

(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2014-509596

(P2014-509596A)

(43) 公表日 平成26年4月21日 (2014. 4. 21)

(51) Int.Cl.	F I	テーマコード (参考)
C O 7 D 405/12 (2006.01)	C O 7 D 405/12 C S P	4 C O 6 3
C O 7 D 409/12 (2006.01)	C O 7 D 409/12	4 H O 1 1
C O 7 D 417/12 (2006.01)	C O 7 D 417/12	
C O 7 D 413/12 (2006.01)	C O 7 D 413/12	
C O 7 D 413/14 (2006.01)	C O 7 D 413/14	
審査請求 未請求 予備審査請求 未請求 (全 163 頁) 最終頁に続く		

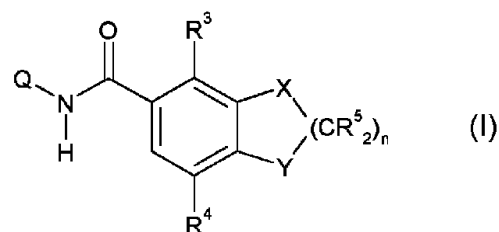
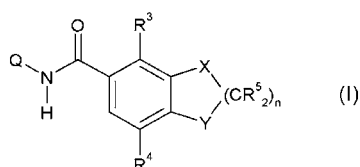
(21) 出願番号	特願2013-558391 (P2013-558391)	(71) 出願人	512151078
(86) (22) 出願日	平成24年3月12日 (2012. 3. 12)		バイエル・インテレクチュアル・プロパテ
(85) 翻訳文提出日	平成25年11月8日 (2013. 11. 8)		イー・ゲー・エム・ペー・ハー
(86) 国際出願番号	PCT/EP2012/054269		ドイツ国、4 O 7 8 9・モンハイム、アル
(87) 国際公開番号	W02012/123409		フレートーノベルーシュトラーセ・1 O
(87) 国際公開日	平成24年9月20日 (2012. 9. 20)	(74) 代理人	100146318
(31) 優先権主張番号	11158258.1		弁理士 岩瀬 吉和
(32) 優先日	平成23年3月15日 (2011. 3. 15)	(74) 代理人	100114188
(33) 優先権主張国	欧州特許庁 (EP)		弁理士 小野 誠
		(74) 代理人	100119253
			弁理士 金山 賢敦
		(74) 代理人	100124855
			弁理士 坪倉 道明
		(74) 代理人	100129713
			弁理士 重森 一輝
		最終頁に続く	

(54) 【発明の名称】 N- (1, 2, 5-オキサジアゾール-3-イル) -, N- (テトラゾール-5-イル) -および N- (トリアゾール-5-イル) ビシクロアリアルカルボキサミド類およびそれらの除草剤と

(57) 【要約】

一般式 (I) の N- (1, 2, 5-オキサジアゾール-3-イル) -, N- (テトラゾール-5-イル) -および N- (トリアゾール-5-イル) ビシクロアリアルカルボキサミド類。N- (1, 2, 5-オキサジアゾール-3-イル) -, N- (テトラゾール-5-イル) -および N- (トリアゾール-5-イル) ビシクロアリアルカルボキサミド類が除草剤として記載されている。この式 (I) において、R³、R⁴およびR⁵は、水素などの基、アルキルなどの有機基およびハロゲンなどの他の基である。Qは複素環である。XおよびYは酸素および硫黄である。

【化1】

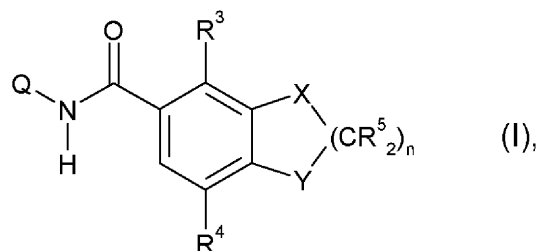


【特許請求の範囲】

【請求項 1】

下記式 (I) の N- (1, 2, 5-オキサジアゾール-3-イル) -, N- (テトラゾール-5-イル) -もしくは N- (トリアゾール-5-イル) ビシクロアリアルカルボキサミドまたは該化合物の塩。

【化 1】

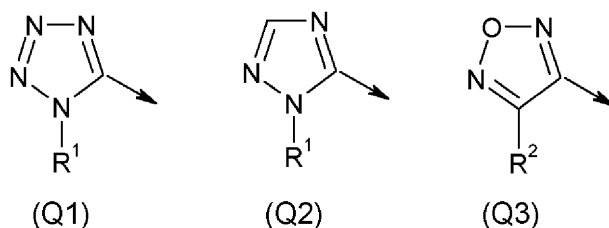


10

[式中、

Q は、Q 1、Q 2 または Q 3 基：

【化 2】



20

であり、

R¹ は、(C₁-C₆)-アルキル、(C₃-C₇)-シクロアルキル、ハロ- (C₁-C₆)-アルキル、(C₂-C₆)-アルケニル、ハロ- (C₂-C₆)-アルケニル、(C₂-C₆)-アルキニル、ハロ- (C₂-C₆)-アルキニル、(C₁-C₆)-アルコキシ- (C₁-C₆)-アルキル、(C₁-C₆)-アルコキシ- (C₂-C₆)-アルケニル、(C₁-C₆)-アルコキシ- (C₂-C₆)-アルキニル、CH₂R⁶、ヘテロアリアル、複素環またはフェニルであり、最後に言及した 3 個の基はそれぞれ、ハロゲン、ニトロ、シアノ、(C₁-C₆)-アルキル、ハロ- (C₁-C₆)-アルキル、(C₃-C₆)-シクロアルキル、(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、ハロ- (C₁-C₆)-アルコキシおよび (C₁-C₆)-アルコキシ- (C₁-C₄)-アルキルからなる群からの u 個の基によって置換されており；

30

R² は、水素、(C₁-C₆)-アルキル、(C₃-C₇)-シクロアルキル、ハロ- (C₁-C₆)-アルキル、(C₁-C₆)-アルコキシ、ハロ- (C₁-C₆)-アルコキシ、(C₂-C₆)-アルケニル、(C₂-C₆)-アルケニルオキシ、ハロ- (C₂-C₆)-アルケニル、(C₂-C₆)-アルキニル、(C₂-C₆)-アルキニルオキシ、ハロ- (C₂-C₆)-アルキニル、シアノ、ニトロ、メチルスルフェニル、メチルスルフィニル、メチルスルホニル、アセチルアミノ、ベンゾイルアミノ、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、メトキシカルボニルメチル、エトキシカルボニルメチル、ベンゾイル、メチルカルボニル、ピペリジニルカルボニル、トリフルオロメチルカルボニル、ハロゲン、アミノ、アミノカルボニル、メチルアミノカルボニル、ジメチルアミノカルボニル、メトキシメチル、またはヘテロアリアル、複素環またはフェニルであり、それらはそれぞれメチル、エチル、メトキシ、トリフルオロメチルおよびハロゲンからなる群からの u 個の基によって置換されており；

40

R³ および R⁴ はそれぞれ独立に、水素、(C₁-C₆)-アルキル、ハロ- (C₁-

50

C_6) - アルキル、 $(C_2 - C_6)$ - アルケニル、ハロ - $(C_2 - C_6)$ - アルケニル、 $(C_2 - C_6)$ - アルキニル、ハロ - $(C_2 - C_6)$ - アルキニル、 $(C_3 - C_7)$ - シクロアルキル、 $(C_3 - C_7)$ - ハロシクロアルキル、 $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ、 $(C_1 - C_6)$ - ハロアルコキシ、 $(C_1 - C_6)$ - アルキルチオ、 $(C_1 - C_6)$ - ハロアルキルチオ、 $(C_1 - C_6)$ - アルキルスルフィニル、 $(C_1 - C_6)$ - ハロアルキルスルフィニル、 $(C_1 - C_6)$ - アルキルスルホニル、 $(C_1 - C_6)$ - ハロアルキルスルホニル、 $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ - $(C_1 - C_4)$ - アルキル、ハロゲン、ニトロまたはシアノであり；

R^5 は、水素またはフッ素であり；

R^6 は、アセトキシ、アセトアミド、N-メチルアセトアミド、ベンゾイルオキシ、ベンゾアミド、N-メチルベンゾアミド、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、ベンゾイル、メチルカルボニル、ピペリジニルカルボニル、モルホリニルカルボニル、トリフルオロメチルカルボニル、アミノカルボニル、メチルアミノカルボニル、ジメチルアミノカルボニル、 $(C_3 - C_6)$ - シクロアルキル、またはヘテロアリール、複素環もしくはフェニルであり、それらはそれぞれメチル、エチル、メトキシ、トリフルオロメチルおよびハロゲンからなる群からの u 個の基によって置換されており；

10

R^7 および R^8 はそれぞれ独立に、水素、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル、ハロ - $(C_1 - C_6)$ - アルキル、 $(C_2 - C_6)$ - アルケニル、ハロ - $(C_2 - C_6)$ - アルケニル、 $(C_2 - C_6)$ - アルキニル、ハロ - $(C_2 - C_6)$ - アルキニル、 $(C_3 - C_7)$ - シクロアルキル、ハロ - $(C_3 - C_7)$ - シクロアルキル、 $-OR^9$ 、 $S(O)_m R^9$ 、 $(C_1 - C_6)$ - アルキルチオ、ハロ - $(C_1 - C_6)$ - アルキルチオ、 $(C_1 - C_6)$ - アルキルスルフィニル、ハロ - $(C_1 - C_6)$ - アルキルスルフィニル、 $(C_1 - C_6)$ - アルキルスルホニル、ハロ - $(C_1 - C_6)$ - アルキルスルホニル、 $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ - $(C_1 - C_4)$ - アルキル、ハロゲン、ニトロ、シアノ、ヘテロアリール、複素環またはフェニルであり、最後に言及した3個の基はそれぞれ、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル、ハロ - $(C_1 - C_6)$ - アルキル、 $(C_3 - C_6)$ - シクロアルキル、 $(C_1 - C_6)$ - アルキルチオ、 $(C_1 - C_6)$ - アルキルスルフィニル、 $(C_1 - C_6)$ - アルキルスルホニル、 $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ、ハロ - $(C_1 - C_6)$ - アルコキシおよび $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ - $(C_1 - C_4)$ - アルキルからなる群からの u 個の基によって置換されており、

20

30

または

R^7 および R^8 がそれらが結合している炭素原子とともに、 $-X^1 - (CH_2)_r - X^2 -$ 、 $-(CH_2)_s - X^3 -$ 、 $-(CH_2)_t - X^3 - CH_2 -$ 、 $-(CH_2)_v - X^3 - CH_2 -$ または $-(CH_2)_w -$ 単位を形成しており、それらにおいて (CH_2) 基のそれぞれは、ハロゲン、メチルおよび $(C_1 - C_3)$ - アルコキシからなる群からの m 個の基によって置換されており、

または

R^7 および R^8 がそれらが結合している炭素原子とともに、 $-O - N((C_1 - C_3) - \text{アルキル}) - CHR^{10} - CH_2 -$ または $-O - N = CR^{10} - CH_2 -$ 単位を形成しており、それらにおいて (CH_2) 基のそれぞれは、ハロゲンおよびメチルからなる群からの m 個の基によって置換されており；

40

R^9 は、水素、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル、ハロ - $(C_1 - C_6)$ - アルキル、 $(C_2 - C_6)$ - アルケニル、ハロ - $(C_2 - C_6)$ - アルケニル、 $(C_2 - C_6)$ - アルキニル、ハロ - $(C_2 - C_6)$ - アルキニル、 $(C_3 - C_7)$ - シクロアルキル、 $(C_3 - C_7)$ - ハロシクロアルキル、 $(C_3 - C_7)$ - シクロアルキル - $(C_1 - C_3)$ - アルキル、ハロ - $(C_3 - C_7)$ - シクロアルキル - $(C_1 - C_3)$ - アルキル、ヘテロアリール、複素環またはフェニルであり、最後に言及した3個の基はそれぞれ、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル、ハロ - $(C_1 - C_6)$ - アルキル、 $(C_3 - C_6)$ - シクロアルキル、 $(C_1 - C_6)$ - アルキルチオ、 $(C_1 - C_6)$ - アルキルスルフィニル、 $(C_1 - C_6)$ - アルキルスルホニル、 $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ、ハロ -

50

($C_1 - C_6$) - アルコキシおよび ($C_1 - C_6$) - アルコキシ - ($C_1 - C_4$) - アルキルからなる群からの s 個の基によって置換されており；

R^{10} は、水素、($C_1 - C_3$) - アルキル、または ($C_1 - C_3$) - アルキル、ハロゲン、シアノおよびニトロからなる群からの u 個の基によって置換されているフェニルであり；

R^{11} は、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、ホルミル、($C_2 - C_6$) - アルキルカルボニル、($C_2 - C_6$) - アルコシカルボニルまたは ($C_1 - C_2$) - アルキルスルホニルであり；

X および Y はそれぞれ独立に、 O 、 S 、 SO 、 SO_2 、 $C=O$ 、 $C=S$ 、 NR^{10} 、 CR^7R^8 、 $C=NO R^{10}$ または $C=NN(R^{11})_2$ であり；

10

X^1 および X^2 はそれぞれ独立に、 O 、 S または N (($C_1 - C_3$) - アルキル) であり；

X^3 は O または S であり；

m は 0、1 または 2 であり；

n は 1、2 または 3 であり；

r は 2、3 または 4 であり；

s は 2、3、4 または 5 であり；

t は 1、2、3 または 4 であり；

u は 0、1、2 または 3 であり；

v は 2 または 3 であり；

20

w は 2、3、4、5 または 6 である。]

【請求項 2】

R^1 が、($C_1 - C_3$) - アルキル、($C_3 - C_5$) - シクロアルキル、ハロ - ($C_1 - C_3$) - アルキルまたは ($C_1 - C_3$) - アルコキシ - ($C_1 - C_3$) - アルキルであり；

R^2 が、水素、($C_1 - C_3$) - アルキル、($C_3 - C_5$) - シクロアルキル、ハロ - ($C_1 - C_3$) - アルキル、($C_1 - C_3$) - アルコキシ、ハロ - ($C_1 - C_3$) - アルコキシ、シアノ、ニトロ、メチルスルフェニル、メチルスルフィニル、メチルスルホニル、アセチルアミノ、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、ハロゲン、アミノ、アミノカルボニル、メチルアミノカルボニル、ジメチルアミノカルボニルまたはメトキシメチルであり；

30

R^3 および R^4 がそれぞれ独立に、水素、($C_1 - C_3$) - アルキル、ハロ - ($C_1 - C_3$) - アルキル、($C_3 - C_5$) - シクロアルキル、($C_1 - C_3$) - アルコキシ、($C_1 - C_3$) - ハロアルコキシ、($C_1 - C_6$) - アルキルチオ、($C_1 - C_6$) - アルキルスルフィニル、($C_1 - C_6$) - アルキルスルホニル、($C_1 - C_6$) - アルコキシ - ($C_1 - C_4$) - アルキル、ハロゲン、ニトロまたはシアノであり；

R^5 が水素であり；

R^7 および R^8 がそれぞれ独立に、水素、($C_1 - C_3$) - アルキル、ハロ - ($C_1 - C_3$) - アルキル、($C_3 - C_5$) - シクロアルキル、 $-OR^9$ 、 $-S(O)_m R^9$ 、($C_1 - C_3$) - アルキルチオ、($C_1 - C_3$) - アルキルスルフィニル、($C_1 - C_3$) - アルキルスルホニル、($C_1 - C_3$) - アルコキシ - ($C_1 - C_3$) - アルキル、ハロゲン、ニトロ、シアノ、ヘテロアリール、複素環またはフェニルであり、最後に言及した 3 個の基がそれぞれ、ハロゲン、ニトロ、シアノ、($C_1 - C_3$) - アルキル、ハロ - ($C_1 - C_3$) - アルキル、($C_3 - C_5$) - シクロアルキル、($C_1 - C_3$) - アルキルチオ、($C_1 - C_3$) - アルキルスルフィニル、($C_1 - C_3$) - アルキルスルホニル、($C_1 - C_3$) - アルコキシ、ハロ - ($C_1 - C_3$) - アルコキシおよび ($C_1 - C_3$) - アルコキシ - ($C_1 - C_3$) - アルキルからなる群からの u 個の基によって置換されており、

40

または

R^7 および R^8 がそれらが結合している炭素原子とともに、 $-X^1 - (CH_2)_r - X$

50

2 —、—(CH₂)_s—X³—、—(CH₂)_t—X³—CH₂—、—(CH₂)_v—X³—CH₂CH₂—または—(CH₂)_w—単位を形成しており、それらにおいて(CH₂)₂基のそれぞれが、ハロゲン、メチルおよび(C₁—C₃)—アルコキシからなる群からのm個の基によって置換されており、

または

R⁷およびR⁸がそれらが結合している炭素原子とともに、—O—N((C₁—C₃)—アルキル)—CHR¹⁰—CH₂—または—O—N=CR¹⁰—CH₂—単位を形成しており、それらにおいて(CH₂)₂基のそれぞれが、ハロゲンおよびメチルからなる群からのm個の基によって置換されており；

R⁹が、水素、(C₁—C₃)—アルキル、ハロ—(C₁—C₃)—アルキル、(C₂—C₃)—アルケニル、(C₂—C₄)—アルキニル、(C₃—C₅)—シクロアルキル、(C₃—C₅)—シクロアルキル—(C₁—C₃)—アルキル、ヘテロアリール、複素環またはフェニル、であり、最後に言及した3個の基がそれぞれ、ハロゲン、ニトロ、シアノ、(C₁—C₃)—アルキル、ハロ—(C₁—C₃)—アルキル、(C₃—C₆)—シクロアルキル、(C₁—C₃)—アルキルチオ、(C₁—C₃)—アルキルスルフィニル、(C₁—C₃)—アルキルスルホニル、(C₁—C₃)—アルコキシ、ハロ—(C₁—C₃)—アルコキシおよび(C₁—C₃)—アルコキシ—(C₁—C₃)—アルキルからなる群からのs個の基によって置換されており；

R¹⁰が水素または(C₁—C₃)—アルキルであり；

XおよびYがそれぞれ独立に、O、SO₂、C=O、C=S、CR⁷R⁸、C=NOR¹⁰であり；

X¹およびX²がそれぞれ独立に、O、S、N(CH₃)であり；

X³がOまたはSであり；

mが0、1または2であり；

nが1または2であり；

rが2または3であり；

sが2、3または4であり；

tが1、2または3であり；

uが0、1または2であり；

vが2または3であり；

wが2、3、4または5である請求項1に記載のN—(1, 2, 5-オキサジアゾール-3-イル)—、N—(テトラゾール-5-イル)—もしくはN—(トリアゾール-5-イル)ビスシクロアリールカルボキサミド。

【請求項3】

除草活性含有量の少なくとも1種類の請求項1または2に記載の式(I)の化合物を特徴とする除草剤組成物。

【請求項4】

製剤補助剤との混合物での請求項3に記載の除草剤組成物。

【請求項5】

殺虫剤、殺ダニ剤、除草剤、殺菌剤、薬害軽減剤および成長調節剤の群からの少なくとも1種類の別の農薬活性物質を含む請求項3または4に記載の除草剤組成物。

【請求項6】

薬害軽減剤を含む請求項5に記載の除草剤組成物。

【請求項7】

シプロスルファミド、クロキントセト—メキシル、メフェンピル—ジエチルまたはイソキサジフェン—エチルを含む請求項6に記載の除草剤組成物。

【請求項8】

さらに別の除草剤を含む請求項5から7のうちのいずれか1項に記載の除草剤組成物。

【請求項9】

有効量の少なくとも1種類の請求項1もしくは2に記載の式(I)の化合物または請求

10

20

30

40

50

項 3 から 8 のうちのいずれか 1 項に記載の除草剤組成物を植物または望ましくない植生の場所に施用することを含む、望ましくない植物の防除方法。

【請求項 10】

望ましくない植物を防除するための、請求項 1 もしくは 2 に記載の式 (I) の化合物または請求項 3 から 8 のうちのいずれか 1 項に記載の除草剤組成物の使用。

【請求項 11】

前記式 (I) の化合物を、有用植物の作物における望ましくない植物の防除に使用する請求項 10 に記載の使用。

【請求項 12】

前記有用植物がトランスジェニック有用植物である請求項 11 に記載の使用。

10

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、除草剤の技術分野、特別には有用植物の作物における広葉雑草およびイネ科雑草の選択的防除のための除草剤の技術分野に関するものである。

【背景技術】

【0002】

WO 2003/010143 および WO 2003/010153 には、特定の N- (テトラゾール-5-イル) - および N- (トリアゾール-5-イル) ベンズアミド類およびそれらの薬理作用が開示されている。CAS 番号 639048-78-5 下で、化合物 N- (1-プロピルテトラゾール-5-イル) - 2, 5-ジクロロベンズアミドが知られている。これらの文書では、これら化合物の除草作用は全く開示されていない。本願より前の優先日を有するが、本願の優先日にはまだ公開されていなかった欧州特許出願 0912169. 0 号および同 10174893. 7 号には、N- (1, 2, 5-オキサジアゾール-3-イル) -, N- (テトラゾール-5-イル) - および N- (トリアゾール-5-イル) アリールカルボキサミド類およびそれらの除草剤としての使用が開示されている。

20

【先行技術文献】

【特許文献】

【0003】

【特許文献 1】 WO 2003/010143

30

【特許文献 2】 WO 2003/010153

【特許文献 3】 欧州特許出願 0912169. 0 号

【特許文献 4】 欧州特許出願 10174893. 7 号

【発明の概要】

【課題を解決するための手段】

【0004】

現在、N- (1, 2, 5-オキサジアゾール-3-イル) -, N- (テトラゾール-5-イル) - および N- (トリアゾール-5-イル) ビシクロアリールカルボキサミド類が除草剤として特に好適なものであることが見いだされた。

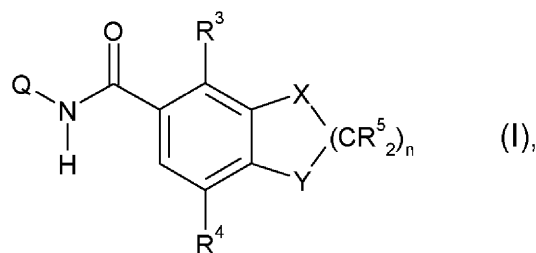
【0005】

40

従って本発明は、下記式 (I) の N- (1, 2, 5-オキサジアゾール-3-イル) -, N- (テトラゾール-5-イル) - もしくは N- (トリアゾール-5-イル) ビシクロアリールカルボキサミド類またはその塩を提供する。

【0006】

【化 1】

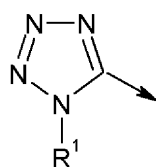


式中、

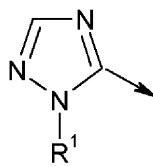
Q は、Q 1、Q 2 または Q 3 基：

【0007】

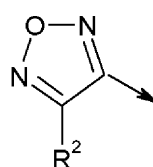
【化 2】



(Q1)



(Q2)



(Q3)

10

20

であり、

R¹ は、(C₁ - C₆) - アルキル、(C₃ - C₇) - シクロアルキル、ハロ - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₂ - C₆) - アルケニル、ハロ - (C₂ - C₆) - アルケニル、(C₂ - C₆) - アルキニル、ハロ - (C₂ - C₆) - アルキニル、(C₁ - C₆) - アルコキシ - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - アルコキシ - (C₂ - C₆) - アルケニル、(C₁ - C₆) - アルコキシ - (C₂ - C₆) - アルキニル、CH₂R⁶、ヘテロアリール、複素環またはフェニルであり、最後に言及した 3 個の基はそれぞれ、ハロゲン、ニトロ、シアノ、(C₁ - C₆) - アルキル、ハロ - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₃ - C₆) - シクロアルキル、(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、ハロ - (C₁ - C₆) - アルコキシおよび (C₁ - C₆) - アルコキシ - (C₁ - C₄) - アルキルからなる群からの u 個の基によって置換されており；

30

R² は、水素、(C₁ - C₆) - アルキル、(C₃ - C₇) - シクロアルキル、ハロ - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - アルコキシ、ハロ - (C₁ - C₆) - アルコキシ、(C₂ - C₆) - アルケニル、(C₂ - C₆) - アルケニルオキシ、ハロ - (C₂ - C₆) - アルケニル、(C₂ - C₆) - アルキニル、(C₂ - C₆) - アルキニルオキシ、ハロ - (C₂ - C₆) - アルキニル、シアノ、ニトロ、メチルスルフェニル、メチルスルフィニル、メチルスルホニル、アセチルアミノ、ベンゾイルアミノ、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、メトキシカルボニルメチル、エトキシカルボニルメチル、ベンゾイル、メチルカルボニル、ピペリジニルカルボニル、トリフルオロメチルカルボニル、ハロゲン、アミノ、アミノカルボニル、メチルアミノカルボニル、ジメチルアミノカルボニル、メトキシメチル、またはヘテロアリール、複素環またはフェニルであり、それらはそれぞれメチル、エチル、メトキシ、トリフルオロメチルおよびハロゲンからなる群からの u 個の基によって置換されており；

40

R³ および R⁴ はそれぞれ独立に、水素、(C₁ - C₆) - アルキル、ハロ - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₂ - C₆) - アルケニル、ハロ - (C₂ - C₆) - アルケニル、(C₂ - C₆) - アルキニル、ハロ - (C₂ - C₆) - アルキニル、(C₃ - C₇) - シクロアルキル、(C₃ - C₇) - ハロシクロアルキル、(C₁ - C₆) - アルコキシ、(C₁ - C₆) - ハロアルコキシ、(C₁ - C₆) - アルキルチオ、(C₁ - C₆) - ハロ

50

アルキルチオ、 $(C_1 - C_6)$ - アルキルスルフィニル、 $(C_1 - C_6)$ - ハロアルキルスルフィニル、 $(C_1 - C_6)$ - アルキルスルホニル、 $(C_1 - C_6)$ - ハロアルキルスルホニル、 $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ - $(C_1 - C_4)$ - アルキル、ハロゲン、ニトロまたはシアノであり；

R^5 は、水素またはフッ素であり；

R^6 は、アセトキシ、アセトアミド、N-メチルアセトアミド、ベンゾイルオキシ、ベンゾアミド、N-メチルベンゾアミド、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、ベンゾイル、メチルカルボニル、ピペリジニルカルボニル、モルホリニルカルボニル、トリフルオロメチルカルボニル、アミノカルボニル、メチルアミノカルボニル、ジメチルアミノカルボニル、 $(C_3 - C_6)$ - シクロアルキル、またはヘテロアリール、複素環もしくはフェニルであり、それらはそれぞれメチル、エチル、メトキシ、トリフルオロメチルおよびハロゲンからなる群からの u 個の基によって置換されており；

R^7 および R^8 はそれぞれ独立に、水素、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル、ハロ - $(C_1 - C_6)$ - アルキル、 $(C_2 - C_6)$ - アルケニル、ハロ - $(C_2 - C_6)$ - アルケニル、 $(C_2 - C_6)$ - アルキニル、ハロ - $(C_2 - C_6)$ - アルキニル、 $(C_3 - C_7)$ - シクロアルキル、ハロ - $(C_3 - C_7)$ - シクロアルキル、 $-OR^9$ 、 $S(O)_m R^9$ 、 $(C_1 - C_6)$ - アルキルチオ、ハロ - $(C_1 - C_6)$ - アルキルチオ、 $(C_1 - C_6)$ - アルキルスルフィニル、ハロ - $(C_1 - C_6)$ - アルキルスルフィニル、 $(C_1 - C_6)$ - アルキルスルホニル、ハロ - $(C_1 - C_6)$ - アルキルスルホニル、 $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ - $(C_1 - C_4)$ - アルキル、ハロゲン、ニトロ、シアノ、ヘテロアリール、複素環またはフェニルであり、最後に言及した3個の基はそれぞれ、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル、ハロ - $(C_1 - C_6)$ - アルキル、 $(C_3 - C_6)$ - シクロアルキル、 $(C_1 - C_6)$ - アルキルチオ、 $(C_1 - C_6)$ - アルキルスルフィニル、 $(C_1 - C_6)$ - アルキルスルホニル、 $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ、ハロ - $(C_1 - C_6)$ - アルコキシおよび $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ - $(C_1 - C_4)$ - アルキルからなる群からの u 個の基によって置換されており、

または

R^7 および R^8 がそれらが結合している炭素原子とともに、 $-X^1 - (CH_2)_r - X^2 -$ 、 $-(CH_2)_s - X^3 -$ 、 $-(CH_2)_t - X^3 - CH_2 -$ 、 $-(CH_2)_v - X^3 - CH_2 -$ または $-(CH_2)_w -$ 単位を形成しており、それらにおいて (CH_2) 基のそれぞれは、ハロゲン、メチルおよび $(C_1 - C_3)$ - アルコキシからなる群からの m 個の基によって置換されており、

または

R^7 および R^8 がそれらが結合している炭素原子とともに、 $-O - N((C_1 - C_3) - \text{アルキル}) - CHR^{10} - CH_2 -$ または $-O - N = CR^{10} - CH_2 -$ 単位を形成しており、それらにおいて (CH_2) 基のそれぞれは、ハロゲンおよびメチルからなる群からの m 個の基によって置換されており；

R^9 は、水素、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル、ハロ - $(C_1 - C_6)$ - アルキル、 $(C_2 - C_6)$ - アルケニル、ハロ - $(C_2 - C_6)$ - アルケニル、 $(C_2 - C_6)$ - アルキニル、ハロ - $(C_2 - C_6)$ - アルキニル、 $(C_3 - C_7)$ - シクロアルキル、 $(C_3 - C_7)$ - ハロシクロアルキル、 $(C_3 - C_7)$ - シクロアルキル - $(C_1 - C_3)$ - アルキル、ハロ - $(C_3 - C_7)$ - シクロアルキル - $(C_1 - C_3)$ - アルキル、ヘテロアリール、複素環またはフェニルであり、最後に言及した3個の基はそれぞれ、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル、ハロ - $(C_1 - C_6)$ - アルキル、 $(C_3 - C_6)$ - シクロアルキル、 $(C_1 - C_6)$ - アルキルチオ、 $(C_1 - C_6)$ - アルキルスルフィニル、 $(C_1 - C_6)$ - アルキルスルホニル、 $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ、ハロ - $(C_1 - C_6)$ - アルコキシおよび $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ - $(C_1 - C_4)$ - アルキルからなる群からの s 個の基によって置換されており；

R^{10} は、水素、 $(C_1 - C_3)$ - アルキル、または $(C_1 - C_3)$ - アルキル、ハロゲン、シアノおよびニトロからなる群からの u 個の基によって置換されているフェニルで

10

20

30

40

50

あり；

R^{11} は、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、ホルミル、 $(C_2 - C_6)$ - アルキルカルボニル、 $(C_2 - C_6)$ - アルコキシカルボニルまたは $(C_1 - C_2)$ - アルキルスルホニルであり；

X および Y はそれぞれ独立に、O、S、SO、SO₂、C=O、C=S、NR¹⁰、C R⁷ R⁸、C=NO R¹⁰ または C=NN (R¹¹)₂ であり；

X¹ および X² はそれぞれ独立に、O、S または N ($(C_1 - C_3)$ - アルキル) であり；

X³ は O または S であり；

m は 0、1 または 2 であり；

n は 1、2 または 3 であり；

r は 2、3 または 4 であり；

s は 2、3、4 または 5 であり；

t は 1、2、3 または 4 であり；

u は 0、1、2 または 3 であり；

v は 2 または 3 であり；

w は 2、3、4、5 または 6 である。

【発明を実施するための形態】

【0008】

式 (I) およびその後の全ての式において、2 個より多い炭素原子を有するアルキル基は直鎖もしくは分岐であることができる。アルキル基は、例えば、メチル、エチル、n-もしくはイソプロピル、n-、イソ-、tert-または2-ブチル、ペンチル類、n-ヘキシル、イソヘキシルおよび1, 3-ジメチルブチルなどのヘキシル類である。ハロゲンはフッ素、塩素、臭素またはヨウ素である。

【0009】

複素環は、3 から 6 個の環原子を含む飽和、半飽和または完全不飽和環基であって、1 から 4 個の環原子が酸素、窒素および硫黄の群からのものであり、さらにはベンゾ環によって縮合していても良いものである。例えば、複素環はピペリジニル、ピロリジニル、テトラヒドロフラニル、ジヒドロフラニルおよびオキセタニルである。

【0010】

ヘテロアリアルは、3 から 6 個の環原子を含む芳香族環状基であって、1 から 4 個の環原子が酸素、窒素および硫黄の群からのものであり、さらにはベンゾ環によって縮合していても良いものである。例えば、ヘテロアリアルは、ベンズイミダゾール-2-イル、フラニル、イミダゾリル、イソオキサゾリル、イソチアゾリル、オキサゾリル、ピラジニル、ピリミジニル、ピリダジニル、ピリジニル、ベンズイソオキサゾリル、チアゾリル、ピロリル、ピラゾリル、チオフェニル、1, 2, 3-オキサジアゾリル、1, 2, 4-オキサジアゾリル、1, 2, 5-オキサジアゾリル、1, 3, 4-オキサジアゾリル、1, 2, 4-トリアゾリル、1, 2, 3-トリアゾリル、1, 2, 5-トリアゾリル、1, 3, 4-トリアゾリル、1, 2, 4-トリアゾリル、1, 2, 4-チアジアゾリル、1, 3, 4-チアジアゾリル、1, 2, 3-チアジアゾリル、1, 2, 5-チアジアゾリル、2H-1, 2, 3, 4-テトラゾリル、1H-1, 2, 3, 4-テトラゾリル、1, 2, 3, 4-オキサトリアゾリル、1, 2, 3, 5-オキサトリアゾリル、1, 2, 3, 4-チアトリアゾリルおよび1, 2, 3, 5-チアトリアゾリルである。

【0011】

ある基が遊離基によって多置換されている場合、それは、この基が言及されているものと同一もしくは異なる1以上の基によって置換されていることを意味する。

【0012】

置換基の性質および結合に従って、一般式 (I) の化合物は立体異性体として存在していても良い。例えば1以上の不斉炭素原子が存在する場合、エナンチオマーおよびジアステレオマーが生じる可能性がある。同様に、nが1である場合（スルホキシド）、立体異

10

20

30

40

50

性体が生じる。立体異性体は、製造で得られた混合物から、一般的な分離方法によって、例えばクロマトグラフィー分離方法によって得ることができる。光学活性な原料および／または補助剤を用いる立体選択的反応を用いることで、立体異性体を選択的に製造することの等しく可能である。本発明はさらに、一般式 (I) によって包含されるが具体的に定義されない全ての立体異性体およびそれらの混合物に関するものでもある。

【0013】

好ましいものは、

R^1 が $(C_1 - C_3)$ - アルキル、 $(C_3 - C_5)$ - シクロアルキル、ハロー $(C_1 - C_3)$ - アルキルまたは $(C_1 - C_3)$ - アルコキシ $(C_1 - C_3)$ - アルキルであり；

10

R^2 が水素、 $(C_1 - C_3)$ - アルキル、 $(C_3 - C_5)$ - シクロアルキル、ハロー $(C_1 - C_3)$ - アルキル、 $(C_1 - C_3)$ - アルコキシ、ハロー $(C_1 - C_3)$ - アルコキシ、シアノ、ニトロ、メチルスルフェニル、メチルスルフィニル、メチルスルホニル、アセチルアミノ、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、ハロゲン、アミノ、アミノカルボニル、メチルアミノカルボニル、ジメチルアミノカルボニルまたはメトキシメチルであり；

R^3 および R^4 がそれぞれ独立に、水素、 $(C_1 - C_3)$ - アルキル、ハロー $(C_1 - C_3)$ - アルキル、 $(C_3 - C_5)$ - シクロアルキル、 $(C_1 - C_3)$ - アルコキシ、 $(C_1 - C_3)$ - ハロアルコキシ、 $(C_1 - C_6)$ - アルキルチオ、 $(C_1 - C_6)$ - アルキルスルフィニル、 $(C_1 - C_6)$ - アルキルスルホニル、 $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ $(C_1 - C_4)$ - アルキル、ハロゲン、ニトロまたはシアノであり；

20

R^5 が水素であり；

R^7 および R^8 がそれぞれ独立に、水素、 $(C_1 - C_3)$ - アルキル、ハロー $(C_1 - C_3)$ - アルキル、 $(C_3 - C_5)$ - シクロアルキル、 $-OR^9$ 、 $-S(O)_m R^9$ 、 $(C_1 - C_3)$ - アルキルチオ、 $(C_1 - C_3)$ - アルキルスルフィニル、 $(C_1 - C_3)$ - アルキルスルホニル、 $(C_1 - C_3)$ - アルコキシ $(C_1 - C_3)$ - アルキル、ハロゲン、ニトロ、シアノ、ヘテロアリール、複素環またはフェニルであり、最後に言及した3個の基がそれぞれ、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 $(C_1 - C_3)$ - アルキル、ハロー $(C_1 - C_3)$ - アルキル、 $(C_3 - C_5)$ - シクロアルキル、 $(C_1 - C_3)$ - アルキルチオ、 $(C_1 - C_3)$ - アルキルスルフィニル、 $(C_1 - C_3)$ - アルキルスルホニル、 $(C_1 - C_3)$ - アルコキシ、ハロー $(C_1 - C_3)$ - アルコキシおよび $(C_1 - C_3)$ - アルコキシ $(C_1 - C_3)$ - アルキルからなる群からの u 個の基によって置換されており、

30

または

R^7 および R^8 がそれらが結合している炭素原子とともに、 $-X^1 - (CH_2)_r - X^2 -$ 、 $-(CH_2)_s - X^3 -$ 、 $-(CH_2)_t - X^3 - CH_2 -$ 、 $-(CH_2)_v - X^3 - CH_2 -$ または $-(CH_2)_w -$ 単位を形成しており、それらにおいて (CH_2) 基のそれぞれが、ハロゲン、メチルおよび $(C_1 - C_3)$ - アルコキシからなる群からの m 個の基によって置換されており、

または

40

R^7 および R^8 がそれらが結合している炭素原子とともに、 $-O - N((C_1 - C_3) - \text{アルキル}) - CHR^{10} - CH_2 -$ または $-O - N = CR^{10} - CH_2 -$ 単位を形成しており、それらにおいて (CH_2) 基のそれぞれが、ハロゲンおよびメチルからなる群からの m 個の基によって置換されており；

R^9 が、水素、 $(C_1 - C_3)$ - アルキル、ハロー $(C_1 - C_3)$ - アルキル、 $(C_2 - C_3)$ - アルケニル、 $(C_2 - C_4)$ - アルキニル、 $(C_3 - C_5)$ - シクロアルキル、 $(C_3 - C_5)$ - シクロアルキル $(C_1 - C_3)$ - アルキル、ヘテロアリール、複素環またはフェニルであり、最後に言及した3個の基がそれぞれ、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 $(C_1 - C_3)$ - アルキル、ハロー $(C_1 - C_3)$ - アルキル、 $(C_3 - C_6)$ - シクロアルキル、 $(C_1 - C_3)$ - アルキルチオ、 $(C_1 - C_3)$ - アルキルスルフィニル

50

、 $(C_1 - C_3)$ - アルキルスルホニル、 $(C_1 - C_3)$ - アルコキシ、ハロー $(C_1 - C_3)$ - アルコキシおよび $(C_1 - C_3)$ - アルコキシ - $(C_1 - C_3)$ - アルキルからなる群からの s 個の基によって置換されており；

