

(19) 日本国特許庁 (JP)

(12) 特 許 公 報 (B2)

(11) 特許番号

特許第5393655号
(P5393655)

(45) 発行日 平成26年1月22日 (2014. 1. 22)

(24) 登録日 平成25年10月25日 (2013. 10. 25)

(51) Int. Cl.

F I

A O 1 N 25/32 (2006. 01)

A O 1 N 25/32

A O 1 N 43/40 (2006. 01)

A O 1 N 43/40 1 O 1 Q

A O 1 P 13/02 (2006. 01)

A O 1 P 13/02

C O 7 D 213/82 (2006. 01)

C O 7 D 213/82

C O 7 D 417/06 (2006. 01)

C O 7 D 417/06

請求項の数 17 (全 192 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号 特願2010-504503 (P2010-504503)
 (86) (22) 出願日 平成20年4月16日 (2008. 4. 16)
 (65) 公表番号 特表2010-524985 (P2010-524985A)
 (43) 公表日 平成22年7月22日 (2010. 7. 22)
 (86) 国際出願番号 PCT/EP2008/003016
 (87) 国際公開番号 W02008/131860
 (87) 国際公開日 平成20年11月6日 (2008. 11. 6)
 審査請求日 平成23年3月28日 (2011. 3. 28)
 (31) 優先権主張番号 07400013. 4
 (32) 優先日 平成19年4月30日 (2007. 4. 30)
 (33) 優先権主張国 欧州特許庁 (EP)

(73) 特許権者 507203353
 バイエル・クロップサイエンス・アーゲー
 BAYER CROPSCIENCE A
 G
 ドイツ国、40789・モンハイム、アル
 フレートーノベルーシュトラッセ・50
 (74) 代理人 100127926
 弁理士 結田 純次
 (74) 代理人 100105290
 弁理士 三輪 昭次
 (72) 発明者 フランク・ツィーマー
 ドイツ連邦共和国65830クリフテル、
 ウーラントシュトラッセ2

最終頁に続く

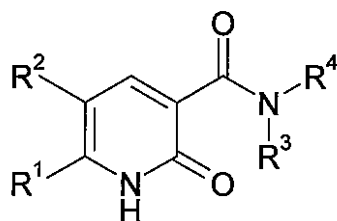
(54) 【発明の名称】 ピリドンカルボキサミド、それを含む作物保護剤、その製造方法及び使用

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I) :

【化 1】



(I)

式中、

 R^1 は、(C₁ - C₆) - ハロアルキル基であり； R^2 は、水素又はハロゲンであり；そして R^3 は、水素、(C₁ - C₁₀) - アルキル、(C₂ - C₁₀) - アルケニル又は(C₂ - C₁₀) - アルキニルであり；

ここで、最後に述べた3つの基は、それぞれ、無置換、又はハロゲン、ヒドロキシル、シアノ、(C₁ - C₄) - アルコキシ、(C₁ - C₄) - ハロアルコキシ、(C₁ - C₄) - アルキルチオ、(C₁ - C₄) - アルキルアミノ、ジ[(C₁ - C₄) - アルキル] - アミノ、[(C₁ - C₄) - アルコキシ] - カルボニル、[(C₁ - C₄) - ハロアルコキシ] - カル

ボニル、無置換若しくはハロゲン、 $(C_1 - C_4)$ - アルキル及び $(C_1 - C_4)$ - ハロアルキルから成るグループから選択された1つ又はそれ以上の基で置換された $(C_3 - C_6)$ - シクロアルキル、無置換若しくはハロゲン、 $(C_1 - C_4)$ - アルキル、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ - アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルコキシ及び $(C_1 - C_4)$ - アルキルチオから成るグループから選択された1つ又はそれ以上の基で置換されたフェニル、及び無置換若しくはハロゲン、 $(C_1 - C_4)$ - アルキル、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ - アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ - アルキルチオ及びオキソから選択された1つ又はそれ以上の基で置換されたヘテロ環から成るグループから選択された1つ又はそれ以上の基で置換され；又は、

$(C_3 - C_6)$ - シクロアルキル、 $(C_4 - C_6)$ - シクロアルケニル、その環の1辺において4～6員環の飽和又は不飽和の炭素環に縮合した $(C_3 - C_6)$ - シクロアルキル、又はその環の1辺において4～6員環の飽和又は不飽和の炭素環に縮合した $(C_4 - C_6)$ - シクロアルケニルであり；

ここで、最後に述べた4つの基は、それぞれ、無置換、又はハロゲン、ヒドロキシル、シアノ、 $(C_1 - C_4)$ - アルキル、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ - アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ - アルキルチオ、 $(C_1 - C_4)$ - アルキルアミノ、ジ[$(C_1 - C_4)$ - アルキル] - アミノ、[$(C_1 - C_4)$ - アルコキシ] - カルボニル、[$(C_1 - C_4)$ - ハロアルコキシ] - カルボニル、無置換若しくはハロゲン、 $(C_1 - C_4)$ - アルキル及び $(C_1 - C_4)$ - ハロアルキルから成るグループから選択された1つ又はそれ以上の基で置換された $(C_3 - C_6)$ - シクロアルキル、無置換若しくはハロゲン、 $(C_1 - C_4)$ - アルキル、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ - アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルコキシ及び $(C_1 - C_4)$ - アルキルチオから選択された1つ又はそれ以上の基で置換されたフェニル、及び無置換若しくはハロゲン、 $(C_1 - C_4)$ - アルキル、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ - アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ - アルキルチオ及びオキソから選択された1つ又はそれ以上の基で置換されたヘテロ環から成るグループから選択された1つ又はそれ以上の基で置換され；そして、

R^4 は、 $(C_1 - C_{10})$ - アルキル、 $(C_2 - C_{10})$ - アルケニル又は $(C_2 - C_{10})$ - アルキニルであり；

ここで、最後に述べた3つの基は、それぞれ、無置換、又はハロゲン、ヒドロキシル、シアノ、 $(C_1 - C_4)$ - アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ - アルキルチオ、 $(C_1 - C_4)$ - アルキルアミノ、ジ[$(C_1 - C_4)$ - アルキル] - アミノ、[$(C_1 - C_4)$ - アルコキシ] - カルボニル及び [$(C_1 - C_4)$ - ハロアルコキシ] - カルボニル、無置換若しくはハロゲン、 $(C_1 - C_4)$ - アルキル及び $(C_1 - C_4)$ - ハロアルキルから成るグループから選択された1つ又はそれ以上の基で置換された $(C_3 - C_6)$ - シクロアルキル、無置換若しくはハロゲン、 $(C_1 - C_4)$ - アルキル、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ - アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルコキシ及び $(C_1 - C_4)$ - アルキルチオから成るグループから選択された1つ又はそれ以上の基で置換されたフェニル、及び無置換若しくはハロゲン、 $(C_1 - C_4)$ - アルキル、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ - アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ - アルキルチオ及びオキソから成るグループから選択された1つ又はそれ以上の基で置換されたヘテロ環から成るグループから選択された1つ又はそれ以上の基で置換され；又は、

$(C_3 - C_6)$ - シクロアルキル、 $(C_4 - C_6)$ - シクロアルケニル、その環の1辺において4～6員環の飽和又は不飽和の炭素環に縮合した $(C_3 - C_6)$ - シクロアルキル、又はその環の1辺において4～6員環の飽和又は不飽和の炭素環に縮合した $(C_4 - C_6)$ - シクロアルケニルであり；

ここで、最後に述べた4つの基は、それぞれ、無置換、又はハロゲン、ヒドロキシル、シアノ、 $(C_1 - C_4)$ - アルキル、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ - アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ - アルキルチオ、 $(C_1 - C_4)$ - アルキルアミノ、ジ[$(C_1 - C_4)$ - アルキル] - アミノ、[$(C_1 - C_4)$ - アルコキシ]

- カルボニル、 $[(C_1 - C_4) - \text{ハロアルコキシ}] - \text{カルボニル}$ 、無置換若しくはハロゲン、 $(C_1 - C_4) - \text{アルキル}$ 及び $(C_1 - C_4) - \text{ハロアルキル}$ から成るグループから選択された1つ又はそれ以上の基で置換された $(C_3 - C_6) - \text{シクロアルキル}$ 、無置換若しくはハロゲン、 $(C_1 - C_4) - \text{アルキル}$ 、 $(C_1 - C_4) - \text{ハロアルキル}$ 、 $(C_1 - C_4) - \text{アルコキシ}$ 、 $(C_1 - C_4) - \text{ハロアルコキシ}$ 及び $(C_1 - C_4) - \text{アルキルチオ}$ から成るグループから選択された1つ又はそれ以上の基で置換されたフェニル、及び無置換若しくはハロゲン、 $(C_1 - C_4) - \text{アルキル}$ 、 $(C_1 - C_4) - \text{ハロアルキル}$ 、 $(C_1 - C_4) - \text{アルコキシ}$ 、 $(C_1 - C_4) - \text{ハロアルコキシ}$ 、 $(C_1 - C_4) - \text{アルキルチオ}$ 及びオキソから成るグループから選択された1つ又はそれ以上の基で置換されたヘテロ環から成るグループから選択された1つ又はそれ以上の基で置換される；

10

又は、

R^1 は、 $(C_1 - C_6) - \text{ハロアルキル}$ 基であり；

R^2 は、ハロゲンであり；

R^3 は、水素であり；そして

R^4 は水素であり；

又は、

R^1 は、式 CF_2Cl 、 CF_2H 、 CF_2CF_3 、 CF_2CF_2H 、 CF_2CF_2Cl 、 $CFClCF_3$ 、 $CFHCF_3$ 、 $CF(CF_3)_2$ 、 $CH(CF_3)_2$ 、 $CF_2CF_2CF_3$ 又は $C(CH_3)_2F$ の基であり；

R^2 は水素であり；

R^3 は水素であり；そして

R^4 は水素である；

20

の化合物又はその塩の、有用な植物に対するメソスルフロン - メチル、テンボトリオン、フェノキサプロップ - P - エチル、チエンカルバゾン、チエンカルバゾン - メチル及びイソキサフルトールからなる群より選ばれた農業用化学薬剤の有害作用を低減又は予防するための、有用植物の保護剤としての使用。

【請求項2】

請求項1に記載の使用であって、

R^3 は、水素、 $(C_1 - C_{10}) - \text{アルキル}$ 、 $(C_2 - C_{10}) - \text{アルケニル}$ 又は $(C_2 - C_{10}) - \text{アルキニル}$ であり；

30

ここで、最後に述べた3つの基は、それぞれ、無置換、又はハロゲン、ヒドロキシル、シアノ、 $(C_1 - C_4) - \text{アルコキシ}$ 、 $(C_1 - C_4) - \text{ハロアルコキシ}$ 、 $(C_1 - C_4) - \text{アルキルチオ}$ 、 $(C_1 - C_4) - \text{アルキルアミノ}$ 、ジ $[(C_1 - C_4) - \text{アルキル}] - \text{アミノ}$ 、 $[(C_1 - C_4) - \text{アルコキシ}] - \text{カルボニル}$ 、 $[(C_1 - C_4) - \text{ハロアルコキシ}] - \text{カルボニル}$ 、無置換若しくはハロゲン、 $(C_1 - C_4) - \text{アルキル}$ 及び $(C_1 - C_4) - \text{ハロアルキル}$ から成るグループから選択された1つ又はそれ以上の基で置換された $(C_3 - C_6) - \text{シクロアルキル}$ 、無置換若しくはハロゲン、 $(C_1 - C_4) - \text{アルキル}$ 、 $(C_1 - C_4) - \text{ハロアルキル}$ 、 $(C_1 - C_4) - \text{アルコキシ}$ 、 $(C_1 - C_4) - \text{ハロアルコキシ}$ 及び $(C_1 - C_4) - \text{アルキルチオ}$ から選択された1つ又はそれ以上の基で置換されたフェニル、及び無置換若しくはハロゲン、 $(C_1 - C_4) - \text{アルキル}$ 、 $(C_1 - C_4) - \text{ハロアルキル}$ 、 $(C_1 - C_4) - \text{アルコキシ}$ 、 $(C_1 - C_4) - \text{ハロアルコキシ}$ 、 $(C_1 - C_4) - \text{アルキルチオ}$ 及びオキソから選択された1つ又はそれ以上の基で置換されたヘテロ環から成るグループから選択された1つ又はそれ以上の基で置換され；又は、

40

$(C_3 - C_6) - \text{シクロアルキル}$ 、又はその環の1辺において4～6員環の飽和又は不飽和の炭素環に縮合した $(C_3 - C_6) - \text{シクロアルキル}$ であり；

ここで、最後に述べた2つの基は、それぞれ、無置換、又は $(C_1 - C_4) - \text{アルキル}$ から成るグループから選択された1つ又はそれ以上の基で置換され；そして、

R^4 は、 $(C_1 - C_{10}) - \text{アルキル}$ 、 $(C_2 - C_{10}) - \text{アルケニル}$ 又は $(C_2 - C_{10}) - \text{アルキニル}$ であり；

ここで、最後に述べた3つの基は、それぞれ、無置換、又はハロゲン、ヒドロキシル、

50

シアノ、 $(C_1 - C_4)$ - アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ - アルキルチオ、 $(C_1 - C_4)$ - アルキルアミノ、ジ $[(C_1 - C_4)$ - アルキル] - アミノ、 $[(C_1 - C_4)$ - アルコキシ] - カルボニル、 $[(C_1 - C_4)$ - ハロアルコキシ] - カルボニル、無置換若しくはハロゲン、 $(C_1 - C_4)$ - アルキル及び $(C_1 - C_4)$ - ハロアルキルから成るグループから選択された1つ又はそれ以上の基で置換された $(C_3 - C_6)$ - シクロアルキル、無置換若しくはハロゲン、 $(C_1 - C_4)$ - アルキル、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ - アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルコキシ及び $(C_1 - C_4)$ - アルキルチオから成るグループから選択された1つ又はそれ以上の基で置換されたフェニル、及び無置換若しくはハロゲン、 $(C_1 - C_4)$ - アルキル、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ - アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ - アルキルチオ及びオキソから選択された1つ又はそれ以上の基で置換された置換されたヘテロ環から成るグループから選択された1つ又はそれ以上の基で置換され；又は、

10

$(C_3 - C_6)$ - シクロアルキル、又はその環の1辺において4～6員環の飽和又は不飽和の炭素環に縮合した $(C_3 - C_6)$ - シクロアルキルであり；

ここで、最後に述べた2つの基は、それぞれ、無置換、又は $(C_1 - C_4)$ - アルキルから成るグループから選択された1つ又はそれ以上の基で置換される；

化合物の使用。

【請求項3】

請求項1に記載の使用であって、

R^3 は、水素、 $(C_1 - C_{10})$ - アルキル、 $(C_2 - C_{10})$ - アルケニル又は $(C_2 - C_{10})$ - アルキニルであり；

20

ここで、最後に述べた3つの基は、それぞれ、無置換、又は $(C_1 - C_4)$ - アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ - アルキルチオ及び $[(C_1 - C_4)$ - アルコキシ] - カルボニルから成るグループから選択された1つ又はそれ以上の基で置換され；そして、

R^4 は、 $(C_1 - C_{10})$ - アルキル、 $(C_2 - C_{10})$ - アルケニル又は $(C_2 - C_{10})$ - アルキニルであり；

ここで、最後に述べた3つの基は、それぞれ、無置換、又は $(C_1 - C_4)$ - アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ - アルキルチオ及び $[(C_1 - C_4)$ - アルコキシ] - カルボニルから成るグループから選択された1つ又はそれ以上の基で置換される；

30

化合物の使用。

【請求項4】

請求項1～3のいずれか1項に記載の使用であって、

R^1 は、 CF_3 、 CF_2Cl 、 CF_2H 、 CF_2CF_3 、 CF_2CF_2H 、 CF_2CF_2Cl 、 $CF_2CF_2CF_3$ 又は $C(CH_3)_2F$ であり；そして

R^2 は、水素又はハロゲンである；

化合物の使用。

【請求項5】

請求項1に記載の使用であって、

40

R^1 は、 $(C_1 - C_6)$ - ハロアルキル基であり；

R^2 は、ハロゲンであり；

R^3 は、水素であり；そして

R^4 は、水素である；

化合物の使用。

【請求項6】

請求項1に記載の使用であって、

R^1 は、式 CF_2Cl 、 CF_2H 、 CF_2CF_3 、 CF_2CF_2H 、 CF_2CF_2Cl 、 $CFClCF_3$ 、 $CFHCF_3$ 、 $CF(CF_3)_2$ 、 $CH(CF_3)_2$ 、 $CF_2CF_2CF_3$ 又は $C(CH_3)_2F$ の基であり；

50

R^2 は、水素であり；

R^3 は、水素であり；そして

R^4 は、水素である；

化合物の使用。

【請求項 7】

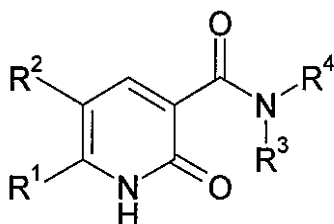
請求項 1 ～ 6 のいずれか 1 項に記載の使用であって、1 つ又はそれ以上の式 (I) の化合物又はその塩が、単独で適用された場合有用な植物に対して損傷を引き起こす 1 つ又はそれ以上の、メソスルフロン - メチル、テンボトリオン、フェノキサプロップ - P - エチル、チエンカルパゾン、チエンカルパゾン - メチル及びイソキサフルトールからなる群より選ばれた農業用化学薬剤と一緒に、場合により製剤助剤の存在下で用いられる使用。

