

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 特 許 公 報(B2)

(11) 特許番号

特許第3920323号

(P3920323)

(45) 発行日 平成19年5月30日(2007.5.30)

(24) 登録日 平成19年2月23日(2007.2.23)

(51) Int. Cl.

F I

C O 7 D 213/85 (2006.01)

C O 7 D 213/85

A O 1 N 47/34 (2006.01)

A O 1 N 47/34

E

A O 1 N 47/36 (2006.01)

A O 1 N 47/36

I O 1 A

A O 1 P 13/00 (2006.01)

A O 1 N 47/36

I O 1 E

A O 1 P 21/00 (2006.01)

A O 1 N 47/36

I O 1 Z

請求項の数 17 (全 94 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号 特願平7-511290  
 (86) (22) 出願日 平成6年10月12日(1994.10.12)  
 (65) 公表番号 特表平9-503772  
 (43) 公表日 平成9年4月15日(1997.4.15)  
 (86) 国際出願番号 PCT/EP1994/003369  
 (87) 国際公開番号 W01995/010507  
 (87) 国際公開日 平成7年4月20日(1995.4.20)  
 審査請求日 平成13年10月11日(2001.10.11)  
 (31) 優先権主張番号 P4335297.9  
 (32) 優先日 平成5年10月15日(1993.10.15)  
 (33) 優先権主張国 ドイツ(DE)

(73) 特許権者

ヘキスト・シェーリング・アグレボ・ゲゼ  
ルシャフト・ミト・ベシュレンクテル・ハ  
フツングドイツ連邦共和国、デー - 1 3 5 0 9 ベ  
ルリン、ミラウストラーセ、54

(74) 代理人

弁理士 江崎 光史

(74) 代理人

弁理士 三原 恒男

(74) 代理人

弁理士 奥村 義道

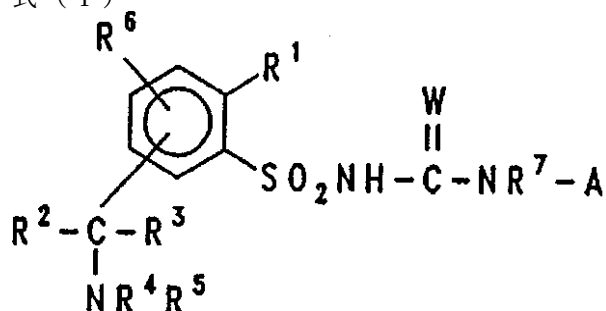
最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 フェニルスルホニル尿素、その製造方法およびその除草剤および植物生長調整剤としての用途

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項1】

式 (I)



〔上式中、

R<sup>1</sup>はCO-Q-R<sup>8</sup>を意味し、R<sup>2</sup>およびR<sup>3</sup>は互いに無関係にHまたは(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキルを意味し、

R<sup>4</sup>はH、(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)アルキル〔これは非置換であるかまたはハロゲン、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルコキシ、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキルチオ、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキルスルフィニル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキルスルホニル、〔(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルコキシ〕-カルボニルおよびCNからなる群からの1個またはそれ以上の基によって置換されている〕または(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)アルケニル〔これは非置換であるかまたは1個またはそれ以上のハロゲン原子によって置換されている〕または(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)アルキニル〔これは非置換であるかまたは1個またはそれ以上のハロ

ゲン原子によって置換されている}、またはヒドロキシ、 $(C_1-C_4)$  アルコキシ、 $[(C_1-C_4)$  アルキル]-カルボニルまたは $(C_1-C_4)$  アルキルスルホニル {このうち後の3種の基のそれぞれは非置換であるかまたはアルキル部分において1個またはそれ以上のハロゲン原子によって、または $(C_1-C_4)$  アルコキシまたは $(C_1-C_4)$  アルキルチオによって置換されている} またはフェニルスルホニル {ここでフェニル基は非置換であるかまたは置換されている} を意味し、そして

$R^5$  は $(C_1-C_4)$  アルキルスルホニルまたは $(C_3-C_6)$  アルケニルスルホニル {この2つの基のそれぞれは非置換であるかまたは1個またはそれ以上のハロゲン原子により、または $(C_1-C_4)$  アルコキシまたは $(C_1-C_4)$  アルキルチオによって置換されている} またはフェニルスルホニルまたはフェニルカルボニル (このフェニルスルホニルまたはフェニルカルボニル基におけるフェニル基はそれぞれ非置換であるかまたは置換されている) またはモノ-またはジ $[(C_1-C_4)$  アルキル]-アミノスルホニルまたは $[(C_1-C_6)$  アルキル]-カルボニル {このうち後の3種の基のそれぞれは非置換であるかまたはハロゲン、 $(C_1-C_4)$  アルコキシ、 $(C_1-C_4)$  アルキルチオ、 $(C_1-C_4)$  アルキルスルフィニル、 $(C_1-C_4)$  アルキルスルホニル、 $[(C_1-C_4)$  アルキル]-カルボニル、 $[(C_1-C_4)$  アルコキシ]-カルボニルおよびCNからなる群からの1個またはそれ以上の基によって置換されている}、またはホルミル、式 $-CO-CO-R'$  {ここで $R' = H, OH, (C_1-C_4)$  アルコキシまたは $(C_1-C_4)$  アルキルである} で表される基または $[(C_3-C_6)$  シクロアルキル]-カルボニル、 $[(C_2-C_6)$  アルケニル]-カルボニルまたは $[(C_2-C_6)$  アルキニル]-カルボニル {このうち後の3種の基のそれぞれは非置換であるかまたは1個またはそれ以上のハロゲン原子によって置換されている} または式



で表される基を意味する {その際、基 $CR^2R^3-NR^4R^5$ がスルホニル尿素分子の $SO_2$ 基に対してパラ-位に位置する場合には、 $R^5 = \text{非置換の} [(C_1-C_6) \text{ アルキル}]-\text{カルボニル}$ という定義は除外される} かまたは

$R^4$  および  $R^5$  は一緒に式 $(-CH_2)_m B$ -または $-B^1-(CH_2)_{m1}-B$ -で表される連鎖 {ここでこの連鎖は非置換であるかまたは1個またはそれ以上の $(C_1-C_3)$  アルキル基で置換されており、そして $m$ は3または4であるかまたは $m^1$ は2または3である} を意味し、そして

Wは酸素-または硫黄原子を意味し、

Bおよび $B^1$ は互いに無関係に $SO_2$ またはCOを意味し、

QはO、Sまたは $-NR^{13}$ を意味し、

TはOまたはSを意味し、

$R^6$  はH、 $(C_1-C_4)$  アルキル、 $(C_1-C_4)$  アルコキシ、 $[(C_1-C_4)$  アルキル]-カルボニルまたは $[(C_1-C_4)$  アルコキシ]-カルボニル {このうち後の4種の基のそれぞれは非置換であるかまたはアルキル部分において1個またはそれ以上のハロゲン原子によって置換されている} またはハロゲン、 $NO_2$ またはCNを意味し、

$R^7$  はHまたは $CH_3$ を意味し、

$R^8$  はH、 $(C_1-C_4)$  アルキル、 $(C_3-C_4)$  アルケニルまたは $(C_3-C_4)$  アルキニル {このうち後の3種の基のそれぞれは非置換であるか又はハロゲン、 $(C_1-C_4)$  アルコキシ、 $(C_1-C_4)$  アルキルチオ、 $[(C_1-C_4)$  アルキル]-カルボニルおよび $[(C_1-C_4)$  アルコキシ]-カルボニルからなる群からの1個またはそれ以上の基によって置換されている} を意味し、

$R^9$  は $(C_1-C_4)$  アルキル、 $(C_3-C_4)$  アルケニルまたは $(C_3-C_4)$  アルキニル {このうち後の3種の基のそれぞれは非置換であるかまたはハロゲン、 $(C_1-C_4)$  アルコキシ、 $(C_1-C_4)$  アルキルチオ、 $[(C_1-C_4)$  アルキル]-カルボニルおよび $[(C_1-C_4)$  アルコキシ]-カルボニルからなる群からの1種またはそれ以上の基によって置換されて

10

20

30

40

50

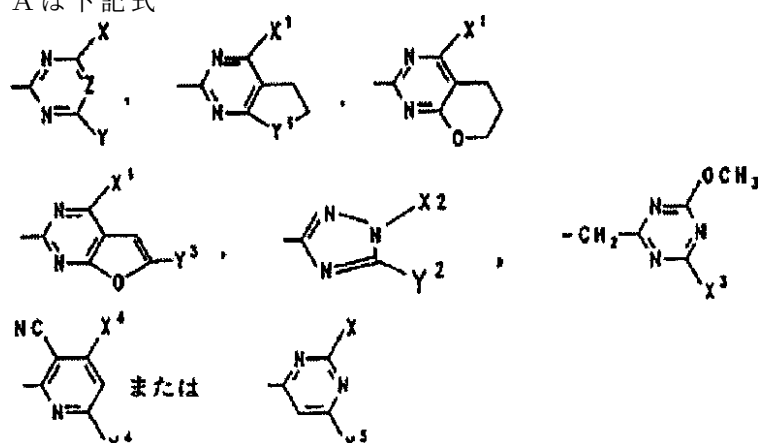
いる} を意味し、

$R^{10}$  および  $R^{11}$  は互いに無関係に H、 $(C_1-C_4)$  アルキル、 $(C_3-C_4)$  アルケニルまたは  $(C_3-C_4)$  アルキニル {このうち後の 3 種の基のそれぞれは非置換であるかまたはハロゲン、 $(C_1-C_4)$  アルコキシ、 $(C_1-C_4)$  アルキルチオ、 $[(C_1-C_4)$  アルキル]-カルボニルおよび  $[(C_1-C_4)$  アルコキシ]-カルボニルからなる群からの 1 個またはそれ以上の基によって置換されている} を意味し、

$R^{12}$  は N-原子と共に、N、O および種々の酸化段階の S からなる群からのもう一つのヘテロ原子を有する 5 または 6 員環を有する複素環式環を形成し、そして非置換であるかまたは  $(C_1-C_4)$  アルキルまたはオキシ基によって置換されているかまたはベンゾ縮合されており、

$R^{13}$  は H、 $(C_1-C_4)$  アルキル、 $(C_3-C_4)$  アルケニルまたは  $(C_3-C_4)$  アルキニル {このうち後の 3 種の基のそれぞれは非置換であるかまたはハロゲン、 $(C_1-C_4)$  アルコキシおよび  $(C_1-C_4)$  アルキルチオからなる群からの 1 個またはそれ以上の基によって置換されている} を意味し、

A は下記式



で表される基を意味し、

基 X および Y のうちの一方は水素、ハロゲン、 $(C_1-C_3)$  アルキルまたは  $(C_1-C_3)$  アルコキシ {このうち後の 2 つの基は非置換であるかまたはハロゲンによってモノ-またはポリ置換されまたは  $(C_1-C_3)$  アルコキシによってモノ置換されている} を意味し、そして

基 X および Y のうちの他方は水素、 $(C_1-C_3)$  アルキル、 $(C_1-C_3)$  アルコキシまたは  $(C_1-C_3)$  アルキルチオ {このうち後の 3 種のアルキル含有基は非置換であるかまたはハロゲンによってモノ-またはポリ置換されまた  $(C_1-C_3)$  アルコキシまたは  $(C_1-C_3)$  アルキルチオによってモノ-またはジ置換されている}、または式  $NR^{14}R^{15}$  で表される基、 $(C_3-C_6)$  シクロアルキル、 $(C_2-C_4)$  アルケニル、 $(C_2-C_4)$  アルキニル、 $(C_3-C_4)$  アルケニルオキシまたは  $(C_3-C_4)$  アルキニルオキシを意味し、

Z は CH または N を意味し、

$R^{14}$  および  $R^{15}$  は互いに無関係に H、 $(C_1-C_3)$  アルキルまたは  $(C_3-C_4)$  アルケニルを意味し、

$X^1$  は  $CH_3$ 、 $OCH_3$ 、 $OC_2H_5$  または  $OCHF_2$  を意味し、

$Y^1$  は -O- または  $-CH_2-$  を意味し、

$X^2$  は  $CH_3$ 、 $C_2H_5$  または  $CH_2CF_3$  を意味し、

$Y^2$  は  $OCH_3$ 、 $OC_2H_5$ 、 $SCH_3$ 、 $SCH_2CH_3$ 、 $CH_3$  または  $C_2H_5$  を意味し、

$X^3$  は  $CH_3$  または  $OCH_3$  を意味し、

$Y^3$  は H または  $CH_3$  を意味し、

$X^4$  は  $CH_3$ 、 $OCH_3$ 、 $OC_2H_5$ 、 $CH_2OCH_3$  または Cl を意味し、 $Y^4$  は  $CH_3$ 、 $OCH_3$ 、 $OC_2H_5$  または Cl を意味し、そして

10

20

30

40

50

$Y^5$ は $CH_3$ 、 $C_2H_5$ 、 $OCH_3$ または $Cl$ を意味する]

で表される化合物またはそれらの塩。

【請求項2】

式(I)において、

$R^4$ がH、 $(C_1-C_4)$ アルキル {これは非置換であるかまたはハロゲン、 $(C_1-C_4)$ アルコキシ、 $(C_1-C_4)$ アルキルチオ、 $(C_1-C_4)$ アルキルスルホニル、 $[(C_1-C_4)$ アルコキシ]-カルボニルおよびCNからなる群からの1個またはそれ以上の基によって置換されている} または $(C_3-C_4)$ アルケニル、 $(C_3-C_4)$ アルキニル、ヒドロキシ、 $(C_1-C_4)$ アルコキシ、 $[(C_1-C_4)$ アルキル]-カルボニルまたは $(C_1-C_4)$ アルキルスルホニル {このうち後の5種の基のおおのは非置換であるかまたはアルキル部分において1個またはそれ以上のハロゲン原子によって置換されている} またはフェニルスルホニル {ここでフェニル基は非置換であるかまたはハロゲン、 $(C_1-C_4)$ アルキルおよび $(C_1-C_4)$ アルコキシからなる群からの1個またはそれ以上の基によって置換されている} を意味し、そして $R^5$ が $(C_1-C_4)$ アルキルスルホニル、 $(C_1-C_4)$ ハロアルキルスルホニル、フェニルスルホニルまたはフェニルカルボニル {このうち後の2種の基におけるフェニル基は非置換であるかまたはハロゲン、 $(C_1-C_4)$ アルキルおよび $(C_1-C_4)$ アルコキシからなる群からの1個またはそれ以上の基によって置換されている} またはモノ-またはジ- $[(C_1-C_4)$ アルキル]-アミノスルホニル、 $[(C_1-C_6)$ アルキル]-カルボニル {これは非置換であるかまたは1個またはそれ以上のハロゲン原子または $(C_1-C_4)$ アルコキシまたは $(C_1-C_4)$ アルキルチオによって置換されている} またはホルミル、 $OHC-CO-$ 、2-オキソ- $(C_3-C_5)$ アルカノイル、 $[(C_1-C_4)$ アルコキシ]-オキサリル、 $[(C_3-C_6)$ シクロアルキル]-カルボニル、 $[(C_2-C_4)$ アルケニル]-カルボニルまたは $[(C_2-C_4)$ アルキニル]-カルボニルまたは式



で表される基を意味し、

WはOまたはSを意味し、

$R^6$ がH、 $(C_1-C_4)$ アルキル、 $(C_1-C_4)$ ハロアルキル、 $(C_1-C_4)$ アルコキシ、 $(C_1-C_4)$ -ハロアルコキシまたはハロゲンを意味し、

$R^8$ が互いに無関係に、 $(C_1-C_4)$ アルキル {これは非置換であるかまたは1個またはそれ以上のハロゲン原子によって置換されている}、または $(C_3-C_4)$ -アルケニルまたは $(C_3-C_4)$ アルキニルを意味し、

$R^9$ がH、 $(C_1-C_4)$ アルキル {これは非置換であるかまたは1個またはそれ以上のハロゲン原子により、または $(C_1-C_4)$ アルコキシ、 $(C_1-C_4)$ アルキルチオ、 $[(C_1-C_4)$ アルコキシ]-カルボニルおよび $[(C_1-C_4)$ アルキル]-カルボニルによって置換されている} を意味し、

$R^{10}$ および $R^{11}$ が互いに無関係にH、 $(C_1-C_4)$ アルキル {これは非置換であるかまたは1個またはそれ以上のハロゲン原子によって置換されている}、または $(C_3-C_4)$ -アルケニルまたは $(C_3-C_4)$ アルキニル {ここで基 $R^{10}$ および $R^{11}$ のうちの少なくとも1つは水素ではない} を意味し、

$R^{12}$ がN-原子と共に、N、Oおよび種々の酸化段階におけるSからなる群からのもう一つのヘテロ原子を有しうる5または6員環を有する複素環であって非置換であるかまたは $(C_1-C_4)$ アルキルによってまたはオキソ基によって置換されているものを意味し、そして

$R^{13}$ が互いに無関係にH、 $(C_1-C_4)$ アルキル {これは非置換であるかまたは1個またはそれ以上のハロゲン原子によって置換されている} または $(C_3-C_4)$ アルケニルまた

は (C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>) アルキニルを意味する  
請求項 1 に記載の化合物またはそれらの塩。

【請求項 3】

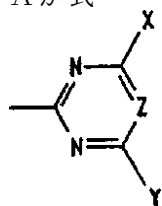
式 (I) において、

R<sup>4</sup> が H、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) アルキル、ヒドロキシまたは (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) アルコキシを意味し、  
R<sup>5</sup> が (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) アルキルスルホニル、CHO、[(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) アルキル]-カルボニル {  
これは非置換であるかまたは 1 個またはそれ以上のハロゲン原子によって置換されている  
}、[(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) アルコキシ]-オキサリル、[(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>) シクロアルキル]-カルボニ  
ルまたは式



(上記各式中、W, T, R<sup>9</sup>~R<sup>12</sup> は前記の式 (I) について請求項 1 で定義されたもの  
と同一の意味を有する)

R<sup>6</sup> が H、(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>) アルコキシまたはハロゲンを意味し、  
A が式



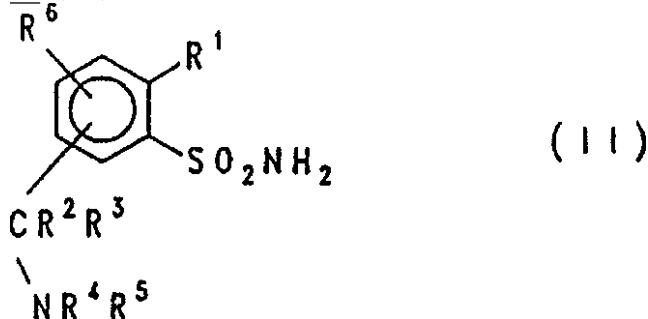
で表される基を意味し、

Z が CH または N を意味し、そして

基 X および Y のうちの一方がハロゲン、(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>) アルコキシ、  
OCF<sub>2</sub>H、CF<sub>3</sub> または OCH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub> を意味しそして基 X および Y のうちの他方が (C<sub>1</sub>-  
C<sub>2</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>) アルコキシまたは (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>) ハロアルコキシを意味する、  
請求項 1 または 2 に記載の化合物またはそれらの塩。

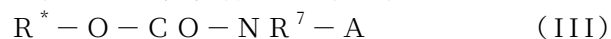
【請求項 4】

式 (II)



[上式中、R<sup>1</sup> ないし R<sup>6</sup> はそれぞれ請求項 1 で式 (I) について定義されたものと同一の  
意味を有する]

で表される化合物を式 (III)



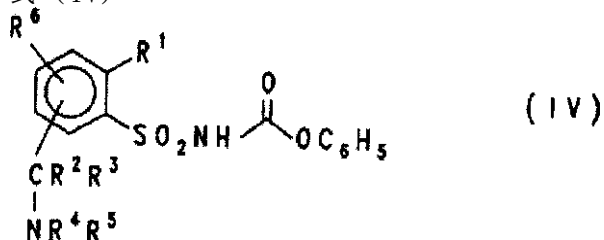
[上式中、R<sup>\*</sup> は場合によっては置換されたフェニルまたは (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) アルキルを意味し、  
R<sup>7</sup> および A はそれぞれ請求項 1 で式 (I) について定義されたものと同一の意味を有  
する]

と反応させることを特徴とする請求項 1 に記載の式 (I) で表される化合物またはそれら

の塩の製造方法。

【請求項 5】

式 (IV)



10

〔上式中、 $R^1$ ないし $R^6$ はそれぞれ請求項 1 で式 (I) について定義されたものと同一の意味を有する〕

で表されるフェニルスルホニルカーバメートを式 (V)

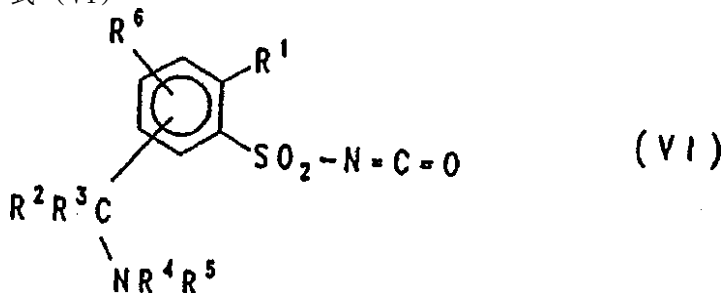


〔上式中、 $R^7$ およびAはそれぞれ請求項 1 で式 (I) について定義されたものと同一の意味を有する〕

で表されるアミノ複素環と反応させることを特徴とする請求項 1 に記載の式 (I) で表される化合物またはそれらの塩の製造方法。

【請求項 6】

式 (VI)



20

〔上式中、 $R^1$ ないし $R^6$ はそれぞれ請求項 1 で式 (I) について定義されたものと同一の意味を有する〕

で表されるスルホニルイソシアネートを式 (V)



〔上式中、 $R^7$ およびAはそれぞれ請求項 1 で式 (I) について定義されたものと同一の意味を有する〕

で表されるアミノ複素環と反応させることを特徴とする請求項 1 に記載の式 (I) で表される化合物またはそれらの塩の製造方法。

【請求項 7】

ワン-ポット反応において、まず式 (V)



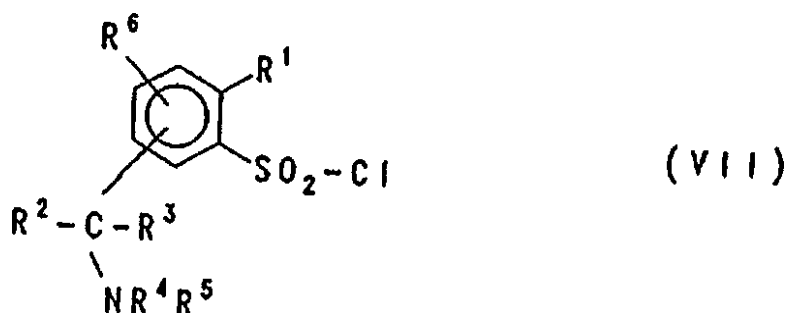
〔上式中、 $R^7$ とAはそれぞれ請求項 1 で式 (I) について定義されたものと同一の意味を有する〕で表されるアミノ複素環を塩基の存在下にホスゲンと反応させそして生成された中間体を請求項 4 に記載の式 (II) のフェニルスルホンアミドと反応させることを特徴とする請求項 1 に記載の式 (I) で表される化合物またはその塩の製造方法。

【請求項 8】

式 (VII)

30

40



〔上式中、 $R^1$ ないし $R^6$ はそれぞれ請求項1で式(I)について定義されたものと同一の意味を有する〕

で表されるスルホニクロライドを $M-OCN$  (ここで $M$ は $NH_4$ 、 $Na$ または $K$ を意味する) で表されるシアネートと、そして塩基の存在下に式(V)



〔上式中、 $R^7$ と $A$ はそれぞれ請求項1で式(I)について定義されたものと同一の意味を有する〕

で表されるアミノ複素環と反応させることを特徴とする請求項1に記載の式(I)で表される化合物またはそれらの塩の製造方法。

#### 【請求項9】

請求項4に記載の式(II)のスルホンアミドを塩基の存在下に式(V')



〔上式中、 $A$ と $W$ は請求項1で式(I)について定義されたものと同一の意味を有する〕  
で表される(チオ-) イソシアネートと反応させることを特徴とする請求項1に記載の式(I)で表される化合物またはそれらの塩の製造方法。

#### 【請求項10】

請求項1～3のうちのいずれか一つに記載の式(I)の化合物またはそれらの塩の少なくとも1種および植物保護において通常の製剤助剤を含有することを特徴とする除草剤。

#### 【請求項11】

請求項1～3のうちのいずれか一つに記載の式(I)の化合物またはそれらの塩の少なくとも1種および植物保護において通常の製剤助剤を含有することを特徴とする植物生長調整剤。

#### 【請求項12】

有害植物を防除する方法において、請求項1～3のうちのいずれか一つに記載の式(I)の化合物またはその塩の少なくとも1種の有効量を有害植物またはそれらの種子またはそれらの耕作地に施用することを特徴とする上記方法。

#### 【請求項13】

植物の生長を調整する方法において、請求項1～3のうちのいずれか一つに記載の式(I)の化合物またはその塩の少なくとも1種の有効量を植物、その種子またはそれらの耕作地に施用することを特徴とする上記方法。

#### 【請求項14】

請求項1～3のうちのいずれか一つに記載の式(I)の化合物またはそれらの塩を除草剤として使用する方法。

#### 【請求項15】

請求項1～3のうちのいずれか一つに記載の式(I)の化合物またはそれらの塩を植物生長調整剤として使用する方法。

#### 【請求項16】

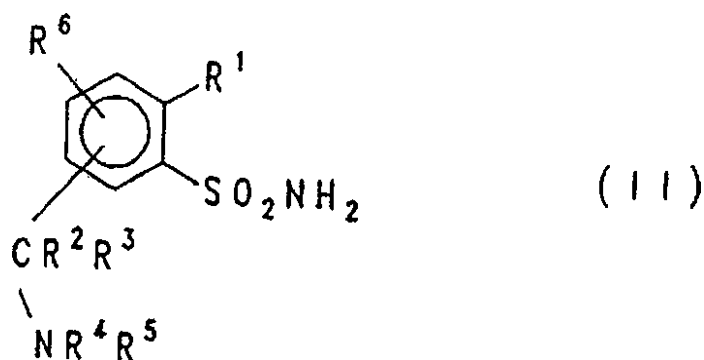
式(II)

10

20

30

40

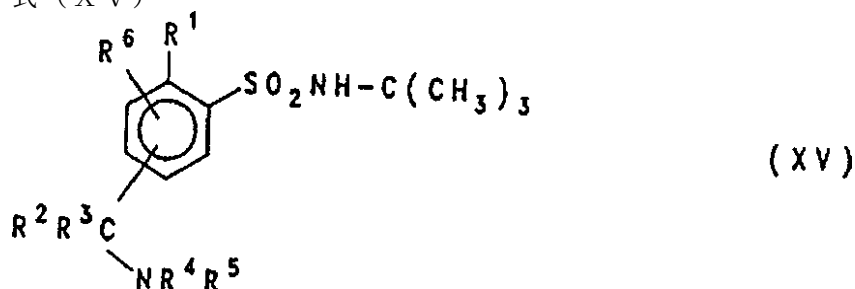


(上式中、 $R^1$ ないし $R^6$ は請求項1で式(I)について定義されたものと同一の意味を有する)

で表される化合物。

【請求項17】

式(XV)



(上式中、 $R^1$ ないし $R^6$ は請求項16で式(II)について定義されたものと同一の意味を有する)

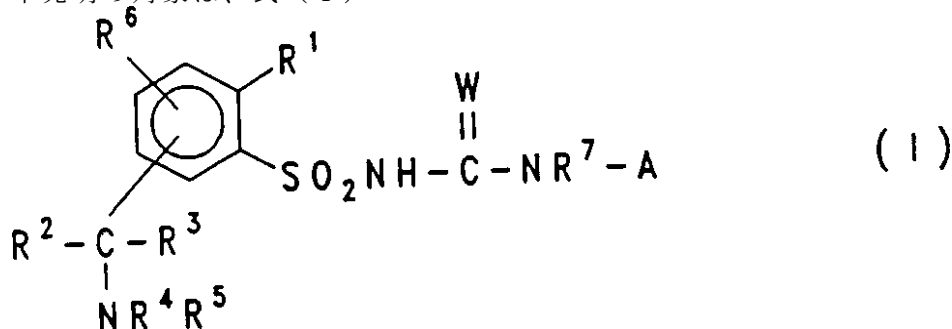
で表される化合物を第三ブチル保護基を除脱するための公知の方法によって反応させることを特徴とする請求項16に記載の式(II)で表される化合物の製造方法。

【発明の詳細な説明】

ある種のフェニルスルホニル尿素は、除草性および植物生長調整性を有することが知られている：米国特許第4,786,314号、同第4,927,453号およびWO89/10921参照。しかしながら、これらのフェニルスルホニル尿素は、それらの使用に際してある場合には重要な有用植物の栽培において例えば持続性が高いかまたは選択性が不十分であるというような欠点を示す。

フェニル環上に特定の基を有するフェニルスルホニル尿素が除草剤および植物の成長調整剤として有利に使用されうることがこの度発見された。

本発明の対象は、式(I)



(上式中、

$R^1$ は $CO-Q-R^8$ を意味し、

$R^2$ および $R^3$ は互いに無関係にHまたは $(C_1-C_4)$ アルキルを意味し、

$R^4$ はH、 $(C_1-C_8)$ アルキル〔これは非置換であるかまたはハロゲン、 $(C_1-C_4)$ アルコキシ、 $(C_1-C_4)$ アルキルチオ、 $(C_1-C_4)$ アルキルスルフィニル、 $(C_1-C_4)$ アルキルスルホニル、 $[(C_1-C_4)$ アルコキシ]カルボニルおよびCNからなる群から

10

20

30

40

50

の1個またはそれ以上の基によって置換されている} または (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>) アルケニル {これは非置換であるかまたは1個またはそれ以上のハロゲン原子によって置換されている} または (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>) アルキニル {これは非置換であるかまたは1個またはそれ以上のハロゲン原子によって置換されている}、またはヒドロキシ、(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]-カルボニルまたは(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) アルキルスルホニル {ここで後に挙げた3種の基のそれぞれは非置換であるかまたはアルキル部分において1個またはそれ以上のハロゲン原子によってまたは(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) アルコキシまたは(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) アルキルチオによって置換されている} またはフェニルスルホニル {ここでフェニル基は非置換であるかまたは好ましくはハロゲン、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>) ハロアルキルおよび(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) アルコキシからなる群からの1個またはそれ以上の基によって置換されている} を意味し、そして

10

R<sup>5</sup>は(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) アルキルスルホニルまたは(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>) アルケニルスルホニル {ここで後に挙げた2つの基のそれぞれは非置換であるかまたは1個またはそれ以上のハロゲン原子により、または(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) アルコキシまたは(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) アルキルチオによって置換されている} またはフェニルスルホニルまたはフェニルカルボニル {このフェニルスルホニルまたはフェニルカルボニル基のそれぞれにおけるフェニル基は非置換であるかまたは、好ましくはハロゲン、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>) ハロアルキルおよび(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) アルコキシからなる群からの1個またはそれ以上の基によって置換されている} またはモノ-またはジ-[(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) アルキル]-アミノスルホニルまたは[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキル]-カルボニル {ここで後に挙げた3種の基のそれぞれは非置換であるかまたはハロゲン、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) アルキルチオ、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) アルキルスルフィニル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) アルキルスルホニル、[(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) アルキル]-カルボニル、[(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) アルコキシ]-カルボニルおよびCNからなる群からの1個またはそれ以上の基によって置換されている}、またはホルミル、式-CO-CO-R' {ここでR' = H、OH、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) アルコキシまたは(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) アルキルである} で表される基または[(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>) シクロアルキル]-カルボニル、[(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>) アルケニル]-カルボニルまたは[(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>) アルキニル]-カルボニル {ここで後に挙げた3種の基のそれぞれは非置換であるかまたは1個またはそれ以上のハロゲン原子によって置換されている} または式