R^{10} が水素または $(C_1 - C_3)$ - アルキルであり；

X および Y がそれぞれ独立に、 O 、 SO_2 、 $C=O$ 、 $C=S$ 、 CR^7R^8 、 $C=NO R^{10}$ であり；

X^1 および X^2 がそれぞれ独立に、 O 、 S 、 $N(CH_3)$ であり；

X^3 が O または S であり；

m が 0 、 1 または 2 であり；

n が 1 または 2 であり；

r が 2 または 3 であり；

s が 2 、 3 または 4 であり；

t が 1 、 2 または 3 であり；

u が 0 、 1 または 2 であり；

v が 2 または 3 であり；

w が 2 、 3 、 4 または 5 である一般式 (I) の化合物である。

【0014】

以下で記載される全ての式において、置換基および記号は、異なる定義がなされていない限り、式 (I) でのものと同じ定義を有する。

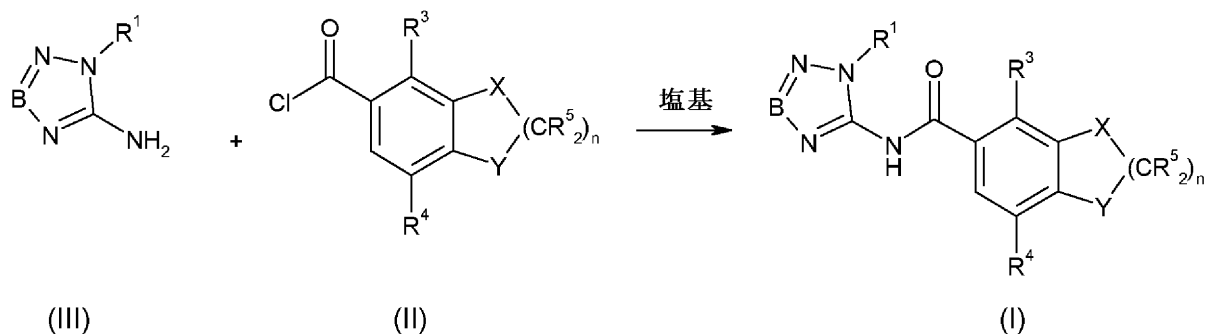
【0015】

Q が $Q1$ または $Q2$ である本発明の化合物は、例えば図式 1 に示した方法により、二環式ベンゾイルクロライド (II) の 5-アミノ-1H-1, 2, 4-トリアゾールまたは 5-アミノ-1H-テトラゾール (III) との塩基触媒反応によって製造することができる。

【0016】

【化 3】

図式 1



式中において、 B は CH または N である。式 (II) の二環式ベンゾイルクロライドまたはその親二環式安息香酸は基本的に公知であり、例えば $WO 96/25413$ 、 $WO 97/09324$ 、 $WO 97/30993$ 、 $WO 97/08164$ 、 $WO 98/49159$ 、 $WO 98/35954$ 、 $WO 98/12192$ 、 $WO 0014087$ および $EP 0636622$ で公知の方法によって製造することができる。

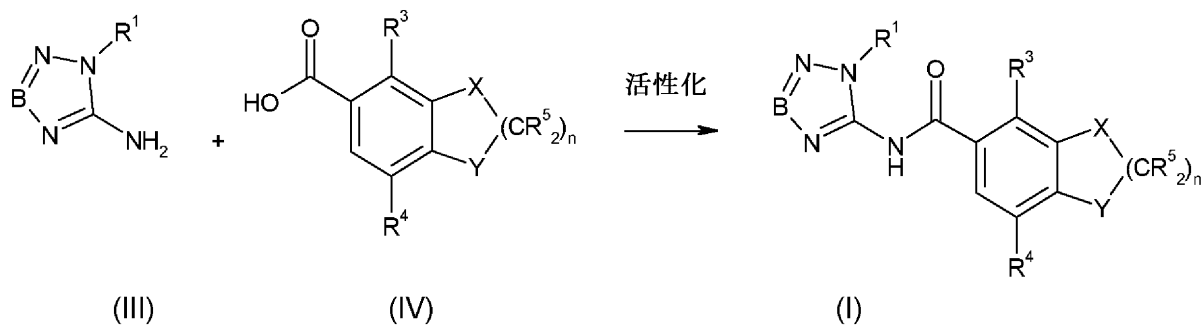
【0017】

Q が $Q1$ または $Q2$ である本発明の化合物は、図式 2 に示した方法により、式 (IV) の安息香酸の 5-アミノ-1H-1, 2, 4-トリアゾールまたは 5-アミノ-1H-テトラゾール (III) との反応によって製造することもできる。

【0018】

【化 4】

図式2



10

活性化のため、アミド化反応に代表的に用いられる脱水試薬、例えば 1, 1'-カルボニルジイミダゾール (CDI)、ジシクロヘキシルカルボジイミド (DCC)、2, 4, 6-トリプロピル-1, 3, 5, 2, 4, 6-トリオキサトリホスフィナン 2, 4, 6-トリオキサイド (T3P) などを用いることが可能である。

【0019】

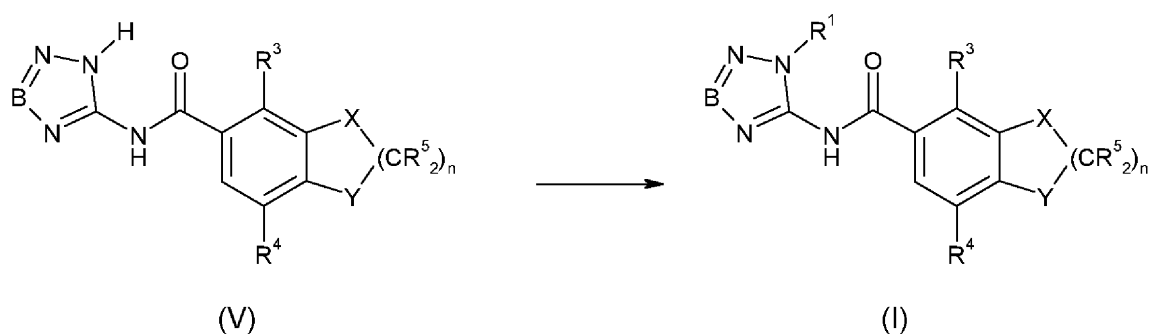
Q が Q1 または Q2 である本発明の化合物は、図式 3 に示した方法により、N-(1H-1, 2, 4-トリアゾール-5-イル) ベンズアミド、N-(1H-テトラゾール-5-イル) ベンズアミド、N-(1H-1, 2, 4-トリアゾール-5-イル) ニコチンアミドまたは N-(1H-テトラゾール-5-イル) ニコチンアミドの反応によって製造することもできる。

20

【0020】

【化 5】

図式 3



30

図式 3 に示したこの反応において、例えば、塩基の存在下にアルキル化剤、例えばアルキルハライドもしくはスルホネートまたはジアルキルサルフェートを用いることが可能である。

【0021】

40

反応段階の順序を変えることが適切な場合があり得る。例えば、スルホキシドを有する安息香酸は、それらの酸塩化物に直接変換することはできない。この場合の一つの選択肢は、最初にアミドをチオエーテルにする段階と次にチオエーテルをスルホキシドに酸化するというものである。

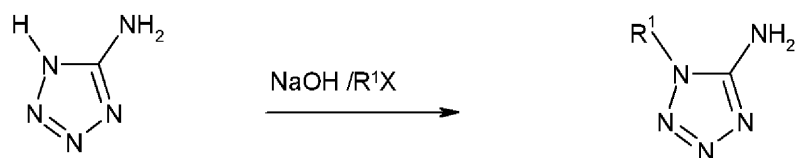
【0022】

式 (III) の 5-アミノ-1H-テトラゾールは市販されているか、文献から公知の方法と同様にして製造することができる。例えば、置換されている 5-アミノテトラゾールは、Journal of the American Chemical Society (1954), 76, 923-924 に記載の方法によってアミノテトラゾールから製造することができる。

50

【0023】

【化6】

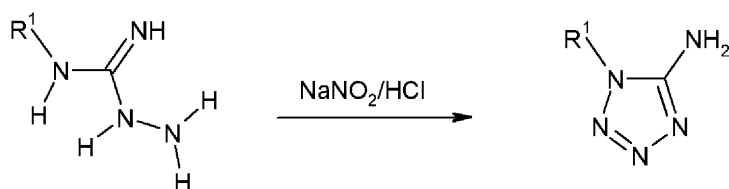


上記の反応で、Xはヨウ素などの脱離基である。置換されている5-アミノテトラゾールは、例えばJournal of the American Chemical Society (1954), 76, 88-89に記載の方法に従って合成することもできる。

10

【0024】

【化7】

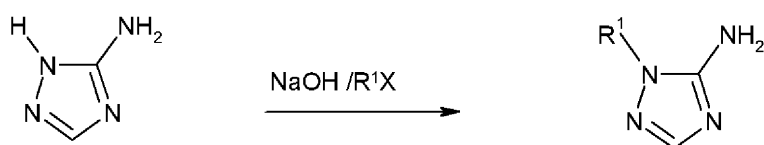


式(III)の5-アミノ-1H-トリアゾール類は市販されているか、文献から公知の方法と同様にして製造することができる。例えば、置換されている5-アミノトリアゾール類は、Zeitschrift fuer Chemie (1990), 30(12), 436-437に記載の方法によってアミノトリアゾールから製造することができる。

20

【0025】

【化8】

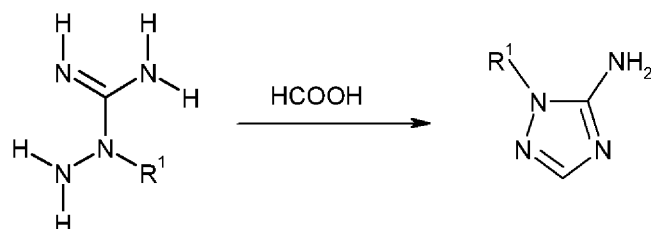


30

置換されている5-アミノトリアゾール類は、例えばChemische Berichte (1964), 97(2), 396-404に記載の方法に従って合成することもできる。

【0026】

【化9】

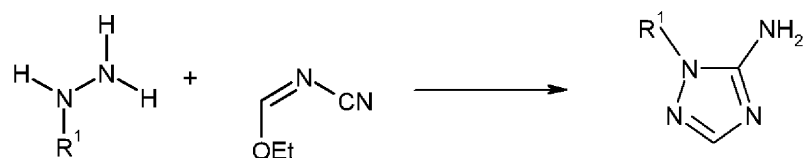


40

置換されている5-アミノトリアゾール類は、例えばAngewandte Chemie (1963), 75, 918に記載の方法に従って合成することもできる。

【0027】

【化 10】



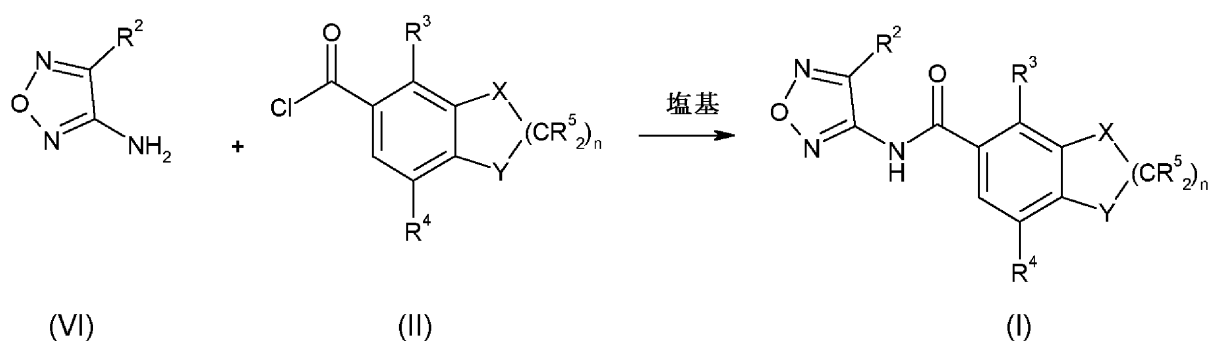
QがQ3である本発明の化合物は、例えば図式4に示した方法により、二環式ベンゾイ
ルククロライド (I I) の4-アミノ-1, 2, 5-オキサジアゾール (V I) との塩基触
媒反応によって製造することができる。

10

【0028】

【化 11】

図式4



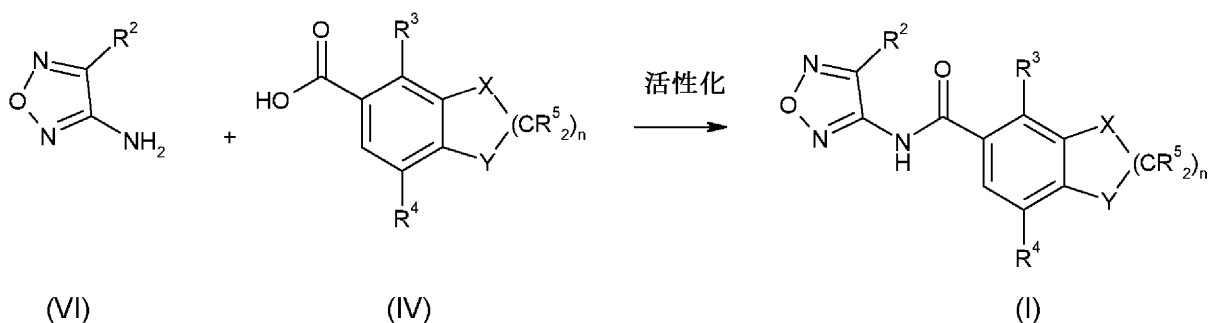
20

本発明の化合物は、図式5に記載の方法により、式 (I V) の二環式安息香酸を4-ア
ミノ-1, 2, 5-オキサジアゾール (V I) と反応させることで製造することもできる
。

【0029】

【化 12】

図式5



30

40

活性化のため、アミド化反応に代表的に用いられる脱水試薬、例えば1, 1'-カルボ
ニルジイミダゾール (C D I)、ジシクロヘキシルカルボジイミド (D C C)、2, 4,
6-トリプロピル-1, 3, 5, 2, 4, 6-トリオキサトリホスフィナン2, 4, 6-
トリオキサイド (T 3 P) などを用いることが可能である。

【0030】

式 (V I) の4-アミノ-1, 2, 5-オキサジアゾール類は、市販されているか、公
知であるか、または文献から公知の方法によって同様に製造することができる。

【0031】

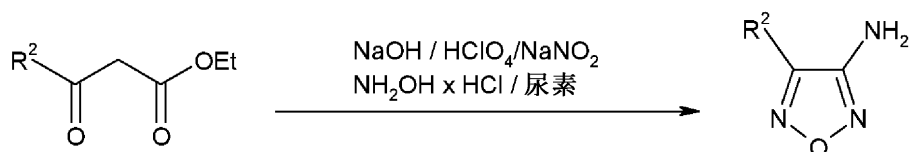
例えば、3-アルキル-4-アミノ-1, 2, 5-オキサジアゾール類は、R u s s i

50

an Chemical Bulletin, Int. Ed., vol. 54, 4, p. 1032-1037 (2005)に記載の方法により、 β -ケトエステル類から製造することができる。

【0032】

【化13】

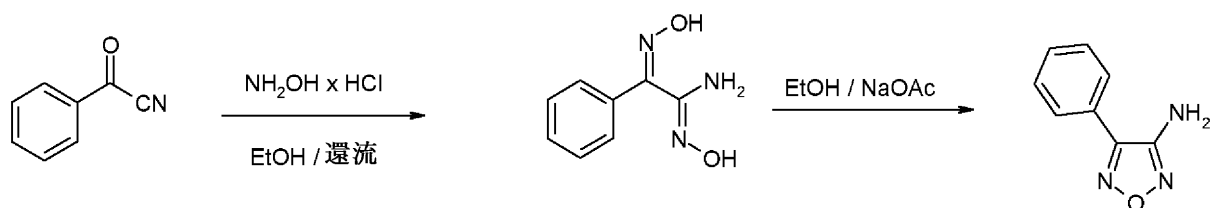


10

3-アリール-4-アミノ-1,2,5-オキサジアゾール類は、例えばRussian Chemical Bulletin, 54(4), 1057-1059, (2005)またはIndian Journal of Chemistry, Section B: Organic Chemistry Including Medicinal Chemistry, 26B(7), 690-2, (1987)に記載の方法に従って合成することができる。

【0033】

【化14】



20

3-アミノ-4-ハロ-1,2,5-オキサジアゾール類は、例えばHeteroatom Chemistry 15(3), 199-207 (2004)に記載の方法により、市販の3,4-ジアミノ-1,2,5-オキサジアゾールからサンドマイヤー反応によって製造することができる。

30

【0034】

【化15】

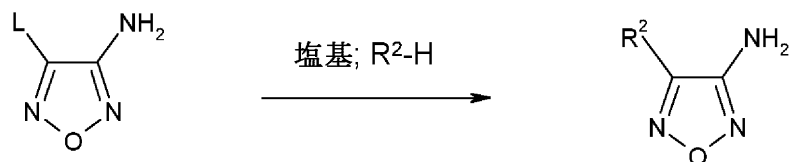


求核性の R^2 基は、Journal of Chemical Research, Synopses, (6), 190, 1985またはIzvestiya Akademii Nauk SSSR, Seriya Khimicheskaya, (9), 2086-8, 1986またはRussian Chemical Bulletin (Izvestiya Akademii Nauk, Seriya Khimicheskayaの翻訳), 53(3), 596-614, 2004に記載の方法に従って、脱離基Lの置換によって3-アミノ-1,2,5-オキサジアゾール類に導入することができる。

40

【0035】

【化 16】



上記の反応によって合成可能な式 (I) の化合物および／またはその塩の回収は並行して行うこともでき、その場合にそれは、手動、部分自動または完全自動で行うことが可能である。例えば、反応の実施、後処理または生成物および／または中間体の精製を自動化することが可能である。全体としてそれは、例えば、D. Tiebes in Combinatorial Chemistry – Synthesis, Analysis, Screening (editor Gunther Jung), Wiley 1999, on pages 1 to 34によって記載の手順を意味するものと理解される。

10

【0036】

反応および後処理の並行実施については、多くの市販の装置、例えばBarnstead International, Dubuque, Iowa 52004-0797, USAからのCalpyso反応ブロックまたはRadleys, Shirehill, Saffron Walden, Essex, CB 11 3AZ, Englandからの反応ステーション、またはPerkin Elmer, Waltham, Massachusetts 02451, USAからのMultiPROBE自動化ワークステーションを用いることが可能である。一般式 (I) の化合物およびその塩または製造途中で生じる中間体の並行精製の場合、利用可能な装置には、例えばISCO, Inc., 4700 Superior Street, Lincoln, NE 68504, USAからのクロマトグラフィー装置などがある。

20

【0037】

詳細に挙げた装置は、個々の作業段階を自動化するモジュラー式手順となるが、作業段階間では手動操作を行わなければならない。これは、個々の自動化モジュールを例えばロボットによって運転する部分もしくは完全統合自動化システムを用いることで回避することができる。この種類の自動化システムは、例えばCaliper, Hopkinton, MA 01748, USAから購入することができる。

30

【0038】

単一合成段階または複数の合成段階の実行は、ポリマー担持試薬／捕捉剤樹脂を用いることで支援することができる。技術文献には、多くの実験プロトコルが記載されており、例えばChemFiles, Vol. 4, No. 1, Polymer-Supported Scavengers and Reagents for Solution-Phase Synthesis (Sigma-Aldrich)である。

【0039】

本明細書に記載の方法は別として、一般式 (I) の化合物およびその塩は、固体相担持法によって完全にまたは部分的に製造することができる。これに関しては、その合成または相当する手順に適合させた合成における個々の中間体または全ての中間体を、合成樹脂に結合させる。固体相担持合成法については、例えばBarry A. Bunin in "The Combinatorial Index", Academic Press, 1998 and Combinatorial Chemistry – Synthesis, Analysis, Screening (編者Gunther Jung), Wiley, 1999などの技術文献に詳細に説明されている。固体相担持合成法を使用することで、文献から公知の多くのプロトコルが可能となり、それらもやはり手動でまたは自動的に行うことができる。これらの反応は、Nexus Biosystems, 12140 Community Road, Poway, CA 92064, USAからのマイクロリアクターでのIRORI技術によって行う

40

50

ことができる。

【0040】

固体相または液体相のいずれでも、単一もしくは複数の合成段階の実施を、マイクロ波技術を用いることで支援することができる。技術文献には、多くの実験プロトコールが記載されており、例えば *Microwaves in Organic and Medicinal Chemistry* (編者 C. O. Kappe および A. Stadler), Wiley, 2005 である。

【0041】

本明細書に記載の方法による製造によって、ライブラリと称される物質の収集物の形態で式 (I) の化合物およびその塩が得られる。本発明は、少なくとも 2 種類の式 (I) の化合物およびそれらの塩を含むライブラリも提供するものである。

10

【0042】

式 (I) の本発明の化合物 (および/またはその塩) は、下記において総称して「本発明の化合物」とも称され、広いスペクトラムの経済的に重要な単子葉および双子葉一年生有害植物に対して優れた除草抗力を有する。その有効成分は、防除が困難であり、根茎、根株または他の多年生の器官から苗条を生じる多年生の雑草植物に対しても良好な防除を行う。

【0043】

従って、本発明はまた、望ましくない植物を防除する方法または好ましくは作物植物において植物の成長を調節する方法を提供するものであり、ここで 1 以上の本発明の化合物を、植物 (例えば雑草植物、例えば単子葉または双子葉の雑草または望ましくない作物)、種子 (例えば穀類、種子または塊茎のような栄養繁殖体 (vegetative propagules) または芽が出た苗条部分) または植物が成長する区画 (例えば栽培下の区画) に施用する。本発明の化合物は、例えば播種前 (適切な場合、土壤中に組み込むことによって)、発芽前または発芽後に施用することができる。本発明の化合物によって防除することができる単子葉および双子葉の雑草相のいくつかの代表的なものの具体例は下記の通りであるが、列挙が特定の種類への限定を強いるものではない。

20

【0044】

単子葉有害植物の属: エギロプス属 (*Aegilops*)、カモジグサ属 (*Agropyron*)、コヌカグサ属 (*Agrostis*)、スズメノテッポウ属 (*Alopecurus*)、セイヨウヌカボ属 (*Apera*)、カラスムギ属 (*Avena*)、ニクキビ属 (*Brachiaria*)、スズメノチャヒキ属 (*Bromus*)、クリノイガ属 (*Cenchrus*)、ツユクサ属 (*Commelina*)、ギョウギシバ属 (*Cynodon*)、カヤツリグサ属 (*Cyperus*)、タツノツメガヤ属 (*Dactyloctenium*)、メヒシバ属 (*Digitaria*)、ヒエ属 (*Echinochloa*)、ハリイ属 (*Eleocharis*)、オヒシバ属 (*Eleusine*)、カゼクサ属 (*Eragrostis*)、ナルコビエ属 (*Eriochloa*)、ウシノケグサ属 (*Festuca*)、テンツキ属 (*Fimbristylis*)、アメリカコナギ属 (*Heteranthera*)、チガヤ属 (*Imperata*)、カモノハシ属 (*Ischaemum*)、アゼガヤ属 (*Leptochloa*)、ドクムギ属 (*Lolium*)、ミズアオイ属 (*Monochoria*)、キビ属 (*Panicum*)、スズメノヒエ属 (*Paspalum*)、クサヨシ属 (*Phalaris*)、アワガエリ属 (*Phleum*)、イチゴツナギ属 (*Poa*)、ツノアイアシ属 (*Rottboellia*)、オモダカ属 (*Sagittaria*)、アブラガヤ属 (*Scirpus*)、エノコログサ属 (*Setaria*)、モロコシ属 (*Sorghum*)。

30

40

【0045】

双子葉雑草の属: イチビ属 (*Abutilon*)、ヒユ属 (*Amaranthus*)、ブタクサ属 (*Ambrosia*)、アノダ属 (*Anoda*)、カミツレモドキ属 (*Anthemis*)、アフアネス (*Aphanes*)、ヨモギ属 (*Artemisia*)、アトリプレックス属 (*Atriplex*)、ヒナギク属 (*Bellis*)、センダングサ属 (

50

Bidens)、ナズナ属 (Cassia)、ヒレアザミ属 (Carduus)、ナンバンサイカチ属 (Cassia)、ヤグルマギク属 (Centaurea)、アカザ属 (Chenopodium)、アザミ属 (Cirsium)、セイヨウヒルガオ属 (Convolvulus)、チョウセンアサガオ属 (Datura)、ヌスビトハギ属 (Desmodium)、エメックス (Emex)、エゾスズシロ属 (Erysimum)、トウダイグサ属 (Euphorbia)、チシマオドリコソウ属 (Galeopsis)、コゴメギク属 (Galinsoga)、ヤエムグラ属 (Galium)、フヨウ属 (Hibiscus)、サツマイモ属 (Ipomoea)、ホウキギ属 (Kochia)、オドリコソウ属 (Lamium)、マメグンバイナズナ属 (Lepidium)、アゼナ属 (Lindernia)、シカレギク属 (Matricaria)、ハッカ属 (Mentha)、ヤマアイ属 (Mercurialis)、ムルゴ (Mullugo)、ワスレナグサ属 (Myosotis)、ケシ属 (Papaver)、アサガオ属 (Pharbitis)、オオバコ属 (Plantago)、タデ属 (Polygonum)、スベリヒユ属 (Portulaca)、キンボウゲ属 (Ranunculus)、ダイコン属 (Raphanus)、イヌガラシ属 (Rorippa)、キカシグサ属 (Rotala)、スイバ属 (Rumex)、オカヒジキ属 (Salsola)、キオン属 (Senecio)、ツノクサネム属 (Sesbania)、キンゴジカ属 (Sida)、シロガラシ属 (Sinapis)、ナス属 (Solanum)、ハチジョウナ属 (Sonchus)、ナガボノウルシ属 (Sphenoclea)、ハコベ属 (Stellaria)、タンポポ属 (Taraxacum)、グンバイナズナ属 (Thlaspi)、ジャジクソウ属 (Trifolium)、イラクサ属 (Urtica)、クワガタソウ属 (Veronica)、スミレ属 (Viola)、オナモミ属 (Xanthium)。

【0046】

本発明の化合物が発芽前に土壌表面に施用される場合、雑草実生の発生が完全に防止されるか、雑草はそれらが子葉期に到達するまで成長するが、そこで成長を停止し、最終的に3から4週間経過した後、完全に枯死する。

【0047】

有効成分が植物の緑色部分に発芽後施用される場合、同様に、処置後に成長は停止し、そして有害植物は、施用時の成長段階にとどまるか、または一定期間の後、完全に枯死するために、作物にとって有害である雑草との競合が、非常に早期にかつ持続的になくなる。

【0048】

本発明の化合物は単子葉および双子葉の雑草に対して優れた除草活性を有するが、経済的に重要な作物の作物、例えばラッカセイ属 (Arachis)、フダンソウ属 (Beta)、アブラナ属 (Brassica)、キュウリ属 (Cucumis)、カボチャ属 (Cucurbita)、ヒマワリ属 (Helianthus)、ニンジン属 (Daucus)、ダイズ属 (Glycine)、ワタ属 (Gossypium)、サツマイモ属 (Ipomoea)、アキノノゲシ属 (Lactuca)、アマ属 (Linum)、トマト属 (Lycopersicon)、タバコ属 (Nicotiana)、インゲンマメ属 (Phaseolus)、エンドウ属 (Pisum)、ナス属 (Solanum)、ソラマメ属 (Vicia) の双子葉作物、またはネギ属 (Allium)、アナナス属 (Ananas)、アスパラガス属 (Asparagus)、カラスムギ属 (Avena)、オオムギ属 (Hordeum)、イネ属 (Oryza)、キビ属 (Panicum)、サトウキビ属 (Saccharum)、ライムギ属 (Secale)、モロコシ属 (Sorghum)、ライコムギ属 (Triticale)、コムギ属 (Triticum)、トウモロコシ属 (Zea)、特にトウモロコシ属およびコムギ属の単子葉作物は、個々の本発明の化合物の構造およびその施用量に応じて、あったとしてもわずかの程度しか損傷を受けない。そのため、本化合物は、農業上有用な植物または観賞植物などの植物作物における望ましくない植物成長を選択的に防除する上で非常に適している。

【0049】

10

20

30

40

50

さらに、本発明の化合物は、（それらの特定の構造および適用される施用量に応じて）作物において優れた成長調節性を有する。それは、調節的効果で植物自体の代謝に介入するので、植物成分を制御するために、そして、例えば乾燥および成長阻害を誘発することによる収穫向上に使用することができる。さらに、それは、植物を枯死させることなく望ましくない植物成長を抑制および阻害するのにも適している。植物成長の阻害は、例えばそれによって倒伏を減らすかまたは完全に防止することができることから、多くの単子葉作物および双子葉作物において重要な役割を果たす。

【0050】

また、有効成分は、その除草性および植物成長調節性のため、遺伝子操作された植物の作物または従来突然変異誘発によって改変された植物において有害植物を防除するために使用することもできる。一般に、トランスジェニック植物は、特別な有利な性質において、例えばある種の農薬、特にある種の除草剤に対する抵抗性、植物病害または植物病害を引き起こす生物体、例えばある種の昆虫もしくは微生物、例えば真菌、細菌もしくはウイルスに対する抵抗性を特徴とする。他の特定の性質は、例えば収穫物の量、品質、貯蔵性、組成および具体的な成分に関係する。例えば、デンプン含量が増加したもしくはデンプン品質が変わったトランスジェニック植物または収穫物において異なる脂肪酸組成を有するものが知られている。

【0051】

トランスジェニック作物に関しては、有用植物および観賞植物の、例えばコムギ、オオムギ、ライムギ、カラスムギ、キビ／モロコシ、イネおよびトウモロコシなどの穀物またはサトウダイコン、ワタ、ダイズ、アブラナ、ジャガイモ、トマト、エンドウマメおよび他の野菜の他の作物の経済的に重要なトランスジェニック作物における本発明の化合物の使用が好ましい。好ましくは、本発明の化合物は、除草剤の植物毒性効果に対して抵抗性であるか、組換え手段によって抵抗性とされた有用植物の作物において除草剤として用いることができる。

【0052】

有用植物および観賞植物の経済的に重要なトランスジェニック作物、例えばコムギ、オオムギ、ライムギ、カラスムギ、キビ／モロコシ、イネ、キャッサバおよびトウモロコシのような穀物または他にテンサイ、ワタ、ダイズ、アブラナ、ジャガイモ、トマト、エンドウおよび他の野菜の作物において本発明の化合物またはその塩を使用することが好ましい。好ましくは、除草剤の植物毒性効果に対して抵抗性であるか組換え手段によって抵抗性となった有用植物の作物において除草剤として、本発明の化合物を使用することが可能である。

【0053】

既存の植物と比較して改変された性質を有する新規植物を製造する従来法は、例えば、従来の育種法および突然変異体の生成である。別法として、改変された性質を有する新規植物は、組換え法を用いて形成することができる（例えば、EP-A-0221044、EP-A-0131624参照）。例えば、下記のような多くの記述がなされている。

【0054】

- 植物中で合成されるデンプンを変性させることを目的とした作物の組換え改変（例えばWO 92/11376、WO 92/14827、WO 91/19806）、
- グルホシネート型（例えば、EP-A-0242236、EP-A-242246参照）またはグリホセート型（WO 92/00377）またはスルホニル尿素（EP-A-0257993、US-A-5013659）の特定の除草剤に対して抵抗性であるトランスジェニック作物、
- 植物を特定の有害生物に対して抵抗性とするバチルス・チューリングゲンシス毒素（Bt毒素）を産生する能力を有するトランスジェニック作物（例えばワタ）（EP-A-0142924、EP-A-0193259）、
- 改変された脂肪酸組成を有するトランスジェニック作物（WO 91/13972）

、

10

20

30

40

50

－新規の成分または二次代謝産物で遺伝子操作された作物、例えば耐病性が高められた新規のフィトアレキシン（EPA 309862、EPA0464461）、

－より多い収穫量およびより高いストレス耐性を有する光呼吸が低下した遺伝子組換え植物（EPA 0305398）、

－医薬的または診断的に重要なタンパク質を産生するトランスジェニック作物（「分子ファーミング（molecular pharming）」）、

－より高い収率またはより良好な品質を特徴とするトランスジェニック作物

－例えば前記の新規性質の組み合わせを特徴とするトランスジェニック作物（「遺伝子スタッキング」）。

【0055】

改変された性質を有する新規なトランスジェニック植物を製造するのに用いることができる多くの分子生物学的技術が基本的に知られており、例えばI. Potrykus and G. Spangenberg（編）Gene Transfer to Plants, Springer Lab Manual（1995）、Springer Verlag Berlin, Heidelberg. またはChristou, "Trends in Plant Science" 1（1996）423－431）を参照する。

【0056】

このような組換え操作においては、突然変異誘発またはDNA配列の組換えによる配列改変を可能にする核酸分子を、プラスミド中に導入することができる。標準的な方法を用いて、例えば、塩基交換を行うことができ、配列の一部を除去することができ、または天然もしくは合成配列を付加することができる。DNA断片を互いに連結するために、断片にアダプターまたはリンカーを付加することができる。Sambrook et al., 1989, Molecular Cloning, A Laboratory Manual, 2nd ed., Cold Spring Harbor Laboratory Press, Cold Spring Harbor, NY; または Winnacker "Gene und Klone", VCH Weinheim 2nd edition, 1996を参照する。

【0057】

例えば、遺伝子産物において活性が低下した植物細胞の製造は、少なくとも一つの適切なアンチセンスRNAまたは共抑制効果を達成するためのセンスRNAの発現によって、または具体的には前記の遺伝子産物の転写産物を切断する少なくとも一つの適切に構築されたリボザイムの発現によって達成することができる。

【0058】

これを行うためには、第1に、存在するあらゆる隣接配列を含む遺伝子産物のコード配列全てを含むDNA分子、あるいはコード配列の一部のみを含むDNA分子を使用することができ、その場合に、これらの部分は、細胞にアンチセンス効果をもたらすのに十分長い必要がある。また、遺伝子産物のコード配列と高度に相同性を有するが、完全に同一なわけではないDNA配列を用いることもできる。

【0059】

植物中で核酸分子を発現するとき、合成されたタンパク質は、植物細胞の所望の区画に局在化してもよい。しかしながら、特定の区画での局在化を行うには、例えば、特定の区画での局在化を確保するDNA配列にコード領域を連結させることが可能である。そのような配列は、当業者には公知である（例えば、Braun et al., EMBO J. 11（1992）、3219－3227; Wolter et al., Proc. Natl. Acad. Sci. USA 85（1988）、846－850; Sonnewald et al., Plant J. 1（1991）、95－106参照）。また、核酸分子は、植物細胞の細胞小器官で発現させることもできる。

【0060】

トランスジェニック植物細胞は、植物全体を与える公知の技術によって再生することができる。基本的に、トランスジェニック植物は、あらゆる所望の植物種、すなわち単子葉と双子葉の両方の植物であることもできる。

【0061】

従って、相同性（＝生来の）遺伝子もしくは遺伝子配列の過剰発現、抑制もしくは阻害または非相同性（＝外来の）遺伝子もしくは遺伝子配列の発現によって、性質が変わったトランスジェニック植物を得ることができる。

【0062】

好ましくは、例えばジカンバのような成長調節剤に対してまたは必須の植物酵素、例えばアセト乳酸シンターゼ（ALS）、EPSPシンターゼ、グルタミンスインターゼ（GS）もしくはヒドロキシフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼ（HPPD）を阻害する除草剤に対して、またはスルホニル尿素、グリホセート類、グルホシネート類またはベンゾイルイソオキサゾールおよび類似の有効成分の群からの除草剤、またはこれら活性化合物のいずれかの組み合わせに対して抵抗性であるトランスジェニック作物において、本発明の化合物を使用することができる。

【0063】

本発明による有効成分をトランスジェニック作物に使用するとき、他の作物で認められる雑草に対する効果が生じるだけでなく、特定のトランスジェニック作物における施用に対して特有の効果、例えば防除することができる雑草スペクトルの変更もしくは具体的には拡大、施用に用いることができる施用量の変更、好ましくはトランスジェニック作物が抵抗性である除草剤との良好な併用性（combinability）ならびにトランスジェニック作物の成長および収獲量の影響もある。

【0064】

従って、本発明は、トランスジェニック作物において有害植物を防除するための除草剤としての本発明の化合物の使用を提供する。

【0065】

本発明の化合物は、水和剤、乳剤、噴霧液、粉剤または粒剤の形態で慣用の製剤で施用することができる。従って、本発明は、本発明の化合物を含む除草および植物成長調節組成物をも提供する。

【0066】

本発明の化合物は、生理的および／または物理化学的パラメータが必要な各種形態で製剤することができる。可能な製剤の例としては、水和剤（WP）、水溶剤（SP）、水溶性濃縮物、乳剤（EC）、乳濁液（EW）、例えば水中油および油中水型乳濁液、噴霧液、懸濁液の濃縮物（SC）、油もしくは水に基づく分散液、油剤、カプセル懸濁液（CS）、粉剤（DP）、種子粉衣製品、散布および土壌施用の粒剤、微粒剤の形態の粒剤（GR）、噴霧粒剤、被覆粒剤および吸着粒剤、水分散性粒剤（WG）、水溶性粒剤（SG）、ULV製剤、マイクロカプセルならびにロウなどがある。

【0067】

これらの個々の製剤タイプは基本液に公知であり、例えば、Winnacker-Kuechler, "Chemische Technologie" [Chemical Technology], 第7巻, C. Hanser Verlag Munich, 第4版 1986, Wade van Valkenburg, "Pesticide Formulations", Marcel Dekker, N. Y., 1973; K. Martens, "Spray Drying" Handbook, 第3版 1979, G. Goodwin Ltd. Londonに記載されている。

【0068】

また、不活性材料、界面活性剤、溶媒およびさらなる添加剤のような必要な製剤補助剤も知られており、例えばWatkins, "Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers", 第2版, D

10

20

30

40

50

arland Books, Caldwell N. J.; H. v. Olphen, "Introduction to Clay Colloid Chemistry"; 第2版, J. Wiley & Sons, N. Y.; C. Marsden, "Solvents Guide"; 第2版, Interscience, N. Y. 1963; McCutcheon's "Detergents and Emulsifiers Annual", MC Publ. Corp., Ridgewood N. J.; Sisley and Wood, "Encyclopedia of Surface Active Agents", Chem. Publ. Co. Inc., N. Y. 1964; Schoenfeldt, "Grenzflaechenaktive Aethylenoxidaddukte" [Interface-active ethylene oxide adducts], Wiss. Verlagsgesell., Stuttgart 1976; Winnacker-Kuechler, "Chemische Technologie", 第7巻, C. Hanser Verlag Munich, 第4版 1986.に記載されている。

10

【0069】

これらの製剤に基づいて、例えば最終製剤の形態でまたはタンクミックスとして、例えば殺虫剤、殺ダニ剤、除草剤、殺菌剤などの他の農薬活性物質と、そして薬害軽減剤、肥料および／または成長調節剤との組み合わせ剤を製造することも可能である。好適な薬害軽減剤は、例えばメフェンピルージエチル、シプロスルファミド (cyprosulfamide)、イソキサジフェンエチル、クロキントセトメキシルおよびジクロルミドである。

20

【0070】

水和剤は、水中に均一に分散可能であり、そして有効成分に加えて、希釈剤または不活性物質は別として、イオン型および／またはノニオン型界面活性剤 (湿潤剤、分散剤)、例えばポリオキシエチル化アルキルフェノール、ポリオキシエチル化脂肪族アルコール、ポリオキシエチル化脂肪族アミン、脂肪族アルコールポリグリコールエーテルサルフェート、アルカンスルホン酸エステル、アルキルベンゼンスルホン酸エステル、リグノスルホン酸ナトリウム、2, 2'-ジナフチルメタン-6, 6'-ジスルホン酸ナトリウム、ジブチルナフタレンスルホン酸ナトリウムまたは他にオレオイルメチルタウリン酸ナトリウムを含む製剤である。水和剤を製造するには、除草活性成分を、例えばハンマーミル、ブロワミルおよびエアジェットミルのような慣用の装置中で微粉碎し、そして同時にまたはその後で製剤補助剤と混合する。

30

【0071】

乳剤は、有効成分を有機溶媒、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、キシレンまたは他に比較的高沸点の芳香族もしくは炭化水素または有機溶媒の混合物中に溶解し、1以上のイオン系および／またはノニオン系界面活性剤 (乳化剤) を添加することによって製造される。使用可能な乳化剤の例は、アルキルアリアルスルホン酸カルシウム塩、例えばドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム、またはノニオン系乳化剤、例えば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、脂肪族アルコールポリグリコールエーテル、プロピレンオキサイ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、例えばソルビタン脂肪酸エステルまたはポリオキシエチレンソルビタンエステル、例えばポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステルである。

40

【0072】

粉剤は、微粉碎された固形物質、例えばタルク、自然粘土、例えばカオリン、ベントナイトおよびピロフィライトまたは珪藻土と共に有効成分を粉碎することによって得られる。

【0073】

懸濁濃縮物は、水または油に基づくものであることができる。それは、例えば、市販の

50

ビーズミルによる湿式粉碎によって、適宜に例えば他の製剤タイプの場合にすでに上記で挙げた界面活性剤を添加して製造することができる。

【0074】

乳濁液、例えば水中油型乳濁液（EW）は、例えば水系有機溶媒および適宜に例えば他の製剤タイプについて前記で挙げた界面活性剤を用いて攪拌機、コロイドミルおよび／またはスタティックミキサーによって製造することができる。