10

【請求項 8】

式 (I)：

【化 2】



(I)

20

式中、

R^1 は、 $(C_1 - C_6)$ - ハロアルキル基であり；

R^2 は、水素又はハロゲンであり；そして

R^3 は、水素、 $(C_1 - C_{10})$ - アルキル、 $(C_2 - C_{10})$ - アルケニル又は $(C_2 - C_{10})$ - アルキニルであり；

ここで、最後に述べた 3 つの基は、それぞれ、無置換、又はハロゲン、ヒドロキシル、シアノ、 $(C_1 - C_4)$ - アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ - アルキルチオ、 $(C_1 - C_4)$ - アルキルアミノ、ジ[$(C_1 - C_4)$ - アルキル] - アミノ、[$(C_1 - C_4)$ - アルコキシ] - カルボニル、[$(C_1 - C_4)$ - ハロアルコキシ] - カルボニル、無置換若しくはハロゲン、 $(C_1 - C_4)$ - アルキル及び $(C_1 - C_4)$ - ハロアルキルから成るグループから選択された 1 つ又はそれ以上の基で置換された $(C_3 - C_6)$ - シクロアルキル、無置換若しくはハロゲン、 $(C_1 - C_4)$ - アルキル、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ - アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルコキシ及び $(C_1 - C_4)$ - アルキルチオから成るグループから選択された 1 つ又はそれ以上の基で置換されたフェニル、及び無置換若しくはハロゲン、 $(C_1 - C_4)$ - アルキル、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ - アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ - アルキルチオ及びオキソから選択された 1 つ又はそれ以上の基で置換されたヘテロ環から成るグループから選択された 1 つ又はそれ以上の基で置換され；又は、

30

$(C_3 - C_6)$ - シクロアルキル、 $(C_4 - C_6)$ - シクロアルケニル、その環の 1 辺において 4 ～ 6 員環の飽和又は不飽和の炭素環に縮合した $(C_3 - C_6)$ - シクロアルキル、又はその環の 1 辺において 4 ～ 6 員環の飽和又は不飽和の炭素環に縮合した $(C_4 - C_6)$ - シクロアルケニルであり；

40

ここで、最後に述べた 4 つの基は、それぞれ、無置換、又はハロゲン、ヒドロキシル、シアノ、 $(C_1 - C_4)$ - アルキル、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ - アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ - アルキルチオ、 $(C_1 - C_4)$ - アルキルアミノ、ジ[$(C_1 - C_4)$ - アルキル] - アミノ、[$(C_1 - C_4)$ - アルコキシ] - カルボニル、[$(C_1 - C_4)$ - ハロアルコキシ] - カルボニル、無置換若しくはハロゲン、 $(C_1 - C_4)$ - アルキル及び $(C_1 - C_4)$ - ハロアルキルから成るグループから選択された 1 つ又はそれ以上の基で置換された $(C_3 - C_6)$ - シクロアルキル、無置換若しく

50

はハロゲン、 $(C_1 - C_4)$ - アルキル、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ - アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルコキシ及び $(C_1 - C_4)$ アルキルチオから選択された1つ又はそれ以上の基で置換されたフェニル、及び無置換若しくはハロゲン、 $(C_1 - C_4)$ - アルキル、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ - アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ アルキルチオ及びオキソから選択された1つ又はそれ以上の基で置換されたヘテロ環から成るグループから選択された1つ又はそれ以上の基で置換され；そして、

R^4 は、 $(C_1 - C_{10})$ - アルキル、 $(C_2 - C_{10})$ - アルケニル又は $(C_2 - C_{10})$ - アルキニルであり；

ここで、最後に述べた3つの基は、それぞれ、無置換、又はハロゲン、ヒドロキシル、シアノ、 $(C_1 - C_4)$ - アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ - アルキルチオ、 $(C_1 - C_4)$ - アルキルアミノ、ジ $[(C_1 - C_4)$ - アルキル] - アミノ、 $[(C_1 - C_4)$ - アルコキシ] - カルボニル及び $[(C_1 - C_4)$ - ハロアルコキシ] - カルボニル、無置換若しくはハロゲン、 $(C_1 - C_4)$ - アルキル及び $(C_1 - C_4)$ - ハロアルキルから成るグループから選択された1つ又はそれ以上の基で置換された $(C_3 - C_6)$ - シクロアルキル、無置換若しくはハロゲン、 $(C_1 - C_4)$ - アルキル、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ - アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルコキシ及び $(C_1 - C_4)$ アルキルチオから成るグループから選択された1つ又はそれ以上の基で置換されたフェニル、及び無置換若しくはハロゲン、 $(C_1 - C_4)$ - アルキル、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ - アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ アルキルチオ及びオキソから成るグループから選択された1つ又はそれ以上の基で置換されたヘテロ環から成るグループから選択された1つ又はそれ以上の基で置換され；又は、

$(C_3 - C_6)$ - シクロアルキル、 $(C_4 - C_6)$ - シクロアルケニル、その環の1辺において4～6員環の飽和又は不飽和の炭素環に縮合した $(C_3 - C_6)$ - シクロアルキル、又はその環の1辺において4～6員環の飽和又は不飽和の炭素環に縮合した $(C_4 - C_6)$ - シクロアルケニルであり；

ここで、最後に述べた4つの基は、それぞれ、無置換、又はハロゲン、ヒドロキシル、シアノ、 $(C_1 - C_4)$ - アルキル、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ - アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ - アルキルチオ、 $(C_1 - C_4)$ - アルキルアミノ、ジ $[(C_1 - C_4)$ - アルキル] - アミノ、 $[(C_1 - C_4)$ - アルコキシ] - カルボニル、 $[(C_1 - C_4)$ - ハロアルコキシ] - カルボニル、無置換若しくはハロゲン、 $(C_1 - C_4)$ - アルキル及び $(C_1 - C_4)$ - ハロアルキルから成るグループから選択された1つ又はそれ以上の基で置換された $(C_3 - C_6)$ - シクロアルキル、無置換若しくはハロゲン、 $(C_1 - C_4)$ - アルキル、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ - アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルコキシ及び $(C_1 - C_4)$ - アルキルチオから成るグループから選択された1つ又はそれ以上の基で置換されたフェニル、及び無置換若しくはハロゲン、 $(C_1 - C_4)$ - アルキル、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ - アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ - アルキルチオ及びオキソから成るグループから選択された1つ又はそれ以上の基で置換されたヘテロ環から成るグループから選択された1つ又はそれ以上の基で置換される；

又は、

R^1 は、 $(C_1 - C_6)$ - ハロアルキル基であり；

R^2 は、ハロゲンであり；

R^3 は、水素であり；そして

R^4 は、水素であり；

又は、

R^1 は、式 CF_2CF_3 、 CF_2CF_2H 、 CF_2CF_2Cl 、 $CFClCF_3$ 、 $CFHCF_3$ 、 $CF(CF_3)_2$ 、 $CH(CF_3)_2$ 、 $CF_2CF_2CF_3$ 又は $C(CH_3)_2F$ の基であり；

R^2 は、水素であり；

R^3 は、水素であり；そして

10

20

30

40

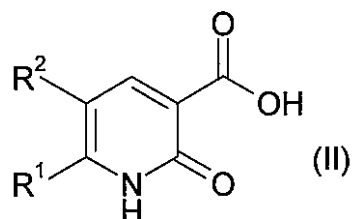
50

R^4 は、水素である；
の化合物又はその塩。

【請求項 9】

請求項 8 で定義された一般式 (I) の化合物又はその塩を製造する方法であって、
(a) 一般式 (II) :

【化 3】

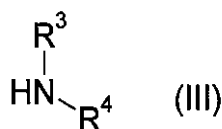


10

式中、

R^1 及び R^2 は、製造すべき式 (I) の化合物において定義した通りである；
のカルボン酸を、式 (III) :

【化 4】

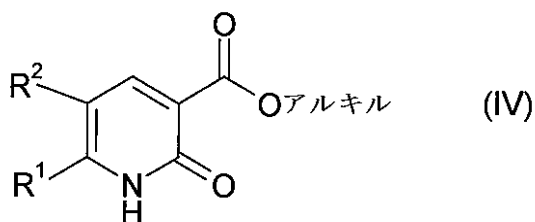


20

式中、

R^3 及び R^4 は、製造すべき式 (I) の化合物で定義した通りである；
のアミン又はその塩と反応させて、式 (I) の化合物を得ること；又は、
(b) 一般式 (IV) :

【化 5】

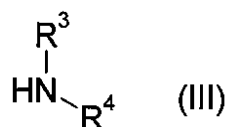


30

式中、

R^1 及び R^2 は、製造すべき式 (I) の化合物で定義した通りであり；そして、「アルキル」は、アルキル基である；
のカルボン酸エステルを、一般式 (III) :

【化 6】

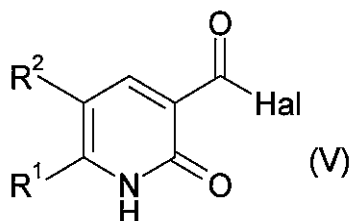


40

式中、

R^3 及び R^4 は、製造すべき式 (I) の化合物で定義した通りである；
のアミン又はその塩と反応させて、式 (I) の化合物を得ること；又は、
(c) 一般式 (V) :

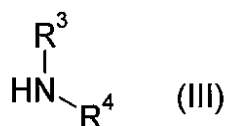
【化 7】



式中、

R¹及びR²は、製造すべき式(Ⅰ)の化合物で定義した通りであり；そして、Halは
、ハロゲン原子又はアシルオキシ基である； 10
のカルボニルハライド又はカルボン酸無水物を、式(Ⅲ)：

【化 8】



式中、

R³及びR⁴は、製造すべき式(Ⅰ)の化合物で定義した通りである； 20
のアミン又はその塩と反応させて、式(Ⅰ)の化合物を得ること；又は、
(d) 製造すべき式(Ⅰ)の化合物におけるR³及びR⁴が、それぞれ水素である場合、
式(Ⅵ)：

【化 9】



式中、

R¹は、製造すべき式(Ⅰ)の化合物で定義した通りであり；そして、
「アルキル」は、アルキル基である； 30
の化合物をマロンアミドと反応させて、式(Ⅰ)の化合物を得ること；
を含む方法。

【請求項 10】

1つ又はそれ以上の請求項1～6及び8のいずれか1項に記載の式(Ⅰ)の化合物又は
その塩、並びに製剤助剤を含む、作物保護組成物。

【請求項 11】

1つ又はそれ以上の請求項1～6及び8のいずれか1項に記載の式(Ⅰ)の化合物又は
その塩、並びに1つ又はそれ以上の、メソスルフロン - メチル、テンボトリオン、フェノ
キサプロップ - P - エチル、チエンカルバゾン、チエンカルバゾン - メチル及びイソキサ
フルトールからなる群より選ばれた農業用化学薬剤及び、場合により、製剤助剤を含む、
作物保護組成物。 40

【請求項 12】

1つ又はそれ以上の請求項1～6及び8のいずれか1項に記載の式(Ⅰ)の化合物又は
その塩の有効量を、農業用化学薬剤の前、後又は同時に、植物、植物の一部、植物種子又は
種子に施用することを含む、メソスルフロン - メチル、テンボトリオン、フェノキサプ
ロップ - P - エチル、チエンカルバゾン、チエンカルバゾン - メチル及びイソキサフル
トールからなる群より選ばれた農業用化学薬剤の植物毒性副作用に対する有用植物の保護方
法。 50

【請求項 13】

施用が発芽後処理法による、請求項 12 に記載の方法。

【請求項 14】

式 (I) の化合物又はその塩の施用が植物種子又は種子を処理することによる、請求項 12 に記載の方法。

【請求項 15】

施用が発芽前処理法による、請求項 12 に記載の方法。

【請求項 16】

1 つ又はそれ以上の請求項 1 ~ 6 及び 8 のいずれか 1 項に記載の式 (I) の化合物又はその塩の有効量を、1 つ又はそれ以上の、メソスルフロン - メチル、テンボトリオン、フェノキサプロップ - P - エチル、チエンカルバゾン、チエンカルバゾン - メチル及びイソキサフルトールからなる群より選ばれた除草剤の前、後又は同時に、植物、植物の一部、植物種子又は種子に施用することを含む、有用作物植物中の有害植物の選択的防除方法。

10

【請求項 17】

1 つ又はそれ以上の式 (I) の化合物又はその塩で種子を処理し、播種後発芽前処理法又は発芽後処理法により除草剤を施用することを含む、請求項 16 に記載の方法。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、有用植物保護化合物、及び農業用化学薬剤、特に除草剤の植物毒性作用を低減する薬害軽減剤として特定化合物を含む組成物に関する。本発明は、特に薬害軽減剤としてのピリドン誘導体、及びそれらの製造方法に関する。

20

【背景技術】

【0002】

農薬を用いることによって農業又は林業に有用な栽植作物の不要生物を防除する場合、有用植物もしばしば使用する除草剤によって多かれ少なかれ被害を受ける。この不要な植物毒性作用は、特に、例えば、トウモロコシ、イネ又は穀類などの有用な作物植物への多数の除草剤の使用時に、そしてそこでは、主として発芽後施用時に見られる。場合によっては、有用植物は、有害生物に対して農薬活性を減弱させ又は実質的に損なうことなく、薬害軽減剤又は解毒剤を用いることにより農薬の植物毒性から保護し得る。ある場合には、雑草などの有害生物に対する農薬作用の改善さえも認められた。

30

【0003】

薬害軽減剤としてこれまで知られている化合物は多数の異なる化学構造種に属しており、薬害軽減剤としてのそれらの適合性は、一般的に農薬の化学構造及び有用作物植物によっても決まる。

【0004】

フェノキシ - 又はヘテロアリアルオキシアルカンカルボン酸のグループからの化合物の薬害軽減剤作用は、これらの化合物を除草剤と組み合わせて施用するという条件で長年知られている。そのような化合物の例は MCPA であり、そして有害植物に対して同時に除草活性を示す類似化合物、又はクロキントセット - メキシル (cloquintocet-mexyl) である。

40

【0005】

更に、複素環中に複数のヘテロ原子を有する N - フェニル置換複素芳香族カルボン酸エステルの誘導体のグループからの薬害軽減剤が知られている。そのような薬害軽減剤の例は、市販の製品中に使用されている、薬害軽減剤のメフェンピル - ジエチル及びイソキサジフェン - エチルである。

【0006】

特許文献 1 はヒドロキシル置換芳香族カルボン酸誘導体の使用を開示している。特許文献 2 は、薬害軽減剤としてサリチル酸の特定の誘導体を記載している。これらの化合物は、特にトウモロコシ及びダイズの作物における薬害軽減剤として使用するのに好適である

50

。

【 0 0 0 7 】

更に、特許文献 3 は、薬害軽減剤として 1, 2 - ジヒドロキノキサリン - 2 - オン誘導体を開示している。

【 0 0 0 8 】

農薬特性を有するピリドンの化学的分類からの活性化化合物は、文献から公知である。種々の生物作用が記載されており；従って、例えば、特許文献 4 は、特定の置換ピリドンカルボキサミドの殺菌作用を記載しており、特許文献 5 及び特許文献 6 は、とりわけヘテロ環カルボキサニリドの殺菌作用を記載している。特許文献 7 は、除草剤としてのヒドロキシル基置換ピリドンカルボキサミドの作用を記載している。薬理学的特性を有する典型例も知られている。このように、特許文献 8 は、アポトーススの誘導剤としてニコチンアニリドを記載し、そして特許文献 9 は、血管新生阻害剤としてジアルキルニコチンアミドを記載している。

10

【 0 0 0 9 】

更に、特許文献 10 は、除草活性を有するスルホニル尿素の合成の前駆物質として、6 - トリフルオロメチル置換ピリドンカルボキサミドを記載している。非特許文献 1 及び特許文献 11 は、ピラノピリジン合成の中間体として、1, 2 - ジヒドロ - 2 - オキソ - 6 - トリフルオロメチルピリジン - 3 - カルボキサミド、6 - クロロ(ジフルオロ)メチル - 1, 2 - ジヒドロ - 2 - オキソピリジン - 3 - カルボキサミド及び 6 - ジフルオロメチル - 1, 2 - ジヒドロ - 2 - オキソピリジン - 3 - カルボキサミドについて述べている。特許文献 12 は、薬理活性のあるスピロピペリジンの合成における中間体として、1, 2 - ジヒドロ - 2 - オキソ - 6 - トリフルオロメチルピリジン - 3 - カルボキサミドについて述べている。

20

【 0 0 1 0 】

特定の農薬と組み合わせた薬害軽減剤としてのこのような化合物の使用は、これまで開示されていない。

【 0 0 1 1 】

特許文献 13 は、植物内在性遺伝子の発現増加が誘導の指標と考えられる、病原体に対する植物の防御を誘導する化合物を同定する方法を記載している。

ここでは、1, 2 - ジヒドロ - 2 - オキソ - 6 - トリフルオロメチルピリジン - 3 - カルボキサミドが、薬害軽減剤と見なし得る 6 種の化合物のグループの一部として記載されている。植物の生物試験により確認される薬害軽減剤作用は、この化合物ではこれまで開示されておらず、そしてまた特許文献 13 によっても十分に開示されていない。