20



30

で表される基を意味する {その際、基CR<sup>2</sup>R<sup>3</sup>-NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>がスルホニル尿素分子のSO<sub>2</sub>基に対してパラ位に位置する場合には、R<sup>5</sup>=非置換の[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキル]-カルボニルという定義は除外される} か、または

R<sup>4</sup>およびR<sup>5</sup>は一緒に式(-CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>B-または-B<sup>1</sup>-(CH<sub>2</sub>)<sub>m1</sub>-B-で表される連鎖 {ここでこの連鎖は非置換であるかまたは1個またはそれ以上、好ましくは4個までの(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>) アルキル基で置換されており、そしてmは3または4であるかまたはm<sup>1</sup>は2または3である} を意味し、そして

40

Wは酸素-または硫黄原子(すなわちOまたはS)を意味し、

BおよびB<sup>1</sup>は互いに無関係にSO<sub>2</sub>またはCOを意味し、

QはO、Sまたは-NR<sup>13</sup>を意味し、

TはOまたはSを意味し、

R<sup>6</sup>はH、(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]-カルボニルまたは[(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) アルコキシ]-カルボニル {ここで後に挙げた4種の基のそれぞれは非置換であるかまたはアルキル部分において1個またはそれ以上のハロゲン原子によって置換されている} またはハロゲン、NO<sub>2</sub>またはCNを意味し、

R<sup>7</sup>はHまたはCH<sub>3</sub>を意味し、

50

$R^8$ はH、 $(C_1-C_4)$ アルキル、 $(C_3-C_4)$ アルケニルまたは $(C_3-C_4)$ アルキニル {ここで後に挙げた3種の基のそれぞれは非置換であるかまたはハロゲン、 $(C_1-C_4)$ アルコキシ、 $(C_1-C_4)$ アルキルチオ、 $[(C_1-C_4)$ アルキル]-カルボニルおよび $[(C_1-C_4)$ アルコキシ]-カルボニルからなる群からの1個またはそれ以上の基によって置換されている}を意味し、

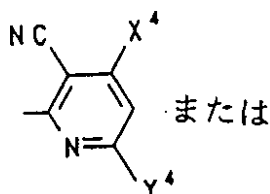
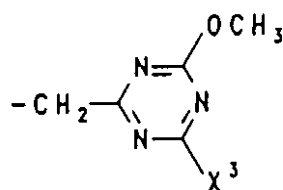
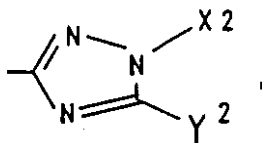
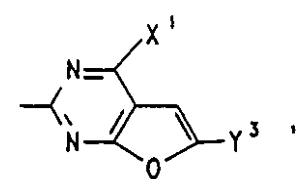
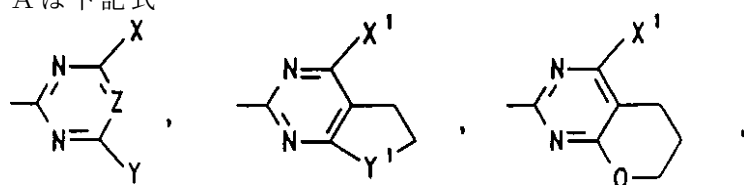
$R^9$ は $(C_1-C_4)$ アルキル、 $(C_3-C_4)$ アルケニルまたは $(C_3-C_4)$ アルケニル {ここで後に挙げた3種の基のそれぞれは非置換であるかまたはハロゲン、 $(C_1-C_4)$ アルコキシ、 $(C_1-C_4)$ アルキルチオ、 $[(C_1-C_4)$ アルキル]-カルボニルおよび $[(C_1-C_4)$ アルコキシ]-カルボニルからなる群からの1種またはそれ以上の基によって置換されている}を意味し、

$R^{10}$ および $R^{11}$ は互いに無関係にH、 $(C_1-C_4)$ アルキル、 $(C_3-C_4)$ アルケニルまたは $(C_3-C_4)$ アルキニル {ここで後に挙げた3種の基のそれぞれは非置換であるか、またはハロゲン、 $(C_1-C_4)$ アルコキシ、 $(C_1-C_4)$ アルキルチオ、 $[(C_1-C_4)$ アルキル]-カルボニルおよび $[(C_1-C_4)$ アルコキシ]-カルボニルからなる群からの1個またはそれ以上の基によって置換されている}を意味し、

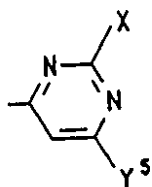
$R^{12}$ はN-原子と共に、N、Oおよび可能な酸化段階のSからなる群からのもう一つのヘテロ原子を有しうる5または6環員を有する複素環式環を形成し、そして非置換であるかまたは $(C_1-C_4)$ アルキルまたはオキシ基によって置換されているかまたはベンゾ縮合されており、

$R^{13}$ はH、 $(C_1-C_4)$ アルキル、 $(C_3-C_4)$ アルケニルまたは $(C_3-C_4)$ アルキニル {ここで後に挙げた3種の基のそれぞれは非置換であるかまたはハロゲン、 $(C_1-C_4)$ アルコキシおよび $(C_1-C_4)$ アルキルチオからなる群からの1個またはそれ以上の基によって置換されている}を意味し、

Aは下記式



または



で表される基を意味し、

基XおよびYのうちの一方は水素、ハロゲン、 $(C_1-C_3)$ アルキルまたは $(C_1-C_3)$ アルコキシ {ここで後に挙げた2つの基は非置換であるかまたはハロゲンによってモノ-またはポリ置換されまたは $(C_1-C_3)$ アルコキシによってモノ置換されている}を意味し、そして

基XおよびYのうちの他方は水素、 $(C_1-C_3)$ アルキル、 $(C_1-C_3)$ アルコキシまたは $(C_1-C_3)$ アルキルチオ {ここで後に挙げた3種のアルキル含有基は非置換であるかまたはハロゲンによってモノ-またはポリ置換されまたは $(C_1-C_3)$ アルコキシまたは $(C_1-C_3)$ アルキルチオによってモノ-またはジ置換されている}、または式 $NR^{14}R^{15}$ で表される基、 $(C_3-C_6)$ シクロアルキル、 $(C_2-C_4)$ アルケニル、 $(C_2-C_4)$ アルキニル、 $(C_3-C_4)$ アルケニルオキシまたは $(C_3-C_4)$ アルキニルオキシを意味し、

10

20

30

40

50

ZはCHまたはNを意味し、

$R^{14}$ および $R^{15}$ は互いに無関係にH、 $(C_1-C_3)$ アルキルまたは $(C_3-C_4)$ アルケニルを意味し、

$X^1$ は $CH_3$ 、 $OCH_3$ 、 $OC_2H_5$ または $OCHF_2$ を意味し、

$Y^1$ は-O-または $-CH_2-$ を意味し、

$X^2$ は $CH_3$ 、 $C_2H_5$ または $CH_2CF_3$ を意味し、

$Y^2$ は $OCH_3$ 、 $OC_2H_5$ 、 $SCH_3$ 、 $SCH_2CH_3$ 、 $CH_3$ または $C_2H_5$ を意味し、

$X^3$ は $CH_3$ または $OCH_3$ を意味し、

$Y^3$ はHまたは $CH_3$ を意味し、

$X^4$ は $CH_3$ 、 $OCH_3$ 、 $OC_2H_5$ 、 $CH_2OCH_3$ またはClを意味し、

$Y^4$ は $CH_3$ 、 $OCH_3$ 、 $OC_2H_5$ またはClを意味し、そして

$Y^5$ は $CH_3$ 、 $C_2H_5$ 、 $OCH_3$ またはClを意味する]

で表される化合物またはそれらの塩である。

式(I)および以下において、炭素骨格中のアルキル、アルコキシ、ハロアルキル、アルキルアミノおよびアルキルチオ基ならびに対応する不飽和の、および/または置換された基は、それぞれ直鎖状または分枝状でありうる。アルコキシ、ハロアルキルその他のような複合的な意味においてもアルキル基は、メチル、エチル、n-またはi-プロピル、n-

、i-、t-または2-ブチルを意味し；アルケニル-およびアルキニル基は、2-プロペニル、2-または3-ブテニル、2-プロピニル、2-または3-ブチニルのような、アルキル

基に対応する可能な不飽和基の意味を有する。ハロゲンは、フッ素、塩素、臭素またはヨウ素を意味し；ハロアルキルは、ハロゲンからなる群からの1個またはそれ以上の原子によって置換されているアルキルを意味し；ハロアルキルは、例えば、 $CF_3$ 、 $CHF_2$ 、 $CH_2CF_3$ である。置換フェニルは、例えば、F、Cl、Br、I、好ましくはF、ClおよびBrのようなハロゲン、更にアルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ

、ヒドロキシル、アミノ、ニトロ、シアノ、アルコキシカルボニル、アルキルカルボニル、ホルミル、カルバモイル、モノ-およびジアルキルアミノカルボニル、モノ-およびジアルキルアミノ、アルキルスルフィニルおよびアルキルスルホニルからなる群からの1個またはそれ以上、好ましくは1、2または3個の基によって置換されているフェニルを意味し、そしてC-原子を有する基の場合においては、1ないし4個のC-原子、特に1または2個のC-原子を有するものが好ましい。その際、一般に、ハロゲン、例えばフッ素および塩素、 $C_1-C_4$ -アルキル、好ましくはメチルまたはエチル、 $C_1-C_4$ -ハロアルキル、好ましくはトリフルオロメチル、 $C_1-C_4$ -アルコキシ、好ましくはメトキシまたはエトキシ、 $C_1-C_4$ -ハロアルコキシ、ニトロおよびシアノからなる群からの置換基が好ましい。

場合によってはベンゾ縮合されており、そして1個のN-原子を有する{例えば $N(R^{12})_2$ の場合}5-または6環員の複素環基は、飽和、不飽和の、またはヘテロ芳香族基、例えば、ピロリジル、ピペリジル、ピラゾリル、モルホリニル、インドリル、キノリニル、ピリミジニル、トリアゾリル、オキサゾリル、ピリジル、ピリミジニル、ピリダジニル、ピラジニル、チアゾリル、オキサゾリル、ピロリル、イミダゾリルおよびベンズオキサゾリルからなる群からの、N-原子を介して結合されている基である。

本発明の対象は、また式(I)によって包括されるすべての立体異性体およびそれらの混合物である。式(I)で表されるそのような化合物は、1個またはそれ以上の不斉炭素原子または一般式(I)に特に示されていない二重結合を有する。鏡像体、ジアステレオマー、Z-およびE-異性体のような、それらの特定の空間形状によって定義される可能な立体異性体は、すべて式(I)によって包括されそして通常の方法によって立体異性体の混合物から得られるか、または立体化学的に純粋な出発物質の使用と組合わされた立体選択的反応によっても製造される。

式(I)の化合物は、 $-SO_2-NH-$ 基の水素が農業に適した陽イオンによって置換されている塩を形成しうる。これらの塩は、例えば、金属塩、特にアルカリ金属塩またはアルカリ土類金属塩、特にナトリウム-およびカリウム塩、またはアンモニウム塩または有機アミンとの塩である。

式(I)の化合物は、 $-SO_2-NH-$ 基の水素が農業に適した陽イオンによって置換されている塩を形成しうる。これらの塩は、例えば、金属塩、特にアルカリ金属塩またはアルカリ土類金属塩、特にナトリウム-およびカリウム塩、またはアンモニウム塩または有機アミンとの塩である。

式(I)の化合物は、 $-SO_2-NH-$ 基の水素が農業に適した陽イオンによって置換されている塩を形成しうる。これらの塩は、例えば、金属塩、特にアルカリ金属塩またはアルカリ土類金属塩、特にナトリウム-およびカリウム塩、またはアンモニウム塩または有機アミンとの塩である。

式(I)の化合物は、 $-SO_2-NH-$ 基の水素が農業に適した陽イオンによって置換されている塩を形成しうる。これらの塩は、例えば、金属塩、特にアルカリ金属塩またはアルカリ土類金属塩、特にナトリウム-およびカリウム塩、またはアンモニウム塩または有機アミンとの塩である。

式(I)の化合物は、 $-SO_2-NH-$ 基の水素が農業に適した陽イオンによって置換されている塩を形成しうる。これらの塩は、例えば、金属塩、特にアルカリ金属塩またはアルカリ土類金属塩、特にナトリウム-およびカリウム塩、またはアンモニウム塩または有機アミンとの塩である。

式(I)の化合物は、 $-SO_2-NH-$ 基の水素が農業に適した陽イオンによって置換されている塩を形成しうる。これらの塩は、例えば、金属塩、特にアルカリ金属塩またはアルカリ土類金属塩、特にナトリウム-およびカリウム塩、またはアンモニウム塩または有機アミンとの塩である。

式(I)の化合物は、 $-SO_2-NH-$ 基の水素が農業に適した陽イオンによって置換されている塩を形成しうる。これらの塩は、例えば、金属塩、特にアルカリ金属塩またはアルカリ土類金属塩、特にナトリウム-およびカリウム塩、またはアンモニウム塩または有機アミンとの塩である。

式(I)の化合物は、 $-SO_2-NH-$ 基の水素が農業に適した陽イオンによって置換されている塩を形成しうる。これらの塩は、例えば、金属塩、特にアルカリ金属塩またはアルカリ土類金属塩、特にナトリウム-およびカリウム塩、またはアンモニウム塩または有機アミンとの塩である。

式(I)の化合物は、 $-SO_2-NH-$ 基の水素が農業に適した陽イオンによって置換されている塩を形成しうる。これらの塩は、例えば、金属塩、特にアルカリ金属塩またはアルカリ土類金属塩、特にナトリウム-およびカリウム塩、またはアンモニウム塩または有機アミンとの塩である。

式(I)の化合物は、 $-SO_2-NH-$ 基の水素が農業に適した陽イオンによって置換されている塩を形成しうる。これらの塩は、例えば、金属塩、特にアルカリ金属塩またはアルカリ土類金属塩、特にナトリウム-およびカリウム塩、またはアンモニウム塩または有機アミンとの塩である。

10

20

30

40

50

本発明による式 (I) の化合物またはそれらの塩において、特に重要なものは  $R^4$  が H、  
 ( $C_1-C_4$ ) アルキル {これは非置換であるかハロゲン、( $C_1-C_4$ ) アルコキシ、( $C_1-C_4$ )  
 アルキルチオ、( $C_1-C_4$ ) アルキルスルホニル、[( $C_1-C_4$ ) アルコキシ] -カル  
 ボニルおよび CN からなる群からの 1 個またはそれ以上の基によって置換されている} また  
 は ( $C_3-C_4$ ) アルケニル、( $C_3-C_4$ ) アルキニル、ヒドロキシ、( $C_1-C_4$ ) アルコ  
 キシ、[( $C_1-C_4$ ) アルキル] -カルボニルまたは ( $C_1-C_4$ ) アルキルスルホニル {こ  
 こで後で挙げた 5 種の基のおおのは非置換であるかまたはアルキル部分において 1 個ま  
 たはそれ以上のハロゲン原子によって置換されている} またはフェニルスルホニル {こ  
 こでフェニル基は非置換であるかまたはハロゲン、( $C_1-C_4$ ) アルキルおよび ( $C_1-C_4$ )  
 アルコキシからなる群からの 1 個またはそれ以上の基によって置換されている} を意味し 10

、そして  
 $R^5$  が ( $C_1-C_4$ ) アルキルスルホニル、( $C_1-C_4$ ) ハロアルキルスルホニル、フェニル  
 スルホニルまたはフェニルカルボニル {ここで後に挙げた 2 種の基におけるフェニル基は  
 非置換であるかまたはハロゲン、( $C_1-C_4$ ) アルキルおよび ( $C_1-C_4$ ) アルコキシから  
 なる群からの 1 個またはそれ以上の基によって置換されている} またはモノ-またはジ [  
 ( $C_1-C_4$ ) アルキル] -アミノスルホニル、[( $C_1-C_6$ ) アルキル] -カルボニル {  
 これは非置換であるかまたは 1 個またはそれ以上のハロゲン原子または ( $C_1-C_4$ ) アル  
 コキシおよび ( $C_1-C_4$ ) アルキルチオによって置換されている} またはホルミル、OH  
 C-CO-、2-オキソ- ( $C_3-C_5$ ) アルカノイル、[( $C_1-C_4$ ) アルコキシ] -オキサリ  
 ル、[( $C_3-C_6$ ) シクロアルキル] -カルボニル、[( $C_2-C_4$ ) アルケニル] -カルボニ  
 ルまたは [( $C_2-C_4$ ) アルキニル] -カルボニルまたは式 20



で表される基を意味し、

W は O または S を意味し、

$R^6$  が H、( $C_1-C_4$ ) アルキル、( $C_1-C_4$ ) ハロアルキル、( $C_1-C_4$ ) アルコキシ、( $C_1-C_4$ )  
 ハロアルコキシまたはハロゲンを意味し、 30

$R^8$  が互いに無関係に、( $C_1-C_4$ ) アルキル {これは非置換であるかまたは 1 個またはそ  
 れ以上のハロゲン原子によって置換されている}、または ( $C_3-C_4$ ) アルケニルまたは  
 ( $C_3-C_4$ ) アルキニルを意味し、

$R^9$  が H、( $C_1-C_4$ ) アルキル {これは非置換であるかまたは 1 個またはそれ以上のハロ  
 ゲン原子により、または ( $C_1-C_4$ ) アルコキシ、( $C_1-C_4$ ) アルキルチオ、[( $C_1-C_4$ )  
 アルコキシ] -カルボニルおよび [( $C_1-C_4$ ) アルキル] -カルボニルによって置換さ  
 れている} を意味し、

$R^{10}$  および  $R^{11}$  が互いに無関係に H、( $C_1-C_4$ ) アルキル {これは非置換であるかまた  
 は 1 個またはそれ以上のハロゲン原子によって置換されている}、または ( $C_3-C_4$ ) ア  
 ルケニルまたは ( $C_3-C_4$ ) アルキニル {ここで基  $R^{10}$  および  $R^{11}$  のうちの少なくとも 1 40  
 つは水素でない} を意味し、

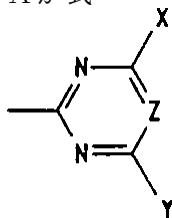
$R^{12}$  が N-原子と共に、N、O および種々の酸化段階における S からなる群からのもう一  
 つのヘテロ原子を有しうる 5 または 6 環員を有する複素環であって非置換であるかまたは  
 ( $C_1-C_4$ ) アルキルによってまたはオキソ基によって置換されているものを意味し、そ  
 して

$R^{13}$  が互いに無関係に、H、( $C_1-C_4$ ) アルキル {これは非置換であるかまたは 1 個ま  
 たはそれ以上のハロゲン原子によって置換されている} または ( $C_3-C_4$ ) アルケニルま  
 たは ( $C_3-C_4$ ) アルキニルを意味する

上記式 (I) の化合物またはそれらの塩である。

式 (I) の化合物またはそれらの塩において、好ましいものは、W が酸素原子を意味し、 50

そして  
Aが式



で表される基を意味し、ここでX、YおよびZは前記と同様な意味を有する、化合物またはそれらの塩である。

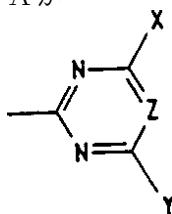
10

式(I)で表される化合物またはそれらの塩において、特に好ましいものは、  
R<sup>4</sup>がH、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル、ヒドロキシまたは(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルコキシを意味し、  
R<sup>5</sup>が(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキルスルホニル、CHO、[(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル]-カルボニル {  
これは非置換であるかまたは1個またはそれ以上のハロゲン原子によって置換されている  
} または[(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルコキシ]-オキサリル、[(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)シクロアルキル]-カル  
ボニルまたは式



20

(上記各式中、W、T、R<sup>9</sup>~R<sup>12</sup>は前記の式(I)において定義されている)  
R<sup>6</sup>がH、(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)アルコキシまたはハロゲンを意味し、  
Aが



30

で表される基を意味し、

ZがCHまたはN、好ましくはCHを意味し、そして  
基XおよびYのうちの一方がハロゲン、(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)アルコキシ、  
OCF<sub>2</sub>H、CF<sub>3</sub>またはOCH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>を意味し、そして基XおよびYのうちの他方が(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)アルコキシまたは(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)ハロアルコキシを意味する

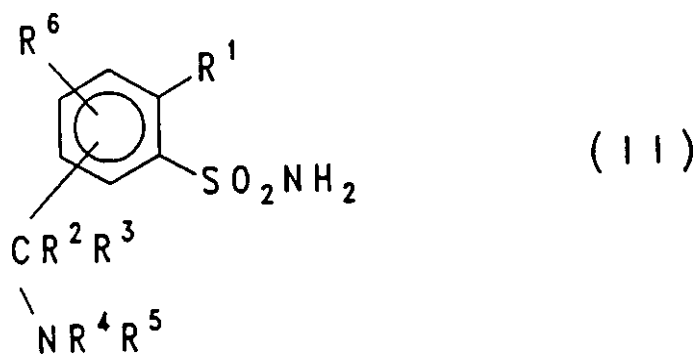
、  
上記式(I)の化合物またはそれらの塩である。

改善された製造の容易性または向上された生物活性のゆえに、基-CR<sup>2</sup>R<sup>3</sup>-NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>が基  
R<sup>1</sup>に対してオルトまたはパラ位に、またはスルホ基に対してオルト位に存在する本発明  
による式(II)の化合物またはそれらの塩が特に重要であり；その際、基-CR<sup>2</sup>R<sup>3</sup>-NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>が基R<sup>1</sup>に対してパラ位に存在するものが好ましい。

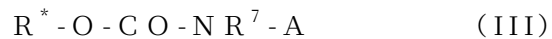
40

本発明の対象は、また、一般式(I)で表される化合物またはそれらの塩の製造方法にお  
いて、

a) 式(II)



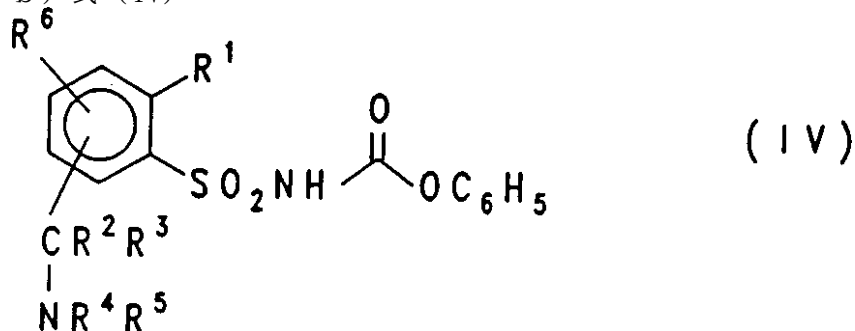
で表される化合物を式 (III)



(上式中、 $R^*$ は場合によっては置換されたフェニルまたは ( $C_1 - C_4$ ) アルキルを意味する)

と反応させるかまたは

b) 式 (IV)

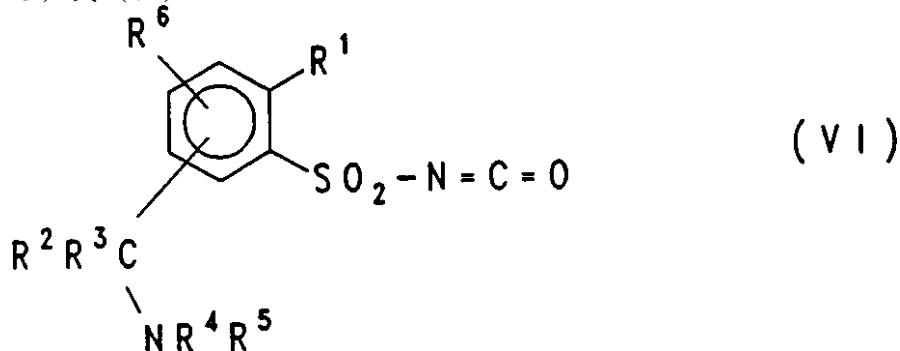


で表されるフェニルスルホニルカーバメートを式 (V)



で表されるアミノ複素環と反応させるかまたは

c) 式 (VI)



で表されるスルホニルイソシアネートで表されるアミノ複素環と反応させるかまたは

d) ワン-ポット反応において、まず式  $H - NR^7 - A$  (V) のアミノ複素環を塩基の存在下にホスゲンと反応させそして生成された中間体を式 (II) のフェニルスルホンアミドと反応させるか、または

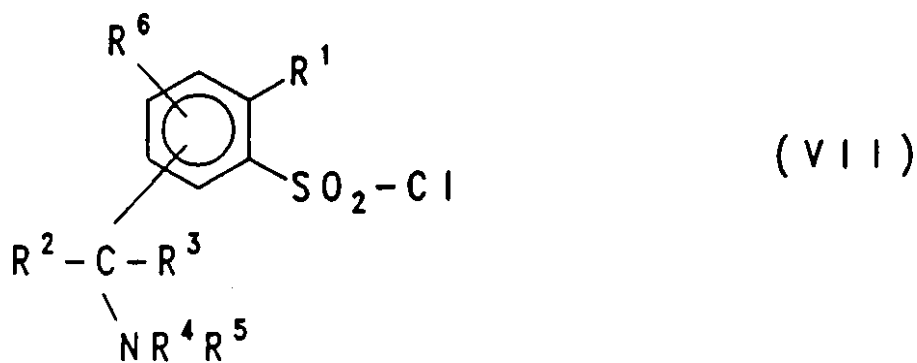
e) 式 (VII)

10

20

30

40



で表されるスルホニクロライドを  $M-OCN$  (ここで  $M$  は  $NH_4$ 、 $Na$  または  $K$  を意味する) で表されるシアネートと、そして塩基の存在下に式

$H-NR^7-A$  (V) のアミノ複素環と反応させるかまたは

f) 上記の式 (II) のスルホンアミドを塩基の存在下に

$W=C=N-A$  (V')

で表される (チオ-) イソシアネートと反応させることを特徴とする上記一般式 (I) の化合物またはそれらの塩の製造方法であり、その際、式 (II) ~ (VII) および (V')

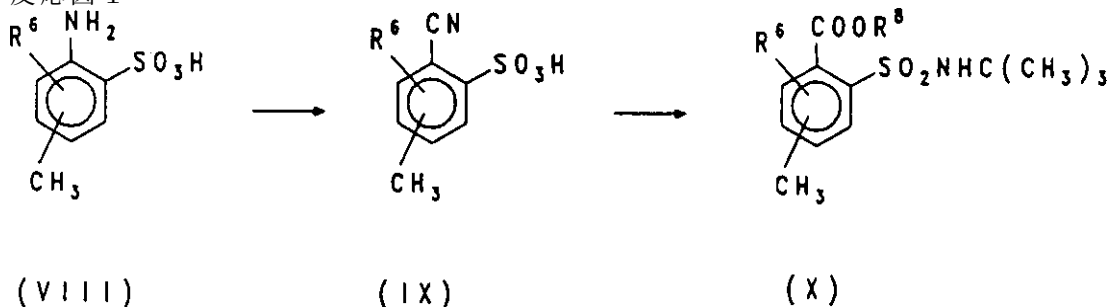
における基  $R^1 \sim R^7$ 、 $A$  または  $W$  は式 (I) と同様に定義されそして方法 a) ~ e) においてはまず  $W=O$  である式 (I) の化合物が得られる。  
式 (II) および (III) の化合物の反応は、好ましくは、不活性有機溶剤、例えばジクロロメタン、アセトニトリル、ジオキサンまたは THF 中で  $0^\circ C$  と溶媒の沸点との間の温度

において塩基性触媒を用いて実施される。その際、塩基としては例えば、1, 8-ジアザビシクロ [5. 4. 0] ウンデセン- (7) (DBU) を、特に  $R^* =$  (置換) フェニルである場合に、(ヨーロッパ特許出願公開第 4 4 8 0 7 号参照)、またはトリメチルアルミニウムまたはトリエチルアルミニウムを特に  $R^* =$  アルキルの場合に (ヨーロッパ特許第 1 6 6 5 1 6 号参照) 使用される。

スルホンアミド (II) は、新規化合物である。それらおよびそれらの製造方法もまた本発明の対象である。  
例として、 $R^2 = R^3 = H$  でありそして  $Q=O$  である化合物 (II) について、製造の可能性をより詳細に例示し、そして  $R^2$  および  $R^3$  が水素以外のものでありおよび/または  $Q$  が  $O$  以外である化合物については多少の改変もまた使用されうる。

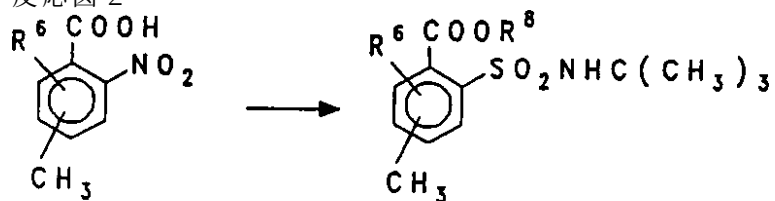
場合によっては置換されたメチルアニリンスルホン酸 (VIII) (DRP 4 8 5 8 3、第 2 4 2 頁参照) から出発して、まずジアゾ化およびサンドマイヤー反応によって  $KCN/CuCN$  を用いてニトリル (IX) へと反応させ、ニトリルのケン化、カルボン酸基のエステル化および文献から公知の方法に類似する方法でのスルホン酸基の第三ブチルで保護されたスルホンアミド基への変換によってスルホンアミド (X) が中間生成物として得られる (反応図 1 参照)。

反応図 1



更に、スルホンアミド (X) は、場合によっては置換されたメチルニトロ安息香酸 (XI) から出発して、エステル化、ニトロ基の還元、ジアゾ化および  $SO_2/CuCl$  とのカップリング [メールワインら、ヘミッシェ・ベリヒテ第 9 0 巻第 8 4 1-1 1 7 8 頁 (1 9 5 7 年) (H. Meerwein, et al., Chem. Ber. 90, 841-1178 (1957) 参照) および第三ブチルアミンを用いるアミノリシス (反応図 2 参照)。

反応図 2



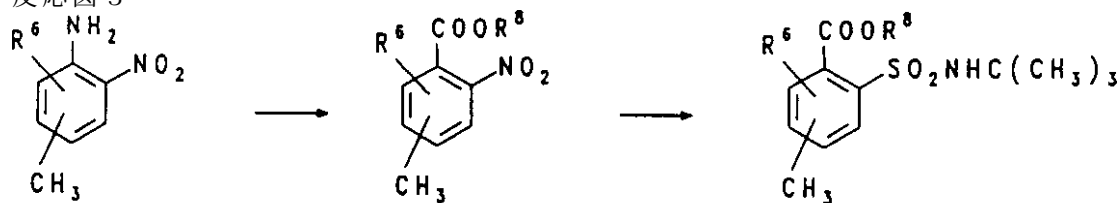
(XI)

(X)

