

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 公表特許公報(A)

(11) 特許出願公表番号

特表2007-537172

(P2007-537172A)

(43) 公表日 平成19年12月20日(2007.12.20)

(51) Int. Cl.	F I	テーマコード (参考)
AO1N 25/32 (2006.01)	AO1N 25/32	4CO50
CO7D 409/14 (2006.01)	CO7D 409/14 CSP	4CO63
CO7D 491/056 (2006.01)	CO7D 491/056	4HO11
CO7D 409/04 (2006.01)	CO7D 409/04	
CO7D 241/44 (2006.01)	CO7D 241/44	

審査請求 未請求 予備審査請求 未請求 (全 184 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号	特願2007-511945 (P2007-511945)	(71) 出願人	507203353 バイエル・クロップサイエンス・アーゲー BAYER CROPPSCIENCE A G
(86) (22) 出願日	平成17年4月26日 (2005.4.26)		
(85) 翻訳文提出日	平成18年12月27日 (2006.12.27)		
(86) 国際出願番号	PCT/EP2005/004445		
(87) 国際公開番号	W02005/112630		ドイツ国、40789 モンハイム、アル フレートーノベルーシュトラーセ 50
(87) 国際公開日	平成17年12月1日 (2005.12.1)		
(31) 優先権主張番号	102004023332.2	(74) 代理人	100091731 弁理士 高木 千嘉
(32) 優先日	平成16年5月12日 (2004.5.12)	(74) 代理人	100127926 弁理士 結田 純次
(33) 優先権主張国	ドイツ (DE)	(74) 代理人	100105290 弁理士 三輪 昭次
		(72) 発明者	ヴォルフガング・シャーパー ドイツ連邦共和国86420ディードルフ ・カペレンヴェーク5c

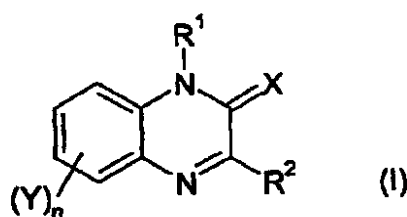
最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 キノキサリン-2-オン誘導体、該誘導体を含む農作物保護剤、並びにそれらの製法及び使用

(57) 【要約】

本発明は、式(I)の化合物又はそれらの塩に関するものであり、ここにおいて、X=O 又はS、(Y)_n=n個の置換基Y、n=0、1、2、3又は4、R¹=H、OH、NH₂、(C₁-C₄)-アルキルアミノ、ジ-[C₁-C₄-アルキル]アミノ又は場合によっては置換されたC₁-C₁₀-アルキル、C₃-C₁₀-アルケニル、C₃-C₁₀-アルキニル又はC₁-C₁₀-アルコキシ、C₃-C₁₀-シクロアルキル、C₄-C₁₀-シクロアルケニル、アリール又はヘテロシクリルであり、R²=H 又は場合によっては置換されたC₁-C₁₀-アルキル、C₃-C₁₀-アルケニル、C₃-C₁₀-アルキニル、C₃-C₁₀-シクロアルキル、C₄-C₁₀-シクロアルケニル、アリール又はヘテロシクリルであり、ここにおいて置換基Yは請求項1において定義した通りであり、これらは栽培植物又は作物にとっての農薬のような農業薬品の植物毒性作用に対する薬害軽減剤として好適である。

【化1】

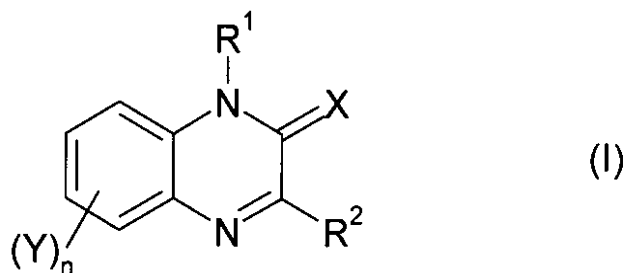


【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I) :

【化 1】



10

で表される化合物又はその塩の、有用植物又は作物植物に対する農業化学品の植物毒性作用を阻止し又は減少させるための薬害軽減剤としての使用。

式中、

Xは酸素又は硫黄であり；

(Y)_nはn個の置換基Yであり、ここでYはそれぞれ他の基から独立にハロゲン、シアノ、ニトロ、(C₁-C₆)-アルキル、(C₂-C₆)-アルケニル、(C₂-C₆)-アルキニル、(C₁-C₆)-アルコキシ、(C₁-C₆)-アルキルチオ、(C₁-C₆)-アルキルスルフィニル、(C₁-C₆)-アルキルスルホニル、(C₁-C₆)-アルコキシカルボニル、(C₁-C₄)-アルキルアミノ又はジ-[(C₁-C₄)-アルキル]アミノ基 [ここですぐ前に記載した10の基のそれぞれは無置換であるか又はハロゲン、(C₁-C₄)-アルコキシ、(C₁-C₄)-ハロアルコキシ及び(C₁-C₄)-アルキルチオからなる群から選択される一つ若しくはそれより多い基で置換される]、又は(C₃-C₆)-シクロアルキル、(C₄-C₆)-シクロアルケニル、アリール若しくはヘテロシクリル [ここですぐ前に記載した4つの基のそれぞれは無置換であるか又はハロゲン、シアノ、ニトロ、(C₁-C₄)-アルキル、(C₁-C₄)-ハロアルキル、(C₁-C₄)-アルコキシ-(C₁-C₄)-アルキル、(C₁-C₄)-アルコキシ、(C₁-C₄)-ハロアルコキシ、(C₁-C₄)-アルコキシ-(C₁-C₄)-アルコキシ及び(C₁-C₄)-アルキルチオからなる群から選択される一つ若しくはそれより多い基で置換される]であり、

20

又は、

隣接する2個のY基は直接結合している炭素原子と一緒に、炭素環又はヘテロ環である4～8員の縮合環であり、N、O及びSからなる群から選択される一つ若しくはそれより多いヘテロ環原子を有し、そして無置換であるか又はハロゲン、シアノ、ニトロ、(C₁-C₄)-アルキル、(C₁-C₄)-ハロアルキル、(C₁-C₄)-アルコキシ、(C₁-C₄)-ハロアルコキシ及び(C₁-C₄)-アルキルチオからなる群から選択される一つ若しくはそれより多い基で置換され、

30

nは0、1、2、3又は4であり、

R¹は水素、ヒドロキシル、アミノ、(C₁-C₄)-アルキルアミノ、ジ-[(C₁-C₄)-アルキル]アミノ、(C₁-C₁₀)-アルキル、(C₃-C₁₀)-アルケニル、(C₃-C₁₀)-アルキニル又は(C₁-C₁₀)-アルコキシ [ここですぐ前に記載した4つの基のそれぞれは、無置換であるか又は一つ若しくはそれより多い同一又は異なる基R^aで置換され、そして置換基を含んで1～30個の炭素原子を有する]、又は(C₃-C₁₀)-シクロアルキル、(C₄-C₁₀)-シクロアルケニル、アリール若しくはヘテロシクリル [ここですぐ前に記載した4つの基のそれぞれは、無置換であるか又は一つ若しくはそれより多い同一又は異なる基R^bで置換され、そして置換基を含んで3～30個の炭素原子を有する]であり、そして

40

R²は水素、(C₁-C₁₀)-アルキル、(C₃-C₁₀)-アルケニル又は(C₃-C₁₀)-アルキニル [ここですぐ前に記載した3つの基のそれぞれは、無置換であるか又は一つ若しくはそれより多い同一又は異なる基R^cで置換され、そして置換基を含んで1～30個の炭素原子を有する]、又は(C₃-C₁₀)-シクロアルキル、(C₄-C₁₀)-シクロアルケニル、アリール若しくはヘテロシクリル [ここですぐ前に記載した4つの基のそれぞれは、無置換であるか又は一つ

50

若しくはそれより多い同一又は異なる基 R^d で置換され、そして置換基を含んで3～30個の炭素原子を有する]であり、

ここで、基 R^1 及び R^2 中、

R^a 、 R^b 、 R^c 及び R^d はそれぞれ無機又は有機の置換基である。

【請求項2】

(Y) $_n$ は n 個の置換基 Y であり、ここで Y はそれぞれ他の基から独立にハロゲン、シアノ、ニトロ、 (C_1-C_4) -アルキル、 (C_2-C_4) -アルケニル、 (C_2-C_4) -アルキニル、 (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、 (C_1-C_4) -アルキルアミノ又はジ- $[(C_1-C_4)$ -アルキル]アミノ基[ここですぐ前に記載した10の基のそれぞれは、無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) -ハロアルコキシ及び (C_1-C_4) -アルキルチオからなる群から選択される一つ若しくはそれより多い基で置換される]、又は (C_3-C_6) -シクロアルキル、 (C_4-C_6) -シクロアルケニル、アリアル若しくはヘテロシクリル[ここですぐ前に記載した4つの基のそれぞれは、無置換であるか又はハロゲン、シアノ、ニトロ、 (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) -ハロアルコキシ及び (C_1-C_4) -アルキルチオ、そして非芳香族基の場合は更にオキソからなる群から選択される一つ若しくはそれより多い基で置換される]であり、

10

又は、

隣接する2個の Y 基は直接結合している炭素原子と一緒に、炭素環又はヘテロ環である4～6員の縮合環であり、 N 、 O 及び S からなる群から選択される一つ若しくはそれより多いヘテロ環原子を有し、そして無置換であるか又はハロゲン、 (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、 (C_1-C_4) -アルキルチオ及びオキソからなる群から選択される一つ若しくはそれより多い基で置換され、そして

20

n は0、1、2、3又は4であり、

R^1 は水素、ヒドロキシル、アミノ、 (C_1-C_4) -アルキルアミノ、ジ- $[(C_1-C_4)$ -アルキル]アミノ、 (C_1-C_6) -アルキル、 (C_3-C_6) -アルケニル、 (C_3-C_6) -アルキニル又は (C_1-C_6) -アルコキシ[ここですぐ前に記載した4つの基のそれぞれは、無置換であるか又は一つ若しくはそれより多い同一又は異なる基 R^a で置換され、そして置換基を含んで1～30個の炭素原子を有する]、又は (C_3-C_6) -シクロアルキル、 (C_4-C_6) -シクロアルケニル、アリアル若しくはヘテロシクリル[ここですぐ前に記載した4つの基のそれぞれは、無置換であるか又は一つ若しくはそれより多い同一又は異なる基 R^b で置換され、そして置換基を含んで3～30個の炭素原子を有する]であり、そして

30

R^2 は水素、 (C_1-C_{10}) -アルキル、 (C_3-C_{10}) -アルケニル又は (C_3-C_{10}) -アルキニル[ここですぐ前に記載した3つの基のそれぞれは、無置換であるか又は一つ若しくはそれより多い同一又は異なる基 R^c で置換され、そして置換基を含んで1～30個の炭素原子を有する]、又は (C_3-C_6) -シクロアルキル、 (C_4-C_6) -シクロアルケニル、アリアル若しくはヘテロシクリル[ここですぐ前に記載した4つの基のそれぞれは、無置換であるか又は一つ若しくはそれより多い同一又は異なる基 R^d で置換され、そして置換基を含んで3～30個の炭素原子を有する]であり、

40

ここで、基 R^1 及び R^2 中、置換基

R^a は、それぞれの場合において他の基 R^a から独立に、ハロゲン、シアノ、ニトロ並びに式 $-Z^a-R^a$ 及び $R^{c^y^c^a}$ の基からなる群から選択される基であり、

R^b は、それぞれの場合において他の基 R^b から独立に、ハロゲン、シアノ、ニトロ並びに式 $-Z^b-R^b$ 及び R^{b^*} の基からなる群から選択される基であり、

R^c は、それぞれの場合において他の基 R^c から独立に、ハロゲン、シアノ、ニトロ並びに式 $-Z^c-R^c$ 及び $R^{c^y^c^c}$ の基からなる群から選択される基であり、

R^d は、それぞれの場合において他の基 R^d から独立に、ハロゲン、シアノ、ニトロ並びに式 $-Z^d-R^d$ 及び R^{d^*} の基からなる群から選択される基であり、

ここで、基 R^a 、 R^b 、 R^c 及び R^d 中、

50

Z^a 、 Z^b 、 Z^c 及び Z^d は、それぞれの場合において互いに独立に、式 $-O-$ 、 $-S(O)_p-$ 、 $-S(O)_p-O-$ 、 $-O-S(O)_p-$ 、 $-NR^0-S(O)_p-$ 、 $-S(O)_p-NR^0-$ 、 $-CO-$ 、 $-O-CO-$ 、 $-CO-O-$ 、 $-S-CO-$ 、 $-CO-S-$ 、 $-S-CS-$ 、 $-CS-S-$ 、 $-O-CO-O-$ 、 $-NR^0-$ 、 $-O-NR^0-$ 、 $-NR^0-O-$ 、 $-NR^0-CO-$ 、 $-CO-NR^0-$ 、 $-O-CO-NR^0-$ 又は $-NR^0-CO-O-$ 、 $-NR^0-CO-NR^0-$ 、 $-NR^0-CO-NR^0-$ 及び $-SiR'R''-$ の二価の基であり、ここで p はそれぞれ整数 0、1又は2であり、そして基 R^0 は互いに独立に水素、 (C_1-C_6) -アルキル、 (C_2-C_6) -アルケニル、 (C_2-C_6) -アルキニル、フェニル、フェニル- (C_1-C_6) -アルキル、 (C_3-C_6) -シクロアルキル又はアシルであり、そして R' 及び R'' は互いに独立に各々、 (C_1-C_6) -アルキル、 (C_2-C_6) -アルケニル、 (C_2-C_6) -アルキニル、フェニル、フェニル- (C_1-C_6) -アルキル又は (C_3-C_6) -シクロアルキルであり、そして

R^{cyc-a} 及び R^{cyc-c} は、全体として3～24個の炭素原子を有する場合によっては置換された環式炭化水素基であり、又は全体として1～24個の炭素原子を有する場合によっては置換されたヘテロ環基であり、そして

R^{a*} 、 R^{b*} 、 R^{c*} 、 R^{d*} 、 R^{b**} 及び R^{c**} は互いに独立に、全体として1～24個の炭素原子を有する場合によっては置換された炭化水素基であり、又は全体として1～24個の炭素原子を有する場合によっては置換されたヘテロ環基であり、又は

R^{a*} 、 R^{b*} 、 R^{c*} 、 R^{d*} は互いに独立に水素である、

請求項1に記載の使用。

【請求項3】

R^1 は水素、 (C_1-C_6) -アルキル、 (C_3-C_6) -アルケニル又は (C_3-C_6) -アルキニル[ここですぐ前に記載した3つの基のそれぞれは、無置換であるか又は一つ若しくはそれより多い同一又は異なる基 R^a で置換され、そして置換基を含んで1～24個の炭素原子を有する]、又は (C_3-C_6) -シクロアルキル又は飽和したヘテロシクリル[ここですぐ前に記載した2つの基のそれぞれは、無置換であるか又は一つ若しくはそれより多い同一又は異なる基 R^b で置換され、そして置換基を含んで3～24個の炭素原子を有する]であり、

ここで、

R^a はハロゲン、シアノ、ニトロ並びに式 $-Z^a-R^{a*}$ 及び R^{cyc-a} からなる群から選択される基であり、そして

R^b はハロゲン、シアノ、ニトロ並びに式 $-Z^b-R^{b*}$ 及び R^{b**} からなる群から選択される基であり、

ここで基 R^a 及び R^b 中、

Z^a 、 Z^b は互いに独立に、 $-O-$ 、 $-S(O)_p-$ 、 $-S(O)_p-O-$ 、 $-O-S(O)_p-$ 、 $-NR^0-S(O)_p-$ 、 $-S(O)_p-NR^0-$ 、 $-CO-$ 、 $-O-CO-$ 、 $-CO-O-$ 、 $-NR^0-$ 、 $-NR^0-CO-$ 、 $-CO-NR^0-$ 、 $-O-CO-NR^0-$ 又は $-NR^0-CO-O-$ 、 $-NR^0-CO-NR^0-$ 、 $-NR^0-CO-NR^0-$ 及び $-SiR'R''-$ であり、ここで p はそれぞれ整数0、1又は2であり、そして基 R^0 は互いに独立に水素、 (C_1-C_4) -アルキル、フェニル、フェニル- (C_1-C_4) -アルキル、 (C_3-C_6) -シクロアルキル、 (C_1-C_4) -アルカノイル、 $[(C_1-C_4)$ -アルコキシ]カルボニル又は (C_1-C_4) -アルキルスルホニルであり、そして R' 及び R'' は互いに独立に、 (C_1-C_4) -アルキル、フェニル、フェニル- (C_1-C_4) -アルキル又は (C_3-C_6) -シクロアルキルであり、

R^{cyc-a} は、 (C_3-C_6) -シクロアルキル、 (C_4-C_6) -シクロアルケニル、フェニル、飽和したヘテロシクリル、不飽和の非芳香族ヘテロシクリル又はヘテロアリールであり、ここですぐ前に記載した6つの基のそれぞれは無置換であるか又はハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシル、チオ、 (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) -アルキル、 (C_3-C_6) -シクロアルキル、 (C_1-C_4) -アルコキシ、 (C_1-C_4) -ハロアルコキシ、 (C_1-C_4) -アルキルチオ、 (C_1-C_4) -ハロアルキルチオ、 (C_1-C_4) -アルキルスルフィニル、 (C_1-C_4) -ハロ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) -ハロアルキルスルホニル、 (C_1-C_4) -アルキルアミノ、ジ- $[(C_1-C_4)$ -アルキル]アミノ、トリメチルシリル、 (C_1-C_4) -アルカノイル、 $[(C_1-C_4)$ -アルコキシ]カルボニル、ジ- $[(C_1-C_4)$ -アルキル]カルバモイル、そして飽和の又は不飽和の非芳香族ヘテロシクリルの場合は、更にオキソからなる群から選択される一つ若しくはそれより多い基で置換されていて、そして

R^2 は (C_1-C_{10}) -アルキル、 (C_3-C_{10}) -アルケニル又は (C_3-C_{10}) -アルキニル [ここですぐ前に記載した3つの基のそれぞれは、無置換であるか又は一つ若しくはそれより多い同一又は異なる基 R^c で置換され、そして置換基を含んで1~24個の炭素原子を有する]、又は (C_3-C_6) -シクロアルキル、アリール若しくはヘテロシクリル [ここですぐ前の3つの基のそれぞれは、無置換であるか又は一つ若しくはそれより多い同一又は異なる基 R^d で置換され、そして置換基を含んで3~24個の炭素原子を有する]であり、

ここで、

R^c は、それぞれの場合において他の基から独立に、ハロゲン、シアノ、ニトロ並びに式 $-Z^c-R^c$ 及び R^{cyc} の基からなる群から選択される基であり、

R^d は、それぞれの場合において他の基から独立に、ハロゲン、シアノ、ニトロ並びに式 $-Z^d-R^d$ 及び R^{d*} の基からなる群から選択される基であり、 10

ここで基 R^c 及び R^d 中、

Z^c 及び Z^d は互いに独立に、 $-O-$ 、 $-S(O)_p-$ 、 $-S(O)_p-O-$ 、 $-O-S(O)_p-$ 、 $-NR^0-S(O)_p-$ 、 $-S(O)_pNR^0-$ 、 $-CO-$ 、 $-O-CO-$ 、 $-CO-O-$ 、 $-NR^0-$ 、 $-NR^0-CO-$ 、 $-CO-NR^0-$ 、 $-O-CO-NR^0-$ 又は $-NR^0-CO-O-$ 、 $-NR^0-CO-NR^0-$ 、 $-NR^0-CO-NR^0-$ 及び $-SiR'R''-$ であり、ここで p はそれぞれ整数0、1又は2であり、そして基 R^0 は互いに独立に水素、 (C_1-C_4) -アルキル、フェニル、フェニル- (C_1-C_4) -アルキル、 (C_3-C_6) -シクロアルキル、 (C_1-C_4) -アルカノイル、 $[(C_1-C_4)$ -アルコキシ]カルボニル又は (C_1-C_4) -アルキルスルホニルであり、そして R' 及び R'' は互いに独立に、 (C_1-C_4) -アルキル、フェニル、フェニル- (C_1-C_4) -アルキル又は (C_3-C_6) -シクロアルキルであり、 20

R^{cyc} は、 (C_3-C_6) -シクロアルキル、 (C_4-C_6) -シクロアルケニル、フェニル、飽和したヘテロシクリル、不飽和の非芳香族ヘテロシクリル又はヘテロアリールであり、ここですぐ前に記載した6つの基のそれぞれは、無置換であるか又はハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシル、チオ、 (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) -アルキル、 (C_3-C_6) -シクロアルキル、 (C_1-C_4) -アルコキシ、 (C_1-C_4) -ハロアルコキシ、 (C_1-C_4) -アルキルチオ、 (C_1-C_4) -ハロアルキルチオ、 (C_1-C_4) -アルキルスルフィニル、 (C_1-C_4) -ハロ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) -ハロアルキルスルホニル、 (C_1-C_4) -アルキルアミノ、ジ- $[(C_1-C_4)$ -アルキル]アミノ、トリメチルシリル、 (C_1-C_4) -アルカノイル、 $[(C_1-C_4)$ -アルコキシ]カルボニル、ジ- $[(C_1-C_4)$ -アルキル]カルバモイル、そして飽和の又は不飽和の非芳香族ヘテロシクリルの場合は更にオキソからなる群から選択される一つ若しくはそれより多い基で置換され、そして R^c 、 R^d 及び R^{d*} は互いに独立に、 30

(C_1-C_{10}) -アルキル、 (C_3-C_{10}) -アルケニル、 (C_3-C_{10}) -アルキニル、 (C_3-C_6) -シクロアルキル、 (C_4-C_6) -シクロアルケニル、アリール又はヘテロシクリルであり、ここですぐ前に記載した7つの基のそれぞれは、無置換であるか又はハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシル、チオ、 (C_3-C_6) -シクロアルキル、 (C_1-C_4) -アルコキシ、 (C_1-C_4) -ハロアルコキシ、 (C_1-C_4) -アルキルチオ、 (C_1-C_4) -ハロアルキルチオ、 (C_1-C_4) -アルキルスルフィニル、 (C_1-C_4) -ハロ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) -ハロアルキルスルホニル、 (C_1-C_4) -アルキルアミノ、ジ- $[(C_1-C_4)$ -アルキル]アミノ、トリメチルシリル、 (C_1-C_4) -アルカノイル、 $[(C_1-C_4)$ -アルコキシ]カルボニル、ジ- $[(C_1-C_4)$ -アルキル]カルバモイルアミノ、そして環式基の場合は更に (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) -アルキル、そしてヘテロシクリルの場合は更にオキソからなる群から選択される一つ若しくはそれより多い基で置換されていて、又は 40

R^c 及び R^d は互いに独立に水素である、

請求項1又は2に記載の使用。

【請求項4】

式(I)の化合物又はその塩を除草剤と組み合わせて使用する、請求項1~3のいずれか1項に記載の使用。

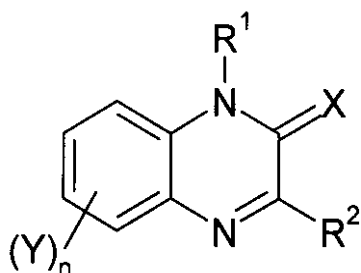
【請求項5】

式(I)の化合物又はその塩を発生後処理法によって使用する、請求項1～4のいずれか1項に記載の使用。

【請求項6】

式(I)：

【化2】



(I)

10

の化合物又はその塩。

式中、

Xは酸素又は硫黄であり；

(Y)_nはn個の置換基Yであり、

ここでYはそれぞれ他の基から独立にハロゲン、シアノ、ニトロ、(C₁-C₆)-アルキル、(C₂-C₆)-アルケニル、(C₂-C₆)-アルキニル、(C₁-C₆)-アルコキシ、(C₁-C₆)-アルキルチオ、(C₁-C₆)-アルキルスルフィニル、(C₁-C₆)-アルキルスルホニル、(C₁-C₆)-アルコキシカルボニル、(C₁-C₄)-アルキルアミノ又はジ-[(C₁-C₄)-アルキル]アミノ基[ここですぐ前に記載した10の基のそれぞれは、無置換であるか又はハロゲン、(C₁-C₄)-アルコキシ、(C₁-C₄)-ハロアルコキシ及び(C₁-C₄)-アルキルチオからなる群から選択される一つ若しくはそれより多い基で置換されている]、又は(C₃-C₆)-シクロアルキル、(C₄-C₆)-シクロアルケニル、アリール若しくはヘテロシクリル[ここですぐ前に記載した4つの基のそれぞれは、無置換であるか又はハロゲン、シアノ、ニトロ、(C₁-C₄)-アルキル、(C₁-C₄)-ハロアルキル、(C₁-C₄)-アルコキシ-(C₁-C₄)-アルキル、(C₁-C₄)-アルコキシ、(C₁-C₄)-ハロアルコキシ、(C₁-C₄)-アルコキシ-(C₁-C₄)-アルコキシ及び(C₁-C₄)-アルキルチオからなる群から選択される一つ若しくはそれより多い基で置換されている]であり、

20

30

又は、

隣接する2個のY基は直接結合している炭素原子と一緒に、炭素環又はヘテロ環である4～8員の縮合環であり、N、O及びSからなる群から選択される1～3個のヘテロ環原子を有し、そして無置換であるか又はハロゲン、シアノ、ニトロ、(C₁-C₄)-アルキル、(C₁-C₄)-ハロアルキル、(C₁-C₄)-アルコキシ、(C₁-C₄)-ハロアルコキシ及び(C₁-C₄)-アルキルチオからなる群から選択される一つ若しくはそれより多い基で置換され、

nは0、1、2、3又は4であり、

R¹は、(C₁-C₄)-アルキル、(C₃-C₁₀)-アルケニル又は(C₃-C₁₀)-アルキニル[ここですぐ前に記載した2つの基のそれぞれは無置換であるか又はすぐ前に記載した3つの基のそれぞれは一つ若しくはそれより多い同一又は異なる基R^aで置換され、そして置換基を含んで1～30個の炭素原子を有する]、又は(C₃-C₁₀)-シクロアルキル、(C₄-C₁₀)-シクロアルケニル、又は飽和したヘテロシクリル[ここですぐ前に記載した3つの基のそれぞれは無置換であるか又は一つ若しくはそれより多い同一又は異なる基R^bで置換され、そして置換基を含んで3～30個の炭素原子を有する]であり、そして

40

R²はアリール又はヘテロシクリルであり、ここですぐ前に記載した2つの基のそれぞれは無置換であるか又は一つ若しくはそれより多い同一又は異なる基R^dで置換され、そして置換基を含んで3～30個の炭素原子を有し、

ここで基R¹及びR²中、置換基

R^aは、それぞれの場合において他の基から独立に、ハロゲン、シアノ、ニトロ並びに式-Z^a-R^a及びR^{cyc-a}の基からなる群から選択される基であり、

50

R^b は、それぞれの場合において他の基から独立に、ハロゲン、シアノ、ニトロ並びに式 $-Z^b-R^{b*}$ 及び R^{b**} の基からなる群から選択される基であり、

R^d は、それぞれの場合において他の基から独立に、ハロゲン、シアノ、ニトロ並びに式 $-Z^d-R^{d*}$ 及び R^{d**} の基からなる群から選択される基であり、

ここで基 R^a 及び R^b 中、

Z^a 及び Z^b はそれぞれ互いに独立に、式 $-O-$ 、 $-S(O)_p-$ 、 $-S(O)_p-O-$ 、 $-O-S(O)_p-$ 、 $-NR^0-S(O)_p-$ 、 $-S(O)_pNR^0-$ 、 $-CO-$ 、 $-O-CO-$ 、 $-CO-O-$ 、 $-S-CO-$ 、 $-CO-S-$ 、 $-S-CS-$ 、 $-CS-S-$ 、 $-O-CO-O-$ 、 $-NR^0-$ 、 $-O-NR^0-$ 、 $-NR^0-O-$ 、 $-NR^0-CO-$ 、 $-CO-NR^0-$ 、 $-O-CO-NR^0-$ 又は $-NR^0-CO-O-$ 、 $-NR^0-CO-NR^0-$ 、 $-NR^0-CO-NR^0-$ 及び $-SiR'R''-$ からなる群から選択される二価の基であり、ここで p はそれぞれ整数 0、1 又は 2 であり、そして置換基 R^0 は互いに独立に水素、 (C_1-C_6) -アルキル、 (C_2-C_6) -アルケニル、 (C_2-C_6) -アルキニル、フェニル、フェニル- (C_1-C_6) -アルキル、 (C_3-C_6) -シクロアルキル又は、好ましくは 1 ~ 10 個の炭素原子を有するアシル(そしてこの場合は好ましくは [(C_1-C_6)-アルキル]カルボニル、[(C_1-C_6)-アルコキシ]カルボニル又は [(C_1-C_6)-アルキル]スルホニルからなる群から選択されるアシル)であり、そして R' 及び R'' は互いに独立に、 (C_1-C_6) -アルキル、 (C_2-C_6) -アルケニル、 (C_2-C_6) -アルキニル、フェニル、フェニル- (C_1-C_6) -アルキル又は (C_3-C_6) -シクロアルキルであり、そして

R^{cyc-a} は全体として 1 ~ 24 個の炭素原子を有する場合によっては置換されている環式炭化水素基であり、又は全体として 1 ~ 24 個の炭素原子を有する場合によっては置換されたヘテロ環基であり、そして

R^{a*} 、 R^{b*} 及び R^{b**} は、互いに独立に、全体として 1 ~ 24 個の炭素原子を有する場合によっては置換されている炭化水素基であり、又は全体として 1 ~ 24 個の炭素原子を有する場合によっては置換されているヘテロ環基であり、又は

R^{a*} 及び R^{b*} は互いに独立に水素であり、そして

ここで基 R^d 中

Z^d は、式 $-O-$ 、 $-S(O)_p-$ 、 $-S(O)_p-O-$ 、 $-O-S(O)_p-$ 、 $-S(O)_pNR^0-$ 、 $-CO-$ 、 $-O-CO-$ 、 $-CO-O-$ 、 $-S-CO-$ 、 $-CO-S-$ 、 $-S-CS-$ 、 $-CS-S-$ 、 $-O-CO-O-$ 、 $-CO-NR^0-$ 、 $-O-CO-NR^0-$ 又は $-SiR'R''-$ からなる群から選択される二価の基であり、ここで p はそれぞれ整数 0、1 又は 2 であり、そして基 R^0 は互いに独立に水素、 (C_1-C_6) -アルキル、 (C_2-C_6) -アルケニル、 (C_2-C_6) -アルキニル、フェニル、フェニル- (C_1-C_6) -アルキル、 (C_3-C_6) -シクロアルキル又は好ましくは 1 ~ 10 個の炭素原子を有するアシルであり、そして R' 及び R'' は互いに独立に、 (C_1-C_6) -アルキル、 (C_2-C_6) -アルケニル、 (C_2-C_6) -アルキニル、フェニル、フェニル- (C_1-C_6) -アルキル又は (C_3-C_6) -シクロアルキルであり、そして

R^{d*} 及び R^{d**} は互いに独立に、全体として 1 ~ 24 個の炭素原子を有する場合によっては置換されている炭化水素基であり、又は全体として 1 ~ 24 個の炭素原子を有する場合によっては置換されているヘテロ環基であり、又は

R^{d*} は水素であるが、但し、以下の式 (I) の化合物及びそれらの塩を除く：

(a) R^1 はシクロヘキシルカルバモイル基で置換された (C_1-C_4) -アルキルであり、そして R^2 は二環式ヘテロアリール基である、

(b) R^1 は N-置換のカルバモイル基で置換された (C_1-C_4) -アルキルであり、そして同時に場合によってはシクロアルキル、ヘテロアリール又はフェニルで置換されていて、そして R^2 はフェニルである、

(c) R^1 は 2-(トリメチルシリル)エトキシ基で置換された (C_1-C_4) -アルキルであり、そして R^2 は場合によっては置換されているフェニルである、

(d) R^2 は場合によっては置換されているフェニル又はヘテロアリールであり、ここにおいて 1 個の置換基は一つより多い環式基を含み、又は二つ若しくはそれより多い置換基が環式である、

(e) R^1 はイミノカルバモイル(アミジン基)で置換された (C_1-C_4) -アルキルであり、そして R^2 はイミノカルバモイル(アミジン基)で置換されたフェニルである、

(f) R^1 は場合によっては置換されているアリール基で置換された (C_1-C_4) -アルキルで

10

20

30

40

50

あり、そしてR²は場合によっては置換されているアリール基である、

(g) R²は場合によっては置換されているインドリル基、又はN-(4-ブルモフェニル)-若しくはN-フェニル-5-(ヒドロキシメチル)ピラゾール-3-イル基である、
そして

また以下の化合物を除く：

(h) 1-(2-ヒドロキシエチル)-3-フェニルキノキサリン-2(1H)-オン、

(i) 1-[2-(ジエチルアミノ)エチル]-3-フェニルキノキサリン-2(1H)-オン、

(j) 1-[3-(ジエチルアミノ)プロピル]-3-フェニルキノキサリン-2(1H)-オン、

(k) 7-クロロ-1-[3-(ジエチルアミノ)プロピル]-3-フェニルキノキサリン-2(1H)-オン

(l) 1-{3-[2-(ピロリジニル-1-カルボニル)ピロリジニル-1-カルボニル]プロピル}-3-フェニルキノキサリン-2(1H)-オン、

(m) 1-{2-[2-(ピロリジニル-1-カルボニル)ピロリジニル-1-カルボニル]エチル}-3-フェニルキノキサリン-2(1H)-オン、

(n) 1-{2-[4-(ピロリジニル-1-カルボニル)チアゾリジニル-3-カルボニル]エチル}-3-フェニルキノキサリン-2(1H)-オン、

(o) 1-{2-[4-(チアゾリジニル-1-カルボニル)チアゾリジニル-3-カルボニル]エチル}-3-フェニルキノキサリン-2(1H)-オン、

(p) 1-{2-[4-(ピロリジニル-1-カルボニル)-1,1-ジオキソチアゾリジニル-3-カルボニル]エチル}-3-フェニルキノキサリン-2(1H)-オン、

(q) 1-[3-(アミノ)プロピル]-3-フェニルキノキサリン-2(1H)-オン、

(r) 1-(オクタヒドロ-2H-キノリジン-1-イルメチル)-3-フェニルキノキサリン-2(1H)-オン、

(s) 6-メトキシ-又は6-メチル-又は6-トリフルオロメチル-又は6-クロロ-1-(オクタヒドロ-2H-キノリジン-1-イルメチル)-3-フェニルキノキサリン-2(1H)-オン (4化合物)、

(t) 1-(メチルチオメチル)-3-フェニルキノキサリン-2(1H)-オン、

(u) 1-(メチルアミノカルボニルメチル)-3-(2-エトキシフェニル)キノキサリン-2(1H)-オン、

(v) 1-(ジメチルアミノメチル)-3-(4-エトキシカルボニルフェニル)-6-ブロモキノキサリン-2(1H)-オン、

(w) 1-(モルホリン-4-イルメチル)-3-(4-エトキシカルボニルフェニル)-6-ブロモキノキサリン-2(1H)-オン、

(x) 1-(4-ベンジルピペリド-1-イルメチル)-3-(4-エチルフェニル)キノキサリン-2(1H)-オン、

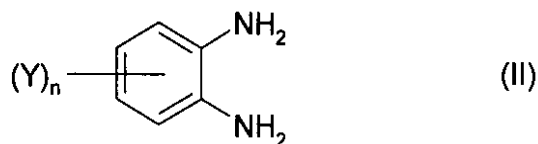
(y) 1-(4-ベンジルピペラジン-1-イルメチル)-3-(3-クロロフェニル)キノキサリン-2(1H)-オン、

(z) 1-{3-[4-(4,5-ジヒドロピリダジン-3(2H)-オン-6-イル)フェノキシ]プロピル}-3-フェニルキノキサリン-2(1H)-オン。

【請求項7】

(a) 式(II)：

【化3】



(ここにおいて(Y)_nは式(I)で定義した通りである)の化合物を、式(III)：

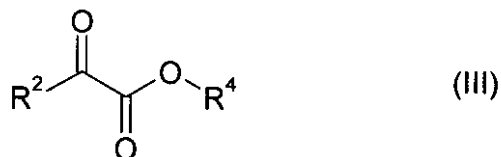
10

20

30

40

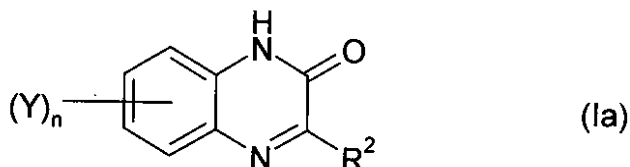
【化4】



(ここにおいて R^2 は式(I)で定義した通りであり、そして R^4 は水素、場合によっては置換されているアルキル、又は場合によっては置換されているアリールである)の β -ケト酸誘導体と反応させることによって、式(1a)：

10

【化5】



(ここにおいて $(Y)_n$ 及び R^2 は式(I)で定義した通りである)の化合物を得て、そしてこの式(1a)の化合物を、式(IV)：

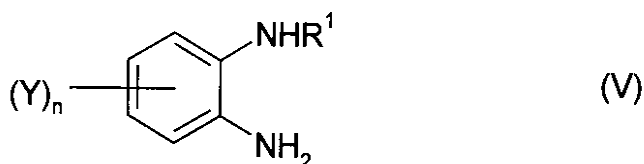


20

(ここにおいて R^1 は式(I)で定義した通りであり、そしてLは脱離基である)のアルキル化剤を用いた反応により、又は R^1 がメチル基である特別な場合は、アルキル化剤であるジメチルホルムアミド、ジメチルアセタールを用いて反応させて、式(I)の化合物又はその塩に変換させる、

(b) 式(V)：

【化6】

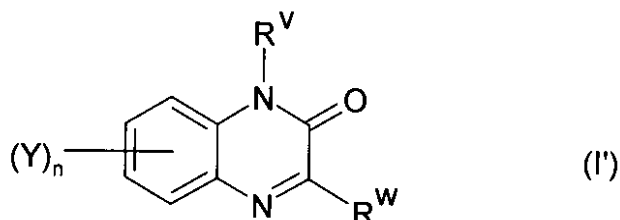


30

(ここにおいて R^1 及び $(Y)_n$ は式(I)で定義した通りである)の化合物を、(a)において記載した式(II)の β -ケト酸誘導体と反応させる、又は

(c) 式(I')：

【化7】



40

(ここにおいて $(Y)_n$ は式(I)で定義した通りであり、

基 R^v は R^1 とは異なるが R^1 の前駆体であり、そして基 R^w は R^2 と同一であり、又は

基 R^w は R^2 とは異なるが R^2 の前駆体であり、そして基 R^v は R^1 と同一である)

の化合物を、「前駆体」として言及した基において、一つ若しくはそれより多い工程を用いる既知の又は慣用的方法によって誘導化して、式(I)の化合物を得る、

ことを含む、請求項6に記載の式(I)の化合物又はその塩の製造方法。

50

【請求項 8】

請求項 1 ~ 3 及び請求項 6 のいずれか 1 項に記載の式 (I) の化合物又はその塩、及び製剤補助剤を含んでいる作物保護組成物。

【請求項 9】

請求項 1 ~ 3 及び請求項 6 のいずれか 1 項に記載の式 (I) の化合物又はその塩及び一つ若しくはそれより多い有害生物防除剤、そして適当ならば製剤補助剤を含んでいる、請求項 8 に記載の作物保護組成物。

【請求項 10】

有効量の一つ若しくはそれより多い請求項 1 ~ 3 及び請求項 6 のいずれか 1 項に記載の式 (I) の化合物又はその塩を有害生物防除剤の処理前、処理後又は同時に、植物、植物の部分、植物の種子又は苗に施用することからなる、農業化学品の植物毒性副作用から有用植物又は作物植物を保護する方法。

10

【請求項 11】

施用方法が発生後処理法によるものである、請求項 10 に記載の方法。

【請求項 12】

式 (I) の化合物の施用方法が植物の種子又は苗を処理ことによるものである、請求項 10 に記載の方法。

【請求項 13】

施用方法が発生前処理法によるものである、請求項 10 に記載の方法。

【請求項 14】

一つ若しくはそれより多い請求項 1 ~ 3 及び請求項 6 のいずれか 1 項に記載の式 (I) の化合物又はその塩の有効量を、一つ若しくはそれより多い除草剤の処理前、処理後又は同時に、植物、植物の部分、植物の種子又は苗に施用することを含む、有用植物の作物栽培における有害植物の選択的防除方法。

20

【請求項 15】

一つ若しくはそれより多い式 (I) の化合物又はその塩を用いて種子を処理し、そして播種後に除草剤が発生前処理法又は発生後処理法によって施用する、請求項 14 に記載の方法。

【発明の詳細な説明】**【技術分野】**

30

【0001】

本発明は有用植物を保護しそしてキノキサリノン誘導体、殊に1,2-ジヒドロキノキサリノン-2-オン誘導体を薬害軽減剤として、そして適宜有害生物防除剤を含んでいる組成物、更には或る種のキノキサリノン誘導体、及びそれらの製造方法に関するものである。

【背景技術】**【0002】**

農業又は林業に有用な植物の栽培における望ましくない生物を有害生物防除剤を用いて防除するとき、有用な植物もまた使用した有害生物防除剤によってそれ自体望ましくない態様で多かれ少なかればしばしば損傷が引き起こされる。この影響は、殊に例えばトウモロコシ、イネ又は穀類のような有用な植物の作物栽培そして主に発芽後処理における数多くの除草剤の使用において直面する。ある場合には、薬害軽減剤又は解毒剤を用いることにより、有害生物に対する防除効果を減少することなく、有用植物を有害生物防除剤の植物毒の特性から保護することができる。ある場合には、雑草のような有害生物に対する改善された防除効果さえ観察することができる。

40

【0003】

これまでに薬害軽減剤として開示されている化合物は種々の化学構造を有している。米国特許US-A 4,902,340 には、キノリン-8-オキシアルカンカルボン酸誘導体がジフェニルエステル及びピリジルオキシフェノキシプロピオン酸系の除草剤に対する薬害軽減剤として開示されている。また 欧州特許出願公開EP-A 0 520 371 には、イソキサゾリン及びイソチアゾリン系が種々の除草剤に対する薬害軽減剤として開示されている。ここにおいて

50

最後に記載した刊行物は、アリールオキシフェノキシカルボン酸系、スルホニルウレア系及びイミダゾリノン系を好適な除草剤として挙げている。置換されたベンゾ縮合5員-及び6員の複素環が薬害軽減剤であることは国際公開W0-A-98/13361から既知である。国際公開W0-A-99/00020には、3-(5-テトラゾリルカルボニル)-2-キノリノン及びそれらの薬害軽減剤としての使用が記載されている。独国特許DE 19621522.6 (W0-A-97/45016)及び独国特許DE 19742951.3 (W0-A-99/16744)には、N-アシルスルホンアミドが薬害軽減剤として、好ましくはトウモロコシ植物の保護として記載されている。

【0004】

化学分類でキノリン-2-オン系である活性化化合物が有害生物防除剤の特性を有していることは文献から知られている。種々の生物学的活性が記載されていて；例えばPestic. Sci. 14 (1983), 135には、1,6-ジメチル-3-フェニル-1,2-ジヒドロキノキサリン-2-オンの抗菌作用が記載されている；米国特許US 3582315号及び米国特許US 3647793号には、1-アルキル-3-フェニル-1,2-ジヒドロキノキサリン-2-オンの除草剤活性が記載されている；英国特許GB 1574429号には、3-(2-チエニル)-1,2-ジヒドロキノキサリン-2-オンの除草剤活性が記載されている。

【0005】

また薬理特性を有する代表的な例も知られている。Helv. Chim. Acta XXXV (1952) 2301、Il Farmaco, Ed. Sci 40 (1985) 303、W0 99/50254、オーストリア特許(AT) 226709及びAT 228204には1-ジアルキルアミノアルキル-3-フェニル-及び-3-ベンジルジヒドロキノキサリノン並びに1-ヒドロキシエチル-3-フェニル-1,2-ジヒドロキノキサリノンの薬理特性が記載されている。W0 97/07116には、1-アミノアルキル-3-アリール-1,2-ジヒドロキノキサリノンがプロリルエンドペプチダーゼの阻害剤として記載されている。W0 2002/002550には、アリール縮合したピラジノンのキナーゼ阻害剤としての使用に関する記載がある。1-カルボエトキシメチル-及び1-カルボキシメチル-3-アミノフェニル-1,2-ジヒドロキノキサリノン誘導体が抗アメーバ作用及び利尿薬作用を有することが示唆されている(Indian J. of Chem. (1974) 124)。これらの化合物の薬害軽減剤としての使用についてはこれまでに開示されてはいない。

【特許文献1】米国特許第4,902,340号明細書

【特許文献2】欧州特許出願公開第0 520 371号明細書

【特許文献3】国際公開第W0-A-98/13361号パンフレット

【特許文献4】国際公開第W0-A-99/00020号パンフレット

【特許文献5】独国特許第DE 19621522.6 (W0-A-97/45016)号明細書

【特許文献6】独国特許第DE 19742951.3 (W0-A-99/16744)号明細書

【特許文献7】米国特許第3582315号明細書

【特許文献8】米国特許第3647793号明細書

【特許文献9】英国特許第1574429号明細書

【特許文献10】国際特許出願第W0 99/50254号明細書

【特許文献11】国際特許出願第W0 97/07116号明細書

【特許文献12】国際特許出願第W0 2002/002550号明細書

【特許文献13】オーストリア特許第226709号

【特許文献14】オーストリア特許第228204号

【非特許文献1】Pestic. Sci. 14 (1983), 135

【非特許文献2】Helv. Chim. Acta XXXV (1952) 2301、Il Farmaco, Ed. Sci 40 (1985) 303

【非特許文献3】Indian J. of Chem. (1974) 124

【発明の開示】

【発明が解決しようとする課題】

【0006】

薬害軽減剤を有害生物防除剤による損傷に対して有用植物を保護するために使用した場合、既知の薬害軽減剤は多くの場合に不利な点を有することが知られている。これらには

以下の点が含まれる。

- 薬害軽減剤は除草剤の効能を減少し、殊に有害植物に対する除草剤の効能を減少する、
- 有用植物の保護特性が不十分である、
- ある種の除草剤との組合せにおいて、薬害軽減剤/除草剤が採用されるべき有用植物のスペクトルが十分には広くない、
- ある種の薬害軽減剤は少数の除草剤との組合せしかできない、
- 薬害軽減剤の使用によって処理すべき施用量及び製剤量が増大し、その結果として処理中に問題を引き起こす。

【0007】

10

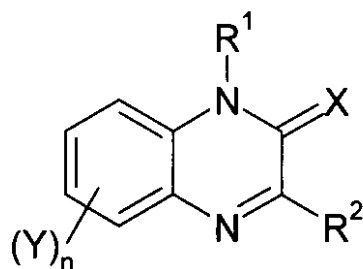
当該言及した理由により、有用植物を保護しそして薬害軽減剤の活性を有する化合物、そして適宜有害生物防除剤を含んでいる代替的な組成物を提供することが求められている。

【課題を解決するための手段】

【0008】

本発明は式 (I) :

【化1】



(I)

20

[式中、

Xは酸素又は硫黄であり；

【0009】

(Y)_nはn個の置換基Yであり、

30

ここで、Yはそれぞれ他の置換基から独立に、ハロゲン、シアノ、ニトロ、(C₁-C₆)-アルキル、(C₂-C₆)-アルケニル、(C₂-C₆)-アルキニル、(C₁-C₆)-アルコキシ、(C₁-C₆)-アルキルチオ、(C₁-C₆)-アルキルスルフィニル、(C₁-C₆)-アルキルスルホニル、(C₁-C₆)-アルコキシカルボニル、(C₁-C₄)-アルキルアミノ又はジ-[(C₁-C₄)-アルキル]アミノ基 [ここですぐ前に記載した10の基のそれぞれは、無置換であるか又はハロゲン、(C₁-C₄)-アルコキシ、(C₁-C₄)-ハロアルコキシ及び(C₁-C₄)-アルキルチオの群から選択される一つ若しくはそれより多い基で置換される]、又は(C₃-C₆)-シクロアルキル、(C₄-C₆)-シクロアルケニル、アリール又はヘテロシクリル [ここですぐ前に記載した4つの基のそれぞれは、無置換であるか又はハロゲン、シアノ、ニトロ、(C₁-C₄)-アルキル、(C₁-C₄)-ハロアルキル、(C₁-C₄)-アルコキシ-(C₁-C₄)-アルキル、(C₁-C₄)-アルコキシ、(C₁-C₄)-ハロアル

40

又は、

隣接する2個のY基は直接結合している炭素原子と一緒に、炭素環又はヘテロ環である4-から8-員の縮合環であり、N、O及びSからなる群から選択される一つ若しくはそれより多いヘテロ環原子を有し、そして無置換であるか又はハロゲン、シアノ、ニトロ、(C₁-C₄)-アルキル、(C₁-C₄)-ハロアルキル、(C₁-C₄)-アルコキシ、(C₁-C₄)-ハロアルコキシ及び(C₁-C₄)-アルキルチオの群から選択される一つ若しくはそれより多い基で置換され、

【0010】

50

nは0、1、2、3又は4、好ましくは0、1、2又は3、そして特に好ましくは0、1又は2であり、そして

R^1 は水素、水酸基、アミノ、 (C_1-C_4) -アルキルアミノ、ジ- $[(C_1-C_4)$ -アルキル]アミノ、 (C_1-C_{10}) -アルキル、 (C_3-C_{10}) -アルケニル、 (C_3-C_{10}) -アルキニル又は (C_1-C_{10}) -アルコキシ[ここですぐ前に記載した4つの基のそれぞれは、無置換であるか又は一つ若しくはそれより多い同一又は異なる基 R^a で置換され、そして置換基を含んで1から30個の炭素原子、好ましくは1から24個の炭素原子を有する]、又は (C_3-C_{10}) -シクロアルキル、 (C_4-C_{10}) -シクロアルケニル、アリール又はヘテロシクリル[ここですぐ前に記載した4つの基のそれぞれは、無置換であるか又は一つ若しくはそれより多い同一又は異なる基 R^b で置換され、そして置換基を含んで1から30個の炭素原子、好ましくは1から24個の炭素原子を有する]であり、そして

10

【0011】

R^2 は水素、 (C_1-C_{10}) -アルキル、 (C_3-C_{10}) -アルケニル又は (C_3-C_{10}) -アルキニル[ここですぐ前に記載した4つの基のそれぞれは、無置換であるか又は一つ若しくはそれより多い同一又は異なる基 R^c で置換され、そして置換基を含んで1から30個の炭素原子、好ましくは1から24個の炭素原子を有する]、又は (C_3-C_{10}) -シクロアルキル、 (C_4-C_{10}) -シクロアルケニル、アリール又はヘテロシクリル[ここですぐ前に記載した4つの基のそれぞれは、無置換であるか又は一つ若しくはそれより多い同一又は異なる基 R^d で置換され、そして置換基を含んで3から30個の炭素原子、好ましくは3から24個の炭素原子を有する]であり、

20

【0012】

ここで基 R^1 及び R^2 中、

R^a は、それぞれの場合において他の基 R^a から独立に、無機又は有機の基であり、好ましくはハロゲン、シアノ、ニトロ並びに式 $-Z^a-R^{a*}$ 及び $R^{c^y c^a}$ の群から選択される基であり、

R^b は、それぞれの場合において他の基 R^b から独立に、無機又は有機の基であり、好ましくはハロゲン、シアノ、ニトロ並びに式 $-Z^b-R^{b*}$ 及び $R^{b^{**}}$ の群から選択される基であり、

R^c は、それぞれの場合において他の基 R^c から独立に、無機又は有機の基であり、好ましくはハロゲン、シアノ、ニトロ並びに式 $-Z^c-R^{c*}$ 及び $R^{c^y c^c}$ の群から選択される基であり、

30

R^d は、それぞれの場合において他の基 R^d から独立に、無機又は有機の基であり、好ましくはハロゲン、シアノ、ニトロ並びに式 $-Z^d-R^{d*}$ 及び $R^{d^{**}}$ の群から選択される基であり、

【0013】

ここで基 R^a 、 R^b 、 R^c 及び R^d 中、

Z^a 、 Z^b 、 Z^c 及び Z^d は、それぞれ互いに独立に、 Z^a 、 Z^b 、 Z^c 及び Z^d は、互いに独立に、少なくとも1個のヘテロ原子を有する単原子又は多原子の二価の官能基であり、そして

$R^{c^y c^a}$ 及び $R^{c^y c^c}$ は全体として1~24個の炭素原子を有する場合によっては置換された環式炭化水素基、又は全体として1から24個の炭素原子を有する場合によっては置換されたヘテロ環基であり、そして

R^{a*} 、 R^{b*} 、 R^{c*} 、 R^{d*} 、 $R^{b^{**}}$ 及び $R^{c^{**}}$ は互いに独立に、全体として1から24個の炭素原子を有する場合によっては置換された環式炭化水素基であり、又は全体として1~24個の炭素原子を有する場合によっては置換されたヘテロ環基であり、又は

40

R^{a*} 、 R^{b*} 、 R^{c*} 、 R^{d*} は互いに独立に水素である]

で表される化合物又はそれらの塩(1,2-ジヒドロキノキサリン-2-オン誘導体)を葉害軽減剤、即ち、有用植物又は作物植物における農業化学品、好ましくは農薬、特に除草剤の植物毒性を阻止し又は減少させる薬剤としての使用を提供するものである。

【0014】

もしも水素シフトによって当該化合物が形式的には式(I)で表すことができない構造を有する互変異性体を形成することが可能な場合には、それらの互変異性体は、それでもやはり本発明に係る式(I)の化合物の定義に含まれるものとする。

50

【0015】

置換基の性質及び結合の如何によっては、式(I)の化合物は立体異性体として存在することができる。エナンチオマー、ジアステレオマー、Z-及びE-異性体のような特別な空間的形態によって定義される全ての可能性がある異性体も式(I)に含まれるものとする。

もしも、例として、一つ若しくはそれより多いアルケニル基が存在する場合には、ジアステレオマー(Z-及びE-異性体)が起こることも可能である。もしも、例として、一つ若しくはそれより多い炭素原子が存在する場合は、エナンチオマー及びジアステレオマーが起こることも可能である。立体異性体は、合成により得られる立体異性体の混合物から慣用的方法、例えばクロマトグラフィーの分離法により得ることができる。また光学活性な出発物質及び/又は補助剤を用いた立体選択的反応を使用することにより、立体異性体を選択的に合成することもできる。それ故、本発明はまた特定の立体型として表されていないもの及びそれらの混合物をも含んで、式(I)で表される全ての立体異性体を含むものである。

【0016】

式(I)で表される種々の置換基の組合せの可能性は、化合物の合成の一般的原理が認められる仕方において理解されるべきである。即ち、式(I)は、化学的に不可能であると当業者が認識するような化合物を含むものではない。

【0017】

式(I)の化合物は塩を形成することができる。塩の形成は、酸性水素原子、例えば R^1 がCOOH基又はスルホンアミド基-NHSO₂-を含んでいる式(I)の化合物に塩基を反応させることにより起こさせることができる。好適な塩基としては、例えば有機アミン及びアンモニウム、アルカリ金属又はアルカリ土類金属水酸化物、炭酸塩及び重炭酸塩、殊に水酸化ナトリウム及び水酸化カリウム、炭酸ナトリウム及び炭酸カリウム並びに重炭酸ナトリウム及び重炭酸カリウムが挙げられる。これらの塩は、農業的に好適な陽イオン、例えば金属塩、殊にアルカリ金属塩又はアルカリ土類金属塩であり、特にナトリウム塩及びカリウム塩、又はアンモニウム塩、有機アミンとの塩又は第四級アンモニウム塩で、酸性水素を置換して得られる化合物である。

【0018】

例えば、HCl、HBr、H₂SO₄又はHNO₃のような鉱酸、又は蟻酸、酢酸、プロピオン酸、シユウ酸又はスルホン酸のような有機酸のような適当な無機酸又は有機酸を、例えば、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ピペリジノ、モルホリノ又はピリジノのような塩基性の基との付加体を形成することにより、式(I)の化合物は塩を形成することができる。この場合、このようにして形成された塩は、酸と共役している塩基を陰イオンとして含んでいる。

【0019】

例えば、硫酸又はカルボン酸のような脱プロトン化された形式で存在している好適な置換基は、アミノ基のように相手のためにプロトン化されることができる基と一緒に分子内塩を形成することができる。

【0020】

これより以下、式(I)の化合物及びそれらの塩は、省略して、本発明に係る又は本発明に従って使用される「化合物(I)」と称する。

上記に及び更に以下において用いられる用語は、当業者にとってはよく知られているものであり、殊に以下に説明する意味を有する：

【0021】

無機の基とは、炭素原子を有さない基であり、好ましくはハロゲン、OH及びその無機の塩であり、ここにおいてHは陽イオンにより置換されていて、例えばアルカリ金属及びアルカリ土類金属塩、NH₂及び(無機)酸、例えば鉱酸とのアンモニウム塩、N₃(アジド)、N₂⁺A⁻(ジアゾニウム基、ここにおいてA⁻は陰イオンである)、NO、NHOH、NHNH₂、NO₂、S(O)OH(スルフィン酸基)、S(O)₂OH(又は、省略して、SO₃H、スルホン酸基)、-O-SO₂H(亜

10

20

30

40

50

硫酸)、 $-O-SO_3H$ (硫酸)、 $-P(O)(OH)_2$ (ホスホン酸基)、 $-O-P(OH)_3$ (リン酸基)及び最後に記載した6個の酸性基及びそれらの(無機)塩の水和物又は脱水和物の形態を意味し、用語「無機の基」はまた水素基(水素原子)を含み、定義においてこの基は既に有機の基で置換されていない骨格の一部としてしばしば称されている(例えば「無置換のフェニル」);ここで、用語「無機の基」は好ましくは、CN、SCN、有機の金属錯体、炭酸塩又はCOOHのような擬ハロゲン基を含まず、それらは炭素原子を含んでいるが故に有機の基とされる。

【0022】

有機の基は炭素原子を有する基であり、この基はヘテロ原子によって結合されることも可能である。好ましくは場合によっては炭化水素基により置換されているか、又は場合によつてはヘテロ環により置換されている。しかしながら、この用語はまた好ましくは、アシル基、即ち、OH基を除去することによって形成される有機酸の基をも含んでいる。アシル基はまた有機アルコール基を有するスルホン酸エステル、ホスホン酸エステル及びホスフィン酸エステル(この場合はポリ塩基酸から誘導されている)、又はそれぞれホスホン酸及びホスフィン酸から誘導されたアルキルスルホニル又はアルキルスルフィニルをも含んでいる。

10

【0023】

炭化水素基は脂肪族、環式脂肪族又は芳香族単環式、又は場合によっては置換されている炭化水素基の場合は、炭素及び水素元素に基づいて、二環式又は多環式の有機の基であり、例えば、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルケニル、アリール、フェニル、ナフチル、インダニル、インデニル等を含んでいる;これは、ヒドロカーボンオキシ基又はヘテロ原子基を経由して結合している炭化水素基にも対応して適用することができる。より特定の定義されていない限り、上記の定義における炭化水素基及びヒドロカーボンオキシ基は、好ましくは1~20個の炭素原子、更に好ましくは1から16個の炭素原子、殊に1から12個の炭素原子を有する。

20

【0024】

炭素骨格において、炭化水素基及び特定な基、アルキル、アルコキシ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、アルキルアミノ、アルキルチオ及びアルキルチオ並びに対応する無置換の及び/又は置換されている基は、それぞれの場合直鎖又は分枝鎖である。

【0025】

用語「 (C_1-C_4) -アルキル」は、1から4個の炭素原子を有する鎖状アルキルの省略表示であり、即ち、メチル、エチル、1-プロピル、2-プロピル、1-ブチル、2-ブチル、2-メチルプロピル及びtert-ブチル基を含んでいる。対応して、より広い記載範囲の炭素原子を有する一般的なアルキル基、例えば「 (C_1-C_6) -アルキル」はより多い数の炭素原子を有する直鎖又は分枝鎖のアルキル基を含み、即ち、実施例において5及び6個のC-原子を有するアルキル基を更に含んでいる。特定して指摘していない限り、低級炭素原子、例えば1から6個のC-原子を有するもの、又は不飽和基の場合は2から6個のC-原子を有するものは、好ましくはアルキル、アルケニル及びアルキニルのような炭化水素基である。

30

【0026】

用語「 (C_1-C_4) -アルキル」は、炭素原子の記載された範囲に対応して1から4個の炭素原子を有する鎖状アルキルの省略された表示であり、即ち、メチル、エチル、1-プロピル、2-プロピル、1-ブチル、2-ブチル、2-メチルプロピル及びtert-ブチル基を含んでいる。対応して、より広い記載範囲の炭素原子を有する一般的なアルキル基、例えば「 (C_1-C_6) -アルキル」はより多くの数の炭素原子、即ち、実施例において5及び6個の炭素原子を有する、直鎖又は分枝鎖のアルキル基を含んでいる。

40

【0027】

特定して指摘されていない限り、以下の炭素骨格、例えば1~6個の炭素原子を有するもの、又は不飽和基の場合は2から6個の炭素原子を有するものは、複合基におけるものをも含むアルキル、アルケニル及びアルキニル基のような炭化水素基に好適なものである。

50

【0028】

アルコキシ、ハロアルキル基等のようなアルキル基は、複合基における意味をも含んで、例えば、メチル、エチル、*n*-又は*i*-プロピル、*n*-、イソ-、*t*-又は2-ブチル、ペンチル；*n*-ヘキシル、イソヘキシル及び1,3-ジメチルブチルのようなヘキシル；*n*-ヘプチル、1-メチルヘキシル及び1,4-ジメチルペンチルのようなヘプチルであり；アルケニル及びアルキニル基は、アルキル基に対応する可能な不飽和の基の意味を有し；アルケニル基には、例えば、ビニル、アリル、1-メチル-2-プロペニル、2-メチル-2-プロペニル、2-ブテニル、ペンテニル、2-メチルペンテニル又はヘキセニル、好ましくはアリル、1-メチルプロパ-2-エン-1-イル、2-メチルプロパ-2-エン-1-イル、ブタ-2-エン-1-イル、ブタ-3-エン-1-イル、1-メチルブタ-3-エン-1-イル又は1-メチルブタ-2-エン-1-イルがある。(C₂C₆)-アルキニル基には、例えば、エチニル、プロパルギル、1-メチル-2-プロピニル、2-メチル-2-プロピニル、2-ブチニル、2-ペンチニル又は2-ヘキシニルがあり、好ましくはプロパルギル、ブタ-2-イン-1-イル、ブタ-3-イン-1-イル又は1-メチルブタ-3-イン-1-イルがある。

10

【0029】

例えば、(C₁-C₁₀)-アルキリデンを含むアルキリデンは二重結合を經由して結合している直鎖又は分枝鎖のアルカン基であるが、ここにおいて結合点の位置は未だ固定されていない。分枝鎖アルカン基の場合における唯一の可能な位置は、無論のことながら、2個の水素原子が二重結合によって置換することができる位置であり；そのような基は例えば、=CH₂、=CH-CH₃、=C(CH₃)-CH₃、=C(CH₃)-C₂H₅ 又は =C(C₂H₅)-C₂H₅ である。

20

【0030】

シクロアルキルは、好ましくは3～8個の炭素原子を有する炭素環の飽和した環系であり、例えばシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル又はシクロヘキシルである。置換されたシクロアルキルは置換基を有する環式系を含み、シクロアルキル基に二重結合、例えばメチリデンのようなアルキリデン基を有する置換基も含まれる。置換されたシクロアルキルはまた例えば、ビスシクロ[1.1.0]ブタン-1-イル、ビスシクロ[1.1.0]ブタン-2-イル、ビスシクロ[2.1.0]ペンタン-1-イル、ビスシクロ[2.1.0]ペンタン-2-イル、ビスシクロ[2.1.0]ペンタン-5-イル、アダマンタン-1-イル及びアダマンタン-2-イルのような多環式の脂肪族系を含んでいる。

【0031】

シクロアルケニルは、好ましくは4～8個の炭素原子を有する炭素環の非芳香族の部分的に不飽和の環系であり、例えば1-シクロブテニル、2-シクロブテニル、1-シクロペンテニル、2-シクロペンテニル、3-シクロペンテニル、又は1-シクロヘキシニル、2-シクロヘキセニル、3-シクロヘキセニル、1,3-シクロヘキサジエニル若しくは1,4-シクロヘキサジエニルがある。置換されたシクロアルキルについての説明は、置換されたシクロアルケニルについても対応して適用することができる。