30

とりわけ、ある場合に市販の薬害軽減剤のレベルよりもかなり低いレベルで記載されてもいる化合物に対する、特許文献 13 に従って得られる発現値は、たとえそうであったとしても、薬害軽減剤としてそれらがそれほど適切ではないということが最良の場合に期待される程度である。

【 0 0 1 2 】

薬害軽減剤が農薬による被害に対して有用植物を保護するために使用された場合、公知の薬害軽減剤は多くの場合不利な点を有する可能性があることが見出された。これらに含まれることとして：

40

- ・ 薬害軽減剤は、有害植物に対して、農薬の効果、特に除草剤の効果を減弱する；
- ・ 有用植物保護作用は不十分である；
- ・ 特定の除草剤と組み合わせた場合、薬害軽減剤 / 除草剤が使用される有用植物のスペクトルは十分広くない；
- ・ 特定の薬害軽減剤は少数の除草剤との組み合わせに限られる；
- ・ 薬害軽減剤を用いることにより、施用すべき施用量及び製剤量が増加し、そのことで施用時に問題を引き起こす可能性がある。

【 先行技術文献 】

【 特許文献 】

50

【 0 0 1 3 】

【特許文献 1】国際公開公報第 2 0 0 4 / 0 8 4 6 3 1 号

【特許文献 2】国際公開公報第 2 0 0 5 / 0 1 5 9 9 4 号

【特許文献 3】国際公開公報第 2 0 0 5 / 1 1 2 6 3 0 号

【特許文献 4】国際公開公報第 2 0 0 1 / 0 1 4 3 3 9 号

【特許文献 5】国際公開公報第 2 0 0 5 / 0 4 2 4 9 2 号

【特許文献 6】国際公開公報第 2 0 0 5 / 0 4 2 4 9 3 号

【特許文献 7】欧州公開特許第 5 4 4 1 5 1 (A) 号

【特許文献 8】国際公開公報第 2 0 0 1 / 0 5 5 1 1 5 号

【特許文献 9】米国公開特許第 2 0 0 4 / 0 1 1 6 4 7 9 号

10

【特許文献 1 0】欧州公開特許第 5 2 2 3 9 2 (A) 号

【特許文献 1 1】英国特許第 2 3 0 5 1 7 4 号

【特許文献 1 2】国際公開公報第 2 0 0 7 / 0 4 1 0 5 2 号

【特許文献 1 3】国際公開公報第 2 0 0 6 / 0 0 7 9 8 1 号

【非特許文献】

【 0 0 1 4 】

【非特許文献 1】Helv. Chim. Acta 71 (1988) 596-601

【発明の概要】

【発明が解決しようとする課題】

【 0 0 1 5 】

20

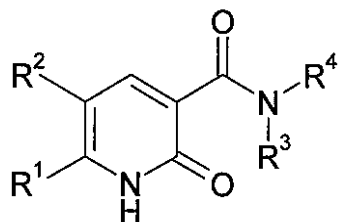
上述の理由により、薬害軽減剤作用を有する代替の化合物を提供する必要がある。

【課題を解決するための手段】

【 0 0 1 6 】

本発明は、式 (I) :

【化 1】



(I)

30

式中、

R¹は、(C₁ - C₆) - ハロアルキル基、好ましくは、式 CF₃、CF₂Cl、CF₂H、CF₂CF₃、CF₂CF₂H、CF₂CF₂Cl、CFClCF₃、CFHCF₃、CF(CF₃)₂、CH(CF₃)₂、CF₂CF₂CF₃又はC(CH₃)₂Fの基であり；

R²は、水素又はハロゲンであり；そして

R³は、水素、(C₁ - C₁₆) - アルキル、(C₂ - C₁₆) - アルケニル又は(C₂ - C₁₆) - アルキニルであり；

ここで、最後に述べた 3 つの基は、それぞれ、無置換、又はハロゲン、ヒドロキシル、シアノ、(C₁ - C₄) - アルコキシ、(C₁ - C₄) - ハロアルコキシ、(C₁ - C₄) - アルキルチオ、(C₁ - C₄) - アルキルアミノ、ジ[(C₁ - C₄) - アルキル] - アミノ、[(C₁ - C₄) - アルコキシ] - カルボニル、[(C₁ - C₄) - ハロアルコキシ] - カルボニル、無置換若しくは置換された(C₃ - C₆) - シクロアルキル、無置換若しくは置換されたフェニル、及び無置換若しくは、置換されたヘテロ環から成るグループから選択された 1 つ又はそれ以上の基で置換され；又は、

40

(C₃ - C₆) - シクロアルキル、(C₄ - C₆) - シクロアルケニル、環の 1 辺において 4 ~ 6 員環の飽和又は不飽和の炭素環に縮合した(C₃ - C₆) - シクロアルキル、又は環の 1 辺において 4 ~ 6 員環の飽和又は不飽和の炭素環に縮合した(C₄ - C₆) - シクロアルケニルであり；

50

ここで、最後に述べた4つの基は、それぞれ、無置換、又はハロゲン、ヒドロキシル、シアノ、 $(C_1 - C_4)$ -アルキル、 $(C_1 - C_4)$ -ハロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ -アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ -ハロアルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ -アルキルチオ、 $(C_1 - C_4)$ -アルキルアミノ、ジ $[(C_1 - C_4)$ -アルキル]-アミノ、 $[(C_1 - C_4)$ -アルコキシ]-カルボニル、 $[(C_1 - C_4)$ -ハロアルコキシ]-カルボニル、無置換若しくは置換された $(C_3 - C_6)$ -シクロアルキル、無置換若しくは置換されたフェニル、及び無置換若しくは置換されたヘテロ環から成るグループから選択された1つ又はそれ以上の基で置換され；そして、

【0017】

R^4 は、 $(C_1 - C_{16})$ -アルキル、 $(C_2 - C_{16})$ -アルケニル又は $(C_2 - C_{16})$ -アルキニルであり；

10

ここで、最後に述べた3つの基は、それぞれ、無置換、又はハロゲン、ヒドロキシル、シアノ、 $(C_1 - C_4)$ -アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ -ハロアルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ -アルキルチオ、 $(C_1 - C_4)$ -アルキルアミノ、ジ $[(C_1 - C_4)$ -アルキル]-アミノ、 $[(C_1 - C_4)$ -アルコキシ]-カルボニル、 $[(C_1 - C_4)$ -ハロアルコキシ]-カルボニル、無置換若しくは置換された $(C_3 - C_6)$ -シクロアルキル、無置換若しくは置換されたフェニル、及び無置換若しくは置換されたヘテロ環から成るグループから選択された1つ又はそれ以上の基で置換され；又は、

$(C_3 - C_6)$ -シクロアルキル、 $(C_4 - C_6)$ -シクロアルケニル、環の1辺において4～6員環の飽和又は不飽和の炭素環に縮合した $(C_3 - C_6)$ -シクロアルキル、又は環の1辺において4～6員環の飽和又は不飽和の炭素環に縮合した $(C_4 - C_6)$ -シクロアルケニルであり；

20

ここで、最後に述べた4つの基は、それぞれ、無置換、又はハロゲン、ヒドロキシル、シアノ、 $(C_1 - C_4)$ -アルキル、 $(C_1 - C_4)$ -ハロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ -アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ -ハロアルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ -アルキルチオ、 $(C_1 - C_4)$ -アルキルアミノ、ジ $[(C_1 - C_4)$ -アルキル]-アミノ、 $[(C_1 - C_4)$ -アルコキシ]-カルボニル、 $[(C_1 - C_4)$ -ハロアルコキシ]-カルボニル、無置換若しくは置換された $(C_3 - C_6)$ -シクロアルキル、無置換若しくは置換されたフェニル、及び無置換若しくは置換されたヘテロ環から成るグループから選択された1つ又はそれ以上の基で置換され；又は、

30

R^3 は、 $(C_1 - C_4)$ -アルコキシ、 $(C_2 - C_4)$ -アルケニルオキシ、 $(C_2 - C_6)$ -アルキニルオキシ又は $(C_2 - C_4)$ -ハロアルコキシであり；そして、

R^4 は、水素又は $(C_1 - C_4)$ -アルキルであり；又は、

R^3 及び R^4 は、直接結合している窒素原子と一緒にになり、4～8員環のヘテロ環となり、この環は、窒素原子に加えて、また、更なるヘテロ原子、好ましくは、N、O及びSから成るグループから選択された2個までの更なるヘテロ環原子を含んでもよく、且つ、無置換、又はハロゲン、シアノ、ニトロ、 $(C_1 - C_4)$ -アルキル、 $(C_1 - C_4)$ -ハロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ -アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ -ハロアルコキシ及び $(C_1 - C_4)$ -アルキルチオから成るグループから選択された1つ又はそれ以上の基で置換され；又は、

R^3 及び R^4 は、直接結合している窒素原子と一緒にになり、基- $N = CR^5 - NR^6R^7$ となり；ここで、

40

R^5 は、水素又は $(C_1 - C_6)$ -アルキルであり、水素であることが好ましく；そして、

R^6 、 R^7 は、互いに独立に、水素又は $(C_1 - C_4)$ -アルキルであり、好ましくは $(C_1 - C_2)$ -アルキルであり；又は、 R^6 及び R^7 は、直接結合している窒素原子と一緒にになり、5～7員環、好ましくは飽和のヘテロ環、例えば、ピペリジニル、ピロリジニル又はモルホリニルを形成し；

又は、

【0018】

R^1 は、 $(C_1 - C_6)$ -ハロアルキル基、好ましくは式 CF_3 、 CF_2Cl 、 CF_2H 、 C

50

F_2CF_3 、 CF_2CF_2H 、 CF_2CF_2Cl 、 $CFClCF_3$ 、 $CFHCF_3$ 、 $CF(CF_3)_2$ 、 $CH(CF_3)_2$ 、 $CF_2CF_2CF_3$ 又は $C(CH_3)_2F$ の基であり、より好ましくは式 CF_3 、 CF_2Cl 、 CF_2H 、 CF_2CF_3 、 CF_2CF_2H 、 CF_2CF_2Cl 、 $CF_2CF_2CF_3$ 又は $C(CH_3)_2F$ であり、特に CF_2Cl 、 CF_2H 、 CF_2CF_3 、 CF_2CF_2H 、 CF_2CF_2Cl 、 $CF_2CF_2CF_3$ 又は $C(CH_3)_2F$ であり、尚より好ましくは CF_2Cl 、 CF_2H 、 CF_2CF_3 、 CF_2CF_2H 、 CF_2CF_2Cl 又は $CF_2CF_2CF_3$ であり；

R^2 は、ハロゲンであり；

R^3 は、水素であり；そして

R^4 は、水素であり；

10

又は、

R^1 は、式 CF_2Cl 、 CF_2H 、 CF_2CF_3 、 CF_2CF_2H 、 CF_2CF_2Cl 、 $CFClCF_3$ 、 $CFHCF_3$ 、 $CF(CF_3)_2$ 、 $CH(CF_3)_2$ 、 $CF_2CF_2CF_3$ 又は $C(CH_3)_2F$ の基であり、より好ましくは式 CF_2Cl 、 CF_2H 、 CF_2CF_3 、 CF_2CF_2H 、 CF_2CF_2Cl 、 $CF_2CF_2CF_3$ 又は $C(CH_3)_2F$ の基であり、尚より好ましくは CF_2Cl 、 CF_2H 、 CF_2CF_3 、 CF_2CF_2H 、 CF_2CF_2Cl 又は $CF_2CF_2CF_3$ であり；

R^2 は、水素であり；

R^3 は、水素であり；そして

R^4 は、水素である；

20

の化合物又はその塩の、有用な植物に対する農業用化学薬剤、好ましくは農薬、特に除草剤の有害作用を低減又は予防するための、有用植物の保護剤としての使用を提供する。

【0019】

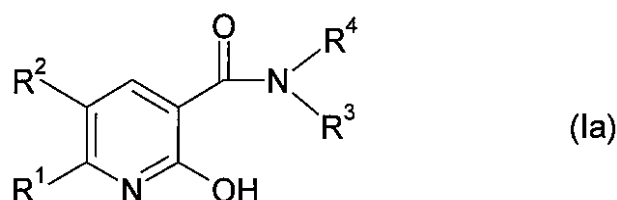
これ以降、式(I)の化合物及びその塩は、ある場合は、本発明に従う又は本発明に従って使用される「化合物(I)」として言及される。

【0020】

式(I)の化合物は、また、水素移動により生成可能で、且つ、その構造が形式的には式(I)に包含されない、互変異性体も含む。しかし、これらの互変異性体は、それでも本発明に従う式(I)の化合物の定義に含まれる。式(I)の化合物の定義は、特に、式(Ia)：

30

【化2】



式中、

R^1 、 R^2 、 R^3 及び R^4 は、式(I)で定義した通りである；

40

の互変異性構造(2-ヒドロキシピリジン-3-カルボキサミド)又はその塩を含む。

【0021】

本発明に従う式(I)のある種の化合物又はそれらの塩は新規であり、そしてまた、本発明の主題の一部を形成する。

【0022】

本発明は、また、式(I)の化合物又はその塩、及び製剤助剤を含む有用植物保護組成物を提供する。本発明は、また、式(I)の化合物又はその塩を、更なる農業用化学薬剤、好ましくは農薬、特に除草剤、及び必要に応じて製剤助剤と組み合わせて含む、有用植物保護組成物を提供する。

【0023】

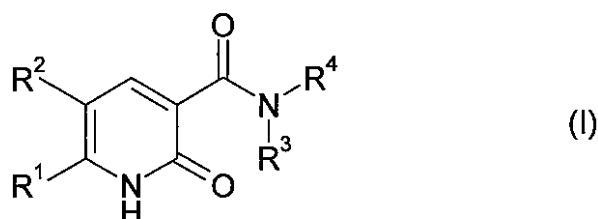
50

式(I)のある種の化合物は、既に、活性化合物を製造するための中間体として記載されており、上記の英国公開特許第2305174(A)号($R^1 = CF_3$ 、 CF_2Cl 又は CF_2H 、及び $R^3 = R^4 = H$ である式(I)の化合物)を参照されたい。既に記載されている欧州公開特許第522392(A)号は、とりわけ、スルホニル尿素を製造するための中間体として、式(I)の化合物を一般的に記載している。本化合物の薬害軽減剤作用は記載されていない。

【0024】

本発明は、また、式(I)：

【化3】



10

式中、

R^1 は、($C_1 - C_6$)-ハロアルキル基、好ましくは式 CF_3 、 CF_2Cl 、 CF_2H 、 CF_2CF_3 、 CF_2CF_2H 、 CF_2CF_2Cl 、 $CFClCF_3$ 、 $CFHCF_3$ 、 $CF(CF_3)_2$ 、 $CH(CF_3)_2$ 、 $CF_2CF_2CF_3$ 又は $C(CH_3)_2F$ の基であり、特に式 CF_3 、 CF_2Cl 、 CF_2H 、 CF_2CF_3 、 CF_2CF_2H 、 CF_2CF_2Cl 、 $CF_2CF_2CF_3$ 又は $C(CH_3)_2F$ の基であり；より好ましくは CF_3 、 CF_2Cl 、 CF_2H 、 CF_2CF_3 、 CF_2CF_2H 、 CF_2CF_2Cl 又は $CF_2CF_2CF_3$ であり；そして

20

R^2 は、水素又はハロゲンであり；そして

R^3 は、水素、($C_1 - C_{16}$)-アルキル、($C_2 - C_{16}$)-アルケニル又は($C_2 - C_{16}$)-アルキニルであり；

ここで、最後に述べた3つの基は、それぞれ、無置換、又はハロゲン、ヒドロキシル、シアノ、($C_1 - C_4$)-アルコキシ、($C_1 - C_4$)-ハロアルコキシ、($C_1 - C_4$)-アルキルチオ、($C_1 - C_4$)-アルキルアミノ、ジ[($C_1 - C_4$)-アルキル] - アミノ、[($C_1 - C_4$)-アルコキシ] - カルボニル及び[($C_1 - C_4$)-ハロアルコキシ] - カ

30

($C_3 - C_6$)-シクロアルキル、($C_4 - C_6$)-シクロアルケニル、環の1辺において4~6員環の飽和又は不飽和の炭素環に縮合した($C_3 - C_6$)-シクロアルキル、又は環の1辺において4~6員環の飽和又は不飽和の炭素環に縮合した($C_4 - C_6$)-シクロアルケニルであり；

ここで、最後に述べた4つの基は、それぞれ、無置換、又はハロゲン、ヒドロキシル、シアノ、($C_1 - C_4$)-アルキル、($C_1 - C_4$)-ハロアルキル、($C_1 - C_4$)-アルコキシ、($C_1 - C_4$)-ハロアルコキシ、($C_1 - C_4$)-アルキルチオ、($C_1 - C_4$)-アルキルアミノ、ジ[($C_1 - C_4$)-アルキル] - アミノ、[($C_1 - C_4$)-アルコキシ] - カルボニル、[($C_1 - C_4$)-ハロアルコキシ] - カルボニル、無置換若しくは置換された($C_3 - C_6$)-シクロアルキル、無置換若しくは置換されたフェニル、及び無置換若しくは置換されたヘテロ環から成るグループから選択された1つ又はそれ以上の基で置換され；そして、