【0075】

粒剤は、吸着性の顆粒状不活性材料上に有効成分を噴霧することによって、または接着剤、例えばポリビニルアルコール、ポリアクリル酸ナトリウムもしくは他に鉱油を用いて、担体物質、例えば砂土、カオリナイトもしくは顆粒状不活性材料の表面に有効成分濃縮液を塗布することによって製造することができる。また、好適な有効成分を、所望の場合に肥料との混合物として、肥料顆粒の製造に慣用のやり方で造粒することもできる。

【0076】

顆粒水和剤は、一般に噴霧乾燥、流動床造粒、パン造粒、高速攪拌機による混合、および固形不活性材料なしの押出といったような慣用の方法によって製造される。

【0077】

平板（pan）粒剤、流動床粒剤、押出粒剤および噴霧粒剤を製造するためには、例えば " Spray-Drying Handbook " 第3版 1979, G. Goodwin Ltd., London; J. E. Browning, " Agglomeration ", Chemical and Engineering 1967, 第147頁以下; " Perry's Chemical Engineer's Handbook ", 第5版, McGraw-Hill, New York 1973, 第8-57頁における方法を参照する。

【0078】

作物保護組成物の製剤に関するさらなる詳細については、例えば、G. C. Klingman, " Weed Control as a Science ", John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, 第81-96頁およびJ. D. Freyer, S. A. Evans, " Weed Control Handbook ", 第5版, Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1968, 第101-103頁を参照する。

【0079】

農薬製剤は、一般に0.1から99質量%、特別には0.1から95質量%の本発明の化合物を含む。水和剤では、有効成分の濃度は、例えば約10から90質量%であり; 100質量%までの残りは、慣用の製剤成分からなる。乳剤では、有効成分の濃度は、約1から90質量%、好ましくは5から80質量%であることができる。粉剤タイプの製剤は、1から30質量%の有効成分、好ましくは通常5から20質量%の有効成分を含み; 噴霧液は、約0.05から80質量%、好ましくは2から50質量%の有効成分を含む。顆粒水和剤では、有効成分含量は、活性化合物が固体で存在するか液体で存在するか、そして造粒助剤、充填剤などが使用されるかによって部分的に決まる。水中に分散可能な顆粒剤では、有効成分の含量は、例えば、1から95質量%、好ましくは10から80質量%である。

【0080】

さらに、記載された有効成分製剤は、それぞれの慣用の粘着付与剤、湿潤剤、分散剤、乳化剤、浸透剤、保存剤、不凍剤および溶媒、充填剤、担体および色素、消泡剤、蒸発抑制剤ならびにpHおよび粘度に影響する薬剤を含んでいても良い。

【0081】

これらの製剤に基づいて、例えば最終製剤の形態でまたはタンクミックスとして、例えば殺虫剤、殺ダニ剤、除草剤、殺菌剤などの他の農薬活性物質と、そして薬害軽減剤、肥料および／または成長調節剤との組み合わせ剤を製造することも可能である。

【0082】

混合物製剤またはタンクミックスでの本発明の化合物についての使用可能な組み合わせ相手は、例えば、アセト乳酸シンターゼ、アセチル-CoAカルボキシラーゼ、セルロースシンターゼ、エノールピルビルシキミ酸-3-リン酸シンターゼ、グルタミンシンターゼ、p-ヒドロキシフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼ、フィトエンデサチュラーゼ、光化学系I (photosystem I)、光化学系II (photosystem II)、プロトポルフィリノーゲンオキシダーゼの阻害に基づく既知の有効成分であり、例えば、Weed Research 26 (1986) 441-445 または “The Pesticide Manual”, 第15版, The British Crop Protection Council and the Royal Soc. of Chemistry, 2009およびその中に引用された文献に記載されている。本発明の化合物と組み合わせることができる公知の除草剤または植物成長調節剤の例には、以下の有効成分（その化合物は、国際標準化機構 (ISO) による「一般名称」によってまたは化学名もしくはコード番号によって明記した）などがあり、そして、常に、酸、塩、エステルならびに異性体、例えば立体異性体および光学異性体のような全ての使用形態を包含する。このリストでは、一つの、そして場合により複数の使用形態を例として挙げている。

【0083】

アセトクロル、アシベンゾラル、アシベンゾラル-S-メチル、アシフルオルフェン、アシフルオルフェン-ナトリウム、アクロニフェン、アラクロール、アリドクロール、アロキシジム、アロキシジム-ナトリウム、アメトリン、アミカルバゾン、アミドクロル、アミドスルフロン、アミノシクロピラクロル、アミノピラリド、アミトロール、スルファミン酸アンモニウム、アンシミドール、アニロホス、アスラム、アトラジン、アザフェニジン、アジムスルフロン、アジプロトリン、ベフルブタミド、ベナゾリン、ベナゾリン-エチル、ベンカルバゾン、ベンフルラリン、ベンフレセート、ベンスリド、ベンスルフロン、ベンスルフロン-メチル、ベントゾン、ベンズフェンジゾン、ベンゾビシクロン、ベンゾフェナップ、ベンゾフルオル、ベンゾイルプロップ、ビシクロピロン、ビフェノックス、ピラナホス、ピラナホス-ナトリウム、ビスピリバック、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、ブロムロン、ブミナホス、ブソキシノン (busoxinone)、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、カルベタミド、カルフェントラゾン、カルフェントラゾン-エチル、クロメトキシフェン、クロランベン、クロラジホップ、クロラジホップ-ブチル、クロルブロムロン、クロルブファミン、クロルフェナク、クロルフェナク-ナトリウム、クロルフェンプロップ、クロルフルレノール、クロルフルレノール-メチル、クロリダゾン、クロリムロン、クロリムロン-エチル、クロルメコート-クロリド、クロルニトルフェン、クロロフタリム (chlorophthalamine)、クロルタール-ジメチル、クロロトルロン、クロルスルフロン、シニドン、シニドン-エチル、シンメチリン、シノスルフロン、クレトジム、クロジナホップ、クロジナホップ-プロパルギル、クロフェンセット、クロマゾン、クロメプロップ、クロプロップ、クロピラリド、クロランスラム、クロランスラム-メチル、クミルロン、シアナミド、シアナジン、シクラニリド、シクロエート、シクロスルファミン、シクロキシジム、シクルロン、シハロホップ、シハロホップ-ブチル、シベルコート、シプラジン、シプラゾール、2, 4-D、2, 4-DB、ダイムロン (daimuron) / ダイムロン (dymron)、ダラボン、ダミノジド、ダゾメット、n-デカノール、デスメジファミン、デスメトリン、デトシルピラゾレート (DTP)、ダイアレート (diallate)、ジカンバ、ジクロベニル、ジクロルプロップ、ジクロルプロップ-P、ジクロホップ、ジクロホップ-メチル、ジクロホップ-P-メチル、ジクロスラム、ジエタチル、ジエタチル-エチル、ジフェノクスロン、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、ジフルフェンゾピル-ナトリウム、ジメフロム、ジケグラック-ナトリウム、ジメピベレート、ジメタクロール、ジメタメトリン、ジメテナミド

、ジメテナミドーP、ジメチピン、ジメトラスルフロソ、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、ジクワットジプロミド、ジチオピ
 ル、ジウロン、DNOC、エグリナジンーエチル、エンドタール、EPTC、エスプロカ
 ルブ、エタルフルラリン、エタメツルフロソ、エタメツルフロソーメチル、エテホン、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、エトキシフェンーエチル、
 エトキシスルフロソ、エトベンザニド、F-5331、すなわちN-[2-クロロ-4-
 フルオロ-5-[4-(3-フルオロプロピル)-4, 5-ジヒドロ-5-オキソ-1H
 -テトラゾール-1-イル]フェニル]エタンスルホンアミド、F-7967、すなわち
 3-[7-クロロ-5-フルオロ-2-(トリフルオロメチル)-1H-ベンズイミダゾ
 ール-4-イル]-1-メチル-6-(トリフルオロメチル)ピリミジン-2, 4(1H
 、3H)-ジオン、フェノプロップ、フェノキサプロップ、フェノキサプロップーP、フェ
 ノキサプロップーエチル、フェノキサプロップーPーエチル、フェノキサスルホン、フェ
 ントラザミド、フェヌロン、フラムプロップ、フラムプロップーMーイソプロピル、フラ
 ムプロップーMーメチル、フラザスルフロソ、フロラスラム、フルアジホップ、フルア
 ジホップーP、フルアジホップーブチル、フルアジホップーPーブチル、フルアゾレート
 (fluaolate)、フルカルバゾン、フルカルバゾンーナトリウム、フルセトス
 ルフロソ、フルクロラリン、フルフェナセット(チフルアミド(thiafluamide))、フルフェンピル、フルフェンピルーエチル、フルメトラリン、フルメツラム、フル
 ミクロラック、フルミクロラックーベンチル、フルミオキサジン、フルミプロピン、フル
 オメツロン、フルオロジフェン、フルオログリコフェン、フルオログリコフェンーエチ
 ル、フルボキサム、フルプロバシル、フルプロバネート、フルピルスルフロソ、フルピル
 スルフロソーメチルーナトリウム、フルレノール、フルレノールーブチル、フルリドン、
 フルロクロリドン、フルロキシピル、フルロキシピルーメブチル、フルルプリミドール、
 フルルタモン(flurtamone)、フルチアセット、フルチアセットーメチル、フル
 チアミド(fluthiamide)、ホメサフェン、ホラムスルフロソ、ホルクロル
 フェニユロン、ホサミン、フリルオキシフェン(furyloxyfen)、ジベレリン
 酸、グルホシネート、グルホシネートーアンモニウム、グルホシネートーP、グルホシネ
 ートーPーアンモニウム、グルホシネートーPーナトリウム、グリホセート、グリホセー
 トーイソプロピルアンモニウム、H-9201、すなわちO-(2, 4-ジメチル-6-
 ニトロフェニル)Oーエチルーイソプロピルホスホルアミドチオエート、ハロサフェン(
 halosafen)、ハロスルフロソ、ハロスルフロソーメチル、ハロキシホップ、ハ
 ロキシホップーP、ハロキシホップーエトキシエチル、ハロキシホップーPーエトキシエ
 チル、ハロキシホップーメチル、ハロキシホップーPーメチル、ヘキサジノン、HW-0
 2、すなわち(2, 4-ジクロロフェノキシ)酢酸1-(ジメトキシホスホリル)エチル
 、イマザメタベンズ、イマザメタベンズーメチル、イマザモックス、イマザモックスーア
 ンモニウム、イマザピック、イマザピル、イマザピルーイソプロピルアンモニウム、イマ
 ザキン、イマザキンーアンモニウム、イマゼタピル、イマゼタピルーアンモニウム、イマ
 ザスルフロソ、イナベンフィド、インダノファン、インダジフラム、インドール酢酸(IAA)、
 4-インドール-3-イル酪酸(IBA)、ヨードスルフロソ、ヨードスルフロ
 ソーメチルーナトリウム、イオキシニル、イブフェンカルバゾン、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、イソキサクロトール、イソキ
 サフルトール、イソキサピリホップ、KUH-043、すなわち3-({[5-(ジフル
 オロメチル)-1-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-4-イル
]メチル}スルホニル)-5, 5-ジメチル-4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール
 、カルブチレート、ケトスピラドックス(ketospiradox)、ラクトフェン、
 レナシル、リニユロン、マレイン酸ヒドラジド、MCPA、MCPB、MCPBーメチル
 、ーエチルおよびーナトリウム、メコプロップ、メコプロップーナトリウム、メコプロッ
 プーブトチル、メコプロップーPーブトチル、メコプロップーPージメチルアンモニウム
 、メコプロップーPー2-エチルヘキシル、メコプロップーPーカリウム、メフェナセッ
 ト、メフルイジド、メピコートークロリド、メソスルフロソ、メソスルフロソーメチル、

10

20

30

40

50

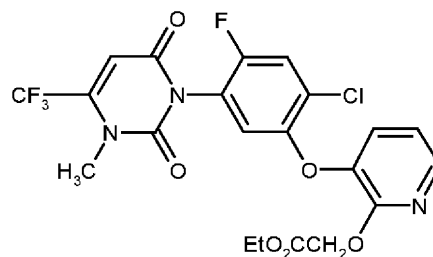
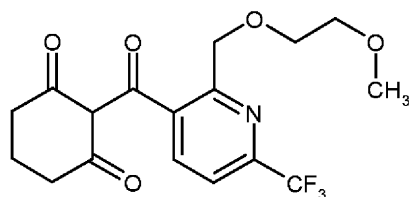
メソトリオン、メタベンズチアズロン、メタム、メタミホップ (metamifop)、メタミトロン、メタザクロール、メタザスルフロソ (metazasulfuron)、メタゾール、メチオピルスルフロソ (methiopyr sulfuron)、メチオゾリン、メトキシフェノソ、メチルダイムロン、1-メチルシクロプロペン、イソチオシアソ酸メチル、メトベンズロン、メトブロムロン、メトラクロール、S-メトラクロール、メトスラム、メトクスロン、メトリブジン、メツルフロソ、メツルフロソ-メチル、モリネート、モナリド、モノカルバミド、モノカルバミド二水素硫酸塩、モノリニュロン、モノスルフロソ、モノスルフロソ-エステル、モニュロン、MT128、すなわち 6-クロロ-N-[(2E)-3-クロロプロプ-2-エン-1-イル]-5-メチル-N-フェニルピリダジン-3-アミン、MT-5950、すなわち N-[3-クロロ-4-(1-メチルエチル)フェニル]-2-メチルペンタンアミド、NGGC-011、ナプロアニリド、ナプロバミド、ナブタラム、NC-310、すなわち 4-(2,4-ジクロロベンゾイル)-1-メチル-5-ベンジルオキシピラゾール、ネブロン、ニコスルフロソ、ニピラクロフェン、ニトラリン、ニトロフェン、ニトロフェノラトナトリウム (nitrophenolate sodium) (異性体混合物)、ニトロフルオルフェン、ノナン酸、ノルフルラゾン、オルベンカルブ、オルソスルファミロン、オリザリン、オキサジアルギル、オキサジアゾン、オキサスルフロソ、オキサジクロメフォン、オキシフルオルフェン、パクロブトラゾール、パラコート、パラコートジクロリド、ペラルゴン酸 (ノナン酸)、ベンジメタリン、ペンドラリン (pendralin)、ペノキススラム、ペンタノクロル、ペントキサゾン、ペルフルイドン、ペトキサミド、フェニソファミ、フェンメジファミ、フェンメジファミ-エチル、ピクロラム、ピコリナフェン、ピノキサデン、ピペロホス、ピリフェノップ、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、プリミスルフロソ-メチル、プロベナゾール、プロフルアゾール (proflumazone)、プロシアジン、プロジアミン、プリフルラリン (prifluralin)、プロホキシジム (profosydin)、プロヘキサジオソ、プロヘキサジオソ-カルシウム、プロヒドロジャスモン (prohydrojasmon)、プロメトン、プロメトリン、プロパクロル、プロパニル、プロパキサホップ、プロパジン、プロファミ、プロピソクロール、プロボキシカルバゾン、プロボキシカルバゾン-ナトリウム、プロピリスルフロソ、プロピザミド、プロスルファミリン、プロスルホカルブ、プロスルフロソ、プリナクロール、ピラクロニル、ピラフルフェン、ピラフルフェン-エチル、ピラスルホトール、ピラゾリネート (ピラゾレート)、ピラゾスルフロソ、ピラゾスルフロソ-エチル、ピラゾキシフェン、ピリバムベンズ (pyribambenz)、ピリバムベンズ-イソプロピル、ピリバムベンズ-プロピル、ピリベンゾキシム、ピリブチカルブ、ピリダフォル (pyridafol)、ピリデート、ピリフタリド、ピリミノバック (pyriminobac)、ピリミノバック-メチル、ピリミスルファミン、ピリチオバック、ピリチオバック-ナトリウム、ピロキサスルホン (pyroxasulfone)、ピロキシスラム (pyroxsulam)、キンクロラック、キンメラック、キノクラミン、キサロホップ、キサロホップ-エチル、キサロホップ-P、キサロホップ-P-エチル、キサロホップ-P-テフリル、リムスルフロソ、サフルフェナシル、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、すなわち (2R)-2-({7-[2-クロロ-4-(トリフルオロメチル)フェノキシ]-2-ナフチル}オキシ)プロパン酸メチル、スルコトリオン、スルファミレート (CDEC)、スルフェントラゾン、スルホメツロン、スルホメツロン-メチル、スルホセート (グリホセート-トリメシウム)、スルホスルフロソ、SYN-523、SYP-249、すなわち 1-エトキシ-3-メチル-1-オキシプロ-3-エン-2-イル-5-[2-クロロ-4-(トリフルオロメチル)フェノキシ]-2-ニトロベンゾエート、SYP-300、すなわち 1- [7-フルオロ-3-オキシ-4-(プロプ-2-イン-1-イル)-3,4-ジヒドロ-2H-1,4-ベンゾオキサジン-6-イル]-3-プロピル-2-チオキソイミダゾリジン-4,5-ジオソ、テブタム、テブチウロン、テクナゼン、テフリルトリオン、

テンボトリオン、テプラロキシジム、テルバシル、テルブカルブ、テルブクロル、テルブメトン、テルブチラジン、テルブトリン (terbutryne)、テニクロール、チアフルアミド (thiafluamide)、チアザフルロン、チアゾピル、チジアジミン、チジアズロン (thidiazuron)、チエンカルバゾン、チエンカルバゾンメチル、チフェンスルフロン、チフェンスルフロンメチル、チオベンカルブ、チオカルバジル、トプラメゾン、トラルコキシジム、トリアファモン (triafamone)、トリアラート、トリアスルフロン、トリアジフラム (triaziflam)、トリアゾフェナミド、トリベヌロン、トリベヌロンメチル、トリクロロ酢酸 (TCA)、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ン、トリフロキシスルフロンナトリウム、トリフルラリン、トリフルスルフロン、トリフルスルフロンメチル、トリメツロン、トリネキサパック、トリネキサパッケエチル、トリトスルフロン (tritofluron)、チトデフ、ユニコナゾール、ユニコナゾールP、ベルノレート、ZJ-0862、すなわち3,4-ジクロロ-N-{2-[(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)オキシ]ベンジル}アニリンおよび以下の化合物。

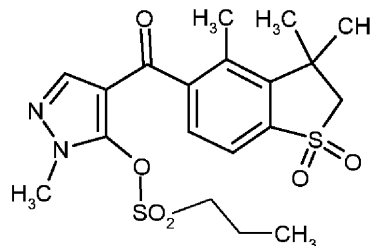
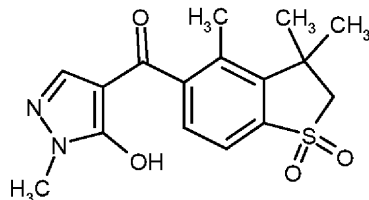
10

【0084】

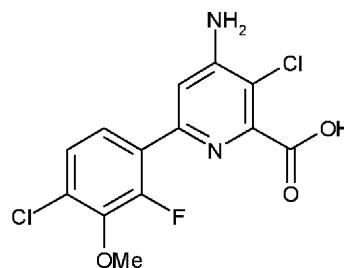
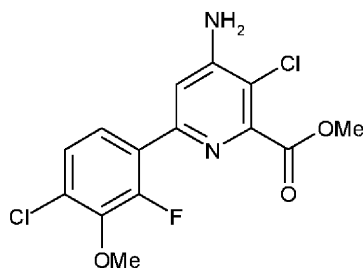
【化17】



20



30



40

施用に関しては、商業的形態での製剤は、適切な場合、例えば水和剤、乳剤、分散剤および水分散性粒剤の場合には一般的な方法で水で希釈する。ダスト剤型製剤、土壌処理用粒剤または散布用粒剤および噴霧溶液の形態での製剤は通常、施用前に他の不活性物質でさらに希釈することはない。

【0085】

式(I)の化合物の必要な施用量は、温度、湿度および使用される除草剤の種類などの外部条件に応じて変動する。それは広い範囲内で変動し得るものであり、例えば0.001から1.0kg/ha以上の活性物質であるが、それは好ましくは0.005から750g/haである。

50

【0086】

下記の実施例は本発明を説明するものである。

【0087】

化学実施例

1. 4-クロロ-3-メトキシ-N-(4-メチル-1, 2, 5-オキサジアゾール-3-イル)-2, 3-ジヒドロ-1-ベンゾチオフェン-5-カルボキサミド1, 1-ジオキシドの合成 (表の実施例番号1928)

4-クロロ-3-メトキシ-2, 3-ジヒドロ-1-ベンゾチオフェン-5-カルボン酸1, 1-ジオキシド1.00g (3.14mmol) および4-メチル-1, 2, 5-オキサジアゾール-3-イル-アミン0.33g (3.15mmol) を室温で (RT) 10
、CH₂Cl₂ 35mL に溶かし、2, 4, 6-トリプロピル-1, 3, 5, 2, 4, 6-トリオキサトリホスフィナン2, 4, 6-トリオキサイド3.02g (4.74mmol) (50% THF 中溶液) を加え、混合物をRTで1時間攪拌した。次に、トリエチルアミン2.18mL (15.64mmol) および4-ジメチルアミノピリジン (DMA P) 75mg (0.61mmol) を加え、混合物全体をRTで16時間攪拌した。これを次に水で洗浄し、6N塩酸で2回洗浄し、有機相をNa₂SO₄で脱水し、シリカゲル層での吸引濾過を行い、1:2ヘプタン/酢酸エチルで洗浄し、濃縮した。収量708mg (63%)。

【0088】

¹H NMR (CDCl₃) : δ = 2.44 (s, 3H)、3.53 (s, 3H)、3.57 (dd, 1H)、3.71 (d, 1H)、5.15 (d, 1H)、7.55 (d, 1H)、7.74 (d, 1H)、9.40 (s, 1H)。

【0089】

2. 4-クロロ-N-(1-メチル-1H-1, 2, 4-トリアゾール-5-イル)-2, 3-ジヒドロ-1-ベンゾチオフェン-5-カルボキサミド1, 1-ジオキシドの合成 (表の実施例番号1545)

4-クロロ-2, 3-ジヒドロ-1-ベンゾチオフェン-5-カルボン酸1, 1-ジオキシド0.80g (3.24mmol)、ジ(1-メチル-1H-1, 2, 4-トリアゾール-5-アミン)サルフェート0.72g (2.43mmol) およびDMA P 20mg (0.164mmol) を最初にピリジン5mLに入れ、塩化チオニル0.65g (5.35mmol) を加え、混合物を70℃で1時間攪拌した。次に、水0.5mLを加え、混合物をさらに30分間攪拌し、飽和KHSO₄溶液で酸性とし、酢酸エチルで3回抽出した (各100mL)。合わせた有機相を飽和NaHCO₃溶液で洗浄し、Na₂SO₄で脱水し、濃縮した。残留物をカラムクロマトグラフィー (シリカゲル、ヘプタン/酢酸エチル) によって精製した。収量642mg (61%)。

【0090】

¹H NMR (DMSO-d₆) : δ = 3.40 (t, 2H)、3.74 (t, 2H)、3.79 (s, 3H)、7.89 (br, 3H)、11.39 (s, 1H)。

【0091】

3. N-(1-エチル-1H-テトラゾール-5-イル)-4, 4, 5, 8-テトラメチル-3, 4-ジヒドロ-2H-チオクロメン-6-カルボキサミド1, 1-ジオキシドの合成 (表の実施例番号189)

4, 4, 5, 8-テトラメチル-3, 4-ジヒドロ-2H-チオクロメン-6-カルボン酸1, 1-ジオキシド1.00g (3.54mmol)、1-エチル-5-アミノテトラゾール0.63g (5.32mmol) およびDMA P 23mg (0.188mmol) を最初にピリジン7mLに入れ、塩化チオニル0.71g (5.86mmol) を加え、混合物を70℃で1時間攪拌した。次に、水0.5mLを加え、混合物をさらに30分間攪拌し、飽和KHSO₄溶液で酸性とし、酢酸エチルで3回抽出した (各100mL)。合わせた有機相を飽和NaHCO₃溶液で洗浄し、Na₂SO₄で脱水し、濃縮した。残留物をカラムクロマトグラフィー (シリカゲル、ヘプタン/酢酸エチル) によって精製 50

した。収量 492 mg (37%)。

【0092】

^1H NMR (CDCl_3) : $\delta = 1.56$ (s, 6H)、 1.64 (t, 3H)、 2.36 (dd, 2H)、 2.65 (s, 3H)、 2.77 (s, 3H)、 3.43 (dd, 2H)、 4.46 (q, 2H)、 7.37 (s, 3H)、 10.16 (s, 1H)。

【0093】

下記の表で列記した実施例は、上記の方法と同様にして製造したか、上記の方法と同様にして得ることができる。下記の表に挙げた化合物は非常に特に好ましいものである。

【0094】

使用される略称は下記の意味を有する。

10

【0095】

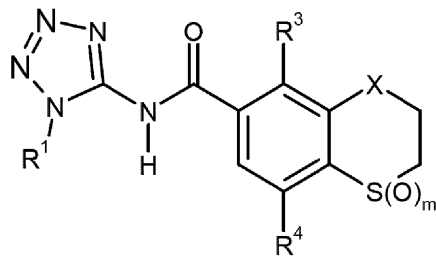
Et = エチル、Me = メチル、n-Pr = n-プロピル、i-Pr = イソプロピル、c-Pr = シクロプロピル、Ph = フェニル。

【0096】

表 1 : Q が Q1 であり、Y が $\text{S}(\text{O})_m$ であり、 R^5 が水素であり、n が 2 である一般式 (I) の本発明の化合物

【0097】

【化 18】



20

【0098】

【表 1】

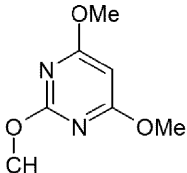
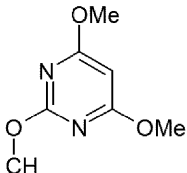
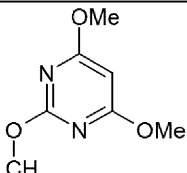
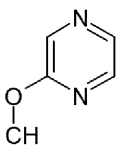
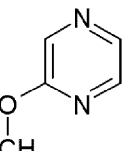
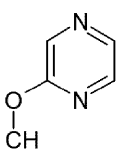
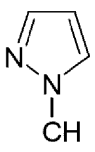
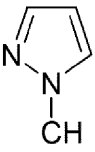
番号	R ¹	R ³	R ⁴	m	X	¹ H NMR
1.	Me	Me	Me	0	CH ₂	
2.	Me	Me	Me	1	CH ₂	
3.	Me	Me	Me	2	CH ₂	
4.	Me	Me	Me	0	CHMe	
5.	Me	Me	Me	1	CHMe	
6.	Me	Me	Me	2	CHMe	
7.	Me	Me	Me	0	C(CH ₃) ₂	CDCl ₃ , 400 MHz: 1.49 (s,6H), 2.04 (dd,2H), 2.28 (s,3H), 2.62 (s,3H), 2.98 (dd,2H), 4.10 (s,3H), 7.22 (s,1H), 8.81 (s,1H)
8.	Me	Me	Me	1	C(CH ₃) ₂	
9.	Me	Me	Me	2	C(CH ₃) ₂	CDCl ₃ , 400 MHz: 1.55 (s,6H), 2.38 (dd,2H), 2.64 (s,3H), 2.81 (s,3H), 3.43 (dd,2H), 4.10 (s,3H), 7.33 (s,1H), 8.87 (s,1H)
10.	Me	Me	Me	0	C(OC ₂ H ₄ O)	
11.	Me	Me	Me	1	C(OC ₂ H ₄ O)	
12.	Me	Me	Me	2	C(OC ₂ H ₄ O)	
13.	Me	Me	Me	0	C(SC ₂ H ₄ S)	
14.	Me	Me	Me	1	C(SC ₂ H ₄ S)	
15.	Me	Me	Me	2	C(SC ₂ H ₄ S)	
16.	Me	Me	Me	0	CHOMe	
17.	Me	Me	Me	1	CHOMe	
18.	Me	Me	Me	2	CHOMe	
19.	Me	Me	Me	0	CHOEt	
20.	Me	Me	Me	1	CHOEt	
21.	Me	Me	Me	2	CHOEt	
22.	Me	Me	Me	0	CHOiPr	
23.	Me	Me	Me	1	CHOiPr	
24.	Me	Me	Me	2	CHOiPr	
25.	Me	Me	Me	0	CHOCH ₂ cPr	
26.	Me	Me	Me	1	CHOCH ₂ cPr	
27.	Me	Me	Me	2	CHOCH ₂ cPr	
28.	Me	Me	Me	0	CHOC ₂ H ₄ OMe	
29.	Me	Me	Me	1	CHOC ₂ H ₄ OMe	
30.	Me	Me	Me	2	CHOC ₂ H ₄ OMe	
31.	Me	Me	Me	0	CHOCH ₂ CCH	
32.	Me	Me	Me	1	CHOCH ₂ CCH	
33.	Me	Me	Me	2	CHOCH ₂ CCH	
34.	Me	Me	Me	0	CHOCH ₂ CH=CH ₂	
35.	Me	Me	Me	1	CHOCH ₂ CH=CH ₂	

10

20

30

40

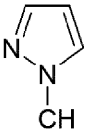
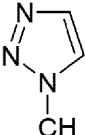
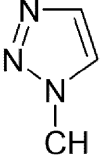
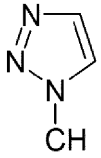
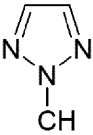
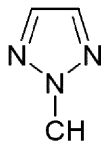
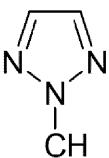
番号	R ¹	R ³	R ⁴	m	X	¹ H NMR
36.	Me	Me	Me	2	CHOCH ₂ CH=CH ₂	
37.	Me	Me	Me	0		
38.	Me	Me	Me	1		
39.	Me	Me	Me	2		
40.	Me	Me	Me	0		CDCl ₃ , 400 MHz: 8.28-8.25 (m,2H), 8.19 (m,1H), 7.62 (s,1H), 6.52 (m,1H), 4.13 (s,3H), 3.81 (m,1H), 3.30 (m,1H), 2.92-2.74 (m,2H), 2.80 (s,3H), 2.32 (s,3H)
41.	Me	Me	Me	1		
42.	Me	Me	Me	2		
43.	Me	Me	Me	0		
44.	Me	Me	Me	1		

10

20

30

40

番号	R ¹	R ³	R ⁴	m	X	¹ H NMR
45.	Me	Me	Me	2		
46.	Me	Me	Me	0		
47.	Me	Me	Me	1		
48.	Me	Me	Me	2		
49.	Me	Me	Me	0		
50.	Me	Me	Me	1		
51.	Me	Me	Me	2		
52.	Me	Me	Me	0	CHOC ₂ H ₄ F	
53.	Me	Me	Me	1	CHOC ₂ H ₄ F	
54.	Me	Me	Me	2	CHOC ₂ H ₄ F	
55.	Me	Me	Me	0	C=NOMe	
56.	Me	Me	Me	1	C=NOMe	
57.	Me	Me	Me	2	C=NOMe	
58.	Me	Me	Me	0	C=NOCH ₂ CCH	

10

20

30

40

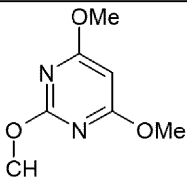
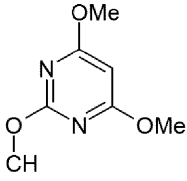
番号	R ¹	R ³	R ⁴	m	X	1H NMR
59.	Me	Me	Me	1	C=NOCH ₂ CCH	
60.	Me	Me	Me	2	C=NOCH ₂ CCH	
61.	Me	Me	Me	0	C=NOCH ₂ CH=CH ₂	
62.	Me	Me	Me	1	C=NOCH ₂ CH=CH ₂	
63.	Me	Me	Me	2	C=NOCH ₂ CH=CH ₂	
64.	Me	Me	Me	0	C=O	
65.	Me	Me	Me	1	C=O	
66.	Me	Me	Me	2	C=O	
67.	Me	Me	Me	0	C=S	
68.	Me	Me	Me	1	C=S	
69.	Me	Me	Me	2	C=S	
70.	Me	Me	Me	0	C=S	
71.	Me	Me	Me	1	C=S	
72.	Me	Me	Me	2	C=S	
73.	Me	Me	Me	0	C=N-N(CH ₃) ₂	
74.	Me	Me	Me	1	C=N-N(CH ₃) ₂	
75.	Me	Me	Me	2	C=N-N(CH ₃) ₂	
76.	Me	Me	Me	0	O	
77.	Me	Me	Me	1	O	
78.	Me	Me	Me	2	O	
79.	Me	Me	Me	0	S	
80.	Me	Me	Me	1	S	
81.	Me	Me	Me	2	S	
82.	Me	Me	Me	0	SO	
83.	Me	Me	Me	1	SO	
84.	Me	Me	Me	2	SO	
85.	Me	Me	Me	0	SO ₂	
86.	Me	Me	Me	1	SO ₂	
87.	Me	Me	Me	2	SO ₂	
88.	Me	Me	Me	0	NMe	
89.	Me	Me	Me	1	NMe	
90.	Me	Me	Me	2	NMe	
91.	Me	Me	H	0	CH ₂	
92.	Me	Me	H	1	CH ₂	
93.	Me	Me	H	2	CH ₂	
94.	Me	Me	H	0	CHMe	
95.	Me	Me	H	1	CHMe	
96.	Me	Me	H	2	CHMe	
97.	Me	Me	H	0	C(CH ₃) ₂	

10

20

30

40

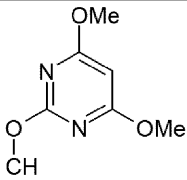
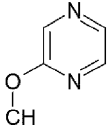
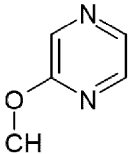
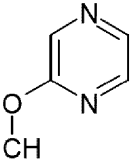
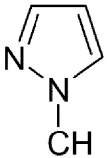
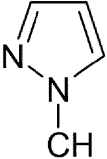
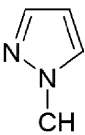
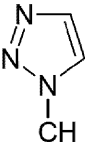
番号	R ¹	R ³	R ⁴	m	X	¹ H NMR
98.	Me	Me	H	1	C(CH ₃) ₂	
99.	Me	Me	H	2	C(CH ₃) ₂	
100.	Me	Me	H	0	C(OC ₂ H ₄ O)	
101.	Me	Me	H	1	C(OC ₂ H ₄ O)	
102.	Me	Me	H	2	C(OC ₂ H ₄ O)	
103.	Me	Me	H	0	C(SC ₂ H ₄ S)	
104.	Me	Me	H	1	C(SC ₂ H ₄ S)	
105.	Me	Me	H	2	C(SC ₂ H ₄ S)	
106.	Me	Me	H	0	CHOMe	
107.	Me	Me	H	1	CHOMe	
108.	Me	Me	H	2	CHOMe	
109.	Me	Me	H	0	CHOEt	
110.	Me	Me	H	1	CHOEt	
111.	Me	Me	H	2	CHOEt	
112.	Me	Me	H	0	CHOiPr	
113.	Me	Me	H	1	CHOiPr	
114.	Me	Me	H	2	CHOiPr	
115.	Me	Me	H	0	CHOCH ₂ cPr	
116.	Me	Me	H	1	CHOCH ₂ cPr	
117.	Me	Me	H	2	CHOCH ₂ cPr	
118.	Me	Me	H	0	CHOC ₂ H ₄ OMe	
119.	Me	Me	H	1	CHOC ₂ H ₄ OMe	
120.	Me	Me	H	2	CHOC ₂ H ₄ OMe	
121.	Me	Me	H	0	CHOCH ₂ CCH	
122.	Me	Me	H	1	CHOCH ₂ CCH	
123.	Me	Me	H	2	CHOCH ₂ CCH	
124.	Me	Me	H	0	CHOCH ₂ CH=CH ₂	
125.	Me	Me	H	1	CHOCH ₂ CH=CH ₂	
126.	Me	Me	H	2	CHOCH ₂ CH=CH ₂	
127.	Me	Me	H	0		
128.	Me	Me	H	1		

10

20

30

40

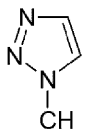
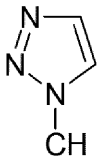
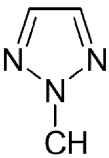
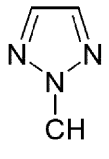
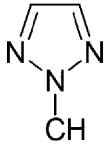
番号	R ¹	R ³	R ⁴	m	X	¹ H NMR
129.	Me	Me	H	2		
130.	Me	Me	H	0		
131.	Me	Me	H	1		
132.	Me	Me	H	2		
133.	Me	Me	H	0		
134.	Me	Me	H	1		
135.	Me	Me	H	2		
136.	Me	Me	H	0		

10

20

30

40

番号	R ¹	R ³	R ⁴	m	X	¹ H NMR
137.	Me	Me	H	1		
138.	Me	Me	H	2		
139.	Me	Me	H	0		
140.	Me	Me	H	1		
141.	Me	Me	H	2		
142.	Me	Me	H	0	CHOC ₂ H ₄ F	
143.	Me	Me	H	1	CHOC ₂ H ₄ F	
144.	Me	Me	H	2	CHOC ₂ H ₄ F	
145.	Me	Me	H	0	C=NOMe	
146.	Me	Me	H	1	C=NOMe	
147.	Me	Me	H	2	C=NOMe	
148.	Me	Me	H	0	C=NOCH ₂ CCH	
149.	Me	Me	H	1	C=NOCH ₂ CCH	
150.	Me	Me	H	2	C=NOCH ₂ CCH	
151.	Me	Me	H	0	C=NOCH ₂ CH=CH ₂	
152.	Me	Me	H	1	C=NOCH ₂ CH=CH ₂	
153.	Me	Me	H	2	C=NOCH ₂ CH=CH ₂	
154.	Me	Me	H	0	C=O	
155.	Me	Me	H	1	C=O	
156.	Me	Me	H	2	C=O	
157.	Me	Me	H	0	C=S	
158.	Me	Me	H	1	C=S	

10

20

30

40

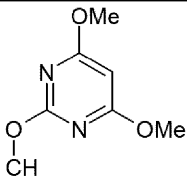
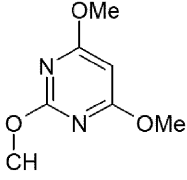
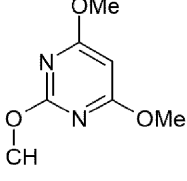
番号	R ¹	R ³	R ⁴	m	X	1H NMR
159.	Me	Me	H	2	C=S	
160.	Me	Me	H	0	C=S	
161.	Me	Me	H	1	C=S	
162.	Me	Me	H	2	C=S	
163.	Me	Me	H	0	C=N-N(CH ₃) ₂	
164.	Me	Me	H	1	C=N-N(CH ₃) ₂	
165.	Me	Me	H	2	C=N-N(CH ₃) ₂	
166.	Me	Me	H	0	O	
167.	Me	Me	H	1	O	
168.	Me	Me	H	2	O	
169.	Me	Me	H	0	S	
170.	Me	Me	H	1	S	
171.	Me	Me	H	2	S	
172.	Me	Me	H	0	SO	
173.	Me	Me	H	1	SO	
174.	Me	Me	H	2	SO	
175.	Me	Me	H	0	SO ₂	
176.	Me	Me	H	1	SO ₂	
177.	Me	Me	H	2	SO ₂	
178.	Me	Me	H	0	NMe	
179.	Me	Me	H	1	NMe	
180.	Me	Me	H	2	NMe	
181.	Et	Me	Me	0	CH ₂	
182.	Et	Me	Me	1	CH ₂	
183.	Et	Me	Me	2	CH ₂	
184.	Et	Me	Me	0	CHMe	
185.	Et	Me	Me	1	CHMe	
186.	Et	Me	Me	2	CHMe	
187.	Et	Me	Me	0	C(CH ₃) ₂	CDCl ₃ , 400 MHz: 1.49 (s, 6H), 1.61 (t, 3H), 2.04 (dd, 2H), 2.29 (s, 3H), 2.62 (s, 3H), 2.99 (dd, 2H), 4.46 (q, 2H), 7.23 (s, 1H), 9.12 (s, 1H)
188.	Et	Me	Me	1	C(CH ₃) ₂	
189.	Et	Me	Me	2	C(CH ₃) ₂	CDCl ₃ , 400 MHz: 1.56 (s, 6H), 1.64 (t, 3H), 2.36 (dd, 2H), 2.65 (s, 3H), 2.77 (s, 3H), 3.43 (dd, 2H), 4.46 (q, 2H), 7.37 (s, 1H), 10.16 (s, 1H)
190.	Et	Me	Me	0	C(OC ₂ H ₄ O)	
191.	Et	Me	Me	1	C(OC ₂ H ₄ O)	
192.	Et	Me	Me	2	C(OC ₂ H ₄ O)	
193.	Et	Me	Me	0	C(SC ₂ H ₄ S)	