30

【0032】

用語「ハロゲン」は、例えば、フッ素、塩素、臭素又はヨウ素を意味する。ハロアルキル、ハロアルケニル及びハロアルキニルはそれぞれ、好ましくはフッ素、塩素及び臭素の群から選択された、殊にフッ素及び塩素の群から選択された同一又は異なるハロゲン原子で部分的に又は完全に置換されたアルキル、アルケニル及びアルキニルを意味し、例えば、CH₂CH₂Cl、CH₂CH₂F、CH₂ClCH₃、CH₂FCH₃、CH₂Cl、CH₂Fのようなモノハロアルキル；CCl₃ 又は CF₃ 若しくは CF₃CF₂のような過ハロアルキルであり；CHF₂、CH₂F、CH₂FCHCl、CHCl₂、CF₂CF₂H、CH₂CF₃、CH₂ClCH₃、CH₂FCH₃ のようなポリハロアルキルであり；ハロアルコキシは、例えば、OCF₃、OCHF₂、OCH₂F、CF₃CF₂O、OCH₂CF₃及びOCH₂CH₂Clであり；これは、ハロアルケニル及び他のハロゲン置換基についても対応して適用することができる。

40

【0033】

アリールは好ましくは6～14個、殊に6～12個の炭素原子を有する単環、二環又は多環式の芳香族系を意味し、例えばフェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、インデニル、インダニル、ペントレニル、フルオレニル、ビフェニリル及びその類似基であり、

50

好ましくはフェニルである。

【0034】

ヘテロ環基又はヘテロ環（ヘテロシクリル）は、少なくとも1個の飽和、不飽和又はヘテロ芳香族で、そして一般に置換されている場合は、他の炭素環又はヘテロ環と縮合していてもよく；異なった定義がされていない限り、ヘテロ環は好ましくは3から9個の環原子、殊に3から6個の環原子を含み、そしてヘテロ環中に一つ若しくはそれより多い、好ましくは1から4個の、殊に1、2又は3個のヘテロ原子、好ましくはN、O及びSの群から選択されるヘテロ原子を含んでいるが；しかしながら、2個の酸素原子は直接に隣接してはならず、そして少なくとも1個の炭素原子は環の中に存在していなければならない、例えばチオフエン、フラン、ピロール、チアゾール、オキサゾール、イミダゾール、イソチアゾール、イソオキサゾール、ピラゾール、1,3,4-オキサジアゾール、1,3,4-チアジアゾール、1,3,4-トリアゾール、1,2,4-オキサジアゾール、1,2,4-チアジアゾール、1,2,4-トリアゾール、1,2,3-トリアゾール、1,2,3,4-テトラゾール、ベンゾ[b]チオフエン、ベンゾ[b]フラン、インドール、ベンゾ[c]チオフエン、ベンゾ[c]フラン、イソインドール、ベンゾキサゾール、ベンゾチアゾール、ベンズイミダゾール、ベンズイソオキサゾール、ベンズイソチアゾール、ベンゾピラゾール、ベンゾチアジアゾール、ベンゾトリアゾール、ジベンゾフラン、ジベンゾチオフエン、カルバゾール、ピリジン、ピラジン、ピリミジン、ピリダジン、1,3,5-トリアジン、1,2,4-トリアジン、1,2,4,5-テトラジン、キノリン、イソキノリン、キノキサリン、キナゾリン、シンノリン、1,8-ナフチリジン、1,5-ナフチリジン、1,6-ナフチリジン、1,7-ナフチリジン、フタラジン、ピリドピリミジン、プリン、プテリジン、4H-キノリジン、ピペリジン、モルホリン、ピペラジン、オキセタン、オキシラン、ピロリジン、オキサゾリン、テトラヒドロフラン、テトラヒドロピラン、1,3-ジオキサラン、1,3-及び1,4-ジオキサラン、イソオキサゾリジン又はチアゾリジンの基が挙げられる。

10

20

【0035】

上記に「ヘテロシクリル」として記載されている基の中で、「ヘテロアリアル」はそれぞれの場合、完全に不飽和な芳香族のヘテロ環化合物を意味し、例えばピリジン、ピリミジン、(1,2,4)-オキサジアゾール、(1,3,4)-オキサジアゾール、ピロール、フラン、チオフエン、オキサゾール、チアゾール、イミダゾール、ピラゾール、イソオキサゾール、1,2,4-トリアゾール、テトラゾール、ピラジン又はピリダジンを意味する。

30

【0036】

更に好ましくは、ヘテロシクリルはN、O及びSの群から選択されるヘテロ原子を有する、部分的に又は完全に水素添加されたヘテロ環基、例えばオキシラニル、オキセタニル、オキサラニル(=テトラヒドロフリル)、オキサニル、ピロリニル、ピロリジニル又はピペリジニルである。更に好ましくは、ヘテロシクリルはN、O及びSの群から選択される2個のヘテロ原子を有する、部分的に又は完全に水素添加されたヘテロ環基、例えばオキサゾリニル、チアゾリニル、ピペラジニル、1,3-ジオキサラニル、1,3-及び1,4-ジオキサニル、オキサゾリニル、イソオキサゾリニル、オキサゾリジニル、イソオキサゾリジニル及びモルホリニルである。もしも部分的に又は完全に飽和された窒素ヘテロ環の場合は、炭素又は窒素を経由して当該分子の残部に結合することもできる。

40

【0037】

ヘテロシクリルは、好ましくは3から7個、殊に3から6個の環原子を有する飽和又は不飽和の脂肪族、殊に飽和のヘテロ環基、又は5若しくは6個の環原子を有するヘテロ芳香族環である。ヘテロシクリルは好ましくはN、O及びSの群から選択されるヘテロ環原子を含んでいる。

【0038】

ヘテロシクリルの好ましい例は、ピリジル、チエニル、フリル、ピロリル、オキシラニル、2-オキセタニル、3-オキセタニル、オキサラニル(=テトラヒドロフリル)、ピロリジニル、ピペリジニル、殊にオキシラニル、2-オキセタニル、3-オキセタニル又はオキサラニルの群から選択される3から6個の環原子を有するヘテロ環基であり、及び2又は3個

50

のヘテロ原子を有するヘテロ環基であり、例えばピリミジニル、ピリダジニル、ピラジニル、トリアジニル、チエニル、チアゾリル、チアジアゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、ピラゾリル、トリアゾリル、ピペラジニル、ジオキサラニル、ジオキサニル、オキサゾリニル、イソオキサゾリニル、オキサゾリジニル、イソオキサゾリジニル又はモルホリニルである。

【0039】

もしも骨格が基 (= 置換基) のリスト又は一般的に定義される基の群から選択される「一つ若しくはそれより多い基により」置換されているときは、それぞれの場合、同一及び/又は構造的に異なる複数の基による同時置換をも含むものである。

【0040】

置換されたヘテロ環基に好適な置換基には以下に記載する置換基があり、そして追加的にはオキソがある。この場合、環式炭素原子上の置換基としてのオキソ基には、例えば、ヘテロ環におけるカルボニル基がある。更に、好ましくはラクトン及びラクタムも含まれる。オキソ基はまたヘテロ環原子においても存在することができ、例えば窒素及び硫黄の場合には種々の酸化状態において存在することができ、そして例えば二価の基 $-N(0)-$ 、 $-S(0)-$ (省略形では $S0$) 及び $-S(0)_2-$ (省略形では $S0_2$) を、ヘテロ環中に形成することができる。

10

【0041】

ヘテロ環において、もしも当該骨格の窒素原子上の水素原子が置換されているときは、オキソ基と異なる置換基はヘテロ原子、例えば窒素原子、に結合することもできる。また、窒素原子及び例えば硫黄原子のようなその他のヘテロ原子の場合は、第四級アンモニア化合物又は硫化化合物を形成する更なる置換も可能である。

20

【0042】

置換されたアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルケニル、アリール、フェニル、ベンジル、ヘテロシクリル及びヘテロアリール基のような置換された基とは、例えば、置換されていない骨格から由来した置換された基であり、当該置換基は、例えばハロゲン、アルコキシ、アルキルチオ、ヒドロキシル、アミノ、ニトロ、カルボキシル、シアノ、アジド、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-及びジアルキルアミノカルボニル；アシルアミノ、モノ-及びジアルキルアミノのような置換されたアミノ；トリアルキルシリル及び場合によっては置換されているシクロアルキル、場合によっては置換されているアリール、場合によっては置換されているヘテロシクリル、ここにおいて最後に記載した環式基のそれぞれはまたヘテロ原子、又はアルキル基にいて言及したような二価の官能基を経由して結合していてもよく、及びアルキルスルフィニル、アルキルスルホニル；そして、環式基 (= 「環式骨格」) の場合は更にアルキル、ハロアルキル、アルキルチオアルキル、アルコキシアルキル、場合によっては置換されているモノ-及びジアルキルアミノアルキル並びにヒドロキシアルキルの群から選択される一つ若しくはそれより多い、好ましくは1、2又は3個の基であり；置換されたアルキル等のような用語「置換された基」とは、置換基として、記載されている飽和炭化水素を含有する基に加えて、場合によっては置換されているアルケニル、アルキニル、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、フェニル、フェノキシ等の不飽和の脂肪族又は芳香族の基をも含んでいる。環中に脂肪族の置換基を有する置換された環式基の場合には、二重結合を経由して環に結合している置換基を有する環式系、例えばメチリデン若しくはエチリデンのようなアルキリデン基、又はオキソ基、イミノ基若しくは置換されているイミノ基によって置換されている置換基を有する環式系をも含まれる。

30

40

【0043】

例として言及した置換基 (= 「第一置換基レベル」) は、もしもそれらが炭化水素含有の置換基を含んでいるならば、場合によっては、例えば当該第一置換基レベルにおいて定義したような置換基の一つにより置換基中で更に置換されることができ (「第二置換基レベル」) 。対応して、更なる置換基レベルも可能である。用語「置換された基」は、好ましくは唯一又は二つの置換基レベルを含んでいる。

50

【0044】

当該置換基レベルにとって好ましい置換基には、例えば、

アミノ、ヒドロキシル、ハロゲン、ニトロ、シアノ、メルカプト、カルボキシル、カルボキサミド、 SF_5 、アミノスルホニル、アルキル、シクロアルキル、アルケニル、シクロアルケニル、アルキニル、モノアルキルアミノ、ジアルキルアミノ、N-アルカノイルアミノ、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、シクロアルコキシ、シクロアルケニルオキシ、アルコキシカルボニル、アルケニルオキシカルボニル、アルキニルオキシカルボニル、アリールオキシカルボニル、アルカノイル、アルケニルカルボニル、アルキニルカルボニル、アリールカルボニル、アルキルチオ、シクロアルキルチオ、アルケニルチオ、シクロアルケニルチオ、アルキニルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、モノアルキルアミノスルホニル、ジアルキルアミノスルホニル、N-アルキルアミノカルボニル、N,N-ジアルキル-アミノカルボニル、N-アルカノイルアミノカルボニル、N-アルカノイル-N-アルキルアミノカルボニル、アリール、アリールオキシ、ベンジル、ベンジルオキシ、ベンジルチオ、アリールチオ、アリールアミノ、ベンジルアミノ、ヘテロシクリル及びトリアルキルシリルが挙げられる。

10

【0045】

炭素原子を有する基の場合は、好ましいものは1から6個の炭素原子を有するものであり、好ましくは1から4個の炭素原子、殊に1から2個の炭素原子を有するものである。好ましい置換基は、一般的にはハロゲン、例えばフッ素及び塩素、 (C_1-C_4) -アルキル、好ましくはメチル又はエチル、 (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又はエトキシ、 (C_1-C_4) -ハロアルコキシ、ニトロ及びシアノである。ここで極めて好ましい置換基はメチル、メトキシ、フッ素及び塩素である。

20

【0046】

一置換又は二置換アミノのような置換されたアミノとは、例えばアルキル、アルコキシ、アシル及びアリールの群から選択される一つ若しくはそれより多い同一又は異なる基でN-置換された置換アミノ基の群から選択される基を意味し；好ましくは、モノ-及びジアルキルアミノ、モノ-及びジアリールアミノ、アシルアミノ、N-アルキル-N-アリールアミノ、N-アルキル-N-アシルアミノ及び飽和のN-ヘテロシクリルがあり；ここで、好ましいものは1から4個の炭素原子を有するアルキル基であり；アリールは好ましくはフェニル又は置換されたフェニルであり；アシルについては、以下に規定される定義が適用されるが、好ましいものは (C_1-C_4) -アルカノイルである。これは、置換されたヒドロキシルアミノ又はヒドラジノについても、対応して適用することができる。

30

置換されたアミノには、窒素原子において4個の有機の置換基を有する第四級アンモニウム化合物（塩）も含まれる。

【0047】

場合によっては置換されているフェニルとは、好ましくは無置換であるか又はハロゲン、 (C_1-C_4) -アルキル、 (C_1-C_4) -アルコキシ、 (C_1-C_4) -ハロアルキル、 (C_1-C_4) -ハロアルコキシ及びニトロの群から選択される同一又は異なる基で、一置換-又は多置換、好ましくは三置換まで置換されているフェニルであり、例えばo-、m-及びp-トリル、ジメチルフェニル、2-、3-及び4-クロロフェニル、2-、3-及び4-フルオロフェニル、2-、3-及び4-トリフルオロメチル-並びに？トリクロロメチルフェニル、2,4-、3,5-、2,5-及び2,3-ジクロロフェニル、o-、m-及びp-メトキシフェニルである。

40

【0048】

場合によっては置換されているシクロアルキルとは、好ましくは無置換であるか又はハロゲン、 (C_1-C_4) -アルキル、 (C_1-C_4) -アルコキシ、 (C_1-C_4) -ハロアルキル及び (C_1-C_4) -ハロアルコキシ、殊に1若しくは2個の (C_1-C_4) -アルキル基の群から選択される同一又は異なる基で、一置換又は多置換、好ましくは三置換まで置換されているシクロアルキルフェニルである。

【0049】

50

場合によっては置換されているヘテロシクリルとは、好ましくは無置換であるか又はハロゲン、(C₁-C₄)-アルキル、(C₁-C₄)-アルコキシ、(C₁-C₄)-ハロアルキル及びオキシの群から選択される同一又は異なる基で、一置換又は多置換、好ましくは三置換まで置換されているヘテロシクリルであり、殊にハロゲン、(C₁-C₄)-アルキル、(C₁-C₄)-アルコキシ、(C₁-C₄)-ハロアルキル、(C₁-C₄)-ハロアルコキシ、ニトロ及びオキシの群から選択される同一又は異なる基で、一置換又は多置換されているヘテロシクリルであり、極めて好ましくは1若しくは2個の(C₁-C₄)-アルキル基で置換されているヘテロシクリルである。

【0050】

アシルは、形式的には酸官能基からヒドロキシル基を除去して形成される有機酸の基を意味し、それはヘテロ原子を経由して酸官能基に結合している酸における有機の基についても可能である。アシルの例としては、チオカルボン酸、無置換又はN-置換のイミノカルボン酸のような、カルボン酸HO-CO-Rの-CO-R基、及びそれらから誘導された酸の基、炭酸モノエステル、N-置換のカルバミン酸、スルホン酸、スルフィン酸、N-置換のスルホンアミド酸、ホスホン酸、ホスフィン酸の基がある。

10

【0051】

アシルは、例えば、ホルミル、[(C₁-C₄)-アルキル]カルボニル、フェニルカルボニル、アルキルオキシカルボニル、フェニルオキシカルボニル、ベンジルオキシカルボニル、アルキルスルホニル、アルキルスルフィニル、N-アルキル-1-イミノアルキル、N-アルキル-及びN,N-ジアルキルカルバモイルのようなアルキルカルボニル及びその他の有機酸の基を意味する。ここで、置換基は、それぞれの場合、アルキル又はフェニル基において更に置換されていてもよく、例えば、アルキル基はハロゲン、アルコキシ、フェニル及びフェノキシの群から選択される一つ若しくはそれより多い基で置換されていてもよく；フェニル置換基における置換基の例としては、置換されたフェニルについて一般的に既に言及した置換基が挙げられる。

20

【0052】

アシルは、好ましくは、狭義にはアシル基を意味し、即ち、酸性基が有機置換基の炭素原子に直接結合している有機酸の基、例えば、ホルミル及びアセチルのようなアルカノイル、フェニルカルボニルのようなアロイル、及びその他の飽和又は不飽和の有機酸の基がある。

【0053】

「アロイル」は、カルボニル基を経由して結合している上記に定義したようなアリール基、例えばベンゾイル基を意味する。

30

もしも一般的な基が「水素」として定義されているときは、これは水素原子を意味する。

基の「イル-位置」とは、基の結合点を意味する。

【0054】

当該一般的な定義に従って：

「(C₁-C₆)-アルキル」は、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、1-ブチル、2-ブチル、2-メチルプロピル又は第三級ブチル基を意味する；

「(C₁-C₁₀)-アルキル」は、それ故上記に記載されているアルキル基を含む他、更にn-ペンチル、1,1-ジメチルプロピル又は2-メチルブチルのような異性体のペンチル基、異性体のヘキシル、ヘプチル、オクチル、ノニル又はデシル基を含んでいる。

40

【0055】

対応して、「(C₂-C₄)-アルケニル」は、例えばビニル、アリル、2-メチル-2-プロペン-1-イル、2-又は3-ブテン-1-イル基を意味し、

対応して、「(C₃-C₁₀)-アルケニル」は、例えばアリル、2-メチル-2-プロペン-1-イル、2-又は3-ブテン-1-イル、ペンテニル、2-メチルペンテニル、ヘキセニル、ヘプテニル、オクテニル、ノネニル又はデセニル基を意味し、

「(C₂-C₄)-アルキニル」は、例えばエチニル、プロパルギル又は2-ブチン-1-イル基を意味し、

50

「(C₃-C₁₀)-アルキニル」は、例えばプロパルギル、2-ブチン-1-イル、2-ペンチン-1-イル、2-メチルペンチン-3-イル、ヘキシニル、ヘプチニル、オクチニル、ノニニル又はデシニル基を意味する。

【0056】

もしもアルキル基の炭素原子が一つ若しくはそれより多い酸素原子で中断されているときは、これは2個の酸素原子が直接に隣接してはならないことを意味する。

【0057】

「(C₃-C₆)-シクロアルキル」は、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル又はシクロヘキシル基を意味し、

「(C₃-C₁₀)-シクロアルキル」は、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、シクロオクチル又はシクロデシル基のような単環式のアルキル基を意味し、ノルボルニル又はビスシクロ[2.2.2]オクチル基のような二環式のアルキル基を意味し、又はデカヒドロナフチル基のような縮合系を意味する。

10

【0058】

「(C₄-C₁₀)-シクロアルケニル」は、シクロアルキレン、シクロブテニル、シクロペンテニル、シクロヘキセニル、シクロヘプテニル、シクロオクテニル又はシクロデセニル基のような単環式のシクロアルキル基を意味し、ノルボルネニル若しくはビスシクロ[2.2.2]オクテニル基のような二環式のシクロアルキル基を意味し、又はテトラ-、ヘキサ-若しくはオクタヒドロナフチル基のような縮合系を意味する。

【0059】

「(C₁-C₄)-アルコキシ」及び「(C₁-C₁₀)-アルコキシ」は、炭化水素基が用語「(C₁-C₄)-アルキル」及び「(C₁-C₁₀)-アルキル」で規定された意味を有するアルコキシ基である。

「(C₁-C₄)-アルコキシ-(C₁-C₄)-アルコキシ」は、エトキシメトキシ、メトキシエトキシ、1-メトキシエトキシ、1-エトキシエトキシ又は1-メトキシプロポキシ基のような更なるアルコキシ基で置換された上記で定義したアルコキシ基である。

20

【0060】

「(C₃-C₁₀)-アルケニルオキシ」、「(C₃-C₁₀)-アルキニルオキシ」、「(C₃-C₁₀)-シクロアルコキシ」及び「(C₄-C₁₀)-シクロアルケニルオキシ」は、炭化水素基が「(C₃-C₁₀)-アルケニル」、「(C₃-C₁₀)-アルキニル」、「(C₃-C₁₀)-シクロアルキル」及び「(C₄-C₁₀)-シクロアルケニル」で規定された意味を有するエーテル基である。

30

「(C₃-C₁₀)-シクロアルキル-(C₁-C₄)-アルコキシ」は、例えばシクロプロピルメトキシ、シクロプロピルエトキシ、シクロブチルメトキシ、シクロペンチルメトキシ、シクロヘキシルメトキシ又はシクロヘキシルエトキシ基を意味する。

【0061】

「(C₄-C₁₀)-シクロアルケニル-(C₁-C₄)-アルコキシ」とは、例えばシクロブテニルオキシ、シクロペンテニルメトキシ、シクロヘキセニルメトキシ又はシクロヘキセニルエトキシ基を意味する。

「(C₃-C₁₀)-シクロアルキル-(C₃-C₄)-アルケニルオキシ」は、例えばシクロプロピルアリルオキシ、シクロブチルアリルオキシ又はシクロペンチルアリルオキシ基を意味する。

「(C₄-C₁₀)-シクロアルケニル-(C₃-C₄)-アルケニルオキシ」は、例えばシクロブテニルアリルオキシ又はシクロペンテニルアリルオキシ基を意味する。

40

【0062】

「(C₁-C₄)-アルキル-(C₃-C₁₀)-シクロアルコキシ」とは、例えばメチルシクロペンチルオキシ、エチルシクロペンチルオキシ、メチルシクロヘキシルオキシ又はエチルシクロヘキシルオキシ基を意味する。

「(C₂-C₄)-アルケニル-(C₃-C₁₀)-シクロアルコキシ」は、例えばビニルシクロペンチルオキシ、アリルシクロペンチルオキシ、ビニルシクロヘキシルオキシ又はアリルシクロヘキシルオキシ基を意味する。

「(C₂-C₄)-アルキニル-(C₃-C₁₀)-シクロアルコキシ」は、例えばエチニルシクロペンチルオキシ、プロピニルシクロペンチルオキシ、エチニルシクロペンチルオキシ又はプロピ

50

ニルシクロヘキシルオキシ基を意味する。

【0063】

「(C₁-C₄)-アルキル-(C₄-C₁₀)-シクロアルケニルオキシ」は、例えばメチルシクロペンテニルオキシ、エチルシクロペンテニルオキシ、メチルシクロヘキセニルオキシ又はエチルシクロヘキセニルオキシ基を意味する。

「(C₂-C₄)-アルケニル-(C₃-C₁₀)-シクロアルケニルオキシ」は、例えばビニルシクロペンテニルオキシ、アリルシクロペンテニルオキシ、ビニルシクロヘキセニルオキシ又はアリルシクロヘキセニルオキシ基を意味する。

「(C₁-C₄)-アルコキシ-(C₃-C₄)-アルケニルオキシ」は、例えばメトキシアリルオキシ又はエトキシアリルオキシ基を意味する。

10

【0064】

「(C₁-C₁₀)-アルカノイル」は、例えばホルミル、アセチル、プロピオニル、ブチリル、2-メチルブチリル、ピパロイル、オクタノイル又はデカノイル基を意味する。

「(C₄-C₁₀)-シクロアルカノイル」は、例えばシクロブチルカルボニル、シクロペンチルカルボニル、シクロヘキシルカルボニル又はシクロノニルカルボニル基を意味する。

「(C₃-C₁₀)-アルケノイル」は、例えばアクリル、メタクリル、クロトノイル、ジメチルアクリル又はオクテノイル基を意味する。

「(C₃-C₁₀)-アルキノイル」は、例えばプロピノイル、ブチノイル、ヘキシノイル又はオクチノイル基を意味する。

【0065】

「モノ-及びジ-(C₁-C₄)-アルキルカルバモイルで、後者の基においてはアルキル基が環式化の形式で結合して3-から8-員環を形成してもよく、ここにおいて場合によっては、一炭素単位が酸素、硫黄、又はS(0)、S(0)₂若しくはNR³基で置換されていてもよく、そしてR³は(C₁-C₄)-アルキル、(C₁-C₄)-アルカノイル、(C₁-C₄)-アルコキシカルボニル、ジ-(C₁-C₄)-アルキルカルバモイル又は場合によっては置換されたアリアルである。」とは、例えばメチル-、エチル-、プロピル-、イソプロピル-、ブチル-又は第三級ブチルカルバモイル基、又はジメチル-、ジエチル-、メチルエチル-又はジイソプロピルカルバモイル基を意味するが、更にピロリジノ-、モルホリノ-、チオモルホリノ-、ピペリジノ-、N-メチル-又はアセチルピペラジノカルバモイル基をも意味する。

20

【0066】

「モノ-又はジ-(C₃-C₁₀)-シクロアルキルカルバモイル」は、例えばシクロプロピル-、シクロブチル-、シクロペンチル-若しくはシクロヘキシルカルバモイル基、又はジシクロプロピル-、ジシクロブチル-、ジシクロペンチル-又はジシクロヘキシルカルバモイル基を意味する。

30

【0067】

「(C₁-C₁₀)-アルコキシカルボニル」は、例えばメトキシカルボニル、エトキシカルボニル、プロポキシカルボニル、イソカルボニルプロポキシ、プトキシカルボニル、イソプトキシカルボニル、第二級プトキシカルボニル又は第三級プトキシカルボニル基を意味する。

「(C₃-C₁₀)-シクロアルコキシカルボニル」は、例えばシクロプロポキシカルボニル、シクロプトキシカルボニル、シクロペンチルオキシカルボニル又はシクロヘキシルオキシカルボニル基を意味する。

40

【0068】

「(C₁-C₁₀)-アルカノイルオキシ」は、例えばアセトキシ、プロピオニルオキシ、ブタノイルオキシ又はピパロイルオキシ基を意味する。

「(C₄-C₁₀)-シクロアルカノイルオキシ」は、例えばシクロプロピルカルボニルオキシ、シクロブチルカルボニルオキシ、シクロペンチルカルボニルオキシ、又はシクロヘキシルカルボニルオキシ基を意味する。

【0069】

「(C₁-C₁₀)-アルコキシカルボニルオキシ」は、例えばメトキシ-、エトキシ-、プロポ

50

キシ-、イソプロポキシ-、ブトキシ- 又は第三級ブトキシカルボニルオキシ基のようなカーボネート基を意味する。

「(C₁-C₁₀)-アルキルアミノカルボニルオキシ」は、例えばメチル-、エチル-、プロピル-、イソプロピル-、ブチル- 又は第三級ブチルアミノカルボニルオキシ基のようなカルバメート基を意味する。

【0070】

「ジ-(C₁-C₁₀)-アルキルアミノカルボニルオキシで、後者の基においてはアルキル基が環式化の形式で結合して3-から8-員環を形成してもよく、ここにおいて場合によっては、一炭素単位が酸素、硫黄、又はS(O)、S(O)₂ 若しくは NR³ 基で置換されていてもよく、そして R³ は (C₁-C₄)-アルキル、(C₁-C₄)-アルカノイル、(C₁-C₄)-アルコキシカルボニル、ジ-(C₁-C₄)-アルキルカルバモイル又は場合によっては置換されているアリアルである。」とは、例えばジメチル-、ジエチル-、メチルエチル-、ジブチル-、ピロリジノ-、ピペリジノ-、モルホリノ-、アセチルピペラジノ- 又は N-メチルピペラジノカルボニルオキシ基のようなカルバメート基を意味する。

10

「(C₁-C₁₀)-アルキルスルホニルアミノ」は、例えばメチル-、エチル-、プロピル-、イソプロピル-、ブチル-、イソブチル、第三級ブチル、オクチル- 又はデシルスルホニルアミノ基を意味する。

【0071】

「(C₁-C₁₀)-アルカノイルアミノ」は、例えばホルミルアミノ、アセチルアミノ、プロピオニルアミノ、イソプロピオニルアミノ、ブタノイルアミノ又はピバロイルアミノ基を意味する。

20

「(C₃-C₁₀)-アルケノイルアミノ」は、例えばアクリルアミノ、メタクリルアミノ、ジメチルアクリルアミノ又はクロトニルアミノ基を意味する。

「(C₄-C₁₀)-シクロアルカノイルアミノ」は、例えばシクロプロパノイルアミノ、シクロブタノイルアミノ、シクロペンタノイルアミノ又はシクロヘキサノイルアミノ基を意味する。

「(C₃-C₁₀)-シクロアルキル-(C₁-C₄)-アルカノイルアミノ」は、例えばシクロプロピルアセチルアミノ又はシクロペンチルアセチルアミノ基を意味する。

【0072】

「モノ- 及び ジ-(C₁-C₁₀)-アルキルアミノカルボニルアミノで、後者の基においてはアルキル基が環式化の形式で結合して3-から8-員環を形成してもよく、ここにおいて場合によっては、一炭素単位が酸素、硫黄、又はS(O)、S(O)₂ 若しくは NR³ 基で置換されていてもよく、そして R³ は (C₁-C₄)-アルキル、(C₁-C₄)-アルカノイル、(C₁-C₄)-アルコキシカルボニル、ジ-(C₁-C₄)-アルキルカルバモイル又は場合によっては置換されているアリアルである。」とは、例えばメチルアミノ-、ジメチルアミノ-、エチルアミノ-、メチルエチルアミノ-、ピペリジノ-、モルホリノ- 又はアセチルピペラジノカルボニルアミノ基のようなウレア基を意味する。

30

【0073】

「(C₁-C₁₀)-アルコキシカルボニルアミノ」は、例えばメトキシ-、エトキシ-、プロポキシ-、イソプロポキシ-、ブトキシ- 又は第三級ブトキシカルボニルアミノ基のようなウレタン基を意味する。

40

「(C₁-C₁₀)-アルキルチオ」は、炭化水素基が「(C₁-C₁₀)-アルキル」で規定された意味を有する、アルキルチオ基を意味する。

「(C₃-C₁₀)-アルケニルチオ」は、炭化水素基が「(C₃-C₁₀)-アルケニル」で規定された意味を有する、アルケニルチオ基を意味する。

「(C₃-C₁₀)-アルキニルチオ」は、炭化水素基が「(C₃-C₁₀)-アルキニル」で規定された意味を有する、アルキニルチオ基を意味する。

「(C₃-C₁₀)-シクロアルキルチオ」は、炭化水素基が「(C₃-C₁₀)-シクロアルキニル」で規定された意味を有する、シクロアルキルチオ基を意味する。

「(C₄-C₁₀)-シクロアルケニルチオ」は、炭化水素基が「(C₄-C₁₀)-シクロアルケニル

50

」で規定された意味を有する、シクロアルケニルチオ基を意味する。

【0074】

「(C₃-C₁₀)-シクロアルキル-(C₁-C₄)-アルキルチオ」は、例えばシクロプロピルメチルチオ、シクロプロピルエチルチオ、シクロペンチルメチルチオ又はシクロヘキシルメチルチオ基を意味する。

「(C₄-C₁₀)-シクロアルケニル-(C₁-C₄)-アルキルチオ」は、例えばシクロペンテニルメチルチオ又はシクロヘキセニルメチルチオ基を意味する。

「(C₃-C₁₀)-シクロアルキル-(C₃-C₄)-アルケニルチオ」は、例えばシクロプロピルアリルチオ、シクロペンチルアリルチオ又はシクロヘキシルアリルチオ基を意味する。

「(C₄-C₁₀)-シクロアルケニル-(C₃-C₄)-アルケニルチオ」は、例えばシクロペンテニルアリルチオ又はシクロヘキセニルアリルチオ基を意味する。 10

「(C₁-C₄)-アルキル-(C₃-C₁₀)-シクロアルキルチオ」は、例えばメチルシクロペンチルチオ又はメチルシクロヘキシルチオ基を意味する。

「(C₁-C₄)-アルキル-(C₄-C₁₀)-シクロアリケニルチオ」は、例えばメチルシクロペンテニルチオ又はメチルシクロヘキセニルチオ基を意味する。

【0075】

「(C₂-C₄)-アルケニル-(C₃-C₁₀)-シクロアルキルチオ」は、例えばビニルシクロペンチルチオ、アリルシクロペンチルチオ、ビニルシクロヘキシルチオ又はアリルシクロヘキシルチオ基を意味する。

「(C₂-C₄)-アルキニル-(C₃-C₁₀)-シクロアルキルチオ」は、例えばエチニルシクロペンチルチオ、プロパルギルシクロペンチルチオ、エチニルシクロヘキシルチオ又はプロパルギルシクロヘキシルチオ基を意味する。 20

【0076】

「(C₁-C₄)-アルキル-(C₄-C₁₀)-シクロアルケニルチオ」は、例えばメチルシクロペンテニルチオ又はメチルシクロヘキセニルチオ基を意味する。

「(C₂-C₄)-アルケニル-(C₄-C₈)-シクロアルケニルチオ」は、例えばアリルシクロペンテニルチオ又はアリルシクロヘキセニルチオ基を意味する。

【0077】

「(C₁-C₁₀)-アルキルスルフィニル」は、例えばメチル-、エチル-、プロピル-、イソプロピル-、ブチル-、イソブチル、第二級ブチル、第三級ブチル又はオクチルスルフィニル基を意味する。 30

「(C₃-C₁₀)-アルケニルスルフィニル」は、例えばアリル-、メチルアリル-、ブテニル-又はオクテニルスルフェニル(octenylsulfenyl)基を意味する。

「(C₃-C₁₀)-アルキニルスルフィニル」は、例えばプロパルギル-、ブチニル-又はオクチニルスルフィニル基を意味する。

「(C₃-C₁₀)-シクロアルキルスルフィニル」は、炭化水素基が「(C₃-C₁₀)-シクロアルキル」で規定された意味を有する、シクロアルキルスルフィニル基を意味する。

「(C₄-C₁₀)-シクロアルケニルスルフィニル」は、炭化水素基が「(C₄-C₁₀)-シクロアルケニル」で規定された意味を有する、シクロアルケニルスルフィニル基を意味する。

【0078】

「(C₃-C₁₀)-シクロアルキル-(C₁-C₄)-アルキルスルフィニル」は、例えばシクロプロピルメチルスルフィニル、シクロプロピルエチルスルフィニル、シクロペンチルメチルスルフィニル又はシクロヘキシルメチルスルフィニル基を意味する。

「(C₄-C₁₀)-シクロアルケニル-(C₁-C₄)-アルキルスルフィニル」は、例えばシクロペンテニルメチルスルフィニル又はシクロヘキセニルメチルスルフィニル基を意味する。

「(C₃-C₁₀)-シクロアルキル-(C₃-C₄)-アルケニルスルフィニル」は、例えばシクロプロピルアリルスルフィニル、シクロペンチルアリルスルフィニル又はシクロヘキシルアリルスルフィニル基を意味する。

「(C₄-C₁₀)-シクロアルケニル-(C₃-C₄)-アルケニルスルフィニル」は、例えばシクロペンテニルアリルスルフィニル又はシクロヘキセニルアリルスルフィニル基を意味する。 40 50

【 0 0 7 9 】

「(C₁-C₄)-アルキル-(C₃-C₁₀)-シクロアルキルスルフィニル」は、例えばメチルシクロペンチルスルフィニル又はメチルシクロヘキセルスルフィニル基を意味する。

「(C₁-C₈)-アルキル-(C₄-C₁₀)-シクロアルケニルスルフィニル」は、例えばメチルシクロペンテニルスルフィニル又はメチルシクロヘキセニルスルフィニル基を意味する。

「(C₂-C₄)-アルケニル-(C₃-C₁₀)-シクロアルキルスルフィニル」は、例えばビニルシクロペンチルスルフィニル、アリルシクロペンチルスルフィニル、ビニルシクロヘキシルスルフィニル又はアリルシクロヘキシルスルフィニル基を意味する。

「(C₂-C₄)-アルキニル-(C₃-C₁₀)-シクロアルキルスルフィニル」は、例えばエチルシクロペンチルスルフィニル、プロパルギルシクロペンチルスルフィニル、エチルシクロペンチルスルフィニル又はプロパルギルシクロヘキシルスルフィニル基を意味する。 10

【 0 0 8 0 】

「(C₂-C₄)-アルケニル-(C₄-C₁₀)-シクロアルケニルスルフィニル」は、例えばビニルシクロペンテニルスルフィニル、アリルシクロペンテニルスルフィニル、ビニルシクロヘキセニルスルフィニル又はアリルシクロヘキセニルスルフィニル基を意味する。

「(C₂-C₄)-アルキニル-(C₄-C₁₀)-シクロアルケニルスルフィニル」は、例えばエチルシクロペンテニルスルフィニル、プロパルギルシクロペンテニルスルフィニル、エチルシクロペンテニルスルフィニル又はプロパルギルシクロヘキセニルスルフィニル基を意味する。

「(C₁-C₁₀)-アルキルスルホニル」は、例えばメチル-、エチル-、プロピル-、イソプロピル-、ブチル-、イソブチル、第二級ブチル、第三級ブチル又はオクチルスルホニル基を意味する。 20

【 0 0 8 1 】

「(C₃-C₁₀)-アルケニルスルホニル」は、例えばアリル-、メチルアリル-、ブテニル-又はオクテニルスルホニル基を意味する。

「(C₃-C₁₀)-アルキニルスルホニル」は、例えばプロパルギル-、ブチニル-又はオクチニルスルホニル基を意味する。

「(C₃-C₁₀)-シクロアルキルスルホニル」は、炭化水素基が「(C₃-C₁₀)-シクロアルキル」で規定された意味を有するシクロアルキルスルホニル基を意味する。

「(C₄-C₁₀)-シクロアルケニルスルホニル」は、炭化水素基が「(C₄-C₁₀)-シクロアルケニル」で規定された意味を有するシクロアルケニルスルホニル基を意味する。 30

【 0 0 8 2 】

「(C₃-C₁₀)-シクロアルキル-(C₁-C₄)-アルキルスルホニル」は、例えばシクロプロピルメチルスルホニル、シクロプロピルエチルスルホニル、シクロペンチルメチルスルホニル又はシクロヘキシルメチルスルホニル基を意味する。

「(C₄-C₁₀)-シクロアルケニル-(C₁-C₄)-アルキルスルホニル」は、例えばシクロペンテニルメチルスルホニル又はシクロヘキセニルメチルスルホニル基を意味する。

「(C₃-C₁₀)-シクロアルキル-(C₃-C₄)-アルケニルスルホニル」は、例えばシクロプロピルアリルスルホニル、シクロペンチルアリルスルホニル又はシクロヘキシルアリルスルホニル基を意味する。 40

「(C₄-C₁₀)-シクロアルケニル-(C₃-C₄)-アルケニルスルホニル」は、例えばシクロペンテニルアリルスルホニル又はシクロヘキセニルアリルスルホニル基を意味する。

【 0 0 8 3 】

「(C₁-C₄)-アルキル-(C₃-C₁₀)-シクロアルキルスルホニル」は、例えばメチルシクロペンチルスルホニル又はメチルシクロヘキシルスルホニル基を意味する。

「(C₁-C₄)-アルキル-(C₄-C₁₀)-シクロアルケニルスルホニル」は、例えばメチルシクロペンテニルスルホニル又はメチルシクロヘキセニルスルホニル基を意味する。

「(C₂-C₄)-アルケニル-(C₃-C₁₀)-シクロアルキルスルホニル」は、例えばビニルシクロペンチルスルホニル、アリルシクロペンチルスルホニル、ビニルシクロヘキシルスルホニル又はアリルシクロヘキシルスルホニル基を意味する。 50

「(C₂-C₄)-アルキニル-(C₃-C₁₀)-シクロアルキルスルホニル」は、例えばエチニルシクロペンチルスルホニル、プロパルギルシクロペンチルスルホニル、エチニルシクロヘキシルスルホニル又はプロパルギルシクロヘキシルスルホニル基を意味する。

「(C₂-C₄)-アルケニル-(C₄-C₁₀)-シクロアルケニルスルホニル」は、例えばビニルシクロペンテニルスルホニル、アリルシクロペンテニルスルホニル、ビニルシクロヘキセニルスルホニル又はアリルシクロヘキセニルスルホニル基を意味する。

【0084】

「モノ-及びジ-(C₁-C₁₀)-アルキルアミノスルホニルで、後者の基においてはアルキル基が環式化の形式で結合して3-から8-員環を形成してもよく、ここにおいて場合によっては、一炭素単位が酸素、硫黄又はS(O)、S(O)₂若しくはNR³基で置換されていてもよく、そしてR³は(C₁-C₄)-アルキル、(C₁-C₄)-アルカノイル、(C₁-C₄)-アルコキシカルボニル、ジ-(C₁-C₄)-アルキルカルバモイル、又は場合によっては置換されているアリールである。」とは、例えばメチル-、エチル-、プロピル-、イソプロピル-、ブチル-、第三級ブチル又はオクチルアミノスルホニル基、又はジメチル-、メチルエチル-、ジエチル-若しくはジブチルアミノスルホニル基、又はピロリジノ-、ピペリジノ-、モルホリノ-、N-メチルピペラジノ-若しくはアセチルピペラジノアミノスルホニル基を意味する。

10

【0085】

「(C₁-C₁₀)-アルキルアミノ」は、炭化水素基が用語「(C₁-C₁₀)-アルキル」で規定された意味を有するアミノ基である。

20

「(C₃-C₁₀)-アルケニルアミノ」は、炭化水素基が用語「(C₃-C₁₀)-アルケニル」で規定された意味を有するアミノ基である。

「(C₃-C₁₀)-アルキニルアミノ」は、炭化水素基が用語「(C₃-C₁₀)-アルキニル」で規定された意味を有するアミノ基である。

「(C₃-C₁₀)-シクロアルキルアミノ」は、炭化水素基が用語「(C₃-C₁₀)-シクロアルキル」で規定された意味を有するアミノ基である。

「(C₃-C₁₀)-シクロアルケニルアミノ」は、炭化水素基が用語「(C₃-C₁₀)-シクロアルケニル」で規定された意味を有するアミノ基である。

【0086】

「(C₃-C₁₀)-シクロアルキル-(C₁-C₄)-アルキルアミノ」は、例えばシクロプロピルメチルアミノ、シクロプロピルエチルアミノ、シクロペンチルメチルアミノ又はシクロヘキシルメチルアミノ基を意味する。

30

「(C₄-C₁₀)-シクロアルケニル-(C₁-C₄)-アルキルアミノ」は、例えばシクロペンテニルメチルアミノ又はシクロヘキセニルメチルアミノ基を意味する。

「(C₄-C₁₀)-シクロアルキル-(C₃-C₄)-アルケニルアミノ」は、例えばシクロプロピルアリルアミノ、シクロペンチルアリルアミノ又はシクロヘキシルアリルアミノ基を意味する。

「(C₄-C₁₀)-シクロアルケニル-(C₃-C₄)-アルケニルアミノ」は、例えばシクロペンテニルアリルアミノ又はシクロヘキセニルアリルアミノ基を意味する。

「(C₁-C₄)-アルキル-(C₃-C₁₀)-シクロアルキルアミノ」は、例えばメチルシクロペンチルアミノ又はメチルシクロヘキシルアミノ基を意味する。

40

【0087】

「(C₁-C₄)-アルキル-(C₄-C₁₀)-シクロアルケニルアミノ」は、例えばメチルシクロペンテニルアミノ又はメチルシクロヘキセニルアミノ基を意味する。

「(C₂-C₄)-アルケニル-(C₃-C₁₀)-シクロアルキルアミノ」は、例えばビニルシクロペンチルアミノ、アリルシクロペンチルアミノ、ビニルシクロヘキシルアミノ又はアリルシクロヘキシルアミノ基を意味する。

「(C₂-C₄)-アルキニル-(C₃-C₁₀)-シクロアルキルアミノ」は、例えばエチニルシクロペンチルアミノ、プロパルギルシクロペンチルアミノ、エチニルシクロヘキシルアミノ又はプロパルギルシクロヘキシルアミノ基を意味する。

50

「(C₂-C₄)-アルケニル-(C₄-C₁₀)-シクロアルケニルアミノ」は、例えばビニルシクロペンテニルアミノ、アリルシクロペンテニルアミノ、ビニルシクロヘキセニルアミノ又はアリルシクロヘキセニルアミノ基を意味する。

「(C₁-C₁₀)-トリアルキルシリル」は、上記の定義に基づいた同一又は異なる3個のアルキル基を保持しているケイ素原子を意味する。

【0088】

「アリーロキシ」は、酸素原子を経由して結合している上記に定義したアリール基を意味し、例えばフェノキシ又はナフチロキシ基がある。

「アリールチオ」は、硫黄原子を経由して結合している上記に定義したアリール基を意味し、例えばフェニルチオ又は1-若しくは2-ナフチルチオ基がある。

「アリールアミノ」は、窒素原子を経由して結合している上記に定義したアリール基を意味し、例えばアニリノ又は1-若しくは2-ナフチルアミノ基がある。

「N-(C₁-C₄)-アルキルアリールアミノ」は、例えばN-メチル-又はN-エチルアニリノ基を意味する。

【0089】

「アリール-(C₁-C₄)-アルコキシ」は、(C₁-C₄)-アルコキシ基を経由して結合しているアリールを意味し、例えばベンジルオキシ、フェニルエトキシ、フェニルプロトキシ又はナフチルメトキシ基がある。

「アリール-(C₃-C₄)-アルケニルオキシ」は、(C₃-C₄)-アルケニルオキシ基を経由して結合しているアリールを意味し、例えば1-、2-又は3-フェニルアリルオキシ基がある。

「アリール-(C₁-C₄)-アルキルチオ」は、アルキルチオ基を経由して結合しているアリール基を意味し、例えばベンジルチオ、ナフチルメチルチオ、1-又は2-フェニルエチルチオ基がある。

「アリール-(C₃-C₄)-アルケニルチオ」は、(C₃-C₄)-アルケニルチオ基を経由して結合しているアリールを意味し、例えば1-、2-又は3-フェニルアリルチオ基がある。

「アリール-(C₁-C₄)-アルキルアミノ」は、(C₁-C₄)-アルキルアミノ基を経由して結合しているアリールを意味し、例えばベンジルアミノ、ナフチルアミノ、1-若しくは2-フェニルエチルアミノ、又は3-フェニルプロピルアミノ基がある。

「N-(C₁-C₄)-アルキル-N-アリール-(C₁-C₄)-アルキルアミノ」は、例えばN-メチル-N-ベンジルアミノ、N-メチル-N-ナフチルアミノ、N-メチル-N-1-又は-2-フェニルエチルアミノ又はN-メチル-N-3-フェニルプロピルアミノ基を意味する。

【0090】

「アリール-(C₃-C₄)-アルケニルアミノ」は、(C₃-C₄)-アルケニルアミノ基を経由して結合しているアリールを意味し、例えば1-、2-又は3-フェニルアリルアミノ基がある。

「N-(C₁-C₄)-アルキル-N-アリール-(C₃-C₄)-アルケニルアミノ」は、例えばN-メチル-N-1-、-2-又は-3-フェニルアリルアミノ基がある。

「アリールカルバモイル」は、例えばフェニル-又は1-若しくは2-ナフチルカルバモイルを意味する。

「N-アリール-N-(C₁-C₄)-アルキルカルバモイル」は、例えばN-メチル-N-フェニルカルバモイル又はN-メチル-N-1-若しくは-2-ナフチルカルバモイルを意味する。

「アリール-(C₁-C₈)-ジアルキルシリル」は、例えばフェニル-又はナフチルジメチルシリル基を意味する。

「ジアリール-(C₃-C₄)-アルキルシリル」は、例えばジフェニル-、フェニルナフチル-又はジナフチルメチルシリル基を意味する。

「トリアリールシリル」は、例えばトリフェニル-、ジフェニルナフチル-又はトリナフチルシリル基を意味する。

【0091】

殊に、より良い作物植物又は有用植物の保護作用(薬害軽減剤作用)、より良い選択性

10

20

30

40

50

及び/又はより良い製造可能性の理由から、本発明に係る式(I)の化合物又はそれらの塩の使用は特に興味あるものであり、ここにおいて個々の基は既に記載されている又は以下に記載する好ましい意味の一つを有し、殊に既に記載されている又は以下に記載する好ましい意味の一つ若しくはそれより多い組合せを含んでいる。

【0092】

Xは好ましくは酸素である。

好ましくは、

(Y)_nはn個の置換基Yであり、

ここにおいてYはそれぞれ他の基から独立に、ハロゲン、シアノ、ニトロ、(C₁-C₄)-アルキル、(C₂-C₄)-アルケニル、(C₂-C₄)-アルキニル、(C₁-C₄)-アルコキシ、(C₁-C₄)-アルキルチオ、(C₁-C₄)-アルキルスルフィニル、(C₁-C₄)-アルキルスルホニル、(C₁-C₄)-アルコキシカルボニル、(C₁-C₄)-アルキルアミノ又はジ-[(C₁-C₄)-アルキル]アミノ基であり

10

、
ここにおいてすぐ前に記載した10の基のそれぞれは無置換であるか又はハロゲン、(C₁-C₄)-アルコキシ、(C₁-C₄)-ハロアルコキシ及び(C₁-C₄)-アルキルチオ、又は(C₃-C₆)-シクロアルキル、(C₄-C₆)-シクロアルケニル、アリール(好ましくはフェニル)又はヘテロシクリル(好ましくは3から6個の環原子及びN、O及びSの群から選択される1から3個のヘテロ環原子を有するヘテロ環)の群から選択される一つ若しくはそれより多い基で置換され、

ここにおいて、すぐ前に記載した4つの基(又はかっこ中に記載した好ましい基)はそれぞれ無置換であるか又はハロゲン、シアノ、ニトロ、(C₁-C₄)-アルキル、(C₁-C₄)-ハロアルキル、(C₁-C₄)-アルコキシ、(C₁-C₄)-ハロアルコキシ及び(C₁-C₄)-アルキルチオ、そして非芳香族の基の場合は更にオキソ、の群から選択される一つ若しくはそれより多い基で置換され、

20

【0093】

又は

隣接する2個のY基は直接結合している炭素原子と一緒に、炭素環又はヘテロ環である4-から8-員の縮合環であり、N、O及びSを含んでいる基から選択される一つ若しくはそれより多いヘテロ環原子を有し、そして無置換であるか又はハロゲン、シアノ、ニトロ、(C₁-C₄)-アルキル、(C₁-C₄)-ハロアルキル、(C₁-C₄)-アルコキシ、(C₁-C₄)-ハロアルコキシ、(C₁-C₄)-アルキルチオ及びオキソの群から選択される一つ若しくはそれより多い基で置換され、そして

30

nは0、1、2、3又は4、好ましくは0、1、2又は3、殊に0、1又は2、極めて好ましくは0又は1である。

【0094】

(Y)_nは殊にn個の置換基Yであり、

ここにおいてYはそれぞれ他の基から独立に、ハロゲン、シアノ、ニトロ、(C₁-C₄)-アルキル、(C₁-C₄)-ハロアルキル、[(C₁-C₄)-アルコキシ]-(C₁-C₄)-アルキル、(C₂-C₄)-アルケニル、(C₂-C₄)-ハロアルケニル、(C₂-C₄)-アルキニル、(C₂-C₄)-ハロアルキニル、(C₃-C₆)-シクロアルキル、(C₅-C₆)-シクロアルケニル基、場合によっては置換されているアリール(好ましくは無置換であるか又はハロゲン、(C₁-C₄)-アルキル、(C₁-C₄)-ハロアルキル、(C₁-C₄)-アルコキシの群から選択される一つ若しくはそれより多い基で置換されているフェニル)、場合によっては置換されているヘテロシクリル(好ましくは、1から3個の環原子及びN、O及びSを含んでいる基から選択される1から3個のヘテロ環原子を有し、無置換であるか又はハロゲン、(C₁-C₄)-アルキル、(C₁-C₄)-ハロアルキル、(C₁-C₄)-アルコキシ及びオキソの群から選択される一つ若しくはそれより多い基で置換されている複素環)、又は(C₁-C₄)-アルコキシ、(C₁-C₄)-ハロアルコキシ、(C₁-C₄)-アルキルチオ、(C₁-C₄)-ハロアルキルチオ、(C₁-C₄)-アルキルスルフィニル、(C₁-C₄)-ハロアルキルスルフィニル、(C₁-C₄)-アルキルスルホニル、(C₁-C₄)-ハロアルキルスルホニル、(C₁-C₄)-アルコキシカルボニル、(C₁-C₄)-ハロアルコキシカルボニル、(C₁-C₄)-アルキルアミノ

40

50

若しくはジ-[(C₁-C₄)-アルキル]アミノであり、

【0095】

又は

隣接する2個のY基は直接結合している炭素原子と一緒に、炭素環又はヘテロ環の4 - から8 - 員の縮合環であり、N、O及びSを含んでいる群から選択される一つ若しくはそれより多いヘテロ環原子を有し、ここにおいて後者の場合には1又は2個のヘテロ原子が芳香族環に結合し、そして無置換であるか又はハロゲン、(C₁-C₄)-アルキル及びオキシの群から選択される一つ若しくはそれより多い基で置換されている。

【0096】

更に好ましくは、(Y)_nはn個の置換基Yであり、

ここにおいてYはそれぞれ他の基から独立に、ハロゲン、シアノ、ニトロ、(C₁-C₄)-アルキル、(C₁-C₄)-ハロアルキル、好ましくは(C₁-C₄)-フルオロアルキル、(C₁-C₄)-アルコキシ-(C₁-C₄)-アルキル、(C₁-C₄)-アルコキシ、(C₁-C₄)-ハロアルコキシ、(C₁-C₄)-アルキルチオ、(C₁-C₄)-ハロアルキルチオ、(C₁-C₄)-アルキルスルフィニル、(C₁-C₄)-ハロアルキルスルフィニル、(好ましくは(C₁-C₄)-フルオロアルキルスルフィニル)、(C₁-C₄)-アルキルスルホニル、(C₁-C₄)-ハロアルキルスルホニル(好ましくは(C₁-C₄)-フルオロアルキルスルホニル)、(C₁-C₄)-アルキルアミノ又はジ-[(C₁-C₄)-アルキル]アミノ基であり、

又は

隣接する2個のY基は直接結合している炭素原子と一緒に、炭素環又はヘテロ環である4 - から8 - 員の縮合環であり、N、O及びSを含んでいる群から選択される1又は2個のヘテロ環原子を有し、ここにおいて後者の場合には、1又は2個のヘテロ原子が芳香族環に結合し、そして無置換であるか又はハロゲン及び(C₁-C₄)-アルキルの群から選択される一つ若しくはそれより多い基で置換されている。

【0097】

更に好ましくは、(Y)_nはn個の置換基Yであり、

ここにおいてYはそれぞれ他の基から独立に、ハロゲン、(C₁-C₄)-アルキル、(C₁-C₄)-ハロアルキル(好ましくは(C₁-C₄)-フルオロアルキル)、(C₁-C₄)-アルコキシ、(C₁-C₄)-ハロアルコキシ(好ましくは(C₁-C₄)-フルオロアルコキシ)又は(C₁-C₄)-ハロアルキルチオ(好ましくは(C₁-C₄)-フルオロアルキルチオ)基であり、

又は

隣接する2個の基Yは一緒に、二価の基2,2-ジフルオロメチレンジオキシ(-O-CF₂-O-; 2,2-ジフルオロ-1,3-ジオキサプロパン-1,3-ジイル)である。

【0098】

極めて好ましくは、基Yは、互いに独立に、ハロゲン、シアノ、(C₁-C₄)-アルキル、トリフルオロメチル、メトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、メチルチオ、トリフルオロメチルチオ又は2,2-ジフルオロメチレンジオキシ、殊にフッ素、塩素、メチル、トリフルオロメチル又はメトキシである。

【0099】

本発明に係る好ましいものは更に、式(I)において、

R¹は水素、水酸基、アミノ、(C₁-C₄)-アルキルアミノ、ジ-[(C₁-C₄)-アルキル]アミノ、(C₁-C₆)-アルキル、(C₃-C₆)-アルケニル、(C₃-C₆)-アルキニル又は(C₁-C₆)-アルコキシであり、

ここにおいてすぐ前に記載した4つの基のそれぞれは無置換であるか又は一つ若しくはそれより多い同一又は異なる基R^aで置換されていて、そして置換基を含んで、1から30個の炭素原子、好ましくは1から24個の炭素原子を有し、又は(C₃-C₆)-シクロアルキル、(C₄-C₆)-シクロアルケニル、アリール又はヘテロシクリルであり、

ここにおいてすぐ前に記載した4つの基のそれぞれは無置換であるか又は一つ若しくはそれより多い同一又は異なる基R^bで置換されていて、そして置換基を含んで、3から3

10

20

30

40

50

0 個の炭素原子、好ましくは 3 から 2 4 個の炭素原子を有し、そして

【 0 1 0 0 】

R^2 は水素、 (C_1-C_{10}) -アルキル、 (C_3-C_{10}) -アルケニル又は (C_3-C_{10}) -アルキニルであり

、
 ここにおいてすぐ前に記載した 3 つの基のそれぞれは無置換であるか又は一つ若しくはそれより多い同一又は異なる基 R^c で置換されていて、そして置換基を含んで、1 から 3 0 個の炭素原子、好ましくは 1 から 2 4 個の炭素原子を有し、又は (C_3-C_6) -シクロアルキル、 (C_4-C_6) -シクロアルケニル、アリール又はヘテロシクリルであり、

ここにおいてすぐ前に記載した 4 つの基のそれぞれは無置換であるか又は一つ若しくはそれより多い同一又は異なる基 R^d で置換されていて、そして置換基を含んで、3 から 3 0 個の炭素原子、好ましくは 3 から 2 4 個の炭素原子を有し、

【 0 1 0 1 】

ここにおいて基 R^1 及び R^2 中、

R^a は、それぞれの場合において他の基 R^a から独立に、無機又は有機の基であり、好ましくはハロゲン、シアノ、ニトロ並びに式 $-Z^a-R^{a*}$ 及び $R^{c^{y^c-a}}$ の群から選択される基であり

、
 R^b は、それぞれの場合において他の基 R^b から独立に、無機又は有機の基であり、好ましくはハロゲン、シアノ、ニトロ並びに式 $-Z^b-R^{b*}$ 及び $R^{b^{c^{y^c-b}}}$ の群から選択される基であり、

R^c は、それぞれの場合において他の基 R^c から独立に、無機又は有機の基であり、好ましくはハロゲン、シアノ、ニトロ並びに式 $-Z^c-R^{c*}$ 及び $R^{c^{y^c-c}}$ の群から選択される基であり

、
 R^d は、それぞれの場合において他の基 R^d から独立に、無機又は有機の基であり、好ましくはハロゲン、シアノ、ニトロ並びに式 $-Z^d-R^{d*}$ 及び $R^{d^{c^{y^c-d}}}$ の群から選択される基であり、

【 0 1 0 2 】

ここにおいて基 R^a 、 R^b 、 R^c 及び R^d 中、

Z^a 、 Z^b 、 Z^c 及び Z^d は、それぞれの場合に互いに独立に、式 $-O-$ 、 $-S(O)_p-$ 、 $-S(O)_p-O-$ 、 $-O-S(O)_p-$ 、 $-NR^0-S(O)_p-$ 、 $-S(O)_p-NR^0-$ 、 $-CO-$ 、 $-O-CO-$ 、 $-CO-O-$ 、 $-S-CO-$ 、 $-CO-S-$ 、 $-S-CS-$ 、 $-CS-S-$ 、 $-O-CO-O-$ 、 $-NR^0-$ 、 $-O-NR^0-$ 、 $-NR^0-O-$ 、 $-NR^0-CO-$ 、 $-CO-NR^0-$ 、 $-O-CO-NR^0-$ 又は $-NR^0-CO-O-$ 、 $-NR^0-CO-NR^0-$ 、 $-NR^0-CO-NR^0-$ 又は $-SiR'R''-$ 、その他 $-O-N=CR^0-$ 又は $-CR^0=N-O-$ の二価の置換基であり、ここにおいて p はそれぞれ整数 0、1 又は 2 であり、そして基 R^0 は互いに独立に水素、 (C_1-C_6) -アルキル、 (C_2-C_6) -アルケニル、 (C_2-C_6) -アルキニル、フェニル、フェニル- (C_1-C_6) -アルキル、 (C_3-C_6) -シクロアルキル又は 1 から 1 0 個の炭素原子を有するアシル(好ましくは $[(C_1-C_6)$ -アルキル]カルボニル、 $[(C_1-C_6)$ -アルコキシ]カルボニル及び $[(C_1-C_6)$ -アルキル]スルホニル)であり、そして R' 及び R'' は互いに独立に、 (C_1-C_6) -アルキル、 (C_2-C_6) -アルケニル、 (C_2-C_6) -アルキニル、フェニル、フェニル- (C_1-C_6) -アルキル又は (C_3-C_6) -シクロアルキルであり、そして

【 0 1 0 3 】

$R^{c^{y^c-a}}$ 及び $R^{c^{y^c-c}}$ は全体として 3 から 2 4 個の炭素原子、好ましくは 1 から 1 8 個の炭素原子を有する場合によっては置換された環式炭化水素基であり、又は全体として 1 から 2 4 個の炭素原子、好ましくは 1 から 1 8 個の炭素原子を有する場合によっては置換された複素環基であり、そして

R^{a*} 、 R^{b*} 、 R^{c*} 、 R^{d*} 、 $R^{b^{c^{y^c-b}}}$ 及び $R^{c^{c^{y^c-c}}}$ は互いに独立に、全体として 1 から 2 4 個の炭素原子、好ましくは 1 から 1 8 個の炭素原子を有する場合によっては置換された環式炭化水素基であり、又は全体として 1 から 2 4 個の炭素原子、好ましくは 1 から 1 8 個の炭素原子を有する場合によっては置換されたヘテロ環基であり、又は

R^{a*} 、 R^{b*} 、 R^{c*} 、 R^{d*} は互いに独立に、水素(好ましくは化学的に安定な場合は置換基を含む。)である、化合物 (I) の使用である。

【 0 1 0 4 】

本発明に係る使用で更に好ましいものとしては、化合物 (I) において、

10

20

30

40

50

基 R^a 、 R^b 、 R^c 及び R^d 中、

Z^a 、 Z^b 、 Z^c 及び Z^d は、互いに独立に、式 $-O-$ 、 $-S(O)_p-$ 、 $-S(O)_p-O-$ 、 $-O-S(O)_p-$ 、 $-NR^0-S(O)_p-$ 、 $-S(O)_pNR^0-$ 、 $-CO-$ 、 $-O-CO-$ 、 $-CO-O-$ 、 $-S-CO-$ 、 $-CO-S-$ 、 $-S-CS-$ 、 $-CS-S-$ 、 $-O-CO-O-$ 、 $-NR^0-$ 、 $-O-NR^0-$ 、 $-NR^0-O-$ 、 $-NR^0-CO-$ 、 $-CO-NR^0-$ 、 $-O-CO-NR^0-$ 又は $-NR^0-CO-O-$ 、 $-NR^0-CO-NR^0-$ 、 $-NR^0-CO-NR^0-$ 又は $-SiR'R''-$ その他 $-O-N=CR^0-$ の二価の置換基であり、ここにおいて p はそれぞれ整数0、1又は2であり、そして基 R^0 は互いに独立に水素、 (C_1-C_6) -アルキル、 (C_2-C_6) -アルケニル、 (C_2-C_6) -アルキニル、フェニル、フェニル- (C_1-C_6) -アルキル、 (C_3-C_6) -シクロアルキル又は1から10個の炭素原子を有するアシル(好ましくは、 $[(C_1-C_6)$ -アルカノイル、 $[(C_1-C_6)$ -アルコキシ]カルボニル及び (C_1-C_6) -アルキルスルホニル)、(好ましくは $[(C_1-C_6)$ -アルキル]カルボニル、 $[(C_1-C_6)$ -アルコキシ]カルボニル及び $[(C_1-C_6)$ -アルキル]スルホニル)であり、そして R' 及び R'' は互いに独立に、 (C_1-C_6) -アルキル、 (C_2-C_6) -アルケニル、 (C_2-C_6) -アルキニル、フェニル、フェニル- (C_1-C_6) -アルキル又は (C_3-C_6) -シクロアルキルであり、好ましくは、式 $-O-$ 、 $-S(O)_p-$ 、 $-S(O)_p-O-$ 、 $-O-S(O)_p-$ 、 $-NR^0-S(O)_p-$ 、 $-S(O)_pNR^0-$ 、 $-CO-$ 、 $-O-CO-$ 、 $-CO-O-$ 、 $-NR^0-$ 、 $-NR^0-CO-$ 、 $-CO-NR^0-$ 、 $-O-CO-NR^0-$ 又は $-NR^0-CO-O-$ 、 $-NR^0-CO-NR^0-$ 、 $-NR^0-CO-NR^0-$ 又は $-SiR'R''-$ の二価の置換基であり、ここにおいて p はそれぞれ整数0、1又は2であり、そして基 R^0 は互いに独立に水素、 (C_1-C_4) -アルキル、フェニル、フェニル- (C_1-C_4) -アルキル、 (C_3-C_6) -シクロアルキル、 (C_1-C_4) -アルカノイル、 $[(C_1-C_4)$ -アルコキシ]カルボニル又は (C_1-C_4) -アルキルスルホニルであり、殊にそれぞれ水素又は (C_1-C_4) -アルキルであり、そして R' 及び R'' は互いに独立に、 (C_1-C_4) -アルキル、フェニル、フェニル- (C_1-C_4) -アルキル又は (C_3-C_6) -シクロアルキルであり、