40

【0025】

R^4 は、($C_1 - C_{16}$)-アルキル、($C_2 - C_{16}$)-アルケニル又は($C_2 - C_{16}$)-アルキニルであり；

ここで、最後に述べた3つの基は、それぞれ、無置換、又はハロゲン、ヒドロキシル、シアノ、($C_1 - C_4$)-アルコキシ、($C_1 - C_4$)-ハロアルコキシ、($C_1 - C_4$)-アルキルチオ、($C_1 - C_4$)-アルキルアミノ、ジ[($C_1 - C_4$)-アルキル] - アミノ、[($C_1 - C_4$)-アルコキシ] - カ

50

ルボニルから成るグループから選択された1つ又はそれ以上の基で置換され；又は、

($C_3 - C_6$) - シクロアルキル、($C_4 - C_6$) - シクロアルケニル、環の1辺において4 ~ 6員環の飽和又は不飽和の炭素環に縮合した($C_3 - C_6$) - シクロアルキル、又は環の1辺において4 ~ 6員環の飽和又は不飽和の炭素環に縮合した($C_4 - C_6$) - シクロアルケニルであり；

ここで、最後に述べた4つの基は、それぞれ、無置換、又はハロゲン、ヒドロキシル、シアノ、($C_1 - C_4$) - アルキル、($C_1 - C_4$) - ハロアルキル、($C_1 - C_4$) - アルコキシ、($C_1 - C_4$) - ハロアルコキシ、($C_1 - C_4$) - アルキルチオ、($C_1 - C_4$) - アルキルアミノ、ジ[($C_1 - C_4$) - アルキル] - アミノ、[($C_1 - C_4$) - アルコキシ] - カルボニル、[($C_1 - C_4$) - ハロアルコキシ] - カルボニル、無置換若しくは置換された($C_3 - C_6$) - シクロアルキル、無置換若しくは置換されたフェニル、及び無置換若しくは置換されたヘテロ環から成るグループから選択された1つ又はそれ以上の基で置換され；又は、

R^3 は、($C_1 - C_4$) - アルコキシ、($C_2 - C_4$) - アルケニルオキシ、($C_2 - C_6$) - アルキニルオキシ又は($C_2 - C_4$) - ハロアルコキシであり；そして

R^4 は、水素又は($C_1 - C_4$) - アルキルであり；又は、

R^3 及び R^4 は、直接結合している窒素原子と一緒にになり、4 ~ 8員環のヘテロ環となり、その環は、窒素原子に加えて、また、更なるヘテロ原子、好ましくはN、O及びSから成るグループから選択された2個までの更なるヘテロ原子を含んでもよく、且つ、無置換、又はハロゲン、シアノ、ニトロ、($C_1 - C_4$) - アルキル、($C_1 - C_4$) - ハロアルキル、($C_1 - C_4$) - アルコキシ、($C_1 - C_4$) - ハロアルコキシ及び($C_1 - C_4$) - アルキルチオから成るグループから選択された1つ又はそれ以上の基で置換され；又は

R^3 及び R^4 は、直接結合している窒素原子と一緒にになり、基 - $N = CR^5 - NR^6R^7$ となり、ここで、

R^5 は、水素又は($C_1 - C_6$) - アルキルであり、水素の方が好ましく；そして

R^6 、 R^7 は、互いに独立に、水素又は($C_1 - C_4$) - アルキルであり、好ましくは($C_1 - C_2$) - アルキルであり、又は R^6 及び R^7 は、直接結合している窒素原子と一緒にになり、5 ~ 7員環、好ましくは飽和のヘテロ環、例えば、ピペリジニル、ピロリジニル又はモルホリニルを形成し；

又は、

【0026】

R^1 は($C_1 - C_6$) - ハロアルキル基であり、好ましくは式 CF_3 、 CF_2Cl 、 CF_2H 、 CF_2CF_3 、 CF_2CF_2H 、 CF_2CF_2Cl 、 $CFClCF_3$ 、 $CFHCF_3$ 、 $CF(CF_3)_2$ 、 $CH(CF_3)_2$ 、 $CF_2CF_2CF_3$ 又は $C(CH_3)_2F$ の基であり、より好ましくは CF_3 、 CF_2Cl 、 CF_2H 、 CF_2CF_3 、 CF_2CF_2H 、 CF_2CF_2Cl 、 $CF_2CF_2CF_3$ 又は $C(CH_3)_2F$ であり、特に CF_2Cl 、 CF_2H 、 CF_2CF_3 、 CF_2CF_2H 、 CF_2CF_2Cl 、 $CF_2CF_2CF_3$ 又は $C(CH_3)_2F$ であり、尚より好ましくは CF_2Cl 、 CF_2CF_3 、 CF_2CF_2Cl 又は $CF_2CF_2CF_3$ であり；

R^2 は、ハロゲンであり；

R^3 は、水素であり；そして

R^4 は、水素であり；

又は、

R^1 は、式 CF_2CF_3 、 CF_2CF_2H 、 CF_2CF_2Cl 、 $CFClCF_3$ 、 $CFHCF_3$ 、 $CF(CF_3)_2$ 、 $CH(CF_3)_2$ 、 $CF_2CF_2CF_3$ 又は $C(CH_3)_2F$ の基であり、好ましくは CF_2CF_3 、 CF_2CF_2H 、 CF_2CF_2Cl 、 $CFClCF_3$ 、 $CF_2CF_2CF_3$ 又は $C(CH_3)_2F$ であり、特に CF_2CF_3 、 CF_2CF_2H 、 CF_2CF_2Cl 、 $CFClCF_3$ 又は $CF_2CF_2CF_3$ であり、尚より好ましくは CF_2CF_3 、 CF_2CF_2H 、 CF_2CF_2Cl 又は $CF_2CF_2CF_3$ であり；

R^2 は、水素であり；

R^3 は、水素であり；そして

R^4 は、水素である；
の化合物又はその塩を提供する。

【0027】

好ましくは、式(I)の化合物及びその塩であって、

R^1 が、1～3個のフッ素原子で置換された($C_1 - C_3$) - アルキルであり；

R^2 が、水素であり；

R^3 が、($C_1 - C_2$) - アルキルであり；そして

R^4 が、($C_1 - C_2$) - アルキルである；

化合物は除外される。

【0028】

最後に述べた除外されることが好ましい化合物は、スルホニル尿素を製造するための中間体として、上記の欧州公開特許第0522392(A)号において、一般的な方法で記載されている。

【0029】

置換基の性質及び結合に依存して、式(I)の化合物は、立体異性体として存在することが出来る。エナンチオマー、ジアステレオマー、Z - 、E - 異性体などの特定の空間形態で定義される全ての可能な立体異性体は、式(I)に包含される。

【0030】

例えば、1つ又はそれ以上のアルケニル基が存在する場合、ジアステレオマー(Z - 及びE - 異性体)が生成することが可能である。例えば、1つ又はそれ以上の不斉炭素原子が存在する場合、エナンチオマー及びジアステレオマーが生成することが可能である。立体異性体は、通常の方法、例えば、クロマトグラフィーの分離手順により、製造で得られた混合物から得ることが可能である。また、光学的に活性な出発物質及び/又は助剤を用いて、立体選択的反応を採用することにより、立体異性体を選択的に製造することも可能である。

【0031】

それ故、本発明は、また、式(I)に包含されるがそれらの特定の立体形態では示されていない全ての立体異性体、及びその混合物に関する。

【0032】

式(I)の種々の置換基の組み合わせの可能性は、化学物質合成の一般原理が観察されるように理解すべきであり、即ち、式(I)は、当業者が化学的に不可能であると認識する化合物は包含しない。

【発明を実施するための形態】

【0033】

上記及び更に以下で用いられる用語は、当業者には精通したものであり、そして特に、以下に説明する意味を有する。

【0034】

用語「($C_1 - C_4$) - アルキル」は、炭素原子の記載された範囲に対応して、1～4個の炭素原子を有する開鎖のアルキル基に対する簡略表記法であり、即ち、メチル、エチル、1 - プロピル、2 - プロピル、1 - ブチル、2 - ブチル、2 - メチルプロピル及びtert - ブチル基を含む。同様に、より広い記載された範囲の炭素原子を有する一般のアルキル基、例えば、「($C_1 - C_6$) - アルキル」は、また、より多くの炭素原子を有する直鎖状又は分枝鎖状のアルキル基、即ち、例えば、5個及び6個の炭素原子を有するアルキル基を含む。

【0035】

特に指示のない限り、低級炭素骨格、例えば、1～6個の炭素原子を有する骨格、不飽和基の場合、2～6個の炭素原子を有する骨格は、アルキル、アルケニル及びアルキニル基などの炭化水素基として、その混成基も含めて、好ましいものである。アルキル基は、アルコキシ、ハロアルキルなどの混成基も含めて、例えば、メチル、エチル、n - 又はイソプロピル、n - 、イソ、t - 又は2 - ブチル、ペンチル；n - ヘキシル、イソヘキシル

10

20

30

40

50

及び 1, 3 - ジメチルブチルなどのヘキシル; n - ヘプチル、1 - メチルヘキシル及び 1, 4 - ジメチルペンチルなどのヘプチルであり、アルケニル及びアルキニル基は、アルキル基に対応する可能な不飽和基の意味を有する。アルケニル基は、例えば、ビニル、アリル、1 - メチル - 2 - プロペニル、2 - メチル - 2 - プロペニル、2 - ブテニル、ペンテニル、2 - メチルペンテニル、又はヘキセニルであり、好ましくは、アリル、1 - メチルプロパ - 2 - エン - 1 - イル、2 - メチルプロパ - 2 - エン - 1 - イル、ブタ - 2 - エン - 1 - イル、ブタ - 3 - エン - 1 - イル、1 - メチルブタ - 3 - エン - 1 - イル、又は 1 - メチルブタ - 2 - エン - 1 - イルである。(C₂ - C₆) - アルキニルは、例えば、エチニル、プロパルギル、1 - メチル - 2 - プロピニル、2 - メチル - 2 - プロピニル、2 - ブチニル、2 - ペンチニル又は 2 - ヘキシニルであり、好ましくは、プロパルギル、ブタ - 2 - イン - 1 - イル、ブタ - 3 - イン - 1 - イル又は 1 - メチルブタ - 3 - イン - 1 - イルである。

【0036】

アルキリデンは、例えば、(C₁ - C₁₀) - アルキリデンの形態を含めて、二重結合を経由して結合する直鎖状又は分枝鎖状アルカンの基であり、結合点の位置は固定していない。分枝鎖状アルカンの場合、唯一の可能な位置は、勿論、2つの水素原子が二重結合で代替されてもよい位置であり、基としては、例えば、=CH₂、=CH - CH₃、=C(CH₃) - CH₃、=C(CH₃) - C₂H₅又は=C(C₂H₅) - C₂H₅がある。

【0037】

シクロアルキルは、飽和の炭素環系であり、好ましくは 3 ~ 8 個の炭素原子を有するものであり、例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル又はシクロヘキシルがある。置換されたシクロアルキルは、置換基を有する環系を包含し、シクロアルキル基において二重結合を有する置換基、例えば、メチリデンなどのアルキリデンを含む置換基も、また、含まれる。置換シクロアルキルとしては、また、多環の脂肪族系、例えば、ビスシクロ[1.1.0]ブタン - 1 - イル、ビスシクロ[1.1.0]ブタン - 2 - イル、ビスシクロ[2.1.0]ペンタン - 1 - イル、ビスシクロ[2.1.0]ペンタン - 2 - イル、ビスシクロ[2.1.0]ペンタン - 5 - イル、アダマンタン - 1 - イル及びアダマンタン - 2 - イルを含む。

【0038】

シクロアルケニルは、好ましくは 4 ~ 8 個の炭素原子を有する炭素環の、非芳香族性で、部分的に不飽和の環系であり、例えば、1 - シクロブテニル、2 - シクロブテニル、1 - シクロペンテニル、2 - シクロペンテニル、3 - シクロペンテニル又は 1 - シクロヘキセニル、2 - シクロヘキセニル、3 - シクロヘキセニル、1, 3 - シクロヘキサジエニル又は 1, 4 - シクロヘキサジエニルがある。置換されたシクロアルキルに対する説明は、同様に置換シクロアルケニルにも適用される。

【0039】

用語「ハロゲン」は、例えば、フッ素、塩素、臭素又はヨウ素を意味する。ハロアルキル、ハロアルケニル及びハロアルキニルは、部分的に又は完全に、同一の又は異なるハロゲン原子で、好ましくはフッ素、塩素及び臭素から成るグループからの、特にフッ素及び塩素から成るグループからのハロゲン原子で置換されたアルキル、アルケニル及びアルキニルであり、例えば、CH₂CH₂Cl、CH₂CH₂F、CH₂ClCH₃、CH₂FCH₃、CH₂Cl、CH₂Fなどのモノハロアルキル; CCl₃又はCF₃又はCF₃CF₂などのペルハロアルキル; CHF₂、CH₂F、CH₂FCHCl、CHCl₂、CF₂CF₂H、CH₂CF₃、CH₂ClCH₃、CH₂FCH₃などのポリハロアルキルがあり、ハロアルコキシとしては、例えば、OCF₃、OCHF₂、OCH₂F、CF₃CF₂O、OCH₂CF₃及びOCH₂CH₂Clがあり、このことは、それぞれ対応して、ハロアルケニル、及びその他のハロゲン置換の基にも適用される。

【0040】

骨格が基のリスト (= グループ) 又は一般的に定義される基のグループからの「1つ又はそれ以上の基」で置換される場合、それぞれの場合、複数の同一の及び/又は構造的に

10

20

30

40

50

異なる基によって、同時に置換されることを含む。

【 0 0 4 1 】

置換アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルケニル、フェニル、ベンジル、ヘテロ環及びヘテロアリール基などの置換された基は、例えば、無置換骨格から誘導される置換された基であり、ここで、置換基は、例えば、1つ又はそれ以上の、好ましくは、ハロゲン、アルコキシ、アルキルチオ、ヒドロキシル、アミノ、ニトロ、カルボキシル、シアノ、アジド、アルコキシカルボニル、アルキルカルボニル、ホルミル、カルバモイル、モノ - 及びジアルキルアミノカルボニル、アシルアミノ、モノ - 及びジアルキルアミノなどの置換アミノ、トリアルキルシリル、及び場合により置換されるシクロアルキル、場合により置換されるフェニル、場合により置換されるヘテロ環、ここで、最後に述べた環状基は、それぞれ、ヘテロ原子を経由して結合してもよく、又は既に述べたアルキル基における二価の官能基であってもよい、及びアルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、そして環状基 (= 「環状骨格」) の場合、また、アルキル、ハロアルキル、アルキルチオアルキル、アルコキシアルキル、場合により置換されるモノ - 及びジアルキルアミノアルキル及びヒドロキシアルキルから成るグループからの1、2又は3個の基であり、置換されたアルキルなどの、用語「置換された基」とは、置換基として、既に述べた飽和の炭化水素含有基に加えて、場合により置換されたアルケニル、アルキニル、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、フェニル、フェノキシなどの対応する不飽和の脂肪族及び芳香族基を含み、環に脂肪族部分を有する置換環状基の場合、これは、二重結合を経由して環に結合する置換基、例えば、メチリデン若しくはエチリデン、又はオキソ基、イミノ基若しくは置換イミノ基などのアルキリデン基で置換された置換基を有する環状系を包含する。

【 0 0 4 2 】

例として述べた置換基 (「第一置換基レベル」) は、それが炭化水素部分を含有する場合、必要に応じて、例えば、第一置換基レベルで定義した置換基の1つによって、その部分が更に置換される (「第二置換基レベル」) ことが可能である。対応する更なる置換基レベルも可能である。用語「置換された基」は、好ましくは、第一又は第二の置換基レベルのみを包含する。

【 0 0 4 3 】

それらの置換基レベル用の好ましい置換基としては、例えば、アミノ、ヒドロキシル、ハロゲン、ニトロ、シアノ、メルカプト、カルボキシル、カルボキサミド、 SF_5 、アミノスルホニル、アルキル、シクロアルキル、アルケニル、シクロアルケニル、アルキニル、モノアルキルアミノ、ジアルキルアミノ、N - アルカノイルアミノ、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、シクロアルコキシ、シクロアルケニルオキシ、アルコキシカルボニル、アルケニルオキシカルボニル、アルキニルオキシカルボニル、アリールオキシカルボニル、アルカノイル、アルケニルカルボニル、アルキニルカルボニル、アリールカルボニル、アルキルチオ、シクロアルキルチオ、アルケニルチオ、シクロアルケニルチオ、アルキニルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、モノアルキルアミノスルホニル、ジアルキルアミノスルホニル、N - アルキルアミノカルボニル、N, N - ジアルキル - アミノカルボニル、N - アルカノイルアミノカルボニル、N - アルカノイル - N - アルキルアミノカルボニル、アリール、アリールオキシ、ベンジル、ベンジルオキシ、ベンジルチオ、アリールチオ、アリールアミノ、ベンジルアミノ、ヘテロ環及びトリアルキルシリルがある。

