J=7. 5Hz, 1H), 7. 30–7. 40 (m, 1H), 7. 25–7. 30 (m, 1H), 7. 10–7. 20 (m, 1H), 4. 57 (d, J=15. 0Hz, 1H), 4. 37 (d, J=15. 0Hz, 1H), 3. 45–3. 55 (m, 2H), 2. 45–2. 65 (m, 2H), 1. 75–1. 85 (m, 2H), 1. 65–1. 70 (m, 1H), 1. 00–1. 30 (m, 2H), 0. 93 (d, J=6. 3Hz, 3H)

V-21* : 7. 45–7. 55 (m, 1H), 7. 35–7. 45 (m, 1H), 7. 25–7. 35 (m, 2H), 5. 32 (d, J=16. 2Hz, 0. 6H), 4. 84 (d, J=15. 6Hz, 0. 4H), 4. 61 (d, J=15. 6Hz, 0. 4H), 4. 19 (d, J=16. 2Hz, 0. 6H), 3. 45–3. 60 (m, 1H), 3. 20–3. 35 (m, 1H), 2. 55–2. 75 (m, 2H), 1. 60–1. 90 (m, 3H), 1. 40–1. 55 (m, 1H), 1. 05–1. 40 (m, 4H), 0. 85–1. 05 (m, 5H)

V-22* : 7.40–7.50 (m, 1H), 7.30–7.40 (m, 2H), 7.19 (d, J=7.5Hz, 1H), 5.08 (d, J=16.2Hz, 0.5H), 4.93 (d, J=15.6Hz, 0.5H), 4.40 (d, J=15.3Hz, 0.5H), 4.27 (d, J=15.9Hz, 0.5H), 3.90 (d, J=6.6Hz, 3H), 3.35–3.45 (m, 1H), 3.10–3.20 (m, 1H), 2.60–2.70 (m, 2H), 1.80–1.90 (m, 1H), 1.65–1.80 (m, 2H), 1.55–1.60 (m, 1H), 1.10–1.40 (m, 1H), 0.95–1.00 (m, 3H)

V-24* : 7.40–7.50 (m, 1H), 7.30–7.40 (m, 2H), 7.19 (d, J=7.8Hz, 1H), 5.08 (d, J=16.2Hz, 0.5H), 4.95 (d, J=15.6Hz, 0.5H), 4.41 (d, J=15.3Hz, 0.5H), 4.31 (d, J=15.6Hz, 0.5H), 4.00–4.15 (m, 2H), 3.35–3.45 (m, 1H), 3.15–3.25 (m, 1H), 2.60–2.70 (m, 2H), 1.85–2.00 (m, 2H), 1.55–1.80 (m, 2H), 1.25–1.35 (m, 1H), 1.10–1.20 (m, 1H), 0.90–1.00 (m, 3H), 0.80–0.90 (m, 6H)

V-25 : 7.15–7.55 (m, 4H), 5.24 (d, J=16.0Hz, 1H), 4.07 (d, J=16.0Hz, 1H), 3.25–3.65 (m, 2H), 1.85–2.75 (m, 6H), 1.20–1.40 (m, 3H), 1.10–1.20 (m, 3H), 0.89 (s, 9H)

V-26 : 7.15–7.50 (m, 4H), 4.90–5.10 (m, 1H), 4.25–4.45 (m, 3H), 3.15–3.45 (m, 2H), 2.50–2.75 (m, 2H), 1.80–2.10 (m, 2H), 1.10–1.40 (m, 6H), 0.86 (s, 9H)

V-27 : 7.10–7.50 (m, 9H), 4.11 (t, J=15.0Hz, 1H), 4.25–4.50 (m, 3H), 3.20–3.65 (m, 2H), 2.75–2.90 (m, 3H), 1.55–2.15 (m, 4H), 1.25–1.40 (m, 3H)

V-28 : V-14と一緒に記載。

V-29* : 7.45–7.50 (m, 1H), 7.30–7.40 (m, 2H), 7.15–7.20 (m, 1H), 5.21 (d, J=16.2Hz, 0.6H), 4.97 (d, J=16.2Hz, 0.4H), 4.33 (d, J=15.9Hz, 0.4H), 4.10 (d, J=16.2Hz, 0.6H), 3.20–3.40 (m, 1.5H), 3.06 (d, J=15.6Hz, 0.5H), 2.15–2.50 (m, 4H), 1.80–2.00 (m, 2H), 1.55–1.80 (m, 2H), 1.20–1.45 (m, 1H), 1.05–1.15 (m, 3H), 0.90 (dd, J=1.8, 6.9Hz, 3H)

V-30* : 7.45–7.50 (m, 1H), 7.25–7.40 (m, 3H), 5.28 (d, J=16.2Hz, 0.6H), 5.00 (d, J=15.9Hz, 0.4H), 4.46 (d, J=15.9Hz, 0.4H), 4.22 (d, J=16.5Hz, 0.6H), 3.00–3.40 (m, 2H), 2.55–2.70 (m, 2H), 1.85–2.00 (m, 2H), 1.55–1.80 (m, 2H), 1.40–1.55 (m, 1H), 1.25–1.40 (m, 2H), 1.05–1.20 (m, 1H), 0.95–1.10 (m, 1H), 0.80–0.95 (m, 4H)

V-31* : 7.40–7.50 (m, 1H), 7.30–7.40 (m, 2H), 7.19 (d, J=7.8Hz, 1H), 5.02 (d, J=15.6Hz, 0.5H), 4.77 (d, J=15.3Hz, 0.5H), 4.57 (d, J=15.3Hz, 0.5H), 4.30–4.40 (m, 2.

5H), 3.15–3.25 (m, 1H), 3.01 (t, J=15.3Hz, 1H), 2.55–2.70 (m, 2H), 1.85–1.95 (m, 2H), 1.55–1.70 (m, 2H), 1.20–1.35 (m, 4H), 0.85 (dd, J=2.7, 6.9Hz, 3H)

V-37 : 7.15–7.55 (m, 4H), 5.19 (d, J=15.0Hz, 1H), 4.22 (d, J=15.0Hz, 1H), 3.41 (d, J=15.0Hz, 1H), 2.99 (d, J=12.0Hz, 1H), 2.71 (d, J=12.0Hz, 1H), 2.20–2.45 (m, 3H), 1.35–1.50 (m, 2H), 1.10–1.15 (m, 9H), 1.03 (s, 3H), 0.91 (s, 3H)

V-38 : 7.15–7.50 (m, 4H), 4.91 (d, J=15.0Hz, 1H), 4.57 (d, J=15.0Hz, 1H), 4.30–4.45 (m, 2H), 3.12 (d, J=15.0Hz, 1H), 2.98 (d, J=15.0Hz, 1H), 2.63 (d, J=9.0Hz, 1H), 2.52 (d, J=9.0Hz, 1H), 1.40 (s, 2H), 1.31 (t, J=7.2Hz, 3H), 1.09 (s, 3H), 1.06 (s, 3H), 1.01 (s, 3H), 0.93 (s, 3H)

V-39 : 11.61 (brs, 1H), 7.50–7.65 (m, 1H), 7.10–7.50 (m, 3H), 4.56 (d, J=14.8Hz, 1H), 4.43 (d, J=14.8Hz, 1H), 3.35–3.65 (m, 2H), 2.50–2.70 (m, 1H), 1.70–1.90 (m, 2H), 1.45–1.70 (m, 3H), 1.25–1.40 (m, 1H), 1.15 (d, J=6.9Hz, 3H)

VI-2 : 7.30–7.55 (m, 3H), 7.15–7.25 (m, 1H), 4.84 (d, J=15.9Hz, 1H), 4.57 (d, J=15.9Hz, 1H), 4.25–4.45 (m, 4H), 3.75–3.90 (m, 2H), 3.21 (t, J=6.0Hz, 2H), 1.98 (t, J=6.0Hz, 2H), 1.36 (t, J=6.9Hz, 3H), 1.30 (t, J=6.9Hz, 3H)

VI-3 : 7.61 (d, J=7.8Hz, 1H), 7.35–7.45 (m, 1H), 7.20–7.25 (m, 2H), 4.55 (s, 2H), 3.90 (t, J=6.0Hz, 2H), 3.30 (t, J=6.0Hz, 2H), 2.13 (quin, J=6.0Hz, 2H)

VI-5 : 7.60–7.65 (m, 1H), 7.40–7.50 (m, 1H), 7.35–7.40 (m, 2H), 4.82 (s, 2H), 4.00 (t, J=6.0Hz, 2H), 3.52 (t, J=6.0Hz, 2H), 2.13 (quin, J=6.0Hz, 2H)

VII-1 : 11.31 (brs, 1H), 7.55–7.60 (m, 1H), 7.30–7.40 (m, 1H), 7.15–7.25 (m, 2H), 4.56 (d, J=15.0Hz, 1H), 3.96 (d, J=15.0Hz, 1H), 3.64 (dd, J=5.7, 10.2Hz, 1H), 3.40–3.45 (m, 1H), 1.85–2.00 (m, 2H), 1.10–1.20 (m, 1H), 0.60–0.65 (m, 1H)

VII-2 : 7.45–7.55 (m, 1H), 7.35–7.45 (m, 1H), 7.15–7.25 (m, 2H), 4.74 (dd, J=8.4, 15.9Hz, 1H), 4.10 (dd, J=15.9, 20.7Hz, 1H), 3.45–3.55 (m, 1H), 3.20–3.30 (m, 1H), 2.25–2.45 (m, 2H), 1.95–2.05 (m, 1H), 1.85–1.95 (m, 1H), 1.15–1.20 (m, 1H), 1.11 (dt, J=2.7, 7.5Hz, 3H), 0.65–0.75 (m, 1H)

VII-3 : 7.45–7.55 (m, 1H), 7.35–7.45 (m, 2H), 7.25–7.30 (m, 1H), 4.76 (dd, J=10.5, 15.9Hz, 1H), 4.10–4.30 (m, 1H), 3.45–3.55 (m, 1H), 3.20–3.30 (m, 1H), 1.95–2.05

(m, 1H), 1.85–1.95 (m, 1H), 1.40–1.50 (m, 1H), 1.25–1.30 (m, 1H), 1.15–1.20 (m, 2H), 0.85–1.05 (m, 2H), 0.65–0.75 (m, 1H)

VII-4 : 7.40–7.50 (m, 1H), 7.25–7.40 (m, 2H), 7.18 (d, $J=7.8$ Hz, 1H), 4.20–4.60 (m, 4H), 3.35–3.45 (m, 1H), 3.16 (d, $J=10.8$ Hz, 1H), 1.95–2.05 (m, 1H), 1.80–1.90 (m, 1H), 1.32 (dt, $J=2.4, 7.2$ Hz, 3H), 1.10–1.20 (m, 1H), 0.60–0.70 (m, 1H)

VII-5 : 7.40–7.50 (m, 1H), 7.30–7.40 (m, 2H), 7.18 (t, $J=7.5$ Hz, 1H), 4.50–4.60 (m, 1H), 4.20–4.35 (m, 1H), 4.00–4.15 (m, 2H), 3.35–3.45 (m, 1H), 3.15–3.20 (m, 1H), 1.80–2.05 (m, 3H), 1.10–1.20 (m, 1H), 0.87 (dd, $J=1.8, 6.6$ Hz, 6H), 0.60–0.75 (m, 1H)

VII-6 (VIII-1との1:2混合物) : 11.79 (brs, 1H), 7.63 (d, $J=8.7$ Hz, 1H), 7.30–7.40 (m, 1.5H), 7.15–7.25 (m, 1.5H), 4.68 (d, $J=14.4$ Hz, 0.7H), 4.30–4.45 (m, 0.3H), 4.19 (d, $J=14.4$ Hz, 0.7H), 3.85–3.90 (m, 0.7H), 3.45–3.55 (m, 0.3H), 3.13 (d, $J=11.4$ Hz, 0.3H), 2.80–2.85 (m, 0.3H), 2.50–2.65 (m, 2H), 2.35 (s, 0.4H), 2.29 (s, 0.3H), 1.80–2.00 (m, 3H), 1.70–1.75 (m, 0.7H), 1.40–1.70 (m, 2.3H)

VII-7 : 7.45–7.55 (m, 1H), 7.35–7.40 (m, 1H), 7.20–7.30 (m, 2H), 5.06 (t, $J=15.9$ Hz, 1H), 4.01 (dd, $J=16.2, 27.9$ Hz, 1H), 3.35–3.45 (m, 1H), 2.95–3.05 (m, 1H), 2.85 (s, 1H), 2.56 (s, 1H), 2.20–2.45 (m, 2H), 1.90–2.10 (m, 4H), 1.60–1.75 (m, 2H), 1.10 (t, $J=7.2$ Hz, 3H)

VII-8* : 7.45 (t, $J=7.8$ Hz, 1H), 7.34 (t, $J=7.5$ Hz, 1H), 7.15–7.25 (m, 2H), 4.86 (d, $J=15.9$ Hz, 0.5H), 4.68 (d, $J=15.9$ Hz, 0.5H), 4.25–4.50 (m, 3H), 3.23 (dd, $J=4.2, 11.4$ Hz, 1H), 2.80–2.90 (m, 2H), 2.48 (s, 1H), 1.90–2.10 (m, 4H), 1.50–1.70 (m, 2H), 1.25–1.35 (m, 3H)

VIII-1 : VII-6と一緒に記載。

VIII-2* : 7.45–7.50 (m, 1H), 7.35–7.40 (m, 2H), 7.21 (d, $J=8.1$ Hz, 1H), 5.29 (t, $J=15.6$ Hz, 1H), 4.25–4.45 (m, 2H), 3.96 (dd, $J=7.2, 15.9$ Hz, 1H), 3.50–3.60 (m, 1H), 2.65–2.75 (m, 1H), 2.50–2.60 (m, 1H), 2.30–2.40 (m, 1H), 1.50–2.05 (m, 6H), 1.31 (dt, $J=7.2, 10.5$ Hz, 3H)

IX-1 : 7.30–7.45 (m, 3H), 7.20 (d, $J=8.1$ Hz, 1H), 4.72 (d, $J=15.6$ Hz, 1H), 4.63 (d, J

=15.6 Hz, 1H), 4.60 (t, J=9.3 Hz, 2H), 4.30–4.45 (m, 2H), 3.36 (t, J=7.2 Hz, 2H), 2.90–3.00 (m, 2H), 2.40–2.50 (m, 2H), 1.32 (t, J=7.2, 3H)

X-1 : 7.56 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.34 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.25 (s, 1H), 4.44 (s, 2H), 3.46 (t, J=5.4 Hz, 2H), 2.44 (t, J=6.6 Hz, 2H), 1.70–1.90 (m, 4H)

X-2 : 11.75 (brs, 1H), 7.50–7.65 (m, 1H), 6.90–7.15 (m, 2H), 4.50 (d, J=14.3 Hz, 1H), 4.38 (d, J=14.3 Hz, 1H), 3.35–3.60 (m, 2H), 2.45–2.60 (m, 1H), 1.80–2.10 (m, 3H), 1.35–1.55 (m, 1H), 1.00 (d, J=6.3 Hz, 3H)

X-3 : 7.15–7.25 (m, 1H), 6.95–7.10 (m, 2H), 4.75–4.90 (m, 1H), 4.25–4.60 (m, 3H), 3.15–3.30 (m, 2H), 2.50–2.70 (m, 1H), 1.90–2.20 (m, 2H), 1.70–1.90 (m, 1H), 1.40–1.55 (m, 1H), 1.20–1.40 (m, 3H), 1.04 (d, J=6.5 Hz, 3H)

X-4 : 11.13 (brs, 1H), 7.60–7.70 (m, 1H), 7.20–7.40 (m, 2H), 7.10–7.20 (m, 1H), 6.28 (d, JHF=53.7 Hz, 1H), 4.52 (s, 2H), 3.40–3.55 (m, 2H), 2.50–2.65 (m, 2H), 1.45–1.80 (m, 6H)

X-5 : 9.78 (brs, 1H), 7.15–7.40 (m, 3H), 7.02 (t, J=8.2 Hz, 1H), 4.25–4.90 (m, 2H), 3.25–3.45 (m, 2H), 2.45–2.60 (m, 1H), 1.75–2.05 (m, 3H), 1.30–1.50 (m, 1H), 0.98 (d, J=6.3 Hz, 3H)

X-6 : 11.84 (brs, 1H), 7.73 (d, J=8.0 Hz, 1H), 7.38 (t, J=8.0 Hz, 1H), 7.25 (d, J=7.7 Hz, 1H), 7.15 (t, J=7.7 Hz, 1H), 4.61 (d, J=14.3 Hz, 1H), 4.45 (d, J=14.3 Hz, 1H), 3.35–3.55 (m, 2H), 2.45–2.60 (m, 1H), 1.80–2.05 (m, 3H), 1.35–1.50 (m, 1H), 0.99 (d, J=6.3 Hz, 3H)