【0105】

$R^{c^{y^c-a}}$ 及び $R^{c^{y^c-c}}$ は全体として3から24個の炭素原子、好ましくは1から18個の炭素原子を有する場合によっては置換された環式炭化水素基であり、又は全体として1から24個の炭素原子、好ましくは1から18個の炭素原子を有する場合によっては置換されたヘテロ環基であり、そして

R^{a^*} 、 R^{b^*} 、 R^{c^*} 、 R^{d^*} 、 $R^{b^{**}}$ 及び $R^{c^{**}}$ は互いに独立に、全体として1から24個の炭素原子、好ましくは1から18個の炭素原子を有する場合によっては置換された環式炭化水素基であり、又は全体として1から24個の炭素原子、好ましくは1から18個の炭素原子を有する場合によっては置換されたヘテロ環基であり、又は

R^{a^*} 、 R^{b^*} 、 R^{c^*} 、 R^{d^*} は互いに独立に水素であり、

【0106】

好ましくは、

$R^{c^{y^c-a}}$ 及び $R^{c^{y^c-c}}$ は、それぞれ互いに独立に、 (C_3-C_6) -シクロアルキル、 (C_4-C_6) -シクロアルケニル、アリアル又はヘテロシクリルであり、ここにおいてすぐ前に記載した4つの基のそれぞれは無置換であるか又はハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシル、チオ、 (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) -アルキル、 (C_3-C_6) -シクロアルキル、 (C_1-C_4) -アルコキシ、 (C_1-C_4) -ハロアルコキシ、 (C_1-C_4) -アルキルチオ、 (C_1-C_4) -ハロアルキルチオ、 (C_1-C_4) -アルキルスルフィニル、 (C_1-C_4) -ハロ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) -ハロアルキルスルホニル、 (C_1-C_4) -アルキルアミノ、ジ- $[(C_1-C_4)$ -アルキル]アミノ、トリメチルシリル、 (C_1-C_4) -アルカノイル、 $[(C_1-C_4)$ -アルコキシ]カルボニル、ジ- $[(C_1-C_4)$ -アルキル]カルバモイル、そしてヘテロシクリルの場合は更にオキソ、の群から選択される一つ若しくはそれより多い基で置換され、そして

【0107】

R^{a^*} 、 R^{b^*} 、 R^{c^*} 、 R^{d^*} 、 $R^{b^{**}}$ 及び $R^{c^{**}}$ は、それぞれ互いに独立に、 (C_1-C_{10}) -アルキル、 (C_3-C_{10}) -アルケニル、 (C_3-C_{10}) -アルキニル、 (C_3-C_6) -シクロアルキル、 (C_4-C_6) -シクロアルケニル、アリアル又はヘテロシクリルであり、ここにおいてすぐ前に記載した7つの基のそれぞれは無置換であるか又はハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシル、チオ、 (C_3-C_6) -シクロアルキル、 (C_1-C_4) -アルコキシ、 (C_1-C_4) -

ハロアルコキシ、(C₁-C₄)-アルキルチオ、(C₁-C₄)-ハロアルキルチオ、(C₁-C₄)-アルキル
 スルフィニル、(C₁-C₄)-ハロアルキルスルフィニル、(C₁-C₄)-アルキルスルホニル、(C₁-
 C₄)-ハロアルキルスルホニル、(C₁-C₄)-アルキルアミノ、ジ-[(C₁-C₄)-アルキル]アミノ
 、トリメチルシリル、(C₁-C₄)-アルカノイル、[(C₁-C₄)-アルコキシ]カルボニル、ジ-[(C₁-
 C₄)-アルキル]カルバモイルアミノ、そして環式基の場合は更に(C₁-C₄)-アルキル、(C₁-
 C₄)-ハロアルキル、(C₁-C₄)-アルコキシ-(C₁-C₄)-アルキル、そしてヘテロシクリルの場合
 は更にオキソ、の群から選択される一つ若しくはそれより多い基で置換されていて、又は

R^{a*}、R^{b*}、R^{c*}、R^{d*}は、それぞれ互いに独立に水素である、化合物(I)の使用である。

【0108】

10

本発明に係る更に好ましいものとしては、化合物(I)において、

R¹は水素、(C₁-C₆)-アルキル、(C₃-C₆)-アルケニル又は(C₃-C₆)-アルキニルであり、

ここにおいてすぐ前に記載した3つの基のそれぞれは無置換であるか又は一つ若しくは
 それより多い同一又は異なる基 R^a で置換されていて、そして置換基を含んで、1から2
 4個の炭素原子、好ましくは1から18個の炭素原子を有し、又は
 (C₃-C₆)-シクロアルキル又は飽和したヘテロシクリルであり、

ここにおいてすぐ前に記載した2つの基のそれぞれは無置換であるか又は一つ若しくは
 それより多い同一又は異なる基 R^b で置換されていて、そして置換基を含んで、3から2
 4個の炭素原子、好ましくは3から18個の炭素原子を有し、

【0109】

20

ここにおいて、

R^aは無機又は有機の基であり、好ましくはハロゲン、シアノ、ニトロ並びに式-Z^a-R^{a*}
 及び R^{c^yc^{-a}} の群から選択される基であり、

R^bは無機又は有機の基であり、好ましくはハロゲン、シアノ、ニトロ並びに式-Z^b-R^{b*}
 及び R^{b**}の群から選択される置換基であり、

ここにおいて基R^a及びR^b中、

Z^a、Z^b、R^{c^yc^{-a}}、R^{a*}、R^{b*}及びR^{b**}は上記に又は更に下記に定義した通りであり、好
 ましくは

Z^a、Z^bは互いに独立に、-O-、-S(O)_p-、-S(O)_p-O-、-O-S(O)_p-、-NR⁰-S(O)_p-、-S(O)_pN
 R⁰-、-CO-、-O-CO-、-CO-O-、-NR⁰-、-NR⁰-CO-、-CO-NR⁰-、-O-CO-NR⁰-又は-NR⁰-CO-O-、
 -NR⁰-CO-NR⁰-、-NR⁰-CO-NR⁰- 又は -SiR'R''- であり、ここにおいて、pはそれぞれ整数
 0、1又は2そして置換基 R⁰ は互いに独立にそれぞれ水素、(C₁-C₄)-アルキル、フェニ
 ル、フェニル-(C₁-C₄)-アルキル、(C₃-C₆)-シクロアルキル、(C₁-C₄)-アルカノイル、[(C₁-
 C₄)-アルコキシ]カルボニル、又は(C₁-C₄)-アルキルスルホニル、殊にそれぞれ水素、
 又は(C₁-C₄)-アルキルであり、そして R'及びR''は互いに独立に、(C₁-C₄)-アルキル、フ
 エニル、フェニル-(C₁-C₄)-アルキル又は(C₃-C₆)-シクロアルキル、殊に(C₁-C₄)-アルキ
 ルであり、

30

【0110】

R^{c^yc^{-a}}は、(C₃-C₆)-シクロアルキル、(C₄-C₆)-シクロアルケニル、フェニル、飽和した
 ヘテロシクリル、不飽和の非芳香族ヘテロシクリル又はヘテロアリールであり、ここにお
 いてすぐ前に記載した6つの基のそれぞれは無置換であるか又はハロゲン、シアノ、ニト
 ロ、アミノ、ヒドロキシル、チオ、(C₁-C₄)-アルキル、(C₁-C₄)-ハロアルキル、(C₁-C₄)-
 アルコキシ-(C₁-C₄)-アルキル、(C₃-C₆)-シクロアルキル、(C₁-C₄)-アルコキシ、(C₁-C₄-
)-ハロアルコキシ、(C₁-C₄)-アルキルチオ、(C₁-C₄)-ハロアルキルチオ、(C₁-C₄)-アルキ
 ルスルフィニル、(C₁-C₄)-ハロアルキルスルフィニル、(C₁-C₄)-アルキルスルホニル、(C₁-
 C₄)-ハロアルキルスルホニル、(C₁-C₄)-アルキルアミノ、ジ-[(C₁-C₄)-アルキル]アミ
 ノ、トリメチルシリル、(C₁-C₄)-アルカノイル、[(C₁-C₄)-アルコキシ]カルボニル、ジ-
 [(C₁-C₄)-アルキル]カルバモイル、そして飽和の又は不飽和の非芳香族ヘテロシクリルの場合
 は更にオキソ、の群から選択される一つ若しくはそれより多い基で置換されていて、
 そして

40

50

【0111】

殊に

R^{cyc-a} は (C_3-C_6) -シクロアルキル、フェニル、3から6個の環原子を有する飽和したヘテロシクリル、又は5又は6個の環原子を有するヘテロアリールであり、ここにおいてすぐ前に記載した4つの基のそれぞれは無置換であるか又はハロゲン、シアノ、ニトロ、 (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) -アルキル、 (C_1-C_4) -アルコキシ、 (C_1-C_4) -ハロアルコキシ、 (C_1-C_4) -アルキルチオ、そして飽和したヘテロシクリルの場合は更にオキソ、の群から選択される一つ若しくはそれより多い基で置換されていて、そして

【0112】

R^{a*} 、 R^{b*} 及び $R^{b^{**}}$ はそれぞれ互いに独立に、

(C_1-C_{10}) -アルキル、 (C_3-C_{10}) -アルケニル、 (C_3-C_{10}) -アルキニル、 (C_3-C_6) -シクロアルキル、 (C_4-C_6) -シクロアルケニル、アリール又はヘテロシクリルであり、ここにおいてすぐ前に記載した7つの基のそれぞれは無置換であるか又はハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシル、チオ、 (C_3-C_6) -シクロアルキル、 (C_1-C_4) -アルコキシ、 (C_1-C_4) -ハロアルコキシ、 (C_1-C_4) -アルキルチオ、 (C_1-C_4) -ハロアルキルチオ、 (C_1-C_4) -アルキルスルフィニル、 (C_1-C_4) -ハロ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) -ハロアルキルスルホニル、 (C_1-C_4) -アルキルアミノ、ジ- $[(C_1-C_4)$ -アルキル]アミノ、トリメチルシリル、 (C_1-C_4) -アルカノイル、 $[(C_1-C_4)$ -アルコキシ]カルボニル、ジ- $[(C_1-C_4)$ -アルキル]カルバモイルアミノ、そして環式基の場合は更に (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) -アルキル、そしてヘテロシクリルの場合は更にオキソ、の群から選択される一つ若しくはそれより多い基で置換されていて、又は

R^{a*} 及び R^{b*} はそれぞれ互いに独立に水素であり、

【0113】

殊に

R^{a*} 、 R^{b*} 及び $R^{b^{**}}$ はそれぞれ互いに独立に、

(C_1-C_6) -アルキル、 (C_3-C_6) -シクロアルキル、フェニル、飽和したヘテロシクリル又はヘテロアリールであり、ここにおいてすぐ前に記載した5つの基のそれぞれは無置換であるか又はハロゲン、シアノ、ニトロ、 (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) -アルキル、 (C_1-C_4) -アルコキシ、 (C_1-C_4) -ハロアルコキシ、 (C_1-C_4) -アルキルチオ、そして飽和したヘテロシクリルの場合は更にオキソ、の群から選択される一つ若しくはそれより多い基で置換されていて、又は

R^{a*} 及び R^{b*} はそれぞれ互いに独立に水素である、化合物(I)の使用である。

【0114】

更に、本発明に係る好ましいものとしては、化合物(I)において、

R^2 は (C_1-C_{10}) -アルキル、 (C_3-C_{10}) -アルケニル又は (C_3-C_{10}) -アルキニル、殊に (C_1-C_6) -アルキル、 (C_3-C_6) -アルケニル又は (C_3-C_6) -アルキニルであり、

ここにおいてすぐ前に記載した6つの基のそれぞれは無置換であるか又は一つ若しくはそれより多い同一又は異なる基 R^c で置換されていて、そして置換基を含んで、1から24個の炭素原子、好ましくは1から18個の炭素原子を有し、

又は

(C_3-C_6) -シクロアルキル、アリール、又はヘテロシクリルであり、殊にフェニル、又はヘテロアリールであり、

ここにおいてすぐ前に記載した5つの基のそれぞれは無置換であるか又は一つ若しくはそれより多い同一又は異なる基 R^d で置換されていて、そして置換基を含んで、3から24個の炭素原子、好ましくは3から18個の炭素原子を有し、

【0115】

ここにおいて、

R^c は無機又は有機の基であり、好ましくはハロゲン、シアノ、ニトロ並びに式 $-Z^c-R^c$

10

20

30

40

50

及び R^{y^c-c} の群から選択される置換基であり、

R^d は無機又は有機の基であり、好ましくはハロゲン、シアノ、ニトロ並びに式 $-Z^d-R^{d*}$ 及び R^{d**} の群から選択される基であり、

ここにおいて基 R^c 及び R^d 中、基又は置換基

Z^c 、 Z^d 、 R^{y^c-c} 、 R^{c*} 、 R^{d*} 及び R^{d**} は、上記に又は更に下記に定義した通りであり、好ましくは

Z^c 及び Z^d はそれぞれ互いに独立に、 $-O-$ 、 $-S(O)_p-$ 、 $-S(O)_p-O-$ 、 $-O-S(O)_p-$ 、 $-NR^0-S(O)_p-$ 、 $-S(O)_pNR^0-$ 、 $-CO-$ 、 $-O-CO-$ 、 $-CO-O-$ 、 $-NR^0-$ 、 $-NR^0-CO-$ 、 $-CO-NR^0-$ 、 $-O-CO-NR^0-$ 又は $-NR^0-CO-O-$ 、 $-NR^0-CO-NR^0-$ 、 $-NR^0-CO-NR^0-$ 又は $-SiR'R''-$ であり、ここにおいて p はそれぞれ整数 0、1又は2であり、そして基 R^0 は互いに独立に水素、 (C_1-C_4) -アルキル、フェニル、フェニル- (C_1-C_4) -アルキル、 (C_3-C_6) -シクロアルキル、 (C_1-C_4) -アルカノイル、 $[(C_1-C_4)$ -アルコキシ]カルボニル又は (C_1-C_4) -アルキルスルホニルであり、殊にそれぞれ水素又は (C_1-C_4) -アルキルであり、そして R' 及び R'' は互いに独立に、 (C_1-C_4) -アルキル、フェニル、フェニル- (C_1-C_4) -アルキル又は (C_3-C_6) -シクロアルキルであり、殊に (C_1-C_4) -アルキルであり、

【0116】

R^{y^c-c} は、 (C_3-C_6) -シクロアルキル、 (C_4-C_6) -シクロアルケニル、フェニル、飽和したヘテロシクリル、不飽和の非芳香族ヘテロシクリル又はヘテロアリールであり、ここにおいてすぐ前に記載した6つの基のそれぞれは無置換であるか又はハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシル、チオ、 (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) -アルキル、 (C_3-C_6) -シクロアルキル、 (C_1-C_4) -アルコキシ、 (C_1-C_4) -ハロアルコキシ、 (C_1-C_4) -アルキルチオ、 (C_1-C_4) -ハロアルキルチオ、 (C_1-C_4) -アルキルスルフィニル、 (C_1-C_4) -ハロ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) -ハロアルキルスルホニル、 (C_1-C_4) -アルキルアミノ、トリメチルシリル、 (C_1-C_4) -アルカノイル、 $[(C_1-C_4)$ -アルコキシ]カルボニル、ジ- $[(C_1-C_4)$ -アルキル]カルバモイル、そして飽和の又は不飽和の非芳香族ヘテロシクリルの場合は更にオキソ、の群から選択される一つ若しくはそれより多い基で置換されていて、そして

【0117】

殊に

R^{y^c-c} は、 (C_3-C_6) -シクロアルキル、フェニル、3から6個の環原子を有する飽和したヘテロシクリル、又は5から6個の環原子を有するヘテロアリールであり、ここにおいてすぐ前に記載した4つの基のそれぞれは無置換であるか又はハロゲン、 (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、 (C_1-C_4) -アルキルチオ、そして飽和したヘテロシクリルの場合は更にオキソ、の群から選択される一つ若しくはそれより多い基で置換されていて、そして

R^{c*} 、 R^{d*} 及び R^{d**} はそれぞれ互いに独立に、

(C_1-C_{10}) -アルキル、 (C_3-C_{10}) -アルケニル、 (C_3-C_{10}) -アルキニル、 (C_3-C_6) -シクロアルキル、 (C_4-C_6) -シクロアルケニル、アリール又はヘテロシクリルであり、ここにおいてすぐ前に記載した7つの基のそれぞれは無置換であるか又はハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシル、チオ、 (C_3-C_6) -シクロアルキル、 (C_1-C_4) -アルコキシ、 (C_1-C_4) -ハロアルコキシ、 (C_1-C_4) -アルキルチオ、 (C_1-C_4) -ハロアルキルチオ、 (C_1-C_4) -アルキルスルフィニル、 (C_1-C_4) -ハロ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) -ハロアルキルスルホニル、 (C_1-C_4) -アルキルアミノ、ジ- $[(C_1-C_4)$ -アルキル]アミノ、トリメチルシリル、 (C_1-C_4) -アルカノイル、 $[(C_1-C_4)$ -アルコキシ]カルボニル、ジ- $[(C_1-C_4)$ -アルキル]カルバモイルアミノ、そして環式基の場合は更に (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) -アルキル、そしてヘテロシクリルの場合は更にオキソ、の群から選択される一つ若しくはそれより多い基で置換されていて、又は

R^{c*} 及び R^{d*} はそれぞれ互いに独立に水素であり、

【0118】

殊に

R^{c^*} 、 R^{d^*} 及び $R^{d^{**}}$ はそれぞれ互いに独立に、

(C_1 - C_6)-アルキル、(C_3 - C_6)-シクロアルキル、フェニル、飽和したヘテロシクリル又はヘテロアリールであり、ここにおいてすぐ前に記載した5つの基のそれぞれは無置換であるか又はハロゲン、(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、(C_1 - C_4)-アルキルチオ、そして飽和したヘテロシクリルの場合は更にオキシ、の群から選択される一つ若しくはそれより多い基で置換されている、又は

R^{c^*} 及び R^{d^*} はそれぞれ互いに独立に水素である、化合物(I)の使用である。

【0119】

ここで、本発明に係る好ましいものとしては、化合物(I)において、

10

R^1 は場合によっては置換されている上記に記載した(C_1 - C_4)-アルキル、(C_2 - C_4)-アルケニル又は(C_2 - C_4)-アルキニル基の一つであり、そして R^2 は場合によっては置換されている上記に記載したフェニル及びヘテロアリール基の一つである、化合物(I)の使用である。

【0120】

基 R^1 及び/又は R^2 の下で記載されているアルキル、アルケニル、アルキニル及びアルコキシ基を含んでいる置換基 R^a 及び R^c の更なる例としては、場合によっては、一置換又は多置換(多置換の場合は、置換基は同一でも又は異なるものであってもよい。)であるが、以下のものが挙げられる：

ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、チオ、アミノ

20

又は

(C_1 - C_{10})-アルカノイル、(C_3 - C_{10})-アルケノイル、(C_3 - C_{10})-アルキニル、(C_4 - C_{10})-シクロアルカノイル

【0121】

又は

(C_1 - C_{10})-アルコキシ、(C_1 - C_{10})-ハロアルコキシ、(C_1 - C_4)-アルコキシ-(C_1 - C_4)-アルコキシ、(C_3 - C_{10})-アルケニルオキシ、(C_3 - C_{10})-アルキニルオキシ、(C_3 - C_{10})-シクロアルコキシ、(C_4 - C_{10})-シクロアルケニルオキシ、(C_3 - C_{10})-シクロアルキル-(C_1 - C_4)-アルコキシ、(C_4 - C_{10})-シクロアルケニル-(C_1 - C_4)-アルコキシ、(C_3 - C_{10})-シクロアルキル-(C_3 - C_4)-アルケニルオキシ、(C_4 - C_{10})-シクロアルケニル-(C_3 - C_4)-アルケニルオキシ、(C_1 - C_4)-アルキル-(C_3 - C_{10})-シクロアルコキシ、(C_2 - C_4)-アルケニル-(C_3 - C_{10})-シクロアルコキシ、(C_2 - C_4)-アルキニル-(C_3 - C_{10})-シクロアルコキシ、(C_1 - C_4)-アルキル-(C_4 - C_{10})-シクロアルケニルオキシ、(C_2 - C_4)-アルケニル-(C_4 - C_{10})-シクロアルケニルオキシ、(C_1 - C_4)-アルコキシ-(C_3 - C_4)-アルケニルオキシ

30

【0122】

又は

カルバモイル、モノ-若しくはジ-[(C_1 - C_4)-アルキル]カルバモイル、モノ-若しくはジ-[(C_3 - C_{10})-シクロアルキル]カルバモイル、N-(C_1 - C_4)-アルコキシ-N-(C_1 - C_4)-アルキルカルバモイル

40

又は

カルボキシル、(C_1 - C_{10})-アルコキシカルボニル、(C_3 - C_{10})-シクロアルコキシカルボニル、(C_1 - C_{10})-アルカノイルオキシ、(C_4 - C_{10})-シクロアルカノイルオキシ、(C_1 - C_{10})-アルコキシカルボニルオキシ、[(C_1 - C_{10})-アルキル]アミノカルボニルオキシ、ジ-[(C_1 - C_{10})-アルキル]アミノカルボニルオキシ、

【0123】

又は

(C_1 - C_{10})-アルキルスルホニルアミノ、(C_1 - C_{10})-アルカノイルアミノ、(C_3 - C_{10})-アルケノイルアミノ、(C_4 - C_{10})-シクロアルカノイルアミノ、(C_3 - C_{10})-シクロアルキル-(C_1 - C_4)-アルカノイルアミノ、モノ-若しくはジ-[(C_1 - C_{10})-アルキル]アミノカルボニルアミノ、

50

又は

[(C₁-C₁₀)-アルコキシ]アルカノイルアミノ

又は

上記に記載した 8 基の N-(C₁-C₄)-アルキル類似体

【 0 1 2 4 】

又は

(C₁-C₁₀)-アルキルチオ、(C₁-C₁₀)-ハロアルキルチオ、(C₃-C₁₀)-アルケニルチオ、(C₃-C₁₀)-アルキニルチオ、(C₃-C₁₀)-シクロアルキルチオ、(C₄-C₁₀)-シクロアルケニルチオ、(C₃-C₁₀)-シクロアルキル-(C₁-C₄)-アルキルチオ、(C₄-C₁₀)-シクロアルケニル-(C₁-C₄)-アルキルチオ、(C₃-C₁₀)-シクロアルキル-(C₃-C₄)-アルケニルチオ、(C₄-C₁₀)-シクロアルケニル-(C₃-C₄)-アルケニルチオ、(C₁-C₄)-アルキル-(C₃-C₁₀)-シクロアルキルチオ、(C₂-C₄)-アルケニル-(C₃-C₁₀)-シクロアルキルチオ、(C₂-C₄)-アルキニル-(C₃-C₁₀)-シクロアルキルチオ、(C₁-C₄)-アルキル-(C₄-C₁₀)-シクロアルケニルチオ、(C₂-C₄)-アルケニル-(C₄-C₁₀)-シクロアルケニルチオ

10

【 0 1 2 5 】

又は

(C₁-C₁₀)-アルキルスルフィニル、(C₁-C₁₀)-ハロアルキルスルフィニル、(C₃-C₁₀)-アルケニルスルフィニル、(C₃-C₁₀)-アルキニルスルフィニル、(C₃-C₁₀)-シクロアルキルスルフィニル、(C₄-C₁₀)-シクロアルケニルスルフィニル、(C₃-C₁₀)-シクロアルキル-(C₁-C₄)-アルキルスルフィニル、(C₄-C₁₀)-シクロアルケニル-(C₁-C₄)-アルキルスルフィニル、(C₃-C₁₀)-シクロアルキル-(C₃-C₄)-アルケニルスルフィニル、(C₄-C₁₀)-シクロアルケニル-(C₃-C₄)-アルケニルスルフィニル、(C₁-C₄)-アルキル-(C₃-C₁₀)-シクロアルキルスルフィニル、(C₂-C₄)-アルケニル-(C₃-C₁₀)-シクロアルキルスルフィニル、(C₂-C₄)-アルキニル-(C₃-C₁₀)-シクロアルキルスルフィニル、(C₁-C₄)-アルキル-(C₄-C₁₀)-シクロアルケニルスルフィニル、(C₂-C₄)-アルケニル-(C₄-C₁₀)-シクロアルケニルスルフィニル、(C₂-C₄)-アルキニル-(C₄-C₁₀)-シクロアルケニルスルフィニル

20

【 0 1 2 6 】

又は

(C₁-C₁₀)-アルキルスルホニル、(C₁-C₁₀)-ハロアルキルスルホニル、(C₃-C₁₀)-アルケニルスルホニル、(C₃-C₁₀)-アルキニルスルホニル、(C₃-C₁₀)-シクロアルキルスルホニル、(C₄-C₁₀)-シクロアルケニルスルホニル、(C₃-C₁₀)-シクロアルキル-(C₁-C₄)-アルキルスルホニル、(C₄-C₁₀)-シクロアルケニル-(C₁-C₄)-アルキルスルホニル、(C₃-C₁₀)-シクロアルキル-(C₃-C₄)-アルケニルスルホニル、(C₄-C₁₀)-シクロアルケニル-(C₃-C₄)-アルケニルスルホニル、(C₁-C₄)-アルキル-(C₃-C₁₀)-シクロアルキルスルホニル、(C₂-C₄)-アルケニル-(C₃-C₁₀)-シクロアルキルスルホニル、(C₃-C₄)-アルキニル-(C₃-C₁₀)-シクロアルキルスルホニル、(C₁-C₄)-アルキル-(C₄-C₁₀)-シクロアルケニルスルホニル、(C₃-C₄)-アルケニル-(C₄-C₁₀)-シクロアルケニルスルホニル、モノ-若しくはジ-(C₁-C₁₀)-アルキルアミノスルホニル

30

【 0 1 2 7 】

又は

ジ-(C₁-C₁₀)-アルキルアミノ、(C₁-C₁₀)-アルキルアミノ、(C₃-C₁₀)-アルケニルアミノ、(C₃-C₁₀)-アルキニルアミノ、(C₃-C₁₀)-シクロアルキルアミノ、(C₄-C₁₀)-シクロアルケニルアミノ、(C₃-C₁₀)-シクロアルキル-(C₁-C₄)-アルキルアミノ、(C₄-C₁₀)-シクロアルケニル-(C₁-C₄)-アルキルアミノ、(C₃-C₁₀)-シクロアルキル-(C₃-C₄)-アルケニルアミノ、(C₄-C₁₀)-シクロアルケニル-(C₃-C₄)-アルケニルアミノ、(C₁-C₄)-アルキル-(C₃-C₁₀)-シクロアルキルアミノ、(C₂-C₄)-アルケニル-(C₃-C₁₀)-シクロアルキルアミノ、(C₂-C₄)-アルキニル-(C₃-C₁₀)-シクロアルキルアミノ、(C₁-C₄)-アルキル-(C₄-C₁₀)-シクロアルケニルアミノ、(C₂-C₄)-アルケニル-(C₄-C₁₀)-シクロアルケニルアミノ

40

又は

最後に記載した 1 4 基の N-(C₁-C₄)-アルキルアミノ類似体

50

又は

ビス-[(C₃-C₁₀)-アルケニル]アミノ、ビス-[(C₃-C₁₀)アルキニル]アミノ

又は

トリ-[(C₁-C₁₀)-アルキル]シリル

【0128】

又は

(C₃-C₁₀)-シクロアルキル、(C₄-C₁₀)-シクロアルケニル、アリアル、ヘテロシクリル、(C₃-C₁₀)-シクロアルキルカルボニル、アロイル、ヘテロシクリルカルボニル、アリアル-(C₁-C₄)-アルキルカルボニル、(C₃-C₁₀)-シクロアルコキシカルボニル、アリアルオキシカルボニル、ヘテロシクリルオキシカルボニル、アリアル-(C₁-C₄)-アルコキシカルボニル、アリアルオキシ、アリアルチオ、アリアルアミノ、N-(C₁-C₄)-アルキル-N-アリアルアミノ、アリアル-(C₁-C₄)-アルコキシ、ヘテロシクリル-(C₁-C₄)-アルコキシ、アリアル-(C₃-C₄)-アルケニルオキシ、アリアル-(C₁-C₄)-アルキルチオ、ヘテロシクリル-(C₁-C₄)-アルキルチオ、アリアル-(C₃-C₄)-アルケニルチオ、アリアル-(C₁-C₄)-アルキルアミノ、N-(C₁-C₄)-アルキル-N-アリアル-(C₁-C₄)-アルキルアミノ、アリアル-(C₃-C₄)-アルケニルアミノ、N-(C₁-C₄)-アルキル-N-アリアル-(C₃-C₄)-アルケニルアミノ、場合によってはN-置換されたアリアルカルバモイル若しくはヘテロシクリルカルバモイル又はヘテロシクリル-(C₁-C₄)-アルキルカルバモイル、アリアルスルホニル、場合によってはN-置換されたアリアルスルホニルアミノ、アリアルスルホニル-N-(C₁-C₄)-アルキルスルホニル、場合によってはN-置換されたアリアルアミノスルホニル若しくはアリアルアミノスルホニルアミノ、N-アリアル-N-(C₁-C₁₀)-アルキルアミノスルホニル、ヘテロシクリルスルホニル、場合によってはN-置換されたヘテロシクリルスルホニルアミノ、アリアル-ジ-[(C₁-C₈)-アルキル]シリル、ジアリアル-(C₁-C₈)-アルキルシリル又はトリアリアルシリルであり、

10

20

ここにおいて、すぐ前に記載した40の基の環式置換基は無置換であるか又はハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシル、オキシル、チオ、(C₁-C₆)-アルキル、(C₂-C₆)-アルケニル、(C₂-C₆)-アルキニル、(C₁-C₄)-ハロアルキル、(C₃-C₈)-シクロアルキル、(C₁-C₄)-アルコキシ、(C₁-C₄)-ハロアルコキシ、(C₁-C₄)-アルキルチオ、(C₁-C₄)-ハロアルキルチオ、(C₁-C₄)-アルキルスルフィニル、(C₁-C₄)-ハロアルキルスルフィニル、(C₁-C₄)-アルキルスルホニル、(C₁-C₄)-ハロアルキルスルホニル、(C₁-C₄)-アルキルア

30

【0129】

R^a及びR^cの更なる例としては、(C₁-C₁₀)-アルキリデンアミノオキシ、(C₃-C₉)-シクロアルキリデンアミノオキシ(それぞれ式 -O-N=CR⁰-R^{a*}及び-O-N=CR⁰-R^{c*})又は1-[(C₁-C₁₀)-アルコキシイミノ]-(C₁-C₄)-アルキル、1-[(C₃-C₉)-シクロアルコキシイミノ]-(C₁-C₄)-アルキル、1-ヒドロキシイミノ-(C₁-C₄)-アルキル基(それぞれ式 -CR⁰=N-O-R^{a*}及び-CR⁰=N-O-R^{c*})がある。

【0130】

場合によってはN-置換された(例えば、場合によってはN-置換されたアリアルカルバモイル、ヘテロシクリルカルバモイル、アリアルアミノスルホニル、アリアルスルホニルアミノ)は、好ましくはアミノ基においては無置換であるか又は(C₁-C₄)-アルキル、(C₁-C₄)-アルカノイル、[(C₁-C₄)-アルコキシ]カルボニル及びフェニルの群から選択される一つ若しくはそれより多い基で置換され、殊に無置換であるか又は(C₁-C₄)-アルキル及びフェニルの群から選択される一つの基で置換され、極めて好ましくは無置換であるか又は(C₁-C₄)-アルキル(後者の場合は、例えばN-アリアル-N-(C₁-C₄)-アルキルカルバモイル)で置換されている。

40

【0131】

ヘテロシクリルを含んでいる最後に記載した基は、好ましくは以下の式のものである：

^NHet-

50

^NHet-CO
^NHet-CO-O-
^NHet-CO-NH-
^NHet-CO-NR-
^NHet-S(O)₂- 及び
^NHet-S(O)₂-NR-、

【0132】

ここにおいて ^NHet は、窒素環原子において自由結合(イル位置)である少なくとも1個の窒素環原子を有する飽和したヘテロシクリル (N-ヘテロシクリル) であり、ここにおいて ^NHet は、窒素環原子に加えて、N、O及びSの群から選択される更なるヘテロ環原子を含んでいてもよく、そしてこの更なるヘテロ環原子は、式 -O-、-S-、-SO-、-SO₂-、-NH-又は-NR'-の基の二価の基として存在し、ここにおいて R及びR'は互いに独立にそれぞれ (C₁-C₄)-アルキル、(C₁-C₄)-アルカノイル、[(C₁-C₄)-アルコキシ]カルボニル、ジ-[(C₁-C₄)-アルキル]カルバモイル又は場合によっては置換されているフェニルである。

10

好ましくは、Rは(C₁-C₄)-アルキルである。

好ましくは、R'は(C₁-C₄)-アルキル、(C₁-C₄)-アルカノイル又は[(C₁-C₄)-アルコキシ]カルボニルである。

【0133】

基R¹及び/又はR²の下で記載されているシクロアルキル、シクロアルケニル、アリール又はヘテロシクリル基を含んでいる好ましい置換基R^b及びR^dは、場合によっては一置換又は多置換(多置換の場合は、置換基は同一でも又は異なるものであってもよい。)であるが、R^a及びR^bとして定義されたもの又は以下に記載されたものである：

20

(C₁-C₁₀)-アルキル、(C₁-C₄)-アルコキシ-(C₁-C₄)-アルキル、(C₃-C₁₀)-アルケニル、(C₃-C₁₀)-アルキニル、(C₃-C₁₀)-シクロアルキル-(C₁-C₄)-アルキル、(C₄-C₁₀)-シクロアルケニル-(C₁-C₄)-アルキル、(C₃-C₁₀)-シクロアルキル-(C₃-C₄)-アルケニル、(C₄-C₁₀)-シクロアルケニル-(C₃-C₄)-アルケニル、(C₁-C₄)-アルコキシ-(C₃-C₄)-アルケニル、アリール-(C₁-C₄)-アルキル、ヘテロシクリル-(C₁-C₄)-アルキル又はアリール-(C₃-C₄)-アルケニル、

ここにおいてすぐ前に記載した3つの基の環式の基は、無置換であるか又はハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシル、チオ、(C₁-C₄)-アルキル、(C₁-C₄)-ハロアルキル、(C₃-C₈)-シクロアルキル、(C₁-C₄)-アルコキシ、(C₁-C₄)-ハロアルコキシ、(C₁-C₄)-アルキルチオ、(C₁-C₄)-ハロアルキルチオ、(C₁-C₄)-アルキルスルフィニル、(C₁-C₄)-ハロアルキルスルフィニル、(C₁-C₄)-アルキルスルホニル、(C₁-C₄)-ハロアルキルスルホニル、(C₁-C₄)-アルキルアミノ、ジ-[(C₁-C₄)-アルキル]アミノ、トリメチルシリル及び(C₁-C₄)-アルカノイルの群から選択される一つ若しくはそれより多い基で置換されている、

30

好ましくは、すぐ前に記載した3つの基の環式の基は無置換であるか又はハロゲン、シアノ、ニトロ、(C₁-C₄)-アルキル、(C₁-C₄)-ハロアルキル、(C₁-C₄)-アルコキシ及び(C₁-C₄)-ハロアルコキシの群から選択される一つ若しくはそれより多い基で置換されている。

【0134】

40

アリール、ヘテロシクリル又はシクロアルキル上で隣接する置換基は、もしもそれが化学的に可能ならば、場合によっては結合して4-から8-員の環を形成してもよい。

【0135】

本発明に係る殊に好ましいものとしては、化合物 (I)において、

R¹は、(C₁-C₆)-アルキル、殊に(C₁-C₄)-アルキルであり、それらは無置換であるか又はヒドロキシル、アミノ、シアノ、ハロゲン(殊にフッ素及び塩素)、(C₁-C₄)-アルコキシ、(C₁-C₄)-アルコキシ-(C₁-C₄)-アルコキシ、(C₁-C₄)-ハロアルコキシ(好ましくは(C₁-C₄)-フルオロアルコキシ)、(C₃-C₄)-アルケニルオキシ、(C₃-C₄)-アルキニルオキシ、(C₁-C₄)-アルキルチオ、(C₁-C₄)-ハロアルキルチオ(好ましくは(C₁-C₄)-フルオロアルキルチオ)、(C₁-C₄)-アルケニルチオ、(C₁-C₄)-アルキニルチオ、(C₁-C₄)-アルキルスルフィ

50

ニル、(C₁-C₄)-ハロアルキルスルフィニル(好ましくは(C₁-C₄)-フルオロアルキルスルフィニル)、(C₁-C₄)-アルキルスルホニル、(C₁-C₄)-ハロアルキルスルホニル(好ましくは(C₁-C₄)-フルオロアルキルスルホニル)、(C₁-C₄)-アルキルアミノ、ジ-[(C₁-C₄)-アルキル]アミノ、

カルボキシル、(C₁-C₄)-アルコキシカルボニル、(C₃-C₈)-シクロアルコキシカルボニル、(C₁-C₄)-アルカノイル、(C₁-C₄)-ハロアルカノイル、(C₃-C₈)-シクロアルカノイル、カルバモイル、モノ-及びジ-[(C₁-C₄)-アルキル]カルバモイル、

(C₁-C₄)-アルキルスルホニルアミノ、(C₁-C₄)-アルカノイルアミノ、モノ-及びジ-[(C₁-C₄)-アルキル]アミノカルボニルアミノ、(C₁-C₄)-アルコキシカルボニルアミノ、

及び上記に記載した5基のN-(C₁-C₄)-アルキル類似体、

(C₁-C₄)-アルカノイルオキシ、(C₁-C₄)-ハロアルカノイルオキシ、(C₃-C₈)-シクロアルカノイルオキシ、(C₁-C₄)-アルコキシカルボニルオキシ、(C₁-C₄)-アルキルアミノカルボニルオキシ、ジ-[(C₁-C₄)-アルキル]アミノカルボニルオキシ、(C₃-C₆)-シクロアルキル、ヘテロシクリルカルボニル、アリール及びヘテロアリール、

ここにおいてすぐ前に記載した4つの基のそれぞれは場合によっては置換されていて、好ましくは無置換であるか又はハロゲン、(C₁-C₄)-アルキル、(C₁-C₄)-ハロアルキル及び(C₁-C₄)-アルコキシの群から選択される一つ若しくはそれより多い基で置換され、

【0136】

そして5-から8-員、好ましくは5-又は6-員の飽和したヘテロシクリルであり、それらは好ましくはN、O及びS、殊にO及びSの群から選択される1から3個のヘテロ環原子を有し、

それは場合によっては置換されていて、好ましくは無置換であるか又は(C₁-C₄)-アルキル及び(C₁-C₄)-アルコキシ、好ましくは(C₁-C₄)-アルキルの群から選択される一つ若しくはそれより多い基で置換されている。

【0137】

ヘテロシクリルカルボニルは、好ましくは式^NHet-COの基であり、ここにおいて^NHet-は上記に定義された通りであるか又は好ましいものとして定義された通りである。

【0138】

更に、本発明に係る殊に好ましいものとしては、化合物(I)において、

R¹は(C₃-C₆)-アルケニルであり、

それは無置換であるか又はハロゲン、好ましくはフッ素又は塩素の群から選択される一つ若しくはそれより多い基で置換され、及びアリールであり、それは無置換であるか又はハロゲン、(C₁-C₄)-アルキル、(C₁-C₄)-ハロアルキル及び(C₁-C₄)-アルコキシの群から選択される一つ若しくはそれより多い基で置換されている、化合物(I)の使用である。

【0139】

更に、本発明に係る殊に好ましいものとしては、化合物(I)において、

R¹が(C₃-C₆)-アルキニル又は(C₃-C₆)-ハロアルキニルである、化合物(I)の使用である。

【0140】

更に、本発明に係る殊に好ましいものとしては、化合物(I)において、

R¹が(C₃-C₆)-シクロアルキル又は5-から8-員の飽和したヘテロシクリルであり、それは無置換であるか又は(C₁-C₄)-アルキル及び(C₁-C₄)-アルコキシ、好ましくは(C₁-C₄)-アルキルの群から選択される一つ若しくはそれより多い基で置換されている、化合物(I)の使用である。

【0141】

更に、本発明に係る殊に好ましいものとしては、化合物(I)において、

R²が(C₁-C₈)-アルキル、(C₃-C₈)-シクロアルキル、アリール又はヘテロアリールであり、ここにおいてすぐ前に記載した2つの基のそれぞれは無置換であるか又はハロゲン、(C₁-C₄)-アルキル、(C₁-C₄)-ハロアルキル及び(C₁-C₄)-アルコキシの群から選択される一つ若しくはそれより多い基で置換されていて、

10

20

30

40

50

ここにおいてヘテロアリアルは、好ましくは5又は6個の環原子を有し、そのうちの1から3個、殊に1又は2個の環原子は、N、O及びS群から選択されるヘテロ環原子であり、極めて好ましくはチエニル、フリル、チアゾリル又はピリジル、例えば2-チエニル、3-チエニル、2-フリル、3-フリル、1,3-チアゾール-2-イル、2-ピリジル、3-ピリジル又は4-ピリジルである、化合物(I)の使用である。

【0142】

式(I)の化合物の幾つかは既知であるか又は既知の方法に類似して製造することができる。植物におけるこれらの薬害軽減剤としての使用はこれまでに開示されていない。

【0143】

本発明に係る式(I)の化合物及びそれらの塩の幾つかは新規であり、そして本発明の内容の一部を構成する。

それ故、本発明はまた式(I)の新規な化合物及びそれらの塩を提供するものであり、ここにおいて

Xは酸素又は硫黄であり；

(Y)_nはn個の置換基Yであり、ここにおいてYは他の置換基から独立に、ハロゲン、シアノ、ニトロ、(C₁-C₆)-アルキル、(C₂-C₆)-アルケニル、(C₂-C₆)-アルキニル、(C₁-C₆)-アルコキシ、(C₁-C₆)-アルキルチオ、(C₁-C₆)-アルキルスルフィニル、(C₁-C₆)-アルキルスルホニル、(C₁-C₆)-アルコキシカルボニル、(C₁-C₄)-アルキルアミノ又はジ-[(C₁-C₄)-アルキル]アミノ基であり、

ここにおいて、すぐ前に記載した10の基のそれぞれは無置換であるか又はハロゲン、(C₁-C₄)-アルコキシ、(C₁-C₄)-ハロアルコキシ及び(C₁-C₄)-アルキルチオ又は(C₃-C₆)-シクロアルキル、(C₄-C₆)-シクロアルケニル、アリアル又はヘテロシクリルの群から選択される一つ若しくはそれより多い基で置換され、

ここにおいてすぐ前に記載した4つの基のそれぞれは無置換であるか又はハロゲン、シアノ、ニトロ、(C₁-C₄)-アルキル、(C₁-C₄)-ハロアルキル、(C₁-C₄)-アルコキシ-(C₁-C₄)-アルキル、(C₁-C₄)-アルコキシ、(C₁-C₄)-ハロアルコキシ、(C₁-C₄)-アルコキシ-(C₁-C₄)-アルコキシ及び(C₁-C₄)-アルキルチオの群から選択される一つ若しくはそれより多い基で置換され、

【0144】

又は

隣接する2個のY基は直接結合している炭素原子と一緒に、炭素環又はヘテロ環である4-から8-員の縮合環であり、N、O及びSを含む基から選択される一つ若しくはそれより多いヘテロ環原子を有し、そして無置換であるか又はハロゲン、シアノ、ニトロ、(C₁-C₄)-アルキル、(C₁-C₄)-ハロアルキル、(C₁-C₄)-アルコキシ、(C₁-C₄)-ハロアルコキシ及び(C₁-C₄)-アルキルチオの群から選択される一つ若しくはそれより多い基で置換されていて、そして

nは0、1、2、3又は4、好ましくは0、1、2又は3、殊に0、1又は2、であり、そして

【0145】

R¹は、(C₁-C₄)-アルキル、(C₃-C₁₀)-アルケニル又は(C₃-C₁₀)-アルキニルであり、

ここにおいてすぐ前に記載した2つの基のそれぞれは無置換であるか、又はすぐ前に記載した3つの基のそれぞれは一つ若しくはそれより多い同一又は異なる基R^aによって置換され、そして置換基を含んで、1から30個の炭素原子、好ましくは1から24個の炭素原子を有し、又は(C₃-C₁₀)-シクロアルキル、(C₄-C₁₀)-シクロアルケニル、又は飽和したヘテロシクリルであり、

ここにおいてすぐ前に記載した3つの基のそれぞれは無置換であるか又は一つ若しくはそれより多い同一又は異なる基R^bによって置換され、そして置換基を含んで、3から30個の炭素原子、好ましくは3から24個の炭素原子を有し、そして

【0146】

10

20

30

40

50

R^2 はアリール又はヘテロシクリルであり、

ここにおいてすぐ前に記載した2つの基のそれぞれは無置換であるか又は一つ若しくはそれより多い同一又は異なる基 R^d によって置換され、そして置換基を含んで、3から30個の炭素原子、好ましくは3から24個の炭素原子を有し、

ここにおいて基 R^1 及び R^2 中、置換基

R^a は、それぞれの場合に他の基から独立に、ハロゲン、シアノ、ニトロ並びに式 $-Z^a-R^a$ 及び $R^{c^y c^a}$ の群から選択される基であり、

R^b は、それぞれの場合に他の基から独立に、ハロゲン、シアノ、ニトロ並びに式 $-Z^b-R^b$ 及び R^{b^*} の群から選択される基であり、

R^c は、それぞれの場合に他の基から独立に、ハロゲン、シアノ、ニトロ並びに式 $-Z^c-R^c$ 及び $R^{c^y c^c}$ の群から選択される基であり、

R^d は、それぞれの場合に他の基から独立に、ハロゲン、シアノ、ニトロ並びに式 $-Z^d-R^d$ 及び R^{d^*} の群から選択される基であり、

【0147】

ここにおいて基 R^a 及び R^b 中、

Z^a 及び Z^b は、それぞれ互いに独立に、式

$-O-$ 、 $-S(O)_p-$ 、 $-S(O)_p-O-$ 、 $-O-S(O)_p-$ 、 $-NR^0-S(O)_p-$ 、 $-S(O)_pNR^0-$ 、 $-CO-$ 、 $-O-CO-$ 、 $-CO-O-$ 、 $-S-CO-$ 、 $-CO-S-$ 、 $-S-CS-$ 、 $-CS-S-$ 、 $-O-CO-O-$ 、 $-NR^0-$ 、 $-O-NR^0-$ 、 $-NR^0-O-$ 、 $-NR^0-CO-$ 、 $-CO-NR^0-$ 、 $-O-CO-NR^0-$ 又は $-NR^0-CO-O-$ 、 $-NR^0-CO-NR^0-$ 、 $-NR^0-CO-NR^0-$ 及び $-SiR'R''-$ の二価の置換基であり、ここにおいて p はそれぞれ整数 0、1又は2であり、そして基 R^0 は互いに独立に水素、 (C_1-C_6) -アルキル、 (C_2-C_6) -アルケニル、 (C_2-C_6) -アルキニル、フェニル、フェニル- (C_1-C_6) -アルキル、 (C_3-C_6) -シクロアルキル又は1から10個の炭素原子を有するアシル(好ましくは $[(C_1-C_6)$ -アルキル]カルボニル、 $[(C_1-C_6)$ -アルコキシ]カルボニル及び $[(C_1-C_6)$ -アルキル]スルホニル)であり、そして R' 及び R'' は互いに独立に、 (C_1-C_6) -アルキル、 (C_2-C_6) -アルケニル、 (C_2-C_6) -アルキニル、フェニル、フェニル- (C_1-C_6) -アルキル又は (C_3-C_6) -シクロアルキルであり、そして

【0148】

$R^{c^y c^a}$ は全体として1から24個の炭素原子、好ましくは1から18個の炭素原子を有する場合によっては置換されている環式炭化水素基であり、又は全体として1から24個の炭素原子、好ましくは1から18個の炭素原子を有する場合によっては置換されたヘテロ環基であり、そして

【0149】

R^a 、 R^b 及び R^{b^*} はそれぞれ互いに独立に、全体として1から24個の炭素原子、好ましくは1から18個の炭素原子を有する場合によっては置換された炭化水素基であり、又は全体として1から24個の炭素原子、好ましくは1から18個の炭素原子を有する場合によっては置換されたヘテロ環基であり、又は

R^a 及び R^b はそれぞれ互いに独立に、水素(好ましくは化学的に安定な場合は置換基も含む)であり、そして

【0150】

ここにおいて基 R^d 中、

Z^d は式 $-O-$ 、 $-S(O)_p-$ 、 $-S(O)_p-O-$ 、 $-O-S(O)_p-$ 、 $-S(O)_pNR^0-$ 、 $-CO-$ 、 $-O-CO-$ 、 $-CO-O-$ 、 $-S-CO-$ 、 $-CO-S-$ 、 $-S-CS-$ 、 $-CS-S-$ 、 $-O-CO-O-$ 、 $-CO-NR^0-$ 、 $-O-CO-NR^0-$ 、 又は $-SiR'R''-$ の二価の基であり、ここにおいて p はそれぞれ整数 0、1又は2であり、そして基 R^0 は互いに独立に水素、 (C_1-C_6) -アルキル、 (C_2-C_6) -アルケニル、 (C_2-C_6) -アルキニル、フェニル、フェニル- (C_1-C_6) -アルキル、 (C_3-C_6) -シクロアルキル又は1から10個の炭素原子を有するアシル(好ましくは $[(C_1-C_6)$ -アルキル]カルボニル、 $[(C_1-C_6)$ -アルコキシ]カルボニル及び $[(C_1-C_6)$ -アルキル]スルホニル)であり、そして R' 及び R'' は互いに独立に、 (C_1-C_6) -アルキル、 (C_2-C_6) -アルケニル、 (C_2-C_6) -アルキニル、フェニル、フェニル- (C_1-C_6) -アルキル又は (C_3-C_6) -シクロアルキルであり、そして

【0151】

40

50

R^{d^*} 及び $R^{d^{**}}$ はそれぞれ互いに独立に、全体として 1 から 24 個の炭素原子を有する場合によっては置換された炭化水素基であり、又は全体として 1 から 24 個の炭素原子を有する場合によっては置換されたヘテロ環基であり、又は

R^{d^*} は水素であるが、但し以下の式 (I) の化合物及びそれらの塩を除く、

(a) R^1 はシクロヘキシルカルバモイル基で置換された (C_1-C_4)-アルキルであり、そして R^2 は二環式ヘテロアリール基である、

(b) R^1 は N-置換のカルバモイル基で置換された (C_1-C_4)-アルキルであり、そして同時に場合によってはシクロアルキル、ヘテロアリール又はフェニルで置換され、そして R^2 はフェニルである、

(c) R^1 は 2-(トリメチルシリル)エトキシ基で置換された (C_1-C_4)-アルキルであり、そして R^2 は場合によっては置換されているフェニルである、 10

(d) R^2 は場合によっては置換されているフェニル又はヘテロアリールであり、ここにおいて 1 個の置換基は一つ若しくはそれより多い環式基を含み、又は二つ若しくはそれより多い置換基が環式である、

(e) R^1 は置換された (C_1-C_4)-アルキルであり、そして R^2 はイミノカルバモイル(アミジン基)で置換されたフェニルである、

(f) R^1 は場合によっては置換されているアリール基で置換された (C_1-C_4)-アルキルであり、そして R^2 は場合によっては置換されているアリール基である、

(g) R^2 は場合によっては置換されているインドリル基又は N-(4-ブromoフェニル)-又は N-フェニル-5-(ヒドロキシメチル)ピラゾール-3-イル基である、 20

そして

【 0 1 5 2 】

また以下の化合物を除く：

(h) 1-(2-ヒドロキシエチル)-3-フェニルキノキサリン-2(1H)-オン、

(i) 1-[2-(ジエチルアミノ)エチル]-3-フェニルキノキサリン-2(1H)-オン、

(j) 1-[3-(ジエチルアミノ)プロピル]-3-フェニルキノキサリン-2(1H)-オン、

(k) 7-クロロ-1-[3-(ジエチルアミノ)プロピル]-3-フェニルキノキサリン-2(1H)-オン、

(l) 1-[3-[2-(ピロリジニル-1-カルボニル)ピロリジニル-1-カルボニル]プロピル]-3-フェニルキノキサリン-2(1H)-オン、

(m) 1-[2-[2-(ピロリジニル-1-カルボニル)ピロリジニル-1-カルボニル]エチル]-3-フェニルキノキサリン-2(1H)-オン、 30

(n) 1-[2-[4-(ピロリジニル-1-カルボニル)チアゾリジニル-3-カルボニル]エチル]-3-フェニルキノキサリン-2(1H)-オン、

(o) 1-[2-[4-(チアゾリジニル-1-カルボニル)チアゾリジニル-3-カルボニル]エチル]-3-フェニルキノキサリン-2(1H)-オン、

(p) 1-[2-[4-(ピロリジニル-1-カルボニル)-1,1-ジオキソチアゾリジニル-3-カルボニル]エチル]-3-フェニルキノキサリン-2(1H)-オン、

(q) 1-[3-(アミノ)プロピル]-3-フェニルキノキサリン-2(1H)-オン、

(r) 1-(オクタヒドロ-2H-キノリジン-1-イルメチル)-3-フェニルキノキサリン-2(1H)-オン、 40

(s) 6-メトキシ-又は 6-メチル-又は 6-トリフルオロメチル-又は 6-クロロ-1-(オクタヒドロ-2H-キノリジン-1-イルメチル)-3-フェニルキノキサリン-2(1H)-オン (4 化合物)、

(t) 1-(メチルチオメチル)-3-フェニルキノキサリン-2(1H)-オン、

(u) 1-(メチルアミノカルボニルメチル)-3-(2-エトキシフェニル)キノキサリン-2(1H)-オン、

(v) 1-(ジメチルアミノメチル)-3-(4-エトキシカルボニルフェニル)-6-ブromoキノキサリン-2(1H)-オン、

(w) 1-(モルホリン-4-イルメチル)-3-(4-エトキシカルボニルフェニル)-6-ブromoキノキサリン-2(1H)-オン、

(x) 1-(4-ベンジルピペリジ-1-イルメチル)-3-(4-エチルフェニル)キノキサリン-2(1H)- 50

オン、

(y) 1-(4-ベンジルピペラジン-1-イルメチル)-3-(3-クロロフェニル)キノキサリン-2(1H)-オン、

(z) 1-[3-[4-(4,5-ジヒドロピリダジン-3(2H)-オン-6-イル)フェノキシ]プロピル]-3-フェニルキノキサリン-2(1H)-オン。

【0153】

定義(a)から(z)において除外されている化合物のいくつかは、既知のものであり、そして以下に記載されている。

Tetrahedron Letters 43 (2002)、1637-1639 (定義 (a) 及び (b) について)

WO-A-2002/002550 (定義 (c) 及び (h) について)

Molecular Crystals and Liquid Crystals 329 (1999)、1137-1143 (殊に定義(d) について)

Carbohydrate Research 228 (2003)、2301-2309 (殊に定義(g) について)

WO-A-99/50254 (定義 (e)、(j)、(k) について)

Helv. Chim. Acta XXXV (1952) 2301(定義 (h)、(i) について)

WO-A-97/07116 (定義 (l)、(m)、(n)、(o)、(p) について)

Yakugaku Zasshi 90 (1970)、1391-5 (定義 (q) について)

Il Farmaco 44 (1989)、945-50、 Il Farmaco 41 (1986)、722-8 (定義 (r) について)

)

Il Farmaco 40 (1985)、303-314 (定義 (s) について)

CAS Registry No. 385798-86-7 (定義 (t) について)

CAS Registry No. 383408-90-0 (定義 (u) について)

CAS Registry No. 376619-52-2 (定義 (v) について)

CAS Registry No. 376616-71-6 (定義 (w) について)

CAS Registry No. 376605-64-0 (定義 (x) について)

CAS Registry No. 376604-67-0 (定義 (y) について)

CAS Registry No. 117826-30-9、JP-A-63145272 (定義(z) について)

【0154】

殊に興味のあるものは、式(I)の一般的な基が上記において好ましいものとして定義されている意味を有する新規な化合物(I)であり、ここにおいて上記で説明した新規な化合物に付される条件も考慮されるべきである。

【0155】

好ましいものは、本発明に係る化合物(I)において、

R^1 は、(C_1 - C_4)-アルキル、(C_3 - C_6)-アルケニル又は(C_3 - C_6)-アルキニルであり、

ここにおいてすぐ前に記載した2つの基のそれぞれは無置換であるか又は最後に記載した3基のそれぞれは一つ若しくはそれより多い同一又は異なる基 R^a で置換され、そして置換基を含んで、1から24個の炭素原子、好ましくは1から18個の炭素原子を有し、又は

(C_3 - C_6)-シクロアルキル又は飽和したヘテロシクリルであり、

ここにおいてすぐ前に記載した2つの基のそれぞれは無置換であるか又は一つ若しくはそれより多い同一又は異なる基 R^b で置換され、そして置換基を含んで、3から24個の炭素原子、好ましくは3から18個の炭素原子を有し、

【0156】

ここにおいて

R^a はそれぞれの場合に独立に、ハロゲン、シアノ、ニトロ並びに式 $-Z^a-R^{a*}$ 及び R^{cyc-a} の群から選択される基であり、

R^b はそれぞれの場合に独立に、ハロゲン、シアノ、ニトロ並びに式 $-Z^b-R^{b*}$ 及び R^{b**} の群から選択される基であり、

ここにおいて基 R^a 及び R^b 中、基又は置換基

Z^a 、 Z^b 、 R^{a*} 、 R^{b*} 及び R^{b**} は、上記に定義した通りであるか又は更に以下に定義する通

10

20

30

40

50

りであり、

好ましくは

Z^a 及び Z^b はそれぞれ互いに独立に、

-O-, $-S(O)_p-$, $-S(O)_p-O-$, $-O-S(O)_p-$, $-NR^0-S(O)_p-$, $-S(O)_pNR^0-$, -CO-, -O-CO-, -CO-O-, $-NR^0-$, $-NR^0-CO-$, $-CO-NR^0-$, $-O-CO-NR^0-$ 又は $-NR^0-CO-O-$, $-NR^0-CO-NR^0-$, $-NR^0-CO-NR^0-$ 又は $-SiR'R''-$ の二価の置換基であり、ここにおいて p はそれぞれ整数 0、1 又は 2 であり、そして基 R^0 は互いに独立に水素、 (C_1-C_4) -アルキル、フェニル、フェニル- (C_1-C_4) -アルキル、 (C_3-C_6) -シクロアルキル、 (C_1-C_4) -アルカノイル、 $[(C_1-C_4)$ -アルコキシ]カルボニル又は (C_1-C_4) -アルキルスルホニル、殊にそれぞれ水素又は (C_1-C_4) -アルキルであり、そして R' 及び R'' は互いに独立に、 (C_1-C_4) -アルキル、フェニル、フェニル- (C_1-C_4) -アルキル又は (C_3-C_6) -シクロアルキルであり、殊に (C_1-C_4) -アルキルであり、

【0157】

R^{cyc-a} は、 (C_3-C_6) -シクロアルキル、 (C_4-C_6) -シクロアルケニル、フェニル、飽和したヘテロシクリル、不飽和の非芳香族ヘテロシクリル又はヘテロアリールであり、

ここにおいてすぐ前に記載した 6 つの基は無置換であるか又はハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシル、チオ、 (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) -アルキル、 (C_3-C_6) -シクロアルキル、 (C_1-C_4) -アルコキシ、 (C_1-C_4) -ハロアルコキシ、 (C_1-C_4) -アルキルチオ、 (C_1-C_4) -ハロアルキルチオ、 (C_1-C_4) -アルキルスルフィニル、 (C_1-C_4) -ハロ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) -ハロアルキルスルホニル、 (C_1-C_4) -アルキルアミノ、ジ- $[(C_1-C_4)$ -アルキル]アミノ、トリメチルシリル、 (C_1-C_4) -アルカノイル、 $[(C_1-C_4)$ -アルコキシ]カルボニル、ジ- $[(C_1-C_4)$ -アルキル]カルバモイル、そして飽和の又は不飽和の非芳香族ヘテロシクリルの場合は更にオキソ、の群から選択される一つ若しくはそれより多い基で置換されていて、

【0158】

殊に

R^{cyc-a} は、 (C_3-C_6) -シクロアルキル、フェニル、3 から 6 個の環原子を有する飽和したヘテロシクリル、又は 5 から 6 個の環原子を有するヘテロアリールであり、ここにおいてすぐ前に記載した 4 つの基のそれぞれは無置換であるか又はハロゲン、シアノ、ニトロ、 (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) -アルキル、 (C_1-C_4) -アルコキシ、 (C_1-C_4) -ハロアルコキシ、 (C_1-C_4) -アルキルチオ、そして飽和したヘテロシクリルの場合は更にオキソ、の群から選択される一つ若しくはそれより多い基で置換され、そして

【0159】

R^a 、 R^b 及び R^{b*} はそれぞれ互いに独立に、 (C_1-C_{10}) -アルキル、 (C_3-C_{10}) -アルケニル、 (C_3-C_{10}) -アルキニル、 (C_3-C_6) -シクロアルキル、 (C_4-C_6) -シクロアルケニル、アリール又はヘテロシクリルであり、ここにおいてすぐ前に記載した 7 つの基のそれぞれは無置換であるか又はハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシル、チオ、 (C_3-C_6) -シクロアルキル、 (C_1-C_4) -アルコキシ、 (C_1-C_4) -ハロアルコキシ、 (C_1-C_4) -アルキルチオ、 (C_1-C_4) -ハロアルキルチオ、 (C_1-C_4) -アルキルスルフィニル、 (C_1-C_4) -ハロ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) -ハロアルキルスルホニル、 (C_1-C_4) -アルキルアミノ、ジ- $[(C_1-C_4)$ -アルキル]アミノ、 (C_1-C_4) -アルキルカルバモイルアミノ、ジ- $[(C_1-C_4)$ -アルキル]カルバモイルアミノ、トリメチルシリル、 (C_1-C_4) -アルカノイル、 $[(C_1-C_4)$ -アルコキシ]カルボニル、カルバモイル、 (C_1-C_4) -アルキルカルバモイル、ジ- $[(C_1-C_4)$ -アルキル]カルバモイル、そして環式基の場合は更に (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) -アルキル、そしてヘテロシクリルの場合は更にオキソ、の群から選択される一つ若しくはそれより多い基で置換され、又は

R^a 及び R^b はそれぞれ互いに独立に水素であり、

【0160】

殊に

10

20

30

40

50

R^{a^*} 、 R^{b^*} 及び $R^{b^{**}}$ はそれぞれ互いに独立に、
 (C_1-C_6) -アルキル、 (C_3-C_6) -シクロアルキル、フェニル、飽和したヘテロシクリル又はヘテロアリールであり、ここにおいて最後に記載した 5 基のそれぞれは無置換であるか又はハロゲン、シアノ、ニトロ、 (C_1-C_4) -アルコキシ、 (C_1-C_4) -ハロアルコキシ、 (C_1-C_4) -アルキルチオ、そして環式基の場合は更に (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) -アルキル、そして飽和したヘテロシクリルの場合は更にオキソ、の群から選択される一つ若しくはそれより多い基で置換され、又は

R^{a^*} 及び R^{b^*} は、それぞれ互いに独立に水素であるが、上記の条件 (a) から (z) に記載されている化合物を除くものである。

【0161】

10

殊に好ましいものは、本発明に係る化合物 (I) において、

R^{y^c-a} は、無置換であるか又は (C_1-C_4) -アルキルで一置換又は多置換された (C_3-C_6) -シクロアルキル、又はフェニル、又は 3 から 6 個の環原子を有する飽和したヘテロシクリル、又は 5 から 6 個の原子を有するヘテロアリールであり、ここにおいてすぐ前に記載した 3 つの基のそれぞれは無置換であるか又はハロゲン、シアノ、ニトロ、 (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) -アルキル、 (C_1-C_4) -アルコキシ、 (C_1-C_4) -ハロアルコキシ、 (C_1-C_4) -アルキルチオ、そして飽和したヘテロシクリルの場合は更にオキソ、の群から選択される一つ若しくはそれより多い基で置換されているものである。

【0162】

20

殊に好ましいものは、本発明に係る化合物 (I) において、

R^{a^*} 、 R^{b^*} 及び $R^{b^{**}}$ はそれぞれ互いに独立に、

(C_1-C_4) -アルキル、 (C_3-C_6) -シクロアルキル、フェニル、3 から 6 個の環原子を有する飽和したヘテロシクリル、又は 5 から 6 個の原子を有するヘテロアリールであり、ここにおいてすぐ前に記載した 5 つの基のそれぞれは無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) -ハロアルコキシ、 (C_1-C_4) -アルキルチオ、そして環式基の場合は更に (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) -アルキル、そして飽和したヘテロシクリルの場合は更にオキソ、の群から選択される一つ若しくはそれより多い基で置換され、又は、