【 0 0 4 4 】

炭素原子を有する基の場合、好ましいものは1 ~ 6個の、好ましくは1 ~ 4個の、特に1 ~ 2個の炭素原子を有する基である。一般的に、ハロゲン、例えば、フッ素及び塩素； $(\text{C}_1 - \text{C}_4)$ - アルキル、好ましくはメチル、エチル； $(\text{C}_1 - \text{C}_4)$ - ハロアルキル、好ましくはトリフルオロメチル； $(\text{C}_1 - \text{C}_4)$ - アルコキシ、好ましくはメトキシ又はエトキシ； $(\text{C}_1 - \text{C}_4)$ - ハロアルコキシ；ニトロ及びシアノから成るグループから選択される置換基が好ましい。ここで、特に好ましい置換基は、メチル、メトキシ、フッ素及び塩

素である。

【 0 0 4 5 】

モノ - 又はジ置換アミノなどの置換アミノは、例えば、アルキル、アルコキシ、アシル及びアリールから成るグループから選択された、1つ又は2つの同一の又は異なる基でN - 置換された置換アミノ基のグループからの基を意味し、好ましくは、モノ - 及びジアルキルアミノ、モノ - 及びジアリールアミノ、アシルアミノ、N - アルキル - N - アリールアミノ、N - アルキル - N - アシルアミノ、及び飽和のN - ヘテロ環であり；ここで、1 ~ 4個の炭素原子を有するアルキル基が好ましく；アリールとしては、好ましくはフェニル又は置換フェニルであり；アシルに対しては、以下の定義が適用されるが、好ましいのは、(C₁ - C₄) - アルカノイルである。このことは、同様に、置換ヒドロキシルアミノ又はヒドラジノにも適用される。

10

【 0 0 4 6 】

置換アミノは、また、窒素原子において4個の有機置換基を有する第四級アンモニウム化合物(塩)を含む。

【 0 0 4 7 】

場合により置換されるフェニルは、好ましくは、無置換、又はモノ若しくは、多置換されたフェニルであり、好ましくは、ハロゲン、(C₁ - C₄) - アルキル、(C₁ - C₄) - アルコキシ、(C₁ - C₄) - ハロアルキル、(C₁ - C₄) - ハロアルコキシ及びニトロからの同一の又は異なる基で三置換までされたフェニルであり、例えば、o - 、m - 及びp - トリル；ジメチルフェニル；2 - 、3 - 及び4 - クロロフェニル；2 - 、3 - 及び4 - フルオロフェニル；2 - 、3 - 、4 - トリフルオロメチル及び - トリクロロメチルフェニル；2, 4 - 、3, 5 - 、2, 5 - 及び2, 3 - ジクロロフェニル；o - 、m - 及びp - メトキシフェニルである。

20

【 0 0 4 8 】

場合により置換されるシクロアルキルとしては、好ましくは、無置換、又はハロゲン、(C₁ - C₄) - アルキル、(C₁ - C₄) - アルコキシ、(C₁ - C₄) - ハロアルキル及び(C₁ - C₄) - ハロアルコキシから成るグループからの同一の又は異なる基で、特に1つ又は2つの(C₁ - C₄) - アルキル基でモノ又は多置換された、好ましくは三置換までされたシクロアルキルである。

【 0 0 4 9 】

場合により置換されるヘテロ環としては、好ましくは、無置換、又はハロゲン、(C₁ - C₄) - アルキル、(C₁ - C₄) - アルコキシ、(C₁ - C₄) - ハロアルキル及び(C₁ - C₄) - ハロアルコキシ、ニトロ及びオキソから成るグループからの同一の又は異なる基によりモノ又は多置換された、好ましくは三置換までされた、特にハロゲン、(C₁ - C₄) - アルキル、(C₁ - C₄) - アルコキシ、(C₁ - C₄) - ハロアルキル及びオキソから成るグループからの基によりモノ又は多置換された、更に特には1つ又は2つの(C₁ - C₄) - アルキル基で置換された、ヘテロ環である。

30

【 0 0 5 0 】

アシルは、形式的には、酸官能基からヒドロキシル基を除去することにより生成する有機酸基を意味する。酸における有機基が、ヘテロ原子を経由して酸官能基に結合することも可能である。アシルの例としては、カルボン酸HO - CO - Rからの - CO - R基、及びそれから誘導される酸基、例えば、チオカルボン酸、無置換又はN - 置換のイミノカルボン酸、又はカルボン酸モノエステルの基、N - 置換カルバミド酸、スルホン酸、スルフィン酸、N - 置換スルホンアミド酸、ホスホン酸、ホスフィン酸を意味する。

40

【 0 0 5 1 】

アシルは、例えば、ホルミル、[(C₁ - C₄) - アルキル]カルボニルなどのアルキルカルボニル、フェニルカルボニル、アルキルオキシカルボニル、フェニルオキシカルボニル、ベンジルオキシカルボニル、アルキルスルホニル、アルキルスルフィニル、N - アルキル - 1 - イミノアルキル、N - アルキル - 及びN, N - ジアルキルカルバモイル、並びにその他の有機酸の基を意味する。ここで、これらの基は、それぞれの場合、更にアルキ

50

ル又はフェニル部分において置換されてもよく、例えば、アルキル部分において、ハロゲン、アルコキシ、フェニル及びフェノキシから成るグループから選択される1つ又はそれ以上の基で置換されてもよく；フェニル部分における置換基の例としては、置換フェニルに対して一般的に上記で既に説明した置換基がある。

【0052】

アシルは、好ましくは、狭い意味でのアシル基、即ち、酸基が直接有機基の炭素原子に結合している有機酸の基を意味し、例えば、ホルミル、アセチルなどのアルカノイル、フェニルカルボニルなどのアロイル、及び飽和又は不飽和有機酸のその他の基である。

【0053】

「アロイル」は、カルボニルを経由して結合する上記で定義したアリール基、例えば、ベンゾイル基を意味する。

10

【0054】

一般基が水素として定義される場合、これは、水素原子を意味する。

【0055】

ある基の「イル - 位 (yl-position)」は、その結合点を意味する。

【0056】

一般的な定義に準拠して：

「 $(C_1 - C_4)$ - アルキル」は、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、1 - ブチル、2 - ブチル、2 - メチルプロピル又はtert - ブチル基であり；

「 $(C_1 - C_{10})$ - アルキル」は、上記で述べたアルキル基、及び、n - ペンチル、1, 1 - ジメチルプロピル又は2 - メチルブチルなどのペンチル異性体、ヘキシル異性体、ヘプチル、オクチル、ノニル又はデシル基を含む。

20

【0057】

従って、「 $(C_2 - C_4)$ - アルケニル」は、例えば、ビニル、アリル、2 - メチル - 2 - プロペン - 1 - イル - 、2 - 又は3 - ブテン - 1 - イル基を意味し；

同様に、「 $(C_3 - C_{10})$ - アルケニル」は、例えば、アリル、2 - メチル - 2 - プロペン - 1 - イル、2 - 又は3 - ブテン - 1 - イル、ペンテニル、2 - メチルペンテニル、ヘキセニル、ヘプテニル、オクテニル、ノネニル又はデセニル基を意味する。

【0058】

「 $(C_2 - C_4)$ - アルキニル」は、例えば、エチニル、プロパルギル又は2 - ブチン - 1 - イル基を意味し；

30

「 $(C_3 - C_{10})$ - アルキニル」は、例えば、プロパルギル、2 - ブチン - 1 - イル、2 - ペンチン - 1 - イル、2 - メチルペンチン - 3 - イル、ヘキシニル、ヘプチニル、オクチニル、ノニル又はデシニル基を意味する。

【0059】

アルキル基の炭素鎖が、1つを超える酸素原子で中断される場合、これは、2つの酸素原子が直接隣接してはならないことを意味する。

【0060】

「 $(C_3 - C_6)$ - シクロアルキル」は、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル又はシクロヘキシル基を意味し；

40

「 $(C_3 - C_{10})$ - シクロアルキル」は、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、シクロオクチル又はシクロデシル基などの単環アルキル基を意味し；また、ノルボルニル又はビスクロ[2.2.2]オクチル基などの二環アルキル基を意味し；又はデカヒドロナフチル基などの縮合環系を意味する。

【0061】

「 $(C_4 - C_{10})$ - シクロアルケニル」は、シクロブテニル、シクロペンテニル、シクロヘキセニル、シクロヘプテニル、シクロオクテニル又はシクロデセニル基などの単環のシクロアルキレン基を意味し；又は、ノルボルネニル又はビスクロ[2.2.2]オクテニル基などの二環のアルキレン基を意味し；又は、テトラ - 、ヘキサ - 又はオクタヒドロナフチル基などの縮合環系を意味する。

50

【 0 0 6 2 】

「 $(C_1 - C_4)$ - アルコキシ」及び「 $(C_1 - C_{10})$ - アルコキシ」は、その炭化水素基が、用語「 $(C_1 - C_4)$ - アルキル」及び「 $(C_1 - C_{10})$ - アルキル」において与えられた意味を有するアルコキシ基を意味する。

【 0 0 6 3 】

特に、作物又は有用な植物のより良好な保護作用（薬害軽減剤作用）、より良好な選択性、及び／又は、より良好な製造性を理由として、記載された式（I）の化合物又はその塩の本発明に従う使用は、個々の基が、既に記載した又は以下に記載する好ましい意味の1つを有し、そして特に、既に記載した又は以下に記載する好ましい意味の1つ又はそれ以上の組合せを含む場合に、特に関心がある。

10

【 0 0 6 4 】

上記の式（I）の一般的定義に包含されるならば、好ましくは、

R^1 は、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルキル基であり、より好ましくは CF_3 、 CF_2Cl 、 CF_2H 、 CF_2CF_3 、 CF_2CF_2H 、 CF_2CF_2Cl 、 $C(CH_3)_2F$ 又は $CF_2CF_2CF_3$ であり、より好ましくは CF_3 、 CF_2Cl 、 CF_2H 、 $CF_2CF_2CF_3$ 又は CF_2CF_3 であり、より好ましくは CF_3 、 CF_2Cl 、 $CF_2CF_2CF_3$ 又は CF_2CF_3 であり、特に CF_3 、 CF_2Cl 又は CF_2CF_3 である。

【 0 0 6 5 】

好ましくは、 R^2 は、水素又はハロゲンである。ここで、ハロゲンは、好ましくはフッ素、塩素、臭素又はヨウ素であり、特に塩素、臭素又はヨウ素であり、更に特別には、塩素又は臭素である。

20

【 0 0 6 6 】

好ましくは、 R^3 は、水素、 $(C_1 - C_{10})$ - アルキル、 $(C_2 - C_{10})$ - アルケニル又は $(C_2 - C_{10})$ - アルキニルであり；

ここで、最後に述べた3個の基は、それぞれ、無置換、又はハロゲン、ヒドロキシル、シアノ、 $(C_1 - C_4)$ - アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ - アルキルチオ、 $(C_1 - C_4)$ - アルキルアミノ、ジ[$(C_1 - C_4)$ - アルキル] - アミノ、[$(C_1 - C_4)$ - アルコキシ] - カルボニル、[$(C_1 - C_4)$ - ハロアルコキシ] - カルボニル、無置換若しくはハロゲン、 $(C_1 - C_4)$ - アルキル及び $(C_1 - C_4)$ - ハロアルキルから選択される1つ又はそれ以上の基で置換され、好ましくは無置換若しくは $(C_1 - C_4)$ - アルキルで置換される $(C_3 - C_6)$ - シクロアルキル、無置換若しくはハロゲン、 $(C_1 - C_4)$ - アルキル、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ - アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルコキシ及び $(C_1 - C_4)$ - アルキルチオから成るグループから選択される1つ又はそれ以上の基で置換されるフェニル、及び無置換若しくはハロゲン、 $(C_1 - C_4)$ - アルキル、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ - アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ - アルキルチオ及びオキソから成るグループから選択される1つ又はそれ以上の基で置換され、好ましくは無置換若しくは $(C_1 - C_4)$ - アルキル、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルキル及び $(C_1 - C_4)$ - アルコキシから成るグループから選択される1つ又はそれ以上の基で置換されるヘテロ環、から成るグループから選択される1つ又はそれ以上の基で置換され；又は、

30

40

$(C_3 - C_6)$ - シクロアルキル、 $(C_4 - C_6)$ - シクロアルケニル、その環の1辺において4～6員環の飽和又不飽和の炭素環に縮合した $(C_3 - C_6)$ - シクロアルキル、又はその環の1辺において4～6員環の飽和又不飽和の炭素環に縮合した $(C_4 - C_6)$ - シクロアルケニルであり；

ここで、最後に述べた4つの基は、それぞれ、無置換、又はハロゲン、ヒドロキシル、シアノ、 $(C_1 - C_4)$ - アルキル、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ - アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ - アルキルチオ、 $(C_1 - C_4)$ - アルキルアミノ、ジ[$(C_1 - C_4)$ - アルキル] - アミノ、[$(C_1 - C_4)$ - アルコキシ] - カルボニル、[$(C_1 - C_4)$ - ハロアルコキシ] - カルボニル、無置換若しくはハロゲン、 $(C_1 - C_4)$ - アルキル及び $(C_1 - C_4)$ - ハロアルキルから成るグループから選択

50

される1つ又はそれ以上の基で置換される ($C_3 - C_6$) - シクロアルキル、無置換若しくはハロゲン、($C_1 - C_4$) - アルキル、($C_1 - C_4$) - ハロアルキル、($C_1 - C_4$) - アルコキシ、($C_1 - C_4$) - ハロアルコキシ及び($C_1 - C_4$) - アルキルチオから成るグループから選択される1つ又はそれ以上の基で置換されるフェニル、及び無置換若しくはハロゲン、($C_1 - C_4$) - アルキル、($C_1 - C_4$) - ハロアルキル、($C_1 - C_4$) - アルコキシ、($C_1 - C_4$) - ハロアルコキシ、($C_1 - C_4$) - アルキルチオ及びオキソから成るグループから選択される1つ又はそれ以上の基で置換され、好ましくは無置換若しくは($C_1 - C_4$) - アルキル($C_1 - C_4$) - ハロアルキル及び($C_1 - C_4$) - アルコキシから成るグループから選択される1つ又はそれ以上の基で置換されるヘテロ環、から成るグループから選択された1つ又はそれ以上の基で置換され；

10

【0067】

より好ましくは、水素、($C_1 - C_6$) - アルキル、($C_2 - C_6$) - アルケニル又は($C_2 - C_6$) - アルキニルであり；

ここで、最後に述べた3つの基は、それぞれ、無置換、又は($C_1 - C_4$) - アルコキシ、($C_1 - C_4$) - ハロアルコキシ、($C_1 - C_4$) - アルキルチオ及び($C_1 - C_4$) - アルコキシカルボニルから成るグループから選択された1つ又はそれ以上の基で置換され；

より好ましくは、水素、($C_1 - C_6$) - アルキル、特に水素であり；そして、

R^4 は、($C_1 - C_{10}$) - アルキル、($C_2 - C_{10}$) - アルケニル又は($C_2 - C_{10}$) - アルキニルであり；

ここで、最後に述べた3つの基は、それぞれ、無置換、又はハロゲン、ヒドロキシル、シアノ、($C_1 - C_4$) - アルコキシ、($C_1 - C_4$) - ハロアルコキシ、($C_1 - C_4$) - アルキルチオ、($C_1 - C_4$) - アルキルアミノ、ジ[($C_1 - C_4$) - アルキル] - アミノ、[($C_1 - C_4$) - アルコキシ] - カルボニル、[($C_1 - C_4$) - ハロアルコキシ] - カルボニル、無置換若しくはハロゲン、($C_1 - C_4$) - アルキル及び($C_1 - C_4$) - ハロアルキルから選択される1つ又はそれ以上の基で置換され、好ましくは無置換若しくは($C_1 - C_4$) - アルキルで置換される($C_3 - C_6$) - シクロアルキル、無置換若しくはハロゲン、($C_1 - C_4$) - アルキル、($C_1 - C_4$) - ハロアルキル、($C_1 - C_4$) - アルコキシ、($C_1 - C_4$) - ハロアルコキシ及び($C_1 - C_4$) - アルキルチオから成るグループから選択される1つ又はそれ以上の基で置換されるフェニル、及び無置換若しくはハロゲン、($C_1 - C_4$) - アルキル、($C_1 - C_4$) - ハロアルキル、($C_1 - C_4$) - アルコキシ、($C_1 - C_4$) - ハロアルコキシ、($C_1 - C_4$) - アルキルチオ及びオキソから成るグループから選択される1つ又はそれ以上の基で置換され、好ましくは無置換若しくは($C_1 - C_4$) - アルキル($C_1 - C_4$) - ハロアルキル及び($C_1 - C_4$) - アルコキシから成るグループから選択される1つ又はそれ以上の基で置換されるヘテロ環、から成るグループから選択される1つ又はそれ以上の基で置換され；又は、

20

30

($C_3 - C_6$) - シクロアルキル、($C_4 - C_6$) - シクロアルケニル、その環の1辺において4～6員環の飽和又不飽和の炭素環に縮合した($C_3 - C_6$) - シクロアルキル、又はその環の1辺において4～6員環の飽和又不飽和の炭素環に縮合した($C_4 - C_6$) - シクロアルケニルであり；