X-7* : 7.40–7.50 (m, 1H), 7.25–7.40 (m, 3H), 4.96 (d, J=15.0 Hz, 0.5H), 4.79 (d, J=15.0 Hz, 0.5H), 4.62 (d, J=15.0 Hz, 0.5H), 4.47 (d, J=15.0 Hz, 0.5H), 4.20–4.40 (m, 2H), 3.10–3.25 (m, 2H), 2.50–2.70 (m, 1H), 1.90–2.20 (m, 2H), 1.70–1.90 (m, 1H), 1.35–1.55 (m, 1H), 1.20–1.35 (m, 3H), 1.03 (d, J=6.3 Hz, 3H)

XI-2 : 7.12 (t, J=8.0 Hz, 1H), 7.02 (d, J=8.0 Hz, 1H), 6.55–6.70 (m, 2H), 4.68 (brs, 2H), 4.63 (d, J=15.6 Hz, 1H), 4.36 (d, J=15.6 Hz, 1H), 3.05–3.30 (m, 2H), 2.40–2.60 (m, 1H), 1.70–2.05 (m, 3H), 1.25–1.45 (m, 1H), 0.95 (d, J=8.0 Hz, 3H)

XI-3 : 7.10 (t, J=7.8 Hz, 1H), 7.02 (d, J=7.8 Hz, 1H), 6.55–6.70 (m, 2H), 4.63 (brs,

2H), 4.61 (d, J=14.1 Hz, 1H), 4.38 (d, J=14.1 Hz, 1H), 3.05–3.35 (m, 2H), 2.45–2.60 (m, 1H), 1.70–2.05 (m, 3H), 1.20–1.45 (m, 5H), 0.89 (t, J=6.6 Hz, 3H)

XI-4 : 6.95–7.15 (m, 2H), 6.55–6.70 (m, 2H), 4.65 (brs, 2H), 4.62 (d, J=14.4 Hz, 1H), 4.38 (d, J=14.4 Hz, 1H), 3.05–3.40 (m, 2H), 2.40–2.60 (m, 1H), 2.00–2.20 (m, 1H), 1.70–1.95 (m, 1H), 1.20–1.65 (m, 3H), 0.88 (d, J=6.6 Hz, 6H)

XI-5 : 6.95–7.20 (m, 2H), 6.55–6.75 (m, 2H), 4.60 (brs, 2H), 4.58 (d, J=14.4 Hz, 1H), 4.41 (d, J=14.7 Hz, 1H), 3.05–3.45 (m, 2H), 2.45–2.70 (m, 1H), 2.10–2.35 (m, 1H), 1.80–2.00 (m, 1H), 1.40–1.80 (m, 1H), 0.95–1.15 (m, 1H), 0.35–0.70 (m, 3H), 0.00–0.25 (m, 2H)

XI-8 : 7.00–7.40 (m, 7H), 6.60–6.70 (m, 2H), 4.67 (brs, 2H), 4.66 (d, J=14.4 Hz, 1H), 4.47 (d, J=14.4 Hz, 1H), 3.20–3.45 (m, 2H), 3.00–3.15 (m, 1H), 2.70–2.95 (m, 1H), 2.45–2.60 (m, 1H), 2.00–2.15 (m, 1H), 1.80–2.00 (m, 1H)

XI-10 : 7.11 (t, J=7.8 Hz, 1H), 7.03 (d, J=7.8 Hz, 1H), 6.55–6.70 (m, 2H), 4.53 (s, 2H), 3.21 (t, J=6.6 Hz, 2H), 2.20 (s, 2H), 1.56 (t, J=6.6 Hz, 2H), 0.97 (s, 6H)

XI-11 : 8.03 (d, J=8.0 Hz, 1H), 7.60 (t, J=8.0 Hz, 1H), 7.30–7.50 (m, 2H), 5.09 (d, J=16.8 Hz, 1H), 4.80 (d, J=16.8 Hz, 1H), 3.10–3.20 (m, 1H), 2.90–3.00 (m, 1H), 2.33 (d, J=6.2 Hz, 2H), 1.75–1.90 (m, 1H), 1.00 (s, 3H), 0.85–0.95 (m, 6H)

XI-12 : 7.10 (t, J=8.0 Hz, 1H), 7.02 (d, J=8.0 Hz, 1H), 6.55–6.70 (m, 2H), 4.62 (d, J=14.4 Hz, 1H), 4.60 (brs, 2H), 4.37 (d, J=14.4 Hz, 1H), 3.10–3.20 (m, 1H), 2.70–2.85 (m, 1H), 2.22 (d, J=6.9 Hz, 2H), 1.60–1.80 (m, 1H), 0.75–1.05 (m, 9H)

XI-13 : 7.95–8.05 (m, 1H), 7.55–7.65 (m, 1H), 7.30–7.45 (m, 2H), 5.00 (d, J=16.8 Hz, 1H), 4.83 (d, J=16.8 Hz, 1H), 3.15–3.35 (m, 2H), 2.26 (q, J=7.2 Hz, 1H), 1.65–1.75 (m, 2H), 1.23 (d, J=7.2 Hz, 3H), 1.06 (s, 3H), 0.94 (s, 3H)

XI-14 : 7.05–7.15 (m, 1H), 6.95–7.05 (m, 1H), 6.55–6.65 (m, 2H), 4.59 (d, J=14.4 Hz, 1H), 4.56 (brs, 2H), 4.42 (d, J=14.4 Hz, 1H), 3.15–3.20 (m, 2H), 2.16 (q, J=7.2 Hz, 1H), 1.50–1.70 (m, 2H), 1.18 (d, J=7.2 Hz, 3H), 0.97 (s, 3H), 0.86 (s, 3H)

XI-15 : 8.03 (d, J=8.4 Hz, 1H), 7.60 (t, J=7.2 Hz, 1H), 7.43 (t, J=7.5 Hz, 1H), 7.34 (d, J=8.1 Hz, 1H), 4.96 (s, 2H), 3.30 (t, J=6.0 Hz, 2H), 2.41 (s, 2H), 1.65–1.80 (m, 6H)

), 1.50–1.55 (m, 4H)

XI-16 : 7.11 (dt, J=0.9, 7.2Hz, 1H), 7.03 (dd, J=1.5, 7.8Hz, 1H), 6.60–6.65 (m, 2H), 4.56 (brs, 2H), 4.52 (s, 2H), 3.21 (t, J=6.3Hz, 2H), 2.30 (s, 2H), 1.55–1.70 (m, 6H), 1.40–1.45 (m, 4H)

XI-17 : 7.99 (d, J=8.0Hz, 1H), 7.57 (t, J=8.0Hz, 1H), 7.35–7.50 (m, 2H), 5.18 (d, J=16.7Hz, 1H), 4.79 (d, J=16.7Hz, 1H), 4.40–4.50 (m, 1H), 3.27 (s, 3H), 2.30–2.65 (m, 2H), 2.00–2.20 (m, 2H), 1.65–1.80 (m, 2H)

XI-18 : 7.11 (t, J=7.8Hz, 1H), 7.03 (d, J=7.8Hz, 1H), 6.60–6.70 (m, 2H), 5.33 (d, J=14.6Hz, 1H), 4.52 (brs, 2H), 4.40–4.45 (m, 1H), 3.95 (d, J=14.6Hz, 1H), 3.35 (s, 3H), 2.45–2.60 (m, 1H), 2.25–2.40 (m, 1H), 1.85–2.10 (m, 2H), 1.45–1.70 (m, 2H)

XII-1 : 8.00–8.05 (m, 1H), 7.55–7.65 (m, 1H), 7.30–7.50 (m, 2H), 4.93 (s, 2H), 2.99 (s, 2H), 2.54 (t, J=6.9Hz, 2H), 1.68 (t, J=6.9Hz, 2H), 1.04 (s, 6H)

XII-2 : 7.10 (dt, J=1.8, 7.5Hz, 1H), 7.00 (dd, J=1.8, 7.5Hz, 1H), 6.60–6.65 (m, 2H), 4.58 (brs, 2H), 4.50 (s, 2H), 2.91 (s, 2H), 2.44 (t, J=7.5Hz, 2H), 1.56 (t, J=7.5Hz, 2H), 0.93 (s, 6H)

XII-3 : 7.95–8.05 (m, 1H), 7.55–7.65 (m, 1H), 7.35–7.45 (m, 1H), 7.25–7.30 (m, 1H), 4.89 (s, 2H), 3.28 (t, J=6.0Hz, 2H), 1.80–1.95 (m, 2H), 1.75–1.80 (m, 2H), 1.29 (s, 6H)

XII-4 : 7.05–7.15 (m, 1H), 6.95–7.05 (m, 1H), 6.55–6.65 (m, 2H), 4.61 (brs, 2H), 4.49 (s, 2H), 3.21 (t, J=6.0Hz, 2H), 1.70–1.85 (m, 2H), 1.60–1.70 (m, 2H), 1.23 (s, 6H)

第24表のプロトン核磁気共鳴ケミカルシフト値は、基準物質としてMe₄Si (テトランメチルシラン) を用い、300MHzにて測定した。

なお、*は、ジアステレオマー混合物を表す。

[0296] 次に、本発明化合物の除草剤としての有用性を、以下の試験例において具体的に説明する。

[0297] 〔試験例1〕湛水条件における雑草発生前処理による除草効果試験

1 / 30000 アールのスチロールカップに沖積土壌を入れた後、水を入れて混和し、水深 4 cm の湛水条件とした。ノビエ、ホタルイ及びコナギの種子を上記カップに混播した後、2. 5 葉期のイネ苗を移植した。播種当日、配合例 2 に準じて調製した本発明化合物の乳剤を、所定の薬量になるように水で希釈し、水面に処理した。カップを 25 乃至 30 °C の温室内に置いて植物を育成し、薬剤処理 3 週間後に、各種植物に対する除草効果を下記の判定基準に従い調査した。結果を第 25 表及び第 26 表に示す。

[0298] 判定基準

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

[0299] [試験例 2] 湛水条件における雑草生育期処理による除草効果試験

1 / 30000 アールのスチロールカップに沖積土壌を入れた後、水を入れて混和し、水深 4 cm の湛水条件とした。ノビエ、ホタルイ及びコナギの種子を上記カップに混播し、25 乃至 30 °C の温室内に置いて植物を育成した。ノビエ、ホタルイ及びコナギが 1 乃至 2 葉期に達したとき、配合例 2 に準じて調製した本発明化合物の乳剤を、所定の薬量になるように水で希釈し、水面に処理した。薬剤処理 3 週間後に、各種植物に対する除草効果を試験例 1 の判定基準に従って調査した。結果を第 27 表に示す。

[0300] [試験例 3] 土壌処理による除草効果試験

縦 21 cm、横 13 cm、深さ 7 cm のプラスチック製箱に殺菌した沖積土壌を入れ、ノビエ、メヒシバ、エノコログサ、カラスムギ、ブラックグラス、イチビ、ブタクサ、アオゲイトウ、シロザ、イヌタデ、ハコベ、トウモロコシ、ダイズ、イネ、コムギ及びビートの種子をそれぞれスポット状に播種し、約 1.5 cm 覆土した。次いで、配合例 2 に準じて調製した本発明化合物の乳

剤を、所定の薬量になるように水で希釈し、土壌表面へ小型スプレーで均一に処理した。薬剤処理3週間後に、各種植物に対する除草効果を試験例1の判定基準に従って調査した。結果を第28表に示す。

[0301] 〔試験例4〕茎葉処理による除草効果試験

縦21cm、横13cm、深さ7cmのプラスチック製箱に殺菌した洪積土壌を入れ、ノビエ、メヒシバ、エノコログサ、カラスムギ、ブラックグラス、イチビ、ブタクサ、アオゲイトウ、シロザ、イヌタデ、ハコベ、トウモロコシ、ダイズ、イネ、コムギ及びビートの種子をそれぞれスポット状に播種し、約1.5cm覆土した後、25乃至30℃の温室内において植物を育成した。14日間育成した後、配合例2に準じて調製した本発明化合物の乳剤を、所定の薬量になるように水で希釈し、茎葉部へ小型スプレーで均一に処理した。薬剤処理3週間後に、各種植物に対する除草効果を試験例1の判定基準に従って調査した。結果を第29表に示す。

[0302] 尚、第25表乃至第29表中の記号は以下の意味を表す。

A：ノビエ、B：ホタルイ、C：コナギ、D：メヒシバ、E：エノコログサ、F：カラスムギ、G：スズメノテッポウ、H：イタリアンライグラス、I：イチビ、J：ブタクサ、K：アオゲイトウ、L：シロザ、M：イヌタデ、N：ハコベ、O：ヤエムグラ、a：移植イネ、b：トウモロコシ、c：ダイズ、d：直播イネ、e：コムギ、f：ビート。

また、処理薬量（g/a）とは、1アール（1a）あたりに換算したときに、記載した数値のg数だけ処理されるように濃度を調整したことを表す。

[0303] 〔第25表〕

化合物 No.	処理薬量 (g/a)	A	B	C
I-1	2.52	5	5	5
I-2	2.52	5	5	5

I-3	2.52	5	5	5
I-4	2.52	5	5	5
I-5	2.52	5	5	5
II-1	2.52	5	5	5
II-2	2.52	5	5	5
II-3	2.52	5	5	5
III-1	2.52	5	5	5
III-2	2.52	5	5	5
III-3	2.52	5	5	5
III-4	3.00	5	5	5
III-5	2.52	5	5	5
III-6	2.52	5	5	5
III-7	1.52	5	5	5
III-8	2.52	5	5	5
III-9	2.52	5	5	5
III-10	2.52	5	5	5
III-11	2.52	5	5	5
III-12	2.52	5	5	5
III-13	2.52	5	5	5
III-14	2.52	5	5	0
III-15	2.52	5	5	3
III-16	2.52	5	5	5
III-18	2.52	5	5	5
III-19	2.52	5	5	5
III-20	2.52	5	5	5
III-21	2.52	5	5	5
III-22	2.52	5	5	5
III-23	2.52	5	5	5

111-25	2.52	5	5	5
111-26	2.52	5	5	5
111-27	2.52	5	5	5
111-28	2.52	5	5	5
111-29	2.52	5	5	5
111-30	2.52	5	5	5
111-31	2.52	5	5	5
111-32	2.52	5	5	5
111-33	2.52	5	5	5
111-34	2.52	5	5	5
111-35	2.52	5	5	5
111-36	2.52	5	5	5
111-37	2.52	5	5	5
111-38	2.52	5	5	5
111-39	2.52	5	5	5
111-40	2.52	5	5	5
111-41	2.52	5	5	5
111-42	2.52	5	5	5
111-43	2.52	5	5	5
111-44	2.52	5	5	5
111-45	2.52	5	5	5
111-46	2.52	5	5	5
111-47	2.52	5	5	5
111-48	2.52	5	5	5
111-49	2.52	5	5	5
111-50	2.52	5	5	5
111-51	2.52	5	5	5
111-52	2.52	5	5	5

111-53	2. 52	5	5	5
111-54	2. 52	5	5	5
111-55	2. 52	5	5	5
111-56	2. 52	5	5	5
111-57	2. 52	5	5	5
111-58	2. 52	5	5	5
111-59	2. 52	5	5	5
111-60	2. 52	5	5	5
111-61	2. 52	5	5	5
111-62	2. 52	5	5	5
111-63	2. 52	5	5	5
111-64	2. 52	5	5	5
111-65	2. 52	5	5	5
111-66	2. 52	5	5	5
111-67	2. 52	5	5	5
111-68	2. 52	5	5	5
111-69	2. 52	5	5	5
111-70	2. 52	3	5	5
111-71	2. 52	5	5	5
111-72	2. 52	5	5	5
111-73	2. 52	5	5	5
111-74	2. 52	5	5	5
111-75	2. 52	5	5	5
111-76	2. 52	5	5	5
111-77	2. 52	5	5	5
111-78	2. 52	5	5	5
111-79	1. 04	5	5	5
111-80	2. 52	5	5	5

III-81	2.52	5	5	5
III-82	2.52	5	5	5
III-83	6.30	5	5	5
III-84	2.52	5	5	5
III-85	2.52	5	5	5
III-86	2.52	5	5	5
III-87	2.52	5	5	5
III-88	2.52	5	5	5
III-89	2.52	5	5	5
III-90	1.28	5	5	5
III-91	2.52	5	5	5
III-92	2.52	2	5	3
III-93	2.52	0	5	2
III-94	2.52	5	5	5
III-95	2.52	5	5	5
III-96	2.52	5	5	5
III-97	2.52	5	5	5
III-98	2.52	5	5	5
III-99	2.17	5	5	5
III-100	2.52	5	5	5
III-101	2.52	5	5	5
III-102	2.52	5	5	5
III-103	2.52	5	5	5
III-104	2.52	5	5	5
III-105	2.52	5	5	5
III-106	2.52	5	5	5
III-107	2.52	5	5	5
III-108	2.52	5	5	5