R^{a^*} 及び R^{b^*} はそれぞれ互いに独立に水素である。

30

【0163】

更に好ましいものは、本発明に係る化合物 (I) において、

R^2 がフェニル又はヘテロアリールであり、

ここにおいてすぐ前に記載した 2 つの基のそれぞれは無置換であるか又は一つ若しくはそれより多い同一又は異なる基 R^d で置換されていて、そして置換基を含んで、3 から 24 個の炭素原子、好ましくは 3 から 18 個の炭素原子を有し、

ここにおいて R^d はそれぞれ独立に、無機又は有機の基であり、好ましくはハロゲン、シアノ、ニトロ並びに式 $-Z^d-R^{d^*}$ 及び $R^{d^{**}}$ の群から選択される置換基であり、

【0164】

ここにおいて基 R^d 中、基又は置換基

40

Z^d 、 R^{d^*} 及び $R^{d^{**}}$ は上記に定義した通りであるか又は更に以下に定義する通りであり、好ましくは

Z^d はそれぞれ互いに独立に、式 $-O-$ 、 $-S(O)_p-$ 、 $-S(O)_p-O-$ 、 $-O-S(O)_p-$ 、 $-S(O)_pNR^0-$ 、 $-CO-$ 、 $-O-CO-$ 、 $-CO-O-$ 、 $-CO-NR^0-$ 、 $-O-CO-NR^0-$ 又は $-SiR'R''-$ の二価の基であり、ここにおいて p はそれぞれ整数 0、1 又は 2 であり、そして置換基 R^0 はそれぞれ互いに独立に水素、 (C_1-C_4) -アルキル、フェニル、フェニル- (C_1-C_4) -アルキル、 (C_3-C_6) -シクロアルキル、 (C_1-C_4) -アルカノイル、 $[(C_1-C_4)$ -アルコキシ]カルボニル又は (C_1-C_4) -アルキルスルホニル、殊にそれぞれ水素又は (C_1-C_4) -アルキルであり、そして R' 及び R'' は互いに独立に、 (C_1-C_4) -アルキル、フェニル、フェニル- (C_1-C_4) -アルキル又は (C_3-C_6) -シクロアルキル、殊に (C_1-C_4) -アルキルであり、

50

【0165】

R^{d^*} 及び $R^{d^{**}}$ は、それぞれ互いに独立に、

(C_1-C_{10})-アルキル、(C_3-C_{10})-アルケニル、(C_3-C_{10})-アルキニル、(C_3-C_6)-シクロアルキル、(C_4-C_6)-シクロアルケニル、アリール又はヘテロシクリルであり、ここにおいてすぐ前に記載した7つの基のそれぞれは無置換であるか又はハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシル、チオ、(C_3-C_6)-シクロアルキル、(C_1-C_4)-アルコキシ、(C_1-C_4)-ハロアルコキシ、(C_1-C_4)-アルキルチオ、(C_1-C_4)-ハロアルキルチオ、(C_1-C_4)-アルキルスルフィニル、(C_1-C_4)-ハロ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)-ハロアルキルスルホニル、(C_1-C_4)-アルキルアミノ、ジ-[(C_1-C_4)-アルキル]アミノ、(C_1-C_4)-アルキルカルバモイルアミノ、ジ-[(C_1-C_4)-アルキル]カルバモイルアミノ、トリメチルシリル、(C_1-C_4)-アルカノイル、[(C_1-C_4)-アルコキシ]カルボニル、カルバモイル、(C_1-C_4)-アルキルカルバモイル、ジ-[(C_1-C_4)-アルキル]カルバモイル、そして環式基の場合は更に (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)-アルキル、そしてヘテロシクリルの場合は更にオキソ、の群から選択される一つ若しくはそれより多い基で置換され、又は

R^d はそれぞれ互いに独立に水素であり、

【0166】

殊に

R^{d^*} 及び $R^{d^{**}}$ はそれぞれ互いに独立に、

(C_1-C_6)-アルキル、(C_3-C_6)-シクロアルキル、フェニル、飽和したヘテロシクリル又はヘテロアリールであり、ここにおいてすぐ前に記載した5つの基のそれぞれは、無置換であるか又はハロゲン、(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、(C_1-C_4)-アルキルチオ、そして飽和したヘテロシクリルの場合は更にオキソ、の群から選択される一つ若しくはそれより多い基で置換され、又は

R^d は、それぞれ互いに独立に水素であるが、上記の条件(a)から(z)に記載されている化合物を除くものである。

【0167】

殊に好ましいものは、本発明に係る化合物 (I) において、

Z^d はそれぞれ互いに独立に、式 -O-、-S(O)_p-、-CO-、-O-CO-、-CO-O-、-CO-NR⁰- 又は -O-CO-NR⁰- の二価の基であり、

ここにおいてpはそれぞれ整数 0、1又は2であり、そして置換基R⁰はそれぞれ互いに独立に水素又は(C_1-C_4)-アルキルである。

【0168】

殊に好ましいものは、本発明に係る化合物 (I) において、

R^{d^*} 及び $R^{d^{**}}$ は、それぞれ互いに独立に、

(C_1-C_4)-アルキル、(C_3-C_6)-シクロアルキル、フェニル、3から6個の環原子を有する飽和したヘテロシクリル、又は5から6個の原子を有するヘテロアリールであり、ここにおいてすぐ前に記載した5つの基のそれぞれは無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)-ハロアルコキシ、(C_1-C_4)-アルキルチオ、そして環式基の場合は更に (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)-アルキル、そして飽和したヘテロシクリルの場合は更にオキソ、の群から選択される一つ若しくはそれより多い基で置換され、又は、

R^a 及び R^b はそれぞれ互いに独立に水素である。

【0169】

基R¹及びR²の下で記載されているアルキル、アルケニル及びアルキニル基を含んでいる置換基R^a及びR^c又はR^dの例としては、場合によっては一置換又は多置換(多置換の場合は、置換基は同一でも又は異なるものであってもよい。)であるが、本発明に係る使用として既に上記に記載している好適な例示としての化合物である。

【0170】

好ましくは

10

20

30

40

50

R¹は一置換又は多置換の(C₁-C₄)-アルキルであり、当該アルキル基において置換することが可能なものは：

ハロゲン、シアノ、アミノ

又は

(C₁-C₄)-アルコキシ、(C₁-C₄)-ハロアルコキシ、好ましくは(C₁-C₄)-フルオロアルコキシ、(C₁-C₄)-アルコキシ-(C₁-C₄)-アルコキシ、(C₃-C₄)-アルケニルオキシ、(C₃-C₄)-アルキニルオキシ、

【0171】

又は

カルバモイル、モノ-若しくはジ-[(C₁-C₄)-アルキル]カルバモイル、モノ-若しくはジ-[(C₃-C₁₀)-シクロアルキル]カルバモイル、N-(C₁-C₄)-アルコキシ-N-(C₁-C₄)-アルキルカルバモイル、

10

又は

カルボキシル、(C₁-C₁₀)-アルコキシカルボニル、(C₃-C₁₀)-シクロアルコキシカルボニル、(C₁-C₁₀)-アルカノイルオキシ、(C₄-C₁₀)-シクロアルカノイルオキシ、(C₁-C₁₀)-アルコキシカルボニルオキシ、[(C₁-C₁₀)-アルキル]アミノカルボニルオキシ、ジ-[(C₁-C₁₀)-アルキル]アミノカルボニルオキシ、

【0172】

又は

(C₁-C₁₀)-アルキルスルホニルアミノ、(C₁-C₁₀)-アルカノイルアミノ、(C₃-C₁₀)-アルケノイルアミノ、(C₄-C₁₀)-シクロアルカノイルアミノ、(C₃-C₁₀)-シクロアルキル-(C₁-C₄)-アルカノイルアミノ、モノ-若しくはジ-[(C₁-C₁₀)-アルキル]アミノカルボニルアミノ、

20

又は

[(C₁-C₁₀)-アルコキシ]カルボニルアミノ

又は

上記に記載した8基のN-(C₁-C₄)-アルキル類似体

【0173】

又は

(C₁-C₄)-アルキルチオ、(C₁-C₄)-ハロアルキルチオ、好ましくは(C₁-C₄)-フルオロアルキルチオ、(C₃-C₄)-アルケニルチオ、(C₃-C₄)-アルキニルチオ、

30

又は

(C₁-C₁₀)-アルキルスルフィニル、(C₁-C₄)-ハロアルキルスルフィニル、(C₃-C₁₀)-アルケニルスルフィニル、(C₃-C₁₀)-アルキニルスルフィニル、(C₃-C₁₀)-シクロアルキルスルフィニル、(C₄-C₁₀)-シクロアルケニルスルフィニル、(C₃-C₁₀)-シクロアルキル-(C₁-C₄)-アルキルスルフィニル、(C₄-C₁₀)-シクロアルケニル-(C₁-C₄)-アルキルスルフィニル、(C₃-C₁₀)-シクロアルキル-(C₃-C₄)-アルケニルスルフィニル、(C₄-C₁₀)-シクロアルケニル-(C₃-C₄)-アルケニルスルフィニル、(C₁-C₄)-アルキル-(C₃-C₁₀)-シクロアルキルスルフィニル、(C₂-C₄)-アルケニル-(C₃-C₁₀)-シクロアルキルスルフィニル、(C₂-C₄)-アルキニル-(C₃-C₁₀)-シクロアルキルスルフィニル、(C₁-C₄)-アルキル-(C₄-C₁₀)-シクロアルケニルスルフィニル、(C₂-C₄)-アルケニル-(C₄-C₁₀)-シクロアルケニルスルフィニル、(C₂-C₄)-アルキニル-(C₄-C₁₀)-シクロアルケニルスルフィニル

40

【0174】

又は

(C₁-C₁₀)-アルキルスルホニル、(C₁-C₄)-ハロアルキルスルフィニル(haloalkylsulfiny l)、(C₃-C₁₀)-アルケニルスルホニル、(C₃-C₁₀)-アルキニルスルホニル、(C₃-C₁₀)-シクロアルキルスルホニル、(C₄-C₁₀)-シクロアルケニルスルホニル、(C₃-C₁₀)-シクロアルキル-(C₁-C₄)-アルキルスルホニル、(C₄-C₁₀)-シクロアルケニル-(C₁-C₄)-アルキルスルホニル、(C₃-C₁₀)-シクロアルキル-(C₃-C₄)-アルケニルスルホニル、(C₄-C₁₀)-シクロアルケニル-(C₃-C₄)-アルケニルスルホニル、(C₁-C₄)-アルキル-(C₃-C₁₀)-シクロアルキルス

50

ルホニル、(C₂-C₄)-アルケニル-(C₃-C₁₀)-シクロアルキルスルホニル、(C₃-C₄)-アルキニル-(C₃-C₁₀)-シクロアルキルスルホニル、(C₁-C₄)-アルキル-(C₄-C₁₀)-シクロアルケニルスルホニル、(C₃-C₄)-アルケニル-(C₄-C₁₀)-シクロアルケニルスルホニル、モノ-若しくはジ-(C₁-C₁₀)-アルキルアミノスルホニル

【0175】

又は

ジ-(C₁-C₁₀)-アルキルアミノ、(C₁-C₁₀)-アルキルアミノ、(C₃-C₁₀)-アルケニルアミノ、(C₃-C₁₀)-アルキニルアミノ、(C₃-C₁₀)-シクロアルキルアミノ、(C₄-C₁₀)-シクロアルケニルアミノ、(C₃-C₁₀)-シクロアルキル-(C₁-C₄)-アルキルアミノ、(C₄-C₁₀)-シクロアルケニル-(C₁-C₄)-アルキルアミノ、(C₃-C₁₀)-シクロアルキル-(C₃-C₄)-アルケニルアミノ、(C₄-C₁₀)-シクロアルケニル-(C₃-C₄)-アルケニルアミノ、(C₁-C₄)-アルキル-(C₃-C₁₀)-シクロアルキルアミノ、(C₂-C₄)-アルケニル-(C₃-C₁₀)-シクロアルキルアミノ、(C₂-C₄)-アルキニル-(C₃-C₁₀)-シクロアルキルアミノ、(C₁-C₄)-アルキル-(C₄-C₁₀)-シクロアルケニルアミノ、(C₂-C₄)-アルケニル-(C₄-C₁₀)-シクロアルケニルアミノ

10

又は

すぎ前に記載した14の基のN-(C₁-C₄)-アルキルアミノ類似体

又は

ビス-[(C₃-C₁₀)-アルケニル]アミノ、ビス-[(C₃-C₁₀)-アルキニル]アミノ

又は

トリ-[(C₁-C₁₀)-アルキル]シリル

20

【0176】

又は

(C₃-C₁₀)-シクロアルキル、ヘテロシクリル、(C₃-C₁₀)-シクロアルキルカルボニル、ベンゾイル、ヘテロシクリルカルボニル、フェニル-(C₁-C₄)-アルキルカルボニル、(C₃-C₁₀)-シクロアルコキシカルボニル、フェノキシカルボニル、ヘテロシクリルオキシカルボニル、フェニル-(C₁-C₄)-アルコキシカルボニル、フェノキシ、フェニルチオ、フェニルアミノ、N-(C₁-C₄)-アルキル-N-フェニルアミノ、フェニル-(C₁-C₄)-アルコキシ、ヘテロシクリル-(C₁-C₄)-アルコキシ、フェニル-(C₃-C₄)-アルケニルオキシ、フェニル-(C₁-C₄)-アルキルチオ、ヘテロシクリル-(C₁-C₄)-アルキルチオ、フェニル-(C₃-C₄)-アルケニルチオ、フェニル-(C₁-C₄)-アルキルアミノ、N-(C₁-C₄)-アルキル-N-フェニル-(C₁-C₄)-アルキルアミノ、フェニル-(C₃-C₄)-アルケニルアミノ、N-(C₁-C₄)-アルキル-N-フェニル-(C₃-C₄)-アルケニルアミノ、場合によってはN-置換されたフェニルカルバモイル若しくはヘテロシクリルカルバモイル若しくはヘテロシクリル-(C₁-C₄)-アルキルカルバモイル、フェニルスルホニル、場合によってはN-置換されたフェニルスルホニルアミノ、フェニルスルホニル-N-(C₁-C₄)-アルキルスルホニル、場合によってはN-置換されたフェニルアミノスルホニル若しくはフェニルアミノスルホニルアミノ、N-フェニル-N-(C₁-C₁₀)-アルキルアミノスルホニル、ヘテロシクリルスルホニル、場合によってはN-置換されたヘテロシクリルスルホニルアミノ、フェニル-ジ-[(C₁-C₈)-アルキル]シリル、ジフェニル-(C₁-C₈)-アルキルシリル若しくはトリフェニルシリル、

30

ここにおいてすぐ前に記載した39の基の環式部分は無置換であるか又はハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシル、チオ、(C₁-C₄)-アルキル、(C₁-C₄)-ハロアルキル、(C₁-C₄)-アルコキシ、(C₁-C₄)-ハロアルコキシ、(C₁-C₄)-アルキルチオ、(C₁-C₄)-ハロアルキルチオ、(C₁-C₄)-アルキルアミノ及びジ-[(C₁-C₄)-アルキル]アミノの群から選択される一つ若しくはそれより多い基で置換されている。

40

【0177】

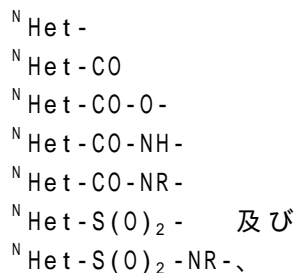
場合によってはN-置換された基(例えば、場合によってはN-置換されたフェニルカルバモイル、ヘテロシクリルカルバモイル、フェニルアミノスルホニル、フェニルスルホニルアミノ)は、好ましくはアミノ基において無置換であるか又は(C₁-C₄)-アルキル、(C₁-C₄)-アルカノイル、[(C₁-C₄)-アルコキシ]カルボニル及びフェニルの群から選択される一つ若しくはそれより多い基で置換され、殊に無置換であるか又は(C₁-C₄)-アルキル及びフ

50

エニルの群から選択される一つ若しくはそれより多い基で置換され、極めて好ましくは(C₁-C₄)-アルキルの群から選択される一つ若しくはそれより多い基で置換されている(後者の場合は、例えば N-フェニル-N-(C₁-C₄)-カルバモイル)。

【0178】

ヘテロシクリルを含んでいる最後に記載した14基は、好ましくは以下の式のものである:



10

【0179】

ここにおいて^NHetは、窒素環原子において自由結合(イル位置)である少なくとも1個の窒素環原子を有する飽和したヘテロシクリル(N-ヘテロシクリル)であり、ここにおいて^NHetは、窒素環原子に加えて、N、O及びSの群から選択される更なるヘテロ環原子を含んでいてもよく、そしてこの更なるヘテロ環原子は、式-O-、-S-、-SO-、-SO₂-、-NH-又は-NR'-の基の二価の基として存在し、ここにおいてR及びR'は互いに独立にそれぞれ(C₁-C₄)-アルキル、(C₁-C₄)-アルカノイル、[(C₁-C₄)-アルコキシ]カルボニル、ジ-[(C₁-C₄)-アルキル]カルバモイル又は場合によっては置換されているフェニルである。

20

好ましくは、Rは(C₁-C₄)-アルキルである。

好ましくは、R'は(C₁-C₄)-アルキル、(C₁-C₄)-アルカノイル又は[(C₁-C₄)-アルコキシ]カルボニルである。

【0180】

好ましいものは、化合物(I)において

R²は場合によっては3個までの同一又は異なる置換基を有するヘテロアリアル又はアリアルで、これらの置換基は(C₁-C₄)-アルキル、(C₁-C₄)-ハロアルキル、ハロゲン又はアルコキシであり、そしてヘテロアリアルは、好ましくはチエニル、フリル、チアゾリル又はピリジル、殊にチエニル又はピリジルである。

30

【0181】

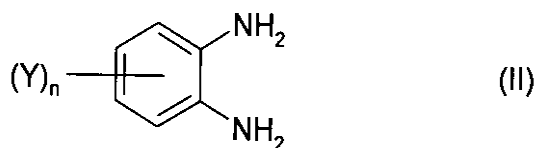
本発明において使用される化合物(I)の例は、以下の表に記載されている。

【0182】

式(I)の化合物は、例えば、

(a) 式(II):

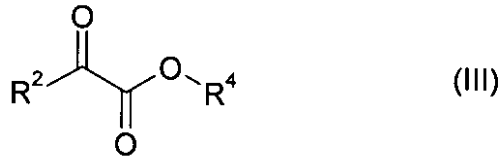
【化2】



40

ここにおいて(Y)_nは式(I)において定義した通りである化合物(II)と、式(III):

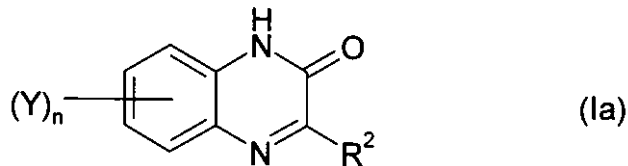
【化 3】



ここにおいて R^2 は式 (I) において定義した通りであり、そして R^4 は水素、場合によっては置換されているアルキル又は場合によっては置換されているアリールである、化合物とを反応させて、

式 (Ia) :

【化 4】



ここにおいて $(\text{Y})_n$ 及び R^2 は式 (I) において定義した通りである、化合物を得る。そしてこの化合物 (Ia) に、

式 (IV) :



ここにおいて R^1 は式 (I) において定義された通りであり、そして L は例えば塩素、臭素、ヨウ素、場合によっては置換されているアルキルスルホニル (好ましくは例えばメチルスルホニル又はエチルスルホニルのような C_1 - C_4)-アルキルスルホニル) 又は場合によっては置換されているアリールスルホニル (好ましくは例えばフェニルスルホニル又は p-トルエンスルホニルのような、場合によっては置換されているアリールスルホニル) のような脱離基である、アルキル化剤と反応させ、

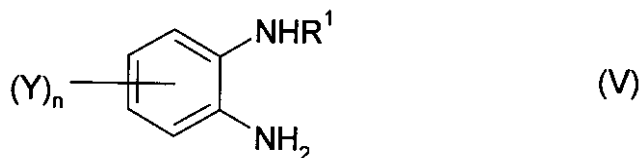
又は、

R^1 がメチル基である特殊な場合においては、アルキル化剤 ジメチルホルムアミド ジメチル アセタールを用いて、式 (I) の化合物又はそれらの塩に変換することができ、

【0183】

(b) 式 (V) :

【化 5】



ここにおいて R^1 及び $(\text{Y})_n$ は式 (I) において定義した通りである化合物を、(a) の下で記載した式 (II) の α -ケト酸誘導体と反応させて、又は

【0184】

(c) 式 (I') :

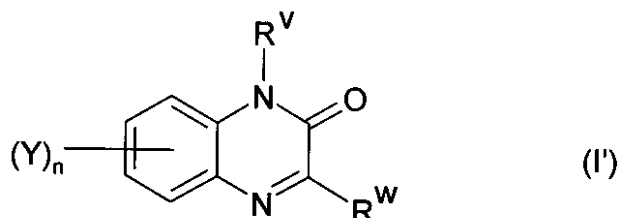
10

20

30

40

【化6】



ここにおいて (Y)_n は式 (I) において定義された通りであり、

基 R^v は R¹ とは異なるが R¹ の前駆体であり、そして基 R^w は R² と同一である、又は

基 R^w は R² とは異なるが R² の前駆体であり、そして基 R^v は R¹ と同一である、式 (I') の化合物を、一つ若しくはそれより多い工程を用いる既知の又は慣用的な方法により、「前駆体」と称する基において誘導化することによって、式 (I) の化合物を得ることができる。

10

20

【0185】

変法 (a) 及び (b) に基づくキノキサリノンを得る環式化は、例えば水中又は不活性有機溶媒中で、20 と 150 との間、好ましくは 50 と 100 との間の温度範囲において行うことができる。好適な有機溶媒は、例えば極性のプロトン又は非プロトン溶媒であり、例えばジエチルエーテル、テトラヒドロフラン及びジオキサンのようなエーテル、又はアセトニトリルのようなニトリル、又はジメチルホルムアミドのようなアミド、又はメタノール若しくはエタノールのようなアルコールが挙げられる。

【0186】

式 (1) の生成物を得るための化合物 (Ia) と式 (IV) のアルキル化剤との反応は、好ましくは不活性有機溶媒中で、酸-結合剤の存在下、20 と 150 との間、好ましくは 50 と 100 との間の温度範囲において行うことができる。好適な有機溶媒は、例えば極性のプロトン又は非プロトン溶媒であり、例えば、テトラヒドロフラン、ジオキサン及びジオキサランのようなエーテル、又はアセトニトリルのようなニトリル、又はジメチルホルムアミドのようなアミド、又はジメチルスルホキシドのようなスルホキシド、又はアセトンのようなケトン、又はメタノール若しくはエタノールのようなアルコールが挙げられる。酸-結合剤には、例えば炭酸ナトリウム、炭酸カリウム若しくは炭酸カルシウムのようなアルカリ金属又はアルカリ土類金属炭酸塩、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム若しくは水酸化カルシウムのようなアルカリ金属又はアルカリ土類金属水酸化物、又は水素化ナトリウム若しくはナトリウムアミド、又は水素化カリウム若しくはカリウムアミドのようなアルカリ金属水素化物又はアミド、又はトリエチルアミン、ピリジン、ジメチルアミノピリジン、DBU (1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]ウンデカ-7-エン)、DBN (1,5-ジアザビシクロ[4.3.0]ノン-5-エン) 及び 1,4-ジアザビシクロ[2.2.2]オクタンのようなその他の有機塩基がある。

30

【0187】

ジメチルホルムアミド ジメチル アセタールの場合は、式 (I) の化合物は、反応相手と直接に又は不活性有機溶媒中で、加熱した温度、便宜的には 80 と 150 との範囲における反応により製造することができる。

40

【0188】

工程 (c) の好適な誘導化反応は、工程 (a) 及び (b) に類似して製造することができ、そしてそれは異なる官能基を有する式 (I) の化合物又はその類似化合物であるといえる式 (I') の化合物から出発するが、これら数多くの反応は当業者にとっては慣用的な又は既知の反応である。ここで、これらの前駆体を誘導化することにより問題としている基 R¹ 及び/又は R² を得ることができる。

【0189】

更に、化合物 (I') のカルボニル基の誘導化、例えば P₂S₅ 又は Lawesson 試薬を用いた硫化反応 (March's Advanced Organic Chemistry, Wiley 2001、1184 頁参照) により、チオン

50

基(式(1))において $X = S$)を得ることができる。

【0190】

式(II)、(III)、(IV)及び(V)の化合物は、商業的に入手可能であるか、又は当業者にとって既知の方法に類似して製造することができる(例えば J. Heterocyclic Chem 31 (1994) 775; Helv. Chim. Acta 35 (1952) 2301; DE 1078131; Tetrahedron 53 (1997) 167 67)。

【0191】

本発明はまた、植物に損傷を引き起こす農薬のような農業化学品殊に除草剤の植物毒性から作物植物又は有用植物を保護するための方法を提供するものであり、その方法は式(I)の化合物又はそれらの塩を薬害軽減剤として使用することを含み、好ましくは有効量の式(I)の化合物又はそれらの塩を植物、植物の部分、又は植物の種子(若しくは苗)に施用するものである。

10

【0192】

当該薬害軽減剤は、活性化合物(有害生物防除剤)と一緒に、数多くの作物植物、例えば穀類(小麦、大麦、ライ小麦(triticale)、ライ麦、イネ、トウモロコシ、アワ・キビ)、砂糖大根、砂糖キビ、菜種、棉及び大豆のような経済的に重要な作物栽培における有害生物の選択的防除に好適である。殊に興味あるものはトウモロコシ及びイネを含んで、穀類(小麦、大麦、ライ麦、ライ小麦、モロコシ)のような単子葉作物及び単子葉の野菜作物のみならず、例えば大豆、菜種、棉、ブドウ、野菜作物、果実植物及び観賞用植物のような双子葉作物である。更に興味あるものは、ある種の有害生物防除剤に対して完全に又は部分的に耐性である突然変異作物又は完全に又は部分的に耐性であるトランスジェニック作物、例えばグルホシネート又はグリホサートに対して耐性であるトウモロコシ、又は除草剤イミダゾリノンに対して耐性である大豆である。しかしながら、当該薬害軽減剤の新規な使用の殊に有利な点は、当該言及した有害生物防除剤に対して通常は十分に耐性でない作物における有効な活性である。

20

【0193】

有害生物防除剤と一緒に使用するためには、本発明に係る式(I)の化合物は、活性化合物と同時に又は如何なる順序においても適用することができ、そして悪く影響することも又は望ましくない有害生物に対する活性化合物の活性を実質的に減少することなく、作物植物における活性化合物の有害な副作用を減少させるか又は完全に除去することができる。ここで、有害生物防除剤の複数の使用、例えば複数の除草剤又は殺虫剤若しくは殺菌剤と除草剤との組合せによる使用によって生じた損傷であっても、実質的に減少し又は完全に除去することができる。この仕方によって、従来除草剤の使用分野をかなり広く展開することが可能となる。

30

【0194】

もしも本発明に係る組成物が有害生物防除剤を含んでいるときは、これらの組成物は適当に希釈した後に、栽培中の場所に、既に発芽した有害及び/又は有用な植物に、又は既に出芽した有害及び/又は有用な植物に直接適用することができる。もしも、本発明に係る組成物が有害生物防除剤を含んでいないときは、これらの組成物は、タンクミックス法即ち、使用者は別々に使用することができる製品(=有害生物防除剤及び有用植物を保護する薬剤)を処理すべき場所に施用する直前に混合しそして希釈することができる方法により有害生物防除剤を処理する前に、又は有害生物防除剤を処理した後に、又は種子の前処理として、即ち、例えば有用植物の種子の粉衣として、使用することができる。

40

【0195】

本発明に係る式(I)の化合物の有利な活性は、それらが発芽前処理方法又は発芽後処理方法により、例えば、タンクミックス若しくは共製剤のような同時適用の場合、又は並行して若しくは連続して別々に適用する場合(分割処理)において、有害生物防除剤と一緒に使用したときに観察される。この適用はまた数回に亘って繰り返すことも可能である。ある場合には、発芽前処理と発芽後処理とを組合せることが好都合なこともある。多くの場合、一つの選択としては、有害生物防除剤との同時処理又は後続的処理と一緒に、有

50

用植物又は作物植物に対する発芽後処理がある。更に、本発明に係る式(Ⅰ)の化合物の使用の可能性としては、種子粉衣、苗(例えばイネ)の(浸漬)処理又は他の増殖部位(例えばジャガイモの塊茎)の処理がある。

【0196】

本発明に係る式(Ⅰ)の化合物を除草剤と組合せて使用するときには、薬害軽減作用に加えて、有害植物に対する作用、例えば除草剤作用の増強がしばしば観察される。更に、多くの場合、有用植物又は作物植物の生育増強も見られ、そして収穫量を増加させることも可能である。

尚、最後に記載した有利な作用のいくつかは、本発明に係る式(Ⅰ)の化合物を有害生物防除剤なしで使用した場合でも、殊に他の環境要因が植物の生育に悪く影響する場合には観察される。

10

【0197】

本発明に係る組成物は一つ若しくはそれより多い有害生物防除剤を含むことができる。好適な有害生物防除剤は、例えば、除草剤、殺虫剤、殺菌剤、殺ダニ剤及び殺線虫剤であり、それだけで使用した場合には、作物植物に対して植物毒性の損傷を生じるか又はおそらく損傷を引き起こすものである。特に興味あるものは、対応する除草剤、殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤及び殺菌剤、殊に除草剤の群から選択される有害生物防除剤として活性化化合物である。

【0198】

有害生物防除剤に対する薬害軽減剤の質量比は広い範囲で変化することができるが、通常は1:100から100:1の範囲であり、好ましくは1:20から20:1、殊に1:10から10:1の範囲である。有害生物防除剤に対する薬害軽減剤の最適な質量比は、使用する薬害軽減剤及び有害生物防除剤の如何により、また保護すべき有用植物又は作物植物の種類の種類に如何にもよる。薬害軽減剤の要求される施用量は、使用する有害生物防除剤及び保護すべき有用植物の種類の種類によって広い範囲で変化することができるが、一般にはヘクタール当たりの薬害軽減剤の量は0.001から10kg、好ましくは0.005から5kg、殊に0.1から1kgである。処理を成功させるために要求される質量比及び量は簡単な予備実験により決定することができる。

20

【0199】

種子粉衣のためには、種子1キログラム当たり薬害軽減剤を、例えば0.005から20g、好ましくは種子1キログラム当たり薬害軽減剤を0.01から10g、殊に種子1キログラム当たり薬害軽減剤を0.05から5gが使用される。

30

【0200】

もしも薬害軽減剤の溶液を種子粉衣のために使用し、そして種子及び苗を当該溶液で湿らす場合は、好適な濃度は一般に質量当たり1から10000ppm、好ましくは100から1000ppmの範囲である。処理を成功させるために要求される質量比及び量は簡単な予備実験により決定することができる。

【0201】

当該薬害軽減剤は、有害生物防除剤とは別々に又は一緒に、慣用的な仕方で製剤することができる。それ故、本発明はまた有用植物-保護組成物又は作物植物-保護組成物をも提供するものである。

40

【0202】

好ましくは薬害軽減剤と有害生物防除剤との併合処理であり、殊に薬害軽減剤と除草剤のレディーミックス(readymix)としての併合処理、又はタンクミックス法による使用である。

【0203】

それのみで又は除草剤と一緒に使用したときに植物に対して損傷を引き起こすおそれのある殺虫剤には、例えば、以下のものである：

有機リン剤、例えばテルブホス(カウンター:Counter(登録商標))、ホノホス(ダイホネート:Dyfonate(登録商標))、ホレート(サイメット:Thimet(登録商標))、クロ

50

ルピリホス (レルダン : Reldan (登録商標))、カルボフラン(フラダン : Furadan (登録商標))のようなカーバメート剤、テフルトリン (ホルセ : Force (登録商標))、デルタメトリン (デシス : Decis (登録商標)) 及びトラロメトリン (スカウト : Scout (登録商標))のようなピレスロイド殺虫剤、及び異なる作用機構を有するその他の殺虫剤。

【0204】

作物植物に対する植物毒性の副作用が式(I)の化合物を用いて減少することができる除草剤は、構造的に完全に異なりそして全く異なる作用機構を有する。好適なものは例えば、ハンドブック「The Pesticide Manual」、13版 2003、The British Crop Protection Council、及び the e-Pesticide Manual Version 3 (2003)、又はその他「Compendium of Pesticide Common Names」(インターネットで検索可能)及びそこに引用されている文献に記載されている商業的に入手可能な除草剤である。これより以下に例として記載する除草剤及び植物成長調節剤は、それぞれの場合、「国際標準化機構」(ISO)に基づく標準化された一般的な活性化化合物名で表記しているか、又は化学名若しくはコード番号で表記している。作物植物及び有用植物に対する植物毒性作用が、本発明に係る化合物(I)を用いることによって減少される活性化化合物の例としては：

アセトクロール；アシフルオルフェン(-ナトリウム)；アクロニフェン；AKH7088、即ち、[[[1-[5-[2-クロロ-4-(トリフルオロメチル)-フェノキシ]-2-ニトロフェニル]-2-メトキシエチリデン]アミノ]オキシ]酢酸及びそのメチルエステル；アラクロール；アロキシジム(-ナトリウム)；アメトリン；アミカルバゾン；アミドクロール；アミドスルフロン；アミノピラリド；アミトロール；AMS、即ち、スルファミン酸アンモニウム；アニロホス；アシュラム；アトラジン；アザフェニジン；アジムスルフロン(DPX-A8947)；アジプロトリン；バルバン；BAS516H、即ち、5-フルオロ-2-フェニル-4H-3,1-ベンゾオキサジン-4-オン；ベフルブタミド；ベナゾリン(-エチル)；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(-ナトリウム)；ベンスフェンジゾン；ベンゾピシクロン；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；ピアラホス(ピラナホス)；ピフェノックス；ビスピリバック(-ナトリウム)；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；プミナホス；プソキシノン；ブタクロール；ブタフェナシル；ブタミホス；ブテナクロール；ブチダゾール；ブトラリン；ブトロキシジム；ブチレート；カフェンストロール(CH-900)；カルベタミド；カフェントラゾン(-エチル)；カロキシジム；CDA A、即ち、2-クロロ-N,N-ジ-2-プロペニルアセトアミド；CDEC、即ち、ジエチルジチオカルバミン酸2-クロロアリル；クロメトキシフェン；クロランベン；クロラジホップ-ブチル；クロルプロムロン；クロルブファム；クロルフェナック；クロルフェンプロップ；クロルフルレノール-メチル；クロリダゾン；クロリムロン(-エチル)；クロルニトロフェン；クロロトルロン；クロロクスロン；クロルプロファム；クロルスルフロン；クロルタール-ジメチル；クロルチアミド；クロルトルロン；シニドン(-メチル又は-エチル)；シンメチリン；シノスルフロン；クレトジム；クレホキシジム；クロジナホップ及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；クロプロップ；クロプロキシジム；クロピラリド；クロピラスルフロン(-メチル)；クロランシュラム(cloransulam)(-メチル)；クミルロン(JC940)；シアナジン；シクロエート；シクロスルファムロン(AC104)；シクロキシジム；シクルロン；シハロホップ及びそのエステル誘導体(例えばブチルエステル、DEH-112)；シペルコート；シプラジン；シプラゾール；ダイムロン；2,4-D；2,4-DB；ダラボン；ダゾメット；デスメデイファム；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(-P)；ジクロホップ及びジクロホップ-メチルのようなエステル；ジクロシュラム(diclosulam)；ジエタチル(-エチル)；ジフェノキスロン；ジフェンゾコート；ジフルフェニカン；ジフルフェンゾピル(-ナトリウム)；ジメフロン；ジメピレート；ジメタクロール；ジメタメトリン；ジメテナミド(SAN-582H)；ジメテナミド(-P)；ジメタゾン；ジメチピン；ジメキシ

10

20

30

40

50

フラム；ジメトラスルフロロン；ジニトラミン；ジノセブ；ジノテルブ；ジフェナミド；ジ
 プロベトリン；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 7 7、即ち、5 - シアノ - 1 - (1 , 1 - ジメチルエチル) - N - メチル - 1 H - ピ
 ラゾール - 4 - カルボキサミド；エンドタール；エポプロダン；E P T C；エスプロカル
 ブ；エタルフルラリン；エタメトスルフロロン - メチル；エチジムロン；エチオジン；エト
 フメセート；エトキシフェン及びそのエステル（例えばエチルエステル、H C - 2 5 2 ）
 ；エトキシスルフロロン；エトベンザニド（H W 5 2 ）；F 5 2 3 1、即ち、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 - 1 H - テトラゾール - 1 - イル] フェニル] エタンスルホンアミド；フェノプロッ
 プ；フェノキサジン；フェノキサプロップ及びフェノキサプロップ - P 及びそれらのエステ
 ル、例えばフェノキサプロップ - P - エチル及びフェノキサプロップ - エチル；フェノキ
 シジム；フェントラザミド；フェニユロン；フラムプロップ（ - メチル又は - イソプロピ
 ル又は - イソプロピル - L ）；フラザスルフロロン；フロラシュラム (florasulam)；フルア
 ジホップ及びフルアジホップ - P 及びそれらのエステル、例えばフルアジホップ - ブチル
 及びフルアジホップ - P - ブチル；フルアゾレート；フルカルバゾン（ - ナトリウム ）；
 フルセトスルフロロン；フルクロラリン；フルフェナセット（F O E 5 0 4 3 ）；フルフ
 ェンピル（ - エチル ）；フルメツラム (flumetsulam)；フルメツロン；フルミクロラック
 - (- ペンチル)；フルミオキサジン（S - 4 8 2 ）；フルミプロピン；フルオメツロン
 ；フルオロクロリドン；フルオロジフェン；フルオログリコフェン（ - エチル ）；フルボ
 キサム（K N W - 7 3 9 ）；フルプロパシル（U B I C - 4 2 4 3 ）；フルプロアネート
 ；フルビルスルフロロン（ - メチル、又は - ナトリウム ）；フルレノール（ - ブチル ）；フル
 リドン；フルロクロリドン；フルロキシピル（ - メチル ）；フルルプリミドール；フル
 ルルタモン；フルチアセット（ - メチル ）；フルチアミド（フルフェナセットとしても知
 られている）；ホメサフェン；ホラムスルフロロン；ホサミン；フリラゾール（M O N 1
 3 9 0 0 ）；フリロキシフェン；グルホシネート（ - アンモニウム ）；グリホサート（ -
 イソプロピルアンモニウム ）；ハロサフェン；ハロスルフロロン（ - メチル ）及びそのエステ
 ル（例えばメチルエステル、N C - 3 1 9 ）；ハロキシホップ及びそのエステル；ハロ
 キシホップ - P（ = R - ハロキシホップ ）及びそのエステル；H C - 2 5 2（ジフェニル
 エーテル）；ヘキサジノン；イマザメタベンズ（ - メチル ）；イマザメタピル；イマザモ
 ックス；イマザピック；イマザピル；イマザキン及びそのアンモニウム塩のような塩；イ
 マゼタメタピル；イマゼタピル；イマゾスルフロロン；インダノファン；ヨードスルフロ
 ン（ - メチル ）（ - ナトリウム ）；アイオキシニル；イソカルバミド；イソプロパリン；イ
 ソプロツロン；イソウロン；イソキサベン；イソキサクロルトール；イソキサフルトール
 ；イソキサピリホップ；カルブチレート；ラクトフェン；レナシル；リニユロン；M C P
 A；M C P A - チオエチル；M C P B；メコプロップ（ - P ）；メフェナセット；メフル
 イジド；メソスルフロロン（ - メチル ）；メソトリオン；メタム；メタミホップ；メタミト
 ロン；メタザクロール；メタベンズチアズロン；メタゾール；メトキシフェノン；メチル
 ダイムロン；メトベンズロン；メトブロムロン；（ S - ）メトラクロール；メトシュラム
 (metosulam)（X R D 5 1 1 ）；メトキスロン；メトリブジン；メトスルフロロン - メチル
 ；M K - 6 1 6；モリネート；モナリッド；硫酸二水素モノカルバミド；モノリニユロン
 ；モニユロン；M T 1 2 8、即ち、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 - ピリダジンアミン；M T 5 9 5 0、即ち、N - [3 -
 クロロ - 4 - (1 - メチルエチル) フェニル] - 2 - メチルペンタンアミド；ナプロアニ
 リド；ナプロパミド；ナプタラム；N C 3 1 0、即ち、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；ニコスルフロロン；ニピ
 ラクロフェン；ニトラリン；ニトロフェン；ニトロフルオルフェン；ノルフルラゾン；オ
 ルベンカルブ；オトスルファミロン；オリザリン；オキサジアルギル（R P - 0 2 0 6 3
 0 ）；オキサジアゾン；オキサスルフロロン；オキサジクロメホン；オキシフルオルフェン
 ；パラコート；ペプレート；ペラルゴン酸；ペンデイメタリン；ペノキスラム；ペンタノ
 クロール；ペントキサゾン；ペルフルイドン；ペントキサミド；フェニソファミン；フェン

10

20

30

40

50

メデイファミン；ピクロラム；ピコリナフェン；ピノキサデン；ピペロホス；ピリブチカルブ；ピリフェノップ - ブチル；プレチラクロール；プリミスルフロソ (-メチル)；プロカルバゾン (-ナトリウム)；プロシアジン；プロジアミン；プロフルアゾール；プロフルラリン；プロホキシジム；プログリナジン (-エチル)；プロメトン；プロメトリン；プロバクロール；プロパニル；プロパキザホップ；プロパジン；プロファミン；プロピソクロール；プロボキシカルバゾン (-ナトリウム)；プロピザミド；プロスルファリン；プロスルホカルブ；プロスルフロソ (CGA - 152005)；プリナクロール；ピラクロニル；ピラフルフェン (-エチル)；ピラゾリネート；ピラゾン；ピラゾスルフロソ (-エチル)；ピラゾキシフェン；ピリベンゾキシム；ピリブチカルブ；ピリダホール；ピリデート；ピリフタリド；ピリミドバク (-メチル)；ピリミフルファン；ピリチオバク (-ナトリウム) (KIH - 2031)；ピロキソホップ及びそのエステル (例えばプロバルギルエステル)；キンクロラック；キンメラック；キノクラミン；キノホップ及びそのエステル誘導体；キザロホップ及びキザロホップ - P及びそれらのエステル誘導体、例えばキザロホップ - エチル；キザロホップ - P - テフリル及び - エチル；レンリデュロン；リムスルフロソ (DPX - E 9636)；S 275、即ち、2 - [4 - クロロ - 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；シデュロン；シマジン；シメトリン；SN 106279、即ち、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]プロピオン酸及びそのメチルエステル；スルコトリオン；スルフェントラゾン (FMC - 97285、F - 6285)；スルファズロン；スルホメツロン (-メチル)；スルホセート (ICI - A0224)；スルホスルフロソ；TCA；テブタム (GCP - 5544)；テブチウロン；テプラルオキシジム (tepraloxym)；ターバシル；テルブカルブ；テルブクロール；テルブメトン；テルブチラジン；テルブトリン；TFH 450、即ち、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；テニルクロール (NSK - 850)；チアフルアミド；チアザフルロン；チアゾピル (Mon - 13200)；チジアジミン (SN - 24085)；チジアズロン；チフェンスルフロソ (-メチル)；チオベンカルブ；チオカルバジル；トブラメゾン；トラルコキシジム；トリアレート；トリアスルフロソ；トリアジフラム；トリアゾフェナミド；トリベニユロン (-メチル)；2、3、6 - トリクロロ安息香酸 (2、3、6 - TBA)；トリクロピル；トリジファン；トリエタジン；トリフロキシスルフロソ (-ナトリウム)；トリフルラリン；トリフルスルフロソ及びそのエステル (例えばメチルエステル、DPX - 66037)；トリメツロン；トリトスルフロソ；チトデフ (tsitodef)；バーナレート；WL 110547、即ち、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；UBH - 509；D - 489；LS 82 - 556；KPP - 300；NC - 324；NC - 330；KH - 218；DPX - N8189；SC - 0774；DOWCO - 535；DK - 8910；V - 53482；PP - 600；MBH - 001；KIH - 9201；ET - 751；KIH - 6127；KIH - 2023及びKIH 5996がある。

10

20

30

40

50

【0205】

作物植物に対する植物毒性の副作用が式 (I)の化合物を用いることによって減少される除草剤には、例えばカーバメート系、チオカーバメート系、ハロアセトアニリド系；キノリルオキシ-、キノキサリルオキシ-、ピリジルオキシ-、ベンゾキサゾリルオキシ-及びベンゾチアゾリルオキシフェノキシアルカンカルボン酸エステルのような置換したフェノキシ-、ナフトキシ-及びフェノキシフェノキシカルボン酸誘導体及びヘテロアリアルオキシフェノキシアルカンカルボン酸誘導体；シクロヘキサジオンオキシム系、ベンゾイルシクロヘキサジオン系、ベンゾイルイソキサゾール系、ベンゾイルピラゾール系、イミダゾリノン系、ピリミジニルオキシピリジンカルボン酸誘導体、ピリミジルオキシ安息香酸誘導体、スルホニルウレア系、スルホニルアミノカルボニルトリアゾリノン系、トリアゾロピリミジンスルホンアミド誘導体、ホスフィン酸誘導体及びそれらの塩、グリシン誘

導体、トリアゾリノン系、トリアジノン系及びS-(N-アリール-N-アルキルカルバモイルメチル)ジチオリン酸エステル系、ピリジンカルボン酸系、ピリジン系、ピリジンカルボキサミド系、1,3,5-トリアジン系及びその他の群からの除草剤がある。

【0206】

好ましいものは、フェノキシフェノキシ-及びヘテロアリールオキシフェノキシカルボン酸エステル及び塩、シクロヘキサンジオンオキシム系、ベンゾイルシクロヘキサンジオン系、ベンゾイルイソキサゾール系、ベンゾイルピラゾール系、スルホニルウレア系、スルホニルアミノカルボニルトリアゾリノン系、イミダゾリノン系及び上述の活性化化合物のそれぞれの混合物、及び/又は除草剤の活性スペクトルを拡大するために使用される活性化化合物、例えばペンタゾン、シアナジン、アトラジン、プロモキシニル、ジカンバ及びその他の葉面作用(leaf-acting)の除草剤との混合物である。

10

【0207】

本発明に係る薬害軽減剤との組合せに好適な除草剤は、例えば：

A) フェノキシフェノキシ-及びヘテロアリールオキシフェノキシカルボン酸誘導体系の除草剤、例えば

A1) フェノキシフェノキシ-及びベンジルオキシカルボン酸誘導体、例えば2-(4-(2,4-ジクロロフェノキシ)フェノキシ)プロピオン酸メチル(ジクロホップ-メチル)、

2-(4-(4-プロモ-2-クロロフェノキシ)フェノキシ)プロピオン酸メチル (DE-A 26 01 54 8)、

2-(4-(4-プロモ-2-フルオロフェノキシ)フェノキシ)プロピオン酸メチル (US-A 4,808, 750)、

2-(4-(2-クロロ-4-トリフルオロメチルフェノキシ)フェノキシ)プロピオン酸メチル (D E-A 24 33 067)、

2-(4-(2-フルオロ-4-トリフルオロメチルフェノキシ)フェノキシ)プロピオン酸メチル (US-A 4,808,750)、

2-(4-(2,4-ジクロロベンジル)フェノキシ)プロピオン酸メチル (DE-A 24 17 487)、

4-(4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)フェノキシ)ペンタ-2-エン酸エチル、

2-(4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)フェノキシ)プロピオン酸メチル (DE-A 24 33 067)、

(R)-2-[4-(4-シアノ-2-フルオロフェノキシ)フェノキシ]プロピオン酸ブチル(シハ口ホ ス-ブチル)

30

【0208】

A2) 「単環式」ヘテロアリールオキシフェノキシアルカンカルボン酸誘導体、例えば

2-(4-(3,5-ジクロロピリジル-2-オキシ)フェノキシ)プロピオン酸エチル (EP-A 0 002 925)、

2-(4-(3,5-ジクロロピリジル-2-オキシ)フェノキシ)プロピオン酸プロパルギル (EP-A 0 003 114)、

(RS)- 又は(R)-2-(4-(3-クロロ-5-トリフルオロメチル-2-ピリジルオキシ)フェノキシ)プロピオン酸メチル (ハロキシホップ-メチル又はハロキシホップ-P-メチル)、

2-(4-(3-クロロ-5-トリフルオロメチル-2-ピリジルオキシ)フェノキシ)プロピオン酸エチル (EP-A 0 003 890)、

40

2-(4-(5-クロロ-3-フルオロ-2-ピリジルオキシ)フェノキシ)プロピオン酸プロパルギル (クロジナホップ-プロパルギル)、

(RS)- 又は(R)-2-(4-(5-トリフルオロメチル-2-ピリジルオキシ)フェノキシ)プロピオン酸ブチル (フルアジホップ-ブチル又はフルアジホップ-P-ブチル)、

(R)-2-[4-(3-クロロ-5-トリフルオロメチル-2-ピリジルオキシ)フェノキシ]プロピオン酸

【0209】

A3) 「二環式」ヘテロアリールオキシフェノキシアルカンカルボン酸誘導体、例えば

(RS)- 又は(R)-2-(4-(6-クロロ-2-キノキサリルオキシ)フェノキシ)プロピオン酸メチ

50

ル及びエチル (キザロホップ-メチル及び?エチル又はキザロホップ-P-メチル及び-P-エチル)、

2-(4-(6-フルオロ-2-キノキサリルオキシ)フェノキシ)プロピオン酸メチル (J. Pest. Sci. Vol. 10, 61 (1985) 参照)、

(R)-2-(4-(6-クロロ-2-キノキサリルオキシ)フェノキシ)プロピオン酸 2-イソプロピリデンアミノオキシエチル (プロパキザホップ)、

(RS)- 又は(R)-2-(4-(6-クロロベンゾキサゾル-2-イルオキシ)フェノキシ)プロピオン酸エチル (フェノキサプロップ-エチル又はフェノキサプロップ-P-エチル)、

2-(4-(6-クロロベンズチアゾル-2-イルオキシ)フェノキシ)プロピオン酸エチル (DE-A-26 40 730),

(RS)- 又は(R)-2-(4-(6-クロロキノキサリルオキシ)フェノキシ)プロピオン酸 テトラヒドロ-2-フリルメチル (EP-A-0 323 727);

【0210】

B) ピリミジニル-又はトリアジニルアミノカルボニル[ベンゼン-, -ピリジン-, -ピラゾール-, -チオフェン-及び-(アルキルスルホニル)アルキルアミノ]スルファミドのようなスルホニルウレア系の除草剤。ピリミジン環又はトリアジン環上の好ましい置換基は、アルコキシ、アルキル、ハロアルコキシ、ハロアルキル、ハロゲン又はジメチルアミノであり、全ての置換基は互いに独立に組合せることが可能である。ベンゼン、ピリジン、ピラゾール、チオフェン又は(アルキルスルホニル)アルキルアミノ基中の好ましい置換基は、アルキル、アルコキシ、ハロゲン、ニトロ、アルコキシカルボニル、アミノカルボニル、アルキルアミノカルボニル、ジアルキルアミノカルボニル、アルコシリアミノカルボニル、ハロアルコキシ、ハロアルキル、アルキルカルボニル、アルコシリアルキル、(アルカンスルホニル)アルキルアミノである。そのような好適なスルホニルウレア系は、例えば、

【0211】

B1) フェニル-及びベンジルスルホニルウレア系、並びに関連する化合物、例えば

1-(2-クロロフェニルスルホニル)-3-(4-メトキシ-6-メチル-1,3,5-トリアジン-2-イル)ウレア (クロルスルフロン)、

1-(2-エトキシカルボニルフェニルスルホニル)-3-(4-クロロ-6-メトキシピリミジン-2-イル)ウレア (クロリムロン-エチル)、

1-(2-メトキシフェニルスルホニル)-3-(4-メトキシ-6-メチル-1,3,5-トリアジン-2-イル)ウレア (メトスルフロン-メチル)、

1-(2-クロロエトキシフェニルスルホニル)-3-(4-メトキシ-6-メチル-1,3,5-トリアジン-2-イル)ウレア (トリアスルフロン)、

1-(2-メトキシカルボニルフェニルスルホニル)-3-(4,6-ジメチルピリミジン-2-イル)ウレア (スルフメツロン-メチル)、

1-(2-メトキシカルボニルフェニルスルホニル)-3-(4-メトキシ-6-メチル-1,3,5-トリアジン-2-イル)-3-メチルウレア (トリベニューロン-メチル)、

1-(2-メトキシカルボニルベンジルスルホニル)-3-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)ウレア (ベンスルフロン-メチル)、

1-(2-メトキシカルボニルフェニルスルホニル)-3-(4,6-ビス-(ジフルオロメトキシ)ピリミジン-2-イル)ウレア (プリミスルフロン-メチル)、

3-(4-エチル-6-メトキシ-1,3,5-トリアジン-2-イル)-1-(2,3-ジヒドロ-1,1-ジオキソ-2-メチルベンゾ[b]チオフェン-7-スルホニル)ウレア (EP-A 0 796 83)、

3-(4-エトキシ-6-エチル-1,3,5-トリアジン-2-イル)-1-(2,3-ジヒドロ-1,1-ジオキソ-2-メチルベンゾ[b]チオフェン-7-スルホニル)ウレア (EP-A 0 079 683)、

3-(4-メトキシ-6-メチル-1,3,5-トリアジン-2-イル)-1-(2-メトキシカルボニル-5-ヨードフェニルスルホニル)ウレア (WO 92/13845)、

2-[4-ジメチルアミノ-6-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)-1,3,5-トリアジン-2-イルカルバモイルスルファミル]-3-メチル安息香酸メチル (DPX-66037、トリフルスルフロン-メ

10

20

30

40

50

チル)、

2-[(4,6-ジメチルピリミジン-2-イル)カルバモイルスルファモイル]安息香酸オキセタン-3-イル (CGA-277476、オキサスルフロ)、

4-ヨード-2-[3-(4-メトキシ-6-メチル-1,3,5-トリアジン-2-イル)ウレイドスルホニル]安息香酸メチル、ナトリウム塩 (ヨードスルフロ-メチル-ナトリウム)、

2-[3-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)ウレイドスルホニル]-4-メタンスルホニルアミノメチル安息香酸メチル (メソスルフロ-メチル、WO 95/10507)、

N,N-ジメチル-2-[3-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)ウレイドスルホニル]-4-ホルミルアミノベンズアミド (ホラムスルフロ、WO 95/01344)、

1-(4,6-ジメトキシ-1,3,5-トリアジン-2-イル)-3-[2-(2-メトキシエトキシ)フェニルスルホニル]ウレア (シノスルフロ)、 10

2-[(4-エトキシ-6-メチルアミノ-1,3,5-トリアジン-2-イル)カルバモイルスルファモイル]安息香酸メチル (エタメトスルフロ-メチル)、

1-(4-メトキシ-6-メチル-1,3,5-トリアジン-2-イル)-3-[2-(3,3,3-トリフルオロプロピル)フェニルスルホニル]ウレア (プロスルフロ)、

2-(4,6-ジメチルピリミジン-2-イルカルバモイルスルファモイル)安息香酸メチル (スルホメツロン-メチル)、

1-(4-メトキシ-6-トリフルオロメチル-1,3,5-トリアジン-2-イル)-3-(2-トリフルオロメチルベンゼンスルホニル)ウレア (トリトスルフロ);

【0212】

20

B2) チエニルスルホニルウレア系、例えば

1-(2-メトキシカルボニルチオフェン-3-イル)-3-(4-メトキシ-6-メチル-1,3,5-トリアジン-2-イル)ウレア (チフェンスルフロ-メチル);

【0213】

B3) ピラゾリルスルホニルウレア系、例えば

1-(4-エトキシカルボニル-1-メチルピラゾール-5-イルスルホニル)-3-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)ウレア (ピラゾスルフロ-エチル)、

3-クロロ-5-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イルカルバモイルスルファモイル)-1-メチルピラゾール-4-カルボン酸メチル (ハロスルフロ-メチル)、

5-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イルカルバモイルスルファモイル)-1-(2-ピリジル)ピラゾール-4-カルボン酸メチル (NC-330、Brighton Crop Prot. Conference 「Weeds」 1991、1巻、45頁 ff. 参照)、 30

1-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)-3-[1-メチル-4-(2-メチル-2H-テトラゾール-5-イル)ピラゾール-5-イルスルホニル]ウレア (DPX-A8947、アジムスルフロ);

【0214】

B4) スルホンジアミド誘導体、例えば

3-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)-1-(N-メチル-N-メチルスルホニルアミノスルホニル)ウレア (アミドスルフロ)及びその構造的類似体(EP-A 0 131 258及び Z. Pfl. K rankh. Pfl. Schutz、特別号 XII、489-497 (1990));

【0215】

40

B5) ピリジルスルホニルウレア系、例えば

1-(3-N,N-ジメチルアミノカルボニルピリジン-2-イルスルホニル)-3-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)ウレア (ニコスルフロ)、

1-(3-エチルスルホニルピリジン-2-イルスルホニル)-3-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)ウレア (リムスルフロ)、

2-[3-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)ウレイドスルホニル]-6-トリフルオロメチル-3-ピリジンカルボン酸メチル、ナトリウム塩 (DPX-KE 459、フルピルスルフロ-メチル-ナトリウム)、

3-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)-1-(3-N-メチルスルホニル-N-メチルアミノピリジン-2-イル)スルホニルウレア又はその塩 (DE-A 40 00 503 及び DE-A 40 30 577)、 50

1-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)-3-(3-トリフルオロメチル-2-ピリジルスルホニル)ウレア (フラザスルフロソ)、

1-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)-3-[3-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)-2-ピリジルスルホニル]ウレア ナトリウム塩 (トリフロキシスルフロソ-ナトリウム);

【0216】

B6) アルコキシフェノキシスルホニルウレア系、例えば

3-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)-1-(2-エトキシフェノキシ)スルホニルウレア又はその塩 (エトキシスルフロソ);

【0217】

B7) イミダゾリルスルホニルウレア系、例えば

1-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)-3-(2-エチルスルホニルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)スルホニルウレア (MON 37500、スルホスルフロソ)、

1-(2-クロロイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イルスルホニル)-3-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)ウレア (イマゾスルフロソ);

【0218】

B8) フェニルアミノスルホニルウレア系、例えば

1-[2-(シクロプロピルカルボニル)フェニルアミノスルホニル]-3-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)ウレア (シクロスルファミソ);

【0219】

C) クロロアセトアニリド系、例えば

アセトクロール、アラクロール、ブタクロール、ジメタクロール、ジメテナミド、メタザクロール、メトラクロール、S-メトラクロール、ペトキサミド、プレチラクロール、プロバクロール、プロピソクロール及びテニルクロール;

【0220】

D) チオカーバメート系、例えば

N,N-ジプロピルチオカルバミン酸 S-エチル (EPTC)、

N,N-ジイソブチルチオカルバミン酸 S-エチル (ブチレート);

シクロエート、ジメピレート、エスプロカルブ、モリネート、オルベンカルブ、ペレート、プロスルホカルブ、チオベンカルブ、チオカルバジル及びトリアレート;

【0221】

E) シクロヘキサジオンオキシム系、例えば

アロキシジム、プトロキシジム、クレトジム、クロプロキシジム、シクロキシジム、プロトキシジム、セトキシジム、テブラロキシジム及びトラルコキシジム;

【0222】

F) イミダゾリノン系、例えば

イマザメタベンズ-メチル、イマザピック、イマザモックス、イマザピル、イマザキン及びイマゼタピル;

【0223】

G) トリアゾロピリミジンスルホンアミド誘導体、例えば

クロランシュラム-メチル (chloransulam-methyl)、ジクロシュラム (diclosulam)、フロラシュラム (florasulam)、フルメツラム (flumetsulam)、メトシュラム (metosulam) 及びペノクスラム (penoxulam);

【0224】

H) ベンゾイルシクロヘキサジオン系、例えば

2-(2-クロロ-4-メチルスルホニルベンゾイル)シクロヘキサン-1,3-ジオン (SC-0051、スルコトリオン)、

2-(2-ニトロベンゾイル)-4,4-ジメチルシクロヘキサン-1,3-ジオン (EP-A 0 274 634)

、

2-(2-ニトロ-3-メチルスルホニルベンゾイル)-4,4-ジメチルシクロヘキサン-1,3-ジオン (WO 91/13548)、

10

20

30

40

50

2-[4-(メチルスルホニル)-2-ニトロベンゾイル]-1,3-シクロヘキサンジオン (メソトリオン);

2-[2-クロロ-3-(5-シアノメチル-4,5-ジヒドロイソキサゾール-3-イル)-4-(エチルスルホニル)ベンゾイル]-1,3-シクロヘキサンジオン、

2-[2-クロロ-3-(5-シアノメチル-4,5-ジヒドロイソキサゾール-3-イル)-4-(メチルスルホニル)ベンゾイル]-1,3-シクロヘキサンジオン、

2-[2-クロロ-3-(5-エトキシメチル-4,5-ジヒドロイソキサゾール-3-イル)-4-(エチルスルホニル)ベンゾイル]-1,3-シクロヘキサンジオン、

2-[2-クロロ-3-(5-エトキシメチル-4,5-ジヒドロイソキサゾール-3-イル)-4-(メチルスルホニル)ベンゾイル]-1,3-シクロヘキサンジオン、

2-[2-クロロ-3-[(2,2,2-トリフルオロエトキシ)メチル]-4-(エチルスルホニル)ベンゾイル]-1,3-シクロヘキサンジオン、

2-[2-クロロ-3-[(2,2,2-トリフルオロエトキシ)メチル]-4-(メチルスルホニル)ベンゾイル]-1,3-シクロヘキサンジオン、

2-[2-クロロ-3-[(2,2-ジヒドロエトキシ)メチル]-4-(エチルスルホニル)ベンゾイル]-1,3-シクロヘキサンジオン、

2-[2-クロロ-3-[(2,2-ジフルオロエトキシ)メチル]-4-(メチルスルホニル)ベンゾイル]-1,3-シクロヘキサンジオン、

2-[2-クロロ-3-[(2,2,3,3-テトラフルオロプロポキシ)メチル]-4-(エチルスルホニル)ベンゾイル]-1,3-シクロヘキサンジオン、

2-[2-クロロ-3-[(2,2,3,3-テトラフルオロプロポキシ)メチル]-4-(メチルスルホニル)ベンゾイル]-1,3-シクロヘキサンジオン、

2-[2-クロロ-3-(シクロプロピルメトキシ)-4-(エチルスルホニル)ベンゾイル]-1,3-シクロヘキサンジオン、

2-[2-クロロ-3-(シクロプロピルメトキシ)-4-(メチルスルホニル)ベンゾイル]-1,3-シクロヘキサンジオン、

2-[2-クロロ-3-(テトラヒドロフラン-2-イルメトキシメチル)-4-(エトキシスルホニル)ベンゾイル]-1,3-シクロヘキサンジオン、

2-[2-クロロ-3-(テトラヒドロフラン-2-イルメトキシメチル)-4-(メチルスルホニル)ベンゾイル]-1,3-シクロヘキサンジオン、

2-[2-クロロ-3-[2-(2-メトキシエトキシ)エトキシメチル]-4-(エチルスルホニル)ベンゾイル]-1,3-シクロヘキサンジオン、

2-[2-クロロ-3-[2-(2-メトキシエトキシ)エトキシメチル]-4-(メチルスルホニル)ベンゾイル]-1,3-シクロヘキサンジオン、

【0225】

I) ベンゾイルイソキサゾール系、例えば

5-シクロプロピル-[2-(メチルスルホニル)-4-(トリフルオロメチル)ベンゾイル]イソキサゾール (イソキサフルトール);

【0226】

J) ベンゾイルピラゾール系、例えば

2-[4-(2,4-ジクロロ-m-トルイル)-1,3-ジメチルピラゾール-5-イルオキシ]-4'-メチルアセトフェノン (ベンゾフェナップ)、

4-(2,4-ジクロロベンゾイル)-1,3-ジメチルピラゾール-5-イル トルエン-4-スルホネート(ピラゾリネート)、

2-[4-(2,4-ジクロロベンゾイル)-1,3-ジメチルピラゾール-5-イルオキシ]アセトフェノン (ピラゾキシフェン);

5-ヒドロキシ-1-メチル-4-[2-(メチルスルホニル)-4-トリフルオロメチルベンゾイル]ピラゾール (W001/74785)、

1-エチル-5-ヒドロキシ-4-[2-(メチルスルホニル)-4-トリフルオロメチルベンゾイル]ピラゾール (W001/74785)、

10

20

30

40

50

1,3-ジメチル-5-ヒドロキシ-4-[2-(メチルスルホニル)-4-トリフルオロメチルベンゾイル]ピラゾール (W001/74785)、

1-エチル-5-ヒドロキシ-3-メチル-4-[2-(メチルスルホニル)-4-トリフルオロメチルベンゾイル]ピラゾール (W001/74785)、

5-ヒドロキシ-1-メチル-4-[2-クロロ-3-(4,5-ジヒドロイソオキサゾール-3-イル)-4-メチルスルホニルベンゾイル]ピラゾール (W0 99/58509)、