ここで、最後に述べた4つの基は、それぞれ、無置換、又はハロゲン、ヒドロキシル、シアノ、($C_1 - C_4$) - アルキル、($C_1 - C_4$) - ハロアルキル、($C_1 - C_4$) - アルコキシ、($C_1 - C_4$) - ハロアルコキシ、($C_1 - C_4$) - アルキルチオ、($C_1 - C_4$) - アルキルアミノ、ジ[($C_1 - C_4$) - アルキル] - アミノ、[($C_1 - C_4$) - アルコキシ] - カルボニル、[($C_1 - C_4$) - ハロアルコキシ] - カルボニル、無置換若しくはハロゲン、($C_1 - C_4$) - アルキル及び($C_1 - C_4$) - ハロアルキルから成るグループから選択される1つ又はそれ以上の基で置換され、好ましくは無置換若しくは($C_1 - C_4$) - アルキルで置換される($C_3 - C_6$) - シクロアルキル、無置換若しくはハロゲン、($C_1 - C_4$) - アルキル、($C_1 - C_4$) - ハロアルキル、($C_1 - C_4$) - アルコキシ、($C_1 - C_4$) - ハロアルコキシ及び($C_1 - C_4$) - アルキルチオから成るグループから選択される1つ又はそれ以上の基で置換されるフェニル、及び無置換若しくはハロゲン、($C_1 - C_4$) -

40

50

アルキル、(C₁ - C₄) - ハロアルキル、(C₁ - C₄) - アルコキシ、(C₁ - C₄) - ハロアルコキシ、(C₁ - C₄) - アルキルチオ及びオキソから成るグループから選択される1つ又はそれ以上の基で置換され、好ましくは無置換若しくは(C₁ - C₄) - アルキル、(C₁ - C₄) - ハロアルキル及び(C₁ - C₄) - アルコキシから成るグループから選択される1つ又はそれ以上の基で置換されるヘテロ環である。

【0068】

ここで、ヘテロ環は、好ましくは3～9員環のヘテロ環であり、特に、5又は6員環のヘテロ環であって、環は、N、O及びSから成るグループからの1～3個のヘテロ原子を有する。

【0069】

より好ましくは、R³は、水素、(C₁ - C₁₀) - アルキル、(C₂ - C₁₀) - アルケニル又は(C₂ - C₁₀) - アルキニルであり；

ここで、最後に述べた3個の基は、それぞれ、無置換、又はハロゲン、ヒドロキシル、シアノ、(C₁ - C₄) - アルコキシ、(C₁ - C₄) - ハロアルコキシ、(C₁ - C₄) - アルキルチオ、(C₁ - C₄) - アルキルアミノ、ジ[(C₁ - C₄) - アルキル] - アミノ、[(C₁ - C₄) - アルコキシ] - カルボニル、[(C₁ - C₄) - ハロアルコキシ] - カルボニル、無置換若しくはハロゲン、(C₁ - C₄) - アルキル及び(C₁ - C₄) - ハロアルキルから成るグループから選択される1つ又はそれ以上の基で置換され、好ましくは無置換若しくは(C₁ - C₄) - アルキルで置換される(C₃ - C₆) - シクロアルキル、無置換若しくはハロゲン、(C₁ - C₄) - アルキル、(C₁ - C₄) - ハロアルキル、(C₁ - C₄) - アルコキシ、(C₁ - C₄) - ハロアルコキシ及び(C₁ - C₄) - アルキルチオから成るグループから選択される1つ又はそれ以上の基で置換されるフェニル、及び無置換若しくはハロゲン、(C₁ - C₄) - アルキル、(C₁ - C₄) - ハロアルキル、(C₁ - C₄) - アルコキシ、(C₁ - C₄) - ハロアルコキシ、(C₁ - C₄) - アルキルチオ及びオキソから成るグループから選択される1つ又はそれ以上の基で置換されるヘテロ環、から成るグループから選択された1つ又はそれ以上の基で置換され；又は、

(C₃ - C₆) - シクロアルキル、又はその環の一辺において4～6員環の飽和又は不飽和の炭素環に縮合した(C₃ - C₆) - シクロアルキルであり；

ここで、最後に述べた2個の基は、それぞれ、無置換、又は(C₁ - C₄) - アルキルから成るグループから選択された1つ又はそれ以上の基で置換され；

より好ましくは、水素、(C₁ - C₆) - アルキル、(C₂ - C₆) - アルケニル又は(C₂ - C₆) - アルキニルであり；

ここで、最後に述べた3つの基は、それぞれ、無置換、又は(C₁ - C₄) - アルコキシ、(C₁ - C₄) - ハロアルコキシ、(C₁ - C₄) - アルキルチオ及び(C₁ - C₄) - アルコキシカルボニルよりなるグループから選択された基で置換され；

より好ましくは、水素、(C₁ - C₄) - アルキルであり、特に水素であり；そして、

R⁴は、既に上記で定義したR⁴であり、又は好ましくは(C₁ - C₁₀) - アルキル、(C₂ - C₁₀) - アルケニル又は(C₂ - C₁₀) - アルキニルであり；

ここで、最後に述べた3個の基は、それぞれ、無置換、又はハロゲン、ヒドロキシル、シアノ、(C₁ - C₄) - アルコキシ、(C₁ - C₄) - ハロアルコキシ、(C₁ - C₄) - アルキルチオ、(C₁ - C₄) - アルキルアミノ、ジ[(C₁ - C₄) - アルキル] - アミノ、[(C₁ - C₄) - アルコキシ] - カルボニル、[(C₁ - C₄) - ハロアルコキシ] - カルボニル、無置換若しくはハロゲン、(C₁ - C₄) - アルキル及び(C₁ - C₄) - ハロアルキルから選択される1つ又はそれ以上の基で置換され、好ましくは無置換若しくは(C₁ - C₄) - アルキルで置換される(C₃ - C₆) - シクロアルキル、無置換若しくはハロゲン、(C₁ - C₄) - アルキル、(C₁ - C₄) - ハロアルキル、(C₁ - C₄) - アルコキシ、(C₁ - C₄) - ハロアルコキシ及び(C₁ - C₄) - アルキルチオから成るグループから選択される1つ又はそれ以上の基で置換されるフェニル、及び無置換若しくはハロゲン、(C₁ - C₄) - アルキル、(C₁ - C₄) - ハロアルキル、(C₁ - C₄) - アルコキシ、(C₁ - C₄) - ハロアルコキシ、(C₁ - C₄) - アルキルチオ及びオキソから成るグループ

10

20

30

40

50

から選択される1つ又はそれ以上の基で置換されるヘテロ環、から成るグループから選択された1つ又はそれ以上の基で置換され；又は、

($C_3 - C_6$) - シクロアルキル、又はその環の1辺において4～6員環の飽和又不飽和の炭素環に縮合した($C_3 - C_6$) - シクロアルキルであり；

ここで、最後に述べた2つの基は、それぞれ、無置換、又は($C_1 - C_4$) - アルキルから成るグループから選択された1つ又はそれ以上の基で置換される。

【0070】

より好ましくは、 R^3 は、水素、($C_1 - C_{10}$) - アルキル、($C_2 - C_{10}$) - アルケニル、又は($C_2 - C_{10}$) - アルキニルであり；

ここで、最後に述べた3つの基は、それぞれ、無置換、又は($C_1 - C_4$) - アルコキシ、($C_1 - C_4$) - ハロアルコキシ、($C_1 - C_4$) - アルキルチオ及び[($C_1 - C_4$) - アルコキシ] - カルボニルから成るグループから選択された1つ又はそれ以上の基で置換され；

好ましくは、水素、($C_1 - C_6$) - アルキル、($C_2 - C_6$) - アルケニル、又は($C_2 - C_6$) - アルキニルであり；

ここで、最後に述べた3つの基は、それぞれ、無置換、又は($C_1 - C_4$) - アルコキシ、($C_1 - C_4$) - ハロアルコキシ、($C_1 - C_4$) - アルキルチオ及び($C_1 - C_4$) - アルコキシカルボニルから成るグループから選択された1つ又はそれ以上の基で置換され；

より好ましくは、水素又は($C_1 - C_4$) - アルキル、特に水素であり；そして、

R^4 は、既に上記で定義した R^4 であり、又は好ましくは($C_1 - C_{10}$) - アルキル、($C_2 - C_{10}$) - アルケニル又は($C_2 - C_{10}$) - アルキニルであり；

ここで、最後に述べた3つの基は、それぞれ、無置換、又は($C_1 - C_4$) - アルコキシ、($C_1 - C_4$) - ハロアルコキシ、($C_1 - C_4$) - アルキルチオ、及び[($C_1 - C_4$) - アルコキシ] - カルボニルから成るグループから選択された1つ又はそれ以上の基で置換され；

好ましくは、($C_1 - C_6$) - アルキル、($C_2 - C_6$) - アルケニル又は($C_2 - C_6$) - アルキニルであり；

ここで、最後に述べた3つの基は、それぞれ、無置換、又は($C_1 - C_4$) - アルコキシ、($C_1 - C_4$) - ハロアルコキシ、($C_1 - C_4$) - アルキルチオ、及び($C_1 - C_4$) - アルコキシカルボニルから成るグループから選択される1つ又はそれ以上の基で置換される。

【0071】

特に好ましくは、式(I)の化合物又はその塩の本発明に従う使用であって、ここで、 R^1 は、 CF_3 、 CF_2Cl 、 CF_2H 、 $CF_2CF_2CF_3$ 又は CF_2CF_3 であり、好ましくは CF_3 、 CF_2Cl 、 $CF_2CF_2CF_3$ 又は CF_2CF_3 であり、特に CF_3 、 CF_2Cl 又は CF_2CF_3 であり；そして

R^2 は、水素又はハロゲンであり、好ましくは水素であり；そして、

R^3 は、水素、($C_1 - C_{10}$) - アルキル、($C_2 - C_{10}$) - アルケニル、又は($C_2 - C_{10}$) - アルキニルであり；

ここで、最後に述べた3つの基は、それぞれ、無置換、又は($C_1 - C_4$) - アルコキシ、($C_1 - C_4$) - ハロアルコキシ、($C_1 - C_4$) - アルキルチオ及び($C_1 - C_4$) - アルコキシカルボニルから成るグループから選択された1つ又はそれ以上の基で置換され、好ましくは水素、($C_1 - C_6$) - アルキル、($C_2 - C_6$) - アルケニル又は($C_2 - C_6$) - アルキニルで置換され、ここで、最後に述べた3つの基は、それぞれ、無置換、又は($C_1 - C_4$) - アルコキシ、($C_1 - C_4$) - ハロアルコキシ、($C_1 - C_4$) - アルキルチオ及び($C_1 - C_4$) - アルコキシカルボニルから成るグループから選択された1つ又はそれ以上の基で置換され、特に水素又は($C_1 - C_4$) - アルキルで置換され；そして、

R^4 は、($C_1 - C_{10}$) - アルキル、($C_2 - C_{10}$) - アルケニル又は($C_2 - C_{10}$) - アルキニルであり；

ここで、最後に述べた3つの基は、それぞれ、無置換、又はハロゲン、ヒドロキシル、

シアノ、 $(C_1 - C_4)$ - アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ - アルキルチオ、 $(C_1 - C_4)$ - アルキルアミノ、ジ $[(C_1 - C_4)$ - アルキル] - アミノ、 $[(C_1 - C_4)$ - アルコキシ] - カルボニル、 $[(C_1 - C_4)$ - ハロアルコキシ] - カルボニル、無置換若しくはハロゲン、 $(C_1 - C_4)$ - アルキル及び $(C_1 - C_4)$ - ハロアルキルから選択される1つ又はそれ以上の基で置換され、好ましくは無置換若しくは $(C_1 - C_4)$ - アルキルで置換される $(C_3 - C_6)$ - シクロアルキル、無置換若しくはハロゲン、 $(C_1 - C_4)$ - アルキル、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ - アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルコキシ及び $(C_1 - C_4)$ - アルキルチオから成るグループから選択される1つ又はそれ以上の基で置換されるフェニル、及び無置換若しくはハロゲン、 $(C_1 - C_4)$ - アルキル、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ - アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ - アルキルチオ及びオキソから成るグループから選択される1つ又はそれ以上の基で置換されるヘテロ環、から成るグループから選択された1つ又はそれ以上の基で置換され；又は、

10

$(C_3 - C_6)$ - シクロアルキル、又はその環の1辺において4～6員環の飽和又不飽和の炭素環に縮合した $(C_3 - C_6)$ - シクロアルキルであり；

ここで、最後に述べた2つの基は、それぞれ、無置換、又は $(C_1 - C_4)$ - アルキルから成るグループから選択された1つ又はそれ以上の基で置換される；であり；

好ましくは、 $(C_1 - C_{10})$ - アルキル、 $(C_2 - C_{10})$ - アルケニル又は $(C_2 - C_{10})$ - アルキニル；

20

ここで、最後に述べた3つの基は、それぞれ、無置換、又は $(C_1 - C_4)$ - アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ - アルキルチオ及び $(C_1 - C_4)$ - アルコキシカルボニルから成るグループから選択された1つ又はそれ以上の基で置換され；

より好ましくは、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル、 $(C_2 - C_6)$ - アルケニル又は $(C_2 - C_6)$ - アルキニルであり；

ここで、最後に述べた3つの基は、それぞれ、無置換、又は $(C_1 - C_4)$ - アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ - アルキルチオ及び $(C_1 - C_4)$ - アルコキシカルボニルから成るグループから選択された1つ又はそれ以上の基で置換され；又は、

R^3 及び R^4 は、直接結合している窒素原子と一緒に、4～6員環のヘテロ環を、好ましくは5又は6員環のヘテロ環を形成し、ここで、その環は、窒素原子に加えて、また、更なるヘテロ環原子を含んでもよく、好ましくは、N、O及びSから成るグループからの2つまでのヘテロ原子を含んでもよく、且つ、無置換、又はハロゲン、シアノ、ニトロ、 $(C_1 - C_4)$ - アルキル、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ - アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルコキシ及び $(C_1 - C_4)$ - アルキルチオから成るグループから選択された1つ又はそれ以上の基で置換され；又は、

30

R^3 及び R^4 は、直接結合している窒素原子と一緒に、基 - $N = CR^5 - NR^6R^7$ を形成し；ここで、

R^5 は、水素又は $(C_1 - C_4)$ - アルキルであり、水素が好ましく、そして、

R^6 、 R^7 は、互いに独立に、水素又は $(C_1 - C_4)$ - アルキル、好ましくは、 $(C_1 - C_2)$ - アルキルであり、又は R^6 及び R^7 は直接結合している窒素原子と一緒に、5又は6員環を、好ましくは、例えば、ピペリジニル、ピロリジニル又はモルホリニルなどの飽和のヘテロ環を形成する；

40

化合物の使用である。

【0072】

特に好ましくは、また、式(I)の化合物又はその塩の本発明に従う使用であって、ここで、

R^1 は、 $(C_1 - C_6)$ - ハロアルキル基、好ましくは CF_3 、 CF_2Cl 、 CF_2H 、 CF_2CF_3 、 CF_2CF_2H 、 CF_2CF_2Cl 、 $CF_2CF_2CF_3$ 及び $C(CH_3)_2F$ であり、より好ましくは CF_3 、 CF_2Cl 、 CF_2H 、 $CF_2CF_2CF_3$ 又は CF_2CF_3 であり、尚

50

より好ましくは CF_3 、 CF_2Cl 、 $\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$ 又は CF_2CF_3 であり、特に CF_3 、 CF_2CF_3 又は CF_2Cl であり；そして、

R^2 は、ハロゲンであり；

R^3 は、水素であり；そして

R^4 は、水素である；

化合物の使用である。

【0073】

同様に、特に好ましくは、また、式 (I) の化合物又はその塩の本発明に従う使用であって、ここで、

R^1 は、 CF_2Cl 、 CF_2H 、 CF_2CF_3 、 $\text{CF}_2\text{CF}_2\text{H}$ 又は $\text{CF}_2\text{CF}_2\text{Cl}$ であり、
好ましくは CF_2Cl 又は CF_2H 又は CF_2CF_3 、より好ましくは CF_2Cl 又は CF_2CF_3 であり、特に CF_2Cl であり；

R^2 は水素であり；

R^3 は水素又は $(\text{C}_1 - \text{C}_4)$ - アルキルであり；そして

R^4 は水素である；

化合物の使用である。

【0074】

特に好ましくは、また、式 (I) の化合物又はその塩の本発明に従う使用であって、ここで、 R^1 、 R^2 、 R^3 及び R^4 で述べた基に対応する一般の基は、それぞれ、表に示された実施例に対応し、又はそれらを包含する。

【0075】

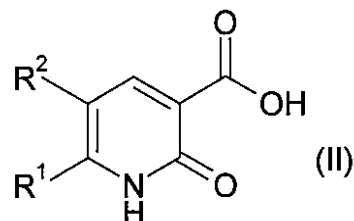
特に好ましくは、また、式 (I) の新規化合物又はその塩の本発明に従う使用であって、ここで、更に、 R^1 、 R^2 、 R^3 及び R^4 は、好ましくは、好ましい使用に対して述べた意味を有する。