同様に、スルホンアミド (X) は、場合によっては置換されたメチルニトロアニリン (XI I) ) から出発して製造される。ジアゾ化および KCN/CuCN とのカップリングによって対応するニトリルが得られ、これはシアノ基の加水分解およびエステル化によってニトロ安息香酸エステル (XIII) へと変換されうる。

ニトロ基は、次に反応図 2 に記載されているように、第三ブチルアミノスルホニル基に変換されうる (反応図 3 参照)。

反応図 3



(XII)

(XIII)

(X)

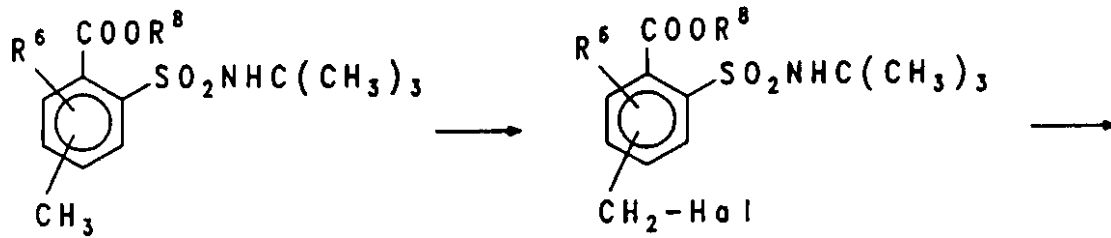
スルホンアミド (II) を製造するためには、式 (X) の化合物を側鎖のハロゲン化によって化合物 (XIV) を得、次いで (XIV) 中のハロゲン原子の置換によってアミンまたはアジドにし、次いでベンジルアミン (XV') へと還元しそしてアミノ基の官能基化および公知の方法 (例えば  $\text{CF}_3\text{COOH}$  を用いる) によって第三ブチル保護基の除去によってスルホンアミド (II') を得る (反応図 4 参照)。

反応図 4

10

20

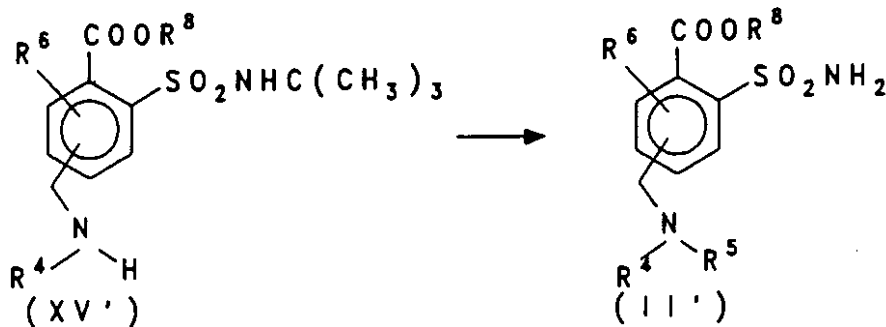
30



(X)

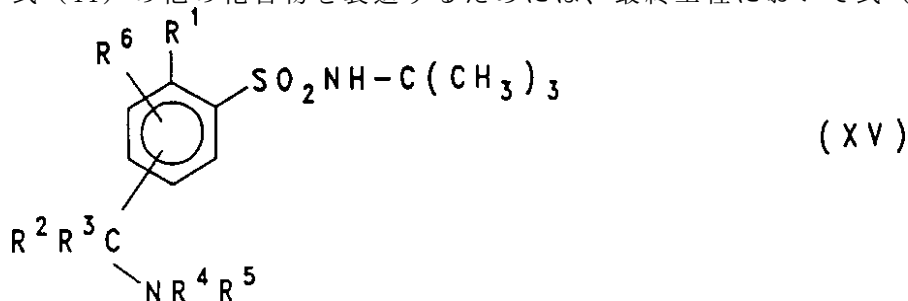
(XIV)

10



20

式 (II) の他の化合物を製造するためには、最終工程において式 (XV)



30

で表される化合物を使用する類似方法もまた使用されうる。

式 (III) で表されるカーバメートは、南アフリカ特許出願 82/5671 および 82/5045 またはヨーロッパ特許出願公開第 70804 号 (米国特許第 4,480,101 号) または RD275056 に記載されている方法に従って製造されうる。

化合物 (IV) とアミノ複素環 (V) との反応は、好ましくは、例えばジオキサン、アセトニトリルまたはテトラヒドロフロンのような不活性の、非プロトン性溶媒中で  $0^\circ\text{C}$  と溶媒の沸点との間の温度において実施される。必要な出発物質 (V) は、文献から公知であるかまたは文献公知の方法に従って製造されうる。式 (IV) のフェニルスルホニルカーバメートは、米国特許第 4684393 号または米国特許第 4743290 号に類似する方法に従って得られる。

40

式 (VI) のフェニルスルホニルイソシアネートは、米国特許第 4481029 号に類似する方法で製造され、そしてアミノ複素環 (V) と反応せしめられる。

方法 d) による式 (V) の化合物のホスゲン化は、好ましくは、立体障害性有機アミン塩基、例えばトリエチルアミンのような塩基の存在下を実施されうる。方法 d) による式 (II) の化合物との次の反応は、公知の方法に類似する方法に従って実施されうる (ヨーロッパ特許出願第 232067 号参照)。

スルクロライド (VII) は、対応するスルホン酸から、例えば

アセトニトリルおよび/またはスルホランのような不活性溶媒中でのカリウム塩とオキシ塩化リンまたは塩化チオニルとの反応のような標準的方法によって、または塊状で還流温度まで加熱することによって得られる [ハウベン-ワイル-クラマン編、「メトーデン・デ

50

ア・オルガニッシェン・ヘミー」、第4版第EXI/2巻、第1067-1073頁、ティエメ出版社1985年刊(Houben-Weyl-Klamann, "Methoden der organischen Chemie", 4. Aufl. Bd. E XI/2, S.1067-1073, Thieme Verlag Stuttgart, 1985参照)。

対応するスルホン酸は、対応するニトロ化合物から化合物(XI)の反応に類似する方法で得られる。

あるいは、個々の場合に、スルホクロライド(VII)は、適当な置換安息香酸エステルのスルホン化(+塩素化)またはスルホクロリネーション(Sulfochlorierung)によって製造される: ホウベン-ワイル-クラマン編、「メトーデン・デア・オルガニッシェン・ヘミー」第4版第E XI/2巻第1067頁以下、ティエメ出版社1985年刊(Houben-Weyl-Klamann, "Methoden der organischen Chemie", 4. Aufl. Bd. E XI/2, S.1067 ff., Thieme Verlag Stuttgart, 1985); ホウベン-ワイル-ミュラー編、「メトーデン・デア・オルガニッシェン・ヘミー」第4版第IX巻第563頁以下、ティエメ出版社1955年刊(Houben-Weyl-Mueller, "Methoden der organischen Chemie", 4. Aufl. Bd. IX, S.563 ff 1955(Thieme Verlag Stuttgart)の方法による類似する方法によるスルホクロリネーション; ホウベン-ワイル-クラマン編「メトーデン・デア・オルガニッシェン・ヘミー」第4版第E XI/2巻第1055頁以下(Houben-Weyl-Klamann, "Methoden der organischen Chemie, 4. Aufl., Bd. E XI/2, S.1055 ff. Thieme Verlag Stuttgart 1985); ホウベン-ワイル-ミュラー、「メトーデン・デア・オルガニッシェン・ヘミー」第4版第IX第435頁以下、ティエメ出版社1955年刊(Houben-Weyl-Mueller, "Methoden der organischen Chemie", 4. Aufl. Bd. IX, S.435 ff., Thieme Verlag Stuttgart)の方法に類似する方法によるスルホン化

10

20

式(V')の(チオ)イソシアネートは、文献公知の方法によって得られる(ヨーロッパ特許出願公開第232067号、同第166516号参照)。(チオ)イソシアネート(V')と化合物(II)との反応は、例えばアセトンまたはアセトニトリルのような不活性非プロトン性溶媒中で、適当な塩基、例えば $N(C_2H_5)_3$ または $K_2CO_3$ の存在下に-10℃ないし100℃、好ましくは20ないし100℃において行われる。

式(I)の化合物の塩は、好ましくは、例えば水、メタノールまたはアセトンのような不活性極性溶媒中で0-100℃の温度において製造される。本発明による塩の製造に適した塩基は、例えば、炭酸カリウムのようなアルカリ金属炭酸塩、アルカリ金属-およびアルカリ土類金属水酸化物、例えばNaOHまたはKOH、またはアンモニアまたはエタノールアミンである。

30

上記の各変法における「不活性溶媒」とは、それぞれの反応条件下では不活性であるが、任意の反応条件下では必ずしも不活性であるというわけではないようなそれぞれの溶媒を意味するものとする。

本発明による式(I)の化合物は、広範囲にわたる経済的に重要な単子葉および双子葉の有害植物に対して卓越した除草効果を示す。根茎、根の断片またはその他の多年生の器官から発芽しそして防除することの困難な多年生の雑草もまた本発明による有効物質によって効果的に防除される。その際、これらの有効物質が播種前、発芽前または発芽後のいずれの時点で施用されるかということは重要なことではない。

本発明による化合物によって防除される単子葉および双子葉の雑草群のうちからいくつかの代表例を例示として挙げることができるが、特定の種に限定することを意図するものではない。

40

単子葉に属する雑草類については、一年生植物群から、例えばカラスムギ(Avena)、ライグラス(Lolium)、スズメノテッポウ(Alopecurus)、カズノコグサ(Phalaris)、イヌビエ(Echinochloa)、メヒシバ(Digitaria)、エノコログサ(Setaria)およびカヤツリグサ(Cyperus)の類が、そして多年生の種属からカモジグサ(Agropyron)、ギョウギシバ(Cynodon)、チガヤ(Imperata)ソルガム類(Sorghum)ならびにまた宿根性のカヤツリグサ類(Cyperus)が効果的に防除される。

双子葉の雑草類の場合には、作用の範囲は、例えば、ヤエムグラ(Galium)、スミレ(Viola)、イヌノフグリ(Veronica)、ホトケグサ(Lamium)、ハコベ(Stellaria)、イヌ

50

ビエ (Amaranthus)、カラシナ (Sinapis)、イポモエア (Ipomoea)、マトリカリア (Matricaria)、アブチロン (Abutilon) およびシダ (Sida) ならびに多年生の雑草類においてはコンボルブルス (Convolvulus)、エゾノキツネアザミ (Cirsium)、スイバ (Rumex) およびヨモギ (Artemisia) にまで及ぶ。

稲作における特定の栽培条件において発生する例えばウリカワ (Sagittaria)、オモダカ (Alisma)、マツバイ (Eleocharia)、ホタルイ (Scirpus) およびカヤツリグサ (Cyperus) のような雑草類もまた本発明による有効物質によって顕著に防除される。

本発明による化合物が発芽前に土の表面に施用された場合には、雑草の実生の発芽が完全に阻止されるかあるいは雑草類は、子葉期まで成育するが次いでそれらの生長が停止し、そして最終的に3ないし4週間の経過後に完全に枯死する。

10

発芽後処理法において緑色の植物部分に有効物質が施用された場合には、処理後極めて速やかに同様に生長の急激な停止が起り、そしてこれらの雑草類は、施用の時点において存在する生長段階のまま留まるかあるいは一定の期間の後に枯死するので、栽培植物に有害な雑草の競生がこのようにして極めて早期にしかも持続的に阻止される。

本発明による化合物は、単子葉および双子葉の雑草に対して卓越した除草作用を示すけれども、例えばコムギ、オオムギ、ライムギ、イネ、トウモロコシ、テンサイ、ワタおよびダイズのような経済的に重要な作物に対しては全く葉害を与えないか無視しうる程度に軽微にしか与えない。これらの理由から、本発明による化合物は、農業用の有用植物の栽培における望ましくない植物の生長の選択的防除に極めて好適である。

更に、本発明による物質は、栽培植物において極めてすぐれた生長調整作用を示す。それらは、植物本来の物質代謝に調節的に関与し、そして従って植物内組織に対して調節するように影響を与え、また例えば乾燥および生長の阻止によって収穫を容易にするために使用されうる。更に、それらはまた望ましくない植物の生長を植物を枯死させることなく一般的に調整しそして抑制するためにも適している。多くの単子葉および双子葉の作物において、植物の生長の抑制が大きな役割を演ずる。何故ならばそれによって倒臥が減少されまたは完全に阻止されうるからである。

20

本発明による化合物は、水和剤、乳剤、噴霧用溶液、粉剤または粒剤の形態で通常の調合物として使用されうる。従って、本発明の対象は、また式 (I) で表される化合物を含有する除草剤および植物生長調整剤である。

式 (I) の化合物またはそれらの塩は、生物学および／または化学-物理的パラメーターに規定されて多種多様に調合されうる。可能な好適な調合剤としては例えば以下のものがある：

30

水和剤 (WP)、水溶性粉末 (SP)、水溶性濃縮物、乳化性濃縮物 (乳剤) (EC)、エマルジョン (EW)、例えば水中油型および油中水型エマルジョン、噴霧用溶液、懸濁濃縮物 (SC)、油または水を基剤とした分散物、油混和性溶液、カプセル懸濁物 (CS)、粉剤 (DP)、種子浸漬剤、散布用および土壌施用粒剤ミクロ粒剤、噴霧粒剤、被覆粒剤および吸着粒剤の形の粒剤 (GR)、水分散性粒剤 (WG)、水溶性粒剤 (SG)、ULV-調合物、マイクロカプセルおよびワックス。

これらの個々の製剤形態は、原理的に知られており、そして例えば下記のものに記載されている：

40

ウイナッカー-キュヒラー「化学技術」第7巻ハウザー社刊第4版1986年 (Winnacker-Kuechler, "Chemische Technologie", Band 7, C. Hauser Verlag, Muenchen, 4. Aufl. 1986) ; ワーデ・ファン・ファルケンブルグ、「農薬調合物、マルセル・デッカー社1973年刊 (Wade van Valkenburg, "Pesticide Formulations", Marcel Dekker, N.Y., 1973) ; マルテンス、「噴霧乾燥便覧」第3版1979年グッドウィン社刊 (K. Martens, "Spray Drying Handbook", 3rd Ed. 1979, G. Goodwin Ltd., London)。

不活性物質、界面活性剤、溶剤およびその他の添加剤のような必要な製剤助剤もまた知られており、例えば下記のものに記載されている：

ワトキンス編「殺虫剤粉末希釈剤および担体のハンドブック」第2版、ダーランド・ブックス社刊 (Watkins, "Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers", 2nd Ed.,

50

Darland Books, Caldwell N.J.) ; オルフエン著「粘土コロイド化学入門」第2版ウィリー社刊(H.v.Olphen, "Introduction to Clay Colloid Chemistry", 2nd Ed., J. Willey & Sons, N.Y.) ; マースデン著「溶剤ガイド」第2版インターサイエンス社1963年刊(C. Marsden, "Solvents Guide", 2nd Ed., Interscience, N.Y. 1963) ; マククチエオン編「洗剤および乳化剤年鑑」MC出版社刊(McCutcheon's "Detergents and Emulsifiers Annual", MC Publ. Corp., Ridgewood N.J.) ; シスレー、ウッド編「界面活性剤百科事典」ケミカル出版社1964年刊(Sisley and Wood, "Encyclopedia of Surface Active Agents", Chem. Publ. Co. Inc., N.Y. 1964) ; シエーンフェルト著「界面活性エチレンオキシドアダクツ」ヴィッセンシャフト出版社1976年刊(Schoenfeldt, "Grenzflaechenaktive Aethylenoxidprodukte", Wiss. Verlagsgesell., Stuttgart 1976) ; ウィナッカー-キュヒラー編「化学技術」第7巻ハウザー社刊第4版1986年(Winnacker-Kuechler, "Chemische Technologie", Band 7, C. Hauser Verlag, Muenchen, 4. Aufl. 1986)。

10

これらの調合物に基づいて、他の農薬有効物質、例えば、殺虫剤、殺ダニ剤、除草剤、殺菌剤、毒性緩和剤、肥料および／または生長調整剤との組合せもまた、例えばレディーミックスまたはタンクミックスの形態で調製される。

水和剤は、水中に均一に分散されうる調合物であって、有効物質と共に希釈剤または不活性物質のほかになおイオン性および／または非イオン性界面活性剤（湿潤剤、分散剤）、例えばポリオキシエチル化アルキルフエノール、ポリオキシエチル化脂肪アルコール、ポリオキシエチル化脂肪アミン、脂肪アルコールポリグリコールエーテルサルフェート、アルカンシルホネート、アルキルベンゼンスルホネート、リグニンスルホン酸ナトリウム、2, 2'-ジナフチルメタン-6, 6'-ジスルホン酸ナトリウム、ジブチルナフタリン-スルホン酸ナトリウムまたはオレイルメチルタウリン酸ナトリウムを含有する。水和剤を製造するためには、除草性有効物質は、例えばハンマーミル、ブローイングミルおよびエアージェットミルのような通常の装置で粉碎され、そして同時に、または次に製剤助剤と混合される。

20

乳剤は、有効物質を有機溶剤、例えばブタノール、シクロヘキサノン、ジメチルホルムアミド、キシレンまたは高沸点芳香族化合物または炭化水素又は有機溶剤の混合物に1種またはそれ以上のイオン性および／または非イオン性界面活性剤（乳化剤）を添加しながら溶解することによって調製される。乳化剤としては例えば以下のものが使用されうる：

ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウムのようなアルキルアリアルスルホン酸のカルシウム塩、または非イオン乳化剤、例えば脂肪族ポリグリコールエステル、アルキルアリアルポリグリコールエーテル、脂肪アルコールポリグリコールエーテル、プロピレンオキシド-エチレンオキシド-縮合生成物、アルキルポリエーテル、ソルビタンエステル、例えばソルビタン脂肪酸エステルまたはポリオキシエチレンソルビタンエステル、例えばポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル。

30

粉剤は、有効物質を微細に分割された固体物質、例えばタルク、天然粘土、例えばカオリン、ベントナイトおよび葉ろう石、またはケイソウ土と共に粉碎することによって得られる。

懸濁濃縮物は、水系または油系でありうる。それらは例えば市販のビーズミルを用いて湿潤粉碎し、そして場合によっては、例えば上記の他の調合物の場合にすでに挙げられたような界面活性剤を添加することによって製造されうる。

40

エマルジョン、例えば水中油型エマルジョン（EW）は、例えば、攪拌機、コロイドミルおよび／または固定ミキサーを用いて、水性有機溶媒および場合によっては、例えば上記の他の調合物についてすでに挙げたような界面活性剤の使用の下に製造される。

粒剤は、吸着性の粒状不活性物質に有効物質を噴霧するかまたは砂、カオリナイトまたは粒状不活性物質のような担体物質の表面上に、例えばポリビニルアルコール、ポリアクリル酸ナトリウムまたは鉱油のような接着剤を用いて有効物質濃縮物を塗布することによって製造されうる。適当な有効物質を粒状肥料の製造にとって通例の方法で、所望ならば肥料との混合物として粒状化することもできる。

水分散性粒剤は、一般に、噴霧乾燥、流動床造粒、ディスク造粒、高速ミキサーによる混

50

合および固体の不活性物質を用いない押出しのような通常の方法によって製造される。ディスク、流動床、押出しおよび噴霧による粒状物については、例えば、「噴霧乾燥ハンドブック」第3版1979年グッドウィン社刊(“Spray-Drying Handbook” 3rd Ed.1979, G. Goodwin Ltd., London); ブローニング「アグロメレーション」、ケミカル・アンド・エンジニアリング誌1967年第147頁以下(J. E. Browning, “Agglomeration”, Chemical and Engineering 1967, pp.147 ff); 「ペリー編化学工学ハンドブック」第5版マグローヒル社1973年刊pp.8-57(“Perry's Chemical Engineer's Handbook”, 5th Ed., McGraw-Hill, New York 1973, pp.8-57)を参照されたい。

植物保護剤の製剤についてのその他の詳細については、例えば、クリングマン著「科学としての雑草防除」ジョンウィリー社1961年刊第81-96頁(G. C. Klingman, “Weed Control as a Science”, John Willy and Sons, Inc., New York, 1961, pp.81-96)およびフライエヴァンス共著「雑草防除ハンドブック」第5版ブラックウェル科学出版社1968年刊第101-103頁(J. D. Freyer, S. A. Evans, “Weed Control Handbook”, 5th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1968, pp.101-103)を参照されたい。 10

本発明による農薬調合物は、原則として、式(I)の有効物質0.1ないし99重量%、特に0.1ないし95重量%を含有する。

水和剤においては、有効物質の濃度は、例えば、約10ないし90重量%であり、100重量%までの残りは、通常の調合成分からなる。乳剤の場合には、有効物質の濃度は、約1ないし90重量%、好ましくは5ないし80重量%でありうる。粉剤は約1ないし30重量%、好ましくは大抵5ないし20重量%の有効物質を含有し、噴霧用溶液は、約0. 20 05ないし80重量%、好ましくは2ないし50重量%の有効物質を含有する。水分散性粒剤の場合には、有効物質の含有量は、一部有効化合物が液体であるかまたは固体であるか、そしていかなる造粒助剤、充填剤その他が使用されるかということに依存する。水分散性粒剤の場合には、有効物質の含有量は、例えば1ないし95重量%、好ましくは10ないし80重量%である。

更に、上記の有効物質の調合物は、場合によっては、それぞれの場合に通例の接着剤、湿潤剤、分散剤、乳化剤、浸透剤、防腐剤、凍結防止剤、溶剤、充填剤、担体、着色剤、泡止め剤、蒸発抑制剤およびpHおよび粘度調節剤を含有する。

混合調合物またはタンクミックスにおいて本発明による有効物質のための組合せ成分としては、例えば、「ウイード・リサーチ」第26巻第441-445頁(1986年)(Weed 30 Research, 26, 441-445(1986))、または「農薬便覧」、第9版英国作物保護協議会編(“The Pesticide Manual”, 9th Ed. The British Crop Protection Council, 1990/91, Bracknell, England)および同書に引用された文献に記載されている有効物質が使用されうる。式

(I)の化合物と組合せられうる文献公知の除草剤としては、例えば以下の有効物質が挙げられる(註：これらの化合物は、国際標準化機構(International Organization for Standardization (ISO)による「一般名称(common name)または場合によっては通常のコッド番号と共に、化学名によって示されている)：

アセトクロール；アシフルオルフエン；アクロニフエン；AKH7088、すなわち、〔〔〔1-〔5-〔2-クロロ-4-(トリフルオロメチル)-フエノキシ〕-2-ニトロフェニル〕-2-メトキシエチリデン〕-アミノ-〕オキシ〕-酢酸および-酢酸メチルエステル；アラ 40 クロール；アロキシジム；アメトリン；アミドスルフロン；アミトロール；AMS、すなわち、スルフアミン酸アンモニウム；アニロホス；アスラム；アトラジン；アジムスルフロン(DPX-A8947)；アジプロトリン；バルバン；BAS516H、すなわち、5-フルオロ-2-フェニル-4H-3, 1-ベンズオキサジン-4-オン；ベナゾリン；ベンフルラリン；ベンフレセート；ベンスルフロン-メチル；ベンスリド；ベントゾン；ベンゾフェナップ；ベンゾフルオール；ベンゾイルプロップ-エチル；ベンズチアズロン；ビアラホス；ピフエノックス；プロマシル；プロモブチド；プロモフェノキシム；プロモキシニル；プロムロン；ブミナホス；ブソキシノン；ブタクロール；ブタミホス；ブテナクロール；ブチダゾール；ブトラリン；ブチレート；カフエンストロール(CH-900)；カルベタミド；カフエントラゾン(ICI-A0051)CDA A、すなわち、2-クロロ 50

-N, N-ジ-2-プロペニルアセトアミド; C D E C、すなわちジエチルジチオカルバミン酸-2-クロロアリルエステル; クロメトキシフエン; クロラムベン; クロラジフオップ-ブチル; クロルメスロン (I C I-A 0 0 5 1); クロルブロムロン; クロルブフアム; クロルフエナック; クロルフルレコール-メチル; クロリダゾン; クロリムロン-エチル; クロニトロフエン; クロロトルロン; クロロキシウロン; クロルプロフアム; クロルスルフロン; クロルタル-ジメチル; クロルチアミド; シンメチリン; シノスルフロン; クレソジウム; クロジナホップおよびそのエステル誘導体 (例えばクロジナホップ-プロパルギル); クロマゾン; クロメプロップ; クロプロキシジウム; クロピラリド; クミルロン (J C 9 4 0); シアナジン; シクロエート; シクロスルフアムロン (A C 1 0 4); シクロキシジウム; シクルロン; シハロホップおよびそのエステル誘導体 (例えばブチルエステル、D E H-1 1 2); シベルクアット; シブラジン; シブラゾール; ダイムロン; 2, 4-DB; ダラポン; デスメジファン; デスメトリン; ジ-アレート; ジカンバ; ジクロベニル; ジクロルプロップ; ジクロホップおよびジクロホップ-メチルのようなそのエステル; ジエタチル; ジフエノクスウロン; ジフエンゾクワット; ジフルフエニカン; ジメフロン; ジメタクロル; ジメタメトリン; ジメテンアミド (S A N-5 8 2 H); ジメタゾン; クロマゾン; ジメチピン; ジメトラスルフロン; ジニトラミン; ジノセブ; ジノテルブ; ジフエナミド; ジプロペトリン; ジクワット; ジチオピル; ジウロン; D N O C; エグリナジン-エチル; E L 1 7 7、すなわち、5-シアノ-1-(1, 1-ジメチルエチル)-N-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド; エンドタール; E P T C; エスプロカルブ; エタルフルラリン; エタメトスルフロン-メチル; エチジウムロン; エチオジン; エトフメセート; F 5 2 3 1、すなわちN-[2-クロロ-4-フルオロ-5-[4-(3-フルオロプロピル)-4, 5-ジヒドロ-5-オキソ-1H-テトラゾール-1-イル]-フェニル]-エタンスルホンアミド; エトキシフエンおよびそのエステル (例えば、エチルエステル、H N-2 5 2); エトベンザニド (H W 5 2); フェノプロップ; フェノキサプロップ; フェノキサン; およびフェノキサプロップ-Pならびにそのエステル、例えばフェノキサプロップ-P-エチルおよびフェノキサプロップ-エチル; フェノキシジウム; フェヌロン; フラムプロップ-メチル; フラザスルフロン; フルアジホップおよびフルアジホップ-Pおよびそのエステル、例えばフルアジホップ-ブチルおよびフルアジホップ-P-ブチル; フルクロラリン; フルメトスラム; フルメチュロン; フルミクラックおよびそのエステル (例えば、ベンチルエステル、S-2 3 0 3 1); フルミオキサジン (S-4 8 2); フルミプロピン; フルポキサム (K N W-7 3 9); フルオロジフエン; フルオログリコフエン-エチル; フルプロパシル (U B I C-4 2 4 3); フルリドン; フルクロロリドン; フルロキシピール; フルルタモン; ホメサフエン; ホサミン; フリルオキシフエン; グルホシネート; グホセート; ハロサテン; ハロスルフロンおよびそのエステル (例えばメチルエステル、N C-3 1 9); ハロキシホップおよびそのエステル; ハロキシホップ-P (= R-ハロキシホップ) およびそのエステル; ヘキサジノン; イマザメタベンズ-メチル; イマザピール; イマザキンおよびアンモニウム塩のような塩; イマゼタメタピール; イマゼタピール; イマゾスルフロン; イオキシニル; イソカルバミド; イソプロパリン; イソプロチュロン; イソウロン; イソキサベン; イソキサピリホップ; カルブチレート; ラクトフエン; レナシル; リニューロン; M C P A; M C P B; メコプロップ; メフエナセット; メフルイディッド; メタミトロン; メタザクロル; メタベンズチアズロン; メタム; メタゾール; メトキシフエノン; メチルジウムロン; メタベンズロン; メトベンズロン; メトブロムロン; メトラクロル; メトスラム (X R D 5 1 1); メトクスロン; メトリブジン; メトスルフロン-メチル; M H; モリネート; モナリド; 硫酸二水素モノカルバミド; モノリヌロン; モヌロン; M T 1 2 8、すなわち、6-クロロ-N-(3-クロロ-2-プロペニル)-5-メチル-N-フェニル-3-ピリダジナミン; M T 5 9 5 0、すなわちN-[3-クロロ-4-(1-メチルエチル)-フェニル]-2-メチルペンタミド; ナプロアニリド; ナプロパミド; ナプタラム; N C 3 1 0、すなわち、4-(2, 4-ジクロロベンゾイル)-1-メチル-5-ベンジルオキシピラゾール; ネブロン; ニコスルフロン; ニピラクロフエン; ニトラリン; ニトロフエン; ニトロフルオルフエン; ノルフルラゾン; オルベンカルブ; オリ

10

20

30

40

50

ザリン；オキサジアジル（R P-0 2 0 6 3 0）；オキサジアゾン；オキシフルオルフエン；パラクワット；ペブレート；ペンジメタリン；ペルフルイドン；フェンイソフアム；フェンメジフアム；ピクロラム；ピペロホス；ピリブチカルブ；ピリフエノップ-ブチル；プレチラクロル；プリミスルフロ-メチル；プロシアジン；プロジアミン；プロフニクラリン；プログリナジン-エチル、プロメトン；プロメトリン；プロバクロル；プロパニル；プロパキザホップおよびそのエステル；プロパジン；プロフアム；プロピソクロル；プロピザミド；プロスルファリン；プロスルホカルブ；プロスルフロ-（C G A-1 5 2 0 0 5）；プリナクロル；ピラゾリネート；ピラゾン；ピラゾスルフロ-エチル；ピラゾキシフエン；ピリデート；ピリチオバック（K I H-2 0 3 1）；ピロキソホップおよびそのエステル（例えばプロパルギルエステル）；キンクロラック；キンメラック；キノホップおよびそのエステル誘導体、キザロホップおよびキザロホップ-Pおよびそのエステル誘導体、例えばキザロホップ-エチル；キザロホップ-P-テフリルおよび-エチル；レンリズロン；リムスルフロ-（D P X-E 9 6 3 6）；S 2 7 5、すなわち、2-[4-クロル-2-フルオロ-5-(2-プロピニルオキシ)-フェニル]-4, 5, 6, 7-テトラヒドロ-2H-インダゾール；セクブメトン；セトキシジム；シズロン；シマジン；シメトリン；S N 1 0 6 2 7 9、すなわち、2-[7-[2-クロロ-4-(トリフルオロ-メチル)-フェノキシ]-2-ナフタレニル]-オキシ]-プロパン酸およびメチルエステル；スルフェントラゾン（F M C-9 7 2 8 5、F-6 2 8 5）；スルファズロン；スルホメチュロン-メチル；スルホセート（I C I-A 0 2 2 4）；T C A；テブタム（G C P-5 5 4 4）；テブチウロン；テルバシル；テルブカルブ；テルブクロル；テルブメトン；テルブチラジン；テルブトリン；T F H 4 5 0、すなわち、N, N-ジエチル-3-[2-エチル-6-メチルフェニル]-スルホニル]-1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-カルボキサミド；テニルクロル（N S K-8 5 0）；チアザフルロン；チゾピル（M o n-1 3 2 0 0）；チジアジミン（S N-1 2 4 0 8 5）；チフェンスルフロ-メチル；チオベンカルブ；チカルバジル；トラルコキシジム；トリ-アレート；トリアスルフロ-；トリアゾフェンアミド；トリベヌロン-メチル；トリクロピール；トリジファン；トリエタジン；トリフルラリン；トリフルスルフロ-およびエステル（例えばメチルエステル、D P X-6 6 0 3 7）；トリメチュロン；トシトデフ；ヴェルノレート；W L 1 1 0 5 4 7、すなわち、5-フェノキシ-1-[3-(トリフルオロメチル)-フェニル]-1H-テトラゾール；U B H-5 0 9；D-4 8 9；L S 8 2-5 5 6；K P P-3 0 0；N C-3 2 4；N C-3 3 0；K H-2 1 8；D P X-N 8 1 8 9；S C-0 7 7 4；D O W C O-5 3 5；D K-8 9 1 0；V-5 3 4 8 2；P P-6 0 0；M B H-0 0 1；K I H-9 2 0 1；E T-7 5 1；K I H-6 1 2 7およびK I H-2 0 2 3。