10

20

30

40

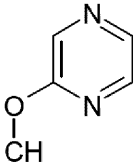
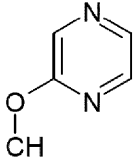
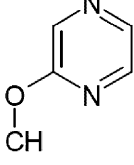
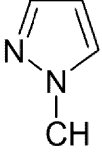
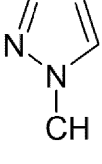
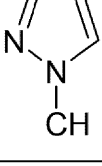
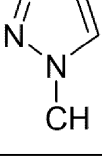
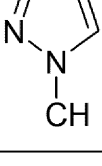
番号	R ¹	R ³	R ⁴	m	X	1H NMR
194.	Et	Me	Me	1	C(SC ₂ H ₄ S)	
195.	Et	Me	Me	2	C(SC ₂ H ₄ S)	
196.	Et	Me	Me	0	CHOMe	
197.	Et	Me	Me	1	CHOMe	
198.	Et	Me	Me	2	CHOMe	
199.	Et	Me	Me	0	CHOEt	
200.	Et	Me	Me	1	CHOEt	
201.	Et	Me	Me	2	CHOEt	
202.	Et	Me	Me	0	CHOiPr	
203.	Et	Me	Me	1	CHOiPr	
204.	Et	Me	Me	2	CHOiPr	
205.	Et	Me	Me	0	CHOCH ₂ cPr	
206.	Et	Me	Me	1	CHOCH ₂ cPr	
207.	Et	Me	Me	2	CHOCH ₂ cPr	
208.	Et	Me	Me	0	CHOC ₂ H ₄ OMe	
209.	Et	Me	Me	1	CHOC ₂ H ₄ OMe	
210.	Et	Me	Me	2	CHOC ₂ H ₄ OMe	
211.	Et	Me	Me	0	CHOCH ₂ CCH	
212.	Et	Me	Me	1	CHOCH ₂ CCH	
213.	Et	Me	Me	2	CHOCH ₂ CCH	
214.	Et	Me	Me	0	CHOCH ₂ CH=CH ₂	
215.	Et	Me	Me	1	CHOCH ₂ CH=CH ₂	
216.	Et	Me	Me	2	CHOCH ₂ CH=CH ₂	
217.	Et	Me	Me	0		
218.	Et	Me	Me	1		
219.	Et	Me	Me	2		

10

20

30

40

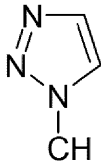
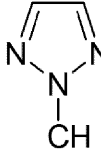
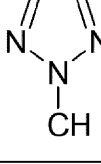
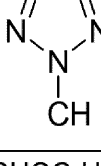
番号	R ¹	R ³	R ⁴	m	X	¹ H NMR
220.	Et	Me	Me	0		
221.	Et	Me	Me	1		
222.	Et	Me	Me	2		
223.	Et	Me	Me	0		
224.	Et	Me	Me	1		
225.	Et	Me	Me	2		
226.	Et	Me	Me	0		
227.	Et	Me	Me	1		

10

20

30

40

番号	R ¹	R ³	R ⁴	m	X	¹ H NMR
228.	Et	Me	Me	2		
229.	Et	Me	Me	0		
230.	Et	Me	Me	1		
231.	Et	Me	Me	2		
232.	Et	Me	Me	0	CHOC ₂ H ₄ F	
233.	Et	Me	Me	1	CHOC ₂ H ₄ F	
234.	Et	Me	Me	2	CHOC ₂ H ₄ F	
235.	Et	Me	Me	0	C=NOMe	
236.	Et	Me	Me	1	C=NOMe	
237.	Et	Me	Me	2	C=NOMe	
238.	Et	Me	Me	0	C=NOCH ₂ CCH	
239.	Et	Me	Me	1	C=NOCH ₂ CCH	
240.	Et	Me	Me	2	C=NOCH ₂ CCH	
241.	Et	Me	Me	0	C=NOCH ₂ CH=CH ₂	
242.	Et	Me	Me	1	C=NOCH ₂ CH=CH ₂	
243.	Et	Me	Me	2	C=NOCH ₂ CH=CH ₂	
244.	Et	Me	Me	0	C=O	
245.	Et	Me	Me	1	C=O	
246.	Et	Me	Me	2	C=O	
247.	Et	Me	Me	0	C=S	
248.	Et	Me	Me	1	C=S	
249.	Et	Me	Me	2	C=S	
250.	Et	Me	Me	0	C=S	
251.	Et	Me	Me	1	C=S	
252.	Et	Me	Me	2	C=S	

10

20

30

40

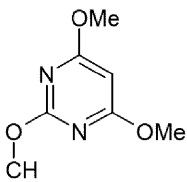
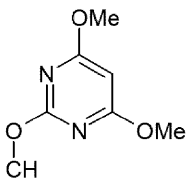
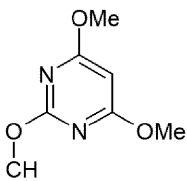
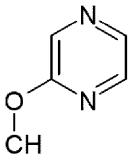
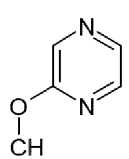
番号	R ¹	R ³	R ⁴	m	X	¹ H NMR
253.	Et	Me	Me	0	C=N-N(CH ₃) ₂	
254.	Et	Me	Me	1	C=N-N(CH ₃) ₂	
255.	Et	Me	Me	2	C=N-N(CH ₃) ₂	
256.	Et	Me	Me	0	O	
257.	Et	Me	Me	1	O	
258.	Et	Me	Me	2	O	
259.	Et	Me	Me	0	S	
260.	Et	Me	Me	1	S	
261.	Et	Me	Me	2	S	
262.	Et	Me	Me	0	SO	
263.	Et	Me	Me	1	SO	
264.	Et	Me	Me	2	SO	
265.	Et	Me	Me	0	SO ₂	
266.	Et	Me	Me	1	SO ₂	
267.	Et	Me	Me	2	SO ₂	
268.	Et	Me	Me	0	NMe	
269.	Et	Me	Me	1	NMe	
270.	Et	Me	Me	2	NMe	
271.	Et	Me	H	0	CH ₂	
272.	Et	Me	H	1	CH ₂	
273.	Et	Me	H	2	CH ₂	
274.	Et	Me	H	0	CHMe	
275.	Et	Me	H	1	CHMe	
276.	Et	Me	H	2	CHMe	
277.	Et	Me	H	0	C(CH ₃) ₂	
278.	Et	Me	H	1	C(CH ₃) ₂	
279.	Et	Me	H	2	C(CH ₃) ₂	
280.	Et	Me	H	0	C(OC ₂ H ₄ O)	
281.	Et	Me	H	1	C(OC ₂ H ₄ O)	
282.	Et	Me	H	2	C(OC ₂ H ₄ O)	
283.	Et	Me	H	0	C(SC ₂ H ₄ S)	
284.	Et	Me	H	1	C(SC ₂ H ₄ S)	
285.	Et	Me	H	2	C(SC ₂ H ₄ S)	
286.	Et	Me	H	0	CHOMe	
287.	Et	Me	H	1	CHOMe	
288.	Et	Me	H	2	CHOMe	
289.	Et	Me	H	0	CHOEt	
290.	Et	Me	H	1	CHOEt	
291.	Et	Me	H	2	CHOEt	

10

20

30

40

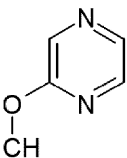
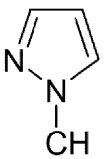
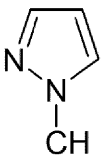
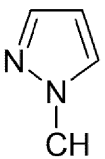
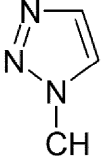
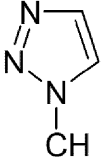
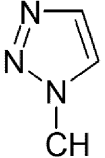
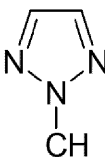
番号	R ¹	R ³	R ⁴	m	X	¹ H NMR
292.	Et	Me	H	0	CHOiPr	
293.	Et	Me	H	1	CHOiPr	
294.	Et	Me	H	2	CHOiPr	
295.	Et	Me	H	0	CHOCH ₂ cPr	
296.	Et	Me	H	1	CHOCH ₂ cPr	
297.	Et	Me	H	2	CHOCH ₂ cPr	
298.	Et	Me	H	0	CHOC ₂ H ₄ OMe	
299.	Et	Me	H	1	CHOC ₂ H ₄ OMe	
300.	Et	Me	H	2	CHOC ₂ H ₄ OMe	
301.	Et	Me	H	0	CHOCH ₂ CCH	
302.	Et	Me	H	1	CHOCH ₂ CCH	
303.	Et	Me	H	2	CHOCH ₂ CCH	
304.	Et	Me	H	0	CHOCH ₂ CH=CH ₂	
305.	Et	Me	H	1	CHOCH ₂ CH=CH ₂	
306.	Et	Me	H	2	CHOCH ₂ CH=CH ₂	
307.	Et	Me	H	0		
308.	Et	Me	H	1		
309.	Et	Me	H	2		
310.	Et	Me	H	0		
311.	Et	Me	H	1		

10

20

30

40

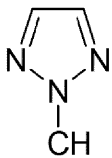
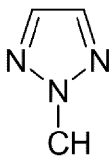
番号	R ¹	R ³	R ⁴	m	X	¹ H NMR
312.	Et	Me	H	2		
313.	Et	Me	H	0		
314.	Et	Me	H	1		
315.	Et	Me	H	2		
316.	Et	Me	H	0		
317.	Et	Me	H	1		
318.	Et	Me	H	2		
319.	Et	Me	H	0		

10

20

30

40

番号	R ¹	R ³	R ⁴	m	X	¹ H NMR
320.	Et	Me	H	1		
321.	Et	Me	H	2		
322.	Et	Me	H	0	CHOC ₂ H ₄ F	
323.	Et	Me	H	1	CHOC ₂ H ₄ F	
324.	Et	Me	H	2	CHOC ₂ H ₄ F	
325.	Et	Me	H	0	C=NOMe	
326.	Et	Me	H	1	C=NOMe	
327.	Et	Me	H	2	C=NOMe	
328.	Et	Me	H	0	C=NOCH ₂ CCH	
329.	Et	Me	H	1	C=NOCH ₂ CCH	
330.	Et	Me	H	2	C=NOCH ₂ CCH	
331.	Et	Me	H	0	C=NOCH ₂ CH=CH ₂	
332.	Et	Me	H	1	C=NOCH ₂ CH=CH ₂	
333.	Et	Me	H	2	C=NOCH ₂ CH=CH ₂	
334.	Et	Me	H	0	C=O	
335.	Et	Me	H	1	C=O	
336.	Et	Me	H	2	C=O	
337.	Et	Me	H	0	C=S	
338.	Et	Me	H	1	C=S	
339.	Et	Me	H	2	C=S	
340.	Et	Me	H	0	C=S	
341.	Et	Me	H	1	C=S	
342.	Et	Me	H	2	C=S	
343.	Et	Me	H	0	C=N-N(CH ₃) ₂	
344.	Et	Me	H	1	C=N-N(CH ₃) ₂	
345.	Et	Me	H	2	C=N-N(CH ₃) ₂	
346.	Et	Me	H	0	O	
347.	Et	Me	H	1	O	
348.	Et	Me	H	2	O	
349.	Et	Me	H	0	S	
350.	Et	Me	H	1	S	
351.	Et	Me	H	2	S	

10

20

30

40

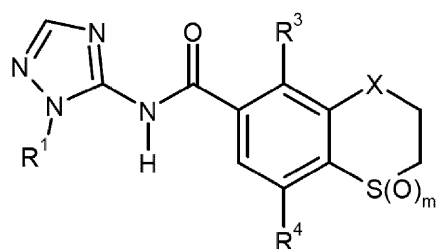
番号	R ¹	R ³	R ⁴	m	X	1H NMR
352.	Et	Me	H	0	SO	
353.	Et	Me	H	1	SO	
354.	Et	Me	H	2	SO	
355.	Et	Me	H	0	SO ₂	
356.	Et	Me	H	1	SO ₂	
357.	Et	Me	H	2	SO ₂	
358.	Et	Me	H	0	NMe	
359.	Et	Me	H	1	NMe	
360.	Et	Me	H	2	NMe	

10

表 2 : Q が Q 2 であり、Y が S (O)_m であり、R⁵ が水素であり、n が 2 である一般式 (I) の本発明の化合物

【0099】

【化19】



20

【0100】

【表 2】

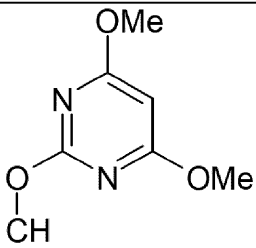
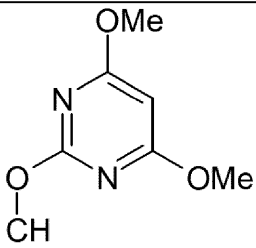
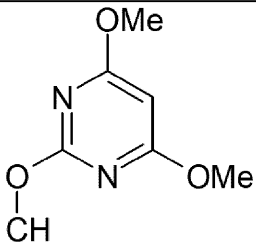
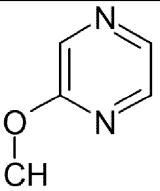
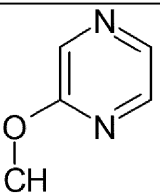
番号	R ¹	R ³	R ⁴	m	X	¹ H NMR
361.	Me	Me	Me	0	CH ₂	
362.	Me	Me	Me	1	CH ₂	
363.	Me	Me	Me	2	CH ₂	
364.	Me	Me	Me	0	CHMe	
365.	Me	Me	Me	1	CHMe	
366.	Me	Me	Me	2	CHMe	
367.	Me	Me	Me	0	C(CH ₃) ₂	
368.	Me	Me	Me	1	C(CH ₃) ₂	
369.	Me	Me	Me	2	C(CH ₃) ₂	
370.	Me	Me	Me	0	C(OC ₂ H ₄ O)	
371.	Me	Me	Me	1	C(OC ₂ H ₄ O)	
372.	Me	Me	Me	2	C(OC ₂ H ₄ O)	
373.	Me	Me	Me	0	C(SC ₂ H ₄ S)	
374.	Me	Me	Me	1	C(SC ₂ H ₄ S)	
375.	Me	Me	Me	2	C(SC ₂ H ₄ S)	
376.	Me	Me	Me	0	CHOMe	
377.	Me	Me	Me	1	CHOMe	
378.	Me	Me	Me	2	CHOMe	
379.	Me	Me	Me	0	CHOEt	
380.	Me	Me	Me	1	CHOEt	
381.	Me	Me	Me	2	CHOEt	
382.	Me	Me	Me	0	CHOiPr	
383.	Me	Me	Me	1	CHOiPr	
384.	Me	Me	Me	2	CHOiPr	
385.	Me	Me	Me	0	CHOCH ₂ cPr	
386.	Me	Me	Me	1	CHOCH ₂ cPr	
387.	Me	Me	Me	2	CHOCH ₂ cPr	
388.	Me	Me	Me	0	CHOC ₂ H ₄ OMe	
389.	Me	Me	Me	1	CHOC ₂ H ₄ OMe	

10

20

30

40

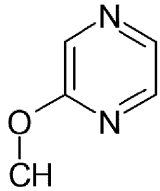
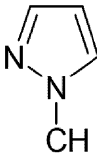
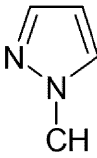
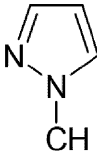
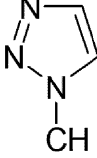
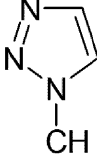
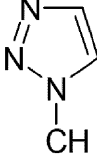
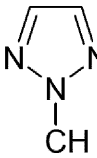
番号	R ¹	R ³	R ⁴	m	X	¹ H NMR
390.	Me	Me	Me	2	CHOC ₂ H ₄ OMe	
391.	Me	Me	Me	0	CHOCH ₂ CCH	
392.	Me	Me	Me	1	CHOCH ₂ CCH	
393.	Me	Me	Me	2	CHOCH ₂ CCH	
394.	Me	Me	Me	0	CHOCH ₂ CH=CH ₂	
395.	Me	Me	Me	1	CHOCH ₂ CH=CH ₂	
396.	Me	Me	Me	2	CHOCH ₂ CH=CH ₂	
397.	Me	Me	Me	0		
398.	Me	Me	Me	1		
399.	Me	Me	Me	2		
400.	Me	Me	Me	0		
401.	Me	Me	Me	1		

10

20

30

40

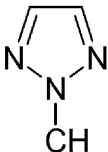
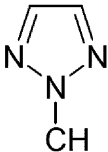
番号	R ¹	R ³	R ⁴	m	X	¹ H NMR
402.	Me	Me	Me	2		
403.	Me	Me	Me	0		
404.	Me	Me	Me	1		
405.	Me	Me	Me	2		
406.	Me	Me	Me	0		
407.	Me	Me	Me	1		
408.	Me	Me	Me	2		
409.	Me	Me	Me	0		

10

20

30

40

番号	R ¹	R ³	R ⁴	m	X	¹ H NMR
410.	Me	Me	Me	1		
411.	Me	Me	Me	2		
412.	Me	Me	Me	0	CHOC ₂ H ₄ F	
413.	Me	Me	Me	1	CHOC ₂ H ₄ F	
414.	Me	Me	Me	2	CHOC ₂ H ₄ F	
415.	Me	Me	Me	0	C=NOMe	
416.	Me	Me	Me	1	C=NOMe	
417.	Me	Me	Me	2	C=NOMe	
418.	Me	Me	Me	0	C=NOCH ₂ CCH	
419.	Me	Me	Me	1	C=NOCH ₂ CCH	
420.	Me	Me	Me	2	C=NOCH ₂ CCH	
421.	Me	Me	Me	0	C=NOCH ₂ CH=CH ₂	
422.	Me	Me	Me	1	C=NOCH ₂ CH=CH ₂	
423.	Me	Me	Me	2	C=NOCH ₂ CH=CH ₂	
424.	Me	Me	Me	0	C=O	
425.	Me	Me	Me	1	C=O	
426.	Me	Me	Me	2	C=O	
427.	Me	Me	Me	0	C=S	
428.	Me	Me	Me	1	C=S	
429.	Me	Me	Me	2	C=S	
430.	Me	Me	Me	0	C=S	
431.	Me	Me	Me	1	C=S	
432.	Me	Me	Me	2	C=S	
433.	Me	Me	Me	0	C=N-N(CH ₃) ₂	

10

20

30

40

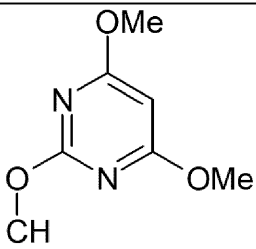
番号	R ¹	R ³	R ⁴	m	X	1H NMR
434.	Me	Me	Me	1	C=N-N(CH ₃) ₂	
435.	Me	Me	Me	2	C=N-N(CH ₃) ₂	
436.	Me	Me	Me	0	O	
437.	Me	Me	Me	1	O	
438.	Me	Me	Me	2	O	
439.	Me	Me	Me	0	S	
440.	Me	Me	Me	1	S	
441.	Me	Me	Me	2	S	
442.	Me	Me	Me	0	SO	
443.	Me	Me	Me	1	SO	
444.	Me	Me	Me	2	SO	
445.	Me	Me	Me	0	SO ₂	
446.	Me	Me	Me	1	SO ₂	
447.	Me	Me	Me	2	SO ₂	
448.	Me	Me	Me	0	NMe	
449.	Me	Me	Me	1	NMe	
450.	Me	Me	Me	2	NMe	
451.	Me	Me	H	0	CH ₂	
452.	Me	Me	H	1	CH ₂	
453.	Me	Me	H	2	CH ₂	
454.	Me	Me	H	0	CHMe	
455.	Me	Me	H	1	CHMe	
456.	Me	Me	H	2	CHMe	
457.	Me	Me	H	0	C(CH ₃) ₂	
458.	Me	Me	H	1	C(CH ₃) ₂	
459.	Me	Me	H	2	C(CH ₃) ₂	
460.	Me	Me	H	0	C(OC ₂ H ₄ O)	
461.	Me	Me	H	1	C(OC ₂ H ₄ O)	
462.	Me	Me	H	2	C(OC ₂ H ₄ O)	

10

20

30

40

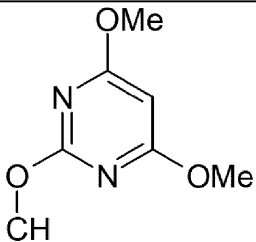
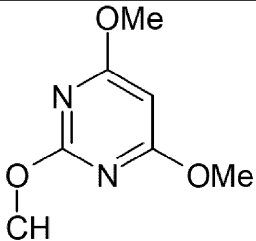
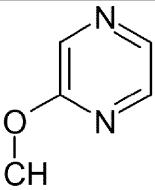
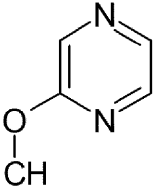
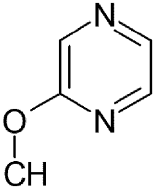
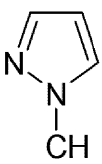
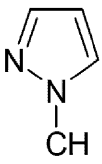
番号	R ¹	R ³	R ⁴	m	X	¹ H NMR
463.	Me	Me	H	0	C(SC ₂ H ₄ S)	
464.	Me	Me	H	1	C(SC ₂ H ₄ S)	
465.	Me	Me	H	2	C(SC ₂ H ₄ S)	
466.	Me	Me	H	0	CHOMe	
467.	Me	Me	H	1	CHOMe	
468.	Me	Me	H	2	CHOMe	
469.	Me	Me	H	0	CHOEt	
470.	Me	Me	H	1	CHOEt	
471.	Me	Me	H	2	CHOEt	
472.	Me	Me	H	0	CHOiPr	
473.	Me	Me	H	1	CHOiPr	
474.	Me	Me	H	2	CHOiPr	
475.	Me	Me	H	0	CHOCH ₂ cPr	
476.	Me	Me	H	1	CHOCH ₂ cPr	
477.	Me	Me	H	2	CHOCH ₂ cPr	
478.	Me	Me	H	0	CHOC ₂ H ₄ OMe	
479.	Me	Me	H	1	CHOC ₂ H ₄ OMe	
480.	Me	Me	H	2	CHOC ₂ H ₄ OMe	
481.	Me	Me	H	0	CHOCH ₂ CCH	
482.	Me	Me	H	1	CHOCH ₂ CCH	
483.	Me	Me	H	2	CHOCH ₂ CCH	
484.	Me	Me	H	0	CHOCH ₂ CH=CH ₂	
485.	Me	Me	H	1	CHOCH ₂ CH=CH ₂	
486.	Me	Me	H	2	CHOCH ₂ CH=CH ₂	
487.	Me	Me	H	0		

10

20

30

40

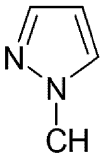
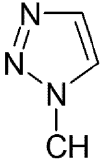
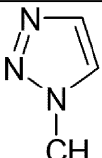
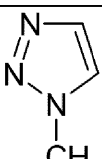
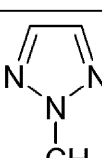
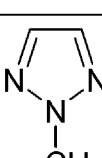
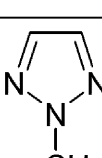
番号	R ¹	R ³	R ⁴	m	X	1H NMR
488.	Me	Me	H	1		
489.	Me	Me	H	2		
490.	Me	Me	H	0		
491.	Me	Me	H	1		
492.	Me	Me	H	2		
493.	Me	Me	H	0		
494.	Me	Me	H	1		

10

20

30

40

番号	R ¹	R ³	R ⁴	m	X	¹ H NMR
495.	Me	Me	H	2		
496.	Me	Me	H	0		
497.	Me	Me	H	1		
498.	Me	Me	H	2		
499.	Me	Me	H	0		
500.	Me	Me	H	1		
501.	Me	Me	H	2		
502.	Me	Me	H	0	CHOC ₂ H ₄ F	
503.	Me	Me	H	1	CHOC ₂ H ₄ F	
504.	Me	Me	H	2	CHOC ₂ H ₄ F	
505.	Me	Me	H	0	C=NOMe	
506.	Me	Me	H	1	C=NOMe	
507.	Me	Me	H	2	C=NOMe	

10

20

30

40

番号	R ¹	R ³	R ⁴	m	X	1H NMR
508.	Me	Me	H	0	C=NOCH ₂ CCH	
509.	Me	Me	H	1	C=NOCH ₂ CCH	
510.	Me	Me	H	2	C=NOCH ₂ CCH	
511.	Me	Me	H	0	C=NOCH ₂ CH=CH ₂	
512.	Me	Me	H	1	C=NOCH ₂ CH=CH ₂	
513.	Me	Me	H	2	C=NOCH ₂ CH=CH ₂	
514.	Me	Me	H	0	C=O	
515.	Me	Me	H	1	C=O	
516.	Me	Me	H	2	C=O	
517.	Me	Me	H	0	C=S	
518.	Me	Me	H	1	C=S	
519.	Me	Me	H	2	C=S	
520.	Me	Me	H	0	C=S	
521.	Me	Me	H	1	C=S	
522.	Me	Me	H	2	C=S	
523.	Me	Me	H	0	C=N-N(CH ₃) ₂	
524.	Me	Me	H	1	C=N-N(CH ₃) ₂	
525.	Me	Me	H	2	C=N-N(CH ₃) ₂	
526.	Me	Me	H	0	O	
527.	Me	Me	H	1	O	
528.	Me	Me	H	2	O	
529.	Me	Me	H	0	S	
530.	Me	Me	H	1	S	
531.	Me	Me	H	2	S	
532.	Me	Me	H	0	SO	
533.	Me	Me	H	1	SO	
534.	Me	Me	H	2	SO	
535.	Me	Me	H	0	SO ₂	
536.	Me	Me	H	1	SO ₂	

10

20

30

40

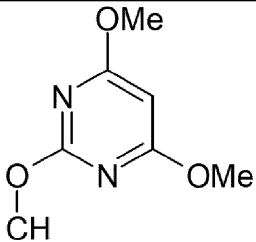
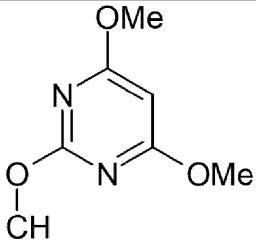
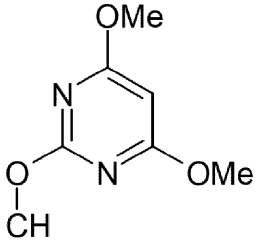
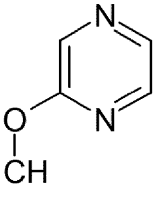
番号	R ¹	R ³	R ⁴	m	X	1H NMR
537.	Me	Me	H	2	SO ₂	
538.	Me	Me	H	0	NMe	
539.	Me	Me	H	1	NMe	
540.	Me	Me	H	2	NMe	
541.	Et	Me	Me	0	CH ₂	
542.	Et	Me	Me	1	CH ₂	
543.	Et	Me	Me	2	CH ₂	
544.	Et	Me	Me	0	CHMe	
545.	Et	Me	Me	1	CHMe	
546.	Et	Me	Me	2	CHMe	
547.	Et	Me	Me	0	C(CH ₃) ₂	
548.	Et	Me	Me	1	C(CH ₃) ₂	
549.	Et	Me	Me	2	C(CH ₃) ₂	
550.	Et	Me	Me	0	C(OC ₂ H ₄ O)	
551.	Et	Me	Me	1	C(OC ₂ H ₄ O)	
552.	Et	Me	Me	2	C(OC ₂ H ₄ O)	
553.	Et	Me	Me	0	C(SC ₂ H ₄ S)	
554.	Et	Me	Me	1	C(SC ₂ H ₄ S)	
555.	Et	Me	Me	2	C(SC ₂ H ₄ S)	
556.	Et	Me	Me	0	CHOMe	
557.	Et	Me	Me	1	CHOMe	
558.	Et	Me	Me	2	CHOMe	
559.	Et	Me	Me	0	CHOEt	
560.	Et	Me	Me	1	CHOEt	
561.	Et	Me	Me	2	CHOEt	
562.	Et	Me	Me	0	CHOiPr	
563.	Et	Me	Me	1	CHOiPr	
564.	Et	Me	Me	2	CHOiPr	
565.	Et	Me	Me	0	CHOCH ₂ cPr	

10

20

30

40

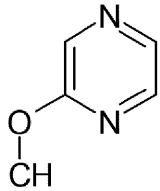
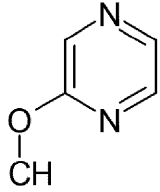
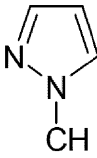
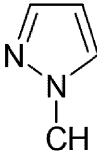
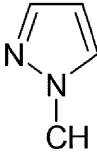
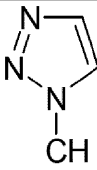
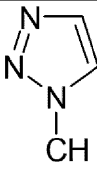
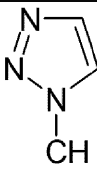
番号	R ¹	R ³	R ⁴	m	X	¹ H NMR
566.	Et	Me	Me	1	CHOCH ₂ cPr	
567.	Et	Me	Me	2	CHOCH ₂ cPr	
568.	Et	Me	Me	0	CHOC ₂ H ₄ OMe	
569.	Et	Me	Me	1	CHOC ₂ H ₄ OMe	
570.	Et	Me	Me	2	CHOC ₂ H ₄ OMe	
571.	Et	Me	Me	0	CHOCH ₂ CCH	
572.	Et	Me	Me	1	CHOCH ₂ CCH	
573.	Et	Me	Me	2	CHOCH ₂ CCH	
574.	Et	Me	Me	0	CHOCH ₂ CH=CH ₂	
575.	Et	Me	Me	1	CHOCH ₂ CH=CH ₂	
576.	Et	Me	Me	2	CHOCH ₂ CH=CH ₂	
577.	Et	Me	Me	0		
578.	Et	Me	Me	1		
579.	Et	Me	Me	2		
580.	Et	Me	Me	0		

10

20

30

40

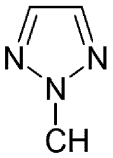
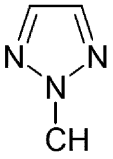
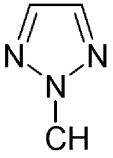
番号	R ¹	R ³	R ⁴	m	X	1H NMR
581.	Et	Me	Me	1		
582.	Et	Me	Me	2		
583.	Et	Me	Me	0		
584.	Et	Me	Me	1		
585.	Et	Me	Me	2		
586.	Et	Me	Me	0		
587.	Et	Me	Me	1		
588.	Et	Me	Me	2		

10

20

30

40

番号	R ¹	R ³	R ⁴	m	X	¹ H NMR
589.	Et	Me	Me	0		
590.	Et	Me	Me	1		
591.	Et	Me	Me	2		
592.	Et	Me	Me	0	CHOC ₂ H ₄ F	
593.	Et	Me	Me	1	CHOC ₂ H ₄ F	
594.	Et	Me	Me	2	CHOC ₂ H ₄ F	
595.	Et	Me	Me	0	C=NOMe	
596.	Et	Me	Me	1	C=NOMe	
597.	Et	Me	Me	2	C=NOMe	
598.	Et	Me	Me	0	C=NOCH ₂ CCH	
599.	Et	Me	Me	1	C=NOCH ₂ CCH	
600.	Et	Me	Me	2	C=NOCH ₂ CCH	
601.	Et	Me	Me	0	C=NOCH ₂ CH=CH ₂	
602.	Et	Me	Me	1	C=NOCH ₂ CH=CH ₂	
603.	Et	Me	Me	2	C=NOCH ₂ CH=CH ₂	
604.	Et	Me	Me	0	C=O	
605.	Et	Me	Me	1	C=O	
606.	Et	Me	Me	2	C=O	
607.	Et	Me	Me	0	C=S	
608.	Et	Me	Me	1	C=S	
609.	Et	Me	Me	2	C=S	
610.	Et	Me	Me	0	C=S	

10

20

30

40

番号	R ¹	R ³	R ⁴	m	X	1H NMR
611.	Et	Me	Me	1	C=S	
612.	Et	Me	Me	2	C=S	
613.	Et	Me	Me	0	C=N-N(CH ₃) ₂	
614.	Et	Me	Me	1	C=N-N(CH ₃) ₂	
615.	Et	Me	Me	2	C=N-N(CH ₃) ₂	
616.	Et	Me	Me	0	O	
617.	Et	Me	Me	1	O	
618.	Et	Me	Me	2	O	
619.	Et	Me	Me	0	S	
620.	Et	Me	Me	1	S	
621.	Et	Me	Me	2	S	
622.	Et	Me	Me	0	SO	
623.	Et	Me	Me	1	SO	
624.	Et	Me	Me	2	SO	
625.	Et	Me	Me	0	SO ₂	
626.	Et	Me	Me	1	SO ₂	
627.	Et	Me	Me	2	SO ₂	
628.	Et	Me	Me	0	NMe	
629.	Et	Me	Me	1	NMe	
630.	Et	Me	Me	2	NMe	
631.	Et	Me	H	0	CH ₂	
632.	Et	Me	H	1	CH ₂	
633.	Et	Me	H	2	CH ₂	
634.	Et	Me	H	0	CHMe	
635.	Et	Me	H	1	CHMe	
636.	Et	Me	H	2	CHMe	
637.	Et	Me	H	0	C(CH ₃) ₂	
638.	Et	Me	H	1	C(CH ₃) ₂	
639.	Et	Me	H	2	C(CH ₃) ₂	

10

20

30

40

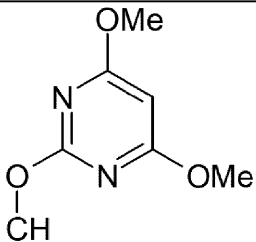
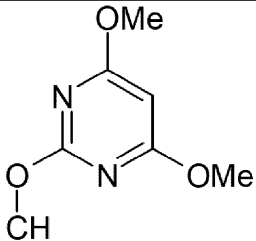
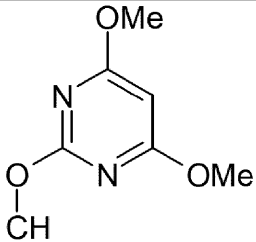
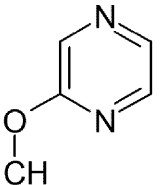
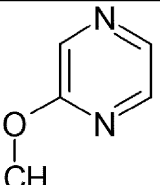
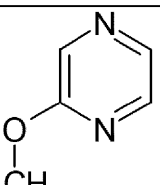
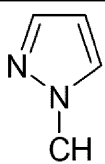
番号	R ¹	R ³	R ⁴	m	X	¹ H NMR
640.	Et	Me	H	0	C(OC ₂ H ₄ O)	
641.	Et	Me	H	1	C(OC ₂ H ₄ O)	
642.	Et	Me	H	2	C(OC ₂ H ₄ O)	
643.	Et	Me	H	0	C(SC ₂ H ₄ S)	
644.	Et	Me	H	1	C(SC ₂ H ₄ S)	
645.	Et	Me	H	2	C(SC ₂ H ₄ S)	
646.	Et	Me	H	0	CHOMe	
647.	Et	Me	H	1	CHOMe	
648.	Et	Me	H	2	CHOMe	
649.	Et	Me	H	0	CHOEt	
650.	Et	Me	H	1	CHOEt	
651.	Et	Me	H	2	CHOEt	
652.	Et	Me	H	0	CHOiPr	
653.	Et	Me	H	1	CHOiPr	
654.	Et	Me	H	2	CHOiPr	
655.	Et	Me	H	0	CHOCH ₂ cPr	
656.	Et	Me	H	1	CHOCH ₂ cPr	
657.	Et	Me	H	2	CHOCH ₂ cPr	
658.	Et	Me	H	0	CHOC ₂ H ₄ OMe	
659.	Et	Me	H	1	CHOC ₂ H ₄ OMe	
660.	Et	Me	H	2	CHOC ₂ H ₄ OMe	
661.	Et	Me	H	0	CHOCH ₂ CCH	
662.	Et	Me	H	1	CHOCH ₂ CCH	
663.	Et	Me	H	2	CHOCH ₂ CCH	
664.	Et	Me	H	0	CHOCH ₂ CH=CH ₂	
665.	Et	Me	H	1	CHOCH ₂ CH=CH ₂	
666.	Et	Me	H	2	CHOCH ₂ CH=CH ₂	

10

20

30

40

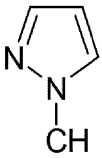
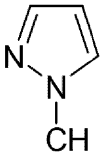
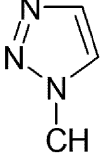
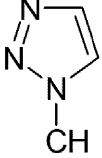
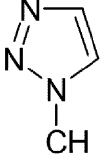
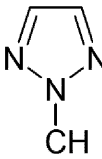
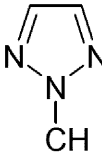
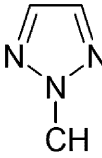
番号	R ¹	R ³	R ⁴	m	X	1H NMR
667.	Et	Me	H	0		
668.	Et	Me	H	1		
669.	Et	Me	H	2		
670.	Et	Me	H	0		
671.	Et	Me	H	1		
672.	Et	Me	H	2		
673.	Et	Me	H	0		

10

20

30

40

番号	R ¹	R ³	R ⁴	m	X	¹ H NMR
674.	Et	Me	H	1		
675.	Et	Me	H	2		
676.	Et	Me	H	0		
677.	Et	Me	H	1		
678.	Et	Me	H	2		
679.	Et	Me	H	0		
680.	Et	Me	H	1		
681.	Et	Me	H	2		
682.	Et	Me	H	0	CHOC ₂ H ₄ F	
683.	Et	Me	H	1	CHOC ₂ H ₄ F	
684.	Et	Me	H	2	CHOC ₂ H ₄ F	

10

20

30

40

番号	R ¹	R ³	R ⁴	m	X	1H NMR
685.	Et	Me	H	0	C=NOMe	
686.	Et	Me	H	1	C=NOMe	
687.	Et	Me	H	2	C=NOMe	
688.	Et	Me	H	0	C=NOCH ₂ CCH	
689.	Et	Me	H	1	C=NOCH ₂ CCH	
690.	Et	Me	H	2	C=NOCH ₂ CCH	
691.	Et	Me	H	0	C=NOCH ₂ CH=CH ₂	
692.	Et	Me	H	1	C=NOCH ₂ CH=CH ₂	
693.	Et	Me	H	2	C=NOCH ₂ CH=CH ₂	
694.	Et	Me	H	0	C=O	
695.	Et	Me	H	1	C=O	
696.	Et	Me	H	2	C=O	
697.	Et	Me	H	0	C=S	
698.	Et	Me	H	1	C=S	
699.	Et	Me	H	2	C=S	
700.	Et	Me	H	0	C=S	
701.	Et	Me	H	1	C=S	
702.	Et	Me	H	2	C=S	
703.	Et	Me	H	0	C=N-N(CH ₃) ₂	
704.	Et	Me	H	1	C=N-N(CH ₃) ₂	
705.	Et	Me	H	2	C=N-N(CH ₃) ₂	
706.	Et	Me	H	0	O	
707.	Et	Me	H	1	O	
708.	Et	Me	H	2	O	
709.	Et	Me	H	0	S	
710.	Et	Me	H	1	S	
711.	Et	Me	H	2	S	
712.	Et	Me	H	0	SO	
713.	Et	Me	H	1	SO	
714.	Et	Me	H	2	SO	

10

20

30

40

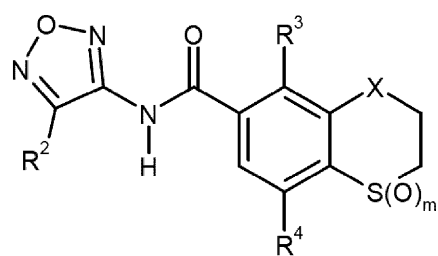
番号	R ¹	R ³	R ⁴	m	X	¹ H NMR
715.	Et	Me	H	0	SO ₂	
716.	Et	Me	H	1	SO ₂	
717.	Et	Me	H	2	SO ₂	
718.	Et	Me	H	0	NMe	
719.	Et	Me	H	1	NMe	
720.	Et	Me	H	2	NMe	

10

表 3 : Q が Q 3 であり、Y が S (O)_m であり、R⁵ が水素であり、n が 2 である一般式 (I) の本発明の化合物

【 0 1 0 1 】

【 化 2 0 】



20

【 0 1 0 2 】

【表 3】

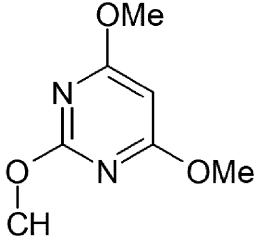
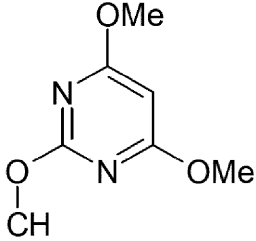
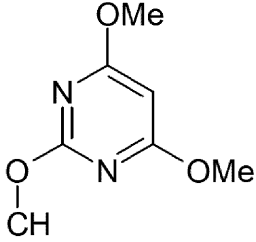
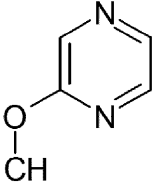
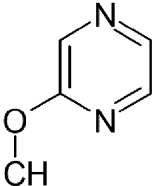
番号	R ²	R ³	R ⁴	m	X	¹ H NMR
721.	Me	Me	Me	0	CH ₂	
722.	Me	Me	Me	1	CH ₂	
723.	Me	Me	Me	2	CH ₂	
724.	Me	Me	Me	0	CHMe	
725.	Me	Me	Me	1	CHMe	
726.	Me	Me	Me	2	CHMe	
727.	Me	Me	Me	0	C(CH ₃) ₂	
728.	Me	Me	Me	1	C(CH ₃) ₂	
729.	Me	Me	Me	2	C(CH ₃) ₂	
730.	Me	Me	Me	0	C(OC ₂ H ₄ O)	
731.	Me	Me	Me	1	C(OC ₂ H ₄ O)	
732.	Me	Me	Me	2	C(OC ₂ H ₄ O)	
733.	Me	Me	Me	0	C(SC ₂ H ₄ S)	
734.	Me	Me	Me	1	C(SC ₂ H ₄ S)	
735.	Me	Me	Me	2	C(SC ₂ H ₄ S)	
736.	Me	Me	Me	0	CHOMe	
737.	Me	Me	Me	1	CHOMe	
738.	Me	Me	Me	2	CHOMe	
739.	Me	Me	Me	0	CHOEt	
740.	Me	Me	Me	1	CHOEt	
741.	Me	Me	Me	2	CHOEt	
742.	Me	Me	Me	0	CHOiPr	
743.	Me	Me	Me	1	CHOiPr	
744.	Me	Me	Me	2	CHOiPr	
745.	Me	Me	Me	0	CHOCH ₂ cPr	
746.	Me	Me	Me	1	CHOCH ₂ cPr	
747.	Me	Me	Me	2	CHOCH ₂ cPr	
748.	Me	Me	Me	0	CHOC ₂ H ₄ OMe	
749.	Me	Me	Me	1	CHOC ₂ H ₄ OMe	

10

20

30

40

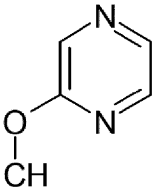
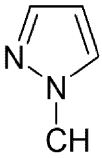
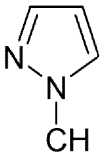
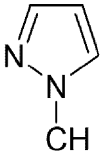
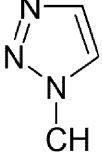
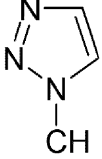
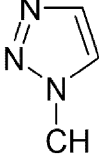
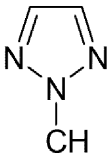
番号	R ²	R ³	R ⁴	m	X	1H NMR
750.	Me	Me	Me	2	CHOC ₂ H ₄ OMe	
751.	Me	Me	Me	0	CHOCH ₂ CCH	
752.	Me	Me	Me	1	CHOCH ₂ CCH	
753.	Me	Me	Me	2	CHOCH ₂ CCH	
754.	Me	Me	Me	0	CHOCH ₂ CH=CH ₂	
755.	Me	Me	Me	1	CHOCH ₂ CH=CH ₂	
756.	Me	Me	Me	2	CHOCH ₂ CH=CH ₂	
757.	Me	Me	Me	0		
758.	Me	Me	Me	1		
759.	Me	Me	Me	2		
760.	Me	Me	Me	0		
761.	Me	Me	Me	1		

10

20

30

40

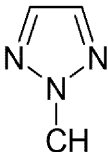
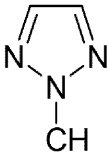
番号	R ²	R ³	R ⁴	m	X	¹ H NMR
762.	Me	Me	Me	2		DMSO-d ₆ , 400 MHz: 11.42 (s, 1H), 8.39 (s, 1H), 8.35-8.30 (m, 2H), 7.70 (s, 1H), 6.52 (dd, 1H), 3.79-3.69 (m, 1H), 3.61-3.52 (m, 1H), 2.80-2.60 (m, 5H), 2.38 (s, 3H), 2.21 (s, 3H)
763.	Me	Me	Me	0		
764.	Me	Me	Me	1		
765.	Me	Me	Me	2		
766.	Me	Me	Me	0		
767.	Me	Me	Me	1		
768.	Me	Me	Me	2		
769.	Me	Me	Me	0		

10

20

30

40

番号	R ²	R ³	R ⁴	m	X	¹ H NMR
770.	Me	Me	Me	1		
771.	Me	Me	Me	2		
772.	Me	Me	Me	0	CHOC ₂ H ₄ F	
773.	Me	Me	Me	1	CHOC ₂ H ₄ F	
774.	Me	Me	Me	2	CHOC ₂ H ₄ F	
775.	Me	Me	Me	0	C=NOMe	
776.	Me	Me	Me	1	C=NOMe	
777.	Me	Me	Me	2	C=NOMe	
778.	Me	Me	Me	0	C=NOCH ₂ CCH	
779.	Me	Me	Me	1	C=NOCH ₂ CCH	
780.	Me	Me	Me	2	C=NOCH ₂ CCH	
781.	Me	Me	Me	0	C=NOCH ₂ CH=CH ₂	
782.	Me	Me	Me	1	C=NOCH ₂ CH=CH ₂	
783.	Me	Me	Me	2	C=NOCH ₂ CH=CH ₂	
784.	Me	Me	Me	0	C=O	
785.	Me	Me	Me	1	C=O	
786.	Me	Me	Me	2	C=O	
787.	Me	Me	Me	0	C=S	
788.	Me	Me	Me	1	C=S	
789.	Me	Me	Me	2	C=S	
790.	Me	Me	Me	0	C=S	
791.	Me	Me	Me	1	C=S	
792.	Me	Me	Me	2	C=S	
793.	Me	Me	Me	0	C=N-N(CH ₃) ₂	

10

20

30

40

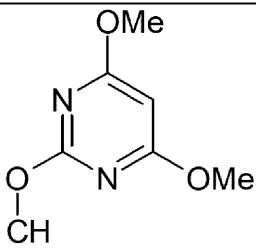
番号	R ²	R ³	R ⁴	m	X	1H NMR
794.	Me	Me	Me	1	C=N-N(CH ₃) ₂	
795.	Me	Me	Me	2	C=N-N(CH ₃) ₂	
796.	Me	Me	Me	0	O	
797.	Me	Me	Me	1	O	
798.	Me	Me	Me	2	O	
799.	Me	Me	Me	0	S	
800.	Me	Me	Me	1	S	
801.	Me	Me	Me	2	S	
802.	Me	Me	Me	0	SO	
803.	Me	Me	Me	1	SO	
804.	Me	Me	Me	2	SO	
805.	Me	Me	Me	0	SO ₂	
806.	Me	Me	Me	1	SO ₂	
807.	Me	Me	Me	2	SO ₂	
808.	Me	Me	Me	0	NMe	
809.	Me	Me	Me	1	NMe	
810.	Me	Me	Me	2	NMe	
811.	Me	Me	H	0	CH ₂	
812.	Me	Me	H	1	CH ₂	
813.	Me	Me	H	2	CH ₂	
814.	Me	Me	H	0	CHMe	
815.	Me	Me	H	1	CHMe	
816.	Me	Me	H	2	CHMe	
817.	Me	Me	H	0	C(CH ₃) ₂	
818.	Me	Me	H	1	C(CH ₃) ₂	
819.	Me	Me	H	2	C(CH ₃) ₂	
820.	Me	Me	H	0	C(OC ₂ H ₄ O)	
821.	Me	Me	H	1	C(OC ₂ H ₄ O)	
822.	Me	Me	H	2	C(OC ₂ H ₄ O)	

10

20

30

40

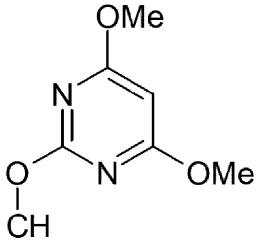
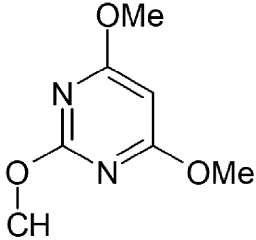
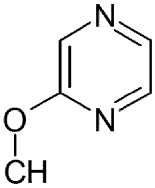
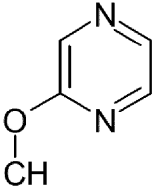
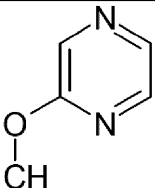
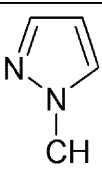
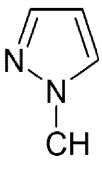
番号	R ²	R ³	R ⁴	m	X	1H NMR
823.	Me	Me	H	0	C(SC ₂ H ₄ S)	
824.	Me	Me	H	1	C(SC ₂ H ₄ S)	
825.	Me	Me	H	2	C(SC ₂ H ₄ S)	
826.	Me	Me	H	0	CHOMe	
827.	Me	Me	H	1	CHOMe	
828.	Me	Me	H	2	CHOMe	
829.	Me	Me	H	0	CHOEt	
830.	Me	Me	H	1	CHOEt	
831.	Me	Me	H	2	CHOEt	
832.	Me	Me	H	0	CHOiPr	
833.	Me	Me	H	1	CHOiPr	
834.	Me	Me	H	2	CHOiPr	
835.	Me	Me	H	0	CHOCH ₂ cPr	
836.	Me	Me	H	1	CHOCH ₂ cPr	
837.	Me	Me	H	2	CHOCH ₂ cPr	
838.	Me	Me	H	0	CHOC ₂ H ₄ OMe	
839.	Me	Me	H	1	CHOC ₂ H ₄ OMe	
840.	Me	Me	H	2	CHOC ₂ H ₄ OMe	
841.	Me	Me	H	0	CHOCH ₂ CCH	
842.	Me	Me	H	1	CHOCH ₂ CCH	
843.	Me	Me	H	2	CHOCH ₂ CCH	
844.	Me	Me	H	0	CHOCH ₂ CH=CH ₂	
845.	Me	Me	H	1	CHOCH ₂ CH=CH ₂	
846.	Me	Me	H	2	CHOCH ₂ CH=CH ₂	
847.	Me	Me	H	0		

10

20

30

40

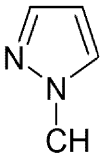
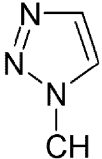
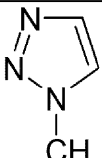
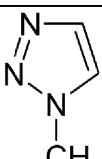
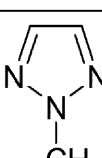
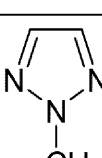
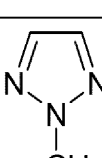
番号	R ²	R ³	R ⁴	m	X	1H NMR
848.	Me	Me	H	1		
849.	Me	Me	H	2		
850.	Me	Me	H	0		
851.	Me	Me	H	1		
852.	Me	Me	H	2		
853.	Me	Me	H	0		
854.	Me	Me	H	1		

10

20

30

40

番号	R ²	R ³	R ⁴	m	X	¹ H NMR
855.	Me	Me	H	2		
856.	Me	Me	H	0		
857.	Me	Me	H	1		
858.	Me	Me	H	2		
859.	Me	Me	H	0		
860.	Me	Me	H	1		
861.	Me	Me	H	2		
862.	Me	Me	H	0	CHOC ₂ H ₄ F	
863.	Me	Me	H	1	CHOC ₂ H ₄ F	
864.	Me	Me	H	2	CHOC ₂ H ₄ F	
865.	Me	Me	H	0	C=NOMe	
866.	Me	Me	H	1	C=NOMe	
867.	Me	Me	H	2	C=NOMe	

10

20

30

40

番号	R ²	R ³	R ⁴	m	X	1H NMR
868.	Me	Me	H	0	C=NOCH ₂ CCH	
869.	Me	Me	H	1	C=NOCH ₂ CCH	
870.	Me	Me	H	2	C=NOCH ₂ CCH	
871.	Me	Me	H	0	C=NOCH ₂ CH=CH ₂	
872.	Me	Me	H	1	C=NOCH ₂ CH=CH ₂	
873.	Me	Me	H	2	C=NOCH ₂ CH=CH ₂	
874.	Me	Me	H	0	C=O	
875.	Me	Me	H	1	C=O	
876.	Me	Me	H	2	C=O	
877.	Me	Me	H	0	C=S	
878.	Me	Me	H	1	C=S	
879.	Me	Me	H	2	C=S	
880.	Me	Me	H	0	C=S	
881.	Me	Me	H	1	C=S	
882.	Me	Me	H	2	C=S	
883.	Me	Me	H	0	C=N-N(CH ₃) ₂	
884.	Me	Me	H	1	C=N-N(CH ₃) ₂	
885.	Me	Me	H	2	C=N-N(CH ₃) ₂	
886.	Me	Me	H	0	O	
887.	Me	Me	H	1	O	
888.	Me	Me	H	2	O	
889.	Me	Me	H	0	S	
890.	Me	Me	H	1	S	
891.	Me	Me	H	2	S	
892.	Me	Me	H	0	SO	
893.	Me	Me	H	1	SO	
894.	Me	Me	H	2	SO	
895.	Me	Me	H	0	SO ₂	
896.	Me	Me	H	1	SO ₂	

10

20

30

40

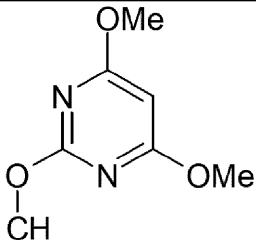
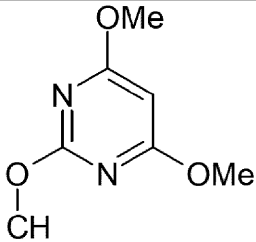
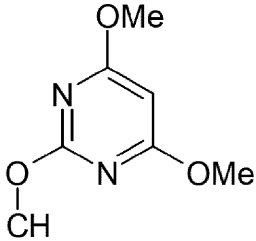
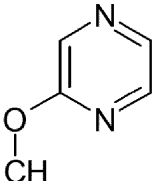
番号	R ²	R ³	R ⁴	m	X	1H NMR
897.	Me	Me	H	2	SO ₂	
898.	Me	Me	H	0	NMe	
899.	Me	Me	H	1	NMe	
900.	Me	Me	H	2	NMe	
901.	Et	Me	Me	0	CH ₂	
902.	Et	Me	Me	1	CH ₂	
903.	Et	Me	Me	2	CH ₂	
904.	Et	Me	Me	0	CHMe	
905.	Et	Me	Me	1	CHMe	
906.	Et	Me	Me	2	CHMe	
907.	Et	Me	Me	0	C(CH ₃) ₂	
908.	Et	Me	Me	1	C(CH ₃) ₂	
909.	Et	Me	Me	2	C(CH ₃) ₂	
910.	Et	Me	Me	0	C(OC ₂ H ₄ O)	
911.	Et	Me	Me	1	C(OC ₂ H ₄ O)	
912.	Et	Me	Me	2	C(OC ₂ H ₄ O)	
913.	Et	Me	Me	0	C(SC ₂ H ₄ S)	
914.	Et	Me	Me	1	C(SC ₂ H ₄ S)	
915.	Et	Me	Me	2	C(SC ₂ H ₄ S)	
916.	Et	Me	Me	0	CHOMe	
917.	Et	Me	Me	1	CHOMe	
918.	Et	Me	Me	2	CHOMe	
919.	Et	Me	Me	0	CHOEt	
920.	Et	Me	Me	1	CHOEt	
921.	Et	Me	Me	2	CHOEt	
922.	Et	Me	Me	0	CHOiPr	
923.	Et	Me	Me	1	CHOiPr	
924.	Et	Me	Me	2	CHOiPr	
925.	Et	Me	Me	0	CHOCH ₂ cPr	

10

20

30

40

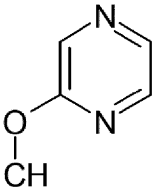
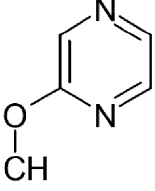
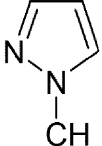
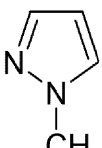
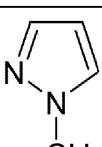
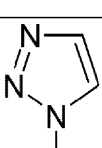
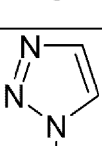
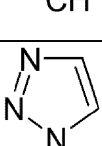
番号	R ²	R ³	R ⁴	m	X	1H NMR
926.	Et	Me	Me	1	CHOCH ₂ cPr	
927.	Et	Me	Me	2	CHOCH ₂ cPr	
928.	Et	Me	Me	0	CHOC ₂ H ₄ OMe	
929.	Et	Me	Me	1	CHOC ₂ H ₄ OMe	
930.	Et	Me	Me	2	CHOC ₂ H ₄ OMe	
931.	Et	Me	Me	0	CHOCH ₂ CCH	
932.	Et	Me	Me	1	CHOCH ₂ CCH	
933.	Et	Me	Me	2	CHOCH ₂ CCH	
934.	Et	Me	Me	0	CHOCH ₂ CH=CH ₂	
935.	Et	Me	Me	1	CHOCH ₂ CH=CH ₂	
936.	Et	Me	Me	2	CHOCH ₂ CH=CH ₂	
937.	Et	Me	Me	0		
938.	Et	Me	Me	1		
939.	Et	Me	Me	2		
940.	Et	Me	Me	0		

10

20

30

40

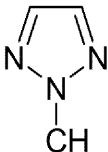
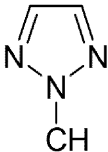
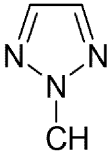
番号	R ²	R ³	R ⁴	m	X	¹ H NMR
941.	Et	Me	Me	1		
942.	Et	Me	Me	2		DMSO-d ₆ , 400 MHz: 11.35 (s, 1H), 8.39 (s, 1H), 8.34-8.30 (m, 2H), 7.67 (s, 1H), 6.52 (dd, 1H), 3.80-3.71 (m, 1H), 3.60-3.53 (m, 1H), 2.82-2.60 (m, 7H), 2.20 (s, 3H), 1.26 (t, 3H)
943.	Et	Me	Me	0		
944.	Et	Me	Me	1		
945.	Et	Me	Me	2		
946.	Et	Me	Me	0		
947.	Et	Me	Me	1		
948.	Et	Me	Me	2		

10

20

30

40

番号	R ²	R ³	R ⁴	m	X	¹ H NMR
949.	Et	Me	Me	0		
950.	Et	Me	Me	1		
951.	Et	Me	Me	2		
952.	Et	Me	Me	0	CHOC ₂ H ₄ F	
953.	Et	Me	Me	1	CHOC ₂ H ₄ F	
954.	Et	Me	Me	2	CHOC ₂ H ₄ F	
955.	Et	Me	Me	0	C=NOMe	
956.	Et	Me	Me	1	C=NOMe	
957.	Et	Me	Me	2	C=NOMe	
958.	Et	Me	Me	0	C=NOCH ₂ CCH	
959.	Et	Me	Me	1	C=NOCH ₂ CCH	
960.	Et	Me	Me	2	C=NOCH ₂ CCH	
961.	Et	Me	Me	0	C=NOCH ₂ CH=CH ₂	
962.	Et	Me	Me	1	C=NOCH ₂ CH=CH ₂	
963.	Et	Me	Me	2	C=NOCH ₂ CH=CH ₂	
964.	Et	Me	Me	0	C=O	
965.	Et	Me	Me	1	C=O	
966.	Et	Me	Me	2	C=O	
967.	Et	Me	Me	0	C=S	
968.	Et	Me	Me	1	C=S	
969.	Et	Me	Me	2	C=S	
970.	Et	Me	Me	0	C=S	

10

20

30

40

番号	R ²	R ³	R ⁴	m	X	1H NMR
971.	Et	Me	Me	1	C=S	
972.	Et	Me	Me	2	C=S	
973.	Et	Me	Me	0	C=N-N(CH ₃) ₂	
974.	Et	Me	Me	1	C=N-N(CH ₃) ₂	
975.	Et	Me	Me	2	C=N-N(CH ₃) ₂	
976.	Et	Me	Me	0	O	
977.	Et	Me	Me	1	O	
978.	Et	Me	Me	2	O	
979.	Et	Me	Me	0	S	
980.	Et	Me	Me	1	S	
981.	Et	Me	Me	2	S	
982.	Et	Me	Me	0	SO	
983.	Et	Me	Me	1	SO	
984.	Et	Me	Me	2	SO	
985.	Et	Me	Me	0	SO ₂	
986.	Et	Me	Me	1	SO ₂	
987.	Et	Me	Me	2	SO ₂	
988.	Et	Me	Me	0	NMe	
989.	Et	Me	Me	1	NMe	
990.	Et	Me	Me	2	NMe	
991.	Et	Me	H	0	CH ₂	
992.	Et	Me	H	1	CH ₂	
993.	Et	Me	H	2	CH ₂	
994.	Et	Me	H	0	CHMe	
995.	Et	Me	H	1	CHMe	
996.	Et	Me	H	2	CHMe	
997.	Et	Me	H	0	C(CH ₃) ₂	
998.	Et	Me	H	1	C(CH ₃) ₂	
999.	Et	Me	H	2	C(CH ₃) ₂	

10

20

30

40

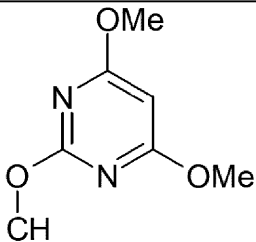
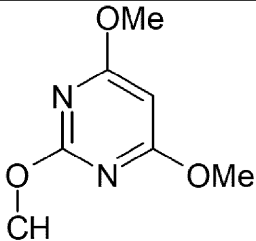
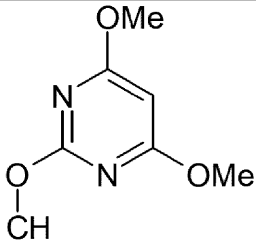
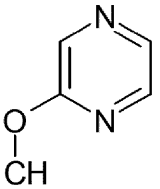
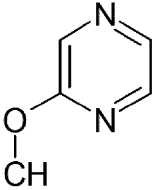
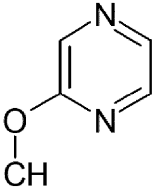
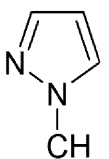
番号	R ²	R ³	R ⁴	m	X	¹ H NMR
1000	Et	Me	H	0	C(OC ₂ H ₄ O)	
1001	Et	Me	H	1	C(OC ₂ H ₄ O)	
1002	Et	Me	H	2	C(OC ₂ H ₄ O)	
1003	Et	Me	H	0	C(SC ₂ H ₄ S)	
1004	Et	Me	H	1	C(SC ₂ H ₄ S)	
1005	Et	Me	H	2	C(SC ₂ H ₄ S)	
1006	Et	Me	H	0	CHOMe	
1007	Et	Me	H	1	CHOMe	
1008	Et	Me	H	2	CHOMe	
1009	Et	Me	H	0	CHOEt	
1010	Et	Me	H	1	CHOEt	
1011	Et	Me	H	2	CHOEt	
1012	Et	Me	H	0	CHOiPr	
1013	Et	Me	H	1	CHOiPr	
1014	Et	Me	H	2	CHOiPr	
1015	Et	Me	H	0	CHOCH ₂ cPr	
1016	Et	Me	H	1	CHOCH ₂ cPr	
1017	Et	Me	H	2	CHOCH ₂ cPr	
1018	Et	Me	H	0	CHOC ₂ H ₄ OMe	
1019	Et	Me	H	1	CHOC ₂ H ₄ OMe	
1020	Et	Me	H	2	CHOC ₂ H ₄ OMe	
1021	Et	Me	H	0	CHOCH ₂ CCH	
1022	Et	Me	H	1	CHOCH ₂ CCH	
1023	Et	Me	H	2	CHOCH ₂ CCH	
1024	Et	Me	H	0	CHOCH ₂ CH=CH ₂	
1025	Et	Me	H	1	CHOCH ₂ CH=CH ₂	
1026	Et	Me	H	2	CHOCH ₂ CH=CH ₂	

10

20

30

40

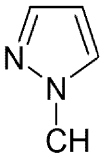
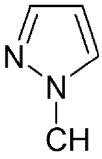
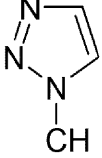
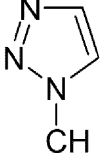
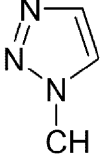
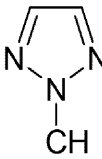
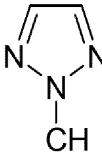
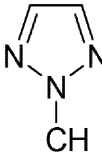
番号	R ²	R ³	R ⁴	m	X	1H NMR
1027	Et	Me	H	0		
1028	Et	Me	H	1		
1029	Et	Me	H	2		
1030	Et	Me	H	0		
1031	Et	Me	H	1		
1032	Et	Me	H	2		
1033	Et	Me	H	0		

10

20

30

40

番号	R ²	R ³	R ⁴	m	X	¹ H NMR
1034	Et	Me	H	1		
1035	Et	Me	H	2		
1036	Et	Me	H	0		
1037	Et	Me	H	1		
1038	Et	Me	H	2		
1039	Et	Me	H	0		
1040	Et	Me	H	1		
1041	Et	Me	H	2		
1042	Et	Me	H	0	CHOC ₂ H ₄ F	
1043	Et	Me	H	1	CHOC ₂ H ₄ F	
1044	Et	Me	H	2	CHOC ₂ H ₄ F	

10

20

30

40

番号	R ²	R ³	R ⁴	m	X	1H NMR
1045	Et	Me	H	0	C=NOMe	
1046	Et	Me	H	1	C=NOMe	
1047	Et	Me	H	2	C=NOMe	
1048	Et	Me	H	0	C=NOCH ₂ CCH	
1049	Et	Me	H	1	C=NOCH ₂ CCH	
1050	Et	Me	H	2	C=NOCH ₂ CCH	
1051	Et	Me	H	0	C=NOCH ₂ CH=CH ₂	
1052	Et	Me	H	1	C=NOCH ₂ CH=CH ₂	
1053	Et	Me	H	2	C=NOCH ₂ CH=CH ₂	
1054	Et	Me	H	0	C=O	
1055	Et	Me	H	1	C=O	
1056	Et	Me	H	2	C=O	
1057	Et	Me	H	0	C=S	
1058	Et	Me	H	1	C=S	
1059	Et	Me	H	2	C=S	
1060	Et	Me	H	0	C=S	
1061	Et	Me	H	1	C=S	
1062	Et	Me	H	2	C=S	
1063	Et	Me	H	0	C=N-N(CH ₃) ₂	
1064	Et	Me	H	1	C=N-N(CH ₃) ₂	
1065	Et	Me	H	2	C=N-N(CH ₃) ₂	
1066	Et	Me	H	0	O	
1067	Et	Me	H	1	O	
1068	Et	Me	H	2	O	
1069	Et	Me	H	0	S	
1070	Et	Me	H	1	S	
1071	Et	Me	H	2	S	
1072	Et	Me	H	0	SO	
1073	Et	Me	H	1	SO	

10

20

30

40

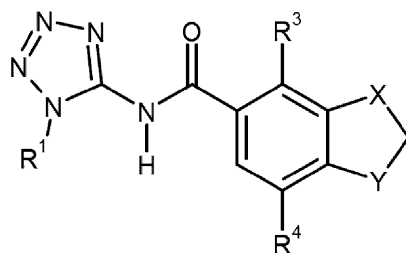
番号	R ²	R ³	R ⁴	m	X	¹ H NMR
1074	Et	Me	H	2	SO	
1075	Et	Me	H	0	SO ₂	
1076	Et	Me	H	1	SO ₂	
1077	Et	Me	H	2	SO ₂	
1078	Et	Me	H	0	NMe	
1079	Et	Me	H	1	NMe	
1080	Et	Me	H	2	NMe	

10

表 4 : Q が Q 1 であり、R⁵ が水素であり、n が 1 である一般式 (I) の本発明の化合物

【 0 1 0 3 】

【 化 2 1 】



20

【 0 1 0 4 】

【表 4】

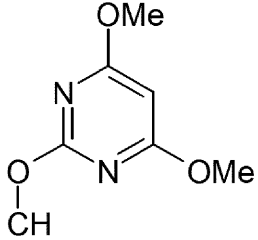
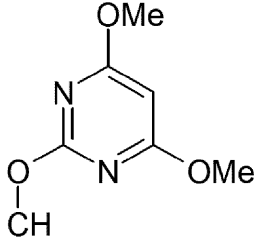
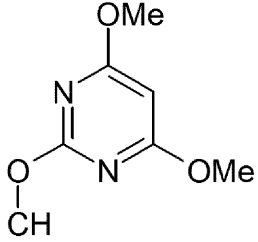
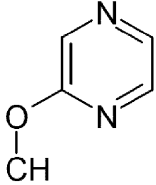
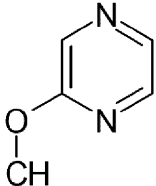
番号	R ¹	R ³	R ⁴	Y	X	¹ H NMR
1081.	Me	Me	Me	S	CH ₂	
1082.	Me	Me	Me	SO	CH ₂	
1083.	Me	Me	Me	SO ₂	CH ₂	
1084.	Me	Me	Me	S	CHMe	
1085.	Me	Me	Me	SO	CHMe	
1086.	Me	Me	Me	SO ₂	CHMe	
1087.	Me	Me	Me	S	C(CH ₃) ₂	
1088.	Me	Me	Me	SO	C(CH ₃) ₂	
1089.	Me	Me	Me	SO ₂	C(CH ₃) ₂	
1090.	Me	Me	Me	S	C(OC ₂ H ₄ O)	
1091.	Me	Me	Me	SO	C(OC ₂ H ₄ O)	
1092.	Me	Me	Me	SO ₂	C(OC ₂ H ₄ O)	
1093.	Me	Me	Me	S	C(SC ₂ H ₄ S)	
1094.	Me	Me	Me	SO	C(SC ₂ H ₄ S)	
1095.	Me	Me	Me	SO ₂	C(SC ₂ H ₄ S)	
1096.	Me	Me	Me	S	CHOMe	
1097.	Me	Me	Me	SO	CHOMe	
1098.	Me	Me	Me	SO ₂	CHOMe	
1099.	Me	Me	Me	S	CHOEt	
1100.	Me	Me	Me	SO	CHOEt	
1101.	Me	Me	Me	SO ₂	CHOEt	
1102.	Me	Me	Me	S	CHOiPr	
1103.	Me	Me	Me	SO	CHOiPr	
1104.	Me	Me	Me	SO ₂	CHOiPr	
1105.	Me	Me	Me	S	CHOCH ₂ cPr	
1106.	Me	Me	Me	SO	CHOCH ₂ cPr	
1107.	Me	Me	Me	SO ₂	CHOCH ₂ cPr	
1108.	Me	Me	Me	S	CHOC ₂ H ₄ OMe	
1109.	Me	Me	Me	SO	CHOC ₂ H ₄ OMe	

10

20

30

40

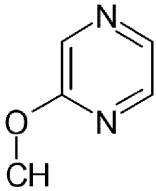
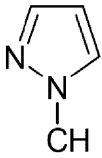
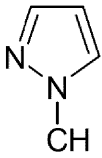
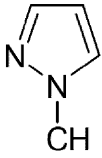
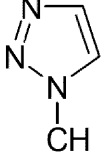
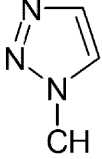
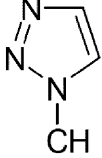
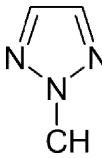
番号	R ¹	R ³	R ⁴	Y	X	¹ H NMR
1110.	Me	Me	Me	SO ₂	CHOC ₂ H ₄ OMe	
1111.	Me	Me	Me	S	CHOCH ₂ CCH	
1112.	Me	Me	Me	SO	CHOCH ₂ CCH	
1113.	Me	Me	Me	SO ₂	CHOCH ₂ CCH	
1114.	Me	Me	Me	S	CHOCH ₂ CH=CH ₂	
1115.	Me	Me	Me	SO	CHOCH ₂ CH=CH ₂	
1116.	Me	Me	Me	SO ₂	CHOCH ₂ CH=CH ₂	
1117.	Me	Me	Me	S		
1118.	Me	Me	Me	SO		
1119.	Me	Me	Me	SO ₂		
1120.	Me	Me	Me	S		
1121.	Me	Me	Me	SO		

10

20

30

40

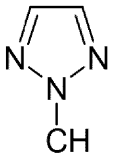
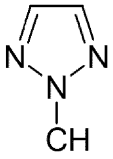
番号	R ¹	R ³	R ⁴	Y	X	¹ H NMR
1122.	Me	Me	Me	SO ₂		
1123.	Me	Me	Me	S		
1124.	Me	Me	Me	SO		
1125.	Me	Me	Me	SO ₂		
1126.	Me	Me	Me	S		
1127.	Me	Me	Me	SO		
1128.	Me	Me	Me	SO ₂		
1129.	Me	Me	Me	S		

10

20

30

40

番号	R ¹	R ³	R ⁴	Y	X	¹ H NMR
1130.	Me	Me	Me	SO		
1131.	Me	Me	Me	SO ₂		
1132.	Me	Me	Me	S	CHOC ₂ H ₄ F	
1133.	Me	Me	Me	SO	CHOC ₂ H ₄ F	
1134.	Me	Me	Me	SO ₂	CHOC ₂ H ₄ F	
1135.	Me	Me	Me	S	C=NOMe	
1136.	Me	Me	Me	SO	C=NOMe	
1137.	Me	Me	Me	SO ₂	C=NOMe	
1138.	Me	Me	Me	S	C=NOCH ₂ CCH	
1139.	Me	Me	Me	SO	C=NOCH ₂ CCH	
1140.	Me	Me	Me	SO ₂	C=NOCH ₂ CCH	
1141.	Me	Me	Me	S	C=NOCH ₂ CH=CH ₂	
1142.	Me	Me	Me	SO	C=NOCH ₂ CH=CH ₂	
1143.	Me	Me	Me	SO ₂	C=NOCH ₂ CH=CH ₂	
1144.	Me	Me	Me	S	C=O	
1145.	Me	Me	Me	SO	C=O	
1146.	Me	Me	Me	SO ₂	C=O	
1147.	Me	Me	Me	S	C=S	
1148.	Me	Me	Me	SO	C=S	
1149.	Me	Me	Me	SO ₂	C=S	
1150.	Me	Me	Me	S	C=S	
1151.	Me	Me	Me	SO	C=S	
1152.	Me	Me	Me	SO ₂	C=S	
1153.	Me	Me	Me	S	C=N-N(CH ₃) ₂	

10

20

30

40

番号	R ¹	R ³	R ⁴	Y	X	1H NMR
1154.	Me	Me	Me	SO	C=N-N(CH ₃) ₂	
1155.	Me	Me	Me	SO ₂	C=N-N(CH ₃) ₂	
1156.	Me	Me	Me	S	O	
1157.	Me	Me	Me	SO	O	
1158.	Me	Me	Me	SO ₂	O	
1159.	Me	Me	Me	S	S	
1160.	Me	Me	Me	SO	S	
1161.	Me	Me	Me	SO ₂	S	
1162.	Me	Me	Me	S	SO	
1163.	Me	Me	Me	SO	SO	
1164.	Me	Me	Me	SO ₂	SO	
1165.	Me	Me	Me	S	SO ₂	
1166.	Me	Me	Me	SO	SO ₂	
1167.	Me	Me	Me	SO ₂	SO ₂	
1168.	Me	Me	Me	S	NMe	
1169.	Me	Me	Me	SO	NMe	
1170.	Me	Me	Me	SO ₂	NMe	
1171.	Me	Me	Me	O	O	
1172.	Me	Me	H	O	O	DMSO-d ₆ , 400 MHz: 11.33 (s,1H), 7.34 (d,1H), 6.92 (d,1H), 6.12 (s,2H), 3.93 (s,3H), 2.30 (s,3H)
1173.	Me	SMe	H	O	O	DMSO-d ₆ , 400 MHz: 11.50 (bs,1H), 7.21 (d,1H), 6.99 (d,1H), 6.18 (s,2H), 3.96 (s,3H), 2.44 (s,3H)
1174.	Me	Cl	H	O	O	
1175.	Me	Cl	H	S	CH ₂	
1176.	Me	Cl	H	SO	CH ₂	
1177.	Me	Cl	H	SO ₂	CH ₂	DMSO, 400 MHz: 3.41 (t,2H), 3.76 (t,2H), 4.02 (s,3H), 7.94 (s,2H), 11.95 (s,1H)

10

20

30

40

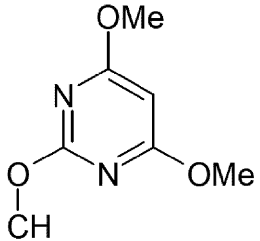
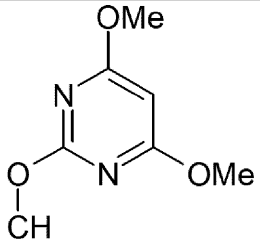
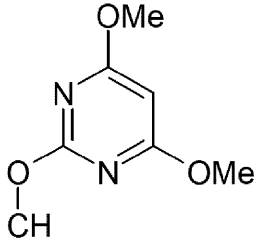
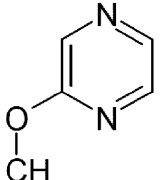
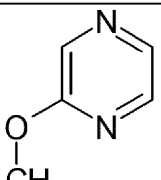
番号	R ¹	R ³	R ⁴	Y	X	1H NMR
1178.	Me	Cl	H	S	CHMe	
1179.	Me	Cl	H	SO	CHMe	
1180.	Me	Cl	H	SO ₂	CHMe	
1181.	Me	Cl	H	S	C(CH ₃) ₂	
1182.	Me	Cl	H	SO	C(CH ₃) ₂	
1183.	Me	Cl	H	SO ₂	C(CH ₃) ₂	
1184.	Me	Cl	H	S	C(OC ₂ H ₄ O)	
1185.	Me	Cl	H	SO	C(OC ₂ H ₄ O)	
1186.	Me	Cl	H	SO ₂	C(OC ₂ H ₄ O)	
1187.	Me	Cl	H	S	C(SC ₂ H ₄ S)	
1188.	Me	Cl	H	SO	C(SC ₂ H ₄ S)	
1189.	Me	Cl	H	SO ₂	C(SC ₂ H ₄ S)	
1190.	Me	Cl	H	S	CHOMe	
1191.	Me	Cl	H	SO	CHOMe	
1192.	Me	Cl	H	SO ₂	CHOMe	CDCl ₃ , 400 MHz: 3.57 (s,3H), 3.68 (dd,1H), 3.81 (d,1H), 4.13 (s,3H), 5.25 (d,1H), 7.80 (d,1H), 7.98 (d,1H), 9.85 (s,1H)
1193.	Me	Cl	H	S	CHOEt	
1194.	Me	Cl	H	SO	CHOEt	
1195.	Me	Cl	H	SO ₂	CHOEt	
1196.	Me	Cl	H	S	CHOiPr	
1197.	Me	Cl	H	SO	CHOiPr	
1198.	Me	Cl	H	SO ₂	CHOiPr	
1199.	Me	Cl	H	S	CHOCH ₂ cPr	
1200.	Me	Cl	H	SO	CHOCH ₂ cPr	
1201.	Me	Cl	H	SO ₂	CHOCH ₂ cPr	
1202.	Me	Cl	H	S	CHOC ₂ H ₄ OMe	
1203.	Me	Cl	H	SO	CHOC ₂ H ₄ OMe	
1204.	Me	Cl	H	SO ₂	CHOC ₂ H ₄ OMe	

10

20

30

40

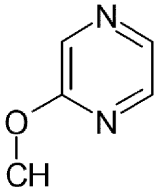
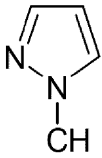
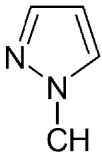
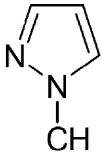
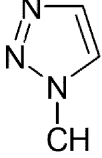
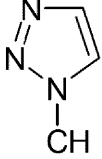
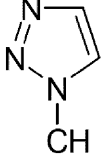
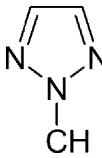
番号	R ¹	R ³	R ⁴	Y	X	¹ H NMR
1205.	Me	Cl	H	S	CHOCH ₂ CCH	
1206.	Me	Cl	H	SO	CHOCH ₂ CCH	
1207.	Me	Cl	H	SO ₂	CHOCH ₂ CCH	
1208.	Me	Cl	H	S	CHOCH ₂ CH=CH ₂	
1209.	Me	Cl	H	SO	CHOCH ₂ CH=CH ₂	
1210.	Me	Cl	H	SO ₂	CHOCH ₂ CH=CH ₂	
1211.	Me	Cl	H	S		
1212.	Me	Cl	H	SO		
1213.	Me	Cl	H	SO ₂		
1214.	Me	Cl	H	S		
1215.	Me	Cl	H	SO		

10

20

30

40

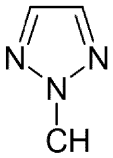
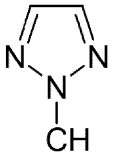
番号	R ¹	R ³	R ⁴	Y	X	¹ H NMR
1216.	Me	Cl	H	SO ₂		
1217.	Me	Cl	H	S		
1218.	Me	Cl	H	SO		
1219.	Me	Cl	H	SO ₂		
1220.	Me	Cl	H	S		
1221.	Me	Cl	H	SO		
1222.	Me	Cl	H	SO ₂		
1223.	Me	Cl	H	S		

10

20

30

40

番号	R ¹	R ³	R ⁴	Y	X	¹ H NMR
1224.	Me	Cl	H	SO		
1225.	Me	Cl	H	SO ₂		
1226.	Me	Cl	H	S	CHOC ₂ H ₄ F	
1227.	Me	Cl	H	SO	CHOC ₂ H ₄ F	
1228.	Me	Cl	H	SO ₂	CHOC ₂ H ₄ F	
1229.	Me	Cl	H	S	C=NOMe	
1230.	Me	Cl	H	SO	C=NOMe	
1231.	Me	Cl	H	SO ₂	C=NOMe	
1232.	Me	Cl	H	S	C=NOCH ₂ CCH	
1233.	Me	Cl	H	SO	C=NOCH ₂ CCH	
1234.	Me	Cl	H	SO ₂	C=NOCH ₂ CCH	
1235.	Me	Cl	H	S	C=NOCH ₂ CH=CH ₂	
1236.	Me	Cl	H	SO	C=NOCH ₂ CH=CH ₂	
1237.	Me	Cl	H	SO ₂	C=NOCH ₂ CH=CH ₂	
1238.	Me	Cl	H	S	C=O	
1239.	Me	Cl	H	SO	C=O	
1240.	Me	Cl	H	SO ₂	C=O	
1241.	Me	Cl	H	S	C=S	
1242.	Me	Cl	H	SO	C=S	
1243.	Me	Cl	H	SO ₂	C=S	
1244.	Me	Cl	H	S	C=S	
1245.	Me	Cl	H	SO	C=S	
1246.	Me	Cl	H	SO ₂	C=S	
1247.	Me	Cl	H	S	C=N-N(CH ₃) ₂	

10

20

30

40

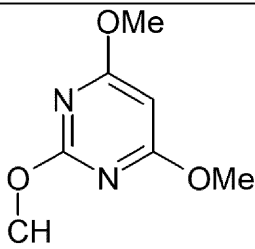
番号	R ¹	R ³	R ⁴	Y	X	¹ H NMR
1248.	Me	Cl	H	SO	C=N-N(CH ₃) ₂	
1249.	Me	Cl	H	SO ₂	C=N-N(CH ₃) ₂	
1250.	Me	Cl	H	S	O	
1251.	Me	Cl	H	SO	O	
1252.	Me	Cl	H	SO ₂	O	
1253.	Me	Cl	H	S	S	
1254.	Me	Cl	H	SO	S	
1255.	Me	Cl	H	SO ₂	S	
1256.	Me	Cl	H	S	SO	
1257.	Me	Cl	H	SO	SO	
1258.	Me	Cl	H	SO ₂	SO	
1259.	Me	Cl	H	S	SO ₂	
1260.	Me	Cl	H	SO	SO ₂	
1261.	Me	Cl	H	SO ₂	SO ₂	
1262.	Me	Cl	H	S	NMe	
1263.	Me	Cl	H	SO	NMe	
1264.	Me	Cl	H	SO ₂	NMe	
1265.	Et	Me	Me	S	CH ₂	
1266.	Et	Me	Me	SO	CH ₂	
1267.	Et	Me	Me	SO ₂	CH ₂	
1268.	Et	Me	Me	S	CHMe	
1269.	Et	Me	Me	SO	CHMe	
1270.	Et	Me	Me	SO ₂	CHMe	
1271.	Et	Me	Me	S	C(CH ₃) ₂	
1272.	Et	Me	Me	SO	C(CH ₃) ₂	
1273.	Et	Me	Me	SO ₂	C(CH ₃) ₂	
1274.	Et	Me	Me	S	C(OC ₂ H ₄ O)	
1275.	Et	Me	Me	SO	C(OC ₂ H ₄ O)	
1276.	Et	Me	Me	SO ₂	C(OC ₂ H ₄ O)	

10

20

30

40

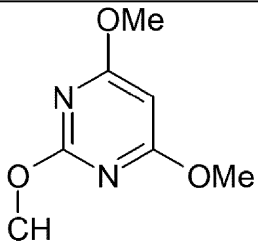
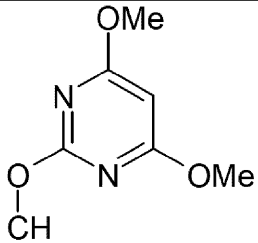
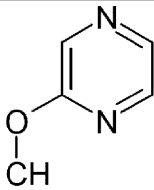
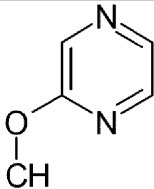
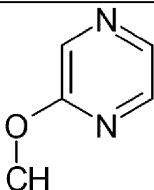
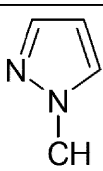
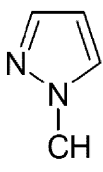
番号	R ¹	R ³	R ⁴	Y	X	¹ H NMR
1277.	Et	Me	Me	S	C(SC ₂ H ₄ S)	
1278.	Et	Me	Me	SO	C(SC ₂ H ₄ S)	
1279.	Et	Me	Me	SO ₂	C(SC ₂ H ₄ S)	
1280.	Et	Me	Me	S	CHOMe	
1281.	Et	Me	Me	SO	CHOMe	
1282.	Et	Me	Me	SO ₂	CHOMe	
1283.	Et	Me	Me	S	CHOEt	
1284.	Et	Me	Me	SO	CHOEt	
1285.	Et	Me	Me	SO ₂	CHOEt	
1286.	Et	Me	Me	S	CHOiPr	
1287.	Et	Me	Me	SO	CHOiPr	
1288.	Et	Me	Me	SO ₂	CHOiPr	
1289.	Et	Me	Me	S	CHOCH ₂ cPr	
1290.	Et	Me	Me	SO	CHOCH ₂ cPr	
1291.	Et	Me	Me	SO ₂	CHOCH ₂ cPr	
1292.	Et	Me	Me	S	CHOC ₂ H ₄ OMe	
1293.	Et	Me	Me	SO	CHOC ₂ H ₄ OMe	
1294.	Et	Me	Me	SO ₂	CHOC ₂ H ₄ OMe	
1295.	Et	Me	Me	S	CHOCH ₂ CCH	
1296.	Et	Me	Me	SO	CHOCH ₂ CCH	
1297.	Et	Me	Me	SO ₂	CHOCH ₂ CCH	
1298.	Et	Me	Me	S	CHOCH ₂ CH=CH ₂	
1299.	Et	Me	Me	SO	CHOCH ₂ CH=CH ₂	
1300.	Et	Me	Me	SO ₂	CHOCH ₂ CH=CH ₂	
1301.	Et	Me	Me	S		

10

20

30

40

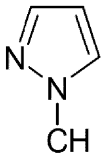
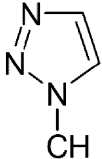
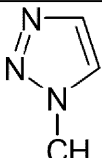
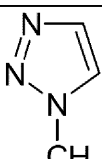
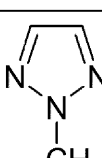
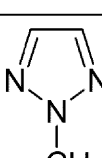
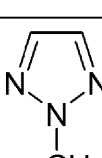
番号	R ¹	R ³	R ⁴	Y	X	¹ H NMR
1302.	Et	Me	Me	SO		
1303.	Et	Me	Me	SO ₂		
1304.	Et	Me	Me	S		
1305.	Et	Me	Me	SO		
1306.	Et	Me	Me	SO ₂		
1307.	Et	Me	Me	S		
1308.	Et	Me	Me	SO		

10

20

30

40

番号	R ¹	R ³	R ⁴	Y	X	¹ H NMR
1309.	Et	Me	Me	SO ₂		
1310.	Et	Me	Me	S		
1311.	Et	Me	Me	SO		
1312.	Et	Me	Me	SO ₂		
1313.	Et	Me	Me	S		
1314.	Et	Me	Me	SO		
1315.	Et	Me	Me	SO ₂		
1316.	Et	Me	Me	S	CHOC ₂ H ₄ F	
1317.	Et	Me	Me	SO	CHOC ₂ H ₄ F	
1318.	Et	Me	Me	SO ₂	CHOC ₂ H ₄ F	
1319.	Et	Me	Me	S	C=NOMe	
1320.	Et	Me	Me	SO	C=NOMe	
1321.	Et	Me	Me	SO ₂	C=NOMe	

10

20

30

40

番号	R ¹	R ³	R ⁴	Y	X	¹ H NMR
1322.	Et	Me	Me	S	C=NOCH ₂ CCH	
1323.	Et	Me	Me	SO	C=NOCH ₂ CCH	
1324.	Et	Me	Me	SO ₂	C=NOCH ₂ CCH	
1325.	Et	Me	Me	S	C=NOCH ₂ CH=CH ₂	
1326.	Et	Me	Me	SO	C=NOCH ₂ CH=CH ₂	
1327.	Et	Me	Me	SO ₂	C=NOCH ₂ CH=CH ₂	
1328.	Et	Me	Me	S	C=O	
1329.	Et	Me	Me	SO	C=O	
1330.	Et	Me	Me	SO ₂	C=O	
1331.	Et	Me	Me	S	C=S	
1332.	Et	Me	Me	SO	C=S	
1333.	Et	Me	Me	SO ₂	C=S	
1334.	Et	Me	Me	S	C=S	
1335.	Et	Me	Me	SO	C=S	
1336.	Et	Me	Me	SO ₂	C=S	
1337.	Et	Me	Me	S	C=N-N(CH ₃) ₂	
1338.	Et	Me	Me	SO	C=N-N(CH ₃) ₂	
1339.	Et	Me	Me	SO ₂	C=N-N(CH ₃) ₂	
1340.	Et	Me	Me	S	O	
1341.	Et	Me	Me	SO	O	
1342.	Et	Me	Me	SO ₂	O	
1343.	Et	Me	Me	S	S	
1344.	Et	Me	Me	SO	S	
1345.	Et	Me	Me	SO ₂	S	
1346.	Et	Me	Me	S	SO	
1347.	Et	Me	Me	SO	SO	
1348.	Et	Me	Me	SO ₂	SO	
1349.	Et	Me	Me	S	SO ₂	
1350.	Et	Me	Me	SO	SO ₂	

10

20

30

40

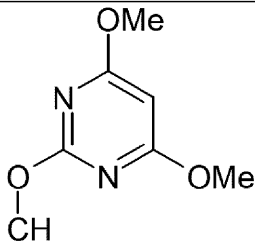
番号	R ¹	R ³	R ⁴	Y	X	1H NMR
1351.	Et	Me	Me	SO ₂	SO ₂	
1352.	Et	Me	Me	S	NMe	
1353.	Et	Me	Me	SO	NMe	
1354.	Et	Me	Me	SO ₂	NMe	
1355.	Et	Me	Me	O	O	
1356.	Et	Me	H	O	O	CDCl ₃ , 400 MHz: 9.65 (s, 1H), 7.42 (d, 1H), 6.79 (d, 1H), 6.06 (s, 2H), 4.43 (q, 2H), 2.41 (s, 3H), 1.60 (t, 3H)
1357.	Et	SMe	H	O	O	
1358.	Et	Cl	H	O	O	
1359.	Et	Cl	H	S	CH ₂	
1360.	Et	Cl	H	SO	CH ₂	
1361.	Et	Cl	H	SO ₂	CH ₂	DMSO, 400 MHz: 1.48 (t, 3H), 3.42 (t, 2H), 3.75 (t, 2H), 4.38 (q, 2H), 7.93 (s, 2H), 11.86 (s, 1H)
1362.	Et	Cl	H	S	CHMe	
1363.	Et	Cl	H	SO	CHMe	
1364.	Et	Cl	H	SO ₂	CHMe	
1365.	Et	Cl	H	S	C(CH ₃) ₂	
1366.	Et	Cl	H	SO	C(CH ₃) ₂	
1367.	Et	Cl	H	SO ₂	C(CH ₃) ₂	
1368.	Et	Cl	H	S	C(OC ₂ H ₄ O)	
1369.	Et	Cl	H	SO	C(OC ₂ H ₄ O)	
1370.	Et	Cl	H	SO ₂	C(OC ₂ H ₄ O)	
1371.	Et	Cl	H	S	C(SC ₂ H ₄ S)	
1372.	Et	Cl	H	SO	C(SC ₂ H ₄ S)	
1373.	Et	Cl	H	SO ₂	C(SC ₂ H ₄ S)	
1374.	Et	Cl	H	S	CHOMe	
1375.	Et	Cl	H	SO	CHOMe	
1376.	Et	Cl	H	SO ₂	CHOMe	CDCl ₃ , 400 MHz: 1.62 (t, 3H),

10

20

30

40

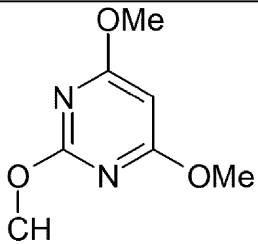
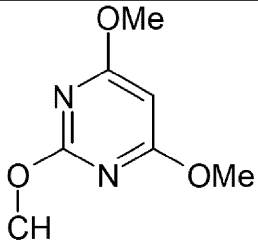
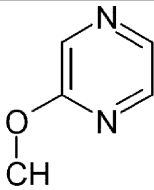
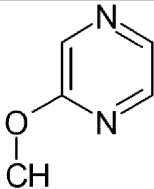
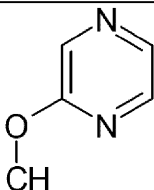
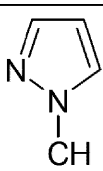
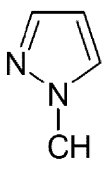
番号	R ¹	R ³	R ⁴	Y	X	¹ H NMR
						3.55 (s,3H), 3.66 (dd,1H), 3.81 (d,1H), 4.47 (q,2H), 5.23 (d,1H), 7.75 (d,1H), 7.94 (d,1H), 10.6 (s,1H)
1377.	Et	Cl	H	S	CHOEt	
1378.	Et	Cl	H	SO	CHOEt	
1379.	Et	Cl	H	SO ₂	CHOEt	
1380.	Et	Cl	H	S	CHOiPr	
1381.	Et	Cl	H	SO	CHOiPr	
1382.	Et	Cl	H	SO ₂	CHOiPr	
1383.	Et	Cl	H	S	CHOCH ₂ cPr	
1384.	Et	Cl	H	SO	CHOCH ₂ cPr	
1385.	Et	Cl	H	SO ₂	CHOCH ₂ cPr	
1386.	Et	Cl	H	S	CHOC ₂ H ₄ OMe	
1387.	Et	Cl	H	SO	CHOC ₂ H ₄ OMe	
1388.	Et	Cl	H	SO ₂	CHOC ₂ H ₄ OMe	
1389.	Et	Cl	H	S	CHOCH ₂ CCH	
1390.	Et	Cl	H	SO	CHOCH ₂ CCH	
1391.	Et	Cl	H	SO ₂	CHOCH ₂ CCH	
1392.	Et	Cl	H	S	CHOCH ₂ CH=CH ₂	
1393.	Et	Cl	H	SO	CHOCH ₂ CH=CH ₂	
1394.	Et	Cl	H	SO ₂	CHOCH ₂ CH=CH ₂	
1395.	Et	Cl	H	S		

10

20

30

40

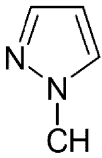
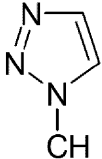
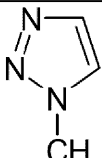
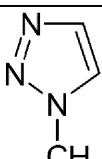
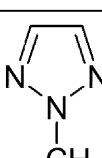
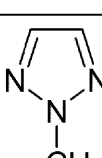
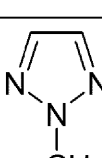
番号	R ¹	R ³	R ⁴	Y	X	1H NMR
1396.	Et	Cl	H	SO		
1397.	Et	Cl	H	SO ₂		
1398.	Et	Cl	H	S		
1399.	Et	Cl	H	SO		
1400.	Et	Cl	H	SO ₂		
1401.	Et	Cl	H	S		
1402.	Et	Cl	H	SO		

10

20

30

40

番号	R ¹	R ³	R ⁴	Y	X	¹ H NMR
1403.	Et	Cl	H	SO ₂		
1404.	Et	Cl	H	S		
1405.	Et	Cl	H	SO		
1406.	Et	Cl	H	SO ₂		
1407.	Et	Cl	H	S		
1408.	Et	Cl	H	SO		
1409.	Et	Cl	H	SO ₂		
1410.	Et	Cl	H	S	CHOC ₂ H ₄ F	
1411.	Et	Cl	H	SO	CHOC ₂ H ₄ F	
1412.	Et	Cl	H	SO ₂	CHOC ₂ H ₄ F	
1413.	Et	Cl	H	S	C=NOMe	
1414.	Et	Cl	H	SO	C=NOMe	
1415.	Et	Cl	H	SO ₂	C=NOMe	

10

20

30

40

番号	R ¹	R ³	R ⁴	Y	X	¹ H NMR
1416.	Et	Cl	H	S	C=NOCH ₂ CCH	
1417.	Et	Cl	H	SO	C=NOCH ₂ CCH	
1418.	Et	Cl	H	SO ₂	C=NOCH ₂ CCH	
1419.	Et	Cl	H	S	C=NOCH ₂ CH=CH ₂	
1420.	Et	Cl	H	SO	C=NOCH ₂ CH=CH ₂	
1421.	Et	Cl	H	SO ₂	C=NOCH ₂ CH=CH ₂	
1422.	Et	Cl	H	S	C=O	
1423.	Et	Cl	H	SO	C=O	
1424.	Et	Cl	H	SO ₂	C=O	
1425.	Et	Cl	H	S	C=S	
1426.	Et	Cl	H	SO	C=S	
1427.	Et	Cl	H	SO ₂	C=S	
1428.	Et	Cl	H	S	C=S	
1429.	Et	Cl	H	SO	C=S	
1430.	Et	Cl	H	SO ₂	C=S	
1431.	Et	Cl	H	S	C=N-N(CH ₃) ₂	
1432.	Et	Cl	H	SO	C=N-N(CH ₃) ₂	
1433.	Et	Cl	H	SO ₂	C=N-N(CH ₃) ₂	
1434.	Et	Cl	H	S	O	
1435.	Et	Cl	H	SO	O	
1436.	Et	Cl	H	SO ₂	O	
1437.	Et	Cl	H	S	S	
1438.	Et	Cl	H	SO	S	
1439.	Et	Cl	H	SO ₂	S	
1440.	Et	Cl	H	S	SO	
1441.	Et	Cl	H	SO	SO	
1442.	Et	Cl	H	SO ₂	SO	
1443.	Et	Cl	H	S	SO ₂	
1444.	Et	Cl	H	SO	SO ₂	

10

20

30

40

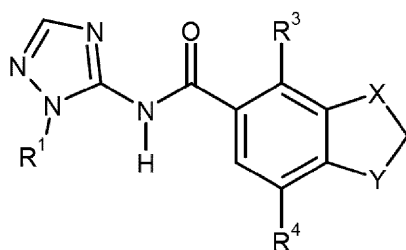
番号	R ¹	R ³	R ⁴	Y	X	¹ H NMR
1445.	Et	Cl	H	SO ₂	SO ₂	
1446.	Et	Cl	H	S	NMe	
1447.	Et	Cl	H	SO	NMe	
1448.	Et	Cl	H	SO ₂	NMe	

表 5 : Q が Q 2 であり、R⁵ が水素であり、n が 1 である一般式 (I) の本発明の化合物

10

【 0 1 0 5 】

【 化 2 2 】



20

【 0 1 0 6 】

【表 5】

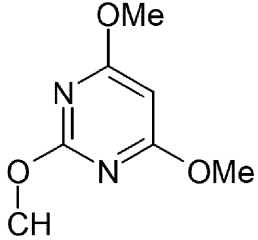
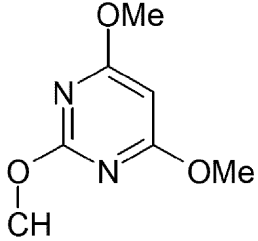
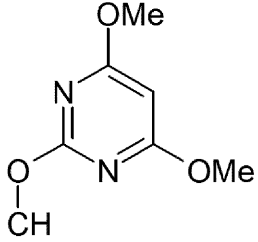
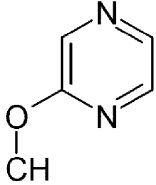
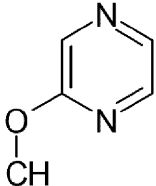
番号	R ¹	R ³	R ⁴	Y	X	¹ H NMR
1449.	Me	Me	Me	S	CH ₂	
1450.	Me	Me	Me	SO	CH ₂	
1451.	Me	Me	Me	SO ₂	CH ₂	
1452.	Me	Me	Me	S	CHMe	
1453.	Me	Me	Me	SO	CHMe	
1454.	Me	Me	Me	SO ₂	CHMe	
1455.	Me	Me	Me	S	C(CH ₃) ₂	
1456.	Me	Me	Me	SO	C(CH ₃) ₂	
1457.	Me	Me	Me	SO ₂	C(CH ₃) ₂	
1458.	Me	Me	Me	S	C(OC ₂ H ₄ O)	
1459.	Me	Me	Me	SO	C(OC ₂ H ₄ O)	
1460.	Me	Me	Me	SO ₂	C(OC ₂ H ₄ O)	
1461.	Me	Me	Me	S	C(SC ₂ H ₄ S)	
1462.	Me	Me	Me	SO	C(SC ₂ H ₄ S)	
1463.	Me	Me	Me	SO ₂	C(SC ₂ H ₄ S)	
1464.	Me	Me	Me	S	CHOMe	
1465.	Me	Me	Me	SO	CHOMe	
1466.	Me	Me	Me	SO ₂	CHOMe	
1467.	Me	Me	Me	S	CHOEt	
1468.	Me	Me	Me	SO	CHOEt	
1469.	Me	Me	Me	SO ₂	CHOEt	
1470.	Me	Me	Me	S	CHOiPr	
1471.	Me	Me	Me	SO	CHOiPr	
1472.	Me	Me	Me	SO ₂	CHOiPr	
1473.	Me	Me	Me	S	CHOCH ₂ cPr	
1474.	Me	Me	Me	SO	CHOCH ₂ cPr	
1475.	Me	Me	Me	SO ₂	CHOCH ₂ cPr	
1476.	Me	Me	Me	S	CHOC ₂ H ₄ OMe	
1477.	Me	Me	Me	SO	CHOC ₂ H ₄ OMe	

10

20

30

40

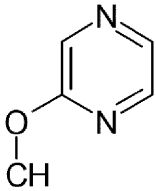
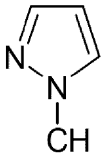
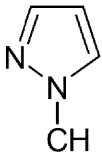
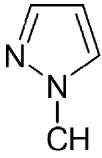
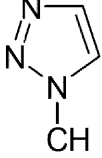
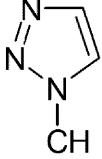
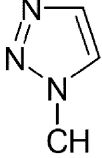
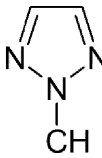
番号	R ¹	R ³	R ⁴	Y	X	¹ H NMR
1478.	Me	Me	Me	SO ₂	CHOC ₂ H ₄ OMe	
1479.	Me	Me	Me	S	CHOCH ₂ CCH	
1480.	Me	Me	Me	SO	CHOCH ₂ CCH	
1481.	Me	Me	Me	SO ₂	CHOCH ₂ CCH	
1482.	Me	Me	Me	S	CHOCH ₂ CH=CH ₂	
1483.	Me	Me	Me	SO	CHOCH ₂ CH=CH ₂	
1484.	Me	Me	Me	SO ₂	CHOCH ₂ CH=CH ₂	
1485.	Me	Me	Me	S		
1486.	Me	Me	Me	SO		
1487.	Me	Me	Me	SO ₂		
1488.	Me	Me	Me	S		
1489.	Me	Me	Me	SO		

10

20

30

40

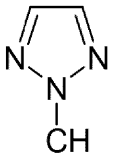
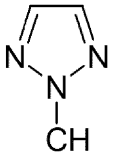
番号	R ¹	R ³	R ⁴	Y	X	¹ H NMR
1490.	Me	Me	Me	SO ₂		
1491.	Me	Me	Me	S		
1492.	Me	Me	Me	SO		
1493.	Me	Me	Me	SO ₂		
1494.	Me	Me	Me	S		
1495.	Me	Me	Me	SO		
1496.	Me	Me	Me	SO ₂		
1497.	Me	Me	Me	S		

10

20

30

40

番号	R ¹	R ³	R ⁴	Y	X	¹ H NMR
1498.	Me	Me	Me	SO		
1499.	Me	Me	Me	SO ₂		
1500.	Me	Me	Me	S	CHOC ₂ H ₄ F	
1501.	Me	Me	Me	SO	CHOC ₂ H ₄ F	
1502.	Me	Me	Me	SO ₂	CHOC ₂ H ₄ F	
1503.	Me	Me	Me	S	C=NOMe	
1504.	Me	Me	Me	SO	C=NOMe	
1505.	Me	Me	Me	SO ₂	C=NOMe	
1506.	Me	Me	Me	S	C=NOCH ₂ CCH	
1507.	Me	Me	Me	SO	C=NOCH ₂ CCH	
1508.	Me	Me	Me	SO ₂	C=NOCH ₂ CCH	
1509.	Me	Me	Me	S	C=NOCH ₂ CH=CH ₂	
1510.	Me	Me	Me	SO	C=NOCH ₂ CH=CH ₂	
1511.	Me	Me	Me	SO ₂	C=NOCH ₂ CH=CH ₂	
1512.	Me	Me	Me	S	C=O	
1513.	Me	Me	Me	SO	C=O	
1514.	Me	Me	Me	SO ₂	C=O	
1515.	Me	Me	Me	S	C=S	
1516.	Me	Me	Me	SO	C=S	
1517.	Me	Me	Me	SO ₂	C=S	
1518.	Me	Me	Me	S	C=S	
1519.	Me	Me	Me	SO	C=S	
1520.	Me	Me	Me	SO ₂	C=S	
1521.	Me	Me	Me	S	C=N-N(CH ₃) ₂	

10

20

30

40

番号	R ¹	R ³	R ⁴	Y	X	1H NMR
1522.	Me	Me	Me	SO	C=N-N(CH ₃) ₂	
1523.	Me	Me	Me	SO ₂	C=N-N(CH ₃) ₂	
1524.	Me	Me	Me	S	O	
1525.	Me	Me	Me	SO	O	
1526.	Me	Me	Me	SO ₂	O	
1527.	Me	Me	Me	S	S	
1528.	Me	Me	Me	SO	S	
1529.	Me	Me	Me	SO ₂	S	
1530.	Me	Me	Me	S	SO	
1531.	Me	Me	Me	SO	SO	
1532.	Me	Me	Me	SO ₂	SO	
1533.	Me	Me	Me	S	SO ₂	
1534.	Me	Me	Me	SO	SO ₂	
1535.	Me	Me	Me	SO ₂	SO ₂	
1536.	Me	Me	Me	S	NMe	
1537.	Me	Me	Me	SO	NMe	
1538.	Me	Me	Me	SO ₂	NMe	
1539.	Me	Me	Me	O	O	
1540.	Me	Me	H	O	O	
1541.	Me	SMe	H	O	O	
1542.	Me	Cl	H	O	O	
1543.	Me	Cl	H	S	CH ₂	
1544.	Me	Cl	H	SO	CH ₂	
1545.	Me	Cl	H	SO ₂	CH ₂	DMSO, 400 MHz: 3.40 (t,2H), 3.74 (t,2H), 3.79 (s,3H), 7.89 (br,3H), 11.39 (s,1H)
1546.	Me	Cl	H	S	CHMe	
1547.	Me	Cl	H	SO	CHMe	
1548.	Me	Cl	H	SO ₂	CHMe	
1549.	Me	Cl	H	S	C(CH ₃) ₂	

10

20

30

40

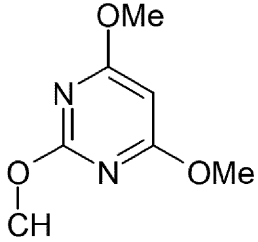
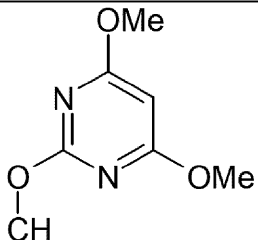
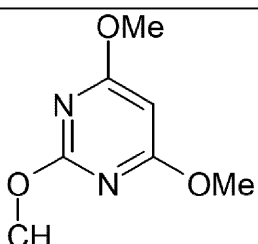
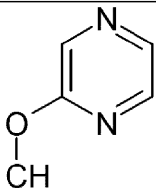
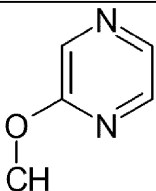
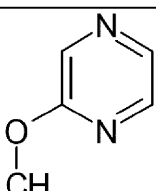
番号	R ¹	R ³	R ⁴	Y	X	1H NMR
1550.	Me	Cl	H	SO	C(CH ₃) ₂	
1551.	Me	Cl	H	SO ₂	C(CH ₃) ₂	
1552.	Me	Cl	H	S	C(OC ₂ H ₄ O)	
1553.	Me	Cl	H	SO	C(OC ₂ H ₄ O)	
1554.	Me	Cl	H	SO ₂	C(OC ₂ H ₄ O)	
1555.	Me	Cl	H	S	C(SC ₂ H ₄ S)	
1556.	Me	Cl	H	SO	C(SC ₂ H ₄ S)	
1557.	Me	Cl	H	SO ₂	C(SC ₂ H ₄ S)	
1558.	Me	Cl	H	S	CHOMe	
1559.	Me	Cl	H	SO	CHOMe	
1560.	Me	Cl	H	SO ₂	CHOMe	CDCl ₃ , 400 MHz: 3.56 (s,3H), 3.68 (dd,1H), 3.71 (d,1H), 3.87 (s,3H), 5.21 (d,1H), 7.64 (s,1H), 7.73 (d,1H), 7.91 (d,1H), 9.85 (s,1H)
1561.	Me	Cl	H	S	CHOEt	
1562.	Me	Cl	H	SO	CHOEt	
1563.	Me	Cl	H	SO ₂	CHOEt	
1564.	Me	Cl	H	S	CHOiPr	
1565.	Me	Cl	H	SO	CHOiPr	
1566.	Me	Cl	H	SO ₂	CHOiPr	
1567.	Me	Cl	H	S	CHOCH ₂ cPr	
1568.	Me	Cl	H	SO	CHOCH ₂ cPr	
1569.	Me	Cl	H	SO ₂	CHOCH ₂ cPr	
1570.	Me	Cl	H	S	CHOC ₂ H ₄ OMe	
1571.	Me	Cl	H	SO	CHOC ₂ H ₄ OMe	
1572.	Me	Cl	H	SO ₂	CHOC ₂ H ₄ OMe	
1573.	Me	Cl	H	S	CHOCH ₂ CCH	
1574.	Me	Cl	H	SO	CHOCH ₂ CCH	
1575.	Me	Cl	H	SO ₂	CHOCH ₂ CCH	
1576.	Me	Cl	H	S	CHOCH ₂ CH=CH ₂	

10

20

30

40

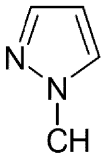
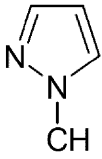
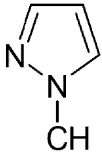
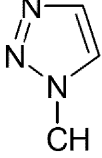
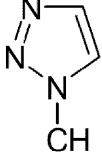
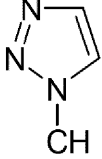
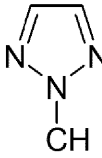
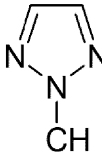
番号	R ¹	R ³	R ⁴	Y	X	1H NMR
1577.	Me	Cl	H	SO	CHOCH ₂ CH=CH ₂	
1578.	Me	Cl	H	SO ₂	CHOCH ₂ CH=CH ₂	
1579.	Me	Cl	H	S		
1580.	Me	Cl	H	SO		
1581.	Me	Cl	H	SO ₂		
1582.	Me	Cl	H	S		
1583.	Me	Cl	H	SO		
1584.	Me	Cl	H	SO ₂		

10

20

30

40

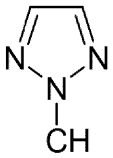
番号	R ¹	R ³	R ⁴	Y	X	1H NMR
1585.	Me	Cl	H	S		
1586.	Me	Cl	H	SO		
1587.	Me	Cl	H	SO ₂		
1588.	Me	Cl	H	S		
1589.	Me	Cl	H	SO		
1590.	Me	Cl	H	SO ₂		
1591.	Me	Cl	H	S		
1592.	Me	Cl	H	SO		

10

20

30

40

番号	R ¹	R ³	R ⁴	Y	X	1H NMR
1593.	Me	Cl	H	SO ₂		
1594.	Me	Cl	H	S	CHOC ₂ H ₄ F	
1595.	Me	Cl	H	SO	CHOC ₂ H ₄ F	
1596.	Me	Cl	H	SO ₂	CHOC ₂ H ₄ F	
1597.	Me	Cl	H	S	C=NOMe	
1598.	Me	Cl	H	SO	C=NOMe	
1599.	Me	Cl	H	SO ₂	C=NOMe	
1600.	Me	Cl	H	S	C=NOCH ₂ CCH	
1601.	Me	Cl	H	SO	C=NOCH ₂ CCH	
1602.	Me	Cl	H	SO ₂	C=NOCH ₂ CCH	
1603.	Me	Cl	H	S	C=NOCH ₂ CH=CH ₂	
1604.	Me	Cl	H	SO	C=NOCH ₂ CH=CH ₂	
1605.	Me	Cl	H	SO ₂	C=NOCH ₂ CH=CH ₂	
1606.	Me	Cl	H	S	C=O	
1607.	Me	Cl	H	SO	C=O	
1608.	Me	Cl	H	SO ₂	C=O	
1609.	Me	Cl	H	S	C=S	
1610.	Me	Cl	H	SO	C=S	
1611.	Me	Cl	H	SO ₂	C=S	
1612.	Me	Cl	H	S	C=S	
1613.	Me	Cl	H	SO	C=S	
1614.	Me	Cl	H	SO ₂	C=S	
1615.	Me	Cl	H	S	C=N-N(CH ₃) ₂	
1616.	Me	Cl	H	SO	C=N-N(CH ₃) ₂	
1617.	Me	Cl	H	SO ₂	C=N-N(CH ₃) ₂	
1618.	Me	Cl	H	S	O	
1619.	Me	Cl	H	SO	O	

10

20

30

40

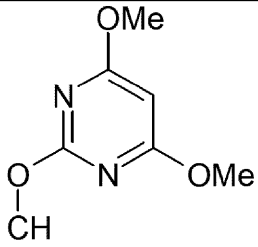
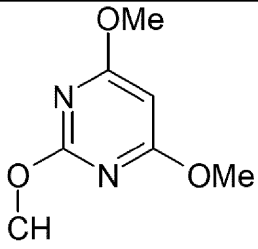
番号	R ¹	R ³	R ⁴	Y	X	¹ H NMR
1620.	Me	Cl	H	SO ₂	O	
1621.	Me	Cl	H	S	S	
1622.	Me	Cl	H	SO	S	
1623.	Me	Cl	H	SO ₂	S	
1624.	Me	Cl	H	S	SO	
1625.	Me	Cl	H	SO	SO	
1626.	Me	Cl	H	SO ₂	SO	
1627.	Me	Cl	H	S	SO ₂	
1628.	Me	Cl	H	SO	SO ₂	
1629.	Me	Cl	H	SO ₂	SO ₂	
1630.	Me	Cl	H	S	NMe	
1631.	Me	Cl	H	SO	NMe	
1632.	Me	Cl	H	SO ₂	NMe	
1633.	Et	Me	Me	S	CH ₂	
1634.	Et	Me	Me	SO	CH ₂	
1635.	Et	Me	Me	SO ₂	CH ₂	
1636.	Et	Me	Me	S	CHMe	
1637.	Et	Me	Me	SO	CHMe	
1638.	Et	Me	Me	SO ₂	CHMe	
1639.	Et	Me	Me	S	C(CH ₃) ₂	
1640.	Et	Me	Me	SO	C(CH ₃) ₂	
1641.	Et	Me	Me	SO ₂	C(CH ₃) ₂	
1642.	Et	Me	Me	S	C(OC ₂ H ₄ O)	
1643.	Et	Me	Me	SO	C(OC ₂ H ₄ O)	
1644.	Et	Me	Me	SO ₂	C(OC ₂ H ₄ O)	
1645.	Et	Me	Me	S	C(SC ₂ H ₄ S)	
1646.	Et	Me	Me	SO	C(SC ₂ H ₄ S)	
1647.	Et	Me	Me	SO ₂	C(SC ₂ H ₄ S)	
1648.	Et	Me	Me	S	CHOMe	

10

20

30

40

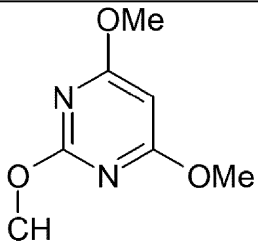
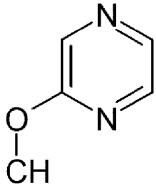
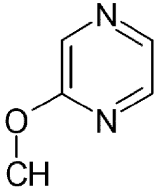
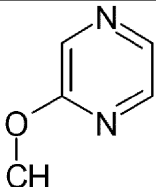
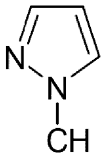
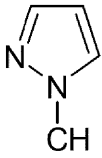
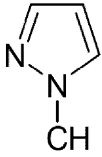
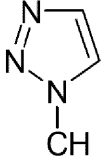
番号	R ¹	R ³	R ⁴	Y	X	1H NMR
1649.	Et	Me	Me	SO	CHOMe	
1650.	Et	Me	Me	SO ₂	CHOMe	
1651.	Et	Me	Me	S	CHOEt	
1652.	Et	Me	Me	SO	CHOEt	
1653.	Et	Me	Me	SO ₂	CHOEt	
1654.	Et	Me	Me	S	CHOiPr	
1655.	Et	Me	Me	SO	CHOiPr	
1656.	Et	Me	Me	SO ₂	CHOiPr	
1657.	Et	Me	Me	S	CHOCH ₂ cPr	
1658.	Et	Me	Me	SO	CHOCH ₂ cPr	
1659.	Et	Me	Me	SO ₂	CHOCH ₂ cPr	
1660.	Et	Me	Me	S	CHOC ₂ H ₄ OMe	
1661.	Et	Me	Me	SO	CHOC ₂ H ₄ OMe	
1662.	Et	Me	Me	SO ₂	CHOC ₂ H ₄ OMe	
1663.	Et	Me	Me	S	CHOCH ₂ CCH	
1664.	Et	Me	Me	SO	CHOCH ₂ CCH	
1665.	Et	Me	Me	SO ₂	CHOCH ₂ CCH	
1666.	Et	Me	Me	S	CHOCH ₂ CH=CH ₂	
1667.	Et	Me	Me	SO	CHOCH ₂ CH=CH ₂	
1668.	Et	Me	Me	SO ₂	CHOCH ₂ CH=CH ₂	
1669.	Et	Me	Me	S		
1670.	Et	Me	Me	SO		

10

20

30

40

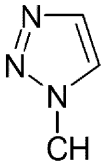
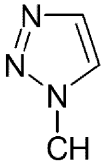
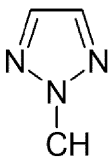
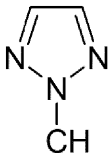
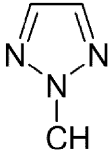
番号	R ¹	R ³	R ⁴	Y	X	¹ H NMR
1671.	Et	Me	Me	SO ₂		
1672.	Et	Me	Me	S		
1673.	Et	Me	Me	SO		
1674.	Et	Me	Me	SO ₂		
1675.	Et	Me	Me	S		
1676.	Et	Me	Me	SO		
1677.	Et	Me	Me	SO ₂		
1678.	Et	Me	Me	S		

10

20

30

40

番号	R ¹	R ³	R ⁴	Y	X	¹ H NMR
1679.	Et	Me	Me	SO		
1680.	Et	Me	Me	SO ₂		
1681.	Et	Me	Me	S		
1682.	Et	Me	Me	SO		
1683.	Et	Me	Me	SO ₂		
1684.	Et	Me	Me	S	CHOC ₂ H ₄ F	
1685.	Et	Me	Me	SO	CHOC ₂ H ₄ F	
1686.	Et	Me	Me	SO ₂	CHOC ₂ H ₄ F	
1687.	Et	Me	Me	S	C=NOMe	
1688.	Et	Me	Me	SO	C=NOMe	
1689.	Et	Me	Me	SO ₂	C=NOMe	
1690.	Et	Me	Me	S	C=NOCH ₂ CCH	
1691.	Et	Me	Me	SO	C=NOCH ₂ CCH	
1692.	Et	Me	Me	SO ₂	C=NOCH ₂ CCH	
1693.	Et	Me	Me	S	C=NOCH ₂ CH=CH ₂	
1694.	Et	Me	Me	SO	C=NOCH ₂ CH=CH ₂	
1695.	Et	Me	Me	SO ₂	C=NOCH ₂ CH=CH ₂	
1696.	Et	Me	Me	S	C=O	

10

20

30

40

番号	R ¹	R ³	R ⁴	Y	X	¹ H NMR
1697.	Et	Me	Me	SO	C=O	
1698.	Et	Me	Me	SO ₂	C=O	
1699.	Et	Me	Me	S	C=S	
1700.	Et	Me	Me	SO	C=S	
1701.	Et	Me	Me	SO ₂	C=S	
1702.	Et	Me	Me	S	C=S	
1703.	Et	Me	Me	SO	C=S	
1704.	Et	Me	Me	SO ₂	C=S	
1705.	Et	Me	Me	S	C=N-N(CH ₃) ₂	
1706.	Et	Me	Me	SO	C=N-N(CH ₃) ₂	
1707.	Et	Me	Me	SO ₂	C=N-N(CH ₃) ₂	
1708.	Et	Me	Me	S	O	
1709.	Et	Me	Me	SO	O	
1710.	Et	Me	Me	SO ₂	O	
1711.	Et	Me	Me	S	S	
1712.	Et	Me	Me	SO	S	
1713.	Et	Me	Me	SO ₂	S	
1714.	Et	Me	Me	S	SO	
1715.	Et	Me	Me	SO	SO	
1716.	Et	Me	Me	SO ₂	SO	
1717.	Et	Me	Me	S	SO ₂	
1718.	Et	Me	Me	SO	SO ₂	
1719.	Et	Me	Me	SO ₂	SO ₂	
1720.	Et	Me	Me	S	NMe	
1721.	Et	Me	Me	SO	NMe	
1722.	Et	Me	Me	SO ₂	NMe	
1723.	Et	Me	Me	O	O	
1724.	Et	Me	H	O	O	
1725.	Et	SMe	H	O	O	

10

20

30

40

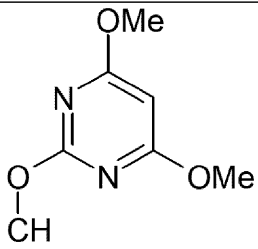
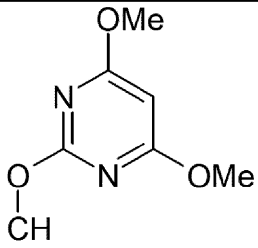
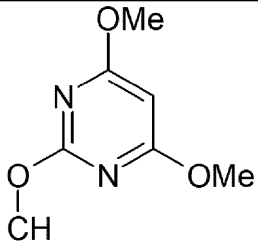
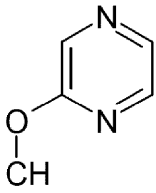
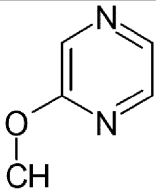
番号	R ¹	R ³	R ⁴	Y	X	¹ H NMR
1726.	Et	Cl	H	O	O	
1727.	Et	Cl	H	S	CH ₂	
1728.	Et	Cl	H	SO	CH ₂	
1729.	Et	Cl	H	SO ₂	CH ₂	
1730.	Et	Cl	H	S	CHMe	
1731.	Et	Cl	H	SO	CHMe	
1732.	Et	Cl	H	SO ₂	CHMe	
1733.	Et	Cl	H	S	C(CH ₃) ₂	
1734.	Et	Cl	H	SO	C(CH ₃) ₂	
1735.	Et	Cl	H	SO ₂	C(CH ₃) ₂	
1736.	Et	Cl	H	S	C(OC ₂ H ₄ O)	
1737.	Et	Cl	H	SO	C(OC ₂ H ₄ O)	
1738.	Et	Cl	H	SO ₂	C(OC ₂ H ₄ O)	
1739.	Et	Cl	H	S	C(SC ₂ H ₄ S)	
1740.	Et	Cl	H	SO	C(SC ₂ H ₄ S)	
1741.	Et	Cl	H	SO ₂	C(SC ₂ H ₄ S)	
1742.	Et	Cl	H	S	CHOMe	
1743.	Et	Cl	H	SO	CHOMe	
1744.	Et	Cl	H	SO ₂	CHOMe	
1745.	Et	Cl	H	S	CHOEt	
1746.	Et	Cl	H	SO	CHOEt	
1747.	Et	Cl	H	SO ₂	CHOEt	
1748.	Et	Cl	H	S	CHOiPr	
1749.	Et	Cl	H	SO	CHOiPr	
1750.	Et	Cl	H	SO ₂	CHOiPr	
1751.	Et	Cl	H	S	CHOCH ₂ cPr	
1752.	Et	Cl	H	SO	CHOCH ₂ cPr	
1753.	Et	Cl	H	SO ₂	CHOCH ₂ cPr	
1754.	Et	Cl	H	S	CHOC ₂ H ₄ OMe	

10

20

30

40

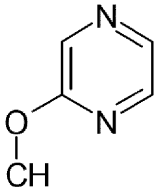
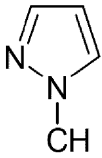
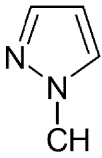
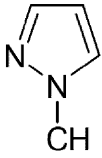
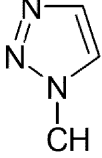
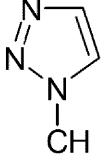
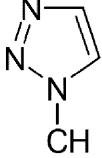
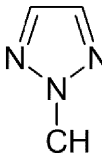
番号	R ¹	R ³	R ⁴	Y	X	¹ H NMR
1755.	Et	Cl	H	SO	CHOC ₂ H ₄ OMe	
1756.	Et	Cl	H	SO ₂	CHOC ₂ H ₄ OMe	
1757.	Et	Cl	H	S	CHOCH ₂ CCH	
1758.	Et	Cl	H	SO	CHOCH ₂ CCH	
1759.	Et	Cl	H	SO ₂	CHOCH ₂ CCH	
1760.	Et	Cl	H	S	CHOCH ₂ CH=CH ₂	
1761.	Et	Cl	H	SO	CHOCH ₂ CH=CH ₂	
1762.	Et	Cl	H	SO ₂	CHOCH ₂ CH=CH ₂	
1763.	Et	Cl	H	S		
1764.	Et	Cl	H	SO		
1765.	Et	Cl	H	SO ₂		
1766.	Et	Cl	H	S		
1767.	Et	Cl	H	SO		

10

20

30

40

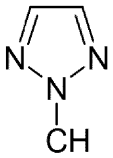
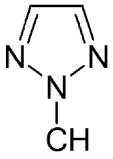
番号	R ¹	R ³	R ⁴	Y	X	¹ H NMR
1768.	Et	Cl	H	SO ₂		
1769.	Et	Cl	H	S		
1770.	Et	Cl	H	SO		
1771.	Et	Cl	H	SO ₂		
1772.	Et	Cl	H	S		
1773.	Et	Cl	H	SO		
1774.	Et	Cl	H	SO ₂		
1775.	Et	Cl	H	S		

10

20

30

40

番号	R ¹	R ³	R ⁴	Y	X	1H NMR
1776.	Et	Cl	H	SO		
1777.	Et	Cl	H	SO ₂		
1778.	Et	Cl	H	S	CHOC ₂ H ₄ F	
1779.	Et	Cl	H	SO	CHOC ₂ H ₄ F	
1780.	Et	Cl	H	SO ₂	CHOC ₂ H ₄ F	
1781.	Et	Cl	H	S	C=NOMe	
1782.	Et	Cl	H	SO	C=NOMe	
1783.	Et	Cl	H	SO ₂	C=NOMe	
1784.	Et	Cl	H	S	C=NOCH ₂ CCH	
1785.	Et	Cl	H	SO	C=NOCH ₂ CCH	
1786.	Et	Cl	H	SO ₂	C=NOCH ₂ CCH	
1787.	Et	Cl	H	S	C=NOCH ₂ CH=CH ₂	
1788.	Et	Cl	H	SO	C=NOCH ₂ CH=CH ₂	
1789.	Et	Cl	H	SO ₂	C=NOCH ₂ CH=CH ₂	
1790.	Et	Cl	H	S	C=O	
1791.	Et	Cl	H	SO	C=O	
1792.	Et	Cl	H	SO ₂	C=O	
1793.	Et	Cl	H	S	C=S	
1794.	Et	Cl	H	SO	C=S	
1795.	Et	Cl	H	SO ₂	C=S	
1796.	Et	Cl	H	S	C=S	
1797.	Et	Cl	H	SO	C=S	
1798.	Et	Cl	H	SO ₂	C=S	
1799.	Et	Cl	H	S	C=N-N(CH ₃) ₂	

10

20

30

40

番号	R ¹	R ³	R ⁴	Y	X	¹ H NMR
1800.	Et	Cl	H	SO	C=N-N(CH ₃) ₂	
1801.	Et	Cl	H	SO ₂	C=N-N(CH ₃) ₂	
1802.	Et	Cl	H	S	O	
1803.	Et	Cl	H	SO	O	
1804.	Et	Cl	H	SO ₂	O	
1805.	Et	Cl	H	S	S	
1806.	Et	Cl	H	SO	S	
1807.	Et	Cl	H	SO ₂	S	
1808.	Et	Cl	H	S	SO	
1809.	Et	Cl	H	SO	SO	
1810.	Et	Cl	H	SO ₂	SO	
1811.	Et	Cl	H	S	SO ₂	
1812.	Et	Cl	H	SO	SO ₂	
1813.	Et	Cl	H	SO ₂	SO ₂	
1814.	Et	Cl	H	S	NMe	
1815.	Et	Cl	H	SO	NMe	
1816.	Et	Cl	H	SO ₂	NMe	

10

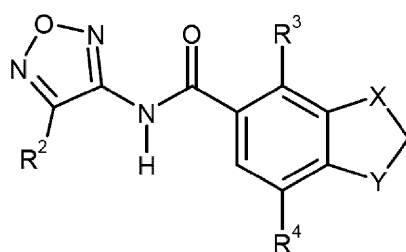
20

30

表 6 : Q が Q 3 であり、R⁵ が水素であり、n が 1 である一般式 (I) の本発明の化合物

【 0 1 0 7 】

【 化 2 3 】



40

【 0 1 0 8 】

【表 6】

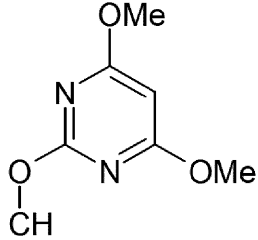
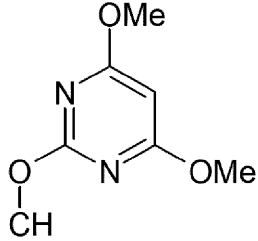
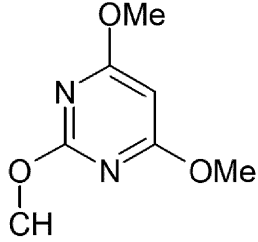
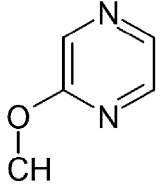
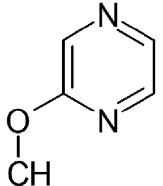
番号	R ²	R ³	R ⁴	Y	X	1H NMR
1817.	Me	Me	Me	S	CH ₂	
1818.	Me	Me	Me	SO	CH ₂	
1819.	Me	Me	Me	SO ₂	CH ₂	
1820.	Me	Me	Me	S	CHMe	
1821.	Me	Me	Me	SO	CHMe	
1822.	Me	Me	Me	SO ₂	CHMe	
1823.	Me	Me	Me	S	C(CH ₃) ₂	
1824.	Me	Me	Me	SO	C(CH ₃) ₂	
1825.	Me	Me	Me	SO ₂	C(CH ₃) ₂	
1826.	Me	Me	Me	S	C(OC ₂ H ₄ O)	
1827.	Me	Me	Me	SO	C(OC ₂ H ₄ O)	
1828.	Me	Me	Me	SO ₂	C(OC ₂ H ₄ O)	
1829.	Me	Me	Me	S	C(SC ₂ H ₄ S)	
1830.	Me	Me	Me	SO	C(SC ₂ H ₄ S)	
1831.	Me	Me	Me	SO ₂	C(SC ₂ H ₄ S)	
1832.	Me	Me	Me	S	CHOMe	
1833.	Me	Me	Me	SO	CHOMe	
1834.	Me	Me	Me	SO ₂	CHOMe	
1835.	Me	Me	Me	S	CHOEt	
1836.	Me	Me	Me	SO	CHOEt	
1837.	Me	Me	Me	SO ₂	CHOEt	
1838.	Me	Me	Me	S	CHOiPr	
1839.	Me	Me	Me	SO	CHOiPr	
1840.	Me	Me	Me	SO ₂	CHOiPr	
1841.	Me	Me	Me	S	CHOCH ₂ cPr	
1842.	Me	Me	Me	SO	CHOCH ₂ cPr	
1843.	Me	Me	Me	SO ₂	CHOCH ₂ cPr	
1844.	Me	Me	Me	S	CHOC ₂ H ₄ OMe	
1845.	Me	Me	Me	SO	CHOC ₂ H ₄ OMe	

10

20

30

40

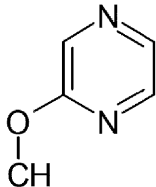
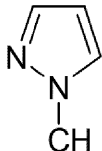
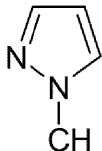
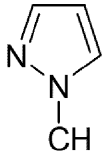
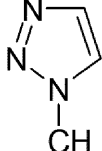
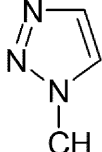
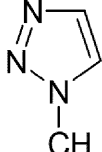
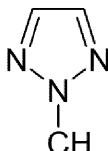
番号	R ²	R ³	R ⁴	Y	X	¹ H NMR
1846.	Me	Me	Me	SO ₂	CHOC ₂ H ₄ OMe	
1847.	Me	Me	Me	S	CHOCH ₂ CCH	
1848.	Me	Me	Me	SO	CHOCH ₂ CCH	
1849.	Me	Me	Me	SO ₂	CHOCH ₂ CCH	
1850.	Me	Me	Me	S	CHOCH ₂ CH=CH ₂	
1851.	Me	Me	Me	SO	CHOCH ₂ CH=CH ₂	
1852.	Me	Me	Me	SO ₂	CHOCH ₂ CH=CH ₂	
1853.	Me	Me	Me	S		
1854.	Me	Me	Me	SO		
1855.	Me	Me	Me	SO ₂		
1856.	Me	Me	Me	S		
1857.	Me	Me	Me	SO		

10

20

30

40

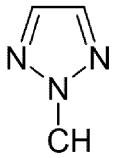
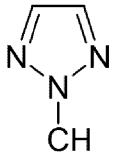
番号	R ²	R ³	R ⁴	Y	X	1H NMR
1858.	Me	Me	Me	SO ₂		
1859.	Me	Me	Me	S		
1860.	Me	Me	Me	SO		
1861.	Me	Me	Me	SO ₂		
1862.	Me	Me	Me	S		
1863.	Me	Me	Me	SO		
1864.	Me	Me	Me	SO ₂		
1865.	Me	Me	Me	S		

10

20

30

40

番号	R ²	R ³	R ⁴	Y	X	¹ H NMR
1866.	Me	Me	Me	SO		
1867.	Me	Me	Me	SO ₂		
1868.	Me	Me	Me	S	CHOC ₂ H ₄ F	
1869.	Me	Me	Me	SO	CHOC ₂ H ₄ F	
1870.	Me	Me	Me	SO ₂	CHOC ₂ H ₄ F	
1871.	Me	Me	Me	S	C=NOMe	
1872.	Me	Me	Me	SO	C=NOMe	
1873.	Me	Me	Me	SO ₂	C=NOMe	
1874.	Me	Me	Me	S	C=NOCH ₂ CCH	
1875.	Me	Me	Me	SO	C=NOCH ₂ CCH	
1876.	Me	Me	Me	SO ₂	C=NOCH ₂ CCH	
1877.	Me	Me	Me	S	C=NOCH ₂ CH=CH ₂	
1878.	Me	Me	Me	SO	C=NOCH ₂ CH=CH ₂	
1879.	Me	Me	Me	SO ₂	C=NOCH ₂ CH=CH ₂	
1880.	Me	Me	Me	S	C=O	
1881.	Me	Me	Me	SO	C=O	
1882.	Me	Me	Me	SO ₂	C=O	
1883.	Me	Me	Me	S	C=S	
1884.	Me	Me	Me	SO	C=S	
1885.	Me	Me	Me	SO ₂	C=S	
1886.	Me	Me	Me	S	C=S	
1887.	Me	Me	Me	SO	C=S	
1888.	Me	Me	Me	SO ₂	C=S	
1889.	Me	Me	Me	S	C=N-N(CH ₃) ₂	

10

20

30

40

番号	R ²	R ³	R ⁴	Y	X	1H NMR
1890.	Me	Me	Me	SO	C=N-N(CH ₃) ₂	
1891.	Me	Me	Me	SO ₂	C=N-N(CH ₃) ₂	
1892.	Me	Me	Me	S	O	
1893.	Me	Me	Me	SO	O	
1894.	Me	Me	Me	SO ₂	O	
1895.	Me	Me	Me	S	S	
1896.	Me	Me	Me	SO	S	
1897.	Me	Me	Me	SO ₂	S	
1898.	Me	Me	Me	S	SO	
1899.	Me	Me	Me	SO	SO	
1900.	Me	Me	Me	SO ₂	SO	
1901.	Me	Me	Me	S	SO ₂	
1902.	Me	Me	Me	SO	SO ₂	
1903.	Me	Me	Me	SO ₂	SO ₂	
1904.	Me	Me	Me	S	NMe	
1905.	Me	Me	Me	SO	NMe	
1906.	Me	Me	Me	SO ₂	NMe	
1907.	Me	Me	Me	O	O	
1908.	Me	Me	H	O	O	
1909.	Me	SMe	H	O	O	
1910.	Me	Cl	H	O	O	
1911.	Me	Cl	H	S	CH ₂	
1912.	Me	Cl	H	SO	CH ₂	
1913.	Me	Cl	H	SO ₂	CH ₂	CDCl ₃ , 400 MHz: 2.52 (s,3H), 3.47 (t,2H), 3.62 (t,2H), 3.79 (s,3H), 7.80 (d,1H), 7.88 (d,1H), 8.14 (s,1H)
1914.	Me	Cl	H	S	CHMe	
1915.	Me	Cl	H	SO	CHMe	
1916.	Me	Cl	H	SO ₂	CHMe	

10

20

30

40

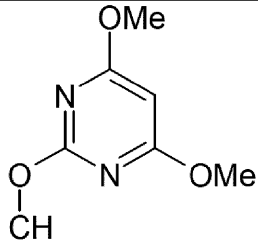
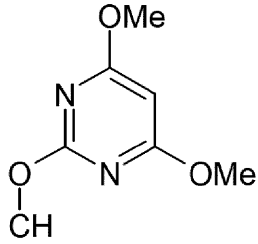
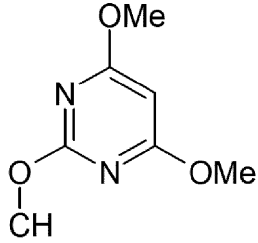
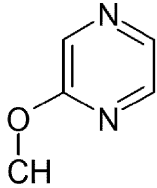
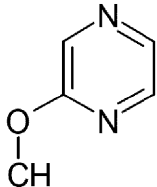
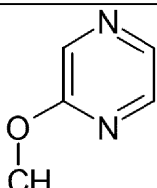
番号	R ²	R ³	R ⁴	Y	X	1H NMR
1917.	Me	Cl	H	S	C(CH ₃) ₂	
1918.	Me	Cl	H	SO	C(CH ₃) ₂	
1919.	Me	Cl	H	SO ₂	C(CH ₃) ₂	
1920.	Me	Cl	H	S	C(OC ₂ H ₄ O)	
1921.	Me	Cl	H	SO	C(OC ₂ H ₄ O)	
1922.	Me	Cl	H	SO ₂	C(OC ₂ H ₄ O)	
1923.	Me	Cl	H	S	C(SC ₂ H ₄ S)	
1924.	Me	Cl	H	SO	C(SC ₂ H ₄ S)	
1925.	Me	Cl	H	SO ₂	C(SC ₂ H ₄ S)	
1926.	Me	Cl	H	S	CHOMe	
1927.	Me	Cl	H	SO	CHOMe	
1928.	Me	Cl	H	SO ₂	CHOMe	CDCI ₃ , 400 MHz: 2.44 (s,3H), 3.53 (s,3H), 3.57 (dd,1H), 3.71 (d,1H), 5.15 (d,1H), 7.55 (d,1H), 7.74 (d,1H), 9.40 (s,1H)
1929.	Me	Cl	H	S	CHOEt	
1930.	Me	Cl	H	SO	CHOEt	
1931.	Me	Cl	H	SO ₂	CHOEt	
1932.	Me	Cl	H	S	CHOiPr	
1933.	Me	Cl	H	SO	CHOiPr	
1934.	Me	Cl	H	SO ₂	CHOiPr	
1935.	Me	Cl	H	S	CHOCH ₂ cPr	
1936.	Me	Cl	H	SO	CHOCH ₂ cPr	
1937.	Me	Cl	H	SO ₂	CHOCH ₂ cPr	
1938.	Me	Cl	H	S	CHOC ₂ H ₄ OMe	
1939.	Me	Cl	H	SO	CHOC ₂ H ₄ OMe	
1940.	Me	Cl	H	SO ₂	CHOC ₂ H ₄ OMe	
1941.	Me	Cl	H	S	CHOCH ₂ CCH	
1942.	Me	Cl	H	SO	CHOCH ₂ CCH	
1943.	Me	Cl	H	SO ₂	CHOCH ₂ CCH	

10

20

30

40

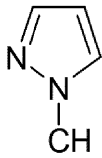
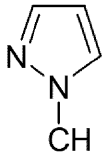
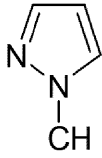
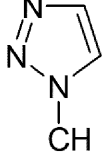
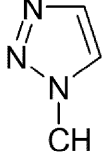
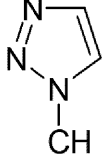
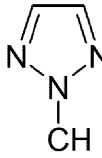
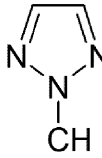
番号	R ²	R ³	R ⁴	Y	X	1H NMR
1944.	Me	Cl	H	S	CHOCH ₂ CH=CH ₂	
1945.	Me	Cl	H	SO	CHOCH ₂ CH=CH ₂	
1946.	Me	Cl	H	SO ₂	CHOCH ₂ CH=CH ₂	
1947.	Me	Cl	H	S		
1948.	Me	Cl	H	SO		
1949.	Me	Cl	H	SO ₂		
1950.	Me	Cl	H	S		
1951.	Me	Cl	H	SO		
1952.	Me	Cl	H	SO ₂		

10

20

30

40

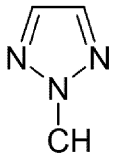
番号	R ²	R ³	R ⁴	Y	X	¹ H NMR
1953.	Me	Cl	H	S		
1954.	Me	Cl	H	SO		
1955.	Me	Cl	H	SO ₂		
1956.	Me	Cl	H	S		
1957.	Me	Cl	H	SO		
1958.	Me	Cl	H	SO ₂		
1959.	Me	Cl	H	S		
1960.	Me	Cl	H	SO		

10

20

30

40

番号	R ²	R ³	R ⁴	Y	X	1H NMR
1961.	Me	Cl	H	SO ₂		
1962.	Me	Cl	H	S	CHOC ₂ H ₄ F	
1963.	Me	Cl	H	SO	CHOC ₂ H ₄ F	
1964.	Me	Cl	H	SO ₂	CHOC ₂ H ₄ F	
1965.	Me	Cl	H	S	C=NOMe	
1966.	Me	Cl	H	SO	C=NOMe	
1967.	Me	Cl	H	SO ₂	C=NOMe	
1968.	Me	Cl	H	S	C=NOCH ₂ CCH	
1969.	Me	Cl	H	SO	C=NOCH ₂ CCH	
1970.	Me	Cl	H	SO ₂	C=NOCH ₂ CCH	
1971.	Me	Cl	H	S	C=NOCH ₂ CH=CH ₂	
1972.	Me	Cl	H	SO	C=NOCH ₂ CH=CH ₂	
1973.	Me	Cl	H	SO ₂	C=NOCH ₂ CH=CH ₂	
1974.	Me	Cl	H	S	C=O	
1975.	Me	Cl	H	SO	C=O	
1976.	Me	Cl	H	SO ₂	C=O	
1977.	Me	Cl	H	S	C=S	
1978.	Me	Cl	H	SO	C=S	
1979.	Me	Cl	H	SO ₂	C=S	
1980.	Me	Cl	H	S	C=S	
1981.	Me	Cl	H	SO	C=S	
1982.	Me	Cl	H	SO ₂	C=S	
1983.	Me	Cl	H	S	C=N-N(CH ₃) ₂	
1984.	Me	Cl	H	SO	C=N-N(CH ₃) ₂	
1985.	Me	Cl	H	SO ₂	C=N-N(CH ₃) ₂	
1986.	Me	Cl	H	S	O	
1987.	Me	Cl	H	SO	O	

10

20

30

40

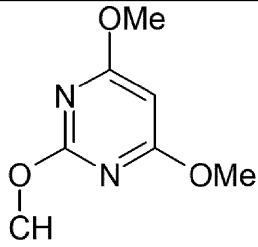
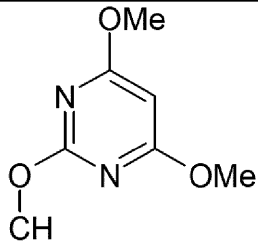
番号	R ²	R ³	R ⁴	Y	X	¹ H NMR
1988.	Me	Cl	H	SO ₂	O	
1989.	Me	Cl	H	S	S	
1990.	Me	Cl	H	SO	S	
1991.	Me	Cl	H	SO ₂	S	
1992.	Me	Cl	H	S	SO	
1993.	Me	Cl	H	SO	SO	
1994.	Me	Cl	H	SO ₂	SO	
1995.	Me	Cl	H	S	SO ₂	
1996.	Me	Cl	H	SO	SO ₂	
1997.	Me	Cl	H	SO ₂	SO ₂	
1998.	Me	Cl	H	S	NMe	
1999.	Me	Cl	H	SO	NMe	
2000.	Me	Cl	H	SO ₂	NMe	
2001.	Et	Me	Me	S	CH ₂	
2002.	Et	Me	Me	SO	CH ₂	
2003.	Et	Me	Me	SO ₂	CH ₂	
2004.	Et	Me	Me	S	CHMe	
2005.	Et	Me	Me	SO	CHMe	
2006.	Et	Me	Me	SO ₂	CHMe	
2007.	Et	Me	Me	S	C(CH ₃) ₂	
2008.	Et	Me	Me	SO	C(CH ₃) ₂	
2009.	Et	Me	Me	SO ₂	C(CH ₃) ₂	
2010.	Et	Me	Me	S	C(OC ₂ H ₄ O)	
2011.	Et	Me	Me	SO	C(OC ₂ H ₄ O)	
2012.	Et	Me	Me	SO ₂	C(OC ₂ H ₄ O)	
2013.	Et	Me	Me	S	C(SC ₂ H ₄ S)	
2014.	Et	Me	Me	SO	C(SC ₂ H ₄ S)	
2015.	Et	Me	Me	SO ₂	C(SC ₂ H ₄ S)	
2016.	Et	Me	Me	S	CHOMe	

10

20

30

40

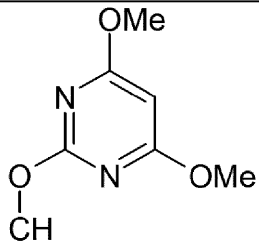
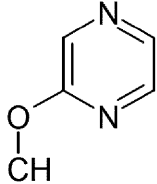
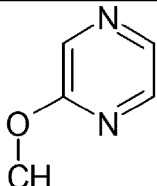
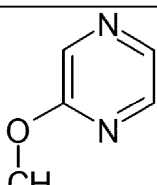
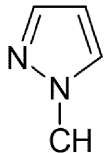
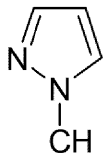
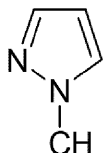
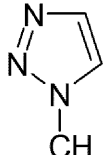
番号	R ²	R ³	R ⁴	Y	X	¹ H NMR
2017.	Et	Me	Me	SO	CHOMe	
2018.	Et	Me	Me	SO ₂	CHOMe	
2019.	Et	Me	Me	S	CHOEt	
2020.	Et	Me	Me	SO	CHOEt	
2021.	Et	Me	Me	SO ₂	CHOEt	
2022.	Et	Me	Me	S	CHOiPr	
2023.	Et	Me	Me	SO	CHOiPr	
2024.	Et	Me	Me	SO ₂	CHOiPr	
2025.	Et	Me	Me	S	CHOCH ₂ cPr	
2026.	Et	Me	Me	SO	CHOCH ₂ cPr	
2027.	Et	Me	Me	SO ₂	CHOCH ₂ cPr	
2028.	Et	Me	Me	S	CHOC ₂ H ₄ OMe	
2029.	Et	Me	Me	SO	CHOC ₂ H ₄ OMe	
2030.	Et	Me	Me	SO ₂	CHOC ₂ H ₄ OMe	
2031.	Et	Me	Me	S	CHOCH ₂ CCH	
2032.	Et	Me	Me	SO	CHOCH ₂ CCH	
2033.	Et	Me	Me	SO ₂	CHOCH ₂ CCH	
2034.	Et	Me	Me	S	CHOCH ₂ CH=CH ₂	
2035.	Et	Me	Me	SO	CHOCH ₂ CH=CH ₂	
2036.	Et	Me	Me	SO ₂	CHOCH ₂ CH=CH ₂	
2037.	Et	Me	Me	S		
2038.	Et	Me	Me	SO		

10

20

30

40

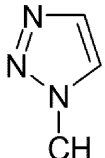
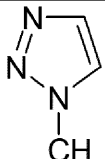
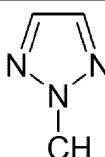
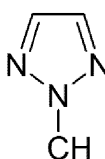
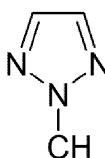
番号	R ²	R ³	R ⁴	Y	X	¹ H NMR
2039.	Et	Me	Me	SO ₂		
2040.	Et	Me	Me	S		
2041.	Et	Me	Me	SO		
2042.	Et	Me	Me	SO ₂		
2043.	Et	Me	Me	S		
2044.	Et	Me	Me	SO		
2045.	Et	Me	Me	SO ₂		
2046.	Et	Me	Me	S		

10

20

30

40

番号	R ²	R ³	R ⁴	Y	X	¹ H NMR
2047.	Et	Me	Me	SO		
2048.	Et	Me	Me	SO ₂		
2049.	Et	Me	Me	S		
2050.	Et	Me	Me	SO		
2051.	Et	Me	Me	SO ₂		
2052.	Et	Me	Me	S	CHOC ₂ H ₄ F	
2053.	Et	Me	Me	SO	CHOC ₂ H ₄ F	
2054.	Et	Me	Me	SO ₂	CHOC ₂ H ₄ F	
2055.	Et	Me	Me	S	C=NOMe	
2056.	Et	Me	Me	SO	C=NOMe	
2057.	Et	Me	Me	SO ₂	C=NOMe	
2058.	Et	Me	Me	S	C=NOCH ₂ CCH	
2059.	Et	Me	Me	SO	C=NOCH ₂ CCH	
2060.	Et	Me	Me	SO ₂	C=NOCH ₂ CCH	
2061.	Et	Me	Me	S	C=NOCH ₂ CH=CH ₂	
2062.	Et	Me	Me	SO	C=NOCH ₂ CH=CH ₂	
2063.	Et	Me	Me	SO ₂	C=NOCH ₂ CH=CH ₂	
2064.	Et	Me	Me	S	C=O	

10

20

30

40

番号	R ²	R ³	R ⁴	Y	X	1H NMR
2065.	Et	Me	Me	SO	C=O	
2066.	Et	Me	Me	SO ₂	C=O	
2067.	Et	Me	Me	S	C=S	
2068.	Et	Me	Me	SO	C=S	
2069.	Et	Me	Me	SO ₂	C=S	
2070.	Et	Me	Me	S	C=S	
2071.	Et	Me	Me	SO	C=S	
2072.	Et	Me	Me	SO ₂	C=S	
2073.	Et	Me	Me	S	C=N-N(CH ₃) ₂	
2074.	Et	Me	Me	SO	C=N-N(CH ₃) ₂	
2075.	Et	Me	Me	SO ₂	C=N-N(CH ₃) ₂	
2076.	Et	Me	Me	S	O	
2077.	Et	Me	Me	SO	O	
2078.	Et	Me	Me	SO ₂	O	
2079.	Et	Me	Me	S	S	
2080.	Et	Me	Me	SO	S	
2081.	Et	Me	Me	SO ₂	S	
2082.	Et	Me	Me	S	SO	
2083.	Et	Me	Me	SO	SO	
2084.	Et	Me	Me	SO ₂	SO	
2085.	Et	Me	Me	S	SO ₂	
2086.	Et	Me	Me	SO	SO ₂	
2087.	Et	Me	Me	SO ₂	SO ₂	
2088.	Et	Me	Me	S	NMe	
2089.	Et	Me	Me	SO	NMe	
2090.	Et	Me	Me	SO ₂	NMe	
2091.	Et	Me	Me	O	O	
2092.	Et	Me	H	O	O	
2093.	Et	SMe	H	O	O	

10

20

30

40

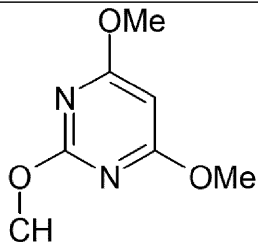
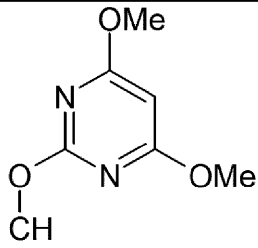
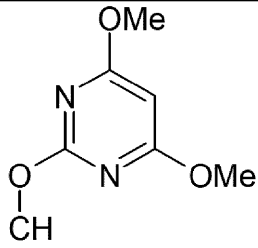
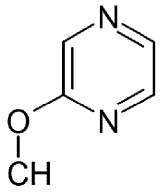
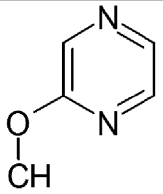
番号	R ²	R ³	R ⁴	Y	X	1H NMR
2094.	Et	Cl	H	O	O	
2095.	Et	Cl	H	S	CH ₂	
2096.	Et	Cl	H	SO	CH ₂	
2097.	Et	Cl	H	SO ₂	CH ₂	
2098.	Et	Cl	H	S	CHMe	
2099.	Et	Cl	H	SO	CHMe	
2100.	Et	Cl	H	SO ₂	CHMe	
2101.	Et	Cl	H	S	C(CH ₃) ₂	
2102.	Et	Cl	H	SO	C(CH ₃) ₂	
2103.	Et	Cl	H	SO ₂	C(CH ₃) ₂	
2104.	Et	Cl	H	S	C(OC ₂ H ₄ O)	
2105.	Et	Cl	H	SO	C(OC ₂ H ₄ O)	
2106.	Et	Cl	H	SO ₂	C(OC ₂ H ₄ O)	
2107.	Et	Cl	H	S	C(SC ₂ H ₄ S)	
2108.	Et	Cl	H	SO	C(SC ₂ H ₄ S)	
2109.	Et	Cl	H	SO ₂	C(SC ₂ H ₄ S)	
2110.	Et	Cl	H	S	CHOMe	
2111.	Et	Cl	H	SO	CHOMe	
2112.	Et	Cl	H	SO ₂	CHOMe	
2113.	Et	Cl	H	S	CHOEt	
2114.	Et	Cl	H	SO	CHOEt	
2115.	Et	Cl	H	SO ₂	CHOEt	
2116.	Et	Cl	H	S	CHOiPr	
2117.	Et	Cl	H	SO	CHOiPr	
2118.	Et	Cl	H	SO ₂	CHOiPr	
2119.	Et	Cl	H	S	CHOCH ₂ cPr	
2120.	Et	Cl	H	SO	CHOCH ₂ cPr	
2121.	Et	Cl	H	SO ₂	CHOCH ₂ cPr	
2122.	Et	Cl	H	S	CHOC ₂ H ₄ OMe	

10

20

30

40

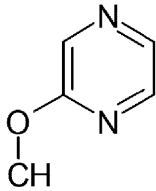
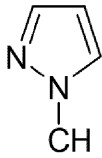
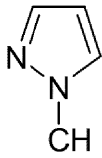
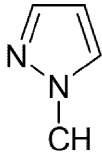
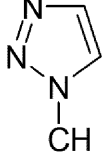
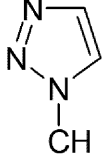
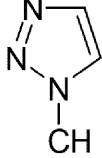
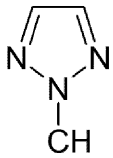
番号	R ²	R ³	R ⁴	Y	X	1H NMR
2123.	Et	Cl	H	SO	CHOC ₂ H ₄ OMe	
2124.	Et	Cl	H	SO ₂	CHOC ₂ H ₄ OMe	
2125.	Et	Cl	H	S	CHOCH ₂ CCH	
2126.	Et	Cl	H	SO	CHOCH ₂ CCH	
2127.	Et	Cl	H	SO ₂	CHOCH ₂ CCH	
2128.	Et	Cl	H	S	CHOCH ₂ CH=CH ₂	
2129.	Et	Cl	H	SO	CHOCH ₂ CH=CH ₂	
2130.	Et	Cl	H	SO ₂	CHOCH ₂ CH=CH ₂	
2131.	Et	Cl	H	S		
2132.	Et	Cl	H	SO		
2133.	Et	Cl	H	SO ₂		
2134.	Et	Cl	H	S		
2135.	Et	Cl	H	SO		

10

20

30

40

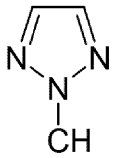
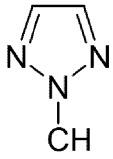
番号	R ²	R ³	R ⁴	Y	X	¹ H NMR
2136.	Et	Cl	H	SO ₂		
2137.	Et	Cl	H	S		
2138.	Et	Cl	H	SO		
2139.	Et	Cl	H	SO ₂		
2140.	Et	Cl	H	S		
2141.	Et	Cl	H	SO		
2142.	Et	Cl	H	SO ₂		
2143.	Et	Cl	H	S		

10

20

30

40

番号	R ²	R ³	R ⁴	Y	X	1H NMR
2144.	Et	Cl	H	SO		
2145.	Et	Cl	H	SO ₂		
2146.	Et	Cl	H	S	CHOC ₂ H ₄ F	
2147.	Et	Cl	H	SO	CHOC ₂ H ₄ F	
2148.	Et	Cl	H	SO ₂	CHOC ₂ H ₄ F	
2149.	Et	Cl	H	S	C=NOMe	
2150.	Et	Cl	H	SO	C=NOMe	
2151.	Et	Cl	H	SO ₂	C=NOMe	
2152.	Et	Cl	H	S	C=NOCH ₂ CCH	
2153.	Et	Cl	H	SO	C=NOCH ₂ CCH	
2154.	Et	Cl	H	SO ₂	C=NOCH ₂ CCH	
2155.	Et	Cl	H	S	C=NOCH ₂ CH=CH ₂	
2156.	Et	Cl	H	SO	C=NOCH ₂ CH=CH ₂	
2157.	Et	Cl	H	SO ₂	C=NOCH ₂ CH=CH ₂	
2158.	Et	Cl	H	S	C=O	
2159.	Et	Cl	H	SO	C=O	
2160.	Et	Cl	H	SO ₂	C=O	
2161.	Et	Cl	H	S	C=S	
2162.	Et	Cl	H	SO	C=S	
2163.	Et	Cl	H	SO ₂	C=S	
2164.	Et	Cl	H	S	C=S	
2165.	Et	Cl	H	SO	C=S	
2166.	Et	Cl	H	SO ₂	C=S	
2167.	Et	Cl	H	S	C=N-N(CH ₃) ₂	

10

20

30

40

番号	R ²	R ³	R ⁴	Y	X	¹ H NMR
2168.	Et	Cl	H	SO	C=N-N(CH ₃) ₂	
2169.	Et	Cl	H	SO ₂	C=N-N(CH ₃) ₂	
2170.	Et	Cl	H	S	O	
2171.	Et	Cl	H	SO	O	
2172.	Et	Cl	H	SO ₂	O	
2173.	Et	Cl	H	S	S	
2174.	Et	Cl	H	SO	S	
2175.	Et	Cl	H	SO ₂	S	
2176.	Et	Cl	H	S	SO	
2177.	Et	Cl	H	SO	SO	
2178.	Et	Cl	H	SO ₂	SO	
2179.	Et	Cl	H	S	SO ₂	
2180.	Et	Cl	H	SO	SO ₂	
2181.	Et	Cl	H	SO ₂	SO ₂	
2182.	Et	Cl	H	S	NMe	
2183.	Et	Cl	H	SO	NMe	
2184.	Et	Cl	H	SO ₂	NMe	

10

20

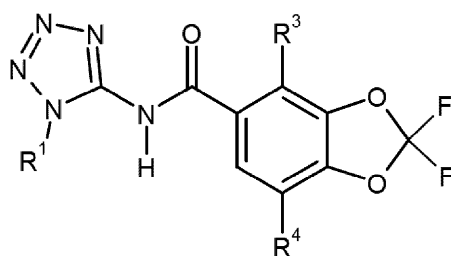
30

40

表 7 : Q が Q 1 であり、X および Y がそれぞれ酸素であり、R⁵ がフッ素であり、n が 1 である一般式 (I) の本発明の化合物

【 0 1 0 9 】

【 化 2 4 】



【 0 1 1 0 】

【表 7】

番号	R ¹	R ³	R ⁴	1H NMR
2185.	Me	Me	Me	
2186.	Me	Me	H	DMSO-d ₆ , 400 MHz: 7.62 (d, 1H), 7.40 (d, 1H), 3.90 (s, 3H), 2.39 (s, 3H)
2187.	Me	Cl	H	
2188.	Me	SMe	H	
2189.	Me	Me	Me	
2190.	Me	Me	H	
2191.	Me	Cl	H	
2192.	Me	SMe	H	
2193.	Et	Me	Me	
2194.	Et	Me	H	
2195.	Et	Cl	H	
2196.	Et	SMe	H	
2197.	Et	Me	Me	
2198.	Et	Me	H	
2199.	Et	Cl	H	
2200.	Et	SMe	H	

10

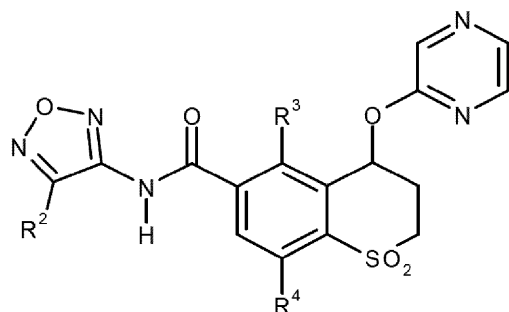
20

30

表 8 : Q が Q 3 であり、X が 2 - (1 , 4 - ピラジニル) オキシメチルであり、Y が S O₂ であり、R⁵ が水素であり、n が 2 である一般式 (I) の本発明の化合物

【 0 1 1 1 】

【 化 2 5 】



40

【 0 1 1 2 】

【表 8】

番号	R ²	R ³	R ⁴	1H NMR
2201.	Cl	Me	Me	
2202.	Cl	Me	H	
2203.	Cl	Cl	H	
2204.	OMe	Me	Me	DMSO-d ₆ , 400 MHz: 11.36 (s,1H), 8.38 (s,1H), 8.33-8.31 (m,2H), 7.60 (s,1H), 6.51 (dd,1H), 4.07 (s,3H), 3.77-3.70 (m,1H), 3.58-3.53 (m,1H), 2.76-2.60 (m,5H), 2.18 (s,3H)
2205.	OMe	Me	H	
2206.	OMe	Cl	H	
2207.	NHAc	Me	Me	
2208.	NHAc	Me	H	
2209.	NHAc	Cl	H	

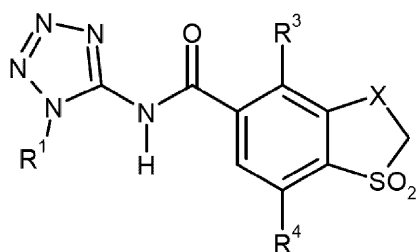
10

表 9：Q が Q 1 であり、Y が S O₂ であり、R⁵ が水素であり、n が 1 である一般式 (I) の本発明の化合物

【0113】

【化 26】

20



【0114】

30

【表 9】

番号	R ¹	R ³	R ⁴	X	1H NMR
2210.	nPr	Me	Me	CH ₂	
2211.	nPr	Me	H	CH ₂	
2212.	nPr	Cl	H	CH ₂	DMSO-d ₆ , 400 MHz: 0.89 (t,3H), 1.89 (m,2H), 3.42 (t,2H), 3.76 (t,2H), 4.33 (t,2H), 7.90 (d,1H), 7.94 (d,1H), 11.84 (s,1H)
2213.	C ₂ H ₄ OMe	Me	Me	CH ₂	
2214.	C ₂ H ₄ OMe	Me	H	CH ₂	
2215.	C ₂ H ₄ OMe	Cl	H	CH ₂	
2216.	CH ₂ CF ₃	Me	Me	CH ₂	
2217.	CH ₂ CF ₃	Me	H	CH ₂	
2218.	CH ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂	
2219.	nPr	Me	Me	CHOMe	
2220.	nPr	Me	H	CHOMe	
2221.	nPr	Cl	H	CHOMe	DMSO-d ₆ , 400 MHz: 0.99 (t,3H), 2.01 (m,2H), 3.53 (s,3H), 3.63 (dd,1H), 3.80 (d,1H), 4.40 (t,2H), 5.22 (d,1H), 7.72 (d,1H), 7.92 (d,1H), 10.80 (s,1H)
2222.	C ₂ H ₄ OMe	Me	Me	CHOMe	
2223.	C ₂ H ₄ OMe	Me	H	CHOMe	
2224.	C ₂ H ₄ OMe	Cl	H	CHOMe	
2225.	CH ₂ CF ₃	Me	Me	CHOMe	
2226.	CH ₂ CF ₃	Me	H	CHOMe	
2227.	CH ₂ CF ₃	Cl	H	CHOMe	

10

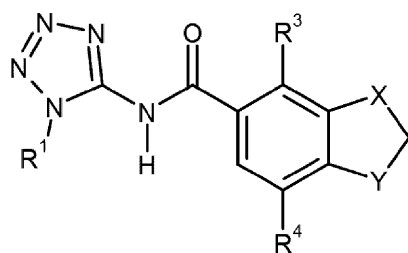
20

30

表 10 : Q が Q 1 であり、R⁵ が水素であり、n が 1 である一般式 (I) の本発明の化合物

【0115】

【化 27】



40

【0116】

【表 10】

番号	R ¹	R ³	R ⁴	X	Y	1H NMR
2228.	Me	Me	Me	S	C=O	
2229.	Me	Me	Me	SO	C=O	
2230.	Me	Me	Me	SO ₂	C=O	
2231.	Me	Me	Me	S	CHOMe	
2232.	Me	Me	Me	SO	CHOMe	
2233.	Me	Me	Me	SO ₂	CHOMe	
2234.	Me	Me	Me	S	CHOEt	
2235.	Me	Me	Me	SO	CHOEt	
2236.	Me	Me	Me	SO ₂	CHOEt	
2237.	Me	Me	Me	S	C=NOMe	
2238.	Me	Me	Me	SO	C=NOMe	
2239.	Me	Me	Me	SO ₂	C=NOMe	
2240.	Me	Me	Me	S	C=NOEt	
2241.	Me	Me	Me	SO	C=NOEt	
2242.	Me	Me	Me	SO ₂	C=NOEt	
2243.	Me	Me	Me	S	O	
2244.	Me	Me	Me	SO	O	
2245.	Me	Me	Me	SO ₂	O	
2246.	Me	Me	Me	S	S	
2247.	Me	Me	Me	SO	S	
2248.	Me	Me	Me	SO ₂	S	
2249.	Me	Me	Me	S	SO ₂	
2250.	Me	Me	Me	SO	SO ₂	
2251.	Me	Me	Me	SO ₂	SO ₂	
2252.	Me	Me	H	S	C=O	
2253.	Me	Me	H	SO	C=O	
2254.	Me	Me	H	SO ₂	C=O	
2255.	Me	Me	H	S	CHOMe	
2256.	Me	Me	H	SO	CHOMe	

10

20

30

40

番号	R ¹	R ³	R ⁴	X	Y	¹ H NMR
2257.	Me	Me	H	SO ₂	CHOMe	
2258.	Me	Me	H	S	CHOEt	
2259.	Me	Me	H	SO	CHOEt	
2260.	Me	Me	H	SO ₂	CHOEt	
2261.	Me	Me	H	S	C=NOMe	
2262.	Me	Me	H	SO	C=NOMe	
2263.	Me	Me	H	SO ₂	C=NOMe	
2264.	Me	Me	H	S	C=NOEt	
2265.	Me	Me	H	SO	C=NOEt	
2266.	Me	Me	H	SO ₂	C=NOEt	
2267.	Me	Me	H	S	O	
2268.	Me	Me	H	SO	O	
2269.	Me	Me	H	SO ₂	O	
2270.	Me	Me	H	S	S	
2271.	Me	Me	H	SO	S	
2272.	Me	Me	H	SO ₂	S	
2273.	Me	Me	H	S	SO ₂	
2274.	Me	Me	H	SO	SO ₂	
2275.	Me	Me	H	SO ₂	SO ₂	

10

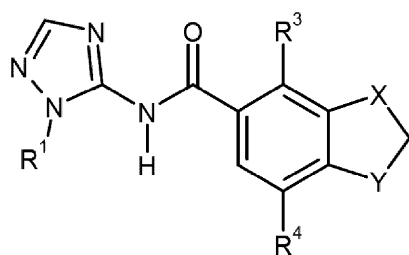
20

30

表 1 1 : Q が Q 2 であり、R⁵ が水素であり、n が 1 である一般式 (I) の本発明の化合物

【 0 1 1 7 】

【 化 2 8 】



40

【 0 1 1 8 】

【表 1 1】

番号	R ¹	R ³	R ⁴	X	Y	1H NMR
2276.	Me	Me	Me	S	C=O	
2277.	Me	Me	Me	SO	C=O	
2278.	Me	Me	Me	SO ₂	C=O	
2279.	Me	Me	Me	S	CHOMe	
2280.	Me	Me	Me	SO	CHOMe	
2281.	Me	Me	Me	SO ₂	CHOMe	
2282.	Me	Me	Me	S	CHOEt	
2283.	Me	Me	Me	SO	CHOEt	
2284.	Me	Me	Me	SO ₂	CHOEt	
2285.	Me	Me	Me	S	C=NOMe	
2286.	Me	Me	Me	SO	C=NOMe	
2287.	Me	Me	Me	SO ₂	C=NOMe	
2288.	Me	Me	Me	S	C=NOEt	
2289.	Me	Me	Me	SO	C=NOEt	
2290.	Me	Me	Me	SO ₂	C=NOEt	
2291.	Me	Me	Me	S	O	
2292.	Me	Me	Me	SO	O	
2293.	Me	Me	Me	SO ₂	O	
2294.	Me	Me	Me	S	S	
2295.	Me	Me	Me	SO	S	
2296.	Me	Me	Me	SO ₂	S	
2297.	Me	Me	Me	S	SO ₂	
2298.	Me	Me	Me	SO	SO ₂	
2299.	Me	Me	Me	SO ₂	SO ₂	
2300.	Me	Me	H	S	C=O	
2301.	Me	Me	H	SO	C=O	
2302.	Me	Me	H	SO ₂	C=O	
2303.	Me	Me	H	S	CHOMe	
2304.	Me	Me	H	SO	CHOMe	

10

20

30

40

番号	R ¹	R ³	R ⁴	X	Y	1H NMR
2305.	Me	Me	H	SO ₂	CHOMe	
2306.	Me	Me	H	S	CHOEt	
2307.	Me	Me	H	SO	CHOEt	
2308.	Me	Me	H	SO ₂	CHOEt	
2309.	Me	Me	H	S	C=NOMe	
2310.	Me	Me	H	SO	C=NOMe	
2311.	Me	Me	H	SO ₂	C=NOMe	
2312.	Me	Me	H	S	C=NOEt	
2313.	Me	Me	H	SO	C=NOEt	
2314.	Me	Me	H	SO ₂	C=NOEt	
2315.	Me	Me	H	S	O	
2316.	Me	Me	H	SO	O	
2317.	Me	Me	H	SO ₂	O	
2318.	Me	Me	H	S	S	
2319.	Me	Me	H	SO	S	
2320.	Me	Me	H	SO ₂	S	
2321.	Me	Me	H	S	SO ₂	
2322.	Me	Me	H	SO	SO ₂	
2323.	Me	Me	H	SO ₂	SO ₂	

10

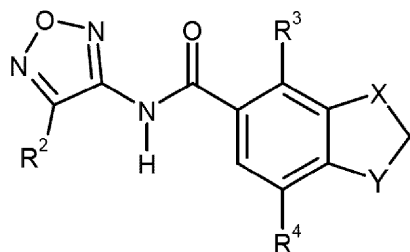
20

30

表 1 2 : Q が Q 3 であり、R⁵ が水素であり、n が 1 である一般式 (I) の本発明の化合物

【 0 1 1 9 】

【 化 2 9 】



40

【 0 1 2 0 】

【表 1 2】

番号	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	1H NMR
2324.	Me	Me	Me	S	C=O	
2325.	Me	Me	Me	SO	C=O	
2326.	Me	Me	Me	SO ₂	C=O	
2327.	Me	Me	Me	S	CHOMe	
2328.	Me	Me	Me	SO	CHOMe	
2329.	Me	Me	Me	SO ₂	CHOMe	
2330.	Me	Me	Me	S	CHOEt	
2331.	Me	Me	Me	SO	CHOEt	
2332.	Me	Me	Me	SO ₂	CHOEt	
2333.	Me	Me	Me	S	C=NOMe	
2334.	Me	Me	Me	SO	C=NOMe	
2335.	Me	Me	Me	SO ₂	C=NOMe	
2336.	Me	Me	Me	S	C=NOEt	
2337.	Me	Me	Me	SO	C=NOEt	
2338.	Me	Me	Me	SO ₂	C=NOEt	
2339.	Me	Me	Me	S	O	
2340.	Me	Me	Me	SO	O	
2341.	Me	Me	Me	SO ₂	O	
2342.	Me	Me	Me	S	S	
2343.	Me	Me	Me	SO	S	
2344.	Me	Me	Me	SO ₂	S	
2345.	Me	Me	Me	S	SO ₂	
2346.	Me	Me	Me	SO	SO ₂	
2347.	Me	Me	Me	SO ₂	SO ₂	
2348.	Me	Me	H	S	C=O	
2349.	Me	Me	H	SO	C=O	
2350.	Me	Me	H	SO ₂	C=O	
2351.	Me	Me	H	S	CHOMe	
2352.	Me	Me	H	SO	CHOMe	

10

20

30

40

番号	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	1H NMR
2353.	Me	Me	H	SO ₂	CHOMe	
2354.	Me	Me	H	S	CHOEt	
2355.	Me	Me	H	SO	CHOEt	
2356.	Me	Me	H	SO ₂	CHOEt	
2357.	Me	Me	H	S	C=NOMe	
2358.	Me	Me	H	SO	C=NOMe	
2359.	Me	Me	H	SO ₂	C=NOMe	
2360.	Me	Me	H	S	C=NOEt	
2361.	Me	Me	H	SO	C=NOEt	
2362.	Me	Me	H	SO ₂	C=NOEt	
2363.	Me	Me	H	S	O	
2364.	Me	Me	H	SO	O	
2365.	Me	Me	H	SO ₂	O	
2366.	Me	Me	H	S	S	
2367.	Me	Me	H	SO	S	
2368.	Me	Me	H	SO ₂	S	
2369.	Me	Me	H	S	SO ₂	
2370.	Me	Me	H	SO	SO ₂	
2371.	Me	Me	H	SO ₂	SO ₂	

10

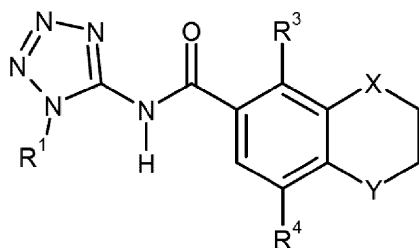
20

30

表 1 3 : Q が Q 1 であり、R⁵ が水素であり、n が 2 である一般式 (I) の本発明の化合物

【 0 1 2 1 】

【 化 3 0 】



40

【 0 1 2 2 】

【表 1 3】

番号	R ¹	R ³	R ⁴	X	Y	1H NMR
2372.	Me	Me	Me	S	C=O	
2373.	Me	Me	Me	SO	C=O	
2374.	Me	Me	Me	SO ₂	C=O	
2375.	Me	Me	Me	S	CHOMe	
2376.	Me	Me	Me	SO	CHOMe	
2377.	Me	Me	Me	SO ₂	CHOMe	
2378.	Me	Me	Me	S	CHOEt	
2379.	Me	Me	Me	SO	CHOEt	
2380.	Me	Me	Me	SO ₂	CHOEt	
2381.	Me	Me	Me	S	C=NOMe	
2382.	Me	Me	Me	SO	C=NOMe	
2383.	Me	Me	Me	SO ₂	C=NOMe	
2384.	Me	Me	Me	S	C=NOEt	
2385.	Me	Me	Me	SO	C=NOEt	
2386.	Me	Me	Me	SO ₂	C=NOEt	
2387.	Me	Me	Me	S	O	
2388.	Me	Me	Me	SO	O	
2389.	Me	Me	Me	SO ₂	O	
2390.	Me	Me	Me	S	S	
2391.	Me	Me	Me	SO	S	
2392.	Me	Me	Me	SO ₂	S	
2393.	Me	Me	Me	S	SO ₂	
2394.	Me	Me	Me	SO	SO ₂	
2395.	Me	Me	Me	SO ₂	SO ₂	
2396.	Me	Me	H	S	C=O	
2397.	Me	Me	H	SO	C=O	
2398.	Me	Me	H	SO ₂	C=O	
2399.	Me	Me	H	S	CHOMe	
2400.	Me	Me	H	SO	CHOMe	

10

20

30

40

番号	R ¹	R ³	R ⁴	X	Y	¹ H NMR
2401.	Me	Me	H	SO ₂	CHOMe	
2402.	Me	Me	H	S	CHOEt	
2403.	Me	Me	H	SO	CHOEt	
2404.	Me	Me	H	SO ₂	CHOEt	
2405.	Me	Me	H	S	C=NOMe	
2406.	Me	Me	H	SO	C=NOMe	
2407.	Me	Me	H	SO ₂	C=NOMe	
2408.	Me	Me	H	S	C=NOEt	
2409.	Me	Me	H	SO	C=NOEt	
2410.	Me	Me	H	SO ₂	C=NOEt	
2411.	Me	Me	H	S	O	
2412.	Me	Me	H	SO	O	
2413.	Me	Me	H	SO ₂	O	
2414.	Me	Me	H	S	S	
2415.	Me	Me	H	SO	S	
2416.	Me	Me	H	SO ₂	S	
2417.	Me	Me	H	S	SO ₂	
2418.	Me	Me	H	SO	SO ₂	
2419.	Me	Me	H	SO ₂	SO ₂	

10

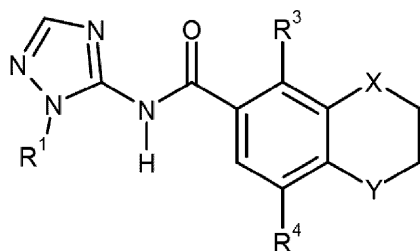
20

30

表 1 4 : Q が Q 2 であり、R⁵ が水素であり、n が 2 である一般式 (I) の本発明の化合物

【 0 1 2 3 】

【 化 3 1 】



40

【 0 1 2 4 】

【表 1 4】

番号	R ¹	R ³	R ⁴	X	Y	1H NMR
2420.	Me	Me	Me	S	C=O	
2421.	Me	Me	Me	SO	C=O	
2422.	Me	Me	Me	SO ₂	C=O	
2423.	Me	Me	Me	S	CHOMe	
2424.	Me	Me	Me	SO	CHOMe	
2425.	Me	Me	Me	SO ₂	CHOMe	
2426.	Me	Me	Me	S	CHOEt	
2427.	Me	Me	Me	SO	CHOEt	
2428.	Me	Me	Me	SO ₂	CHOEt	
2429.	Me	Me	Me	S	C=NOMe	
2430.	Me	Me	Me	SO	C=NOMe	
2431.	Me	Me	Me	SO ₂	C=NOMe	
2432.	Me	Me	Me	S	C=NOEt	
2433.	Me	Me	Me	SO	C=NOEt	
2434.	Me	Me	Me	SO ₂	C=NOEt	
2435.	Me	Me	Me	S	O	
2436.	Me	Me	Me	SO	O	
2437.	Me	Me	Me	SO ₂	O	
2438.	Me	Me	Me	S	S	
2439.	Me	Me	Me	SO	S	
2440.	Me	Me	Me	SO ₂	S	
2441.	Me	Me	Me	S	SO ₂	
2442.	Me	Me	Me	SO	SO ₂	
2443.	Me	Me	Me	SO ₂	SO ₂	
2444.	Me	Me	H	S	C=O	
2445.	Me	Me	H	SO	C=O	
2446.	Me	Me	H	SO ₂	C=O	
2447.	Me	Me	H	S	CHOMe	
2448.	Me	Me	H	SO	CHOMe	

10

20

30

40

番号	R ¹	R ³	R ⁴	X	Y	¹ H NMR
2449.	Me	Me	H	SO ₂	CHOMe	
2450.	Me	Me	H	S	CHOEt	
2451.	Me	Me	H	SO	CHOEt	
2452.	Me	Me	H	SO ₂	CHOEt	
2453.	Me	Me	H	S	C=NOMe	
2454.	Me	Me	H	SO	C=NOMe	
2455.	Me	Me	H	SO ₂	C=NOMe	
2456.	Me	Me	H	S	C=NOEt	
2457.	Me	Me	H	SO	C=NOEt	
2458.	Me	Me	H	SO ₂	C=NOEt	
2459.	Me	Me	H	S	O	
2460.	Me	Me	H	SO	O	
2461.	Me	Me	H	SO ₂	O	
2462.	Me	Me	H	S	S	
2463.	Me	Me	H	SO	S	
2464.	Me	Me	H	SO ₂	S	
2465.	Me	Me	H	S	SO ₂	
2466.	Me	Me	H	SO	SO ₂	
2467.	Me	Me	H	SO ₂	SO ₂	

10

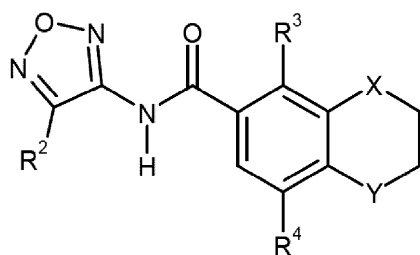
20

30

表 1 5 : Q が Q 3 であり、R⁵ が水素であり、n が 2 である一般式 (I) の本発明の化合物

【 0 1 2 5 】

【 化 3 2 】



40

【 0 1 2 6 】

【表 1 5】

番号	R ¹	R ³	R ⁴	X	Y	1H NMR
2468.	Me	Me	Me	S	C=O	
2469.	Me	Me	Me	SO	C=O	
2470.	Me	Me	Me	SO ₂	C=O	
2471.	Me	Me	Me	S	CHOMe	
2472.	Me	Me	Me	SO	CHOMe	
2473.	Me	Me	Me	SO ₂	CHOMe	
2474.	Me	Me	Me	S	CHOEt	
2475.	Me	Me	Me	SO	CHOEt	
2476.	Me	Me	Me	SO ₂	CHOEt	
2477.	Me	Me	Me	S	C=NOMe	
2478.	Me	Me	Me	SO	C=NOMe	
2479.	Me	Me	Me	SO ₂	C=NOMe	
2480.	Me	Me	Me	S	C=NOEt	
2481.	Me	Me	Me	SO	C=NOEt	
2482.	Me	Me	Me	SO ₂	C=NOEt	
2483.	Me	Me	Me	S	O	
2484.	Me	Me	Me	SO	O	
2485.	Me	Me	Me	SO ₂	O	
2486.	Me	Me	Me	S	S	
2487.	Me	Me	Me	SO	S	
2488.	Me	Me	Me	SO ₂	S	
2489.	Me	Me	Me	S	SO ₂	
2490.	Me	Me	Me	SO	SO ₂	
2491.	Me	Me	Me	SO ₂	SO ₂	
2492.	Me	Me	H	S	C=O	
2493.	Me	Me	H	SO	C=O	
2494.	Me	Me	H	SO ₂	C=O	
2495.	Me	Me	H	S	CHOMe	
2496.	Me	Me	H	SO	CHOMe	

10

20

30

40

番号	R ¹	R ³	R ⁴	X	Y	1H NMR
2497.	Me	Me	H	SO ₂	CHOMe	
2498.	Me	Me	H	S	CHOEt	
2499.	Me	Me	H	SO	CHOEt	
2500.	Me	Me	H	SO ₂	CHOEt	
2501.	Me	Me	H	S	C=NOMe	
2502.	Me	Me	H	SO	C=NOMe	
2503.	Me	Me	H	SO ₂	C=NOMe	
2504.	Me	Me	H	S	C=NOEt	
2505.	Me	Me	H	SO	C=NOEt	
2506.	Me	Me	H	SO ₂	C=NOEt	
2507.	Me	Me	H	S	O	
2508.	Me	Me	H	SO	O	
2509.	Me	Me	H	SO ₂	O	
2510.	Me	Me	H	S	S	
2511.	Me	Me	H	SO	S	
2512.	Me	Me	H	SO ₂	S	
2513.	Me	Me	H	S	SO ₂	
2514.	Me	Me	H	SO	SO ₂	
2515.	Me	Me	H	SO ₂	SO ₂	

10

20

30

B. 製剤例

a) 粉剤は式 (I) の化合物および／またはその塩 10 重量部と不活性物質としてのタルク 90 重量部を混合し、その混合物をハンマーミルで粉砕することにより得られる。

【0127】

b) 容易に水に分散しうる水和剤は式 (I) の化合物および／またはその塩 25 重量部、不活性物質としてのカオリン含有石英 64 重量部、リグノスルホン酸カリウム 10 重量部ならびに湿展剤および分散剤としてのオレイルメチルタウリン酸ナトリウム 1 重量部のを混合し、その混合物をピン付きディスクミルで粉砕することにより得られる。

【0128】

40

c) 容易に水に分散しうる分散液濃縮物は式 (I) の化合物および／またはその塩 20 重量部をアルキルフェノールポリグリコールエーテル (Triton (登録商標) X207) 6 重量部、イソトリデカノールポリグリコールエーテル (8EO) 3 重量部およびパラフィン系鉱油 (沸点範囲: 例えば約 255 から 277 °C) 71 重量部と混合し、その混合物をボールミルで 5 ミクロン以下の粉末度まで粉砕することにより得られる。

【0129】

d) 乳剤は式 (I) の化合物および／またはその塩 15 重量部、溶媒としてのシクロヘキサノン 75 重量部および乳化剤としてのエトキシ化ノニルフェノール 10 重量部から得られる。

【0130】

50

e) 顆粒水和剤は、
 式 (I) の化合物および／またはその塩 75 重量部、
 リグノスルホン酸カルシウム 10 重量部、
 ラウリル硫酸ナトリウム 5 重量部、
 ポリビニルアルコール 3 重量部および
 カオリン 7 重量部

を混合し、その混合物をピン付きディスクミルで粉碎し、その粉末を造粒液としての水に噴霧して流動床で造粒することにより得られる。

【0131】

f) 顆粒水和剤はまた、
 式 (I) の化合物および／またはその塩 25 重量部、
 ナトリウム 2, 2'-ジナフチルメタン-6, 6'-ジスルホン酸ナトリウム 5 重量部

10

、
 オレイルメチルタウリン酸ナトリウム 2 重量部、
 ポリビニルアルコール 1 重量部、
 炭酸カルシウム 17 重量部および
 水 50 重量部

をコロイドミルで均質化および予備粉碎し、次にその混合物をビーズミルで粉碎し、得られた懸濁液を噴霧塔で単一物質ノズルにより噴霧および乾燥することにより得られる。

【0132】

20

C. 生物試験例

1. 有害植物に対する発芽前除草作用

単子葉および双子葉雑草および作物の種子を、木質繊維ポットで砂壤土に入れ、土で覆う。次に、水和剤 (WP) の形態でまたは乳剤 (EC) として製剤した本発明の化合物を、水施用量 600 から 800 L/ha (変換値) で、0.2% の湿展剤を加えた水系懸濁液または乳濁液として、覆っている土の表面に施用する。処理後、ポットを温室に入れ、試験植物のための良好な生育条件下に維持する。3 週間の試験期間後に、未処理対照との比較によって、試験植物に対する損傷の肉眼評価を行う (除草活性パーセント (%): 100% 作用 = 植物が枯死、0% 作用 = 対照植物と同様)。例えば、化合物番号 7、9、40、187 および 189 がそれぞれ施用量 320 g/ha で、イチビ (*Abutilon theophrasti*) およびアオビユ (*Amaranthus retroflexus*) に対して少なくとも 80% の抗力を示す。化合物番号 9、40、187、189 および 2204 がそれぞれ施用量 320 g/ha で、イヌカミツレ (*Matricaria inodora*)、ハコベ (*Stellaria media*) およびオオイヌノフグリ (*Veronica persica*) に対して少なくとも 80% の効力を示す。

30

【0133】

2. 有害植物に対する発芽後除草作用

単子葉および双子葉雑草および作物の種子を、木質繊維ポットで砂壤土に入れ、土で覆い、温室において良好な生育条件下で栽培する。播種から 2 から 3 週間後、試験植物を 1 葉期で処理する。次に、水和剤 (WP) の形態でまたは乳剤 (EC) として製剤した本発明の化合物を、水施用量 600 から 800 L/ha (変換値) で、0.2% の湿展剤を加えて、水系懸濁液または乳濁液として植物の緑の部分に噴霧する。試験植物を約 3 週間にわたり温室で至適な生育条件下に置いた後、製剤の作用を、未処理対照との比較で肉眼的に評点する (除草活性パーセント (%): 100% 作用 = 植物が枯死、0% 作用 = 対照植物と同様)。

40

【0134】

良好な発芽後効力 (PO) の例。例えば、化合物番号 7 および 2204 がそれぞれ施用量 80 g/ha で、イチビ (*Abutilon theophrasti*) およびサンシキスミレ (*Viola tricolor*) に対して少なくとも 80% の効力を示す。化合物番号 9、187 および 189 がそれぞれ施用量 80 g/ha で、イチビ (*Abut*

50

ilon theophrasti) およびアオビユ (Amaranthus retroflexus) に対して少なくとも 80% の効力を示す。化合物番号 40、187 および 189 がそれぞれ施用量 80 g/ha で、イヌカミツレ (Matricaria inodora)、ハコベ (Stellaria media) およびオオイヌノフグリ (Veronica persica) に対して少なくとも 80% の効力を示す。

【国際調査報告】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/EP2012/054269

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER INV. C07D409/12 C07D409/14 C07D411/12 C07D413/12 C07D413/14 C07D417/12 ADD. According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC		
B. FIELDS SEARCHED Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) C07D 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 practicable, search terms used) EPO-Internal, CHEM ABS Data		
C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	EP 0 173 657 A2 (ENICHEM SINTESI [IT]) 5 March 1986 (1986-03-05) claim 1	1-12
A	----- WO 2004/101532 A1 (BAYER CROPSCIENCE AG [DE]; GESING ERNST R F [DE]; DREWES MARK WILHELM) 25 November 2004 (2004-11-25) claim 1 -----	1-12
☐ Further documents are listed in the continuation of Box C. ☒ See patent family annex.		
* Special categories of cited documents : "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance "E" earlier application or patent but published on or after the international filing date "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified) "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed "T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention "X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone "Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art "&" document member of the same patent family		
Date of the actual completion of the international search 3 May 2012		Date of mailing of the international search report 11/05/2012
Name and mailing address of the ISA/ European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Fax: (+31-70) 340-3016		Authorized officer Wolf, Claudia

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No

PCT/EP2012/054269

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
EP 0173657	A2	05-03-1986	AR 240382 A1 30-04-1990
		AU 573022 B2 26-05-1988	
		AU 4617585 A 06-03-1986	
		BR 8504138 A 17-06-1986	
		CA 1252642 A1 18-04-1989	
		DE 3574871 D1 25-01-1990	
		EP 0173657 A2 05-03-1986	
		ES 8604536 A1 01-07-1986	
		IT 1196237 B 16-11-1988	
		JP 1486915 C 14-03-1989	
		JP 61076405 A 18-04-1986	
		JP 63035605 B 15-07-1988	
		PH 22083 A 20-05-1988	
		US 4671818 A 09-06-1987	
		ZA 8506154 A 30-04-1986	

WO 2004101532	A1	25-11-2004	CN 1548425 A 24-11-2004
			WO 2004101532 A1 25-11-2004

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2012/054269

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES

INV. C07D409/12 C07D409/14 C07D411/12 C07D413/12 C07D413/14
C07D417/12

ADD.

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPC) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPC

B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)

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

C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
A	EP 0 173 657 A2 (ENICHEM SINTESI [IT]) 5. März 1986 (1986-03-05) Anspruch 1 -----	1-12
A	WO 2004/101532 A1 (BAYER CROPSCIENCE AG [DE]; GESING ERNST R F [DE]; DREWES MARK WILHELM) 25. November 2004 (2004-11-25) Anspruch 1 -----	1-12

☐ Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen
 ☒ Siehe Anhang Patentfamilie

* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :

"A" Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist

"E" frühere Anmeldung oder Patent, die bzw. 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 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

3. Mai 2012

Absenddatum des internationalen Recherchenberichts

11/05/2012

Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde

Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040,
Fax: (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Bediensteter

Wolf, Claudia

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2012/054269

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
EP 0173657	A2	05-03-1986	AR 240382 A1 30-04-1990
		AU 573022 B2 26-05-1988	
		AU 4617585 A 06-03-1986	
		BR 8504138 A 17-06-1986	
		CA 1252642 A1 18-04-1989	
		DE 3574871 D1 25-01-1990	
		EP 0173657 A2 05-03-1986	
		ES 8604536 A1 01-07-1986	
		IT 1196237 B 16-11-1988	
		JP 1486915 C 14-03-1989	
		JP 61076405 A 18-04-1986	
		JP 63035605 B 15-07-1988	
		PH 22083 A 20-05-1988	
		US 4671818 A 09-06-1987	
		ZA 8506154 A 30-04-1986	

WO 2004101532	A1	25-11-2004	CN 1548425 A 24-11-2004
			WO 2004101532 A1 25-11-2004

フロントページの続き

(51)Int.Cl.		F I		テーマコード (参考)
A O 1 N 43/713 (2006.01)		A O 1 N 43/713		
A O 1 N 43/832 (2006.01)		A O 1 N 43/82	1 O 3	
A O 1 P 13/00 (2006.01)		A O 1 P 13/00		

(81)指定国 AP(BW,GH,GM,KE,LR,LS,MW,MZ,NA,RW,SD,SL,SZ,TZ,UG,ZM,ZW),EA(AM,AZ,BY,KG,KZ,MD,RU,TJ,TM),EP(AL,AT,BE,BG,CH,CY,CZ,DE,DK,EE,ES,FI,FR,GB,GR,HR,HU,IE,IS,IT,LT,LU,LV,MC,MK,MT,NL,NO,PL,PT,RO,RS,SE,SI,SK,SM,TR),OA(BF,BJ,CF,CG,CI,CM,GA,GN,GQ,GW,ML,MR,NE,SN,TD,TG),AE,AG,AL,AM,AO,AT,AU,AZ,BA,BB,BG,BH,BR,BW,BY,BZ,CA,CH,CL,CN,CO,CR,CU,CZ,DE,DK,DM,DO,DZ,EC,EE,EG,ES,FI,GB,GD,GE,GH,GM,GT,HN,HR,HU,ID,IL,IN,IS,JP,KE,KG,KM,KN,KP,KR,KZ,LA,LC,LK,LR,LS,LT,LU,LY,MA,MD,ME,MG,MK,MN,MW,MX,MY,MZ,NA,NG,NI,NO,NZ,OM,PE,PG,PH,PL,PT,QA,RO,RS,RU,RW,SC,SD,SE,SG,SK,SL,SM,ST,SV,SY,TH,TJ,TM,TN,TR,TT,TZ,UA,UG,US,UZ,VC,VN

(74)代理人 100137213
弁理士 安藤 健司

(74)代理人 230105223
弁護士 城山 康文

(72)発明者 フアン・アルムシツク, アンドレアス
ドイツ国、6 1 1 8 4・カーベン、アム・ブロイル・4ペー

(72)発明者 アーレンス, ハルトムート
ドイツ国、6 3 3 2 9・エゲルスバツハ、アウフ・デル・ホーエ・1 4

(72)発明者 ケーン, アルニム
ドイツ国、5 5 2 7 0・クライナーヴァインターンハイム、リンクシュトラッセ・1 2

(72)発明者 デルナーリーピング, シモン
ドイツ国、6 1 2 6 7・ノイーアンスバツハ、ホルヴェーク・1 1ペー

(72)発明者 ブラウン, ラルフ
ドイツ国、7 6 8 5 7・ランベルク、ビショフベツクーシュトラッセ・1アー

(72)発明者 ホイザーハーゲン, イゾルデ
ドイツ国、5 1 3 7 5・レバークゼン、ドューンフェルダー・シュトラッセ・2 2

(72)発明者 ロジンガー, クリストファー・ヒュー
ドイツ国、6 5 7 1 9・ホフハイム、アム・ホツホフェルド・3 3

(72)発明者 ハインマン, イネス
ドイツ国、6 5 7 1 9・ホフハイム、ユビールシュトラッセ・1 3

(72)発明者 ガツツヴァイラー, エルマー
ドイツ国、6 1 2 3 1・バート・ナウハイム、アム・ナウハイマー・バツハ・2 2

Fターム(参考) 4C063 AA01 AA03 BB08 BB09 CC81 CC94 CC95 DD34 DD41 DD47
DD58 EE03

4H011 AB01 BB09 BB10 DA15 DA16 DD03 DD04

(54)【発明の名称】 Nー(1, 2, 5ーオキサジアゾールー3ーイル)ー、Nー(テトラゾールー5ーイル)ーおよびNー(トリアゾールー5ーイル)ビシクロアリアルカルボキサミド類およびそれらの除草剤としての使用