III-109	2.52	5	5	5
III-110	2.52	5	5	5
III-111	2.52	5	5	5
III-112	2.52	5	5	5
III-113	2.52	5	5	5
III-114	0.64	5	5	5
IV-1	2.52	5	5	5
IV-2	2.52	5	5	5
IV-3	2.52	5	5	5
IV-4	2.52	5	5	5
IV-5	2.52	5	5	5
IV-6	2.52	5	5	5
IV-7	2.52	5	5	5
IV-8	2.52	5	5	5
IV-9	2.52	5	5	5
IV-10	2.52	5	5	5
IV-11	2.52	5	5	5
IV-12	2.52	5	5	5
IV-13	2.52	5	5	5
IV-14	1.79	5	5	5
IV-15	2.52	5	5	5
IV-16	2.52	5	5	5
IV-17	2.52	5	5	5
IV-18	2.52	5	5	5
IV-19	2.52	5	5	5
IV-20	2.52	5	5	5
IV-21	2.52	5	5	5
IV-23	2.52	5	5	5

IV-24	2. 52	5	5	5
IV-25	2. 52	5	5	5
IV-26	2. 52	5	5	5
IV-27	2. 52	5	5	5
IV-28	2. 52	5	5	5
IV-29	2. 52	0	4	0
IV-30	2. 52	5	5	4
IV-31	2. 52	5	5	5
IV-32	2. 52	5	5	5
IV-33	2. 52	5	5	5
IV-34	2. 52	5	5	5
IV-35	2. 52	5	5	0
V-1	2. 52	5	5	5
V-2	2. 52	5	5	5
V-3	2. 52	5	5	5
V-4	2. 52	5	5	5
V-5	2. 52	5	5	5
V-6	2. 52	5	5	5
V-8	2. 52	5	5	5
V-9	2. 52	5	5	5
V-10	2. 52	5	5	5
V-12	2. 52	5	5	5
V-13	2. 52	5	5	5
V-14	2. 52	5	5	5
V-15	2. 52	5	5	5
V-16	2. 52	5	5	5
V-17	2. 52	5	5	5
V-18	2. 52	5	5	5

V-19	2. 52	5	5	5
V-20	2. 52	5	5	5
V-21	2. 52	5	5	5
V-22	2. 52	5	5	5
V-23	2. 52	5	5	5
V-24	2. 52	5	5	5
V-25	2. 52	5	5	5
V-26	2. 52	5	5	5
V-27	2. 52	5	5	5
V-29	2. 52	5	5	5
V-30	2. 52	5	5	5
V-31	2. 52	5	5	5
V-32	2. 52	5	5	5
V-33	2. 52	5	5	5
V-34	2. 52	5	5	5
V-35	2. 52	5	5	5
V-36	2. 52	5	5	5
V-37	2. 52	5	5	3
V-38	2. 52	5	5	0
V-39	2. 52	5	5	0
V-40	2. 52	5	5	0
VI-1	2. 52	5	5	5
VI-2	2. 52	5	5	5
VI-3	2. 52	5	5	5
VI-4	2. 52	5	5	5
VI-5	2. 52	5	5	5
VI-6	2. 52	5	5	5
VI-7	2. 52	5	5	5

VII-1	2.52	5	5	5
VII-2	2.52	5	5	5
VII-3	2.52	5	5	5
VII-4	2.52	5	5	5
VII-5	2.52	5	5	5
VII-6	2.52	5	5	5
VII-7	1.00	5	5	5
VII-8	2.52	5	5	5
VIII-2	2.52	5	5	5
VIII-3	2.52	5	5	5
IX-1	2.52	5	5	5
X-1	2.52	5	5	5
X-2	2.52	5	5	5
X-3	2.52	5	5	5
X-4	2.52	5	5	4
X-5	2.52	5	3	4
X-6	2.52	5	5	5
X-7	2.52	5	5	5

[0304] [第26表]

化合物 No.	処理薬量 (g/a)	a
I-1	2.52	0
I-2	2.52	0
I-3	2.52	0
I-4	2.52	0

I-5	2.52	0
II-1	2.52	0
II-2	2.52	0
II-3	2.52	0
III-1	0.64	3
III-2	0.64	3
III-3	0.64	2
III-4	0.75	1
III-5	0.64	3
III-6	0.64	0
III-7	0.40	0
III-8	0.64	2
III-9	0.64	0
III-10	0.64	0
III-11	0.64	0
III-12	0.64	0
III-13	0.64	0
III-14	0.64	0
III-15	0.64	0
III-16	0.64	2
III-17	0.64	0
III-18	0.64	0
III-19	0.64	0
III-20	0.64	0
III-21	2.52	0
III-22	0.64	0
III-23	0.64	0
III-25	2.52	0

III-26	2. 52	0
III-27	2. 52	0
III-28	2. 52	0
III-29	2. 52	0
III-30	2. 52	0
III-31	2. 52	0
III-32	2. 52	3
III-33	2. 52	2
III-34	2. 52	1
III-35	2. 52	4
III-36	2. 52	0
III-37	2. 52	0
III-38	2. 52	0
III-39	2. 52	5
III-40	2. 52	2
III-41	2. 52	2
III-42	2. 52	2
III-43	2. 52	0
III-44	2. 52	0
III-45	2. 52	0
III-46	0. 64	0
III-47	2. 52	0
III-48	0. 64	0
III-49	2. 52	0
III-50	0. 64	0
III-51	0. 64	0
III-52	2. 52	0
III-53	2. 52	0

III-54	0.64	O
III-55	2.52	O
III-56	2.52	O
III-57	2.52	O
III-58	0.64	O
III-59	2.52	O
III-60	2.52	O
III-61	2.52	O
III-62	0.64	O
III-63	2.52	O
III-64	2.52	O
III-65	2.52	O
III-66	2.52	O
III-67	0.64	O
III-68	2.52	O
III-69	2.52	O
III-70	2.52	O
III-71	2.52	O
III-72	0.64	O
III-73	0.64	O
III-74	2.52	O
III-75	0.64	O
III-76	2.52	O
III-77	2.52	O
III-78	0.64	O
III-79	1.04	O
III-80	2.52	O
III-81	2.52	O

III-82	2.52	O
III-83	6.30	O
III-84	2.52	O
III-85	2.52	O
III-86	2.52	O
III-87	2.52	O
III-88	2.52	O
III-89	2.52	O
III-90	1.28	O
III-91	2.52	O
III-92	2.52	O
III-93	2.52	O
III-95	2.52	O
III-96	0.64	O
III-97	0.64	O
III-98	0.64	O
III-99	2.17	O
III-100	2.52	O
III-101	2.52	1
III-102	2.52	O
III-103	2.52	O
III-104	2.52	O
III-105	2.52	O
III-106	2.52	O
III-107	0.64	O
III-108	0.64	O
III-109	0.64	O
III-110	0.64	O

III-111	0.64	0
III-112	2.52	2
III-113	2.52	4
III-114	0.64	0
IV-1	0.64	0
IV-2	0.64	0
IV-3	0.64	0
IV-4	0.64	0
IV-5	0.64	0
IV-6	0.64	0
IV-7	2.52	3
IV-8	2.52	2
IV-9	0.64	0
IV-10	2.52	0
IV-11	2.52	0
IV-12	2.52	0
IV-13	2.52	5
IV-14	1.79	0
IV-15	2.52	0
IV-16	2.52	0
IV-17	2.52	0
IV-18	2.52	0
IV-19	2.52	0
IV-20	2.52	0
IV-21	2.52	0
IV-23	2.52	0
IV-24	0.64	0
VI-25	0.64	0

VI-26	0.64	O
IV-27	0.64	O
IV-28	0.64	1
IV-29	2.52	O
IV-30	2.52	O
IV-31	2.52	O
IV-32	2.52	O
IV-33	2.52	O
IV-34	2.52	O
IV-35	2.52	O
V-1	0.64	O
V-2	2.52	O
V-4	2.52	O
V-5	0.64	O
V-8	2.52	O
V-9	0.64	O
V-10	2.52	O
V-12	0.64	O
V-13	2.52	O
V-14	2.52	O
V-15	2.52	1
V-16	2.52	O
V-17	2.52	1
V-18	0.64	O
V-19	0.64	O
V-20	0.64	O
V-21	0.64	O
V-22	0.64	O

V-23	0.64	O
V-24	0.64	O
V-25	2.52	O
V-26	2.52	O
V-27	2.52	O
V-29	2.52	O
V-30	2.52	O
V-31	2.52	O
V-32	0.64	O
V-33	0.64	O
V-34	0.64	O
V-35	0.64	O
V-36	0.64	O
V-37	2.52	O
V-38	2.52	O
V-39	2.52	O
V-40	2.52	O
VI-1	0.64	3
VI-2	0.64	O
VI-3	0.64	O
VI-4	0.64	O
VI-5	0.64	O
VI-6	0.64	O
VI-7	0.64	O
VII-1	2.52	O
VII-2	2.52	O
VII-3	2.52	O
VII-4	2.52	O

VII-5	2.52	0
VII-6	2.52	2
VII-7	1.00	0
VII-8	2.52	0
VIII-2	2.52	2
VIII-3	2.52	0
IX-1	2.52	0
X-1	2.52	5
X-2	2.52	3
X-3	2.52	4
X-4	2.52	0
X-5	2.52	0
X-6	2.52	2
X-7	2.52	0

[0305] [第 27 表]

化合物 No.	処理薬量 (g/a)	A	B	C
I-1	2.52	4	4	4
I-2	2.52	4	5	5
I-3	2.52	5	5	5
I-4	2.52	5	5	5
I-5	2.52	5	5	5
II-1	2.52	5	5	5
II-2	2.52	5	5	5
II-3	2.52	5	5	5

III-1	2.52	5	5	5
III-2	2.52	5	5	5
III-3	2.52	5	5	5
III-4	1.50	5	5	5
III-5	2.52	5	5	5
III-6	2.52	5	5	5
III-7	1.52	5	5	5
III-8	2.52	5	5	5
III-9	2.52	5	5	5
III-10	2.52	5	5	5
III-11	2.52	5	5	5
III-12	2.52	5	5	5
III-13	2.52	5	5	5
III-14	2.52	4	5	3
III-15	2.52	4	4	0
III-16	2.52	5	5	5
III-17	2.52	4	5	0
III-18	2.52	5	5	5
III-19	2.52	5	5	5
III-20	2.52	5	4	5
III-21	2.52	5	5	5
III-22	2.52	5	5	5
III-23	2.52	5	5	5
III-25	2.52	5	4	5
III-26	2.52	5	5	5
III-27	2.52	4	5	5
III-28	2.52	4	5	4
III-29	2.52	4	5	4

111-30	2.52	5	5	5
111-31	2.52	5	5	5
111-32	2.52	5	5	5
111-33	2.52	5	5	4
111-34	2.52	5	5	5
111-35	2.52	5	5	4
111-36	2.52	5	5	5
111-37	2.52	5	5	5
111-38	2.52	5	5	5
111-39	2.52	5	5	5
111-40	2.52	5	5	5
111-41	2.52	5	5	5
111-42	2.52	5	5	5
111-43	2.52	5	5	5
111-44	2.52	4	5	5
111-45	2.52	3	5	4
111-46	2.52	5	5	5
111-47	2.52	5	5	5
111-48	2.52	5	5	5
111-49	2.52	5	5	5
111-50	2.52	5	5	5
111-51	2.52	5	5	5
111-52	2.52	5	5	5
111-53	2.52	5	5	4
111-54	2.52	5	5	5
111-55	2.52	5	5	4
111-56	2.52	5	5	5
111-57	2.52	5	5	5

111-58	2.52	5	5	5
111-59	2.52	5	5	5
111-60	2.52	5	5	5
111-61	2.52	5	5	5
111-62	2.52	5	5	5
111-63	2.52	5	5	5
111-64	2.52	5	5	5
111-65	2.52	5	5	5
111-66	2.52	5	5	5
111-67	2.52	5	5	5
111-68	2.52	5	5	5
111-69	2.52	5	5	5
111-70	2.52	0	5	4
111-71	2.52	5	5	4
111-72	2.52	5	5	5
111-73	2.52	5	5	5
111-74	2.52	5	5	5
111-75	2.52	5	5	5
111-76	2.52	5	5	5
111-77	2.52	5	5	5
111-78	2.52	5	5	5
111-79	1.04	5	5	5
111-80	2.52	5	5	5
111-81	2.52	5	4	4
111-82	2.52	5	5	4
111-83	6.30	5	5	5
111-84	2.52	5	5	5
111-85	2.52	5	4	5

III-86	2.52	5	5	5
III-87	2.52	3	5	4
III-88	2.52	5	5	5
III-89	2.52	5	5	5
III-90	1.28	4	5	5
III-91	2.52	5	5	5
III-92	2.52	5	5	5
III-93	2.52	4	5	4
III-94	2.52	5	5	5
III-95	2.52	5	5	5
III-96	2.52	5	5	5
III-97	2.52	5	5	5
III-98	2.52	5	5	5
III-99	2.17	5	5	5
III-100	2.52	5	5	5
III-101	2.52	5	5	5
III-102	2.52	5	5	5
III-103	2.52	5	5	4
III-104	2.52	5	5	5
III-105	2.52	5	5	5
III-106	2.52	5	5	5
III-107	2.52	4	4	5
III-108	2.52	5	5	5
III-109	2.52	5	5	5
III-110	2.52	5	5	5
III-111	2.52	5	5	5
III-112	2.52	5	5	5
III-113	2.52	5	5	5

III-114	0.64	3	5	5
IV-1	2.52	5	5	5
IV-2	2.52	5	5	5
IV-3	2.52	5	5	5
IV-4	2.52	5	5	5
IV-5	2.52	5	5	5
IV-6	2.52	5	5	5
IV-7	2.52	5	4	5
IV-8	2.52	5	5	5
IV-9	2.52	5	5	5
IV-10	2.52	5	5	5
IV-11	2.52	5	5	5
IV-12	2.52	4	5	4
IV-13	2.52	5	5	5
IV-14	1.79	3	4	4
IV-15	2.52	5	5	4
IV-16	2.52	5	5	5
IV-17	2.52	5	5	5
IV-18	2.52	5	5	5
IV-19	2.52	5	5	5
IV-20	2.52	5	5	5
IV-21	2.52	4	5	4
IV-23	2.52	5	5	5
IV-24	2.52	5	5	5
IV-25	2.52	5	5	5
IV-26	2.52	5	5	5
IV-27	2.52	5	5	5
IV-28	2.52	5	5	5

IV-29	2. 52	0	5	3
IV-30	2. 52	0	5	3
IV-31	2. 52	5	5	5
IV-32	2. 52	5	5	5
IV-33	2. 52	4	5	3
IV-34	2. 52	5	5	0
IV-35	2. 52	0	5	0
V-1	2. 52	5	5	5
V-2	2. 52	5	5	5
V-3	2. 52	5	5	5
V-4	2. 52	5	5	5
V-5	2. 52	5	5	5
V-6	2. 52	5	5	4
V-8	2. 52	5	5	4
V-9	2. 52	5	5	5
V-10	2. 52	5	5	5
V-12	2. 52	5	5	5
V-13	2. 52	5	5	5
V-14	2. 52	5	5	5
V-15	2. 52	5	5	4
V-16	2. 52	5	5	4
V-17	2. 52	5	5	4
V-18	2. 52	5	5	5
V-19	2. 52	5	5	5
V-20	2. 52	5	5	5
V-21	2. 52	5	5	5
V-22	2. 52	5	5	5
V-23	2. 52	5	5	5

V-24	2. 52	5	5	5
V-25	2. 52	5	5	5
V-26	2. 52	0	5	5
V-27	2. 52	0	4	4
V-29	2. 52	5	5	4
V-30	2. 52	5	5	4
V-31	2. 52	5	5	4
V-32	2. 52	5	5	5
V-33	2. 52	5	5	5
V-34	2. 52	5	5	5
V-35	2. 52	5	5	5
V-36	2. 52	5	5	5
V-37	2. 52	0	5	0
V-38	2. 52	0	0	0
V-39	2. 52	4	5	4
V-40	2. 52	4	5	3
VI-1	2. 52	5	5	5
VI-2	2. 52	4	5	5
VI-3	2. 52	0	5	3
VI-4	2. 52	4	5	4
VI-5	2. 52	0	5	3
VI-6	2. 52	5	5	5
VI-7	2. 52	5	5	5
VII-1	2. 52	4	4	4
VII-2	2. 52	5	5	5
VII-3	2. 52	5	5	5
VII-4	2. 52	5	5	5
VII-5	2. 52	5	5	5

VII-6	2.52	5	4	4
VII-7	1.00	5	5	5
VII-8	2.52	5	5	5
VIII-2	2.52	5	4	5
VIII-3	2.52	5	5	5
IX-1	2.52	5	5	4
X-1	2.52	5	5	5
X-2	2.52	5	5	5
X-3	2.52	5	5	5
X-4	2.52	5	5	4
X-5	2.52	5	5	4
X-6	2.52	5	5	4
X-7	2.52	5	4	4

[0306]

[表1]