5-ヒドロキシ-1-メチル-4-[3-(4,5-ジヒドロイソオキサゾール-3-イル)-2-メチル-4-メチルスルホニルベンゾイル]ピラゾール (W0 99/58509)、

1-エチル-5-ヒドロキシ-3-メチル-4-[2-メチル-4-メチルスルホニル-3-(2-メトキシエチルアミノ)ベンゾイル]ピラゾール (W0 96/26206)、

3-シクロプロピル-5-ヒドロキシ-1-メチル-4-[2-メチル-4-メチルスルホニル-3-(2-メトキシエチルアミノ)ベンゾイル]ピラゾール (W0 96/26206)、

5-ベンゾオキシ-1-エチル-4-[2-メチル-4-メチルスルホニル-3-(2-メトキシエチルアミノ)ベンゾイル]ピラゾール (W0 96/26206)、

1-エチル-5-ヒドロキシ-4-(3-ジメチルアミノ-2-メチル-4-メチルスルホニルベンゾイル)ピラゾール (W0 96/26206)、

5-ヒドロキシ-1-メチル-4-(2-クロロ-3-ジメチルアミノ-4-メチルスルホニルベンゾイル)ピラゾール (W0 96/26206)、

1-エチル-5-ヒドロキシ-4-(3-アリルアミノ-2-クロロ-4-メチルスルホニルベンゾイル)ピラゾール (W096/26206)、

1-エチル-5-ヒドロキシ-4-(2-メチル-4-メチルスルホニル-3-モルホリノベンゾイル)ピラゾール (W096/26206)、

5-ヒドロキシ-1-イソプロピル-4-(2-クロロ-4-メチルスルホニル-3-モルホリノベンゾイル)ピラゾール (W096/26206)、

3-シクロプロピル-5-ヒドロキシ-1-メチル-4-(2-クロロ-4-メチルスルホニル-3-モルホリノベンゾイル)ピラゾール (W096/26206)、

1,3-ジメチル-5-ヒドロキシ-4-(2-クロロ-4-メチルスルホニル-3-ピラゾール-1-イルベンゾイル)ピラゾール (W096/26206)、

1-エチル-5-ヒドロキシ-3-メチル-4-(2-クロロ-4-メチルスルホニル-3-ピラゾール-1-イルベンゾイル)ピラゾール (W096/26206)、

1-エチル-5-ヒドロキシ-4-(2-クロロ-4-メチルスルホニル-3-ピラゾール-1-イルベンゾイル)ピラゾール (W096/26206)、

【0227】

K) スルホニルアミノカルボニルtriaゾリノン系、例えば

4,5-ジヒドロ-3-メトキシ-4-メチル-5-オキソ-N-(2-トリフルオロメトキシフェニルスルホニル)-1H-1,2,4-triaゾール-1-カルボキサミド ナトリウム塩 (フルカルバゾン - ナトリウム)、

2-(4,5-ジヒドロ-4-メチル-5-オキソ-3-プロポキシ-1H-1,2,4-triaゾール-1-イル)カルボキサミドスルホニル安息香酸メチル ナトリウム塩 (プロポキシカルバゾン - ナトリウム) ;

【0228】

L) triaゾリノン系、例えば

4-アミノ-N-tert-ブチル-4,5-ジヒドロ-3-イソプロピル-5-オキソ-1,2,4-1H-triaゾール-1-カルボキサミド (アミカルバゾン)、

2-(2,4-ジヒドロ-5-プロポ-2-イニルオキシフェニル)-5,6,7,8-テトラヒドロ-1,2,4-triaゾール[4,3-a]ピリジン-3(2H)-オン (アザフェニジン)、

(RS)-2-クロロ-3-[2-クロロ-5-(4-ジフルオロメチル-4,5-ジヒドロ-3-メチル-5-オキソ-1H-1,2,4-triaゾール-1-イル)-4-フルオロフェニル]プロピオン酸エチル (カルフェントラゾン - エチル)、

2',4'-ジクロロ-5'-(4-ジフルオロメチル-4,5-ジヒドロ-3-メチル-5-オキソ-1H-1,2,4-

10

20

30

40

50

トリアゾール-1-イル)メタンスルホンアニリド (スルフェントラゾン);

【0229】

M) ホスフィン酸及び誘導体、例えば

4-[ヒドロキシ(メチル)ホスフィノイル]-L-ホモアラニル-L-アラニル-L-アラニン (ピラナホス)、

DL-ホモアラニン-4-イル(メチル)ホスフィン酸アンモニウム塩 (グルホシネート-アンモニウム);

【0230】

N) グリシン誘導体、例えば

N-(ホスホノメチル)グリシン及びその塩 (グリホサート及びその塩、例えばナトリウム塩又はイソプロピルアンモニウム塩)、

N-(ホスホノメチル)グリシン トリメシウム塩 (スルホセート);

【0231】

O) ピリミジニルオキシピリジンカルボン酸誘導体及びピリミジニルオキシ安息香酸誘導体、例えば

3-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)オキシピリジン-2-カルボン酸ベンジル(EP-A 0 249 707)、

3-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)オキシピリジン-2-カルボン酸メチル(EP-A 0 249 707)、

2,6-ビス[(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)オキシ]安息香酸 1-(エトキシカルボニルオキシエチル) (EP-A 0 472 113)、

2,6-ビス[(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)オキシ]安息香酸 (ビスピリバック-ナトリウム)、

ピリベンゾキシム、ピリフタリド、ピリミノバック-メチル及びピリチオバック-ナトリウム;

【0232】

P) S-(N-アリール-N-アルキルカルバモイルメチル)ジチオホスホン酸エステル系、例えば

S-[N-(4-クロロフェニル)-N-イソプロピルカルバモイルメチル] 0,0-ジメチル ジチオホスフェート (アニロホス);

【0233】

Q) トリアジノン系、例えば

3-シクロヘキシル-6-ジメチルアミノ-1-メチル-1,3,5-トリアジン-2,4-(1H,3H)-ジオン (ヘキサジノン)、

4-アミノ-4,5-ジヒドロ-3-メチル-6-フェニル-1,2,4-トリアジン-5-オン (メタミトロン)、

4-アミノ-6-tert-ブチル-4,5-ジヒドロ-3-メチルチオ-1,2,4-トリアジン-5-オン (メトリブジン);

【0234】

R) ピリジンカルボン酸系、例えば

クロピラリド、フルロキシピル、ピクロラム及びトリクロピル;

S) ピリジン系、例えば

ジチオピル及びチアゾピル;

T) ピリジンカルボキサミド系、例えば

ジフルフェニカン及びピコリナフェン;

U) 1,3,5-トリアジン系、例えば

アメトリン、アトラジン、シアナジン、ジメタメトリン、プロメトン、プロメトリン、プロバジン、シマジン、シメトリン、テルブメトン、テルブチラジン、テルプトリン及びトリエタジン;

【0235】

10

20

30

40

50

V) 植物成長調節剤、例えば

ホルクロルフェニユロン及びチジアズロン；

W) ケトエノール系、例えば

2,2-ジメチルプロピオン酸 8-(2,6-ジエチル-p-トリル)-1,2,4,5-テトラヒドロ-7-オキシ-7H-ピラゾロ[1,2-d][1,4,5]オキサジアゼピン-9-イル (ピノキサデン)。

【0236】

グループ A から W の除草剤は、例えば、上記に記載したそれぞれの刊行物及び「The Pesticide Manual」、The British Crop Protection Council、13 版、2003、又は the Pesticide Manual、Version 3.0、British Crop Protection Council 2003 から既知のものである。

10

【0237】

式 (I) の化合物と上記に記載した一つ若しくはそれより多い有害生物防除剤との組合せは、有力な物理化学的及び生物学的パラメーターの如何によって、種々の方法で製剤化することができる。好適な製剤型の例としては：

- 乳剤は活性化合物を、有機溶媒、例えばブタノール、シクロヘキサノン、ジメチルホルムアミド、キシレン又はその他の比較的高沸点の芳香族若しくは炭化水素、又は有機溶媒と一つ若しくはそれより多いイオン性及び/又は非イオン性の界面活性剤(乳化剤)との混合物中に溶解させることによって調製することができる。好適な乳化剤には、例えば、アルキルアリアルスルホン酸カルシウム、脂肪酸ポリグリコールエステル、アルキルアリアルポリグリコールエーテル、脂肪アルコールポリグリコールエーテル、プロピレンオキシド/エチレンオキシド縮合物、アルキルポリエーテル、ソルビタンエステル及びポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステルがある；

20

【0238】

- 粉剤は活性化合物を細かく粉砕した無機又は有機物質、例えばタルク、又はカオリン、ベントナイト及びパイロフィライトのような天然の粘土、又は珪藻土と一緒に粉砕して調製することができる；

【0239】

- 水ベース又は油ベースの懸濁濃縮剤は、例えば、ビードミルを用いて湿式粉砕法により調製することができる；

30

- 水溶性粉剤；
- 水溶性濃縮製剤；
- 水溶性粒剤、水-分散性粒剤並びに散撒用及び土壌処理用粒剤のような粒剤；
- 有効成分に加えて希釈剤又は不活性物質及び界面活性剤を含んでいる水和剤；
- カプセル懸濁剤及びマイクロカプセル剤；
- ULV 製剤(微量散布剤)がある。

【0240】

上記に言及した製剤型は当業者にとっては既知のものであり、そして例えば、K. Martens、「Spray Drying Handbook」、3 版、G. Goodwin Ltd., London、1979；W. van Valkenburg、「Pesticide Formulations」、Marcel Dekker, N.Y. 1973；Winnaker-Kuchler、「Chemische Technologie」(Chemical Technology)、7 巻、C. Hanser Verlag Munich、4 版、1986；「Perry's Chemical Engineer's Handbook」、5 版、McGraw-Hill、N.Y. 1973、8-57 頁に記載されている。

40

【0241】

不活性物質、界面活性剤、溶媒及びその他の添加物のような製剤に必要な補助剤も既知のものであり、そして例えば、McCutcheon's「Detergents and Emulsifiers Annual」、MC Publ. Corp., Ridgewood N.J.；C. Marsden、「Solvents Guide」、2 版、Interscience, N.Y. 1963；H. von Olphen、「Introduction to Clay Colloid Chemistry」、2 版、J. Wiley & Sons, N.Y.；Schoenfeldt、「Grenzflächenaktive Äthylenoxidaddukte」(Surface-active ethylene oxide adducts)、Wiss. Verlagsgesellschaft, Stuttgart 1976；Sisley and Wood、「Encyclopedia of Surface Active Agents」、Chem. Publ.

50

Co. Inc., N.Y. 1964; Watkins, 「Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers」、2版、Darland Books、Caldwell N.J.; Winnacker-Kuchler, 「Chemische Technologie」、7巻、C. Hanser Verlag Munich、4版、1986に記載されている。

【0242】

上記の製剤補助剤に加えて、有用植物保護組成物には、場合によっては、慣用的な粘着付与剤(tackifiers)、湿展剤、分散剤、浸透剤、乳化剤、保存剤、不凍剤、増量剤、担体、着色剤、消泡剤、蒸発防止剤及びpH又は粘度調節剤を含めることができる。

【0243】

製剤型の如何によって、この有用植物保護組成物は、一般的に0.1から99質量%、殊に0.2から95質量%の一つ若しくはそれより多い式(I)の薬害軽減剤又は薬害軽減剤と有害生物防除剤との組合せを含んでいる。更に、これらは1から99.9質量%、殊に4から99.5質量%の一つ若しくはそれより多い固形又は液状の添加物、及び0から25質量%、殊に0.1から25質量%の界面活性剤を含んでいる。乳剤の場合は、活性化合物、即ち、薬害軽減剤及び/又は有害生物防除剤の濃度は、一般的に1から90質量%、殊に5から80質量%である。粉剤は、通常1から30質量%、殊に5から20質量%の有効成分を含んでいる。水和剤では、有効成分の濃度は一般的に10から90質量%である。水-分散性粒剤では、有効成分の量は、例えば1と95質量%との間、好ましくは10と80質量%との間である。

【0244】

使用に際しては、市場で入手可能な形式で提供される当該製剤は、場合によっては、例えば水和剤、乳剤、分散剤及び水-分散性粒剤の場合には、水を用いて通常の仕方で希釈することができる。粉剤、粒剤及び噴霧用溶液の場合は、通常は使用前において他の不活性物質により更に希釈することなく使用することができる。当該薬害軽減剤の施用量は、特に、温度、湿度及び使用する除草剤系のような外的条件によって変動する。

【0245】

以下の実施例は本発明について説明するためのものであるが、しかしながらこれらに限定されるものではなく、量は他に定義されていない限り、質量基準による。

【実施例】

【0246】

1. 製剤実施例

1.1 粉剤

粉剤は、式(I)の化合物の10質量部又は有害生物防除剤(例えば除草剤)と式(I)の薬害軽減剤との活性化合物混合物の10質量部、及び不活性物質としてのタルクの90質量部とを混合し、そしてハンマーミル中で粉碎して得ることができた。

【0247】

1.2 水-分散性粉剤

直ちに水中に分散することができる水和剤は、式(I)の化合物の25質量部又は有害生物防除剤(例えば除草剤)と式(I)の薬害軽減剤との活性化合物混合物の25質量部、不活性物質としてのカオリン含有石英の64質量部、リグニンスルホン酸カリウムの10質量部、及びオレオイルメチルタウリンナトリウム及び分散剤の1質量部とをピン付きミル中で粉碎して得ることができた。

【0248】

1.3 水-分散性製剤

直ちに水中に分散することができる水-分散性製剤は、式(I)の化合物の20質量部又は有害生物防除剤(例えば除草剤)と式(I)の薬害軽減剤との活性化合物混合物の20質量部、アルキルフェノール ポリグリコール エーテル(Triton(商標登録) X 207)の6質量部、イソトリデカノール ポリグリコール エーテルの3質量部、及びパラフィン系鉱油の71質量部とをボールミル中で粉碎して5ミクロン以下の微粉として得ることができた。

【0249】

10

20

30

40

50

1.4 乳剤

乳剤は、式 (I) の化合物の 15 質量部又は有害生物防除剤 (例えば除草剤) と式 (I) の薬害軽減剤との活性化化合物混合物の 15 質量部、溶媒としてのシクロヘキサノンの 75 質量部、及び乳化剤としてのエトキシ化されたノニルフェノールの 10 質量部から得ることができた。

【0250】

1.5 水-分散性粒剤

水-分散性粒剤は

式 (I) の薬害軽減剤又は有害生物防除剤と式 (I) の薬害軽減剤との混合物	75 質量部	10
リゲニンスルホン酸カルシウム	10 質量部	
ラウリル硫酸ナトリウム	5 質量部	
ポリビニルアルコール	3 質量部	及び
カオリン	7 質量部	

を、ピン付ミルで粉碎し、そしてその粉末を流動式床中で、造粒液としての水を噴霧し粒状として得ることができた。

【0251】

水-分散性粒剤はまた

式 (I) の薬害軽減剤又は有害生物防除剤と式 (I) の薬害軽減剤との混合物	25 質量部	20
2,2'-ジナフチルメタン-6,6'-ジスルホン酸ナトリウム	5 質量部	
オレオイルメチルタウリンナトリウム	2 質量部	
炭酸カルシウム	17 質量部	
水	50 質量部	及び
ポリビニルアルコール	1 質量部	

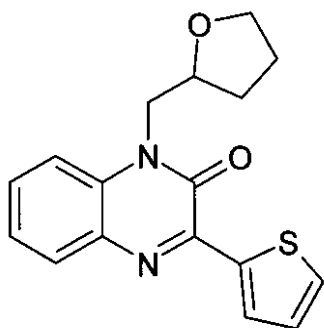
を、コロイドミル中で粉末化し、次いでビードミル中で粉碎し、そして得られた懸濁を単一液体ノズルを用いた噴霧塔中で微粉末とし、そしてこれを乾燥して得ることができた。

【0252】

2. 製造実施例

実施例 A

【化7】



1-テトラヒドロフルフリル-3-(2-チエニル)-1,2-ジヒドロキノキサリン-2-オン

N-テトラヒドロフルフリル-o-フェニレンジアミン塩酸塩 1.00 g (4.4mmol)、トリエチルアミン 0.49 g (4.8 mmol)、及び(2-チエニル)グリオキシル酸エチル 0.81 g (4.4mol) をエタノール20 ml中で還流下に8時間加熱した。その混合物を濃縮し、残留物を水/ジクロロメタンに取り出して、そして有機相を乾燥して濃縮した。残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(酢酸エチル/ヘプタン 1:1)で精製した。この結果、融点123 のやや黄色味を帯びた固体 0.22 g (理論値の 16.0%)を得た。

【0253】

実施例 B

10

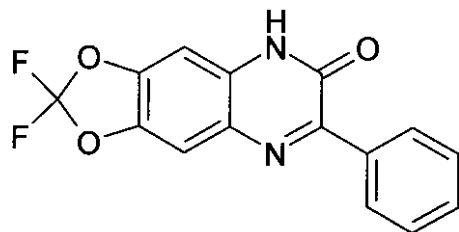
20

30

40

50

【化 8】

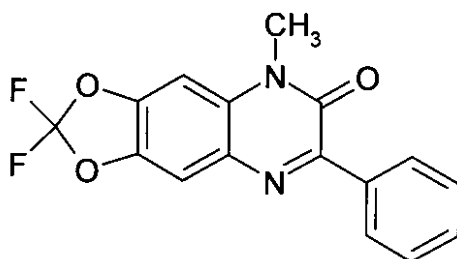


6,7-(ジフルオロメチレンジオキシ)-3-フェニル-1,2-ジヒドロキノキサリン-2-オン
 4,5-(ジフルオロメチレンジオキシ)-o-フェニレンジアミン ビス塩酸塩 1.25 g (4.79 mmol)、トリエチルアミン 1.07 g (10.53 mmol) 及びグリオキシル酸メチル 0.79 g (4.79 mmol) をメタノール 50 ml 中で還流下に 8 時間加熱した。まだ熱いうちに、当該生成物を無色の固体として沈殿させた。冷却後に、当該生成物を吸引して濾過し、そして濾過ケーキを少量のメタノールで洗浄した。この結果、融点 291 - 292 の無色の固体 1.25 g (理論値の 86.3%) を得た。

【0254】

実施例 C

【化 9】



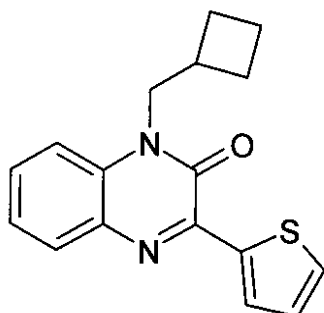
6,7-(ジフルオロメチレンジオキシ)-1-メチル-3-フェニル-1,2-ジヒドロキノキサリン-2-オン
 オン

6,7-(ジフルオロメチレンジオキシ)-3-フェニル-1,2-ジヒドロキノキサリン-2-オン (実施例 B) 0.55 g (1.81 mmol) 及びジメチルホルムアミド ジメチル アセタール 0.65 g (5.49 mmol) をジメチルホルムアミド 25 ml 中、95 で 8 時間攪拌した。冷却後この混合物を濃縮し、残留物を希釈水酸化ナトリウム水溶液とジクロロメタンに取り出して、そして有機相を水で洗浄し、乾燥しそして濃縮した。この残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘプタン/酢酸エチル 4 : 1) で精製した。この結果、融点 165 のやや黄色味を帯びた固体 0.32 g (理論値の 55.1%) を得た。

【0255】

実施例 D

【化 10】



1-シクロブチルメチル-3-(2-チエニル)-1,2-ジヒドロキノキサリン-2-オン

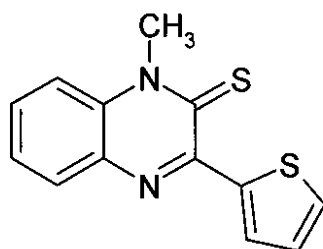
3-(2-チエニル)-1,2-ジヒドロキノキサリン-2-オン (実施例 Bと同様にして、*o*-フェニレンジアミン及び (2-チエニル)グリオキシル酸エチルから製造した。) 0.46 g (2 mmol)、プロモメチルシクロブタン 0.30 g (2 mmol) 及び炭酸カリウム 0.28 g (2 mmol) をジメチルホルムアミド 10 ml中、90 °Cで5時間攪拌した。冷却後この混合物を濃縮し、残留物を水/ジクロロメタンに取り出した。有機相を乾燥して濃縮した。この残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘプタン/酢酸エチル 4 : 1) で精製した。この結果、最初に、2-クロロブチルオキシ-3-(2-チエニル)キノキサリン (0-アルキル化産物、無色の固体、融点 103 °C) 0.04 g (理論値の 5.4%) を得、そして次いで、融点 110 °Cの無色の固体 0.41 g (理論値の 59.9%) を得た。

10

【0256】

実施例 E

【化11】



20

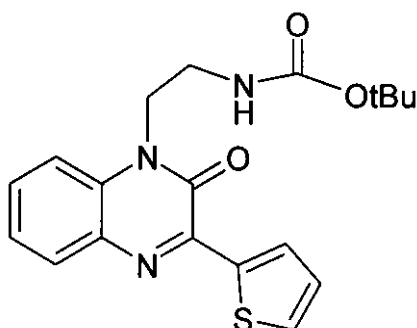
1-メチル-3-(2-チエニル)-1,2-ジヒドロキノキサリン-2-チオン

1-メチル-3-(2-チエニル)-1,2-ジヒドロキノキサリン-2-オン (実施例 Bと同様にして、*o*-フェニレンジアミン及び (2-チエニル)グリオキシル酸エチルから製造した。) 0.48 g (2 mmol) 及びLawesson 試薬 0.41 mg (1 mmol) をキシレン 10 ml中で還流下に10時間加熱した。この混合物を濃縮し、そして残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘプタン/酢酸エチル 1 : 4) で精製した。この結果、融点 113 °Cのオレンジ色の固体 0.15 g (理論値の 26.0%) を得た。

【0257】

実施例 F

【化12】



40

1-(2-Boc-アミノエチル)-3-(2-チエニル)-1,2-ジヒドロキノキサリン-2-オン

3-(2-チエニル)-1,2-ジヒドロキノキサリン-2-オン (実施例 Bと同様にして、*o*-フェニレンジアミン及び (2-チエニル)グリオキシル酸エチルから製造した。) 5.1 g (0.022 mol)、2-(tert-ブトキシカルボニルアミノ)エチルブロミド [= 2-(*boc*-アミノ)エチルブロミド] 5.0 g (0.022 mol) 及び炭酸カリウム 3.5 g (0.025 mol) を 90 °Cで7時間攪拌した。溶媒を減圧により除去し、そしてその残留物を水/ジクロロメタンに取り出して、そして有機相を乾燥して濃縮した。この残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘプタン/酢酸エチル 7 : 3) で精製した。この結果、最初に0-アルキル異性体 (m.p. 144-145 °C) 0.86 g (理論値の 9.9%) を得、そして次いで所望する生成物 1.59 g (理論値

50

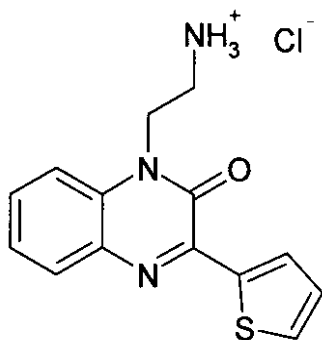
の 18.2%) を得た。

無色結晶、m.p. 156-157

【0258】

実施例 G

【化13】



10

1-(2-アミノエチル)-3-(2-チエニル)-1,2-ジヒドロキノキサリン-2-オン塩酸塩

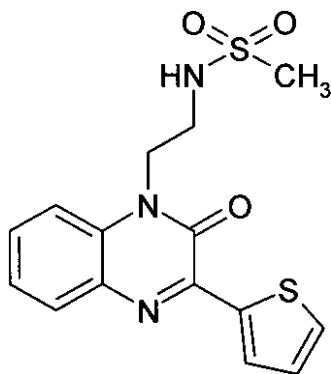
実施例 F の生成物 1.50 g (4 mmol) をジオキササン 20 ml に溶解し、そして 4 M 塩酸のジオキササン溶液 2 ml を添加した。この混合物を室温で 5 時間攪拌し、そして還流下に 5 時間攪拌した。冷却後に沈殿した塩酸塩を吸引濾過して除去した。この結果、無色の固体 1.08 g (理論値の 82.6%) を得た：m.p. >250 。

20

【0259】

実施例 H

【化14】



30

1-(2-メチルスルホニルアミノエチル)-3-(2-チエニル)-1,2-ジヒドロキノキサリン-2-オン

室温において塩化メタンスルホニル 126 mg (1.1 mmol) のジクロロメタン溶液の少量を、実施例 G のアミン塩酸塩 300 mg (1.0 mmol) 及びトリエチルアミン 223 mg (2.2 mmol) のジクロロメタン溶液 10 ml 中に滴下し、この混合物を室温で 6 時間攪拌した。この反応混合物を水中に注ぎ、そして有機相を乾燥して濃縮した。この粗生成物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘプタン/酢酸エチル 7 : 3) で精製した。この結果、無色固体の生成物 110 mg (理論値の 47.0%) を得た。

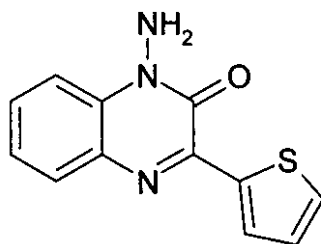
40

M.p.: 236-237

【0260】

実施例 I

【化 1 5】



1-アミノ-3-(2-チエニル)-1,2-ジヒドロキノキサリン-2-オン

10

3-(2-チエニル)-1,2-ジヒドロキノキサリン-2-オン(実施例 Bと同様にして、o-フェニレンジアミン及び(2-チエニル)グリオキシル酸エチルから製造した。) 3.50 g (15 mmol) 及びヒドロキシルアミンO-スルホン酸4.77 g (42 mmol)の水酸化ナトリウム溶液3.07 g (77mmol)を室温で15時間攪拌した。この混合物を水で希釈し、そしてジクロロメタンに溶解させ、そして有機相を乾燥して濃縮した。この残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘプタン/酢酸エチル 4:1)で精製した。この結果、融点164の無色固体の生成物 0.36 g (理論値の 9.2%)を得た。

【0261】

以下の表は、上記の実施例及び更に上記に記載されている方法と同様にして得ることができる式(I)の化合物の多くを、例示的な仕方で記載している。

20

【0262】

表1及び2において：

Bu	=	ブチル	Et	=	エチル
Me	=	メチル	Ph	=	フェニル
Pr	=	プロピル	Th	=	チエニル
i	=	イソ	s	=	第二級
t	=	第四級			

これは以下のような複合の用語に対しても対応して適用される。

iPr	=	イソプロピル
iBu	=	イソブチル
sBu	=	第二級ブチル
tBu	=	第四級ブチル

30

【0263】

もしもアルキル基が更に特定することなく表に記載されているときは、問題としている置換基は直鎖のアルキル基である。

もしも定義「H」が「(Y)_n」に対して与えられているときは、これは無置換の骨格(n = 0)を意味する。

m.p.	=	融点
・HCl	=	親化合物の塩酸塩

【0264】

40

【表 1】

表 1 : 式 (I-1) の化合物

実施例	(Y) _n	R ²	R ¹	m. p. [°C]
1	H	Me	H	246-248
2	H	Et	H	
3	H	Pr	H	
4	H	i-Pr	H	>250
5	7-OMe	i-Pr	H	179
6	6,7-Cl ₂	i-Pr	H	>250
7	6,7-Me ₂	i-Pr	H	268-269
8	H	Bu	H	
9	H	i-Bu	H	
10	H	s-Bu	H	184-185
11	H	t-Bu	H	
12	H	シクロプロピル	H	
13	H	シクロブチル	H	
14	H	シクロペンチル	H	238
15	H	シクロヘキシル	H	>250
16	H	シクロヘプチル	H	
17	H	トリフルオロメチル	H	233-236
18	H	ベンジル	H	199-201
19	H	1-フェニルエチル	H	
20	H	2-フェニルエチル	H	218-219
21	H	2-ピコリル	H	
22	H	3-ピコリル	H	
23	H	4-ピコリル	H	
24	H	2-チエニルメチル	H	
25	H	3-チエニルメチル	H	
26	H	4-クロロベンジル	H	
27	H	4-メチルベンジル	H	

10

20

30

40

【 0 2 6 5 】

【表 2】
(表 1 続き)

実施例	(Y) _n	R ²	R ¹	m. p. [°C]
28	H	4-メトキシベンジル	H	
29	H	3-インドリルメチル	H	216-218
30	H	Ph	H	250-251
31	5-Me	Ph	H	
32	6-Me	Ph	H	
33	7-Me	Ph	H	
34	8-Me	Ph	H	
35	5-Cl	Ph	H	
36	6-Cl	Ph	H	
37	7-Cl	Ph	H	
38	8-Cl	Ph	H	
39	5-F	Ph	H	
40	6-F	Ph	H	
41	7-F	Ph	H	
42	8-F	Ph	H	
43	5-OMe	Ph	H	
44	6-OMe	Ph	H	
45	7-OMe	Ph	H	199
46	8-OMe	Ph	H	
47	5-CF ₃	Ph	H	
48	6-CF ₃	Ph	H	>250
49	7-CF ₃	Ph	H	>250
50	8-CF ₃	Ph	H	
51	6, 7-Me ₂	Ph	H	>250
52	5, 7-Me ₂	Ph	H	
53	5, 6- Me ₂	Ph	H	
54	7, 8- Me ₂	Ph	H	
55	5, 7- Me ₂	Ph	H	
56	6, 8- Me ₂	Ph	H	
57	5, 8- Me ₂	Ph	H	
58	6, 7-Cl ₂	Ph	H	>250

10

20

30

40

【表 3】

(表 1 続き)

実施例	(Y) _n	R ²	R ¹	m. p. [°C]
59	5, 6- Cl ₂	Ph	H	
60	5, 7- Cl ₂	Ph	H	
61	7, 8- Cl ₂	Ph	H	
62	6, 8- Cl ₂	Ph	H	
63	5, 8- Cl ₂	Ph	H	
64	6, 7-(OMe) ₂	Ph	H	258
65	6, 7-O-CF ₂ -O-	Ph	H	>291-292
66	6, 7-F ₂	Ph	H	>250
67	5, 7-F ₂	Ph	H	
68	5, 6-F ₂	Ph	H	
69	7, 8-F ₂	Ph	H	>250
70	6, 8-F ₂	Ph	H	
71	5, 8-F ₂	Ph	H	
72	6, 7-(CF ₃) ₂	Ph	H	
73	5, 7-(CF ₃) ₂	Ph	H	>270
74	5, 6-(CF ₃) ₂	Ph	H	
75	7, 8-(CF ₃) ₂	Ph	H	
76	6, 8-(CF ₃) ₂	Ph	H	
77	5, 8-(CF ₃) ₂	Ph	H	
78	6-Cl, 7-F	Ph	H	
79	H	2-Th	H	>250
80	5-Me	2-Th	H	
81	6-Me	2-Th	H	>250
82	7-Me	2-Th	H	
83	8-Me	2-Th	H	
84	5-Cl	2-Th	H	
85	6-Cl	2-Th	H	>250
86	7-Cl	2-Th	H	
87	8-Cl	2-Th	H	
88	5-F	2-Th	H	
89	6-F	2-Th	H	

10

20

30

40

【表 4】

(表 1 続き)

実施例	(Y) _n	R ²	R ¹	m. p. [°C]
90	7-F	2-Th	H	>250
91	8-F	2-Th	H	
92	5-OMe	2-Th	H	
93	6-OMe	2-Th	H	
94	7-OMe	2-Th	H	215
95	8-OMe	2-Th	H	
96	5-CF ₃	2-Th	H	
97	6-CF ₃	2-Th	H	>250
98	7-CF ₃	2-Th	H	>250
99	8-CF ₃	2-Th	H	
100	6, 7-Me ₂	2-Th	H	>250
101	5, 7-Me ₂	2-Th	H	
102	5, 6-Me ₂	2-Th	H	
103	7, 8-Me ₂	2-Th	H	
104	5, 7-Me ₂	2-Th	H	
105	6, 8-Me ₂	2-Th	H	
106	5, 8-Me ₂	2-Th	H	
107	6, 7-Cl ₂	2-Th	H	>250
108	5, 7-Cl ₂	2-Th	H	
109	5, 6-Cl ₂	2-Th	H	
110	7, 8-Cl ₂	2-Th	H	
111	6, 8-Cl ₂	2-Th	H	
112	5, 8-Cl ₂	2-Th	H	
113	6, 7-(OMe) ₂	2-Th	H	>270
114	6, 7-O-CF ₂ -O-	2-Th	H	>270
115	6, 7-F ₂	2-Th	H	>250
116	5, 7-F ₂	2-Th	H	
117	5, 6-F ₂	2-Th	H	
118	7, 8-F ₂	2-Th	H	
119	6, 8-F ₂	2-Th	H	
120	5, 8-F ₂	2-Th	H	

10

20

30

40

【表 5】
 (表 1 続き)

実施例	(Y) _n	R ²	R ¹	m. p. [°C]
121	5, 7-(CF ₃) ₂	2-Th	H	>250
122	6, 7-(CF ₃) ₂	2-Th	H	
123	5, 6-(CF ₃) ₂	2-Th	H	
124	7, 8-(CF ₃) ₂	2-Th	H	
125	6, 8-(CF ₃) ₂	2-Th	H	
126	5, 8-(CF ₃) ₂	2-Th	H	
127	6-Cl, 7-F	2-Th	H	>250
128	6-COOMe	2-Th	H	油状
129	6-COOEt	2-Th	H	油状
130	H	p-トリル	H	232
131	H	m-トリル	H	220
132	H	o-トリル	H	
133	H	4-C ₆ H ₄ -tBu	H	213-214
134	H	4-C ₆ H ₄ Cl	H	213-214
135	H	3-C ₆ H ₄ Cl	H	
136	H	2-C ₆ H ₄ Cl	H	
137	H	4-C ₆ H ₄ F	H	
138	H	3-C ₆ H ₄ F	H	
139	H	2-C ₆ H ₄ F	H	
140	H	4-C ₆ H ₄ OMe	H	>250
141	H	3-C ₆ H ₄ OMe	H	
142	H	2-C ₆ H ₄ OMe	H	
143	H	4-C ₆ H ₄ CF ₃	H	
144	H	3-C ₆ H ₄ CF ₃	H	212
145	H	2-C ₆ H ₄ CF ₃	H	>250
146	H	2, 3-C ₆ H ₃ Me ₂	H	
147	H	2, 4-C ₆ H ₃ Me ₂	H	265
148	H	2, 5-C ₆ H ₃ Me ₂	H	>250
149	H	2, 6-C ₆ H ₃ Me ₂	H	
150	H	3, 4-C ₆ H ₃ Me ₂	H	241
151	H	3, 5-C ₆ H ₃ Me ₂	H	202

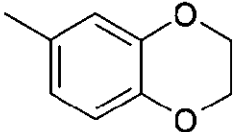
10

20

30

40

【表 6】
(表 1 続き)

実施例	(Y) _n	R ²	R ¹	m. p. [°C]
152	H	2,3-C ₆ H ₃ Cl ₂	H	204
153	H	2,4-C ₆ H ₃ Cl ₂	H	>250
154	H	2,5-C ₆ H ₃ Cl ₂	H	
155	H	2,6-C ₆ H ₃ Cl ₂	H	
156	H	3,4-C ₆ H ₃ Cl ₂	H	>250
157	H	3,5-C ₆ H ₃ Cl ₂	H	
158	H	2,4,6-C ₆ H ₂ Me ₃	H	202-204
159	H	3,4-C ₆ H ₃ (OMe) ₂	H	238
160	H		H	>250
161	H	4-Cl, 2-F, 5-OMe-Ph	H	>250
162	H	3-Th	H	268-269
163	H	2-フリル	H	268
164	H	3-フリル	H	
165	H	2-チアゾリル	H	
166	H	4-チアゾリル	H	
167	H	5-チアゾリル	H	
168	H	2-ピリジル	H	
169	H	3-ピリジル	H	
170	H	4-ピリジル	H	
171	H	3-Me-2-ピリジル	H	244
172	H	4-Me-2-ピリジル	H	170
173	H	5-Me-2-ピリジル	H	232
174	H	6-Me-2-ピリジル	H	254
175	H	2-Me-3-ピリジル	H	
176	H	4-Me-3-ピリジル	H	
177	H	5-Me-3-ピリジル	H	
178	H	6-Me-3-ピリジル	H	
179	H	2-Me-4-ピリジル	H	

10

20

30

40

【表 7】

(表 1 続き)

実施例	(Y) _n	R ²	R ¹	m. p. [°C]
180	H	3-Me-4-ピリジル	H	
181	H	3-Me-2-チエニル	H	264
182	H	4-Me-2-チエニル	H	253
183	H	5-Me-2-チエニル	H	>250
184	H	2-Me-3-チエニル	H	
185	H	4-Me-3-チエニル	H	
186	H	5-Me-3-チエニル	H	
187	H	3, 4-Me ₂ -2-チエニル	H	
188	H	3, 5-Me ₂ -2-チエニル	H	
189	H	4, 5-Me ₂ -2-チエニル	H	
190	H	2, 4-Me ₂ -3-チエニル	H	
191	H	2, 5-Me ₂ -3-チエニル	H	221
192	H	4, 5-Me ₂ -3-チエニル	H	
193	H	3-Cl-2-チエニル	H	
194	H	4-Cl-2-チエニル	H	
195	H	5-Cl-2-チエニル	H	>250
196	H	2-Cl-3-チエニル	H	
197	H	4-Cl-3-チエニル	H	
198	H	5-Cl-3-チエニル	H	
199	H	3, 4-Cl ₂ -2-チエニル	H	
200	H	3, 5-Cl ₂ -2-チエニル	H	
201	H	4, 5-Cl ₂ -2-チエニル	H	
202	H	2, 4-Cl ₂ -3-チエニル	H	
203	H	2, 5-Cl ₂ -3-チエニル	H	>250
204	H	4, 5-Cl ₂ -3-チエニル	H	
205	H	Me	Me	
206	H	Et	Me	
207	H	Pr	Me	
208	H	i-Pr	Me	
209	H	Bu	Me	
210	H	i-Bu	Me	

10

20

30

40

【表 8】

(表 1 続き)

実施例	(Y) _n	R ²	R ¹	m. p. [°C]
211	H	s-Bu	Me	
212	H	t-Bu	Me	
213	H	シクロプロピル	Me	
214	H	シクロブチル	Me	
215	H	シクロペンチル	Me	96
216	H	シクロヘキシル	Me	183
217	H	シクロヘプチル	Me	
218	H	トリフルオロメチル	Me	137
219	H	ベンジル	Me	
220	H	1-フェニルエチル	Me	
221	H	2-フェニルエチル	Me	93
222	H	2-ピコリル	Me	
223	H	3-ピコリル	Me	
224	H	4-ピコリル	Me	
225	H	2-チエニルメチル	Me	
226	H	3-チエニルメチル	Me	
227	H	4-クロロベンジル	Me	
228	H	4-メチルベンジル	Me	
229	H	4-メトキシベンジル	Me	
230	H	3-インドリルメチル	Me	
231	H	Ph	Me	130-132
232	5-Me	Ph	Me	
233	6-Me	Ph	Me	135
234	7-Me	Ph	Me	
235	8-Me	Ph	Me	
236	5-Cl	Ph	Me	
237	6-Cl	Ph	Me	
238	7-Cl	Ph	Me	
239	8-Cl	Ph	Me	
240	5-F	Ph	Me	
241	6-F	Ph	Me	

10

20

30

40

【表 9】

(表 1 続き)

実施例	(Y) _n	R ²	R ¹	m. p. [°C]
242	7-F	Ph	Me	
243	8-F	Ph	Me	
244	5-OMe	Ph	Me	
245	6-OMe	Ph	Me	
246	7-OMe	Ph	Me	
247	8-OMe	Ph	Me	
248	5-CF ₃	Ph	Me	
249	6-CF ₃	Ph	Me	152
250	7-CF ₃	Ph	Me	100
251	8-CF ₃	Ph	Me	
252	6, 7-Me ₂	Ph	Me	
253	5, 7-Me ₂	Ph	Me	
254	5, 6-Me ₂	Ph	Me	
255	7, 8-Me ₂	Ph	Me	
256	5, 7-Me ₂	Ph	Me	
257	6, 8-Me ₂	Ph	Me	
258	5, 8-Me ₂	Ph	Me	
259	5, 7-Cl ₂	Ph	Me	
260	6, 7-Cl ₂	Ph	Me	
261	5, 6-Cl ₂	Ph	Me	
262	7, 8-Cl ₂	Ph	Me	
263	6, 8-Cl ₂	Ph	Me	
264	5, 8-Cl ₂	Ph	Me	
265	6, 7-(OMe) ₂	Ph	Me	
266	6, 7-O-CF ₂ -O-	Ph	Me	165
267	5, 7-F ₂	Ph	Me	
268	6, 7-F ₂	Ph	Me	141-142
269	5, 6-F ₂	Ph	Me	
270	7, 8-F ₂	Ph	Me	>250
271	6, 8-F ₂	Ph	Me	
272	5, 8-F ₂	Ph	Me	

10

20

30

40

【表 10】

(表 1 続き)

実施例	(Y) _n	R ²	R ¹	m. p. [°C]
273	6-F, 7-NMe ₂	Ph	Me	168-169
274	5, 7-(CF ₃) ₂	Ph	Me	
275	6, 7-(CF ₃) ₂	Ph	Me	
276	5, 6-(CF ₃) ₂	Ph	Me	
277	7, 8-(CF ₃) ₂	Ph	Me	
278	6, 8-(CF ₃) ₂	Ph	Me	
279	5, 8-(CF ₃) ₂	Ph	Me	
280	6-Cl, 7-F	Ph	Me	
281	H	2-Th	Me	170-171
282	5-Me	2-Th	Me	
283	6-Me	2-Th	Me	194
284	7-Me	2-Th	Me	
285	8-Me	2-Th	Me	
286	5-Cl	2-Th	Me	
287	6-Cl	2-Th	Me	
288	7-Cl	2-Th	Me	
289	8-Cl	2-Th	Me	
290	5-F	2-Th	Me	
291	6-F	2-Th	Me	
292	7-F	2-Th	Me	
293	8-F	2-Th	Me	
294	5-OMe	2-Th	Me	
295	6-OMe	2-Th	Me	
296	7-OMe	2-Th	Me	
297	8-OMe	2-Th	Me	
298	5-CF ₃	2-Th	Me	
299	6-CF ₃	2-Th	Me	185
300	7-CF ₃	2-Th	Me	
301	8-CF ₃	2-Th	Me	
302	5, 7-Me ₂	2-Th	Me	
303	6, 7-Me ₂	2-Th	Me	

10

20

30

40

【表 1 1】

(表 1 続き)

実施例	(Y) _n	R ²	R ¹	m. p. [°C]
304	5, 6-Me ₂	2-Th	Me	
305	7, 8-Me ₂	2-Th	Me	
306	5, 7-Me ₂	2-Th	Me	
307	6, 8-Me ₂	2-Th	Me	
308	5, 8-Me ₂	2-Th	Me	
309	5, 7-Cl ₂	2-Th	Me	
310	6, 7-Cl ₂	2-Th	Me	
311	5, 6-Cl ₂	2-Th	Me	
312	7, 8-Cl ₂	2-Th	Me	
313	6, 8-Cl ₂	2-Th	Me	
314	5, 8-Cl ₂	2-Th	Me	
315	6, 7-(OMe) ₂	2-Th	Me	
316	6, 7-O-CF ₂ -O-	2-Th	Me	241
317	5, 7-F ₂	2-Th	Me	
318	6, 7-F ₂	2-Th	Me	
319	5, 6-F ₂	2-Th	Me	
320	7, 8-F ₂	2-Th	Me	
321	6, 8-F ₂	2-Th	Me	
322	5, 8-F ₂	2-Th	Me	
323	5, 7-(CF ₃) ₂	2-Th	Me	
324	6, 7-(CF ₃) ₂	2-Th	Me	
325	5, 6-(CF ₃) ₂	2-Th	Me	
326	7, 8-(CF ₃) ₂	2-Th	Me	
327	6, 8-(CF ₃) ₂	2-Th	Me	
328	5, 8-(CF ₃) ₂	2-Th	Me	
329	6-Cl, 7-F	2-Th	Me	
330	H	p-トリル	Me	149
331	H	m-トリル	Me	
332	H	o-トリル	Me	109
333	H	4-tBu	Me	
334	H	4-C ₆ H ₄ Cl	Me	178

10

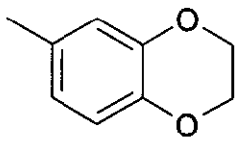
20

30

40

【表 1 2】

(表 1 続き)

実施例	(Y) _n	R ²	R ¹	m. p. [°C]
335	H	3-C ₆ H ₄ Cl	Me	
336	H	2-C ₆ H ₄ Cl	Me	
337	H	4-C ₆ H ₄ F	Me	
338	H	3-C ₆ H ₄ F	Me	
339	H	2-C ₆ H ₄ F	Me	
340	H	4-C ₆ H ₄ OMe	Me	152
341	H	3-C ₆ H ₄ OMe	Me	
342	H	2-C ₆ H ₄ OMe	Me	
343	H	4-C ₆ H ₄ CF ₃	Me	166
344	H	3-C ₆ H ₄ CF ₃	Me	143
345	H	2-C ₆ H ₄ CF ₃	Me	
346	H	2, 3-C ₆ H ₃ Me ₂	Me	
347	H	2, 4-C ₆ H ₃ Me ₂	Me	
348	H	2, 5-C ₆ H ₃ Me ₂	Me	
349	H	2, 6-C ₆ H ₃ Me ₂	Me	138
350	H	3, 4-C ₆ H ₃ Me ₂	Me	119
351	H	3, 5-C ₆ H ₃ Me ₂	Me	
352	H	2, 4, 6-C ₆ H ₂ Me ₃	Me	186
353	H		Me	
354	H	2, 3-C ₆ H ₃ Cl ₂	Me	188
355	H	2, 4-C ₆ H ₃ Cl ₂	Me	
356	H	2, 5-C ₆ H ₃ Cl ₂	Me	
357	H	2, 6-C ₆ H ₃ Cl ₂	Me	
358	H	3, 4-C ₆ H ₃ Cl ₂	Me	191
359	H	3, 5-C ₆ H ₃ Cl ₂	Me	
360	H	3, 4-C ₆ H ₃ (OMe) ₂	Me	
361	H	4-Cl, 2-F, 5-OMe-フェニル	Me	177
362	H	3-Th	Me	

10

20

30

40

【表 1 3】

(表 1 続き)

実施例	(Y) _n	R ²	R ¹	m. p. [°C]
363	H	2-フリル	Me	183
364	H	3-フリル	Me	
365	H	2-チアゾリル	Me	
366	H	4-チアゾリル	Me	
367	H	5-チアゾリル	Me	
368	H	2-ピリジル	Me	108
369	H	3-ピリジル	Me	
370	H	4-ピリジル	Me	
371	H	3-Me-2-ピリジル	Me	183
372	H	4-Me-2-ピリジル	Me	134
373	H	5-Me-2-ピリジル	Me	94
374	H	6-Me-2-ピリジル	Me	183
375	H	2-Me-3-ピリジル	Me	
376	H	4-Me-3-ピリジル	Me	
377	H	5-Me-3-ピリジル	Me	
378	H	6-Me-3-ピリジル	Me	
379	H	2-Me-4-ピリジル	Me	
380	H	3-Me-4-ピリジル	Me	
381	H	3-Me-2-チエニル	Me	
382	H	4-Me-2-チエニル	Me	196
383	H	5-Me-2-チエニル	Me	189
384	H	2-Me-3-チエニル	Me	
385	H	4-Me-3-チエニル	Me	
386	H	5-Me-3-チエニル	Me	
387	H	3, 4-Me ₂ -2-チエニル	Me	
388	H	3, 5-Me ₂ -2-チエニル	Me	
389	H	4, 5-Me ₂ -2-チエニル	Me	
390	H	2, 4-Me ₂ -3-チエニル	Me	
391	H	2, 5-Me ₂ -3-チエニル	Me	
392	H	4, 5-Me ₂ -3-チエニル	Me	
393	H	3-Cl-2-チエニル	Me	

10

20

30

40

【表 1 4】

(表 1 続き)

実施例	(Y) _n	R ²	R ¹	m. p. [°C]
394	H	4-Cl-2-チエニル	Me	
395	H	5-Cl-2-チエニル	Me	212-213
396	H	2-Cl-3-チエニル	Me	
397	H	4-Cl-3-チエニル	Me	
398	H	5-Cl-3-チエニル	Me	
399	H	3,4-Cl ₂ -2-チエニル	Me	
400	H	3,5-Cl ₂ -2-チエニル	Me	
401	H	4,5-Cl ₂ -2-チエニル	Me	
402	H	2,4-Cl ₂ -3-チエニル	Me	
403	H	2,5-Cl ₂ -3-チエニル	Me	169
404	H	4,5-Cl ₂ -3-チエニル	Me	
405	H	Me	(CH ₂) ₂ NEt ₂	油状
406	H	Et	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
407	H	Pr	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
408	H	i-Pr	(CH ₂) ₂ NEt ₂	油状
409	H	Bu	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
410	H	i-Bu	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
411	H	s-Bu	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
412	H	t-Bu	(CH ₂) ₂ NEt ₂	油状
413	H	シクロプロピル	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
414	H	シクロブチル	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
415	H	シクロペンチル	(CH ₂) ₂ NEt ₂	油状
416	H	シクロヘキシル	(CH ₂) ₂ NEt ₂	油状
417	H	シクロヘプチル	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
418	H	トリフルオロメチル	(CH ₂) ₂ NEt ₂	油状
419	H	ベンジル	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
420	H	1-フェニルエチル	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
421	H	2-フェニルエチル	(CH ₂) ₂ NEt ₂	油状
422	H	2-ピコリル	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
423	H	3-ピコリル	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
424	H	4-ピコリル	(CH ₂) ₂ NEt ₂	

10

20

30

40

【表 15】

(表 1 続き)

実施例	(Y) _n	R ²	R ¹	m. p. [°C]
425	H	2-チエニルメチル	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
426	H	3-チエニルメチル	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
427	H	4-クロロベンジル	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
428	H	4-メチルベンジル	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
429	H	4-メトキシベンジル	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
430	H	3-インドリルメチル	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
431	H	Ph	(CH ₂) ₂ NEt ₂	油状
432	H	Ph	(CH ₂) ₂ NEt ₂ · HCl	134
433	5-Me	Ph	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
434	6-Me	Ph	(CH ₂) ₂ NEt ₂	油状
435	6-Me	Ph	(CH ₂) ₂ NEt ₂ · HCl	223
436	7-Me	Ph	(CH ₂) ₂ NEt ₂	78
437	8-Me	Ph	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
438	5-Cl	Ph	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
439	6-Cl	Ph	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
440	7-Cl	Ph	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
441	8-Cl	Ph	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
442	5-F	Ph	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
443	6-F	Ph	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
444	7-F	Ph	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
445	8-F	Ph	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
446	5-OMe	Ph	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
447	6- OMe	Ph	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
448	7- OMe	Ph	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
449	8- OMe	Ph	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
450	5-CF ₃	Ph	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
451	6-CF ₃	Ph	(CH ₂) ₂ NEt ₂	油状
452	7-CF ₃	Ph	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
453	8-CF ₃	Ph	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
454	6, 7-Me ₂	Ph	(CH ₂) ₂ NEt ₂	77
455	5, 6- Me ₂	Ph	(CH ₂) ₂ NEt ₂	

10

20

30

40

【表 16】

(表 1 続き)

実施例	(Y) _n	R ²	R ¹	m. p. [°C]
456	7, 8- Me ₂	Ph	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
457	5, 7- Me ₂	Ph	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
458	6, 8- Me ₂	Ph	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
459	5, 8- Me ₂	Ph	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
460	6, 7-Cl ₂	Ph	(CH ₂) ₂ NEt ₂	109
461	5, 6- Cl ₂	Ph	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
462	7, 8- Cl ₂	Ph	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
463	6, 8- Cl ₂	Ph	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
464	5, 8- Cl ₂	Ph	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
465	6, 7-(OMe) ₂	Ph	(CH ₂) ₂ NEt ₂	油状
466	6, 7-O-CF ₂ -O-	Ph	(CH ₂) ₂ NEt ₂	78-79
467	6, 7-F ₂	Ph	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
468	5, 6- F ₂	Ph	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
469	7, 8- F ₂	Ph	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
470	6, 8- F ₂	Ph	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
471	5, 8- F ₂	Ph	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
472	6, 7-CF ₃	Ph	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
473	5, 6- CF ₃	Ph	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
474	7, 8- CF ₃	Ph	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
475	6, 8- CF ₃	Ph	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
476	5, 8- CF ₃	Ph	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
477	6-Cl, 7-F	Ph	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
478	H	2-Th	(CH ₂) ₂ NEt ₂	油状
479	H	2-Th	(CH ₂) ₂ NEt ₂ · HCl	
480	5-Me	2-Th	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
481	6-Me	2-Th	(CH ₂) ₂ NEt ₂	86
482	6-Me	2-Th	(CH ₂) ₂ NEt ₂ · HCl	275
483	7-Me	2-Th	(CH ₂) ₂ NEt ₂	油状
484	8-Me	2-Th	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
485	5-Cl	2-Th	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
486	6-Cl	2-Th	(CH ₂) ₂ NEt ₂	油状

10

20

30

40

【表 17】
(表 1 続き)

実施例	(Y) _n	R ²	R ¹	m. p. [°C]
487	7-Cl	2-Th	(CH ₂) ₂ NEt ₂	油状
488	8-Cl	2-Th	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
489	5-F	2-Th	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
490	6-F	2-Th	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
491	7-F	2-Th	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
492	8-F	2-Th	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
493	5-OMe	2-Th	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
494	6- OMe	2-Th	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
495	7- OMe	2-Th	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
496	8- OMe	2-Th	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
497	5-CF ₃	2-Th	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
498	6-CF ₃	2-Th	(CH ₂) ₂ NEt ₂	固形
499	7-CF ₃	2-Th	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
500	8-CF ₃	2-Th	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
501	6, 7-Me ₂	2-Th	(CH ₂) ₂ NEt ₂	129
502	5, 6- Me ₂	2-Th	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
503	7, 8- Me ₂	2-Th	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
504	5, 7- Me ₂	2-Th	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
505	6, 8- Me ₂	2-Th	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
506	5, 8- Me ₂	2-Th	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
507	6, 7-Cl ₂	2-Th	(CH ₂) ₂ NEt ₂	油状
508	5, 6- Cl ₂	2-Th	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
509	7, 8- Cl ₂	2-Th	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
510	6, 8- Cl ₂	2-Th	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
511	5, 8- Cl ₂	2-Th	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
512	6, 7-(OMe) ₂	2-Th	(CH ₂) ₂ NEt ₂	127
513	6, 7-O-CF ₂ -O-	2-Th	(CH ₂) ₂ NEt ₂	70-71
514	6, 7-F ₂	2-Th	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
515	5, 6- F ₂	2-Th	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
516	7, 8- F ₂	2-Th	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
517	6, 8- F ₂	2-Th	(CH ₂) ₂ NEt ₂	

10

20

30

40

【表 18】
(表 1 続き)

実施例	(Y) _n	R ²	R ¹	m. p. [°C]
518	5, 8- F ₂	2-Th	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
519	6, 7-CF ₃	2-Th	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
520	5, 6- CF ₃	2-Th	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
521	7, 8- CF ₃	2-Th	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
522	6, 8- CF ₃	2-Th	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
523	5, 8- CF ₃	2-Th	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
524	6-Cl, 7-F	2-Th	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
525	6-COOEt	2-Th	(CH ₂) ₂ NEt ₂	油状
526	H	p-トリル	(CH ₂) ₂ NEt ₂	油状
527	H	m-トリル	(CH ₂) ₂ NEt ₂	油状
528	H	o-トリル	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
529	H	4-tBu	(CH ₂) ₂ NEt ₂	油状
530	H	4-C ₆ H ₄ Cl	(CH ₂) ₂ NEt ₂	油状
531	H	3-C ₆ H ₄ Cl	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
532	H	2-C ₆ H ₄ Cl	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
533	H	4-C ₆ H ₄ F	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
534	H	3-C ₆ H ₄ F	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
535	H	2-C ₆ H ₄ F	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
536	H	4-C ₆ H ₄ OMe	(CH ₂) ₂ NEt ₂	油状
537	H	3-C ₆ H ₄ OMe	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
538	H	2-C ₆ H ₄ OMe	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
539	H	4-C ₆ H ₄ CF ₃	(CH ₂) ₂ NEt ₂	油状
540	H	3-C ₆ H ₄ CF ₃	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
541	H	2-C ₆ H ₄ CF ₃	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
542	H	2, 3-C ₆ H ₃ Me ₂	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
543	H	2, 4-C ₆ H ₃ Me ₂	(CH ₂) ₂ NEt ₂	油状
544	H	2, 5-C ₆ H ₃ Me ₂	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
545	H	2, 6-C ₆ H ₃ Me ₂	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
546	H	3, 4-C ₆ H ₃ Me ₂	(CH ₂) ₂ NEt ₂	油状
546a	H	3, 4-C ₆ H ₃ Me ₂	(CH ₂) ₂ NEt ₂ · HCl	137
547	H	3, 5-C ₆ H ₃ Me ₂	(CH ₂) ₂ NEt ₂	油状

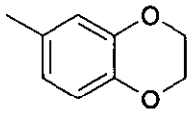
10

20

30

40

【表 19】
(表 1 続き)

実施例	(Y) _n	R ²	R ¹	m. p. [°C]
548	H	2, 4, 6-C ₆ H ₂ Me ₃	(CH ₂) ₂ NEt ₂	油状
549	H	3, 4-C ₆ H ₃ (OMe) ₂	(CH ₂) ₂ NEt ₂	97
560	H		(CH ₂) ₂ NEt ₂	油状
561	H	2, 3-C ₆ H ₃ Cl ₂	(CH ₂) ₂ NEt ₂	油状
562	H	2, 4-C ₆ H ₃ Cl ₂	(CH ₂) ₂ NEt ₂	油状
563	H	2, 5-C ₆ H ₃ Cl ₂	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
564	H	2, 6-C ₆ H ₃ Cl ₂	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
565	H	3, 4-C ₆ H ₃ Cl ₂	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
566	H	3, 5-C ₆ H ₃ Cl ₂	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
567	H	2, 4, 6-C ₆ H ₂ Cl ₃	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
568	H	4-Cl, 2-F, 5-OMe-C ₆ H ₂	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
569	H	3-Th	(CH ₂) ₂ NEt ₂	油状
570	H	2-フリル	(CH ₂) ₂ NEt ₂	油状
571	H	3-フリル	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
572	H	2-チアゾリル	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
573	H	4-チアゾリル	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
574	H	5-チアゾリル	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
575	H	2-ピリジル	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
575a	H	2-ピリジル	(CH ₂) ₂ NEt ₂ · HO-CO-CF ₃	油状
576	H	3-ピリジル	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
577	H	4-ピリジル	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
578	H	3-Me-2-ピリジル	(CH ₂) ₂ NEt ₂	油状
579	H	4-Me-2-ピリジル	(CH ₂) ₂ NEt ₂	油状
580	H	5-Me-2-ピリジル	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
581	H	6-Me-2-ピリジル	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
581a	H	6-Me-2-ピリジル	(CH ₂) ₂ NEt ₂ · HO-CO-CF ₃	油状
582	H	2-Me-3-ピリジル	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
583	H	4-Me-3-ピリジル	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
584	H	5-Me-3-ピリジル	(CH ₂) ₂ NEt ₂	

10

20

30

40

【表 20】

(表 1 続き)

実施例	(Y) _n	R ²	R ¹	m. p. [°C]
585	H	6-Me-3-ピリジル	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
586	H	2-Me-4-ピリジル	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
587	H	3-Me-4-ピリジル	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
588	H	2-Me-3-チエニル	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
588a	H	3-Me-2-チエニル	(CH ₂) ₂ NEt ₂	油状
589	H	4-Me-3-チエニル	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
589a	H	4-Me-2-チエニル	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
590	H	5-Me-3-チエニル	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
590a	H	5-Me-2-チエニル	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
591	H	3, 4-Me ₂ -2-チエニル	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
592	H	3, 5-Me ₂ -2-チエニル	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
593	H	4, 5-Me ₂ -2-チエニル	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
594	H	2, 4-Me ₂ -3-チエニル	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
595	H	2, 5-Me ₂ -3-チエニル	(CH ₂) ₂ NEt ₂	油状
596	H	4, 5-Me ₂ -3-チエニル	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
597	H	3-Cl-2-チエニル	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
598	H	4-Cl-2-チエニル	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
599	H	5-Cl-2-チエニル	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
600	H	2-Cl-3-チエニル	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
601	H	4-Cl-3-チエニル	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
602	H	5-Cl-3-チエニル	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
603	H	3, 4-Cl ₂ -2-チエニル	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
604	H	3, 5- Cl ₂ -2-チエニル	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
605	H	4, 5- Cl ₂ -2-チエニル	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
606	H	2, 4- Cl ₂ -3-チエニル	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
607	H	2, 5- Cl ₂ -3-チエニル	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
608	H	4, 5- Cl ₂ -3-チエニル	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
609	H	Me	CH ₂ COOMe	135-136
610	H	Et	CH ₂ COOMe	
611	H	Pr	CH ₂ COOMe	
612	H	i-Pr	CH ₂ COOMe	油状

10

20

30

40

【表 2 1】
 (表 1 続き)

実施例	(Y) _n	R ²	R ¹	m. p. [°C]
613	7-OMe	i-Pr	CH ₂ COOMe	
614	6,7-Cl ₂	i-Pr	CH ₂ COOMe	
615	6,7-Me ₂	i-Pr	CH ₂ COOMe	
616	H	Bu	CH ₂ COOMe	
617	H	i-Bu	CH ₂ COOMe	
618	H	s-Bu	CH ₂ COOMe	
619	H	t-Bu	CH ₂ COOMe	
620	H	シクロプロピル	CH ₂ COOMe	
621	H	シクロブチル	CH ₂ COOMe	
622	H	シクロペンチル	CH ₂ COOMe	
623	H	シクロヘキシル	CH ₂ COOMe	
624	H	シクロヘプチル	CH ₂ COOMe	
625	H	トリフルオロメチル	CH ₂ COOMe	
626	H	ベンジル	CH ₂ COOMe	
627	H	1-フェニルエチル	CH ₂ COOMe	
628	H	2-フェニルエチル	CH ₂ COOMe	
629	H	2-ピコリル	CH ₂ COOMe	
630	H	3-ピコリル	CH ₂ COOMe	
631	H	4-ピコリル	CH ₂ COOMe	
632	H	2-チエニルメチル	CH ₂ COOMe	
633	H	3-チエニルメチル	CH ₂ COOMe	
634	H	4-クロロベンジル	CH ₂ COOMe	
635	H	4-メチルベンジル	CH ₂ COOMe	
636	H	4-メトキシベンジル	CH ₂ COOMe	
637	H	3-インドリルメチル	CH ₂ COOMe	
638	H	Ph	CH ₂ COOMe	油状
639	5-Me	Ph	CH ₂ COOMe	
640	6-Me	Ph	CH ₂ COOMe	
641	7-Me	Ph	CH ₂ COOMe	
642	8-Me	Ph	CH ₂ COOMe	
643	5-Cl	Ph	CH ₂ COOMe	

10

20

30

40

【表 2 2】

(表 1 続き)

実施例	(Y) _n	R ²	R ¹	m. p. [°C]
644	6-Cl	Ph	CH ₂ COOMe	
645	7-Cl	Ph	CH ₂ COOMe	
646	8-Cl	Ph	CH ₂ COOMe	
647	5-F	Ph	CH ₂ COOMe	
648	6-F	Ph	CH ₂ COOMe	
649	7-F	Ph	CH ₂ COOMe	
650	8-F	Ph	CH ₂ COOMe	
651	5-OMe	Ph	CH ₂ COOMe	
652	6- OMe	Ph	CH ₂ COOMe	
653	7- OMe	Ph	CH ₂ COOMe	
654	8- OMe	Ph	CH ₂ COOMe	
655	5-CF ₃	Ph	CH ₂ COOMe	
656	6-CF ₃	Ph	CH ₂ COOMe	
657	7-CF ₃	Ph	CH ₂ COOMe	
658	8-CF ₃	Ph	CH ₂ COOMe	
659	6, 7-Me ₂	Ph	CH ₂ COOMe	185
660	5, 7-Me ₂	Ph	CH ₂ COOMe	
661	5, 6- Me ₂	Ph	CH ₂ COOMe	
662	7, 8- Me ₂	Ph	CH ₂ COOMe	
663	5, 7- Me ₂	Ph	CH ₂ COOMe	
664	6, 8- Me ₂	Ph	CH ₂ COOMe	
665	5, 8- Me ₂	Ph	CH ₂ COOMe	
666	6, 7-Cl ₂	Ph	CH ₂ COOMe	
667	5, 6- Cl ₂	Ph	CH ₂ COOMe	
668	5, 7- Cl ₂	Ph	CH ₂ COOMe	
669	7, 8- Cl ₂	Ph	CH ₂ COOMe	
670	6, 8- Cl ₂	Ph	CH ₂ COOMe	
671	5, 8- Cl ₂	Ph	CH ₂ COOMe	
672	6, 7-(OMe) ₂	Ph	CH ₂ COOMe	
673	6, 7-O-CF ₂ -O-	Ph	CH ₂ COOMe	
674	6, 7-F ₂	Ph	CH ₂ COOMe	