【0076】

一般式 (I) の化合物は、例えば、

(a) 一般式 (II)：

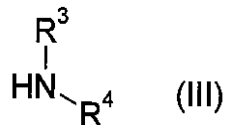
【化4】



式中、

R^1 及び R^2 は、製造すべき式 (I) の化合物に対して定義した通りである；
のカルボン酸を、式 (III)：

【化5】



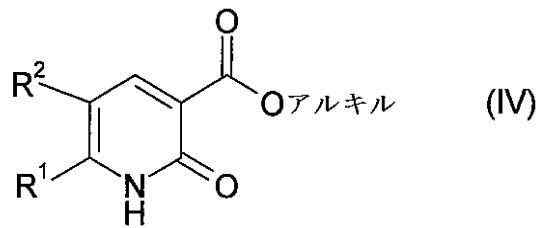
式中、

R^3 及び R^4 は、製造すべき式 (I) の化合物に対して定義した通りである；
のアミン又はその塩と、必要に応じて、カルボン酸活性化剤、例えば、N, N - カルボニルジイミダゾール (CDI)、又は脱水剤、例えば、ジシクロヘキシルカルボジイミド (DCC) の存在下で反応させて、式 (I) の化合物を得る；又は、

【0077】

(b) 一般式 (IV) :

【化 6】



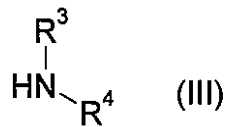
10

式中、

R^1 及び R^2 は、製造すべき式 (I) の化合物に対して定義した通りであり；そして、
「アルキル」は、アルキル基、例えば、メチル又はエチルである；

のカルボン酸エステルを、式 (III) :

【化 7】



20

式中、

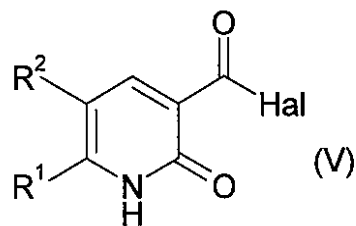
R^3 及び R^4 は、製造すべき式 (I) の化合物に対して定義した通りである；

のアミン又はその塩と反応させて、式 (I) の化合物を得る；又は、

【0078】

(c) 一般式 (V) :

【化 8】



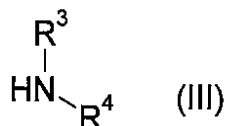
30

式中、

R^1 及び R^2 は、製造すべき式 (I) の化合物に対して定義した通りであり；そして、

Hal は、ハロゲン原子、例えば、塩素であり、又はアシルオキシ基である；のカルボ
ニルハライド又はカルボン酸無水物を、式 (III) :

【化 9】



40

式中、

R^3 及び R^4 は、製造すべき式 (I) の化合物に対して定義した通りである；

のアミン又はその塩と反応させて、式 (I) の化合物を得る；

【0079】

(d) 製造すべき式 (I) の化合物における R^3 及び R^4 が、それぞれ水素である場合は
、式 (VI) :

【化 10】



式中、

R^1 は製造すべき式(Ⅰ)の化合物に対して定義した通りであり；そして、「アルキル」は、アルキル基、例えば、メチル又はエチルである；
 の化合物を、マロンアミドと反応させて、式(Ⅰ)の化合物を得る；
 ことにより製造することができる。

10

【0080】

変法(a)に基づくアミド生成は、例えば、不活性有機溶媒中で、0～150の温度範囲で、好ましくは0～50の間で行うことが出来る。好適な有機溶媒としては、例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン及びジオキサンなどのエーテル類、アセトニトリルなどのニトリル類、ジメチルホルムアミドなどのアミド類など極性のプロトン性、非プロトン性の溶媒がある。

【0081】

変法(b)に基づくアミドの生成は、例えば、不活性の有機溶媒中、0～150の温度範囲で、好ましくは50～100の温度範囲で行うことが出来る。好適な有機溶媒としては、例えば、テトラヒドロフラン及びジオキサンなどのエーテル類、アセトニトリルなどのニトリル類、又はジメチルホルムアミドなどのアミド類など、極性のプロトン性、非プロトン性の溶媒がある。しかし、変法(b)に基づくアミドの生成では、昇温下、不希釈の反応試薬を反応させる方法が好ましい。

20

【0082】

変法(c)に基づくアミドの生成は、例えば、酸結合剤の存在下で、不活性の有機溶媒中、0～150の温度範囲で、好ましくは50～100の温度範囲で行うことが出来る。好適な有機溶媒としては、例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン及びジオキサンなどのエーテル類、又はアセトニトリルなどのニトリル類、又はジメチルホルムアミドなどのアミド類など極性のプロトン性、非プロトン性の溶媒がある。酸結合剤としては、例えば、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム又は炭酸カルシウムなどのアルカリ金属、又はアルカリ土類金属の炭酸塩；水酸化ナトリウム、水酸化カリウム又は水酸化カルシウムなどのアルカリ金属、又はアルカリ土類金属の水酸化物；又は水素化ナトリウム、水素化カリウム又はナトリウムアミド若しくはカリウムアミドなどのアルカリ金属又はアルカリ土類金属の水素化物又はアミド類、又はトリエチルアミン、ピリジン、ジメチルアミノピリジン、DBU(1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]-ウンデカ-7-エン)、DBN(1,5-ジアザビシクロ[4.3.0]ノナ-5-エン)及び1,4-ジアザビシクロ[2.2.2]オクタンなどのその他の有機塩基がある。変法(d)に基づくアミドの生成は、欧州特許第522392号、及びHelv. Chim. Acta 71 (1988) 596-601及び英国特許第2305174号に記載された方法と類似の方法で実施可能である。一般的に、マロンアミドは、有機の無水極性又は非極性溶媒中で、例えば、アルコール中で、アルカリ金属、アルカリ金属水素化物又はアルカリ金属アルコキシドなどの強塩基を用いて反応性の塩に転換し、その後、式(VI)の化合物と反応することが可能である。式(VI)の化合物は、一般的には、0から溶媒の沸点(溶媒に依存して約150まで)の温度範囲で行うことが出来る。

30

40

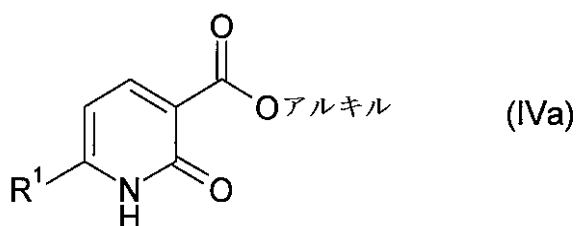
【0083】

一般式(ⅠⅠ)、(ⅠⅠⅠ)、(ⅠⅤ)及び(Ⅴ)の化合物は市販されているか、又は当業者に公知の方法と類似の方法(例えば、Helv. Chim. Acta 71 (1988) 596；欧州特許第502740号；欧州特許第522392号)によって製造可能である。

【0084】

50

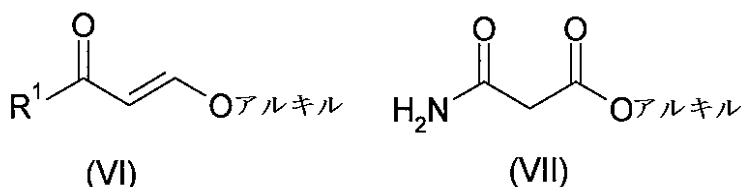
従って、例えば、式 (IVa) :
【化 1 1】



10

の化合物は、式 (VI) のアルコキシビニルエーテルを、式 (VII) のアルキルマロンアミドと反応させることにより得られる。

【化 1 2】



20

【0085】

式 (VI) の出発物質は市販されているか、又は公知の方法 (例えば、Synthesis 2000, 738-742; J. Fluor. Chem., 107, 2001, 285-300; Organometallics 15, 1996, 5374-5379) で製造可能である。

【0086】

R^2 がハロゲン原子である式 (IV) の化合物は、式 (IVa) の化合物から通常のハロゲン化で製造可能である。ピリジンのハロゲン化剤として用いるのに好適なものは、例えば、塩素 (J. Org. Chem. 23, 1958, 1614); 臭素 (Synth. Commun. 19, 1989, 553-560; 米国特許第 2 5 3 2 0 5 5 号); ヨウ素 (Tetrahedron Lett. 45, 2004, 6633-6636); 次亜塩素酸ナトリウム (J. Org. Chem. 49, 1984, 4784-4786; J. Med. Chem. 36, 1993, 2676-2688; 米国特許第 4 9 6 0 8 9 6 号); 次亜臭素酸ナトリウム (J. Med. Chem. 32, 1989, 2178-2199); チオニルクロリド (Organic Letters, 6, 2004, 3-5); N-クロロスクシンイミド (J. Med. Chem. 46, 2003, 702-715); N-ブロモスクシンイミド (Chem. Pharm. Bull. 48, 2000, 1847-1853); N-ヨードスクシンイミド (J. Med. Chem. 36, 1993, 2676-2788) である。更に、式 (IV) の化合物は、式 (IVa) の化合物から、連続ニトロ化 (例えば: J. Med. Chem. 36, 1993, 2676-2688; J. Heterocycl. Chem. 33, 1996, 287-294); 還元 (例えば: J. Med. Chem. 33, 1990, 1859-1865)、Sandmeyer 又は Schiemann 反応における、ジアゾ化とそれに続くジアゾニウム塩の反応で製造可能である。

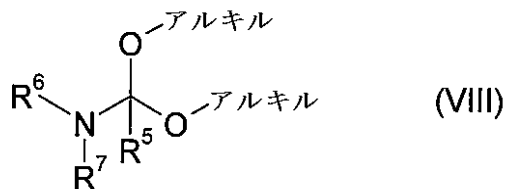
30

【0087】

R^3 及び R^4 が直接結合する窒素原子と一緒にあって、基 - $N = CR^5 - NR^6R^7$ となる式 (I) の化合物は、 R^3 及び R^4 が水素である式 (I) の化合物を、 R^5 、 R^6 及び R^7 が上記で定義された通りである式 (VIIII) :

40

【化 1 3】



の化合物と、公知の方法（例えば、Synthesis 1980, 119-121; J. Med. Chem., 33, 1990, 2052-2059を参照）に従って反応させることにより製造可能である。

10

【0088】

本発明は、また、農薬又は、特に作物植物又は有用植物に被害を引き起こす除草剤などの、農業用化学薬剤の植物毒性作用から作物植物又は有用植物を保護する方法を提供するが、本方法は、好ましくは植物、植物の一部又はそれらの種子(又は種)に、有効量の式(I)の化合物又はその塩を施用することにより、薬害軽減剤として式(I)の化合物又はその塩を用いることを含む。

【0089】

化合物(I) (= 薬害軽減剤) は、活性化合物(農薬)と併せて、多くの作物植物、例えば、か穀類(コムギ、オオムギ、ライコムギ、ライムギ、イネ、トウモロコシ、キビ)、サトウダイコン、サトウキビ、アブラナ、ワタ、ヒマワリ、エンドウ、豆類及びダイズなど、経済的に重要な作物中の有害生物の選択的防除における使用に好適である。トウモロコシ及びイネを含むか穀類(コムギ、オオムギ、ライムギ、ライコムギ、ソルガム)などの単子葉作物、及び単子葉野菜作物、並びに例えば、ダイズ、アブラナ、ワタ、ブドウ、野菜植物、果実植物及び観賞植物などの双子葉作物が特に興味を持たれる。薬害軽減剤(I)と除草剤/薬害軽減剤との組み合わせも、また、例えば、有用及び観賞芝、特にライグラス、牧草又はギョウギシバの生えた芝区画など、有用植物及び観賞植物の苗床及び区画において有害植物を防除するのに好適である。

20

【0090】

薬害軽減剤(I)と除草剤/薬害軽減剤との組み合わせが使用され得る有用植物及び作物植物の中から、特定の農薬に完全又は部分的に耐性の変種作物、又は完全又は部分的に耐性の遺伝子組換え作物、例えば、グルホシナート若しくはグリホサートに耐性のトウモロコシ作物、又は除草活性イミダゾリノンに耐性のダイズ作物もまた興味を持たれる。しかしながら、この新規な方法で使用される薬害軽減剤の特別な利点は、施用される除草剤への耐性が通常不十分な作物に効率的に作用することである。

30

【0091】

農薬との併用使用では、本発明の式(I)の化合物は、活性化合物と同時に又は任意の順序で施用することができ、そしてその結果、不要有害生物に対するこれらの活性化合物の活性に悪影響を及ぼし又は実質的に活性を低下させることなく、作物植物中のこれら活性化合物の有害副作用を低減又は完全になくすることができる。ここでは、複数の農薬、例えば、複数の除草剤又は殺虫剤若しくは防カビ剤と組み合わせた除草剤を用いることによって引き起こされる被害も、実質的に低減し又は完全になくすることができる。このように、従来の農薬の使用領域を拡大することが可能である。

40

【0092】

本発明の組成物が農薬を含む場合、これらの組成物は、適切な希釈後に耕作中の区域に、既に出芽している有害及び/又は有用植物に、又は既に発芽している有害及び/又は有用植物のいずれかに直接施用される。本発明の組成物がいずれの農薬も含まない場合、これらの組成物はタンクミックス法によって使用することができる - 即ち、使用者は、処理すべき区域へ施用する直前に、又は農薬の施用に先立って、又は農薬の施用後、又は種子の前処理のために、即ち、例えば、有用植物の種子粉衣のために、別々に入手可能な製品 (= 農薬及び有用植物を保護する薬剤) を混合し希釈する。好ましくは、薬害軽減剤及び

50

農薬は、特に薬害軽減剤が除草剤の後に植物に施用される場合、互いに短時間内に施用される。

【0093】

本発明の化合物(I)の有利な作用は、発芽前処理法又は発芽後処理法により農薬と併せて使用する場合、例えば、タンクミックス若しくは共製剤として同時施用の場合に、又は並行又は連続(分割施用)での個別施用の場合に認められる。多数回施用を反復することも可能である。ある場合には、発芽前施用と発芽後施用を組み合わせることも好都合である。ほとんどの場合、1つの選択肢は、有用植物又は作物植物に対して、農薬の同時又は後期施用と併せた発芽後施用である。種子粉衣、苗(例えばイネ)の(浸漬)処理又は他の繁殖体(例えば、ジャガイモ根茎)の処理のために、本発明の化合物(I)を使用する

10

【0094】

本発明の化合物(I)を除草剤と組み合わせて使用する場合、薬害軽減剤作用に加えて、有害植物に対する除草作用における作用増強もしばしば認められる。更に、多くの場合、有用植物又は作物植物の成長向上が見られ、そして収量の増加も可能である。

【0095】

本発明の組成物は、1つ又はそれ以上の農薬を含むことができる。好適な農薬は、単独で使用する場合に、作物植物に植物毒性被害を引き起こす可能性のある又は被害を引き起こす可能性の高い、例えば、除草剤、殺虫剤、防カビ剤、殺ダニ剤及び殺線虫剤である。除草剤、殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤及び防カビ剤、とりわけ除草剤のグループからの、

20

【0096】

薬害軽減剤対農薬の重量比は、広い限度内で変動することができ、そして一般的には1:100~100:1、好ましくは1:20~20:1、特に1:10~10:1の範囲である。薬害軽減剤対農薬の最適重量比は、使用する個々の薬害軽減剤及び個々の農薬、及び保護すべき有用植物又は作物植物のタイプの両方によって決まる。薬害軽減剤の所要施用量は、使用農薬及び有用植物のタイプに応じて、広い限度内で変動することができ、そして一般的に1ヘクタール当り0.001~10kg、好ましくは0.01~1kg、特に0.05~0.5kgの薬害軽減剤の範囲である。成功裏の処理に要する重量比及び量は、簡単な予備実験によって決定することができる。

30

【0097】

種子粉衣では、例えば、種子1kg当り0.005~20gの薬害軽減剤、好ましくは種子1kg当り0.01~10gの薬害軽減剤、特に種子1kg当り0.05~5gの薬害軽減剤が使用される。

【0098】

液剤の薬害軽減剤を種子処理に使用し、そして種子又は苗が液剤で湿潤している場合、好適な濃度は、重量ベースで、一般的に1~10,000ppm、好ましくは100~1,000ppmである。成功裏の処理に要する重量比及び量は、簡単な予備実験によって決定することができる。

【0099】

薬害軽減剤は、常法により、別々に又は農薬と併せて製剤化し得る。従って、本発明は、また、有用な植物保護又は作物植物保護組成物を提供する。

40

【0100】

薬害軽減剤及び農薬の共同施用、特にレディミックスとしての又はタンクミックス法による使用の薬害軽減剤及び除草剤の共同施用が好ましい。

【0101】

種子の処理に薬害軽減剤(I)を使用し、続いて発芽前又は発芽後処理法により播種後に農薬、好ましくは除草剤を施用することも好ましい。

【0102】

式(I)の化合物又はその塩は、そのまま又はそれらの調合剤(製剤)の形態で、例

50

例えば、殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、除草剤、防カビ剤、薬害軽減剤、肥料及び/又は成長調節剤などの他の農薬活性化合物との組み合わせで、例えば、最終製剤として又はタンクミックスとして使用することができる。この場合、組み合わせ製剤は、組み合わせるべき活性化合物の物理的性質及び安定性を考慮して上述の処方に基づいて製造することが出来る。混合物の製剤又はタンクミックスにおいて、本発明の活性化合物の組み合わせ相手として好適なものは、例えば、公知の、好ましくは、その作用が、例えば、アセト乳酸シンターゼ、アセチルコエンザイムAカルボキシラーゼ、P S I、P S I I、H P P D O、フィトエンデサチュラーゼ、プロトポルフィリノーゲンオキシダーゼ、グルタミンシンターゼ、セルロース生合成、5 - エノールピルビルシキミ酸3 - リン酸シンターゼの阻害に基づく除草活性化合物である。そのような化合物、及び、また、場合によっては未知の又は異なる作用機序を有する使用し得る他の化合物も、例えば、Weed Research 26, 441 445 (1986)に、又は「農薬マニュアル」(“The Pesticide Manual”), 12th edition 2000に、又は13th edition 2003 又は 14th edition 2006/2007に、又は対応の「e - 農薬マニュアル」(“e-Pesticide Manual”), version 4 (2006)に、いずれもBritish Crop Protection Councilの出版(以後略して「PM」ともいう)、そして又そこに引用されている文献に記載されている。「一般名」(“common names”)のリストも、インターネット上の「農薬一般名一覧」(“The Compendium of Pesticide Common Names”)で利用可能である。式(I)の化合物と組み合わせ得る文献から公知の除草剤の例は、例えば、以下の活性化合物(注記: 化合物は、国際標準化機構(I S O)による「一般名」(“common names”)によるか又は化学名により記載され、適切な場合は慣用コード番号と併記)である:

【0103】

アセトクロル; アシベンゾラル - S - メチル; アシフルオルフェン(-ナトリウム); アクロニフェン; A D - 6 7; A K H 7 0 8 8、即ち、[[[1 - [5 - [2 - クロロ - 4 - (トリフルオロメチル)フェノキシ] - 2 - ニトロフェニル] - 2 - メトキシエチリデン]アミノ]オキシ]酢酸及び[[[1 - [5 - [2 - クロロ - 4 - (トリフルオロメチル)フェノキシ] - 2 - ニトロフェニル] - 2 - メトキシエチリデン]アミノ]オキシ]酢酸メチル; アラクロル; アロキシジム(-ナトリウム); アメトリン; アミカルバゾン、アミドクロル、アミドスルフロン; アミノピラリド; アミトロール; A M S、即ち、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; アビグリシン; アザフェニジン、アジムスルフロン(D P X - A 8 9 4 7); アジプロトリン; バルバン; B A S 5 1 6 H、即ち、5 - フルオロ - 2 - フェニル - 4 H - 3, 1 - ベンゾオキサジン - 4 - オン; ベフルブタミド; (U B H - 5 0 9)、ベナゾリン(-エチル); ベンカルバゾン; ベンフルラリン; ベンフレサート; ベノキサコル; ベンスルフロン(-メチル); ベンスリド; ベンタゾン; ベンズフェンジゾン; ベンゾビシクロン、ベンゾフェナブ; ベンゾフルオル; ベンゾイルフロップ(-エチル); ベンズチアズロン; ピアラホス; ピフェノックス; ビスピリバク(-ナトリウム)(K I H - 2 0 2 3); ボラックス; プロマシル; プロモブチド; プロモフェノキシム; プロモキシニル; プロムロン; プミナホス; ブソキシノン(busoxinone); ブタクロル; ブタフェナシル、ブタミホス; プテナクロル(K H - 2 1 8); プチアゾール; プトラリン; プトロキシジム; プチレート; カフェンストロール(C H - 9 0 0); カルベタミド; カルフェントラゾン(-エチル); C D A A、即ち、2 - クロロ - N, N - ジ - 2 - プロペニルアセトアミド; C D E C、即ち、2 - クロロアリルジエチルジチオカルバメート; クロメトキシフェン; クロランベン; クロラジホップ - ブチル、クロルプロムロン; クロルブファム; クロルフェナク; クロルフェンプロップ; クロルフルレコール(-メチル); クロルフルレノール(-メチル); クロリダゾン; クロリムロン(-エチル); クロルメクアット(塩化物); クロルニトロフェン; クロロフタリム(M K - 6 1 6); クロロトルロン; クロロクスロン; クロロプロファム; クロルスルフロン; クロルタル - ジメチル; クロルチアミド; クロルトルロン、シニドン(-メチル及び - エチル)、シンメチリン; シノスルフロン; クレホキシジム; クレトジム; クロジナホップ及びそのエステル誘導体(例えば、クロジナホップ - プロパルギル); ク

10

20

30

40

50

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；クロプロキシジム；クロ
 ピラリド；クロピラスルフロン（ - メチル）、クロキントセット（cloquintocet）（ - メ
 キシル）；クロランスラム（ - メチル）、クミルロン（ J C 9 4 0 ）；シアナミド；シア
 ナジン；シクロアート；シクロスルファミロン（ A C 1 0 4 ）；シクロキシジム；シクル
 ロン；シハロホップ及びそのエステル誘導体（例えば、ブチルエステル、 D E H - 1 1 2
 ）；シペルコート；シプラジン；シプラゾール；シプロスルファミド；ダイムロン； 2 ,
 4 - D、 2 , 4 - D B；ダラボン；ダミノジド；ダゾメット； n - デカノール；デスメジ
 ファム；デスメトリン；ジアラート；ジカンバ；ジクロベニル；ジクロルミド；ジクロル
 プロップ（ - P ）塩；ジクロホップ及びジクロホップ - メチルなどのそのエステル、ジク
 ロホップ - P（ - メチル）；ジクロスラム、ジエタチル（ - エチル）；ジフェノクスロン
 ；ジフェンゾクアット（メチルスルファート）；ジフルフェニカン；ジフルフェンゾピル
 （ - ナトリウム）；ジメフロン；ジメピペラート、ジメタクロル；ジメタメトリン；ジメ
 タゾン；ジメテナミド（ S A N - 5 8 2 H ）；ジメテナミド - P；ジメチルアルシン酸；
 ジメチピン；ジメトラスルフロン、ジニトラミン；ジノセブ；ジノテルブ；ジフェナミド
 ；ジプロペトリン；ジクアット塩；ジチオピル；ジウロン； D N O C；エグリナジン - エ
 チル； E L 7 7、即ち、 5 - シアノ - 1 - （ 1 , 1 - ジメチルエチル） - N - メチル - 1
 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド；エンドタール；エボプロダン、 E P T C；エスプ
 ロカルブ；エタルフルラリン；エタメトスルフロン - メチル；エテホン；エチジムロン；
 エチオジン；エトフメサート；エトキシフェン及びそのエステル（例えば、エチルエステ
 ル、 H N - 2 5 2 ）；エトキシスルフロン、エトベンザニド（ H W 5 2 ）； F 5 2 3 1、
 即ち、 N - [2 - クロロ - 4 - フルオロ - 5 - [4 - （ 3 - フルオロプロピル） - 4 , 5 -
 ジヒドロ - 5 - オキソ - 1 H - テトラゾール - 1 - イル]フェニル] - エタンスルホンア
 ミド；フェンクロラゾール（ - エチル）；フェンクロリム；フェノプロップ；フェノキサ
 ン、フェノキサプロップ及びフェノキサプロップ - P 及び、また、それらのエステル、例
 えば、フェノキサプロップ - P - エチル及びフェノキサプロップ - エチル；フェノキシジ
 ム；フェントラザミド、フェヌロン；硫酸第一鉄；フラムプロップ（ - メチル又は - イソ
 プロピル又は - イソプロピル - L ）；フラムプロップ - M（ - メチル又は - イソプロピル
 ）；フラザスルフロン；フロラスラム、フルアジホップ及びフルアジホップ - P 及びそれ
 らのエステル、例えば、フルアジホップ - ブチル及びフルアジホップ - P - ブチル；フル
 アゾレート、フルカルバゾン（ - ナトリウム）、フルセトスルフロン；フルクロラリン；
 フルフェナセット；フルフェンピル（ - エチル）；フルメトラリン；フルメトスラム；フル
 メツロン；フルミクロラク（ - ペンチル）；フルミオキサジン（ S - 4 8 2 ）；フルミ
 プロピン；フルオメツロン；フルオロクロリドン；フルオロジフェン；フルオログリコフ
 ェン（ - エチル）；フルボキサム（ K N W - 7 3 9 ）；フルプロバシル（ U B I C - 4 2
 4 3 ）；フルプロパノアート；フルピルスルフロン（ - メチル）（ - ナトリウム）；フル
 ラゾール；フルレノール（ - ブチル）；フルリドン；フルロクロリドン；フルロキシビル
 （ - メブチル）；フルルプリミドール；フルルタモン；フルチアセット（ - メチル）（ K
 I H - 9 2 0 1 ）；フルチアミド；フルキソフェニム；ホメサフェン；フォラムスルフロ
 ン、フォルクロフェヌロン；フォサミン；フリラゾール；フリルオキシフェン；ジベレリ
 ン酸（ gibberellic acid ）；グルホシナート（ - アンモニウム）；グリホサート（ - イソ
 プロピルアンモニウム）；ハロサフェン；ハロスルフロン（ - メチル）；ハロキシホップ
 及びそのエステル；ハロキシホップ - P（ = R - ハロキシホップ）及びそのエステル； H
 C - 2 5 2；ヘキサジノン；イマザメタベンズ（ - メチル）；イマザメタピル、イマザメ
 タモックス、イマザピック、イマザピル；イマザキン及びアンモニウム塩；などの塩、イ
 マゼタメタピル；イマゼタピル；イマゾスルフロン；イナベンフィド；インダノファン；
 インドール - 3 - 酢酸； 4 - インドール - 3 - イル酪酸；ヨードスルフロン - メチル（ -
 ナトリウム）；イオキシニル；イソカルバミド；イソプロパリン；イソプロツロン；イソ
 ウロン；イソキサベン；イソキサクロルトール；イソキサジフェン（ - エチル）；イソキ
 サフルトール；イソキサピリホップ；カルブチラート；ラクトフェン；レナシル；リヌロ
 ン；マレイン酸ヒドラジド（ M H ）； M C P A； M C P B；メコプロップ（ - P ）；メフ

10

20

30

40

50

エナセット；メフェンピル（-ジエチル）；メフルイジド；メピクアット（-塩化物）；
 メソスルフロ（-メチル）；メソトリオン、メタム；メタミホップ；メタミトロン；メ
 タザクロル；メタベンズチアズロン；メタム；メタゾール；メトキシフェノン；メチルア
 ルソン酸；メチルシクロプロペン；メチルジムロン；メチルイソチオシアナート；メトベ
 ンズロン；メトブロムロン；（アルファ-）-メトラクロル；メトスラム（XRD511
 ）；メトクスロン；メトリブジン；メトスルフロ（-メチル）；モリネート；モナリド；モ
 ノカルバミド硫酸二水素塩；モノリヌロン；モヌロン；MT128、即ち、6-クロロ-
 N-（3-クロロ-2-プロペニル）-5-メチル-N-フェニル-3-ピリダジニアミン；MT5950、
 即ち、N-[3-クロロ-4-（1-メチルエチル）フェニル]-2-
 10
 メチルペンタンアミド；ナプロアニリド；ナプロパミド；ナブタラム；NC310、即ち、
 4-（2,4-ジクロロベンゾイル）-1-メチル-5-ベンジルオキシピラゾール；
 ネブロン；ニコスルフロ（-メチル）；ニピラクロフェン；ニトラリン；ニトロフェン；ニ
 トロフェ
 ノラート混合物；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；
 オルタスルファムロン；オキサベトリニル；オリザリン；オキサジアルギル（RP-02
 0630）；オキサジアゾン；オキサスルフロ（-メチル）；オキサジクロメホン、オキシフル
 オル
 フェン；パクロブトラゾール；パラコート（ジクロリド）；ペブラート；ペラルゴン酸；
 ペンジメタリン；ペノクスラム；ペンタクロロフェノール；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；フェニソファム；フェンメジファム；ピクロラム
 ；ピコリナフェン、ピノキサデン（pinoxaden）、ピペロホス；ピリブチカルブ；ピリフ
 20
 ェノップ-ブチル；プレチラクロル；プリミスルフロ（-メチル）；プロベナゾール；
 プロカルバゾン（-ナトリウム）；プロシアジン；プロジアミン；プロフルラリン；プロホ
 キシジム；プロヘキサジオン（-カルシウム）；プロヒドロジャスモン；プログリナジン
 （-エチル）；プロメトン；プロメトリン；プロバクロル；プロパニル；プロパキサホッ
 プ；プロバジン；プロファム；プロピソクロル；プロボキサカルバゾン（-ナトリウム）
 （MKH-6561）；ジヒドロジャスモン酸n-プロピル；プロピザミド；プロスルファ
 リン；プロスルホカルブ；プロスルフロ（CGA-152005）；プリナクロル；
 ピラクロニル；ピラフルフェン（-エチル）（ET-751）；ピラスルホトール（pyra
 sulfotole）；ピラゾリナート；ピラゾン；ピラゾスルフロ（-エチル）；ピラゾキシ
 フェン；ピリベンゾキシム、ピリブチカルブ、ピリダホール、ピリダート；ピリフタリド
 ；ピリミノバック（-メチル）（KIH-6127）；ピリミスルファン（KIH-59
 30
 96）；ピリチオバック（-ナトリウム）（KIH-2031）；ピロキサスルホン（KIH-485）；
 ピロキソホップ及びそのエステル誘導体（例えば、プロパルギルエステ
 ル）；プロクスラム；キンクロラック；キンメラック；キノクラミン、キノホップ及びそ
 のエステル誘導体；キザロホップ及びキザロホップ-P及びそれらのエステル誘導体、例
 えば、キザロホップ-エチル；キザロホップ-P-テフリル及び-エチル；レンリデュロ
 ン（renriduron）；リムスルフロ（DPX-E9636）；S275、即ち2-[4-
 クロロ-2-フルオロ-5-（2-プロピニルオキシ）フェニル]-4,5,6,7-テトラ
 ヒドロ-2H-インダゾール；サフルフェナシル（N'-[2-クロロ-4-フルオロ-
 5-（3-メチル-2,6-ジオキソ-4-（トリフルオロメチル）-3,6-ジヒドロ-
 40
 1（2H）-ピリミジル）ベンゾイル]-N-イソプロピル-N-メチルスルファミド）
 、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；シントフェン；S
 N106279、即ち、2-[7-[2-クロロ-4-（トリフルオロメチル）フェノ
 キシ]-2-ナフタレニル]オキシ]プロパン酸及び2-[7-[2-クロロ-4-（
 トリフルオロメチル）フェノキシ]-2-ナフタレニル]オキシ]プロパン酸メチル；ス
 ルコトリオン、スルフェントラゾン（FMC-97285、F-6285）；スルファズ
 ロン；スルホメツロン（-メチル）；スルホサート（ICI-A0224）；スルホスル
 フロン、TCA；テブタム（GCP-5544）；テブチウロン；テクナセン（tecnacen
 e）；テンボトリオン；テフリルトリオン；テブラロキシジム、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；TFH450、即ち
 50
 、N,N-ジエチル-3-[(2-エチル-6-メチルフェニル)スルホニル]-1H-

1, 2, 4 - ト

リアゾール - 1 - カルボキサミド ; テニルクロール (NSK - 850) ; チアフルアミド、チアザフルロン ; チアゾピル (Mon - 13200) ; チジアジミン (SN - 24085) ; チジアズロン ; チエンカルバゾン ; チフェンスルフロンの - メチル ; チオベンカルブ ; Ti35 ; チオカルバジル ; トブラメゾン ; トラルコキシジム ; トリアラート ; トリアスルフロンの ; トリアジフラム、トリアジフェナミド ; トリベヌロンの - メチル ; 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の ; トリフルラリン ; トリフルスルフロンの及びエステル (例えば、メチルエステル、DPX - 66037) ; トリメツロン ; トリネキサパック ; トリトスルフロンの ; トシトデフ (tsitodef) ; ウニコナゾール ; ベルノラート ; WL110547、即ち、5 - フェノキシ - 1 - [3 - (トリフル

10

【 0104 】

それら単独で又は除草剤と併せて使用した場合に植物へ被害を引き起こし得る殺虫剤は、例えば、以下のとおりである :

有機リン殺虫剤、例えば、テルブホス (Counter (登録商標))、ホノホス (Dyfonate (登録商標))、ホレート (Thimet (登録商標))、クロルピリホス (Reidan (登録商標))、カルボフラン (Furadan (登録商標)) などのカルバメート、テフルトリン (Force (登録商標)) などのピレスロイド系殺虫剤、デルタメトリン (Decis (登録商標)) 及びトラロメ

20

【 0105 】

式 (I) の化合物を用いて作物植物に対するその植物毒性副作用を低減し得る除草剤は、例えば、カーバメート、チオカーバメート、ハロアセトアニリド、置換フェノキシ -、ナフトキシ - 及びフェノキシフェノキシカルボン酸誘導体及びキノリルオキシ -、キノキサリルオキシ -、ピリジルオキシ -、ベンゾオキサゾリルオキシ - 及びベンゾチアゾリルオキシフェノキシアルカンカルボン酸エステルなどのヘテロアリールオキシフェノキシアルカンカルボン酸誘導体、シクロヘキサンジオンオキシム、ベンゾイルシクロヘキサンジオン、ベンゾイルイソオキサゾール、ベンゾイルピラゾール、イミダゾリノン、ピリミジニルオキシピリジンカルボン酸誘導体、ピリミジルオキシ安息香酸誘導体、スルホニル尿

30

【 0106 】

この場合、好適なものは、フェノキシフェノキシ - 及びヘテロアリールオキシフェノキシカルボン酸エステル及び塩、シクロヘキサンジオンオキシム、ベンゾイルシクロヘキサンジオン、ベンゾイルイソオキサゾール、ベンゾイルピラゾール、スルホニル尿素、スルホニルアミノカルボニルチアゾリノン、チアゾロピリミジンスルホンアミド誘導体、ホスフィン酸誘導体及びそれらの塩、グリシン誘導体、チアