

(19) 日本国特許庁 (JP)

(12) 公表特許公報 (A)

(11) 特許出願公表番号

特表2012-504576

(P2012-504576A)

(43) 公表日 平成24年2月23日 (2012. 2. 23)

|                                    |                      |             |
|------------------------------------|----------------------|-------------|
| (51) Int. Cl.                      | F I                  | テーマコード (参考) |
| <b>C O 7 D 241/18</b> (2006. 01)   | C O 7 D 241/18 C S P | 4 C O 6 3   |
| <b>C O 7 D 401/06</b> (2006. 01)   | C O 7 D 401/06       | 4 H O 1 1   |
| <b>C O 7 D 403/06</b> (2006. 01)   | C O 7 D 403/06       |             |
| <b>A O 1 P 13/00</b> (2006. 01)    | A O 1 P 13/00        |             |
| <b>A O 1 N 43/60</b> (2006. 01)    | A O 1 N 43/60        |             |
| 審査請求 未請求 予備審査請求 有 (全 147 頁) 最終頁に続く |                      |             |

(21) 出願番号 特願2011-529528 (P2011-529528)  
 (86) (22) 出願日 平成21年9月29日 (2009. 9. 29)  
 (85) 翻訳文提出日 平成23年5月26日 (2011. 5. 26)  
 (86) 国際出願番号 PCT/EP2009/062573  
 (87) 国際公開番号 W02010/037727  
 (87) 国際公開日 平成22年4月8日 (2010. 4. 8)  
 (31) 優先権主張番号 08165693.6  
 (32) 優先日 平成20年10月2日 (2008. 10. 2)  
 (33) 優先権主張国 欧州特許庁 (EP)

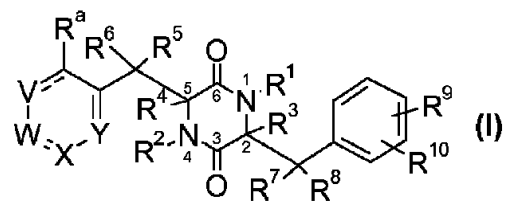
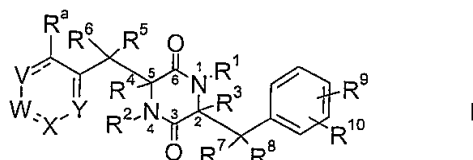
(71) 出願人 508020155  
 ビーエーエスエフ ソシエタス・ヨーロピア  
 BASF SE  
 ドイツ連邦共和国 ルートヴィヒスハーフェン (番地なし)  
 D-67056 Ludwigshafen, Germany  
 (74) 代理人 100091096  
 弁理士 平木 祐輔  
 (74) 代理人 100118773  
 弁理士 藤田 節  
 (74) 代理人 100122389  
 弁理士 新井 栄一

最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 除草活性を有するピペラジン化合物

(57) 【要約】

本発明は、式 I

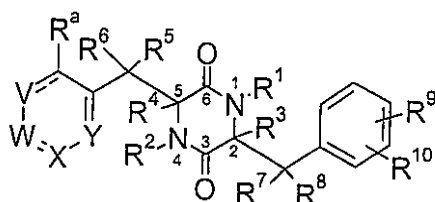


(式中、各可変部は、明細書に従って定義される)

で表されるピペラジン化合物、上記ピペラジン化合物の農業上好適な塩、式 I で表されるピペラジン化合物を製造するための方法及び中間体生成物、上記化合物を含む手段及び除草剤としてのすなわち雑草を駆除するためのその使用、ならびに望ましくない植物の成長を駆除するための方法であって、除草効果を得るために十分に多い量の少なくとも 1 種の式 I で表されるピペラジン化合物を、植物体、植物体の種子及び／又は植物体の生息地に効かせる、上記方法に関する。

【選択図】 なし

【化 1】



1

10

20

30

40

50

$C_6$ -アルキニル)-N-( $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ)アミノ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキルスルホニル、トリ- $C_1 \sim C_4$ -アルキルシリル、フェニル、フェノキシ、フェニルアミノ、又は、O、N及びSからなる群から選択される1、2、3又は4個のヘテロ原子を含有している5もしくは6員単環式又は9もしくは10員二環式ヘテロ環(ここで、各環式基は、置換されていないか、又は1、2、3又は4個の基 $R^{aa}$ によって置換されている)であり；

$R^{aa}$ は、ハロゲン、OH、CN、 $NO_2$ 、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_1 \sim C_4$ -ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ -ハロアルコキシ、 $S(O)_n R^y$ 、 $Z-C(=O)-R^{a1}$ 、 $Z-C(=S)-R^{a1}$ 、 $Z-C(=N-OR^A)-R^{a1}$ 、 $Z-C(=N(O)-R^A)-R^{a1}$ 、オキソ(=O)及びトリ- $C_1 \sim C_4$ -アルキルシリルであり；

$R^1$ は、OH、CN、 $C_5 \sim C_{12}$ -アルキル、 $C_5 \sim C_{12}$ -アルケニル、 $C_5 \sim C_{12}$ -アルキニル、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキル、 $C_5 \sim C_6$ -シクロアルケニル、 $CH_2CH=CHCH_3$ 、 $CH_2CH_2CH=CH_2$ 、 $CH_2C(CH_3)=CH_2$ 、 $CH_2CH=C(CH_3)_2$ 、 $CH_2C=CHCH_3$ 、 $CH_2CH_2C=CH$ 、 $NR^A R^B$ 、 $S(O)_n R^y$ 、 $S(O)_n NR^A R^B$ 、 $CO-C_1 \sim C_2$ -クロロアルキル、 $CONR^A R^B$ 、フェニル、又は、O、N及びSからなる群から選択される1、2、3又は4個のヘテロ原子を含有している5もしくは6員単環式又は9もしくは10員二環式飽和、部分不飽和又は芳香族ヘテロ環(ここで、各環式基は、 $Z^1$ を介して結合されていて、置換されていないか、又は1、2、3又は4個の基 $R^{aa}$ 、及び部分的又は完全に $R^{aa}$ で置換されている下記の基： $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_3 \sim C_4$ -アルケニル、 $C_3 \sim C_4$ -アルキニルによって置換されている)であって；

$Z^1$ は、カルボニル又は基Zであり；

ここで、各基 $R'$ 、 $R^a$ 及びそのサブ置換基において、その炭素鎖及び／又はその環式基は、1、2、3又は4個の置換基 $R^{aa}$ 及び／又は $R^{a1}$ を有してよく；

$R^2$ は、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_3 \sim C_4$ -アルケニル又は $C_3 \sim C_4$ -アルキニルであり；

$R^3$ は、OH、 $NH_2$ 、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ -アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ -アルキニル、 $C_1 \sim C_4$ -ヒドロキシアルキル、 $C_1 \sim C_4$ -シアノアルキル、 $C_1 \sim C_4$ -ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ- $C_1 \sim C_4$ -アルキル又は $C(=O)R^{11}$ であって；

$R^{11}$ は、水素、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_1 \sim C_4$ -ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ又は $C_1 \sim C_4$ -ハロアルコキシであり；

$R^4$ は、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル又は $C_1 \sim C_4$ -ハロアルキルであり、又は $R^4$ 及び $R^5$ は、一緒になって共有結合であり；

$R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^8$ は、互いに独立して、水素、ハロゲン、CN、 $NO_2$ 、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_1 \sim C_4$ -ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ -アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ -アルキニル、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ -ハロアルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキル又は $C_3 \sim C_6$ -シクロアルケニルであり；

$R^9$ 、 $R^{10}$ は、互いに独立して、水素、ハロゲン、OH、ハロアルキル、 $NR^A R^B$ 、 $NR^A C(O)R^{91}$ 、CN、 $NO_2$ 、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_1 \sim C_4$ -ハロアルキル、 $C_2 \sim C_4$ -アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ -アルキニル、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ -ハロアルコキシ、 $O-C(O)R^{91}$ 、フェノキシ又はベンジルオキシであり、ここで、各基 $R^9$ 及び $R^{10}$ において、その炭素鎖及び／又はその環式基は、1、2、3又は4個の置換基 $R^{aa}$ を有してよく；

$R^{91}$ は、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル又は $NR^A R^B$ であり；

V、W、X、Yは、互いに独立して、N又は $C-R^b$ であって、

$R^b$ は、互いに独立して、水素、CN、 $NO_2$ 、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_1 \sim C_4$ -ハロアルキル、 $C_2 \sim C_4$ -アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ -アルキニル、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ -ハロアルコキシ、ベンジル又は $S(O)_n R^y$ であり；

10

20

30

40

50

$R^a$  及び／又は  $R^b$  は、その隣接環炭素原子に結合されている基  $R^a$  又は  $R^b$  と一緒に、又はその隣接環窒素原子と一緒に、それら自体が、5 もしくは 6 員飽和又は部分もしくは完全不飽和環を形成していてもよく、この環は、炭素原子に加えて、O、N 及び S からなる群から選択される 1、2 又は 3 個のヘテロ原子を含有していてもよく、この環は、1～3 個の基  $R^a$  によって置換されていてよく、及び／又はさらなる飽和、不飽和又は芳香族炭素もしくはヘテロ環式環に縮合されていてよく；

【化 2】

## 二

10

は、二重結合であるか、又は  $R^a$  が、その V 位にある窒素原子と環を形成している場合は一重結合であり；

但し、V、W、X、Y の 1～3 個の基が N である場合は、 $R^1$  は、 $C_5 \sim C_6$  - アルキル、 $C_1 \sim C_4$  - ハロアルキル、 $CH_2CH=CHCH_3$ 、 $CH_2CH_2CH=CH_2$ 、 $CH_2C(CH_3)=CH_2$ 、 $CH_2C=CHCH_3$  又は  $CH_2CH_2C=CH$  ではない）で表されるピペラジン化合物又はその農業上好適な塩。

【請求項 2】

$R^a$  が、ハロゲン、CN、 $NO_2$ 、 $C_1 \sim C_4$  - アルキル、 $C_3 \sim C_6$  - シクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$  - ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$  - アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$  - ハロアルコキシ、 $O-Z-C_3 \sim C_6$  - シクロアルキル、 $S(O)_nR^y$ 、 $C_2 \sim C_6$  - アルケニル、 $C_3 \sim C_6$  - シクロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$  - アルケニルオキシ、 $C_2 \sim C_6$  - アルキニル、 $C_3 \sim C_6$  - アルキニルオキシ、 $C_3 \sim C_6$  - チオアルキニル、 $NR^A R^B$ 、トリ- $C_1 \sim C_4$  - アルキルシリル、 $Z-P(=O)(R^{a1})_2$ 、炭素又は窒素を介して結合されていて、O、N 及び S からなる群から選択される 1、2、3 又は 4 個のヘテロ原子を含有して、基  $R^a$  及び／又は  $R^{a1}$  によって部分的又は完全に置換されていてよい 3～7 員単環式又は 9 もしくは 10 員二環式飽和、不飽和又は芳香族ヘテロ環であり、 $R^A$ 、 $R^B$  が互いに独立して、水素、 $C_1 \sim C_6$  - アルキル、 $C_3 \sim C_6$  - アルケニル又は  $C_3 \sim C_6$  - アルキニルであって；

20

$R^A$ 、 $R^B$  は、それらが結合している窒素原子と一緒に、5 もしくは 6 員飽和又は部分もしくは完全不飽和環を形成していてもよく、この環は、炭素原子に加えて、O、N 及び S からなる群から選択される 1、2 又は 3 個のヘテロ原子を含有していてもよく、この環は、1～3 個の基  $R^a$  によって置換されていてよく；

30

$R^a$  が、ハロゲン、OH、CN、 $NO_2$ 、 $C_1 \sim C_4$  - アルキル、 $C_1 \sim C_4$  - ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$  - アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$  - ハロアルコキシ、 $S(O)_nR^y$ 、 $Z-C(=O)-R^{a1}$  又はトリ- $C_1 \sim C_4$  - アルキルシリルであり；

$R^b$  が、互いに独立して、水素、CN、 $NO_2$ 、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$  - アルキル、 $C_1 \sim C_4$  - ハロアルキル、 $C_2 \sim C_4$  - アルケニル、 $C_3 \sim C_6$  - アルキニル、 $C_1 \sim C_4$  - アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$  - ハロアルコキシ、ベンジル又は  $S(O)_nR^y$  であって；

$R^b$  は、その隣接炭素原子に結合されている基  $R^a$  又は  $R^b$  と一緒に、5 もしくは 6 員飽和又は部分もしくは完全不飽和環を形成していてもよく、この環は、炭素原子に加えて、O、N 及び S からなる群から選択される 1、2 又は 3 個のヘテロ原子を含有していてもよく、この環は、1～3 個の基  $R^a$  によって置換されていてよく；

40

【化 3】

## 二

が、二重結合である、

請求項 1 に記載の式 I で表される化合物。

【請求項 3】

$R^a$  が、ハロゲン、シアノ又はニトロである、請求項 1 又は 2 に記載の式 I で表される

50

化合物。

【請求項 4】

$R^a$  が、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ -ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ -ハロアルコキシ、 $S(O)_n R^y$ 、 $C_1 \sim C_4$ -ハロアルキルチオ、又は、窒素を介して結合されていて、O、N及びSからなる群から選択される1、2、3又は4個のヘテロ原子を含有していて、基 $R^{aa}$ 及び／又は $R^{a1}$ によって部分的又は完全に置換されていてよい3～7員単環式又は9もしくは10員二環式飽和、不飽和又は芳香族ヘテロ環である、請求項1又は2に記載の式Iで表される化合物。

【請求項 5】

$R^a$  が、塩素、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ -チオアルキル、トリフルオロメチル又は $NR^A R^B$ であり、この場合、 $R^A$ 及び $R^B$ は、それらが結合している窒素原子と一緒にあって、O及びNからなる群から選択される1又は2個のヘテロ原子を含有している置換されていてよい6員飽和ヘテロ環を形成する、請求項1又は2に記載の式Iで表される化合物。

10

【請求項 6】

$R^4$  及び $R^5$  が一緒になって共有結合である、請求項1～5のいずれかに記載の式Iで表される化合物。

【請求項 7】

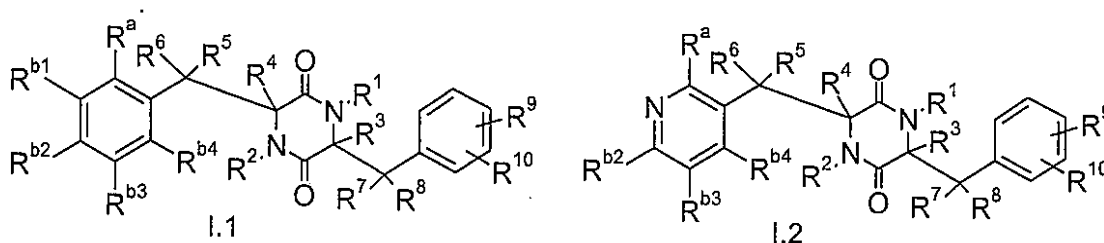
ピペラジン環におけるエキソ二重結合が(Z)配置を有している、請求項6に記載の式Iで表される化合物。

20

【請求項 8】

式I. 1又はI. 2

【化 4】



30

(式中、 $R^{b1}$ 、 $R^{b2}$ 、 $R^{b3}$ 及び $R^{b4}$ は、基 $R^b$ である) に対応している、請求項1～7のいずれかに記載の式Iで表される化合物。

【請求項 9】

$R^1$  が、OH、CN、 $NH_2$ 、 $OCH_3$ 、 $CH_2CN$ 、 $CH_2OCH_3$ 、 $SO_2CH_3$ 、 $CH_2-C-C_3H_5$ 又は $CH_2CH=CHCl$ である、請求項1～8のいずれかに記載の式Iで表される化合物。

【請求項 10】

$R^2$  がメチル又はエチルである、請求項1～9のいずれかに記載の式Iで表される化合物。

40

【請求項 11】

$R^3$  がメチル又はエチルである、請求項1～10のいずれかに記載の式Iで表される化合物。

【請求項 12】

$R^4$  及び $R^5$  が、一緒になって共有結合であるか、又は共に水素であり、 $R^6$ 、 $R^7$ 及び $R^8$ が水素である、請求項1～11のいずれかに記載の式Iで表される化合物。

【請求項 13】

請求項1～12のいずれかに記載の式Iで表される少なくとも1種のピペラジン化合物又はその農業上好適な塩の除草剤として有効な量と、作物保護剤を製剤するのに慣用されている補助剤とを含んでいる組成物。

50

少なくとも１種のさらなる活性化合物を含んでいる請求項１３に記載の組成物。

請求項 1 ～ 12 のいずれかに記載の式 I で表される少なくとも 1 種のピペラジン化合物又はその農業上好適な塩の除草剤として有効な量を、植物体、植物体の種子及び／又は植物体の生息地に作用させることを含む、望ましくない植物を防除するための方法。

【技術分野】

本発明は、式 I

10

[illegible]

(式中、

R<sup>a</sup> は、ハロゲン、CN、NO<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>－アルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>－シクロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>－ハロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>－アルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>－チオアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>－ハロアルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>－ハロチオアルキル、O－Z－C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>－シクロアルキル、S(O)<sub>n</sub>R<sup>y</sup>、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>－アルケニル、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>－シクロアルケニル、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>－アルケニルオキシ、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>－チオアルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>－アルキニル、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>－アルキニルオキシ、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>－チオアルキニル、NR<sup>A</sup>R<sup>B</sup>、トリ－C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>－アルキルシリル、Z－C(=O)－R<sup>a1</sup>、Z－C(=S)－R<sup>a1</sup>、Z－C(=N－OR<sup>A</sup>)－R<sup>a1</sup>、Z－C[=N(O)－R<sup>A</sup>]－R<sup>a1</sup>、Z－P(=O)(R<sup>a1</sup>)<sub>2</sub>、炭素又は窒素を介して結合されていて、O、N及びSからなる群から選択される1、2、3又は4個のヘテロ原子を含有していて、基R<sup>a</sup>及び／又はR<sup>a1</sup>によって部分的又は完全に置換されていてよく、及び／又はさらなる飽和、不飽和又は芳香族炭素環もしくはヘテロ環式環に縮合されていてよい3～7員単環式又は9もしくは10員二環式飽和、不飽和又は芳香族ヘテロ環であって、

20

30

R<sup>y</sup> は、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> - アルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>4</sub> - アルケニル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>4</sub> - アルキニル、N R<sup>A</sup> R<sup>B</sup> 又は C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> - ハロアルキルであり、n は、0、1 又は 2 であり；

R<sup>A</sup>、R<sup>B</sup>は、互いに独立して、水素、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>-アルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>-アルケニル又はC<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>-アルキニル、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>-シクロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>-アルキルカルボニル、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>-シクロアルキルカルボニル、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>-アルケニルカルボニル、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>-シクロアルケニルカルボニル及びC<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>-アルキニルカルボニルであり  
:

R<sup>A</sup>、R<sup>B</sup>は、それらが結合している窒素原子と一緒に、5もしくは6員飽和又は部分もしくは完全不飽和環を形成していてもよく、この環は、炭素原子に加えて、O、N及びSからなる群から選択される1、2又は3個のヘテロ原子を含有していてもよく、この環は、1～3個の基R<sup>a</sup>によって置換されていてよく；

40

Zは、共有結合、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>-アルキレン、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>-アルケニル又はC<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>-アルキニルであり；

R<sup>a1</sup> は、水素、OH、C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>－アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>－ハロアルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>－シクロアルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>－アルケニル、C<sub>5</sub>～C<sub>6</sub>－シクロアルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>－アルキニル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>－アルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>－ハロアルコキシ、C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>－アルケニルオキシ、C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>－アルキニルオキシ、NH<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>－アルキルアミノ、〔ジ－(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>)－アルキル〕アミノ、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>－アルコキシアミノ、C<sub>1</sub>～

50

C<sub>6</sub>-アルキルスルホニルアミノ、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>-アルキルアミノスルホニルアミノ、[ジ- (C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)-アルキルアミノ]スルホニルアミノ、C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>-アルケニルアミノ、C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>-アルキニルアミノ、N-(C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>-アルケニル)-N-(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>-アルキル)アミノ、N-(C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>-アルキニル)-N-(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>-アルキル)アミノ、N-(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>-アルコキシ)-N-(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>-アルキル)アミノ、N-(C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>-アルケニル)-N-(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>-アルコキシ)アミノ、N-(C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>-アルキニル)-N-(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>-アルコキシ)アミノ、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>-アルキルスルホニル、トリ-C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>-アルキルシリル、フェニル、フェノキシ、フェニルアミノ、又は、O、N及びSからなる群から選択される1、2、3又は4個のヘテロ原子を含有している5もしくは6員単環式又は9もしくは10員二環式ヘテロ環（ここで、各環式基は、置換されていないか、又は1、2、3又は4個の基R<sup>a a</sup>によって置換されている）であり；

R<sup>a a</sup>は、ハロゲン、OH、CN、NO<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>-アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>-ハロアルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>-アルコキシ、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>-ハロアルコキシ、S(O)<sub>n</sub>R<sup>y</sup>、Z-C(=O)-R<sup>a 1</sup>、Z-C(=S)-R<sup>a 1</sup>、Z-C(=N-OR<sup>A</sup>)-R<sup>a 1</sup>、Z-C(=N(O)-R<sup>A</sup>)-R<sup>a 1</sup>、オキソ(=O)及びトリ-C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>-アルキルシリルであり；

R<sup>1</sup>は、OH、CN、C<sub>5</sub>~C<sub>12</sub>-アルキル、C<sub>5</sub>~C<sub>12</sub>-アルケニル、C<sub>5</sub>~C<sub>12</sub>-アルキニル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>-アルコキシ、C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>-シクロアルキル、C<sub>5</sub>~C<sub>6</sub>-シクロアルケニル、CH<sub>2</sub>CH=CHCH<sub>3</sub>、CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH=CH<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>C(CH<sub>3</sub>)=CH<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>CH=C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>C=CCH<sub>3</sub>、CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C=CH、NR<sup>A</sup>R<sup>B</sup>、S(O)<sub>n</sub>R<sup>y</sup>、S(O)<sub>n</sub>NR<sup>A</sup>R<sup>B</sup>、CO-C<sub>1</sub>~C<sub>2</sub>-クロロアルキル、CONR<sup>A</sup>R<sup>B</sup>、フェニル、又は、O、N及びSからなる群から選択される1、2、3又は4個のヘテロ原子を含有している5もしくは6員単環式又は9もしくは10員二環式飽和、部分不飽和又は芳香族ヘテロ環（ここで、各環式基は、Z<sup>1</sup>を介して結合されていて、置換されていないか、又は1、2、3又は4個の基R<sup>a a</sup>、及び部分的又は完全にR<sup>a a</sup>で置換されている下記の基：C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>-アルキル、C<sub>3</sub>~C<sub>4</sub>-アルケニル及びC<sub>3</sub>~C<sub>4</sub>-アルキニルによって置換されている）であって；

Z<sup>1</sup>は、カルボニル又は基Zであり；

ここで、各基R<sup>1</sup>、R<sup>a</sup>及びそのサブ置換基において、その炭素鎖及び／又はその環式基は、1、2、3又は4個の置換基R<sup>a a</sup>及び／又はR<sup>a 1</sup>を有してよく；

R<sup>2</sup>は、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>-アルキル、C<sub>3</sub>~C<sub>4</sub>-アルケニル又はC<sub>3</sub>~C<sub>4</sub>-アルキニルであり；

R<sup>3</sup>は、OH、NH<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>-アルキル、C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>-シクロアルキル、C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>-アルケニル、C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>-アルキニル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>-ヒドロキシアルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>-シアノアルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>-ハロアルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>-アルコキシ-C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>-アルキル又はC(=O)R<sup>1 1</sup>であって；

R<sup>1 1</sup>は、水素、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>-アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>-ハロアルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>-アルコキシ又はC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>-ハロアルコキシであり；

R<sup>4</sup>は、水素、ハロゲン、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>-アルキル又はC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>-ハロアルキルであり、又はR<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>は、一緒になって共有結合であり；

R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、R<sup>7</sup>、R<sup>8</sup>は、互いに独立して、水素、ハロゲン、OH、CN、NO<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>-アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>-ハロアルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>-アルケニル、C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>-アルキニル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>-アルコキシ、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>-ハロアルコキシ、C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>-シクロアルキル、C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>-シクロアルケニル又はC<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>-シクロアルキニルであり；

R<sup>9</sup>、R<sup>10</sup>は、互いに独立して、水素、ハロゲン、OH、ハロアルキル、NR<sup>A</sup>R<sup>B</sup>、NR<sup>A</sup>C(O)R<sup>9 1</sup>、CN、NO<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>-アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>-ハロアルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>4</sub>-アルケニル、C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>-アルキニル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>-アルコキシ、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>-ハロアルコキシ、O-C(O)R<sup>9 1</sup>、フェノキシ又はベンジルオキシであり

10

20

30

40

50

、ここで、各基  $R^9$  及び  $R^{10}$  において、その炭素鎖及び／又はその環式基は、1、2、3又は4個の置換基  $R^a$  を有していてもよく；

$R^9$  は、 $C_1 \sim C_4$  -アルキル又は  $NR^A R^B$  であり；

V、W、X、Yは、互いに独立して、N又は  $C-R^b$  であって、

$R^b$  は、互いに独立して、水素、CN、 $NO_2$ 、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$  -アルキル、 $C_1 \sim C_4$  -ハロアルキル、 $C_2 \sim C_4$  -アルケニル、 $C_3 \sim C_6$  -アルキニル、 $C_1 \sim C_4$  -アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$  -ハロアルコキシ、ベンジル又は  $S(O)_n R^y$  であり；

$R^a$  及び／又は  $R^b$  は、その隣接環炭素原子に結合されている基  $R^a$  又は  $R^b$  と一緒に、又はその隣接環窒素原子と一緒に、それら自体が、5もしくは6員飽和又は部分もしくは完全不飽和環を形成していてもよく、この環は、炭素原子に加えて、O、N及びSからなる群から選択される1、2又は3個のヘテロ原子を含有していてもよく、この環は、1～3個の基  $R^a$  によって置換されていてよく、及び／又はさらなる飽和、不飽和又は芳香族炭素もしくはヘテロ環式環に縮合されていてよく；

【化2】

## 二

### 【0003】

は、二重結合であるか、又は  $R^a$  が、そのV位にある窒素原子と環を形成している場合は一重結合であり；

但し、V、W、X、Yの1～3個の基がNである場合は、 $R^1$  は、 $C_5 \sim C_6$  -アルキル、 $C_1 \sim C_4$  -ハロアルキル、 $CH_2CH=CHCH_3$ 、 $CH_2CH_2CH=CH_2$ 、 $CH_2C(CH_3)=CH_2$ 、 $CH_2C \equiv CH_3$  又は  $CH_2CH_2C \equiv CH$  ではない）で表されるピペラジン化合物及びその農業上好適な塩に関する。

### 【0004】

さらには、本発明は、式Iで表されるピペラジン化合物及びその農薬として有用な塩を調製するための方法及び中間体ならびに除草剤としてのその使用（すなわち、有害植物体を防除するための）に関し、さらには式Iで表される少なくとも1種のピペラジン化合物又はIの農薬として有用な塩の除草剤として有効な量を、植物体、植物体の種子及び／又は植物体の生息地に作用させることを含む、望ましくない植物を防除するための方法にも関する。

### 【0005】

本発明のさらなる実施形態は、その特許請求の範囲、その明細書及びその実施例に見出され得る。本発明の主題についての先に言及した特徴及び以下にさらに例示されることになる特徴は、それぞれの所与の組み合わせでのみならず他の組み合わせでも本発明の範囲を逸脱することなく適用され得ることは理解されるべきである。

### 【背景技術】

### 【0006】

植物体病原菌 *S. scabiei* (S. scabiei) により産生されるタキストミン (thaxtomin) A 及び B (非特許文献1) は、中心ピペラジン-2, 5-ジオン環を有する天然産物であり、これは、その3位に4-ニトロインドール-3-イルメチル基、及び、その2位に場合によるOH置換ベンジル基を有している。このものの植物体傷害活性のため、この化合物の群は、除草剤として用いるのに適しているかについても調べられたことがある（非特許文献2）。

### 【0007】

（特許文献1）及び（特許文献2）国際公開第2007/077247号パンフレットには除草剤2, 5-ジケトピペラジンが記載されており、これは、その3位及び6位に、メチレン基又はメチン基を介して結合されているフェニル基又はヘタリール基を有している。

### 【先行技術文献】

10

20

30

40

50

【特許文献】

【0008】

【特許文献1】国際公開第2007/077201号パンフレット

【特許文献2】国際公開第2007/077247号パンフレット

【非特許文献】

【0009】

【非特許文献1】King R. R. et al., J. Agric. Food Chem. (1992) 40, 834-837

【非特許文献2】King R. R. et al., J. Agric. Food Chem. (2001) 49, 2298-2301

【発明の概要】

【発明が解決しようとする課題】

10

【0010】

本発明の目的は、除草活性を有する化合物を提供することである。提供されるのは、特に、作物植物体との適合性が商業的な施用に十分なものである、特に低施用量でも、強力な除草活性を有する、化合物である。

【課題を解決するための手段】

【0011】

この目的及びさらなる目的は、冒頭で定義した式Iで表される化合物及びその農業上好適な塩によって達成される。

【発明を実施するための形態】

【0012】

20

本発明による化合物は、国際公開第2007/077201号パンフレット及び国際公開第2007/077247号パンフレットから知られている化合物とは、そのピペラジン環の1位におけるそのN-置換及び2位におけるその置換基が基本的に異なっている。

【0013】

本発明による各化合物は、国際公開第2007/077201号パンフレット及び国際公開第2007/077247号パンフレットに記載されている合成経路と同じように、有機化学の標準的な方法、例えば以下に記載する各工程を含む方法（本明細書以下では方法A）に従って調製され得る。

【0014】

方法A

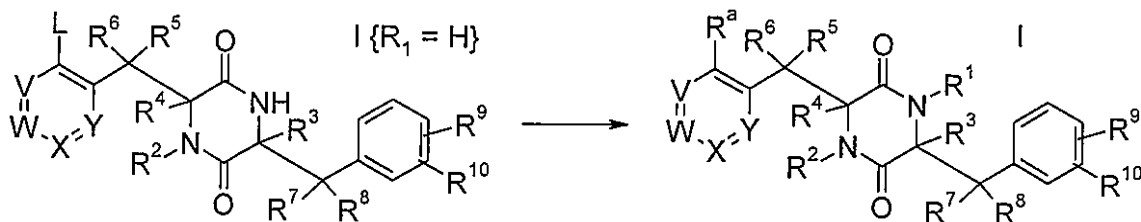
30

$R^1 \neq$  水素である式Iで表される化合物は、好ましくは、 $R^1$  が水素である式Iで表されるピペラジン化合物を、水素とは異なる基  $R^1$  を含有しているアルキル化剤又はアシル化剤と反応させることにより、調製され得る（方法A）。そのような反応は、例えばI.O.

Donkor et al., Bioorg. Med. Chem. Lett. 11 (19) (2001), 2647-2649, B.B. Snider et al., Tetrahedron 57 (16) (2001), 3301-3307, I. Yasuhiro et al., J. Am. Chem. Soc. 124(47) (2002), 14017-14019, 又はM. Falorni et al., Europ. J. Org. Chem. (8) (2000), 1669-1675によって報告されている方法に従って、公知の方法と同じように、行われ得る。

【化3】

40



【0015】

方法Aによれば、 $R^1 =$  水素である式Iで表されるピペラジン化合物は、適するアルキル化剤（本明細書以下では化合物  $X^1 - R^1$ ）又はアシル化剤（本明細書以下では化合物

50

$X^2-R^1$ ) と反応させ、これにより、 $R^1 \neq$  水素である式 I で表されるピペラジン化合物が得られる。

#### 【0016】

このアルキル化剤  $X^1-R^1$  中、 $X^1$  は、ハロゲン又は  $O-SO_2-R^m$  (ここで、 $R^m$  は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル又はハロ $\sim C_1 \sim C_4$ -アルキルによって場合により置換されている  $C_1 \sim C_4$ -アルキル又はアリールの意味を有している) であり得る。アシル化剤  $X^2-R^1$  中、 $X^2$  は、ハロゲン (特には Cl) であり得る。ここでは、 $R^1 \neq$  水素であって、先に記載されている意味を有しており、特には  $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ -アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ -シクロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ -アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキニル、フェニル- $C_1 \sim C_6$ -アルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリル- $C_1 \sim C_6$ -アルキル; フェニル- ( $C_1 \sim C_6$ -アルコキシカルボニル)- $C_1 \sim C_6$ -アルキル又はフェニルヘテロシクリル- $C_1 \sim C_6$ -アルキル; 又は  $CO-R^{11}$  又は  $SO_2-R^{25}$ ; であり、ここで、記載した  $R^1$  の脂肪族部分構造、環状部分構造又は芳香族部分構造は、部分的又は完全にハロゲン化されていてよく及び/又は以下の各基: シアノ、ヒドロキシル、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_1 \sim C_4$ -ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ -アルキルチオ、(ジ- ( $C_1 \sim C_4$ )-アルキル) アミノ、 $C_1 \sim C_4$ -アルキルカルボニル、ヒドロキシカルボニル、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシカルボニル、アミノカルボニル、 $C_1 \sim C_4$ -アルキルアミノカルボニル、(ジ- ( $C_1 \sim C_4$ )-アルキル) アミノカルボニル又は  $C_1 \sim C_4$ -アルキルカルボニルオキシのうちの 1~3 個を有しているよい。

10

20

#### 【0017】

この反応は、通常、 $-78^\circ C \sim$  その反応混合物の沸点の範囲内にある温度、好ましくは  $-50^\circ C \sim 65^\circ C$ 、特に好ましくは  $-30^\circ C \sim 65^\circ C$  の温度で行われる。この反応は、一般的には、溶媒中で、好ましくは不活性有機溶媒中で、行われる。

#### 【0018】

適する不活性有機溶媒としては、脂肪族炭化水素 (例えばペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン及び  $C_5 \sim C_8$ -アルカン混合物)、芳香族炭化水素 (例えばトルエン、*o*-キシレン、*m*-キシレン及び *p*-キシレン)、ハロゲン化炭化水素 (例えばジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム及びクロロベンゼン)、エーテル (例えばジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、*tert*-ブチルメチルエーテル、ジオキサン、アニソール及びテトラヒドロフラン)、ニトリル (例えばアセトニトリル及びプロピオニトリル)、ケトン (例えばアセトン、メチルエチルケトン、ジエチルケトン及び *tert*-ブチルメチルケトン)、アルコール (例えばメタノール、エタノール、*n*-プロパノール、イソプロパノール、*n*-ブタノール、*tert*-ブチルアルコール)、水、ならびにジメチルスルホキシド、ジメチルホルムアミド及びジメチルアセトアミド、さらにはモルホリン及び *N*-メチルモルホリンが挙げられる。記載した各溶媒の混合物も用いられ得る。

30

#### 【0019】

本発明の好ましい実施形態では、この反応は、例えば 1:10~10:1 (体積部) の混合比を用いた、テトラヒドロフラン/水混合物中で行われる。もう 1 つの好ましい実施形態では、トルエン、ジクロロメタン、テトラヒドロフランもしくはジメチルホルムアミド又はこれらのものの混合物が考えられる。本発明の特に好ましい実施形態では、この反応は、テトラヒドロフラン中で行われる。

40

#### 【0020】

好ましい実施形態においては、 $R^1 = H$  である化合物 I は、塩基の存在下にアルキル化剤又はアシル化剤と反応させる。

#### 【0021】

適する塩基は、一般的には、無機化合物、例えばアルカリ金属水酸化物及びアルカリ土類金属水酸化物 (例えば水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム又は水酸化カルシウム)、アンモニア水溶液、アルカリ金属酸化物及びアルカリ土類金属酸化物 (例

50

例えば酸化リチウム、酸化ナトリウム、酸化カルシウム及び酸化マグネシウム)、アルカリ金属水素化物及びアルカリ土類金属水素化物(例えば水素化リチウム、水素化ナトリウム、水素化カリウム及び水素化カルシウム)、アルカリ金属アミド(例えばリチウムアミド(例えばリチウムジイソプロピルアミド)、ナトリウムアミド及びカリウムアミド)、アルカリ金属炭酸塩及びアルカリ土類金属炭酸塩(例えば炭酸リチウム、炭酸カリウム、炭酸セシウム及び炭酸カルシウム)、さらにはアルカリ金属重炭酸塩(例えば重炭酸ナトリウム)も、有機金属化合物、特にアルカリ金属アルキル(例えばメチルリチウム、ブチルリチウム及びフェニルリチウム)、アルキルマグネシウムハロゲン化物(例えばメチルマグネシウムクロリド)、ならびにアルカリ金属アルコキシド及びアルカリ土類金属アルコキシド(例えばナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウムエトキシド、カリウムtert-ブトキシド、カリウムtert-ペンタオキシド及びジメトオキシマグネシウム)、さらには有機塩基、例えば三級アミン(例えばトリメチルアミン、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、2-ヒドロキシピリジン及びN-メチルピペリジン)、ピリジン、置換されたピリジン(例えばコリジン、ルチジン及び4-ジメチルアミノピリジン)、及び二環式アミンである。各種塩基の混合物も用いられ得る。

10

#### 【0022】

本発明に記載の方法の一実施形態では、IIの反応は、塩基の存在下に、好ましくは塩基カリウムtert-ブトキシド、2-ヒドロキシピリジン又はアンモニア水溶液あるいはこれら塩基の混合物の存在下に、行われる。好ましくは、これら塩基のただ1つが用いられる。特に好ましい実施形態では、この反応は、アンモニアの水溶液の存在下に行われ、これは、例えば、10~50%濃度(w/v)であり得る。

20

#### 【0023】

この塩基は、一般的には、等モル量で用いられる。塩基は、過剰でも、あるいは溶媒としてでも、用いられ得る。本発明に記載の方法の好ましい実施形態では、この塩基は、等モル量で、又は、実質的に等モル量で、加えられる。さらに好ましい実施形態では、用いられる塩基は、水素化ナトリウムである。

#### 【0024】

本発明に記載の各方法のうちの1つによって得られた反応混合物は、例えば、通常の方法で、後処理され得る。これは、例えば、水と混合し、その相を分離させ、適切であれば、その粗製生成物をクロマトグラフィー精製することによって、行われ得る。この中間体及び最終生成物の一部のものは粘稠な油状物の形態で得られるが、これは、一般には、減圧下で及び適度に高められた温度で、揮発成分が除去され得る、又は、精製され得る。この中間体及び最終生成物が固形物として得られる場合は、その精製は、再結晶化又は温浸によっても行われ得る。

30

#### 【0025】

##### 方法B

##### B. 1

先に述べた手順と同じように、 $R^2$ が水素である化合物Iはアルキル化剤 $R^2-X^1$ 又はアシル化剤 $R^2-X^2$ と反応させ得、これにより $R^2 \neq$ 水素である式Iで表される化合物が得られる(方法B)。この反応条件は、方法Aの反応条件に対応している。好ましい塩基は、水素化ナトリウム(NaH)、リチウムジイソプロピルアミド(LDA)及びリチウムヘキサメチルジシラジド(LiHMDS)である。

40

#### 【0026】

##### B. 2

先に述べた手順と同じように、 $R^3$ が水素である化合物Iはアルキル化剤 $R^3-X^1$ 又はアシル化剤 $R^3-X^2$ と反応させ得、これにより $R^3 \neq$ 水素である式Iで表される化合物が得られる。この反応条件は、方法Aの反応条件に対応している。

#### 【0027】

式I又はII中の基 $R^1$ が水素である場合は、アルキル化により基 $R^1$ が導入される。式I又はII中の基 $R^1$ が保護基である場合は、これは、最初に除去され、 $R^1$ が水素で

50

ある化合物が得られ、これに、基  $R^1$  がアルキル化により導入される。式 I 又は I I 中の  $R^2$  が水素である場合は、この基  $R^2$  は、アルキル化又はアシル化工程により導入される。 $R^1$  及び  $R^2$  が同じである場合は、そのアルキル化又はアシル化工程は、同時に、又は、任意の順序で、連続的に行われ得る。基  $R^1$ 、 $R^2$  及び  $R^3$  が同じである場合は、その基  $R^3$  は、基  $R^1$  及び／又は  $R^2$  の導入と同時に、又はそれらに続いて、導入され得る。

#### 【0028】

別法として、この基  $R^1$ 、 $R^2$  及び／又は  $R^3$  は、化合物 I 又は I I の他の前駆体にも導入され得る。つまり、例えば、 $R^1$ 、 $R^2$  及び／又は  $R^3$  が水素である化合物 I V、V I、V I I I、I X、X I 及び X I I が、先に記載した反応に付され得る。

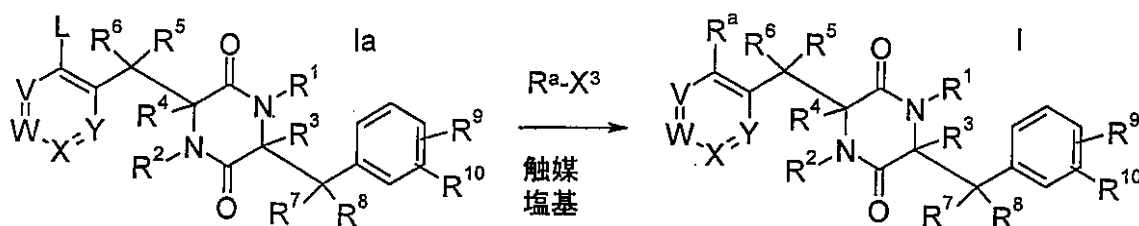
10

#### 【0029】

##### 方法 C

式 I で表される化合物は、例えば J. Tsuji, Top. Organomet. Chem. (14) (2005), 332 pp 又は J. Tsuji, Organic Synthesis with Palladium Compounds (1980), 207 pp と同じように、以下のスキームに例示されている方法に従ってその置換基  $R^a$  を変換させることによって調製され得る。

#### 【化 4】



20

#### 【0030】

つまり、例えば、 $R^a$  が CN、置換されていてもよいフェニル、又は置換されていてもよいヘテロ環式基である式 I で表される化合物は、 $R^a$  がハロゲン（例えば Cl、Br 又は I）である化合物 I からその置換基  $R^a$  を変換させることによって調製され得る。

#### 【0031】

この目的のために、その置換基  $R^a$  の代わりに、適する脱離基 L を有する式 I a で表されるピペラジン化合物は、基  $R^a$  を含有するカップリングパートナー（化合物  $R^a - X^3$ ）と反応させることによって式 I で表される別のピペラジン誘導体に変換される。

30

#### 【0032】

この反応は、通常、触媒の存在下に、好ましくは遷移金属触媒の存在下に、行われる。この反応は、一般的には、塩基の存在下に行われる。

#### 【0033】

以下の本明細書では、この反応系列は、この置換基  $R^a$  の例を用いて示されているが、当然、この反応系列は、その各置換基  $R^b$  を変換させるのにも同じような方式で用いられ得る。

40

#### 【0034】

適する脱離基 L は、例えば、ハロゲン、又は、例えばトリフラートのような  $S(O)_n R^k$ （ここで、 $n = 0, 1, 2, 3$  であり、 $R^k$  は、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、ハロ  $\sim C_1 \sim C_6$ -アルキル又はハロゲン化されていてもよいもしくは  $C_1 \sim C_4$ -アルキル-置換されたアリーの意味を有している）である。

#### 【0035】

適するカップリングパートナー  $X^3 - R^a$  は、 $R^a$  が  $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_2 \sim C_6$ -アルケニル、アリール又はヘテロアリールの意味を有している場合は、特に、 $X^3$  が、以下の各基：

・  $Zn - R^1$ （ここで、 $R^1$  は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_2 \sim C_6$ -アル

50

ケニル、アリール又はヘテロアリールの意味を有している) ;

・  $B(OR^m)_2$  (ここで、 $R^m$  は、H又は $C_1 \sim C_6$ -アルキルの意味を有しており、2つのアルキル置換基は一緒になって $C_2 \sim C_4$ -アルキレン鎖を形成してよい) ; 又は

・  $SnR^n_3$  (ここで、 $R^n$  は、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、アリール又はアルコキシアルケニルの意味を有している) ;

のうちの1つである、化合物である。

#### 【0036】

$R^a$  が $C_2 \sim C_6$ -アルキニルである場合は、 $X^3$  は、水素でもあり得る。

#### 【0037】

10

この反応は、通常、 $-78^\circ\text{C} \sim$ その反応混合物の沸点の範囲内にある温度、好ましくは $-30^\circ\text{C} \sim 65^\circ\text{C}$ 、特に好ましくは $30^\circ\text{C} \sim 65^\circ\text{C}$ の温度で行われる。この反応は、一般的には、塩基の存在下にある不活性有機溶媒中で行われる。

#### 【0038】

適する溶媒は、方法Aに対して挙げた化合物である。本発明に記載の方法の別の実施形態では、テトラヒドロフラン及び触媒量の水が用いられる。別の実施形態では、テトラヒドロフランがそれ自体で用いられる。

#### 【0039】

適する塩基は、方法Aに対して挙げた化合物である。この塩基は、一般的には、等モル量で用いられる。塩基は、過剰で、あるいは溶媒としても用いられ得る。

20

#### 【0040】

本発明に記載の方法の好ましい実施形態では、この塩基は、等モル量で加えられる。さらに好ましい実施形態では、用いられる塩基は、トリエチルアミン又は炭酸セシウムであり、特に好ましくは炭酸セシウムである。

#### 【0041】

本発明に記載の方法に適している触媒は、原理的には、遷移金属Ni、Fe、Pd及びCuの化合物である。有機化合物又は無機化合物が用いられ得る。各種のリガンドを有している遷移金属錯体が適している (Accts. Chem. Res. 2008, 41 (11), 1439-1564, special issue; Angew. Chem. Int. Ed. Engl., 2009, 48, 4114-4133; を参照されたい)。言及され得る例は、 $Pd(PPh_3)_2Cl_2$ 、 $Pd(OAc)_2$ 、 $PdCl_2$  又は $Na_2PdCl_4$  である。本明細書では、Phは、フェニルである。

30

#### 【0042】

$R^a$  がCNである化合物Iを調製するためには、Lが塩素、臭素又はヨウ素である化合物Iaは、公知の方法 (Organikum, 21. edition 2001, Wiley, p. 404; Tetrahedron Lett. 42, 2001, p. 7473; Org. Lett. 5, 2003, 1785; を参照されたい) と同じように銅シアニドとも反応され得る。

#### 【0043】

この反応は、通常、 $100^\circ\text{C} \sim$ その反応混合物の沸点の範囲内にある温度、好ましくは $100^\circ\text{C} \sim 250^\circ\text{C}$ の温度で行われる。この反応は、一般的には、不活性有機溶媒中で行われる。適する溶媒は、特に、非プロトン性極性溶媒、例えばジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン、N, N'-ジメチルイミダゾリジン-2-オン及びジメチルアセトアミドである。

40

#### 【0044】

別法として、この基 $R^a$ の変換は、その化合物Iの前駆体中でも行われ得る。つまり、例えば、 $R^a$  がハロゲン原子 (例えばCl、Br又はI) である化合物IIが、先に記載した反応に付され得る。

#### 【0045】

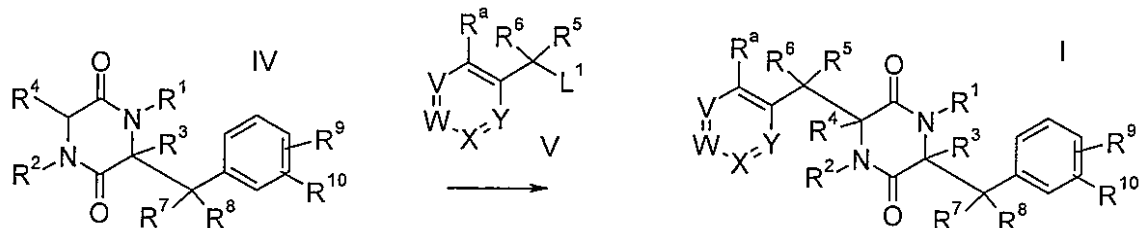
##### 方法D

以下に示す合成に従って、式Iで表される化合物は、式IVで表されるピペラジン化合物を化合物Vとカップリングさせることによって調製され得る。このIVとVのカップリ

50

ングは、例えばG. Porzi, et al., Tetrahedron 9 (19), (1998), 3411-3420又はC. I. Harding et al., Tetrahedron 60 (35), (2004), 7679-7692に従って、公知の方法と同じように達成され得る。

【化5】



10

【0046】

このスキーム中、V、W、X、Y及び $R^1 \sim R^{10}$ は、先に記載されている意味を有している。 $L^1$ は、適する脱離基、例えばハロゲン又は $OSO_2R^m$ （ここで、 $R^m$ は、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、アリール、又は、 $C_1 \sim C_4$ -アルキルによって1～3置換されているアリールの意味を有している）である。

【0047】

この反応は、一般的には、 $-78^\circ C \sim$ その反応混合物の沸点の範囲内にある温度、好ましくは $-78^\circ C \sim 40^\circ C$ の範囲内、特に好ましくは $-78^\circ C \sim 30^\circ C$ の範囲内にある温度で行われる。

20

【0048】

この反応は、一般的には、塩基の存在下にある不活性有機溶媒中で行われる。適する溶媒は、方法Aに対して挙げた溶媒、好ましくはテトラヒドロフランである。

【0049】

適する塩基は、方法Aに対して挙げた化合物である。さらに好ましい実施形態では、用いられる塩基は、特に好ましくは実質的に等モル量の、特には等モル量の、リチウムジイソプロピルアミドである。

【0050】

式Vで表される化合物群の一部のものは市販されており、あるいはその対応する市販の前駆体を変換させることにより（文献に記載されている）調製され得るものである。後処理は、方法Aと同じように行われ得る。

30

【0051】

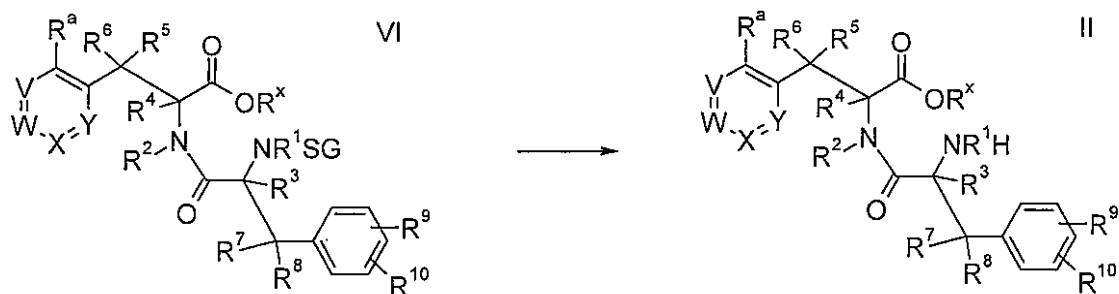
この式Iで表される化合物の調製に必要とされる各前駆体及び各中間体の一部のものは、市販されているか、文献から知られているか、又は文献から公知の方法によって調製され得るものである。

【0052】

例えば、式IIで表されるジペプチド化合物は、例えばGlenn L. Stahl et al., J. Org. Chem. 43(11), (1978), 2285-6又はA. K. Ghosh et al., Org. Lett. 3(4), (2001), 635-638に従って、公知の方法と同じように式VIで表されるN保護ジペプチドから調製され得る。

40

【化6】



【0053】

50

式 I I 及び V I 中、各可変部は、式 I に対して記載されている意味を有しており、S G は、窒素保護基、例えば B o c (= t e r t -ブトキシカルボニル)、であり、O R <sup>x</sup> は、酸素原子を介して結合されている脱離基である。式 I で表される化合物についての好ましい意味は、当然、式 I I 又は I V で表される化合物にも、対応する方式で、まったく当てはまる。脱離基 O R <sup>x</sup> に関しては、式 I I に対して先に記載したことが当てはまる。

#### 【0054】

つまり、例えば、S G が B o c であり、O R <sup>x</sup> が適する脱離基（ここで、R <sup>x</sup> は、例えば、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>-アルキル、特にメチル、エチル又はベンジルである）である式 V I で表されるジペプチドは、酸の存在下で、式 I I で表される化合物に変換され得る。

#### 【0055】

この反応は、通常、-30℃～その反応混合物の沸点の範囲内にある温度、好ましくは0℃～50℃、特に好ましくは20℃～35℃で行われる。

#### 【0056】

この反応は、溶媒中で、特に不活性有機溶媒中に行われ得る。適する溶媒は、塩基環化に対して挙げた溶媒、特にテトラヒドロフラン又はジクロロメタンあるいはこれらのものの混合物、好ましくはジクロロメタンである。

#### 【0057】

適する酸は、原理的には、ブレンステッド酸、及び、ルイス酸、である。特に、無機酸、例えばハロゲン化水素酸（例えばフッ化水素酸、塩酸、臭化水素酸）、無機オキソ酸（例えば硫酸及び過塩素酸）、さらには無機ルイス酸（例えばホウ素 トリフルオリド、三塩化アルミニウム、塩化鉄（I I I）、塩化スズ（I V）、塩化チタン（I V）及び塩化亜鉛（I I）、ならびに有機酸、例えばカルボン酸及びヒドロキシカルボン酸（例えばギ酸、酢酸、プロピオン酸、シュウ酸、クエン酸及びトリフルオロ酢酸）、さらには有機スルホン酸（例えばトルエンスルホン酸、ベンゼンスルホン酸、ショウノウスルホン酸等）が用いられ得る。当然、さまざまな酸の混合物も用いられ得る。

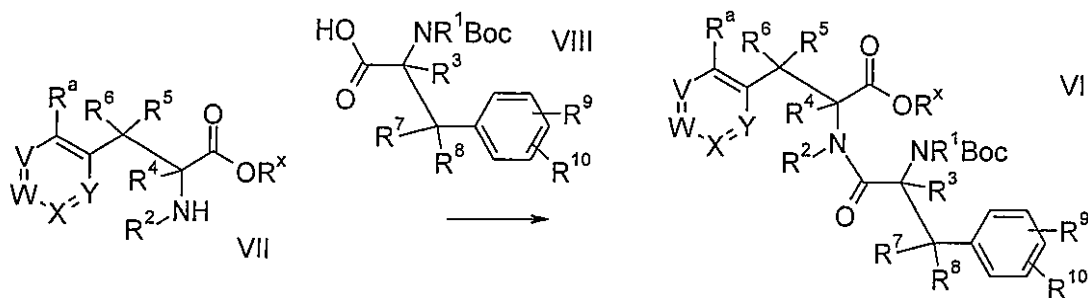
#### 【0058】

本発明に記載の方法の一実施形態では、この反応は、有機酸の存在下に、例えば強有機酸（例えばギ酸、酢酸又はトリフルオロ酢酸あるいはこれらのものの混合物）の存在下に行われる。好ましい実施形態では、この反応は、トリフルオロ酢酸の存在下に行われる。後処理は、方法 A と同じように行われ得る。

#### 【0059】

式 V I で表される保護ジペプチドは、例えば Wilford L. Mendelson et al., Int. J. Peptide & Protein Research 35(3), (1990), 249-57 に従って、公知の方法と同じように調製され得る。典型的な経路は、以下のスキーム：

#### 【化7】



#### 【0060】

に従って、式 V I I で表されるアミノ酸エステルで B o c 保護アミノ酸 V I I I をアミド化する経路である。

#### 【0061】

このスキーム中、各可変部は、先に言及した意味を有している。B o c の代わりに、他のアミノ保護基も用いられ得る。

#### 【0062】

このV I IとV I I Iの反応は、一般的には、 $-30^{\circ}\text{C}$ ～その反応混合物の沸点の範囲内にある温度、好ましくは $0^{\circ}\text{C}$ ～ $50^{\circ}\text{C}$ 、特に好ましくは $20^{\circ}\text{C}$ ～ $35^{\circ}\text{C}$ で行われる。この反応は、溶媒中で、特に不活性有機溶媒中で行われ得る。方法Aに対してその塩基環化との関連で記載した溶媒が適している。

#### 【0063】

一般には、この反応は、活性化剤の存在を必要とする。適する活性化剤は、例えば、ポリスチレン担持又は非ポリスチレン担持ジシクロヘキシルカルボジイミド(DCC)、ジイソプロピルカルボジイミド、1-エチル-3-(ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド(EDAC)、カルボニルジイミダゾール、クロロギ酸エステル(例えばメチルクロロホルマート、エチルクロロホルマート、イソプロピルクロロホルマート、イソブチルクロロホルマート、sec-ブチルクロロホルマート又はアリルクロロホルマート)、ピバロイルクロリド、ポリリン酸、プロパンホスホン酸無水物、ビス(2-オキソ-3-オキサゾリジニル)ホスホリルクロリド(BOPCI)又はスルホニルクロリド(例えばメタンスルホニルクロリド、トルエンスルホニルクロリド又はベンゼンスルホニルクロリド)のような、縮合剤である。一実施形態によれば、用いる活性化剤は、EDAC又はDCCである。

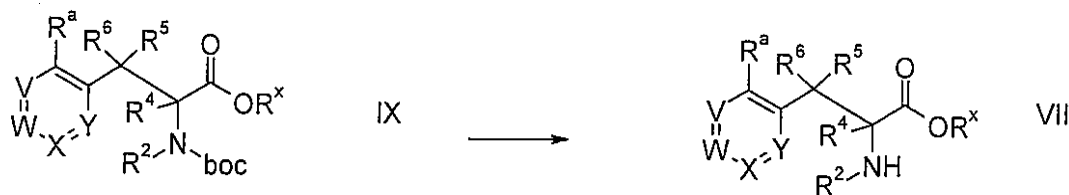
#### 【0064】

このV I IとV I I Iの反応は、塩基の存在下に好ましくは行われる。適する塩基は、方法Aに対して挙げた化合物である。一実施形態では、用いる塩基はトリエチルアミン又はN-エチルジイソプロピルアミンあるいはこれらのものの混合物であり、特に好ましくはN-エチルジイソプロピルアミンである。後処理は、方法Aと同じように行われ得る。

#### 【0065】

一方、式V I Iで表される化合物は、例えばGlenn L. Stahl et al., J. Org. Chem. 43(11), (1978), 2285-6又はA. K. Ghosh et al., Org. Lett. 3(4), (2001), 635-638に従って、対応する保護されたアミノ酸化合物IXを公知の方法と同じように脱保護することにより、調製され得る。Boc保護アミノ酸化合物IXからのV I Iの調製を以下のスキームに示す。このBoc基の代わりには、他のアミノ保護基も用いられ得る。

#### 【化8】



#### 【0066】

この式IXで表される化合物のその化合物V I Iへの変換は、典型的には、酸の存在下に $-30^{\circ}\text{C}$ ～その反応混合物の沸点の範囲内にある温度、好ましくは $0^{\circ}\text{C}$ ～ $50^{\circ}\text{C}$ 、特に好ましくは $20^{\circ}\text{C}$ ～ $35^{\circ}\text{C}$ で行われる。この反応は、溶媒中で、好ましくは不活性有機溶媒中で、行われ得る。

#### 【0067】

適する溶媒は、その塩基環化に対して挙げた溶媒、特にテトラヒドロフラン又はジクロロメタンあるいはこれらのものの混合物、好ましくはジクロロメタンである。

#### 【0068】

適する酸及び酸性触媒は、原理的には、ブレンステッド酸及びルイス酸であり、特に先に言及したものである。

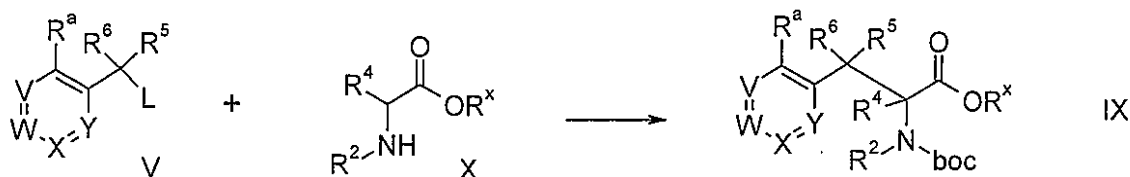
#### 【0069】

本発明に記載の方法の一実施形態では、この反応は、有機酸、例えばギ酸、酢酸又はトリフルオロ酢酸あるいはこれらのものの混合物のような強有機酸、好ましくはトリフルオロ酢酸の存在下に行われる。後処理は、方法Aと同じように行われ得る。

#### 【0070】

式 I X で表される化合物は、以下のスキームに示す反応に従って調製され得る。その化合物 V とその保護されたアミノ酸化合物 X の反応は、例えば I. Ojima et al., J. Am. Chem. Soc., 109(21), (1987), 6537-6538 又は J. M. McIntosh et al., Tetrahedron 48(30), (1992), 6219-6224 に従って、文献から公知の方法と同じように行われ得る。

【化 9】



10

【0071】

このスキーム中、その各可変部は、先に言及した意味を有している。L は、脱離基であり、例えば方法 F に対して記載した各脱離基のうちの一つである。Boc の代わりに、他のアミノ保護基も用いられ得る。

【0072】

この V と X の反応は、一般的には、塩基の存在下に行われる。適する塩基は、方法 A に対して挙げた化合物である。さらに好ましい実施形態では、用いる塩基は、リチウムジイソプロピルアミドであり、特に好ましくは実質的に等モル量で、特に等モル量で用いられる。

【0073】

20

この反応は、通常、 $-78^{\circ}\text{C}$  ~ その反応混合物の沸点の範囲内にある温度、好ましくは  $-78^{\circ}\text{C}$  ~ その沸点、特に好ましくは  $-78^{\circ}\text{C}$  ~  $30^{\circ}\text{C}$  で行われる。

【0074】

この反応は溶媒中で行われ得、好ましくは不活性有機溶媒中で行われる。適する溶媒は、原理的には、その塩基環化に対して記載した溶媒、特にジクロロメタン又はテトラヒドロフランあるいはこれらのものの混合物、好ましくはテトラヒドロフランである。後処理は、方法 A と同じように行われ得る。

【0075】

式 V で表される化合物の一部のものは市販されており、又は対応する市販前駆体の、文献に記載されている変換により、調製され得る。

30

【0076】

式 V I I I、X で表されるアミノ酸誘導体又は以下に記載する誘導体 X V の一部のものは同様に市販されており、又は対応する市販前駆体の文献に記載の変換により調製され得るものである。

【0077】

$R^1 \neq$  水素である式 I V で表される化合物は、 $R^1$  が水素である式 I V で表されるピペラジン化合物を、水素とは異なる基  $R^1$  を含有しているアルキル化剤又はアシル化剤と反応させることにより、調製され得る。同じようにして、 $R^2 \neq$  水素である化合物 I V は、 $R^2$  が水素である式 I V で表されるピペラジン化合物を、水素とは異なる基  $R^2$  を含有しているアルキル化剤又はアシル化剤と反応させることにより、調製され得る。そのような反応は、例えば I. O. Donkor et al., Bioorg. Med. Chem. Lett. 11 (19) (2001), 2647-2649、B. B. Snider et al., Tetrahedron 57 (16) (2001), 3301-3307、I. Yasuhiro et al., J. Am. Chem. Soc. 124(47) (2002), 14017-14019、又は M. Falorni et al., Europ. J. Org. Chem. (8) (2000), 1669-1675 によって報告されている方法によって、公知の方法と同じように行われ得る。

40

## 【化10】



## 【0078】

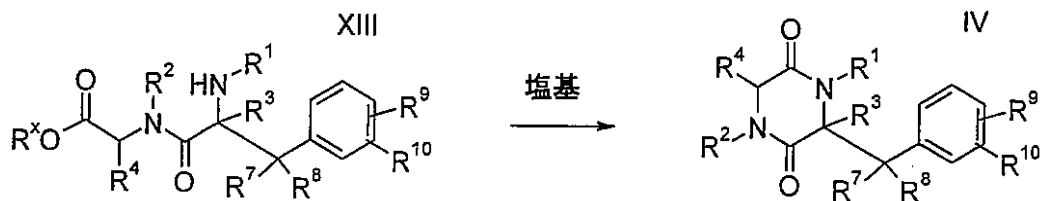
アルキル化剤又はアシル化剤に関しては、方法B及びCに対して記載したことが同じように当てはまる。これらの反応の反応条件に関しては、方法B及びCに対して先に記載したことが同じように当てはまる。

10

## 【0079】

式IVで表される化合物は、また、例えばT. Kawasaki et al., Org. Lett. 2(19) (2000), 3027-3029に従って、さらなる公知の方法と同じように式XIIIで表される化合物の分子内環化によっても調製され得る。

## 【化11】



20

## 【0080】

ここでは、OR<sup>x</sup>は、適する脱離基であり、R<sup>x</sup>は、ここでは、例えば、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>-アルキル、特にメチル、エチル又はベンジルである。

## 【0081】

式XIII中、その各可変部は、式Iに対して記載されている意味を有している。その基OR<sup>x</sup>は、酸素を介して結合されている適する脱離基である。R<sup>x</sup>は、ここでは、例えば、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>-アルキル、特にメチル、エチル、又はフェニル-C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>-アルキル（例えばベンジル）である。

30

## 【0082】

式XIIIで表される化合物の環化は塩基の存在下に行われ得る。このケースでは、その反応は、一般には、0℃～その反応混合物の沸点の範囲内にある温度、好ましくは10℃～50℃、特に好ましくは15℃～35℃の温度で行われる。この反応は、溶媒中、好ましくは不活性有機溶媒中で、行われ得る。

## 【0083】

適する溶媒は、原理的には、熱環化に対して挙げた化合物、特に1:10～10:1の混合比を有しているテトラヒドロフラン/水混合物である。

## 【0084】

適する塩基は、方法Aによる塩基環化に対して記載した塩基であり、特にカリウムtert-ブトキシド、2-ヒドロキシピリジン又はアンモニア水溶液あるいはこれらの塩基の混合物である。好ましくは、これの塩基のうちのただ一つが用いられる。特に好ましい実施形態では、この反応は、アンモニア水溶液の存在下に行われ、これは、例えば、10～50%濃度(v/v)であり得る。

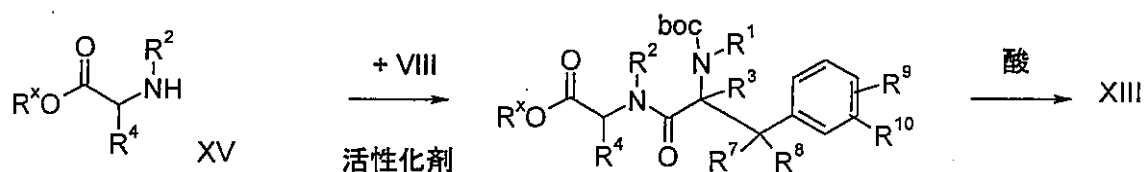
40

## 【0085】

一方、式XIIIで表される化合物は、例えばWilford L. Mendelson et al., Int. J. Peptide & Protein Research 35(3), (1990), 249-57、Glenn L. Stahl et al., J. Org. Chem. 43(11), (1978), 2285-6、又はA. K. Ghosh et al., Org. Lett. 3(4), (2001), 635-638、に従って、公知の方法と同じように、以下のスキームに示す合成によって調製され得る。

50

## 【化 1 2】



## 【0086】

このスキーム中、その各可変部  $R^x$ 、 $R^1 \sim R^4$  及び  $R^7 \sim R^{10}$  は、式 I I 又は X I I I に対して記載されている意味を有している。第 1 の工程において、この合成には、活性化剤の存在下に B o c 保護アミノ酸 V I I I でアミノ酸化合物 X V をカップリングさせることが含まれる。

10

## 【0087】

式 X V で表される化合物と式 V I I I で表される化合物の反応は、通常、 $-30^\circ\text{C} \sim$  その反応混合物の沸点の範囲内にある温度、好ましくは  $10^\circ\text{C} \sim 50^\circ\text{C}$ 、特に好ましくは  $20^\circ\text{C} \sim 35^\circ\text{C}$  の温度で行われる。この反応は、溶媒中、好ましくは不活性有機溶媒中で、行われ得る。さらなる詳細については、その化合物 V I I I でそのアミノ酸化合物 V I I I をアミド化することによるその化合物 V I の調製に参照がなされる。

## 【0088】

20

一般には、この反応は、活性化剤の存在を必要とする。適する活性化剤は、例えば、ポリスチレンー担持又は非ポリスチレンー担持ジシクロヘキシルカルボジイミド (D C C)、ジイソプロピルカルボジイミド、1-エチル-3-(ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド (E D A C)、カルボニルジイミダゾール、クロロギ酸エステル (例えばメチルクロロホルマート、エチルクロロホルマート、イソプロピルクロロホルマート、イソブチルクロロホルマート、s e c-ブチルクロロホルマート又はアリルクロロホルマート)、ピバロイルクロリド、ポリリン酸、プロパンホスホン酸無水物、ビス(2-オキソ-3-オキサゾリジニル)ホスホリルクロリド (B O P C I) 又はスルホニルクロリド (例えばメタンスルホニルクロリド、トルエンスルホニルクロリド又はベンゼンスルホニルクロリド) のような縮合剤である。一実施形態によれば、この好ましい活性化剤は、E D A C 及び D C C である。

30

## 【0089】

X V と V I I I の反応は、好ましくは、塩基の存在下に行われる。適する塩基は、方法 A に対して挙げた塩基である。一実施形態では、用いる塩基は、トリエチルアミン又は N-エチルジイソプロピルアミンあるいはこれらのものの混合物であり、特に好ましくは N-エチルジイソプロピルアミンである。後処理は、方法 A と同じように行われ得る。

## 【0090】

その化合物 X I V を脱保護してその化合物 X I I I を得るのは、典型的には、酸で処理することにより行われる。この反応は、通常、 $-30^\circ\text{C} \sim$  その反応混合物の沸点の範囲内にある温度、好ましくは  $10^\circ\text{C} \sim 50^\circ\text{C}$ 、特に好ましくは  $20^\circ\text{C} \sim 35^\circ\text{C}$  で行われる。この反応は、溶媒中、好ましくは不活性有機溶媒中で、行われ得る。

40

## 【0091】

適する溶媒は、原理的には、塩基環化に関連して方法 A に対して記載した溶媒、特にテトラヒドロフラン又はジクロロメタンあるいはこれらのものの混合物であり、好ましくはジクロロメタンである。

## 【0092】

用いる酸は、方法 A に対して記載した酸である。さらなる詳細については、V I を脱保護してその化合物 I I を得ることに参照がなされる。そこに記載されている反応条件もこの化合物 X I V を脱保護するのに適している。本発明に記載の方法の一実施形態では、この反応は、有機酸 (特に強有機酸) の存在下、例えばギ酸、酢酸又はトリフルオロ酢

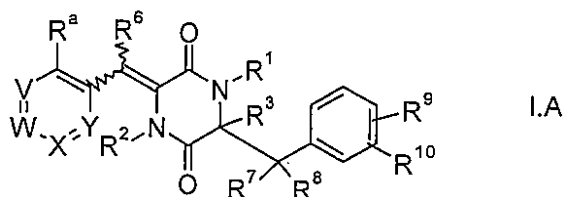
50

酸あるいはこれらのものの混合物の存在下、好ましくはトリフルオロ酢酸の存在下に行われる。後処理は、方法 A と同じように行われ得る。

【0093】

$R^4$  及び  $R^5$  が一緒になって共有結合である式 I で表される化合物（式 I . A）

【化13】



10

【0094】

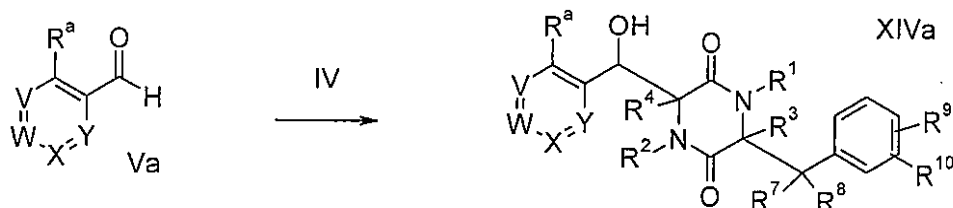
は、有機化合物合成の標準的な方法を用いてさまざまな経路によって、好ましくは以下に示す合成によって、調製され得る。

【0095】

方法 E

$R^6$  が H である式 X I V で表される化合物（式 X I V a）は、以下：

【化14】



20

【0096】

のスキームに例示されているように、アルドール反応でそのアルデヒド V a をそのピペラジン I V とカップリングさせることによって調製され得る。

【0097】

この式中、その各可変部は、式 I に対して記載されている意味を有している。式 X I V a 中、その基  $R^1$  及び  $R^2$  は、互いに独立して、アルキルカルボニル（例えばアセチル）であってもよい。この反応は、一般的には、I I a の X I V への変換に対して記載した条件と同じように、行われる。

【0098】

このアルドール反応は、また、その対応するアルドール縮合生成物、すなわち  $R^6$  が H である式 I . A で表される化合物も、直接、生じ得る。これは、その反応が、高められた温度で、また比較的長い反応時間で行われる場合、特にそうである。

【0099】

このアルデヒド V a は、市販されているか、又はアルデヒドの公知の調製方法に従って合成され得る。そのようなアルドール縮合は、J. Org. Chem. 2000, 65 (24), 8402-8405 に記載されている方法と同じように、行われ得る。

40

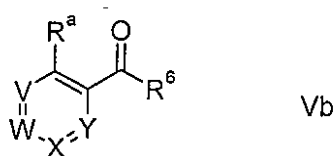
【0100】

原理的には、このアルドール反応又は縮合は、 $R^6$  が水素である必要はなく、 $C_1 \sim C_6$  -アルキル、 $C_3 \sim C_6$  -シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$  -アルケニル、 $C_3 \sim C_6$  -シクロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$  -アルキニル、 $C_3 \sim C_6$  -シクロアルキニル、フェニル、フェニル- $C_1 \sim C_6$  -アルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリル- $C_1 \sim C_6$  -アルキル；フェニル-（ $C_1 \sim C_6$  -アルコキシカルボニル）- $C_1 \sim C_6$  -アルキル又はフェニルヘテロシクリル- $C_1 \sim C_6$  -アルキル；好ましくは  $C_1 \sim C_6$  -アルキル；であってもよい化合物 I を調製するのにも用いられ得る。このケースでは、そのアルデヒド V

50

aの代わりに、そのケトンVb

【化15】



【0101】

10

(式中、 $R^6$ は、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_1 \sim C_4$ -ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ -アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ -アルキニル、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ -ハロアルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ -シクロアルケニル又は $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキニルであり、好ましくは $C_1 \sim C_6$ -アルキルである)が用いられる。

【0102】

20

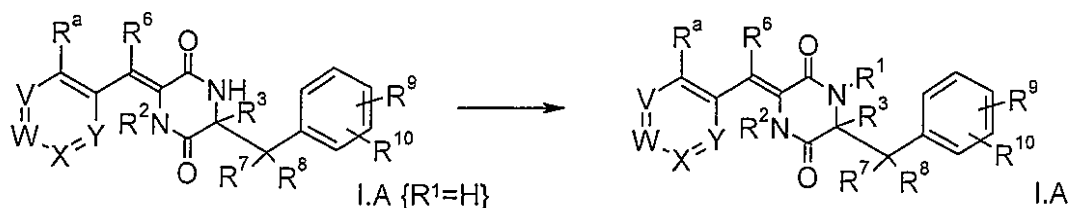
しかしながら、ここでは、特には、 $R^6$ が、その結合点に対して $\alpha$ 位のところに結合されている炭素原子が水素原子を有している基である場合は、その複雑な反応混合物の生成があり得る。さらには、多くの場合、そのアルドール化が、好ましくは、 $R^6$ がHである化合物I.Aの調製のに用いられるように、より強烈な反応条件も、必要とされる。後処理は、方法Aと同じように行われ得る。

【0103】

方法F

その方法Bは、有利なこととして、 $R^1 \neq$ 水素である化合物I.Aの調製に適している。方法Aに対して記載されている条件及び好ましい条件は、この化合物I.Aの調製にも同じように当てはまる。

【化16】



30

【0104】

有利に適している溶媒は、方法Aに対して掲載した溶媒、特にはトルエン、ジクロロメタン、テトラヒドロフラン又はジメチルホルムアミドあるいはこれらのものの混合物、好ましくはテトラヒドロフランである。

【0105】

40

好ましい実施形態では、 $R^1 = H$ である化合物Iは、塩基の存在下にアルキル化剤又はアシル化剤と反応させる。適する塩基は、方法Aに対して掲載した化合物である。この塩基は、一般的には、等モル量で用いられる。この塩基は、過剰でも、又は溶媒としても、用いられ得る。好ましい実施形態では、この塩基は、等モル量で、又は実質的に等モル量で、加えられる。さらに好ましい実施形態では、用いる塩基は、水素化ナトリウムである。後処理は、方法Aと同じように行われ得る。

【0106】

別法として、 $R^1$ 及び $R^2$ がそれぞれ水素である基 $NR^1$ 及び／又は $NR^2$ のアルキル化又はアシル化は、前駆体中でも行われ得る。つまり、例えば、 $R^1$ 及び／又は $R^2$ がHである化合物I I、I V、V I、V I I、V I I I、I X、X、X I I I、X I V、X V

50

又はX V Iは、先に述べたようにしてN－アルキル化又はN－アシル化され得る。

#### 【0107】

この反応混合物は通常の方法で後処理され、例えば水と混合し、その相を分離させ、適切であれば、その粗製生成物をクロマトグラフィー精製することによって後処理される。この中間体及び最終生成物の一部のものは無色又は若干茶色の粘稠な油状物の形態で得られ、これは、減圧下で及び適度に高められた温度で、精製される、又は、揮発成分が除去される。この中間体及び最終生成物が固形物として得られる場合は、その精製は、再結晶化又は温浸によっても行われ得る。

#### 【0108】

個々の各化合物 I が上記に記載されている経路によっては得られ得ない場合は、他の化合物 I の誘導体化によってそれらは調製され得る。

10

#### 【0109】

この合成が異性体の混合物を生じる場合は、しかしながら、一部のケースではこの個々の異性体は使用のための後処理の期間中又は施用の期間中に（例えば光、酸又は塩基の作用下で）相互変換され得るので、分離は一般には必ずしも必要とされない。そのような変換は、施用後でも、例えば植物体を処理するケースではその処理された植物体中又はその防除されるべき有害植物体中でも起こり得る。

#### 【0110】

本発明による化合物の各置換基に対して記載されている有機部分構造は、その個々の群構成員を個々に列挙するための集合用語である。例えばアルキル、ハロアルキル、アルケニル、アルキニル等の、炭化水素鎖、及び、アルコキシ、ハロアルコキシ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、N－アルキルスルホニルアミノ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アルコキシアミノ、アルキルアミノスルホニルアミノ、ジアルキルアミノスルホニルアミノ、アルケニルアミノ、アルキニルアミノ、N－（アルケニル）－N－（アルキル）アミノ、N－（アルキニル）－N－（アルキル）アミノ、N－（アルコキシ）－N－（アルキル）アミノ、N－（アルケニル）－N－（アルコキシ）アミノ又はN－（アルキニル）－N－（アルコキシ）アミノ中のアルキル部分構造及びアルケニル部分構造は、すべて、直鎖又は分岐であり得る。

20

#### 【0111】

接頭部分C<sub>n</sub>～C<sub>m</sub>－は、その炭化水素単位の炭素のそれぞれの数を指定しているものである。特段の断りがない限り、ハロゲン化された置換基は、1～5個の同じ又は異なるハロゲン原子（特にはフッ素原子又は塩素原子）を有している。

30

#### 【0112】

ハロゲンという意味は、各場合、フッ素、塩素、臭素又はヨウ素を表す。

#### 【0113】

他の意味の例は以下のとおりである。

#### 【0114】

アルキル、及び、例えばアルコキシ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、N－アルキルスルホニルアミノ、アルキルアミノスルホニルアミノ、ジアルキルアミノスルホニルアミノ、N－（アルケニル）－N－（アルキル）アミノ、N－（アルキニル）－N－（アルキル）アミノ、N－（アルコキシ）－N－（アルキル）アミノ中のそのアルキル部分構造：1個又はそれ以上の炭素原子（例えば1又は2、1～4又は1～6個の炭素原子）を有している飽和直鎖又は分岐炭化水素基、例えばC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>－アルキルで、例えばメチル、エチル、プロピル、1－メチルエチル、ブチル、1－メチルプロピル、2－メチルプロピル、1，1－ジメチルエチル、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、2，2－ジメチルプロピル、1－エチルプロピル、ヘキシル、1，1－ジメチルプロピル、1，2－ジメチルプロピル、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、1，1－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－エチルブチル、2－エチルブチル、1，1，2－トリメチ

40

50

ルプロピル、1, 2, 2-トリメチルプロピル、1-エチル-1-メチルプロピル、1-エチル-2-メチルプロピル等。本発明に従う一実施形態では、アルキルは、例えばC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>-アルキルのような、小アルキル基を表す。本発明に従うもう1つの実施形態では、アルキルは、例えばC<sub>5</sub>~C<sub>6</sub>-アルキルのような、比較的大きいアルキル基を表す。

#### 【0115】

ハロアルキル：先に言及したアルキル基で、その水素原子の一部又は全部が、例えばフッ素、塩素、臭素及び／又はヨウ素等のハロゲン原子によって置換されているもの、例えばクロロメチル、ジクロロメチル、トリクロロメチル、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロフルオロメチル、ジクロロフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、2-フルオロエチル、2-クロロエチル、2-ブロモエチル、2-ヨードエチル、2, 2-ジフルオロエチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、2-クロロ-2-フルオロエチル、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエチル、2, 2-ジクロロ-2-フルオロエチル、2, 2, 2-トリクロロエチル、ペンタフルオロエチル、2-フルオロプロピル、3-フルオロプロピル、2, 2-ジフルオロプロピル、2, 3-ジフルオロプロピル、2-クロロプロピル、3-クロロプロピル、2, 3-ジクロロプロピル、2-ブロモプロピル、3-ブロモプロピル、3, 3, 3-トリフルオロプロピル、3, 3, 3-トリクロロプロピル、2, 2, 3, 3, 3-ペンタフルオロプロピル、ヘプタフルオロプロピル、1-(フルオロメチル)-2-フルオロエチル、1-(クロロメチル)-2-クロロエチル、1-(ブロモメチル)-2-ブロモエチル、4-フルオロブチル、4-クロロブチル、4-ブロモブチル及びノナフルオロブチル。

#### 【0116】

シクロアルキル、及び、例えばシクロアルコキシ又はシクロアルキルカルボニル中のシクロアルキル部分構造：3個又はそれ以上の炭素原子（例えば3~6個の炭素環員）を有している単環式飽和炭化水素基で、例えばシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル及びシクロヘキシル。

#### 【0117】

アルケニル、及び、例えばアルケニルアミノ、アルケニルオキシ、N-(アルケニル)-N-(アルキル)アミノ、N-(アルケニル)-N-(アルコキシ)アミノ中のそのアルケニル部分構造：2個又はそれ以上の炭素原子（例えば2~4、2~6又は3~6個の炭素原子）及び任意の位置に二重結合を有しているモノ不飽和直鎖又は分岐炭化水素基で、例えばC<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>-アルケニル、例えばエテニル、1-プロペニル、2-プロペニル、1-メチルエテニル、1-ブテニル、2-ブテニル、3-ブテニル、1-メチル-1-プロペニル、2-メチル-1-プロペニル、1-メチル-2-プロペニル、2-メチル-2-プロペニル、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-メチル-1-ブテニル、2-メチル-1-ブテニル、3-メチル-1-ブテニル、1-メチル-2-ブテニル、2-メチル-2-ブテニル、3-メチル-2-ブテニル、1-メチル-3-ブテニル、2-メチル-3-ブテニル、3-メチル-3-ブテニル、1, 1-ジメチル-2-プロペニル、1, 2-ジメチル-1-プロペニル、1, 2-ジメチル-2-プロペニル、1-エチル-1-プロペニル、1-エチル-2-プロペニル、1-ヘキセニル、2-ヘキセニル、3-ヘキセニル、4-ヘキセニル、5-ヘキセニル、1-メチル-1-ペンテニル、2-メチル-1-ペンテニル、3-メチル-1-ペンテニル、4-メチル-1-ペンテニル、1-メチル-2-ペンテニル、2-メチル-2-ペンテニル、3-メチル-2-ペンテニル、4-メチル-2-ペンテニル、1-メチル-3-ペンテニル、2-メチル-3-ペンテニル、3-メチル-3-ペンテニル、4-メチル-3-ペンテニル、1-メチル-4-ペンテニル、2-メチル-4-ペンテニル、3-メチル-4-ペンテニル、4-メチル-4-ペンテニル、1, 1-ジメチル-2-ブテニル、1, 1-ジメチル-3-ブテニル、1, 2-ジメチル-1-ブテニル、1, 2-ジメチル-2-ブテニル、1, 2-ジメチル-3-ブテニル、1, 3-ジメチル-1-ブテニル、1, 3-ジメチル-2-ブテニル、1, 3-ジメチル-3-ブテニル、2, 2-ジメチル-3-ブテニル、2, 3-ジメチル-1-ブテニル、2, 3-ジメチル-2-ブテニル、2, 3-ジ

メチル-3-ブテニル、3, 3-ジメチル-1-ブテニル、3, 3-ジメチル-2-ブテニル、1-エチル-1-ブテニル、1-エチル-2-ブテニル、1-エチル-3-ブテニル、2-エチル-1-ブテニル、2-エチル-2-ブテニル、2-エチル-3-ブテニル、1, 1, 2-トリメチル-2-プロペニル、1-エチル-1-メチル-2-プロペニル、1-エチル-2-メチル-1-プロペニル、1-エチル-2-メチル-2-プロペニル等。

#### 【0118】

シクロアルケニル：3～6（好ましくは5又は6）個の炭素環員を有している単環式モノ不飽和炭化水素基で、例えばシクロペンテン-1-イル、シクロペンテン-3-イル、シクロヘキセン-1-イル、シクロヘキセン-3-イル、シクロヘキセン-4-イル。

10

#### 【0119】

アルキニル、及び、例えばアルキニルオキシ、アルキニルアミノ、N-（アルキニル）-N-（アルキル）アミノ又はN-（アルキニル）-N-（アルコキシ）アミノ中のそのアルキニル部分構造：2個又はそれ以上の炭素原子（例えば2～4、2～6又は3～6個の炭素原子）及び任意の位置に三重結合を有している直鎖又は分岐炭化水素基で、例えばC<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>-アルキニル、例えばエチニル、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-2-プロピニル、1-ペンチニル、2-ペンチニル、3-ペンチニル、4-ペンチニル、1-メチル-2-ブチニル、1-メチル-3-ブチニル、2-メチル-3-ブチニル、3-メチル-1-ブチニル、1, 1-ジメチル-2-プロピニル、1-エチル-2-プロピニル、1-ヘキシニル、2-ヘキシニル、3-ヘキシニル、4-ヘキシニル、5-ヘキシニル、1-メチル-2-ペンチニル、1-メチル-3-ペンチニル、1-メチル-4-ペンチニル、2-メチル-3-ペンチニル、2-メチル-4-ペンチニル、3-メチル-1-ペンチニル、3-メチル-4-ペンチニル、4-メチル-1-ペンチニル、4-メチル-2-ペンチニル、1, 1-ジメチル-2-ブチニル、1, 1-ジメチル-3-ブチニル、1, 2-ジメチル-3-ブチニル、2, 2-ジメチル-3-ブチニル、3, 3-ジメチル-1-ブチニル、1-エチル-2-ブチニル、1-エチル-3-ブチニル、2-エチル-3-ブチニル、1-エチル-1-メチル-2-プロピニル等。

20

#### 【0120】

アルコキシ：酸素原子を介して結合されている先に定義したアルキルで、例えばメトキシ、エトキシ、n-プロポキシ、1-メチルエトキシ、ブトキシ、1-メチルプロポキシ、2-メチルプロポキシ又は1, 1-ジメチルエトキシ、ペントキシ、1-メチルブトキシ、2-メチルブトキシ、3-メチルブトキシ、1, 1-ジメチルプロポキシ、1, 2-ジメチルプロポキシ、2, 2-ジメチルプロポキシ、1-エチルプロポキシ、ヘキシルオキシ、1-メチルペントキシ、2-メチルペントキシ、3-メチルペントキシ、4-メチルペントキシ、1, 1-ジメチルブトキシ、1, 2-ジメチルブトキシ、1, 3-ジメチルブトキシ、2, 2-ジメチルブトキシ、2, 3-ジメチルブトキシ、3, 3-ジメチルブトキシ、1-エチルブトキシ、2-エチルブトキシ、1, 1, 2-トリメチルプロポキシ、1, 2, 2-トリメチルプロポキシ、1-エチル-1-メチルプロポキシ又は1-エチル-2-メチルプロポキシ。

30

40

#### 【0121】

5もしくは6員ヘテロ環：5もしくは6個の環原子を有する環式基で、1, 2, 3又は4個の環原子が、O、S及びNからなる群から選択されるヘテロ原子であり、その環式基が飽和、部分飽和又は芳香族である、環式基。ヘテロ環式基の例は、以下である。

#### 【0122】

炭素を介して結合されている5員飽和環、例えばテトラヒドロフラン-2-イル、テトラヒドロフラン-3-イル、テトラヒドロチエン-2-イル、テトラヒドロチエン-3-イル、テトラヒドロピロール-2-イル、テトラヒドロピロール-3-イル、テトラヒドロピラゾール-3-イル、テトラヒドロピラゾール-4-イル、テトラヒドロイソオキサゾール-3-イル、テトラヒドロイソオキサゾール

50

ー４－イル、テトラヒドロイソオキサゾールー５－イル、１，２－オキサチオランー３－イル、１，２－オキサチオランー４－イル、１，２－オキサチオランー５－イル、テトラヒドロイソチアゾールー３－イル、テトラヒドロイソチアゾールー４－イル、テトラヒドロイソチアゾールー５－イル、１，２－ジチオランー３－イル、１，２－ジチオランー４－イル、テトラヒドロイミダゾールー２－イル、テトラヒドロイミダゾールー４－イル、テトラヒドロオキサゾールー２－イル、テトラヒドロオキサゾールー４－イル、テトラヒドロオキサゾールー５－イル、テトラヒドロチアゾールー２－イル、テトラヒドロチアゾールー４－イル、テトラヒドロチアゾールー５－イル、１，３－ジオキサランー２－イル、１，３－ジオキサランー４－イル、１，３－オキサチオランー２－イル、１，３－オキサチオランー４－イル、１，３－オキサチオランー５－イル、１，３－ジチオランー２－イル、１，３－ジチオランー４－イル、１，３，２－ジオキサチオランー４－イル；

10

炭素を介して結合されている６員飽和環、例えば、

テトラヒドロピランー２－イル、テトラヒドロピランー３－イル、テトラヒドロピランー４－イル、ピペリジンー２－イル、ピペリジンー３－イル、ピペリジンー４－イル、テトラヒドロチオピランー２－イル、テトラヒドロチオピランー３－イル、テトラヒドロチオピランー４－イル、１，３－ジオキササンー２－イル、１，３－ジオキササンー４－イル、１，３－ジオキササンー５－イル、１，４－ジオキササンー２－イル、１，３－ジチアサンー２－イル、１，３－ジチアサンー４－イル、１，３－ジチアサンー５－イル、１，４－ジチアサンー２－イル、１，３－オキサチアサンー２－イル、１，３－オキサチアサンー４－イル、１，３－オキサチアサンー５－イル、１，３－オキサチアサンー６－イル、１，４－オキサチアサンー２－イル、１，４－オキサチアサンー３－イル、１，２－ジチアサンー３－イル、１，２－ジチアサンー４－イル、ヘキサヒドロピリミジンー２－イル、ヘキサヒドロピリミジンー４－イル、ヘキサヒドロピリミジンー５－イル、ヘキサヒドロピラジンー２－イル、ヘキサヒドロピリダジンー３－イル、ヘキサヒドロピリダジンー４－イル、テトラヒドロー１，３－オキサジンー２－イル、テトラヒドロー１，３－オキサジンー４－イル、テトラヒドロー１，３－オキサジンー５－イル、テトラヒドロー１，３－オキサジンー６－イル、テトラヒドロー１，３－チアジンー２－イル、テトラヒドロー１，３－チアジンー４－イル、テトラヒドロー１，３－チアジンー５－イル、テトラヒドロー１，３－チアジンー６－イル、テトラヒドロー１，４－チアジンー２－イル、テトラヒドロー１，４－チアジンー３－イル、テトラヒドロー１，４－オキサジンー２－イル、テトラヒドロー１，４－オキサジンー３－イル、テトラヒドロー１，２－オキサジンー３－イル、テトラヒドロー１，２－オキサジンー４－イル、テトラヒドロー１，２－オキサジンー５－イル、テトラヒドロー１，２－オキサジンー６－イル；

20

30

窒素を介して結合されている５員飽和環、例えば、

テトラヒドロピロールー１－イル、テトラヒドロピラゾールー１－イル、テトラヒドロイソオキサゾールー２－イル、テトラヒドロイソチアゾールー２－イル、テトラヒドロイミダゾールー１－イル、テトラヒドロオキサゾールー３－イル、テトラヒドロチアゾールー３－イル；

窒素を介して結合されている６員飽和環、例えば、

ピペリジンー１－イル、ヘキサヒドロピリミジンー１－イル、ヘキサヒドロピラジンー１－イル、ヘキサヒドロピリダジンー１－イル、テトラヒドロー１，３－オキサジンー３－イル、テトラヒドロー１，３－チアジンー３－イル、テトラヒドロー１，４－チアジンー４－イル、テトラヒドロー１，４－オキサジンー４－イル、テトラヒドロー１，２－オキサジンー２－イル；

40

炭素を介して結合されている５員部分不飽和環、例えば、

２，３－ジヒドロフランー２－イル、２，３－ジヒドロフランー３－イル、２，５－ジヒドロフランー２－イル、２，５－ジヒドロフランー３－イル、４，５－ジヒドロフランー２－イル、４，５－ジヒドロフランー３－イル、２，３－ジヒドロチエンー２－イル、２，３－ジヒドロチエンー３－イル、２，５－ジヒドロチエンー２－イル、２，５－ジヒドロチエンー３－イル、４，５－ジヒドロチエンー２－イル、４，５－ジヒドロチエンー３

50

ーイル、2, 3-ジヒドロ-1H-ピロール-2-イル、2, 3-ジヒドロ-1H-ピ  
 ール-3-イル、2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-2-イル、2, 5-ジヒドロ-1  
 H-ピロール-3-イル、4, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-2-イル、4, 5-ジヒ  
 ドロ-1H-ピロール-3-イル、3, 4-ジヒドロ-2H-ピロール-2-イル、3,  
 4-ジヒドロ-2H-ピロール-3-イル、3, 4-ジヒドロ-5H-ピロール-2-イ  
 ル、3, 4-ジヒドロ-5H-ピロール-3-イル、4, 5-ジヒドロ-1H-ピラゾ  
 ール-3-イル、4, 5-ジヒドロ-1H-ピラゾール-4-イル、4, 5-ジヒドロ-1  
 H-ピラゾール-5-イル、2, 5-ジヒドロ-1H-ピラゾール-3-イル、2, 5-  
 ジヒドロ-1H-ピラゾール-4-イル、2, 5-ジヒドロ-1H-ピラゾール-5-イ  
 ル、4, 5-ジヒドロイソオキサゾール-3-イル、4, 5-ジヒドロイソオキサゾ  
 ール-4-イル、4, 5-ジヒドロイソオキサゾール-5-イル、2, 5-ジヒドロイソオキ  
 サゾール-3-イル、2, 5-ジヒドロイソオキサゾール-4-イル、2, 5-ジヒドロ  
 イソオキサゾール-5-イル、2, 3-ジヒドロイソオキサゾール-3-イル、2, 3-  
 ジヒドロイソオキサゾール-4-イル、2, 3-ジヒドロイソオキサゾール-5-イル、  
 4, 5-ジヒドロイソチアゾール-3-イル、4, 5-ジヒドロイソチアゾール-4-イ  
 ル、4, 5-ジヒドロイソチアゾール-5-イル、2, 5-ジヒドロイソチアゾール-3  
 -イル、2, 5-ジヒドロイソチアゾール-4-イル、2, 5-ジヒドロイソチアゾ  
 ール-5-イル、2, 3-ジヒドロイソチアゾール-3-イル、2, 3-ジヒドロイソチア  
 ズール-4-イル、2, 3-ジヒドロイソチアゾール-5-イル、 $\Delta^3-1$ , 2-ジチオ1  
 -3-イル、 $\Delta^3-1$ , 2-ジチオ1-4-イル、 $\Delta^3-1$ , 2-ジチオ1-5-イル、  
 4, 5-ジヒドロ-1H-イミダゾール-2-イル、4, 5-ジヒドロ-1H-イミダ  
 ズール-4-イル、4, 5-ジヒドロ-1H-イミダゾール-5-イル、2, 5-ジヒドロ  
 -1H-イミダゾール-2-イル、2, 5-ジヒドロ-1H-イミダゾール-4-イル、  
 2, 5-ジヒドロ-1H-イミダゾール-5-イル、2, 3-ジヒドロ-1H-イミダ  
 ズール-2-イル、2, 3-ジヒドロ-1H-イミダゾール-4-イル、4, 5-ジヒドロ  
 オキサゾール-2-イル、4, 5-ジヒドロオキサゾール-4-イル、4, 5-ジヒドロ  
 オキサゾール-5-イル、2, 5-ジヒドロオキサゾール-2-イル、2, 5-ジヒドロ  
 オキサゾール-4-イル、2, 5-ジヒドロオキサゾール-5-イル、2, 3-ジヒドロ  
 オキサゾール-2-イル、2, 3-ジヒドロオキサゾール-4-イル、2, 3-ジヒドロ  
 オキサゾール-5-イル、4, 5-ジヒドロチアゾール-2-イル、4, 5-ジヒドロ  
 チアゾール-4-イル、4, 5-ジヒドロチアゾール-5-イル、2, 5-ジヒドロチア  
 ズール-2-イル、2, 5-ジヒドロチアゾール-4-イル、2, 5-ジヒドロチア  
 ズール-5-イル、2, 3-ジヒドロチアゾール-2-イル、2, 3-ジヒドロチア  
 ズール-4-イル、2, 3-ジヒドロチアゾール-5-イル、1, 3-ジオキサール-2-イル、  
 1, 3-ジオキサール-4-イル、1, 3-ジチオ1-2-イル、1, 3-ジチオ1-4  
 -イル、1, 3-オキサチオ1-2-イル、1, 3-オキサチオ1-4-イル、1, 3-  
 オキサチオ1-5-イル；

炭素を介して結合されている6員部分不飽和環、例えば、

2H-3, 4-ジヒドロピラン-6-イル、2H-3, 4-ジヒドロピラン-5-イル、  
 2H-3, 4-ジヒドロピラン-4-イル、2H-3, 4-ジヒドロピラン-3-イル、  
 2H-3, 4-ジヒドロピラン-2-イル、2H-3, 4-ジヒドロチオピラン-6-イ  
 ル、2H-3, 4-ジヒドロチオピラン-5-イル、2H-3, 4-ジヒドロチオピラン  
 -4-イル、2H-3, 4-ジヒドロチオピラン-3-イル、2H-3, 4-ジヒドロチ  
 オピラン-2-イル、1, 2, 3, 4-テトラヒドロピリジン-6-イル、1, 2, 3,  
 4-テトラヒドロピリジン-5-イル、1, 2, 3, 4-テトラヒドロピリジン-4-イ  
 ル、1, 2, 3, 4-テトラヒドロピリジン-3-イル、1, 2, 3, 4-テトラヒドロ  
 ピリジン-2-イル、2H-5, 6-ジヒドロピラン-2-イル、2H-5, 6-ジヒド  
 ロピラン-3-イル、2H-5, 6-ジヒドロピラン-4-イル、2H-5, 6-ジヒド  
 ロピラン-5-イル、2H-5, 6-ジヒドロピラン-6-イル、2H-5, 6-ジヒド  
 ロチオピラン-2-イル、2H-5, 6-ジヒドロチオピラン-3-イル、2H-5, 6

10

20

30

40

50

ー ジヒドロチオピランー 4-イル、2H-5, 6-ジヒドロチオピランー 5-イル、2H-5, 6-ジヒドロチオピランー 6-イル、1, 2, 5, 6-テトラヒドロピリジンー 2-イル、1, 2, 5, 6-テトラヒドロピリジンー 3-イル、1, 2, 5, 6-テトラヒドロピリジンー 4-イル、1, 2, 5, 6-テトラヒドロピリジンー 5-イル、1, 2, 5, 6-テトラヒドロピリジンー 6-イル、2, 3, 4, 5-テトラヒドロピリジンー 2-イル、2, 3, 4, 5-テトラヒドロピリジンー 3-イル、2, 3, 4, 5-テトラヒドロピリジンー 4-イル、2, 3, 4, 5-テトラヒドロピリジンー 5-イル、2, 3, 4, 5-テトラヒドロピリジンー 6-イル、4H-ピランー 2-イル、4H-ピランー 3-イル、4H-ピランー 4-イル、4H-チオピランー 2-イル、4H-チオピランー 3-イル、4H-チオピランー 4-イル、1, 4-ジヒドロピリジンー 2-イル、1, 4-ジヒドロピリジンー 3-イル、1, 4-ジヒドロピリジンー 4-イル、2H-ピランー 2-イル、2H-ピランー 3-イル、2H-ピランー 4-イル、2H-ピランー 5-イル、2H-ピランー 6-イル、2H-チオピランー 2-イル、2H-チオピランー 3-イル、2H-チオピランー 4-イル、2H-チオピランー 5-イル、2H-チオピランー 6-イル、1, 2-ジヒドロピリジンー 2-イル、1, 2-ジヒドロピリジンー 3-イル、1, 2-ジヒドロピリジンー 4-イル、1, 2-ジヒドロピリジンー 5-イル、1, 2-ジヒドロピリジンー 6-イル、3, 4-ジヒドロピリジンー 2-イル、3, 4-ジヒドロピリジンー 3-イル、3, 4-ジヒドロピリジンー 4-イル、3, 4-ジヒドロピリジンー 5-イル、3, 4-ジヒドロピリジンー 6-イル、2, 5-ジヒドロピリジンー 2-イル、2, 5-ジヒドロピリジンー 3-イル、2, 5-ジヒドロピリジンー 4-イル、2, 5-ジヒドロピリジンー 5-イル、2, 5-ジヒドロピリジンー 6-イル、2, 3-ジヒドロピリジンー 2-イル、2, 3-ジヒドロピリジンー 3-イル、2, 3-ジヒドロピリジンー 4-イル、2, 3-ジヒドロピリジンー 5-イル、2, 3-ジヒドロピリジンー 6-イル、2H-5, 6-ジヒドロ-1, 2-オキサジン-3-イル、2H-5, 6-ジヒドロ-1, 2-オキサジン-4-イル、2H-5, 6-ジヒドロ-1, 2-オキサジン-5-イル、2H-5, 6-ジヒドロ-1, 2-オキサジン-6-イル、2H-5, 6-ジヒドロ-1, 2-チアジン-3-イル、2H-5, 6-ジヒドロ-1, 2-チアジン-4-イル、2H-5, 6-ジヒドロ-1, 2-チアジン-5-イル、2H-5, 6-ジヒドロ-1, 2-チアジン-6-イル、4H-5, 6-ジヒドロ-1, 2-オキサジン-3-イル、4H-5, 6-ジヒドロ-1, 2-オキサジン-4-イル、4H-5, 6-ジヒドロ-1, 2-オキサジン-5-イル、4H-5, 6-ジヒドロ-1, 2-オキサジン-6-イル、4H-5, 6-ジヒドロ-1, 2-チアジン-3-イル、4H-5, 6-ジヒドロ-1, 2-チアジン-4-イル、4H-5, 6-ジヒドロ-1, 2-チアジン-5-イル、4H-5, 6-ジヒドロ-1, 2-チアジン-6-イル、2H-3, 6-ジヒドロ-1, 2-オキサジン-3-イル、2H-3, 6-ジヒドロ-1, 2-オキサジン-4-イル、2H-3, 6-ジヒドロ-1, 2-オキサジン-5-イル、2H-3, 6-ジヒドロ-1, 2-オキサジン-6-イル、2H-3, 6-ジヒドロ-1, 2-チアジン-3-イル、2H-3, 6-ジヒドロ-1, 2-チアジン-4-イル、2H-3, 6-ジヒドロ-1, 2-チアジン-5-イル、2H-3, 6-ジヒドロ-1, 2-チアジン-6-イル、2, 3, 4, 5-テトラヒドロピリダジン-3-イル、2, 3, 4, 5-テトラヒドロピリダジン-4-イル、2, 3, 4, 5-テトラヒドロピリダジン-5-イル、2, 3, 4, 5-テトラヒドロピリダジン-6-イル、3, 4, 5, 6-テトラヒドロピリダジン-3-イル、3, 4, 5, 6-テトラヒドロピリダジン-4-イル、1, 2, 5, 6-テトラヒドロピリダジン-3-イル、1, 2, 5, 6-テトラヒドロピリダジン-4-イル、1, 2, 5, 6-テトラヒドロピリダジン-5-イル、1, 2, 5

, 6-テトラヒドロピリダジン-6-イル、1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリダジン-3-イル、1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリダジン-4-イル、4H-5, 6-ジヒドロ-1, 3-オキサジン-2-イル、4H-5, 6-ジヒドロ-1, 3-オキサジン-4-イル、4H-5, 6-ジヒドロ-1, 3-オキサジン-5-イル、4H-5, 6-ジヒドロ-1, 3-オキサジン-6-イル、4H-5, 6-ジヒドロ-1, 3-チアジン-2-イル、4H-5, 6-ジヒドロ-1, 3-チアジン-4-イル、4H-5, 6-ジヒドロ-1, 3-チアジン-5-イル、4H-5, 6-ジヒドロ-1, 3-チアジン-6-イル、3, 4, 5, 6-テトラヒドロピリミジン-2-イル、3, 4, 5, 6-テトラヒドロピリミジン-4-イル、3, 4, 5, 6-テトラヒドロピリミジン-5-イル、3, 4, 5, 6-テトラヒドロピリミジン-6-イル、1, 2, 3, 4-テトラヒドロピラジン-2-イル、1, 2, 3, 4-テトラヒドロピラジン-5-イル、1, 2, 3, 4-テトラヒドロピリミジン-2-イル、1, 2, 3, 4-テトラヒドロピリミジン-4-イル、1, 2, 3, 4-テトラヒドロピリミジン-5-イル、1, 2, 3, 4-テトラヒドロピリミジン-6-イル、2, 3-ジヒドロ-1, 4-チアジン-2-イル、2, 3-ジヒドロ-1, 4-チアジン-3-イル、2, 3-ジヒドロ-1, 4-チアジン-5-イル、2, 3-ジヒドロ-1, 4-チアジン-6-イル、2H-1, 2-オキサジン-3-イル、2H-1, 2-オキサジン-4-イル、2H-1, 2-オキサジン-5-イル、2H-1, 2-オキサジン-6-イル、2H-1, 2-チアジン-3-イル、2H-1, 2-チアジン-4-イル、2H-1, 2-チアジン-5-イル、2H-1, 2-チアジン-6-イル、4H-1, 2-オキサジン-3-イル、4H-1, 2-オキサジン-4-イル、4H-1, 2-オキサジン-5-イル、4H-1, 2-オキサジン-6-イル、4H-1, 2-チアジン-3-イル、4H-1, 2-チアジン-4-イル、4H-1, 2-チアジン-5-イル、4H-1, 2-チアジン-6-イル、6H-1, 2-オキサジン-3-イル、6H-1, 2-オキサジン-4-イル、6H-1, 2-オキサジン-5-イル、6H-1, 2-オキサジン-6-イル、6H-1, 2-チアジン-3-イル、6H-1, 2-チアジン-4-イル、6H-1, 2-チアジン-5-イル、6H-1, 2-チアジン-6-イル、2H-1, 3-オキサジン-2-イル、2H-1, 3-オキサジン-4-イル、2H-1, 3-オキサジン-5-イル、2H-1, 3-オキサジン-6-イル、2H-1, 3-チアジン-2-イル、2H-1, 3-チアジン-4-イル、2H-1, 3-チアジン-5-イル、2H-1, 3-チアジン-6-イル、4H-1, 3-オキサジン-2-イル、4H-1, 3-オキサジン-4-イル、4H-1, 3-オキサジン-5-イル、4H-1, 3-オキサジン-6-イル、4H-1, 3-チアジン-2-イル、4H-1, 3-チアジン-4-イル、4H-1, 3-チアジン-5-イル、4H-1, 3-チアジン-6-イル、6H-1, 3-オキサジン-2-イル、6H-1, 3-オキサジン-4-イル、6H-1, 3-オキサジン-5-イル、6H-1, 3-オキサジン-6-イル、6H-1, 3-チアジン-2-イル、6H-1, 3-チアジン-4-イル、6H-1, 3-チアジン-5-イル、6H-1, 3-チアジン-6-イル、2H-1, 4-オキサジン-2-イル、2H-1, 4-オキサジン-3-イル、2H-1, 4-オキサジン-5-イル、2H-1, 4-オキサジン-6-イル、2H-1, 4-チアジン-2-イル、2H-1, 4-チアジン-3-イル、1, 4-ジヒドロピリダジン-3-イル、1, 4-ジヒドロピリダジン-4-イル、1, 4-ジヒドロピリダジン-5-イル、1, 4-ジヒドロピリダジン-6-イル、1, 4-ジヒドロピラジン-2-イル、1, 2-ジヒドロピラジン-2-イル、1, 2-ジヒドロピラジン-3-イル、1, 2-ジヒドロピラジン-5-イル、1, 2-ジヒドロピラジン-6-イル、1, 4-ジヒドロピリミジン-2-イル、1, 4-ジヒドロピリミジン-4-イル、1, 4-ジヒドロピリミジン-5-イル、1, 4-ジヒドロピリミジン-6-イル、3, 4-ジヒドロピリミジン-2-イル、3, 4-ジヒドロピリミジン-4-イル、3, 4-ジヒドロピリミジン-5-イル又は3, 4-ジヒドロピリミジン-6-イル；

窒素を介して結合されている 5 員部分不飽和環、例えば、

2, 3-ジヒドロ-1H-ピロール-1-イル、2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-1-イル、4, 5-ジヒドロ-1H-ピラゾール-1-イル、2, 5-ジヒドロ-1H-ピラゾール-1-イル、2, 3-ジヒドロ-1H-ピラゾール-1-イル、2, 5-ジヒドロイソオキサゾール-2-イル、2, 3-ジヒドロイソオキサゾール-2-イル、2, 5-ジヒドロイソチアゾール-2-イル、2, 3-ジヒドロイソオキサゾール-2-イル、4, 5-ジヒドロ-1H-イミダゾール-1-イル、2, 5-ジヒドロ-1H-イミダゾール-1-イル、2, 3-ジヒドロ-1H-イミダゾール-1-イル、2, 3-ジヒドロオキサゾール-3-イル、2, 3-ジヒドロチアゾール-3-イル、1, 2, 4- $\Delta^4$ -オキサジアゾリン-2-イル、1, 2, 4- $\Delta^2$ -オキサジアゾリン-4-イル、1, 2, 4- $\Delta^3$ -オキサジアゾリン-2-イル、1, 3, 4- $\Delta^2$ -オキサジアゾリン-4-イル、1, 2, 4- $\Delta^5$ -チアジアゾリン-2-イル、1, 2, 4- $\Delta^3$ -チアジアゾリン-2-イル、1, 2, 4- $\Delta^2$ -チアジアゾリン-4-イル、1, 3, 4- $\Delta^2$ -チアジアゾリン-4-イル、1, 2, 3- $\Delta^2$ -トリアゾリン-1-イル、1, 2, 4- $\Delta^2$ -トリアゾリン-1-イル、1, 2, 4- $\Delta^2$ -トリアゾリン-4-イル、1, 2, 4- $\Delta^3$ -トリアゾリン-1-イル、1, 2, 4- $\Delta^1$ -トリアゾリン-4-イル；

10

窒素を介して結合されている 6 員部分不飽和環、例えば、

1, 2, 3, 4-テトラヒドロピリジン-1-イル、1, 2, 5, 6-テトラヒドロピリジン-1-イル、1, 4-ジヒドロピリジン-1-イル、1, 2-ジヒドロピリジン-1-イル、2H-5, 6-ジヒドロ-1, 2-オキサジン-2-イル、2H-5, 6-ジヒドロ-1, 2-チアジン-2-イル、2H-3, 6-ジヒドロ-1, 2-オキサジン-2-イル、2H-3, 6-ジヒドロ-1, 2-チアジン-2-イル、2H-3, 4-ジヒドロ-1, 2-オキサジン-2-イル、2H-3, 4-ジヒドロ-1, 2-チアジン-2-イル、2, 3, 4, 5-テトラヒドロピリダジン-2-イル、1, 2, 5, 6-テトラヒドロピリダジン-1-イル、1, 2, 5, 6-テトラヒドロピリダジン-2-イル、1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリダジン-1-イル、3, 4, 5, 6-テトラヒドロピリミジン-3-イル、1, 2, 3, 4-テトラヒドロピラジン-1-イル、1, 2, 3, 4-テトラヒドロピリミジン-1-イル、1, 2, 3, 4-テトラヒドロピリミジン-3-イル、2, 3-ジヒドロ-1, 4-チアジン-4-イル、2H-1, 2-オキサジン-2-イル、2H-1, 2-チアジン-2-イル、4H-1, 4-オキサジン-4-イル、4H-1, 4-チアジン-4-イル、1, 4-ジヒドロピリダジン-1-イル、1, 4-ジヒドロピラジン-1-イル、1, 2-ジヒドロピラジン-1-イル、1, 4-ジヒドロピリミジン-1-イル又は 3, 4-ジヒドロピリミジン-3-イル；

20

30

炭素を介して結合されている 5 員ヘテロ芳香族環、例えば、

2-フリル、3-フリル、2-チエニル、3-チエニル、ピロール-2-イル、ピロール-3-イル、ピラゾール-3-イル、ピラゾール-4-イル、イソオキサゾール-3-イル、イソオキサゾール-4-イル、イソオキサゾール-5-イル、イソチアゾール-3-イル、イソチアゾール-4-イル、イソチアゾール-5-イル、イミダゾール-2-イル、イミダゾール-4-イル、オキサゾール-2-イル、オキサゾール-4-イル、オキサゾール-5-イル、チアゾール-2-イル、チアゾール-4-イル、チアゾール-5-イル、1, 2, 3-オキサジアゾール-4-イル、1, 2, 3-オキサジアゾール-5-イル、1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル、1, 2, 4-オキサジアゾール-5-イル、1, 3, 4-オキサジアゾール-2-イル、1, 2, 3-チアジアゾール-4-イル、1, 2, 3-チアジアゾール-5-イル、1, 2, 4-チアジアゾール-3-イル、1, 2, 4-チアジアゾール-5-イル、1, 3, 4-チアジアゾリル-2-イル、1, 2, 3-トリアゾール-4-イル、1, 2, 4-トリアゾール-3-イル、(1H)-テトラゾール-5-イル及び(2H)-テトラゾール-5-イル；

40

炭素を介して結合されている 6 員ヘテロ芳香族環、例えば、

ピリジン-2-イル、ピリジン-3-イル、ピリジン-4-イル、ピリダジン-3-イル、ピリダジン-4-イル、ピリミジン-2-イル、ピリミジン-4-イル、ピリミジン-

50

5-イル、ピラジン-2-イル、1, 3, 5-トリアジン-2-イル、1, 2, 4-トリアジン-3-イル、1, 2, 4-トリアジン-5-イル及び1, 2, 4-トリアジン-6-イル；

窒素を介して結合されている5員ヘテロ芳香族環、例えば、ピロール-1-イル、ピラゾール-1-イル、イミダゾール-1-イル、1, 2, 3-トリアゾール-1-イル、1, 2, 4-トリアゾール-1-イル、(1H)-テトラゾール-1-イル及び(2H)-テトラゾール-2-イル。

#### 【0123】

先に言及したヘテロ環は、指定した方式で、置換され得る。先に言及したヘテロ環では、イオウ原子は、S=O又はS(=O)<sub>2</sub>に酸化され得る。

10

#### 【0124】

その基R<sup>3</sup>及び／又はR<sup>4</sup>を有している炭素原子のところでは、式Iで表される化合物は、キラル中心を有している。加えて、その置換パターンに応じて、1つ又はそれ以上のさらなるキラル中心をそれらのものは含有し得る。したがって、本発明による化合物は、純粋エナンチオマー又はジアステレオマーとして、又はエナンチオマー又はジアステレオマー混合物として、存在し得る。本発明は、純粋エナンチオマー又はジアステレオマーならびにこれらのものの混合物のいずれもを提供するものである。

#### 【0125】

式Iの化合物は、農薬として有用なその塩の形態でも存在し得るものであって、その塩の種類は一般には重要でない。適する塩は、一般的には、その化合物Iの除草活性に対してカチオン及びアニオンがそれぞれ悪い影響を有していない、そのようなカチオンの塩又はそのような酸の酸付加塩である。

20

#### 【0126】

適するカチオンは、特には、アルカリ金属（好ましくはリチウム、ナトリウム又はカリウム）のイオン、アルカリ土類金属（好ましくはカルシウム又はマグネシウム）のイオン、及び遷移金属（好ましくはマンガン、銅、亜鉛又は鉄）のイオンである。用いられ得るもう1つのカチオンはアンモニウムであり、この場合、望まれるなら、1～4個の水素原子は、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>-アルキル、ヒドロキシ～C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>-アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>-アルコキシ～C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>-アルキル、ヒドロキシ～C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>-アルコキシ～C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>-アルキル、フェニル又はベンジルによって置き換えられていてよく、好ましくはアンモニウム、ジメチルアンモニウム、ジイソプロピルアンモニウム、テトラメチルアンモニウム、テトラブチルアンモニウム、2-(2-ヒドロキシエト-1-オキシ)エト-1-イルアンモニウム、ジ(2-ヒドロキシエト-1-イル)アンモニウム、トリメチルベンジルアンモニウムである。また、ホスホニウムイオン、スルホニウムイオン（好ましくはトリ(C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>-アルキル)スルホニウム)又はスルホキソニウムイオン（好ましくはトリ(C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>-アルキル)スルホキソニウム)も適している。

30

#### 【0127】

適する酸付加塩のアニオンは、基本的には、クロリド、ブロミド、フルオリド、硫酸水素、硫酸、リン酸二水素、リン酸水素、硝酸、重炭酸、炭酸、ヘキサフルオロケイ酸、ヘキサフルオロリン酸、安息香酸、さらにはアルカン酸のアニオン、好ましくはギ酸、酢酸、プロピオン酸又は酪酸、である。

40

#### 【0128】

その可変部に関しては、その中間体の特に好ましい実施形態は、式Iの基の可変部に対応している。

#### 【0129】

特定の実施形態では、式Iで表される化合物の可変部は以下に示される意味を有していて、そのような意味は、それ自体及び互いの組み合わせのいずれでも、式Iで表される化合物の特定の実施形態である。

#### 【0130】

可変部V、W、X及びYのうち、0～3個の基は、好ましくは窒素である。

50

## 【0131】

好ましい実施形態では、その基 V、W、X、Y を含んでいる 6 員環は、ピリジン、ピリミジン及びピラジン（特にピリジン）のような置換されたヘテロ芳香族である。

## 【0132】

さらなる特に好ましい実施形態は、フェニルに関する。

## 【0133】

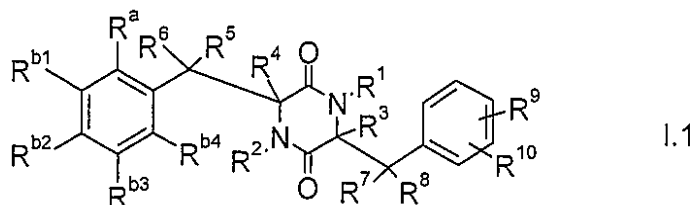
式 I で表される化合物の一実施形態では、V、W、X 及び Y は C - R<sup>b</sup> である。

## 【0134】

これらの化合物は、次の式 I. 1

## 【化17】

10



I.1

## 【0135】

（式中、その各基 R<sup>b1</sup>、R<sup>b2</sup>、R<sup>b3</sup> 及び R<sup>b4</sup> はそれぞれ基 R<sup>b</sup> に対応しており、  
好ましくは以下のとおりの意味： 20

R<sup>b1</sup> は、H、アルキル、アルコキシ、特に H、F、CF<sub>3</sub> 又は OCH<sub>3</sub> である；

R<sup>b2</sup> は、H、ハロゲン、アルキル、ハロメチル、特に H、Cl、CF<sub>3</sub> 又は CH<sub>3</sub> である；

R<sup>b3</sup> は、ハロゲン、CH<sub>3</sub> 又は OCH<sub>3</sub>、特に F、CH<sub>3</sub> 又は OCH<sub>3</sub> である；

R<sup>b4</sup> は、H、ハロゲン、CH<sub>3</sub> 又は OCH<sub>3</sub>、特に H、F、Cl、Br、CH<sub>3</sub> 又は OCH<sub>3</sub> である；

を有している）

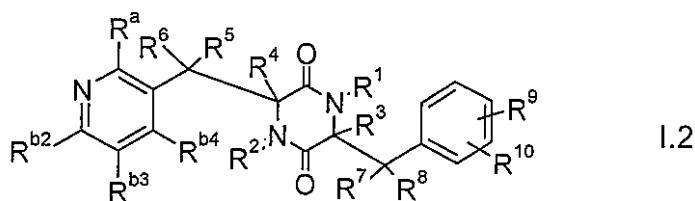
に対応している。

## 【0136】

30

式 I で表される化合物のさらなる実施形態では、V は N であり、W、X 及び Y は C - R<sup>b</sup> である。これらの化合物は、次の式 I. 2

## 【化18】



I.2

40

## 【0137】

（式中、その各基 R<sup>b2</sup>、R<sup>b3</sup> 及び R<sup>b4</sup> はそれぞれ基 R<sup>b</sup> に対応しており、好ましくは以下のとおりの意味：

R<sup>b2</sup> は、H、ハロゲン、アルキル、ハロメチル、特に H、Cl、CF<sub>3</sub> 又は CH<sub>3</sub> である；

R<sup>b3</sup> は、ハロゲン、CH<sub>3</sub> 又は OCH<sub>3</sub>、特に F、CH<sub>3</sub> 又は OCH<sub>3</sub> である；

R<sup>b4</sup> は、H、ハロゲン、CH<sub>3</sub> 又は OCH<sub>3</sub>、特に H、F、Cl、Br、CH<sub>3</sub> 又は OCH<sub>3</sub> である；

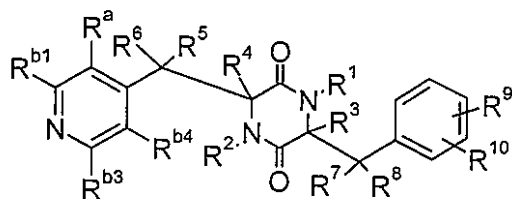
50

を有している)  
に対応している。

【0138】

式 I で表される化合物のさらなる実施形態では、V、X 及び Y は C-R<sup>b</sup> であり、W は N である。これらの化合物は、次の式 I. 3

【化19】



I.3

10

【0139】

(式中、その各基 R<sup>b1</sup>、R<sup>b3</sup> 及び R<sup>b4</sup> はそれぞれ基 R<sup>b</sup> に対応しており、好ましくは以下のとおりの意味：

R<sup>b1</sup> は、H である；

R<sup>b3</sup> は、ハロゲン、CH<sub>3</sub> 又は OCH<sub>3</sub>、特に F、CH<sub>3</sub> 又は OCH<sub>3</sub> である；

R<sup>b4</sup> は、H、ハロゲン、CH<sub>3</sub> 又は OCH<sub>3</sub>、特に H、F、Cl、Br、CH<sub>3</sub> 又は OCH<sub>3</sub> である；

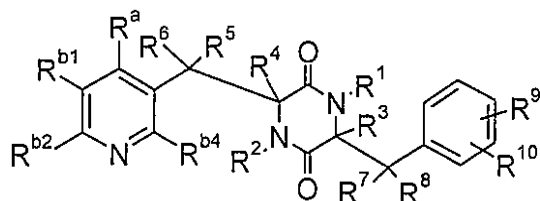
を有している)

に対応している。

【0140】

式 I で表される化合物のさらなる実施形態では、V、W 及び Y は C-R<sup>b</sup> であり、X は N である。これらの化合物は、次の式 I. 4

【化20】



I.4

30

【0141】

(式中、その各基 R<sup>b1</sup>、R<sup>b2</sup> 及び R<sup>b4</sup> はそれぞれ基 R<sup>b</sup> に対応しており、好ましくは以下のとおりの意味：

R<sup>b1</sup> は、H である；

R<sup>b2</sup> は、H、ハロゲン、ハロメチル、特に H、Cl、CF<sub>3</sub> である；

R<sup>b4</sup> は、H、ハロゲン、CH<sub>3</sub> 又は OCH<sub>3</sub>、特に H、F、Cl、Br、CH<sub>3</sub> 又は OCH<sub>3</sub> である；

を有している)

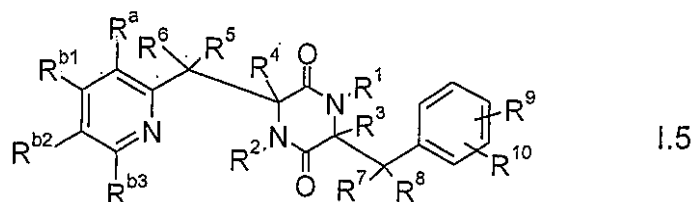
に対応している。

【0142】

式 I で表される化合物のさらなる実施形態では、V、W 及び X は C-R<sup>b</sup> であり、Y は N である。これらの化合物は、次の式 I. 5

40

## 【化 2 1】



I.5

## 【0 1 4 3】

10

(式中、その各基  $R^{b1}$ 、 $R^{b2}$  及び  $R^{b3}$  はそれぞれ基  $R^b$  に対応しており、好ましくは以下のとおりの意味：

$R^{b1}$  は、H である；

$R^{b2}$  は、H、ハロゲン、ハロメチル、特に H、Cl、 $CF_3$  である；

$R^{b3}$  は、ハロゲン、 $CH_3$  又は  $OCH_3$ 、特に F、 $CH_3$  又は  $OCH_3$  である；  
を有している)

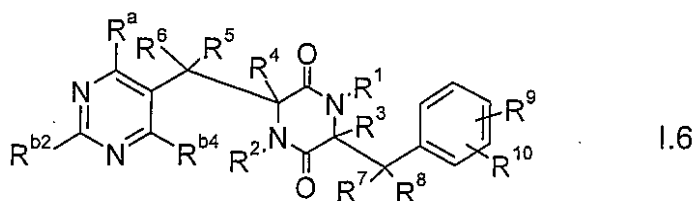
に対応している。

## 【0 1 4 4】

式 I で表される化合物のさらなる実施形態では、V 及び X は N であり、W 及び Y は C- $R^b$  である。これらの化合物は、次の式 I. 6

20

## 【化 2 2】



I.6

## 【0 1 4 5】

30

(式中、その各基  $R^{b2}$  及び  $R^{b4}$  はそれぞれ基  $R^b$  に対応しており、好ましくは以下のとおりの意味：

$R^{b2}$  は、H、ハロゲン、ハロメチル、特に H、Cl、 $CF_3$  である；

$R^{b4}$  は、H、ハロゲン、 $CH_3$  又は  $OCH_3$ 、特に H、F、Cl、Br、 $CH_3$  又は  $OCH_3$  である；  
を有している)

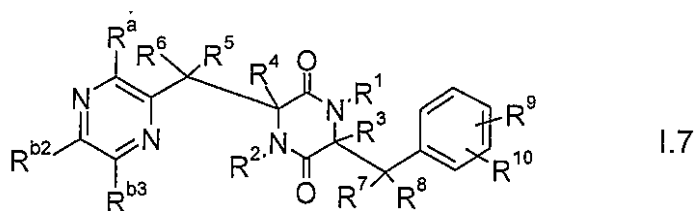
に対応している。

## 【0 1 4 6】

式 I で表される化合物のさらなる実施形態では、V 及び Y は N であり、W 及び X は C- $R^b$  である。これらの化合物は、次の式 I. 7

40

## 【化 2 3】



I.7

## 【0147】

(式中、その各基  $R^{b2}$  及び  $R^{b3}$  はそれぞれ基  $R^b$  に対応しており、好ましくは以下の  
 とおりの意味：

$R^{b2}$  は、H、ハロゲン、ハロメチル、特に H、Cl、 $CF_3$  である；

$R^{b3}$  は、ハロゲン、 $CH_3$  又は  $OCH_3$ 、特に F、 $CH_3$  又は  $OCH_3$  である；  
 を有している)

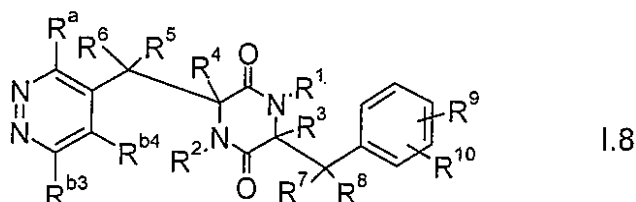
に対応している。

## 【0148】

式 I で表される化合物のさらなる実施形態では、V 及び W は N であり、X 及び Y は C-  
 $R^b$  である。これらの化合物は、次の式 I. 8

10

## 【化24】



## 【0149】

20

(式中、その各基  $R^{b3}$  及び  $R^{b4}$  はそれぞれ基  $R^b$  に対応しており、好ましくは以下の  
 とおりの意味：

$R^{b3}$  は、ハロゲン、 $CH_3$  又は  $OCH_3$ 、特に F、 $CH_3$  又は  $OCH_3$  である；

$R^{b4}$  は、H、ハロゲン、 $CH_3$  又は  $OCH_3$ 、特に H、F、Cl、Br、 $CH_3$  又は  
 $OCH_3$  である；

を有している)

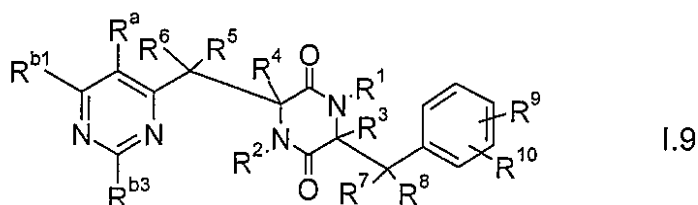
に対応している。

## 【0150】

式 I で表される化合物のさらなる実施形態では、W 及び Y は N であり、V 及び X は C-  
 $R^b$  である。これらの化合物は、次の式 I. 9

30

## 【化25】



## 【0151】

(式中、その各基  $R^{b1}$  及び  $R^{b3}$  はそれぞれ基  $R^b$  に対応しており、好ましくは以下の  
 とおりの意味：

40

$R^{b1}$  は、H である；

$R^{b3}$  は、ハロゲン、 $CH_3$  又は  $OCH_3$ 、特に F、 $CH_3$  又は  $OCH_3$  である；

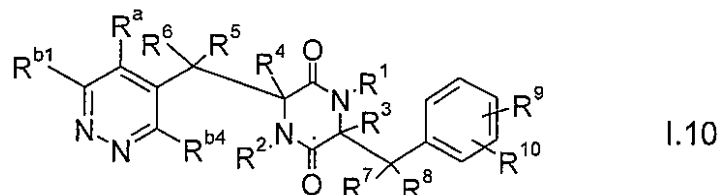
を有している)

に対応している。

## 【0152】

式 I で表される化合物のさらなる実施形態では、W 及び X は N であり、V 及び Y は C-  
 $R^b$  である。これらの化合物は、次の式 I. 10

【化 2 6】



【0153】

(式中、その各基  $R^{b1}$  及び  $R^{b4}$  はそれぞれ基  $R^b$  に対応しており、好ましくは以下の  
 とおりの意味：

10

$R^{b1}$  は、Hである；

$R^{b4}$  は、H、ハロゲン、 $CH_3$  又は  $OCH_3$ 、特にはH、F、Cl、Br、 $CH_3$  又は  
 $OCH_3$  である；

を有している)

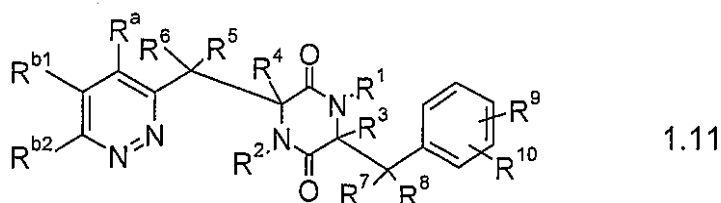
に対応している。

【0154】

式 I で表される化合物のさらなる実施形態では、X 及び Y は N であり、V 及び W は C -  
 $R^b$  である。これらの化合物は、次の式 I. 11

20

【化 2 7】



【0155】

(式中、その基  $R^{b1}$  及び  $R^{b2}$  はそれぞれ基  $R^b$  に対応しており、好ましくは以下のと  
 おりの意味：

30

$R^{b1}$  は、Hである；

$R^{b2}$  は、H、ハロゲン、ハロメチル、特にはH、Cl、 $CF_3$  である；

を有している)

に対応している。

【0156】

式 I で表される化合物の特に好ましい態様は、式 I にとっての好ましい意味をその各可  
 変部  $R^a$  及び  $R^1 \sim R^{10}$  が有している各式 I. 1 ~ I. 11 の態様のそれぞれに関連し  
 ている。

【0157】

本発明の第 1 の好ましい実施形態では、 $R^a$  は、CN 又は  $NO_2$  である。

40

【0158】

$R^a$  は、特には、CN、 $NO_2$ 、又は、好ましくは環員として 1、2 又は 3 個の窒素原子  
 又は 1 個の酸素もしくは 1 個のイオウ原子及び場合により 1 又は 2 個の窒素原子を有し  
 ていて、置換されていない又は  $R^{aa}$  及び / 又は  $R^{a1}$  からなる群から選択される 1 又は  
 2 個の置換基を有してよい、先に定義した、5 もしくは 6 員ヘテロ芳香族基である。

【0159】

本発明のさらに好ましい実施形態では、 $R^a$  は、好ましくは環員として 1、2、3 又は  
 4 個の窒素原子又は 1 個の酸素もしくは 1 個のイオウ原子及び場合により 1 又は 2 個の窒  
 素原子を有していて、置換されていない又は  $R^{aa}$  から選択される 1 又は 2 個の置換基を  
 有してよい、先に定義した 5 もしくは 6 員ヘテロ環である。好ましいものとしては、

50

例えば、

ヘテロ芳香族基：ピリダジン-3-イル、ピリダジン-4-イル、ピリミジン-2-イル、ピリミジン-4-イル、ピリミジン-5-イル、ピラジン-2-イル、2-フリル、3-フリル、2-チエニル、3-チエニル、ピラゾール-1-イル、ピラゾール-3-イル、ピラゾール-4-イル、イソオキサゾール-3-イル、イソオキサゾール-4-イル、イソオキサゾール-5-イル、イソチアゾール-3-イル、イソチアゾール-4-イル、イソチアゾール-5-イル、イミダゾール-1-イル、イミダゾール-2-イル、イミダゾール-4-イル、オキサゾール-2-イル、オキサゾール-4-イル、オキサゾール-5-イル、チアゾール-2-イル、チアゾール-4-イル及びチアゾール-5-イル；  
 のような、窒素を介して結合されている飽和又は部分不飽和基が挙げられる。

10

#### 【0160】

もう1つの態様では、 $R^a$ は、炭素を介して結合されているヘテロ芳香族基であり、例えばピラゾール-3-イル、イミダゾール-5-イル、オキサゾール-2-イル、チアゾール-2-イル、チアゾール-4-イル、チアゾール-5-イル、ピリジン-2-イル、ピリジン-3-イル、ピリジン-4-イル、ピリミジン-2-イル、ピリミジン-4-イル、ピリミジン-5-イル、ピリダジン-4-イル、ピラジン-2-イル、(1H)-テトラゾール-5-イル及び(2H)-テトラゾール-5-イルであり、ここで、例としてここに記載した各ヘテロ環のそれぞれは、 $R^{aa}$ から選沢される1又は2個の置換基を有してよい。好ましい基 $R^{aa}$ は、特には、F、Cl、CN、 $NO_2$ 、 $CH_3$ 、エチル、 $OCH_3$ 、 $OC_2H_5$ 、 $OCHF_2$ 、 $OCF_3$ 及び $CF_3$ である。

20

#### 【0161】

好ましいものとしては、 $R^a$ が、ハロゲン（特にはCl又はBr）である式Iで表される化合物及びその塩も挙げられる。

#### 【0162】

さらに好ましい態様では、 $R^a$ は、 $NR^A R^B$ （ここで、 $R^A$ 及び $R^B$ は、互いに独立して、水素、アルキル、ハロアルキル、アルケニル、アルキニル又はアルコキシアルキル又はシアノアルキルである）である。

#### 【0163】

さらに好ましい態様では、 $R^a$ は、 $C(R^{aa})C(O)R^{a1}$ （ここで、 $R^{aa}$ は、特には、CN又は基 $C(O)R^{a1}$ であり、 $R^{a1}$ は好ましくは $C_1 \sim C_6$ -アルコキシである）である。

30

#### 【0164】

$R^a$ が、シクロアルキルである場合は、シクロヘキシル及び特にはシクロプロピルが好ましい基である。

#### 【0165】

さらに好ましい態様では、 $R^a$ は、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ、 $C_3 \sim C_8$ -アルケニルオキシ又は $C_3 \sim C_8$ -アルキニルオキシによって置換されていてよい $C_1 \sim C_4$ -アルキルである。

#### 【0166】

さらに好ましい態様では、 $R^a$ は、ハロゲン、CN、 $NO_2$ 又は $NR^A R^B$ によって置換されていてよい $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_2 \sim C_6$ -アルケニル又は $C_2 \sim C_6$ -アルキニルである。

40

#### 【0167】

さらに好ましい態様では、 $R^a$ は、ハロゲンによって置換されていてよい $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ、例えば $OCH_3$ 、 $OC_2H_5$ 、 $OCHF_2$ 又は $OCF_3$ である。

#### 【0168】

基 $R^b$ は、好ましくは、H、F、Cl、 $C_1 \sim C_2$ -アルキル、 $C_1 \sim C_2$ -フルオロアルキル、 $CH=CH_2$ 、 $C_1 \sim C_2$ -アルコキシ又は $C_1 \sim C_2$ -フルオロアルコキシ、特にはF、Cl、 $CH_3$ 、 $C_2H_5$ 、 $OCH_3$ 、 $CH=CH_2$ 又は $OCF_3$ である。

#### 【0169】

50

特に好ましい実施形態では、 $R^b$  は、そのヘテロアリール環の結合点に対してオルト位 ( $R^{b4}$ ) に位置しているハロゲン (特に  $Cl$  又は  $F$ )、メチル又はメトキシである。

【0170】

$R^b$  が、ハロゲンである式 I で表される化合物の中からは、好ましいものとしては、 $R^b$  が、その基  $R^a$  に対してパラ位に位置している化合物も挙げられる。

【0171】

$R^b$  が、ハロゲンである式 I で表される化合物の中からは、好ましいものとしては、 $R^b$  が、 $F$  又は  $Cl$  である化合物が挙げられる。

【0172】

式 I で表される化合物の一態様では、 $R^1$  は、 $CN$ 、 $NO_2$ 、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$  - アルコキシ、 $C(=O)-R^{a1}$ 、 $C_3 \sim C_6$  - シクロアルキル及び場合によりフェニルから選択される基によって置換されているアルキル (特にメチル) である。

【0173】

式 I で表される化合物のさらなる態様では、 $R^1$  は、 $NH_2$  又は  $SO_2 R^y$  である。

【0174】

式 I で表される化合物のさらなる態様では、 $R^1$  は、 $CH_2CH=CHCH_3$ 、 $CH_2CH_2CH=CH_2$ 、 $CH_2C \equiv CCH_3$ 、 $CH_2CH_2C \equiv CH$  である。

【0175】

式 I で表される化合物のさらなる態様では、 $R^1$  は、特にハロゲンによって置換されている置換  $C_3 \sim C_4$  - アルケニル又は  $C_3 \sim C_4$  - アルキニルである。 $R^1$  が  $R^{aa}$  によって置換されている基である場合、各基  $R^{aa}$  で置換された  $R^1$  の意味は当然異なる。

【0176】

$R^2$  は、好ましくは  $CH_3$  である。

【0177】

$R^3$  は、好ましくは  $C_1 \sim C_3$  - アルキル、 $C_1 \sim C_2$  - フルオロアルキル又は  $C_2 \sim C_3$  - アルケニル、特に  $CH_3$ 、 $C_2H_5$ 、 $n$ -プロピル、 $CF_3$  又はアリルであり、好ましくは  $CH_3$  又は  $C_2H_5$  である。

【0178】

$R^6$  が、基  $C(=O)R^{11}$  であり、ここで  $R^{11}$  が上記の意味の 1 つを有し、特に  $H$ 、 $C_1 \sim C_4$  - アルキル (好ましくは  $CH_3$  もしくは  $C_2H_5$ )、又は  $C_1 \sim C_4$  - ハロアルキル (好ましくは  $C_1 \sim C_2$  - フルオロアルキル、例えば  $CF_3$ ) である、式 I で表される化合物も好ましい。

【0179】

好ましくは、少なくとも一方の、特に双方の基  $R^7$  及び  $R^8$  は、 $H$  である。

【0180】

$R^9$  が、 $H$  とは異なる基である式 I で表される各化合物の中からは、好ましいものとしては、 $R^9$  が、その基  $CR^7R^8$  に対してパラ位に位置している化合物が挙げられる。

【0181】

$R^9$  が、 $H$  とは異なる基である式 I で表される各化合物の中からは、好ましいものとしては、 $R^9$  が、結合点に対してメタ位に位置しており、好ましくはハロゲン、特に  $F$  又は  $Cl$  である化合物が挙げられる。同様に、もう 1 つの好ましい実施形態では、 $R^9$  は、 $H$  である。

【0182】

$R^{10}$  は、好ましくは、 $H$  又はハロゲン (例えば  $Cl$  又は  $F$ 、特に  $F$ ) である。好ましい態様では、 $R^{10}$  は、そのオルト又はパラ位に位置している。特に好ましくは、 $R^{10}$  は、 $H$  である。

【0183】

その基  $C(O)R^{11}$  中では、 $R^{11}$  は、好ましくは、 $H$ 、 $C_1 \sim C_4$  - アルキル又は  $C_1 \sim C_4$  - ハロアルキルである。

【0184】

10

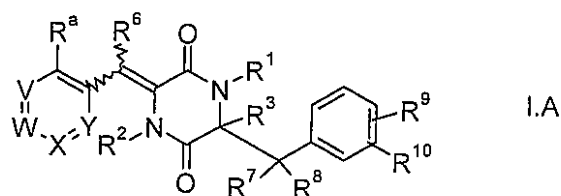
20

30

40

50

式 I で表される化合物及びその塩の中からは、好ましいものとしては、式 I . A :  
【化 2 8】



I.A

## 【0185】

10

(式中、各可変部は、式 I に対して記載されている各意味のうちの一つ、特には好ましいものであると記載されている意味、を有している)

で表される化合物及びその農業上好適な塩が挙げられる。

## 【0186】

式 I 及び特には式 I . A 中ならびにこれらから誘導される下位式群中では、その各基  $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^8$ 、 $R^9$ 、 $R^{10}$ 、 $R^a$  及び  $R^b$  は、互いに独立してだが、好ましくは組み合わせで、以下のとおりの意味：

$R^1$  は、 $NH_2$ 、 $SO_2CH_3$ 、 $CH_2CO_2-C_1-C_4$ -アルキル、 $CH_2CH_2C \equiv CCH_3$ 、 $CH_2C(CH_3)=CH_2$ 、 $CH_2CH=CHCH_3$ 、 $C_3 \sim C_4$ -ハロアルケニル、 $CH_2-c-C_3H_5$ 、場合により置換されているベンジル、 $CN$ 、 $Cl$ 、 $F$ によって置換されている  $C_1 \sim C_2$ -アルキルである；

20

$R^2$  は、 $CH_3$  である；

$R^3$  は、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $OH$ 、 $CH_2OH$ 、 $NH_2$ 、 $C(O)R^{11}$  (ここで、 $R^{11}$  は、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ、特には  $CH_3$  又は  $C_2H_5$  である) である；

$R^6$  は、 $H$ 、 $CH_3$  又は  $C_2H_5$ 、特には  $H$  である；

$R^7$ 、 $R^8$  は、 $H$  である；

$R^9$  は、 $H$ 、ハロゲン、 $OH$ 、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_1 \sim C_4$ -アルキルカルボニルオキシ、特には  $H$  又は 3-ハロゲン、 $OH$ 、 $CH_3$ 、 $OCOCH_3$ 、特定的には  $H$  又は 3- $F$  である；

$R^{10}$  は、 $H$  又は  $F$  である；

30

$R^a$  は、ハロゲン、 $CN$ 、 $NO_2$ 、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ -チオアルキル、 $NR^A R^B$ 、ハロアルキル、ハロアルコキシ、特には  $Cl$ 、 $CN$ 、 $NO_2$ 、 $CH_3$ 、 $OCH_3$ 、 $OC_2H_5$ 、 $SCH_3$ 、又は  $NR^A R^B$  (ここで、 $R^A$  及び  $R^B$  は、その窒素原子と一緒に、例えば、 $N$ -モルホリニルのような、6員飽和ヘテロ環を形成している) である；及び

$R^b$  は、 $H$ 、 $F$ 、 $Cl$ 、 $Br$ 、 $CH_3$ 、 $OCH_3$ 、ハロメチルであり、特には、その基  $R^b$  の位置に応じて、先に  $R^{b1}$ 、 $R^{b2}$ 、 $R^{b3}$ 、 $R^{b4}$  に対してさらに記載した各意味を有している；

を有している。

## 【0187】

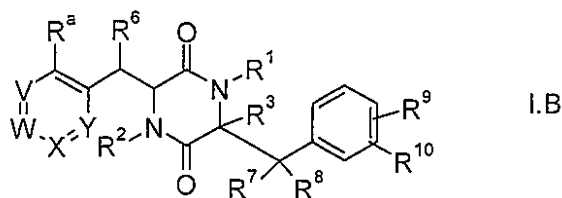
40

特に好ましい態様では、その化合物 I . A は、その各式 I . 1 ~ I . 11 の好ましい特徴を有している。それゆえ、式 I . 1A ~ I . 11A とそれらは呼ばれる。

## 【0188】

式 I で表される化合物のさらなる実施形態は、 $R^4$  及び  $R^5$  が  $H$  である実施形態に関連している。そのような化合物は、次の式 I . B

【化 2 9】



I.B

【0189】

に対応している。

10

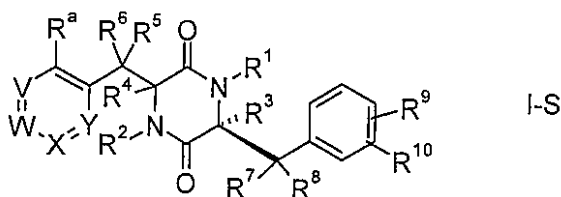
【0190】

特に好ましい態様では、その化合物 I. B は、その各式 I. 1 ~ I. 11 の好ましい特徴を有している。それゆえ、式 I. 1 B ~ I. 11 B とそれらは呼ばれる。

【0191】

その基 R<sup>3</sup> を有している炭素原子のところに、式 I で表される化合物は、キラル中心を有している。本発明の好ましい実施形態は、以下

【化 3 0】



I-S

20

【0192】

(式中、その可変部は、先に記載されている各意味のうちの一つ、特に好ましいものである又は特に好ましいものであると記載されている各意味のうちの一つを有している) に示す式、I-S で表される純粋エナンチオマー、及び式、I-S で表されるエナンチオマーのエナンチオマー過剰を有しているエナンチオマー混合物にも、関連している。

30

【0193】

特に好ましい態様では、その化合物、I-S は、その各式 I. 1 ~ I. 11 の好ましい特徴を有している。それゆえ、式 I. 1-S ~ I. 11-S とそれらは呼ばれる。

【0194】

R<sup>4</sup> が R<sup>5</sup> への結合を表していない場合は、この化合物 I も、その基 R<sup>4</sup> を有している炭素原子のところにキラル中心を有している。式 I で表される化合物、特に式、I-S で表される化合物に対しては、この位置での S 配置が好ましい。

【0195】

エナンチオマー過剰とは、好ましくは、少なくとも 70%、特に少なくとも 80%、好ましくは少なくとも 90% の e e 値を、意味している。好ましいものとしては、そのエナンチオマー I-S の農業上好適な塩及び式 I-S で表されるエナンチオマーのエナンチオマー過剰を有しているその各塩のエナンチオマー混合物も挙げられる。

40

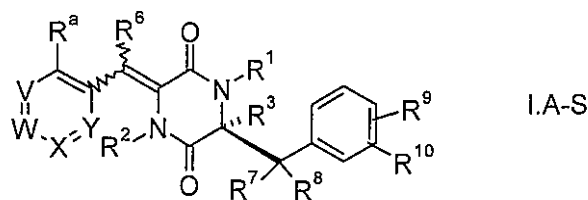
【0196】

同様に好ましいものである、もう 1 つの実施形態は、I で表わされるラセミ体及びその塩に関連している。

【0197】

特に好ましい実施形態は、以下

## 【化 3 1】



## 【0198】

10

(式中、その各可変部は、先に記載されている各意味のうちの一つ、特には好ましいものである又は特に好ましいものであると記載されている各意味のうちの一つを有している)に記載されている式 I. A-S で表される純粋エナンチオマー、及び式 I. A-S で表されるエナンチオマーのエナンチオマー過剰を有しているエナンチオマー混合物にも、関連している。

## 【0199】

好ましいものとしては、そのエナンチオマー I. A-S の農業上好適な塩及び式 I. A-S で表されるエナンチオマーのエナンチオマー過剰を有しているその各塩のエナンチオマー混合物も挙げられる。

## 【0200】

20

本発明のもう 1 つの特に好ましい実施形態は、I. A で表わされるラセミ体及びその塩に関連している。

## 【0201】

その各式 I. A 及びそれから誘導される下位式群で表される各化合物の中からは、好ましいものとしては、そのピペラジン環のところのエキソ二重結合が、その (Z) 配置を有している化合物が挙げられる。好ましいものとしては、その Z 異性体が過剰で存在しているその (E) 異性体とその (Z) 異性体との混合物、特には 1 : 2 より大きくない、特には 1 : 5 より大きくない E / Z 比を有している異性体混合物も挙げられる。

## 【0202】

特にはその使用を視野に入れると、好ましいものとしては、以下の各表に列挙されている式 I で表される各化合物が挙げられ、それらの化合物は、それぞれ、次の式 I. 1 A'、I. 1 B'、I. 2 A' 及び I. 2 B'、に対応している。置換基のために各表中に記載されている基は、さらにそれ自体で、それが記載されている組み合わせとは無関係に、当該の置換基の特に好ましい態様である。

30

## 【0203】

## 表 1

化合物についての R<sup>a</sup> が CN であり、R<sup>b 2</sup>、R<sup>b 3</sup> 及び R<sup>b 4</sup> が H であり、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>9</sup> 及び R<sup>10</sup> のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

## 【0204】

40

## 表 2

化合物についての R<sup>a</sup> が CN であり、R<sup>b 2</sup> 及び R<sup>b 3</sup> が H であり、R<sup>b 4</sup> が F であり、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>9</sup> 及び R<sup>10</sup> のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

## 【0205】

## 表 3

化合物についての R<sup>a</sup> が CN であり、R<sup>b 2</sup> 及び R<sup>b 3</sup> が H であり、R<sup>b 4</sup> が Cl であり、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>9</sup> 及び R<sup>10</sup> のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

## 【0206】

50

## 表 4

化合物についての  $R^a$  が  $CN$  であり、 $R^{b2}$  及び  $R^{b3}$  が  $H$  であり、 $R^{b4}$  が  $Br$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0207】

## 表 5

化合物についての  $R^a$  が  $CN$  であり、 $R^{b2}$  及び  $R^{b3}$  が  $H$  であり、 $R^{b4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0208】

10

## 表 6

化合物についての  $R^a$  が  $CN$  であり、 $R^{b2}$  及び  $R^{b3}$  が  $H$  であり、 $R^{b4}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0209】

## 表 7

化合物についての  $R^a$  が  $CN$  であり、 $R^{b2}$  が  $H$  であり、 $R^{b3}$  が  $F$  であり、 $R^{b4}$  が  $H$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0210】

20

## 表 8

化合物についての  $R^a$  が  $CN$  であり、 $R^{b2}$  が  $H$  であり、 $R^{b3}$  が  $F$  であり、 $R^{b4}$  が  $F$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0211】

## 表 9

化合物についての  $R^a$  が  $CN$  であり、 $R^{b2}$  が  $H$  であり、 $R^{b3}$  が  $F$  であり、 $R^{b4}$  が  $Cl$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0212】

30

## 表 10

化合物についての  $R^a$  が  $CN$  であり、 $R^{b2}$  が  $H$  であり、 $R^{b3}$  が  $F$  であり、 $R^{b4}$  が  $Br$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0213】

## 表 11

化合物についての  $R^a$  が  $CN$  であり、 $R^{b2}$  が  $H$  であり、 $R^{b3}$  が  $F$  であり、 $R^{b4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0214】

40

## 表 12

化合物についての  $R^a$  が  $CN$  であり、 $R^{b2}$  が  $H$  であり、 $R^{b3}$  が  $F$  であり、 $R^{b4}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0215】

## 表 13

化合物についての  $R^a$  が  $Cl$  であり、 $R^{b2}$  が  $H$  であり、 $R^{b3}$  が  $F$  であり、 $R^{b4}$  が  $H$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0216】

50

## 表 1 4

化合物についての  $R^a$  が C 1 であり、 $R^{b\ 2}$  及び  $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が F であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 2 1 7】

## 表 1 5

化合物についての  $R^a$  が C 1 であり、 $R^{b\ 2}$  及び  $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が C 1 であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 2 1 8】

10

## 表 1 6

化合物についての  $R^a$  が C 1 であり、 $R^{b\ 2}$  及び  $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が B r であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 2 1 9】

## 表 1 7

化合物についての  $R^a$  が C 1 であり、 $R^{b\ 2}$  及び  $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が C H <sub>3</sub> であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 2 2 0】

20

## 表 1 8

化合物についての  $R^a$  が C 1 であり、 $R^{b\ 2}$  及び  $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が O C H <sub>3</sub> であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 2 2 1】

## 表 1 9

化合物についての  $R^a$  が C 1 であり、 $R^{b\ 2}$  が H であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が H であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 2 2 2】

30

## 表 2 0

化合物についての  $R^a$  が C 1 であり、 $R^{b\ 2}$  が H であり、 $R^{b\ 3}$  であり、 $R^{b\ 4}$  が F であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 2 2 3】

## 表 2 1

化合物についての  $R^a$  が C 1 であり、 $R^{b\ 2}$  が H であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が C 1 であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 2 2 4】

40

## 表 2 2

化合物についての  $R^a$  が C 1 であり、 $R^{b\ 2}$  が H であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が B r であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 2 2 5】

## 表 2 3

化合物についての  $R^a$  が C 1 であり、 $R^{b\ 2}$  が H であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が C H <sub>3</sub> であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 2 2 6】

50

## 表 2 4

化合物についての  $R^a$  が  $Cl$  であり、 $R^{b2}$  が  $H$  であり、 $R^{b3}$  が  $F$  であり、 $R^{b4}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0227】

## 表 2 5

化合物についての  $R^a$  が  $NO_2$  であり、 $R^{b2}$  であり、 $R^{b3}$  であり、 $R^{b4}$  が  $H$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0228】

10

## 表 2 6

化合物についての  $R^a$  が  $NO_2$  であり、 $R^{b2}$  及び  $R^{b3}$  が  $H$  であり、 $R^{b4}$  が  $F$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0229】

## 表 2 7

化合物についての  $R^a$  が  $NO_2$  であり、 $R^{b2}$  及び  $R^{b3}$  が  $H$  であり、 $R^{b4}$  が  $Cl$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0230】

20

## 表 2 8

化合物についての  $R^a$  が  $NO_2$  であり、 $R^{b2}$  及び  $R^{b3}$  が  $H$  であり、 $R^{b4}$  が  $Br$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0231】

## 表 2 9

化合物についての  $R^a$  が  $NO_2$  であり、 $R^{b2}$  及び  $R^{b3}$  が  $H$  であり、 $R^{b4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0232】

30

## 表 3 0

化合物についての  $R^a$  が  $NO_2$  であり、 $R^{b2}$  及び  $R^{b3}$  が  $H$  であり、 $R^{b4}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0233】

## 表 3 1

化合物についての  $R^a$  が  $NO_2$  であり、 $R^{b2}$  が  $H$  であり、 $R^{b3}$  が  $F$  であり、 $R^{b4}$  が  $H$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0234】

40

## 表 3 2

化合物についての  $R^a$  が  $NO_2$  であり、 $R^{b2}$  が  $H$  であり、 $R^{b3}$  であり、 $R^{b4}$  が  $F$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0235】

## 表 3 3

化合物についての  $R^a$  が  $NO_2$  であり、 $R^{b2}$  が  $H$  であり、 $R^{b3}$  が  $F$  であり、 $R^{b4}$  が  $Cl$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0236】

50

## 表 3 4

化合物についての  $R^a$  が  $\text{NO}_2$  であり、 $R^{b\ 2}$  が H であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が Br であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 2 3 7】

## 表 3 5

化合物についての  $R^a$  が  $\text{NO}_2$  であり、 $R^{b\ 2}$  が H であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が  $\text{CH}_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 2 3 8】

10

## 表 3 6

化合物についての  $R^a$  が  $\text{NO}_2$  であり、 $R^{b\ 2}$  が H であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が  $\text{OCH}_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 2 3 9】

## 表 3 7

化合物についての  $R^a$  が  $\text{CH}_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  及び  $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が H であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 2 4 0】

20

## 表 3 8

化合物についての  $R^a$  が  $\text{CH}_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  及び  $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が F であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 2 4 1】

## 表 3 9

化合物についての  $R^a$  が  $\text{CH}_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  及び  $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が Cl であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 2 4 2】

30

## 表 4 0

化合物についての  $R^a$  が  $\text{CH}_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  及び  $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が Br であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 2 4 3】

## 表 4 1

化合物についての  $R^a$  が  $\text{CH}_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  及び  $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が  $\text{CH}_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 2 4 4】

40

## 表 4 2

化合物についての  $R^a$  が  $\text{CH}_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  及び  $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が  $\text{OCH}_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 2 4 5】

## 表 4 3

化合物についての  $R^a$  が  $\text{CH}_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が H であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が H であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 2 4 6】

50

## 表 4 4

化合物についての  $R^a$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が H であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が F であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 2 4 7】

## 表 4 5

化合物についての  $R^a$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が H であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が Cl であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 2 4 8】

10

## 表 4 6

化合物についての  $R^a$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が H であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が Br であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 2 4 9】

## 表 4 7

化合物についての  $R^a$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が H であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 2 5 0】

20

## 表 4 8

化合物についての  $R^a$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が H であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 2 5 1】

## 表 4 9

化合物についての  $R^a$  が  $CF_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  及び  $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が H であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 2 5 2】

30

## 表 5 0

化合物についての  $R^a$  が  $CF_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  及び  $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が F であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 2 5 3】

## 表 5 1

化合物についての  $R^a$  が  $CF_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  及び  $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が Cl であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 2 5 4】

40

## 表 5 2

化合物についての  $R^a$  が  $CF_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  及び  $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が Br であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 2 5 5】

## 表 5 3

化合物についての  $R^a$  が  $CF_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  及び  $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 2 5 6】

50

## 表 5 4

化合物についての  $R^a$  が  $CF_3$  であり、 $R^{b2}$  及び  $R^{b3}$  が H であり、 $R^{b4}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0257】

## 表 5 5

化合物についての  $R^a$  が  $CF_3$  であり、 $R^{b2}$  が H であり、 $R^{b3}$  が F であり、 $R^{b4}$  が H であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0258】

10

## 表 5 6

化合物についての  $R^a$  が  $CF_3$  であり、 $R^{b2}$  が H であり、 $R^{b3}$  が F であり、 $R^{b4}$  が F であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0259】

## 表 5 7

化合物についての  $R^a$  が  $CF_3$  であり、 $R^{b2}$  が H であり、 $R^{b3}$  が F であり、 $R^{b4}$  が Cl であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0260】

20

## 表 5 8

化合物についての  $R^a$  が  $CF_3$  であり、 $R^{b2}$  が H であり、 $R^{b3}$  が F であり、 $R^{b4}$  が Br であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0261】

## 表 5 9

化合物についての  $R^a$  が  $CF_3$  であり、 $R^{b2}$  が H であり、 $R^{b3}$  が F であり、 $R^{b4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0262】

30

## 表 6 0

化合物についての  $R^a$  が  $CF_3$  であり、 $R^{b2}$  が H であり、 $R^{b3}$  が F であり、 $R^{b4}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0263】

## 表 6 1

化合物についての  $R^a$  が  $OCH_3$  であり、 $R^{b2}$  及び  $R^{b3}$  が H であり、 $R^{b4}$  が H であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0264】

40

## 表 6 2

化合物についての  $R^a$  が  $OCH_3$  であり、 $R^{b2}$  及び  $R^{b3}$  が H であり、 $R^{b4}$  が F であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0265】

## 表 6 3

化合物についての  $R^a$  が  $OCH_3$  であり、 $R^{b2}$  及び  $R^{b3}$  が H であり、 $R^{b4}$  が Cl であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0266】

50

## 表 6 4

化合物についての  $R^a$  が  $OC H_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  及び  $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が Br であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 2 6 7】

## 表 6 5

化合物についての  $R^a$  が  $OC H_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  及び  $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 2 6 8】

10

## 表 6 6

化合物についての  $R^a$  が  $OC H_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  及び  $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が  $OC H_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 2 6 9】

## 表 6 7

化合物についての  $R^a$  が  $OC H_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が H であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が H であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 2 7 0】

20

## 表 6 8

化合物についての  $R^a$  が  $OC H_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が H であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が F であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 2 7 1】

## 表 6 9

化合物についての  $R^a$  が  $OC H_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が H であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が Cl であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 2 7 2】

30

## 表 7 0

化合物についての  $R^a$  が  $OC H_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が H であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が Br であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 2 7 3】

## 表 7 1

化合物についての  $R^a$  が  $OC H_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が H であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 2 7 4】

40

## 表 7 2

化合物についての  $R^a$  が  $OC H_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が H であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が  $OC H_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 2 7 5】

## 表 7 3

化合物についての  $R^a$  が  $OC_2 H_5$  であり、 $R^{b\ 2}$  及び  $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が H であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 2 7 6】

50

## 表 7 4

化合物についての  $R^a$  が  $OC_2H_5$  であり、 $R^{b2}$  及び  $R^{b3}$  が H であり、 $R^{b4}$  が F であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0277】

## 表 7 5

化合物についての  $R^a$  が  $OC_2H_5$  であり、 $R^{b2}$  及び  $R^{b3}$  が H であり、 $R^{b4}$  が Cl であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0278】

10

## 表 7 6

化合物についての  $R^a$  が  $OC_2H_5$  であり、 $R^{b2}$  及び  $R^{b3}$  が H であり、 $R^{b4}$  が Br であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0279】

## 表 7 7

化合物についての  $R^a$  が  $OC_2H_5$  であり、 $R^{b2}$  及び  $R^{b3}$  が H であり、 $R^{b4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0280】

20

## 表 7 8

化合物についての  $R^a$  が  $OC_2H_5$  であり、 $R^{b2}$  及び  $R^{b3}$  が H であり、 $R^{b4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0281】

## 表 7 9

化合物についての  $R^a$  が  $OC_2H_5$  であり、 $R^{b2}$  が H であり、 $R^{b3}$  が F であり、 $R^{b4}$  が H であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0282】

30

## 表 8 0

化合物についての  $R^a$  が  $OC_2H_5$  であり、 $R^{b2}$  が H であり、 $R^{b3}$  が F であり、 $R^{b4}$  が F であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0283】

## 表 8 1

化合物についての  $R^a$  が  $OC_2H_5$  であり、 $R^{b2}$  が H であり、 $R^{b3}$  が F であり、 $R^{b4}$  が Cl であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0284】

40

## 表 8 2

化合物についての  $R^a$  が  $OC_2H_5$  であり、 $R^{b2}$  が H であり、 $R^{b3}$  が F であり、 $R^{b4}$  が Br であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0285】

## 表 8 3

化合物についての  $R^a$  が  $OC_2H_5$  であり、 $R^{b2}$  が H であり、 $R^{b3}$  が F であり、 $R^{b4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0286】

50

## 表 8 4

化合物についての  $R^a$  が  $OC_2H_5$  であり、 $R^{b2}$  が H であり、 $R^{b3}$  が F であり、 $R^{b4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0287】

## 表 8 5

化合物についての  $R^a$  がモルホリン-1-イルであり、 $R^{b2}$  及び  $R^{b3}$  が H であり、 $R^{b4}$  が H であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0288】

10

## 表 8 6

化合物についての  $R^a$  がモルホリン-1-イルであり、 $R^{b2}$  及び  $R^{b3}$  が H であり、 $R^{b4}$  が F であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0289】

## 表 8 7

化合物についての  $R^a$  がモルホリン-1-イルであり、 $R^{b2}$  及び  $R^{b3}$  が H であり、 $R^{b4}$  が Cl であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0290】

20

## 表 8 8

化合物についての  $R^a$  がモルホリン-1-イルであり、 $R^{b2}$  及び  $R^{b3}$  が H であり、 $R^{b4}$  が Br であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0291】

## 表 8 9

化合物についての  $R^a$  がモルホリン-1-イルであり、 $R^{b2}$  及び  $R^{b3}$  が H であり、 $R^{b4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0292】

30

## 表 9 0

化合物についての  $R^a$  がモルホリン-1-イルであり、 $R^{b2}$  及び  $R^{b3}$  が H であり、 $R^{b4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0293】

## 表 9 1

化合物についての  $R^a$  がモルホリン-1-イルであり、 $R^{b2}$  が H であり、 $R^{b3}$  が F であり、 $R^{b4}$  が H であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0294】

40

## 表 9 2

化合物についての  $R^a$  がモルホリン-1-イルであり、 $R^{b2}$  が H であり、 $R^{b3}$  が F であり、 $R^{b4}$  が F であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0295】

## 表 9 3

化合物についての  $R^a$  がモルホリン-1-イルであり、 $R^{b2}$  が H であり、 $R^{b3}$  が F であり、 $R^{b4}$  が Cl であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0296】

50

## 表 9 4

化合物についての  $R^a$  がモルホリン-1-イルであり、 $R^{b2}$  が H であり、 $R^{b3}$  が F であり、 $R^{b4}$  が Br であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0297】

## 表 9 5

化合物についての  $R^a$  がモルホリン-1-イルであり、 $R^{b2}$  が H であり、 $R^{b3}$  が F であり、 $R^{b4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0298】

10

## 表 9 6

化合物についての  $R^a$  がモルホリン-1-イルであり、 $R^{b2}$  が H であり、 $R^{b3}$  が F であり、 $R^{b4}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0299】

## 表 9 7

化合物についての  $R^a$  が CN であり、 $R^{b2}$  が F であり、 $R^{b3}$  であり、 $R^{b4}$  が H であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0300】

20

## 表 9 8

化合物についての  $R^a$  が CN であり、 $R^{b2}$  が F であり、 $R^{b3}$  が H であり、 $R^{b4}$  が F であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0301】

## 表 9 9

化合物についての  $R^a$  が CN であり、 $R^{b2}$  が F であり、 $R^{b3}$  が H であり、 $R^{b4}$  が Cl であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0302】

30

## 表 100

化合物についての  $R^a$  が CN であり、 $R^{b2}$  が F であり、 $R^{b3}$  が H であり、 $R^{b4}$  が Br であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0303】

## 表 101

化合物についての  $R^a$  が CN であり、 $R^{b2}$  が F であり、 $R^{b3}$  が H であり、 $R^{b4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0304】

40

## 表 102

化合物についての  $R^a$  が CN であり、 $R^{b2}$  が F であり、 $R^{b3}$  が H であり、 $R^{b4}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0305】

## 表 103

化合物についての  $R^a$  が CN であり、 $R^{b2}$  が F であり、 $R^{b3}$  が F であり、 $R^{b4}$  が H であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0306】

50

## 表 1 0 4

化合物についての  $R^a$  が CN であり、 $R^{b\ 2}$  が F であり、 $R^{b\ 3}$  であり、 $R^{b\ 4}$  が F であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0307】

## 表 1 0 5

化合物についての  $R^a$  が CN であり、 $R^{b\ 2}$  が F であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が Cl であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0308】

10

## 表 1 0 6

化合物についての  $R^a$  が CN であり、 $R^{b\ 2}$  が F であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が Br であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0309】

## 表 1 0 7

化合物についての  $R^a$  が CN であり、 $R^{b\ 2}$  が F であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0310】

20

## 表 1 0 8

化合物についての  $R^a$  が CN であり、 $R^{b\ 2}$  が F であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0311】

## 表 1 0 9

化合物についての  $R^a$  が Cl であり、 $R^{b\ 2}$  が F であり、 $R^{b\ 3}$  であり、 $R^{b\ 4}$  が H であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0312】

30

## 表 1 1 0

化合物についての  $R^a$  が Cl であり、 $R^{b\ 2}$  が F であり、 $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が F であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0313】

## 表 1 1 1

化合物についての  $R^a$  が Cl であり、 $R^{b\ 2}$  が F であり、 $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が Cl であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0314】

40

## 表 1 1 2

化合物についての  $R^a$  が Cl であり、 $R^{b\ 2}$  が F であり、 $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が Br であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0315】

## 表 1 1 3

化合物についての  $R^a$  が Cl であり、 $R^{b\ 2}$  が F であり、 $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0316】

50

## 表 1 1 4

化合物についての  $R^a$  が Cl であり、 $R^{b2}$  が F であり、 $R^{b3}$  が H であり、 $R^{b4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0317】

## 表 1 1 5

化合物についての  $R^a$  が Cl であり、 $R^{b2}$  が F であり、 $R^{b3}$  が F であり、 $R^{b4}$  が H であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0318】

10

## 表 1 1 6

化合物についての  $R^a$  が Cl であり、 $R^{b2}$  が F であり、 $R^{b3}$  であり、 $R^{b4}$  が F であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0319】

## 表 1 1 7

化合物についての  $R^a$  が Cl であり、 $R^{b2}$  が F であり、 $R^{b3}$  が F であり、 $R^{b4}$  が Cl であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0320】

20

## 表 1 1 8

化合物についての  $R^a$  が Cl であり、 $R^{b2}$  が F であり、 $R^{b3}$  が F であり、 $R^{b4}$  が Br であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0321】

## 表 1 1 9

化合物についての  $R^a$  が Cl であり、 $R^{b2}$  が F であり、 $R^{b3}$  が F であり、 $R^{b4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0322】

30

## 表 1 2 0

化合物についての  $R^a$  が Cl であり、 $R^{b2}$  が F であり、 $R^{b3}$  が F であり、 $R^{b4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0323】

## 表 1 2 1

化合物についての  $R^a$  が  $NO_2$  であり、 $R^{b2}$  が F であり、 $R^{b3}$  であり、 $R^{b4}$  が H であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0324】

40

## 表 1 2 2

化合物についての  $R^a$  が  $NO_2$  であり、 $R^{b2}$  が F であり、 $R^{b3}$  が H であり、 $R^{b4}$  が F であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0325】

## 表 1 2 3

化合物についての  $R^a$  が  $NO_2$  であり、 $R^{b2}$  が F であり、 $R^{b3}$  が H であり、 $R^{b4}$  が Cl であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0326】

50

## 表 1 2 4

化合物についての  $R^a$  が  $\text{NO}_2$  であり、 $R^{b\ 2}$  が F であり、 $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が Br であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 3 2 7】

## 表 1 2 5

化合物についての  $R^a$  が  $\text{NO}_2$  であり、 $R^{b\ 2}$  が F であり、 $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が  $\text{CH}_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 3 2 8】

## 表 1 2 6

化合物についての  $R^a$  が  $\text{NO}_2$  であり、 $R^{b\ 2}$  が F であり、 $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が  $\text{OCH}_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 3 2 9】

## 表 1 2 7

化合物についての  $R^a$  が  $\text{NO}_2$  であり、 $R^{b\ 2}$  が F であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が H であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 3 3 0】

## 表 1 2 8

化合物についての  $R^a$  が  $\text{NO}_2$  であり、 $R^{b\ 2}$  が F であり、 $R^{b\ 3}$  であり、 $R^{b\ 4}$  が F であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 3 3 1】

## 表 1 2 9

化合物についての  $R^a$  が  $\text{NO}_2$  であり、 $R^{b\ 2}$  が F であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が Cl であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 3 3 2】

## 表 1 3 0

化合物についての  $R^a$  が  $\text{NO}_2$  であり、 $R^{b\ 2}$  が F であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が Br であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 3 3 3】

## 表 1 3 1

化合物についての  $R^a$  が  $\text{NO}_2$  であり、 $R^{b\ 2}$  が F であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が  $\text{CH}_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 3 3 4】

## 表 1 3 2

化合物についての  $R^a$  が  $\text{NO}_2$  であり、 $R^{b\ 2}$  が F であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が  $\text{OCH}_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 3 3 5】

## 表 1 3 3

化合物についての  $R^a$  が  $\text{CH}_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が F であり、 $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が H であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 3 3 6】

10

20

30

40

50

## 表 1 3 4

化合物についての  $R^a$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が F であり、 $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が F であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 3 3 7】

## 表 1 3 5

化合物についての  $R^a$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が F であり、 $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が Cl であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 3 3 8】

## 表 1 3 6

化合物についての  $R^a$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が F であり、 $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が Br であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 3 3 9】

## 表 1 3 7

化合物についての  $R^a$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が F であり、 $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 3 4 0】

## 表 1 3 8

化合物についての  $R^a$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が F であり、 $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 3 4 1】

## 表 1 3 9

化合物についての  $R^a$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が F であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が H であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 3 4 2】

## 表 1 4 0

化合物についての  $R^a$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が F であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が F であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 3 4 3】

## 表 1 4 1

化合物についての  $R^a$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が F であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が Cl であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 3 4 4】

## 表 1 4 2

化合物についての  $R^a$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が F であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が Br であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 3 4 5】

## 表 1 4 3

化合物についての  $R^a$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が F であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 3 4 6】

10

20

30

40

50

## 表 1 4 4

化合物についての  $R^a$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b2}$  が F であり、 $R^{b3}$  が F であり、 $R^{b4}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0347】

## 表 1 4 5

化合物についての  $R^a$  が  $CF_3$  であり、 $R^{b2}$  が F であり、 $R^{b3}$  が H であり、 $R^{b4}$  が H であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0348】

10

## 表 1 4 6

化合物についての  $R^a$  が  $CF_3$  であり、 $R^{b2}$  が F であり、 $R^{b3}$  が H であり、 $R^{b4}$  が F であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0349】

## 表 1 4 7

化合物についての  $R^a$  が  $CF_3$  であり、 $R^{b2}$  が F であり、 $R^{b3}$  が H であり、 $R^{b4}$  が Cl であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0350】

20

## 表 1 4 8

化合物についての  $R^a$  が  $CF_3$  であり、 $R^{b2}$  が F であり、 $R^{b3}$  が H であり、 $R^{b4}$  が Br であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0351】

## 表 1 4 9

化合物についての  $R^a$  が  $CF_3$  であり、 $R^{b2}$  が F であり、 $R^{b3}$  が H であり、 $R^{b4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0352】

30

## 表 1 5 0

化合物についての  $R^a$  が  $CF_3$  であり、 $R^{b2}$  が F であり、 $R^{b3}$  が H であり、 $R^{b4}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0353】

## 表 1 5 1

化合物についての  $R^a$  が  $CF_3$  であり、 $R^{b2}$  が F であり、 $R^{b3}$  が F であり、 $R^{b4}$  が H であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0354】

40

## 表 1 5 2

化合物についての  $R^a$  が  $CF_3$  であり、 $R^{b2}$  が F であり、 $R^{b3}$  が F であり、 $R^{b4}$  が F であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0355】

## 表 1 5 3

化合物についての  $R^a$  が  $CF_3$  であり、 $R^{b2}$  が F であり、 $R^{b3}$  が F であり、 $R^{b4}$  が Cl であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0356】

50

## 表 1 5 4

化合物についての  $R^a$  が  $CF_3$  であり、 $R^{b2}$  が F であり、 $R^{b3}$  が F であり、 $R^{b4}$  が Br であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0357】

## 表 1 5 5

化合物についての  $R^a$  が  $CF_3$  であり、 $R^{b2}$  が F であり、 $R^{b3}$  が F であり、 $R^{b4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0358】

10

## 表 1 5 6

化合物についての  $R^a$  が  $CF_3$  であり、 $R^{b2}$  が F であり、 $R^{b3}$  が F であり、 $R^{b4}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0359】

## 表 1 5 7

化合物についての  $R^a$  が  $OCH_3$  であり、 $R^{b2}$  が F であり、 $R^{b3}$  が H であり、 $R^{b4}$  が H であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0360】

20

## 表 1 5 8

化合物についての  $R^a$  が  $OCH_3$  であり、 $R^{b2}$  が F であり、 $R^{b3}$  が H であり、 $R^{b4}$  が F であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0361】

## 表 1 5 9

化合物についての  $R^a$  が  $OCH_3$  であり、 $R^{b2}$  が F であり、 $R^{b3}$  が H であり、 $R^{b4}$  が Cl であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0362】

30

## 表 1 6 0

化合物についての  $R^a$  が  $OCH_3$  であり、 $R^{b2}$  が F であり、 $R^{b3}$  が H であり、 $R^{b4}$  が Br であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0363】

## 表 1 6 1

化合物についての  $R^a$  が  $OCH_3$  であり、 $R^{b2}$  が F であり、 $R^{b3}$  が H であり、 $R^{b4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0364】

40

## 表 1 6 2

化合物についての  $R^a$  が  $OCH_3$  であり、 $R^{b2}$  が F であり、 $R^{b3}$  が H であり、 $R^{b4}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0365】

## 表 1 6 3

化合物についての  $R^a$  が  $OCH_3$  であり、 $R^{b2}$  が F であり、 $R^{b3}$  が F であり、 $R^{b4}$  が H であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0366】

50

## 表 1 6 4

化合物についての  $R^a$  が  $OC H_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が F であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が F であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 3 6 7】

## 表 1 6 5

化合物についての  $R^a$  が  $OC H_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が F であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が Cl であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 3 6 8】

10

## 表 1 6 6

化合物についての  $R^a$  が  $OC H_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が F であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が Br であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 3 6 9】

## 表 1 6 7

化合物についての  $R^a$  が  $OC H_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が F であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 3 7 0】

20

## 表 1 6 8

化合物についての  $R^a$  が  $OC H_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が F であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が  $OC H_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 3 7 1】

## 表 1 6 9

化合物についての  $R^a$  が  $OC_2 H_5$  であり、 $R^{b\ 2}$  が F であり、 $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が H であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 3 7 2】

30

## 表 1 7 0

化合物についての  $R^a$  が  $OC_2 H_5$  であり、 $R^{b\ 2}$  が F であり、 $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が F であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 3 7 3】

## 表 1 7 1

化合物についての  $R^a$  が  $OC_2 H_5$  であり、 $R^{b\ 2}$  が F であり、 $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が Cl であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 3 7 4】

40

## 表 1 7 2

化合物についての  $R^a$  が  $OC_2 H_5$  であり、 $R^{b\ 2}$  が F であり、 $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が Br であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 3 7 5】

## 表 1 7 3

化合物についての  $R^a$  が  $OC_2 H_5$  であり、 $R^{b\ 2}$  が F であり、 $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 3 7 6】

50

## 表 1 7 4

化合物についての  $R^a$  が  $OC_2H_5$  であり、 $R^{b2}$  が F であり、 $R^{b3}$  が H であり、 $R^{b4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0377】

## 表 1 7 5

化合物についての  $R^a$  が  $OC_2H_5$  であり、 $R^{b2}$  が F であり、 $R^{b3}$  が F であり、 $R^{b4}$  が H であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0378】

10

## 表 1 7 6

化合物についての  $R^a$  が  $OC_2H_5$  であり、 $R^{b2}$  が F であり、 $R^{b3}$  が F であり、 $R^{b4}$  が F であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0379】

## 表 1 7 7

化合物についての  $R^a$  が  $OC_2H_5$  であり、 $R^{b2}$  が F であり、 $R^{b3}$  が F であり、 $R^{b4}$  が Cl であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0380】

20

## 表 1 7 8

化合物についての  $R^a$  が  $OC_2H_5$  であり、 $R^{b2}$  が F であり、 $R^{b3}$  が F であり、 $R^{b4}$  が Br であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0381】

## 表 1 7 9

化合物についての  $R^a$  が  $OC_2H_5$  であり、 $R^{b2}$  が F であり、 $R^{b3}$  が F であり、 $R^{b4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0382】

30

## 表 1 8 0

化合物についての  $R^a$  が  $OC_2H_5$  であり、 $R^{b2}$  が F であり、 $R^{b3}$  が F であり、 $R^{b4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0383】

## 表 1 8 1

化合物についての  $R^a$  が モルホリン-1-イル であり、 $R^{b2}$  が F 及び  $R^{b3}$  が H であり、 $R^{b4}$  が H であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0384】

40

## 表 1 8 2

化合物についての  $R^a$  が モルホリン-1-イル であり、 $R^{b2}$  が F 及び  $R^{b3}$  が H であり、 $R^{b4}$  が F であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0385】

## 表 1 8 3

化合物についての  $R^a$  が モルホリン-1-イル であり、 $R^{b2}$  が F 及び  $R^{b3}$  が H であり、 $R^{b4}$  が Cl であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0386】

50

## 表 1 8 4

化合物についての  $R^a$  がモルホリン-1-イルであり、 $R^{b\ 2}$  が F 及び  $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が Br であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0387】

## 表 1 8 5

化合物についての  $R^a$  がモルホリン-1-イルであり、 $R^{b\ 2}$  が F 及び  $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0388】

## 表 1 8 6

化合物についての  $R^a$  がモルホリン-1-イルであり、 $R^{b\ 2}$  が F 及び  $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0389】

## 表 1 8 7

化合物についての  $R^a$  がモルホリン-1-イルであり、 $R^{b\ 2}$  が F であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が H であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0390】

## 表 1 8 8

化合物についての  $R^a$  がモルホリン-1-イルであり、 $R^{b\ 2}$  が F であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が F であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0391】

## 表 1 8 9

化合物についての  $R^a$  がモルホリン-1-イルであり、 $R^{b\ 2}$  が F であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が Cl であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0392】

## 表 1 9 0

化合物についての  $R^a$  がモルホリン-1-イルであり、 $R^{b\ 2}$  が F であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が Br であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0393】

## 表 1 9 1

化合物についての  $R^a$  がモルホリン-1-イルであり、 $R^{b\ 2}$  が F であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0394】

## 表 1 9 2

化合物についての  $R^a$  がモルホリン-1-イルであり、 $R^{b\ 2}$  が F であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0395】

## 表 1 9 3

化合物についての  $R^a$  が CN であり、 $R^{b\ 2}$  が Cl であり、 $R^{b\ 3}$  であり、 $R^{b\ 4}$  が H であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0396】

10

20

30

40

50

## 表 1 9 4

化合物についての  $R^a$  が CN であり、 $R^{b\ 2}$  が Cl であり、 $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が F であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0397】

## 表 1 9 5

化合物についての  $R^a$  が CN であり、 $R^{b\ 2}$  が Cl であり、 $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が Cl であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0398】

10

## 表 1 9 6

化合物についての  $R^a$  が CN であり、 $R^{b\ 2}$  が Cl であり、 $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が Br であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0399】

## 表 1 9 7

化合物についての  $R^a$  が CN であり、 $R^{b\ 2}$  が Cl であり、 $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0400】

20

## 表 1 9 8

化合物についての  $R^a$  が CN であり、 $R^{b\ 2}$  が Cl であり、 $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0401】

## 表 1 9 9

化合物についての  $R^a$  が CN であり、 $R^{b\ 2}$  が Cl であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が H であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0402】

30

## 表 2 0 0

化合物についての  $R^a$  が CN であり、 $R^{b\ 2}$  が Cl であり、 $R^{b\ 3}$  であり、 $R^{b\ 4}$  が F であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0403】

## 表 2 0 1

化合物についての  $R^a$  が CN であり、 $R^{b\ 2}$  が Cl であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が Cl であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0404】

40

## 表 2 0 2

化合物についての  $R^a$  が CN であり、 $R^{b\ 2}$  が Cl であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が Br であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0405】

## 表 2 0 3

化合物についての  $R^a$  が CN であり、 $R^{b\ 2}$  が Cl であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0406】

50

## 表 2 0 4

化合物についての  $R^a$  が CN であり、 $R^{b\ 2}$  が Cl であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0407】

## 表 2 0 5

化合物についての  $R^a$  が Cl であり、 $R^{b\ 2}$  が Cl であり、 $R^{b\ 3}$  であり、 $R^{b\ 4}$  が H であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0408】

10

## 表 2 0 6

化合物についての  $R^a$  が Cl であり、 $R^{b\ 2}$  が Cl であり、 $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が F であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0409】

## 表 2 0 7

化合物についての  $R^a$  が Cl であり、 $R^{b\ 2}$  が Cl であり、 $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が Cl であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0410】

20

## 表 2 0 8

化合物についての  $R^a$  が Cl であり、 $R^{b\ 2}$  が Cl であり、 $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が Br であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0411】

## 表 2 0 9

化合物についての  $R^a$  が Cl であり、 $R^{b\ 2}$  が Cl であり、 $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0412】

30

## 表 2 1 0

化合物についての  $R^a$  が Cl であり、 $R^{b\ 2}$  が Cl であり、 $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0413】

## 表 2 1 1

化合物についての  $R^a$  が Cl であり、 $R^{b\ 2}$  が Cl であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が H であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0414】

40

## 表 2 1 2

化合物についての  $R^a$  が Cl であり、 $R^{b\ 2}$  が Cl であり、 $R^{b\ 3}$  であり、 $R^{b\ 4}$  が F であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0415】

## 表 2 1 3

化合物についての  $R^a$  が Cl であり、 $R^{b\ 2}$  が Cl であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が Cl であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0416】

50

## 表 2 1 4

化合物についての  $R^a$  が C 1 であり、 $R^{b\ 2}$  が C 1 であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が Br であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 4 1 7】

## 表 2 1 5

化合物についての  $R^a$  が C 1 であり、 $R^{b\ 2}$  が C 1 であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 4 1 8】

10

## 表 2 1 6

化合物についての  $R^a$  が C 1 であり、 $R^{b\ 2}$  が C 1 であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 4 1 9】

## 表 2 1 7

化合物についての  $R^a$  が  $NO_2$  であり、 $R^{b\ 2}$  が C 1 であり、 $R^{b\ 3}$  であり、 $R^{b\ 4}$  が H であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 4 2 0】

20

## 表 2 1 8

化合物についての  $R^a$  が  $NO_2$  であり、 $R^{b\ 2}$  が C 1 であり、 $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が F であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 4 2 1】

## 表 2 1 9

化合物についての  $R^a$  が  $NO_2$  であり、 $R^{b\ 2}$  が C 1 であり、 $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が C 1 であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 4 2 2】

30

## 表 2 2 0

化合物についての  $R^a$  が  $NO_2$  であり、 $R^{b\ 2}$  が C 1 であり、 $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が Br であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 4 2 3】

## 表 2 2 1

化合物についての  $R^a$  が  $NO_2$  であり、 $R^{b\ 2}$  が C 1 であり、 $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 4 2 4】

40

## 表 2 2 2

化合物についての  $R^a$  が  $NO_2$  であり、 $R^{b\ 2}$  が C 1 であり、 $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 4 2 5】

## 表 2 2 3

化合物についての  $R^a$  が  $NO_2$  であり、 $R^{b\ 2}$  が C 1 であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が H であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 4 2 6】

50

## 表 2 2 4

化合物についての  $R^a$  が  $\text{NO}_2$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $\text{Cl}$  であり、 $R^{b\ 3}$  であり、 $R^{b\ 4}$  が  $\text{F}$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 4 2 7】

## 表 2 2 5

化合物についての  $R^a$  が  $\text{NO}_2$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $\text{Cl}$  であり、 $R^{b\ 3}$  が  $\text{F}$  であり、 $R^{b\ 4}$  が  $\text{Cl}$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 4 2 8】

10

## 表 2 2 6

化合物についての  $R^a$  が  $\text{NO}_2$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $\text{Cl}$  であり、 $R^{b\ 3}$  が  $\text{F}$  であり、 $R^{b\ 4}$  が  $\text{Br}$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 4 2 9】

## 表 2 2 7

化合物についての  $R^a$  が  $\text{NO}_2$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $\text{Cl}$  であり、 $R^{b\ 3}$  が  $\text{F}$  であり、 $R^{b\ 4}$  が  $\text{CH}_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 4 3 0】

20

## 表 2 2 8

化合物についての  $R^a$  が  $\text{NO}_2$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $\text{Cl}$  であり、 $R^{b\ 3}$  が  $\text{F}$  であり、 $R^{b\ 4}$  が  $\text{OCH}_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 4 3 1】

## 表 2 2 9

化合物についての  $R^a$  が  $\text{CH}_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $\text{Cl}$  であり、 $R^{b\ 3}$  が  $\text{H}$  であり、 $R^{b\ 4}$  が  $\text{H}$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 4 3 2】

30

## 表 2 3 0

化合物についての  $R^a$  が  $\text{CH}_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $\text{Cl}$  であり、 $R^{b\ 3}$  が  $\text{H}$  であり、 $R^{b\ 4}$  が  $\text{F}$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 4 3 3】

## 表 2 3 1

化合物についての  $R^a$  が  $\text{CH}_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $\text{Cl}$  であり、 $R^{b\ 3}$  が  $\text{H}$  であり、 $R^{b\ 4}$  が  $\text{Cl}$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 4 3 4】

40

## 表 2 3 2

化合物についての  $R^a$  が  $\text{CH}_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $\text{Cl}$  であり、 $R^{b\ 3}$  が  $\text{H}$  であり、 $R^{b\ 4}$  が  $\text{Br}$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 4 3 5】

## 表 2 3 3

化合物についての  $R^a$  が  $\text{CH}_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $\text{Cl}$  であり、 $R^{b\ 3}$  が  $\text{H}$  であり、 $R^{b\ 4}$  が  $\text{CH}_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 4 3 6】

50

## 表 2 3 4

化合物についての  $R^a$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $Cl$  であり、 $R^{b\ 3}$  が  $H$  であり、 $R^{b\ 4}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 4 3 7】

## 表 2 3 5

化合物についての  $R^a$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $Cl$  であり、 $R^{b\ 3}$  が  $F$  であり、 $R^{b\ 4}$  が  $H$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 4 3 8】

10

## 表 2 3 6

化合物についての  $R^a$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $Cl$  であり、 $R^{b\ 3}$  が  $F$  であり、 $R^{b\ 4}$  が  $F$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 4 3 9】

## 表 2 3 7

化合物についての  $R^a$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $Cl$  であり、 $R^{b\ 3}$  が  $F$  であり、 $R^{b\ 4}$  が  $Cl$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 4 4 0】

20

## 表 2 3 8

化合物についての  $R^a$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $Cl$  であり、 $R^{b\ 3}$  が  $F$  であり、 $R^{b\ 4}$  が  $Br$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 4 4 1】

## 表 2 3 9

化合物についての  $R^a$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $Cl$  であり、 $R^{b\ 3}$  が  $F$  であり、 $R^{b\ 4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 4 4 2】

30

## 表 2 4 0

化合物についての  $R^a$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $Cl$  であり、 $R^{b\ 3}$  が  $F$  であり、 $R^{b\ 4}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 4 4 3】

## 表 2 4 1

化合物についての  $R^a$  が  $CF_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $Cl$  であり、 $R^{b\ 3}$  が  $H$  であり、 $R^{b\ 4}$  が  $H$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 4 4 4】

40

## 表 2 4 2

化合物についての  $R^a$  が  $CF_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $Cl$  であり、 $R^{b\ 3}$  が  $H$  であり、 $R^{b\ 4}$  が  $F$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 4 4 5】

## 表 2 4 3

化合物についての  $R^a$  が  $CF_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $Cl$  であり、 $R^{b\ 3}$  が  $H$  であり、 $R^{b\ 4}$  が  $Cl$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 4 4 6】

50

## 表 2 4 4

化合物についての  $R^a$  が  $CF_3$  であり、 $R^{b2}$  が  $Cl$  であり、 $R^{b3}$  が  $H$  であり、 $R^{b4}$  が  $Br$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0447】

## 表 2 4 5

化合物についての  $R^a$  が  $CF_3$  であり、 $R^{b2}$  が  $Cl$  であり、 $R^{b3}$  が  $H$  であり、 $R^{b4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0448】

10

## 表 2 4 6

化合物についての  $R^a$  が  $CF_3$  であり、 $R^{b2}$  が  $F$  であり、 $R^{b3}$  が  $H$  であり、 $R^{b4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0449】

## 表 2 4 7

化合物についての  $R^a$  が  $CF_3$  であり、 $R^{b2}$  が  $Cl$  であり、 $R^{b3}$  が  $F$  であり、 $R^{b4}$  が  $H$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0450】

20

## 表 2 4 8

化合物についての  $R^a$  が  $CF_3$  であり、 $R^{b2}$  が  $Cl$  であり、 $R^{b3}$  が  $F$  であり、 $R^{b4}$  が  $F$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0451】

## 表 2 4 9

化合物についての  $R^a$  が  $CF_3$  であり、 $R^{b2}$  が  $Cl$  であり、 $R^{b3}$  が  $F$  であり、 $R^{b4}$  が  $Cl$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0452】

30

## 表 2 5 0

化合物についての  $R^a$  が  $CF_3$  であり、 $R^{b2}$  が  $Cl$  であり、 $R^{b3}$  が  $F$  であり、 $R^{b4}$  が  $Br$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0453】

## 表 2 5 1

化合物についての  $R^a$  が  $CF_3$  であり、 $R^{b2}$  が  $Cl$  であり、 $R^{b3}$  が  $F$  であり、 $R^{b4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0454】

40

## 表 2 5 2

化合物についての  $R^a$  が  $CF_3$  であり、 $R^{b2}$  が  $Cl$  であり、 $R^{b3}$  が  $F$  であり、 $R^{b4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0455】

## 表 2 5 3

化合物についての  $R^a$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b2}$  が  $Cl$  であり、 $R^{b3}$  が  $H$  であり、 $R^{b4}$  が  $H$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0456】

50

## 表 2 5 4

化合物についての  $R^a$  が  $OC H_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $Cl$  であり、 $R^{b\ 3}$  が  $H$  であり、 $R^{b\ 4}$  が  $F$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 4 5 7】

## 表 2 5 5

化合物についての  $R^a$  が  $OC H_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $Cl$  であり、 $R^{b\ 3}$  が  $H$  であり、 $R^{b\ 4}$  が  $Cl$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 4 5 8】

10

## 表 2 5 6

化合物についての  $R^a$  が  $OC H_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $Cl$  であり、 $R^{b\ 3}$  が  $H$  であり、 $R^{b\ 4}$  が  $Br$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 4 5 9】

## 表 2 5 7

化合物についての  $R^a$  が  $OC H_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $Cl$  であり、 $R^{b\ 3}$  が  $H$  であり、 $R^{b\ 4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 4 6 0】

20

## 表 2 5 8

化合物についての  $R^a$  が  $OC H_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $Cl$  であり、 $R^{b\ 3}$  が  $H$  であり、 $R^{b\ 4}$  が  $OC H_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 4 6 1】

## 表 2 5 9

化合物についての  $R^a$  が  $OC H_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $Cl$  であり、 $R^{b\ 3}$  が  $F$  であり、 $R^{b\ 4}$  が  $H$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 4 6 2】

30

## 表 2 6 0

化合物についての  $R^a$  が  $OC H_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $Cl$  であり、 $R^{b\ 3}$  が  $F$  であり、 $R^{b\ 4}$  が  $F$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 4 6 3】

## 表 2 6 1

化合物についての  $R^a$  が  $OC H_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $Cl$  であり、 $R^{b\ 3}$  が  $F$  であり、 $R^{b\ 4}$  が  $Cl$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 4 6 4】

40

## 表 2 6 2

化合物についての  $R^a$  が  $OC H_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $Cl$  であり、 $R^{b\ 3}$  が  $F$  であり、 $R^{b\ 4}$  が  $Br$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 4 6 5】

## 表 2 6 3

化合物についての  $R^a$  が  $OC H_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $Cl$  であり、 $R^{b\ 3}$  が  $F$  であり、 $R^{b\ 4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 4 6 6】

50

## 表 2 6 4

化合物についての  $R^a$  が  $OC_2H_5$  であり、 $R^{b2}$  が  $Cl$  であり、 $R^{b3}$  が  $F$  であり、 $R^{b4}$  が  $OC_2H_5$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0467】

## 表 2 6 5

化合物についての  $R^a$  が  $OC_2H_5$  であり、 $R^{b2}$  が  $Cl$  であり、 $R^{b3}$  が  $H$  であり、 $R^{b4}$  が  $H$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0468】

## 表 2 6 6

化合物についての  $R^a$  が  $OC_2H_5$  であり、 $R^{b2}$  が  $Cl$  であり、 $R^{b3}$  が  $H$  であり、 $R^{b4}$  が  $F$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0469】

## 表 2 6 7

化合物についての  $R^a$  が  $OC_2H_5$  であり、 $R^{b2}$  が  $Cl$  であり、 $R^{b3}$  が  $H$  であり、 $R^{b4}$  が  $Cl$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0470】

## 表 2 6 8

化合物についての  $R^a$  が  $OC_2H_5$  であり、 $R^{b2}$  が  $Cl$  であり、 $R^{b3}$  が  $H$  であり、 $R^{b4}$  が  $Br$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0471】

## 表 2 6 9

化合物についての  $R^a$  が  $OC_2H_5$  であり、 $R^{b2}$  が  $Cl$  であり、 $R^{b3}$  が  $H$  であり、 $R^{b4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0472】

## 表 2 7 0

化合物についての  $R^a$  が  $OC_2H_5$  であり、 $R^{b2}$  が  $Cl$  であり、 $R^{b3}$  が  $H$  であり、 $R^{b4}$  が  $OC_2H_5$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0473】

## 表 2 7 1

化合物についての  $R^a$  が  $OC_2H_5$  であり、 $R^{b2}$  が  $Cl$  であり、 $R^{b3}$  が  $F$  であり、 $R^{b4}$  が  $H$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0474】

## 表 2 7 2

化合物についての  $R^a$  が  $OC_2H_5$  であり、 $R^{b2}$  が  $Cl$  であり、 $R^{b3}$  が  $F$  であり、 $R^{b4}$  が  $F$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0475】

## 表 2 7 3

化合物についての  $R^a$  が  $OC_2H_5$  であり、 $R^{b2}$  が  $Cl$  であり、 $R^{b3}$  が  $F$  であり、 $R^{b4}$  が  $Cl$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0476】

10

20

30

40

50

## 表 2 7 4

化合物についての  $R^a$  が  $OC_2H_5$  であり、 $R^{b2}$  が  $Cl$  であり、 $R^{b3}$  が  $F$  であり、 $R^{b4}$  が  $Br$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0477】

## 表 2 7 5

化合物についての  $R^a$  が  $OC_2H_5$  であり、 $R^{b2}$  が  $Cl$  であり、 $R^{b3}$  が  $F$  であり、 $R^{b4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0478】

10

## 表 2 7 6

化合物についての  $R^a$  が  $OC_2H_5$  であり、 $R^{b2}$  が  $Cl$  であり、 $R^{b3}$  が  $F$  であり、 $R^{b4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0479】

## 表 2 7 7

化合物についての  $R^a$  が モルホリン-1-イルであり、 $R^{b2}$  が  $Cl$  及び  $R^{b3}$  が  $H$  であり、 $R^{b4}$  が  $H$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0480】

20

## 表 2 7 8

化合物についての  $R^a$  が モルホリン-1-イルであり、 $R^{b2}$  が  $Cl$  及び  $R^{b3}$  が  $H$  であり、 $R^{b4}$  が  $F$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0481】

## 表 2 7 9

化合物についての  $R^a$  が モルホリン-1-イルであり、 $R^{b2}$  が  $Cl$  及び  $R^{b3}$  が  $H$  であり、 $R^{b4}$  が  $Cl$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0482】

30

## 表 2 8 0

化合物についての  $R^a$  が モルホリン-1-イルであり、 $R^{b2}$  が  $Cl$  及び  $R^{b3}$  が  $H$  であり、 $R^{b4}$  が  $Br$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0483】

## 表 2 8 1

化合物についての  $R^a$  が モルホリン-1-イルであり、 $R^{b2}$  が  $Cl$  及び  $R^{b3}$  が  $H$  であり、 $R^{b4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0484】

40

## 表 2 8 2

化合物についての  $R^a$  が モルホリン-1-イルであり、 $R^{b2}$  が  $Cl$  及び  $R^{b3}$  が  $H$  であり、 $R^{b4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0485】

## 表 2 8 3

化合物についての  $R^a$  が モルホリン-1-イルであり、 $R^{b2}$  が  $Cl$  であり、 $R^{b3}$  が  $F$  であり、 $R^{b4}$  が  $H$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0486】

50

## 表 2 8 4

化合物についての  $R^a$  がモルホリン-1-イルであり、 $R^{b\ 2}$  が Cl であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が F であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 4 8 7】

## 表 2 8 5

化合物についての  $R^a$  がモルホリン-1-イルであり、 $R^{b\ 2}$  が Cl であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が Cl であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 4 8 8】

## 表 2 8 6

化合物についての  $R^a$  がモルホリン-1-イルであり、 $R^{b\ 2}$  が Cl であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が Br であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 4 8 9】

## 表 2 8 7

化合物についての  $R^a$  がモルホリン-1-イルであり、 $R^{b\ 2}$  が Cl であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 4 9 0】

## 表 2 8 8

化合物についての  $R^a$  がモルホリン-1-イルであり、 $R^{b\ 2}$  が Cl であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 4 9 1】

## 表 2 8 9

化合物についての  $R^a$  が CN であり、 $R^{b\ 2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  であり、 $R^{b\ 4}$  が H であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 4 9 2】

## 表 2 9 0

化合物についての  $R^a$  が CN であり、 $R^{b\ 2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が F であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 4 9 3】

## 表 2 9 1

化合物についての  $R^a$  が CN であり、 $R^{b\ 2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が Cl であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 4 9 4】

## 表 2 9 2

化合物についての  $R^a$  が CN であり、 $R^{b\ 2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が Br であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 4 9 5】

## 表 2 9 3

化合物についての  $R^a$  が CN であり、 $R^{b\ 2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 4 9 6】

10

20

30

40

50

## 表 2 9 4

化合物についての  $R^a$  が CN であり、 $R^{b\ 2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0497】

## 表 2 9 5

化合物についての  $R^a$  が CN であり、 $R^{b\ 2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が H であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0498】

10

## 表 2 9 6

化合物についての  $R^a$  が CN であり、 $R^{b\ 2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  であり、 $R^{b\ 4}$  が F であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0499】

## 表 2 9 7

化合物についての  $R^a$  が CN であり、 $R^{b\ 2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が Cl であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0500】

20

## 表 2 9 8

化合物についての  $R^a$  が CN であり、 $R^{b\ 2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が Br であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0501】

## 表 2 9 9

化合物についての  $R^a$  が CN であり、 $R^{b\ 2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0502】

30

## 表 3 0 0

化合物についての  $R^a$  が CN であり、 $R^{b\ 2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0503】

## 表 3 0 1

化合物についての  $R^a$  が Cl であり、 $R^{b\ 2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  であり、 $R^{b\ 4}$  が H であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0504】

40

## 表 3 0 2

化合物についての  $R^a$  が Cl であり、 $R^{b\ 2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が F であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0505】

## 表 3 0 3

化合物についての  $R^a$  が Cl であり、 $R^{b\ 2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が Cl であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0506】

50

## 表 3 0 4

化合物についての  $R^a$  が  $Cl$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が  $H$  であり、 $R^{b\ 4}$  が  $Br$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0507】

## 表 3 0 5

化合物についての  $R^a$  が  $Cl$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が  $H$  であり、 $R^{b\ 4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0508】

10

## 表 3 0 6

化合物についての  $R^a$  が  $Cl$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が  $H$  であり、 $R^{b\ 4}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0509】

## 表 3 0 7

化合物についての  $R^a$  が  $Cl$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が  $F$  であり、 $R^{b\ 4}$  が  $H$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0510】

20

## 表 3 0 8

化合物についての  $R^a$  が  $Cl$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  であり、 $R^{b\ 4}$  が  $F$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0511】

## 表 3 0 9

化合物についての  $R^a$  が  $Cl$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が  $F$  であり、 $R^{b\ 4}$  が  $Cl$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0512】

30

## 表 3 1 0

化合物についての  $R^a$  が  $Cl$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が  $F$  であり、 $R^{b\ 4}$  が  $Br$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0513】

## 表 3 1 1

化合物についての  $R^a$  が  $Cl$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が  $F$  であり、 $R^{b\ 4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0514】

40

## 表 3 1 2

化合物についての  $R^a$  が  $Cl$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が  $F$  であり、 $R^{b\ 4}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0515】

## 表 3 1 3

化合物についての  $R^a$  が  $NO_2$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  であり、 $R^{b\ 4}$  が  $H$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0516】

50

## 表 3 1 4

化合物についての  $R^a$  が  $\text{NO}_2$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $\text{CH}_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が  $\text{H}$  であり、 $R^{b\ 4}$  が  $\text{F}$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 5 1 7】

## 表 3 1 5

化合物についての  $R^a$  が  $\text{NO}_2$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $\text{CH}_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が  $\text{H}$  であり、 $R^{b\ 4}$  が  $\text{Cl}$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 5 1 8】

## 表 3 1 6

化合物についての  $R^a$  が  $\text{NO}_2$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $\text{CH}_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が  $\text{H}$  であり、 $R^{b\ 4}$  が  $\text{Br}$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 5 1 9】

## 表 3 1 7

化合物についての  $R^a$  が  $\text{NO}_2$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $\text{CH}_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が  $\text{H}$  であり、 $R^{b\ 4}$  が  $\text{CH}_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 5 2 0】

## 表 3 1 8

化合物についての  $R^a$  が  $\text{NO}_2$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $\text{CH}_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が  $\text{H}$  であり、 $R^{b\ 4}$  が  $\text{OCH}_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 5 2 1】

## 表 3 1 9

化合物についての  $R^a$  が  $\text{NO}_2$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $\text{CH}_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が  $\text{F}$  であり、 $R^{b\ 4}$  が  $\text{H}$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 5 2 2】

## 表 3 2 0

化合物についての  $R^a$  が  $\text{NO}_2$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $\text{CH}_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  であり、 $R^{b\ 4}$  が  $\text{F}$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 5 2 3】

## 表 3 2 1

化合物についての  $R^a$  が  $\text{NO}_2$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $\text{CH}_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が  $\text{F}$  であり、 $R^{b\ 4}$  が  $\text{Cl}$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 5 2 4】

## 表 3 2 2

化合物についての  $R^a$  が  $\text{NO}_2$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $\text{CH}_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が  $\text{F}$  であり、 $R^{b\ 4}$  が  $\text{Br}$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 5 2 5】

## 表 3 2 3

化合物についての  $R^a$  が  $\text{NO}_2$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $\text{CH}_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が  $\text{F}$  であり、 $R^{b\ 4}$  が  $\text{CH}_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 5 2 6】

10

20

30

40

50

## 表 3 2 4

化合物についての  $R^a$  が  $\text{NO}_2$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $\text{CH}_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が  $\text{F}$  であり、 $R^{b\ 4}$  が  $\text{OCH}_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0527】

## 表 3 2 5

化合物についての  $R^a$  が  $\text{CH}_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $\text{CH}_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が  $\text{H}$  であり、 $R^{b\ 4}$  が  $\text{H}$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0528】

10

## 表 3 2 6

化合物についての  $R^a$  が  $\text{CH}_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $\text{CH}_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が  $\text{H}$  であり、 $R^{b\ 4}$  が  $\text{F}$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0529】

## 表 3 2 7

化合物についての  $R^a$  が  $\text{CH}_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $\text{CH}_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が  $\text{H}$  であり、 $R^{b\ 4}$  が  $\text{Cl}$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0530】

20

## 表 3 2 8

化合物についての  $R^a$  が  $\text{CH}_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $\text{CH}_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が  $\text{H}$  であり、 $R^{b\ 4}$  が  $\text{Br}$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0531】

## 表 3 2 9

化合物についての  $R^a$  が  $\text{CH}_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $\text{CH}_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が  $\text{H}$  であり、 $R^{b\ 4}$  が  $\text{CH}_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0532】

30

## 表 3 3 0

化合物についての  $R^a$  が  $\text{CH}_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $\text{CH}_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が  $\text{H}$  であり、 $R^{b\ 4}$  が  $\text{OCH}_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0533】

## 表 3 3 1

化合物についての  $R^a$  が  $\text{CH}_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $\text{CH}_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が  $\text{F}$  であり、 $R^{b\ 4}$  が  $\text{H}$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0534】

40

## 表 3 3 2

化合物についての  $R^a$  が  $\text{CH}_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $\text{CH}_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が  $\text{F}$  であり、 $R^{b\ 4}$  が  $\text{F}$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0535】

## 表 3 3 3

化合物についての  $R^a$  が  $\text{CH}_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $\text{CH}_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が  $\text{F}$  であり、 $R^{b\ 4}$  が  $\text{Cl}$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0536】

50

## 表 3 3 4

化合物についての  $R^a$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が Br であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0537】

## 表 3 3 5

化合物についての  $R^a$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0538】

10

## 表 3 3 6

化合物についての  $R^a$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0539】

## 表 3 3 7

化合物についての  $R^a$  が  $CF_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が H であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0540】

20

## 表 3 3 8

化合物についての  $R^a$  が  $CF_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が F であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0541】

## 表 3 3 9

化合物についての  $R^a$  が  $CF_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が Cl であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0542】

30

## 表 3 4 0

化合物についての  $R^a$  が  $CF_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が Br であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0543】

## 表 3 4 1

化合物についての  $R^a$  が  $CF_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0544】

40

## 表 3 4 2

化合物についての  $R^a$  が  $CF_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0545】

## 表 3 4 3

化合物についての  $R^a$  が  $CF_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が H であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0546】

50

## 表 3 4 4

化合物についての  $R^a$  が  $CF_3$  であり、 $R^{b2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b3}$  が F であり、 $R^{b4}$  が F であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0547】

## 表 3 4 5

化合物についての  $R^a$  が  $CF_3$  であり、 $R^{b2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b3}$  が F であり、 $R^{b4}$  が Cl であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0548】

10

## 表 3 4 6

化合物についての  $R^a$  が  $CF_3$  であり、 $R^{b2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b3}$  が F であり、 $R^{b4}$  が Br であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0549】

## 表 3 4 7

化合物についての  $R^a$  が  $CF_3$  であり、 $R^{b2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b3}$  が F であり、 $R^{b4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0550】

20

## 表 3 4 8

化合物についての  $R^a$  が  $CF_3$  であり、 $R^{b2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b3}$  が F であり、 $R^{b4}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0551】

## 表 3 4 9

化合物についての  $R^a$  が  $OCH_3$  であり、 $R^{b2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b3}$  が H であり、 $R^{b4}$  が H であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0552】

30

## 表 3 5 0

化合物についての  $R^a$  が  $OCH_3$  であり、 $R^{b2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b3}$  が H であり、 $R^{b4}$  が F であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0553】

## 表 3 5 1

化合物についての  $R^a$  が  $OCH_3$  であり、 $R^{b2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b3}$  が H であり、 $R^{b4}$  が Cl であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0554】

40

## 表 3 5 2

化合物についての  $R^a$  が  $OCH_3$  であり、 $R^{b2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b3}$  が H であり、 $R^{b4}$  が Br であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0555】

## 表 3 5 3

化合物についての  $R^a$  が  $OCH_3$  であり、 $R^{b2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b3}$  が H であり、 $R^{b4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0556】

50

## 表 3 5 4

化合物についての  $R^a$  が  $OC H_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が  $OC H_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 5 5 7】

## 表 3 5 5

化合物についての  $R^a$  が  $OC H_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が H であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 5 5 8】

10

## 表 3 5 6

化合物についての  $R^a$  が  $OC H_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が F であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 5 5 9】

## 表 3 5 7

化合物についての  $R^a$  が  $OC H_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が Cl であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 5 6 0】

20

## 表 3 5 8

化合物についての  $R^a$  が  $OC H_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が Br であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 5 6 1】

## 表 3 5 9

化合物についての  $R^a$  が  $OC H_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 5 6 2】

30

## 表 3 6 0

化合物についての  $R^a$  が  $OC H_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が  $OC H_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 5 6 3】

## 表 3 6 1

化合物についての  $R^a$  が  $OC_2H_5$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が H であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 5 6 4】

40

## 表 3 6 2

化合物についての  $R^a$  が  $OC_2H_5$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が F であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 5 6 5】

## 表 3 6 3

化合物についての  $R^a$  が  $OC_2H_5$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が Cl であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 5 6 6】

50

## 表 3 6 4

化合物についての  $R^a$  が  $OC_2H_5$  であり、 $R^{b2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b3}$  が H であり、 $R^{b4}$  が Br であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0567】

## 表 3 6 5

化合物についての  $R^a$  が  $OC_2H_5$  であり、 $R^{b2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b3}$  が H であり、 $R^{b4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0568】

## 表 3 6 6

化合物についての  $R^a$  が  $OC_2H_5$  であり、 $R^{b2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b3}$  が H であり、 $R^{b4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0569】

## 表 3 6 7

化合物についての  $R^a$  が  $OC_2H_5$  であり、 $R^{b2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b3}$  が F であり、 $R^{b4}$  が H であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0570】

## 表 3 6 8

化合物についての  $R^a$  が  $OC_2H_5$  であり、 $R^{b2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b3}$  が F であり、 $R^{b4}$  が F であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0571】

## 表 3 6 9

化合物についての  $R^a$  が  $OC_2H_5$  であり、 $R^{b2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b3}$  が F であり、 $R^{b4}$  が Cl であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0572】

## 表 3 7 0

化合物についての  $R^a$  が  $OC_2H_5$  であり、 $R^{b2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b3}$  が F であり、 $R^{b4}$  が Br であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0573】

## 表 3 7 1

化合物についての  $R^a$  が  $OC_2H_5$  であり、 $R^{b2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b3}$  が F であり、 $R^{b4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0574】

## 表 3 7 2

化合物についての  $R^a$  が  $OC_2H_5$  であり、 $R^{b2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b3}$  が F であり、 $R^{b4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0575】

## 表 3 7 3

化合物についての  $R^a$  が モルホリン-1-イル であり、 $R^{b2}$  が  $CH_3$  及び  $R^{b3}$  が H であり、 $R^{b4}$  が H であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0576】

10

20

30

40

50

## 表 3 7 4

化合物についての  $R^a$  がモルホリン-1-イルであり、 $R^{b\ 2}$  が  $CH_3$  及び  $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が F であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 5 7 7】

## 表 3 7 5

化合物についての  $R^a$  がモルホリン-1-イルであり、 $R^{b\ 2}$  が  $CH_3$  及び  $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が Cl であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 5 7 8】

## 表 3 7 6

化合物についての  $R^a$  がモルホリン-1-イルであり、 $R^{b\ 2}$  が  $CH_3$  及び  $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が Br であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 5 7 9】

## 表 3 7 7

化合物についての  $R^a$  がモルホリン-1-イルであり、 $R^{b\ 2}$  が  $CH_3$  及び  $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 5 8 0】

## 表 3 7 8

化合物についての  $R^a$  がモルホリン-1-イルであり、 $R^{b\ 2}$  が  $CH_3$  及び  $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 5 8 1】

## 表 3 7 9

化合物についての  $R^a$  がモルホリン-1-イルであり、 $R^{b\ 2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が H であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 5 8 2】

## 表 3 8 0

化合物についての  $R^a$  がモルホリン-1-イルであり、 $R^{b\ 2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が F であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 5 8 3】

## 表 3 8 1

化合物についての  $R^a$  がモルホリン-1-イルであり、 $R^{b\ 2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が Cl であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 5 8 4】

## 表 3 8 2

化合物についての  $R^a$  がモルホリン-1-イルであり、 $R^{b\ 2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が Br であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 5 8 5】

## 表 3 8 3

化合物についての  $R^a$  がモルホリン-1-イルであり、 $R^{b\ 2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 5 8 6】

10

20

30

40

50

## 表 3 8 4

化合物についての  $R^a$  がモルホリン-1-イルであり、 $R^{b\ 2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0587】

## 表 3 8 5

化合物についての  $R^a$  が CN であり、 $R^{b\ 2}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  であり、 $R^{b\ 4}$  が H であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0588】

10

## 表 3 8 6

化合物についての  $R^a$  が CN であり、 $R^{b\ 2}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が F であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0589】

## 表 3 8 7

化合物についての  $R^a$  が CN であり、 $R^{b\ 2}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が Cl であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0590】

20

## 表 3 8 8

化合物についての  $R^a$  が CN であり、 $R^{b\ 2}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が Br であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0591】

## 表 3 8 9

化合物についての  $R^a$  が CN であり、 $R^{b\ 2}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0592】

30

## 表 3 9 0

化合物についての  $R^a$  が CN であり、 $R^{b\ 2}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0593】

## 表 3 9 1

化合物についての  $R^a$  が CN であり、 $R^{b\ 2}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が H であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0594】

40

## 表 3 9 2

化合物についての  $R^a$  が CN であり、 $R^{b\ 2}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  であり、 $R^{b\ 4}$  が F であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0595】

## 表 3 9 3

化合物についての  $R^a$  が CN であり、 $R^{b\ 2}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が Cl であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0596】

50

## 表 3 9 4

化合物についての  $R^a$  が CN であり、 $R^{b2}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^{b3}$  が F であり、 $R^{b4}$  が Br であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0597】

## 表 3 9 5

化合物についての  $R^a$  が CN であり、 $R^{b2}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^{b3}$  が F であり、 $R^{b4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0598】

10

## 表 3 9 6

化合物についての  $R^a$  が CN であり、 $R^{b2}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^{b3}$  が F であり、 $R^{b4}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0599】

## 表 3 9 7

化合物についての  $R^a$  が Cl であり、 $R^{b2}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^{b3}$  であり、 $R^{b4}$  が H であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0600】

20

## 表 3 9 8

化合物についての  $R^a$  が Cl であり、 $R^{b2}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^{b3}$  が H であり、 $R^{b4}$  が F であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0601】

## 表 3 9 9

化合物についての  $R^a$  が Cl であり、 $R^{b2}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^{b3}$  が H であり、 $R^{b4}$  が Cl であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0602】

30

## 表 4 0 0

化合物についての  $R^a$  が Cl であり、 $R^{b2}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^{b3}$  が H であり、 $R^{b4}$  が Br であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0603】

## 表 4 0 1

化合物についての  $R^a$  が Cl であり、 $R^{b2}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^{b3}$  が H であり、 $R^{b4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0604】

40

## 表 4 0 2

化合物についての  $R^a$  が Cl であり、 $R^{b2}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^{b3}$  が H であり、 $R^{b4}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0605】

## 表 4 0 3

化合物についての  $R^a$  が Cl であり、 $R^{b2}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^{b3}$  が F であり、 $R^{b4}$  が H であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0606】

50

## 表 4 0 4

化合物についての  $R^a$  が Cl であり、 $R^{b2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b3}$  であり、 $R^{b4}$  が F であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0607】

## 表 4 0 5

化合物についての  $R^a$  が Cl であり、 $R^{b2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b3}$  が F であり、 $R^{b4}$  が Cl であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0608】

10

## 表 4 0 6

化合物についての  $R^a$  が Cl であり、 $R^{b2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b3}$  が F であり、 $R^{b4}$  が Br であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0609】

## 表 4 0 7

化合物についての  $R^a$  が Cl であり、 $R^{b2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b3}$  が F であり、 $R^{b4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0610】

20

## 表 4 0 8

化合物についての  $R^a$  が Cl であり、 $R^{b2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b3}$  が F であり、 $R^{b4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0611】

## 表 4 0 9

化合物についての  $R^a$  が  $NO_2$  であり、 $R^{b2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b3}$  であり、 $R^{b4}$  が H であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0612】

30

## 表 4 1 0

化合物についての  $R^a$  が  $NO_2$  であり、 $R^{b2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b3}$  が H であり、 $R^{b4}$  が F であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0613】

## 表 4 1 1

化合物についての  $R^a$  が  $NO_2$  であり、 $R^{b2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b3}$  が H であり、 $R^{b4}$  が Cl であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0614】

40

## 表 4 1 2

化合物についての  $R^a$  が  $NO_2$  であり、 $R^{b2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b3}$  が H であり、 $R^{b4}$  が Br であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0615】

## 表 4 1 3

化合物についての  $R^a$  が  $NO_2$  であり、 $R^{b2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b3}$  が H であり、 $R^{b4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0616】

50

## 表 4 1 4

化合物についての  $R^a$  が  $\text{NO}_2$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $\text{OCH}_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が  $\text{OCH}_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0617】

## 表 4 1 5

化合物についての  $R^a$  が  $\text{NO}_2$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $\text{OCH}_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が H であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0618】

10

## 表 4 1 6

化合物についての  $R^a$  が  $\text{NO}_2$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $\text{OCH}_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  であり、 $R^{b\ 4}$  が F であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0619】

## 表 4 1 7

化合物についての  $R^a$  が  $\text{NO}_2$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $\text{OCH}_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が Cl であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0620】

20

## 表 4 1 8

化合物についての  $R^a$  が  $\text{NO}_2$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $\text{OCH}_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が Br であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0621】

## 表 4 1 9

化合物についての  $R^a$  が  $\text{NO}_2$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $\text{OCH}_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が  $\text{CH}_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0622】

30

## 表 4 2 0

化合物についての  $R^a$  が  $\text{NO}_2$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $\text{OCH}_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が  $\text{OCH}_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0623】

## 表 4 2 1

化合物についての  $R^a$  が  $\text{CH}_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $\text{OCH}_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が H であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0624】

40

## 表 4 2 2

化合物についての  $R^a$  が  $\text{CH}_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $\text{OCH}_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が F であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0625】

## 表 4 2 3

化合物についての  $R^a$  が  $\text{CH}_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $\text{OCH}_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が Cl であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0626】

50

## 表 4 2 4

化合物についての  $R^a$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b2}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^{b3}$  が H であり、 $R^{b4}$  が Br であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0627】

## 表 4 2 5

化合物についての  $R^a$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b2}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^{b3}$  が H であり、 $R^{b4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0628】

## 表 4 2 6

化合物についての  $R^a$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b2}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^{b3}$  が H であり、 $R^{b4}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0629】

## 表 4 2 7

化合物についての  $R^a$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b2}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^{b3}$  が F であり、 $R^{b4}$  が H であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0630】

## 表 4 2 8

化合物についての  $R^a$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b2}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^{b3}$  が F であり、 $R^{b4}$  が F であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0631】

## 表 4 2 9

化合物についての  $R^a$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b2}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^{b3}$  が F であり、 $R^{b4}$  が Cl であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0632】

## 表 4 3 0

化合物についての  $R^a$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b2}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^{b3}$  が F であり、 $R^{b4}$  が Br であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0633】

## 表 4 3 1

化合物についての  $R^a$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b2}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^{b3}$  が F であり、 $R^{b4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0634】

## 表 4 3 2

化合物についての  $R^a$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b2}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^{b3}$  が F であり、 $R^{b4}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0635】

## 表 4 3 3

化合物についての  $R^a$  が  $CF_3$  であり、 $R^{b2}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^{b3}$  が H であり、 $R^{b4}$  が H であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0636】

10

20

30

40

50

## 表 4 3 4

化合物についての  $R^a$  が  $CF_3$  であり、 $R^{b2}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^{b3}$  が H であり、 $R^{b4}$  が F であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0637】

## 表 4 3 5

化合物についての  $R^a$  が  $CF_3$  であり、 $R^{b2}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^{b3}$  が H であり、 $R^{b4}$  が Cl であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0638】

10

## 表 4 3 6

化合物についての  $R^a$  が  $CF_3$  であり、 $R^{b2}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^{b3}$  が H であり、 $R^{b4}$  が Br であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0639】

## 表 4 3 7

化合物についての  $R^a$  が  $CF_3$  であり、 $R^{b2}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^{b3}$  が H であり、 $R^{b4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0640】

20

## 表 4 3 8

化合物についての  $R^a$  が  $CF_3$  であり、 $R^{b2}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^{b3}$  が H であり、 $R^{b4}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0641】

## 表 4 3 9

化合物についての  $R^a$  が  $CF_3$  であり、 $R^{b2}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^{b3}$  が F であり、 $R^{b4}$  が H であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0642】

30

## 表 4 4 0

化合物についての  $R^a$  が  $CF_3$  であり、 $R^{b2}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^{b3}$  が F であり、 $R^{b4}$  が F であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0643】

## 表 4 4 1

化合物についての  $R^a$  が  $CF_3$  であり、 $R^{b2}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^{b3}$  が F であり、 $R^{b4}$  が Cl であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0644】

40

## 表 4 4 2

化合物についての  $R^a$  が  $CF_3$  であり、 $R^{b2}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^{b3}$  が F であり、 $R^{b4}$  が Br であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0645】

## 表 4 4 3

化合物についての  $R^a$  が  $CF_3$  であり、 $R^{b2}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^{b3}$  が F であり、 $R^{b4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0646】

50

## 表 4 4 4

化合物についての  $R^a$  が  $CF_3$  であり、 $R^{b2}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^{b3}$  が F であり、 $R^{b4}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0647】

## 表 4 4 5

化合物についての  $R^a$  が  $OCH_3$  であり、 $R^{b2}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^{b3}$  が H であり、 $R^{b4}$  が H であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0648】

## 表 4 4 6

化合物についての  $R^a$  が  $OCH_3$  であり、 $R^{b2}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^{b3}$  が H であり、 $R^{b4}$  が F であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0649】

## 表 4 4 7

化合物についての  $R^a$  が  $OCH_3$  であり、 $R^{b2}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^{b3}$  が H であり、 $R^{b4}$  が Cl であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0650】

## 表 4 4 8

化合物についての  $R^a$  が  $OCH_3$  であり、 $R^{b2}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^{b3}$  が H であり、 $R^{b4}$  が Br であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0651】

## 表 4 4 9

化合物についての  $R^a$  が  $OCH_3$  であり、 $R^{b2}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^{b3}$  が H であり、 $R^{b4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0652】

## 表 4 5 0

化合物についての  $R^a$  が  $OCH_3$  であり、 $R^{b2}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^{b3}$  が H であり、 $R^{b4}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0653】

## 表 4 5 1

化合物についての  $R^a$  が  $OCH_3$  であり、 $R^{b2}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^{b3}$  が F であり、 $R^{b4}$  が H であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0654】

## 表 4 5 2

化合物についての  $R^a$  が  $OCH_3$  であり、 $R^{b2}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^{b3}$  が F であり、 $R^{b4}$  が F であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0655】

## 表 4 5 3

化合物についての  $R^a$  が  $OCH_3$  であり、 $R^{b2}$  が  $OCH_3$  であり、 $R^{b3}$  が F であり、 $R^{b4}$  が Cl であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0656】

10

20

30

40

50

## 表 4 5 4

化合物についての  $R^a$  が  $OC H_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $OC H_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が Br であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0657】

## 表 4 5 5

化合物についての  $R^a$  が  $OC H_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $OC H_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0658】

## 表 4 5 6

化合物についての  $R^a$  が  $OC H_3$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $OC H_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が  $OC H_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0659】

## 表 4 5 7

化合物についての  $R^a$  が  $OC_2H_5$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $OC H_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が H であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0660】

## 表 4 5 8

化合物についての  $R^a$  が  $OC_2H_5$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $OC H_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が F であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0661】

## 表 4 5 9

化合物についての  $R^a$  が  $OC_2H_5$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $OC H_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が Cl であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0662】

## 表 4 6 0

化合物についての  $R^a$  が  $OC_2H_5$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $OC H_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が Br であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0663】

## 表 4 6 1

化合物についての  $R^a$  が  $OC_2H_5$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $OC H_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0664】

## 表 4 6 2

化合物についての  $R^a$  が  $OC_2H_5$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $OC H_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が  $OC H_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0665】

## 表 4 6 3

化合物についての  $R^a$  が  $OC_2H_5$  であり、 $R^{b\ 2}$  が  $OC H_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が H であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0666】

10

20

30

40

50

## 表 4 6 4

化合物についての  $R^a$  が  $OC_2H_5$  であり、 $R^{b2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b3}$  が F であり、 $R^{b4}$  が F であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0667】

## 表 4 6 5

化合物についての  $R^a$  が  $OC_2H_5$  であり、 $R^{b2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b3}$  が F であり、 $R^{b4}$  が Cl であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0668】

## 表 4 6 6

化合物についての  $R^a$  が  $OC_2H_5$  であり、 $R^{b2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b3}$  が F であり、 $R^{b4}$  が Br であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0669】

## 表 4 6 7

化合物についての  $R^a$  が  $OC_2H_5$  であり、 $R^{b2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b3}$  が F であり、 $R^{b4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0670】

## 表 4 6 8

化合物についての  $R^a$  が  $OC_2H_5$  であり、 $R^{b2}$  が  $CH_3$  であり、 $R^{b3}$  が F であり、 $R^{b4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0671】

## 表 4 6 9

化合物についての  $R^a$  が モルホリン-1-イルであり、 $R^{b2}$  が  $CH_3$  及び  $R^{b3}$  が H であり、 $R^{b4}$  が H であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0672】

## 表 4 7 0

化合物についての  $R^a$  が モルホリン-1-イルであり、 $R^{b2}$  が  $CH_3$  及び  $R^{b3}$  が H であり、 $R^{b4}$  が F であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0673】

## 表 4 7 1

化合物についての  $R^a$  が モルホリン-1-イルであり、 $R^{b2}$  が  $CH_3$  及び  $R^{b3}$  が H であり、 $R^{b4}$  が Cl であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0674】

## 表 4 7 2

化合物についての  $R^a$  が モルホリン-1-イルであり、 $R^{b2}$  が  $CH_3$  及び  $R^{b3}$  が H であり、 $R^{b4}$  が Br であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0675】

## 表 4 7 3

化合物についての  $R^a$  が モルホリン-1-イルであり、 $R^{b2}$  が  $CH_3$  及び  $R^{b3}$  が H であり、 $R^{b4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0676】

10

20

30

40

50

## 表 4 7 4

化合物についての  $R^a$  がモルホリン-1-イルであり、 $R^{b\ 2}$  が  $OC H_3$  及び  $R^{b\ 3}$  が H であり、 $R^{b\ 4}$  が  $OC H_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 6 7 7】

## 表 4 7 5

化合物についての  $R^a$  がモルホリン-1-イルであり、 $R^{b\ 2}$  が  $OC H_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が H であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 6 7 8】

## 表 4 7 6

化合物についての  $R^a$  がモルホリン-1-イルであり、 $R^{b\ 2}$  が  $OC H_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が F であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 6 7 9】

## 表 4 7 7

化合物についての  $R^a$  がモルホリン-1-イルであり、 $R^{b\ 2}$  が  $OC H_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が Cl であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 6 8 0】

## 表 4 7 8

化合物についての  $R^a$  がモルホリン-1-イルであり、 $R^{b\ 2}$  が  $OC H_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が Br であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 6 8 1】

## 表 4 7 9

化合物についての  $R^a$  がモルホリン-1-イルであり、 $R^{b\ 2}$  が  $OC H_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が  $CH_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 6 8 2】

## 表 4 8 0

化合物についての  $R^a$  がモルホリン-1-イルであり、 $R^{b\ 2}$  が  $OC H_3$  であり、 $R^{b\ 3}$  が F であり、 $R^{b\ 4}$  が  $OC H_3$  であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^9$  及び  $R^{1\ 0}$  のその組み合わせが各場合において表 A の 1 つの行に対応している式 I で表される化合物。

【0 6 8 3】

## 表 A

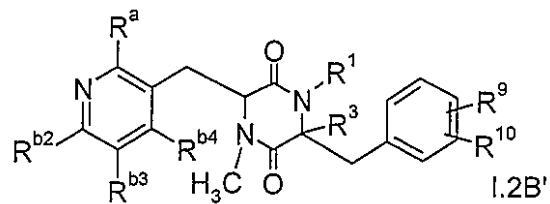
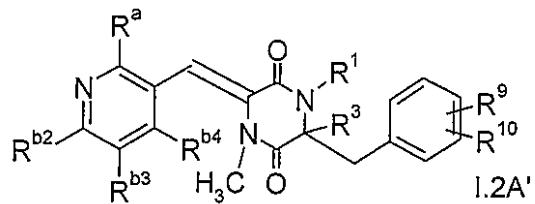
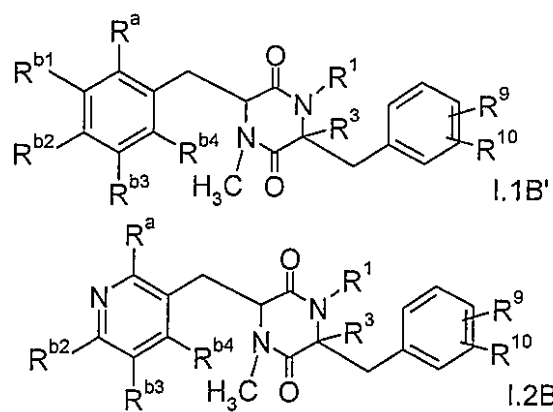
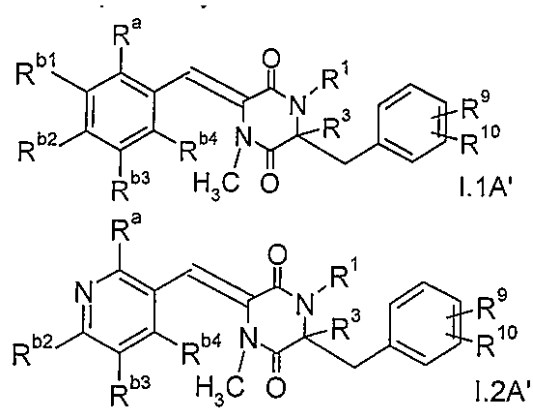
式 I で表される化合物で、それぞれ、式 I. 1 A'、I. 1 B'、I. 2 A' 及び I. 2 B'、

10

20

30

【化 3 2】



10

【 0 6 8 4】

に対応している化合物

【表 1】

| No.  | 式     | R <sup>1</sup>                                   | R <sup>3</sup>                                  | R <sup>9</sup> | R <sup>10</sup> |
|------|-------|--------------------------------------------------|-------------------------------------------------|----------------|-----------------|
| A-1  | I.1A' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>3</sub>                                 | H              | H               |
| A-2  | I.1A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                                 | H              | H               |
| A-3  | I.1A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub>                                 | H              | H               |
| A-4  | I.1A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>3</sub>                                 | H              | H               |
| A-5  | I.1A' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | H              | H               |
| A-6  | I.1A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | H              | H               |
| A-7  | I.1A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | H              | H               |
| A-8  | I.1A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | H              | H               |
| A-9  | I.1A' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H              | H               |
| A-10 | I.1A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H              | H               |
| A-11 | I.1A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H              | H               |
| A-12 | I.1A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H              | H               |
| A-13 | I.1A' | CH <sub>2</sub> CN                               | OH                                              | H              | H               |
| A-14 | I.1A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | OH                                              | H              | H               |
| A-15 | I.1A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | OH                                              | H              | H               |
| A-16 | I.1A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | OH                                              | H              | H               |
| A-17 | I.1A' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> OH                              | H              | H               |
| A-18 | I.1A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> OH                              | H              | H               |
| A-19 | I.1A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> OH                              | H              | H               |
| A-20 | I.1A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> OH                              | H              | H               |
| A-21 | I.1A' | CH <sub>2</sub> CN                               | NH <sub>2</sub>                                 | H              | H               |
| A-22 | I.1A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | NH <sub>2</sub>                                 | H              | H               |
| A-23 | I.1A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | NH <sub>2</sub>                                 | H              | H               |
| A-24 | I.1A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | NH <sub>2</sub>                                 | H              | H               |
| A-25 | I.1A' | CH <sub>2</sub> CN                               | COOCH <sub>3</sub>                              | H              | H               |
| A-26 | I.1A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | COOCH <sub>3</sub>                              | H              | H               |
| A-27 | I.1A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | COOCH <sub>3</sub>                              | H              | H               |
| A-28 | I.1A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | COOCH <sub>3</sub>                              | H              | H               |
| A-29 | I.1A' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | H              | H               |
| A-30 | I.1A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | H              | H               |
| A-31 | I.1A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | H              | H               |
| A-32 | I.1A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | H              | H               |
| A-33 | I.1A' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>3</sub>                                 | 2-F            | H               |
| A-34 | I.1A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                                 | 2-F            | H               |
| A-35 | I.1A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub>                                 | 2-F            | H               |
| A-36 | I.1A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>3</sub>                                 | 2-F            | H               |

10

20

30

40

| No.  | 式     | R <sup>1</sup>                                   | R <sup>3</sup>                                  | R <sup>9</sup> | R <sup>10</sup> |
|------|-------|--------------------------------------------------|-------------------------------------------------|----------------|-----------------|
| A-37 | I.1A' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 2-F            | H               |
| A-38 | I.1A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 2-F            | H               |
| A-39 | I.1A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 2-F            | H               |
| A-40 | I.1A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 2-F            | H               |
| A-41 | I.1A' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2-F            | H               |
| A-42 | I.1A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2-F            | H               |
| A-43 | I.1A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2-F            | H               |
| A-44 | I.1A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2-F            | H               |
| A-45 | I.1A' | CH <sub>2</sub> CN                               | OH                                              | 2-F            | H               |
| A-46 | I.1A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | OH                                              | 2-F            | H               |
| A-47 | I.1A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | OH                                              | 2-F            | H               |
| A-48 | I.1A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | OH                                              | 2-F            | H               |
| A-49 | I.1A' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> OH                              | 2-F            | H               |
| A-50 | I.1A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> OH                              | 2-F            | H               |
| A-51 | I.1A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> OH                              | 2-F            | H               |
| A-52 | I.1A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> OH                              | 2-F            | H               |
| A-53 | I.1A' | CH <sub>2</sub> CN                               | NH <sub>2</sub>                                 | 2-F            | H               |
| A-54 | I.1A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | NH <sub>2</sub>                                 | 2-F            | H               |
| A-55 | I.1A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | NH <sub>2</sub>                                 | 2-F            | H               |
| A-56 | I.1A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | NH <sub>2</sub>                                 | 2-F            | H               |
| A-57 | I.1A' | CH <sub>2</sub> CN                               | COOCH <sub>3</sub>                              | 2-F            | H               |
| A-58 | I.1A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | COOCH <sub>3</sub>                              | 2-F            | H               |
| A-59 | I.1A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | COOCH <sub>3</sub>                              | 2-F            | H               |
| A-60 | I.1A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | COOCH <sub>3</sub>                              | 2-F            | H               |
| A-61 | I.1A' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | 2-F            | H               |
| A-62 | I.1A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | 2-F            | H               |
| A-63 | I.1A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | 2-F            | H               |
| A-64 | I.1A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | 2-F            | H               |
| A-65 | I.1A' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>3</sub>                                 | 3-F            | H               |
| A-66 | I.1A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                                 | 3-F            | H               |
| A-67 | I.1A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub>                                 | 3-F            | H               |
| A-68 | I.1A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>3</sub>                                 | 3-F            | H               |
| A-69 | I.1A' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 3-F            | H               |
| A-70 | I.1A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 3-F            | H               |
| A-71 | I.1A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 3-F            | H               |
| A-72 | I.1A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 3-F            | H               |
| A-73 | I.1A' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 3-F            | H               |
| A-74 | I.1A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 3-F            | H               |

10

20

30

40

| No.   | 式     | R <sup>1</sup>                                   | R <sup>3</sup>                                  | R <sup>9</sup> | R <sup>10</sup> |
|-------|-------|--------------------------------------------------|-------------------------------------------------|----------------|-----------------|
| A-75  | I.1A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 3-F            | H               |
| A-76  | I.1A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 3-F            | H               |
| A-77  | I.1A' | CH <sub>2</sub> CN                               | OH                                              | 3-F            | H               |
| A-78  | I.1A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | OH                                              | 3-F            | H               |
| A-79  | I.1A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | OH                                              | 3-F            | H               |
| A-80  | I.1A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | OH                                              | 3-F            | H               |
| A-81  | I.1A' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> OH                              | 3-F            | H               |
| A-82  | I.1A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> OH                              | 3-F            | H               |
| A-83  | I.1A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> OH                              | 3-F            | H               |
| A-84  | I.1A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> OH                              | 3-F            | H               |
| A-85  | I.1A' | CH <sub>2</sub> CN                               | NH <sub>2</sub>                                 | 3-F            | H               |
| A-86  | I.1A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | NH <sub>2</sub>                                 | 3-F            | H               |
| A-87  | I.1A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | NH <sub>2</sub>                                 | 3-F            | H               |
| A-88  | I.1A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | NH <sub>2</sub>                                 | 3-F            | H               |
| A-89  | I.1A' | CH <sub>2</sub> CN                               | COOCH <sub>3</sub>                              | 3-F            | H               |
| A-90  | I.1A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | COOCH <sub>3</sub>                              | 3-F            | H               |
| A-91  | I.1A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | COOCH <sub>3</sub>                              | 3-F            | H               |
| A-92  | I.1A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | COOCH <sub>3</sub>                              | 3-F            | H               |
| A-93  | I.1A' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | 3-F            | H               |
| A-94  | I.1A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | 3-F            | H               |
| A-95  | I.1A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | 3-F            | H               |
| A-96  | I.1A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | 3-F            | H               |
| A-97  | I.1A' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>3</sub>                                 | 4-F            | H               |
| A-98  | I.1A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                                 | 4-F            | H               |
| A-99  | I.1A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub>                                 | 4-F            | H               |
| A-100 | I.1A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>3</sub>                                 | 4-F            | H               |
| A-101 | I.1A' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 4-F            | H               |
| A-102 | I.1A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 4-F            | H               |
| A-103 | I.1A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 4-F            | H               |
| A-104 | I.1A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 4-F            | H               |
| A-105 | I.1A' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 4-F            | H               |
| A-106 | I.1A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 4-F            | H               |
| A-107 | I.1A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 4-F            | H               |
| A-108 | I.1A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 4-F            | H               |
| A-109 | I.1A' | CH <sub>2</sub> CN                               | OH                                              | 4-F            | H               |
| A-110 | I.1A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | OH                                              | 4-F            | H               |
| A-111 | I.1A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | OH                                              | 4-F            | H               |
| A-112 | I.1A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | OH                                              | 4-F            | H               |

10

20

30

40

| No.   | 式     | R <sup>1</sup>                                   | R <sup>3</sup>                                  | R <sup>9</sup> | R <sup>10</sup> |
|-------|-------|--------------------------------------------------|-------------------------------------------------|----------------|-----------------|
| A-113 | I.1A' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> OH                              | 4-F            | H               |
| A-114 | I.1A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> OH                              | 4-F            | H               |
| A-115 | I.1A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> OH                              | 4-F            | H               |
| A-116 | I.1A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> OH                              | 4-F            | H               |
| A-117 | I.1A' | CH <sub>2</sub> CN                               | NH <sub>2</sub>                                 | 4-F            | H               |
| A-118 | I.1A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | NH <sub>2</sub>                                 | 4-F            | H               |
| A-119 | I.1A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | NH <sub>2</sub>                                 | 4-F            | H               |
| A-120 | I.1A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | NH <sub>2</sub>                                 | 4-F            | H               |
| A-121 | I.1A' | CH <sub>2</sub> CN                               | COOCH <sub>3</sub>                              | 4-F            | H               |
| A-122 | I.1A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | COOCH <sub>3</sub>                              | 4-F            | H               |
| A-123 | I.1A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | COOCH <sub>3</sub>                              | 4-F            | H               |
| A-124 | I.1A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | COOCH <sub>3</sub>                              | 4-F            | H               |
| A-125 | I.1A' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | 4-F            | H               |
| A-126 | I.1A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | 4-F            | H               |
| A-127 | I.1A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | 4-F            | H               |
| A-128 | I.1A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | 4-F            | H               |
| A-129 | I.1A' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>3</sub>                                 | 3-F            | 2-F             |
| A-130 | I.1A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                                 | 3-F            | 2-F             |
| A-131 | I.1A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub>                                 | 3-F            | 2-F             |
| A-132 | I.1A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>3</sub>                                 | 3-F            | 2-F             |
| A-133 | I.1A' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 3-F            | 2-F             |
| A-134 | I.1A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 3-F            | 2-F             |
| A-135 | I.1A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 3-F            | 2-F             |
| A-136 | I.1A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 3-F            | 2-F             |
| A-137 | I.1A' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 3-F            | 2-F             |
| A-138 | I.1A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 3-F            | 2-F             |
| A-139 | I.1A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 3-F            | 2-F             |
| A-140 | I.1A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 3-F            | 2-F             |
| A-141 | I.1A' | CH <sub>2</sub> CN                               | OH                                              | 3-F            | 2-F             |
| A-142 | I.1A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | OH                                              | 3-F            | 2-F             |
| A-143 | I.1A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | OH                                              | 3-F            | 2-F             |
| A-144 | I.1A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | OH                                              | 3-F            | 2-F             |
| A-145 | I.1A' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> OH                              | 3-F            | 2-F             |
| A-146 | I.1A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> OH                              | 3-F            | 2-F             |
| A-147 | I.1A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> OH                              | 3-F            | 2-F             |
| A-148 | I.1A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> OH                              | 3-F            | 2-F             |
| A-149 | I.1A' | CH <sub>2</sub> CN                               | NH <sub>2</sub>                                 | 3-F            | 2-F             |
| A-150 | I.1A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | NH <sub>2</sub>                                 | 3-F            | 2-F             |

10

20

30

40

| No.   | 式     | R <sup>1</sup>                                   | R <sup>3</sup>                                  | R <sup>9</sup> | R <sup>10</sup> |
|-------|-------|--------------------------------------------------|-------------------------------------------------|----------------|-----------------|
| A-151 | I.1A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | NH <sub>2</sub>                                 | 3-F            | 2-F             |
| A-152 | I.1A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | NH <sub>2</sub>                                 | 3-F            | 2-F             |
| A-153 | I.1A' | CH <sub>2</sub> CN                               | COOCH <sub>3</sub>                              | 3-F            | 2-F             |
| A-154 | I.1A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | COOCH <sub>3</sub>                              | 3-F            | 2-F             |
| A-155 | I.1A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | COOCH <sub>3</sub>                              | 3-F            | 2-F             |
| A-156 | I.1A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | COOCH <sub>3</sub>                              | 3-F            | 2-F             |
| A-157 | I.1A' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | 3-F            | 2-F             |
| A-158 | I.1A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | 3-F            | 2-F             |
| A-159 | I.1A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | 3-F            | 2-F             |
| A-160 | I.1A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | 3-F            | 2-F             |
| A-161 | I.1A' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>3</sub>                                 | 3-F            | 4-F             |
| A-162 | I.1A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                                 | 3-F            | 4-F             |
| A-163 | I.1A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub>                                 | 3-F            | 4-F             |
| A-164 | I.1A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>3</sub>                                 | 3-F            | 4-F             |
| A-165 | I.1A' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 3-F            | 4-F             |
| A-166 | I.1A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 3-F            | 4-F             |
| A-167 | I.1A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 3-F            | 4-F             |
| A-168 | I.1A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 3-F            | 4-F             |
| A-169 | I.1A' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 3-F            | 4-F             |
| A-170 | I.1A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 3-F            | 4-F             |
| A-171 | I.1A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 3-F            | 4-F             |
| A-172 | I.1A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 3-F            | 4-F             |
| A-173 | I.1A' | CH <sub>2</sub> CN                               | OH                                              | 3-F            | 4-F             |
| A-174 | I.1A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | OH                                              | 3-F            | 4-F             |
| A-175 | I.1A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | OH                                              | 3-F            | 4-F             |
| A-176 | I.1A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | OH                                              | 3-F            | 4-F             |
| A-177 | I.1A' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> OH                              | 3-F            | 4-F             |
| A-178 | I.1A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> OH                              | 3-F            | 4-F             |
| A-179 | I.1A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> OH                              | 3-F            | 4-F             |
| A-180 | I.1A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> OH                              | 3-F            | 4-F             |
| A-181 | I.1A' | CH <sub>2</sub> CN                               | NH <sub>2</sub>                                 | 3-F            | 4-F             |
| A-182 | I.1A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | NH <sub>2</sub>                                 | 3-F            | 4-F             |
| A-183 | I.1A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | NH <sub>2</sub>                                 | 3-F            | 4-F             |
| A-184 | I.1A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | NH <sub>2</sub>                                 | 3-F            | 4-F             |
| A-185 | I.1A' | CH <sub>2</sub> CN                               | COOCH <sub>3</sub>                              | 3-F            | 4-F             |
| A-186 | I.1A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | COOCH <sub>3</sub>                              | 3-F            | 4-F             |
| A-187 | I.1A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | COOCH <sub>3</sub>                              | 3-F            | 4-F             |
| A-188 | I.1A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | COOCH <sub>3</sub>                              | 3-F            | 4-F             |

10

20

30

40

| No.   | 式     | R <sup>1</sup>                                   | R <sup>3</sup>                                  | R <sup>9</sup> | R <sup>10</sup> |
|-------|-------|--------------------------------------------------|-------------------------------------------------|----------------|-----------------|
| A-189 | I.1A' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | 3-F            | 4-F             |
| A-190 | I.1A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | 3-F            | 4-F             |
| A-191 | I.1A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | 3-F            | 4-F             |
| A-192 | I.1A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | 3-F            | 4-F             |
| A-193 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>3</sub>                                 | H              | H               |
| A-194 | I.1B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                                 | H              | H               |
| A-195 | I.1B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub>                                 | H              | H               |
| A-196 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>3</sub>                                 | H              | H               |
| A-197 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | H              | H               |
| A-198 | I.1B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | H              | H               |
| A-199 | I.1B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | H              | H               |
| A-200 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | H              | H               |
| A-201 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H              | H               |
| A-202 | I.1B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H              | H               |
| A-203 | I.1B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H              | H               |
| A-204 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H              | H               |
| A-205 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CN                               | OH                                              | H              | H               |
| A-206 | I.1B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | OH                                              | H              | H               |
| A-207 | I.1B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | OH                                              | H              | H               |
| A-208 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | OH                                              | H              | H               |
| A-209 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> OH                              | H              | H               |
| A-210 | I.1B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> OH                              | H              | H               |
| A-211 | I.1B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> OH                              | H              | H               |
| A-212 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> OH                              | H              | H               |
| A-213 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CN                               | NH <sub>2</sub>                                 | H              | H               |
| A-214 | I.1B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | NH <sub>2</sub>                                 | H              | H               |
| A-215 | I.1B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | NH <sub>2</sub>                                 | H              | H               |
| A-216 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | NH <sub>2</sub>                                 | H              | H               |
| A-217 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CN                               | COOCH <sub>3</sub>                              | H              | H               |
| A-218 | I.1B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | COOCH <sub>3</sub>                              | H              | H               |
| A-219 | I.1B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | COOCH <sub>3</sub>                              | H              | H               |
| A-220 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | COOCH <sub>3</sub>                              | H              | H               |
| A-221 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | H              | H               |
| A-222 | I.1B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | H              | H               |
| A-223 | I.1B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | H              | H               |
| A-224 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | H              | H               |
| A-225 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>3</sub>                                 | 2-F            | H               |
| A-226 | I.1B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                                 | 2-F            | H               |

10

20

30

40

| No.   | 式     | R <sup>1</sup>                                   | R <sup>3</sup>                                  | R <sup>9</sup> | R <sup>10</sup> |
|-------|-------|--------------------------------------------------|-------------------------------------------------|----------------|-----------------|
| A-227 | I.1B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub>                                 | 2-F            | H               |
| A-228 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>3</sub>                                 | 2-F            | H               |
| A-229 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 2-F            | H               |
| A-230 | I.1B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 2-F            | H               |
| A-231 | I.1B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 2-F            | H               |
| A-232 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 2-F            | H               |
| A-233 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2-F            | H               |
| A-234 | I.1B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2-F            | H               |
| A-235 | I.1B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2-F            | H               |
| A-236 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2-F            | H               |
| A-237 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CN                               | OH                                              | 2-F            | H               |
| A-238 | I.1B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | OH                                              | 2-F            | H               |
| A-239 | I.1B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | OH                                              | 2-F            | H               |
| A-240 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | OH                                              | 2-F            | H               |
| A-241 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> OH                              | 2-F            | H               |
| A-242 | I.1B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> OH                              | 2-F            | H               |
| A-243 | I.1B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> OH                              | 2-F            | H               |
| A-244 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> OH                              | 2-F            | H               |
| A-245 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CN                               | NH <sub>2</sub>                                 | 2-F            | H               |
| A-246 | I.1B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | NH <sub>2</sub>                                 | 2-F            | H               |
| A-247 | I.1B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | NH <sub>2</sub>                                 | 2-F            | H               |
| A-248 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | NH <sub>2</sub>                                 | 2-F            | H               |
| A-249 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CN                               | COOCH <sub>3</sub>                              | 2-F            | H               |
| A-250 | I.1B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | COOCH <sub>3</sub>                              | 2-F            | H               |
| A-251 | I.1B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | COOCH <sub>3</sub>                              | 2-F            | H               |
| A-252 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | COOCH <sub>3</sub>                              | 2-F            | H               |
| A-253 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | 2-F            | H               |
| A-254 | I.1B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | 2-F            | H               |
| A-255 | I.1B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | 2-F            | H               |
| A-256 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | 2-F            | H               |
| A-257 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>3</sub>                                 | 3-F            | H               |
| A-258 | I.1B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                                 | 3-F            | H               |
| A-259 | I.1B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub>                                 | 3-F            | H               |
| A-260 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>3</sub>                                 | 3-F            | H               |
| A-261 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 3-F            | H               |
| A-262 | I.1B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 3-F            | H               |
| A-263 | I.1B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 3-F            | H               |
| A-264 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 3-F            | H               |

10

20

30

40

| No.   | 式     | R <sup>1</sup>                                   | R <sup>3</sup>                                  | R <sup>9</sup> | R <sup>10</sup> |
|-------|-------|--------------------------------------------------|-------------------------------------------------|----------------|-----------------|
| A-265 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 3-F            | H               |
| A-266 | I.1B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 3-F            | H               |
| A-267 | I.1B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 3-F            | H               |
| A-268 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 3-F            | H               |
| A-269 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CN                               | OH                                              | 3-F            | H               |
| A-270 | I.1B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | OH                                              | 3-F            | H               |
| A-271 | I.1B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | OH                                              | 3-F            | H               |
| A-272 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | OH                                              | 3-F            | H               |
| A-273 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> OH                              | 3-F            | H               |
| A-274 | I.1B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> OH                              | 3-F            | H               |
| A-275 | I.1B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> OH                              | 3-F            | H               |
| A-276 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> OH                              | 3-F            | H               |
| A-277 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CN                               | NH <sub>2</sub>                                 | 3-F            | H               |
| A-278 | I.1B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | NH <sub>2</sub>                                 | 3-F            | H               |
| A-279 | I.1B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | NH <sub>2</sub>                                 | 3-F            | H               |
| A-280 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | NH <sub>2</sub>                                 | 3-F            | H               |
| A-281 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CN                               | COOCH <sub>3</sub>                              | 3-F            | H               |
| A-282 | I.1B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | COOCH <sub>3</sub>                              | 3-F            | H               |
| A-283 | I.1B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | COOCH <sub>3</sub>                              | 3-F            | H               |
| A-284 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | COOCH <sub>3</sub>                              | 3-F            | H               |
| A-285 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | 3-F            | H               |
| A-286 | I.1B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | 3-F            | H               |
| A-287 | I.1B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | 3-F            | H               |
| A-288 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | 3-F            | H               |
| A-289 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>3</sub>                                 | 4-F            | H               |
| A-290 | I.1B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                                 | 4-F            | H               |
| A-291 | I.1B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub>                                 | 4-F            | H               |
| A-292 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>3</sub>                                 | 4-F            | H               |
| A-293 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 4-F            | H               |
| A-294 | I.1B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 4-F            | H               |
| A-295 | I.1B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 4-F            | H               |
| A-296 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 4-F            | H               |
| A-297 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 4-F            | H               |
| A-298 | I.1B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 4-F            | H               |
| A-299 | I.1B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 4-F            | H               |
| A-300 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 4-F            | H               |
| A-301 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CN                               | OH                                              | 4-F            | H               |
| A-302 | I.1B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | OH                                              | 4-F            | H               |

10

20

30

40

| No.   | 式     | R <sup>1</sup>                                   | R <sup>3</sup>                                  | R <sup>9</sup> | R <sup>10</sup> |
|-------|-------|--------------------------------------------------|-------------------------------------------------|----------------|-----------------|
| A-303 | I.1B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | OH                                              | 4-F            | H               |
| A-304 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | OH                                              | 4-F            | H               |
| A-305 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> OH                              | 4-F            | H               |
| A-306 | I.1B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> OH                              | 4-F            | H               |
| A-307 | I.1B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> OH                              | 4-F            | H               |
| A-308 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> OH                              | 4-F            | H               |
| A-309 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CN                               | NH <sub>2</sub>                                 | 4-F            | H               |
| A-310 | I.1B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | NH <sub>2</sub>                                 | 4-F            | H               |
| A-311 | I.1B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | NH <sub>2</sub>                                 | 4-F            | H               |
| A-312 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | NH <sub>2</sub>                                 | 4-F            | H               |
| A-313 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CN                               | COOCH <sub>3</sub>                              | 4-F            | H               |
| A-314 | I.1B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | COOCH <sub>3</sub>                              | 4-F            | H               |
| A-315 | I.1B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | COOCH <sub>3</sub>                              | 4-F            | H               |
| A-316 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | COOCH <sub>3</sub>                              | 4-F            | H               |
| A-317 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | 4-F            | H               |
| A-318 | I.1B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | 4-F            | H               |
| A-319 | I.1B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | 4-F            | H               |
| A-320 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | 4-F            | H               |
| A-321 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>3</sub>                                 | 3-F            | 2-F             |
| A-322 | I.1B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                                 | 3-F            | 2-F             |
| A-323 | I.1B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub>                                 | 3-F            | 2-F             |
| A-324 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>3</sub>                                 | 3-F            | 2-F             |
| A-325 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 3-F            | 2-F             |
| A-326 | I.1B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 3-F            | 2-F             |
| A-327 | I.1B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 3-F            | 2-F             |
| A-328 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 3-F            | 2-F             |
| A-329 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 3-F            | 2-F             |
| A-330 | I.1B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 3-F            | 2-F             |
| A-331 | I.1B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 3-F            | 2-F             |
| A-332 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 3-F            | 2-F             |
| A-333 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CN                               | OH                                              | 3-F            | 2-F             |
| A-334 | I.1B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | OH                                              | 3-F            | 2-F             |
| A-335 | I.1B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | OH                                              | 3-F            | 2-F             |
| A-336 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | OH                                              | 3-F            | 2-F             |
| A-337 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> OH                              | 3-F            | 2-F             |
| A-338 | I.1B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> OH                              | 3-F            | 2-F             |
| A-339 | I.1B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> OH                              | 3-F            | 2-F             |
| A-340 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> OH                              | 3-F            | 2-F             |

10

20

30

40

| No.   | 式     | R <sup>1</sup>                                   | R <sup>3</sup>                                  | R <sup>9</sup> | R <sup>10</sup> |
|-------|-------|--------------------------------------------------|-------------------------------------------------|----------------|-----------------|
| A-341 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CN                               | NH <sub>2</sub>                                 | 3-F            | 2-F             |
| A-342 | I.1B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | NH <sub>2</sub>                                 | 3-F            | 2-F             |
| A-343 | I.1B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | NH <sub>2</sub>                                 | 3-F            | 2-F             |
| A-344 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | NH <sub>2</sub>                                 | 3-F            | 2-F             |
| A-345 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CN                               | COOCH <sub>3</sub>                              | 3-F            | 2-F             |
| A-346 | I.1B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | COOCH <sub>3</sub>                              | 3-F            | 2-F             |
| A-347 | I.1B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | COOCH <sub>3</sub>                              | 3-F            | 2-F             |
| A-348 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | COOCH <sub>3</sub>                              | 3-F            | 2-F             |
| A-349 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | 3-F            | 2-F             |
| A-350 | I.1B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | 3-F            | 2-F             |
| A-351 | I.1B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | 3-F            | 2-F             |
| A-352 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | 3-F            | 2-F             |
| A-353 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>3</sub>                                 | 3-F            | 4-F             |
| A-354 | I.1B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                                 | 3-F            | 4-F             |
| A-355 | I.1B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub>                                 | 3-F            | 4-F             |
| A-356 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>3</sub>                                 | 3-F            | 4-F             |
| A-357 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 3-F            | 4-F             |
| A-358 | I.1B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 3-F            | 4-F             |
| A-359 | I.1B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 3-F            | 4-F             |
| A-360 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 3-F            | 4-F             |
| A-361 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 3-F            | 4-F             |
| A-362 | I.1B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 3-F            | 4-F             |
| A-363 | I.1B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 3-F            | 4-F             |
| A-364 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 3-F            | 4-F             |
| A-365 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CN                               | OH                                              | 3-F            | 4-F             |
| A-366 | I.1B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | OH                                              | 3-F            | 4-F             |
| A-367 | I.1B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | OH                                              | 3-F            | 4-F             |
| A-368 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | OH                                              | 3-F            | 4-F             |
| A-369 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> OH                              | 3-F            | 4-F             |
| A-370 | I.1B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> OH                              | 3-F            | 4-F             |
| A-371 | I.1B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> OH                              | 3-F            | 4-F             |
| A-372 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> OH                              | 3-F            | 4-F             |
| A-373 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CN                               | NH <sub>2</sub>                                 | 3-F            | 4-F             |
| A-374 | I.1B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | NH <sub>2</sub>                                 | 3-F            | 4-F             |
| A-375 | I.1B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | NH <sub>2</sub>                                 | 3-F            | 4-F             |
| A-376 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | NH <sub>2</sub>                                 | 3-F            | 4-F             |
| A-377 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CN                               | COOCH <sub>3</sub>                              | 3-F            | 4-F             |
| A-378 | I.1B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | COOCH <sub>3</sub>                              | 3-F            | 4-F             |

10

20

30

40

| No.   | 式     | R <sup>1</sup>                                   | R <sup>3</sup>                                  | R <sup>9</sup> | R <sup>10</sup> |
|-------|-------|--------------------------------------------------|-------------------------------------------------|----------------|-----------------|
| A-379 | I.1B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | COOCH <sub>3</sub>                              | 3-F            | 4-F             |
| A-380 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | COOCH <sub>3</sub>                              | 3-F            | 4-F             |
| A-381 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | 3-F            | 4-F             |
| A-382 | I.1B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | 3-F            | 4-F             |
| A-383 | I.1B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | 3-F            | 4-F             |
| A-384 | I.1B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | 3-F            | 4-F             |
| A-385 | I.2A' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>3</sub>                                 | H              | H               |
| A-386 | I.2A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                                 | H              | H               |
| A-387 | I.2A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub>                                 | H              | H               |
| A-388 | I.2A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>3</sub>                                 | H              | H               |
| A-389 | I.2A' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | H              | H               |
| A-390 | I.2A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | H              | H               |
| A-391 | I.2A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | H              | H               |
| A-392 | I.2A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | H              | H               |
| A-393 | I.2A' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H              | H               |
| A-394 | I.2A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H              | H               |
| A-395 | I.2A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H              | H               |
| A-396 | I.2A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H              | H               |
| A-397 | I.2A' | CH <sub>2</sub> CN                               | OH                                              | H              | H               |
| A-398 | I.2A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | OH                                              | H              | H               |
| A-399 | I.2A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | OH                                              | H              | H               |
| A-400 | I.2A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | OH                                              | H              | H               |
| A-401 | I.2A' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> OH                              | H              | H               |
| A-402 | I.2A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> OH                              | H              | H               |
| A-403 | I.2A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> OH                              | H              | H               |
| A-404 | I.2A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> OH                              | H              | H               |
| A-405 | I.2A' | CH <sub>2</sub> CN                               | NH <sub>2</sub>                                 | H              | H               |
| A-406 | I.2A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | NH <sub>2</sub>                                 | H              | H               |
| A-407 | I.2A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | NH <sub>2</sub>                                 | H              | H               |
| A-408 | I.2A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | NH <sub>2</sub>                                 | H              | H               |
| A-409 | I.2A' | CH <sub>2</sub> CN                               | COOCH <sub>3</sub>                              | H              | H               |
| A-410 | I.2A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | COOCH <sub>3</sub>                              | H              | H               |
| A-411 | I.2A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | COOCH <sub>3</sub>                              | H              | H               |
| A-412 | I.2A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | COOCH <sub>3</sub>                              | H              | H               |
| A-413 | I.2A' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | H              | H               |
| A-414 | I.2A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | H              | H               |
| A-415 | I.2A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | H              | H               |
| A-416 | I.2A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | H              | H               |

10

20

30

40

| No.   | 式     | R <sup>1</sup>                                   | R <sup>3</sup>                                  | R <sup>9</sup> | R <sup>10</sup> |
|-------|-------|--------------------------------------------------|-------------------------------------------------|----------------|-----------------|
| A-417 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>3</sub>                                 | 2-F            | H               |
| A-418 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                                 | 2-F            | H               |
| A-419 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub>                                 | 2-F            | H               |
| A-420 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>3</sub>                                 | 2-F            | H               |
| A-421 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 2-F            | H               |
| A-422 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 2-F            | H               |
| A-423 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 2-F            | H               |
| A-424 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 2-F            | H               |
| A-425 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2-F            | H               |
| A-426 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2-F            | H               |
| A-427 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2-F            | H               |
| A-428 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2-F            | H               |
| A-429 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> CN                               | OH                                              | 2-F            | H               |
| A-430 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | OH                                              | 2-F            | H               |
| A-431 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | OH                                              | 2-F            | H               |
| A-432 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | OH                                              | 2-F            | H               |
| A-433 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> OH                              | 2-F            | H               |
| A-434 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> OH                              | 2-F            | H               |
| A-435 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> OH                              | 2-F            | H               |
| A-436 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> OH                              | 2-F            | H               |
| A-437 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> CN                               | NH <sub>2</sub>                                 | 2-F            | H               |
| A-438 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | NH <sub>2</sub>                                 | 2-F            | H               |
| A-439 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | NH <sub>2</sub>                                 | 2-F            | H               |
| A-440 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | NH <sub>2</sub>                                 | 2-F            | H               |
| A-441 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> CN                               | COOCH <sub>3</sub>                              | 2-F            | H               |
| A-442 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | COOCH <sub>3</sub>                              | 2-F            | H               |
| A-443 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | COOCH <sub>3</sub>                              | 2-F            | H               |
| A-444 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | COOCH <sub>3</sub>                              | 2-F            | H               |
| A-445 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | 2-F            | H               |
| A-446 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | 2-F            | H               |
| A-447 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | 2-F            | H               |
| A-448 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | 2-F            | H               |
| A-449 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>3</sub>                                 | 3-F            | H               |
| A-450 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                                 | 3-F            | H               |
| A-451 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub>                                 | 3-F            | H               |
| A-452 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>3</sub>                                 | 3-F            | H               |
| A-453 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 3-F            | H               |
| A-454 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 3-F            | H               |

10

20

30

40

| No.   | 式     | R <sup>1</sup>                                   | R <sup>3</sup>                                  | R <sup>9</sup> | R <sup>10</sup> |
|-------|-------|--------------------------------------------------|-------------------------------------------------|----------------|-----------------|
| A-455 | I.2A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 3-F            | H               |
| A-456 | I.2A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 3-F            | H               |
| A-457 | I.2A' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 3-F            | H               |
| A-458 | I.2A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 3-F            | H               |
| A-459 | I.2A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 3-F            | H               |
| A-460 | I.2A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 3-F            | H               |
| A-461 | I.2A' | CH <sub>2</sub> CN                               | OH                                              | 3-F            | H               |
| A-462 | I.2A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | OH                                              | 3-F            | H               |
| A-463 | I.2A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | OH                                              | 3-F            | H               |
| A-464 | I.2A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | OH                                              | 3-F            | H               |
| A-465 | I.2A' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> OH                              | 3-F            | H               |
| A-466 | I.2A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> OH                              | 3-F            | H               |
| A-467 | I.2A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> OH                              | 3-F            | H               |
| A-468 | I.2A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> OH                              | 3-F            | H               |
| A-469 | I.2A' | CH <sub>2</sub> CN                               | NH <sub>2</sub>                                 | 3-F            | H               |
| A-470 | I.2A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | NH <sub>2</sub>                                 | 3-F            | H               |
| A-471 | I.2A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | NH <sub>2</sub>                                 | 3-F            | H               |
| A-472 | I.2A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | NH <sub>2</sub>                                 | 3-F            | H               |
| A-473 | I.2A' | CH <sub>2</sub> CN                               | COOCH <sub>3</sub>                              | 3-F            | H               |
| A-474 | I.2A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | COOCH <sub>3</sub>                              | 3-F            | H               |
| A-475 | I.2A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | COOCH <sub>3</sub>                              | 3-F            | H               |
| A-476 | I.2A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | COOCH <sub>3</sub>                              | 3-F            | H               |
| A-477 | I.2A' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | 3-F            | H               |
| A-478 | I.2A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | 3-F            | H               |
| A-479 | I.2A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | 3-F            | H               |
| A-480 | I.2A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | 3-F            | H               |
| A-481 | I.2A' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>3</sub>                                 | 4-F            | H               |
| A-482 | I.2A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                                 | 4-F            | H               |
| A-483 | I.2A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub>                                 | 4-F            | H               |
| A-484 | I.2A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>3</sub>                                 | 4-F            | H               |
| A-485 | I.2A' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 4-F            | H               |
| A-486 | I.2A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 4-F            | H               |
| A-487 | I.2A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 4-F            | H               |
| A-488 | I.2A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 4-F            | H               |
| A-489 | I.2A' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 4-F            | H               |
| A-490 | I.2A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 4-F            | H               |
| A-491 | I.2A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 4-F            | H               |
| A-492 | I.2A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 4-F            | H               |

10

20

30

40

| No.   | 式     | R <sup>1</sup>                                   | R <sup>3</sup>                                  | R <sup>9</sup> | R <sup>10</sup> |
|-------|-------|--------------------------------------------------|-------------------------------------------------|----------------|-----------------|
| A-493 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> CN                               | OH                                              | 4-F            | H               |
| A-494 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | OH                                              | 4-F            | H               |
| A-495 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | OH                                              | 4-F            | H               |
| A-496 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | OH                                              | 4-F            | H               |
| A-497 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> OH                              | 4-F            | H               |
| A-498 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> OH                              | 4-F            | H               |
| A-499 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> OH                              | 4-F            | H               |
| A-500 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> OH                              | 4-F            | H               |
| A-501 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> CN                               | NH <sub>2</sub>                                 | 4-F            | H               |
| A-502 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | NH <sub>2</sub>                                 | 4-F            | H               |
| A-503 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | NH <sub>2</sub>                                 | 4-F            | H               |
| A-504 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | NH <sub>2</sub>                                 | 4-F            | H               |
| A-505 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> CN                               | COOCH <sub>3</sub>                              | 4-F            | H               |
| A-506 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | COOCH <sub>3</sub>                              | 4-F            | H               |
| A-507 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | COOCH <sub>3</sub>                              | 4-F            | H               |
| A-508 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | COOCH <sub>3</sub>                              | 4-F            | H               |
| A-509 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | 4-F            | H               |
| A-510 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | 4-F            | H               |
| A-511 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | 4-F            | H               |
| A-512 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | 4-F            | H               |
| A-513 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>3</sub>                                 | 3-F            | 2-F             |
| A-514 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                                 | 3-F            | 2-F             |
| A-515 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub>                                 | 3-F            | 2-F             |
| A-516 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>3</sub>                                 | 3-F            | 2-F             |
| A-517 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 3-F            | 2-F             |
| A-518 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 3-F            | 2-F             |
| A-519 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 3-F            | 2-F             |
| A-520 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 3-F            | 2-F             |
| A-521 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 3-F            | 2-F             |
| A-522 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 3-F            | 2-F             |
| A-523 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 3-F            | 2-F             |
| A-524 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 3-F            | 2-F             |
| A-525 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> CN                               | OH                                              | 3-F            | 2-F             |
| A-526 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | OH                                              | 3-F            | 2-F             |
| A-527 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | OH                                              | 3-F            | 2-F             |
| A-528 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | OH                                              | 3-F            | 2-F             |
| A-529 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> OH                              | 3-F            | 2-F             |
| A-530 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> OH                              | 3-F            | 2-F             |

10

20

30

40

| No.   | 式     | R <sup>1</sup>                                   | R <sup>3</sup>                                  | R <sup>9</sup> | R <sup>10</sup> |
|-------|-------|--------------------------------------------------|-------------------------------------------------|----------------|-----------------|
| A-531 | I.2A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> OH                              | 3-F            | 2-F             |
| A-532 | I.2A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> OH                              | 3-F            | 2-F             |
| A-533 | I.2A' | CH <sub>2</sub> CN                               | NH <sub>2</sub>                                 | 3-F            | 2-F             |
| A-534 | I.2A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | NH <sub>2</sub>                                 | 3-F            | 2-F             |
| A-535 | I.2A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | NH <sub>2</sub>                                 | 3-F            | 2-F             |
| A-536 | I.2A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | NH <sub>2</sub>                                 | 3-F            | 2-F             |
| A-537 | I.2A' | CH <sub>2</sub> CN                               | COOCH <sub>3</sub>                              | 3-F            | 2-F             |
| A-538 | I.2A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | COOCH <sub>3</sub>                              | 3-F            | 2-F             |
| A-539 | I.2A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | COOCH <sub>3</sub>                              | 3-F            | 2-F             |
| A-540 | I.2A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | COOCH <sub>3</sub>                              | 3-F            | 2-F             |
| A-541 | I.2A' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | 3-F            | 2-F             |
| A-542 | I.2A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | 3-F            | 2-F             |
| A-543 | I.2A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | 3-F            | 2-F             |
| A-544 | I.2A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | 3-F            | 2-F             |
| A-545 | I.2A' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>3</sub>                                 | 3-F            | 4-F             |
| A-546 | I.2A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                                 | 3-F            | 4-F             |
| A-547 | I.2A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub>                                 | 3-F            | 4-F             |
| A-548 | I.2A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>3</sub>                                 | 3-F            | 4-F             |
| A-549 | I.2A' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 3-F            | 4-F             |
| A-550 | I.2A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 3-F            | 4-F             |
| A-551 | I.2A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 3-F            | 4-F             |
| A-552 | I.2A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 3-F            | 4-F             |
| A-553 | I.2A' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 3-F            | 4-F             |
| A-554 | I.2A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 3-F            | 4-F             |
| A-555 | I.2A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 3-F            | 4-F             |
| A-556 | I.2A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 3-F            | 4-F             |
| A-557 | I.2A' | CH <sub>2</sub> CN                               | OH                                              | 3-F            | 4-F             |
| A-558 | I.2A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | OH                                              | 3-F            | 4-F             |
| A-559 | I.2A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | OH                                              | 3-F            | 4-F             |
| A-560 | I.2A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | OH                                              | 3-F            | 4-F             |
| A-561 | I.2A' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> OH                              | 3-F            | 4-F             |
| A-562 | I.2A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> OH                              | 3-F            | 4-F             |
| A-563 | I.2A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> OH                              | 3-F            | 4-F             |
| A-564 | I.2A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> OH                              | 3-F            | 4-F             |
| A-565 | I.2A' | CH <sub>2</sub> CN                               | NH <sub>2</sub>                                 | 3-F            | 4-F             |
| A-566 | I.2A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | NH <sub>2</sub>                                 | 3-F            | 4-F             |
| A-567 | I.2A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | NH <sub>2</sub>                                 | 3-F            | 4-F             |
| A-568 | I.2A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | NH <sub>2</sub>                                 | 3-F            | 4-F             |

10

20

30

40

| No.   | 式     | R <sup>1</sup>                                   | R <sup>3</sup>                                  | R <sup>9</sup> | R <sup>10</sup> |
|-------|-------|--------------------------------------------------|-------------------------------------------------|----------------|-----------------|
| A-569 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> CN                               | COOCH <sub>3</sub>                              | 3-F            | 4-F             |
| A-570 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | COOCH <sub>3</sub>                              | 3-F            | 4-F             |
| A-571 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | COOCH <sub>3</sub>                              | 3-F            | 4-F             |
| A-572 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | COOCH <sub>3</sub>                              | 3-F            | 4-F             |
| A-573 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | 3-F            | 4-F             |
| A-574 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | 3-F            | 4-F             |
| A-575 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | 3-F            | 4-F             |
| A-576 | 1.2A' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | 3-F            | 4-F             |
| A-577 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>3</sub>                                 | H              | H               |
| A-578 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                                 | H              | H               |
| A-579 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub>                                 | H              | H               |
| A-580 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>3</sub>                                 | H              | H               |
| A-581 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | H              | H               |
| A-582 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | H              | H               |
| A-583 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | H              | H               |
| A-584 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | H              | H               |
| A-585 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H              | H               |
| A-586 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H              | H               |
| A-587 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H              | H               |
| A-588 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H              | H               |
| A-589 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CN                               | OH                                              | H              | H               |
| A-590 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | OH                                              | H              | H               |
| A-591 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | OH                                              | H              | H               |
| A-592 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | OH                                              | H              | H               |
| A-593 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> OH                              | H              | H               |
| A-594 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> OH                              | H              | H               |
| A-595 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> OH                              | H              | H               |
| A-596 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> OH                              | H              | H               |
| A-597 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CN                               | NH <sub>2</sub>                                 | H              | H               |
| A-598 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | NH <sub>2</sub>                                 | H              | H               |
| A-599 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | NH <sub>2</sub>                                 | H              | H               |
| A-600 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | NH <sub>2</sub>                                 | H              | H               |
| A-601 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CN                               | COOCH <sub>3</sub>                              | H              | H               |
| A-602 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | COOCH <sub>3</sub>                              | H              | H               |
| A-603 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | COOCH <sub>3</sub>                              | H              | H               |
| A-604 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | COOCH <sub>3</sub>                              | H              | H               |
| A-605 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | H              | H               |
| A-606 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | H              | H               |

10

20

30

40

| No.   | 式     | R <sup>1</sup>                                   | R <sup>3</sup>                                  | R <sup>9</sup> | R <sup>10</sup> |
|-------|-------|--------------------------------------------------|-------------------------------------------------|----------------|-----------------|
| A-607 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | H              | H               |
| A-608 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | H              | H               |
| A-609 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>3</sub>                                 | 2-F            | H               |
| A-610 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                                 | 2-F            | H               |
| A-611 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub>                                 | 2-F            | H               |
| A-612 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>3</sub>                                 | 2-F            | H               |
| A-613 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 2-F            | H               |
| A-614 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 2-F            | H               |
| A-615 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 2-F            | H               |
| A-616 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 2-F            | H               |
| A-617 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2-F            | H               |
| A-618 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2-F            | H               |
| A-619 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2-F            | H               |
| A-620 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2-F            | H               |
| A-621 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CN                               | OH                                              | 2-F            | H               |
| A-622 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | OH                                              | 2-F            | H               |
| A-623 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | OH                                              | 2-F            | H               |
| A-624 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | OH                                              | 2-F            | H               |
| A-625 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> OH                              | 2-F            | H               |
| A-626 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> OH                              | 2-F            | H               |
| A-627 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> OH                              | 2-F            | H               |
| A-628 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> OH                              | 2-F            | H               |
| A-629 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CN                               | NH <sub>2</sub>                                 | 2-F            | H               |
| A-630 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | NH <sub>2</sub>                                 | 2-F            | H               |
| A-631 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | NH <sub>2</sub>                                 | 2-F            | H               |
| A-632 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | NH <sub>2</sub>                                 | 2-F            | H               |
| A-633 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CN                               | COOCH <sub>3</sub>                              | 2-F            | H               |
| A-634 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | COOCH <sub>3</sub>                              | 2-F            | H               |
| A-635 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | COOCH <sub>3</sub>                              | 2-F            | H               |
| A-636 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | COOCH <sub>3</sub>                              | 2-F            | H               |
| A-637 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | 2-F            | H               |
| A-638 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | 2-F            | H               |
| A-639 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | 2-F            | H               |
| A-640 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | 2-F            | H               |
| A-641 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>3</sub>                                 | 3-F            | H               |
| A-642 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                                 | 3-F            | H               |
| A-643 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub>                                 | 3-F            | H               |
| A-644 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>3</sub>                                 | 3-F            | H               |

10

20

30

40

| No.   | 式     | R <sup>1</sup>                                   | R <sup>3</sup>                                  | R <sup>9</sup> | R <sup>10</sup> |
|-------|-------|--------------------------------------------------|-------------------------------------------------|----------------|-----------------|
| A-645 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 3-F            | H               |
| A-646 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 3-F            | H               |
| A-647 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 3-F            | H               |
| A-648 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 3-F            | H               |
| A-649 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 3-F            | H               |
| A-650 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 3-F            | H               |
| A-651 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 3-F            | H               |
| A-652 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 3-F            | H               |
| A-653 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CN                               | OH                                              | 3-F            | H               |
| A-654 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | OH                                              | 3-F            | H               |
| A-655 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | OH                                              | 3-F            | H               |
| A-656 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | OH                                              | 3-F            | H               |
| A-657 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> OH                              | 3-F            | H               |
| A-658 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> OH                              | 3-F            | H               |
| A-659 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> OH                              | 3-F            | H               |
| A-660 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> OH                              | 3-F            | H               |
| A-661 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CN                               | NH <sub>2</sub>                                 | 3-F            | H               |
| A-662 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | NH <sub>2</sub>                                 | 3-F            | H               |
| A-663 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | NH <sub>2</sub>                                 | 3-F            | H               |
| A-664 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | NH <sub>2</sub>                                 | 3-F            | H               |
| A-665 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CN                               | COOCH <sub>3</sub>                              | 3-F            | H               |
| A-666 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | COOCH <sub>3</sub>                              | 3-F            | H               |
| A-667 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | COOCH <sub>3</sub>                              | 3-F            | H               |
| A-668 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | COOCH <sub>3</sub>                              | 3-F            | H               |
| A-669 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | 3-F            | H               |
| A-670 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | 3-F            | H               |
| A-671 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | 3-F            | H               |
| A-672 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | 3-F            | H               |
| A-673 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>3</sub>                                 | 4-F            | H               |
| A-674 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                                 | 4-F            | H               |
| A-675 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub>                                 | 4-F            | H               |
| A-676 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>3</sub>                                 | 4-F            | H               |
| A-677 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 4-F            | H               |
| A-678 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 4-F            | H               |
| A-679 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 4-F            | H               |
| A-680 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 4-F            | H               |
| A-681 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 4-F            | H               |
| A-682 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 4-F            | H               |

10

20

30

40

| No.   | 式     | R <sup>1</sup>                                   | R <sup>3</sup>                                  | R <sup>9</sup> | R <sup>10</sup> |
|-------|-------|--------------------------------------------------|-------------------------------------------------|----------------|-----------------|
| A-683 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 4-F            | H               |
| A-684 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 4-F            | H               |
| A-685 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CN                               | OH                                              | 4-F            | H               |
| A-686 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | OH                                              | 4-F            | H               |
| A-687 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | OH                                              | 4-F            | H               |
| A-688 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | OH                                              | 4-F            | H               |
| A-689 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> OH                              | 4-F            | H               |
| A-690 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> OH                              | 4-F            | H               |
| A-691 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> OH                              | 4-F            | H               |
| A-692 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> OH                              | 4-F            | H               |
| A-693 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CN                               | NH <sub>2</sub>                                 | 4-F            | H               |
| A-694 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | NH <sub>2</sub>                                 | 4-F            | H               |
| A-695 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | NH <sub>2</sub>                                 | 4-F            | H               |
| A-696 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | NH <sub>2</sub>                                 | 4-F            | H               |
| A-697 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CN                               | COOCH <sub>3</sub>                              | 4-F            | H               |
| A-698 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | COOCH <sub>3</sub>                              | 4-F            | H               |
| A-699 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | COOCH <sub>3</sub>                              | 4-F            | H               |
| A-700 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | COOCH <sub>3</sub>                              | 4-F            | H               |
| A-701 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | 4-F            | H               |
| A-702 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | 4-F            | H               |
| A-703 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | 4-F            | H               |
| A-704 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | 4-F            | H               |
| A-705 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>3</sub>                                 | 3-F            | 2-F             |
| A-706 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                                 | 3-F            | 2-F             |
| A-707 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub>                                 | 3-F            | 2-F             |
| A-708 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>3</sub>                                 | 3-F            | 2-F             |
| A-709 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 3-F            | 2-F             |
| A-710 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 3-F            | 2-F             |
| A-711 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 3-F            | 2-F             |
| A-712 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 3-F            | 2-F             |
| A-713 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 3-F            | 2-F             |
| A-714 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 3-F            | 2-F             |
| A-715 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 3-F            | 2-F             |
| A-716 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 3-F            | 2-F             |
| A-717 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CN                               | OH                                              | 3-F            | 2-F             |
| A-718 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | OH                                              | 3-F            | 2-F             |
| A-719 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | OH                                              | 3-F            | 2-F             |
| A-720 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | OH                                              | 3-F            | 2-F             |

10

20

30

40

| No.   | 式     | R <sup>1</sup>                                   | R <sup>3</sup>                                  | R <sup>9</sup> | R <sup>10</sup> |
|-------|-------|--------------------------------------------------|-------------------------------------------------|----------------|-----------------|
| A-721 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> OH                              | 3-F            | 2-F             |
| A-722 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> OH                              | 3-F            | 2-F             |
| A-723 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> OH                              | 3-F            | 2-F             |
| A-724 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> OH                              | 3-F            | 2-F             |
| A-725 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CN                               | NH <sub>2</sub>                                 | 3-F            | 2-F             |
| A-726 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | NH <sub>2</sub>                                 | 3-F            | 2-F             |
| A-727 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | NH <sub>2</sub>                                 | 3-F            | 2-F             |
| A-728 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | NH <sub>2</sub>                                 | 3-F            | 2-F             |
| A-729 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CN                               | COOCH <sub>3</sub>                              | 3-F            | 2-F             |
| A-730 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | COOCH <sub>3</sub>                              | 3-F            | 2-F             |
| A-731 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | COOCH <sub>3</sub>                              | 3-F            | 2-F             |
| A-732 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | COOCH <sub>3</sub>                              | 3-F            | 2-F             |
| A-733 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | 3-F            | 2-F             |
| A-734 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | 3-F            | 2-F             |
| A-735 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | 3-F            | 2-F             |
| A-736 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | 3-F            | 2-F             |
| A-737 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>3</sub>                                 | 3-F            | 4-F             |
| A-738 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                                 | 3-F            | 4-F             |
| A-739 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub>                                 | 3-F            | 4-F             |
| A-740 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>3</sub>                                 | 3-F            | 4-F             |
| A-741 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 3-F            | 4-F             |
| A-742 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 3-F            | 4-F             |
| A-743 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 3-F            | 4-F             |
| A-744 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 3-F            | 4-F             |
| A-745 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 3-F            | 4-F             |
| A-746 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 3-F            | 4-F             |
| A-747 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 3-F            | 4-F             |
| A-748 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 3-F            | 4-F             |
| A-749 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CN                               | OH                                              | 3-F            | 4-F             |
| A-750 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | OH                                              | 3-F            | 4-F             |
| A-751 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | OH                                              | 3-F            | 4-F             |
| A-752 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | OH                                              | 3-F            | 4-F             |
| A-753 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> OH                              | 3-F            | 4-F             |
| A-754 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> OH                              | 3-F            | 4-F             |
| A-755 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> OH                              | 3-F            | 4-F             |
| A-756 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> OH                              | 3-F            | 4-F             |
| A-757 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CN                               | NH <sub>2</sub>                                 | 3-F            | 4-F             |
| A-758 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | NH <sub>2</sub>                                 | 3-F            | 4-F             |

10

20

30

40

| No.   | 式     | R <sup>1</sup>                                   | R <sup>3</sup>                     | R <sup>9</sup> | R <sup>10</sup> |
|-------|-------|--------------------------------------------------|------------------------------------|----------------|-----------------|
| A-759 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | NH <sub>2</sub>                    | 3-F            | 4-F             |
| A-760 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | NH <sub>2</sub>                    | 3-F            | 4-F             |
| A-761 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CN                               | COOCH <sub>3</sub>                 | 3-F            | 4-F             |
| A-762 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | COOCH <sub>3</sub>                 | 3-F            | 4-F             |
| A-763 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | COOCH <sub>3</sub>                 | 3-F            | 4-F             |
| A-764 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | COOCH <sub>3</sub>                 | 3-F            | 4-F             |
| A-765 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CN                               | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | 3-F            | 4-F             |
| A-766 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | 3-F            | 4-F             |
| A-767 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | 3-F            | 4-F             |
| A-768 | 1.2B' | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                          | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | 3-F            | 4-F             |

c-C<sub>3</sub>H<sub>5</sub> = シクロプロピル

10

# 【0685】

先に例示として言及した各化合物及びそれらの塩の中からは、好ましいものとしては、そのピペラジン環のところのエキソ二重結合がその（Z）配置を有している化合物及び塩が挙げられる。好ましいものとしては、そのZ異性体が過剰で存在しているその（Z）異性体とその（E）異性体の混合物、特には1：2より大きくない（特には1：5より大きくない）E/Z比を有している異性体混合物も挙げられる。

20

# 【0686】

先に例示として言及した式 I、1 B' で表される各化合物及びそれらの塩の中からは、好ましいものとしては、R<sup>3</sup> 及び位置 R<sup>4</sup> の水素原子が c i s 配置を有している化合物及び塩が挙げられる。好ましいものとしては、その c i s 異性体が過剰で存在しているその c i s 異性体とその t r a n s 異性体の混合物、特には1：2より大きくない（特には1：5より大きくない）c i s / t r a n s 比を有している異性体混合物も挙げられる。

30

# 【0687】

本発明で例示として記載されているその各化合物及びそれらの塩の中からは、好ましいものとしては、その基 R<sup>3</sup> を有している炭素原子がその S 配置を有している化合物及び塩が挙げられ、さらにはその S エナンチオマーのエナンチオマー過剰を有しているエナンチオマー混合物、特には少なくとも70%、特に好ましくは少なくとも80%、好ましくは少なくとも90%の e e 値を有しているエナンチオマー混合物も挙げられる。好ましいものとしては、そのような化合物のラセミ化合物及びそれらの塩も挙げられる。

# 【0688】

この化合物 I 及びその農薬として有用な塩は、異性体混合物として及びその純粋異性体の形態でも、除草剤として適している。それらは、それ自体でも又は適切に製剤された組成物としても、適している。その化合物 I、特にはその好ましい態様の化合物 I、を含んでいる除草剤組成物は、特に高施用量で、非作物面の植物をきわめて有効に防除する。それらは、コムギ、イネ、トウモロコシ、ダイズ及びワタのような作物における広葉雑草及び雑草イネ科植物に対してその作物植物体になんら有意な損傷を引き起こすことなく作用する。この効果は、主に、低施用量で認められる。

40

# 【0689】

当該の施用方法にもよるが、その化合物 I（特にはその好ましい態様の）又はそれを含んでいる組成物は、さらに、さらなる数の作物植物体において、望ましくない植物体を消滅させるのに用いられ得る。適する作物の例は、以下の作物：

アリウム・セパ（Allium cepa、タマネギ）、アナナス・コモスス（Ananas comosus、パイナップル）、アラキス・ヒポゲア（Arachis hypogaea、ラッカセイ）、アスパラガス・

50

オフィチナリス (*Asparagus officinalis*、アスパラガス)、アベナ・サチバ (*Avena sativa*、エンバク)、ベータ・ブルガリス品種アルチシマ (*Beta vulgaris spec. altissima*、テンサイ)、ベータ・ブルガリス品種ラパ (*Beta vulgaris spec. rapa*、サトウダイコン)、ブラッシカ・ナプス変種ナプス (*Brassica napus var. napus*、セイヨウアブラナ)、ブラッシカ・ナプス変種ナポブラッシカ (*Brassica napus var. napobrassica*、セイヨウキャベツ)、ブラッシカ・ラパ変種シルベストリス (*Brassica rapa var. silvestris*、インドアブラナ)、ブラッシカ・オレラセア (*Brassica oleracea*、セイヨウキャベツ)、ブラッシカ・ニグラ (*Brassica nigra*、クロガラシ)、カメリア・シネンシス (*Camelia sinensis*、チャ)、カルタムス・チンクトリウス (*Carthamus tinctorius*、ベニバナ)、カルヤ・イリノイネンシス (*Carya illinoensis*、ペカン)、シトルス・リモン (*Citrus limon*、レモン)、シトルス・シネンシス (*Citrus sinensis*、オレンジスイート)、コフェア・アラビカ (*Coffea arabica*、アラビアコーヒーノキ)、コフェア・カネフォラ (*Coffea canephora*、ロブスタコーヒーノキ)、コフェア・リベリカ (*Coffea liberica*、リベリアコーヒーノキ)、ククミス・サチバス (*Cucumis sativus*、キュウリ)、シノドン・デクチドン (*Cynodon dactylon*、ギョウギシバ)、ダウカス・カロタ (*Daucus carota*、ニンジン)、エラエイシ・ギネエンシス (*Elaeis guineensis*、アブラヤシ)、フラガリア・ベスカ (*Fragaria vesca*、エゾヘビイチゴ)、グリシン・マクス (*Glycine max*、ダイズ)、ゴシッピーウム・ヒルスツム (*Gossypium hirsutum*、リクチワタ)、ゴシッピーウム・アルボレウム (*Gossypium arboreum*、キダチワタ)、ゴシッピーウム・ヘルバケウム (*Gossypium herbaceum*、アジアカワタ)、ゴシッピーウム・ビチフォリウム (*Gossypium vitifolium*、ウミシマワタ)、ヘリアンタス・アヌウス (*Helianthus annuus*、ヒマワリ)、ヘベア・ブラシリエンシス (*Hevea brasiliensis*、パラゴムノキ)、ホルデウム・ブルガレ (*Hordeum vulgare*、オオムギ)、フムラス・ルプルス (*Humulus lupulus*、ホップ)、イポモエア・バタタス (*Ipomoea batatas*、サツマイモ)、ジュグラン・レギア (*Juglans regia*、シナノグルミ)、レンス・クリナリス (*Lens culinaris*、ヒラマメ)、リヌム・ウシタチシマム (*Linum usitatissimum*、アマ)、リコペルシコン・リコペルシカム (*Lycopersicon lycopersicum*、トマト)、マルス・品種 (*Malus spec.*、リンゴ属の品種)、マニホット・エスクレンタ (*Manihot esculenta*、キャッサバ)、メジカゴ・サチバ (*Medicago sativa*、アルファルファ)、ムサ・品種 (*Musa spec.*、バナナ属の品種)、ニコチアナ・タバクム (*Nicotiana tabacum*、タバコ)、ニコチアナ・ルスチカ (*Nicotiana rustica*、マルバタバコ)、オレア・エウロペア (*Olea europaea*、オリーブ)、オリザ・サチバ (*Oryza sativa*、イネ)、ファセオラス・ルナタス (*Phaseolus lunatus*、ライマメ)、ファセオラス・ブルガリス (*Phaseolus vulgaris*、インゲンマメ)、ピセア・アビエス (*Picea abies*、ドイツトウヒ)、ピナス・品種 (*Pinus spec.*、マツ属の品種)、ピスタシア・ベラ (*Pistacia vera*、ピスタシオノキ)、ピスム・サチバム (*Pisum sativum*、エンドウ)、プルナス・アビウム (*Prunus avium*、セイヨウウミザクラ)、プルナス・ペルシカ (*Prunus persica*、モモ)、ピルス・コムニス (*Pyrus communis*、セイヨウナシ)、プルヌス・アルメニアカ (*Prunus armeniaca*、アンズ)、プルヌス・サラス (*Prunus cerasus*、サクラ)、プルヌス・デュルシス (*Prunus dulcis*、アーモンド)、プルヌス・ドメスチカ (*Prunus domestica*、プルーン)、リベス・シルベストレ (*Ribes sylvestre*、フサスグリ)、リシナス・コムニス (*Ricinus communis*、ヒマ)、サッカラム・オフィシナルム (*Saccharum officinarum*、サトウキビ)、セカレ・セレアレ (*Secale cereale*、ライムギ)、シナピス・アルバ (*Sinapis alba*、シロガラシ)、ソラナム・ツベロサム (*Solanum tuberosum*、ジャガイモ)、ソルガム・ビコロル (*Sorghum bicolor*、モロコシ)、ソルガム・ブルガレ (*Sorghum vulgare*、ハウキモロコシ)、テオブロマ・カカオ (*Theobroma cacao*、カカオ)、トリフォリウム・プラテンセ (*Trifolium pratense*、アカツメクサ)、トリチウム・アエスチバム (*Triticum aestivum*、コムギ)、トリチカレ (*Triticale*、ライコムギ)、トリチウム・デュラム (*Triticum durum*、マカロニコムギ)、ビシア・ファバ (*Vicia faba*、ソラマメ)、ビティス・ビニフェラ (*Vitis vinifera*、ブドウ)、及びゼア・マイス (*Zea mays*、トウモロコシ)、

10

20

30

40

50

である。

#### 【0690】

用語「作物植物体」には、品種改良、突然変異又は遺伝子工学によって改変されている植物体も含まれる。遺伝子改変植物体は、交雑育種、突然変異又は自然組み換え（すなわちその遺伝情報の再組み立て）によっては自然条件下で起こらないような方式で遺伝物質が改変されている植物体である。ここで、一般には、植物体の各特性を改良するためには、1つ又はそれ以上の遺伝子が、その植物体の遺伝物質に組み込まれている。

#### 【0691】

つまり、この用語「作物植物体」には、品種改良や遺伝子工学によって、ある種の除草剤の群、例えばヒドロキシフェニルピルバートジオキシゲナーゼ（HPPD）阻害物質、アセトラクタートシンターゼ（ALS）阻害物質、例えばスルホニル尿素（欧州特許出願公開第0257993号明細書、米国特許第5,013,659号明細書）やイミダゾリノン（例えば、米国特許第6,222,100号明細書、国際公開第01/82685号パンフレット、国際公開第00/26390号パンフレット、国際公開第97/41218号パンフレット、国際公開第98/02526号パンフレット、国際公開第98/02527号パンフレット、国際公開第04/106529号パンフレット、国際公開第05/20673号パンフレット、国際公開第03/14357号パンフレット、国際公開第03/13225号パンフレット、国際公開第03/14356号パンフレット、国際公開第04/16073号パンフレットを参照されたい）等、エノルピルビルシキマート3-ホスファートシンターゼ（enolpyruvylshikimate 3-phosphate synthase）（EPSPS）阻害物質、例えば、グリホセート（例えば、国際公開第92/00377号パンフレットを参照されたい）等、グルタミンシンテターゼ（GS）阻害物質、例えば、グルホシネート（例えば、欧州特許出願公開第0242236号明細書、欧州特許出願公開第242246号明細書を参照されたい）等、又はオキシニル系除草剤（例えば、米国特許第5,559,024号明細書を参照されたい）、に対して耐性を獲得している植物体も含まれる。

#### 【0692】

イミダゾリノン（例えばイマザモックス）に耐性の多くの作物植物体（例えばClearfield（登録商標）アブラナ）が古典的品種改良法（突然変異）の利用により作出されている。グリホセート又はグルホシネート（これらは、商品名Roundup Ready（登録商標）（グリホセート）及びLiberty Link（登録商標）（グルホシネート）で市販されている）に抵抗性の、例えばダイズ、ワタ、トウモロコシ、ビート及びアブラナのような作物植物が、遺伝子工学法の利用により作出されている。

#### 【0693】

つまり、この用語「作物植物体」には、遺伝子工学の利用により、1種又はそれ以上のトキシン、例えば細菌株バチルス種（*Bacillus* spp.）のトキシン、を産生する植物体も含まれる。そのような遺伝子改変植物体によって産生されるトキシンとしては、例えば、バチルス種（特にはバチルス・ツリンギエンシス（*Bacillus thuringiensis*））の殺昆虫タンパク質、例えばエンドトキシンCry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1、Cry9c、Cry34Ab1又はCry35Ab1；栄養成長期産生殺昆虫タンパク質（vegetative insecticidal proteins）（VIP）、例えばVIP1、VIP2、VIP3、又はVIP3A；線虫コロニー形成性細菌（nematode-colonizing bacteria）（例えばホトルハブダス属の種（*Photorhabdus* spp.）又はゼノルハブダス属の種（*Xenorhabdus* spp.））の殺昆虫タンパク質；動物生物のトキシン、例えばハチトキシン、クモトキシン又はサソリトキシン；真菌トキシン、例えばストレプトミセテス（*Streptomyces*）から産生されるトキシン；植物レクチン、例えばエンドウレクチン又はオオムギレクチン；アグルチニン（agglutinins）；プロテインナーゼ阻害物質、例えばトリプシン阻害物質、セリンプロテアーゼ阻害物質、パタチン阻害物質、シスタチン阻害物質、又はパパイン阻害物質；リボソーム不活化タンパク質（ribosome-inactivating proteins）（RIP）、例えばリシン、トウモロコシ

R I P、アブリン、ルフィン、サボリン又はブリヨジン；ステロイド代謝酵素、例えば 3-ヒドロキシステロイドオキシダーゼ、エクジステロイド-I D P-グリコシルトランスフェラーゼ、コレステロールオキシダーゼ、エクジソン阻害物質、又は H M G-C o A-レダクターゼ；イオンチャネルブロッカー、例えばナトリウムチャネル又はカルシウムチャネルの阻害物質；幼若ホルモンエステラーゼ；利尿ホルモン受容体（ヘリコキニン受容体）；スチルベンシンターゼ、ビベンジルシンターゼ、キチナーゼ、及びグルカナーゼ；が挙げられる。その植物体中では、これらのトキシンは、プレトキシン（pre-toxins）、ハイブリッドタンパク質（hybrid proteins）又はトランケーテッドタンパク質（truncated proteins）あるいはそうでなければ改変タンパク質（modified proteins）としても産生され得る。ハイブリッドタンパク質は、異なるタンパク質ドメインの新規な組み合わせを特徴としている（例えば、国際公開第 2 0 0 2 / 0 1 5 7 0 1 号パンフレットを参照されたい）。このようなトキシン又はそのようなトキシンを産生する遺伝子改変植物体のさらなる例は、欧州特許出願公開第 3 7 4 7 5 3 号明細書、国際公開第 9 3 / 0 0 7 2 7 8 号パンフレット、国際公開第 9 5 / 3 4 6 5 6 号パンフレット、欧州特許出願公開第 4 2 7 5 2 9 号明細書、欧州特許出願公開第 4 5 1 8 7 8 号明細書、国際公開第 0 3 / 0 1 8 8 1 0 号パンフレット及び国際公開第 0 3 / 0 5 2 0 7 3 号パンフレットに開示されている。そのような遺伝子改変植物体の作成方法は当業者には知られており、例えば、先に言及した文献に開示されている。先に言及した各トキシンの多くは、それらを産生している植物体に、節足動物のあらゆる分類学上の群に属する害虫、特にカブトムシ（beetles）（コレオプテラ（Coleoptera；鞘翅目））、二翅類昆虫（ディプテラ（Diptera；双翅目））及びチョウ（butterflies）（レピドプテラ（Lepidoptera；鱗翅目））に、ならびにセンチュウ（nematodes）（ネマトーダ（Nematoda；線虫綱））にも耐性を賦与する。

#### 【0694】

殺昆虫トキシンをコードする 1 種又はそれ以上の遺伝子を産生する遺伝子改変植物体は、例えば、先に言及した文献に記載されており、またそれらのうちの一部のものは、例えば、Y i e l d G a r d（登録商標）（そのトキシン C r y 1 A b を産生するトウモロコシ栽培変種）、Y i e l d G a r d（登録商標）P l u s（そのトキシン C r y 1 A b 及び C r y 3 B b 1 を産生するトウモロコシ栽培変種）、S t a r l i n k（登録商標）（そのトキシン C r y 9 c を産生するトウモロコシ栽培変種）、H e r c u l e x（登録商標）R W（そのトキシン C r y 3 4 A b 1、C r y 3 5 A b 1 及びその酵素ホスフィトリシン-N-アセチルトランスフェラーゼ（P A T）を産生するトウモロコシ栽培変種）；N u C O T N（登録商標）3 3 B（そのトキシン C r y 1 A c を産生するワタ栽培変種）、B o l l g a r d（登録商標）I（そのトキシン C r y 1 A c を産生するワタ栽培変種）、B o l l g a r d（登録商標）I I（そのトキシン C r y 1 A c 及びトキシン C r y 2 A b 2 を産生するワタ栽培変種）；V I P C O T（登録商標）（V I P トキシンを産生するワタ栽培変種）；N e w L e a f（登録商標）（そのトキシン C r y 3 A を産生するジャガイモ栽培変種）；S y n g e n t a S e e d s S A S 社（仏）から販売の B t - X t r a（登録商標）、N a t u r e G a r d（登録商標）、K n o c k O u t（登録商標）、B i t e G a r d（登録商標）、P r o t e c t a（登録商標）、B t 1 1（例えば A g r i s u r e（登録商標）C B）及び B t 1 7 6（そのトキシン C r y 1 A b 及びその P A T 酵素を産生するトウモロコシ栽培変種）、S y n g e n t a S e e d s S A S 社（仏）から販売の M I R 6 0 4（そのトキシン C r y 3 A の改変体を産生するトウモロコシ栽培変種、国際公開第 0 3 / 0 1 8 8 1 0 号パンフレットを参照されたい）、M o n s a n t o E u r o p e S . A . 社（ベルギー）から販売の M O N 8 6 3（そのトキシン C r y 3 B b 1 を産生するトウモロコシ栽培変種）、M o n s a n t o E u r o p e S . A . 社（ベルギー）から販売の I P C 5 3 1（そのトキシン C r y 1 A c の改変体を産生するワタ栽培変種）、及び P i o n e e r O v e r s e a s C o r p o r a t i o n 社（ベルギー）から販売の 1 5 0 7（そのトキシン C r y 1 F 及びその P A T 酵素を産生するトウモロコシ栽培変種）のように、市販もされている。

#### 【0695】

つまり、この用語「作物植物体」には、遺伝子工学の利用により、細菌性、ウイルス性又は真菌性病原体に対してより効果があり又は抵抗性が増大されている１種又はそれ以上のタンパク質、例えば、感染特異的タンパク質（pathogenesis-related proteins）（P Rタンパク質、欧州特許出願公開第０３９２２２５号明細書を参照されたい）、抵抗タンパク質（resistance proteins）（例えば、メキシコ産野生種ジャガイモであるソラヌム・ブルボカスタヌム（*Solanum bulbocastanum*）由来のジャガイモ栽培変種、ファイトフトラ・インフェスタンス（*Phytophthora infestans*）に対する２種の抵抗遺伝子を産生する）又はT 4－l y s o z y m（例えばジャガイモ栽培変種植物体、このタンパク質を産生することによって、エルビニア・アミロボラ（*Erwinia amylovora*）のような細菌に対して抵抗性がある）等を産生する植物体も、含まれる。

10

## 【０６９６】

つまり、この用語「作物植物体」には、遺伝子工学法の利用により、例えば、その可能収量（例えばバイオマス、穀物収量、デンプン含有量、油分含有量又はタンパク質含有量）；日照り、塩分又は他の生長制限環境因子に対する耐性；あるいは害虫ならびに真菌性、細菌性さらにはウイルス性病原体に対する抵抗性；を高めさせることにより、その生産性が改善されている植物体も含まれる。

## 【０６９７】

この用語「作物植物体」には、遺伝子工学法の利用により、特にはヒト又は動物の栄養摂取を改善するためにその構成成分が改変されている植物体、例えば健康促進性長鎖オメガー３脂肪酸又は不飽和オメガー９脂肪酸を産生する油脂植物体（例えば、N e x e r a（登録商標）アブラナ）も含まれる。

20

## 【０６９８】

この用語「作物植物体」には、遺伝子工学法の利用によりその原料物質の生産性を改善させるように、例えばジャガイモのアミロペクチン含有量を増大させるように改変されている植物体（A m f l o r a（登録商標）ジャガイモ）も、含まれる。

## 【０６９９】

さらに、式 I で表される化合物は、植物体一部分を落葉及び／又は乾燥させるのにも適していることが見出されており、これには、ワタ、ジャガイモ、アブラナ、ヒマワリ、ダイズ又はソラマメのような作物植物体、特にはワタ、が適している。この関連では、植物体を乾燥及び／又は落葉させるための組成物、そのような組成物を調製するための方法、及び式 I で表される化合物を用いた植物体の乾燥及び／又は落葉方法が見出されている。

30

## 【０７００】

乾燥化剤としては、式 I で表される化合物は、ジャガイモ、アブラナ、ヒマワリ及びダイズのような作物植物体の地上部分のみならず、禾穀類の地上部分も、乾燥化させるのに、特に適している。これは、そのような重要な作物植物体の完全機械収穫を可能にするものである。

## 【０７０１】

また、収穫を容易にすることも、経済的関心事であるが、これは、柑橘類果実、オリーブならびに他の仁果類果実、石果及び堅果の品種及び変種において、その裂開、つまりその木への着生の低下を、一定の時間期間内に集中させることによって、可能にされる。この同じ活性、すなわちその植物体の果実部分又は葉部分と苗条部分との間にある器官脱離組織の発達促進は、有用な植物体（特にはワタ）の容易調節可能落葉にも必須である。

40

## 【０７０２】

さらには、個々のワタ植物体の成熟時間間隔を短縮させることは、収穫後の繊維品質の向上をもたらす。

## 【０７０３】

この化合物 I（又はその化合物 I を含んでいる除草剤組成物）は、例えば、噴霧準備が完了した水溶液、粉末、懸濁液の形態で、さらには高濃度水性、油性又は他の懸濁液もしくははディスパージョン、エマルジョン、オイルディスパージョン、ペースト、粉、広域散布用剤の形態で、あるいは顆粒の形態で、その種子に噴霧、霧化、散粉、散布、注水する

50

ことによって、又はその種子を処理することによって、あるいはその種子と混合することによって、用いられ得る。施用剤形は、その意図される目的によって決まるものであるが、各場合においては、本発明による活性成分の可能な限りの微細な分散が確保されるべきである。

#### 【0704】

この除草剤組成物には、式 I で表される少なくとも 1 種の化合物又は I の農薬として有用な塩の除草剤として有効な量、及び、作物保護剤を製剤するのに慣用されている補助剤が含まれている。

#### 【0705】

作物保護剤を製剤するのに慣用されている補助剤の例は、不活性補助剤（固体担体）、界面活性剤（例えば分散剤、保護コロイド、乳化剤、湿潤剤及び粘着性付与剤）、有機及び無機増粘剤、静菌剤、凍結防止剤、消泡剤、場合による着色剤、及び（種子用製剤の）接着剤である。

#### 【0706】

増粘剤（すなわち、その製剤に改変された流動特性、すなわち静止の状態では高粘度、及び、運動の状態では低粘度、を賦与する化合物）の例は、多糖類、例えばキサンタンガム（Kelco 製 Kelzan（登録商標））、Rhodopol（登録商標）23（Rhône-Poulenc 製）又は Veegum（登録商標）（R. T. Vanderbilt 製）、ならびに有機及び無機板状物質、例えば Attaclay（登録商標）（Engelhard 製）である。

#### 【0707】

消泡剤の例は、シリコンエマルジョン（例えば、Silikon（登録商標）SRE（Wacker 社）又は Rhodia 製の Rhodorsil（登録商標））、長鎖アルコール、脂肪酸、脂肪酸の塩、有機フッ素化合物ならびにこれらのものの混合物である。

#### 【0708】

静菌剤は、その除草剤水性製剤を安定化させるのに加えられ得る。静菌剤の例は、ジクロロフェン及びベンジルアルコールヘミホルマル系の静菌剤（ICI 製 Proxel（登録商標）又は Thor Chemie 製 Acticide（登録商標）RS 及び Rohm & Haas 製 Kathon（登録商標）MK）、さらにはイソチアゾリノン誘導体、例えばアルキルイソチアゾリノン及びベンゾイソチアゾリノン（Thor Chemie 製 Acticide（登録商標）MBS）である。

#### 【0709】

凍結防止剤の例は、エチレングリコール、プロピレングリコール、尿素又はグリセロールである。

#### 【0710】

着色剤の例は、低水溶解度顔料（ピグメント）及び水溶性染料である。言及され得る例は、ローダミン B、C. I. ピグメントレッド 112、C. I. ソルベントレッド 1、ならびにピグメントブルー 15：4、ピグメントブルー 15：3、ピグメントブルー 15：2、ピグメントブルー 15：1、ピグメントブルー 80、ピグメントイエロー 1、ピグメントイエロー 13、ピグメントレッド 112、ピグメントレッド 48：2、ピグメントレッド 48：1、ピグメントレッド 57：1、ピグメントレッド 53：1、ピグメントオレンジ 43、ピグメントオレンジ 34、ピグメントオレンジ 5、ピグメントグリーン 36、ピグメントグリーン 7、ピグメントホワイト 6、ピグメントブラウン 25、ベイシックバイオレット 10、ベイシックバイオレット 49、アシッドレッド 51、アシッドレッド 52、アシッドレッド 14、アシッドブルー 9、アシッドイエロー 23、ベイシックレッド 10、ベイシックレッド 108、の名称で知られている染料である。

#### 【0711】

結着剤の例は、ポリビニルピロリドン、ポリビニルアセタート、ポリビニルアルコール及びチローゼである。

#### 【0712】

10

20

30

40

50

適する不活性補助剤は、例えば、以下のとおりである。

【0713】

中～高沸点の鉱油留分（例えばケロシン及びディーゼルオイル）さらにはコールタールオイル及び植物又は動物由来のオイル、脂肪族、環状及び芳香族炭化水素（例えばパラフィン、テトラヒドロナフタレン、アルキル化されたナフタレン及びその誘導体、アルキル化されたベンゼン及びその誘導体）、アルコール例えばメタノール、エタノール、プロパノール、ブタノール及びシクロヘキサノール、ケトン例えばシクロヘキサノン、又は強極性溶媒、例えばN-メチルピロリドンのようなアミン、さらには水。

【0714】

固体担体は、鉱物質土類（例えば、シリカ、シリカゲル、ケイ酸塩、タルク、カオリン、石灰石、石灰、チョーク、ボール、黄土、クレイ、ドロマイト、珪藻土）；硫酸カルシウム、硫酸マグネシウム及び酸化マグネシウム；粉碎合成材、肥料（例えば、硫酸アンモニウム、リン酸アンモニウム、硝酸アンモニウムや尿素）、さらには栽培植物由来の産物（例えば、禾穀類穀粉、樹皮挽き粉、木材挽き粉及び堅果殻引き粉）、セルロース粉末、ならびに他の固体担体である。

【0715】

適する界面活性剤（補佐剤、湿潤剤、粘着付与剤、分散剤や乳化剤）は、芳香族スルホン酸、例えば、リグニンスルホン酸（例えばBorresperseタイプ、Borregard）、フェノールスルホン酸、ナフタレンスルホン酸（Morwetタイプ、Akzo Nobel）及びジブチルナフタレンスルホン酸（Nekalタイプ、BASF）、さらには脂肪酸の、アルカリ金属塩、アルカリ土類金属塩及びアンモニウム塩；アルキルスルホナート及びアルキルアリアルスルホナート；アルキルスルファート、ラウリルエーテルスルファート、及び脂肪アルコールスルファート；ならびに硫酸化ヘキサ-、ヘプター、及びオクターデカノール；さらには硫酸化脂肪アルコールグリコールエーテルの塩；及びスルホン化ナフタレン及びその誘導体とホルムアルデヒドとの縮合物、ナフタレン又はナフタレンスルホン酸とフェノール及びホルムアルデヒドとの縮合物；ポリオキシエチレンオクチルフェニルエーテル；エトキシ化イソオクチルフェノール、エトキシ化オクチルフェノール又はエトキシ化ノニルフェノール；アルキルフェニルもしくはトリブチルフェニルポリグリコールエーテル、アルキルアリアルポリエーテルアルコール、イソトリデシルアルコール、脂肪アルコール／エチレンオキシド縮合物、エトキシ化ひまし油、ポリオキシエチレンアルキルエーテル又はポリオキシプロピレンアルキルエーテル、ラウリルアルコールポリグリコールエーテルアセタート、ソルビトールエステル、リグノ亜硫酸塩廃液、さらには蛋白、変性蛋白、多糖類（例えばメチルセルロース）、疎水変性されたスターチ、ポリビニルアルコール（Mowiol（登録商標）タイプ、Clariant）、ポリカルボキシラート（BASF SE、Sokolantタイプ）、ポリアルコキシラート、ポリビニルアミン（BASF SE、Lupasolタイプ）、ポリピロリドン及びそのコポリマーである。

【0716】

粉粒剤、広域散布用剤及び粉末剤は、その活性成分を固体担体と一緒にして混合又は粉碎することによって調製され得る。

【0717】

顆粒剤、例えば被覆顆粒剤、含浸顆粒剤及び均質顆粒剤は、その活性成分を固体担体に結着させることによって調製され得る。

【0718】

水性施用剤形は、エマルジョン濃縮物、懸濁液、ペースト、水和性粉粒又は水分散性顆粒から、水を加えることによって調製され得る。エマルジョン、ペースト又はオイルディスパーションを調製するためには、式I又はIaで表される化合物は、そのままでか又は油又は溶媒に溶解させて、湿潤剤、粘着付与剤、分散剤又は乳化剤を用いることにより、水にホモジナイズされ得る。別法として、活性物質、湿潤剤、粘着付与剤、分散剤又は乳化剤及び（望まれるなら）溶媒又は油を含んでいる濃縮物を調製することも可能であり、

これは、水で希釈するのに適している。

【0719】

施用準備が完了した調製物中の式 I で表される化合物の濃度は、広い範囲内で変わり得る。一般には、この製剤は、0.001～98重量%、好ましくは0.01～95重量%の少なくとも1種の活性化合物を含んでいる。活性化合物は、90%～100%（好ましくは95%～100%）の純度（NMRスペクトルによる）で用いられる。

【0720】

本発明の化合物 I は、例えば、以下のように製剤され得る。

【0721】

1. 水で希釈する調製品

10

A 液剤 (Water-soluble concentrates)

活性化合物10重量部を90重量部の水又は水可溶溶媒に溶解させる。別法としては、湿潤剤又は他の補佐剤を加える。水で希釈すると活性化合物は溶解する。これにより活性化合物含有量が10重量%の製剤が得られる。

【0722】

B 分散製剤 (Dispersible concentrates)

活性化合物20重量部を10重量部の分散剤（例えばポリビニルピロリドン）を加えてある70重量部のシクロヘキサノンに溶解させる。水で希釈するとディスパージョンが得られる。この活性化合物含有量は、20重量%である。

【0723】

20

C 乳剤 (Emulsifiable concentrates)

活性化合物15重量部をドデシルベンゼンスルホン酸カルシウムとヒマシ油エトキシレートを加えてある（各場合5重量部）75重量部の有機溶媒（例えばアルキル芳香族）に溶解させる。水で希釈するとエマルジョンが得られる。この製剤は15重量%の活性化合物含有量を有する。

【0724】

D エマルジョン製剤 (Emulsions)

活性化合物25重量部をドデシルベンゼンスルホン酸カルシウムとヒマシ油エトキシレートを加えてある（各場合5重量部）35重量部の有機溶媒（例えばアルキル芳香族）に溶解させる。乳化装置（例えばUltraturrax）を用いてこの混合物を30重量部の水に導入し、均質なエマルジョンにする。水で希釈するとエマルジョンが得られる。この製剤は25重量%の活性化合物含有量を有する。

30

【0725】

E 懸濁製剤 (Suspensions)

攪拌下にあるボールミル中で、活性化合物20重量部を10重量部の分散剤＋湿潤剤及び70重量部の水又は有機溶媒を加えて粉碎し、微細活性化合物懸濁液を得る。水で希釈するとその活性化合物の安定懸濁液が得られる。この製剤中の活性化合物含有量は20重量%である。

【0726】

F 顆粒水和剤及び顆粒水溶剤 (Water-dispersible granules and water-soluble granules)

40

専用の装置（例えば、押出機、噴霧塔、流動床）を用いて、活性化合物50重量部を50重量部の分散剤＋湿潤剤を加えて細かく粉碎し、顆粒水和剤又は顆粒水溶剤にする。水で希釈するとその活性化合物の安定なディスパージョン又は溶液が得られる。この製剤は50重量%の活性化合物含有量を有する。

【0727】

G 水和剤及び水溶剤 (Water-dispersible powders and water-soluble powders)

ローター・ステーター・ミル中で、活性化合物75重量部を25重量部の分散剤＋湿潤剤＋シリカゲルを加えて粉碎する。水で希釈するとその活性化合物の安定なディスパージョン又は溶液が得られる。この製剤の活性化合物含有量は75重量%である。

50

## 【0728】

## H ゲル剤(Gel formulations)

ボールミル中で、活性化化合物20重量部、分散剤10重量部、ゲル化湿潤剤1重量部、及び水又は有機溶媒70重量部を粉碎して、微細懸濁液を得る。水で希釈すると活性化化合物含有量が20重量%の安定な懸濁液が得られる。

## 【0729】

## 2. 希釈せずに施用する調製品

## I 粉剤(Dusts)

活性化化合物5重量部を細かく粉碎し、95重量部の微粉碎カオリンと緊密に混合する。これにより、活性化化合物含有量が5重量%の散粉用粉剤が得られる。

10

## 【0730】

## J 顆粒剤(Granules)(GR、FG、GG、MG)

活性化化合物0.5重量部を細かく粉碎し、99.5重量部の担体と組み合わせる。ここでは、最新の方法は、押出し、噴霧乾燥又は流動床である。これにより、活性化化合物含有量が0.5重量%の希釈せずに施用されることになる顆粒剤が得られる。

## 【0731】

## K ULV溶液剤(ULV solutions)(UL)

活性化化合物10重量部を90重量部の有機溶媒(例えばキシレン)に溶解させる。これにより、活性化化合物含有量が10重量%の希釈せずに施用されることになる調製品が得られる。

20

## 【0732】

その化合物I又はそれを含んでいる除草剤組成物は、作物植物体の発芽前又は発芽後、あるいはその種子と一緒に、適用され得る。その除草剤組成物又は活性化化合物で前処理された作物植物体の種子を適用することによってもその除草剤組成物又は活性化化合物を適用できる。この活性化化合物に対する耐性が、一部の作物植物体にとって、あまりよくない場合は、噴霧装置の利用により、その感受性の作物植物体の葉とその除草剤組成物が接触しないよう可能な限り離して、同時に、下に生育している望ましくない植物体の葉、又はその裸の土壌表面にその活性化化合物が届くように、その除草剤組成物を噴霧する適用方法が用いられ得る(後方直結(post-directed)、傍置き(lay-by))。

## 【0733】

さらなる実施形態では、この式Iで表される化合物又はその除草剤組成物は、種子処理によっても適用され得る。

30

## 【0734】

種子処理には、基本的には、本発明による式Iで表される化合物又はそれから調製される組成物を基にした、当業者にはよく知られているあらゆる手順(種子ドレッシング、種子コーティング、種子ダスティング、種子ソーキング、種子フィルムコーティング、種子多層コーティング、種子エンクラスティング、種子浸漬及び種子ペレットティング)が含まれる。本発明では、この除草剤組成物は、希釈して、又は希釈せずに、適用され得る。

## 【0735】

この用語種子には、例えば、トウモロコシ、種子、果実、塊茎、挿し木ほか類似形体の、あらゆるタイプの種子が含まれる。本発明では、好ましくは、この用語種子は、トウモロコシ及び種子のことを言っている。

40

## 【0736】

用いる種子は、先に言及した有用な植物体の種子であってよいが、遺伝子導入植物体、又は通常の品種改良法によって得られた植物体、の種子であってもよい。

## 【0737】

活性化化合物の適用量は、0.001~3.0(好ましくは0.01~1.0)kg/h aの活性物質(a.s.)であり、これは、その防除標的、その季節、その標的植物体、及びその生長段階によっても左右される。その種子を処理するためには、この化合物Iは、一般的には、100kgの種子当たり0.001~10kgの量で、用いられる。

50

## 【0738】

また、式 I で表される化合物を、毒性緩和剤との組み合わせで用いるのが有利であり得る。毒性緩和剤は、望ましくない植物体に対する式 I で表される化合物の除草活性に実質的に影響することなく有用な植物体に対する損傷を予防又は低減する化学物質化合物である。毒性緩和剤は、その有用な植物体の播種前でも（例えば、その種子処理で、あるいは挿し木又は苗木に）、また植物体の発芽前又は後でも、用いられ得る。この毒性緩和剤と式 I で表される化合物とは、同時に、又は続いて、用いられ得る。適する毒性緩和剤は、例えば、（キノリン-8-オキシ）酢酸、1-フェニル-5-ハロアルキル-1H-1, 2, 4-トリアゾール-3-カルボン酸、1-フェニル-4, 5-ジヒドロ-5-アルキル-1H-ピラゾール-3, 5-ジカルボン酸、4, 5-ジヒドロ-5, 5-ジアリール-3-イソオキサゾールカルボン酸、ジクロロアセトアミド、アルファ-オキシミノフェニルアセトニトリル、アセトフェノンオキシム、4, 6-ジハロ-2-フェニルピリミジン、N-（（4-（アミノカルボニル）フェニル）スルホニル）-2-ベンズアミド、1, 8-ナフタル酸無水物、2-ハロ-4-（ハロアルキル）-5-チアゾールカルボン酸、ホスホロチオラート及びO-フェニルN-アルキルカルバマートならびにこれらのものの農薬として有用な塩、及び、それらが酸活性を有しているとして、これらのものの農薬として有用な誘導体（例えばアミド、エステル及びチオエーテル）である。

10

## 【0739】

その活性スペクトルを広げるために、また相乗効果を得るために、式 I で表される化合物は、他の除草又は生長調節活性化合物の群のうちの多くの代表的なものと、あるいは毒性緩和剤と、混合され得、また一緒に適用もされ得る。適する混合パートナーは、例えば、1, 2, 4-チアジアゾール、1, 3, 4-チアジアゾール、アミド、アミノリン酸及びその誘導体、アミノトリアゾール、アニリド、アリールオキシ／ヘテロアリールオキシアルカン酸及びその誘導体、安息香酸及びその誘導体、ベンゾチアジアジノン、2-（ヘタロイル／アロイル）-1, 3-シクロヘキサジオン、ヘテロアリールアリールケトン、ベンジルイソオキサゾリジノン、メタ-CF<sub>3</sub>-フェニル誘導体、カルバマート、キノリンカルボン酸及びその誘導体、クロロアセトアニリド、シクロヘキセノンオキシムエーテル誘導体、ジアジン、ジクロロプロピオン酸及びその誘導体、ジヒドロベンゾフラン、ジヒドロフラン-3-オン、ジニトロアニリン、ジニトロフェノール、ジフェニルエーテル、ジピリジル、ハロカルボン酸及びその誘導体、尿素、3-フェニルウラシル、イミダゾール、イミダゾリノン、N-フェニル-3, 4, 5, 6-テトラヒドロフタルイミド、オキサジアゾール、オキシラン、フェノール、アリールオキシフェノキシプロピオン酸エステル、ヘテロアリールオキシフェノキシプロピオン酸エステル、フェニル酢酸及びその誘導体、2-フェニルプロピオン酸及びその誘導体、ピラゾール、フェニルピラゾール、ピリダジン、ピリジンカルボン酸及びその誘導体、ピリミジルエーテル、スルホンアミド、スルホニル尿素、トリアジン、トリアジノン、トリアゾリノン、トリアゾールカルボキサミド、ウラシルさらにはフェニルピラゾリン及びイソオキサゾリンならびにこれらの誘導体である。

20

30

## 【0740】

さらには、その化合物 I を単独で適用するのが、又は他の除草剤との組み合わせで適用するのが、あるいはそうでなければさらなる作物保護剤、例えば害虫又は植物病原性真菌もしくは細菌を防除するための組成物と、一緒にして、混合するのも、有用であり得る。また、栄養不足及び微量元素不足を軽減するのに用いられる無機塩溶液との混和も関心事である。植物非有害性オイルやオイル製剤のような他の添加剤も加えられ得る。

40

## 【0741】

本発明による式 I で表されるピペラジン化合物との組み合わせで用いられ得る除草剤の例は、

b 1) その脂質生合成阻害剤の群からは：

アロキシジム、アロキシジム-ナトリウム、ブトロキシジム、クレトジム、クロジナホプ、クロジナホプ-プロパルギル、シクロキシジム、シハロホプ、シハロホプ-ブチル、

50

ジクロホプ、ジクロホプーメチル、フェノキサプロブ、フェノキサプロブーエチル、フェノキサプロブーP、フェノキサプロブーPーエチル、フルアジホプ、フルアジホブーブチル、フルアジホブーP、フルアジホブーPーブチル、ハロキシホプ、ハロキシホブーメチル、ハロキシホブーP、ハロキシホブーPーメチル、メタミホプ、ピノキサデン、プロホキシジム、プロパキサホプ、キサロホプ、キサロホブーエチル、キサロホブーテフリル、キサロホブーP、キサロホブーPーエチル、キサロホブーPーテフリル、セトキシジム、テブラロキシジム、トラルコキシジム、ベンフレセート、ブチレート、シクレート、ダラポン、ジメピペレート、エプトク、エスプロカルブ、エトフメセート、フルプロパネート、モリネート、オルベンカルブ、ペブレート、プロスルホカルブ、トカ、チオベンカルブ、チオカルバジル、トリアレート及びベルノレート；

10

b 2) そのALS阻害剤の群からは：

アミドスルフロン、アジムスルフロン、ベンスルフロン、ベンスルフロナーメチル、ビスピリバク、ビスピリバクーナトリウム、クロリムロン、クロリムロンーエチル、クロルスルフロン、シノスルフロン、クロランスラム、クロランスラムーメチル、シクロスルファミロン、ジクロスラム、エタメトスルフロン、エタメトスルフロナーメチル、エトキシスルフロン、フラザスルフロン、フロラスラム、フルカルバゾン、フルカルバゾナーナトリウム、フルセトスルフロン、フルメツラム、フルピルスルフロン、フルピルスルフロナーメチルーナトリウム、ホラムスルフロン、ハロスルフロン、ハロスルフロナーメチル、イマザメタベンゾ、イマザメタベンゾーメチル、イマザモキス、イマザブ酸、イマザピル、イマザキン、イマゼタピル、イマゾスルフロン、ヨードスルフロン、ヨードスルフロナーメチルーナトリウム、メソスルフロン、メトスラム、メトスルフロン、メトスルフロナーメチル、ニイコスルフロン、オルトスルファミロン、オキサスルフロン、ペノキッスラム、プリミスルフロン、プリミスルフロナーメチル、プロポキシカルバゾン、プロポキシカルバゾナーナトリウム、プロスルフロン、ピラゾスルフロン、ピラゾスルフロナーエチル、ピリベンゾオキシム、ピリミスルファン、ピリフタリド、ピリミノバク、ピリミノバクーメチル、ピリチオバク、ピリチオバクーナトリウム、ピロキッスラム、リムスルフロン、スルホメツロン、スルホメツロンーメチル、スルホスルフロン、チエンカルバゾン、チエンカルバゾナーメチル、チフェンスルフロン、チフェンスルフロナーメチル、トリアスルフロン、トリベヌロン、トリベヌロンーメチル、トリフロキシスルフロン、トリフルスルフロン、トリフルスルフロナーメチル及びトリトスルフロン；

20

30

b 3) その光合成阻害剤の群からは：

アメトリン、アミカルバゾン、アトラジン、ベンタゾン、ベンタゾナーナトリウム、ブロマシル、プロモフェノキシム、プロモキシニルならびにその塩及びエステル、クロロブロムロン、クロリダゾン、クロロトルロン、クロロキスロン、シアナジン、デスミジファミン、デスメトリン、ジメフロン、ジメタメトリン、ジクアト、ジクアトージプロミド、ジウロン、フルオメツロン、ヘキサジノン、イオキシニルならびにその塩及びエステル、イソプロツロン、イソウロン、カルブチレート、レナシル、リヌロン、メタミトロン、メタベンズチアズロン、メトベンズロン、メトキスロン、ムトリブジン、モノリヌロン、ネブロン、パラクアト、パラクアトージクロリド、パラクアトージメチルスルファート、ペントクロル、フェンミジファミン、フェンミジファミンーエチル、プロメトン、プロメトリン、プロプアニル、プロバジン、ピリダホール、ピリダート、シズロン、シマジン、シメトリン、トブチウロン、テルバシル、テルブメトン、テルブチルアジン、テルブトリン、チジアズロン及びトリエタジン；

40

b 4) そのプロトポルフィリノーゲンーIXオキシダーゼ阻害剤の群からは：

アシフルオルフェン、アシフルオルフェンーナトリウム、アザフェニジン、ベンカルバゾン、ベンズフェンジゾン、ビフェノキス、ブタフェナシル、カルフェントラゾン、カルフェントラゾナーエチル、クロメトキシフェン、シニドナーエチル、フルアゾレート、フルフェンピル、フルフェンピルーエチル、フルミクロラク、フルミクロラクーペンチル、フルミオキサジン、フルオログリコフェン、フルオログリコフェンーエチル、フルチアセト、フルチアセトーメチル、ホメサフェン、ハロサフェン、ラクトフェン、オキサジアル

50

ギル、オキサジアゾン、オキシフルオルフェン、ペントキサゾン、プロフルアゾール、ピラクロニル、ピラフルフェン、ピラフルフェン-エチル、サフルフェナシル、スルフェントラゾン、チジアジミン、2-クロロ-5-(3, 6-ジヒドロ-3-メチル-2, 6-ジオキソ-4-(トリフルオロメチル)-1(2H)-ピリミジニル)-4-フルオロ-N-(イソプロピル)メチルスルファモイル)ベンズアミド(CAS 372137-35-4)、エチル(3-(2-クロロ-4-フルオロ-5-(1-メチル-6-トリフルオロメチル-2, 4-ジオキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロピリミジン-3-イル)フェノキシ)-2-ピリジルオキシ)アセタート(CAS 353292-31-6)、N-エチル-3-(2, 6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェノキシ)-5-メチル-1H-ピラゾール-1-カルボキサミド(CAS 452098-92-9)、N-テトラヒドロフルフリル-3-(2, 6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェノキシ)-5-メチル-1H-ピラゾール-1-カルボキサミド(CAS 915396-43-9)、N-エチル-3-(2-クロロ-6-フルオロ-4-トリフルオロメチルフェノキシ)-5-メチル-1H-ピラゾール-1-カルボキサミド(CAS 452099-05-7)及びN-テトラヒドロフルフリル-3-(2-クロロ-6-フルオロ-4-トリフルオロメチルフェノキシ)-5-メチル-1H-ピラゾール-1-カルボキサミド(CAS 45100-03-7)；

b 5) その白化除草剤(bleacher herbicides)の群からは：

アクロニフェン、アミトロール、ベフルブトアミド、ベンゾビシクロン、ベンゾフェナプ、クロマゾン、ジフルフェニカン、フルリドン、フルクロリドン、フルルタモン、イソキサフルトール、メソトリオン、ノルフルラゾン、ピコリナフェン、ピラスルフトール、ピラゾリネート、ピラゾキシフェン、スルコトリオン、テフリルトリオン、テンボトリオン、トブラメゾン、4-ヒドロキシ-3-(2-(2-メトキシエトキシ)メチル)-6-(トリフルオロメチル)-3-ピリジル)カルボニル)ビシクロ(3. 2. 1)オクト-3-エン-2-オン(CAS 352010-68-5)及び4-(3-トリフルオロメチルフェノキシ)-2-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピリミジン(CAS 180608-33-7)；

b 6) そのEPSP シンターゼ阻害剤の群からは：

グリホセート、グリホセート-イソプロピルアンモニウム及びグリホセート-トリメシウム(スルホセート)；

b 7) そのグルタミンシンターゼ阻害剤の群からは：

ピラナホス(ビアラホス)、ピラナホス-ナトリウム、グルホシネート及びグルホシネート-アンモニウム；

b 8) そのDHPシンターゼ阻害剤の群からは：

アスラム；

b 9) その有糸分裂阻害剤の群からは：

アミプロホ、アミプロホス-メチル、ベンフルラリン、ブタミホ、ブトラリン、カルベトアミド、クロルプロファム、クロルタール、クロルタール-ジメチル、ジニトロアミン、ジチオピル、エタルフルラリン、フルクロラリン、オリザリン、ペンジメタリン、プロジアミン、プロファム、プロピズアミド、トブタム、チアゾピル及びトリフルラリン；

b 10) そのVLCFA阻害剤の群からは：

アセトクロル、アラクロル、アニロホ、ブタクロル、カフェンストロール、ジメタクロル、ジメタンアミド、ジメテンアミド-P、ジフェンアミド、フェントラズアミド、フルフェンアセト、メフェンアセト、メタザクロル、メトラクロル、メトラクロル-S、ナプロアニリド、ナプロブアミド、ペトキサミド、ピペロホ、プレチラクロル、プロバクロル、プロピソクロル、ピロキサスルホン(KIH-485)及びテニルクロル；

次の式2：

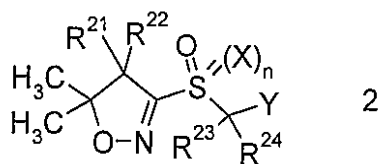
10

20

30

40

## 【化 3 3】



## 【0 7 4 2】

(ここで、各可変部は、以下のとおりの意味：

Yは、フェニル、又は冒頭で定義した5もしくは6員ヘテロアリールであり、この基は、  
1～3個の基 R<sup>a a</sup> によって置換されていてよい；

R<sup>2 1</sup>、R<sup>2 2</sup>、R<sup>2 3</sup>、R<sup>2 4</sup>は、H、ハロゲン又はC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>-アルキルである；

Xは、O又はNHである；

nは、0又は1である；

を有している)

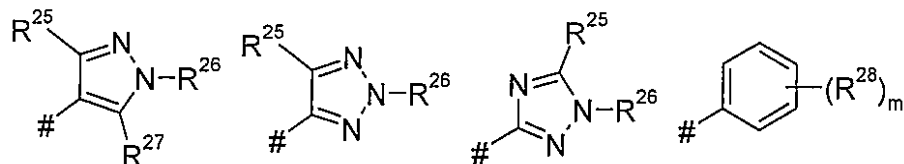
で表される化合物。

## 【0 7 4 3】

この式2で表される化合物は、特には、以下のとおりの意味：

Yは、

## 【化 3 4】



## 【0 7 4 4】

(ここで、#は、その分子の骨格への結合を表している)

である；

R<sup>2 1</sup>、R<sup>2 2</sup>、R<sup>2 3</sup>、R<sup>2 4</sup>は、H、C<sub>1</sub>、F又はCH<sub>3</sub>である；

R<sup>2 5</sup>は、ハロゲン、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>-アルキル又はC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>-ハロアルキルである；

R<sup>2 6</sup>は、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>-アルキルである；

R<sup>2 7</sup>は、ハロゲン、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>-アルコキシ又はC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>-ハロアルコキシである；

R<sup>2 8</sup>は、H、ハロゲン、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>-アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>-ハロアルキル又はC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>-ハロアルコキシである；

mは、0、1、2又は3である；

Xは、酸素である；

nは、0又は1である、

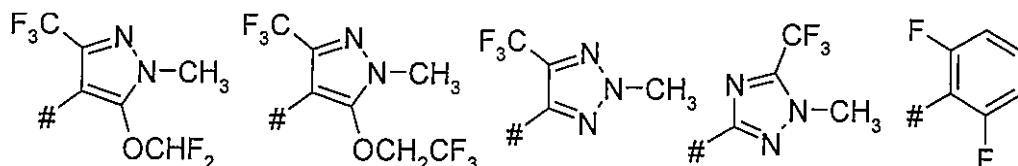
を有している。

## 【0 7 4 5】

好ましい式2で表される化合物は、以下のとおりの意味：

Yは、

## 【化 3 5】



10

20

30

40

50

## 【0746】

である；

$R^{21}$  は、Hである；

$R^{22}$ 、 $R^{23}$  は、Fである；

$R^{24}$  は、H又はFである；

Xは、酸素である；

nは、0又は1である；

を有している。

## 【0747】

特に好ましい式2で表される化合物は、

3-(5-(2, 2-ジフルオロエトキシ)-1-メチル-3-トリフルオロメチル-1  
H-ピラゾール-4-イルメタンスルホニル)-4-フルオロ-5, 5-ジメチル-4,  
5-ジヒドロイソオキサゾール；3-{(5-(2, 2-ジフルオロエトキシ)-1-メ  
チル-3-トリフルオロメチル-1 H-ピラゾール-4-イル)フルオロメタンスルホニ  
ル}-5, 5-ジメチル-4, 5-ジヒドロイソオキサゾール；4-(4-フルオロ-5  
, 5-ジメチル-4, 5-ジヒドロイソオキサゾール-3-スルホニルメチル)-2-メ  
チル-5-トリフルオロメチル-2 H-(1, 2, 3) トリアゾール；4-((5, 5-  
ジメチル-4, 5-ジヒドロイソオキサゾール-3-スルホニル)フルオロメチル)-2  
-メチル-5-トリフルオロメチル-2 H-(1, 2, 3) トリアゾール；4-(5, 5-  
ジメチル-4, 5-ジヒドロイソオキサゾール-3-スルホニルメチル)-2-メチル  
-5-トリフルオロメチル-2 H-(1, 2, 3) トリアゾール；3-{(5-(2, 2-  
ジフルオロエトキシ)-1-メチル-3-トリフルオロメチル-1 H-ピラゾール-4  
-イル)ジフルオロメタンスルホニル}-5, 5-ジメチル-4, 5-ジヒドロイソオキ  
サゾール；4-((5, 5-ジメチル-4, 5-ジヒドロイソオキサゾール-3-スルホ  
ニル)ジフルオロメチル)-2-メチル-5-トリフルオロメチル-2 H-(1, 2, 3)  
) トリアゾール；3-{(5-(2, 2-ジフルオロエトキシ)-1-メチル-3-トリ  
フルオロメチル-1 H-ピラゾール-4-イル)ジフルオロメタンスルホニル}-4-フ  
ルオロ-5, 5-ジメチル-4, 5-ジヒドロイソオキサゾール；4-(ジフルオロ-(  
4-フルオロ-5, 5-ジメチル-4, 5-ジヒドロイソオキサゾール-3-スルホニル  
)メチル)-2-メチル-5-トリフルオロメチル-2 H-(1, 2, 3) トリアゾール  
；

であり；

b 1 1) そのセルロース生合成阻害剤の群からは：

クロルチアミド、ジクロベニル、フルボキサム及びイソキサベン；

b 1 2) そのデカップラー(decoupler)除草剤の群からは：

ジノセブ、ジノテルブ及びD N O C及びその塩；

b 1 3) そのオーキシン除草剤の群からは：

2, 4-Dならびにその塩及びエステル、2, 4-DBならびにその塩及びエステル、  
アミノピラリド及びその塩例えばアミノピラリド-トリス(2-ヒドロキシプロピル)ア  
ンモニウム及びそのエステル、ベナゾリン、ベナゾリン-エチル、クロランベンならびに  
その塩及びエステル、クロムプロブ、クロピラリドならびにその塩及びエステル、ジカン  
バならびにその塩及びエステル、ジクロルプロブならびにその塩及びエステル、ジクロル  
プロブ-Pならびにその塩及びエステル、フルロキシビル、フルロキシビル-ブトメチル  
、フルロキシビル-メブチル、M C P Aならびにその塩及びエステル、M C P A-チオエ  
チル、M C P Bならびにその塩及びエステル、メコプロブならびにその塩及びエステル、  
メコプロブ-Pならびにその塩及びエステル、ピクロラムならびにその塩及びエステル、  
キンクロラク、キンメラク、T B A (2, 3, 6)ならびにその塩及びエステル、トリク  
ロピルならびにその塩及びエステル、さらには5, 6-ジクロロ-2-シクロプロピル-  
4-ピリミジンカルボン酸(C A S 8 5 8 9 5 6-0 8-8)ならびにその塩及びエス  
テル；

10

20

30

40

50

b 1 4) そのオーキシシン輸送阻害剤の群からは：

ジフルフェンゾピル、ジフルフェンゾピルーナトリウム、ナブタラム及びナブタラムーナトリウム；

b 1 5) その他の除草剤の群からは：

プロモブチド、クロルフルレノール、クロルフルレノールーメチル、シネチリン、クミルウロン、ダラボン、ダゾメト、ジフェンゾクアト、ジフェンゾクアトーメチルスルファート、ジメチピン、D S M A、ジムロン、エンドタール及びその塩、エトベンザニド、フランプロブ、フランプロブーイソプロピル、フランプロブーメチル、フランプロブーMーイソプロピル、フランプロブーMーメチル、フルレノール、フルレノールーブチル、フルルプイミドール、ホサミン、ホサミンーアンモニウム、インダノファン、マレイン酸ヒドラジド、メフルイジド、メタム、メチルアジド、メチルプロミド、メチルージムロン、メチルヨージド、M S M A、オレイン酸、オキサジクロメホン、ペラルゴン酸、ピリブチカルブ、キノクラミン、トリアジフラム、トリジファン及び6 クロロー3ー(2ーシクロプロピルー6ーメチルフェノキシ)ー4ーピリダジノール(C A S 4 9 9 2 2 3ー4 9ー3)ならびにその塩及びエステル；

である。

#### 【0748】

好ましい毒性緩和剤の例は、ベノキサコル、クロキントセト、シオムトリニル、シプロスルファミド、ジクロルミド、ジシクロノン、ジエトレート、フェンクロラゾール、フェンクロリム、フルラゾール、フルキソフェニム、フリラゾール、イソキサジフェン、メフェンビル、メフェネート、ナフタル酸無水物、オキサブトリニル、4ー(ジクロロアセチル)ー1ーオキサー4ーアザスピロ(4. 5)デカン(M O N 4 6 6 0、C A S 7 1 5 2 6ー0 7ー3)及び2, 2, 5ートリメチルー3ー(ジクロロアセチル)ー1, 3ーオキサゾリジン(Rー2 9 1 4 8、C A S 5 2 8 3 6ー3 1ー4)である。

#### 【0749】

群b 1)～b 1 5)の活性化合物、及び毒性緩和剤は、公知の除草剤及び毒性緩和剤であり、例えば、The Compendium of Pesticide Common Names (<http://www.alanWod.net/pesticides/>)；B. Hock, C. Fedtke, R. R. Schmidt, Herbicide (Herbicides), Georg Thieme Verlag, Stuttgart, 1995；を参照されたい。さらなる除草活性化合物は、公知文献である国際公開第9 6／2 6 2 0 2号パンフレット、国際公開第9 7／4 1 1 1 6号パンフレット、国際公開第9 7／4 1 1 1 7号パンフレット、国際公開第9 7／4 1 1 1 8号パンフレット、国際公開第0 1／8 3 4 5 9号パンフレット及び国際公開第2 0 0 8／0 7 4 9 9 1号パンフレットさらにはW. Kramer et al. (ed.) "Modern Crop Protection Compounds", Vol. 1, Wiley VCH, 2007ならびに本明細書で挙げられた文献に記載されている。

#### 【0750】

本発明による化合物I及びその組成物は植物体強化活性も有している。つまり、それらは、有害真菌だけでなく、ウイルスや細菌のような、望まれていない微生物による攻撃に抗するその植物体の防御系を易動化させるのに適しているのである。植物体強化(抵抗誘発性)物質とは、本文脈では、処理された後望まれていない微生物によって接触されたとき、その処理された植物体がそのような微生物に対してかなりの程度の抵抗を見せるように、処理された植物体の防御系を刺激することができる物質を意味すると理解する。

#### 【0751】

この化合物Iは、その処理の後ある一定の時間期間内、望まれていない微生物による攻撃から植物体を防護するのに用いられ得る。その防護が有効である時間期間は、一般的には、この化合物Iでその植物体を処理した後1～2 8日、好ましくは1～1 4日に及び、また、その種子を処理した後は、播種の後9ヶ月間にまで及ぶ。

#### 【0752】

本発明による化合物I及びその組成物は、その収穫収量を増大させるのにも適している。

10

20

30

40

50

## 【0753】

さらには、それらは、有害性が低減されていて、その植物体によっては十分耐えられるものである。

## 【実施例】

## 【0754】

以下の本明細書に、式 I で表されるピペラジン化合物の調製を例として例示するが、これらは、本発明の主題を、示されている実施例に、限定しようとするものではない。

## 【0755】

## 合成実施例

出発物質を適切に改変し、以下の合成実施例に記載されている手順を用いて、さらなる化合物 I を得た。このようにして得られた化合物を、物理データと一緒に、以下にある表に掲載する。

10

## 【0756】

以下に示す生成物は、NMR 分光法による、その融点の測定によって、又は HPLC MS 分光分析により測定されるその質量 ( $m/z$ ) 又は保持時間 (RT; min) によって、特性評価された。

## 【0757】

ここで、

HPLC MS = 質量分光分析が連結された高性能液体クロマトグラフィー；

HPLC カラム：

20

a) RP-18 カラム (Merck KgaA (独) 製 Chromolith Speed ROD)、 $50 \times 4.6$  mm；移動相：アセトニトリル + 0.1% トリフルオロ酢酸 (TFA) / 水 + 0.1% TFA、 $40^\circ\text{C}$  にて 5:95  $\rightarrow$  100:0 / 5 分の勾配を用いる、流量 1.8 ml/min；又は

b) RP-18 カラム (Waters 製 XTerra MS 5mm)、移動相：アセトニトリル + 0.1% ギ酸 (A) / 水 + 0.1% ギ酸 (B) で  $20 \sim 25^\circ\text{C}$  にて 5:95 (A/B)  $\rightarrow$  100:0 (A/B) / 8 分の勾配を用いる、流量 2 ml/min；

MS：四極子エレクトロスプレーイオン化、80 V (ポジティブモード)；  
である。

30

## 【0758】

特段の断りがない限り、この HPLC / MS データは、方法 a) を用いて取得された。

## 【0759】

## I. 調製実施例

(実施例 1：2-ベンジル-5-[1-(2-シアノフェニル)メター (Z)-イリデン]-2, 4-ジメチル-3, 6-ジオキソピペラジン-1-カルボニトリルの調製)

$0^\circ\text{C}$  にて、88 mg の NaH (パラフィン油中 60% 濃度) を、690 mg の 2-[5-ベンジル-1, 5-ジメチル-3, 6-ジオキソピペラジン-(2Z)-イリデンメチル]-ベンゾニトリル (参照 PCT/EP 2008/057329) を 5 ml のジメチルホルムアミド (DMF) に溶解させた溶液に少しずつ加えた。 $0^\circ\text{C}$  にて 1 時間攪拌した後、263.7 mg のプロモアセトニトリルを 2 ml の DMF に溶解させた溶液をゆっくりと加えた。 $0^\circ\text{C}$  にてさらに 2 時間攪拌し、 $20 \sim 25^\circ\text{C}$  にて 18 時間攪拌した後、5% 濃度の水性クエン酸を反応混合物に加え、この混合物を  $\text{CH}_2\text{Cl}_2$  で抽出した。合わせた有機相を乾燥させた後、溶媒を除去した。残渣を酢酸エチルから再結晶化させた後、373 mg (理論濃度 49%) の表題化合物が得られた。

40

## 【0760】

(実施例 2：3-[5-ベンジル-4-メトキシメチル-1, 5-ジメチル-3, 6-ジオキソピペラジン-(2Z)-イリデンメチル]ピリジン-2-カルボニトリルの調製)

$0^\circ\text{C}$  にて、88 mg の NaH (パラフィン油中 60% 濃度) を、692 mg の 3-[5-ベンジル-1, 5-ジメチル-3, 6-ジオキソピペラジン-(2Z)-イリデンメチル

50

]-ピリジン-2-カルボニトリル(参照PCT/EP2008/057329)を5mlのDMFに溶解させた溶液に少しずつ加えた。0℃にて1時間攪拌した後、274.9mgのプロモメチルメチルエーテルを2mlのDMFに溶解させた溶液をゆっくりと加えた。0℃にてさらに2時間攪拌し、20~25℃にて18時間攪拌した後、5%濃度の水性クエン酸を反応混合物に加え、この反応混合物をCH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub>で抽出した。合わせた有機相を乾燥させた後、溶媒を除去した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(シクロヘキサン/酢酸エチル)にかけた後、281mg(理論濃度36%)の表題化合物が得られた。

#### 【0761】

(実施例3:3-[4-アセチル-5-ベンジル-1,5-ジメチル-3,6-ジオキソピペラジン-(2Z)-イリデンメチル]ピリジン-2-カルボニトリルの調製)

10

0℃にて、88mgのNaH(パラフィン油中60%濃度)を、692mg(2mmol)の3-[5-ベンジル-1,5-ジメチル-3,6-ジオキソピペラジン-(2Z)-イリデンメチル]ピリジン-2-カルボニトリル(参照PCT/EP2008/057329)を6mlのDMFに溶解させた溶液に少しずつ加えた。0℃にて2時間攪拌した後、溶液172.7mgの塩化アセチルを1.5mlのDMFに溶解させた溶液をゆっくりと滴加した。0℃にてさらに1時間攪拌し、20~25℃にて18時間攪拌した後、反応混合物を5%濃度のクエン酸溶液に攪拌しながら加え、沈殿生成物を濾過して乾燥させた。これを酢酸エチルから再結晶化させた後、258mg(理論濃度33%)の表題化合物が得られた。

#### 【0762】

20

(実施例4:2-[5-ベンジル-4-メタンスルホニル-1,5-ジメチル-3,6-ジオキソピペラジン-(2Z)-イリデンメチル]ベンゾニトリルの調製)

0℃にて、88mgのNaH(パラフィン油中60%濃度)を、690mgの2-[5-ベンジル-1,5-ジメチル-3,6-ジオキソピペラジン-(2Z)-イリデンメチル]-ベンゾニトリル(参照PCT/EP2008/057329)を5mlのDMFに溶解させた溶液に少しずつ加えた。0℃にて1時間攪拌した後、251.9mgの塩化メタンスルホニルを2mlのDMFに溶解させた溶液をゆっくりと加えた。反応混合物を0℃にてさらに攪拌し、20~25℃にて18時間攪拌した後、50mlの5%濃度のクエン酸を加え、この反応混合物をCH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub>で抽出した。合わせた有機相を乾燥させた後、溶媒を除去した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(シクロヘキサン/酢酸エチル)に

30

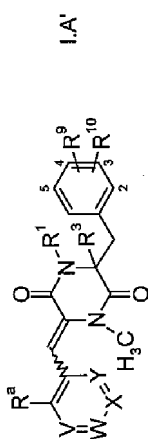
#### 【0763】

(実施例5:4-アミノ-3-ベンジル-1,3-ジメチル-6-[1-(2-ニトロフェニル)メタ-(Z)-イリデン]ピペラジン-2,5-ジオンの調製)

0℃にて、44mgのNaH(パラフィン油中60%濃度)を溶液365.4mgの3-ベンジル-1,3-ジメチル-6-[1-(2-ニトロフェニル)メタ-(Z)-イリデン]ピペラジン-2,5-ジオン(参照PCT/EP2008/057329)を5mlのDMFに溶解させた溶液に加え、次いでこの混合物を0℃にて1時間攪拌した。218mgのp-ニトロベンゾイルオキシアミンを少しずつ加えた後、混合物を0℃にて1時間攪拌し、次いで20~25℃にて2時間攪拌した。反応混合物に希クエン酸を加え、この反応混合物をCH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub>で抽出した。合わせた有機相を乾燥させた後、溶媒を除去した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(シクロヘキサン/酢酸エチル)及び予備HPLC(アセトニトリル/水+0.05%TFA)にかけた後、出発物質との混合物として28mg(理論濃度7%)の表題化合物が得られた(表題化合物約70%)。

40

表1: 式1, A'に対応している式1で表される化合物:



| No.  | R <sup>a</sup>  | V  | W  | X   | Y  | R <sup>1</sup>                                                | R <sup>3</sup>  | R <sup>9</sup> /R <sup>10</sup> | 異性体 <sup>7)</sup> | 物理データ(m.p.[°C];<br>HPLC: RT[min]/m/z) |
|------|-----------------|----|----|-----|----|---------------------------------------------------------------|-----------------|---------------------------------|-------------------|---------------------------------------|
| I-1  | NO <sub>2</sub> | CH | CH | CH  | CH | NH <sub>2</sub>                                               | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.033 / 381.1 [M+H] <sup>+</sup>      |
| I-2  | CN              | CH | CH | CH  | CH | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                               | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.347 / 423.7 [M] <sup>+</sup>        |
| I-3  | NO <sub>2</sub> | CH | CH | CH  | CH | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                               | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.60 / 444.15 [M+H] <sup>+</sup>      |
| I-4  | CN              | CH | CH | CH  | CH | CH <sub>2</sub> CN                                            | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.048 / 384.8 [M] <sup>+</sup>        |
| I-5  | CN              | CH | CH | CH  | CH | CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.356 / 432.1 [M+H] <sup>+</sup>      |
| I-6  | CN              | CH | CH | CH  | CH | CH <sub>2</sub> F                                             | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.600 / 377.8 [M] <sup>+</sup>        |
| I-7  | CN              | CH | CH | CH  | CH | CH <sub>2</sub> -COCH <sub>2</sub> Cl                         | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.755 / 422.0 [M] <sup>+</sup>        |
| I-8  | NO <sub>2</sub> | CH | CH | CH  | CH | CH <sub>2</sub> -COCH <sub>2</sub> Cl                         | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.811 / 442.1 [M] <sup>+</sup>        |
| I-9  | NO <sub>2</sub> | CH | CH | CH  | CH | CH <sub>2</sub> CN                                            | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.304 / 405.1 [M+H] <sup>+</sup>      |
| I-10 | NO <sub>2</sub> | CH | CH | CH  | CH | CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.446 / 451.9 [M+H] <sup>+</sup>      |
| I-11 | NO <sub>2</sub> | CH | CH | CH  | CH | CH <sub>2</sub> F                                             | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.859 / 398.1 [M+H] <sup>+</sup>      |
| I-12 | CN              | CH | CH | CH  | CH | CH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>                            | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.065 / 398.3 [M+H] <sup>+</sup>      |
| I-13 | NO <sub>2</sub> | CH | CH | CH  | CH | CH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>                            | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.367 / 419.8 [M+H] <sup>+</sup>      |
| I-14 | CN              | CH | CH | CH  | CH | CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>          | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.365 / 400.8 [M+H] <sup>+</sup>      |
| I-15 | NO <sub>2</sub> | CH | CH | C-F | CH | CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>          | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.511 / 420.3 [M+H] <sup>+</sup>      |
| I-16 | CN              | CH | CH | CH  | CH | CH <sub>2</sub> -CH=CHCH <sub>3</sub>                         | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.558 / 400.4 [M+H] <sup>+</sup>      |

| No.  | R <sup>a</sup>  | V  | W  | X  | Y  | R <sup>1</sup>                                                                        | R <sup>3</sup>  | R <sup>9</sup> /R <sup>10</sup> | 異性体 <sup>b)</sup> | 物理データ(m.p.[°C]:<br>HPLC: RT[min]/m/z) |
|------|-----------------|----|----|----|----|---------------------------------------------------------------------------------------|-----------------|---------------------------------|-------------------|---------------------------------------|
| I-17 | NO <sub>2</sub> | CH | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> -CH=CHCH <sub>3</sub>                                                 | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.609 / 419.5 [M+H] <sup>+</sup>      |
| I-18 | NO <sub>2</sub> | CH | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -CH=CH <sub>2</sub>                                   | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.479 / 420.8 [M+H] <sup>+</sup>      |
| I-19 | CN              | CH | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -CH=CH <sub>2</sub>                                   | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.447 / 400.8 [M+H] <sup>+</sup>      |
| I-20 | NO <sub>2</sub> | CH | CH | CH | CH | (CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> CH <sub>3</sub>                                       | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 4.123 / 436.8 [M+H] <sup>+</sup>      |
| I-21 | CN              | CH | CH | CH | CH | (CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> CH <sub>3</sub>                                       | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 4.073 / 415.8 [M] <sup>+</sup>        |
| I-22 | NO <sub>2</sub> | CH | CH | CH | CH | (CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> CH <sub>3</sub>                                       | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 4.337 / 450.8 [M+H] <sup>+</sup>      |
| I-23 | CN              | CH | CH | CH | CH | (CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> CH <sub>3</sub>                                       | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 4.290 / 429.8 [M] <sup>+</sup>        |
| I-24 | NO <sub>2</sub> | CH | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>                                      | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.831 / 420.2 [M+H] <sup>+</sup>      |
| I-25 | CN              | CH | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>                                      | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.775 / 400.4 [M+H] <sup>+</sup>      |
| I-26 | CN              | CH | CH | CH | CH | (CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CN                                                    | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.235 / 412.8 [M] <sup>+</sup>        |
| I-27 | NO <sub>2</sub> | CH | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                                         | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.831 / 456.2 [M+H] <sup>+</sup>      |
| I-28 | CN              | CH | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                                         | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.845 / 436.4 [M+H] <sup>+</sup>      |
| I-29 | NO <sub>2</sub> | CH | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> -(4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )                 | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.859 / 486.2 [M+H] <sup>+</sup>      |
| I-30 | CN              | CH | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> -(4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )                 | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.821 / 466.4 [M+H] <sup>+</sup>      |
| I-31 | CN              | CH | CH | CH | CH | COC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                                                       | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 4.009 / 472.2 [M+Na] <sup>+</sup>     |
| I-32 | CN              | CH | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> -(4-COOC <sub>6</sub> H <sub>5</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> ) | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.727 / 494.7 [M+H] <sup>+</sup>      |
| I-33 | NO <sub>2</sub> | CH | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> -CH=CHCl                                                              | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.744 / 441.7 [M+H] <sup>+</sup>      |
| I-34 | CN              | CH | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> -CH=CHCl                                                              | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 4.213 / 420.7 [M+H] <sup>+</sup>      |
| I-35 | NO <sub>2</sub> | CH | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> -(4-NO <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )                  | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.785 / 501.7 [M+H] <sup>+</sup>      |
| I-36 | CN              | CH | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> -(4-NO <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )                  | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.739 / 481.7 [M+H] <sup>+</sup>      |
| I-37 | NO <sub>2</sub> | CH | CH | CH | CH | COC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                                                       | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.995 / 470.7 [M+Na] <sup>+</sup>     |
| I-38 | NO <sub>2</sub> | CH | CH | CH | CH | (CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CN                                                    | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.754 / 433.3 [M+H] <sup>+</sup>      |
| I-39 | NO <sub>2</sub> | CH | CH | CH | CH | (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CN                                                    | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.388 / 419.2 [M+H] <sup>+</sup>      |

10

20

30

40

| No.  | R <sup>a</sup>                   | V  | W  | X  | Y  | R <sup>1</sup>                                                                      | R <sup>3</sup>  | R <sup>9</sup> /R <sup>10</sup> | 異性体 <sup>b)</sup> | 物理データ(m.p.[°C];<br>HPLC: RT[min]/m/z) |
|------|----------------------------------|----|----|----|----|-------------------------------------------------------------------------------------|-----------------|---------------------------------|-------------------|---------------------------------------|
| I-40 | CN                               | CH | CH | CH | CH | (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CN                                                  | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.231 / 398.9 [M] <sup>+</sup>        |
| I-41 | CN                               | N  | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> CN                                                                  | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 2.887 / 386.2 [M+H] <sup>+</sup>      |
| I-42 | CN                               | N  | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                                                    | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 2.918 / 391.2 [M+H] <sup>+</sup>      |
| I-43 | CN                               | N  | CH | CH | CH | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                                                     | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.122 / 426.2 [M+H] <sup>+</sup>      |
| I-44 | CN                               | CH | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> C=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                                  | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.774 / 414.8 [M+H] <sup>+</sup>      |
| I-45 | CN                               | N  | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> (4-CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> ) | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.497 / 495.2 [M+H] <sup>+</sup>      |
| I-46 | CN                               | N  | CH | CH | CH | (CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CN                                                  | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 2.924 / 417.5 [M+H] <sup>+</sup>      |
| I-47 | CN                               | N  | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> (4-NO <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )                 | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.518 / 482.2 [M+H] <sup>+</sup>      |
| I-48 | CN                               | N  | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> C=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                                  | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.533 / 414.8 [M+H] <sup>+</sup>      |
| I-49 | OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | N  | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> CN                                                                  | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.289 / 405.3 [M+H] <sup>+</sup>      |
| I-50 | OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | N  | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>                                    | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.726 / 420.4 [M+H] <sup>+</sup>      |
| I-51 | CF <sub>3</sub>                  | CH | CH | CH | CH | (CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> CH <sub>3</sub>                                     | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 4.481 / 473.8 [M+H] <sup>+</sup>      |
| I-52 | CN                               | N  | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> (4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )                | CH <sub>3</sub> | H                               | E                 | 3.490 / 467.8 [M+H] <sup>+</sup>      |
| I-53 | CF <sub>3</sub>                  | N  | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                                                    | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 132                                   |
| I-54 | CF <sub>3</sub>                  | N  | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> CN                                                                  | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 185                                   |
| I-55 | CN                               | N  | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> -C(CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )=CH <sub>2</sub>  | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.365 / 459.4 [M+H] <sup>+</sup>      |
| I-56 | CN                               | N  | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> -CH=CHCl                                                            | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.490 / 421.3 [M+H] <sup>+</sup>      |
| I-57 | OCF <sub>3</sub>                 | CH | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> CN                                                                  | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.632 / 444.9 [M+H] <sup>+</sup>      |
| I-58 | CF <sub>3</sub>                  | CH | CH | CH | CH | (CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> CH <sub>3</sub>                                     | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 4.290 / 459.8 [M+H] <sup>+</sup>      |
| I-59 | CF <sub>3</sub>                  | CH | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                       | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.752 / 475.7 [M+H] <sup>+</sup>      |
| I-60 | CF <sub>3</sub>                  | CH | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> -CH=CHCH <sub>3</sub>                                               | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.973 / 443.8 [M+H] <sup>+</sup>      |
| I-61 | CF <sub>3</sub>                  | CH | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> C=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                                  | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 4.138 / 475.8 [M+H] <sup>+</sup>      |
| I-62 | CF <sub>3</sub>                  | CH | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>                                                  | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.842 / 441.7 [M+H] <sup>+</sup>      |

10

20

30

40

| No.  | R <sup>a</sup>                   | V  | W  | X  | Y                  | R <sup>1</sup>                                                       | R <sup>3</sup>  | R <sup>9</sup> /R <sup>10</sup> | 異性体 <sup>b)</sup> | 物理データ(m.p.[°C];<br>HPLC: RT[min]/m/z) |
|------|----------------------------------|----|----|----|--------------------|----------------------------------------------------------------------|-----------------|---------------------------------|-------------------|---------------------------------------|
| I-63 | CF <sub>3</sub>                  | CH | CH | CH | CH                 | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>                     | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.957 / 443.8 [M+H] <sup>+</sup>      |
| I-64 | OCF <sub>3</sub>                 | CH | CH | CH | CH                 | (CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> CH <sub>3</sub>                      | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 4.544 / 489.8 [M+H] <sup>+</sup>      |
| I-65 | OCF <sub>3</sub>                 | CH | CH | CH | CH                 | (CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> CH <sub>3</sub>                      | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 4.358 / 475.8 [M+H] <sup>+</sup>      |
| I-66 | OCF <sub>3</sub>                 | CH | CH | CH | CH                 | CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>        | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.822 / 491.7 [M+H] <sup>+</sup>      |
| I-67 | OCF <sub>3</sub>                 | CH | CH | CH | CH                 | CH <sub>2</sub> -CH=CHCH <sub>3</sub>                                | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 4.042 / 459.7 [M+H] <sup>+</sup>      |
| I-68 | OCF <sub>3</sub>                 | CH | CH | CH | CH                 | CH <sub>2</sub> C=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                   | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 4.203 / 473.3 [M+H] <sup>+</sup>      |
| I-69 | OCF <sub>3</sub>                 | CH | CH | CH | CH                 | CH <sub>2</sub> C≡CCCH <sub>3</sub>                                  | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.916 / 456.7 [M+H] <sup>+</sup>      |
| I-70 | OCF <sub>3</sub>                 | CH | CH | CH | CH                 | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>                     | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 4.031 / 459.7 [M+H] <sup>+</sup>      |
| I-71 | OCHF <sub>2</sub>                | CH | CH | CH | CH                 | CH <sub>2</sub> C=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                   | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.739 / 455.4 [M+H] <sup>+</sup>      |
| I-72 | OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | N  | CH | CH | CH                 | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                                     | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 113                                   |
| I-73 | CN                               | N  | CH | CH | CH                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub> | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.572 / 415.4 [M+H] <sup>+</sup>      |
| I-74 | OCHF <sub>2</sub>                | CH | CH | CH | CH                 | (CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> CH <sub>3</sub>                      | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 4.364 / 471.4 [M+H] <sup>+</sup>      |
| I-75 | OCHF <sub>2</sub>                | CH | CH | CH | CH                 | (CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> CH <sub>3</sub>                      | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 4.167 / 457.4 [M+H] <sup>+</sup>      |
| I-76 | OCHF <sub>2</sub>                | CH | CH | CH | CH                 | CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>        | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.922 / 473.3 [M+H] <sup>+</sup>      |
| I-77 | OCHF <sub>2</sub>                | CH | CH | CH | CH                 | CH <sub>2</sub> -CH=CHCH <sub>3</sub>                                | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.922 / 473.3 [M+H] <sup>+</sup>      |
| I-78 | OCHF <sub>2</sub>                | CH | CH | CH | CH                 | CH <sub>2</sub> C≡CCCH <sub>3</sub>                                  | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.739 / 439.4 [M+H] <sup>+</sup>      |
| I-79 | OCHF <sub>2</sub>                | CH | CH | CH | CH                 | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>                     | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.841 / 441.4 [M+H] <sup>+</sup>      |
| I-80 | OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | N  | CH | CH | CH                 | CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>        | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.51 / 452.4 [M+H] <sup>+</sup>       |
| I-81 | Br                               | N  | CH | CH | CH                 | CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>        | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.269 / 488.3 [M+H] <sup>+</sup>      |
| I-82 | Br                               | N  | CH | CH | CH                 | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>                     | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.497 / 456.2 [M+H] <sup>+</sup>      |
| I-83 | Br                               | N  | CH | CH | CH                 | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                                     | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.142 / 445.1 [M+H] <sup>+</sup>      |
| I-84 | OCHF <sub>2</sub>                | CH | CH | CH | CH                 | CH <sub>2</sub> CN                                                   | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.448 / 426.9 [M+H] <sup>+</sup>      |
| I-85 | CF <sub>3</sub>                  | N  | CH | CH | C-OCH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                                     | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.224 / 463.7 [M+H] <sup>+</sup>      |

10

20

30

40

| No.   | R <sup>a</sup>                                  | V  | W  | X   | Y  | R <sup>1</sup>                                                    | R <sup>3</sup>  | R <sup>9</sup> /R <sup>10</sup> | 異性体 <sup>*)</sup> | 物理データ(m.p.[°C];<br>HPLC: RT[min]/m/z)             |
|-------|-------------------------------------------------|----|----|-----|----|-------------------------------------------------------------------|-----------------|---------------------------------|-------------------|---------------------------------------------------|
| I-86  | CN                                              | N  | CH | CH  | CH | CH <sub>2</sub> SCCH <sub>3</sub>                                 | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.082 / 359.8 [M-SCCH <sub>3</sub> ] <sup>+</sup> |
| I-87  | CN                                              | N  | CH | CH  | CH | (CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OH                                | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.616 / 405.8 [M+H] <sup>+</sup>                  |
| I-88  | CN                                              | N  | CH | CH  | CH | CH <sub>2</sub> -COC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                  | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.239 / 464.3 [M] <sup>+</sup>                    |
| I-89  | OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                | N  | CH | C-F | CH | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                                  | CH <sub>3</sub> | 3-F                             | Z                 | 3.534 / 445.7 [M] <sup>+</sup>                    |
| I-90  | CN                                              | N  | CH | CH  | CH | CH <sub>2</sub> -(2-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )            | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.752 / 472.1 [M+H] <sup>+</sup>                  |
| I-91  | (CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH <sub>3</sub> | N  | CH | CH  | CH | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                                  | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 2.521 / 421.5 [M] <sup>+</sup>                    |
| I-92  | CN                                              | CH | CH | CH  | CH | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                  | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.110 / 404.8 [M+H] <sup>+</sup>                  |
| I-93  | CN                                              | CH | CH | CH  | CH | CH <sub>2</sub> SCCH <sub>3</sub>                                 | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.353 / 358.8 [M-SCCH <sub>3</sub> ] <sup>+</sup> |
| I-94  | CN                                              | CH | CH | CH  | CH | (CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> Cl                                | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.418 / 421.7 [M] <sup>+</sup>                    |
| I-95  | NO <sub>2</sub>                                 | CH | CH | CH  | CH | (CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> Cl                                | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.463 / 441.7 [M] <sup>+</sup>                    |
| I-96  | Br                                              | N  | CH | CH  | CH | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                  | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 97                                                |
| I-97  | Br                                              | N  | CH | CH  | CH | CH <sub>2</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                    | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 115                                               |
| I-98  | OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                | N  | CH | CH  | CH | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>    | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.545 / 437.9 [M] <sup>+</sup>                    |
| I-99  | OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                | N  | CH | CH  | CH | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.369 / 454.2 [M+H] <sup>+</sup>                  |
| I-100 | CN                                              | N  | CH | CH  | CH | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 132                                               |
| I-101 | CN                                              | N  | CH | CH  | CH | CH <sub>2</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                    | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 130                                               |
| I-102 | OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                | N  | CH | CH  | CH | CH <sub>2</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                    | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 62                                                |
| I-103 | OCH <sub>3</sub>                                | N  | CH | CH  | CH | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                                  | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 152                                               |
| I-104 | CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                 | N  | CH | CH  | CH | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                                  | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.681 / 484.1 [M+H] <sup>+</sup>                  |
| I-105 | OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                | N  | CH | CH  | CH | CH <sub>2</sub> -CHO                                              | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.071 / 408.2 [M+H] <sup>+</sup>                  |
| I-106 | NHCH <sub>3</sub>                               | N  | CH | CH  | CH | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                                  | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 2.208 / 394.5 [M] <sup>+</sup>                    |
| I-107 | CN                                              | N  | CH | CH  | CH | CH <sub>2</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                    | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.063 / 405.1 [M+H] <sup>+</sup>                  |
| I-108 | COCH <sub>3</sub>                               | N  | CH | CH  | CH | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                                  | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 126                                               |

10

20

30

40

| No.   | R <sup>a</sup>                   | V  | W  | X  | Y  | R <sup>1</sup>                                                                     | R <sup>3</sup>  | R <sup>9</sup> /R <sup>10</sup> | 異性体 <sup>*)</sup> | 物理データ(m.p.[°C];<br>HPLC: R <sub>T</sub> [min]/m/z) |
|-------|----------------------------------|----|----|----|----|------------------------------------------------------------------------------------|-----------------|---------------------------------|-------------------|----------------------------------------------------|
| I-109 | CN                               | N  | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                                 | CH <sub>3</sub> | H                               | E                 | 3.337 / 419.1 [M+H] <sup>+</sup>                   |
| I-110 | OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | N  | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> CH=N-OCH <sub>3</sub> (E)                                          | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.290 / 437.2 [M+H] <sup>+</sup>                   |
| I-111 | OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | N  | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> CH(OH)CH <sub>3</sub>                                              | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 130                                                |
| I-112 | OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | N  | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> -CH=CHCO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                              | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.393 / 464.8 [M+H] <sup>+</sup>                   |
| I-113 | OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | N  | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH                                                 | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 2.765 / 410.1 [M+H] <sup>+</sup>                   |
| I-114 | OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | N  | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> CH(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                                 | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.270 / 454.2 [M+H] <sup>+</sup>                   |
| I-115 | OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | N  | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> CH=N-OH                                                            | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 139                                                |
| I-116 | OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | N  | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> COCH <sub>3</sub>                                                  | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 152                                                |
| I-117 | OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | N  | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> CH(OH)CH <sub>2</sub> OH                                           | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 2.651 / 440.1 [M+H] <sup>+</sup>                   |
| I-118 | OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | N  | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> CH(OH)CH <sub>2</sub> Cl                                           | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.091 / 458.1 [M+H] <sup>+</sup>                   |
| I-119 | OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | N  | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                   | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 135                                                |
| I-120 | OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | N  | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> CH=N-OCH <sub>3</sub> (Z)                                          | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.310 / 437.2 [M+H] <sup>+</sup>                   |
| I-121 | CN                               | CH | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                                                   | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.142 / 358.8 [M-OCH <sub>3</sub> ] <sup>+</sup>   |
| I-122 | CN                               | N  | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> OCOCH <sub>3</sub>                                                 | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 2.973 / 359.1 [M-OCOCH <sub>3</sub> ] <sup>+</sup> |
| I-123 | Cl                               | N  | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl                                | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 150                                                |
| I-124 | Cl                               | N  | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                                 | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 139                                                |
| I-125 | CN                               | N  | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl                                | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 168                                                |
| I-126 | OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | N  | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl                                | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.530 / 458.1 [M+H] <sup>+</sup>                   |
| I-127 | OCH <sub>3</sub>                 | N  | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl                                | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.331 / 444.1 [M+H] <sup>+</sup>                   |
| I-128 | Cl                               | N  | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                                     | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 125                                                |
| I-129 | Cl                               | N  | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                     | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 104                                                |
| I-130 | Cl                               | N  | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> OCOC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>                                | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 170                                                |
| I-131 | Cl                               | N  | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Si(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 4.259 / 486.1 [M] <sup>+</sup>                     |

10

20

30

40

| No.   | R <sup>a</sup>                   | V  | W  | X  | Y  | R <sup>1</sup>                                                                     | R <sup>3</sup>  | R <sup>9</sup> /R <sup>10</sup> | 異性体 <sup>b)</sup> | 物理データ(m.p.[°C];<br>HPLC: RT[min]/m/z)                              |
|-------|----------------------------------|----|----|----|----|------------------------------------------------------------------------------------|-----------------|---------------------------------|-------------------|--------------------------------------------------------------------|
| I-132 | OCH <sub>3</sub>                 | N  | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                                     | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 132                                                                |
| I-133 | OCH <sub>3</sub>                 | N  | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                     | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.841 / 472.1 [M+H] <sup>+</sup>                                   |
| I-134 | OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | N  | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                     | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 4.022 / 486.1 [M+H] <sup>+</sup>                                   |
| I-135 | OCH <sub>3</sub>                 | N  | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Si(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 4.109 / 482.2 [M+H] <sup>+</sup>                                   |
| I-136 | OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | N  | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Si(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 4.272 / 496.2 [M+H] <sup>+</sup>                                   |
| I-137 | CN                               | N  | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                                 | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.434 / 419.1 [M+H] <sup>+</sup>                                   |
| I-138 | COCH <sub>3</sub>                | N  | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                     | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 57                                                                 |
| I-139 | COCH <sub>3</sub>                | N  | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> OCOC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>                                | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.601 / 478.1 [M+H] <sup>+</sup>                                   |
| I-140 | COCH <sub>3</sub>                | N  | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                                     | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 66                                                                 |
| I-141 | CN                               | N  | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> OH                                                                 | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 2.412 / 377.1 [M+H] <sup>+</sup>                                   |
| I-142 | CN                               | N  | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Si(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 4.109 / 477.1 [M+H] <sup>+</sup>                                   |
| I-143 | CN                               | CH | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                                 | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.684 / 358.1 [M-OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ] <sup>+</sup> |
| I-144 | CN                               | CH | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Si(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 4.106/359.1 [M-OR <sup>9</sup> ] <sup>+</sup>                      |
| I-145 | NO <sub>2</sub>                  | CH | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Si(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 4.332/379.0 [M-OR <sup>9</sup> ] <sup>+</sup>                      |
| I-146 | CN                               | CH | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Si(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                               | E                 | 4.037/359.1 [M-OR <sup>9</sup> ] <sup>+</sup>                      |
| I-147 | COCH <sub>3</sub>                | N  | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Si(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.831 / 494.2 [M+H] <sup>+</sup>                                   |
| I-148 | CN                               | CH | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                    | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.218 / 432.1 [M+H] <sup>+</sup>                                   |
| I-149 | CN                               | N  | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                      | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 2.956 / 433.1 [M+H] <sup>+</sup>                                   |
| I-150 | OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | N  | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>    | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.549 / 468.2 [M+H] <sup>+</sup>                                   |
| I-151 | CN                               | N  | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> H                                  | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 2.643 / 419.1 [M+H] <sup>+</sup>                                   |
| I-152 | CN                               | CH | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> H                                  | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 2.952 / 418.1 [M+H] <sup>+</sup>                                   |
| I-153 | NO <sub>2</sub>                  | CH | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                    | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 3.263 / 452.1 [M+H] <sup>+</sup>                                   |
| I-154 | CN                               | N  | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> H                                                  | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 2.619 / 405.0 [M+H] <sup>+</sup>                                   |

10

20

30

40

| No.   | R <sup>a</sup> | V  | W  | X  | Y  | R <sup>1</sup>                     | R <sup>3</sup>  | R <sup>9</sup> /R <sup>10</sup> | 異性体 <sup>*)</sup> | 物理データ(m.p.[°C];<br>HPLC: RT[min]/m/z) |
|-------|----------------|----|----|----|----|------------------------------------|-----------------|---------------------------------|-------------------|---------------------------------------|
| I-155 | CN             | CH | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> H  | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 2.926 / 404.1 [M+H] <sup>+</sup>      |
| I-156 | CN             | N  | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH | CH <sub>3</sub> | H                               | Z                 | 2.391 / 391.1 [M+H] <sup>+</sup>      |

\*) これは、ピペラジン骨格における二重結合の立体化学を指す。調製される化合物は、いずれの場合もラセミ体である。

10

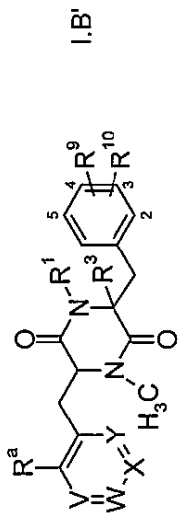
20

30

40

【表 3】

表 II: 式 I、B'に対応している式 I で表される化合物:



| No.   | R <sup>a</sup>  | V  | W  | X  | Y  | R <sup>1</sup>                                                  | R <sup>3</sup>  | R <sup>9</sup> /R <sup>10</sup> | cis /<br>trans <sup>*)</sup> | 物理データ (m.p.[°C];<br>HPLC: RT[min]/m/z) |
|-------|-----------------|----|----|----|----|-----------------------------------------------------------------|-----------------|---------------------------------|------------------------------|----------------------------------------|
| II-1  | CN              | CH | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> CN                                              | CH <sub>3</sub> | H                               | cis                          | 2.886 / 387.8 [M+H] <sup>+</sup>       |
| II-2  | CN              | CH | CH | CH | CH | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                                 | CH <sub>3</sub> | H                               | cis                          | 3.211 / 426.7 [M+H] <sup>+</sup>       |
| II-3  | CN              | CH | CH | CH | CH | COC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                                 | CH <sub>3</sub> | H                               | cis                          | 3.662 / 452.7 [M+H] <sup>+</sup>       |
| II-4  | CN              | CH | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                   | CH <sub>3</sub> | H                               | cis                          | 2.712 / 438.8 [M+H] <sup>+</sup>       |
| II-5  | CN              | CH | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>             | CH <sub>3</sub> | H                               | cis                          | 2.468 / 402.2 [M+H] <sup>+</sup>       |
| II-6  | NO <sub>2</sub> | CH | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> CN                                              | CH <sub>3</sub> | H                               | cis                          | 3.000 / 407.7 [M+H] <sup>+</sup>       |
| II-7  | NO <sub>2</sub> | CH | CH | CH | CH | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                                 | CH <sub>3</sub> | H                               | cis                          | 3.310 / 445.7 [M+H] <sup>+</sup>       |
| II-8  | NO <sub>2</sub> | CH | CH | CH | CH | COC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                                 | CH <sub>3</sub> | H                               | cis                          | 3.737 / 471.7 [M+H] <sup>+</sup>       |
| II-9  | NO <sub>2</sub> | CH | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                   | CH <sub>3</sub> | H                               | cis                          | 3.537 / 458.8 [M+H] <sup>+</sup>       |
| II-10 | NO <sub>2</sub> | CH | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>            | CH <sub>3</sub> | H                               | cis                          | 3.317 / 422.8 [M+H] <sup>+</sup>       |
| II-11 | CN              | CH | CH | CH | CH | (CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub> | H                               | cis                          | 4.076 / 418.8 [M+H] <sup>+</sup>       |
| II-12 | CN              | CH | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                               | cis                          | 3.043 / 434.8 [M+H] <sup>+</sup>       |
| II-13 | CN              | CH | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> CH=CHCH <sub>3</sub>                            | CH <sub>3</sub> | H                               | cis                          | 3.134 / 402.8 [M+H] <sup>+</sup>       |
| II-14 | CN              | CH | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> CH=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>             | CH <sub>3</sub> | H                               | cis                          | 3.314 / 416.8 [M+H] <sup>+</sup>       |
| II-15 | CN              | CH | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> C≡CCCH <sub>3</sub>                             | CH <sub>3</sub> | H                               | cis                          | 3.314 / 416.8 [M+H] <sup>+</sup>       |
| II-16 | CN              | CH | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>                | CH <sub>3</sub> | H                               | cis                          | 3.658 / 402.8 [M+H] <sup>+</sup>       |

10

20

30

40

| No.   | R <sup>a</sup>                                  | V  | W  | X  | Y  | R <sup>1</sup>                                                  | R <sup>3</sup>  | R <sup>9</sup> /R <sup>10</sup> | cis /<br>trans <sup>a)</sup> | 物理データ (m.p.[°C];<br>HPLC: RT[min]/m/z) |
|-------|-------------------------------------------------|----|----|----|----|-----------------------------------------------------------------|-----------------|---------------------------------|------------------------------|----------------------------------------|
| II-17 | NO <sub>2</sub>                                 | CH | CH | CH | CH | (CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub> | H                               | cis                          | 4.161 / 438.8 [M+H] <sup>+</sup>       |
| II-18 | NO <sub>2</sub>                                 | CH | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                               | cis                          | 3.22 / 454.8 [M+H] <sup>+</sup>        |
| II-19 | NO <sub>2</sub>                                 | CH | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>                | CH <sub>3</sub> | H                               | cis                          | 3.367 / 422.8 [M+H] <sup>+</sup>       |
| II-20 | NO <sub>2</sub>                                 | CH | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> CH=CHCH <sub>3</sub>                            | CH <sub>3</sub> | H                               | cis                          | 3.423 / 422.8 [M+H] <sup>+</sup>       |
| II-21 | NO <sub>2</sub>                                 | CH | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> CH=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>             | CH <sub>3</sub> | H                               | cis                          | 3.286 / 436.8 [M+H] <sup>+</sup>       |
| II-22 | NO <sub>2</sub>                                 | CH | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> C≡CCCH <sub>3</sub>                             | CH <sub>3</sub> | H                               | trans                        | 3.126 / 420.8 [M+H] <sup>+</sup>       |
| II-23 | NO <sub>2</sub>                                 | CH | CH | CH | CH | (CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub> | H                               | cis                          | 3.494 / 402.8 [M+H] <sup>+</sup>       |
| II-24 | CN                                              | CH | CH | CH | CH | (CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub> | H                               | cis                          | 4.292 / 432.8 [M+H] <sup>+</sup>       |
| II-25 | CN                                              | CH | CH | CH | CH | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                              | CH <sub>3</sub> | H                               | cis                          | 3.737 / 471.7 [M+H] <sup>+</sup>       |
| II-26 | OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                | N  | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                                | CH <sub>3</sub> | H                               | cis                          | 115                                    |
| II-27 | CN                                              | CH | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                                | CH <sub>3</sub> | H                               | cis                          | 2.885 / 360.8 [M-OMe] <sup>+</sup>     |
| II-28 | OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                | N  | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                                | CH <sub>3</sub> | H                               | trans                        | 104                                    |
| II-29 | OCH <sub>3</sub>                                | N  | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                                | CH <sub>3</sub> | H                               | cis                          | 162                                    |
| II-30 | OCH <sub>3</sub>                                | N  | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                                | CH <sub>3</sub> | H                               | trans                        | 2.682 / 398.3 [M+H] <sup>+</sup>       |
| II-31 | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                 | N  | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                                | CH <sub>3</sub> | H                               | trans                        | 2.485 / 449.8 [M+H] <sup>+</sup>       |
| II-32 | OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                | N  | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                  | CH <sub>3</sub> | H                               | cis                          | 121                                    |
| II-33 | CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                 | N  | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                                | CH <sub>3</sub> | H                               | cis                          | 3.254 / 485.7 [M] <sup>+</sup>         |
| II-34 | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                 | N  | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                                | CH <sub>3</sub> | H                               | cis                          | 2.486 / 449.8 [M] <sup>+</sup>         |
| II-35 | (CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH <sub>3</sub> | N  | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                                | CH <sub>3</sub> | H                               | cis                          | 2.323 / 423.6 [M] <sup>+</sup>         |
| II-36 | (CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH <sub>3</sub> | N  | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                                | CH <sub>3</sub> | H                               | trans                        | 2.510 / 423.6 [M] <sup>+</sup>         |
| II-37 | OCH <sub>3</sub>                                | N  | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>              | CH <sub>3</sub> | H                               | cis                          | 3.156 / 426.1 [M+H] <sup>+</sup>       |
| II-38 | OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                | N  | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>              | CH <sub>3</sub> | H                               | cis                          | 3.188 / 440.2 [M+H] <sup>+</sup>       |
| II-39 | OCH <sub>3</sub>                                | N  | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>              | CH <sub>3</sub> | H                               | trans                        | 3.156 / 426.1 [M+H] <sup>+</sup>       |

10

20

30

40

| No.   | R <sup>a</sup>                   | V  | W  | X  | Y  | R <sup>1</sup>                                                 | R <sup>3</sup>  | R <sup>9</sup> /R <sup>10</sup> | cis /<br>trans <sup>*)</sup> | 物理データ (m.p.[°C];<br>HPLC: RT[min]/m/z)           |
|-------|----------------------------------|----|----|----|----|----------------------------------------------------------------|-----------------|---------------------------------|------------------------------|--------------------------------------------------|
| II-40 | OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | N  | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> CH(OH)CH <sub>3</sub>                          | CH <sub>3</sub> | H                               | cis                          | 2.780 / 426.1 [M+H] <sup>+</sup>                 |
| II-41 | OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | N  | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> CH(OH)CH <sub>2</sub> OH                       | CH <sub>3</sub> | H                               | cis                          | 2.423 / 442.1 [M+H] <sup>+</sup>                 |
| II-42 | OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | N  | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> CH(OH)CH <sub>3</sub>                          | CH <sub>3</sub> | H                               | trans                        | 2.680 / 426.1 [M+H] <sup>+</sup>                 |
| II-43 | OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | N  | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH                             | CH <sub>3</sub> | H                               | cis                          | 2.537 / 412.1 [M+H] <sup>+</sup>                 |
| II-44 | OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | N  | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> CH(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>             | CH <sub>3</sub> | H                               | cis                          | 3.000 / 424.1 [M-OCH <sub>3</sub> ] <sup>+</sup> |
| II-45 | OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | N  | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> CH(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>             | CH <sub>3</sub> | H                               | trans                        | 2.994 / 424.1 [M-OCH <sub>3</sub> ] <sup>+</sup> |
| II-46 | NO <sub>2</sub>                  | CH | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> H                              | CH <sub>3</sub> | H                               | cis                          | 2.794 / 426.1 [M+H] <sup>+</sup>                 |
| II-47 | OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | N  | CH | CH | CH | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H                               | cis                          | 3.064 / 440.3 [M+H] <sup>+</sup>                 |

\*) cis/trans は、ジケトピペラジン骨格の(ヘテロ)アリーラルキル基およびベンジル基の位置を指す。

## 使用実施例

以下の温室実験により式 I で表される化合物の除草活性を実証した。

## 【0765】

使用した栽培容器は、およそ 3.0 % の腐葉土を含む砂壤土がその基土として入っているプラスチック製フラワーポットであった。それぞれの種に対しては各試験植物体のその種子は別々に播種した。

## 【0766】

その発芽前処理については、水に懸濁又は乳化させてある各活性化合物を、播種の後、微細分散型ノズルを用いて直接適用した。発芽と生育を促進させるために各容器を緩く灌漑し、そのあと透明プラスチック製フードで各植物体が根付くまで覆っておいた。各活性化合物によって各試験植物体が損傷されていない限り、各試験植物体の均一な発芽をこの覆いはもたらした。

## 【0767】

発芽後処理については、その植物体の習性に応じて、各試験植物体を、3 ~ 15 cm の背丈まで先ず生育させ、そしてそのあと、水に懸濁又は乳化させてある各活性化合物で処理した。この目的のためには、各試験植物体は、同じ容器内に直接播種して生育させたか、又は最初は苗木として別々に生育させ、処理の数日前に各試験容器に移植した。

## 【0768】

その種に応じて、各植物体を、10 ~ 25 °C 又は 20 ~ 35 °C に置いておいた。その試験期間は、2 ~ 4 週間に及んだ。この期間中、各植物体を世話し、そしてその個々の処理に対する各植物体の応答を評価した。

## 【0769】

評価は、0 ~ 100 の尺度を用いて行った。「100」は、その植物体がまったく発芽しなかったこと、又は少なくとも空中部分が完全に破壊されていたことを意味し、そして「0」は、まったく損傷がなかったこと、又は正常な生育の過程にあったことを意味する。良好な除草活性とは、少なくとも 70 の値にあるものであり、非常に良好な除草活性とは、少なくとも 85 の値にあるものである。

## 【0770】

この温室実験に用いた植物体は、以下の種：

## 【表 4】

| Bayer コード | 学名                            | 一般名                          |
|-----------|-------------------------------|------------------------------|
| ABUTH     | <i>Abutilon theophrasti</i>   | イチビ(China jute)              |
| ALOMY     | <i>Alopecurus myosuroides</i> | ノスズメノテッポウ(blackgrass)        |
| AMARE     | <i>Amaranthus retroflexus</i> | アオゲイトウ(redroot pigweed)      |
| APESV     | <i>Apera spica-venti</i>      | カゼクサ(windgrass)              |
| CHEAL     | <i>Chenopodium album</i>      | シロザ(white goosefoot)         |
| ECHCG     | <i>Echinochloa crus-galli</i> | イヌビエ(barnyardgrass)          |
| LOLMU     | <i>Lolium multiflorum</i>     | イタリアンライグラス(Italian ryegrass) |
| SETIT     | <i>Setaria italica</i>        | オオアワ(Italian millet)         |
| SETVI     | <i>Setaria viridis</i>        | エノコログサ(green foxtail)        |
| SETFA     | <i>Setaria faberi</i>         | アキノエノコログサ(giant foxtail)     |

## 【0771】

に属するものであった。

## 【0772】

(実施例1～12：個々の活性化合物)

1) 1.0 kg/h aの適用量で、各活性化合物I-7及びI-25は、発芽後法により適用されて、ABUTHに対して非常に良好な除草活性を示した。

## 【0773】

2) 0.5 kg/h aの適用量で、各活性化合物I-10及びI-21は、ならびに1.0 kg/h aの適用量で、活性化合物I-2は、発芽後法により適用されて、AMAREに対して非常に良好な除草活性を示した。

## 【0774】

3) 0.5 kg/h aの適用量で、各活性化合物I-10、I-14、I-24、I-18、I-19、I-26、I-34、I-38、I-39、I-40、I-53、I-54、I-56、I-57、I-72、I-76、I-81、I-85、I-91、I-92、I-94、I-95、I-103、II-1、II-14、II-15、II-31、II-32、II-33及びII-34は、0.3 kg/h aの適用量で、活性化合物II-26は、ならびに0.25 kg/h aの適用量で、活性化合物I-83は、発芽前法により適用されて、APESVに対して非常に良好な除草活性を示し、各活性化合物I-48及びI-49は、良好な除草活性を示した。

10

## 【0775】

4) 1.0 kg/h aの適用量で、各活性化合物I-5及びI-26は、発芽前法により適用されて、APESVに対して良好な除草活性を示し、各活性化合物I-4、I-5、I-9、I-12、I-13、I-16及びI-42は、非常に良好な除草活性を示した。

20

## 【0776】

5) 0.5 kg/h aの適用量で、活性化合物I-21は、発芽後法により適用されて、CHEALに対して非常に良好な除草活性を示した。

## 【0777】

6) 1.0 kg/h aの適用量で、各活性化合物I-4、I-5、I-9、I-12、I-13、I-14、I-16、I-26及びI-42は、ならびに0.5 kg/h aの適用量で、各活性化合物I-14、I-18、I-19、I-24、I-26、I-34、I-38、I-39、I-40、I-49、I-53、I-54、I-56、I-63、I-72、I-79、I-81、I-84、I-85、I-86、I-91、I-92、I-93、I-94、I-95、I-103、II-1、II-14、II-15、II-31、II-32、II-33及びII-34は、0.3 kg/h aの適用量で、活性化合物II-26は、ならびに0.25 kg/h aの適用量で、各活性化合物I-83及びII-27は、発芽前法により適用されて、ECHCGに対して非常に良好な除草活性を示した。

30

## 【0778】

7) 1.0 kg/h aの適用量で、活性化合物I-19は、発芽後法により適用されて、ECHCGに対して非常に良好な除草活性を示した。

## 【0779】

8) 1.0 kg/h aの適用量で、各活性化合物I-4、I-5、I-12、I-13、I-14、I-16及びI-42は、ならびに0.5 kg/h aの適用量で、各活性化合物I-14、I-19、I-24、I-48、I-49、I-53、I-54、I-56、I-57、I-63、I-72、I-76、I-79、I-81、I-84、I-85、I-86、I-91、I-92、I-93、I-94、I-95、I-103、II-1、II-14、II-15、II-31、II-33及びII-34は、0.3 kg/h aの適用量で、活性化合物II-26は、ならびに0.25 kg/h aの適用量で、各活性化合物I-83及びII-27は、発芽前法により適用されて、SETFAに対して非常に良好な除草活性を示した。

40

## 【0780】

50

9) 1.0 kg/h a の適用量で、活性化合物 I-25 は、発芽後法により適用されて、SETFA に対して非常に良好な除草活性を示した。

【0781】

10) 1.0 kg/h a の適用量で、活性化合物 I-19 は、発芽後法により適用されて、SETIT に対して非常に良好な除草活性を示した。

【0782】

11) 1.0 kg/h a の適用量で、活性化合物 I-5 は、ならびに 0.5 kg/h a の適用量で、活性化合物 I-24 は、発芽前法により適用されて、SETVI に対して非常に良好な除草活性を示した。

【0783】

12) 0.5 kg/h a の適用量で、各活性化合物 I-3 及び I-21 は、ならびに 1.0 kg/h a の適用量で、活性化合物 I-2 は、発芽後法により適用されて、SETVI に対して非常に良好な除草活性を示した。

【0784】

(実施例 13～14：活性化合物組み合わせ)

記載されているそれぞれの成分 A 及び B を 5 重量%濃度もしくは 10 重量%濃度エマルジョンコンセントレートとして製剤し（又は成分 B の市販製剤を用い）、その溶媒系の量を加え、その活性化合物を適用するのに用いた噴霧液に導入した。この実施例では、用いた溶媒は水であった。

【0785】

この試験期間は 20 日間又は 21 日間に及んだ。この期間中、各植物体を世話し、そしてその活性化合物による処理に対するその反応を追跡した。

【0786】

以下の実施例では、S. R. Colby (1967) "Calculating synergistic and antagonistic responses of herbicide combinations", Weeds 15, p. 22ff. の方法を用いて、その個々の活性化合物の活性が単純に加法的である場合に期待される、値 E を、計算した。

【0787】

$$E = X + Y - (X \cdot Y / 100)$$

ここで

X = 活性化合物 A を適用量 a で用いたときのパーセント活性；

Y = 活性化合物 B を適用量 b で用いたときのパーセント活性；

E = A + B による適用量 a + b での期待活性 (%)

実験で測定された値が Colby に従って計算された値 E よりも大きい場合は、相乗効果が存在する。

【0788】

これらの試験の結果は以下の使用実施例 13 及び 14 の各表に記載されており、少なくとも 1 種の式 I で表されるピペラジンジオン化合物及び少なくとも 1 種のさらなる除草剤を含んでいる混合物の相乗効果が示されている実証されている。

【0789】

ここで、a. s. = active substance (活性物質) である (100% 活性化合物に基づく)。以下の使用実施例 12～16 では、Colby に従って計算された値 E は、括弧 ( ) 内に記載されている。

【0790】

0～100% の尺度を用いて評価したのは、その処理されていない対照植物体との比較での、その化学組成物による損傷であった。0 は、損傷がまったくないことを意味し、そして 100 は、その植物体が完全に崩壊したことを意味する。

10

20

30

40

【表 5】

13)アトラジン(500g/l ISC)と組み合わせた活性化合物 I-43(5%EC)の発芽前法による  
相乗除草活性:

| 活性化合物        | 適用量<br>a.s. g/ha | 20 日後の除草活性(%)<br>対 |         |
|--------------|------------------|--------------------|---------|
|              |                  | ALOMY              | LOLMU   |
| I-43         | 62.5             | 60                 | 45      |
| I-43         | 125              | 85                 | 90      |
| I-43         | 250              | 95                 | 95      |
| アトラジン        | 125              | 35                 | 0       |
| アトラジン        | 250              | 65                 | 20      |
| I-43 + アトラジン | 125 + 125        | 98 (90)            | -       |
| I-43 + アトラジン | 250 + 125        | 98 (97)            | -       |
| I-43 + アトラジン | 62.5 + 250       | 98 (86)            | -       |
| I-43 + アトラジン | 125 + 250        | 100 (95)           | -       |
| I-43 + アトラジン | 250 + 250        | 100 (98)           | 98 (96) |

10

20

【表 6】

14)ピロキサスルホン(100g/l ISC)と組み合わせた活性化合物 II-26(5%EC)の発芽前法による  
相乗除草活性:

| 活性化合物            | 適用量<br>a.s. g/ha | 20 日後の除草活性(%)<br>対 |         |         |
|------------------|------------------|--------------------|---------|---------|
|                  |                  | ALOMY              | LOLMU   | SETFA   |
| II-26            | 31.25            | 30                 | 0       | 10      |
| II-26            | 62.5             | 60                 | 15      | -       |
| II-26            | 125              | 90                 | 98      | 75      |
| II-26            | 250              | 95                 |         | 100     |
| ピロキサスルホン         | 3.12             | 25                 | 15      | 0       |
| ピロキサスルホン         | 6.25             | -                  | -       | 25      |
| ピロキサスルホン         | 12.5             | 95                 | 75      | -       |
| ピロキサスルホン         | 25               | 95                 | 80      | 95      |
| II-26 + ピロキサスルホン | 31.25 + 3.12     | 65 (48)            | -       | -       |
| II-26 + ピロキサスルホン | 62.5 + 3.12      | 85 (70)            | -       | -       |
| II-26 + ピロキサスルホン | 125 + 3.12       | 98 (93)            | -       | -       |
| II-26 + ピロキサスルホン | 125 + 6.25       | -                  | -       | 90 (81) |
| II-26 + ピロキサスルホン | 62.5 + 12.5      | -                  | 90 (79) | -       |

30

40

## 【国際調査報告】

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No  
PCT/EP2009/062573

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER  
INV. C07D401/06 C07D403/06 A01N43/60

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

## B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)  
C07D A01N

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

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

EPO-Internal

## C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

| Category* | Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages                                                                             | Relevant to claim No. |
|-----------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------|
| X         | WO 2007/077201 A (BASF AG [DE]; HUPE EIKE [DE]; ZAGAR CYRILL [CN]; WITSCHER MATTHIAS [DE] 12 July 2007 (2007-07-12)<br>page 54 - page 76                       | 1-15                  |
| A         | WO 2007/077247 A (BASF AG [DE]; HUPE EIKE [DE]; ZAGAR CYRILL [CN]; WITSCHER MATTHIAS [DE] 12 July 2007 (2007-07-12)<br>the whole document<br>page 58 - page 83 | 1-15                  |

☐ 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 document but published on or after the international filing date
- \*L\* document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- \*O\* document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- \*P\* document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

- \*T\* later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
- \*X\* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
- \*Y\* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art
- \*A\* document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

13 November 2009

Date of mailing of the international search report

24/11/2009

Name and mailing address of the ISA/

European Patent Office, P.B. 5618 Patentlaan 2  
NL - 2280 HV Rijswijk  
Tel. (+31-70) 340-2040,  
Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Bader, Karl Günther

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No

PCT/EP2009/062573

| Patent document<br>cited in search report | Publication<br>date | Patent family<br>member(s) | Publication<br>date |
|-------------------------------------------|---------------------|----------------------------|---------------------|
| WO 2007077201 A                           | 12-07-2007          | AR 058408 A1               | 30-01-2008          |
|                                           |                     | AU 2006334406 A1           | 12-07-2007          |
|                                           |                     | CA 2634195 A1              | 12-07-2007          |
|                                           |                     | CN 101374820 A             | 25-02-2009          |
|                                           |                     | EA 200801630 A1            | 30-12-2008          |
|                                           |                     | EC SP088594 A              | 29-08-2008          |
|                                           |                     | EP 1971580 A1              | 24-09-2008          |
|                                           |                     | JP 2009522238 T            | 11-06-2009          |
|                                           |                     | KR - 20080098021 A         | 06-11-2008          |
|                                           |                     | US 2009156553 A1           | 18-06-2009          |
| WO 2007077247 A                           | 12-07-2007          | AR 058922 A1               | 05-03-2008          |
|                                           |                     | AU 2007204015 A1           | 12-07-2007          |
|                                           |                     | CA 2633483 A1              | 12-07-2007          |
|                                           |                     | CN 101365687 A             | 11-02-2009          |
|                                           |                     | EA 200801627 A1            | 30-12-2008          |
|                                           |                     | EC SP088596 A              | 29-08-2008          |
|                                           |                     | EP 1971581 A1              | 24-09-2008          |
|                                           |                     | JP 2009522333 T            | 11-06-2009          |
|                                           |                     | KR 20080092407 A           | 15-10-2008          |
|                                           |                     | US 2009137396 A1           | 28-05-2009          |
|                                           |                     | UY 30084 A1                | 31-08-2007          |

## INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2009/062573

**A. KLASIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES**  
 INV. C07D401/06 C07D403/06 A01N43/60

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

**B. RECHERCHIERTE GEBIETE**

Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)  
 C07D A01N

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

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

EPO-Internal

**C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN**

| Kategorie | Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile                                                                | Betr. Anspruch Nr. |
|-----------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------------------|
| X         | WO 2007/077201 A (BASF AG [DE]; HUPE EIKE [DE]; ZAGAR CYRILL [CN]; WITSCHER MATTHIAS [DE] 12. Juli 2007 (2007-07-12)<br>Seite 54 - Seite 76                       | 1-15               |
| A         | WO 2007/077247 A (BASF AG [DE]; HUPE EIKE [DE]; ZAGAR CYRILL [CN]; WITSCHER MATTHIAS [DE] 12. Juli 2007 (2007-07-12)<br>das ganze Dokument<br>Seite 58 - Seite 83 | 1-15               |

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

\* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :

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

\*E\* älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist

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

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

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

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

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

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

\*Z\* Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

13. November 2009

Absenddatum des internationalen Recherchenberichts

24/11/2009

Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde  
 Europäische Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2  
 NL - 2280 HV Rijswijk  
 Tel. (+31-70) 340-2040,  
 Fax: (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Bediensteter

Bader, Karl Günther

## INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2009/062573

| Im Recherchenbericht<br>angeführtes Patentdokument | Datum der<br>Veröffentlichung | Mitglied(er) der<br>Patentfamilie | Datum der<br>Veröffentlichung |
|----------------------------------------------------|-------------------------------|-----------------------------------|-------------------------------|
| WO 2007077201 A                                    | 12-07-2007                    | AR 058408 A1                      | 30-01-2008                    |
|                                                    |                               | AU 2006334406 A1                  | 12-07-2007                    |
|                                                    |                               | CA 2634195 A1                     | 12-07-2007                    |
|                                                    |                               | CN 101374820 A                    | 25-02-2009                    |
|                                                    |                               | EA 200801630 A1                   | 30-12-2008                    |
|                                                    |                               | EC SP088594 A                     | 29-08-2008                    |
|                                                    |                               | EP 1971580 A1                     | 24-09-2008                    |
|                                                    |                               | JP 2009522238 T                   | 11-06-2009                    |
|                                                    |                               | KR 20080098021 A                  | 06-11-2008                    |
|                                                    |                               | US 2009156553 A1                  | 18-06-2009                    |
| WO 2007077247 A                                    | 12-07-2007                    | AR 058922 A1                      | 05-03-2008                    |
|                                                    |                               | AU 2007204015 A1                  | 12-07-2007                    |
|                                                    |                               | CA 2633483 A1                     | 12-07-2007                    |
|                                                    |                               | CN 101365687 A                    | 11-02-2009                    |
|                                                    |                               | EA 200801627 A1                   | 30-12-2008                    |
|                                                    |                               | EC SP088596 A                     | 29-08-2008                    |
|                                                    |                               | EP 1971581 A1                     | 24-09-2008                    |
|                                                    |                               | JP 2009522333 T                   | 11-06-2009                    |
|                                                    |                               | KR 20080092407 A                  | 15-10-2008                    |
|                                                    |                               | US 2009137396 A1                  | 28-05-2009                    |
|                                                    |                               | UY 30084 A1                       | 31-08-2007                    |

## フロントページの続き

(51)Int.Cl. F I テーマコード (参考)  
**A O 1 N 43/70 (2006.01)** A O 1 N 43/70  
**A O 1 N 43/80 (2006.01)** A O 1 N 43/80 1 O 1

(81)指定国 AP(BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), EA(AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), EP(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), OA(BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG), 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

(74)代理人 100111741

弁理士 田中 夏夫

(72)発明者 パラ ラバド, リリアナ

ドイツ連邦共和国 7 7 6 5 4 オフエンブルク, ヴェルターブルーメンシュトッカーシュトラッセ 2 2

(72)発明者 シュテルツァー, フランク

ドイツ連邦共和国 6 8 3 0 9 マンハイム, イダーデーメルリング 4 0

(72)発明者 ヴィトシェル, マティアス

ドイツ連邦共和国 6 7 0 9 8 パート デュルクハイム, ヘーエンヴェーク 1 2 ベー

(72)発明者 ザイツ, トーマス

ドイツ連邦共和国 6 8 5 1 9 フィールンハイム, エミルーノルデーシュトラッセ 1 0

(72)発明者 ジーモン, アンニャ

ドイツ連邦共和国 6 9 4 6 9 ヴァインハイム, ムルトリング 6 5

(72)発明者 ラインハルト, ロベルト

ドイツ連邦共和国 6 7 1 1 7 リンブルガーホフ, ベルヴァールトシュタインシュトラッセ 6

(72)発明者 ジーヴァーニツヒ, ベルント

ドイツ連邦共和国 6 7 4 5 4 ハスロッホ, ベルトルトーブレヒトシュトラッセ 1 8 アー

(72)発明者 グロースマン, クラオス

ドイツ連邦共和国 6 7 1 4 1 ノイホーフエン, マインシュトラッセ 1

(72)発明者 エアハルト, トーマス

ドイツ連邦共和国 6 7 3 4 6 シュパイヤー, マオルブロンナー ホーフ 4 9

(72)発明者 ニュートン, トレヴァー ウィリアム

ドイツ連邦共和国 6 7 4 3 5 ノイシュタット, ノイベルクシュトラッセ 3 0

(72)発明者 マヨア, ユリア

ドイツ連邦共和国 6 8 1 6 7 マンハイム, レナウシュトラッセ 2 0

(72)発明者 クー, タオ

ドイツ連邦共和国 6 7 0 6 3 ルートヴィヒスハーフェン, フォンデーアータン シュトラッセ 4 0

(72)発明者 モベルク, ウィリアム カール

ドイツ連邦共和国 6 7 4 3 3 ノイシュタット, ケレライシュトラッセ 1 6

(72)発明者 ゴング, ジュン

ドイツ連邦共和国 6 8 1 6 7 マンハイム, アイヒェンドルフシュトラッセ 1 5 アー

(72)発明者 ラック, ミヒャエル

ドイツ連邦共和国 6 9 2 1 4 エッペルハイム, ヒルダシュトラッセ 1 1 / 1

(72)発明者 フラッセット, ティモ

ドイツ連邦共和国 6 8 1 6 5 マンハイム, パッサーマンシュトラッセ 3 5

(72)発明者 クロイツ, クラオス

ドイツ連邦共和国 7 9 2 1 1 デンツリンゲン, ハオプトシュトラッセ 3 0 / 4

F ターム(参考) 4C063 AA01 BB03 CC34 DD12 DD28 DD29 EE03

4H011 AB01 BA06 BB09 BB10 DA15 DA16 DF04