市販される形態で存在する調合物は、使用に際して場合によっては通常の方法で、例えば水和剤、乳剤、分散剤および水分散性粒剤の場合には水で希釈される。粉剤、土壌用または散布用粒剤および噴霧用溶液は、通常、使用前に他の不活性物質でもはやそれ以上希釈されることはない。

式（I）の化合物の必要な使用量は、温度、湿度、使用される除草剤の種類その他のような外的条件によって変えられる。それは、広い範囲内において、例えば、有効物質0.001ないし10.0kg/haまたはそれ以上の間で、しかし好ましくは0.005ないし5kg/haの間で変えることができる。

A. 化合物製造例

略語：百分率および割合は、特記しない限り重量に関するものとする。

i. v. = 減圧下

h = 時間

例 A 1

N-第三ブチル-5-ブロムメチル-2-メトキシカルボニルベンゼンスルホンアミド

N-ブロモサクシンイミド36g（202mmol）およびアゾビスイソブチロニトリル（AIBN）0.5gの添加を昼光電球の照射を同時に行いながら実施した後に、テトラクロロメタン420ml中、N-第三ブチル-2-メトキシカルボニル-5-メチルベンゼン

10

20

30

40

50

スルホンアミド 54.8 g (192 mmol) の溶液を窒素の保護ガスの雰囲気中で還流温度で 6～8 時間加熱する。次に、この溶液を濾過し、そして二硫化ナトリウム溶液、炭酸水素ナトリウムおよび水で順次洗滌し、 $\text{Na}_2\text{SO}_4$  上で乾燥しそして減圧下に蒸発乾固する。残渣をジイソプロピルエーテル／酢酸エチルから結晶化すると、融点 88-90 °C の N-第三ブチル-5-ブロモメチル-2-メトキシカルボニルベンゼンスルホンアミド 41.9 g (57%) が得られる。

#### 例 A 2

N-第三ブチル-5-アジドメチル-2-メトキシカルボニル-ベンゼンスルホンアミド  
エタノール 240 ml 中、N-第三ブチル-5-ブロモメチル-2-メトキシカルボニルベン  
ゼンスルホンアミド 25.5 g (70 mmol) およびアジ化ナトリウム 5.9 g (90  
mmol) の溶液を還流温度で 6 時間加熱する。次にこの溶液を蒸発乾固し、そして残渣  
を水／酢酸エチルを用いて抽出する。粗生成物をジイソプロピルエーテルと共に浸漬する  
と、融点 63-65 °C の N-第三ブチル-5-アジドメチル-2-メトキシカルボニルベンゼ  
ンスルホンアミド 16.6 g (72.5%) が得られる。

10

#### 例 A 3

N-第三ブチル-5-アミノメチル-2-メトキシカルボニルベンゼンスルホンアミド  
N-第三ブチル-5-アミノメチル-2-メトキシカルボニルベンゼンスルホンアミド 16  
.3 g (50 mmol) をメタノール 300 ml 中に溶解し、そして Pd/C (5%) 上  
で水素化する。この混合物を濾過しそして蒸発乾固する。得られた粗生成物を 4:1 の割  
合で酢酸エチルエステル／メタノールを用いるシリカゲルカラムを通す溶離によって精製  
する。粘稠な油状物として N-第三ブチル-5-アミノメチル-2-メトキシカルボニルベン  
ゼンスルホンアミド 11.2 g (74%) が得られる。

20

$^1\text{H}$  NMR (100 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ):  $\delta$  = 1.25 (s, 9H,  $\text{C}(\text{CH}_3)_3$ )、  
1.80 (bs, 2H,  $\text{NH}_2$ )、3.95 (s, 3H,  $\text{OCH}_3$ )、4.00 (s, 2H,  
Ar- $\text{CH}_2$ )、6.20 (bs, 1H,  $\text{SO}_2\text{NH}$ )、7.58 (dd, 1H, Ar-H)、  
7.80 (d, 1H, Ar-H)、8.10 (dd, 1H, Ar-H)。

#### 例 A 4

N-第三ブチル-5-アセトアミドメチル-2-メトキシカルボニルベンゼンスルホンアミド  
ジクロロメタン 30 ml 中の N-第三ブチル-5-アミノメチル-2-メトキシカルボニルベ  
ンゼンスルホンアミド 2.01 g (6.7 mmol) およびトリエチルアミン 0.93 m  
l (6.7 mmol) の 0 °C に冷却した溶液に、ジクロロメタン 10 ml 中に溶解された  
塩化アセチル 0.63 g (8 mmol) を滴加し、そして次に室温において 2 時間攪拌を  
続ける。反応溶液を水で洗滌し、そして減圧下に蒸発乾固する。粘稠な油状物として N-  
第三ブチル-5-アセトアミドメチル-2-メトキシカルボニルベンゼンスルホンアミド 2.  
1 g (91%) が得られる。

30

$^1\text{H}$  NMR (100 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ):

$\delta$  = 1.25 (s, 9H,  $\text{C}(\text{CH}_3)_3$ )、2.05 (s, 3H,  $\text{COCH}_3$ )、3.9  
5 (s, 3H,  $\text{OCH}_3$ )、4.50 (s, 2H, Ar- $\text{CH}_2$ )、6.15 (s, 1H,  
 $\text{SO}_2\text{NH}$ )、6.38 (bt, 1H, NH)、7.47 (dd, 1H, Ar-H)、7.  
75 (d, 1H, Ar-H)、7.95 (dd, 1H, Ar-H)。

40

#### 例 A 5

5-アセトアミドメチル-2-メトキシカルボニルベンゼンスルホンアミド  
トリフルオロ酢酸 25 ml 中、N-第三ブチル-5-アセトアミドメチル-2-メトキシカル  
ボニルベンゼンスルホンアミド 2.09 g (6.0 mmol) の溶液を室温において 14  
時間攪拌し、次いで蒸発乾固する。残渣を酢酸エチルから結晶化すると、融点 173-1  
75 °C の 5-アセトアミドメチル-2-メトキシカルボニルベンゼンスルホンアミド 1.3  
3 g (76%) が得られる。

#### 例 A 6

N-[4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)アミノカルボニル]-5-アセトアミドメチ  
ル-2-メトキシカルボニルベンゼンスルホンアミド

50

アセトニトリル 20 ml 中、5-アセトアミドメチル-2-メトキシカルボニルベンゼンスルホンアミド 1.3 g (4.54 mmol) および N-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル) フェニルカーバメート 1.25 g (4.54 mmol) の懸濁物に、1,8-ジアザビシクロ〔5,4,0〕ウンデセン-(7) (DBU) 0.69 g (4.54 mmol) を 0℃において添加する。室温において2時間の後に水およびジエチルエーテルで希釈し、塩酸で pH 1~2 まで酸性化しそして得られた沈澱物を濾別しそして乾燥する。融点 149-150℃の N-〔(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル) アミノカルボニル〕-5-アセトアミドメチル-2-メトキシカルボニルベンゼンスルホンアミド 1.32 g (62%) が得られる。

以下の表 1~4 に記載された式 (I) の化合物 (W=O、A=ピリミジニルまたはトリアジニル) は、例 A 1 ないし A 6 に類似する方法で得られる。表中に用いられた略語は、次のとおりである： 10

Fp. =℃で表された融点

Vb. =化合物番号=例番号

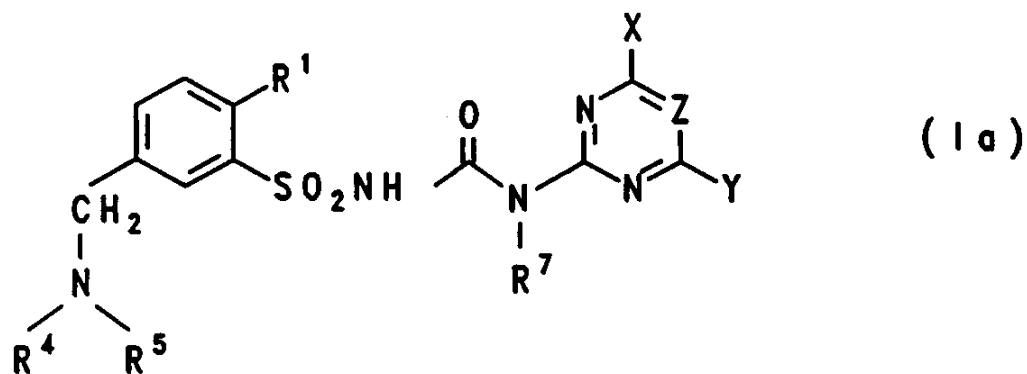
Me =メチル = CH<sub>3</sub>

Et =エチル

Bu = n-Bu = n-ブチル = n-C<sub>4</sub>H<sub>9</sub>

Ph =フェニル

表 1



| Vb. | R <sup>1</sup>                  | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup> | R <sup>7</sup> | X                                | Y                                | Z  | Fp. °C  |
|-----|---------------------------------|----------------|----------------|----------------|----------------------------------|----------------------------------|----|---------|
| 1   | CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H              | CHO            | H              | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                 | CH | 124-125 |
| 2   | "                               | "              | "              | H              | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                  | CH |         |
| 3   | "                               | "              | "              | H              | CH <sub>3</sub>                  | CH <sub>3</sub>                  | CH |         |
| 4   | "                               | "              | "              | H              | CH <sub>3</sub>                  | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | CH |         |
| 5   | "                               | "              | "              | H              | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                 | N  |         |
| 6   | "                               | "              | "              | H              | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                  | N  |         |
| 7   | "                               | "              | "              | H              | OCH <sub>3</sub>                 | Cl                               | CH |         |
| 8   | "                               | "              | "              | H              | OCF <sub>2</sub> H               | CH <sub>3</sub>                  | CH |         |
| 9   | "                               | "              | "              | H              | OCF <sub>2</sub> H               | OCF <sub>2</sub> H               | CH |         |
| 10  | "                               | "              | "              | H              | OCH <sub>3</sub>                 | Br                               | CH |         |
| 11  | "                               | "              | "              | H              | OCH <sub>3</sub>                 | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | CH |         |
| 12  | "                               | "              | "              | H              | OCH <sub>3</sub>                 | SCH <sub>3</sub>                 | CH |         |
| 13  | "                               | "              | "              | H              | OCH <sub>3</sub>                 | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | N  |         |
| 14  | "                               | "              | "              | H              | OCH <sub>3</sub>                 | OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>   | CH |         |
| 15  | "                               | "              | "              | H              | CH <sub>3</sub>                  | Cl                               | CH |         |
| 16  | "                               | "              | "              | H              | Cl                               | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | CH |         |
| 17  | "                               | "              | "              | H              | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | CH |         |
| 18  | "                               | "              | "              | H              | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>    | OCH <sub>3</sub>                 | CH |         |
| 19  | "                               | "              | "              | H              | CF <sub>3</sub>                  | OCH <sub>3</sub>                 | CH |         |
| 20  | "                               | "              | "              | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>                  | CH |         |
| 21  | "                               | "              | "              | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                 | CH |         |
| 22  | "                               | "              | "              | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | CH |         |
| 23  | "                               | "              | "              | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                 | N  |         |

| Vb. | R <sup>1</sup> | R <sup>4</sup>  | R <sup>5</sup>    | R <sup>7</sup>  | X                                | Y                                  | Z  | Fp. °C  |
|-----|----------------|-----------------|-------------------|-----------------|----------------------------------|------------------------------------|----|---------|
| 24  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | CH(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CH |         |
| 25  | "              | "               | "                 | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | CH |         |
| 26  | "              | "               | "                 | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | N  |         |
| 27  | "              | H               | COCH <sub>3</sub> | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | CH | 149-150 |
| 28  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | CH |         |
| 29  | "              | "               | "                 | H               | CH <sub>3</sub>                  | CH <sub>3</sub>                    | CH |         |
| 30  | "              | "               | "                 | H               | CH <sub>3</sub>                  | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | CH | 10      |
| 31  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | N  |         |
| 32  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | N  |         |
| 33  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | Cl                                 | CH |         |
| 34  | "              | "               | "                 | H               | OCF <sub>2</sub> H               | CH <sub>3</sub>                    | CH |         |
| 35  | "              | "               | "                 | H               | OCF <sub>2</sub> H               | OCF <sub>2</sub> H                 | CH |         |
| 36  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | Br                                 | CH |         |
| 37  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | CH |         |
| 38  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | SCH <sub>3</sub>                   | CH | 20      |
| 39  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | N  |         |
| 40  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>     | CH |         |
| 41  | "              | "               | "                 | H               | CH <sub>3</sub>                  | Cl                                 | CH |         |
| 42  | "              | "               | "                 | H               | Cl                               | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | CH |         |
| 43  | "              | "               | "                 | H               | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | CH |         |
| 44  | "              | "               | "                 | H               | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>    | OCH <sub>3</sub>                   | CH |         |
| 45  | "              | "               | "                 | H               | CF <sub>3</sub>                  | OCH <sub>3</sub>                   | CH |         |
| 46  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>                    | CH |         |
| 47  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                   | CH | 30      |
| 48  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>   | CH |         |
| 49  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                   | N  |         |
| 50  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | CH(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CH |         |
| 51  | "              | "               | "                 | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | CH |         |
| 52  | "              | "               | "                 | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | N  |         |
| 53  | "              | CH <sub>3</sub> | CHO               | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | CH | 171-175 |
| 54  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | CH | 135-140 |
| 55  | "              | "               | "                 | H               | CH <sub>3</sub>                  | CH <sub>3</sub>                    | CH | 123-126 |
| 56  | "              | "               | "                 | H               | CH <sub>3</sub>                  | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | CH | 40      |
| 57  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | N  |         |
| 58  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | N  | 105     |

| Vb. | R <sup>1</sup> | R <sup>4</sup>  | R <sup>5</sup>    | R <sup>7</sup>  | X                                | Y                                  | Z  | Fp.°C   |
|-----|----------------|-----------------|-------------------|-----------------|----------------------------------|------------------------------------|----|---------|
| 59  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | Cl                                 | CH | 125-130 |
| 60  | "              | "               | "                 | H               | OCF <sub>2</sub> H               | CH <sub>3</sub>                    | CH |         |
| 61  | "              | "               | "                 | H               | OCF <sub>2</sub> H               | OCF <sub>2</sub> H                 | CH |         |
| 62  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | Br                                 | CH |         |
| 63  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | CH |         |
| 64  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | SCH <sub>3</sub>                   | CH |         |
| 65  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | N  | 10      |
| 66  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>     | CH |         |
| 67  | "              | "               | "                 | H               | CH <sub>3</sub>                  | Cl                                 | CH |         |
| 68  | "              | "               | "                 | H               | Cl                               | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | CH |         |
| 69  | "              | "               | "                 | H               | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | CH |         |
| 70  | "              | "               | "                 | H               | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>    | OCH <sub>3</sub>                   | CH |         |
| 71  | "              | "               | "                 | H               | CF <sub>3</sub>                  | OCH <sub>3</sub>                   | CH |         |
| 72  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>                    | CH |         |
| 73  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                   | CH | 20      |
| 74  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>   | CH |         |
| 75  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                   | N  |         |
| 76  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | CH(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CH |         |
| 77  | "              | "               | "                 | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | CH |         |
| 78  | "              | "               | "                 | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | N  |         |
| 79  | "              | CH <sub>3</sub> | COCH <sub>3</sub> | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | CH | 146-149 |
| 80  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | CH |         |
| 81  | "              | "               | "                 | H               | CH <sub>3</sub>                  | CH <sub>3</sub>                    | CH |         |
| 82  | "              | "               | "                 | H               | CH <sub>3</sub>                  | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | CH | 30      |
| 83  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | N  |         |
| 84  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | N  |         |
| 85  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | Cl                                 | CH |         |
| 86  | "              | "               | "                 | H               | OCF <sub>2</sub> H               | CH <sub>3</sub>                    | CH |         |
| 87  | "              | "               | "                 | H               | OCF <sub>2</sub> H               | OCF <sub>2</sub> H                 | CH |         |
| 88  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | Br                                 | CH |         |
| 89  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | CH |         |
| 90  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | SCH <sub>3</sub>                   | CH | 40      |
| 91  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | N  |         |
| 92  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>     | CH |         |
| 93  | "              | "               | "                 | H               | CH <sub>3</sub>                  | Cl                                 | CH |         |

| Vb. | R <sup>1</sup> | R <sup>4</sup>  | R <sup>5</sup>                  | R <sup>7</sup>  | X                                | Y                                  | Z  | Fp. °C  |
|-----|----------------|-----------------|---------------------------------|-----------------|----------------------------------|------------------------------------|----|---------|
| 94  | "              | "               | "                               | H               | Cl                               | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | CH |         |
| 95  | "              | "               | "                               | H               | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | CH |         |
| 96  | "              | "               | "                               | H               | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>    | OCH <sub>3</sub>                   | CH |         |
| 97  | "              | "               | "                               | H               | CF <sub>3</sub>                  | OCH <sub>3</sub>                   | CH |         |
| 98  | "              | "               | "                               | H               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>                    | CH |         |
| 99  | "              | "               | "                               | H               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                   | CH |         |
| 100 | "              | "               | "                               | H               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>   | CH | 10      |
| 101 | "              | "               | "                               | H               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                   | N  |         |
| 102 | "              | "               | "                               | H               | OCH <sub>3</sub>                 | CH(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CH |         |
| 103 | "              | "               | "                               | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | CH |         |
| 104 | "              | "               | "                               | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | N  |         |
| 105 | "              | H               | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | CH | 192-194 |
| 106 | "              | "               | "                               | H               | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | CH |         |
| 107 | "              | "               | "                               | H               | CH <sub>3</sub>                  | CH <sub>3</sub>                    | CH |         |
| 108 | "              | "               | "                               | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | N  | 20      |
| 109 | "              | "               | "                               | H               | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | N  |         |
| 110 | "              | "               | "                               | H               | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | NHCH <sub>3</sub>                  | N  |         |
| 111 | "              | "               | "                               | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | CH |         |
| 112 | "              | "               | "                               | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | N  |         |
| 113 | "              | CH <sub>3</sub> | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | CH | 107-109 |
| 114 | "              | "               | "                               | H               | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | CH |         |
| 115 | "              | "               | "                               | H               | CH <sub>3</sub>                  | CH <sub>3</sub>                    | CH |         |
| 116 | "              | "               | "                               | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | N  |         |
| 117 | "              | "               | "                               | H               | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | N  | 30      |
| 118 | "              | "               | "                               | H               | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | NHCH <sub>3</sub>                  | N  |         |
| 119 | "              | "               | "                               | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | CH |         |
| 120 | "              | "               | "                               | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | N  |         |
| 121 | "              | OH              | CHO                             | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | CH |         |
| 122 | "              | "               | "                               | H               | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | CH |         |
| 123 | "              | "               | "                               | H               | CH <sub>3</sub>                  | CH <sub>3</sub>                    | CH |         |
| 124 | "              | "               | "                               | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | N  |         |
| 125 | "              | "               | "                               | H               | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | N  | 40      |
| 126 | "              | "               | "                               | H               | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | NHCH <sub>3</sub>                  | N  |         |
| 127 | "              | "               | "                               | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | CH |         |
| 128 | "              | "               | "                               | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | N  |         |

| Vb. | R <sup>1</sup> | R <sup>4</sup>   | R <sup>5</sup>                     | R <sup>7</sup>  | X                              | Y                 | Z  | Fp. °C  |
|-----|----------------|------------------|------------------------------------|-----------------|--------------------------------|-------------------|----|---------|
| 129 | "              | OCH <sub>3</sub> | CHO                                | H               | OCH <sub>3</sub>               | OCH <sub>3</sub>  | CH | 142-145 |
| 130 | "              | "                | "                                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | CH <sub>3</sub>   | CH |         |
| 131 | "              | "                | "                                  | H               | CH <sub>3</sub>                | CH <sub>3</sub>   | CH |         |
| 132 | "              | "                | "                                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | OCH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 133 | "              | "                | "                                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | CH <sub>3</sub>   | N  |         |
| 134 | "              | "                | "                                  | H               | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | NHCH <sub>3</sub> | N  |         |
| 135 | "              | "                | "                                  | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>               | OCH <sub>3</sub>  | CH | 10      |
| 136 | "              | "                | "                                  | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>               | CH <sub>3</sub>   | N  |         |
| 137 | "              | OH               | COCH <sub>3</sub>                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | OCH <sub>3</sub>  | CH |         |
| 138 | "              | "                | "                                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | CH <sub>3</sub>   | CH |         |
| 139 | "              | "                | "                                  | H               | CH <sub>3</sub>                | CH <sub>3</sub>   | CH |         |
| 140 | "              | "                | "                                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | OCH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 141 | "              | "                | "                                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | CH <sub>3</sub>   | N  |         |
| 142 | "              | "                | "                                  | H               | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | NHCH <sub>3</sub> | N  |         |
| 143 | "              | "                | "                                  | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>               | OCH <sub>3</sub>  | CH |         |
| 144 | "              | "                | "                                  | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>               | CH <sub>3</sub>   | N  | 20      |
| 145 | "              | OCH <sub>3</sub> | COCH <sub>3</sub>                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | OCH <sub>3</sub>  | CH | 195-196 |
| 146 | "              | "                | "                                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | CH <sub>3</sub>   | CH |         |
| 147 | "              | "                | "                                  | H               | CH <sub>3</sub>                | CH <sub>3</sub>   | CH |         |
| 148 | "              | "                | "                                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | OCH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 149 | "              | "                | "                                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | CH <sub>3</sub>   | N  |         |
| 150 | "              | "                | "                                  | H               | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | NHCH <sub>3</sub> | N  |         |
| 151 | "              | "                | "                                  | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>               | OCH <sub>3</sub>  | CH |         |
| 152 | "              | "                | "                                  | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>               | CH <sub>3</sub>   | N  | 30      |
| 153 | "              | H                | COC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>    | H               | OCH <sub>3</sub>               | OCH <sub>3</sub>  | CH | 150-152 |
| 154 | "              | "                | "                                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | CH <sub>3</sub>   | CH |         |
| 155 | "              | "                | "                                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | OCH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 156 | "              | "                | "                                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | CH <sub>3</sub>   | N  |         |
| 157 | "              | CH <sub>3</sub>  | "                                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | OCH <sub>3</sub>  | CH |         |
| 158 | "              | "                | "                                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | CH <sub>3</sub>   | CH |         |
| 159 | "              | "                | "                                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | OCH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 160 | "              | "                | "                                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | CH <sub>3</sub>   | N  |         |
| 161 | "              | H                | COCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub> | H               | OCH <sub>3</sub>               | OCH <sub>3</sub>  | CH | 40      |
| 162 | "              | "                | "                                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | CH <sub>3</sub>   | CH |         |
| 163 | "              | "                | "                                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | OCH <sub>3</sub>  | N  |         |

| Vb. | R <sup>1</sup> | R <sup>4</sup>  | R <sup>5</sup>                                  | R <sup>7</sup> | X                | Y                | Z  | Fp. °C  |
|-----|----------------|-----------------|-------------------------------------------------|----------------|------------------|------------------|----|---------|
| 164 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 165 | "              | CH <sub>3</sub> | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |         |
| 166 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |         |
| 167 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |         |
| 168 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 169 | "              | H               | COCO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |         |
| 170 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH | 10      |
| 171 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |         |
| 172 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 173 | "              | CH <sub>3</sub> | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |         |
| 174 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |         |
| 175 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |         |
| 176 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 177 | "              | H               | COCF <sub>3</sub>                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 158     |
| 178 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH | 20      |
| 179 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |         |
| 180 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 181 | "              | CH <sub>3</sub> | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 144-147 |
| 182 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |         |
| 183 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |         |
| 184 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 185 | "              | H               | COOCH <sub>3</sub>                              | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 160-161 |
| 186 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |         |
| 187 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  | 30      |
| 188 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 189 | "              | CH <sub>3</sub> | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 157-159 |
| 190 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |         |
| 191 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |         |
| 192 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 193 | "              | H               | CONHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |         |
| 194 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |         |
| 195 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  | 40      |
| 196 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 197 | "              | CH <sub>3</sub> | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |         |
| 198 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |         |

| Vb. | R <sup>1</sup> | R <sup>4</sup>                                                       | R <sup>5</sup>                                   | R <sup>7</sup> | X                | Y                | Z  | Fp. °C  |
|-----|----------------|----------------------------------------------------------------------|--------------------------------------------------|----------------|------------------|------------------|----|---------|
| 199 | "              | "                                                                    | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |         |
| 200 | "              | "                                                                    | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 201 | "              | H                                                                    | CSNHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |         |
| 202 | "              | "                                                                    | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |         |
| 203 | "              | "                                                                    | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |         |
| 204 | "              | "                                                                    | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 205 | "              | CH <sub>3</sub>                                                      | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 10      |
| 206 | "              | "                                                                    | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |         |
| 207 | "              | "                                                                    | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |         |
| 208 | "              | "                                                                    | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 209 | "              | H                                                                    | SO <sub>2</sub> NHCH <sub>3</sub>                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |         |
| 210 | "              | "                                                                    | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |         |
| 211 | "              | "                                                                    | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |         |
| 212 | "              | "                                                                    | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 213 | "              | CH <sub>3</sub>                                                      | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 171-173 |
| 214 | "              | "                                                                    | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH | 20      |
| 215 | "              | "                                                                    | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |         |
| 216 | "              | "                                                                    | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 217 | "              | H                                                                    | SO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 162     |
| 218 | "              | "                                                                    | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |         |
| 219 | "              | "                                                                    | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |         |
| 220 | "              | "                                                                    | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 221 | "              | CH <sub>3</sub>                                                      | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 127-129 |
| 222 | "              | "                                                                    | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH | 30      |
| 223 | "              | "                                                                    | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |         |
| 224 | "              | "                                                                    | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 225 | "              | -CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CO-                 |                                                  | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |         |
| 226 | "              | "                                                                    |                                                  | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |         |
| 227 | "              | "                                                                    |                                                  | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |         |
| 228 | "              | "                                                                    |                                                  | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 229 | "              | -CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> -   |                                                  | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |         |
| 230 | "              | "                                                                    |                                                  | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |         |
| 231 | "              | "                                                                    |                                                  | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  | 40      |
| 232 | "              | "                                                                    |                                                  | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 233 | "              | -CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CO- |                                                  | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |         |

| Vb. | R <sup>1</sup> | R <sup>4</sup>                                                                     | R <sup>5</sup>                  | R <sup>7</sup> | X                | Y                | Z  | Fp. °C  |
|-----|----------------|------------------------------------------------------------------------------------|---------------------------------|----------------|------------------|------------------|----|---------|
| 234 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |         |
| 235 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |         |
| 236 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 237 | "              | -CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> - | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |         |
| 238 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |         |
| 239 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |         |
| 240 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  | 10      |
| 241 | "              | -CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -                | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |         |
| 242 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |         |
| 243 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |         |
| 244 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 245 | "              | H                                                                                  | COC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |         |
| 246 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |         |
| 247 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |         |
| 248 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 249 | "              | CH <sub>3</sub>                                                                    | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 20      |
| 250 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |         |
| 251 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |         |
| 252 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 253 | "              | H                                                                                  | COCH <sub>2</sub> Cl            | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 144-145 |
| 254 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |         |
| 255 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |         |
| 256 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 257 | "              | CH <sub>3</sub>                                                                    | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 138-140 |
| 258 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH | 30      |
| 259 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |         |
| 260 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 261 | "              | H                                                                                  | COCHCl <sub>2</sub>             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |         |
| 262 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |         |
| 263 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |         |
| 264 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 265 | "              | CH <sub>3</sub>                                                                    | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |         |
| 266 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH | 40      |
| 267 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |         |
| 268 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |

| Vb. | R <sup>1</sup> | R <sup>4</sup>                                | R <sup>5</sup>                                | R <sup>7</sup> | X                | Y                | Z  | Fp. °C |
|-----|----------------|-----------------------------------------------|-----------------------------------------------|----------------|------------------|------------------|----|--------|
| 269 | "              | H                                             | COCCl <sub>3</sub>                            | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 270 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 271 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 272 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 273 | "              | CH <sub>3</sub>                               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 274 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 275 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  | 10     |
| 276 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 277 | "              | H                                             | COCH=CH <sub>2</sub>                          | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 278 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 279 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 280 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 281 | "              | CH <sub>3</sub>                               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 282 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 283 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  | 20     |
| 284 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 285 | "              | H                                             | COC≡CH                                        | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 286 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 287 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 288 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 289 | "              | CH <sub>3</sub>                               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 290 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 291 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 292 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  | 30     |
| 293 | "              | H                                             | COC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 294 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 295 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 296 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 297 | "              | CH <sub>3</sub>                               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 298 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 299 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 300 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  | 40     |
| 301 | "              | SO <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | SO <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 302 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 303 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |

| Vb. | R <sup>1</sup> | R <sup>4</sup>                  | R <sup>5</sup>                                | R <sup>7</sup> | X                | Y                | Z  | Fp. °C |
|-----|----------------|---------------------------------|-----------------------------------------------|----------------|------------------|------------------|----|--------|
| 304 | "              | "                               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 305 | "              | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 306 | "              | "                               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 307 | "              | "                               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 308 | "              | "                               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 309 | "              | H                               | COCH <sub>2</sub> Br                          | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 310 | "              | "                               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  | 10     |
| 311 | "              | CH <sub>3</sub>                 | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 312 | "              | "                               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 313 | "              | H                               | COCH <sub>2</sub> F                           | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 314 | "              | "                               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 315 | "              | CH <sub>3</sub>                 | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 316 | "              | "                               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 317 | "              | H                               | COCH <sub>2</sub> C≡CH                        | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 318 | "              | "                               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 319 | "              | CH <sub>3</sub>                 | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 20     |
| 320 | "              | "                               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 321 | "              | H                               | COCO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 322 | "              | "                               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 323 | "              | CH <sub>3</sub>                 | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 324 | "              | "                               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 325 | "              | H                               | CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 326 | "              | "                               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 327 | "              | CH <sub>3</sub>                 | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 30     |
| 328 | "              | "                               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 329 | "              | H                               | COSCH <sub>3</sub>                            | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 330 | "              | "                               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 331 | "              | CH <sub>3</sub>                 | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 332 | "              | "                               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 333 | "              | H                               | CSOCH <sub>3</sub>                            | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 334 | "              | "                               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 335 | "              | CH <sub>3</sub>                 | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 336 | "              | "                               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  | 40     |
| 337 | "              | H                               | CSSCH <sub>3</sub>                            | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 338 | "              | "                               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |

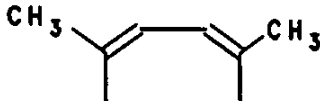
| Vb. | R <sup>1</sup> | R <sup>4</sup>  | R <sup>5</sup>                         | R <sup>7</sup> | X                | Y                | Z  | Fp. °C |
|-----|----------------|-----------------|----------------------------------------|----------------|------------------|------------------|----|--------|
| 339 | "              | CH <sub>3</sub> | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 340 | "              | "               | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 341 | "              | H               | COCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>    | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 342 | "              | "               | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 343 | "              | CH <sub>3</sub> | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 344 | "              | "               | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 345 | "              | H               | COC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>     | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 10     |
| 346 | "              | "               | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 347 | "              | CH <sub>3</sub> | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 348 | "              | "               | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 349 | "              | H               | CO-Cyclopropyl                         | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 350 | "              | "               | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 351 | "              | CH <sub>3</sub> | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 352 | "              | "               | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 353 | "              | H               | CO-Cyclobutyl                          | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 20     |
| 354 | "              | "               | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 355 | "              | CH <sub>3</sub> | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 356 | "              | "               | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 357 | "              | H               | CO-Cyclopentyl                         | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 358 | "              | "               | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 359 | "              | CH <sub>3</sub> | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 360 | "              | "               | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 361 | "              | H               | CO-Cyclohexyl                          | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 362 | "              | "               | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  | 30     |
| 363 | "              | CH <sub>3</sub> | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 364 | "              | "               | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 365 | "              | H               | CONHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 366 | "              | "               | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 367 | "              | CH <sub>3</sub> | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 368 | "              | "               | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 369 | "              | H               | CSNHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 370 | "              | "               | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  | 40     |
| 371 | "              | CH <sub>3</sub> | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 372 | "              | "               | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 373 | "              | H               | CONH-n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>   | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |

| Vb. | R <sup>1</sup> | R <sup>4</sup>           | R <sup>5</sup>                                      | R <sup>7</sup> | X                | Y                | Z  | Fp. °C |
|-----|----------------|--------------------------|-----------------------------------------------------|----------------|------------------|------------------|----|--------|
| 374 | "              | "                        | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 375 | "              | CH <sub>3</sub>          | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 376 | "              | "                        | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 377 | "              | H                        | CSNHCH <sub>3</sub>                                 | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 378 | "              | "                        | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 379 | "              | CH <sub>3</sub>          | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 380 | "              | "                        | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  | 10     |
| 381 | "              | H                        | CSNHCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 382 | "              | "                        | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 383 | "              | CH <sub>3</sub>          | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 384 | "              | "                        | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 385 | "              | CH <sub>3</sub>          | CSNHCH <sub>2</sub> COCH <sub>3</sub>               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 386 | "              | "                        | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 387 | "              | CH <sub>3</sub>          | CSNHCH <sub>2</sub> COC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 388 | "              | "                        | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  | 20     |
| 389 | "              | CH <sub>3</sub>          | CONHCH <sub>2</sub> COCH <sub>3</sub>               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 390 | "              | "                        | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 391 | "              | CH <sub>3</sub>          | CONHCH <sub>2</sub> COC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 392 | "              | "                        | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 393 | "              | -CONHCH <sub>2</sub> CO- |                                                     | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 394 | "              | "                        |                                                     | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 395 | "              | H                        | SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F                   | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 396 | "              | "                        | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 397 | "              | CH <sub>3</sub>          | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 30     |
| 398 | "              | "                        | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 399 | "              | H                        | SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                     | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 400 | "              | "                        | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 401 | "              | CH <sub>3</sub>          | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 402 | "              | "                        | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 403 | "              | H                        | SO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>       | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 404 | "              | "                        | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 405 | "              | CH <sub>3</sub>          | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 406 | "              | "                        | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  | 40     |
| 407 | "              | H                        | SO <sub>2</sub> -n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>    | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 408 | "              | "                        | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |

| Vb. | R <sup>1</sup> | R <sup>4</sup>   | R <sup>5</sup>                                  | R <sup>7</sup> | X                | Y                | Z  | Fp. °C  |
|-----|----------------|------------------|-------------------------------------------------|----------------|------------------|------------------|----|---------|
| 409 | "              | CH <sub>3</sub>  | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |         |
| 410 | "              | "                | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 411 | "              | OH               | COC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                 | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |         |
| 412 | "              | "                | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 413 | "              | OCH <sub>3</sub> | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |         |
| 414 | "              | "                | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 415 | "              | OH               | COCH <sub>2</sub> Cl                            | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 10      |
| 416 | "              | "                | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 417 | "              | OCH <sub>3</sub> | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |         |
| 418 | "              | "                | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 419 | "              | OH               | COCF <sub>3</sub>                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |         |
| 420 | "              | "                | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 421 | "              | OCH <sub>3</sub> | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 159-161 |
| 422 | "              | "                | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 423 | "              | OH               | COCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>              | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 20      |
| 424 | "              | "                | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 425 | "              | OCH <sub>3</sub> | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 130-131 |
| 426 | "              | "                | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 427 | "              | OH               | COCO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |         |
| 428 | "              | "                | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 429 | "              | OCH <sub>3</sub> | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 158-159 |
| 430 | "              | "                | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 431 | "              | OH               | COOCH <sub>3</sub>                              | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |         |
| 432 | "              | "                | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  | 30      |
| 433 | "              | OCH <sub>3</sub> | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 137-138 |
| 434 | "              | "                | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 435 | "              | OH               | Cyclopropyl                                     | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |         |
| 436 | "              | "                | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 437 | "              | OCH <sub>3</sub> | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 118-120 |
| 438 | "              | "                | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 439 | "              | OH               | COC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                 | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |         |
| 440 | "              | "                | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 441 | "              | OCH <sub>3</sub> | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 40      |
| 442 | "              | "                | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 443 | "              | OH               | COCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |         |

| Vb. | R <sup>1</sup> | R <sup>4</sup>                | R <sup>5</sup>                                   | R <sup>7</sup> | X                | Y                | Z  | Fp. °C     |
|-----|----------------|-------------------------------|--------------------------------------------------|----------------|------------------|------------------|----|------------|
| 444 | "              | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |            |
| 445 | "              | OCH <sub>3</sub>              | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 126-128    |
| 446 | "              | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |            |
| 447 | "              | OH                            | COCH=CH <sub>2</sub>                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |            |
| 448 | "              | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |            |
| 449 | "              | OCH <sub>3</sub>              | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |            |
| 450 | "              | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  | 10         |
| 451 | "              | OH                            | COC≡CH                                           | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |            |
| 452 | "              | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |            |
| 453 | "              | OCH <sub>3</sub>              | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |            |
| 454 | "              | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |            |
| 455 | "              | OH                            | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                  | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |            |
| 456 | "              | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |            |
| 457 | "              | OCH <sub>3</sub>              | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 146-148    |
| 458 | "              | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  | 20         |
| 459 | "              | OH                            | SO <sub>2</sub> NHCH <sub>3</sub>                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |            |
| 460 | "              | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |            |
| 461 | "              | OCH <sub>3</sub>              | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 179-180    |
| 462 | "              | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |            |
| 463 | "              | OH                            | SO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |            |
| 464 | "              | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |            |
| 465 | "              | OCH <sub>3</sub>              | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 179-180    |
| 466 | "              | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |            |
| 467 | "              | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | CHO                                              | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 168-170 30 |
| 468 | "              | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |            |
| 469 | "              | "                             | COCH <sub>3</sub>                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |            |
| 470 | "              | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |            |
| 471 | "              | "                             | Cyclopropyl                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |            |
| 472 | "              | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |            |
| 473 | "              | "                             | COCH <sub>2</sub> Cl                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |            |
| 474 | "              | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |            |
| 475 | "              | "                             | COCF <sub>3</sub>                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |            |
| 476 | "              | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  | 40         |
| 477 | "              | "                             | COOCH <sub>3</sub>                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |            |
| 478 | "              | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |            |

| Vb. | R <sup>1</sup>                                | R <sup>4</sup>                | R <sup>5</sup>                                   | R <sup>7</sup> | X                | Y                | Z  | Fp. °C  |    |
|-----|-----------------------------------------------|-------------------------------|--------------------------------------------------|----------------|------------------|------------------|----|---------|----|
| 479 | "                                             | "                             | COC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                  | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |         |    |
| 480 | "                                             | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |    |
| 481 | "                                             | "                             | CONHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |         |    |
| 482 | "                                             | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |    |
| 483 | "                                             | "                             | CSNHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |         |    |
| 484 | "                                             | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |    |
| 485 | "                                             | "                             | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                  | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 154-155 | 10 |
| 486 | "                                             | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |    |
| 487 | "                                             | "                             | SO <sub>2</sub> NHCH <sub>3</sub>                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 150-152 |    |
| 488 | "                                             | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |    |
| 489 | "                                             | "                             | SO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |         |    |
| 490 | "                                             | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |    |
| 491 | "                                             | "                             | SO <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>    | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |         |    |
| 492 | "                                             | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |    |
| 493 | CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | H                             | CHO                                              | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |         | 20 |
| 494 | "                                             | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |    |
| 495 | "                                             | "                             | COCH <sub>3</sub>                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |         |    |
| 496 | "                                             | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |    |
| 497 | "                                             | "                             | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                  | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |         |    |
| 498 | "                                             | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |    |
| 499 | "                                             | CH <sub>3</sub>               | CHO                                              | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |         |    |
| 500 | "                                             | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |    |
| 501 | "                                             | "                             | COCH <sub>3</sub>                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |         |    |
| 502 | "                                             | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         | 30 |
| 503 | "                                             | "                             | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                  | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |         |    |
| 504 | "                                             | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |    |
| 505 | "                                             | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | CHO                                              | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |         |    |
| 506 | "                                             | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |    |
| 507 | "                                             | "                             | COCH <sub>3</sub>                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |         |    |
| 508 | "                                             | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |    |
| 509 | "                                             | "                             | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                  | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |         |    |
| 510 | "                                             | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         | 40 |
| 511 | "                                             | OH                            | CHO                                              | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |         |    |
| 512 | "                                             | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |    |
| 513 | "                                             | "                             | COCH <sub>3</sub>                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |         |    |

| Vb. | R <sup>1</sup>                     | R <sup>4</sup>                                                                      | R <sup>5</sup>                  | R <sup>7</sup> | X                                | Y                                | Z  | Fp. °C           |
|-----|------------------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------|---------------------------------|----------------|----------------------------------|----------------------------------|----|------------------|
| 514 | "                                  | "                                                                                   | "                               | H              | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                  | N  |                  |
| 515 | "                                  | "                                                                                   | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H              | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                 | CH |                  |
| 516 | "                                  | "                                                                                   | "                               | H              | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                  | N  |                  |
| 517 | "                                  | OCH <sub>3</sub>                                                                    | CHO                             | H              | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                 | CH |                  |
| 518 | "                                  | "                                                                                   | "                               | H              | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                  | N  |                  |
| 519 | "                                  | "                                                                                   | COCH <sub>3</sub>               | H              | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                 | CH |                  |
| 520 | "                                  | "                                                                                   | "                               | H              | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                  | N  | 10               |
| 521 | CO <sub>2</sub> -n-Bu              | H                                                                                   | CHO                             | H              | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                 | CH |                  |
| 522 | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CH <sub>3</sub>                                                                     | CHO                             | H              | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                  | N  |                  |
| 523 | CONHCH <sub>3</sub>                | H                                                                                   | CHO                             | H              | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                 | CH |                  |
| 524 | COSCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                                                                     | COCH <sub>3</sub>               | H              | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                  | N  |                  |
| 525 | CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>    | n-Bu                                                                                | CHO                             | H              | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                 | CH |                  |
| 526 | "                                  | "                                                                                   | "                               | H              | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                  | N  |                  |
| 527 | "                                  | H                                                                                   | "                               | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | N  |                  |
| 528 | "                                  | CH <sub>3</sub>                                                                     | "                               | H              | "                                | "                                | N  | 20               |
| 529 | "                                  | H                                                                                   | COCH <sub>3</sub>               | H              | "                                | "                                | "  |                  |
| 530 | "                                  | CH <sub>3</sub>                                                                     | "                               | H              | "                                | "                                | "  |                  |
| 531 | "                                  | "                                                                                   | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H              | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                 | CH |                  |
| 532 | "                                  | "                                                                                   | "                               | H              | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                  | N  |                  |
| 533 | CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>    |  |                                 | H              | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                 | CH |                  |
| 534 | "                                  | "                                                                                   | "                               | H              | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                  | N  | 30               |
| 535 | CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>    | CH <sub>3</sub>                                                                     | CHO                             | H              | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                 | CH | Na- 塩<br>236-238 |
| 536 | CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>    | H                                                                                   | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H              | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                 | CH | Na- 塩<br>170-173 |
| 537 | CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>    | CH <sub>3</sub>                                                                     | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H              | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                 | CH | Na- 塩<br>191     |
| 538 | CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>    | OCH <sub>3</sub>                                                                    | CHO                             | H              | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                 | CH | Na- 塩<br>215-216 |
| 539 | CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>    | OCH <sub>3</sub>                                                                    | COCH <sub>3</sub>               | H              | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                 | CH | Na- 塩<br>224-225 |

10

20

30

40

| Vb. | R <sup>1</sup>                  | R <sup>4</sup>                | R <sup>5</sup>                                   | R <sup>7</sup> | X                | Y                | Z  | Fp. °C           |
|-----|---------------------------------|-------------------------------|--------------------------------------------------|----------------|------------------|------------------|----|------------------|
| 540 | CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H                             | COOCH <sub>3</sub>                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | Na- 塩<br>203-205 |
| 541 | CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>               | SO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | Na- 塩<br>122     |
| 542 | CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>               | CONHEt                                           | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | Na- 塩<br>190-192 |
| 543 | CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>               | CONHEt                                           | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 150-152          |
| 544 | CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>               | CONHEt                                           | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |                  |
| 545 | CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H                             | CONHEt                                           | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |                  |
| 546 | CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H                             | CONHEt                                           | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |                  |
| 547 | CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |                               | -CO-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -CO-         | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 220-221          |
| 548 | CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |                               | -CO-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -CO-         | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |                  |
| 549 | CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |                               | -CO-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -CO-         | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |                  |
| 550 | CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |                               | -CO-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -CO-         | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |                  |
| 551 | CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |                               | -CO-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -CO-         | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | Na- 塩<br>210-212 |
| 552 | CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>              | COCF <sub>3</sub>                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | Na- 塩<br>228-229 |
| 553 | CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>              | COOCH <sub>3</sub>                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | Na- 塩<br>184-185 |
| 554 | CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>              | Cyclopropyl                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | Na- 塩<br>216     |
| 555 | CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>              | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                  | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | Na- 塩<br>183-185 |
| 556 | CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | CHO                                              | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | Na- 塩<br>237-239 |
| 557 | CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | Cyclopropyl                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | Na- 塩<br>178-180 |
| 558 | CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | COCCl <sub>3</sub>                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 109-111          |
| 559 | CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | COCCl <sub>3</sub>                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | Na- 塩<br>174-176 |
| 560 | CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | COCCl <sub>3</sub>                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |                  |
| 561 | CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | COCOOCH <sub>3</sub>                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |                  |
| 562 | CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | COCOOCH <sub>3</sub>                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 138-140          |
| 563 | CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | COCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 121-123          |

10

20

30

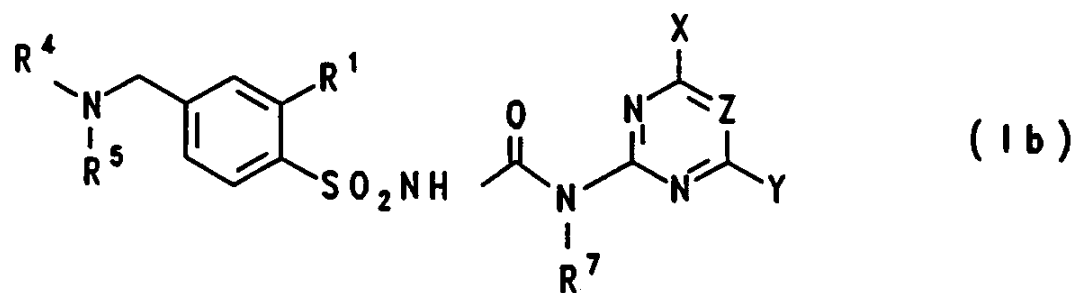
40

| Vb. | R <sup>1</sup>                  | R <sup>4</sup>                 | R <sup>5</sup>                     | R <sup>7</sup> | X                | Y                | Z  | Fp. °C           |
|-----|---------------------------------|--------------------------------|------------------------------------|----------------|------------------|------------------|----|------------------|
| 564 | CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>  | COCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub> | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |                  |
| 565 | CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>  | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>    | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 154-155          |
| 566 | CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>  | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>    | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | Na- 塩<br>161     |
| 567 | CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>  | SO <sub>2</sub> NHCH <sub>3</sub>  | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 150-152          |
| 568 | CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>  | SO <sub>2</sub> NHCH <sub>3</sub>  | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | Na- 塩<br>165-168 |
| 569 | CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>    | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 163-164          |
| 570 | CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>    | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | Na- 塩<br>166-168 |
| 571 | CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | CHO                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 165-166          |
| 572 | CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | CHO                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | Na- 塩<br>207-208 |
| 573 | CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>               | CONHPh                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 178-179          |
| 574 | CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>               | CONHEt                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 155-157          |
| 575 | CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>               | COCCl <sub>3</sub>                 | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 165-168          |
| 576 | CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>               | COCCl <sub>3</sub>                 | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | Na- 塩<br>100     |
| 577 | CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>               | COCHCl <sub>2</sub>                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 145-150          |
| 578 | CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>               | COCHCl <sub>2</sub>                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | Na- 塩<br>235     |

10

20

表 2



| Vb. | R <sup>1</sup>                  | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup> | R <sup>7</sup>  | X                                | Y                                  | Z  | Fp. °C  |
|-----|---------------------------------|----------------|----------------|-----------------|----------------------------------|------------------------------------|----|---------|
| 1   | CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H              | CHO            | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | CH | 142-144 |
| 2   | "                               | "              | "              | H               | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | CH |         |
| 3   | "                               | "              | "              | H               | CH <sub>3</sub>                  | CH <sub>3</sub>                    | CH |         |
| 4   | "                               | "              | "              | H               | CH <sub>3</sub>                  | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | CH |         |
| 5   | "                               | "              | "              | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | N  |         |
| 6   | "                               | "              | "              | H               | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | N  |         |
| 7   | "                               | "              | "              | H               | OCH <sub>3</sub>                 | Cl                                 | CH |         |
| 8   | "                               | "              | "              | H               | OCF <sub>2</sub> H               | CH <sub>3</sub>                    | CH |         |
| 9   | "                               | "              | "              | H               | OCF <sub>2</sub> H               | OCF <sub>2</sub> H                 | CH |         |
| 10  | "                               | "              | "              | H               | OCH <sub>3</sub>                 | Br                                 | CH |         |
| 11  | "                               | "              | "              | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | CH |         |
| 12  | "                               | "              | "              | H               | OCH <sub>3</sub>                 | SCH <sub>3</sub>                   | CH |         |
| 13  | "                               | "              | "              | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | N  |         |
| 14  | "                               | "              | "              | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>     | CH |         |
| 15  | "                               | "              | "              | H               | CH <sub>3</sub>                  | Cl                                 | CH |         |
| 16  | "                               | "              | "              | H               | Cl                               | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | CH |         |
| 17  | "                               | "              | "              | H               | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | CH |         |
| 18  | "                               | "              | "              | H               | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>    | OCH <sub>3</sub>                   | CH |         |
| 19  | "                               | "              | "              | H               | CF <sub>3</sub>                  | OCH <sub>3</sub>                   | CH |         |
| 20  | "                               | "              | "              | H               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>                    | CH |         |
| 21  | "                               | "              | "              | H               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                   | CH |         |
| 22  | "                               | "              | "              | H               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>   | CH |         |
| 23  | "                               | "              | "              | H               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                   | N  |         |
| 24  | "                               | "              | "              | H               | OCH <sub>3</sub>                 | CH(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CH |         |
| 25  | "                               | "              | "              | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | CH |         |

10

20

30

40

| Vb. | R <sup>1</sup> | R <sup>4</sup>  | R <sup>5</sup>    | R <sup>7</sup>  | X                                | Y                                  | Z  | Fp. °C  |
|-----|----------------|-----------------|-------------------|-----------------|----------------------------------|------------------------------------|----|---------|
| 26  | "              | "               | "                 | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | N  |         |
| 27  | "              | H               | COCH <sub>3</sub> | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | CH | 167-169 |
| 28  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | CH |         |
| 29  | "              | "               | "                 | H               | CH <sub>3</sub>                  | CH <sub>3</sub>                    | CH |         |
| 30  | "              | "               | "                 | H               | CH <sub>3</sub>                  | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | CH |         |
| 31  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | N  |         |
| 32  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | N  | 10      |
| 33  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | Cl                                 | CH |         |
| 34  | "              | "               | "                 | H               | OCF <sub>2</sub> H               | CH <sub>3</sub>                    | CH |         |
| 35  | "              | "               | "                 | H               | OCF <sub>2</sub> H               | OCF <sub>2</sub> H                 | CH |         |
| 36  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | Br                                 | CH |         |
| 37  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | CH |         |
| 38  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | SCH <sub>3</sub>                   | CH |         |
| 39  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | N  |         |
| 40  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>     | CH | 20      |
| 41  | "              | "               | "                 | H               | CH <sub>3</sub>                  | Cl                                 | CH |         |
| 42  | "              | "               | "                 | H               | Cl                               | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | CH |         |
| 43  | "              | "               | "                 | H               | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | CH |         |
| 44  | "              | "               | "                 | H               | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>    | OCH <sub>3</sub>                   | CH |         |
| 45  | "              | "               | "                 | H               | CF <sub>3</sub>                  | OCH <sub>3</sub>                   | CH |         |
| 46  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>                    | CH |         |
| 47  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                   | CH |         |
| 48  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>   | CH |         |
| 49  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                   | N  | 30      |
| 50  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | CH(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CH |         |
| 51  | "              | "               | "                 | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | CH |         |
| 52  | "              | "               | "                 | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | N  |         |
| 53  | "              | CH <sub>3</sub> | CHO               | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | CH | 160-162 |
| 54  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | CH |         |
| 55  | "              | "               | "                 | H               | CH <sub>3</sub>                  | CH <sub>3</sub>                    | CH |         |
| 56  | "              | "               | "                 | H               | CH <sub>3</sub>                  | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | CH |         |
| 57  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | N  | 40      |
| 58  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | N  |         |
| 59  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | Cl                                 | CH |         |
| 60  | "              | "               | "                 | H               | OCF <sub>2</sub> H               | CH <sub>3</sub>                    | CH |         |

| Vb. | R <sup>1</sup> | R <sup>4</sup>  | R <sup>5</sup>    | R <sup>7</sup>  | X                                | Y                                  | Z  | Fp. °C  |
|-----|----------------|-----------------|-------------------|-----------------|----------------------------------|------------------------------------|----|---------|
| 61  | "              | "               | "                 | H               | OCF <sub>2</sub> H               | OCF <sub>2</sub> H                 | CH |         |
| 62  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | Br                                 | CH |         |
| 63  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | CH |         |
| 64  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | SCH <sub>3</sub>                   | CH |         |
| 65  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | N  |         |
| 66  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>     | CH |         |
| 67  | "              | "               | "                 | H               | CH <sub>3</sub>                  | Cl                                 | CH | 10      |
| 68  | "              | "               | "                 | H               | Cl                               | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | CH |         |
| 69  | "              | "               | "                 | H               | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | CH |         |
| 70  | "              | "               | "                 | H               | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>    | OCH <sub>3</sub>                   | CH |         |
| 71  | "              | "               | "                 | H               | CF <sub>3</sub>                  | OCH <sub>3</sub>                   | CH |         |
| 72  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>                    | CH |         |
| 73  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                   | CH |         |
| 74  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>   | CH |         |
| 75  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                   | N  | 20      |
| 76  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | CH(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CH |         |
| 77  | "              | "               | "                 | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | CH |         |
| 78  | "              | "               | "                 | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | N  |         |
| 79  | "              | CH <sub>3</sub> | COCH <sub>3</sub> | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | CH | 166-168 |
| 80  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | CH |         |
| 81  | "              | "               | "                 | H               | CH <sub>3</sub>                  | CH <sub>3</sub>                    | CH |         |
| 82  | "              | "               | "                 | H               | CH <sub>3</sub>                  | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | CH |         |
| 83  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | N  |         |
| 84  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | N  | 30      |
| 85  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | Cl                                 | CH |         |
| 86  | "              | "               | "                 | H               | OCF <sub>2</sub> H               | CH <sub>3</sub>                    | CH |         |
| 87  | "              | "               | "                 | H               | OCF <sub>2</sub> H               | OCF <sub>2</sub> H                 | CH |         |
| 88  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | Br                                 | CH |         |
| 89  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | CH |         |
| 90  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | SCH <sub>3</sub>                   | CH |         |
| 91  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | N  |         |
| 92  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>     | CH | 40      |
| 93  | "              | "               | "                 | H               | CH <sub>3</sub>                  | Cl                                 | CH |         |
| 94  | "              | "               | "                 | H               | Cl                               | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | CH |         |
| 95  | "              | "               | "                 | H               | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | CH |         |

| Vb. | R <sup>1</sup> | R <sup>4</sup>   | R <sup>5</sup>                  | R <sup>7</sup>  | X                                | Y                                  | Z  | Fp. °C |
|-----|----------------|------------------|---------------------------------|-----------------|----------------------------------|------------------------------------|----|--------|
| 96  | "              | "                | "                               | H               | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>    | OCH <sub>3</sub>                   | CH |        |
| 97  | "              | "                | "                               | H               | CF <sub>3</sub>                  | OCH <sub>3</sub>                   | CH |        |
| 98  | "              | "                | "                               | H               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>                    | CH |        |
| 99  | "              | "                | "                               | H               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                   | CH |        |
| 100 | "              | "                | "                               | H               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>   | CH |        |
| 101 | "              | "                | "                               | H               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                   | N  |        |
| 102 | "              | "                | "                               | H               | OCH <sub>3</sub>                 | CH(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CH | 10     |
| 103 | "              | "                | "                               | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | CH |        |
| 104 | "              | "                | "                               | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | N  |        |
| 105 | "              | H                | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | CH |        |
| 106 | "              | "                | "                               | H               | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | CH |        |
| 107 | "              | "                | "                               | H               | CH <sub>3</sub>                  | CH <sub>3</sub>                    | CH |        |
| 108 | "              | "                | "                               | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | N  |        |
| 109 | "              | "                | "                               | H               | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | N  |        |
| 110 | "              | "                | "                               | H               | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | NHCH <sub>3</sub>                  | N  | 20     |
| 111 | "              | "                | "                               | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | CH |        |
| 112 | "              | "                | "                               | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | N  |        |
| 113 | "              | CH <sub>3</sub>  | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | CH |        |
| 114 | "              | "                | "                               | H               | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | CH |        |
| 115 | "              | "                | "                               | H               | CH <sub>3</sub>                  | CH <sub>3</sub>                    | CH |        |
| 116 | "              | "                | "                               | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | N  |        |
| 117 | "              | "                | "                               | H               | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | N  |        |
| 118 | "              | "                | "                               | H               | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | NHCH <sub>3</sub>                  | N  |        |
| 119 | "              | "                | "                               | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | CH | 30     |
| 120 | "              | "                | "                               | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | N  |        |
| 121 | "              | OH               | CHO                             | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | CH |        |
| 122 | "              | "                | "                               | H               | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | CH |        |
| 123 | "              | "                | "                               | H               | CH <sub>3</sub>                  | CH <sub>3</sub>                    | CH |        |
| 124 | "              | "                | "                               | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | N  |        |
| 125 | "              | "                | "                               | H               | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | N  |        |
| 126 | "              | "                | "                               | H               | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | NHCH <sub>3</sub>                  | N  |        |
| 127 | "              | "                | "                               | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | CH | 40     |
| 128 | "              | "                | "                               | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | N  |        |
| 129 | "              | OCH <sub>3</sub> | CHO                             | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | CH |        |
| 130 | "              | "                | "                               | H               | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | CH |        |

| Vb. | R <sup>1</sup> | R <sup>4</sup>   | R <sup>5</sup>                     | R <sup>7</sup>  | X                              | Y                 | Z  | Fp. °C  |
|-----|----------------|------------------|------------------------------------|-----------------|--------------------------------|-------------------|----|---------|
| 131 | "              | "                | "                                  | H               | CH <sub>3</sub>                | CH <sub>3</sub>   | CH |         |
| 132 | "              | "                | "                                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | OCH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 133 | "              | "                | "                                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | CH <sub>3</sub>   | N  |         |
| 134 | "              | "                | "                                  | H               | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | NHCH <sub>3</sub> | N  |         |
| 135 | "              | "                | "                                  | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>               | OCH <sub>3</sub>  | CH |         |
| 136 | "              | "                | "                                  | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>               | CH <sub>3</sub>   | N  |         |
| 137 | "              | OH               | COCH <sub>3</sub>                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | OCH <sub>3</sub>  | CH | 10      |
| 138 | "              | "                | "                                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | CH <sub>3</sub>   | CH |         |
| 139 | "              | "                | "                                  | H               | CH <sub>3</sub>                | CH <sub>3</sub>   | CH |         |
| 140 | "              | "                | "                                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | OCH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 141 | "              | "                | "                                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | CH <sub>3</sub>   | N  |         |
| 142 | "              | "                | "                                  | H               | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | NHCH <sub>3</sub> | N  |         |
| 143 | "              | "                | "                                  | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>               | OCH <sub>3</sub>  | CH |         |
| 144 | "              | "                | "                                  | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>               | CH <sub>3</sub>   | N  |         |
| 145 | "              | OCH <sub>3</sub> | COCH <sub>3</sub>                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | OCH <sub>3</sub>  | CH | 20      |
| 146 | "              | "                | "                                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | CH <sub>3</sub>   | CH |         |
| 147 | "              | "                | "                                  | H               | CH <sub>3</sub>                | CH <sub>3</sub>   | CH |         |
| 148 | "              | "                | "                                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | OCH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 149 | "              | "                | "                                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | CH <sub>3</sub>   | N  |         |
| 150 | "              | "                | "                                  | H               | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | NHCH <sub>3</sub> | N  |         |
| 151 | "              | "                | "                                  | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>               | OCH <sub>3</sub>  | CH |         |
| 152 | "              | "                | "                                  | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>               | CH <sub>3</sub>   | N  |         |
| 153 | "              | H                | COC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>    | H               | OCH <sub>3</sub>               | OCH <sub>3</sub>  | CH | 196     |
| 154 | "              | "                | "                                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | CH <sub>3</sub>   | CH | 30      |
| 155 | "              | "                | "                                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | OCH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 156 | "              | "                | "                                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | CH <sub>3</sub>   | N  |         |
| 157 | "              | CH <sub>3</sub>  | "                                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | OCH <sub>3</sub>  | CH |         |
| 158 | "              | "                | "                                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | CH <sub>3</sub>   | CH |         |
| 159 | "              | "                | "                                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | OCH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 160 | "              | "                | "                                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | CH <sub>3</sub>   | N  |         |
| 161 | "              | H                | COCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub> | H               | OCH <sub>3</sub>               | OCH <sub>3</sub>  | CH | 192-195 |
| 162 | "              | "                | "                                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | CH <sub>3</sub>   | CH | 40      |
| 163 | "              | "                | "                                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | OCH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 164 | "              | "                | "                                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | CH <sub>3</sub>   | N  |         |
| 165 | "              | CH <sub>3</sub>  | "                                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | OCH <sub>3</sub>  | CH |         |