10

20

30

40

【表 2 3】

(表 1 続き)

実施例	(Y) _n	R ²	R ¹	m. p. [°C]
675	5, 7- F ₂	Ph	CH ₂ COOMe	
676	5, 6- F ₂	Ph	CH ₂ COOMe	
677	7, 8- F ₂	Ph	CH ₂ COOMe	
678	6, 8- F ₂	Ph	CH ₂ COOMe	
679	5, 8- F ₂	Ph	CH ₂ COOMe	
680	6, 7- (CF ₃) ₂	Ph	CH ₂ COOMe	
681	5, 7- (CF ₃) ₂	Ph	CH ₂ COOMe	
682	5, 6- (CF ₃) ₂	Ph	CH ₂ COOMe	
683	7, 8- (CF ₃) ₂	Ph	CH ₂ COOMe	
684	6, 8- (CF ₃) ₂	Ph	CH ₂ COOMe	
685	5, 8- (CF ₃) ₂	Ph	CH ₂ COOMe	
686	6-Cl, 7-F	Ph	CH ₂ COOMe	
687	H	2-Th	CH ₂ COOMe	油状
688	5-Me	2-Th	CH ₂ COOMe	油状
689	6-Me	2-Th	CH ₂ COOMe	油状
690	7-Me	2-Th	CH ₂ COOMe	
691	8-Me	2-Th	CH ₂ COOMe	油状
692	5-Cl	2-Th	CH ₂ COOMe	
693	6-Cl	2-Th	CH ₂ COOMe	
694	7-Cl	2-Th	CH ₂ COOMe	
695	8-Cl	2-Th	CH ₂ COOMe	
696	5-F	2-Th	CH ₂ COOMe	
697	6-F	2-Th	CH ₂ COOMe	
698	7-F	2-Th	CH ₂ COOMe	
699	8-F	2-Th	CH ₂ COOMe	
700	5-OMe	2-Th	CH ₂ COOMe	
701	6- OMe	2-Th	CH ₂ COOMe	
702	7- OMe	2-Th	CH ₂ COOMe	
703	8- OMe	2-Th	CH ₂ COOMe	
704	5-CF ₃	2-Th	CH ₂ COOMe	
705	6-CF ₃	2-Th	CH ₂ COOMe	

10

20

30

40

【表 2 4】

(表 1 続き)

実施例	(Y) _n	R ²	R ¹	m. p. [°C]
706	7-CF ₃	2-Th	CH ₂ COOMe	
707	8-CF ₃	2-Th	CH ₂ COOMe	
708	6, 7-Me ₂	2-Th	CH ₂ COOMe	油状
709	5, 7-Me ₂	2-Th	CH ₂ COOMe	
710	5, 6- Me ₂	2-Th	CH ₂ COOMe	
711	7, 8- Me ₂	2-Th	CH ₂ COOMe	
712	5, 7- Me ₂	2-Th	CH ₂ COOMe	
713	6, 8- Me ₂	2-Th	CH ₂ COOMe	
714	5, 8- Me ₂	2-Th	CH ₂ COOMe	
715	6, 7-Cl ₂	2-Th	CH ₂ COOMe	
716	5, 7-Cl ₂	2-Th	CH ₂ COOMe	
717	5, 6- Cl ₂	2-Th	CH ₂ COOMe	
718	7, 8- Cl ₂	2-Th	CH ₂ COOMe	
719	6, 8- Cl ₂	2-Th	CH ₂ COOMe	
720	5, 8- Cl ₂	2-Th	CH ₂ COOMe	
721	6, 7-(OMe) ₂	2-Th	CH ₂ COOMe	
722	6, 7-O-CF ₂ -O-	2-Th	CH ₂ COOMe	
723	6, 7-F ₂	2-Th	CH ₂ COOMe	
724	5, 7-F ₂	2-Th	CH ₂ COOMe	
725	5, 6- F ₂	2-Th	CH ₂ COOMe	
726	7, 8- F ₂	2-Th	CH ₂ COOMe	
727	6, 8- F ₂	2-Th	CH ₂ COOMe	
728	5, 8- F ₂	2-Th	CH ₂ COOMe	
729	5, 7-(CF ₃) ₂	2-Th	CH ₂ COOMe	
730	6, 7-(CF ₃) ₂	2-Th	CH ₂ COOMe	
731	5, 6- (CF ₃) ₂	2-Th	CH ₂ COOMe	
732	7, 8- (CF ₃) ₂	2-Th	CH ₂ COOMe	
733	6, 8- (CF ₃) ₂	2-Th	CH ₂ COOMe	
734	5, 8- (CF ₃) ₂	2-Th	CH ₂ COOMe	
735	6-Cl, 7-F	2-Th	CH ₂ COOMe	
736	7-COOMe	2-Th	CH ₂ COOMe	

10

20

30

40

【表 2 5】
 (表 1 続き)

実施例	(Y) _n	R ²	R ¹	m. p. [°C]
737	7-COOEt	2-Th	CH ₂ COOMe	
738	H	p-トリル	CH ₂ COOMe	
739	H	m-トリル	CH ₂ COOMe	
740	H	o-トリル	CH ₂ COOMe	
741	H	4-tBu	CH ₂ COOMe	
742	H	4-C ₆ H ₄ Cl	CH ₂ COOMe	
743	H	3-C ₆ H ₄ Cl	CH ₂ COOMe	
744	H	2-C ₆ H ₄ Cl	CH ₂ COOMe	
745	H	4-C ₆ H ₄ F	CH ₂ COOMe	
746	H	3-C ₆ H ₄ F	CH ₂ COOMe	
747	H	2-C ₆ H ₄ F	CH ₂ COOMe	
748	H	4-C ₆ H ₄ OMe	CH ₂ COOMe	
749	H	3-C ₆ H ₄ OMe	CH ₂ COOMe	
750	H	2-C ₆ H ₄ OMe	CH ₂ COOMe	
751	H	4-C ₆ H ₄ CF ₃	CH ₂ COOMe	
752	H	3-C ₆ H ₄ CF ₃	CH ₂ COOMe	
753	H	2-C ₆ H ₄ CF ₃	CH ₂ COOMe	
754	H	2, 3-C ₆ H ₃ Me ₂	CH ₂ COOMe	
755	H	2, 4-C ₆ H ₃ Me ₂	CH ₂ COOMe	
756	H	2, 5-C ₆ H ₃ Me ₂	CH ₂ COOMe	
757	H	2, 6-C ₆ H ₃ Me ₂	CH ₂ COOMe	
758	H	3, 4-C ₆ H ₃ Me ₂	CH ₂ COOMe	
759	H	3, 5-C ₆ H ₃ Me ₂	CH ₂ COOMe	
760	H	2, 3-C ₆ H ₃ Cl ₂	CH ₂ COOMe	
761	H	2, 4-C ₆ H ₃ Cl ₂	CH ₂ COOMe	
762	H	2, 5-C ₆ H ₃ Cl ₂	CH ₂ COOMe	
763	H	2, 6-C ₆ H ₃ Cl ₂	CH ₂ COOMe	
764	H	3, 4-C ₆ H ₃ Cl ₂	CH ₂ COOMe	
765	H	3, 5-C ₆ H ₃ Cl ₂	CH ₂ COOMe	
766	H	2, 4, 6-C ₆ H ₂ Me ₃	CH ₂ COOMe	
767	H	3, 4-C ₆ H ₃ (OMe) ₂	CH ₂ COOMe	

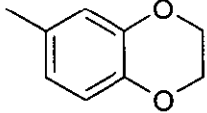
10

20

30

40

【表 2 6】
 (表 1 続き)

実施例	(Y) _n	R ²	R ¹	m. p. [°C]
768	H		CH ₂ COOMe	
769	H	4-Cl, 2-F, 5-OMe-Ph	CH ₂ COOMe	
770	H	3-Th	CH ₂ COOMe	
771	H	2-フリル	CH ₂ COOMe	
772	H	3-フリル	CH ₂ COOMe	
773	H	2-チアゾリル	CH ₂ COOMe	
774	H	4-チアゾリル	CH ₂ COOMe	
775	H	5-チアゾリル	CH ₂ COOMe	
776	H	2-ピリジル	CH ₂ COOMe	
777	H	3-ピリジル	CH ₂ COOMe	
778	H	4-ピリジル	CH ₂ COOMe	
779	H	3-Me-2-ピリジル	CH ₂ COOMe	
780	H	4-Me-2-ピリジル	CH ₂ COOMe	
781	H	5-Me-2-ピリジル	CH ₂ COOMe	
782	H	6-Me-2-ピリジル	CH ₂ COOMe	
783	H	2-Me-3-ピリジル	CH ₂ COOMe	
784	H	4-Me-3-ピリジル	CH ₂ COOMe	
785	H	5-Me-3-ピリジル	CH ₂ COOMe	
786	H	6-Me-3-ピリジル	CH ₂ COOMe	
787	H	2-Me-4-ピリジル	CH ₂ COOMe	
788	H	3-Me-4-ピリジル	CH ₂ COOMe	
789	H	3-Me-2-チエニル	CH ₂ COOMe	
790	H	4-Me-2-チエニル	CH ₂ COOMe	
791	H	5-Me-2-チエニル	CH ₂ COOMe	
792	H	2-Me-3-チエニル	CH ₂ COOMe	
793	H	4-Me-3-チエニル	CH ₂ COOMe	
794	H	5-Me-3-チエニル	CH ₂ COOMe	
795	H	3, 4-Me ₂ -2-チエニル	CH ₂ COOMe	
796	H	3, 5-Me ₂ -2-チエニル	CH ₂ COOMe	

10

20

30

40

【表 27】
 (表 1 続き)

実施例	(Y) _n	R ²	R ¹	m. p. [°C]
797	H	4,5-Me ₂ -2-チエニル	CH ₂ COOMe	
798	H	2,4-Me ₂ -3-チエニル	CH ₂ COOMe	
799	H	2,5-Me ₂ -3-チエニル	CH ₂ COOMe	
800	H	4,5-Me ₂ -3-チエニル	CH ₂ COOMe	
801	H	3-Cl-2-チエニル	CH ₂ COOMe	
802	H	4-Cl-2-チエニル	CH ₂ COOMe	
803	H	5-Cl-2-チエニル	CH ₂ COOMe	
804	H	2-Cl-3-チエニル	CH ₂ COOMe	
805	H	4-Cl-3-チエニル	CH ₂ COOMe	
806	H	5-Cl-3-チエニル	CH ₂ COOMe	
807	H	3,4-Cl ₂ -2-チエニル	CH ₂ COOMe	
808	H	3,5-Cl ₂ -2-チエニル	CH ₂ COOMe	
809	H	4,5-Cl ₂ -2-チエニル	CH ₂ COOMe	
810	H	2,4-Cl ₂ -3-チエニル	CH ₂ COOMe	
811	H	2,5-Cl ₂ -3-チエニル	CH ₂ COOMe	
812	H	4,5-Cl ₂ -3-チエニル	CH ₂ COOMe	
813	H	Ph	CH ₂ COOEt	116
814	H	Ph	CH ₂ COOPr	102
815	H	Ph	CH ₂ CH ₂ COOiPr	145
816	H	Ph	CH ₂ COOBu	
817	H	Ph	CH ₂ COOiBu	
818	H	Ph	CH ₂ COOsBu	
819	H	Ph	CH ₂ COOtBu	
820	H	Ph	CH ₂ COOH	228
821	H	Ph	CH(Me)COOMe	
822	H	Ph	CH(Me)COOEt	
823	H	Ph	(CH ₂) ₂ COOMe	
824	H	Ph	(CH ₂) ₂ COOEt	
825	H	Ph	(CH ₂) ₃ COOMe	
826	H	Ph	(CH ₂) ₃ COOEt	
827	H	Ph	(CH ₂) ₃ COOH	

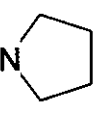
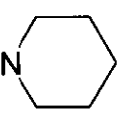
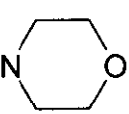
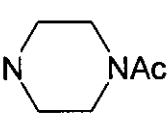
10

20

30

40

【表 2 8】
 (表 1 続き)

実施例	(Y) _n	R ²	R ¹	m. p. [°C]
828	H	Ph	CH ₂ CONMe ₂	
829	H	Ph	CH ₂ CONEt ₂	149-150
830	H	Ph	CH ₂ CONPr ₂	
831	H	Ph	CH ₂ CONiPr ₂	
832	H	Ph	CH ₂ CONMeEt	
833	H	Ph	CH ₂ CO-N 	
834	H	Ph	CH ₂ CO-N 	
835	H	Ph	CH ₂ CO-N  O	207
836	H	Ph	CH ₂ CO-N  NAc	
837	H	Ph	CH ₂ CONMe (OMe)	219-220
838	H	Ph	CH ₂ CONMePh	
839	H	Ph	CH ₂ CONHMe	
840	H	Ph	CH ₂ CONHEt	
841	H	Ph	CH ₂ CONHPr	
842	H	Ph	CH ₂ CONHiPr	
843	H	Ph	CH ₂ CONHBu	
844	H	Ph	CH ₂ CONHiBu	
845	H	Ph	CH ₂ CONHsBu	
846	H	Ph	CH ₂ CONHtBu	
847	H	Ph	CH ₂ CONHPh	
848	H	Ph	CH ₂ COMe	159-161
849	H	Ph	CH(CH ₃)COMe	
850	H	Ph	CH ₂ COCF ₃	
851	H	Ph	CH ₂ COEt	

10

20

30

40

【表 2 9】

(表 1 続き)

実施例	(Y) _n	R ²	R ¹	m. p. [°C]
852	H	Ph	CH ₂ COPr	
853	H	Ph	CH ₂ COiPr	
854	H	Ph	CH ₂ COTBu	
855	H	Ph	CH ₂ OMe	油状
856	H	Ph	CH ₂ OEt	油状
857	H	Ph	(CH ₂) ₂ OMe	油状
858	H	Ph	(CH ₂) ₂ OEt	油状
859	H	Ph	(CH ₂) ₂ OPr	
860	H	Ph	(CH ₂) ₂ OiPr	
861	H	Ph	(CH ₂) ₂ OTBu	油状
862	H	Ph	(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	油状
863	H	Ph	(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂ OEt	
864	H	Ph	(CH ₂) ₂ OCH ₂ CF ₃	
865	H	Ph	(CH ₂) ₂ OPh	
866	H	Ph	(CH ₂) ₃ OH	
867	H	Ph	(CH ₂) ₃ OMe	
868	H	Ph	(CH ₂) ₃ OEt	
869	H	Ph	(CH ₂) ₃ OPr	
870	H	Ph	(CH ₂) ₃ OiPr	
871	H	Ph	(CH ₂) ₃ OTBu	
872	H	Ph	(CH ₂) ₂ (OMe) ₂	
873	H	Ph	(CH ₂) ₂ (OEt) ₂	
874	H	Ph	CH ₂ (OMe) ₂	
875	H	Ph	CH ₂ (OEt) ₂	
876	H	Ph	CH ₂ CH(OMe)CH ₂ OMe	225
877	H	Ph	CH ₂ SMe	94
878	H	Ph	(CH ₂) ₂ SMe	
879	H	Ph	(CH ₂) ₂ SEt	
880	H	Ph	(CH ₂) ₂ SPr	
881	H	Ph	(CH ₂) ₂ SiPr	
882	H	Ph	(CH ₂) ₂ StBu	

10

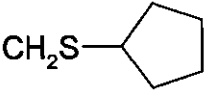
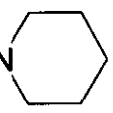
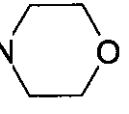
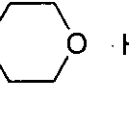
20

30

40

【表 3 0】

(表 1 続き)

実施例	(Y) _n	R ²	R ¹	m. p. [°C]
883	H	Ph	(CH ₂) ₂ SPh	油状
884	H	Ph	(CH ₂) ₂ SCH ₂ CF ₃	
885	H	Ph	(CH ₂) ₂ S-シクロペンチル	
886	H	Ph	CH ₂ S— 	
887	H	Ph	(CH ₂) ₂ S(O)Me	
888	H	Ph	(CH ₂) ₂ S(O) ₂ Me	
889	H	Ph	(CH ₂) ₂ S(O)Et	
890	H	Ph	(CH ₂) ₂ S(O) ₂ Et	
891	H	Ph	(CH ₂) ₂ S(O)Ph	
892	H	Ph	(CH ₂) ₂ S(O) ₂ Ph	153-154
893	H	Ph	(CH ₂) ₂ NH ₂	
893a	H	Ph	(CH ₂) ₂ NH ₂ · HCl	256
894	H	Ph	(CH ₂) ₂ NHMe · HCl	
895	H	Ph	(CH ₂) ₂ NHEt	
896	H	Ph	(CH ₂) ₂ NHPr	
897	H	Ph	(CH ₂) ₂ NHiPr	
898	H	Ph	(CH ₂) ₃ NH ₂	
899	H	Ph	(CH ₂) ₂ NMe ₂	
900	H	Ph	(CH ₂) ₂ NMe ₂ · HCl	
901	H	Ph	(CH ₂) ₂ NPr ₂	
902	H	Ph	(CH ₂) ₂ NiPr ₂	
903	H	Ph	(CH ₂) ₂ —N— 	
904	H	Ph	(CH ₂) ₂ —N— 	95
905	H	Ph	(CH ₂) ₂ —N—  · HCl	190

10



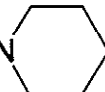

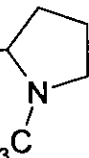
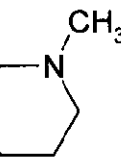
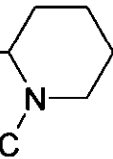
20

30

40

【表 3 1】

(表 1 続き)

実施例	(Y) _n	R ²	R ¹	m. p. [°C]
906	H	Ph	$(\text{CH}_2)_2\text{-N}$ 	
907	H	Ph	$(\text{CH}_2)_3\text{NMe}_2$	油状
908	H	Ph	$(\text{CH}_2)_3\text{NMe}_2 \cdot \text{HCl}$	208-209
909	H	Ph	$(\text{CH}_2)_3\text{NEt}_2$	141
910	H	Ph	$(\text{CH}_2)_3\text{NEt}_2 \cdot \text{HCl}$	
911	H	Ph	$(\text{CH}_2)_3\text{-N}$ 	
912	H	Ph	$(\text{CH}_2)_3\text{-N}$ 	
913	H	Ph	$(\text{CH}_2)_3\text{-N}$ 	油状
914	H	Ph	$\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{NMe}_2$	
915	H	Ph	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{NMe}_2$	
916	H	Ph	$\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{NMe}_2$	74-75
917	H	Ph	$\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{NMe}_2 \cdot \text{HCl}$	198-199
918	H	Ph	$(\text{CH}_2)_2\text{-N}$ 	
919	H	Ph	$\text{CH}_2\text{-N}$ 	
920	H	Ph	$(\text{CH}_2)_2\text{-N}$ 	
921	H	Ph	$(\text{CH}_2)_2\text{NHAc}$	203

10




20

30

40

【表 3 2】

(表 1 続き)

実施例	(Y) _n	R ²	R ¹	m. p. [°C]
922	H	Ph	(CH ₂) ₂ NHCOEt	
923	H	Ph	(CH ₂) ₂ NHCOPr	
924	H	Ph	(CH ₂) ₂ NHCOiPr	
925	H	Ph	(CH ₂) ₂ NHCOBu	
926	H	Ph	(CH ₂) ₂ NHCOtBu	
927	H	Ph	(CH ₂) ₂ NHCOPh	
928	H	Ph	(CH ₂) ₂ NHCOOMe	151
929	H	Ph	(CH ₂) ₂ NHCOOEt	
930	H	Ph	(CH ₂) ₂ NHCOOPr	
931	H	Ph	(CH ₂) ₂ NHCOOiPr	
932	H	Ph	(CH ₂) ₂ NHCOOtBu	137
933	7-CF ₃	Ph	(CH ₂) ₂ NHCOOtBu	150-154
934	H	Ph	(CH ₂) ₂ NHCONHMe	
935	H	Ph	(CH ₂) ₂ NHCONMe ₂	
936	H	Ph	(CH ₂) ₂ NHCONHEt	
937	H	Ph	(CH ₂) ₂ NHCONEt ₂	
938	H	Ph	(CH ₂) ₂ NHCO-N 	
939	H	Ph	(CH ₂) ₂ NHCO-N 	
940	H	Ph	(CH ₂) ₂ NHCO-N 	
941	H	Ph	(CH ₂) ₂ NMeCONMe ₂	
942	H	Ph	(CH ₂) ₂ NMeCONEt ₂	
943	H	Ph	(CH ₂) ₂ NHSO ₂ Me	170
944	H	Ph	(CH ₂) ₂ NMeSO ₂ Me	
945	H	Ph	(CH ₂) ₂ NHSO ₂ Ph	
946	H	Ph	(CH ₂) ₂ NMeSO ₂ Ph	

10


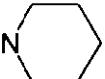
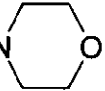
20

30

40

【表 3 3】

(表 1 続き)

実施例	(Y) _n	R ²	R ¹	m. p. [°C]
947	H	Ph	(CH ₂) ₂ OH	127-129
948	7-NO ₂	Ph	(CH ₂) ₂ OH	147-150
949	H	Ph	(CH ₂) ₂ OAc	113-114
950	H	Ph	(CH ₂) ₂ OCOPr	
951	H	Ph	(CH ₂) ₂ OCOiPr	
952	H	Ph	(CH ₂) ₂ OCOBu	
953	H	Ph	(CH ₂) ₂ OCOtBu	
954	H	Ph	(CH ₂) ₂ OCOOME	
955	H	Ph	(CH ₂) ₂ OCOOEt	
956	H	Ph	(CH ₂) ₂ OCOOPr	
957	H	Ph	(CH ₂) ₂ OCOOiPr	
958	H	Ph	(CH ₂) ₂ OCOOBu	
959	H	Ph	(CH ₂) ₂ OCOOtBu	
960	H	Ph	(CH ₂) ₂ OCOME ₂	
961	H	Ph	(CH ₂) ₂ OCONEt ₂	
962	H	Ph	(CH ₂) ₂ OCO-N 	
963	H	Ph	(CH ₂) ₂ OCO-N 	
964	H	Ph	(CH ₂) ₂ OCO-N 	
965	H	Ph	CH ₂ CH(OH)Me	104-105
966	H	Ph	CH ₂ CH(OH)CH ₂ OH	
967	H	Ph	Et	
968	H	Ph	Pr	
969	H	Ph	iPr	油状
970	H	Ph	Bu	
971	H	Ph	iBu	

10

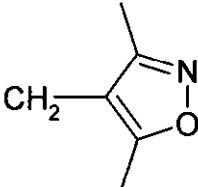
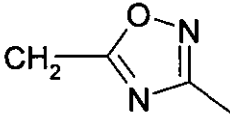
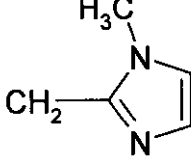
20

30

40

【表 3 4】

(表 1 続き)

実施例	(Y) _n	R ²	R ¹	m. p. [°C]
972	H	Ph	sBu	
973	H	Ph	tBu	
974	H	Ph	CH ₂ CH ₂ F	
975	H	Ph	CH ₂ CHF ₂	
976	H	Ph	CH ₂ CF ₃	145-146
977	H	Ph	(CH ₂) ₂ CF ₃	
978	H	Ph	CH ₂ -シクロプロピル	
979	H	Ph	CH ₂ -シクロブチル	
980	H	Ph	CH ₂ -シクロペンチル	
981	H	Ph	CH ₂ -シクロヘキシル	
982	H	Ph	ベンジル	151-152
983	H	Ph	2-フルフリル	
984	H	Ph	3-フルフリル	
985	H	Ph	2-チエニルメチル	
986	H	Ph	3-チエニルメチル	
987	H	Ph	2-(5-クロロチエニル)メチル	134
988	H	Ph		124-125
989	H	Ph		167
990	H	Ph		

10

20

30

40

【表 3 5】

(表 1 続き)

実施例	(Y) _n	R ²	R ¹	m. p. [°C]
991	H	Ph		
992	H	Ph		
993	H	Ph		
994	H	Ph		
995	H	Ph		
996	H	Ph		
997	H	Ph		
998	H	Ph		129-131
999	H	Ph		76-77

10

20

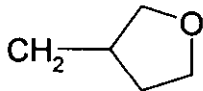
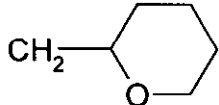
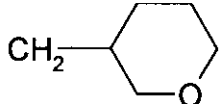
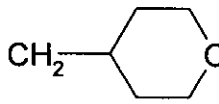
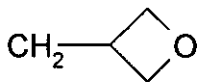
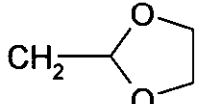
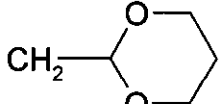
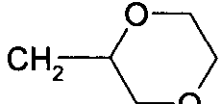
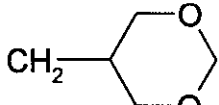
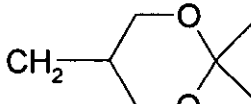
30

40

【 0 2 9 9 】

【表 3 6】

(表 1 続き)

実施例	(Y) _n	R ²	R ¹	m. p. [°C]
1000	H	Ph		118
1001	H	Ph		120-121
1002	H	Ph		
1003	H	Ph		
1004	H	Ph		
1005	H	Ph		113-114
1006	H	Ph		
1007	H	Ph		
1008	H	Ph		
1009	H	Ph		

10

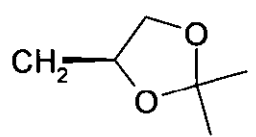
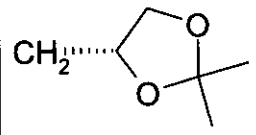
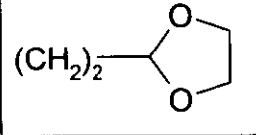
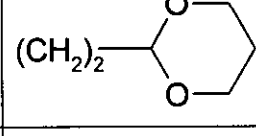
20

30

40

【 0 3 0 0 】

【表 3 7】
 (表 1 続き)

実施例	(Y) _n	R ²	R ¹	m. p. [°C]
1010	H	Ph		油状
1011	H	Ph		油状
1012	H	Ph		
1013	H	Ph		
1014	H	Ph	アリル	64-65
1015	H	Ph	クロチル	
1016	H	Ph	2-ペンテン-1-イル	
1017	H	Ph	2-メチルアリル	
1018	H	Ph	3-メチル-2-ブテン-1-イル	
1019	H	Ph	2-クロロ-2-プロペン-1-イル	
1020	H	Ph	2-フルオロ-2-プロペン-1-イル	
1021	H	Ph	2-ブロモ-2-プロペン-1-イル	
1022	H	Ph	3-クロロ-2-ブテン-1-イル	
1023	H	Ph	3-クロロ-2-プロペン-1-イル	
1024	H	Ph	3-ブロモ-2-プロペン-1-イル	
1025	H	Ph	2,3-ジクロロ-2-プロペン-1-イル	
1026	H	Ph	シンナミル	

10

20

30

40

【表 3 8】

(表 1 続き)

実施例	(Y) _n	R ²	R ¹	m. p. [°C]
1027	H	Ph	プロパルギル	139-141
1028	H	Ph	2-ブチン-1-イル	141
1029	H	Ph	フェニルプロパルギル	
1030	H	Ph	トリメチルシリルプロパルギル	
1031	H	Ph	CH ₂ CN	
1032	H	Ph	(CH ₂) ₂ CN	
1033	H	2-Th	CH ₂ COOEt	179
1034	H	2-Th	CH ₂ COOPr	168
1035	H	2-Th	CH ₂ CH ₂ COOiPr	141
1036	H	2-Th	CH ₂ COOBu	
1037	H	2-Th	CH ₂ COOiBu	
1038	H	2-Th	CH ₂ COOsBu	
1039	H	2-Th	CH ₂ COOtBu	134
1040	H	2-Th	CH ₂ COOH	固形
1041	H	2-Th	CH(Me)COOMe	132
1042	H	2-Th	CH(Me)COOEt	149
1043	H	2-Th	(CH ₂) ₂ COOMe	
1044	H	2-Th	(CH ₂) ₂ COOEt	
1045	H	2-Th	(CH ₂) ₃ COOMe	
1046	H	2-Th	(CH ₂) ₃ COOEt	
1047	H	2-Th	(CH ₂) ₃ COOH	
1048	H	2-Th	CH ₂ CONMe ₂	227-228
1049	6-Me	2-Th	CH ₂ CONMe ₂	>250
1050	6-Cl	2-Th	CH ₂ CONMe ₂	>250
1051	7-Me	2-Th	CH ₂ CONMe ₂	>250
1052	8-Me	2-Th	CH ₂ CONMe ₂	196
1053	6, 7-Me ₂	2-Th	CH ₂ CONMe ₂	>250
1054	H	2-Th	CH ₂ CONEt ₂	170-171
1055	6, 7-Me ₂	2-Th	CH ₂ CONEt ₂	216
1056	H	2-Th	CH ₂ CONPr ₂	

10

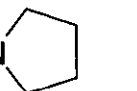

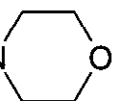
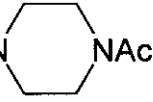
20

30

40

【表 3 9】

(表 1 続き)

実施例	(Y) _n	R ²	R ¹	m. p. [°C]
1057	H	2-Th	CH ₂ CONiPr ₂	
1058	H	2-Th	CH ₂ CONMe ₂	
1059	H	2-Th	CH ₂ CO-N 	
1060	H	2-Th	CH ₂ CO-N 	
1061	H	2-Th	CH ₂ CO-N 	254
1062	H	2-Th	CH ₂ CO-N 	
1063	H	2-Th	CH ₂ CONMe (OMe)	198-199
1064	H	2-Th	CH ₂ CONMePh	
1065	H	2-Th	CH ₂ CONHMe	
1066	H	2-Th	CH ₂ CONHEt	
1067	H	2-Th	CH ₂ CONHPr	
1068	H	2-Th	CH ₂ CONHiPr	
1069	H	2-Th	CH ₂ CONHBu	
1070	H	2-Th	CH ₂ CONHiBu	
1071	H	2-Th	CH ₂ CONHsBu	
1072	H	2-Th	CH ₂ CONHiBu	
1073	H	2-Th	CH ₂ CONHPh	>250
1074	H	2-Th	CH ₂ COMe	
1075	H	2-Th	CH(CH ₃)COMe	107
1076	H	2-Th	CH ₂ COCF ₃	
1077	H	2-Th	CH ₂ COEt	
1078	H	2-Th	CH ₂ COPr	
1079	H	2-Th	CH ₂ COiPr	
1080	H	2-Th	CH ₂ COtBu	

10

20

30

40

【表 4 0】
(表 1 続き)

実施例	(Y) _n	R ²	R ¹	m. p. [°C]
1081	H	2-Th	CH ₂ OMe	142
1082	H	2-Th	CH ₂ OEt	110
1083	H	2-Th	(CH ₂) ₂ OMe	115
1084	H	2-Th	(CH ₂) ₂ OEt	82-83
1085	H	2-Th	(CH ₂) ₂ OPr	
1086	H	2-Th	(CH ₂) ₂ OiPr	
1087	H	2-Th	(CH ₂) ₂ OtBu	油状
1088	H	2-Th	(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	油状
1089	H	2-Th	(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂ OEt	
1090	H	2-Th	(CH ₂) ₂ OCH ₂ CF ₃	
1091	H	2-Th	(CH ₂) ₂ OPh	
1092	H	2-Th	(CH ₂) ₃ OH	
1093	H	2-Th	(CH ₂) ₃ OMe	
1094	H	2-Th	(CH ₂) ₃ OEt	
1095	H	2-Th	(CH ₂) ₃ OPr	
1096	H	2-Th	(CH ₂) ₃ OiPr	
1097	H	2-Th	(CH ₂) ₃ OtBu	
1098	H	2-Th	(CH ₂) ₂ CH(OMe) ₂	
1100	H	2-Th	(CH ₂) ₂ CH(OEt) ₂	
1101	H	2-Th	CH ₂ CH(OMe) ₂	
1102	H	2-Th	CH ₂ CH(OEt) ₂	80
1103	H	2-Th	CH ₂ CH(OMe)CH ₂ OMe	油状
1104	H	2-Th	CH ₂ SMe	156
1105	H	2-Th	(CH ₂) ₂ SMe	111-112
1106	H	2-Th	(CH ₂) ₂ SEt	油状
1107	H	2-Th	(CH ₂) ₂ SPr	
1108	H	2-Th	(CH ₂) ₂ SiPr	油状
1109	H	2-Th	(CH ₂) ₂ StBu	
1110	H	2-Th	(CH ₂) ₂ SPh	油状
1111	H	2-Th	(CH ₂) ₂ SCH ₂ CF ₃	油状
1112	H	2-Th	(CH ₂) ₂ S-シクロペンチル	油状

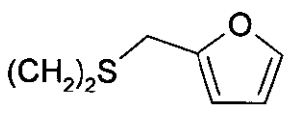
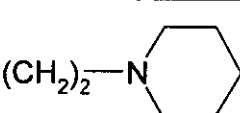
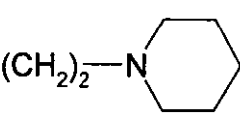
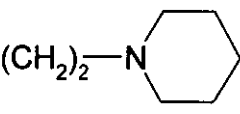
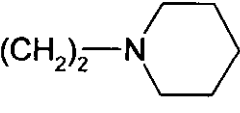
10

20

30

40

【表 4 1】
 (表 1 続き)

実施例	(Y) _n	R ²	R ¹	m. p. [°C]
1113	H	2-Th		油状
1114	H	2-Th	(CH ₂) ₂ S(O)Me	183
1115	H	2-Th	(CH ₂) ₂ S(O) ₂ Me	219-220
1116	H	2-Th	(CH ₂) ₂ S(O)Et	
1117	H	2-Th	(CH ₂) ₂ S(O) ₂ Et	
1118	H	2-Th	(CH ₂) ₂ S(O)Ph	
1119	H	2-Th	(CH ₂) ₂ S(O) ₂ Ph	231
1120	H	2-Th	(CH ₂) ₂ NH ₂ · HCl	>250
1121	H	2-Th	(CH ₂) ₂ NHMe	
1122	H	2-Th	(CH ₂) ₂ NHEt	
1123	H	2-Th	(CH ₂) ₂ NHPr	
1124	H	2-Th	(CH ₂) ₂ NHiPr	
1125	H	2-Th	(CH ₂) ₃ NH ₂	
1126	H	2-Th	(CH ₂) ₂ NMe ₂	95-96
1127	H	2-Th	(CH ₂) ₂ NMe ₂ · HCl	
1128	H	2-Th	(CH ₂) ₂ NPr ₂	
1129	H	2-Th	(CH ₂) ₂ NiPr ₂	油状
1130	H	2-Th	(CH ₂) ₂ NiPr ₂ · HCl	256-257
1131	H	2-Th		102-103
1132	6,7-Me ₂	2-Th		135
1133	6-Cl	2-Th		119
1134	7-Me	2-Th		油状

10

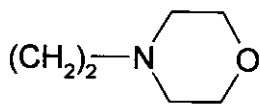
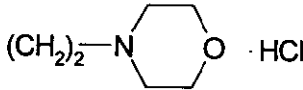
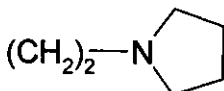
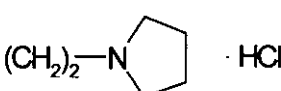
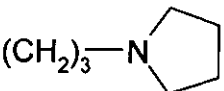
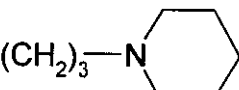
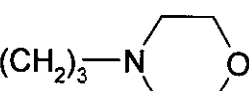
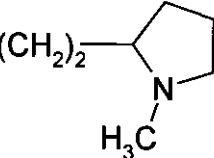
20

30

40

【表 4 2】

(表 1 続き)

実施例	(Y) _n	R ²	R ¹	m. p. [°C]
1135	H	2-Th		137
1136	H	2-Th		>220
1137	H	2-Th		100-101
1138		2-Th		269-270
1139	H	2-Th	(CH ₂) ₃ NMe ₂	195-196
1140	H	2-Th	(CH ₂) ₃ NMe ₂ · HCl	206
1141	H	2-Th	(CH ₂) ₃ NEt ₂	85
1142	H	2-Th	(CH ₂) ₃ NEt ₂ · HCl	
1143	H	2-Th		
1144	H	2-Th		
1145	H	2-Th		油状
1146	H	2-Th	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ NMe ₂	油状
1147	H	2-Th	CH ₂ CH(CH ₃)NMe ₂	油状
1148	H	2-Th	CH ₂ CH(CH ₃)NMe ₂ · HCl	127-128
1149	H	2-Th		油状

10

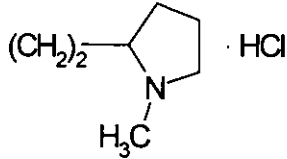
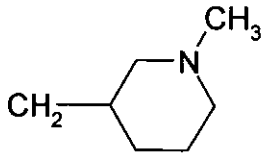
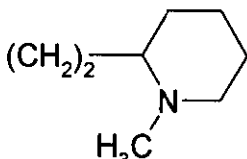
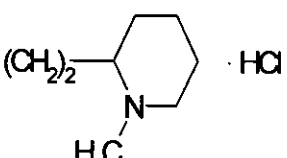
20

30

40

【表 4 3】

(表 1 続き)

実施例	(Y) _n	R ²	R ¹	m. p. [°C]
1150	H	2-Th		247-248
1151	H	2-Th		油状
1152	H	2-Th		油状
1153	H	2-Th		230-231
1154	H	2-Th	(CH ₂) ₂ NHAc	
1155	H	2-Th	(CH ₂) ₂ NHCOEt	
1156	H	2-Th	(CH ₂) ₂ NHCOPr	
1157	H	2-Th	(CH ₂) ₂ NHCOiPr	
1158	H	2-Th	(CH ₂) ₂ NHCOBu	
1159	H	2-Th	(CH ₂) ₂ NHCOtBu	
1160	H	2-Th	(CH ₂) ₂ NHCOPh	
1161	H	2-Th	(CH ₂) ₂ NHCOOMe	
1162	H	2-Th	(CH ₂) ₂ NHCOOEt	
1163	H	2-Th	(CH ₂) ₂ NHCOOPr	
1164	H	2-Th	(CH ₂) ₂ NHCOOiPr	
1165	H	2-Th	(CH ₂) ₂ NHCOOtBu	156-157
1166	H	2-Th	(CH ₂) ₂ NHCONHMe	
1167	H	2-Th	(CH ₂) ₂ NHCONMe ₂	
1168	H	2-Th	(CH ₂) ₂ NHCONHEt	
1169	H	2-Th	(CH ₂) ₂ NHCONEt ₂	

10

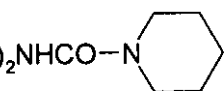
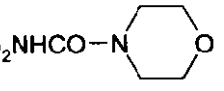
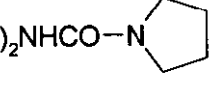
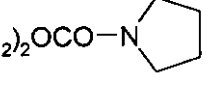
20

30

40

【表 4 4】

(表 1 続き)

実施例	(Y) _n	R ²	R ¹	m. p. [°C]
1170	H	2-Th	(CH ₂) ₂ NHCO-N 	
1171	H	2-Th	(CH ₂) ₂ NHCO-N 	
1172	H	2-Th	(CH ₂) ₂ NHCO-N 	
1173	H	2-Th	(CH ₂) ₂ NMeCONMe ₂	
1174	H	2-Th	(CH ₂) ₂ NMeCONEt ₂	
1175	H	2-Th	(CH ₂) ₂ NHSO ₂ Me	236-237
1176	H	2-Th	(CH ₂) ₂ NMeSO ₂ Me	
1177	H	2-Th	(CH ₂) ₂ NHSO ₂ Ph	
1178	H	2-Th	(CH ₂) ₂ NMeSO ₂ Ph	
1179	H	2-Th	(CH ₂) ₂ OH	177
1180	H	2-Th	(CH ₂) ₂ OAc	125-126
1181	H	2-Th	(CH ₂) ₂ OCOPr	
1182	H	2-Th	(CH ₂) ₂ OCOiPr	
1183	H	2-Th	(CH ₂) ₂ OCOBu	
1184	H	2-Th	(CH ₂) ₂ OCOtBu	
1185	H	2-Th	(CH ₂) ₂ OCOOME	
1186	H	2-Th	(CH ₂) ₂ OCOOEt	
1187	H	2-Th	(CH ₂) ₂ OCOOPr	
1188	H	2-Th	(CH ₂) ₂ OCOOiPr	
1189	H	2-Th	(CH ₂) ₂ OCOOBu	
1190	H	2-Th	(CH ₂) ₂ OCOOtBu	
1191	H	2-Th	(CH ₂) ₂ OCONMe ₂	
1192	H	2-Th	(CH ₂) ₂ OCONEt ₂	
1193	H	2-Th	(CH ₂) ₂ OCO-N 	

10

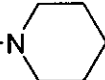
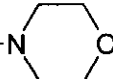
20

30

40

【表 4 5】

(表 1 続き)

実施例	(Y) _n	R ²	R ¹	m. p. [°C]
1194	H	2-Th	(CH ₂) ₂ OCO-N 	
1195	H	2-Th	(CH ₂) ₂ OCO-N 	
1196	H	2-Th	CH ₂ CH(OH)Me	油状
1197	H	2-Th	CH ₂ CH(OH)CH ₂ OH	油状
1198	H	2-Th	Et	148
1199	H	2-Th	Pr	111
1200	H	2-Th	iPr	
1201	H	2-Th	Bu	
1202	H	2-Th	iBu	
1203	H	2-Th	sBu	
1204	H	2-Th	tBu	
1205	H	2-Th	CH ₂ CH ₂ F	184
1206	H	2-Th	CH ₂ CHF ₂	181
1207	H	2-Th	CH ₂ CF ₃	195-196
1208	H	2-Th	(CH ₂) ₂ CF ₃	144
1209	H	2-Th	CH ₂ -シクロプロピル	130-131
1210	H	2-Th	CH ₂ -シクロブチル	110
1211	H	2-Th	CH ₂ -シクロペンチル	
1212	H	2-Th	CH ₂ -シクロヘキシル	
1213	H	2-Th	ベンジル	
1214	H	2-Th	2-フルフリル	
1215	H	2-Th	3-フルフリル	
1216	H	2-Th	2-チエニルメチル	
1217	H	2-Th	3-チエニルメチル	
1218	H	2-Th	2-(5-クロロチエニル)メチル	198

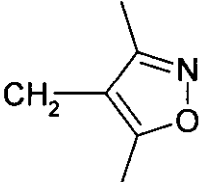
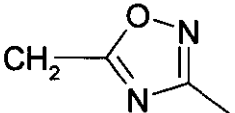
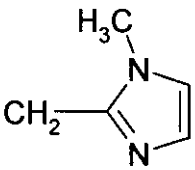
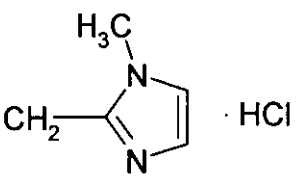
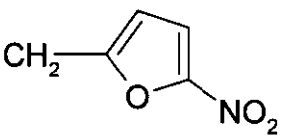
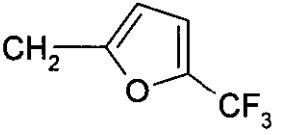
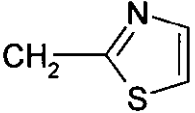
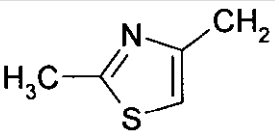
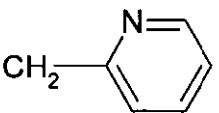
10

20

30

40

【表 4 6】
 (表 1 続き)

実施例	(Y) _n	R ²	R ¹	m. p. [°C]
1219	H	2-Th		
1220	H	2-Th		185
1221	H	2-Th		212
1222	H	2-Th		>220
1223	H	2-Th		
1224	H	2-Th		
1225	H	2-Th		
1226	H	2-Th		
1227	H	2-Th		

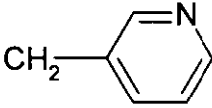
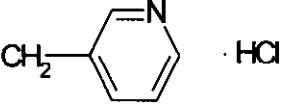
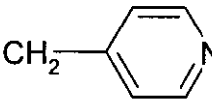
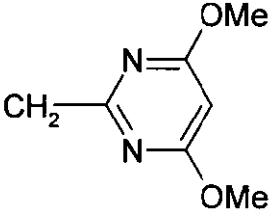
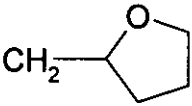
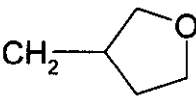
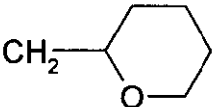
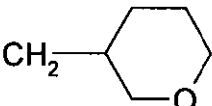
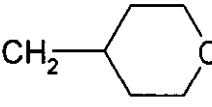
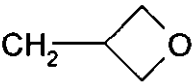
10

20

30

40

【表 4 7】
 (表 1 続き)

実施例	(Y) _n	R ²	R ¹	m. p. [°C]
1228	H	2-Th		169
1229	H	2-Th		>230
1230	H	2-Th		
1231	H	2-Th		
1232	H	2-Th		123
1233	H	2-Th		100
1234	H	2-Th		141-142
1235	H	2-Th		
1236	H	2-Th		
1237	H	2-Th		

10

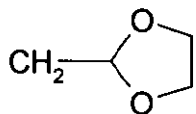
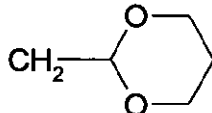
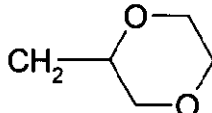
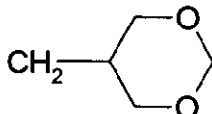
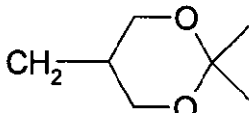
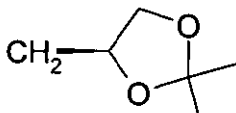
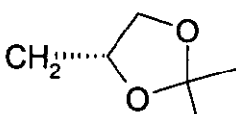
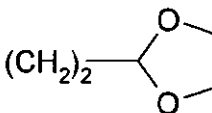
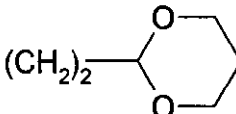
20

30

40

【表 4 8】

(表 1 続き)

実施例	(Y) _n	R ²	R ¹	m. p. [°C]
1238	H	2-Th		171
1239	H	2-Th		
1240	H	2-Th		
1241	H	2-Th		
1242	H	2-Th		
1243	H	2-Th		油状
1244	H	2-Th		油状
1245	H	2-Th		149
1246	H	2-Th		
1247	H	2-Th	アリル	152
1248	H	2-Th	クロチル	122
1249	H	2-Th	2-ペンテン-1-イル	
1250	H	2-Th	2-メチルアリル	126

10

20

30

40

【表 4 9】
(表 1 続き)

実施例	(Y) _n	R ²	R ¹	m. p. [°C]
1251	H	2-Th	3-メチル-2-ブテン-1-イル	129-130
1252	H	2-Th	2-クロロ-2-プロペン-1-イル	130-131
1253	H	2-Th	2-フルオロ-2-プロペン-1-イル	
1254	H	2-Th	2-ブロモ-2-プロペン-1-イル	
1255	H	2-Th	3-クロロ-2-ブテン-1-イル	131-132
1256	H	2-Th	3-クロロ-2-プロペン-1-イル	
1257	H	2-Th	3-ブロモ-2-プロペン-1-イル	
1258	H	2-Th	2,3-ジクロロ-2-プロペン-1-イル	
1259	H	2-Th	3,3-ジクロロ-2-プロペン-1-イル	60
1260	H	2-Th	シンナミル	189
1261	H	2-Th	プロパルギル	222
1262	H	2-Th	2-ブチン-1-イル	208
1263	H	2-Th	フェニルプロパルギル	
1264	H	2-Th	トリメチルシリルプロパルギル	
1265	H	2-Th	CH ₂ CN	215
1266	H	2-Th	(CH ₂) ₂ CN	
1267	H	iPr	アリル	
1268	H	iPr	クロチル	油状
1269	H	Ph	CH ₂ CONH ₂	>260
1270	H	Th	CH ₂ CONH ₂	
1271	H	5-Me-3-フリル	Me	208
1272	H	5-Me-3-フリル	(CH ₂) ₂ NEt ₂	186
1273	H	5-Me-3-フリル	(CH ₂) ₂ NEt ₂ · HCl	無定形
1274	H	4-ビフェニル	Me	154

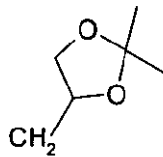
10

20

30

40

【表 5 0】
 (表 1 続き)

実施例	(Y) _n	R ²	R ¹	m. p. [°C]
1274a	H	4-ビフェニリル	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
1275	H	4-ビフェニリル	(CH ₂) ₂ NEt ₂ · HCl	187
1276	H	2-ピリジル	(CH ₂) ₂ NEt ₂ · HCl	230
1277	H	シクロヘキシル	(CH ₂) ₂ NEt ₂ · HCl	116
1278	H	6-Me-2-ピリジル	(CH ₂) ₂ NEt ₂ · HCl	223
1279	H	m-トリル	(CH ₂) ₂ NEt ₂ · HCl	201
1280	H	3,5-ジクロロ-2-チアゾリル	(CH ₂) ₂ NEt ₂	120
1281	H	3,5-ジクロロ-2-チアゾリル	(CH ₂) ₂ NEt ₂ · HCl	>250
1282	H	インダン-5-イル	Me	143
1283	H	インダン-5-イル	(CH ₂) ₂ NEt ₂	油状
1284	H	インダン-5-イル	(CH ₂) ₂ NEt ₂ · HCl	186
1285	H	2,5-ジ-Me-3-チエニル	(CH ₂) ₂ NEt ₂ · HCl	194
1286	H	4-イソプロピルフェニル	Me	76
1287	H	4-イソプロピルフェニル	(CH ₂) ₂ NEt ₂	油状
1288	H	4-イソプロピルフェニル	(CH ₂) ₂ NEt ₂ · HCl	160
1289	H	2,3-ジクロロフェニル	(CH ₂) ₂ NEt ₂ · HCl	217
1290	H	2,3-ジメチルフェニル	(CH ₂) ₂ NEt ₂ · HCl	無定形
1291	H	2-フリル	(CH ₂) ₂ NEt ₂ · HCl	240
1292	H	Ph	(CH ₂) ₂ NH ₂ · HCl	256
1293	H	2-Th	(CH ₂) ₂ NH ₂ · HCl	>250
1294	H	Ph	1,3-ジオキサラン-4-イルメチル	79
1295	H	2-Th	1,3-ジオキサラン-4-イルメチル	153
1296	H	Ph		油状

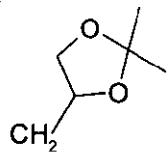
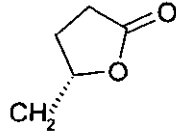
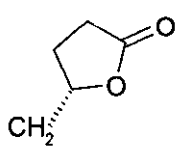
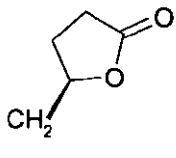
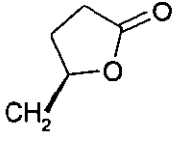
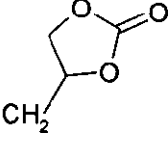
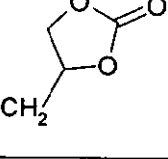
10

20

30

40

【表 5 1】
 (表 1 続き)

実施例	(Y) _n	R ²	R ¹	m. p. [°C]
1297	H	2-Th		油状
1298	H	Ph		油状
1299	H	2-Th		油状
1300	H	Ph		油状
1301	H	2-Th		油状
1302	6, 7-Me ₂	Ph	(CH ₂) ₂ NEt ₂ · HCl	245
1303	H	Ph		88
1304	H	2-Th		184
1305	H	Ph	3, 5-ジメチルピラゾール-1-イル	123
1306	H	2-Th	3, 5-ジメチルピラゾール-1-イル	158

10

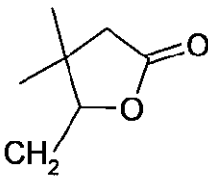
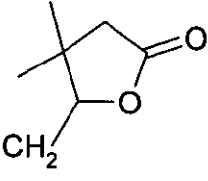
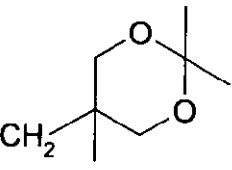
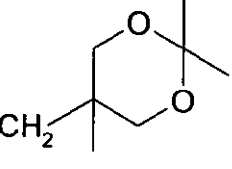
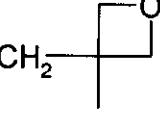
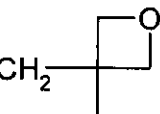
20

30

40

【表 5 2】

(表 1 続き)

実施例	(Y) _n	R ²	R ¹	m. p. [°C]
1307	H	1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-6- ナフチル	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
1308	6, 7-Cl ₂	イソプロピル	(CH ₂) ₂ NEt ₂	油状
1309	H	2, 3, 5-Cl ₃ -Ph	(CH ₂) ₂ NEt ₂	油状
1310	H	4-フェノキシフェニル	(CH ₂) ₂ NEt ₂	油状
1311	H	Ph		202
1312	H	2-Th		193
1313	6, 7-Cl ₂	Ph	(CH ₂) ₂ NEt ₂	109
1314	H	4-SCH ₃ -Ph	(CH ₂) ₂ NEt ₂	油状
1315	H	Ph		127
1316	H	2-Th		166
1317	H	Ph		90
1318	H	2-Th		159
1319	H	Ph	CH ₂ C(CH ₃) ₂ OCH ₃	102
1320	H	2-Th	CH ₂ C(CH ₃) ₂ OCH ₃	129

10

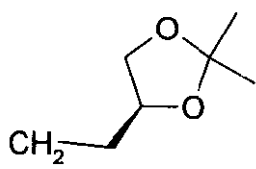
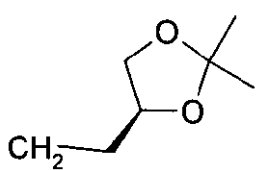
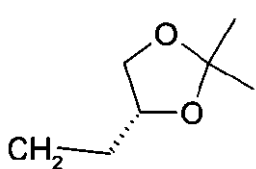
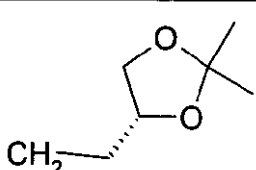
20

30

40

【表 5 3】

(表 1 続き)

実施例	(Y) _n	R ²	R ¹	m. p. [°C]
1321	6-CF ₃	2-Th	イソプロピル	146
1322	H	4-シクロヘキシル-Ph	(CH ₂) ₂ NEt ₂	油状
1323	H	4-シクロヘキシル-Ph	(CH ₂) ₂ NEt ₂ · HCl	182
1324	H	Ph	CH ₂ CH(CH ₃)OCH ₃	91
1325	H	2-Th	CH ₂ CH(CH ₃)OCH ₃	99
1326	H	Ph		油状
1327	H	2-Th		77
1328	H	Ph		油状
1329	H	2-Th		100
1330	H	Ph	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ OEt	油状
1331	H	2-Th	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ OEt	油状
1332	H	4-Et-Ph	(CH ₂) ₂ NEt ₂	油状
1333	H	Ph	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂ OMe	油状
1334	H	2-Th	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂ OMe	
1335	H	4-ベンジルオキシ-Ph	(CH ₂) ₂ NEt ₂	油状
1336	H	Ph	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ OMe	
1337	H	2-Th	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ OMe	104
1338	H	4-NO ₂ -Ph	Me	246
1339	H	4-NO ₂ -Ph	(CH ₂) ₂ NEt ₂	112

10

20

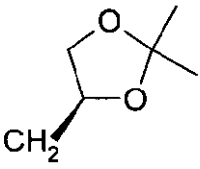
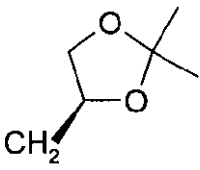
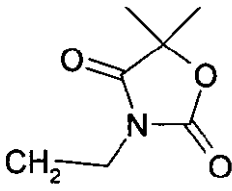
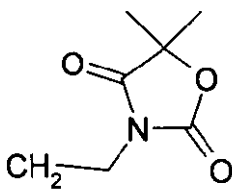
30

40

【 0 3 1 7 】

【表 5 4】

(表 1 続き)

実施例	(Y) _n	R ²	R ¹	m. p. [°C]
1340	H	Ph	1-クロロシクロプロピル-1- イルメチル	
1341	H	2-Th	1-クロロシクロプロピル-1- イルメチル	180
1342	H	4-OMe-Ph		油状
1343	H	4-Me-Ph		油状
1344	H	Ph	NH ₂	125
1345	H	2-Th	NH ₂	164
1346	H	Ph		105
1347	H	2-Th		210
1348	H	Ph	2-(4-フルオロフェノキシ) エチル	111
1349	H	2-Th	2-(4-フルオロフェノキシ) エチル	174
1350	H	Ph	2,2-ジメチル-1,3-ジオキソ ラン-5-イル	157
1351	H	2-Th	2,2-ジメチル-1,3-ジオキソ ラン-5-イル	211

10

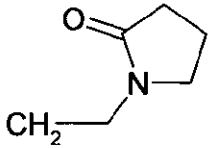
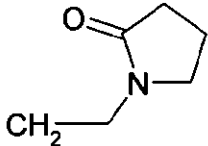
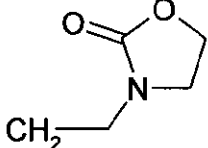
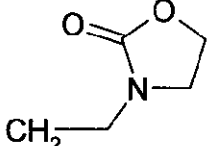
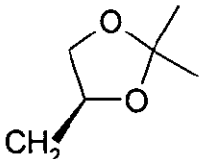
20

30

40

【表 5 5】

(表 1 続き)

実施例	(Y) _n	R ²	R ¹	m. p. [°C]
1352	H	Ph		140
1353	H	2-Th		166
1354	H	Ph		
1355	H	2-Th		油状
1356	H	4-フルオロ-3-メチルフェニル	H	244
1357	H	4-フルオロ-3-メチルフェニル	Me	123
1358	H	4-フルオロ-3-メチルフェニル	(CH ₂) ₂ NEt ₂	油状
1359	H	4-フルオロ-3-メチルフェニル	(CH ₂) ₂ NEt ₂ · HCl	169
1360	H	4-フルオロ-3-メチルフェニル		
1361	6,7-Me ₂	4-フルオロ-3-メチルフェニル	(CH ₂) ₂ NEt ₂	66
1362	6,7-Me ₂	4-フルオロ-3-メチルフェニル	(CH ₂) ₂ NEt ₂ · HCl	262

10

20

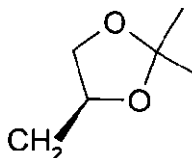
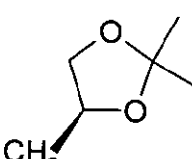
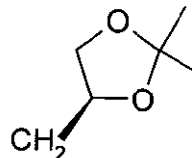
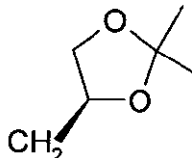
30

40

【 0 3 1 9 】

【表 5 6】

(表 1 続き)

実施例	(Y) _n	R ²	R ¹	m. p. [°C]
1363	6, 7-Me ₂	4-フルオロ-3-メチルフェニル	Me	159
1364	6, 7-Me ₂	4-フルオロ-3-メチルフェニル		117
1365	6, 7-Me ₂	4-フルオロ-3-メチルフェニル	H	264
1366	6, 7-Me ₂	m-トリル	Me	150
1367	6, 7-Me ₂	m-トリル		93
1368	6, 7-Me ₂	m-トリル	(CH ₂) ₂ NEt ₂	97
1369	6, 7-Me ₂	m-トリル	(CH ₂) ₂ NEt ₂ · HCl	252
1370	6, 7-Me ₂	m-トリル	H	>280
1371	7-Me	Ph	(CH ₂) ₂ NEt ₂ · HCl	228
1372	H	Ph	2-(アリルオキシ)エチル	44
1373	H	2-Th	2-(アリルオキシ)エチル	95
1374	6, 7-Me ₂	3, 5-ジメチルフェニル	H	288
1375	6, 7-Me ₂	3, 5-ジメチルフェニル	Me	164
1376	6, 7-Me ₂	3, 5-ジメチルフェニル	(CH ₂) ₂ NEt ₂	107
1377	6, 7-Me ₂	3, 5-ジメチルフェニル	(CH ₂) ₂ NEt ₂ · HCl	265
1378	6, 7-Me ₂	3, 5-ジメチルフェニル		129
1379	H	3, 5-ジメチルフェニル	(CH ₂) ₂ NEt ₂ · HCl	209
1380	H	3, 5-ジメチルフェニル		108

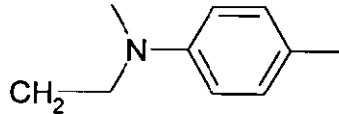
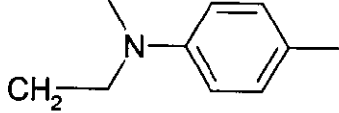
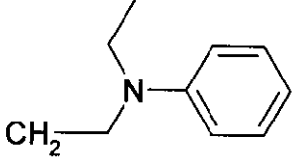
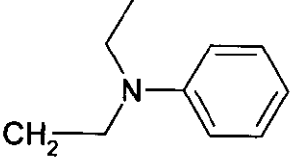
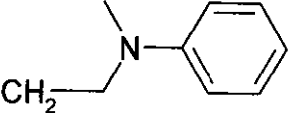
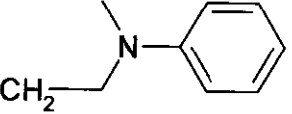
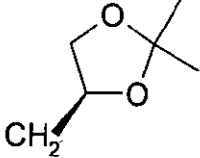
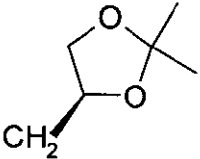
10

20

30

40

【表 5 7】
 (表 1 続き)

実施例	(Y) _n	R ²	R ¹	m. p. [°C]
1381	H	2-Th		油状
1382	H	Ph		油状
1383	H	Ph		95
1384	H	2-Th		92
1385	H	Ph		油状
1386	H	2-Th		油状
1387	6, 7-Me ₂	Ph		113
1388	6, 7-Me ₂	2-Th		128
1389	6, 7-Me ₂	Ph	(CH ₂) ₂ NMe ₂	197
1390	6, 7-Me ₂	Ph	(CH ₂) ₂ NMe ₂ · HCl	267
1391	6, 7-Me ₂	2-Th	(CH ₂) ₂ NMe ₂	144

10

20

30

40

【表 5 8】
(表 1 続き)

実施例	(Y) _n	R ²	R ¹	m. p. [°C]
1392	6, 7-Me ₂	2-Th	(CH ₂) ₂ NMe ₂ · HCl	289
1393	7-Me	2-Th	(CH ₂) ₂ NEt ₂ · HCl	
1394	6, 7-Me ₂	2-Th	(CH ₂) ₂ NEt ₂ · HCl	
1395	6, 7-Me ₂	2-Th	CH ₂ COOEt	油状
1396	6, 7-Me ₂	2-Th	CH ₂ COOH	263
1397	H	4-ビフェニリル	H	>260
1398	H	5-メチル-2-フリル	H	>250
1399	H	3, 5-ジメチルフェニル	H	202
1400	H	4-イソプロピルフェニル	H	181
1401	H	2, 4-ジクロロ-5-チアゾリル	H	>260
1402	H	Ph	(CH ₂) ₂ N ⁽⁺⁾ Me ₃ I ⁽⁻⁾	
1403	H	2-Th	(CH ₂) ₂ N ⁽⁺⁾ Me ₃ I ⁽⁻⁾	
1404	H	Ph	(CH ₂) ₂ N ⁽⁺⁾ Me ₂ Et I ⁽⁻⁾	
1405	H	2-Th	(CH ₂) ₂ N ⁽⁺⁾ Me ₂ Et I ⁽⁻⁾	
1406	H	Ph	(CH ₂) ₂ N ⁽⁺⁾ Et ₂ Me I ⁽⁻⁾	220
1407	H	2-Th	(CH ₂) ₂ N ⁽⁺⁾ Et ₂ Me I ⁽⁻⁾	
1408	H	Ph	(CH ₂) ₂ N ⁽⁺⁾ Et ₃ I ⁽⁻⁾	
1409	H	2-Th	(CH ₂) ₂ N ⁽⁺⁾ Et ₃ I ⁽⁻⁾	196
1410	H	Ph	(CH ₂) ₂ ON=C(CH ₃) ₂	油状
1411	H	2-Th	(CH ₂) ₂ ON=C(CH ₃) ₂	油状
1412	H	2-ベンゾチエニル	Me	
1413	H	2-ベンゾチエニル	(CH ₂) ₂ NMe ₂	樹脂状
1414	H	2-ベンゾチエニル	(CH ₂) ₂ NMe ₂ · HCl	265
1415	6, 7-Me ₂	Ph	CH ₂ OMe	135
1416	6, 7-Me ₂	Ph	CH ₂ OEt	
1417	6, 7-Me ₂	Ph	(CH ₂) ₂ OMe	
1418	6, 7-Me ₂	Ph	(CH ₂) ₂ OEt	
1419	6, 7-Me ₂	2-Th	CH ₂ OMe	175
1420	6, 7-Me ₂	2-Th	CH ₂ OEt	
1421	6, 7-Me ₂	2-Th	(CH ₂) ₂ OMe	