〔第28表〕

化合物 No.	処理薬量 (g/a)	A	D	E	F	G	H	I	J	K	L	M	N	O	b	c	d	e	f
I-1	6.3	5	5	2	4	5	0	3	4	0	4	0	4		0	0	2	4	2
I-2	6.3	5	5	2	0	5	2	5	4	0	0	2	5		3	1	3	0	2
I-3	6.3	5	5	0	3	5	1	5	4	0	2	0	4		0	0	0	3	0
I-4	6.3	5	5	2	0	5	3	4	4	0	0	0	4		0	0	0	0	0
I-5	6.3	5	1	0	0	5	0	4	4	0	0	0	4		0	0	0	0	0
II-1	6.3	5	5	5	0	5	2		4	0	0		4		4	0	3	4	2
II-2	6.3	5	5	5	1	5	4		4	0	2		3	0	0	0	5	5	3
II-3	6.3	5	5	5	0	5	0		4	0	0		4	3	0	0	5	3	2
III-1	6.3	5	5	4	0	5	1	3	0	0	0	0	3		5	3	4	0	0
III-2	6.3	5	5	5	3	5	5	4	4	4	3	5	5	5	5	4	5	5	0
III-3	6.3	5	5	5	2	5	5	5	5	4	0	5	5	5	5	3	5	5	2
III-5	6.3	5	5	5	2	5	4	5	5	4	2	4	5	5	4	4	5	5	3
III-6	6.3	5	5	5	0	5	4	0	3	2	5	0	3	0	0	3	5	3	0
III-7	6.3	5	5	5	0	5	4	3	3		0		4	4	0	0	5	3	0
III-8	6.3	5	5	5	3	5	5	4	5	4	3	4	4		4	4	5	5	3
III-9	6.3	5	5	5	0	5	1	2	4	0	0	0	5		5	0	5	0	0
III-10	6.3	5	5	5	0	5	3	3	3	0	0	0	3	0	0	0	5	3	0
III-11	6.3	5	5	5	3	5	4	2	5	1	3	0	3		1	3	5	4	0
III-12	6.3	5	5	5	0	5	0	0	1	0	0	0	3	3	1	0	3	3	0
III-13	6.3	5	5	5	3	5	5	5	5	3	4	0	4		5	2	5	5	0
III-14	6.3	5	5	3	0	0	0	0	0	0	0	0	4	0	0	0	3	0	0
III-15	6.3	5	4	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
III-16	6.3	5	5	5	0	5	4	4	4	3	0	4	4		5	3	5		3
III-17	6.3	3	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
III-18	6.3	5	5	5	0	5	3	3	4	0		0	3	0	3	0	4	0	0
III-19	6.3	5	5	5	4	5	5	5	5	5	3		4		5	4	5	5	2
III-20	6.3	5	5	5	4	5	5	5	4	4	5		4	4	5	4	5	5	3
III-21	6.3	5	5	5	1	5	5	5	5	3	5	5	5		4	2	5	5	2
III-22	6.3	5	5	5	3	5	5	5	3	1	4	3	5		5	2	5	5	1
III-23	6.3	5	5	4	3	5	5	5	0	3	2	2	2	3	1	3	4	4	0
III-25	6.3	5	5	5	5	5	5	4	4	5	5	5	5		4	1	5	5	3
III-26	6.3	5	5	5	5	5	5	2	4	5	5	5	5	5	1	1		5	0
III-27	6.3	5	5	5	5	5	5	2	4	5	5	5	5	5	5	1	5	5	0
III-28	6.3	5	5	5	5	5	5	2	1	4	5	3	4		2	0	5	5	4
III-29	6.3	5	5	5	3	5	5	1	1	2	4	3	3	0	0	0	3	3	0
III-30	6.3	5	5	5	5	5	5	1	4	4	4	4	5		5	1	5	5	0
III-31	6.3	5	5	5	5	5	5	1	2	1	5	0	4	5	0	0	4	5	0
III-32	6.3	5	5	5	4	5	5	1	3	4	4	3	4		1	0	5	4	0
III-33	6.3	5	5	5	4	5	4	1	3	5	3	4	4		1	0	5	5	0
III-34	6.3	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5		5		5	3	5	5	5
III-35	6.3	5	5	5	4	5	5	4	4	4	5	5	5		5	2		5	3
III-36	6.3	5	5	5	5	5	5	5	4	4	5	5	5		5	3		5	5

[0307] [表2]

〔第28表の続き〕

III-37	6.3	5	5	5	0	5	5	3	5	4	5	2	5		2	0	2	5	5
III-38	6.3	5	2	3	0	5	0	3	3	0	3	0	5	0	0	1	0	0	3
III-39	6.3	5	5	5	4	5	5	5	5	4	5	3	5		5	3	5	5	4
III-40	6.3	5	5	5	3	5	5	5	5		5		4		4	0	5	5	5
III-41	3.2	5	5	5	4	5	4	0	5	5	4	4	5	0	4	3	5	5	3
III-42	3.2	5	5	5	3	5	5	0	5	4	3	0	5	0	4	2	5	5	2
III-43	3.2	5	5	5	0	5	5	0	5	5	3	4	5	0	4	2	5	5	0
III-44	6.3	5	4	4	0	5	3	4	5	5	5	5	5	4	0	2	5	5	0
III-45	6.3	5	4	3	2	5	5	5	5	5	5	5	4	3	0	2	5	5	3
III-46	6.3	5	5	5	0	5	4	2	4	0	0		2		0	0	0	1	0
III-47	6.3	5	5	4	5	5	5	5	4	0	3	4	4		5	4	4	5	0
III-48	6.3	5	5	3		5	3	4	4	1	0	0	3	0	0	0	2	2	0
III-49	6.3	5	5	4	0	5	5	5	5	1	0	3	3	0	4	4	3	4	0
III-50	6.3	5	5	4	4	5	5	4	4	1	4	5	3	3	3	5	3	5	1
III-51	6.3	5	4	3	0	5	4	4	5	4	0	4	3	0	1	4	2	0	0
III-52	6.3	5	5	5	0	5	3	5	5	0	0	2	3	4	5	3	4	3	3
III-53	6.3	5	5	5	1	5	5	4	4	0	3	1	3		1	2	4	3	0
III-54	6.3	5	4	3	0	4	1	3	4	0	0	0	0	0	0	3	1	0	0
III-55	6.3	5	5	5	0	5	5	4	4		4		5		1	3	4	0	0
III-56	6.3	5	5	3	0	5	4	4	5	0	0	4	4	0	5	4	2	3	0
III-57	6.3	5	5	5	0	5	4	4	4	0	3	4	4		5	2	3	3	0
III-58	6.3	5	5	5	0	5	2	4	4	0	1	0	0	4	3	1	1	0	3
III-59	6.3	5	5	5	0	5	4	4	4		4	3	5		4	4	1	0	0
III-60	6.3	5	4	3	0	5	3	3	3	0	0	0	4	0	0	0	0	0	0
III-61	6.3	5	3	3	0	5	2	2	1	0	0	0	3	0	0	5	0	0	0
III-62	6.3	5	3	4	0	5	0	4	3	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
III-63	6.3	5	3	1	0	5	0	0	0	0	0	0	4	0	0	1	0	0	0
III-64	6.3	5	5	5	0	5	3	4	4	0	0	0	4	0	0	3	0	0	1
III-65	6.3	5	5	4	0	5	0	4	4	0	1	0	3		0	4	3	0	0
III-66	6.3	5	5	5	0	5	3	5	4	0	0	0	4	0	0	4	2	0	0
III-67	6.3	5	4	2	0	5	2	4	3	2	0	3	4	0	3	2	1	0	0
III-68	6.3	5	5	5	0	5	3	3	3	0	0	0	4	0	0	0	0	0	0
III-69	6.3	5	5	5	0	5	5	4	4	0	3	1	3		4	2	4	4	4
III-70	6.3	4	2	0	0	5	0	2	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
III-71	6.3	5	4	3	0	5	4	3	4	0	3	0	5		1	0	1	0	0
III-72	6.3	5	5	4	0	5	5	4	5	3	0	4	4	3	5	5	5	3	
III-73	6.3	5	5	5	4	5	5	4	4	0	4	2	4	3	1	0	5	5	0
III-75	6.3	4	4	4	5	5	5	5	4	2	5		5	5	1	1	4	5	0
III-76	6.3	5	5	5	3	5	5	4	3	1	4	2	5	3	2	0	3	4	2
III-78	6.3	5	5	5	0	4	5	0	3	0	1	4	4	1	0	1	3	2	0
III-79	2.6	5	5	5	0	5	5	1	4	2	4	1	5		1	0	1	4	3
III-80	6.3	5	5	5	0	5	5	3	4	1	5		5	3	2	1	5	5	4
III-81	6.3	5	5	4	0	5	3	1	4	1	4	1	5		2	0	0	3	0
III-82	6.3	5	4	4	0	5	0	3	3	3	0	0	3		0	0	0	0	3
III-84	6.3	5	5	3	0	5	4	2	4	4	5	1	5		3	0	3		5
III-85	6.3	5	5	5	5	5	5	5	5	4	3	4	4		5	3		5	4

[0308] [表3]

〔第28表の続き〕

III-87	6.3	3	4	1	5	5	5	1	1	0	3	0	4		0	0	0	5	0
III-88	6.3	5	5	5	4	5	5	0	4	0	3	0	4		4	2	2	4	0
III-89	6.3	5	5	4	3	5	5	0	2	0	0	0	4		0	0	0	4	2
III-90	3.2	5	5	5	3	5	4	0	3		0				1	2	3	5	0
III-91	6.3	5	5	3	2	5	5	0	1	0	4	0	4		0	1	3	4	0
III-94	6.3	5	5	5	4	5	5	4	5	2	4	4	4	0	4	5	5	5	0
III-95	6.3	5	5	4	1	5	5	4	3	0	3	0	4	0	0	1	3	3	0
III-96	6.3	5	5	3	3	5	5	3	5	1	4	5	4		4	2	3	4	0
III-97	6.3	5	4	4	0	5	1	0	3	0	0	0	4	5	0	0	0	0	0
III-98	6.3	5	5	3	3	5	4	4	5	0	4		5		5	3	2	4	0
III-99	5.4	5	4	3	2	5	5	5	5	2	3	5	5		3	3	5	5	3
III-100	3.2	5	5	5	1	5	4	4		3	2		5	0	5	4	5	1	3
III-101	3.2	5	5	5	1	5	3	5		3	1		5	0	5	2	5	2	0
III-102	3.2	5	5	5	1	5	3	5		3	0		5	0	5	4	5	1	0
III-103	6.3	5	4	2	0	5	5	3	3	1	4		5		1	2	2	3	1
III-104	3.2	5	5	5	3	5	0	3		2	3		5	0	4	0	2	0	3
III-105	3.2	5	4	4	0	5	4	4		2	0		4	0	4	0	2	0	1
III-106	3.2	5	5	5	0	5	3	5		3	0		5	0	5	2	4	0	3
III-107	6.3	5	5	5	4	5	5	5	3	5	3	5	3		2	3	5	5	0
III-108	6.3	5	5	5	5	5	5	5	4	4	4	5	4		3	3	5	5	4
III-109	6.3	5	5	5	4	5	5	5	3	2	4	3	4		4	1	5	5	0
III-110	6.3	5	5	5	5	5	5	4	2	3	3	4	3		1	0	5	5	0
III-111	6.3	5	5	4	4	5	4	3	0	1	3	4	3		2	0	4	4	0
III-112	6.3	5	5	5	0	5	4	3	5	0	4	3	3	5	4	1	0	0	0
III-113	6.3	5	5	5	0	5	4	4	0	2	3	3	5		5	0	5	5	1
III-114	1.6	3	1	0	0	5	3		0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
IV-1	6.3	5	5	5	3	5	5	5	4	1	2		4	0	5	5	4	4	0
IV-2	6.3	5	5	5	5	5	5	4	2	0	5	0	5	4	5	0	5	5	0
IV-3	6.3	5	5	5	5	5	5	2	0	0	5	0	4	4	3	0	5	5	0
IV-4	6.3	5	4	4	0	5	3	2	4	0	3	2	5		3	0	3	4	0
IV-5	6.3				0	5	0	0	0		3		4	0	2	0	0	5	0
IV-6	6.3	5	5	5	4	5	3	2	3	2	0		4	4	3	0	4	5	0
IV-7	6.3	5	5	5	5	5	5	5	2	0	4	3	4		5	3	5	5	0
IV-8	6.3	5	5	5	5	5	5	4	2	0	4	3	4	3	5	1	5	5	2
IV-9	6.3	5	5	5	5	5	5	2	0	3	0	5	4	3	1	0	3	5	0
IV-10	6.3	5	5	3	3	5	3	0	0	0	3	1	3	4	0	0	4	5	0
IV-11	6.3	5	4	4	5	5	5	2	1		3	2	4		4	0	5	5	0
IV-12	6.3	5	3	3	5	5	5	0	0	0	5	0	5		3	0	3	5	1
IV-13	6.3	5	5	5	4	5	5	4	5	4	5	5	5		5	3	5	5	4
IV-14	4.5	5	5	5	3	5	5	5	5	5	5	5	5		4	0	5	5	3
IV-15	6.3	5	5	5	1	5	5	5	3	5	5	5	5		1	0	3	4	4
IV-16	6.3	5	5	4	1	5	5	2	5	5	5	4	5		0	2	2	3	0
IV-17	6.3	5		4	0	5	4	0	4		5	2	3		0	1	0	1	0
IV-18	6.3	5	5	5	3	5	5	5	5	4	5	5	5		1	2		5	5
IV-19	6.3	5	5	5	3	5	5	5	5	5	5	5	5		5	0	5	4	0
IV-20	6.3	5	5	5	0	5	4	3	5	1	5	5	5	5	5	3	5	4	3

[0309] [表4]

〔第 28 表の続き〕

IV-21	6.3	5	5	5	3	5	5	5	5	5	5	5	5	3	1	4	3
IV-23	6.3	5	5	5	3	5	5	4	4	4	5	4	5	4	5	4	4
IV-24	6.3	5	5	5	1	5	4	2	0	0	4	0	3	0	5	0	3
IV-25	6.3	5	5	5	0	5	4	0	0	0	3	0	3	1	0	1	2
IV-26	6.3	5	5	4	0	5	0	1	0	0	4	0	1	2	1	0	0
IV-27	6.3	5	5	3	0	5	5	0	1	0	0	0	2	0	0	1	5
IV-28	6.3	5	5	4	0	5	5	0	0	0	0	0	3	0	0	4	3
IV-29	6.3	0	5	3	0	5	1	0			5	0	0	0	0	0	3
IV-30	6.3	3	2	0	0	5	4	0	0	0	1	0	3	0	2	0	0
IV-31	6.3	5	5	4	5	5	5	3	3	0	2	0	5	4	1	4	5
IV-32	6.3	5	3	1	2	5	5	0	0	0	3	0	3	0	0	1	3
IV-33	6.3	4	2	3	0	3	0	0		0	0	0	0	0	0	1	0
V-1	6.3	5	5	5	3	5	3	5	4	5	4	0	3	0	5	0	5
V-2	6.3	5	5	5	0	5	5	4	3	3	5	1	5	5	1	5	5
V-3	6.3	5	5	5	0	5	5	3	3	3	5	2	5	4	1	4	5
V-4	6.3	5	5	4	3	5	4	3	3	3	5	1	5	3	1	4	5
V-5	6.3	5	5	5	0	5	0	1	0	0	0	0	4	0	0	0	0
V-6	6.3	4	5	5	0	5	4	2	1	1	3	0	5	1	0	3	4
V-8	6.3	5	5	5	1	5	5	2	3	0	5	0	5	0	5	2	5
V-9	6.3	5	5	5	0	5	2	3	0	0	0	0	3	3	0	5	0
V-10	6.3	5	5	4	1	5	5	2	0	0	5	0	4	3	0	3	4
V-12	6.3	5	5	5	0	5	1	0	0	0	3	0	3	2	0	0	0
V-13	6.3	5	5	5	0	5	4	3	0	1	4	0	5	0	5	1	5
V-14	6.3	5	5	5	3	5	5	3	3	2	0	1	4	4	0	5	5
V-15	6.3	5	5	5	5	5	5	3	0	1	5	1	4	5	2	5	5
V-16	6.3	5	5	5	4	5	5	3	0	1	5	1	5	5	1	5	5
V-17	6.3	5	5	5	0	5	5	0	1	2	3	0	5	5	2	5	5
V-18	6.3	5	5	5	1	5	5	3	4	4	4	2	4	4	4	3	5
V-19	6.3	5	5	4	0	5	5	2	2	2		0	4	5	1	3	5
V-20	6.3	5	5	5	4	5	5	1	3	1	4	1	5	4	4	1	5
V-21	6.3	5	5	5	0	5	5	3	1	2	4	1	4	4	4	1	5
V-22	6.3	5	5	3	0	5	5	4	2	0	4	0	5	0	3	2	3
V-23	6.3	5	5	3	0	5	5	3	0	0	5	0	5	4	1	5	5
V-24	6.3	5	2	0	0	5	5	0	0	0	0	0	5	4	0	1	3
V-25	6.3	4	4	5	0	5	4	0	0	0	0	0	2	0	0	3	4
V-29	6.3	5	5	5	3	5	5	0	0	0	5	0	5	0	3	0	3
V-30	6.3	5	5	5	2	5	5	2	0	2	4	0	5	3	0	3	4
V-31	6.3	5	5	3	0	5	4	0	0	0	0	0	0	0	3	0	2
V-32	6.3	5	5	5	0	5	5	0	4	0	4	0	1	5	4	2	5
V-33	6.3	5	5	3	5	5	5	1	2	0	5	0	5	4	3	4	5
V-34	6.3	5	5	3	2	5	5	0	0	0	0	0	2	0	3	2	5
V-35	6.3	5	5	4	5	5	4	3	0	0	4	0	3	1	1	3	5
V-36	6.3	4	4	1	0	5	5	0	0	0	3	0	0	3	0	1	1
V-39	3.2	5	5	5	0	5	0	5	0	0	0	3	0	0	4	0	0
V-40	3.2	5	4	4	0	4	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
VI-1	6.3	5	5	5	0	5	5	4	4	5	5	5	5	5	5	3	5

[0310] [表5]

〔第28表の続き〕

VI-2	6.3	5	5	5	0	5	3	0	0	0	5	0	5	3	0	0	0	0	1
VI-3	6.3	1	0	0	0	3	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
VI-4	6.3	3	0	0	0	3	0	0	0	0	0	0	2	0	0	0	0	3	0
VI-5	6.3	0	0	0	0	3	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
VI-6	6.3	5	3	0	0	5	0	0	0	0	3	3	4		1	2	0	0	4
VI-7	7.1	5	5	2	0	5	4	0	4	1	2	3	4		1	1	3	3	2
VII-1	6.3	4	5	4	0	5	4	5	4	0	4	2	4		2	4	2	0	3
VII-2	6.3	5	5	5	2	5	5	5	5		4		5		3	0	3	3	2
VII-3	6.3	5	5	5	0	5	4	5	4		5	4	5		5	1	2	0	3
VII-4	6.3	5	5	5	0	5	4	5	4	1	4	2		4	0	0	0	0	3
VII-5	6.3	5	5	4	0	5	3	5	4		3	3	4	4	0	0	0	0	3
VII-6	6.3	5	5	5	3	5	5	5	5	2	5	3	5		2	1	4	4	4
VII-7	2.5	5	5	5	1	5	5	5	4	2	5	2	5		5	1	4	4	3
VII-8	6.3	5	5	5	3	5	5	5	4	1	5	2	5		4	4	3	3	4
VIII-2	6.3	5	5	5	3	5	5	5	5	3	5	4	5		4	1	4	4	5
VIII-3	6.3	5	5	5	3	5	5	5	4	2	5	4	5		4	1	4	4	0
IX-1	6.3	5	5	5	4	5	5	4	3	5	5	4	5		0	0		5	1
X-1	6.3	5	5	4	4	5	5	1	5	3	3	0	3	0	3	0	5	5	0
X-2	6.3	5	5	5	4	5	5	4	4	4	5	4	5		5	3	5	5	3
X-3	6.3	5	5	5	5	5	5	2	1	3	5	1	5		2	0	5	5	3
X-4	6.3	5	5	5	0	5	0	0	1	0	0	0	0		0	0	3	1	0
X-5	6.3	5	4	2	0	5	0	0	0	0	0	0	0		0	0	0	0	0
X-6	6.3	5	5	5	5	5	5	4	3	1	5	2	5		5	0	5	5	3
X-7	6.3	5	5	5	5	5	5	3	0	1	4	1	5		5	1	5	5	0

[0311]

[表6]

〔第 2 9 表〕

化合物 No.	処理薬量 (g/a)	A	D	E	F	G	H	I	J	K	L	M	N	O	b	c	d	e	f
I-1	6.3	5	4	4	0	5	4	5	4	0	3		4	3	5	3	3	0	3
I-2	6.3	5	4	4	0	5	2	4	4	0	3	0	4	3	5	3	4	0	2
I-3	6.3	5	2	3	0	5	3	4	4	0	5	0	3	4	5	3	3	0	3
I-4	6.3	5	2	3	0	5	2	5	3	3	4	0	3	3	4	3	3	0	1
I-5	6.3	5	2	3	0	5	0	5	4	1	4	0	3	5	5	3	3	0	2
II-1	6.3	5	5	5	0	4	2		4	0	0		4	4	5	3	5	0	2
II-2	6.3	5	5	4	0	5	3		5	0	0		3	4	1	3	3	2	1
II-3	6.3	5	4	4	0	5	1		4	0	0		3	4	0	3	3	0	1
III-1	6.3	5	5	5	0	5	3	4	3	0	1	0	3		5	5	5	1	2
III-2	6.3	5	5	5	3	5	5	5	5	3	3	4	4	4	5	4	5	4	0
III-3	6.3	5	5	5	0	5	4	5	4	2	3	3	3	3	5	4	5	3	0
III-5	6.3	5	5	5	2	5	5	5	5	3	2	4	4	4	5	5	5	4	0
III-6	6.3	5	5	5	0	5	3	5	3	0	2	0	3	3	5	4	5	2	0
III-7	6.3	5	5	4	0	5	4	4	3	3	0	0	3	3	3	3	5	1	0
III-8	6.3	5	5	5	3	5	5	5	5	3	3	3	4	2	5	5	5	3	0
III-9	6.3	5	5	5	0	4	4	4	3	0	0	0	4		5	4	4	2	0
III-10	6.3	5	5	5	1	5	4	5	4	0	0	0	3	3	5	4	5	2	0
III-11	6.3	5	5	5	0	5	4	4	3	0	1	0	3	3	5	4	5	3	0
III-12	6.3	5	5	4	0	5	3	3	2	0	0	0	4	3	1	4	5	2	0
III-13	6.3	5	5	5	1	5	5	5	3	0	0	1	3	4	5	4	5	3	0
III-14	6.3	5	4	3	0	4	0	3	4	3	3		4	5	0	3	4	0	0
III-15	6.3	5	5	2	0	3	0	4	4	3	4	0	3	4	0	3	0	0	0
III-16	6.3	5	5	5	0	5	5	5	4	2	0	3	4	4	5	4	5	3	4
III-17	6.3	1	0	0	0	0	0	0	2	4	0	0	1	3	0	3	0	0	0
III-18	6.3	5	5	5	1	4	1	5	3	2	0	0	3	3	5	4	5	2	0
III-19	6.3	5	5	5	1	5	3	5	4	3	3	3	3	3	5	4	5	3	1
III-20	6.3	5	5	5	4	5	5	5	4	3	5	1	4	5	5	5	5	4	2
III-21	6.3	5	5	5	3	5	5	5	3	2	3	3	3	4	5	5	5	4	2
III-22	6.3	5	5	5	4	5	5	4	4	1	5	3	4	2	5	4	5	4	0
III-23	6.3	5	5	4	3	5	3	5	3	4	4	0	3	3	5	5	5	3	2
III-24	6.3	4	4	4	0	5	3	3	1	0	0		3		5	3	3	0	0
III-25	6.3	5	5	5	5	5	4	5	4	5	4	5	4	3	5	5	5	5	3
III-26	6.3	5	5	5	4	5	5	5	3	5	4	3	3	3	5	5	4	5	2
III-27	6.3	5	5	5	4	5	4	5	4	5	5	5	4	3	5	4	4	5	2
III-28	6.3	5	5	5	4	4	5	5	3	3	4	3	4	4	5	4	5	5	2
III-29	6.3	5	4	5	2	4	5	4	3	5	4	4	3	4	5	5	4	5	2
III-30	6.3	5	5	5	4	5	5	5	3	4	4	4	4	4	5	5	5	4	3
III-31	6.3	5	5	5	4	5	5	5	3	3	2	3	4	5	5	5	4	4	3
III-32	6.3	5	5	5	4	5	5	4	3	3	1	4	4	4	5	4	4	5	3
III-33	6.3	5	5	5	3	5	4	4	3	3	2	3	3	3	5	4	3	4	4
III-34	6.3	5	5	5	3	5	4	5	4	5	4	4	4	5	5	5	5	3	4
III-35	6.3	5	5	4	3	5	5	5	4	2	3	4	4	4	5	4	5	4	2

[0312] [表7]

〔第29表の続き〕

III-36	6.3	5	5	5	1	5	4	5	4	3	3	5	4	4	5	5	5	4	4
III-37	6.3	5	5	4	1	5	4	5	4	3	4	5	4	5	5	5	5	4	4
III-38	6.3	5	3	4	0	5	0	5	4	1	4	2	4	5	3	4	3	0	3
III-39	6.3	5	5	5	4	5	5	5	4	2	5	3	4	4	5	4	5	4	3
III-40	6.3	5	5	5	3	5	5	5	3		5		5	4	5	4	5	3	4
III-41	3.2	5	4	5	0	5	4	5	4	3	3	0	4	3	5	4	5	0	0
III-42	3.2	5	5	5	3	5	4	4	4	2	1	0	4	3	5	4	5	3	0
III-43	3.2	5	4	5	0	5	3	4	4	2	2	3	4	3	5	4	5	0	0
III-44	6.3	5	4	3	0	5	3	5	4	4	4		5	4	2	5	4	3	4
III-45	6.3	5	4	4	3	5	4	5	5	4	5	3	5	5	3	5	3	2	5
III-46	6.3	5	4	4	0	5	1	4	3	3	0	4	3	2	4	5	3	0	0
III-47	6.3	5	4	5	0	5	4	5	4	1	3	4	4	4	4	5	5	3	0
III-48	6.3	5	5	5	1	5	3	5	4	3	4	3	3	4	5	5	4	3	2
III-49	6.3	5	5	4	0	5	4	5	4	2	3	5	4	5	5	5	5	3	0
III-50	6.3	5	4	4	0	5	3	4	5	5	0	5	3	3	5	5	3	2	0
III-51	6.3	5	5	5	0	4	1	4	3	0	0	1	3	4	4	5	3	0	0
III-52	6.3	5	5	4	0	5	3	4	3	2		3	3	4	4	5	4	0	1
III-53	6.3	5	5	5	3	5	4	4	4	1	4	3	3	4	4	4	3	1	1
III-54	6.3	5	3	3	0	4	2	5	5	0	1	0	4	4	5	5	3	0	0
III-55	6.3	5	5	3	0	5	3	5	4		4	1	4	5	3	4	3	0	0
III-56	6.3	5	5	4	0	5	3	5	4	3	5	4	4	5	5	5	4	1	0
III-57	6.3	5	5	4	0	5	4	5	4	0	4	3	3	4	4	5	5	0	0
III-58	6.3	4	3	4	0	3	2	4	4	0	0	0	3	3	5	5	3	0	0
III-59	6.3	5	5	4	0	5	3	5	4	0	4	4	4	4	5	5	4	0	0
III-60	6.3	5	4	3	0	5	0	3	4	0	0	1	3	4	4	4	3	0	0
III-61	6.3	4	4	3	0	4	2	4	4	0	3	0	3	4	3	4	2	0	0
III-62	6.3	5	4	4	0	5	1	4	5	4	4	3	3	3	5	5	4	0	0
III-63	6.3	4	2	3	0	4	0	3	4	0	0	2	4	3	4	4	3	0	0
III-64	6.3	5	3	3	0	5	1	4	4	0	3	0	3	3	4	4	2	0	3
III-65	6.3	5	3	3	0	4	1	3	5		3	0	3	3	4	4	3	0	0
III-66	6.3	5	4	3	0	5	3	3	3	0	3	2	4	4	4	4	4	0	1
III-67	6.3	5	5	5	0	5	0	4	5	5	4	4	3	3	5	5	4	3	0
III-68	6.3	5	5	3	0	5	0	3	4	0	3	0	4	4	4	4	2	0	0
III-69	6.3	5	5	4	0	5	1	4	4	0	5	2	3	3	5	4	5	0	1
III-70	6.3	5	1	0	0	4	0	3	3	0	3	0	3	3	0	4	0	0	0
III-71	6.3	5	5	4	0	5	3	4	3	0	4	2	4	3	3	4	3	0	0
III-72	6.3	5	5	5	0	5	0	4	5	5	4	4	3	3	5	5	4	3	0
III-73	6.3	5	5	5	1	5	5	4	4	4	5	4	4	3	5	4	5	3	0
III-75	6.3	5	5	5	3	5	4	4	4	4	5	3	3	4	5	4	4	4	1
III-76	6.3	5	5	5	0	5	3	4	3	3	5	4	3	2	5	4	4	3	1
III-78	6.3	5	4	5	0	5	3	5	4	3	4	2	3	2	5	4	3	3	0
III-79	2.6	5	5	5	3	5	3	4	3	0	4	1	4	3	4	4	4	2	3
III-80	6.3	5	5	5	4	5	5	4	3		4	3	4	4	5	5	5	4	4
III-81	6.3	5	4	4	0	5	2	4	3	2	3	2	3	4	5	5	4	0	3
III-82	6.3	5	4	4	0	5	1	3	3	0	3	1	3	3	5	3	3	0	2
III-84	6.3	5	5	5	0	5	3	4	3	3	5	0	4	4	5	4	4	3	3

[0313] [表8]

〔第29表の続き〕

III-85	6.3	5	5	5	5	5	5	5	3	5	5	4	4	5	4	5	5	0
III-87	6.3	5	5	5	5	4	3	3	2	5	3	4	4	5	4	3	5	0
III-88	6.3	5	5	3	0	5	5	3	5	4	4	5	4	5	4	5	0	0
III-89	6.3	5	5	4	1	5	5	3	4	4	1	3	4	3	5	5	4	1
III-90	3.2	4	3	2	2	5	4			2		4	3	5	5	5	4	0
III-91	6.3	5	4	3	3	5	4	4	2	4	4	4	4	5	4	5	4	3
III-94	6.3	5	5	5	3	5	3	5	4	4	5	2	4	4	4	5	5	1
III-95	6.3	5	5	5	2	5	3	4	4	4	5	2	3	4	5	5	5	0
III-96	6.3	5	5	5	0	5	4	4	5	4	3	5	3	5	5	4	4	2
III-97	6.3	4	3	4	0	1	4	4	3	1	4	3	4	4	5	5	0	3
III-98	6.3	4	4	4	0	5	3	4	5		4	0	3	3	5	4	1	3
III-99	5.4	5	5	5	0	5	4	4	4	3	4	5	3	4	5	5	3	1
III-100	3.2	5	4	4	0	5	3	4		1	1		3	4	5	4	4	0
III-101	3.2	5	5	4	1	5	3	4		3	2		4	4	5	4	5	1
III-102	3.2	5	4	4	0	5	1	3		3	1		3	3	5	4	4	0
III-103	6.3	5	5	4	0	5	3	4	2	1	4	4	3	2	4	4	3	0
III-104	3.2	5	3	4	0	5	0	3		1	3		3	3	4	4	3	0
III-105	3.2	5	3	4	0	5	0	3		3	2		3	3	4	4	3	0
III-106	3.2	5	4	4	0	5	0	3		3	0		3	3	4	5	4	0
III-107	6.3	5	5	5	3	5	5	4	3	5	5	2	4	4	5	4	5	5
III-108	6.3	5	5	5	5	5	5	5	3	5	5	3	4	4	5	5	5	5
III-109	6.3	5	5	5	4	5	5	4	3	3	5		3	3	5	5	3	5
III-110	6.3	5	5	5	4	5	4	5	3	4	5	4	3	3	5	5	5	5
III-111	6.3	5	5	5	0	4	4	4	2	3	4	3	4	4	5	5	4	5
III-112	6.3	5	4	4	0	5	1	4	4	2	3	3	4	3	5	5	4	0
III-113	6.3	5	5	5	0	5	5	3	1	0	2	1	3		5	3	4	3
III-114	1.6	4	0	0	0	3	0	3	3	0	0	0	0	0	0	3	0	0
IV-1	6.3	5	5	5	0	5	4	5	3	0	2	3	3	3	5	5	3	0
IV-2	6.3	5	5	5	5	5	5	4	3	1	5	1	4	4	5	4	5	5
IV-3	6.3	5	5	5	2	5	5	3	3	2	5	0	4	4	5	4	4	3
IV-4	6.3	5	5	5	3	5	3	4	3	5	4	1	4	5	5	4	5	3
IV-5	6.3	5	5	5	2	5	2	4	3	4	3	0	4	4	5	4	5	3
IV-6	6.3	5	5	5	4	5	4	5	3	3	5	1	4	4	5	4	5	5
IV-7	6.3	5	5	5	5	5	4	5	2	3	4	2	3	3	5	4	5	5
IV-8	6.3	5	5	5	5	5	4	5	2	3	5	3	3	4	5	4	5	5
IV-9	6.3	5	5	5	5	5	2	4	2	4	5	0	3	3	5	4	5	5
IV-10	6.3	5	5	5	5	5	2	5	2	5	4	2	3	4	5	5	5	5
IV-11	6.3	5	5	5	4	5	5	3	3		5		4	4	5	4	3	4
IV-12	6.3	5	5	5	5	5	5	4	3	3	5	3	4	4	5	4	3	5
IV-13	6.3	5	5	5	4	5	5	5	3	3	4	4	4	5	5	5	5	4
IV-14	4.5	5	5	5	1	5	4	5	4	3	4	3	4	4	5	5	3	3
IV-15	6.3	5	5	5	1	5	4	5	4	3	5	4	4	5	4	4	4	2
IV-16	6.3	5	5	5	1	5	5	4	5	5	5	4	4	5	4	5	4	3
IV-17	6.3	5	5	5	0	5	4	5	4	3	5	3	4	5	5	5	2	0
IV-18	6.3	5	5	5	2	5	4	5	4	2	4	5	4	5	5	5	4	5
IV-19	6.3	5	5	5	2	5	3	5	4		3	3	4	4	5	4	5	4

[0314] [表9]

〔第 2 9 表の続き〕

IV-20	6.3	5	5	5	0	5	2	4	3	0	3	3	4	4	4	4	4	3	3
IV-21	6.3	5	5	5	3	5	4	4	4	5	3	4	4	5	5	5	5	4	1
IV-23	6.3	5	5	5	2	5	5	5	3	3	4	3	4	4	5	5	5	2	4
IV-24	6.3	5	5	5	0	5	1	4	4	2	4	0	3	3	5	3	3	0	1
IV-25	6.3	5	5	5	0	5	0	3	1	2	5	0	3	4	5	3	3	0	2
IV-26	6.3	5	5	4	0	3	0	3	1	2	5	2	3	1	5	3	5	0	0
IV-27	6.3	5	5	5	3	5	5	4	3	2	4	4	4	4	5	4	5	3	3
IV-28	6.3	5	5	5	3	5	5	4	3	0	1	0	4	5	4	4	5	3	3
IV-29	6.3	0	0	0	0	5	1	2	2	0	5	0	3	3	0	3	2	0	3
IV-30	6.3	5	3	0	0	5	3	2	3	0	4	0	4	4	2	3	3	1	1
IV-31	6.3	5	5	5	4	5	5	5	3	0	3	3	4	4	5	4	5	3	3
IV-32	6.3	5	2	4	4	5	4	4	2	0	3	1	4	1	5	4	4	3	3
IV-33	6.3	3	0	0	0	0	0	2	3	0	0	0	3	3	0	3	3	0	0
V-1	6.3	5	5	5	0	5	3	4	2	3	3	1	4	3	5	4	5	1	2
V-2	6.3	5	5	5	0	5	5	4	3	1	5	1	4	3	5	4	5	3	3
V-3	6.3	5	5	5	0	5	4	4	3	2	5	3	4	5	4	4	5	3	4
V-4	6.3	5	5	5	0	5	4	3	2	0	4	1	4	2	5	4	5	2	3
V-5	6.3	5	1	5	0	3	0	3	1	0	3	0	3	2	0	3	4	0	1
V-6	6.3	5	5	4	2	5	2	3	2	0	3	0	4	0	4	4	4	1	3
V-8	6.3	5	5	5	1	5	5	4	2	0	4	0	4	3	5	4	5	1	3
V-9	6.3	5	5	5	0	5	3	3	2	0	0	0	4	0	5	5	3	0	0
V-10	6.3	5	5	5	0	5	4	4	2	0	5	0	4	4	5	4	4	1	4
V-12	6.3	5	5	5	0	3	2	4	1	0	3	0	3	2	5	4	4	0	0
V-13	6.3	5	5	5	0	5	3	4	2	3	5	3	4	3	4	4	4	0	3
V-14	6.3	5	5	5	0	5	3	3	3	0	4		4	4	5	5	5	3	0
V-15	6.3	5	5	5	3	5	3	3	2	2	5	1	4	4	5	4	4	5	1
V-16	6.3	5	5	5	3	5	3	3	2	1	4	2	3	5	5	5	4	3	3
V-17	6.3	5	5	5	2	5	4	4	3	2	3		4	4	5	4	4	3	3
V-18	6.3	5	5	5	3	5	5	4	3	4	4	3	4	4	5	5	5	4	2
V-19	6.3	5	5	5	0	5	5	3	3	4	4	3	4	4	5	4	5	3	2
V-20	6.3	5	5	5	3	5	5	4	3	4	5		4	4	5	4	5	4	3
V-21	6.3	5	5	5	0	5	5	4	4	3	5	3	3	4	5	4	5	4	3
V-22	6.3	5	5	5	0	5	5	3	3	4	4	3	4	4	5	4	5	4	3
V-23	6.3	5	5	4	0	4	5	5	2	3	5	2	5	4	4	4	5	4	4
V-24	6.3	5	3	3	0	5	3	4	2	3	4	0	3	3	4	5	5	2	2
V-25	6.3	4	1	4	0	1	0	0	1	0	0	0	3	0	4	4	2	3	0
V-29	6.3	5	4	4	1	5	1	1	1	3	5	2	3	3	4	4	4	1	1
V-30	6.3	5	5	4	0	5	3	1	1	1	4	2	3	2	4	4	4	3	2
V-31	6.3	5	4	4	0	5	0	1	1	0	0	0	3	1	4	4	4	0	0
V-32	6.3	5	5	5	0	5	4	4	3	1	4	0	3	2	5	4	5	1	0
V-33	6.3	5	5	5	0	5	4	3	3	4	4	4	3	3	4	5	5	4	3
V-34	6.3	5	5	4	0	5	2	3	3	3	4	2	3	3	5	4	3	0	0
V-35	6.3	5		5	2	5	1	4	3	4	5	3	3	3	5	4	5	3	2
V-36	6.3	5	3	4	0	5	3	3	2	5	4	2	3	3	5	4	2	2	0
V-39	3.2	5	3	4	0	5	1	3	4	0	3	3	4	4	5	3	4	0	2
V-40	3.2	4	3	4	0	3	0	1	2	0	0	0	2	0	5	3	3	0	0

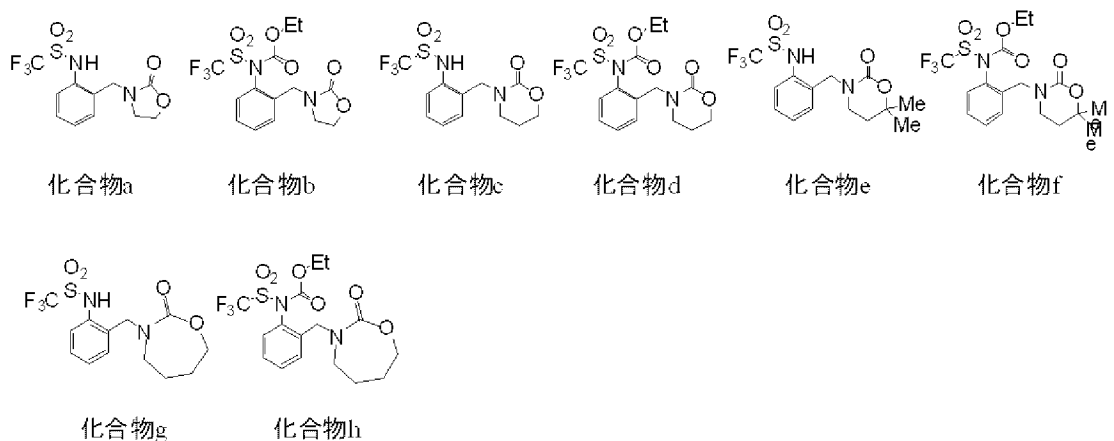
[0315] [表10]

〔第 2 9 表の続き〕

VI-1	6.3	5	5	5	0	5	5	5	4	0	1	0	4	4	5	4	4	3	3
VI-2	6.3	5	4	5	0	5	2	4	3	0	0	0	3	3	4	3	3	0	1
VI-3	6.3	4	1	1	0	3	0	3	2	0	0	0	1	1	0	0	0	0	0
VI-4	6.3	1	0	0	0	0	0	3	2	0	0	0	0	1	0	0	0	0	0
VI-5	6.3	4	0	0	0	0	0	3	0	0	0	0	3	4	3	0	0	0	0
VI-6	6.3	5	5	5	0	5	2	5	4	3	4	2	4	5	5	4	4	4	4
VI-7	7.1	5	5	5	2	5	4	5	3	4	3	3	4	4	5	5	5	4	4
VII-1	6.3	5	4	5	0	5	4	5	4	0	3	0	3	4	5	3	3	0	3
VII-2	6.3	5	5	4	0	5	4	5	5	3	3	0	4	5	4	3	3	0	2
VII-3	6.3	5	4	4	0	5	3	5	4	3	4	2	4	5	3	3	3	0	3
VII-4	6.3	5	3	4	0	5	4	5	3	3	3	3	4	4	5	3	5	0	3
VII-5	6.3	5	5	4	0	5	3	5	4		4	1	4	4	2	3	3	0	3
VII-6	6.3	5	5	5	5	5	5	5	4	1	4	3	4	4	5	5	4	4	4
VII-7	2.5	5	5	5	2	5	4	4	3	0	4	0	4	4	5	4	4	4	4
VII-8	6.3	5	5	5	1	5	5	5	3	3	4	2	3	4	5	5	5	1	4
VIII-2	6.3	5	5	5	0	5	5	5	4	0	5	2	4	4	5	5	4	0	5
VIII-3	6.3	5	5	5	1	5	3	5	3	3	4	3	4	5	5	4	5	0	4
IX-1	6.3	5	5	4	4	5	5	5	4	4	4	3	4	4	5	4	5	4	1
X-1	6.3	5	5	4	0	5	5	4	3	0	3	0	3	3	2	3	5	4	0
X-2	6.3	5	5	5	4	5	5	4	4	4	5	5	4	4	5	5	5	4	4
X-3	6.3	5	5	5	5	5	5	5	4	3	5	2	3	3	5	4	5	5	3
X-4	6.3	5	5	4	0	5	0	1	2	0	3	0	1	1	4	4	3	0	0
X-5	6.3	4	4	3	0	4	1	2	0	0	0	0	0	0	5	3	4	0	3
X-6	6.3	5	5	5	5	5	5	3	2	2	4	2	4	4	5	4	3	5	3
X-7	6.3	5	5	5	3	5	4	4	2	2	4	1	3	4	5	4	5	4	1

[0316] 本発明化合物は新規化合物であるが、構造上類似の化合物として以下の対照化合物 a 乃至対照化合物 h が知られている。

[0317] [化38]



[0318] 対照化合物 a 及び対照化合物 b は前記の特許文献 2 に、対照化合物 c 乃至

対照化合物 h は前記の特許文献 3 に記載されているが、本発明者らは、除草効果において本発明化合物が対照化合物よりも明らかに優れていることを見出した。その一例として、水田の重要雑草であるノビエに対する除草効果の比較を、以下に比較例として具体的に示す。

[0319] 〔比較例〕湛水条件におけるノビエ生育期処理による除草効果試験

1 / 3 0 0 0 0 アールのスチロールカップに沖積土壌を入れた後、水を入れて混和し、水深 4 cm の湛水条件とした。ノビエを上記カップに播種し、25 乃至 30 °C の温室内に置いて植物を育成した。ノビエが 2 乃至 2.5 葉期に達したとき、配合例 2 に準じて調製した本発明化合物及び対照化合物の乳剤を、所定の薬量になるように水で希釈し、水面に処理した。薬剤処理 3 週間後に、除草効果を試験例 1 の判定基準に従って調査した。結果を第 30 表に示す。

[0320] 表中の記号 A はノビエを表す。

[0321] 〔第 30 表〕

化合物 No.	処理薬量 (g / a)	A
a	0.16	0
a	0.64	0
a	2.52	4
II-1	0.16	2
II-1	0.64	5
II-1	2.52	5
b	0.16	0
b	0.64	0

b	2.52	3
11-2	0.16	0
11-2	0.64	5
11-2	2.52	5
c	0.16	0
c	0.64	2
c	2.52	5
111-1	0.16	3
111-1	0.64	5
111-1	2.52	5
d	0.16	0
d	0.64	2
d	2.52	5
111-9	0.16	4
111-9	0.64	5
111-9	2.52	5
e	0.16	0
e	0.64	3
e	2.52	5
111-46	0.16	0
111-46	0.64	4

III-46	2.52	5
f	0.16	0
f	0.64	0
f	2.52	5
III-58	0.16	0
III-58	0.64	5
III-58	2.52	5
g	0.16	0
g	0.64	0
g	2.52	5
V-1	0.16	0
V-1	0.64	5
V-1	2.52	5
h	0.16	0
h	0.64	1
h	2.52	5
V-10	0.16	0
V-10	0.64	5
V-10	2.52	5

産業上の利用可能性

[0322] 本発明のハロアルキルスルホンアニリド誘導体又は農薬として許容される

その塩類は、イネ用、トウモロコシ用、ムギ用、ビート用及びダイズ用選択性除草剤として有用である。

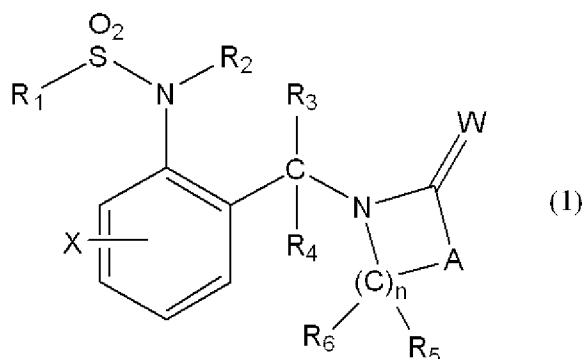
なお、２００８年９月２日に出願された日本特許出願２００８－２２５１３７号、２００８年１０月７日に出願された日本特許出願２００８－２６０６５２号、２００９年２月１３日に出願された日本特許出願２００９－０３１８１８号、２００９年３月１８日に出願された日本特許出願２００９－０６６１６１号、２００９年３月１８日に出願された日本特許出願２００９－０６６１６３号、及び２００９年６月２４日に出願された日本特許出願２００９－１４９４０３号の明細書、特許請求の範囲、及び要約書の全内容をここに引用し、本発明の明細書の開示として、取り入れるものである。

請求の範囲

[請求項1] 一般式（１）で表されるハロアルキルスルホンアニリド誘導体又は農薬として許容されるその塩類。

一般式（１）：

[化1]



〔式中、Aは－C（R₇）（R₈）－又は－N（R₉）－を表し、

Wは酸素原子又は硫黄原子を表し、

nは1乃至4の整数を表し、

R₁はハロC₁－C₆アルキルを表し、

R₂は水素原子、C₁－C₆アルキル、ハロC₁－C₆アルキル、C₂－C₆アルケニル、ハロC₂－C₆アルケニル、C₂－C₆アルキニル、ハロC₂－C₆アルキニル、C₁－C₆アルコキシC₁－C₆アルキル、ハロC₁－C₆アルコキシC₁－C₆アルキル、C₁－C₆アルコキシC₁－C₆アルコキシC₁－C₆アルキル、トリC₁－C₆アルキルシリルC₁－C₆アルコキシC₁－C₆アルキル、フェニルC₁－C₆アルキル、Yから選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニルC₁－C₆アルキル、C₁－C₁₂アルキルカルボニル、ハロC₁－C₁₂アルキルカルボニル、シクロC₃－C₆アルキルカルボニル、シクロC₃－C₆アルキルC₁－C₆アルキルカルボニル、C₂－C₆アルケニルカルボニル、フェニルカルボニル、Yから選択される1以上の置換基を有する置換フェニルカルボニル、複素環カルボニル、Yから選択される1以上の置換基を有

する置換複素環カルボニル、 C_1-C_{12} アルコキシカルボニル、ハロ
 C_1-C_{12} アルコキシカルボニル、 C_1-C_6 アルコキシ C_1-C_6 アルコ
キシカルボニル、 C_1-C_6 アルキルチオ C_1-C_6 アルコキシカルボニ
ル、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル C_1-C_6 アルコキシカルボニル、
 C_1-C_6 アルキルスルホニル C_1-C_6 アルコキシカルボニル、 C_2-C
 $_6$ アルケニルオキシカルボニル、ハロ C_2-C_6 アルケニルオキシカル
ボニル、 C_2-C_6 アルキニルオキシカルボニル、フェノキシカルボニ
ル、 Y から選択される1以上の置換基を有する置換フェノキシカルボ
ニル、フェニル C_1-C_6 アルコキシカルボニル、 Y から選択される1
以上の置換基を有する置換フェニル C_1-C_6 アルコキシカルボニル、
フェノキシ C_1-C_6 アルキルカルボニル、 Y から選択される1以上の
置換基を有する置換フェノキシ C_1-C_6 アルキルカルボニル、モノ（
 C_1-C_6 アルキル）アミノカルボニル、モノ（ハロ C_1-C_6 アルキル
）アミノカルボニル、同一又は異なっても良いジ（ C_1-C_6 アル
キル）アミノカルボニル、同一又は異なっても良いハロジ（ C_1
 $-C_6$ アルキル）アミノカルボニル、 C_1-C_6 アルキルチオカルボニル
、ハロ C_1-C_6 アルキルチオカルボニル、 C_1-C_6 アルキルスルホニ
ル、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル、フェニルスルホニル、 Y から
選択される1以上の置換基を有する置換フェニルスルホニル、 C_1-
 C_6 アルキルチオ C_1-C_6 アルキル、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ C_1-
 C_6 アルキル、フェニル C_1-C_6 アルコキシ C_1-C_6 アルキル、 Y から
選択される1以上の置換基を有する置換フェニル C_1-C_6 アルコキシ
 C_1-C_6 アルキル、フェニルチオ C_1-C_6 アルキル、 Y から選択され
る1以上の置換基を有する置換フェニルチオ C_1-C_6 アルキル、フェ
ニル C_1-C_6 アルキルチオ C_1-C_6 アルキル、 Y から選択される1以
上の置換基を有する置換フェニル C_1-C_6 アルキルチオ C_1-C_6 アル
キル、フェニルスルホニル C_1-C_6 アルキル、 Y から選択される1以
上の置換基を有する置換フェニルスルホニル C_1-C_6 アルキル、フェ

ニル C_1-C_6 アルキルスルホニル C_1-C_6 アルキル、 Y から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニル C_1-C_6 アルキルスルホニル C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルキルカルボニルオキシ C_1-C_6 アルキル、フェニルカルボニルオキシ C_1-C_6 アルキル、 Y から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニルカルボニルオキシ C_1-C_6 アルキル、フェニルカルボニル C_1-C_6 アルキル、 Y から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニルカルボニル C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルコキシカルボニルオキシ C_1-C_6 アルキル、フェニルカルボニルオキシ C_1-C_6 アルコキシ C_1-C_6 アルキル、 Y から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニルカルボニルオキシ C_1-C_6 アルコキシ C_1-C_6 アルキル、モノ C_1-C_6 アルキルアミノカルボニルオキシ C_1-C_6 アルキル、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6 アルキル) アミノカルボニルオキシ C_1-C_6 アルキル、フェニルアミノカルボニルオキシ C_1-C_6 アルキル、 Y から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニルアミノカルボニルオキシ C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルキル (フェニル) アミノカルボニルオキシ C_1-C_6 アルキル、 Y から選択される 1 以上の置換基を有する置換 C_1-C_6 アルキル (フェニル) アミノカルボニルオキシ C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルキルカルボニル C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルコキシカルボニル C_1-C_6 アルキル、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6 アルキル) アミノチオ又はシアノを表し、

R_3 及び R_4 はそれぞれ独立に、水素原子、 C_1-C_6 アルキル、ハロ C_1-C_6 アルキル、シクロ C_3-C_6 アルキル、ハロシクロ C_3-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルコキシ、ハロ C_1-C_6 アルコキシ、ハロゲン又はシアノを表し、又、 R_3 と R_4 はお互い結合して 3~7 員環を形成することができる、

R_5 、 R_6 、 R_7 及び R_8 はそれぞれ独立に、水素原子、ハロゲン、 C_1-C_6 アルキル、ハロ C_1-C_6 アルキル、 C_2-C_6 アルケニル、 C_2

-C₆アルキニル、シクロC₃-C₆アルキル、ハロシクロC₃-C₆アルキル、C₁-C₆アルコキシC₁-C₆アルキル、ハロC₁-C₆アルコキシC₁-C₆アルキル、ヒドロキシC₁-C₆アルキル、C₁-C₆アルキルチオC₁-C₆アルキル、ハロC₁-C₆アルキルチオC₁-C₆アルキル、モノ(C₁-C₆アルキル)アミノC₁-C₆アルキル、同一又は異なっても良いジ(C₁-C₆アルキル)アミノC₁-C₆アルキル、フェニル、Yから選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニル、複素環、Yから選択される1以上の置換基を環上に有する置換複素環、フェニルC₁-C₆アルキル、Yから選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニルC₁-C₆アルキル、フェノキシC₁-C₆アルキル、Yから選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェノキシC₁-C₆アルキル、C₁-C₆アルキルカルボニル、ハロC₁-C₆アルキルカルボニル、フェニルカルボニル、Yから選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニルカルボニル、C₁-C₆アルコキシカルボニル、ハロC₁-C₆アルコキシカルボニル、カルボキシル、モノ(C₁-C₆アルキル)アミノカルボニル、同一又は異なっても良いジ(C₁-C₆アルキル)アミノカルボニル、フェニルアミノカルボニル、Yから選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニルアミノカルボニル、フェニルC₁-C₆アルキルアミノカルボニル、Yから選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニルC₁-C₆アルキルアミノカルボニル、C₁-C₆アルコキシ、ハロC₁-C₆アルコキシ、フェノキシ、Yから選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェノキシ、C₁-C₆アルキルチオ、ハロC₁-C₆アルキルチオ、フェニルチオ、Yから選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニルチオ、C₁-C₆アルキルスルホニル、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル、モノ(C₁-C₆アルキル)アミノ、ジ(C₁-C₆アルキル)アミノ、C₁-C₆アルキルカルボニルオキシ、水酸基、アミノ、シアノ又はニトロを表し、

R_9 は水素原子、 C_1-C_6 アルキル、ハロ C_1-C_6 アルキル、シクロ C_3-C_6 アルキル、ハロシクロ C_3-C_6 アルキル、 C_2-C_6 アルケニル、ハロ C_2-C_6 アルケニル、 C_2-C_6 アルキニル、 C_1-C_6 アルコキシ C_1-C_6 アルキル、ハロ C_1-C_6 アルコキシ C_1-C_6 アルキル、ヒドロキシ C_1-C_6 アルキル、シクロ C_3-C_6 アルキル C_1-C_6 アルキル、フェニル C_1-C_6 アルキル、 Y から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニル C_1-C_6 アルキル、フェニル、 Y から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニル、フェノキシ C_1-C_6 アルキル、 Y から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェノキシ C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルキルカルボニル C_1-C_6 アルキル、ハロ C_1-C_6 アルキルカルボニル C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルコキシカルボニル C_1-C_6 アルキル、ハロ C_1-C_6 アルコキシカルボニル C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルキルカルボニル、ハロ C_1-C_6 アルキルカルボニル、シクロ C_3-C_6 アルキルカルボニル、シクロ C_3-C_6 アルキル C_1-C_6 アルキルカルボニル、 C_2-C_6 アルケニルカルボニル、フェニルカルボニル、 Y から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルカルボニル、複素環カルボニル、 Y から選択される1以上の置換基を有する置換複素環カルボニル、 C_1-C_6 アルコキシカルボニル、ハロ C_1-C_6 アルコキシカルボニル、フェノキシカルボニル、 Y から選択される1以上の置換基を有する置換フェノキシカルボニル、アミノカルボニル、モノ(C_1-C_6 アルキル)アミノカルボニル、モノハロ(C_1-C_6 アルキル)アミノカルボニル、同一又は異なっても良いジ(C_1-C_6 アルキル)アミノカルボニル、同一又は異なっても良いハロジ(C_1-C_6 アルキル)アミノカルボニル、 C_1-C_6 アルキルチオカルボニル、ハロ C_1-C_6 アルキルチオカルボニル、 C_1-C_6 アルキルスルホニル、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル、フェニルスルホニル、 Y から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルスルホニル、 C_1-C_6 アルキルチオ C_1-C

C_6 アルキル、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ C_1-C_6 アルキル、フェニルチオ C_1-C_6 アルキル、Yから選択される1以上の置換基を有する置換フェニルチオ C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル C_1-C_6 アルキル、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル C_1-C_6 アルキル、フェニルスルフィニル C_1-C_6 アルキル、Yから選択される1以上の置換基を有する置換フェニルスルフィニル C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルキルスルホニル C_1-C_6 アルキル、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル C_1-C_6 アルキル、フェニルスルホニル C_1-C_6 アルキル、Yから選択される1以上の置換基を有する置換フェニルスルホニル C_1-C_6 アルキル、シアノ、アミノ又は水酸基を表し、
 又、同一炭素上の R_5 、 R_6 、 R_7 及び R_8 はお互い結合して、酸素原子、硫黄原子又は窒素原子（該窒素原子は C_1-C_6 アルキル、 C_2-C_6 アルケニル、 C_2-C_6 アルキニル又はシクロ C_3-C_6 アルキルによって置換されていても良い。）から選択される1又は2のヘテロ原子により中断されていても良く、任意に置換されていても良い3～7員環を形成すること、及びオレフィン又はカルボニルを形成することができ、

さらに R_5 、 R_6 、 R_7 、 R_8 及び R_9 は異なった炭素上の R_5 、 R_6 、 R_7 又は R_8 と結合して、酸素原子、硫黄原子又は窒素原子（該窒素原子は C_1-C_6 アルキル、 C_2-C_6 アルケニル、 C_2-C_6 アルキニル又はシクロ C_3-C_6 アルキルによって置換されていても良い。）から選択される1又は2のヘテロ原子により中断されていても良く、任意に置換されていても良い3～8員環を形成することができ、

また R_5 及び R_6 は隣り合った炭素上の R_5 又は R_6 と一緒にって結合を表すことができ、

$n = 2$ 乃至4の場合、 R_5 及び R_6 は隣り合った R_5 又は R_6 と同一でも異なっても良く、

X は、ハロゲン、 C_1-C_6 アルキル、 C_2-C_6 アルケニル、 C_2-C

C_6 アルキニル、シクロ C_3-C_6 アルキル、ハロ C_1-C_6 アルキル、ハロシクロ C_3-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルコキシ、ハロ C_1-C_6 アルコキシ、 C_1-C_6 アルキルチオ、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル、 C_1-C_6 アルキルスルホニル、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル、フェニル、 Y から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニル、複素環、 Y から選択される1以上の置換基を環上に有する置換複素環、フェノキシ、 Y から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェノキシ、フェニルチオ、 Y から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニルチオ、フェニルスルフィニル、 Y から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニルスルフィニル、フェニルスルホニル、 Y から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニルスルホニル、 C_1-C_6 アルキルカルボニル、ハロ C_1-C_6 アルキルカルボニル、フェニルカルボニル、 Y から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニルカルボニル、 C_1-C_6 アルコキシカルボニル、ハロ C_1-C_6 アルコキシカルボニル、カルボキシル、モノ(C_1-C_6 アルキル)アミノカルボニル、モノハロ(C_1-C_6 アルキル)アミノカルボニル、同一又は異なっても良いジ(C_1-C_6 アルキル)アミノカルボニル、同一又は異なっても良いハロジ(C_1-C_6 アルキル)アミノカルボニル、フェニルアミノカルボニル、 Y から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニルアミノカルボニル、フェニル C_1-C_6 アルキルアミノカルボニル、 Y から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニル C_1-C_6 アルキルアミノカルボニル、水酸基、アミノ、シアノ又はニトロを表し、

前記 Y はハロゲン、 C_1-C_6 アルキル、 C_2-C_6 アルケニル、 C_2-C_6 アルキニル、シクロ C_3-C_6 アルキル、ハロ C_1-C_6 アルキル、ハロシクロ C_3-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルコキシ、ハロ C_1-C_6 アルコキシ、 C_1-C_6 アルキルチオ、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ、 C_1-C_6

C_6 アルキルスルフィニル、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル、 C_1-C_6 アルキルスルホニル、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル、フェニル、（ハロゲン、 C_1-C_6 アルキル、 C_2-C_6 アルケニル、 C_2-C_6 アルキニル、シクロ C_3-C_6 アルキル、ハロ C_1-C_6 アルキル、ハロシクロ C_3-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルコキシ、ハロ C_1-C_6 アルコキシ、 C_1-C_6 アルキルチオ、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル、 C_1-C_6 アルキルスルホニル、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル、 C_1-C_6 アルキルカルボニル、ハロ C_1-C_6 アルキルカルボニル、 C_1-C_6 アルコキシカルボニル、カルボキシル、モノ（ C_1-C_6 アルキル）アミノカルボニル、同一又は異なっても良いジ（ C_1-C_6 アルキル）アミノカルボニル、水酸基、アミノ、シアノ及びニトロ）からなる群から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル、複素環、（ハロゲン、 C_1-C_6 アルキル、 C_2-C_6 アルケニル、 C_2-C_6 アルキニル、シクロ C_3-C_6 アルキル、ハロ C_1-C_6 アルキル、ハロシクロ C_3-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルコキシ、ハロ C_1-C_6 アルコキシ、 C_1-C_6 アルキルチオ、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル、 C_1-C_6 アルキルスルホニル、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル、 C_1-C_6 アルキルカルボニル、ハロ C_1-C_6 アルキルカルボニル、 C_1-C_6 アルコキシカルボニル、カルボキシル、モノ（ C_1-C_6 アルキル）アミノカルボニル、同一又は異なっても良いジ（ C_1-C_6 アルキル）アミノカルボニル、水酸基、アミノ、シアノ及びニトロ）からなる群から選択される1以上の置換基を有する置換複素環、フェノキシ、（ハロゲン、 C_1-C_6 アルキル、 C_2-C_6 アルケニル、 C_2-C_6 アルキニル、シクロ C_3-C_6 アルキル、ハロ C_1-C_6 アルキル、ハロシクロ C_3-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルコキシ、ハロ C_1-C_6 アルコキシ、 C_1-C_6 アルキルチオ、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ、 C_1-C_6 アルキルスルフィニ

ル、ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル、C₁-C₆アルキルスルホニル、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル、C₁-C₆アルキルカルボニル、ハロC₁-C₆アルキルカルボニル、C₁-C₆アルコキシカルボニル、カルボキシル、モノ(C₁-C₆アルキル)アミノカルボニル、同一又は異なっているいても良いジ(C₁-C₆アルキル)アミノカルボニル、水酸基、アミノ、シアノ及びニトロ)からなる群から選択される1以上の置換基を有する置換フェノキシ、フェニルチオ、(ハロゲン、C₁-C₆アルキル、C₂-C₆アルケニル、C₂-C₆アルキニル、シクロC₃-C₆アルキル、ハロC₁-C₆アルキル、ハロシクロC₃-C₆アルキル、C₁-C₆アルコキシ、ハロC₁-C₆アルコキシ、C₁-C₆アルキルチオ、ハロC₁-C₆アルキルチオ、C₁-C₆アルキルスルフィニル、ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル、C₁-C₆アルキルスルホニル、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル、C₁-C₆アルキルカルボニル、ハロC₁-C₆アルキルカルボニル、C₁-C₆アルコキシカルボニル、カルボキシル、モノ(C₁-C₆アルキル)アミノカルボニル、同一又は異なっているいても良いジ(C₁-C₆アルキル)アミノカルボニル、水酸基、アミノ、シアノ及びニトロ)からなる群から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルチオ、フェニルスルフィニル、(ハロゲン、C₁-C₆アルキル、C₂-C₆アルケニル、C₂-C₆アルキニル、シクロC₃-C₆アルキル、ハロC₁-C₆アルキル、ハロシクロC₃-C₆アルキル、C₁-C₆アルコキシ、ハロC₁-C₆アルコキシ、C₁-C₆アルキルチオ、ハロC₁-C₆アルキルチオ、C₁-C₆アルキルスルフィニル、ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル、C₁-C₆アルキルスルホニル、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル、C₁-C₆アルキルカルボニル、ハロC₁-C₆アルキルカルボニル、C₁-C₆アルコキシカルボニル、カルボキシル、モノ(C₁-C₆アルキル)アミノカルボニル、同一又は異なっているいても良いジ(C₁-C₆アルキル)アミノカルボニル、水酸基、アミノ、シアノ及びニトロ)からなる群から選択され

る 1 以上の置換基を有する置換フェニルスルフィニル、フェニルスルホニル、（ハロゲン、 C_1-C_6 アルキル、 C_2-C_6 アルケニル、 C_2-C_6 アルキニル、シクロ C_3-C_6 アルキル、ハロ C_1-C_6 アルキル、ハロシクロ C_3-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルコキシ、ハロ C_1-C_6 アルコキシ、 C_1-C_6 アルキルチオ、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル、 C_1-C_6 アルキルスルホニル、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル、 C_1-C_6 アルキルカルボニル、ハロ C_1-C_6 アルキルカルボニル、 C_1-C_6 アルコキシカルボニル、カルボキシル、モノ（ C_1-C_6 アルキル）アミノカルボニル、同一又は異なっても良いジ（ C_1-C_6 アルキル）アミノカルボニル、水酸基、アミノ、シアノ及びニトロ）からなる群から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニルスルホニル、 C_1-C_6 アルキルカルボニル、ハロ C_1-C_6 アルキルカルボニル、フェニルカルボニル、（ハロゲン、 C_1-C_6 アルキル、 C_2-C_6 アルケニル、 C_2-C_6 アルキニル、シクロ C_3-C_6 アルキル、ハロ C_1-C_6 アルキル、ハロシクロ C_3-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルコキシ、ハロ C_1-C_6 アルコキシ、 C_1-C_6 アルキルチオ、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル、 C_1-C_6 アルキルスルホニル、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル、 C_1-C_6 アルキルカルボニル、ハロ C_1-C_6 アルキルカルボニル、 C_1-C_6 アルコキシカルボニル、カルボキシル、モノ（ C_1-C_6 アルキル）アミノカルボニル、同一又は異なっても良いジ（ C_1-C_6 アルキル）アミノカルボニル、水酸基、アミノ、シアノ及びニトロ）からなる群から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニルカルボニル、 C_1-C_6 アルコキシカルボニル、カルボキシル、モノ（ C_1-C_6 アルキル）アミノカルボニル、同一又は異なっても良いジ（ C_1-C_6 アルキル）アミノカルボニル、フェニルアミノカルボニル、（ハロゲン、 C_1-C_6 アルキル、 C_2-C_6 アルケニル、 C_2-C

C_6 アルキニル、シクロ C_3-C_6 アルキル、ハロ C_1-C_6 アルキル、ハロシクロ C_3-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルコキシ、ハロ C_1-C_6 アルコキシ、 C_1-C_6 アルキルチオ、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル、 C_1-C_6 アルキルスルホニル、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル、 C_1-C_6 アルキルカルボニル、ハロ C_1-C_6 アルキルカルボニル、 C_1-C_6 アルコキシカルボニル、カルボキシル、モノ(C_1-C_6 アルキル)アミノカルボニル、同一又は異なっても良いジ(C_1-C_6 アルキル)アミノカルボニル、水酸基、アミノ、シアノ及びニトロ)からなる群から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルアミノカルボニル、フェニル C_1-C_6 アルキルアミノカルボニル、(ハロゲン、 C_1-C_6 アルキル、 C_2-C_6 アルケニル、 C_2-C_6 アルキニル、シクロ C_3-C_6 アルキル、ハロ C_1-C_6 アルキル、ハロシクロ C_3-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルコキシ、ハロ C_1-C_6 アルコキシ、 C_1-C_6 アルキルチオ、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル、 C_1-C_6 アルキルスルホニル、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル、 C_1-C_6 アルキルカルボニル、ハロ C_1-C_6 アルキルカルボニル、 C_1-C_6 アルコキシカルボニル、カルボキシル、モノ(C_1-C_6 アルキル)アミノカルボニル、同一又は異なっても良いジ(C_1-C_6 アルキル)アミノカルボニル、水酸基、アミノ、シアノ及びニトロ)からなる群から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル C_1-C_6 アルキルアミノカルボニル、水酸基、アミノ、シアノ又はニトロを表すか、又は、

Yは、ベンゼン環又は複素環上の隣接する炭素原子若しくは窒素原子と一緒に、酸素原子、硫黄原子及び窒素原子(該窒素原子は C_1-C_6 アルキル、 C_2-C_6 アルケニル、 C_2-C_6 アルキニル又はシクロ C_3-C_6 アルキルによって置換されていても良い。)から選択される1又は2のヘテロ原子により中断されていても良い C_1-C_4 アル

キレン、ハロ C_1-C_4 アルキレン、 C_2-C_4 アルケニレン又はハロ C_2-C_4 アルケニレンにより 5 又は 6 員環を形成していても良く、

前記複素環はチエニル、フリル、ピロリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、イソオキサゾリニル、チアゾリル、イソチアゾリル、ピラゾリル、イミダゾリル、1, 3, 4-オキサジアゾリル、1, 2, 4-オキサジアゾリル、1, 3, 4-チアジアゾリル、1, 2, 4-チアジアゾリル、1, 2, 4-トリアゾリル、1, 2, 3-チアジアゾリル、1, 2, 3-トリアゾリル、1, 2, 3, 4-テトラゾリル、ピリジル、ピリミジニル、ピラジニル、ピリダジニル、1, 3, 5-トリアジニル、1, 2, 4-トリアジニル、ベンゾチエニル、ベンゾフリル、インドリル、ベンゾチアゾリル、ベンゾイミダゾリル、ベンゾイソオキサゾリル、ベンゾイソチアゾリル、インダゾリル、ベンゾオキサゾリル、キノリル、イソキノリル、キノキサリニル、フタラジニル、シンノリニル又はキナゾリニルであり、

尚、上記のいずれかの基が 2 以上の置換基を有する場合には、これらの置換基は、同一でも又は異なっても良い。]

- [請求項2] n が 3 又は 4 である請求項 1 に記載のハロアルキルスルホンアニリド誘導体又は農薬として許容されるその塩類。
- [請求項3] A が $-C(R_7)(R_8)-$ である請求項 1 に記載のハロアルキルスルホンアニリド誘導体又は農薬として許容されるその塩類。
- [請求項4] n が 1 である請求項 3 に記載のハロアルキルスルホンアニリド誘導体又は農薬として許容されるその塩類。
- [請求項5] n が 2 である請求項 3 に記載のハロアルキルスルホンアニリド誘導体又は農薬として許容されるその塩類。
- [請求項6] n が 3 である請求項 3 に記載のハロアルキルスルホンアニリド誘導体又は農薬として許容されるその塩類。
- [請求項7] n が 4 である請求項 3 に記載のハロアルキルスルホンアニリド誘導体又は農薬として許容されるその塩類。

[請求項8] R_3 及び R_4 が水素原子である請求項 1～7 のいずれかに記載のハロアルキルスルホンアニリド誘導体又は農薬として許容されるその塩類。

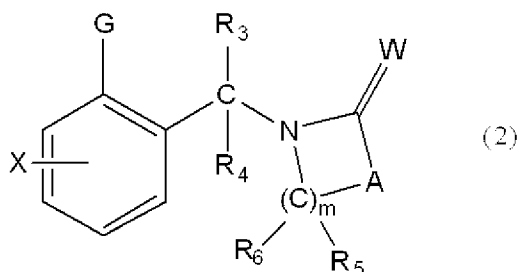
[請求項9] 請求項 1～8 のいずれかに記載のハロアルキルスルホンアニリド誘導体又は農薬として許容されるその塩を有効成分として含有する農薬。

[請求項10] 請求項 1～8 のいずれかに記載のハロアルキルスルホンアニリド誘導体又は農薬として許容されるその塩を有効成分として含有する除草剤。

[請求項11] 一般式 (2) で表される製造中間体

一般式 (2) :

[化2]



〔式中、A、W、 R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 及び X は上記と同じ意味を表し、

m は 3 又は 4 の整数を表し、

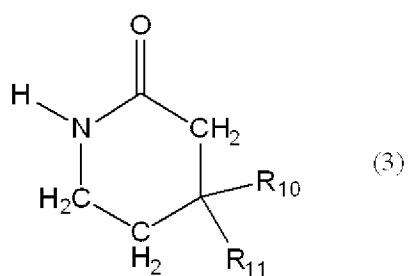
G はアミノ又はニトロを表し、

尚、A が $-C(R_7)(R_8)-$ の場合、 R_5 、 R_6 、 R_7 及び R_8 の中の少なくとも 1 つは水素原子ではない。〕

[請求項12] 一般式 (3) で表される製造中間体

一般式 (3) :

[化3]



〔式中、R₁₀及びR₁₁はお互い結合して、酸素原子、硫黄原子又は窒素原子（該窒素原子はC₁-C₆アルキル、C₂-C₆アルケニル、C₂-C₆アルキニル又はシクロC₃-C₆アルキルによって置換されていても良い。）から選択される1又は2のヘテロ原子により中断されていても良く、任意に置換されていても良い3～7員環を形成するC₁-C₆アルキレン。〕

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2009/065343

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

See extra sheet.

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

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

C07D205/08, A01N43/36, A01N43/40, A01N43/44, A01P13/02, C07D207/27, C07D211/72, C07D211/76, C07D213/64, C07D221/20, C07D223/10, C07D239/06, C07D239/10, C07D243/04, C07D491/044

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

Jitsuyo Shinan Koho 1922-1996 Jitsuyo Shinan Toroku Koho 1996-2009
Kokai Jitsuyo Shinan Koho 1971-2009 Toroku Jitsuyo Shinan Koho 1994-2009

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

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X Y	WO 2004/011429 A1 (Nihon Nohyaku Co., Ltd.), 05 February, 2004 (05.02.04), Page 2, line 29 to page 15, line 18; page 16; table 6, No.6-339 & JP 2004-107323 A & AU 2003252259 A1 & TW 200404764 A	1, 2, 5, 6, 8-11 3, 4, 7
Y	JP 53-130652 A (CIBA-Geigy AG.), 14 November, 1978 (14.11.78), Claim 1; examples 1 to 10; tables 2 to 6; page 34, upper left column, line 5 to lower right column, the last line & BE 865979 A & DE 2815820 A & NL 7803885 A & FR 2387219 A & BR 7802330 A & ZA 7802158 A & US 4208202 A & CH 629076 A	3, 4, 7



Further documents are listed in the continuation of Box C.



See patent family annex.

* Special categories of cited documents:

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

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

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

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

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

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

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

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

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search
30 September, 2009 (30.09.09)

Date of mailing of the international search report
13 October, 2009 (13.10.09)

Name and mailing address of the ISA/
Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2009/065343

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	JP 59-206351 A (Chevron Research Co.), 22 November, 1984 (22.11.84), Full text & DE 3415820 A & GB 2139223 A & US 4479900 A & FR 2545084 A & AU 8427268 A & CA 1204764 A	3, 4, 7
Y	JP 58-210062 A (Velsicol Chemical Corp.), 07 December, 1983 (07.12.83), Full text & US 4398938 A & BE 896780 A & DE 3317936 A & GB 2120658 A & FR 2527207 A & AU 8314822 A & BR 8302563 A & ZA 8302936 A & CA 1184909 A & CH 653672 A & RO 87141 A & KR 8601336 B	3, 4, 7
Y	JP 01-025764 A (Monsanto Co.), 27 January, 1989 (27.01.89), Examples 398, 487; pages 139, 152, 155, 183 186 & EP 295233 A & AU 8817450 A & BR 8802760 A & US 4855442 A & CN 1033457 A & DD 289461 A & KR 9007189 B	3, 4, 7
X	US 5683966 A (FMC CORP.), 04 November, 1997 (04.11.97), Column 1, line 50 to column 2, line 11 & WO 97/047607 A1 & AU 9715272 A	11
X	JP 2005-533067 A (F. Hoffmann-LA Roche AG.), 04 November, 2005 (04.11.05), Claim 1; example 58 & US 2004/014766 A1 & WO 2003/106459 A1 & AU 2003236702 A1 & EP 1515972 A1 & BR 200311760 A & KR 2005016548 A & MX 2004012057 A1 & CN 1659168 A & RU 2295525 C2	11
X	JP 2007-531787 A (Janssen Pharmaceutica N.V.), 08 November, 2007 (08.11.07), Examples A5, B8 & WO 2005/097795 A1 & EP 1735312 A1 & AU 2005231985 A1 & CN 1942471 A & US 2007/232636 A1	12
P, X	CN 101255160 A (SHANGHAI PHARMATECH CO., LTD.), 03 September, 2008 (03.09.08), Examples 3 to 5 (Family: none)	12

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2009/065343

Continuation of A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

(International Patent Classification (IPC))

C07D205/08(2006.01)i, A01N43/36(2006.01)i, A01N43/40(2006.01)i,
A01N43/44(2006.01)i, A01P13/02(2006.01)i, C07D207/27(2006.01)i,
C07D211/72(2006.01)i, C07D211/76(2006.01)i, C07D213/64(2006.01)i,
C07D221/20(2006.01)i, C07D223/10(2006.01)i, C07D239/06(2006.01)i,
C07D239/10(2006.01)i, C07D243/04(2006.01)i, C07D491/044(2006.01)i

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

A. 発明の属する分野の分類（国際特許分類（I P C）） Int.Cl. 特別ページ参照			
B. 調査を行った分野 調査を行った最小限資料（国際特許分類（I P C）） Int.Cl. C07D205/08, A01N43/36, A01N43/40, A01N43/44, A01P13/02, C07D207/27, C07D211/72, C07D211/76, C07D213/64, C07D221/20, C07D223/10, C07D239/06, C07D239/10, C07D243/04, C07D491/044			
最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの 日本国実用新案公報 1 9 2 2 - 1 9 9 6 年 日本国公開実用新案公報 1 9 7 1 - 2 0 0 9 年 日本国実用新案登録公報 1 9 9 6 - 2 0 0 9 年 日本国登録実用新案公報 1 9 9 4 - 2 0 0 9 年			
国際調査で使用した電子データベース（データベースの名称、調査に使用した用語） CA/REGISTRY (STN)			
C. 関連すると認められる文献			
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求項の番号	
X	WO 2004/011429 A1（日本農薬株式会社）2004. 02. 05, 第2頁第29行～第15頁第18行、第16頁、第6表のNo. 6-339	1, 2, 5, 6, 8-11	
Y	& JP 2004-107323 A & AU 2003252259 A1 & TW 200404764 A	3, 4, 7	
Y	JP 53-130652 A（チバ・ガイギー・アクチエンゲゼルシャフト） 1978. 11. 14, 請求項1、実施例1～10、表2～6、第34頁左上 欄第5行～右下欄最終行 & BE 865979 A & DE 2815820 A & NL 7803885 A & FR 2387219 A & BR 7802330 A & ZA 7802158 A & US 4208202 A & CH 629076 A	3, 4, 7	
☒ C欄の続きにも文献が列挙されている。 ☐ パテントファミリーに関する別紙を参照。			
* 引用文献のカテゴリー 「A」特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの 「E」国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの 「L」優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献（理由を付す） 「O」口頭による開示、使用、展示等に言及する文献 「P」国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願		の日の後に公表された文献 「T」国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの 「X」特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの 「Y」特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの 「&」同一パテントファミリー文献	
国際調査を完了した日 3 0 . 0 9 . 2 0 0 9		国際調査報告の発送日 1 3 . 1 0 . 2 0 0 9	
国際調査機関の名称及びあて先 日本国特許庁（I S A / J P） 郵便番号1 0 0 - 8 9 1 5 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号		特許庁審査官（権限のある職員） 鈴木 智雄 電話番号 0 3 - 3 5 8 1 - 1 1 0 1 内線 3 4 9 2	4 P 4 1 5 0

C (続き) . 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求項の番号
Y	JP 59-206351 A (シエプロン・リサーチ・コンパニー) 1984. 11. 22, 全文 & DE 3415820 A & GB 2139223 A & US 4479900 A & FR 2545084 A & AU 8427268 A & CA 1204764 A	3, 4, 7
Y	JP 58-210062 A (ベルジコル・ケミカル・コーポレーション) 1983. 12. 07, 全文 & US 4398938 A & BE 896780 A & DE 3317936 A & GB 2120658 A & FR 2527207 A & AU 8314822 A & BR 8302563 A & ZA 8302936 A & CA 1184909 A & CH 653672 A & RO 87141 A & KR 8601336 B	3, 4, 7
Y	JP 01-025764 A (モンサント カンパニー) 1989. 01. 27, 実施例 3 9 8、4 8 7、第 1 3 9、1 5 2、1 5 5、1 8 3、1 8 6 頁 & EP 295233 A & AU 8817450 A & BR 8802760 A & US 4855442 A & CN 1033457 A & DD 289461 A & KR 9007189 B	3, 4, 7
X	US 5683966 A (FMC CORP) 1997. 11. 04, 第 1 欄第 5 0 行～第 2 欄第 1 1 行 & WO 97/047607 A1 & AU 9715272 A	11
X	JP 2005-533067 A (エフ・ホフマン・ラ ロシュ アーゲー) 2005. 11. 04, 請求項 1、実施例 5 8 & US 2004/014766 A1 & WO 2003/106459 A1 & AU 2003236702 A1 & EP 1515972 A1 & BR 200311760 A & KR 2005016548 A & MX 2004012057 A1 & CN 1659168 A & RU 2295525 C2	11
X	JP 2007-531787 A (ジヤンセン・ファーマシユーチカ・ナームロー ゼ・フエンノートシヤツプ) 2007. 11. 08, 実施例 A 5、実施例 B 8 & WO 2005/097795 A1 & EP 1735312 A1 & AU 2005231985 A1 & CN 1942471 A & US 2007/232636 A1	12
P, X	CN 101255160 A (SHANGHAI PHARMATECH CO LTD) 2008. 09. 03, 実施例 3～5, (ファミリーなし)	12

発明の属する分野の分類

C07D205/08 (2006.01) i, A01N43/36 (2006.01) i, A01N43/40 (2006.01) i, A01N43/44 (2006.01) i,
A01P13/02 (2006.01) i, C07D207/27 (2006.01) i, C07D211/72 (2006.01) i,
C07D211/76 (2006.01) i, C07D213/64 (2006.01) i, C07D221/20 (2006.01) i,
C07D223/10 (2006.01) i, C07D239/06 (2006.01) i, C07D239/10 (2006.01) i,
C07D243/04 (2006.01) i, C07D491/044 (2006.01) i