| Vb. | R <sup>1</sup> | R <sup>4</sup>  | R <sup>5</sup>                                  | R <sup>7</sup> | X                | Y                | Z  | Fp. °C  |
|-----|----------------|-----------------|-------------------------------------------------|----------------|------------------|------------------|----|---------|
| 166 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |         |
| 167 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |         |
| 168 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 169 | "              | H               | COCO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 183-185 |
| 170 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |         |
| 171 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |         |
| 172 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  | 10      |
| 173 | "              | CH <sub>3</sub> | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |         |
| 174 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |         |
| 175 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |         |
| 176 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 177 | "              | H               | COCF <sub>3</sub>                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 180-182 |
| 178 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |         |
| 179 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |         |
| 180 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  | 20      |
| 181 | "              | CH <sub>3</sub> | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 144-147 |
| 182 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |         |
| 183 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |         |
| 184 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 185 | "              | H               | COOCH <sub>3</sub>                              | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 178-180 |
| 186 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |         |
| 187 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |         |
| 188 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 189 | "              | CH <sub>3</sub> | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 30      |
| 190 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |         |
| 191 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |         |
| 192 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 193 | "              | H               | CONHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |         |
| 194 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |         |
| 195 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |         |
| 196 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 197 | "              | CH <sub>3</sub> | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 40      |
| 198 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |         |
| 199 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |         |
| 200 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |

| Vb. | R <sup>1</sup> | R <sup>4</sup>                                                       | R <sup>5</sup>                                   | R <sup>7</sup> | X                | Y                | Z  | Fp. °C |
|-----|----------------|----------------------------------------------------------------------|--------------------------------------------------|----------------|------------------|------------------|----|--------|
| 201 | "              | H                                                                    | CSNHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 202 | "              | "                                                                    | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 203 | "              | "                                                                    | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 204 | "              | "                                                                    | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 205 | "              | CH <sub>3</sub>                                                      | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 206 | "              | "                                                                    | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 207 | "              | "                                                                    | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  | 10     |
| 208 | "              | "                                                                    | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 209 | "              | H                                                                    | SO <sub>2</sub> NHCH <sub>3</sub>                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 210 | "              | "                                                                    | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 211 | "              | "                                                                    | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 212 | "              | "                                                                    | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 213 | "              | CH <sub>3</sub>                                                      | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 214 | "              | "                                                                    | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 215 | "              | "                                                                    | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  | 20     |
| 216 | "              | "                                                                    | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 217 | "              | H                                                                    | SO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 218 | "              | "                                                                    | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 219 | "              | "                                                                    | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 220 | "              | "                                                                    | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 221 | "              | CH <sub>3</sub>                                                      | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 222 | "              | "                                                                    | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 223 | "              | "                                                                    | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 224 | "              | "                                                                    | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  | 30     |
| 225 | "              | -CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CO-                 |                                                  | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 226 | "              | "                                                                    |                                                  | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 227 | "              | "                                                                    |                                                  | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 228 | "              | "                                                                    |                                                  | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 229 | "              | -CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> -   |                                                  | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 230 | "              | "                                                                    |                                                  | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 231 | "              | "                                                                    |                                                  | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 232 | "              | "                                                                    |                                                  | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  | 40     |
| 233 | "              | -CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CO- |                                                  | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 234 | "              | "                                                                    |                                                  | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 235 | "              | "                                                                    |                                                  | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |

| Vb. | R <sup>1</sup> | R <sup>4</sup>                                                                     | R <sup>5</sup>                  | F <sup>7</sup> | X                | Y                | Z  | Fp.°C   |
|-----|----------------|------------------------------------------------------------------------------------|---------------------------------|----------------|------------------|------------------|----|---------|
| 236 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 237 | "              | -CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> - | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |         |
| 238 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |         |
| 239 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |         |
| 240 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 241 | "              | -CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -                | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |         |
| 242 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH | 10      |
| 243 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |         |
| 244 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 245 | "              | H                                                                                  | COC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |         |
| 246 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |         |
| 247 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |         |
| 248 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 249 | "              | CH <sub>3</sub>                                                                    | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |         |
| 250 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |         |
| 251 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  | 20      |
| 252 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 253 | "              | H                                                                                  | COCH <sub>2</sub> Cl            | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 170-172 |
| 254 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |         |
| 255 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |         |
| 256 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 257 | "              | CH <sub>3</sub>                                                                    | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |         |
| 258 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |         |
| 259 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  | 30      |
| 260 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 261 | "              | H                                                                                  | COCHCl <sub>2</sub>             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 158-160 |
| 262 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |         |
| 263 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |         |
| 264 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 265 | "              | CH <sub>3</sub>                                                                    | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |         |
| 266 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |         |
| 267 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |         |
| 268 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  | 40      |
| 269 | "              | H                                                                                  | COCCl <sub>3</sub>              | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 194-196 |
| 270 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |         |

| Vb. | R <sup>1</sup> | R <sup>4</sup>                                | R <sup>5</sup>                                | R <sup>7</sup> | X                | Y                | Z  | Fp. °C |
|-----|----------------|-----------------------------------------------|-----------------------------------------------|----------------|------------------|------------------|----|--------|
| 271 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 272 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 273 | "              | CH <sub>3</sub>                               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 274 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 275 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 276 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 277 | "              | H                                             | COCH=CH <sub>2</sub>                          | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 10     |
| 278 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 279 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 280 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 281 | "              | CH <sub>3</sub>                               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 282 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 283 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 284 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 285 | "              | H                                             | COC=CH                                        | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 20     |
| 286 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 287 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 288 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 289 | "              | CH <sub>3</sub>                               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 290 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 291 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 292 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 293 | "              | H                                             | COC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 294 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH | 30     |
| 295 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 296 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 297 | "              | CH <sub>3</sub>                               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 298 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 299 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 300 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 301 | "              | SO <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | SO <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 302 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 303 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  | 40     |
| 304 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 305 | "              | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>               | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |

| Vb. | R <sup>1</sup> | R <sup>4</sup>  | R <sup>5</sup>                                | R <sup>7</sup> | X                | Y                | Z  | Fp. °C |
|-----|----------------|-----------------|-----------------------------------------------|----------------|------------------|------------------|----|--------|
| 306 | "              | "               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 307 | "              | "               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 308 | "              | "               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 309 | "              | H               | COCH <sub>2</sub> Br                          | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 310 | "              | "               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 311 | "              | CH <sub>3</sub> | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 312 | "              | "               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  | 10     |
| 313 | "              | H               | COCH <sub>2</sub> F                           | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 314 | "              | "               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 315 | "              | CH <sub>3</sub> | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 316 | "              | "               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 317 | "              | H               | COCH <sub>2</sub> C≡CH                        | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 318 | "              | "               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 319 | "              | CH <sub>3</sub> | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 320 | "              | "               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  | 20     |
| 321 | "              | H               | COCO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 322 | "              | "               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 323 | "              | CH <sub>3</sub> | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 324 | "              | "               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 325 | "              | H               | CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 326 | "              | "               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 327 | "              | CH <sub>3</sub> | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 328 | "              | "               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 329 | "              | H               | COSCH <sub>3</sub>                            | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 30     |
| 330 | "              | "               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 331 | "              | CH <sub>3</sub> | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 332 | "              | "               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 333 | "              | H               | CSOCH <sub>3</sub>                            | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 334 | "              | "               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 335 | "              | CH <sub>3</sub> | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 336 | "              | "               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 337 | "              | H               | CSSCH <sub>3</sub>                            | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 40     |
| 338 | "              | "               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 339 | "              | CH <sub>3</sub> | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 340 | "              | "               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |

| Vb. | R <sup>1</sup> | R <sup>4</sup>  | R <sup>5</sup>                         | R <sup>7</sup> | X                | Y                | Z  | Fp. °C  |
|-----|----------------|-----------------|----------------------------------------|----------------|------------------|------------------|----|---------|
| 341 | "              | H               | COCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>    | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 195-196 |
| 342 | "              | "               | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 343 | "              | CH <sub>3</sub> | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |         |
| 344 | "              | "               | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 345 | "              | H               | COC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>     | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |         |
| 346 | "              | "               | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 347 | "              | CH <sub>3</sub> | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 10      |
| 348 | "              | "               | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 349 | "              | H               | CO-Cyclopropyl                         | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 202-203 |
| 350 | "              | "               | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 351 | "              | CH <sub>3</sub> | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |         |
| 352 | "              | "               | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 353 | "              | H               | CO-Cyclobutyl                          | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |         |
| 354 | "              | "               | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 355 | "              | CH <sub>3</sub> | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 20      |
| 356 | "              | "               | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 357 | "              | H               | CO-Cyclopentyl                         | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |         |
| 358 | "              | "               | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 359 | "              | CH <sub>3</sub> | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |         |
| 360 | "              | "               | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 361 | "              | H               | CO-Cyclohexyl                          | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |         |
| 362 | "              | "               | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 363 | "              | CH <sub>3</sub> | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |         |
| 364 | "              | "               | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  | 30      |
| 365 | "              | H               | CONHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 178-182 |
| 366 | "              | "               | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 367 | "              | CH <sub>3</sub> | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |         |
| 368 | "              | "               | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 369 | "              | H               | CSNHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |         |
| 370 | "              | "               | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 371 | "              | CH <sub>3</sub> | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |         |
| 372 | "              | "               | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |         |
| 373 | "              | H               | CONH-n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>   | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 183-184 |
| 374 | "              | "               | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  | 40      |
| 375 | "              | CH <sub>3</sub> | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |         |

| Vb. | R <sup>1</sup> | R <sup>4</sup>           | R <sup>5</sup>                                      | R <sup>7</sup> | X                | Y                | Z  | Fp. °C |
|-----|----------------|--------------------------|-----------------------------------------------------|----------------|------------------|------------------|----|--------|
| 376 | "              | "                        | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 377 | "              | H                        | CSNHCH <sub>3</sub>                                 | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 378 | "              | "                        | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 379 | "              | CH <sub>3</sub>          | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 380 | "              | "                        | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 381 | "              | H                        | CSNHCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 382 | "              | "                        | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  | 10     |
| 383 | "              | CH <sub>3</sub>          | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 384 | "              | "                        | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 385 | "              | CH <sub>3</sub>          | CSNHCH <sub>2</sub> COCH <sub>3</sub>               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 386 | "              | "                        | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 387 | "              | CH <sub>3</sub>          | CSNHCH <sub>2</sub> COC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 388 | "              | "                        | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 389 | "              | CH <sub>3</sub>          | CONHCH <sub>2</sub> COCH <sub>3</sub>               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 390 | "              | "                        | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  | 20     |
| 391 | "              | CH <sub>3</sub>          | CONHCH <sub>2</sub> COC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 392 | "              | "                        | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 393 | "              | -CONHCH <sub>2</sub> CO- |                                                     | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 394 | "              | "                        | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 395 | "              | H                        | SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F                   | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 396 | "              | "                        | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 397 | "              | CH <sub>3</sub>          | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 398 | "              | "                        | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 399 | "              | H                        | SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                     | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 30     |
| 400 | "              | "                        | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 401 | "              | CH <sub>3</sub>          | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 402 | "              | "                        | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 403 | "              | H                        | SO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>       | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 404 | "              | "                        | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 405 | "              | CH <sub>3</sub>          | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 406 | "              | "                        | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 407 | "              | H                        | SO <sub>2</sub> -n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>    | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 40     |
| 408 | "              | "                        | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 409 | "              | CH <sub>3</sub>          | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 410 | "              | "                        | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |

| Vb. | R <sup>1</sup> | R <sup>4</sup>   | R <sup>5</sup>                                  | R <sup>7</sup> | X                | Y                | Z  | Fp. °C |
|-----|----------------|------------------|-------------------------------------------------|----------------|------------------|------------------|----|--------|
| 411 | "              | OH               | COC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                 | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 412 | "              | "                | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 413 | "              | OCH <sub>3</sub> | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 414 | "              | "                | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 415 | "              | OH               | COCH <sub>2</sub> Cl                            | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 416 | "              | "                | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 417 | "              | OCH <sub>3</sub> | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 10     |
| 418 | "              | "                | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 419 | "              | OH               | COCF <sub>3</sub>                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 420 | "              | "                | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 421 | "              | OCH <sub>3</sub> | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 422 | "              | "                | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 423 | "              | OH               | COCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>              | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 424 | "              | "                | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 425 | "              | OCH <sub>3</sub> | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 20     |
| 426 | "              | "                | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 427 | "              | OH               | COCO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 428 | "              | "                | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 429 | "              | OCH <sub>3</sub> | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 430 | "              | "                | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 431 | "              | OH               | COOCH <sub>3</sub>                              | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 432 | "              | "                | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 433 | "              | OCH <sub>3</sub> | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 434 | "              | "                | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  | 30     |
| 435 | "              | OH               | Cyclopropyl                                     | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 436 | "              | "                | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 437 | "              | OCH <sub>3</sub> | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 438 | "              | "                | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 439 | "              | OH               | COC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                 | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 440 | "              | "                | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 441 | "              | OCH <sub>3</sub> | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 442 | "              | "                | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 443 | "              | OH               | COCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 40     |
| 444 | "              | "                | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 445 | "              | OCH <sub>3</sub> | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |

| Vb. | R <sup>1</sup> | R <sup>4</sup>                | R <sup>5</sup>                                   | R <sup>7</sup> | X                | Y                | Z  | Fp. °C |
|-----|----------------|-------------------------------|--------------------------------------------------|----------------|------------------|------------------|----|--------|
| 446 | "              | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 447 | "              | OH                            | COCH=CH <sub>2</sub>                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 448 | "              | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 449 | "              | OCH <sub>3</sub>              | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 450 | "              | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 451 | "              | OH                            | COC=CH                                           | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 452 | "              | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  | 10     |
| 453 | "              | OCH <sub>3</sub>              | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 454 | "              | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 455 | "              | OH                            | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                  | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 456 | "              | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 457 | "              | OCH <sub>3</sub>              | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 458 | "              | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 459 | "              | OH                            | SO <sub>2</sub> NHCH <sub>3</sub>                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 460 | "              | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  | 20     |
| 461 | "              | OCH <sub>3</sub>              | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 462 | "              | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 463 | "              | OH                            | SO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 464 | "              | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 465 | "              | OCH <sub>3</sub>              | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 466 | "              | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 467 | "              | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | CHO                                              | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 468 | "              | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 469 | "              | "                             | COCH <sub>3</sub>                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 30     |
| 470 | "              | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 471 | "              | "                             | Cyclopropyl                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 472 | "              | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 473 | "              | "                             | COCH <sub>2</sub> Cl                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 474 | "              | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 475 | "              | "                             | COCF <sub>3</sub>                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 476 | "              | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 477 | "              | "                             | COOCH <sub>3</sub>                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 40     |
| 478 | "              | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 479 | "              | "                             | COC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                  | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 480 | "              | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |

| Vb. | R <sup>1</sup>                                | R <sup>4</sup>                | R <sup>5</sup>                                   | R <sup>7</sup> | X                | Y                | Z  | Fp. °C |
|-----|-----------------------------------------------|-------------------------------|--------------------------------------------------|----------------|------------------|------------------|----|--------|
| 481 | "                                             | "                             | CONHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 482 | "                                             | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 483 | "                                             | "                             | CSNHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 484 | "                                             | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 485 | "                                             | "                             | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                  | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 486 | "                                             | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 487 | "                                             | "                             | SO <sub>2</sub> NHCH <sub>3</sub>                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 10     |
| 488 | "                                             | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 489 | "                                             | "                             | SO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 490 | "                                             | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 491 | "                                             | "                             | SO <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>    | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 492 | "                                             | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 493 | CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | H                             | CHO                                              | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 494 | "                                             | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 495 | "                                             | "                             | COCH <sub>3</sub>                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 20     |
| 496 | "                                             | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 497 | "                                             | "                             | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                  | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 498 | "                                             | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 499 | "                                             | CH <sub>3</sub>               | CHO                                              | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 500 | "                                             | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 501 | "                                             | "                             | COCH <sub>3</sub>                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 502 | "                                             | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 503 | "                                             | "                             | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                  | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 504 | "                                             | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  | 30     |
| 505 | "                                             | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | CHO                                              | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 506 | "                                             | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 507 | "                                             | "                             | COCH <sub>3</sub>                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 508 | "                                             | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 509 | "                                             | "                             | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                  | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 510 | "                                             | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 511 | "                                             | OH                            | CHO                                              | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 512 | "                                             | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  | 40     |
| 513 | "                                             | "                             | COCH <sub>3</sub>                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 514 | "                                             | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 515 | "                                             | "                             | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                  | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |

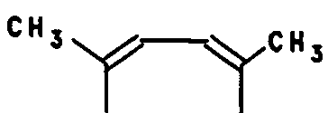
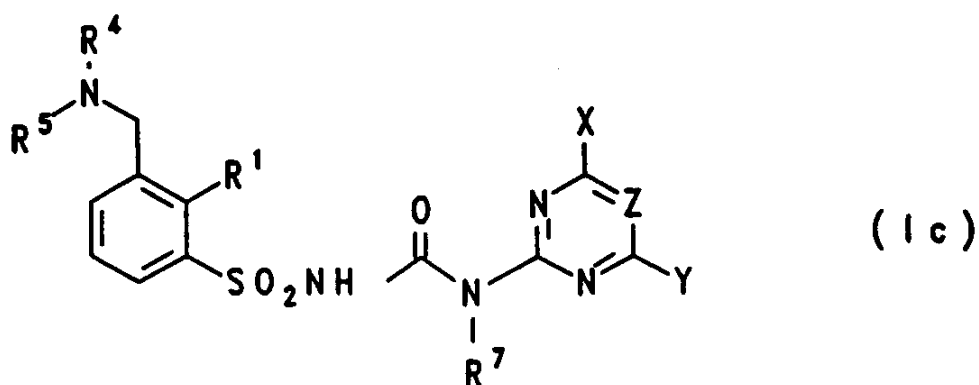
| Vb. | R <sup>1</sup>        | R <sup>4</sup>                                                                      | R <sup>5</sup>                  | R <sup>7</sup> | X                                | Y                | Z  | Fp. °C |
|-----|-----------------------|-------------------------------------------------------------------------------------|---------------------------------|----------------|----------------------------------|------------------|----|--------|
| 516 | "                     | "                                                                                   | "                               | H              | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 517 | "                     | OCH <sub>3</sub>                                                                    | CHO                             | H              | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 518 | "                     | "                                                                                   | "                               | H              | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 519 | "                     | "                                                                                   | COCH <sub>3</sub>               | H              | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 520 | "                     | "                                                                                   | "                               | H              | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 521 | CO <sub>2</sub> -n-Bu | H                                                                                   | CHO                             | H              | "                                | OMe              | CH |        |
| 522 | CONMe <sub>2</sub>    | Me                                                                                  | "                               | H              | "                                | Me               | N  | 10     |
| 523 | CONHMe                | H                                                                                   | "                               | H              | "                                | OMe              | CH |        |
| 524 | COSMe                 | Me                                                                                  | CO-Me                           | H              | "                                | Me               | N  |        |
| 525 | CO <sub>2</sub> Me    | n-Bu                                                                                | CHO                             | H              | "                                | OMe              | CH |        |
| 526 | "                     | n-Bu                                                                                | "                               | H              | "                                | Me               | N  |        |
| 527 | "                     | H                                                                                   | "                               | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | NMe <sub>2</sub> | "  |        |
| 528 | "                     | Me                                                                                  | "                               | H              | "                                | "                | "  |        |
| 529 | "                     | H                                                                                   | CO-Me                           | H              | "                                | "                | "  |        |
| 530 | "                     | Me                                                                                  | "                               | H              | "                                | "                | "  | 20     |
| 531 | "                     | "                                                                                   | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H              | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 532 | "                     | "                                                                                   | "                               | H              | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 533 | "                     |  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 534 | "                     | "                                                                                   | "                               | H              | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>  | N  |        |

表 3



| Vb. | R <sup>1</sup>                  | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup> | R <sup>7</sup> | X                                | Y                                  | Z  | Fp. °C |
|-----|---------------------------------|----------------|----------------|----------------|----------------------------------|------------------------------------|----|--------|
| 1   | CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H              | CHO            | H              | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | CH |        |
| 2   | "                               | "              | "              | H              | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | CH |        |
| 3   | "                               | "              | "              | H              | CH <sub>3</sub>                  | CH <sub>3</sub>                    | CH |        |
| 4   | "                               | "              | "              | H              | CH <sub>3</sub>                  | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | CH |        |
| 5   | "                               | "              | "              | H              | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | N  | 10     |
| 6   | "                               | "              | "              | H              | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | N  |        |
| 7   | "                               | "              | "              | H              | OCH <sub>3</sub>                 | Cl                                 | CH |        |
| 8   | "                               | "              | "              | H              | OCF <sub>2</sub> H               | CH <sub>3</sub>                    | CH |        |
| 9   | "                               | "              | "              | H              | OCF <sub>2</sub> H               | OCF <sub>2</sub> H                 | CH |        |
| 10  | "                               | "              | "              | H              | OCH <sub>3</sub>                 | Br                                 | CH |        |
| 11  | "                               | "              | "              | H              | OCH <sub>3</sub>                 | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | CH |        |
| 12  | "                               | "              | "              | H              | OCH <sub>3</sub>                 | SCH <sub>3</sub>                   | CH |        |
| 13  | "                               | "              | "              | H              | OCH <sub>3</sub>                 | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | N  | 30     |
| 14  | "                               | "              | "              | H              | OCH <sub>3</sub>                 | OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>     | CH |        |
| 15  | "                               | "              | "              | H              | CH <sub>3</sub>                  | Cl                                 | CH |        |
| 16  | "                               | "              | "              | H              | Cl                               | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | CH |        |
| 17  | "                               | "              | "              | H              | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | CH |        |
| 18  | "                               | "              | "              | H              | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>    | OCH <sub>3</sub>                   | CH |        |
| 19  | "                               | "              | "              | H              | CF <sub>3</sub>                  | OCH <sub>3</sub>                   | CH |        |
| 20  | "                               | "              | "              | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>                    | CH |        |
| 21  | "                               | "              | "              | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                   | CH |        |
| 22  | "                               | "              | "              | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>   | CH | 40     |
| 23  | "                               | "              | "              | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                   | N  |        |
| 24  | "                               | "              | "              | H              | OCH <sub>3</sub>                 | CH(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CH |        |

| Vb. | R <sup>1</sup> | R <sup>4</sup>  | R <sup>5</sup>    | R <sup>7</sup>  | X                                | Y                                  | Z  | Fp. °C  |
|-----|----------------|-----------------|-------------------|-----------------|----------------------------------|------------------------------------|----|---------|
| 25  | "              | "               | "                 | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | CH |         |
| 26  | "              | "               | "                 | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | N  |         |
| 27  | "              | H               | COCH <sub>3</sub> | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | CH | 198-200 |
| 28  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | CH |         |
| 29  | "              | "               | "                 | H               | CH <sub>3</sub>                  | CH <sub>3</sub>                    | CH |         |
| 30  | "              | "               | "                 | H               | CH <sub>3</sub>                  | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | CH |         |
| 31  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | N  | 10      |
| 32  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | N  |         |
| 33  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | Cl                                 | CH |         |
| 34  | "              | "               | "                 | H               | OCF <sub>2</sub> H               | CH <sub>3</sub>                    | CH |         |
| 35  | "              | "               | "                 | H               | OCF <sub>2</sub> H               | OCF <sub>2</sub> H                 | CH |         |
| 36  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | Br                                 | CH |         |
| 37  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | CH |         |
| 38  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | SCH <sub>3</sub>                   | CH |         |
| 39  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | N  | 20      |
| 40  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>     | CH |         |
| 41  | "              | "               | "                 | H               | CH <sub>3</sub>                  | Cl                                 | CH |         |
| 42  | "              | "               | "                 | H               | Cl                               | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | CH |         |
| 43  | "              | "               | "                 | H               | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | CH |         |
| 44  | "              | "               | "                 | H               | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>    | OCH <sub>3</sub>                   | CH |         |
| 45  | "              | "               | "                 | H               | CF <sub>3</sub>                  | OCH <sub>3</sub>                   | CH |         |
| 46  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>                    | CH |         |
| 47  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                   | CH |         |
| 48  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>   | CH | 30      |
| 49  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                   | N  |         |
| 50  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | CH(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CH |         |
| 51  | "              | "               | "                 | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | CH |         |
| 52  | "              | "               | "                 | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | N  |         |
| 53  | "              | CH <sub>3</sub> | CHO               | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | CH |         |
| 54  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | CH |         |
| 55  | "              | "               | "                 | H               | CH <sub>3</sub>                  | CH <sub>3</sub>                    | CH |         |
| 56  | "              | "               | "                 | H               | CH <sub>3</sub>                  | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | CH |         |
| 57  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | N  | 40      |
| 58  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | N  |         |
| 59  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | Cl                                 | CH |         |

| Vb. | R <sup>1</sup> | R <sup>4</sup>  | R <sup>5</sup>    | R <sup>7</sup>  | X                                | Y                                  | Z  | Fp. °C |
|-----|----------------|-----------------|-------------------|-----------------|----------------------------------|------------------------------------|----|--------|
| 60  | "              | "               | "                 | H               | OCF <sub>2</sub> H               | CH <sub>3</sub>                    | CH |        |
| 61  | "              | "               | "                 | H               | OCF <sub>2</sub> H               | OCF <sub>2</sub> H                 | CH |        |
| 62  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | Br                                 | CH |        |
| 63  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | CH |        |
| 64  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | SCH <sub>3</sub>                   | CH |        |
| 65  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | N  |        |
| 66  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>     | CH | 10     |
| 67  | "              | "               | "                 | H               | CH <sub>3</sub>                  | Cl                                 | CH |        |
| 68  | "              | "               | "                 | H               | Cl                               | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | CH |        |
| 69  | "              | "               | "                 | H               | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | CH |        |
| 70  | "              | "               | "                 | H               | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>    | OCH <sub>3</sub>                   | CH |        |
| 71  | "              | "               | "                 | H               | CF <sub>3</sub>                  | OCH <sub>3</sub>                   | CH |        |
| 72  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>                    | CH |        |
| 73  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                   | CH |        |
| 74  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>   | CH | 20     |
| 75  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                   | N  |        |
| 76  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | CH(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CH |        |
| 77  | "              | "               | "                 | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | CH |        |
| 78  | "              | "               | "                 | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | N  |        |
| 79  | "              | CH <sub>3</sub> | COCH <sub>3</sub> | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | CH |        |
| 80  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | CH |        |
| 81  | "              | "               | "                 | H               | CH <sub>3</sub>                  | CH <sub>3</sub>                    | CH |        |
| 82  | "              | "               | "                 | H               | CH <sub>3</sub>                  | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | CH |        |
| 83  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | N  | 30     |
| 84  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | N  |        |
| 85  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | Cl                                 | CH |        |
| 86  | "              | "               | "                 | H               | OCF <sub>2</sub> H               | CH <sub>3</sub>                    | CH |        |
| 87  | "              | "               | "                 | H               | OCF <sub>2</sub> H               | OCF <sub>2</sub> H                 | CH |        |
| 88  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | Br                                 | CH |        |
| 89  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | CH |        |
| 90  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | SCH <sub>3</sub>                   | CH |        |
| 91  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | N  | 40     |
| 92  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>     | CH |        |
| 93  | "              | "               | "                 | H               | CH <sub>3</sub>                  | Cl                                 | CH |        |
| 94  | "              | "               | "                 | H               | Cl                               | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | CH |        |

| Vb. | R <sup>1</sup> | R <sup>4</sup>   | R <sup>5</sup>                  | R <sup>7</sup>  | X                                | Y                                  | Z  | Fp. °C |
|-----|----------------|------------------|---------------------------------|-----------------|----------------------------------|------------------------------------|----|--------|
| 95  | "              | "                | "                               | H               | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | CH |        |
| 96  | "              | "                | "                               | H               | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>    | OCH <sub>3</sub>                   | CH |        |
| 97  | "              | "                | "                               | H               | CF <sub>3</sub>                  | OCH <sub>3</sub>                   | CH |        |
| 98  | "              | "                | "                               | H               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>                    | CH |        |
| 99  | "              | "                | "                               | H               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                   | CH |        |
| 100 | "              | "                | "                               | H               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>   | CH |        |
| 101 | "              | "                | "                               | H               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                   | N  | 10     |
| 102 | "              | "                | "                               | H               | OCH <sub>3</sub>                 | CH(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CH |        |
| 103 | "              | "                | "                               | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | CH |        |
| 104 | "              | "                | "                               | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | N  |        |
| 105 | "              | H                | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | CH |        |
| 106 | "              | "                | "                               | H               | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | CH |        |
| 107 | "              | "                | "                               | H               | CH <sub>3</sub>                  | CH <sub>3</sub>                    | CH |        |
| 108 | "              | "                | "                               | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | N  |        |
| 109 | "              | "                | "                               | H               | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | N  | 20     |
| 110 | "              | "                | "                               | H               | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | NHCH <sub>3</sub>                  | N  |        |
| 111 | "              | "                | "                               | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | CH |        |
| 112 | "              | "                | "                               | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | N  |        |
| 113 | "              | CH <sub>3</sub>  | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | CH |        |
| 114 | "              | "                | "                               | H               | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | CH |        |
| 115 | "              | "                | "                               | H               | CH <sub>3</sub>                  | CH <sub>3</sub>                    | CH |        |
| 116 | "              | "                | "                               | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | N  |        |
| 117 | "              | "                | "                               | H               | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | N  |        |
| 118 | "              | "                | "                               | H               | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | NHCH <sub>3</sub>                  | N  | 30     |
| 119 | "              | "                | "                               | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | CH |        |
| 120 | "              | "                | "                               | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | N  |        |
| 121 | "              | OH               | CHO                             | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | CH |        |
| 122 | "              | "                | "                               | H               | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | CH |        |
| 123 | "              | "                | "                               | H               | CH <sub>3</sub>                  | CH <sub>3</sub>                    | CH |        |
| 124 | "              | "                | "                               | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | N  |        |
| 125 | "              | "                | "                               | H               | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | N  |        |
| 126 | "              | "                | "                               | H               | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | NHCH <sub>3</sub>                  | N  | 40     |
| 127 | "              | "                | "                               | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | CH |        |
| 128 | "              | "                | "                               | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | N  |        |
| 129 | "              | OCH <sub>3</sub> | CHO                             | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | CH |        |

| Vb. | R <sup>1</sup> | R <sup>4</sup>   | R <sup>5</sup>                     | R <sup>7</sup>  | X                              | Y                 | Z  | Fp. °C |
|-----|----------------|------------------|------------------------------------|-----------------|--------------------------------|-------------------|----|--------|
| 130 | "              | "                | "                                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | CH <sub>3</sub>   | CH |        |
| 131 | "              | "                | "                                  | H               | CH <sub>3</sub>                | CH <sub>3</sub>   | CH |        |
| 132 | "              | "                | "                                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | OCH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 133 | "              | "                | "                                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | CH <sub>3</sub>   | N  |        |
| 134 | "              | "                | "                                  | H               | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | NHCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 135 | "              | "                | "                                  | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>               | OCH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 136 | "              | "                | "                                  | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>               | CH <sub>3</sub>   | N  | 10     |
| 137 | "              | OH               | COCH <sub>3</sub>                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | OCH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 138 | "              | "                | "                                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | CH <sub>3</sub>   | CH |        |
| 139 | "              | "                | "                                  | H               | CH <sub>3</sub>                | CH <sub>3</sub>   | CH |        |
| 140 | "              | "                | "                                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | OCH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 141 | "              | "                | "                                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | CH <sub>3</sub>   | N  |        |
| 142 | "              | "                | "                                  | H               | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | NHCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 143 | "              | "                | "                                  | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>               | OCH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 144 | "              | "                | "                                  | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>               | CH <sub>3</sub>   | N  | 20     |
| 145 | "              | OCH <sub>3</sub> | COCH <sub>3</sub>                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | OCH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 146 | "              | "                | "                                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | CH <sub>3</sub>   | CH |        |
| 147 | "              | "                | "                                  | H               | CH <sub>3</sub>                | CH <sub>3</sub>   | CH |        |
| 148 | "              | "                | "                                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | OCH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 149 | "              | "                | "                                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | CH <sub>3</sub>   | N  |        |
| 150 | "              | "                | "                                  | H               | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | NHCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 151 | "              | "                | "                                  | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>               | OCH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 152 | "              | "                | "                                  | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>               | CH <sub>3</sub>   | N  |        |
| 153 | "              | H                | COC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>    | H               | OCH <sub>3</sub>               | OCH <sub>3</sub>  | CH | 30     |
| 154 | "              | "                | "                                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | CH <sub>3</sub>   | CH |        |
| 155 | "              | "                | "                                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | OCH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 156 | "              | "                | "                                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | CH <sub>3</sub>   | N  |        |
| 157 | "              | CH <sub>3</sub>  | "                                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | OCH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 158 | "              | "                | "                                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | CH <sub>3</sub>   | CH |        |
| 159 | "              | "                | "                                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | OCH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 160 | "              | "                | "                                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | CH <sub>3</sub>   | N  |        |
| 161 | "              | H                | COCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub> | H               | OCH <sub>3</sub>               | OCH <sub>3</sub>  | CH | 40     |
| 162 | "              | "                | "                                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | CH <sub>3</sub>   | CH |        |
| 163 | "              | "                | "                                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | OCH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 164 | "              | "                | "                                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | CH <sub>3</sub>   | N  |        |

| Vb. | R <sup>1</sup> | R <sup>4</sup>  | R <sup>5</sup>                                  | R <sup>7</sup> | X                | Y                | Z  | Fp. °C |
|-----|----------------|-----------------|-------------------------------------------------|----------------|------------------|------------------|----|--------|
| 165 | "              | CH <sub>3</sub> | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 166 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 167 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 168 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 169 | "              | H               | COCO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 170 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 171 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  | 10     |
| 172 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 173 | "              | CH <sub>3</sub> | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 174 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 175 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 176 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 177 | "              | H               | COCF <sub>3</sub>                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 178 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 179 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  | 20     |
| 180 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 181 | "              | CH <sub>3</sub> | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 182 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 183 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 184 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 185 | "              | H               | COOCH <sub>3</sub>                              | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 186 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 187 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 188 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  | 30     |
| 189 | "              | CH <sub>3</sub> | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 190 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 191 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 192 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 193 | "              | H               | CONHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 194 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 195 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 196 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  | 40     |
| 197 | "              | CH <sub>3</sub> | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 198 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 199 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |

| Vb. | R <sup>1</sup> | R <sup>4</sup>                                                       | R <sup>5</sup>                                   | R <sup>7</sup> | X                | Y                | Z  | Fp. °C |
|-----|----------------|----------------------------------------------------------------------|--------------------------------------------------|----------------|------------------|------------------|----|--------|
| 200 | "              | "                                                                    | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 201 | "              | H                                                                    | CSNHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 202 | "              | "                                                                    | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 203 | "              | "                                                                    | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 204 | "              | "                                                                    | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 205 | "              | CH <sub>3</sub>                                                      | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 206 | "              | "                                                                    | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH | 10     |
| 207 | "              | "                                                                    | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 208 | "              | "                                                                    | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 209 | "              | H                                                                    | SO <sub>2</sub> NHCH <sub>3</sub>                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 210 | "              | "                                                                    | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 211 | "              | "                                                                    | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 212 | "              | "                                                                    | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 213 | "              | CH <sub>3</sub>                                                      | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 214 | "              | "                                                                    | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH | 20     |
| 215 | "              | "                                                                    | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 216 | "              | "                                                                    | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 217 | "              | H                                                                    | SO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 218 | "              | "                                                                    | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 219 | "              | "                                                                    | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 220 | "              | "                                                                    | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 221 | "              | CH <sub>3</sub>                                                      | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 222 | "              | "                                                                    | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 223 | "              | "                                                                    | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  | 30     |
| 224 | "              | "                                                                    | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 225 | "              | -CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CO-                 |                                                  | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 226 | "              | "                                                                    |                                                  | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 227 | "              | "                                                                    |                                                  | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 228 | "              | "                                                                    |                                                  | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 229 | "              | -CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> -   |                                                  | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 230 | "              | "                                                                    |                                                  | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 231 | "              | "                                                                    |                                                  | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  | 40     |
| 232 | "              | "                                                                    |                                                  | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 233 | "              | -CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CO- |                                                  | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 234 | "              | "                                                                    |                                                  | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |

| Vb. | R <sup>1</sup> | R <sup>4</sup>                                                                     | R <sup>5</sup>                  | R <sup>7</sup> | X                | Y                | Z  | Fp. °C |
|-----|----------------|------------------------------------------------------------------------------------|---------------------------------|----------------|------------------|------------------|----|--------|
| 235 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 236 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 237 | "              | -CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> - | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 238 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 239 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 240 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 241 | "              | -CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -                | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 10     |
| 242 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 243 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 244 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 245 | "              | H                                                                                  | COC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 246 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 247 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 248 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 249 | "              | CH <sub>3</sub>                                                                    | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 250 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH | 20     |
| 251 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 252 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 253 | "              | H                                                                                  | COCH <sub>2</sub> Cl            | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 254 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 255 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 256 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 257 | "              | CH <sub>3</sub>                                                                    | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 258 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 259 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  | 30     |
| 260 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 261 | "              | H                                                                                  | COCHCl <sub>2</sub>             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 262 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 263 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 264 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 265 | "              | CH <sub>3</sub>                                                                    | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 266 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 267 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  | 40     |
| 268 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 269 | "              | H                                                                                  | COCCl <sub>3</sub>              | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |

| Vb. | R <sup>1</sup> | R <sup>4</sup>                                | R <sup>5</sup>                                | R <sup>7</sup> | X                | Y                | Z  | Fp. °C |
|-----|----------------|-----------------------------------------------|-----------------------------------------------|----------------|------------------|------------------|----|--------|
| 270 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 271 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 272 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 273 | "              | CH <sub>3</sub>                               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 274 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 275 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 276 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  | 10     |
| 277 | "              | H                                             | COCH=CH <sub>2</sub>                          | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 278 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 279 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 280 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 281 | "              | CH <sub>3</sub>                               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 282 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 283 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 284 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  | 20     |
| 285 | "              | H                                             | COC=CH                                        | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 286 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 287 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 288 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 289 | "              | CH <sub>3</sub>                               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 290 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 291 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 292 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 293 | "              | H                                             | COC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 30     |
| 294 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 295 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 296 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 297 | "              | CH <sub>3</sub>                               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 298 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 299 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 300 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 301 | "              | SO <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | SO <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 40     |
| 302 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 303 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 304 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |

| Vb. | R <sup>1</sup> | R <sup>4</sup>                  | R <sup>5</sup>                                | R <sup>7</sup> | X                | Y                | Z  | Fp. °C |
|-----|----------------|---------------------------------|-----------------------------------------------|----------------|------------------|------------------|----|--------|
| 305 | "              | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 306 | "              | "                               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 307 | "              | "                               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 308 | "              | "                               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 309 | "              | H                               | COCH <sub>2</sub> Br                          | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 310 | "              | "                               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 311 | "              | CH <sub>3</sub>                 | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 10     |
| 312 | "              | "                               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 313 | "              | H                               | COCH <sub>2</sub> F                           | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 314 | "              | "                               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 315 | "              | CH <sub>3</sub>                 | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 316 | "              | "                               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 317 | "              | H                               | COCH <sub>2</sub> C≡CH                        | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 318 | "              | "                               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 319 | "              | CH <sub>3</sub>                 | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 20     |
| 320 | "              | "                               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 321 | "              | H                               | COCO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 322 | "              | "                               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 323 | "              | CH <sub>3</sub>                 | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 324 | "              | "                               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 325 | "              | H                               | CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 326 | "              | "                               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 327 | "              | CH <sub>3</sub>                 | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 328 | "              | "                               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  | 30     |
| 329 | "              | H                               | COSCH <sub>3</sub>                            | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 330 | "              | "                               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 331 | "              | CH <sub>3</sub>                 | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 332 | "              | "                               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 333 | "              | H                               | CSOCH <sub>3</sub>                            | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 334 | "              | "                               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 335 | "              | CH <sub>3</sub>                 | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 336 | "              | "                               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 337 | "              | H                               | CSSCH <sub>3</sub>                            | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 40     |
| 338 | "              | "                               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 339 | "              | CH <sub>3</sub>                 | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |

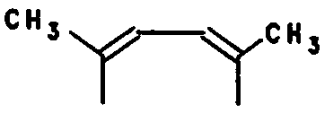
| Vb. | R <sup>1</sup> | R <sup>4</sup>  | R <sup>5</sup>                         | R <sup>7</sup> | X                | Y                | Z  | Fp. °C |
|-----|----------------|-----------------|----------------------------------------|----------------|------------------|------------------|----|--------|
| 340 | "              | "               | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 341 | "              | H               | COCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>    | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 342 | "              | "               | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 343 | "              | CH <sub>3</sub> | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 344 | "              | "               | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 345 | "              | H               | COC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>     | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 346 | "              | "               | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  | 10     |
| 347 | "              | CH <sub>3</sub> | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 348 | "              | "               | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 349 | "              | H               | CO-Cyclopropyl                         | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 350 | "              | "               | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 351 | "              | CH <sub>3</sub> | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 352 | "              | "               | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 353 | "              | H               | CO-Cyclobutyl                          | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 354 | "              | "               | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  | 20     |
| 355 | "              | CH <sub>3</sub> | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 356 | "              | "               | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 357 | "              | H               | CO-Cyclopentyl                         | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 358 | "              | "               | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 359 | "              | CH <sub>3</sub> | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 360 | "              | "               | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 361 | "              | H               | CO-Cyclohexyl                          | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 362 | "              | "               | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 363 | "              | CH <sub>3</sub> | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 30     |
| 364 | "              | "               | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 365 | "              | H               | CONHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 366 | "              | "               | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 367 | "              | CH <sub>3</sub> | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 368 | "              | "               | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 369 | "              | H               | CSNHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 370 | "              | "               | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 371 | "              | CH <sub>3</sub> | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 40     |
| 372 | "              | "               | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 373 | "              | H               | CONH-n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>   | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 374 | "              | "               | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |

| Vb. | R <sup>1</sup> | R <sup>4</sup>           | R <sup>5</sup>                                      | R <sup>7</sup> | X                | Y                | Z  | Fp. °C |
|-----|----------------|--------------------------|-----------------------------------------------------|----------------|------------------|------------------|----|--------|
| 375 | "              | CH <sub>3</sub>          | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 376 | "              | "                        | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 377 | "              | H                        | CSNHCH <sub>3</sub>                                 | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 378 | "              | "                        | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 379 | "              | CH <sub>3</sub>          | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 380 | "              | "                        | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 381 | "              | H                        | CSNHCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 10     |
| 382 | "              | "                        | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 383 | "              | CH <sub>3</sub>          | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 384 | "              | "                        | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 385 | "              | CH <sub>3</sub>          | CSNHCH <sub>2</sub> COCH <sub>3</sub>               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 386 | "              | "                        | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 387 | "              | CH <sub>3</sub>          | CSNHCH <sub>2</sub> COC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 388 | "              | "                        | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 389 | "              | CH <sub>3</sub>          | CONHCH <sub>2</sub> COCH <sub>3</sub>               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 20     |
| 390 | "              | "                        | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 391 | "              | CH <sub>3</sub>          | CONHCH <sub>2</sub> COC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 392 | "              | "                        | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 393 | "              | -CONHCH <sub>2</sub> CO- |                                                     | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 394 | "              | "                        |                                                     | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 395 | "              | H                        | SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F                   | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 396 | "              | "                        | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 397 | "              | CH <sub>3</sub>          | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 398 | "              | "                        | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  | 30     |
| 399 | "              | H                        | SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                     | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 400 | "              | "                        | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 401 | "              | CH <sub>3</sub>          | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 402 | "              | "                        | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 403 | "              | H                        | SO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>       | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 404 | "              | "                        | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 405 | "              | CH <sub>3</sub>          | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 406 | "              | "                        | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 407 | "              | H                        | SO <sub>2</sub> -n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>    | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 40     |
| 408 | "              | "                        | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 409 | "              | CH <sub>3</sub>          | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |

| Vb. | R <sup>1</sup> | R <sup>4</sup>   | R <sup>5</sup>                                  | R <sup>7</sup> | X                | Y                | Z  | Fp. °C |
|-----|----------------|------------------|-------------------------------------------------|----------------|------------------|------------------|----|--------|
| 410 | "              | "                | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 411 | "              | OH               | COC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                 | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 412 | "              | "                | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 413 | "              | OCH <sub>3</sub> | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 414 | "              | "                | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 415 | "              | OH               | COCH <sub>2</sub> Cl                            | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 416 | "              | "                | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  | 10     |
| 417 | "              | OCH <sub>3</sub> | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 418 | "              | "                | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 419 | "              | OH               | COCF <sub>3</sub>                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 420 | "              | "                | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 421 | "              | OCH <sub>3</sub> | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 422 | "              | "                | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 423 | "              | OH               | COCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>              | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 424 | "              | "                | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  | 20     |
| 425 | "              | OCH <sub>3</sub> | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 426 | "              | "                | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 427 | "              | OH               | COCO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 428 | "              | "                | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 429 | "              | OCH <sub>3</sub> | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 430 | "              | "                | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 431 | "              | OH               | COOCH <sub>3</sub>                              | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 432 | "              | "                | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 433 | "              | OCH <sub>3</sub> | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 30     |
| 434 | "              | "                | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 435 | "              | OH               | Cyclopropyl                                     | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 436 | "              | "                | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 437 | "              | OCH <sub>3</sub> | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 438 | "              | "                | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 439 | "              | OH               | COC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                 | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 440 | "              | "                | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 441 | "              | OCH <sub>3</sub> | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 40     |
| 442 | "              | "                | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 443 | "              | OH               | COCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 444 | "              | "                | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |

| Vb. | R <sup>1</sup> | R <sup>4</sup>                | R <sup>5</sup>                                   | R <sup>7</sup> | X                | Y                | Z  | Fp. °C |
|-----|----------------|-------------------------------|--------------------------------------------------|----------------|------------------|------------------|----|--------|
| 445 | "              | OCH <sub>3</sub>              | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 446 | "              | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 447 | "              | OH                            | COCH=CH <sub>2</sub>                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 448 | "              | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 449 | "              | OCH <sub>3</sub>              | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 450 | "              | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 451 | "              | OH                            | COC≡CH                                           | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 10     |
| 452 | "              | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 453 | "              | OCH <sub>3</sub>              | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 454 | "              | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 455 | "              | OH                            | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                  | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 456 | "              | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 457 | "              | OCH <sub>3</sub>              | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 458 | "              | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 459 | "              | OH                            | SO <sub>2</sub> NHCH <sub>3</sub>                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 20     |
| 460 | "              | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 461 | "              | OCH <sub>3</sub>              | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 462 | "              | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 463 | "              | OH                            | SO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 464 | "              | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 465 | "              | OCH <sub>3</sub>              | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 466 | "              | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 467 | "              | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | CHO                                              | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 468 | "              | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  | 30     |
| 469 | "              | "                             | COCH <sub>3</sub>                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 470 | "              | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 471 | "              | "                             | Cyclopropyl                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 472 | "              | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 473 | "              | "                             | COCH <sub>2</sub> Cl                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 474 | "              | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 475 | "              | "                             | COCF <sub>3</sub>                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 476 | "              | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 477 | "              | "                             | COOCH <sub>3</sub>                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 40     |
| 478 | "              | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 479 | "              | "                             | COC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                  | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |

| Vb. | R <sup>1</sup>                                | R <sup>4</sup>                | R <sup>5</sup>                                   | R <sup>7</sup> | X                | Y                | Z  | Fp. °C |
|-----|-----------------------------------------------|-------------------------------|--------------------------------------------------|----------------|------------------|------------------|----|--------|
| 480 | "                                             | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 481 | "                                             | "                             | CONHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 482 | "                                             | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 483 | "                                             | "                             | CSNHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 484 | "                                             | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 485 | "                                             | "                             | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                  | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 486 | "                                             | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  | 10     |
| 487 | "                                             | "                             | SO <sub>2</sub> NHCH <sub>3</sub>                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 488 | "                                             | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 489 | "                                             | "                             | SO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 490 | "                                             | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 491 | "                                             | "                             | SO <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>    | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 492 | "                                             | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 493 | CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | H                             | CHO                                              | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 494 | "                                             | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  | 20     |
| 495 | "                                             | "                             | COCH <sub>3</sub>                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 496 | "                                             | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 497 | "                                             | "                             | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                  | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 498 | "                                             | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 499 | "                                             | CH <sub>3</sub>               | CHO                                              | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 500 | "                                             | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 501 | "                                             | "                             | COCH <sub>3</sub>                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 502 | "                                             | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 503 | "                                             | "                             | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                  | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 30     |
| 504 | "                                             | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 505 | "                                             | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | CHO                                              | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 506 | "                                             | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 507 | "                                             | "                             | COCH <sub>3</sub>                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 508 | "                                             | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 509 | "                                             | "                             | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                  | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 510 | "                                             | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 511 | "                                             | OH                            | CHO                                              | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 40     |
| 512 | "                                             | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 513 | "                                             | "                             | COCH <sub>3</sub>                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 514 | "                                             | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |

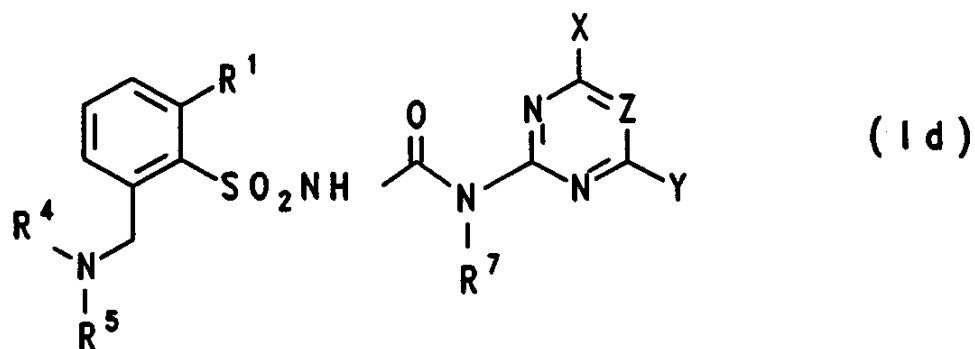
| Vb. | R <sup>1</sup>                  | R <sup>4</sup>                                                                      | R <sup>5</sup>                  | R <sup>7</sup> | X                                | Y                | Z  | Fp. °C       |
|-----|---------------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------|---------------------------------|----------------|----------------------------------|------------------|----|--------------|
| 515 | "                               | "                                                                                   | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H              | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub> | CH |              |
| 516 | "                               | "                                                                                   | "                               | H              | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>  | N  |              |
| 517 | "                               | OCH <sub>3</sub>                                                                    | CHO                             | H              | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub> | CH |              |
| 518 | "                               | "                                                                                   | "                               | H              | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>  | N  |              |
| 519 | "                               | "                                                                                   | COCH <sub>3</sub>               | H              | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub> | CH |              |
| 520 | "                               | "                                                                                   | "                               | H              | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>  | N  |              |
| 521 | COO-n-Bu                        | H                                                                                   | CHO                             | H              | "                                | OMe              | CH | 10           |
| 522 | CONMe <sub>2</sub>              | Me                                                                                  | "                               | H              | "                                | Me               | N  |              |
| 523 | CONHMe                          | H                                                                                   | "                               | H              | "                                | OMe              | CH |              |
| 524 | COSMe                           | Me                                                                                  | CO-Me                           | H              | "                                | Me               | N  |              |
| 525 | COOMe                           | n-Bu                                                                                | CHO                             | H              | "                                | OMe              | CH |              |
| 526 | "                               | "                                                                                   | "                               | H              | "                                | Me               | N  |              |
| 527 | "                               | H                                                                                   | "                               | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | NMe <sub>2</sub> | N  |              |
| 528 | "                               | Me                                                                                  | "                               | H              | "                                | "                | N  |              |
| 529 | "                               | H                                                                                   | CO-Me                           | H              | "                                | "                | N  |              |
| 530 | "                               | Me                                                                                  | "                               | H              | "                                | "                | N  | 20           |
| 531 | "                               | "                                                                                   | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H              | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub> | CH |              |
| 532 | "                               | "                                                                                   | "                               | H              | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>  | N  |              |
| 533 | "                               |  |                                 | H              | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub> | CH |              |
| 534 | "                               | "                                                                                   | "                               | H              | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>  | N  |              |
| 535 | CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H                                                                                   | COCH <sub>3</sub>               | H              | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub> | CH | Na- 塩<br>270 |

10

20

30

表 4



| Vb. | R <sup>1</sup>                  | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup> | R <sup>7</sup> | X                                | Y                                  | Z  | Fp. °C |
|-----|---------------------------------|----------------|----------------|----------------|----------------------------------|------------------------------------|----|--------|
| 1   | CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H              | CHO            | H              | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | CH |        |
| 2   | "                               | "              | "              | H              | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | CH |        |
| 3   | "                               | "              | "              | H              | CH <sub>3</sub>                  | CH <sub>3</sub>                    | CH |        |
| 4   | "                               | "              | "              | H              | CH <sub>3</sub>                  | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | CH |        |
| 5   | "                               | "              | "              | H              | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | N  |        |
| 6   | "                               | "              | "              | H              | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | N  |        |
| 7   | "                               | "              | "              | H              | OCH <sub>3</sub>                 | Cl                                 | CH |        |
| 8   | "                               | "              | "              | H              | OCF <sub>2</sub> H               | CH <sub>3</sub>                    | CH |        |
| 9   | "                               | "              | "              | H              | OCF <sub>2</sub> H               | OCF <sub>2</sub> H                 | CH |        |
| 10  | "                               | "              | "              | H              | OCH <sub>3</sub>                 | Br                                 | CH |        |
| 11  | "                               | "              | "              | H              | OCH <sub>3</sub>                 | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | CH |        |
| 12  | "                               | "              | "              | H              | OCH <sub>3</sub>                 | SCH <sub>3</sub>                   | CH |        |
| 13  | "                               | "              | "              | H              | OCH <sub>3</sub>                 | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | N  |        |
| 14  | "                               | "              | "              | H              | OCH <sub>3</sub>                 | OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>     | CH |        |
| 15  | "                               | "              | "              | H              | CH <sub>3</sub>                  | Cl                                 | CH |        |
| 16  | "                               | "              | "              | H              | Cl                               | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | CH |        |
| 17  | "                               | "              | "              | H              | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | CH |        |
| 18  | "                               | "              | "              | H              | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>    | OCH <sub>3</sub>                   | CH |        |
| 19  | "                               | "              | "              | H              | CF <sub>3</sub>                  | OCH <sub>3</sub>                   | CH |        |
| 20  | "                               | "              | "              | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>                    | CH |        |
| 21  | "                               | "              | "              | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                   | CH |        |
| 22  | "                               | "              | "              | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>   | CH |        |
| 23  | "                               | "              | "              | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                   | N  |        |
| 24  | "                               | "              | "              | H              | OCH <sub>3</sub>                 | CH(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CH |        |

10

20

30

40

| Vb. | R <sup>1</sup> | R <sup>4</sup>  | R <sup>5</sup>    | R <sup>7</sup>  | X                                | Y                                  | Z  | Fp. °C  |
|-----|----------------|-----------------|-------------------|-----------------|----------------------------------|------------------------------------|----|---------|
| 25  | "              | "               | "                 | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | CH |         |
| 26  | "              | "               | "                 | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | N  |         |
| 27  | "              | H               | COCH <sub>3</sub> | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | CH |         |
| 28  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | CH |         |
| 29  | "              | "               | "                 | H               | CH <sub>3</sub>                  | CH <sub>3</sub>                    | CH |         |
| 30  | "              | "               | "                 | H               | CH <sub>3</sub>                  | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | CH |         |
| 31  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | N  | 10      |
| 32  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | N  |         |
| 33  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | Cl                                 | CH |         |
| 34  | "              | "               | "                 | H               | OCF <sub>2</sub> H               | CH <sub>3</sub>                    | CH |         |
| 35  | "              | "               | "                 | H               | OCF <sub>2</sub> H               | OCF <sub>2</sub> H                 | CH |         |
| 36  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | Br                                 | CH |         |
| 37  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | CH |         |
| 38  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | SCH <sub>3</sub>                   | CH |         |
| 39  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | N  | 20      |
| 40  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>     | CH |         |
| 41  | "              | "               | "                 | H               | CH <sub>3</sub>                  | Cl                                 | CH |         |
| 42  | "              | "               | "                 | H               | Cl                               | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | CH |         |
| 43  | "              | "               | "                 | H               | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | CH |         |
| 44  | "              | "               | "                 | H               | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>    | OCH <sub>3</sub>                   | CH |         |
| 45  | "              | "               | "                 | H               | CF <sub>3</sub>                  | OCH <sub>3</sub>                   | CH |         |
| 46  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>                    | CH |         |
| 47  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                   | CH |         |
| 48  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>   | CH | 30      |
| 49  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                   | N  |         |
| 50  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | CH(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CH |         |
| 51  | "              | "               | "                 | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | CH |         |
| 52  | "              | "               | "                 | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | N  |         |
| 53  | "              | CH <sub>3</sub> | CHO               | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | CH | 150-151 |
| 54  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | CH |         |
| 55  | "              | "               | "                 | H               | CH <sub>3</sub>                  | CH <sub>3</sub>                    | CH |         |
| 56  | "              | "               | "                 | H               | CH <sub>3</sub>                  | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | CH |         |
| 57  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | N  | 40      |
| 58  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | N  |         |
| 59  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | Cl                                 | CH |         |

| Vb. | R <sup>1</sup> | R <sup>4</sup>  | R <sup>5</sup>    | R <sup>7</sup>  | X                                | Y                                  | Z  | Fp. °C |
|-----|----------------|-----------------|-------------------|-----------------|----------------------------------|------------------------------------|----|--------|
| 60  | "              | "               | "                 | H               | OCF <sub>2</sub> H               | CH <sub>3</sub>                    | CH |        |
| 61  | "              | "               | "                 | H               | OCF <sub>2</sub> H               | OCF <sub>2</sub> H                 | CH |        |
| 62  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | Br                                 | CH |        |
| 63  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | CH |        |
| 64  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | SCH <sub>3</sub>                   | CH |        |
| 65  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | N  |        |
| 66  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>     | CH | 10     |
| 67  | "              | "               | "                 | H               | CH <sub>3</sub>                  | Cl                                 | CH |        |
| 68  | "              | "               | "                 | H               | Cl                               | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | CH |        |
| 69  | "              | "               | "                 | H               | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | CH |        |
| 70  | "              | "               | "                 | H               | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>    | OCH <sub>3</sub>                   | CH |        |
| 71  | "              | "               | "                 | H               | CF <sub>3</sub>                  | OCH <sub>3</sub>                   | CH |        |
| 72  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>                    | CH |        |
| 73  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                   | CH |        |
| 74  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>   | CH | 20     |
| 75  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                   | N  |        |
| 76  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | CH(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CH |        |
| 77  | "              | "               | "                 | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | CH |        |
| 78  | "              | "               | "                 | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | N  |        |
| 79  | "              | CH <sub>3</sub> | COCH <sub>3</sub> | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | CH |        |
| 80  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | CH |        |
| 81  | "              | "               | "                 | H               | CH <sub>3</sub>                  | CH <sub>3</sub>                    | CH |        |
| 82  | "              | "               | "                 | H               | CH <sub>3</sub>                  | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | CH |        |
| 83  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | N  | 30     |
| 84  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | N  |        |
| 85  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | Cl                                 | CH |        |
| 86  | "              | "               | "                 | H               | OCF <sub>2</sub> H               | CH <sub>3</sub>                    | CH |        |
| 87  | "              | "               | "                 | H               | OCF <sub>2</sub> H               | OCF <sub>2</sub> H                 | CH |        |
| 88  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | Br                                 | CH |        |
| 89  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | CH |        |
| 90  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | SCH <sub>3</sub>                   | CH |        |
| 91  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | N  | 40     |
| 92  | "              | "               | "                 | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>     | CH |        |
| 93  | "              | "               | "                 | H               | CH <sub>3</sub>                  | Cl                                 | CH |        |
| 94  | "              | "               | "                 | H               | Cl                               | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | CH |        |

| Vb. | R <sup>1</sup> | R <sup>4</sup>   | R <sup>5</sup>                  | R <sup>7</sup>  | X                                | Y                                  | Z  | Fp. °C |
|-----|----------------|------------------|---------------------------------|-----------------|----------------------------------|------------------------------------|----|--------|
| 95  | "              | "                | "                               | H               | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | CH |        |
| 96  | "              | "                | "                               | H               | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>    | OCH <sub>3</sub>                   | CH |        |
| 97  | "              | "                | "                               | H               | CF <sub>3</sub>                  | OCH <sub>3</sub>                   | CH |        |
| 98  | "              | "                | "                               | H               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>                    | CH |        |
| 99  | "              | "                | "                               | H               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                   | CH |        |
| 100 | "              | "                | "                               | H               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>   | CH |        |
| 101 | "              | "                | "                               | H               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                   | N  | 10     |
| 102 | "              | "                | "                               | H               | OCH <sub>3</sub>                 | CH(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CH |        |
| 103 | "              | "                | "                               | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | CH |        |
| 104 | "              | "                | "                               | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | N  |        |
| 105 | "              | H                | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | CH |        |
| 106 | "              | "                | "                               | H               | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | CH |        |
| 107 | "              | "                | "                               | H               | CH <sub>3</sub>                  | CH <sub>3</sub>                    | CH |        |
| 108 | "              | "                | "                               | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | N  |        |
| 109 | "              | "                | "                               | H               | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | N  | 20     |
| 110 | "              | "                | "                               | H               | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | NHCH <sub>3</sub>                  | N  |        |
| 111 | "              | "                | "                               | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | CH |        |
| 112 | "              | "                | "                               | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | N  |        |
| 113 | "              | CH <sub>3</sub>  | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | CH |        |
| 114 | "              | "                | "                               | H               | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | CH |        |
| 115 | "              | "                | "                               | H               | CH <sub>3</sub>                  | CH <sub>3</sub>                    | CH |        |
| 116 | "              | "                | "                               | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | N  |        |
| 117 | "              | "                | "                               | H               | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | N  |        |
| 118 | "              | "                | "                               | H               | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | NHCH <sub>3</sub>                  | N  | 30     |
| 119 | "              | "                | "                               | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | CH |        |
| 120 | "              | "                | "                               | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | N  |        |
| 121 | "              | OH               | CHO                             | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | CH |        |
| 122 | "              | "                | "                               | H               | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | CH |        |
| 123 | "              | "                | "                               | H               | CH <sub>3</sub>                  | CH <sub>3</sub>                    | CH |        |
| 124 | "              | "                | "                               | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | N  |        |
| 125 | "              | "                | "                               | H               | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | N  |        |
| 126 | "              | "                | "                               | H               | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | NHCH <sub>3</sub>                  | N  | 40     |
| 127 | "              | "                | "                               | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | CH |        |
| 128 | "              | "                | "                               | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                    | N  |        |
| 129 | "              | OCH <sub>3</sub> | CHO                             | H               | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub>                   | CH |        |

| Vb. | R <sup>1</sup> | R <sup>4</sup>   | R <sup>5</sup>                     | R <sup>7</sup>  | X                              | Y                 | Z  | Fp. °C |
|-----|----------------|------------------|------------------------------------|-----------------|--------------------------------|-------------------|----|--------|
| 130 | "              | "                | "                                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | CH <sub>3</sub>   | CH |        |
| 131 | "              | "                | "                                  | H               | CH <sub>3</sub>                | CH <sub>3</sub>   | CH |        |
| 132 | "              | "                | "                                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | OCH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 133 | "              | "                | "                                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | CH <sub>3</sub>   | N  |        |
| 134 | "              | "                | "                                  | H               | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | NHCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 135 | "              | "                | "                                  | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>               | OCH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 136 | "              | "                | "                                  | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>               | CH <sub>3</sub>   | N  | 10     |
| 137 | "              | OH               | COCH <sub>3</sub>                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | OCH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 138 | "              | "                | "                                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | CH <sub>3</sub>   | CH |        |
| 139 | "              | "                | "                                  | H               | CH <sub>3</sub>                | CH <sub>3</sub>   | CH |        |
| 140 | "              | "                | "                                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | OCH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 141 | "              | "                | "                                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | CH <sub>3</sub>   | N  |        |
| 142 | "              | "                | "                                  | H               | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | NHCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 143 | "              | "                | "                                  | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>               | OCH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 144 | "              | "                | "                                  | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>               | CH <sub>3</sub>   | N  | 20     |
| 145 | "              | OCH <sub>3</sub> | COCH <sub>3</sub>                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | OCH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 146 | "              | "                | "                                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | CH <sub>3</sub>   | CH |        |
| 147 | "              | "                | "                                  | H               | CH <sub>3</sub>                | CH <sub>3</sub>   | CH |        |
| 148 | "              | "                | "                                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | OCH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 149 | "              | "                | "                                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | CH <sub>3</sub>   | N  |        |
| 150 | "              | "                | "                                  | H               | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | NHCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 151 | "              | "                | "                                  | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>               | OCH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 152 | "              | "                | "                                  | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub>               | CH <sub>3</sub>   | N  |        |
| 153 | "              | H                | COC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>    | H               | OCH <sub>3</sub>               | OCH <sub>3</sub>  | CH | 30     |
| 154 | "              | "                | "                                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | CH <sub>3</sub>   | CH |        |
| 155 | "              | "                | "                                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | OCH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 156 | "              | "                | "                                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | CH <sub>3</sub>   | N  |        |
| 157 | "              | CH <sub>3</sub>  | "                                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | OCH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 158 | "              | "                | "                                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | CH <sub>3</sub>   | CH |        |
| 159 | "              | "                | "                                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | OCH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 160 | "              | "                | "                                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | CH <sub>3</sub>   | N  |        |
| 161 | "              | H                | COCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub> | H               | OCH <sub>3</sub>               | OCH <sub>3</sub>  | CH | 40     |
| 162 | "              | "                | "                                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | CH <sub>3</sub>   | CH |        |
| 163 | "              | "                | "                                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | OCH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 164 | "              | "                | "                                  | H               | OCH <sub>3</sub>               | CH <sub>3</sub>   | N  |        |

| Vb. | R <sup>1</sup> | R <sup>4</sup>  | R <sup>5</sup>                                  | R <sup>7</sup> | X                | Y                | Z  | Fp. °C |
|-----|----------------|-----------------|-------------------------------------------------|----------------|------------------|------------------|----|--------|
| 165 | "              | CH <sub>3</sub> | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 166 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 167 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 168 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 169 | "              | H               | COCO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 170 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 171 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  | 10     |
| 172 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 173 | "              | CH <sub>3</sub> | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 174 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 175 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 176 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 177 | "              | H               | COCF <sub>3</sub>                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 178 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 179 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 180 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  | 20     |
| 181 | "              | CH <sub>3</sub> | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 182 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 183 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 184 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 185 | "              | H               | COOCH <sub>3</sub>                              | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 186 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 187 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 188 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  | 30     |
| 189 | "              | CH <sub>3</sub> | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 190 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 191 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 192 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 193 | "              | H               | CONHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 194 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 195 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 196 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 197 | "              | CH <sub>3</sub> | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 40     |
| 198 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 199 | "              | "               | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |

| Vb. | R <sup>1</sup> | R <sup>4</sup>                                                       | R <sup>5</sup>                                   | R <sup>7</sup> | X                | Y                | Z  | Fp. °C |
|-----|----------------|----------------------------------------------------------------------|--------------------------------------------------|----------------|------------------|------------------|----|--------|
| 200 | "              | "                                                                    | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 201 | "              | H                                                                    | CSNHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 202 | "              | "                                                                    | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 203 | "              | "                                                                    | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 204 | "              | "                                                                    | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 205 | "              | CH <sub>3</sub>                                                      | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 206 | "              | "                                                                    | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH | 10     |
| 207 | "              | "                                                                    | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 208 | "              | "                                                                    | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 209 | "              | H                                                                    | SO <sub>2</sub> NHCH <sub>3</sub>                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 210 | "              | "                                                                    | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 211 | "              | "                                                                    | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 212 | "              | "                                                                    | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 213 | "              | CH <sub>3</sub>                                                      | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 214 | "              | "                                                                    | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH | 20     |
| 215 | "              | "                                                                    | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 216 | "              | "                                                                    | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 217 | "              | H                                                                    | SO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 218 | "              | "                                                                    | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 219 | "              | "                                                                    | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 220 | "              | "                                                                    | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 221 | "              | CH <sub>3</sub>                                                      | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 222 | "              | "                                                                    | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 223 | "              | "                                                                    | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  | 30     |
| 224 | "              | "                                                                    | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 225 | "              | -CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CO-                 |                                                  | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 226 | "              | "                                                                    |                                                  | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 227 | "              | "                                                                    |                                                  | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 228 | "              | "                                                                    |                                                  | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 229 | "              | -CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> -   |                                                  | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 230 | "              | "                                                                    |                                                  | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 231 | "              | "                                                                    |                                                  | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  | 40     |
| 232 | "              | "                                                                    |                                                  | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 233 | "              | -CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CO- |                                                  | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 234 | "              | "                                                                    |                                                  | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |

| Vb. | R <sup>1</sup> | R <sup>4</sup>                                                                     | R <sup>5</sup>                  | R <sup>7</sup> | X                | Y                | Z  | Fp. °C |
|-----|----------------|------------------------------------------------------------------------------------|---------------------------------|----------------|------------------|------------------|----|--------|
| 235 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 236 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 237 | "              | -CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> - | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 238 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 239 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 240 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 241 | "              | -CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -                | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 10     |
| 242 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 243 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 244 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 245 | "              | H                                                                                  | COC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 246 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 247 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 248 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 249 | "              | CH <sub>3</sub>                                                                    | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 20     |
| 250 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 251 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 252 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 253 | "              | H                                                                                  | COCH <sub>2</sub> Cl            | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 254 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 255 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 256 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 257 | "              | CH <sub>3</sub>                                                                    | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 258 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH | 30     |
| 259 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 260 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 261 | "              | H                                                                                  | COCHCl <sub>2</sub>             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 262 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 263 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 264 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 265 | "              | CH <sub>3</sub>                                                                    | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 266 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 267 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  | 40     |
| 268 | "              | "                                                                                  | "                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 269 | "              | H                                                                                  | COCCl <sub>3</sub>              | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |

| Vb. | R <sup>1</sup> | R <sup>4</sup>                                | R <sup>5</sup>                                | R <sup>7</sup> | X                | Y                | Z  | Fp. °C |
|-----|----------------|-----------------------------------------------|-----------------------------------------------|----------------|------------------|------------------|----|--------|
| 270 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 271 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 272 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 273 | "              | CH <sub>3</sub>                               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 274 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 275 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 276 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  | 10     |
| 277 | "              | H                                             | COCH=CH <sub>2</sub>                          | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 278 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 279 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 280 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 281 | "              | CH <sub>3</sub>                               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 282 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 283 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 284 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  | 20     |
| 285 | "              | H                                             | COC=CH                                        | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 286 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 287 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 288 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 289 | "              | CH <sub>3</sub>                               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 290 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 291 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 292 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 293 | "              | H                                             | COC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 30     |
| 294 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 295 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 296 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 297 | "              | CH <sub>3</sub>                               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 298 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 299 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 300 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 301 | "              | SO <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | SO <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 40     |
| 302 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 303 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 304 | "              | "                                             | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |

| Vb. | R <sup>1</sup> | R <sup>4</sup>                  | R <sup>5</sup>                                | R <sup>7</sup> | X                | Y                | Z  | Fp. °C |
|-----|----------------|---------------------------------|-----------------------------------------------|----------------|------------------|------------------|----|--------|
| 305 | "              | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 306 | "              | "                               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH |        |
| 307 | "              | "                               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | N  |        |
| 308 | "              | "                               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 309 | "              | H                               | COCH <sub>2</sub> Br                          | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 310 | "              | "                               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 311 | "              | CH <sub>3</sub>                 | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 10     |
| 312 | "              | "                               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 313 | "              | H                               | COCH <sub>2</sub> F                           | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 314 | "              | "                               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 315 | "              | CH <sub>3</sub>                 | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 316 | "              | "                               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 317 | "              | H                               | COCH <sub>2</sub> C=CH                        | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 318 | "              | "                               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 319 | "              | CH <sub>3</sub>                 | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 20     |
| 320 | "              | "                               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 321 | "              | H                               | COCO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 322 | "              | "                               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 323 | "              | CH <sub>3</sub>                 | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 324 | "              | "                               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 325 | "              | H                               | CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 326 | "              | "                               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 327 | "              | CH <sub>3</sub>                 | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 328 | "              | "                               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  | 30     |
| 329 | "              | H                               | COSCH <sub>3</sub>                            | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 330 | "              | "                               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 331 | "              | CH <sub>3</sub>                 | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 332 | "              | "                               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 333 | "              | H                               | CSOCH <sub>3</sub>                            | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 334 | "              | "                               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 335 | "              | CH <sub>3</sub>                 | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 336 | "              | "                               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  | 40     |
| 337 | "              | H                               | CSSCH <sub>3</sub>                            | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 338 | "              | "                               | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 339 | "              | CH <sub>3</sub>                 | "                                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |

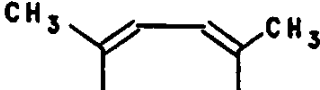
| Vb. | R <sup>1</sup> | R <sup>4</sup>  | R <sup>5</sup>                         | R <sup>7</sup> | X                | Y                | Z  | Fp. °C |
|-----|----------------|-----------------|----------------------------------------|----------------|------------------|------------------|----|--------|
| 340 | "              | "               | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 341 | "              | H               | COCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>    | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 342 | "              | "               | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 343 | "              | CH <sub>3</sub> | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 344 | "              | "               | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 345 | "              | H               | COC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>     | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 346 | "              | "               | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  | 10     |
| 347 | "              | CH <sub>3</sub> | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 348 | "              | "               | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 349 | "              | H               | CO-Cyclopropyl                         | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 350 | "              | "               | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 351 | "              | CH <sub>3</sub> | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 352 | "              | "               | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 353 | "              | H               | CO-Cyclobutyl                          | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 354 | "              | "               | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  | 20     |
| 355 | "              | CH <sub>3</sub> | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 356 | "              | "               | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 357 | "              | H               | CO-Cyclopentyl                         | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 358 | "              | "               | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 359 | "              | CH <sub>3</sub> | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 360 | "              | "               | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 361 | "              | H               | CO-Cyclohexyl                          | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 362 | "              | "               | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 363 | "              | CH <sub>3</sub> | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 30     |
| 364 | "              | "               | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 365 | "              | H               | CONHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 366 | "              | "               | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 367 | "              | CH <sub>3</sub> | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 368 | "              | "               | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 369 | "              | H               | CSNHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 370 | "              | "               | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 371 | "              | CH <sub>3</sub> | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 40     |
| 372 | "              | "               | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 373 | "              | H               | CONH-n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>   | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 374 | "              | "               | "                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |

| Vb. | R <sup>1</sup> | R <sup>4</sup>           | R <sup>5</sup>                                      | R <sup>7</sup> | X                | Y                | Z  | Fp. °C |
|-----|----------------|--------------------------|-----------------------------------------------------|----------------|------------------|------------------|----|--------|
| 375 | "              | CH <sub>3</sub>          | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 376 | "              | "                        | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 377 | "              | H                        | CSNHCH <sub>3</sub>                                 | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 378 | "              | "                        | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 379 | "              | CH <sub>3</sub>          | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 380 | "              | "                        | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 381 | "              | H                        | CSNHCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 10     |
| 382 | "              | "                        | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 383 | "              | CH <sub>3</sub>          | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 384 | "              | "                        | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 385 | "              | CH <sub>3</sub>          | CSNHCH <sub>2</sub> COCH <sub>3</sub>               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 386 | "              | "                        | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 387 | "              | CH <sub>3</sub>          | CSNHCH <sub>2</sub> COC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 388 | "              | "                        | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 389 | "              | CH <sub>3</sub>          | CONHCH <sub>2</sub> COCH <sub>3</sub>               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 20     |
| 390 | "              | "                        | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 391 | "              | CH <sub>3</sub>          | CONHCH <sub>2</sub> COC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 392 | "              | "                        | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 393 | "              | -CONHCH <sub>2</sub> CO- | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 394 | "              | "                        | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 395 | "              | H                        | SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F                   | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 396 | "              | "                        | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 397 | "              | CH <sub>3</sub>          | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 398 | "              | "                        | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  | 30     |
| 399 | "              | H                        | SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                     | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 400 | "              | "                        | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 401 | "              | CH <sub>3</sub>          | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 402 | "              | "                        | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 403 | "              | H                        | SO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>       | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 404 | "              | "                        | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 405 | "              | CH <sub>3</sub>          | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 406 | "              | "                        | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 407 | "              | H                        | SO <sub>2</sub> -n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>    | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 40     |
| 408 | "              | "                        | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 409 | "              | CH <sub>3</sub>          | "                                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |

| Vb. | R <sup>1</sup> | R <sup>4</sup>   | R <sup>5</sup>                                  | R <sup>7</sup> | X                | Y                | Z  | Fp. °C |
|-----|----------------|------------------|-------------------------------------------------|----------------|------------------|------------------|----|--------|
| 410 | "              | "                | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 411 | "              | OH               | COC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                 | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 412 | "              | "                | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 413 | "              | OCH <sub>3</sub> | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 414 | "              | "                | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 415 | "              | OH               | COCH <sub>2</sub> Cl                            | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 416 | "              | "                | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  | 10     |
| 417 | "              | OCH <sub>3</sub> | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 418 | "              | "                | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 419 | "              | OH               | COCF <sub>3</sub>                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 420 | "              | "                | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 421 | "              | OCH <sub>3</sub> | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 422 | "              | "                | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 423 | "              | OH               | COCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>              | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 424 | "              | "                | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  | 20     |
| 425 | "              | OCH <sub>3</sub> | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 426 | "              | "                | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 427 | "              | OH               | COCO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 428 | "              | "                | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 429 | "              | OCH <sub>3</sub> | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 430 | "              | "                | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 431 | "              | OH               | COOCH <sub>3</sub>                              | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 432 | "              | "                | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 433 | "              | OCH <sub>3</sub> | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 30     |
| 434 | "              | "                | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 435 | "              | OH               | Cyclopropyl                                     | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 436 | "              | "                | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 437 | "              | OCH <sub>3</sub> | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 438 | "              | "                | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 439 | "              | OH               | COC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                 | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 440 | "              | "                | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 441 | "              | OCH <sub>3</sub> | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 40     |
| 442 | "              | "                | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 443 | "              | OH               | COCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 444 | "              | "                | "                                               | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |

| Vb. | R <sup>1</sup> | R <sup>4</sup>                | R <sup>5</sup>                                   | R <sup>7</sup> | X                | Y                | Z  | Fp. °C |
|-----|----------------|-------------------------------|--------------------------------------------------|----------------|------------------|------------------|----|--------|
| 445 | "              | OCH <sub>3</sub>              | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 446 | "              | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 447 | "              | OH                            | COCH=CH <sub>2</sub>                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 448 | "              | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 449 | "              | OCH <sub>3</sub>              | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 450 | "              | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 451 | "              | OH                            | COC≡CH                                           | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 10     |
| 452 | "              | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 453 | "              | OCH <sub>3</sub>              | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 454 | "              | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 455 | "              | OH                            | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                  | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 456 | "              | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 457 | "              | OCH <sub>3</sub>              | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 458 | "              | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 459 | "              | OH                            | SO <sub>2</sub> NHCH <sub>3</sub>                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 20     |
| 460 | "              | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 461 | "              | OCH <sub>3</sub>              | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 462 | "              | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 463 | "              | OH                            | SO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 464 | "              | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 465 | "              | OCH <sub>3</sub>              | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 466 | "              | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 467 | "              | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | CHO                                              | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 468 | "              | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  | 30     |
| 469 | "              | "                             | COCH <sub>3</sub>                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 470 | "              | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 471 | "              | "                             | Cyclopropyl                                      | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 472 | "              | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 473 | "              | "                             | COCH <sub>2</sub> Cl                             | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 474 | "              | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 475 | "              | "                             | COCF <sub>3</sub>                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 476 | "              | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 477 | "              | "                             | COOCH <sub>3</sub>                               | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 40     |
| 478 | "              | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 479 | "              | "                             | COC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                  | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |

| Vb. | R <sup>1</sup>                                | R <sup>4</sup>                | R <sup>5</sup>                                   | R <sup>7</sup> | X                | Y                | Z  | Fp. °C |
|-----|-----------------------------------------------|-------------------------------|--------------------------------------------------|----------------|------------------|------------------|----|--------|
| 480 | "                                             | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 481 | "                                             | "                             | CONHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 482 | "                                             | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 483 | "                                             | "                             | CSNHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 484 | "                                             | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 485 | "                                             | "                             | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                  | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 486 | "                                             | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  | 10     |
| 487 | "                                             | "                             | SO <sub>2</sub> NHCH <sub>3</sub>                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 488 | "                                             | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 489 | "                                             | "                             | SO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 490 | "                                             | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 491 | "                                             | "                             | SO <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>    | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 492 | "                                             | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 493 | CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | H                             | CHO                                              | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 494 | "                                             | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  | 20     |
| 495 | "                                             | "                             | COCH <sub>3</sub>                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 496 | "                                             | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 497 | "                                             | "                             | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                  | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 498 | "                                             | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 499 | "                                             | CH <sub>3</sub>               | CHO                                              | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 500 | "                                             | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 501 | "                                             | "                             | COCH <sub>3</sub>                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 502 | "                                             | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 503 | "                                             | "                             | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                  | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 30     |
| 504 | "                                             | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 505 | "                                             | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | CHO                                              | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 506 | "                                             | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 507 | "                                             | "                             | COCH <sub>3</sub>                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 508 | "                                             | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 509 | "                                             | "                             | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                  | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 510 | "                                             | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 511 | "                                             | OH                            | CHO                                              | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH | 40     |
| 512 | "                                             | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 513 | "                                             | "                             | COCH <sub>3</sub>                                | H              | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 514 | "                                             | "                             | "                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | N  |        |

| Vb. | R <sup>1</sup>                  | R <sup>4</sup>                                                                      | R <sup>5</sup>                  | R <sup>7</sup> | X                                | Y                | Z  | Fp. °C |
|-----|---------------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------|---------------------------------|----------------|----------------------------------|------------------|----|--------|
| 515 | "                               | "                                                                                   | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H              | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 516 | "                               | "                                                                                   | "                               | H              | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 517 | "                               | OCH <sub>3</sub>                                                                    | CHO                             | H              | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 518 | "                               | "                                                                                   | "                               | H              | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 519 | "                               | "                                                                                   | COCH <sub>3</sub>               | H              | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 520 | "                               | "                                                                                   | "                               | H              | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 521 | COO-n-Bu                        | H                                                                                   | CHO                             | H              | "                                | OMe              | CH | 10     |
| 522 | CONMe <sub>2</sub>              | Me                                                                                  | "                               | H              | "                                | Me               | N  |        |
| 523 | CONHMe                          | H                                                                                   | "                               | H              | "                                | OMe              | CH |        |
| 524 | CO-SMe                          | Me                                                                                  | CO-Me                           | H              | "                                | Me               | N  |        |
| 525 | CO-OMe                          | n-Bu                                                                                | CHO                             | H              | "                                | OMe              | CH |        |
| 526 | "                               | n-Bu                                                                                | "                               | H              | "                                | Me               | N  |        |
| 527 | "                               | H                                                                                   | "                               | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | NMe <sub>2</sub> | N  |        |
| 528 | "                               | Me                                                                                  | "                               | H              | "                                | "                | N  |        |
| 529 | "                               | H                                                                                   | CO-Me                           | H              | "                                | "                | N  |        |
| 530 | "                               | Me                                                                                  | "                               | H              | "                                | "                | N  | 20     |
| 531 | "                               | "                                                                                   | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H              | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 532 | "                               | "                                                                                   | "                               | H              | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>  | N  |        |
| 533 | CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |  |                                 | H              | OCH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub> | CH |        |
| 534 | "                               | "                                                                                   | "                               | H              | OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>  | N  |        |

## B. 製剤例

a) 式 (I) の化合物 10 重量部および不活性物質としてタルク 90 重量部を混合しそしてハンマーミルで粉碎することによって粉剤が得られる。

b) 式 (I) の化合物 25 重量部、不活性物質としてカオリン含有石英 64 重量部、リグニンスルホン酸カリウム 10 重量部および湿潤および分散剤としてオレイルメチルタウリン酸ナトリウム 1 重量部を混合し、そしてピンディスクミルで粉碎することによって、水中で容易に分散しうる水和剤が得られる。

c) 式 (I) の化合物 20 重量部を、アルキルフエノールポリグリコールエーテル [(<sup>R</sup>) トリトン ((<sup>R</sup>) Triton) X 207] 6 重量部、イソトリデカノールポリグリコールエーテル (EO 8 単位) 3 重量部およびパラフィン系鉱油 (沸騰範囲例えば約 255 ないし 277 °C 以上) と混合し、そしてボールミルで 5 ミクロン以下の微細度まで粉碎することによって、水中で容易に分散されうる分散濃縮物が得られる。

d) 式 (I) の化合物 15 重量部、溶媒としてシクロヘキサノン 75 重量部および乳化剤としてオキシエチル化ノニルフエノール 10 重量部から乳剤が得られる。

e) 式 (I) の化合物 75 重量部  
 リグニンスルホン酸カルシウム 10 "  
 ラウリル硫酸ナトリウム 5 "  
 ポリビニルアルコールおよび 3 "  
 カオリン 7 "

以上のものを混合し、ピンディスクミルで粉碎し、そしてこの粉末を流動床において造粒液体としての水により噴霧して粒状化することによって、水中で分散されうる粒剤が得ら

10

20

30

40

50

れる。

|                                  |         |
|----------------------------------|---------|
| f) 式 (I) の化合物                    | 2 5 重量部 |
| 2, 2'-ジナフチルメタン-6, 6'-ジスルホン酸ナトリウム | 5 "     |
| オレイルメチルタウリン酸ナトリウム                | 2 "     |
| ポリビニルアルコール                       | 1 "     |
| 炭酸カルシウムおよび                       | 1 7 "   |
| 水                                | 5 0 重量部 |

以上のものをコロイドミルで均質化し、粉碎し、次いでビーズミルで細碎しそしてこのようにして得られた懸濁物をスプレー塔内で単一物質ノズルによって噴霧しそして乾燥することによって、水中で分散されうる粒剤が得られる。

10

### C. 生物試験例

#### 1. 発芽前処理における除草効果

単子葉および双子葉の雑草植物の種子および／または根茎の断片をプラスチックポットの砂の多いローム質の土の中に植付けそして土で覆う。次に、水和剤または乳剤の形態に製剤された本発明による式 (I) の化合物またはその塩を水性懸濁剤または乳剤として 6 0 0 ないし 8 0 0 l / h a の換算された水使用量において種々の施用量で覆土の表面上に施用する。

処理後に上記のポットを温室内に移し、そして雑草にとって良好な成育条件に保つ。3 ないし 4 週間の試験期間の後に、未処理の対照植物に比較した試験植物の発芽後の植物または発芽への葉害の視覚的な評価を行った。試験結果が示すように、本発明による化合物は、広範なイネ科の雑草類およびその他の雑草類に対してすぐれた発芽前処理除草効果を示す。例えば、表 1 からの例 1, 2 7, 5 3 ~ 5 5, 5 8, 5 9, 7 9, 1 0 5, 1 1 3, 1 2 9, 1 4 5, 1 5 3, 1 7 7, 1 8 1, 1 8 5, 1 8 9, 2 1 3, 2 1 7, 2 2 1, 2 5 3, 2 5 7, 4 2 1, 4 2 5, 4 2 9, 4 3 3, 4 3 7, 4 4 5, 4 5 7, 4 6 1, 4 6 5, 4 6 7, 4 8 5, 4 8 7, 5 3 5 ~ 5 4 3, 5 4 7, 5 5 1 ~ 5 5 9, 5 6 2, 5 6 3 および 5 6 5 ~ 5 7 8 の化合物ならびに表 2 からの例 1, 2 7, 5 3, 7 9, 1 5 3, 1 6 1, 1 6 9, 1 7 7, 1 8 1, 1 8 5, 2 5 3, 2 6 1, 2 6 9, 3 4 1, 3 4 9, 3 6 5 および 3 7 3 の化合物ならびに表 3 からの例 2 7 および 5 3 5 の化合物ならびに表 4 からの例 5 3 の化合物は、発芽前処理法において 1 ヘクタールあたり有効物質 0. 3 k g ないし 0. 0 0 5 k g の施用量においてカラシナ (*Sinapis alba*)、ハコベ (*Stellaria media*)、キクの類 (*Chrysanthemum segetum*) およびライグラス (*Lolium multiflorum*) のような有害植物に対して極めてすぐれた除草効果を示す。

20

30

#### 2. 発芽後処理における除草効果

単子葉および双子葉の雑草類の種子および／または根茎の断片をプラスチックポット内の砂の多いローム質の土の中に植付け、土で覆いそして温室内で良好な成育条件下で栽培する。播種の 3 週間後に、三葉期の段階の試験植物を処理する。水和剤および／または乳剤として製剤された本発明による式 (I) の化合物またはその塩を、6 0 0 ないし 8 0 0 l / h a の換算された水使用量において種々の施用量で植物の緑色部分に噴霧し、そして温室内において最適の成育条件下で試験植物を約 3 ないし 4 週間栽培した後、葉剤の効果を未処理の対照と比較して視覚的に評価する。本発明による葉剤は、発芽後処理においても広範にわたる経済的に重要なイネ科の雑草類およびその他の雑草類に対してすぐれた除草効果を示す。例えば、表 1 からの例 1, 2 7, 5 3 ~ 5 5, 5 8, 5 9, 7 9, 1 0 5, 1 1 3, 1 2 9, 1 4 5, 1 5 3, 1 7 7, 1 8 1, 1 8 5, 1 8 9, 2 1 3, 2 1 7, 2 2 1, 2 5 3, 2 5 7, 4 2 1, 4 2 5, 4 2 9, 4 3 3, 4 3 7, 4 4 5, 4 5 7, 4 6 1, 4 6 5, 4 6 7, 4 8 5, 4 8 7, 5 3 5 ~ 5 4 3, 5 4 7, 5 5 1 ~ 5 5 9, 5 6 2, 5 6 3 および 5 6 5 ~ 5 7 8 の化合物ならびに表 2 からの例 1, 2 7, 5 3, 7 9, 1 5 3, 1 6 1, 1 6 9, 1 7 7, 1 8 1, 1 8 5, 2 5 3, 2 6 1, 2 6 9, 3 4 1, 3 4 9, 3 6 5 および 3 7 3 の化合物ならびに表 3 からの例 2 7 および 5 3 5 の化合物ならびに表 4 からの例 5 3 の化合物は、カラシナ (*Sinapis alba*)、ハコベ (*Stellaria media*)、キクの類 (*Chrysanthemum segetum*) およびライグラス (*Lolium multiflorum*) のような有害植物に対して極めてすぐれた除草効果を示す。

40

50

) のような有害植物に対して発芽後処理法において 1 ヘクタールあたり 0.3 kg ないし 0.005 kg の施用量において極めてすぐれた除草効果を示す。

### 3. 栽培植物に対する許容性

温室内におけるその他の試験において、多数の栽培植物および雑草植物の種子を砂の多いローム質の土の中に植付けそして土で覆った。

ポットのうちの一部のものは、直ちに上記の 1. に記載したように処理し、残部は、温室内において、植物を 2 枚ないし 3 枚の本葉が生えるまで成育させ、そして次に本発明による式 (I) の物質またはその塩を 2. において記載したように種々の施用量において噴霧した。

施用および温室内における栽培の 4 ないし 5 週間後に、視覚的な評価によって、本発明による化合物が例えば、ダイズ、ワタ、ナタネ、テンサイおよびバレイショのような双子葉の栽培植物に対して、発芽前および発芽後処理法において有効物質の高い施用量においても薬害を与えないことが立証された。いくつかの有効物質は、更に例えばオオムギ、コムギ、ライムギ、ソルガム類、トウモロコシまたはイネのようなイネ科の栽培植物にたいしても薬害をもたらしさない。従って、式 (I) の化合物またはその塩は、農作物における望ましくない植物の生長の防除に使用する場合において高い選択性を示す。

フロントページの続き

(51)Int.Cl.

F I

**C 0 7 D 239/42 (2006.01)**

A 0 1 P 13/00

**C 0 7 D 251/46 (2006.01)**

A 0 1 P 21/00

C 0 7 D 239/42

Z

C 0 7 D 251/46

F

(72)発明者 ローレンツ・クラウス

ドイツ連邦共和国、デー - 6 4 3 3 1 ヴァイターシュタット、フォル・デア・グルーベ、9

(72)発明者 ヴィルムス・ロタール

ドイツ連邦共和国、デー - 6 5 7 1 9 ホーフハイム、ケーニッヒシュタイナー・ストラーセ、5  
9

(72)発明者 バウアー・クラウス

ドイツ連邦共和国、デー - 6 3 4 5 6 ハナウ、ドールナー・ストラーセ、53デー

(72)発明者 ビーリンガー・ヘルマン

ドイツ連邦共和国、デー - 6 5 8 1 7 エップシュタイン/タウヌス、アイヒェンヴェーク、26

審査官 谷尾 忍

(56)参考文献 米国特許第04927453 (US, A)

特開昭62-016457 (JP, A)

国際公開第89/010921 (WO, A1)

特許第3365633 (JP, B2)

米国特許第4981509 (US, A)

米国特許第4892946 (US, A)

特開昭62-129276 (JP, A)

特開昭59-152377 (JP, A)

特開平2-207075 (JP, A)

(58)調査した分野(Int.Cl., DB名)

C07D213/85

A01N 47/34

A01N 47/36

C07D239/42

C07D251/46

CA(STN)

CAOLD(STN)

REGISTRY(STN)