10

20

30

40

【表 5 9】

(表 1 続き)

実施例	(Y) _n	R ²	R ¹	m. p. [°C]
1422	6, 7-Me ₂	2-Th	(CH ₂) ₂ OEt	

【 0 3 2 3 】

表 1 の化合物の幾つかに対する更なる物理的データ :

核磁気共鳴スペクトルの特性を示すデータ (¹H-NMR データ、(ppm)):

実施例 No. 405 (CDCl₃) 1.08 (tr, 6H, CH₂CH₃); 2.59 (s, 3H, CH₃); 2.68 (q, 4H, CH₂CH₃); 2.75 (tr, 2H, NCH₂); 4.35 (tr, 2H, CH₂Het); 7.82 (d, 1H, キノキサリン-H)

実施例 No. 408 (CDCl₃) 1.08 (tr, 6H, CH₂CH₃); 1.31 (d, 6H, iPrCH₃); 2.69 (q, 4H, CH₂CH₃); 2.75 (tr, 2H, NCH₂); 3.62 (sept, 1H, メチン-H); 4.35 (tr, 2H, CH₂Het); 7.83 (d, 1H, キノキサリン-H)

実施例 No. 412 (CDCl₃) 1.07 (tr, 6H, CH₂CH₃); 1.49 (s, 9H, C(CH₃)₃); 2.65 (q, 4H, CH₂CH₃); 2.75 (tr, 2H, NCH₂); 4.32 (tr, 2H, CH₂Het); 7.82 (d, 1H, キノキサリノン-H)

実施例 No. 415 (CDCl₃) 1.12 (tr, 6H, CH₂CH₃); 1.88-2.12 (m, 6H, シクロペンチル-H); 2.43-2.58 (m, 2H, シクロペンチル-H); 2.71 (q, 4H, CH₂CH₃); 2.81 (tr, 2H, NCH₂); 4.44 (tr, 2H, CH₂Het); 7.97 (d, 1H, キノキサリノン-H)

実施例 No. 416 (CDCl₃) 1.42 (tr, 6H, CH₂CH₃); 1.1-2.0 (m, 10H, シクロヘキシル-H); 3.2-3.4 (m, 7H); 4.73 (tr, 2H, CH₂Het); 7.87 (d, 1H, キノキサリノン-H)

実施例 No. 418 (CDCl₃) 1.03 (tr, 6H, CH₂CH₃); 2.64 (q, 4H, CH₂CH₃); 2.79 (tr, 2H, NCH₂); 4.40 (tr, 2H, CH₂Het); 8.00 (d, 1H, キノキサリノン-H)

実施例 No. 421 (CDCl₃) 1.09 (tr, 6H, CH₂CH₃); 2.69 (q, 4H, CH₂CH₃); 2.77 (tr, 2H, NCH₂); 3.13 (m, 2H, CH₂Ph); 3.28 (m, 2H, CH₂CH₂Ph); 4.35 (tr, 2H, CH₂Het); 7.86 (d, 1H, キノキサリノン-H)

実施例 No. 431 (CDCl₃) 1.08 (tr, 6H, CH₃); 2.68 (q, 4H, CH₂CH₃); 2.80 (tr, 2H, NCH₂); 4.42 (tr, 2H, CH₂Het); 8.50 (m, 2H, フェニル-H)

実施例 No. 434 (CDCl₃) 1.10 (tr, 6H, CH₂CH₃); 2.48 (s, 3H, CH₃); 2.69 (q, 4H, CH₂CH₃); 2.80 (tr, 2H, NCH₂); 4.40 (tr, 2H, CH₂Het); 7.75 (s, 1H, キノキサリノン-H); 8.30 (m, 2H, フェニル-H)

実施例 No. 451 (CDCl₃) 1.07 (tr, 6H, CH₂CH₃); 2.66 (q, 4H, CH₂CH₃); 2.81 (tr, 2H, NCH₂); 4.43 (tr, 2H, CH₂Het); 8.23 (s, 1H, キノキサリノン-H); 8.34 (m, 2H, フェニル-H)

実施例 No. 465 (CDCl₃) 1.10 (tr, 6H, CH₂CH₃); 2.70 (q, 4H, CH₂CH₃); 2.82 (tr, 2H, NCH₂); 3.98, 4.02 (2s, 6H, 2 OCH₃); 4.42 (tr, 2H, CH₂Het); 6.91, 7.39 (2s, 2H, キノキサリノン-H); 8.28 (m, 2H, フェニル-H)

実施例 No. 478: (CDCl₃) 1.07 (tr, 6H, CH₃); 2.65 (q, 4H, CH₂CH₃); 2.79 (tr, 2H, NCH₂); 4.42 (tr, 2H, CH₂Het); 8.48 (d, 1H, Th)

実施例 No. 481: (CDCl₃) 1.08 (tr, 6H, CH₂CH₃); 2.51 (s, 3H, CH₃); 2.68 (q, 4H, CH₂CH₃); 2.80 (tr, 2H, NCH₂); 4.38 (tr, 2H, CH₂Het); 8.47 (d, 1H, Th)

実施例 No. 482: (CDCl₃) 1.50 (tr, 6H, CH₂CH₃); 3.29 (m, 6H, 3CH₂); 4.99 (tr, 2H, CH₂Het); 8.42 (2d, 2H, チエニル-H, キノキサリン-H)

実施例 No. 486: (CDCl₃) 1.05 (tr, 6H, CH₃); 2.65 (q, 4H, CH₂CH₃); 2.80 (tr, 2H, NCH₂); 4.38 (tr, 2H, CH₂Het); 8.48 (d, 1H, Th)

実施例 No. 487: (CDCl₃) 1.02 (tr, 6H, CH₃); 2.65 (q, 4H, CH₂CH₃); 2.78 (tr, 2H, NCH₂); 4.38 (tr, 2H, CH₂Het); 8.48 (d, 1H, Th)

実施例 No. 498 (CDCl₃) 1.10 (tr, 6H, CH₂CH₃); 2.72 (q, 4H, CH₂CH₃); 2.87 (tr, 2

10

20

30

40

50

H, NCH₂); 4.50 (tr, 2H, CH₂Het); 8.19 (s, 1H, キノキサリノン-H); 8.52 (m, 2H, フェニル-H)

実施例 No. 501: (CDCl₃) 1.10 (tr, 6H, CH₂CH₃); 2.36, 2.42 (2s, 6H, 2CH₃); 2.69 (q, 4H, CH₂CH₃); 2.80 (tr, 2H, NCH₂); 4.42 (tr, 2H, CH₂Het); 8.42 (d, 1H, Th)

実施例 No. 507 (CDCl₃) 1.03 (tr, 6H, CH₂CH₃); 2.62 (q, 4H, CH₂CH₃); 2.79 (tr, 2H, NCH₂); 4.36 (tr, 2H, CH₂Het); 7.58, 7.98 (2s, 2H, キノキサリノン-H); 8.48 (d, 1H, チオフェン-H)

実施例 No. 525: (CDCl₃) 1.09 (tr, 6H, CH₃); 1.47 (tr, 3H, エステル-CH₃); 2.68 (q, 4H, CH₂CH₃); 2.83 (tr, 2H, NCH₂); 4.47 (m, 4H, OCH₂, CH₂Het); 8.44 (d, 1H, Th)

10

【 0 3 2 4 】

実施例 No. 526 (CDCl₃) 1.09 (tr, 6H, CH₂CH₃); 2.42 (s, 3H, tolyl-CH₃); 2.69 (q, 4H, CH₂CH₃); 2.80 (tr, 2H, NCH₂); 4.41 (tr, 2H, CH₂Het); 7.93 (d, 1H, キノキサリノン-H); 8.23 (d, 2H, フェニル-H)

実施例 No. 527 (CDCl₃) 1.09 (tr, 6H, CH₂CH₃); 2.42 (s, 3H, トリル-CH₃); 2.69 (q, 4H, CH₂CH₃); 2.80 (tr, 2H, NCH₂); 4.41 (tr, 2H, CH₂Het); 7.95 (d, 1H, キノキサリノン-H); 8.10 (d, 2H, フェニル-H)

実施例 No. 529 (CDCl₃) 1.09 (tr, 6H, CH₂CH₃); 1.36 (s, 9H, tert-ブチル); 2.68 (q, 4H, CH₂CH₃); 2.80 (tr, 2H, NCH₂); 4.42 (tr, 2H, CH₂Het); 7.94 (d, 1H, キノキサリノン-H); 8.12 (d, 2H, フェニル-H)

20

実施例 No. 530 (CDCl₃) 1.08 (tr, 6H, CH₂CH₃); 2.68 (q, 4H, CH₂CH₃); 2.80 (tr, 2H, NCH₂); 4.42 (tr, 2H, CH₂Het); 7.94 (d, 1H, キノキサリノン-H); 8.35 (d, 2H, フェニル-H)

実施例 No. 536 (CDCl₃) 1.10 (tr, 6H, CH₂CH₃); 2.69 (q, 4H, CH₂CH₃); 2.81 (tr, 2H, NCH₂); 3.89 (s, 3H, OCH₃); 4.42 (tr, 2H, CH₂Het); 7.92 (d, 1H, キノキサリノン-H); 6.99, 8.38 (2d, 4H, フェニル-H)

実施例 No. 539 (CDCl₃) 1.10 (tr, 6H, CH₂CH₃); 2.69 (q, 4H, CH₂CH₃); 2.82 (tr, 2H, NCH₂); 4.42 (tr, 2H, CH₂Het); 7.96 (d, 1H, キノキサリノン-H); 7.74, 8.48 (2d, 4H, フェニル-H)

実施例 No. 543 (CDCl₃) 1.08 (tr, 6H, CH₂CH₃); 2.35, 2.38 (2s, 6H, ジメチルフェニル-CH₃); 2.69 (q, 4H, CH₂CH₃); 2.83 (tr, 2H, NCH₂); 4.42 (tr, 2H, CH₂Het); 7.16 (s, 1H, フェニル-H); 7.96 (d, 1H, キノキサリノン-H);

30

実施例 No. 546a (CDCl₃) 1.09 (tr, 6H, CH₂CH₃); 2.34, 2.37 (2s, 6H, ジメチルフェニル-CH₃); 2.67 (q, 4H, CH₂CH₃); 2.80 (tr, 2H, NCH₂); 4.42 (tr, 2H, CH₂Het); 7.94 (d, 1H, キノキサリノン-H); 8.07 (d, 1H, フェニル-H); 8.09 (s, 1H, フェニル-H);

実施例 No. 547 (CDCl₃) 1.09 (tr, 6H, CH₂CH₃); 2.40 (s, 6H, ジメチルフェニル-CH₃); 2.69 (q, 4H, CH₂CH₃); 2.81 (tr, 2H, NCH₂); 4.42 (tr, 2H, CH₂Het); 7.11 (s, 1H, フェニル-H); 7.88 (s, 2H, フェニル-H); 7.93 (d, 1H, キノキサリノン-H);

実施例 No. 548 (CDCl₃) 1.07 (tr, 6H, CH₂CH₃); 2.07 (s, 6H, トリメチルフェニル-CH₃); 2.33 (s, 3H, トリメチルフェニル-CH₃); 2.68 (q, 4H, CH₂CH₃); 2.83 (tr, 2H, NCH₂); 4.42 (tr, 2H, CH₂Het); 6.94 (s, 2H, フェニル-H); 7.97 (d, 1H, キノキサリノン-H);

40

実施例 No. 549 (CDCl₃) 1.11 (tr, 6H, CH₂CH₃); 2.70 (q, 4H, CH₂CH₃); 2.81 (tr, 2H, NCH₂); 3.96, 4.01 (2s, 6H, 2OCH₃); 4.42 (tr, 2H, CH₂Het); 6.97 (d, 1H, フェニル-H); 7.95 (d, 1H, キノキサリノン-H); 8.02 (s, 1H, フェニル-H); 8.17 (d, 1H, フェニル-H);

実施例 No. 560 (CDCl₃) 1.09 (tr, 6H, CH₂CH₃); 2.69 (q, 4H, CH₂CH₃); 2.80 (tr, 2H, NCH₂); 4.30 (m, 4H, OCH₂); 4.41 (tr, 2H, CH₂Het); 6.96 (d, 1H, フェニル-H); 7.93 (d, 1H, キノキサリノン-H); 7.95 (m, 2H, フェニル-H);

実施例 No. 561 (CDCl₃) 1.08 (tr, 6H, CH₂CH₃); 2.67 (q, 4H, CH₂CH₃); 2.80 (tr, 2

50

H, NCH₂); 4.40 (tr, 2H, CH₂Het); 7.55 (d, 1H, フェニル-H); 7.93 (d, 1H, キノキサリノン-H); 7.95 (m, 2H, フェニル-H);

実施例 No. 562 (CDCl₃) 1.08 (tr, 6H, CH₂CH₃); 2.68 (q, 4H, CH₂CH₃); 2.82 (tr, 2H, NCH₂); 4.40 (tr, 2H, CH₂Het); 7.28 (s, 1H, フェニル-H); 7.93 (d, 1H, キノキサリノン-H);

実施例 No. 569: (CDCl₃) 1.10 (tr, 6H, CH₃); 2.69 (q, 4H, CH₃CH₂); 2.80 (tr, 2H, CH₂NEt₂); 4.43 80 (tr, 2H, CH₂Het); 8.90 (d, 1H, チエニル)

実施例 No. 570 (CDCl₃) 1.08 (tr, 6H, CH₂CH₃); 2.68 (q, 4H, CH₂CH₃); 2.81 (tr, 2H, NCH₂); 4.42 (tr, 2H, CH₂Het); 6.62 (dd, 1H, フリル-H); 7.72 (d, 1H, フリル-H); 7.93 (d, 1H, フリル-H); 8.02 (d, 1H, キノキサリノン-H);

実施例 No. 575a (CDCl₃) 1.23 (tr, 6H, CH₂CH₃); 3.31 (m, 6H, CH₂CH₃, NCH₂); 4.82 (tr, 2H, CH₂Het); 8.09, 8.18 (2 dd, 2H, ピリジル-H, キノキサリノン-H); 8.88 (dd, 1H, ピリジル-H);

実施例 No. 578 (CDCl₃) 1.08 (tr, 6H, CH₂CH₃); 2.35 (s, 3H, CH₃Pyr); 2.68 (q, 4H, CH₂CH₃); 2.81 (tr, 2H, NCH₂); 4.41 (tr, 2H, CH₂Het); 7.97 (d, 1H, キノキサリノン-H); 8.60 (d, 1H, ピリジル-H)

実施例 No. 579 (CDCl₃) 1.10 (tr, 6H, CH₂CH₃); 2.48 (s, 3H, CH₃Pyr); 2.68 (q, 4H, CH₂CH₃); 2.82 (tr, 2H, NCH₂); 4.41 (tr, 2H, CH₂Het); 7.21 (d, 1H, ピリジル-H); 8.09 (d, 1H, キノキサリノン-H); 8.10 (s, 1H, ピリジル-H); 8.71 (d, 1H, ピリジル-H)

実施例 No. 581a (CDCl₃) 1.43 (tr, 6H, CH₂CH₃); 2.71 (s, 3H, CH₃Pyr); 3.31 (m, 6H, CH₂CH₃, NCH₂); 4.83 (tr, 2H, CH₂Het); 7.31 (d, 1H, ピリジル-H); 7.90 (d, 1H, ピリジル-H); 8.07 (d, 1H, キノキサリノン-H);

【 0 3 2 5 】

実施例 No. 588a (CDCl₃) 1.09 (tr, 6H, CH₂CH₃); 2.68 (q, 4H, CH₂CH₃); 2.78 (s, 3H, CH₃Th); 2.82 (tr, 2H, NCH₂); 4.43 (tr, 2H, CH₂Het); 7.02 (d, チエニル-H); 7.92 (d, 1H, キノキサリノン-H);

実施例 No. 595 (CDCl₃) 1.09 (tr, 6H, CH₂CH₃); 2.45, 2.63 (2s, 6H, 2 CH₃Th); 2.70 (q, 4H, CH₂CH₃); 2.78 (tr, 2H, NCH₂); 4.43 (tr, 2H, CH₂Het); 7.29 (s, チエニル-H); 7.89 (d, 1H, キノキサリノン-H);

実施例 No. 612: (CDCl₃) 1.32 (d, 6H, 2CH₃); 3.61 (sept, 1H, メチン-H); 3.78 (s, 3H, OCH₃); 2.80 (tr, 2H, NCH₂); 5.05 (s, 2H, CH₂Het); 7.98 (d, 1H, キノキサリノン-H)

実施例 No. 638: (CDCl₃) 3.80 (s, 3H, OCH₃); 5.12 (s, 2H, CH₂Het); 8.32 (m, 2H, フェニル-H)

実施例 No. 687: (CDCl₃) 3.79 (s, 3H, OCH₃); 5.15 (s, 2H, CH₂Het); 8.48 (d, 1H, チエニル-H)

実施例 No. 688: (CDCl₃) 2.76 (s, 3H, CH₃); 3.78 (s, 3H, OCH₃); 5.14 (s, 2H, CH₂Het); 8.47 (d, 1H, チエニル-H)

実施例 No. 689: (CDCl₃) 2.52 (s, 3H, CH₃); 3.80 (s, 3H, OCH₃); 5.12 (s, 2H, CH₂Het); 8.47 (d, 1H, チエニル-H)

実施例 No. 691: (CDCl₃) 2.62 (s, 3H, CH₃); 3.80 (s, 3H, OCH₃); 5.17 (s, 2H, CH₂Het); 8.34 (d, 1H, チエニル-H)

実施例 No. 708: (CDCl₃) 2.35, 2.41 (2s, 6H, 2CH₃); 3.78 (s, 3H, OCH₃); 5.12 (s, 2H, CH₂Het); 8.45 (d, 1H, チエニル-H)

実施例 No. 855: (CDCl₃) 3.49 (s, 3H, CH₃); 5.80 (s, 2H, CH₂); 8.30 (m, 2H, Ph)

実施例 No. 856: (CDCl₃) 1.21 (tr, 3H, CH₃); 3.71 (q, 2H, CH₂Et); 5.82 (s, 2H, CH₂Het); 8.28 (m, 2H, Ph)

実施例 No. 857: (CDCl₃) 3.37 (s, 3H, CH₃); 3.80 (tr, 2H, OCH₂); 4.53 (tr, 2H, CH₂Het); 8.30 (m, 2H, Ph)

10

20

30

40

50

実施例 No. 858: (CDCl₃) 1.15 (tr, 3H, CH₃); 3.51 (q, 2H, CH₂Et); 3.82 (s, 2H, OC H₂); 8.30 (m, 2H, Ph)

実施例 No. 861 (CDCl₃) 1.09 (s, 9H, C(CH₃)₃); 3.78 (tr, 3H, CH₂O); 4.49 (tr, 2H, CH₂Het); 7.92 (d, 1H, キノキサリノン-H); 8.30 (m, 2H, フェニル-H)

実施例 No. 862 (CDCl₃) 3.32 (s, 3H, OCH₃); 3.50, 3.65 (2m, 4H, OCH₂CH₂O); 3.90 (tr, 2H, OCH₂); 4.57 (tr, 2H, CH₂Het); 7.92 (d, 1H, キノキサリノン-H); 8.30 (m, 2H, フェニル-H)

実施例 No. 883: (CDCl₃) 3.30 (tr, 2H, SCH₂); 4.50 (tr, 2H, CH₂Het); 7.92 (d, 1H, キノキサリノン-H) 8.47 (m, 2H, Ph)

実施例 No. 907: (CDCl₃) 1.31 (tr, 6H, 2CH₃); 2.29 (sext、2H, CH₂) 3.05-3.30 (m, 6H, 3CH₂N); 4.41 (tr, 2H, CH₂Het); 7.95 (d, 1H, キノキサリノン-H) 8.38 (m, 2H, Ph) 10

実施例 No. 913: (CDCl₃) 2.00 (quintet、2H, CH₂CH₂CH₂); 2.50 (m, 6H, 3CH₂N) 3.71 (tr, 4H, CH₂O); 4.42 (tr, 2H, CH₂Het); 7.95 (d, 1H, キノキサリノン-H) 8.40 (m, 2H, Ph)

実施例 No. 969 (CDCl₃) 1.72 (d, 6H, 2 CH₃); 5.35 (幅広のs、1H, メチン-H); 7.95 (d, 1H, キノキサリノン-H); 8.28 (m, 2H, フェニル-H)

実施例 No. 1010: (CDCl₃) 1.32, 1.42 (2s, 6H, 2CH₃); 3.91, 4.17 (2dd, 2H, OCH₂); 4.34, 4.68 (2dd, 2H, CH₂Het); 4.56 (m, 1H, メチン-H), 8.30 (m, 2H, フェニル-H) 20

【 0 3 2 6 】

実施例 No. 1011: (CDCl₃) 1.32, 1.42 (2s, 6H, 2CH₃); 3.91, 4.17 (2dd, 2H, OCH₂); 4.34, 4.68 (2dd, 2H, CH₂Het); 4.56 (m, 1H, メチン-H), 8.30 (m, 2H, フェニル-H)

実施例 No. 1040: (DMSO) 5.10 (s, 2H, CH₂Het); 8.39 (d, 1H, チエニル-H)

実施例 No. 1087 (CDCl₃) 1.09 (s, 9H, C(CH₃)₃); 3.78 (tr, 3H, CH₂O); 4.50 (tr, 2H, CH₂Het); 7.89 (d, 1H, キノキサリノン-H); 8.48 (dd, 1H, チエニル-H)

実施例 No. 1088 (CDCl₃) 3.32 (s, 3H, OCH₃); 3.48, 3.65 (2m, 4H, OCH₂CH₂O); 3.90 (tr, 2H, OCH₂); 4.58 (tr, 2H, CH₂Het); 7.88 (d, 1H, キノキサリノン-H); 8.48 (dd, 1H, チエニル-H) 30

実施例 No. 1103: (CDCl₃) 3.34, 3.42 (2s 6H, 2CH₃); 3.48, 3.68 (2dd, 2H, OCH₂); 3.88 (m, 1H, メチン-H); 4.53 (dd, 2H, CH₂Het); 8.48 (d, 1H, チエニル)

実施例 No. 1106: (CDCl₃) 1.34 (tr, 3H, CH₃); 2.74 (q, 2H, CH₂CH₃); 2.90 (tr, 2H, SCH₂CH₂); 4.52 (tr, 2H, CH₂Het); 8.48 (d, 1H, チエニル)

実施例 No. 1108: (CDCl₃) 1.35 (d, 6H, 2CH₃); 2.91 (tr, 2H, SCH₂); 3.13 (sept、1H, メチン-H); 4.52 (tr, 2H, CH₂Het); 8.48 (d, 1H, チエニル)

実施例 No. 1110: (CDCl₃) 3.29 (tr, 2H, SCH₂); 4.50 (tr, 2H, CH₂Het); 7.88 (d, 1H, キノキサリノン-H); 8.48 (d, 1H, チエニル)

実施例 No. 1111: (CDCl₃) 3.07 (tr, 2H, SCH₂); 3.29 (q, 2H, SCH₂CF₃); 4.58 (tr, 2H, CH₂Het); 8.48 (d, 1H, チエニル) 40

実施例 No. 1112: (CDCl₃) 1.50-1.70, 1.70-1.80, 2.05-2.15 (3m, 8H, シクロペンチル); 2.91 (tr, 2H, SCH₂); 3.31 (quint、1H, メチン-H); 4.53 (tr, 2H, CH₂Het); 8.48 (d, 1H, チエニル)

実施例 No. 1113: (CDCl₃) 2.90 (tr, 2H, SCH₂); 3.89 (s, 2H, SCH₂フリル); 4.51 (tr, 2H, CH₂Het); 6.31 (s, 2H, フリル-H); 8.48 (d, 1H, チエニル)

実施例 No. 1129: (CDCl₃) 1.02 (d, 12H, 4CH₃) 2.79 (tr, 2H, NCH₂); 3.09 (sept、2H, メチン-H); 4.32 (tr, 2H, CH₂Het); 8.48 (d, 1H, チエニル)

実施例 No. 1134: (CDCl₃) 1.48 (m, 2H, CH₂) 1.62 (m, 4H, 2CH₂); 2.50-2.95 (m, 6H, 3NCH₂); 4.49 (tr, 2H, CH₂Het); 8.48 (d, 1H, チエニル)

実施例 No. 1145: (CDCl₃) 2.20 (sext、2H, CH₂) 2.42-2.55 (m, 6H, 3CH₂N); 3.70 (tr 50

, 4H, OCH₂); 4.44 (tr, 2H, CH₂Het); 7.92 (d, 1H, キノキサリノン-H) 8.47 (d, 1H, チエニル)

実施例 No. 1146: (DMSO) 0.87 (d, 3H, CH₃) 2.12 (s, 6H, CH₃N); 2.10-2.40 (m, 3H, メチン-H, NCH₂); 4.33 (m, 2H, CH₂Het); 7.92 (d, 2H, キノキサリノン-H); 8.40 (d, 1H, チエニル)

実施例 No. 1147: (CDCl₃) 2.33 (d, 3H, CH₃) 2.92 (s, 6H, CH₃N); 3.90 (m, 1H, メチン-H); 4.68, 4.95 (2dd, 2H, CH₂Het); 7.92 (d, 2H, キノキサリノン-H) 8.45 (d, 1H, チエニル)

実施例 No. 1149: (CDCl₃) 1.65-1.90 (m, 6H, 3CH₂) 2.05-2.20 (m, 2H, CH₂N); 2.38 (s, 3H, CH₂); 3.12 (tr, 1H, メチン-H); 4.32, 4.49 (2m, 2H, CH₂Het); 7.92 (d, 2H, キノキサリノン-H) 8.48 (d, 1H, チエニル) 10

実施例 No. 1151: (CDCl₃) 1.43 (m, 1H); 1.85-2.10 (m, 3H,); 2.38 (s, 3H, CH₂); 2.55-2.90 (m, 3H); 3.78 (s, 3H, CH₃); 3.60 (dd, 2H); 4.32 (dd, 2H, CH₂Het); 7.92 (d, 2H, キノキサリノン-H) 8.42 (d, 1H, チエニル)

実施例 No. 1152: (CDCl₃) 2.87 (s, 3H, CH₃); 3.60 (dd, 2H); 4.32, 4.60 (2m, 2H, CH₂Het); 7.92 (d, 2H, キノキサリノン-H) 8.45 (d, 1H, チエニル)

実施例 No. 1196: (CDCl₃) 1.41 (d, 3H, CH₃); 4.30-4.40 (m, 2H); 4.45-4.60 (m, 1H); 7.92 (d, 2H, キノキサリノン-H) 8.47 (d, 1H, チエニル)

実施例 No. 1197: (DMSO) 3.51 (m, 2H, OCH₂); 3.98 (m, 1H, メチン-H); 4.39 (d, 2H, CH₂Het); 4.80 (tr, 1H, CH₂OH), 4.93 (d, 1H, CHOH) 8.40 (d, 1H, チエニル) 20

【 0 3 2 7 】

実施例 No. 1243: (CDCl₃) 1.32, 1.41 (2s, 6H, 2CH₃); 3.92, 4.18 (2dd, 2H, OCH₂); 4.35, 4.70 (2dd, 2H, CH₂Het); 4.58 (m, 1H, メチン-H), 8.48 (d, 1H, チエニル)

実施例 No. 1244: (CDCl₃) 1.32, 1.41 (2s, 6H, 2CH₃); 3.92, 4.18 (2dd, 2H, OCH₂); 4.35, 4.70 (2dd, 2H, CH₂Het); 4.58 (m, 1H, メチン-H), 8.48 (d, 1H, チエニル)

実施例 No. 1268: (CDCl₃) 1.31 (d, 6H, iPrCH₃); 1.69 (d, 2H, クロチル-CH₃); 3.67 (sept, 1H, メチン-H); 4.83 (m, 2H, CH₂Het); 5.59, 5.82 (2m, 2H, オレフィン-H); 7.93 (d, 2H, キノキサリノン-H)

実施例 No. 1273: (CDCl₃) 1.52 (tr, 6H, CH₂CH₃); 2.52 (s, 3H, CH₃); 3.49 (m, 6H, CH₂CH₃, NCH₂); 5.03 (tr, 2H, CH₂Het); 6.32, 7.97 (2d, 2H, フリル-H); 8.32 (d, 1H, キノキサリノン-H); 30

実施例 No. 1282: (CDCl₃) 1.08 (tr, 6H, CH₂CH₃); 2.10 (m, 2H, 2-インダニル-CH₂); 2.48 (s, 3H, CH₃); 2.80 (tr, 4H, CH₂CH₃); 2.96 (m, 4H, 1,3-インダニル-CH₂); 4.42 (tr, 2H, CH₂Het); 7.92 (d, 1H, キノキサリノン-H); 8.08 (d, 1H, インダン-6-イル-H); 8.13 (d, 1H, インダン-4-イル-H)

実施例 No. 1283: (CDCl₃) 1.08 (tr, 6H, CH₂CH₃); 2.10 (m, 2H, 2-インダニル-CH₂); 2.68 (q, 4H, CH₂CH₃), 2.80 (tr, 2H, NCH₂); 2.96 (m, 4H, 1,3-インダニル-CH₂); 4.42 (tr, 2H, CH₂Het); 7.92 (d, 1H, キノキサリノン-H); 8.08 (d, 1H, インダン-6-イル-H); 8.13 (d, 1H, インダン-4-イル-H)

実施例 No. 1287: (CDCl₃) 1.08 (tr, 6H, CH₂CH₃); 1.38 (d, 6H, イソプロピル-CH₃); 2.68 (q, 4H, CH₂CH₃), 2.80 (tr, 4H, CH₂CH₃); 2.97 (sept, 1H, メチン-H); 4.42 (tr, 2H, CH₂Het); 7.33, 8.22 (2d, 4H, フェニル-H); 7.92 (d, 1H, キノキサリノン-H); 40

実施例 No. 1290: (CDCl₃) 1.52 (tr, 6H, CH₂CH₃); 2.34, 2.38 (2s, 6H, 2CH₃) 3.29 (m, 6H, CH₂CH₃, NCH₂); 5.00 (tr, 2H, CH₂Het); 8.0-8.2 (m, 5H, フェニル-H, キノキサリノン-H);

実施例 No. 1296: (CDCl₃) 1.32, 1.42 (2d, 6H, CH₃); 3.91, 4.18, 4.33, 4.69 (4dd, 4H, 2CH₂); 4.57 (quintet, 1H, メチン-H); 7.95 (d, 1H, キノキサリノン-H); 8.30 (m, 2H, フェニル-H)

実施例 No. 1297: (CDCl₃) 1.32, 1.42 (2d, 6H, CH₃); 3.91, 4.18, 4.33, 4.69 (4dd, 4H, 2CH₂); 4.57 (quintet, 1H, メチン-H); 7.90 (d, 1H, キノキサリノン-H); 8.48 (40

d, 1H, チエニル-H)

実施例 No. 1298: (CDCl₃) 2.2, 2.43-2.70 (2m, 1H, 3H CH₂CH₂CO); 4.43, 4.78 (2dd, 2H, CH₂N); 4.97 (m, 1H, メチン-H); 7.96 (d, 1H, キノキサリノン-H); 8.30 (m, 2H, フェニル-H)

実施例 No. 1299: (CDCl₃) 2.2, 2.43-2.70 (2m, 1H, 3H CH₂CH₂CO); 4.43, 4.78 (2dd, 2H, CH₂N); 4.97 (m, 1H, メチン-H); 7.90 (d, 1H, キノキサリノン-H); 8.45 (d, 1H, キノキサリノン-H)

実施例 No. 1300: (CDCl₃) 2.2, 2.43-2.70 (2m, 1H, 3H CH₂CH₂CO); 4.43, 4.78 (2dd, 2H, CH₂N); 4.97 (m, 1H, メチン-H); 7.96 (d, 1H, キノキサリノン-H); 8.30 (m, 2H, フェニル-H)

実施例 No. 1290: (CDCl₃) 1.52 (tr, 6H, CH₂CH₃); 2.34, 2.38 (2s, 6H, 2CH₃) 3.29 (m, 6H, CH₂CH₃, NCH₂); 5.00 (tr, 2H, CH₂Het); 8.0-8.2 (m, 5H, フェニル-H, キノキサリノン-H);

実施例 No. 1301: (CDCl₃) 2.2, 2.43-2.70 (2m, 1H, 3H CH₂CH₂CO); 4.43, 4.78 (2dd, 2H, CH₂N); 4.97 (m, 1H, メチン-H); 7.90 (d, 1H, キノキサリノン-H); 8.45 (d, 1H, キノキサリノン-H)

実施例 No. 1307: (CDCl₃) 1.08 (tr, 6H, CH₂CH₃); 1.80 (m, 4H, 2,3-ビスメチレン); 2.68 (q, 4H, CH₂CH₃); 2.77-2.90 (m, 4H, 1,4-ビスメチレン) 4.41 (tr, 2H, CH₂Het); 7.92 (d, 1H, キノキサリノン-H); 8.00 (s, 1H, テトラリン-H); 8.02 (d, 1H, テトラリン-H)

実施例 No. 1308: (CDCl₃) 1.02 (tr, 6H, CH₂CH₃); 1.29 (d, 6H, CH(CH₃)₂); 2.61 (q, 4H, CH₂CH₃); 2.74 (tr, 2H, CH₂N); 3.58 (sept, 1H, メチン-H); 4.25 (tr, 2H, CH₂Het); 7.50, 7.95 (2s, 2H, キノキサリノン-H);

実施例 No. 1309: (CDCl₃) 1.07 (tr, 6H, CH₂CH₃); 2.65 (q, 4H, CH₂CH₃); 2.80 (tr, 2H, CH₂N); 4.40 (tr, 2H, CH₂Het); 7.40, 7.57 (2d 2H, フェニル-H); 7.93 (d, 1H, キノキサリノン-H)

実施例 No. 1310: (CDCl₃) 1.09 (tr, 6H, CH₂CH₃); 2.68 (q, 4H, CH₂CH₃); 2.81 (tr, 2H, CH₂N); 4.42 (tr, 2H, CH₂Het); 7.40, 7.57 (2d 2H, フェニル-H); 7.92 (d, 1H, キノキサリノン-H); 8.36 (d 2H, フェニル-H)

実施例 No. 1314: (CDCl₃) 1.08 (tr, 6H, CH₂CH₃); 2.53 (s, 3H, SCH₃); 2.68 (q, 4H, CH₂CH₃); 2.80 (tr, 2H, CH₂N); 4.42 (tr, 2H, CH₂Het); 7.93 (d, 1H, キノキサリノン-H); 8.33 (d, 2H, フェニル-H)

実施例 No. 1315: (CDCl₃) 1.07 (tr, 6H, CH₂CH₃); 2.68 (q, 4H, CH₂CH₃); 2.82 (tr, 2H, CH₂N); 4.41 (tr, 2H, CH₂Het); 7.93 (d, 1H, キノキサリノン-H)

【 0 3 2 8 】

実施例 No. 1322: (CDCl₃) 1.09 (tr, 6H, CH₂CH₃); 1.20-1.60, 1.70-1.95 (2m, 10H, シクロヘキシル-CH₂); 2.59 (m, 1H, メチン-H); 2.68 (q, 4H, CH₂CH₃); 2.83 (tr, 2H, CH₂N); 4.42 (tr, 2H, CH₂Het); 7.95 (d, 1H, キノキサリノン-H); 8.24 (d, 2H, フェニル-H)

実施例 No. 1326: (CDCl₃) 1.38, 1.50 (2s, 6H, CH₃); 1.9-2.2 (m, 2H, CH₂); 3.63, 4.11 (2dd, 2H, CH₂O); 4.27 (m, 1H, メチン-H); 4.49 (tr, 2H, CH₂Het); 7.95 (d, 1H, キノキサリノン-H); 8.29 (d, 2H, フェニル-H)

実施例 No. 1328: (CDCl₃) 1.38, 1.50 (2s, 6H, CH₃); 1.9-2.2 (m, 2H, CH₂); 3.63, 4.11 (2dd, 2H, CH₂O); 4.27 (m, 1H, メチン-H); 4.49 (tr, 2H, CH₂Het); 7.95 (d, 1H, キノキサリノン-H); 8.29 (d, 2H, フェニル-H)

実施例 No. 1330: (CDCl₃) 1.04 (d, 3H, CH(CH₃)); 1.29 (tr, 3H, CH₂CH₃); 2.42 (m, 1H, メチン-H), 3.38 (d, 2H, CHCH₂O); 3.43 (q, 2H, OCH₂CH₃), 4.37 (d, 2H, CH₂Het); 7.93 (d, 1H, キノキサリノン-H); 8.29 (d, 2H, フェニル-H)

実施例 No. 1331: (CDCl₃) 1.05 (d, 3H, CH(CH₃)); 1.28 (tr, 3H, CH₂CH₃); 2.42 (m, 1H, メチン-H), 3.37 (d, 2H, CHCH₂O); 3.43 (q, 2H, OCH₂CH₃), 4.38 (d, 2H, CH₂Het)

t); 7.90 (d, 1H, キノキサリノン-H); 8.48 (d, 1H, チエニル-H)

実施例 No. 1332: (CDCl₃) 1.08 (tr, 6H, NCH₂CH₃); 1.25 (tr, 6H, C₆H₄CH₂CH₃); 2.68 (q, 6H, NCH₂CH₃, C₆H₄CH₂CH₃); 2.79 (tr, 2H, CH₂N); 4.41 (tr, 2H, CH₂Het); 7.93 (d, 1H, キノキサリノン-H), 8.23 (d, 2H, フェニル-H)

実施例 No. 1333: (CDCl₃) 1.03 (s, 6H, C(CH₃)₂); 3.10 (s, 2H, OCH₂); 3.35 (s, 3H, OCH₃); 4.39 (tr, 2H, CH₂Het); 7.92 (d, 1H, キノキサリノン-H); 8.28 (d, 2H, フェニル-H)

実施例 No. 1335: (CDCl₃) 1.09 (tr, 6H, CH₂CH₃); 2.68 (q, 4H, CH₂CH₃); 2.80 (tr, 2H, CH₂N); 4.42 (tr, 2H, CH₂Het); 5.15 (s, 2H, ベンジル-CH₂); 7.08, 8.38 (2d, 4H, C₆H₄); 7.93 (d, 1H, キノキサリノン-H)

実施例 No. 1342: (CDCl₃) 1.32, 1.42 (2d, 6H, CH₃); 3.89 (s, 3H OCH₃); 3.91, 4.16, 4.33, 4.69 (4dd, 4H, 2CH₂); 4.57 (quintet, 1H, メチン-H); 7.00, 8.38 (2d, 4H, フェニル-H); 7.93 (d, 1H, キノキサリノン-H)

実施例 No. 1343: (CDCl₃) 1.32, 1.42 (2d, 6H, CH₃); 3.42 (s, 3H, トリル-CH₃); 3.91, 4.16, 4.33, 4.69 (4dd, 4H, 2CH₂); 4.57 (quintet, メチン-H); 7.28, 8.22 (2d, 4H, フェニル-H); 7.93 (d, 1H, キノキサリノン-H);

実施例 No. 1355: (CDCl₃) 3.68 (2tr, 4H, 2CH₂N); 4.29 (tr, 2H, CH₂Het); 4.58 (tr, 2H CH₂O); 7.93 (d, 1H, キノキサリノン-H); 8.45 (d, 1H, チエニル-H)

実施例 No. 1358: (CDCl₃) 1.09 (tr, 6H, CH₂CH₃); 2.36 (s, 3H, CH₃アリアル); 2.68 (q, 4H, CH₂CH₃); 2.80 (tr, 2H, CH₂N); 4.42 (tr, 2H, CH₂Het); 5.15 (s, 2H, ベンジル-CH₂); 7.93 (d, 1H, キノキサリノン-H); 8.20 (m, 2H, フェニル-H)

実施例 No. 1360: (CDCl₃) 1.32, 1.42 (2d, 6H, CH₃); 2.37 (s, 3H, CH₃アリアル); 3.91, 4.16, 4.33, 4.69 (4dd, 4H, 2CH₂); 4.57 (quintet, 1H, メチン-H); 7.92 (d, 1H, キノキサリノン-H); 8.20 (m, 2H, フェニル-H);

実施例 No. 1381: (CDCl₃) 2.25 (s, 3H, トリル-CH₃); 2.92 (s, 3H, NCH₃); 3.73 (tr, 2H, CH₂N); 4.52 (tr, 2H, CH₂Het); 6.75, 7.09 (2d, 4H, フェニル-H); 7.91 (d, 1H, キノキサリノン-H); 8.49 (d, 1H, チエニル-H)

実施例 No. 1382: (CDCl₃) 2.27 (s, 3H, トリル-CH₃); 2.97 (s, 3H, NCH₃); 3.75 (tr, 2H, CH₂N); 4.50 (tr, 2H, CH₂Het); 6.75, 7.09 (2d, 4H, フェニル-H); 7.93 (d, 1H, キノキサリノン-H); 8.29 (m, 2H, フェニル-H)

実施例 No. 1385: (CDCl₃) 3.00 (s, 3H, NCH₃); 3.78 (tr, 2H, CH₂N); 4.52 (tr, 2H, CH₂Het); 7.93 (d, 1H, キノキサリノン-H); 8.30 (m, 2H, フェニル-H)

実施例 No. 1386: (CDCl₃) 2.98 (s, 3H, NCH₃); 3.80 (tr, 2H, CH₂N); 4.57 (tr, 2H, CH₂Het); 7.91 (d, 1H, キノキサリノン-H); 8.49 (d, 1H, チエニル-H)

実施例 No. 1395: (CDCl₃) 1.28 (tr, 3H, CH₂CH₃); 2.36, 2.40 (2s, 6H, 6,7-Me₂); 4.25 (q, 2H, CH₂CH₃); 5.10 (s, 2H, CH₂N); 6.88, 7.69 (2s, 2H, キノキサリノン-H); 7.28, 7.55, 8.45 (tr, d, d, 3H, チエニル-H)

実施例 No. 1410: (CDCl₃) 1.69, 1.87 (2s, 6H, 2CH₃); 4.43, 4.63 (2tr, 4H, 2CH₂); 7.93 (d, 1H, キノキサリノン-H); 8.33 (m, 2H, フェニル-H)

実施例 No. 1411: (CDCl₃) 1.65, 1.85 (2s, 6H, 2CH₃); 4.44, 4.65 (2tr, 4H, 2CH₂); 7.89 (d, 1H, キノキサリノン-H); 8.49 (m, 2H, フェニル-H)

実施例 No. 1413: (CDCl₃) 1.09 (tr, 6H, 2CH₃); 2.70 (tr, 4H, 2CH₂CH₃); 2.83 (2H, tr, CH₂N); 4.49 (tr, 2H, CH₂Het); 7.91 (d, 1H, キノキサリノン-H); 8.03, 9.09, 9.22 (2d, s, 3H, ベンゾチオフェン-H)

【 0 3 2 9 】

10

20

30

40

【表 6 0】

表 2 : 式 (I - 2) の化合物

実施例	Y	R ²	R ¹	m.p. [°C]
2-1	H	Ph	Me	187-188
2-2	H	2-Th	Me	113
2-3	H	Ph	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
2-4	H	2-Th	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
2-5	H	Ph	H	
2-6	5-Me	Ph	H	
2-7	6-Me	Ph	H	
2-8	7-Me	Ph	H	
2-9	8-Me	Ph	H	
2-10	5-Cl	Ph	H	
2-11	6-Cl	Ph	H	
2-12	7-Cl	Ph	H	
2-13	8-Cl	Ph	H	
2-14	5-F	Ph	H	
2-15	15	Ph	H	
2-16	16	Ph	H	
2-17	8-F	Ph	H	
2-18	5-OMe	Ph	H	
2-19	6- OMe	Ph	H	
2-20	7- OMe	Ph	H	
2-21	8- OMe	Ph	H	
2-22	5-CF ₃	Ph	H	
2-23	6-CF ₃	Ph	H	
2-24	7-CF ₃	Ph	H	
2-25	8-CF ₃	Ph	H	
2-26	6,7-Me ₂	Ph	H	
2-27	5,7-Me ₂	Ph	H	

10

20

30

40

【 0 3 3 0 】

【表 6 1】
(表 2 続き)

実施例	Y	R ²	R ¹	m.p. [°C]
2-28	5,6- Me ₂	Ph	H	
2-29	7,8- Me ₂	Ph	H	
2-30	5,7- Me ₂	Ph	H	
2-31	6,8- Me ₂	Ph	H	
2-32	5,8- Me ₂	Ph	H	
2-33	6,7-Cl ₂	Ph	H	
2-34	5,6- Cl ₂	Ph	H	
2-35	5,7- Cl ₂	Ph	H	
2-36	7,8- Cl ₂	Ph	H	
2-37	6,8- Cl ₂	Ph	H	
2-38	5,8- Cl ₂	Ph	H	
2-39	6,7-(OMe) ₂	Ph	H	
2-40	6,7-O-CF ₂ -O-	Ph	H	
2-41	6,7-F ₂	Ph	H	
2-42	5,7-F ₂	Ph	H	
2-43	5,6-F ₂	Ph	H	
2-44	7,8-F ₂	Ph	H	
2-45	6,8-F ₂	Ph	H	
2-46	5,8-F ₂	Ph	H	
2-47	6,7-(CF ₃) ₂	Ph	H	
2-48	5,7-(CF ₃) ₂	Ph	H	
2-49	5,6-(CF ₃) ₂	Ph	H	
2-50	7,8-(CF ₃) ₂	Ph	H	
2-51	6,8-(CF ₃) ₂	Ph	H	
2-52	5,8-(CF ₃) ₂	Ph	H	
2-53	6-Cl, 7-F	Ph	H	
2-54	H	2-Th	H	
2-55	5-Me	2-Th	H	
2-56	6-Me	2-Th	H	
2-57	7-Me	2-Th	H	
2-58	8-Me	2-Th	H	

10

20

30

40

【表 6 2】
(表 2 続き)

実施例	Y	R ²	R ¹	m.p. [°C]
2-59	5-Cl	2-Th	H	
2-60	6-Cl	2-Th	H	
2-61	7-Cl	2-Th	H	
2-62	8-Cl	2-Th	H	
2-63	5-F	2-Th	H	
2-64	6-F	2-Th	H	
2-65	7-F	2-Th	H	
2-66	8-F	2-Th	H	
2-67	5-OMe	2-Th	H	
2-68	6- OMe	2-Th	H	
2-69	7- OMe	2-Th	H	
2-70	8- OMe	2-Th	H	
2-71	5-CF ₃	2-Th	H	
2-72	6-CF ₃	2-Th	H	
2-73	7-CF ₃	2-Th	H	
2-74	8-CF ₃	2-Th	H	
2-75	6,7-Me ₂	2-Th	H	
2-76	5,7-Me ₂	2-Th	H	
2-77	5,6- Me ₂	2-Th	H	
2-78	7,8- Me ₂	2-Th	H	
2-79	5,7- Me ₂	2-Th	H	
2-80	6,8- Me ₂	2-Th	H	
2-81	5,8- Me ₂	2-Th	H	
2-82	6,7-Cl ₂	2-Th	H	
2-83	5,6- Cl ₂	2-Th	H	
2-84	5,7- Cl ₂	2-Th	H	
2-85	7,8- Cl ₂	2-Th	H	
2-86	6,8- Cl ₂	2-Th	H	
2-87	5,8- Cl ₂	2-Th	H	
2-88	6,7-(OMe) ₂	2-Th	H	
2-89	6,7-O-CF ₂ -O-	2-Th	H	

10

20

30

40

【表 6 3】
(表 2 続き)

実施例	Y	R ²	R ¹	m.p. [°C]
2-90	6,7-F ₂	2-Th	H	
2-91	5,7-F ₂	2-Th	H	
2-92	5,6-F ₂	2-Th	H	
2-93	7,8-F ₂	2-Th	H	
2-94	6,8-F ₂	2-Th	H	
2-95	5,8-F ₂	2-Th	H	
2-96	6,7-(CF ₃) ₂	2-Th	H	
2-97	5,7-(CF ₃) ₂	2-Th	H	
2-98	5,6-(CF ₃) ₂	2-Th	H	
2-99	7,8-(CF ₃) ₂	2-Th	H	
2-100	6,8-(CF ₃) ₂	2-Th	H	
2-101	5,8-(CF ₃) ₂	2-Th	H	
2-102	6-Cl, 7-F	2-Th	H	
2-103	H	2-Th	Me	
2-104	H	2-Th	Me	
2-105	H	2-Th	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
2-106	H	2-Th	(CH ₂) ₂ NEt ₂	
2-107	H	Ph	CH ₂ COOEt	
2-108	H	Ph	CH ₂ COOPr	
2-109	H	Ph	CH ₂ CH ₂ COOiPr	
2-110	H	Ph	CH ₂ COOBu	
2-111	H	Ph	CH ₂ COOiBu	
2-112	H	Ph	CH ₂ COOsBu	
2-113	H	Ph	CH ₂ COOtBu	
2-114	H	Ph	CH ₂ COOH	
2-115	H	Ph	CH(Me)COOMe	
2-116	H	Ph	CH(Me)COOEt	
2-117	H	Ph	(CH ₂) ₂ COOMe	
2-118	H	Ph	(CH ₂) ₂ COOEt	
2-119	H	Ph	(CH ₂) ₃ COOMe	
2-120	H	Ph	(CH ₂) ₃ COOEt	

10


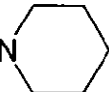
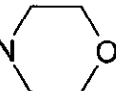

20

30

40

【表 6 4】

(表 2 続き)

実施例	Y	R ²	R ¹	m.p. [°C]
2-121	H	Ph	(CH ₂) ₃ COOH	
2-122	H	Ph	CH ₂ CONMe ₂	
2-123	H	Ph	CH ₂ CONEt ₂	
2-124	H	Ph	CH ₂ CONPr ₂	
2-125	H	Ph	CH ₂ CONiPr ₂	
2-126	H	Ph	CH ₂ CONMeEt	
2-127	H	Ph	CH ₂ CO-N 	
2-128	H	Ph	CH ₂ CO-N 	
2-129	H	Ph	CH ₂ CO-N 	
2-130	H	Ph	CH ₂ CO-N 	
2-131	H	Ph	CH ₂ CONMe(OMe)	
2-132	H	Ph	CH ₂ CONMePh	
2-133	H	Ph	CH ₂ CONHMe	
2-134	H	Ph	CH ₂ CONHEt	
2-135	H	Ph	CH ₂ CONHPr	
2-136	H	Ph	CH ₂ CONHiPr	
2-137	H	Ph	CH ₂ CONHBu	
2-138	H	Ph	CH ₂ CONHiBu	
2-139	H	Ph	CH ₂ CONHsBu	
2-140	H	Ph	CH ₂ CONHtBu	
2-141	H	Ph	CH ₂ CONHPh	
2-142	H	Ph	CH ₂ COMe	
2-143	H	Ph	CH(CH ₃)COMe	
2-144	H	Ph	CH ₂ COCF ₃	

10

20

30

40

【表 6 5】

(表 2 続き)

実施例	Y	R ²	R ¹	m.p. [°C]
2-145	H	Ph	CH ₂ COEt	
2-146	H	Ph	CH ₂ COPr	
2-147	H	Ph	CH ₂ COiPr	
2-148	H	Ph	CH ₂ COtBu	
2-149	H	Ph	CH ₂ OMe	
2-150	H	Ph	CH ₂ OEt	
2-151	H	Ph	(CH ₂) ₂ OMe	
2-152	H	Ph	(CH ₂) ₂ OEt	
2-153	H	Ph	(CH ₂) ₂ OPr	
2-154	H	Ph	(CH ₂) ₂ OiPr	
2-155	H	Ph	(CH ₂) ₂ OtBu	
2-156	H	Ph	(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	
2-157	H	Ph	(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂ OEt	
2-158	H	Ph	(CH ₂) ₂ OCH ₂ CF ₃	
2-159	H	Ph	(CH ₂) ₂ OPh	
2-160	H	Ph	(CH ₂) ₃ OH	
2-161	H	Ph	(CH ₂) ₃ OMe	
2-162	H	Ph	(CH ₂) ₃ OEt	
2-163	H	Ph	(CH ₂) ₃ OPr	
2-164	H	Ph	(CH ₂) ₃ OiPr	
2-165	H	Ph	(CH ₂) ₃ OtBu	
2-166	H	Ph	(CH ₂) ₂ (OMe) ₂	
2-167	H	Ph	(CH ₂) ₂ (OEt) ₂	
2-168	H	Ph	CH ₂ (OMe) ₂	
2-169	H	Ph	CH ₂ (OEt) ₂	
2-170	H	Ph	CH ₂ CH(OMe)CH ₂ OMe	
2-171	H	Ph	CH ₂ SMe	
2-172	H	Ph	(CH ₂) ₂ SMe	
2-173	H	Ph	(CH ₂) ₂ SEt	
2-174	H	Ph	(CH ₂) ₂ SPr	
2-175	H	Ph	(CH ₂) ₂ SiPr	

10

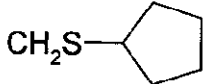

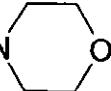
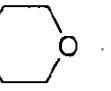
20

30

40

【表 6 6】

(表 2 続き)

実施例	Y	R ²	R ¹	m.p. [°C]
2-176	H	Ph	(CH ₂) ₂ StBu	
2-177	H	Ph	(CH ₂) ₂ SPh	
2-178	H	Ph	(CH ₂) ₂ SCH ₂ CF ₃	
2-179	H	Ph	(CH ₂) ₂ S-シクロペンチル	
2-180	H	Ph	CH ₂ S- 	
2-181	H	Ph	(CH ₂) ₂ S(O)Me	
2-182	H	Ph	(CH ₂) ₂ S(O) ₂ Me	
2-183	H	Ph	(CH ₂) ₂ S(O)Et	
2-184	H	Ph	(CH ₂) ₂ S(O) ₂ Et	
2-185	H	Ph	(CH ₂) ₂ S(O)Ph	
2-186	H	Ph	(CH ₂) ₂ S(O) ₂ Ph	
2-187	H	Ph	(CH ₂) ₂ NH ₂	
2-188	H	Ph	(CH ₂) ₂ NHMe · HCl	
2-189	H	Ph	(CH ₂) ₂ NHEt	
2-190	H	Ph	(CH ₂) ₂ NHPr	
2-191	H	Ph	(CH ₂) ₂ NHiPr	
2-192	H	Ph	(CH ₂) ₃ NH ₂	
2-193	H	Ph	(CH ₂) ₂ NMe ₂	
2-194	H	Ph	(CH ₂) ₂ NMe ₂ · HCl	
2-195	H	Ph	(CH ₂) ₂ NPr ₂	
2-196	H	Ph	(CH ₂) ₂ NiPr ₂	
2-197	H	Ph	(CH ₂) ₂ -N- 	
2-198	H	Ph	(CH ₂) ₂ -N- 	
2-199	H	Ph	(CH ₂) ₂ -N-  · HCl	

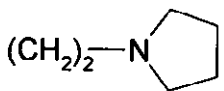
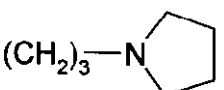
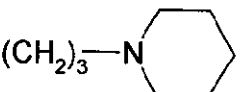
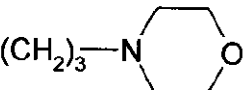
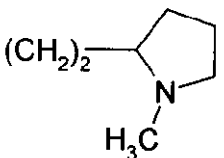
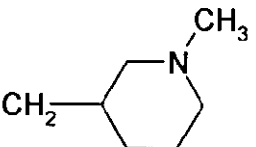
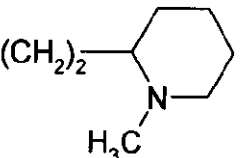
10

20

30

40

【表 6 7】
 (表 2 続き)

実施例	Y	R ²	R ¹	m.p. [°C]
2-200	H	Ph		
2-201	H	Ph	(CH ₂) ₃ NMe ₂	
2-202	H	Ph	(CH ₂) ₃ NMe ₂ · HCl	
2-203	H	Ph	(CH ₂) ₃ NEt ₂	
2-204	H	Ph	(CH ₂) ₃ NEt ₂ · HCl	
2-205	H	Ph		
2-206	H	Ph		
2-207	H	Ph		
2-208	H	Ph	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ NMe ₂	
2-209	H	Ph	CH(CH ₃)CH ₂ NMe ₂	
2-210	H	Ph	CH ₂ CH(CH ₃)NMe ₂	
2-211	H	Ph	CH ₂ CH(CH ₃)NMe ₂ · HCl	
2-212	H	Ph		
2-213	H	Ph		
2-214	H	Ph		
2-215	H	Ph	(CH ₂) ₂ NHAc	

10




20

30

40

【表 6 8】

(表 2 続き)

実施例	Y	R ²	R ¹	m.p. [°C]
2-216	H	Ph	(CH ₂) ₂ NHCOEt	
2-217	H	Ph	(CH ₂) ₂ NHCOPr	
2-218	H	Ph	(CH ₂) ₂ NHCOiPr	
2-219	H	Ph	(CH ₂) ₂ NHCOBu	
2-220	H	Ph	(CH ₂) ₂ NHCOTBu	
2-221	H	Ph	(CH ₂) ₂ NHCOPh	
2-222	H	Ph	(CH ₂) ₂ NHCOOMe	
2-223	H	Ph	(CH ₂) ₂ NHCOOEt	
2-224	H	Ph	(CH ₂) ₂ NHCOOPr	
2-225	H	Ph	(CH ₂) ₂ NHCOOiPr	
2-226	H	Ph	(CH ₂) ₂ NHCOOtBu	
2-227	7-CF ₃	Ph	(CH ₂) ₂ NHCOOtBu	
2-228	H	Ph	(CH ₂) ₂ NHCONHMe	
2-229	H	Ph	(CH ₂) ₂ NHCONMe ₂	
2-230	H	Ph	(CH ₂) ₂ NHCONHET	
2-231	H	Ph	(CH ₂) ₂ NHCONEt ₂	
2-232	H	Ph	(CH ₂) ₂ NHCO-N 	
2-233	H	Ph	(CH ₂) ₂ NHCO-N 	
2-234	H	Ph	(CH ₂) ₂ NHCO-N 	
2-235	H	Ph	(CH ₂) ₂ NMeCONMe ₂	
2-236	H	Ph	(CH ₂) ₂ NMeCONEt ₂	
2-237	H	Ph	(CH ₂) ₂ NHSO ₂ Me	
2-238	H	Ph	(CH ₂) ₂ NMeSO ₂ Me	
2-239	H	Ph	(CH ₂) ₂ NHSO ₂ Ph	
2-240	H	Ph	(CH ₂) ₂ NMeSO ₂ Ph	

10




20

30

40

【 0 3 3 8 】

【表 6 9】
 (表 2 続き)

実施例	Y	R ²	R ¹	m.p. [°C]
2-241	H	Ph	(CH ₂) ₂ OH	
2-242	7-NO ₂	Ph	(CH ₂) ₂ OH	
2-243	H	Ph	(CH ₂) ₂ OAc	
2-244	H	Ph	(CH ₂) ₂ OCOPr	
2-245	H	Ph	(CH ₂) ₂ OCOiPr	
2-246	H	Ph	(CH ₂) ₂ OCOBu	
2-247	H	Ph	(CH ₂) ₂ OCOtBu	
2-248	H	Ph	(CH ₂) ₂ OCOOMe	
2-249	H	Ph	(CH ₂) ₂ OCOOEt	
2-250	H	Ph	(CH ₂) ₂ OCOOPr	
2-251	H	Ph	(CH ₂) ₂ OCOOiPr	
2-252	H	Ph	(CH ₂) ₂ OCOOBu	
2-253	H	Ph	(CH ₂) ₂ OCOOtBu	
2-254	H	Ph	(CH ₂) ₂ OCONMe ₂	
2-255	H	Ph	(CH ₂) ₂ OCONEt ₂	
2-256	H	Ph	(CH ₂) ₂ OCO-N 	
2-257	H	Ph	(CH ₂) ₂ OCO-N 	
2-258	H	Ph	(CH ₂) ₂ OCO-N 	
2-259	H	Ph	CH ₂ CH(OH)Me	
2-260	H	Ph	CH ₂ CH(OH)CH ₂ OH	
2-261	H	Ph	Et	
2-262	H	Ph	Pr	
2-263	H	Ph	iPr	
2-264	H	Ph	Bu	
2-265	H	Ph	iBu	

10

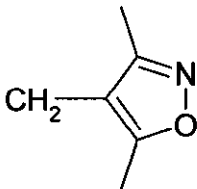
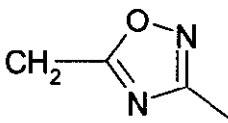
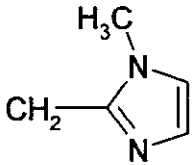
20

30

40

【表 7 0】

(表 2 続き)

実施例	Y	R ²	R ¹	m.p. [°C]
2-266	H	Ph	sBu	
2-267	H	Ph	tBu	
2-268	H	Ph	CH ₂ CH ₂ F	
2-269	H	Ph	CH ₂ CHF ₂	
2-270	H	Ph	CH ₂ CF ₃	
2-271	H	Ph	(CH ₂) ₂ CF ₃	
2-272	H	Ph	CH ₂ -シクロプロピル	
2-273	H	Ph	CH ₂ -シクロブチル	
2-274	H	Ph	CH ₂ -シクロペンチル	
2-275	H	Ph	CH ₂ -シクロヘキシル	
2-276	H	Ph	ベンジル	
2-277	H	Ph	2-フルフリル	
2-278	H	Ph	3-フルフリル	
2-279	H	Ph	2-チエニルメチル	
2-280	H	Ph	3-チエニルメチル	
2-281	H	Ph	2-(5-クロロチエニル)メチル	
2-282	H	Ph		
2-283	H	Ph		
2-284	H	Ph		

10

20

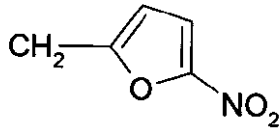
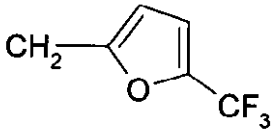
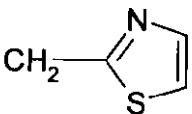
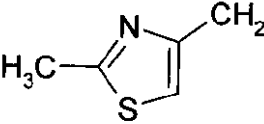
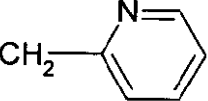
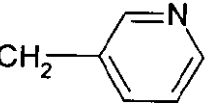
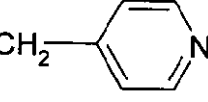
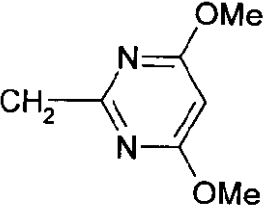
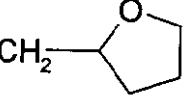
30

40

【 0 3 4 0 】

【表 7 1】

(表 2 続き)

実施例	Y	R ²	R ¹	m.p. [°C]
2-285	H	Ph		
2-286	H	Ph		
2-287	H	Ph		
2-288	H	Ph		
2-289	H	Ph		
2-290	H	Ph		
2-291	H	Ph		
2-292	H	Ph		
2-293	H	Ph		

10

20

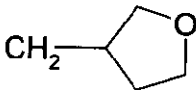
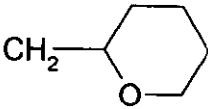
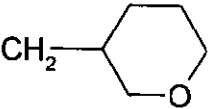
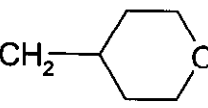
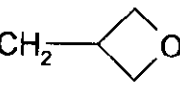
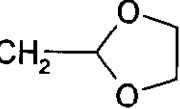
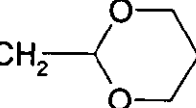
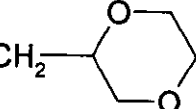
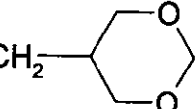
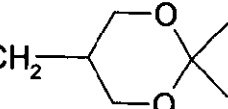
30

40

【 0 3 4 1 】

【表 7 2】

(表 2 続き)

実施例	Y	R ²	R ¹	m.p. [°C]
2-294	H	Ph		
2-295	H	Ph		
2-296	H	Ph		
2-297	H	Ph		
2-298	H	Ph		
2-299	H	Ph		
2-300	H	Ph		
2-301	H	Ph		
2-302	H	Ph		
2-303	H	Ph		

10

20

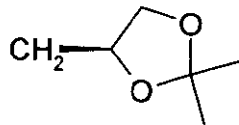
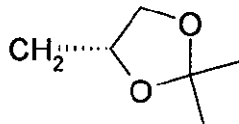
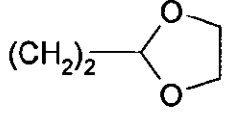
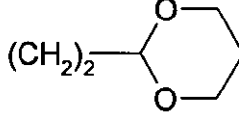
30

40

【 0 3 4 2 】

【表 7 3】

(表 2 続き)

実施例	Y	R ²	R ¹	m.p. [°C]
2-304	H	Ph		
2-305	H	Ph		
2-306	H	Ph		
2-307	H	Ph		
2-308	H	2-Th	CH ₂ COOEt	
2-309	H	2-Th	CH ₂ COOPr	
2-310	H	2-Th	CH ₂ CH ₂ COOiPr	
2-311	H	2-Th	CH ₂ COOBu	
2-312	H	2-Th	CH ₂ COOiBu	
2-313	H	2-Th	CH ₂ COOsBu	
2-314	H	2-Th	CH ₂ COOtBu	
2-315	H	2-Th	CH ₂ COOH	
2-316	H	2-Th	CH(Me)COOMe	
2-317	H	2-Th	CH(Me)COOEt	
2-318	H	2-Th	(CH ₂) ₂ COOMe	
2-319	H	2-Th	(CH ₂) ₂ COOEt	
2-320	H	2-Th	(CH ₂) ₃ COOMe	
2-321	H	2-Th	(CH ₂) ₃ COOEt	
2-322	H	2-Th	(CH ₂) ₃ COOH	
2-323	H	2-Th	CH ₂ CONMe ₂	
2-324	H	2-Th	CH ₂ CONEt ₂	
2-325	H	2-Th	CH ₂ CONPr ₂	

10





20

30

40

【表 7 4】

(表 2 続き)

実施例	Y	R ²	R ¹	m.p. [°C]
2-326	H	2-Th	CH ₂ CONiPr ₂	
2-327	H	2-Th	CH ₂ CONMeEt	
2-328	H	2-Th	CH ₂ CO-N 	
2-329	H	2-Th	CH ₂ CO-N 	
2-330	H	2-Th	CH ₂ CO-N 	
2-331	H	2-Th	CH ₂ CO-N 	
2-332	H	2-Th	CH ₂ CONMe(OMe)	
2-333	H	2-Th	CH ₂ CONMePh	
2-334	H	2-Th	CH ₂ CONHMe	
2-335	H	2-Th	CH ₂ CONHEt	
2-336	H	2-Th	CH ₂ CONHPr	
2-337	H	2-Th	CH ₂ CONHiPr	
2-338	H	2-Th	CH ₂ CONHBu	
2-339	H	2-Th	CH ₂ CONHiBu	
2-340	H	2-Th	CH ₂ CONHsBu	
2-341	H	2-Th	CH ₂ CONHiBu	
2-342	H	2-Th	CH ₂ CONHPh	
2-343	H	2-Th	CH ₂ COMe	
2-344	H	2-Th	CH(CH ₃)COMe	
2-345	H	2-Th	CH ₂ COCF ₃	
2-346	H	2-Th	CH ₂ COEt	
2-347	H	2-Th	CH ₂ COPr	
2-348	H	2-Th	CH ₂ COiPr	
2-349	H	2-Th	CH ₂ COtBu	

10

20

30

40

【表 7 5】

(表 2 続き)

実施例	Y	R ²	R ¹	m.p. [°C]
2-350	H	2-Th	CH ₂ OMe	
2-351	H	2-Th	CH ₂ OEt	
2-352	H	2-Th	(CH ₂) ₂ OMe	
2-353	H	2-Th	(CH ₂) ₂ OEt	
2-354	H	2-Th	(CH ₂) ₂ OPr	
2-355	H	2-Th	(CH ₂) ₂ OiPr	
2-356	H	2-Th	(CH ₂) ₂ OtBu	
2-357	H	2-Th	(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	
2-358	H	2-Th	(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂ OEt	
2-359	H	2-Th	(CH ₂) ₂ OCH ₂ CF ₃	
2-360	H	2-Th	(CH ₂) ₂ OPh	
2-361	H	2-Th	(CH ₂) ₃ OH	
2-362	H	2-Th	(CH ₂) ₃ OMe	
2-363	H	2-Th	(CH ₂) ₃ OEt	
2-364	H	2-Th	(CH ₂) ₃ OPr	
2-365	H	2-Th	(CH ₂) ₃ OiPr	
2-366	H	2-Th	(CH ₂) ₃ OtBu	
2-367	H	2-Th	(CH ₂) ₂ (OMe) ₂	
2-368	H	2-Th	(CH ₂) ₂ (OEt) ₂	
2-369	H	2-Th	CH ₂ (OMe) ₂	
2-370	H	2-Th	CH ₂ (OEt) ₂	
2-371	H	2-Th	CH ₂ CH(OMe)CH ₂ OMe	
2-372	H	2-Th	CH ₂ SMe	
2-373	H	2-Th	(CH ₂) ₂ SMe	
2-374	H	2-Th	(CH ₂) ₂ SEt	
2-375	H	2-Th	(CH ₂) ₂ SPr	
2-376	H	2-Th	(CH ₂) ₂ SiPr	
2-377	H	2-Th	(CH ₂) ₂ SiBu	
2-378	H	2-Th	(CH ₂) ₂ SPh	
2-379	H	2-Th	(CH ₂) ₂ SCH ₂ CF ₃	
2-380	H	2-Th	(CH ₂) ₂ S-シクロペンチル	

10

20


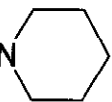
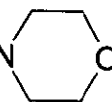
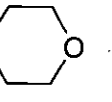
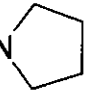
30

40

【 0 3 4 5 】

【表 7 6】

(表 2 続き)

実施例	Y	R ²	R ¹	m.p. [°C]
2-381	H	2-Th	CH_2S — 	
2-382	H	2-Th	$(\text{CH}_2)_2\text{S}(\text{O})\text{Me}$	
2-383	H	2-Th	$(\text{CH}_2)_2\text{S}(\text{O})_2\text{Me}$	
2-384	H	2-Th	$(\text{CH}_2)_2\text{S}(\text{O})\text{Et}$	
2-385	H	2-Th	$(\text{CH}_2)_2\text{S}(\text{O})_2\text{Et}$	
2-386	H	2-Th	$(\text{CH}_2)_2\text{S}(\text{O})\text{Ph}$	
2-387	H	2-Th	$(\text{CH}_2)_2\text{S}(\text{O})_2\text{Ph}$	
2-388	H	2-Th	$(\text{CH}_2)_2\text{NH}_2$	
2-389	H	2-Th	$(\text{CH}_2)_2\text{NHMe} \cdot \text{HCl}$	
2-390	H	2-Th	$(\text{CH}_2)_2\text{NHEt}$	
2-391	H	2-Th	$(\text{CH}_2)_2\text{NHPr}$	
2-392	H	2-Th	$(\text{CH}_2)_2\text{NHiPr}$	
2-393	H	2-Th	$(\text{CH}_2)_3\text{NH}_2$	
2-394	H	2-Th	$(\text{CH}_2)_2\text{NMe}_2$	
2-395	H	2-Th	$(\text{CH}_2)_2\text{NMe}_2 \cdot \text{HCl}$	
2-396	H	2-Th	$(\text{CH}_2)_2\text{NPr}_2$	
2-397	H	2-Th	$(\text{CH}_2)_2\text{NiPr}_2$	
2-398	H	2-Th	$(\text{CH}_2)_2$ — 	
2-399	H	2-Th	$(\text{CH}_2)_2$ — 	
2-400	H	2-Th	$(\text{CH}_2)_2$ —  · HCl	
2-401	H	2-Th	$(\text{CH}_2)_2$ — 	
2-402	H	2-Th	$(\text{CH}_2)_3\text{NMe}_2$	

10

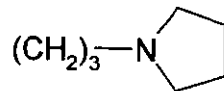
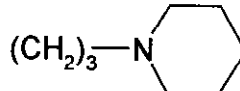
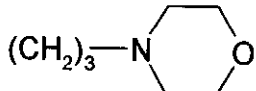
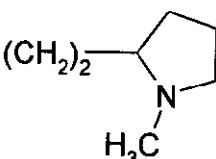
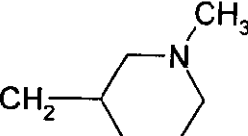
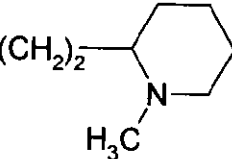
20

30

40

【表 7 7】

(表 2 続き)

実施例	Y	R ²	R ¹	m.p. [°C]
2-403	H	2-Th	(CH ₂) ₃ NMe ₂ ·HCl	
2-404	H	2-Th	(CH ₂) ₃ NEt ₂	
2-405	H	2-Th	(CH ₂) ₃ NEt ₂ ·HCl	
2-406	H	2-Th	(CH ₂) ₃ -N 	
2-407	H	2-Th	(CH ₂) ₃ -N 	
2-408	H	2-Th	(CH ₂) ₃ -N 	
2-409	H	2-Th	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ NMe ₂	
2-410	H	2-Th	CH(CH ₃)CH ₂ NMe ₂	
2-411	H	2-Th	CH ₂ CH(CH ₃)NMe ₂	
2-412	H	2-Th	CH ₂ CH(CH ₃)NMe ₂ ·HCl	
2-413	H	2-Th	(CH ₂) ₂ -N 	
2-414	H	2-Th	CH ₂ -N 	
2-415	H	2-Th	(CH ₂) ₂ -N 	
2-416	H	2-Th	(CH ₂) ₂ NHAc	
2-417	H	2-Th	(CH ₂) ₂ NHCOEt	
2-418	H	2-Th	(CH ₂) ₂ NHCOPr	
2-419	H	2-Th	(CH ₂) ₂ NHCOiPr	

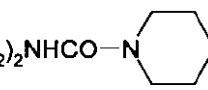
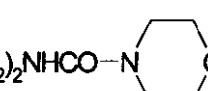
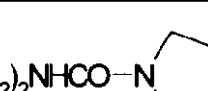
10

20

30

40

【表 7 8】
 (表 2 続き)

実施例	Y	R ²	R ¹	m.p. [°C]
2-420	H	2-Th	(CH ₂) ₂ NHCOBu	
2-421	H	2-Th	(CH ₂) ₂ NHCOTBu	
2-422	H	2-Th	(CH ₂) ₂ NHCOPh	
2-423	H	2-Th	(CH ₂) ₂ NHCOOMe	
2-424	H	2-Th	(CH ₂) ₂ NHCOOEt	
2-425	H	2-Th	(CH ₂) ₂ NHCOOPr	
2-426	H	2-Th	(CH ₂) ₂ NHCOOiPr	
2-427	H	2-Th	(CH ₂) ₂ NHCOOtBu	
2-428	7-CF ₃	2-Th	(CH ₂) ₂ NHCOOtBu	
2-429	H	2-Th	(CH ₂) ₂ NHCONHMe	
2-430	H	2-Th	(CH ₂) ₂ NHCONMe ₂	
2-431	H	2-Th	(CH ₂) ₂ NHCONHEt	
2-432	H	2-Th	(CH ₂) ₂ NHCONEt ₂	
2-433	H	2-Th	(CH ₂) ₂ NHCO-N 	
2-434	H	2-Th	(CH ₂) ₂ NHCO-N 	
2-435	H	2-Th	(CH ₂) ₂ NHCO-N 	
2-436	H	2-Th	(CH ₂) ₂ NMeCONMe ₂	
2-437	H	2-Th	(CH ₂) ₂ NMeCONEt ₂	
2-438	H	2-Th	(CH ₂) ₂ NHSO ₂ Me	
2-439	H	2-Th	(CH ₂) ₂ NMeSO ₂ Me	
2-440	H	2-Th	(CH ₂) ₂ NHSO ₂ Ph	
2-441	H	2-Th	(CH ₂) ₂ NMeSO ₂ Ph	
2-442	H	2-Th	(CH ₂) ₂ OH	
2-443	7-NO ₂	2-Th	(CH ₂) ₂ OH	
2-444	H	2-Th	(CH ₂) ₂ OAc	

10




20

30

40

【表 7 9】

(表 2 続き)

実施例	Y	R ²	R ¹	m.p. [°C]
2-445	H	2-Th	(CH ₂) ₂ OCOPr	
2-446	H	2-Th	(CH ₂) ₂ OCOiPr	
2-447	H	2-Th	(CH ₂) ₂ OCOBu	
2-448	H	2-Th	(CH ₂) ₂ OCOtBu	
2-449	H	2-Th	(CH ₂) ₂ OCOOMe	
2-450	H	2-Th	(CH ₂) ₂ OCOOEt	
2-451	H	2-Th	(CH ₂) ₂ OCOOPr	
2-452	H	2-Th	(CH ₂) ₂ OCOOiPr	
2-453	H	2-Th	(CH ₂) ₂ OCOOBu	
2-454	H	2-Th	(CH ₂) ₂ OCOOtBu	
2-455	H	2-Th	(CH ₂) ₂ OCONMe ₂	
2-456	H	2-Th	(CH ₂) ₂ OCONEt ₂	
2-457	H	2-Th	(CH ₂) ₂ OCO-N 	
2-458	H	2-Th	(CH ₂) ₂ OCO-N 	
2-459	H	2-Th	(CH ₂) ₂ OCO-N 	
2-460	H	2-Th	CH ₂ CH(OH)Me	
2-461	H	2-Th	CH ₂ CH(OH)CH ₂ OH	
2-462	H	2-Th	Et	
2-463	H	2-Th	Pr	
2-464	H	2-Th	iPr	
2-465	H	2-Th	Bu	
2-466	H	2-Th	iBu	
2-467	H	2-Th	sBu	
2-468	H	2-Th	tBu	
2-469	H	2-Th	CH ₂ CH ₂ F	

10

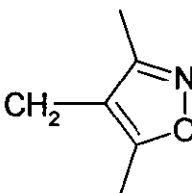
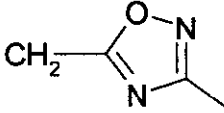
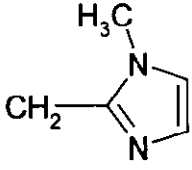
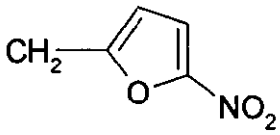
20

30

40

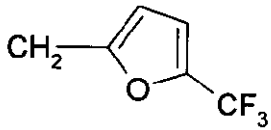
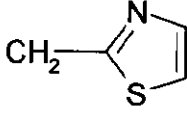
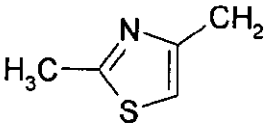
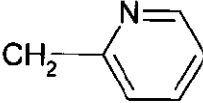
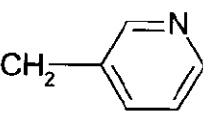
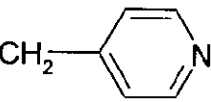
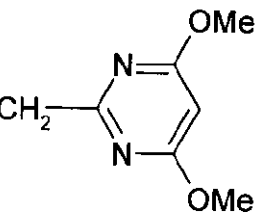
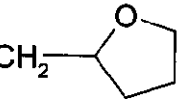
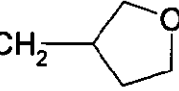
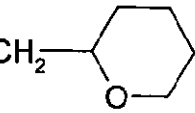
【 0 3 4 9 】

【表 80】
(表 2 続き)

実施例	Y	R ²	R ¹	m.p. [°C]
2-470	H	2-Th	CH ₂ CHF ₂	
2-471	H	2-Th	CH ₂ CF ₃	
2-472	H	2-Th	(CH ₂) ₂ CF ₃	
2-473	H	2-Th	CH ₂ -シクロプロピル	
2-474	H	2-Th	CH ₂ -シクロブチル	10
2-475	H	2-Th	CH ₂ -シクロペンチル	
2-476	H	2-Th	CH ₂ -シクロヘキシル	
2-477	H	2-Th	ベンジル	
2-478	H	2-Th	2-フルフリル	
2-479	H	2-Th	3-フルフリル	
2-480	H	2-Th	2-チエニルメチル	
2-481	H	2-Th	3-チエニルメチル	20
2-482	H	2-Th	2-(5-クロロチエニル)メチル	
2-483	H	2-Th		
2-484	H	2-Th		30
2-485	H	2-Th		
2-486	H	2-Th		40

【 0 3 5 0 】

【表 8 1】
 (表 2 続き)

実施例	Y	R ²	R ¹	m.p. [°C]
2-487	H	2-Th		
2-488	H	2-Th		
2-489	H	2-Th		
2-490	H	2-Th		
2-491	H	2-Th		
2-492	H	2-Th		
2-493	H	2-Th		
2-494	H	2-Th		
2-495	H	2-Th		
2-496	H	2-Th		

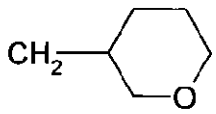
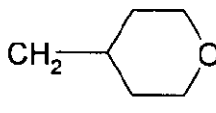
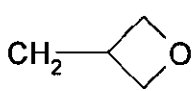
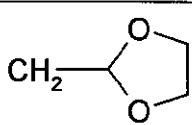
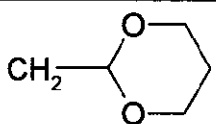
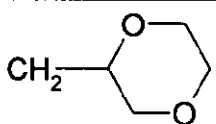
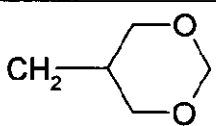
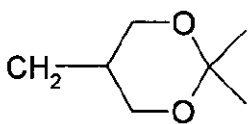
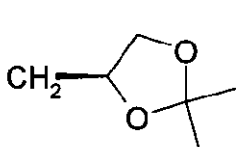
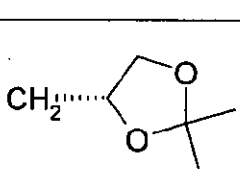
10

20

30

40

【表 8 2】
 (表 2 続き)

実施例	Y	R ²	R ¹	m.p. [°C]
2-497	H	2-Th		
2-498	H	2-Th		
2-499	H	2-Th		
2-500	H	2-Th		
2-501	H	2-Th		
2-502	H	2-Th		
2-503	H	2-Th		
2-504	H	2-Th		
2-505	H	2-Th		
2-506	H	2-Th		

10

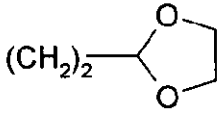
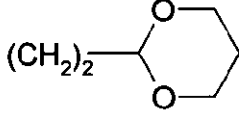
20

30

40

【 0 3 5 2 】

【表 8 3】
(表 2 続き)

実施例	Y	R ²	R ¹	m.p. [°C]
2-507	H	2-Th		
2-508	H	2-Th		
2-509	5-Me	2-Th	H	
2-510	6-Me	2-Th	H	
2-511	7-Me	2-Th	H	
2-512	8-Me	2-Th	H	
2-513	5-Cl	2-Th	H	
2-514	6-Cl	2-Th	H	
2-515	7-Cl	2-Th	H	
2-516	8-Cl	2-Th	H	
2-517	5-F	2-Th	H	
2-518	6-F	2-Th	H	
2-519	7-F	2-Th	H	
2-520	H	p-トリル	H	
2-521	H	m-トリル	H	
2-522	H	o-トリル	H	
2-523	H	4-tBu	H	
2-524	H	4-C ₆ H ₄ Cl	H	
2-525	H	3-C ₆ H ₄ Cl	H	
2-526	H	2-C ₆ H ₄ Cl	H	
2-527	H	4-C ₆ H ₄ F	H	
2-528	H	3-C ₆ H ₄ F	H	
2-529	H	2-C ₆ H ₄ F	H	
2-530	H	4-C ₆ H ₄ OMe	H	
2-531	H	3-C ₆ H ₄ OMe	H	
2-532	H	2-C ₆ H ₄ OMe	H	
2-533	H	4-C ₆ H ₄ CF ₃	H	

10

20

30

40

【表 8 4】
(表 2 続き)

実施例	Y	R ²	R ¹	m.p. [°C]
2-534	H	3-C ₆ H ₄ CF ₃	H	
2-535	H	2-C ₆ H ₄ CF ₃	H	
2-536	H	2,3-C ₆ H ₃ Me ₂	H	
2-537	H	2,4-C ₆ H ₃ Me ₂	H	
2-538	H	2,5-C ₆ H ₃ Me ₂	H	
2-539	H	2,6-C ₆ H ₃ Me ₂	H	
2-540	H	3,4-C ₆ H ₃ Me ₂	H	
2-541	H	3,5-C ₆ H ₃ Me ₂	H	
2-542	H	2,3-C ₆ H ₃ Cl ₂	H	
2-543	H	2,4-C ₆ H ₃ Cl ₂	H	
2-544	H	2,5-C ₆ H ₃ Cl ₂	H	
2-545	H	2,6-C ₆ H ₃ Cl ₂	H	
2-546	H	3,4-C ₆ H ₃ Cl ₂	H	
2-547	H	3,5-C ₆ H ₃ Cl ₂	H	
2-548	H	2,4,6-C ₆ H ₂ Me ₃	H	
2-549	H	3,4-C ₆ H ₃ (OMe) ₂	H	
2-550	6,7-(CF ₃) ₂	p-トリル	H	
2-551	5,7-(CF ₃) ₂	m-トリル	H	
2-552	5,6-(CF ₃) ₂	o-トリル	H	
2-553	7,8-(CF ₃) ₂	4-tBu	H	
2-554	6,8-(CF ₃) ₂	4-C ₆ H ₄ Cl	H	
2-555	5,8-(CF ₃) ₂	3-C ₆ H ₄ Cl	H	

10

20

30

【 0 3 5 4 】

3. 生物学的实施例

3.1 損傷の得点評価

植物に対する損傷は対照植物と比較した 0 ~ 100 % の基準で目視的に評価した。

0% = 無処理植物と比較してそれと分かる影響は無い。

100% = 処理した植物は枯死した。

40

【 0 3 5 5 】

3.2 発芽後処理における除草剤の影響及び薬害軽減剤の効果

単子葉及び双子葉の有害植物及び作物植物の種子又は根茎小片を、プラスチック製ポットの砂状ローム土壤中に静置し、表土をかけそして良好な生育条件下の温室中で生育させた。一方、水稻栽培において遭遇する有害植物をポット中で水位を土壌表面上 2 cm までにして栽培した。蒔種 3 週間後に、試験植物の第三葉期に処理をした。乳剤として製剤した本発明に係る除草剤/薬害軽減剤の活性化化合物の混合物、そして並行試験においては対応して製剤した個々の活性化化合物を、ヘクタール当たり水 300 l/ha (換算) の施用量の種々の処理量で植物の緑色部に噴霧した。最適生育条件下の温室中に 2 ~ 3 週間静置し

50

た後、標品の効果が無処理対照と目視により比較して評価した。稲又は水稲栽培において遭遇する有害植物の場合は、活性化合物は灌漑水中に直接に添加するか（粒剤処理に類似した処理）又は植物の上に及び灌漑水中に噴霧した。

【 0 3 5 6 】

当該試験により、本発明に係る薬害軽減剤、例えば表 1 の化合物で実施例番号 5, 10, 15, 17, 29, 30, 45, 48, 65, 79, 81, 94, 97, 100, 114, 115, 121, 127, 128, 129, 131, 144, 151, 156, 158, 162, 163, 171, 172, 173, 174, 181, 191, 250, 273, 331, 334, 343, 351, 372, 374, 395, 405, 408, 412, 415, 416, 421, 431, 432, 434, 435, 436, 460, 465, 466, 478, 481, 482, 483, 486, 487, 501, 507, 513, 526, 530, 536, 539, 543, 546, 546a, 547, 548, 549, 560, 561, 562, 569, 570, 575a, 578, 579, 581a, 588, 595, 612, 638, 659, 687, 688, 689, 708, 813, 814, 815, 829, 835, 837, 847, 848, 855, 856, 857, 858, 861, 862, 876, 877, 883, 892, 893a, 904, 908, 909, 913, 921, 928, 932, 933, 943, 947, 948, 949, 969, 987, 988, 989, 999, 1000, 1001, 1010, 1011, 1014, 1027, 1028, 1033, 1034, 1035, 1036, 1039, 1040, 1041, 1042, 1049, 1050, 1051, 1052, 1053, 1054, 1055, 1061, 1063, 1073, 1075, 1081, 1082, 1083, 1084, 1087, 1088, 1102, 1103, 1104, 1105, 1106, 1108, 1110, 1111, 1112, 1113, 1114, 1115, 1119, 1120, 1126, 1129, 1130, 1131, 1134, 1137, 1138, 1139, 1140, 1141, 1145, 1146, 1148, 1150, 1151, 1152, 1153, 1165, 1175, 1179, 1196, 1197, 1199, 1207, 1208, 1209, 1210, 1218, 1221, 1229, 1233, 1234, 1238, 1243, 1244, 1245, 1250, 1251, 1252, 1259, 1261, 1262, 1268, 1269, 1272, 1275, 1276, 1277, 1278, 1279, 1280, 1283, 1284, 1287, 1288, 1289, 1294, 1295, 1296, 1297, 1298, 1299, 1300, 1301, 1303, 1304, 1305, 1306, 1307, 1308, 1309, 1310, 1311, 1312, 1314, 1315, 1316, 1317, 1318, 1319, 1320, 1321, 1322, 1323, 1324, 1325, 1327, 1328, 1330, 1331, 1332, 1335, 1336, 1342, 1344, 1345, 1346, 1347, 1353, 1355, 1356, 1357, 1358, 1359, 1360, 1361, 1362, 1363, 1364, 1365, 1366, 1367, 1368, 1369, 1370, 1371, 1372, 1373, 1375, 1376, 1377, 1378, 1379, 1380, 1381, 1382, 1383, 1384, 1398, 1400, 1401, 1406, 1409, 1414, 1410, 1411, 1415, 1419, 2-1 及び 2-2 の化合物は、除草剤との混合において、例えば H P P D 阻害剤系の除草剤（例えば、2-アロイルシクロヘキサジオン系に属する 2-[[5,8-ジメチル-1,1-ジオキソド-4-(ピラジン-2-イルオキシ)-3,4-ジヒドロ-2H-チオクロメン-6-イル]カルボニル]シクロヘキサン-1,3-ジオンのような化合物）は、除草剤：薬害軽減剤の比率が 2：1 から 1：20 において、トウモロコシ、稲、小麦、大麦又はその他の穀類に対する除草剤の損傷を薬害軽減剤なしで個々の除草剤を使用したときと比較して有意差を以って、即ち、作物植物に対する損傷を 30 から 100%まで減少することができた。同時に、経済的に重要な植物に対する除草剤の活性に対しては全く有意差のある悪い影響はなかった。それ故イネ科雑草及び広葉雑草の広いスペクトルに対して優れた発生後除草作用を達成することが可能である。

【 国際調査報告 】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No

PCT/EP2005/004445

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER IPC 7 A01N25/32 C07D241/50 C07D241/52		
According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC		
B. FIELDS SEARCHED		
Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) IPC 7 A01N C07D		
Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched		
Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used) EPO-Internal, CHEM ABS Data, WPI Data, PAJ		
C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	EP 0 216 299 A (BASF AKTIENGESELLSCHAFT) 1 April 1987 (1987-04-01) page 1, lines 7-14 page 2, line 1 - page 3, line 32 examples 1-117 claims 1-10	1-15
A	EP 0 663 397 A (HOECHST SCHERING AGREVO GMBH) 19 July 1995 (1995-07-19) page 1, line 21 - page 9, line 25 page 25; table 5	1-15
A	EP 0 144 001 A (HOECHST AKTIENGESELLSCHAFT) 12 June 1985 (1985-06-12) page 1, line 1 - page 2, line 22 pages 11,12; examples 13,14; table 1	1-15
-/--		
<input checked="" type="checkbox"/> Further documents are listed in the continuation of box C.		<input checked="" type="checkbox"/> Patent family members are listed in annex.
<p>* Special categories of cited documents:</p> <p>*A* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance</p> <p>*E* earlier document but published on or after the international filing date</p> <p>*L* document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)</p> <p>*O* document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means</p> <p>*P* document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed</p>		<p>*T* later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention</p> <p>*X* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone</p> <p>*Y* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.</p> <p>*G* document member of the same patent family</p>
Date of the actual completion of the international search 5 August 2005		Date of mailing of the international search report 22/08/2005
Name and mailing address of the ISA European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl, Fax: (+31-70) 340-3016		Authorized officer Marie, G

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

 International Application No
 PCT/EP2005/004445

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	DATABASE CA 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; FERFRA, S. ET AL: "Synthesis of quinoxalin-2-ones linked to pyrazolines and pyrazoles" XP002339370 retrieved from STN Database accession no. 2004:813034 RN 848143-38-4, 39-5, 41-9, 42-0 abstract & INDIAN JOURNAL OF CHEMISTRY, SECTION B: ORGANIC CHEMISTRY INCLUDING MEDICINAL CHEMISTRY, 43B(5), 947-951 CODEN: IJSBDB; ISSN: 0376-4699, 2004, -----	6
X	DATABASE CA 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; FERFRA, SOUAD ET AL: "Synthesis of new quinoxalines bonded to different azoles" XP002339371 retrieved from STN Database accession no. 2004:770114 RN 852805-14-2, 17-5 abstract & JOURNAL MAROCAIN DE CHIMIE HETEROCYCLIQUE, 1(1), 12-21 CODEN: JMCHCE, 2002, -----	6
X	DATABASE CA 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; TAGUCHI, KAZUHIRO ET AL: "Preparation of quinoxalines as fluorescent labeling reagents" XP002339372 retrieved from STN Database accession no. 2004:758826 RN 757230-35-6, 36-7, 38-9 abstract & JP 2004 256488 A2 (NATIONAL INSTITUTE OF ADVANCED INDUSTRIAL SCIENCE AND TECHNOLOGY, JAPA) 16 September 2004 (2004-09-16) ----- -/--	6

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No
PCT/EP2005/004445

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	<p>DATABASE CA 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; NILSSON, BJOERN ET AL: "Preparation of piperaziny1-2(1H)-pyrazinones for treatment of 5-HT2A receptor-related disorders" XP002339373 retrieved from STN Database accession no. 2004:80683 RN 651047-39-1, 40-4, 43-7 abstract & WO 2004/009586 A1 (BIOVITRUM AB, SWED.) 29 January 2004 (2004-01-29)</p>	6
X	<p>DATABASE CA 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; HAMID, HAMIDA MOHAMED ABDEL: "A novel synthesis of acyclonucleosides via allylation of 3-'1-(phenylhydrazono)-L-threo-2,3,4-trihy droxybut-1-yl!quinoxalin- 2(1H)one" XP002339374 retrieved from STN Database accession no. 2003:827264 RN 641629-41-6, 46-1, 40-5, 44-9, 45-0, 47-2 abstract & CARBOHYDRATE RESEARCH , 338(22), 2301-2309 CODEN: CRBRAT; ISSN: 0008-6215, 2003,</p>	6
X	<p>DATABASE CA 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; HAYAMA, TAKASHI ET AL: "Preparation of pyrazinone derivatives as Cdk4 and Cdk6 inhibiting anticancer agents" XP002339375 retrieved from STN Database accession no. 2002:31439 RN 388612-93-9, 65-5, 69-9, 70-2, 71-3, 72-4, 73-5, 74-6, 75-7, 77-9, 78-0, 79-1, 80-4, 81-5, 86-0, 67-1, 89-3, 90-6 abstract & WO 02/02550 A1 (BANYU PHARMACEUTICAL CO., LTD., JAPAN) 10 January 2002 (2002-01-10)</p>	6

-/--

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No
PCT/EP2005/004445

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	<p>DATABASE CA 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; LAWRENCE, DAVID S. ET AL: "Structure-activity studies of substituted quinoxalinones as multiple-drug-resistance antagonists" XP002339376 retrieved from STN Database accession no. 2000:897082 RN 240486-39-9, 40-2, 328250-13-1 abstract & JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY , 44(4), 594-601 CODEN: JMCMAR; ISSN: 0022-2623, 2001,</p>	6
X	<p>DATABASE CA 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; MASLIVETS, A. N. ET AL: "A second type of stabilization of alkoxycarbonyl(imidoyl)ketenes" XP002339377 retrieved from STN Database accession no. 2000:742890 RN 313343-97-4 abstract & CHEMISTRY OF HETEROCYCLIC COMPOUNDS (NEW YORK)(TRANSLATION OF KHIMIYA GETEROTSIKLICHESKIKH SOEDINENII) , 36(5), 615-616 CODEN: CHCCAL; ISSN: 0009-3122, 2000,</p>	6
X	<p>DATABASE CA 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; DRUSHLYAK, A. G. ET AL: "Inclined alignment of nematic liquid crystals by dopants having bent molecules" XP002339378 retrieved from STN Database accession no. 1999:661519 RN 251948-42-2, 43-3 abstract & MOLECULAR CRYSTALS AND LIQUID CRYSTALS SCIENCE AND TECHNOLOGY, SECTION A: MOLECULAR CRYSTALS AND LIQUID CRYSTALS , 329, 1137-1143 CODEN: MCLCE9; ISSN: 1058-725X, 1999,</p>	6

-/--

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

 International Application No
 PCT/EP2005/004445

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	DATABASE CA 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; SMITH, CHARLES: "P-glycoprotein and MRP inhibitors for chemosensitizing multidrug resistant tumor cells" XP002339379 retrieved from STN Database accession no. 1999:565911 RN 240486-39-9, 40-2 abstract & WO 99/43323 A1 (FOX CHASE CANCER CENTER, USA) 2 September 1999 (1999-09-02)	6
X	DATABASE CA 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; MATUSZCZAK, BARBARA ET AL: "Syntheses in the series of pyrazolyl-substituted quinoxalines" XP002339380 retrieved from STN Database accession no. 1998:191690 RN 204654-29-5, 31-9 abstract & HETEROCYCLES, 45(12), 2449-2462 CODEN: HTCYAM; ISSN: 0385-5414, 1997,	6
X	DATABASE CA 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; FENG, JUN ET AL: "Photodimerization of 1-methyl-2-oxoquinoxaline" XP002339381 retrieved from STN Database accession no. 1995:344948 RN 161558-94-7 abstract & CHINESE SCIENCE BULLETIN, 39(5), 402-6 CODEN: CSBUEF; ISSN: 1001-6538, 1994,	6
X	DATABASE CA 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; RASHED, NAGWA ET AL: "Pyrazolylquinoxaline derivatives from 3-'1-(phenylhydrazono)-L-threo-2,3,4- trihydroxybutyl-1H-quinoxalin-2-one." XP002339382 retrieved from STN Database accession no. 1995:178303 RN 160383-61-9, 62-0 abstract -/--	6

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

 International Application No
 PCT/EP2005/004445

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	& ALEXANDRIA JOURNAL OF PHARMACEUTICAL SCIENCES , 7(1), 47-9 CODEN: AJPSES; ISSN: 1110-1792, 1993, ----- DATABASE CA 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; RASHED, NAGWA ET AL: "Synthesis of organofluorine compounds utilizing 3-(1-(3-fluorophenylhydrazono)-D-erythro-2,3,4-trihydroxybutyl)quinoxalin-2(1H)-one as precursor" XP002339383 retrieved from STN Database accession no. 1993:560232 RN 150016-55-0 abstract & HETEROCYCLES , 36(5), 961-9 CODEN: HTCYAM; ISSN: 0385-5414, 1993, -----	6
X	DATABASE CA 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; AWAD, LAILA F. ET AL: "Methylation of 3-(1-arylhydrazono-L-threo-2,3,4-trihydroxybutyl)-6,7-dimethyl-1H-quinoxalin-2-ones" XP002339384 retrieved from STN Database accession no. 1991:607954 RN 136771-30-7, 29-4, 31-8, 32-9, 33-0, 34-1 abstract & ALEXANDRIA JOURNAL OF PHARMACEUTICAL SCIENCES , 5(1), 14-16 CODEN: AJPSES; ISSN: 1110-1792, 1991, -----	6
X	DATABASE CA 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; BERNAUER, KARL ET AL: "Preparation of 3,5-disubstituted pyrocatechol derivatives as catechol-O-methyltransferase inhibitors" XP002339385 retrieved from STN Database accession no. 1991:449134 RN 134610-58-5, 59-6, 68-7, 134611-14-6 abstract & AU 603 788 B2 (HOFFMANN-LA ROCHE, F., UND CO. A.-G., SWITZ.) 29 November 1990 (1990-11-29) ----- -/--	6

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No
PCT/EP2005/004445

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	<p>DATABASE CA 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; AWAD, IBRAHIM M. A. ET AL: "Studies in the Vilsmeier-Haack reaction. Application to quinoxalinones" XP002339386 retrieved from STN Database accession no. 1991:207196 RN 133528-76-4, 77-5, 78-6 abstract & COLLECTION OF CZECHOSLOVAK CHEMICAL COMMUNICATIONS , 55(11), 2715-21 CODEN: CCCCAK; ISSN: 0010-0765, 1990,</p>	6
X	<p>DATABASE CA 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; AWAD, IBRAHIM M. A.: "Studies on the Vilsmeier-Haack reaction. Part VIII. Application to quinoxaline-2-thiones and their antibacterial activities" XP002339387 retrieved from STN Database accession no. 1991:122284 RN 132599-09-8, 10-1, 11-2 abstract & INDIAN JOURNAL OF CHEMISTRY, SECTION B: ORGANIC CHEMISTRY INCLUDING MEDICINAL CHEMISTRY , 30B(1), 89-92 CODEN: IJSBDB; ISSN: 0376-4699, 1991,</p>	6
X	<p>DATABASE CA 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; EL ASHRY, EL SAYED H. ET AL: "Heterocycles from carbohydrate precursors. Part 44. A novel synthesis of pyridazinones. Preparation of 3-'1-aryl-6(1H)-pyridazinon-3-yl!-2(1H)- quinoxalinones" XP002339388 retrieved from STN Database accession no. 1988:112397 RN 113314-11-7 abstract & HETEROCYCLES , 26(8), 2101-8 CODEN: HTCYAM; ISSN: 0385-5414, 1987,</p> <p style="text-align: center;">-/--</p>	6

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No
PCT/EP2005/004445

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	<p>DATABASE CA 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; EL ASHRY, EL SAYED H. ET AL: "Heterocycles from carbohydrate precursors. XXXIII. The scope of the reactions of hydrazines and hydrazones: dehydrative cyclizations of some nitrogen derivatives of dehydro-L-ascorbic acid" XP002339389 retrieved from STN Database accession no. 1987:534285 RN 110383-76-1 abstract & GAZZETTA CHIMICA ITALIANA , 116(12), 721-4 CODEN: GCITA9; ISSN: 0016-5603, 1986,</p> <p style="text-align: center;">-----</p>	6
X	<p>DATABASE CA 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; EL ASHRY, EL SAYED H. ET AL: "Heterocycles from carbohydrate precursors. Part 28. Synthesis of p-fluorophenylflavazoles from dehydro-D-isoascorbic acid" XP002339390 retrieved from STN Database accession no. 1987:18973 RN 105291-55-2 abstract & CARBOHYDRATE RESEARCH , 152, 339-42 CODEN: CRBRAT; ISSN: 0008-6215, 1986,</p> <p style="text-align: center;">-----</p>	6
X	<p>DATABASE CA 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; LUMMA, WILLIAM C., JR. ET AL: "Piperazinylquinoxalines with central serotoninmimetic activity" XP002339391 retrieved from STN Database accession no. 1981:30709 RN 55686-67-4, 76052-75-0 abstract & JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY , 24(1), 93-101 CODEN: JMCMAR; ISSN: 0022-2623, 1981,</p> <p style="text-align: center;">-----</p> <p style="text-align: center;">-/--</p>	6

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No
PCT/EP2005/004445

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	<p>DATABASE CA 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; EL ASHRY, EL SAYED H. ET AL: "Heterocycles from carbohydrate precursors. Part VIII. Reactions of 3-(1-arylhydrazono-L-threo-2,3,4-trihydrox- ybutyl)-1-methyl-2- quinoxalinones" XP002339392 retrieved from STN Database accession no. 1978:563856 RN 67912-33-8, 34-9, 35-0, 36-1 abstract & CARBOHYDRATE RESEARCH , 64, 81-8 CODEN: CRBRAT; ISSN: 0008-6215, 1978,</p>	6
X	<p>DATABASE CA 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; SETH, M. ET AL: "Antiamoebic agents. Syntheses of substituted indophenazines, aza-indophenazines, and azaquinoxalines" XP002339393 retrieved from STN Database accession no. 1974:477871 RN 53493-73-5, 53493-74-6 abstract & INDIAN JOURNAL OF CHEMISTRY , 12(2), 124-8 CODEN: IJOCAP; ISSN: 0019-5103, 1974,</p>	6
X	<p>DATABASE CA 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; COOK, A. H. ET AL: "Quinoxaline cyanines. III" XP002339394 retrieved from STN Database accession no. 1944:2172 RN 855873-79-9 abstract & JOURNAL OF THE CHEMICAL SOCIETY, ABSTRACTS 397-401 CODEN: JCSAAZ; ISSN: 0590-9791, 1943,</p>	6

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP2005/004445

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
EP 0216299	A	01-04-1987	DE 3533791 A1 EP 0216299 A1 ES 2003353 A6 JP 62072678 A	26-03-1987 01-04-1987 01-11-1988 03-04-1987
EP 0663397	A	19-07-1995	DE 4344074 A1 CA 2138924 A1 EP 0663397 A2 JP 7330739 A	29-06-1995 24-06-1995 19-07-1995 19-12-1995
EP 0144001	A	12-06-1985	DE 3340771 A1 AT 26975 T AU 572224 B2 AU 3529084 A BR 8405722 A CA 1242722 A1 DE 3463501 D1 EP 0144001 A1 ES 8600283 A1 GR 80899 A1 HU 36681 A2 IL 73468 A JP 60116662 A ZA 8408758 A	23-05-1985 15-05-1987 05-05-1988 16-05-1985 17-09-1985 04-10-1988 11-06-1987 12-06-1985 01-01-1986 26-02-1985 28-10-1985 30-06-1988 24-06-1985 26-06-1985
JP 2004256488	A2	16-09-2004	JP 2004256488 A	16-09-2004
WO 2004009586	A1	29-01-2004	AU 2003243101 A1 BR 0312789 A CA 2492924 A1 EP 1534391 A1 US 2004063693 A1	09-02-2004 03-05-2005 29-01-2004 01-06-2005 01-04-2004
WO 0202550	A1	10-01-2002	AT 276257 T AU 6785201 A CA 2413002 A1 DE 60105610 D1 DE 60105610 T2 EP 1295878 A1 ES 2223884 T3 US 2003203907 A1	15-10-2004 14-01-2002 19-12-2002 21-10-2004 27-01-2005 26-03-2003 01-03-2005 30-10-2003
WO 9943323	A1	02-09-1999	US 6248752 B1	19-06-2001
AU 603788	B2	29-11-1990	AR 245097 A1 AT 90072 T AU 6976487 A CA 1302418 C CS 9104022 A3 DE 3786026 D1 DK 82087 A EP 0237929 A1 ES 2056792 T3 FI 871041 A ,B, HK 165896 A HU 43804 A2 IE 61316 B1 IL 81791 A	30-12-1993 15-06-1993 17-09-1987 02-06-1992 16-12-1992 08-07-1993 12-09-1987 23-09-1987 16-10-1994 12-09-1987 13-09-1996 28-12-1987 02-11-1994 01-12-1992

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP2005/004445

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
AU 603788	B2	JP 2006568 C	11-01-1996
		JP 7042254 B	10-05-1995
		JP 62240649 A	21-10-1987
		KR 9301054 B1	13-02-1993
		KR 9301337 B1	26-02-1993
		LU 90219 A9	28-05-1998
		LV 5742 A4	20-10-1996
		MC 1807 A	22-12-1987
		NL 970041 I1	02-02-1998
		NO 870984 A ,B,	14-09-1987
		NZ 219496 A	21-12-1990
		PT 84449 A ,B	01-04-1987
		US 5389653 A	14-02-1995
		US 5476875 A	19-12-1995
		US 5633371 A	27-05-1997
		US 5236952 A	17-08-1993
		US 5705703 A	06-01-1998
		ZA 8701564 A	28-10-1987
		MX 9203634 A1	01-07-1992

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2005/004445

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES		
IPK 7	A01N25/32	C07D241/50 C07D241/52
Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK		
B. RECHERCHIERTE GEBIETE		
Recherchiertes Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)		
IPK 7 A01N C07D		
Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen		
Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)		
EPO-Internal, CHEM ABS Data, WPI Data, PAJ		
C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
A	EP 0 216 299 A (BASF AKTIENGESELLSCHAFT) 1. April 1987 (1987-04-01) Seite 1, Zeilen 7-14 Seite 2, Zeile 1 - Seite 3, Zeile 32 Beispiele 1-117 Ansprüche 1-10	1-15
A	EP 0 663 397 A (HOECHST SCHERING AGREVO GMBH) 19. Juli 1995 (1995-07-19) Seite 1, Zeile 21 - Seite 9, Zeile 25 Seite 25; Tabelle 5	1-15
A	EP 0 144 001 A (HOECHST AKTIENGESELLSCHAFT) 12. Juni 1985 (1985-06-12) Seite 1, Zeile 1 - Seite 2, Zeile 22 Seiten 11,12; Beispiele 13,14; Tabelle 1	1-15
-/--		
<input checked="" type="checkbox"/>	Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen	<input checked="" type="checkbox"/> Siehe Anhang Patentfamilie
* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :		
A Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist		
E älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist		
L Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)		
O Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht		
P Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist		
**T* Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist		
X Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden		
Y Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist		
Z Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist		
Datum des Abschlusses der internationalen Recherche		Absenddatum des internationalen Recherchenberichts
5. August 2005		22/08/2005
Name und Postanschrift der internationalen Recherchenbehörde Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl. Fax: (+31-70) 340-3016		Bevollmächtigter Bediensteter Marie, G

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2005/004445

C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	<p>DATABASE CA 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; FERFRA, S. ET AL: "Synthesis of quinoxalin-2-ones linked to pyrazolines and pyrazoles" XP002339370 gefunden im STN Database accession no. 2004:813034 RN 848143-38-4, 39-5, 41-9, 42-0 Zusammenfassung & INDIAN JOURNAL OF CHEMISTRY, SECTION B: ORGANIC CHEMISTRY INCLUDING MEDICINAL CHEMISTRY, 43B(5), 947-951 CODEN: IJSBDB; ISSN: 0376-4699, 2004,</p>	6
X	<p>DATABASE CA 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; FERFRA, SOUAD ET AL: "Synthesis of new quinoxalines bonded to different azoles" XP002339371 gefunden im STN Database accession no. 2004:770114 RN 852805-14-2, 17-5 Zusammenfassung & JOURNAL MAROCAIN DE CHIMIE HETEROCYCLIQUE, 1(1), 12-21 CODEN: JMCHCE, 2002,</p>	6
X	<p>DATABASE CA 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; TAGUCHI, KAZUHIRO ET AL: "Preparation of quinoxalines as fluorescent labeling reagents" XP002339372 gefunden im STN Database accession no. 2004:758826 RN 757230-35-6, 36-7, 38-9 Zusammenfassung & JP 2004 256488 A2 (NATIONAL INSTITUTE OF ADVANCED INDUSTRIAL SCIENCE AND TECHNOLOGY, JAPA) 16. September 2004 (2004-09-16)</p>	6

-/--

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2005/004445

C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Beiz. Anspruch Nr.
X	<p>DATABASE CA 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; NILSSON, BJOERN ET AL: "Preparation of piperaziny1-2(1H)-pyrazinones for treatment of 5-HT2A receptor-related disorders" XP002339373 gefunden im STN Database accession no. 2004:80683 RN 651047-39-1, 40-4, 43-7 Zusammenfassung & WO 2004/009586 A1 (BIOVITRUM AB, SWED.) 29. Januar 2004 (2004-01-29)</p>	6
X	<p>DATABASE CA 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; HAMID, HAMIDA MOHAMED ABDEL: "A novel synthesis of acyclonucleosides via allylation of 3-'1-(phenylhydrazono)-L-threo-2,3,4-trihy droxybut-1-yl!quinoxalin- 2(1H)one" XP002339374 gefunden im STN Database accession no. 2003:827264 RN 641629-41-6, 46-1, 40-5, 44-9, 45-0, 47-2 Zusammenfassung & CARBOHYDRATE RESEARCH , 338(22), 2301-2309 CODEN: CRBRAT; ISSN: 0008-6215, 2003,</p>	6
X	<p>DATABASE CA 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; HAYAMA, TAKASHI ET AL: "Preparation of pyrazinone derivatives as Cdk4 and Cdk6 inhibiting anticancer agents" XP002339375 gefunden im STN Database accession no. 2002:31439 RN 388612-93-9, 65-5, 69-9, 70-2, 71-3, 72-4, 73-5, 74-6, 75-7, 77-9, 78-0, 79-1, 80-4, 81-5, 86-0, 67-1, 89-3, 90-6 Zusammenfassung & WO 02/02550 A1 (BANYU PHARMACEUTICAL CO., LTD., JAPAN) 10. Januar 2002 (2002-01-10)</p>	6

-/--

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2005/004445

C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	<p>DATABASE CA 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; LAWRENCE, DAVID S. ET AL: "Structure-activity studies of substituted quinoxalinones as multiple-drug-resistance antagonists" XP002339376 gefunden im STN Database accession no. 2000:897082 RN 240486-39-9, 40-2, 328250-13-1 Zusammenfassung & JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY, 44(4), 594-601 CODEN: JMCMAR; ISSN: 0022-2623, 2001,</p>	6
X	<p>DATABASE CA 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; MASLIVETS, A. N. ET AL: "A second type of stabilization of alkoxy-carbonyl(imido)ketenes" XP002339377 gefunden im STN Database accession no. 2000:742890 RN 313343-97-4 Zusammenfassung & CHEMISTRY OF HETEROCYCLIC COMPOUNDS (NEW YORK)(TRANSLATION OF KHIMIYA GETEROTSIKLICHESKIKH SOEDINENII), 36(5), 615-616 CODEN: CHCCAL; ISSN: 0009-3122, 2000,</p>	6
X	<p>DATABASE CA 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; DRUSHLYAK, A. G. ET AL: "Inclined alignment of nematic liquid crystals by dopants having bent molecules" XP002339378 gefunden im STN Database accession no. 1999:661519 RN 251948-42-2, 43-3 Zusammenfassung & MOLECULAR CRYSTALS AND LIQUID CRYSTALS SCIENCE AND TECHNOLOGY, SECTION A: MOLECULAR CRYSTALS AND LIQUID CRYSTALS, 329, 1137-1143 CODEN: MCLCE9; ISSN: 1058-725X, 1999,</p>	6

-/--

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2005/004445

C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	<p>DATABASE CA 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; SMITH, CHARLES: "P-glycoprotein and MRP inhibitors for chemosensitizing multidrug resistant tumor cells" XP002339379 gefunden im STN Database accession no. 1999:565911 RN 240486-39-9, 40-2 Zusammenfassung & WO 99/43323 A1 (FOX CHASE CANCER CENTER, USA) 2. September 1999 (1999-09-02)</p>	6
X	<p>DATABASE CA 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; MATUSZCZAK, BARBARA ET AL: "Syntheses in the series of pyrazolyl-substituted quinoxalines" XP002339380 gefunden im STN Database accession no. 1998:191690 RN 204654-29-5, 31-9 Zusammenfassung & HETEROCYCLES, 45(12), 2449-2462 CODEN: HTCYAM; ISSN: 0385-5414, 1997,</p>	6
X	<p>DATABASE CA 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; FENG, JUN ET AL: "Photodimerization of 1-methyl-2-oxoquinoxaline" XP002339381 gefunden im STN Database accession no. 1995:344948 RN 161558-94-7 Zusammenfassung & CHINESE SCIENCE BULLETIN, 39(5), 402-6 CODEN: CSBUEF; ISSN: 1001-6538, 1994,</p>	6
X	<p>DATABASE CA 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; RASHED, NAGWA ET AL: "Pyrazolylquinoxaline derivatives from 3-¹-(phenylhydrazono)-L-threo-2,3,4- trihydroxybutyl]-1H-quinoxalin-2-one." XP002339382 gefunden im STN Database accession no. 1995:178303 RN 160383-61-9, 62-0 Zusammenfassung</p> <p style="text-align: center;">-/--</p>	6

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2005/004445

C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	<p>& ALEXANDRIA JOURNAL OF PHARMACEUTICAL SCIENCES , 7(1), 47-9 CODEN: AJPSES; ISSN: 1110-1792, 1993,</p> <p>-----</p> <p>DATABASE CA 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; RASHED, NAGWA ET AL: "Synthesis of organofluorine compounds utilizing 3-'1-(3-fluorophenylhydrazono)-D-erythro-2,3,4-trihydroxybutyl!quinoxalin-2(1H)- one as precursor" XP002339383 gefunden im STN Database accession no. 1993:560232 RN 150016-55-0 Zusammenfassung & HETEROCYCLES , 36(5), 961-9 CODEN: HTCYAM; ISSN: 0385-5414, 1993,</p> <p>-----</p>	6
X	<p>DATABASE CA 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; AWAD, LAILA F. ET AL: "Methylation of 3-(1-arylhydrazono-L-threo-2,3,4-trihydroxybutyl)-6,7-dimethyl-1H-quinoxalin-2-ones" XP002339384 gefunden im STN Database accession no. 1991:607954 RN 136771-30-7, 29-4, 31-8, 32-9, 33-0, 34-1 Zusammenfassung & ALEXANDRIA JOURNAL OF PHARMACEUTICAL SCIENCES , 5(1), 14-16 CODEN: AJPSES; ISSN: 1110-1792, 1991,</p> <p>-----</p>	6
X	<p>DATABASE CA 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; BERNAUER, KARL ET AL: "Preparation of 3,5-disubstituted pyrocatechol derivatives as catechol-O-methyltransferase inhibitors" XP002339385 gefunden im STN Database accession no. 1991:449134 RN 134610-58-5, 59-6, 68-7, 134611-14-6 Zusammenfassung & AU 603 788 B2 (HOFFMANN-LA ROCHE, F., UND CO. A.-G., SWITZ.) 29. November 1990 (1990-11-29)</p> <p>-----</p> <p style="text-align: center;">-/--</p>	6

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2005/004445

C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	<p>DATABASE CA 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; AWAD, IBRAHIM M. A. ET AL: "Studies in the Vilsmeier-Haack reaction. Application to quinoxalinones" XP002339386 gefunden im STN Database accession no. 1991:207196 RN 133528-76-4, 77-5, 78-6 Zusammenfassung & COLLECTION OF CZECHOSLOVAK CHEMICAL COMMUNICATIONS , 55(11), 2715-21 CODEN: CCCCAK; ISSN: 0010-0765, 1990, -----</p>	6
X	<p>DATABASE CA 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; AWAD, IBRAHIM M. A.: "Studies on the Vilsmeier-Haack reaction. Part VIII. Application to quinoxaline-2-thiones and their antibacterial activities" XP002339387 gefunden im STN Database accession no. 1991:122284 RN 132599-09-8, 10-1, 11-2 Zusammenfassung & INDIAN JOURNAL OF CHEMISTRY, SECTION B: ORGANIC CHEMISTRY INCLUDING MEDICINAL CHEMISTRY , 30B(1), 89-92 CODEN: IJSBDB; ISSN: 0376-4699, 1991, -----</p>	6
X	<p>DATABASE CA 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; EL ASHRY, EL SAYED H. ET AL: "Heterocycles from carbohydrate precursors. Part 44. A novel synthesis of pyridazinones. Preparation of 3-'1-aryl-6(1H)-pyridazinon-3-yl!-2(1H)- quinoxalinones" XP002339388 gefunden im STN Database accession no. 1988:112397 RN 113314-11-7 Zusammenfassung & HETEROCYCLES , 26(8), 2101-8 CODEN: HTCYAM; ISSN: 0385-5414, 1987, ----- -/--</p>	6

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2005/004445

C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	<p>DATABASE CA 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; EL ASHRY, EL SAYED H. ET AL: "Heterocycles from carbohydrate precursors. XXXIII. The scope of the reactions of hydrazines and hydrazones: dehydrative cyclizations of some nitrogen derivatives of dehydro-L-ascorbic acid" XP002339389 gefunden im STN Database accession no. 1987:534285 RN 110383-76-1 Zusammenfassung & GAZZETTA CHIMICA ITALIANA , 116(12), 721-4 CODEN: GCITA9; ISSN: 0016-5603, 1986,</p>	6
X	<p>DATABASE CA 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; EL ASHRY, EL SAYED H. ET AL: "Heterocycles from carbohydrate precursors. Part 28. Synthesis of p-fluorophenylflavazoles from dehydro-D-isoascorbic acid" XP002339390 gefunden im STN Database accession no. 1987:18973 RN 105291-55-2 Zusammenfassung & CARBOHYDRATE RESEARCH , 152, 339-42 CODEN: CRBRAT; ISSN: 0008-6215, 1986,</p>	6
X	<p>DATABASE CA 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; LUMMA, WILLIAM C., JR. ET AL: "Piperazinylquinoxalines with central serotoninmimetic activity" XP002339391 gefunden im STN Database accession no. 1981:30709 RN 55686-67-4, 76052-75-0 Zusammenfassung & JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY , 24(1), 93-101 CODEN: JMCMAR; ISSN: 0022-2623, 1981,</p> <p style="text-align: center;">----- -/--</p>	6

1

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2005/004445

C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	<p>DATABASE CA 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; EL ASHRY, EL SAYED H. ET AL: "Heterocycles from carbohydrate precursors. Part VIII. Reactions of 3-(1-arylhydrazono-L-threo-2,3,4-trihydrox ybutyl)-1-methyl-2- quinoxalinones" XP002339392 gefunden im STN Database accession no. 1978:563856 RN 67912-33-8, 34-9, 35-0, 36-1 Zusammenfassung & CARBOHYDRATE RESEARCH , 64, 81-8 CODEN: CRBRAT; ISSN: 0008-6215, 1978,</p>	6
X	<p>DATABASE CA 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; SETH, M. ET AL: "Antiamoebic agents. Syntheses of substituted indophenazines, azaindophenazines, and azaquinoxalines" XP002339393 gefunden im STN Database accession no. 1974:477871 RN 53493-73-5, 53493-74-6 Zusammenfassung & INDIAN JOURNAL OF CHEMISTRY , 12(2), 124-8 CODEN: IJOCAP; ISSN: 0019-5103, 1974,</p>	6
X	<p>DATABASE CA 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; COOK, A. H. ET AL: "Quinoxaline cyanines. III" XP002339394 gefunden im STN Database accession no. 1944:2172 RN 855873-79-9 Zusammenfassung & JOURNAL OF THE CHEMICAL SOCIETY, ABSTRACTS 397-401 CODEN: JCSAAZ; ISSN: 0590-9791, 1943,</p>	6

INTERNATIONALE RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2005/004445

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument		Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
EP 0216299	A	01-04-1987	DE 3533791 A1	26-03-1987
			EP 0216299 A1	01-04-1987
			ES 2003353 A6	01-11-1988
			JP 62072678 A	03-04-1987
EP 0663397	A	19-07-1995	DE 4344074 A1	29-06-1995
			CA 2138924 A1	24-06-1995
			EP 0663397 A2	19-07-1995
			JP 7330739 A	19-12-1995
EP 0144001	A	12-06-1985	DE 3340771 A1	23-05-1985
			AT 26975 T	15-05-1987
			AU 572224 B2	05-05-1988
			AU 3529084 A	16-05-1985
			BR 8405722 A	17-09-1985
			CA 1242722 A1	04-10-1988
			DE 3463501 D1	11-06-1987
			EP 0144001 A1	12-06-1985
			ES 8600283 A1	01-01-1986
			GR 80899 A1	26-02-1985
			HU 36681 A2	28-10-1985
			IL 73468 A	30-06-1988
			JP 60116662 A	24-06-1985
			ZA 8408758 A	26-06-1985
JP 2004256488	A2	16-09-2004	JP 2004256488 A	16-09-2004
WO 2004009586	A1	29-01-2004	AU 2003243101 A1	09-02-2004
			BR 0312789 A	03-05-2005
			CA 2492924 A1	29-01-2004
			EP 1534391 A1	01-06-2005
			US 2004063693 A1	01-04-2004
WO 0202550	A1	10-01-2002	AT 276257 T	15-10-2004
			AU 6785201 A	14-01-2002
			CA 2413002 A1	19-12-2002
			DE 60105610 D1	21-10-2004
			DE 60105610 T2	27-01-2005
			EP 1295878 A1	26-03-2003
			ES 2223884 T3	01-03-2005
			US 2003203907 A1	30-10-2003
WO 9943323	A1	02-09-1999	US 6248752 B1	19-06-2001
AU 603788	B2	29-11-1990	AR 245097 A1	30-12-1993
			AT 90072 T	15-06-1993
			AU 6976487 A	17-09-1987
			CA 1302418 C	02-06-1992
			CS 9104022 A3	16-12-1992
			DE 3786026 D1	08-07-1993
			DK 82087 A	12-09-1987
			EP 0237929 A1	23-09-1987
			ES 2056792 T3	16-10-1994
			FI 871041 A ,B,	12-09-1987
			HK 165896 A	13-09-1996
			HU 43804 A2	28-12-1987
			IE 61316 B1	02-11-1994
			IL 81791 A	01-12-1992

INTERNATIONALE RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2005/004445

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
AU 603788	B2	JP 2006568 C	11-01-1996
		JP 7042254 B	10-05-1995
		JP 62240649 A	21-10-1987
		KR 9301054 B1	13-02-1993
		KR 9301337 B1	26-02-1993
		LU 90219 A9	28-05-1998
		LV 5742 A4	20-10-1996
		MC 1807 A	22-12-1987
		NL 970041 I1	02-02-1998
		NO 870984 A ,B,	14-09-1987
		NZ 219496 A	21-12-1990
		PT 84449 A ,B	01-04-1987
		US 5389653 A	14-02-1995
		US 5476875 A	19-12-1995
		US 5633371 A	27-05-1997
		US 5236952 A	17-08-1993
		US 5705703 A	06-01-1998
		ZA 8701564 A	28-10-1987
		MX 9203634 A1	01-07-1992

フロントページの続き

(51) Int.Cl.		F I	テーマコード(参考)
C 0 7 D 401/04	(2006.01)	C 0 7 D 401/04	
C 0 7 D 405/04	(2006.01)	C 0 7 D 405/04	
C 0 7 D 417/04	(2006.01)	C 0 7 D 417/04	
C 0 7 D 403/06	(2006.01)	C 0 7 D 403/06	
C 0 7 D 401/06	(2006.01)	C 0 7 D 401/06	
C 0 7 D 413/06	(2006.01)	C 0 7 D 413/06	
C 0 7 D 405/06	(2006.01)	C 0 7 D 405/06	
C 0 7 D 417/06	(2006.01)	C 0 7 D 417/06	
C 0 7 D 405/12	(2006.01)	C 0 7 D 405/12	

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

- (72) 発明者 ロータール・ヴィルムス
ドイツ連邦共和国 6 5 7 1 9 ホーフハイム . ケーニツヒシュタイナーシュトラッセ 5 0
- (72) 発明者 クリストファー・ロジンガー
ドイツ連邦共和国 6 5 7 1 9 ホーフハイム . アム・ホーフフェルト 3 3
- (72) 発明者 エルヴィーン・ハッカー
ドイツ連邦共和国 6 5 2 3 9 ホーフハイム . マルガレーテンシュトラッセ 1 6
- (72) 発明者 エックハルト・ローゼ
ドイツ連邦共和国 6 5 8 3 5 リーダーバッハ . ヴァッヘンハイマーシュトラッセ 7 8
- (72) 発明者 デイルク・シュムツラー
ドイツ連邦共和国 6 5 7 9 5 ハッテルスハイム . ハウプトマンヴェーク 2

F ターム(参考) 4C050 AA01 AA08 BB08 CC16 DD10 EE02 FF05 GG02 GG03 HH01
4C063 AA01 AA03 BB01 BB03 BB08 CC34 CC51 CC58 CC62 CC72
CC73 CC75 CC78 CC81 CC82 CC92 DD03 DD06 DD10 DD12
DD25 DD34 EE03
4H011 AB01 AC01 BA01 BB06 BB14 BC09 DA02 DA15 DA16 DC05
DD03 DD04

【要約の続き】

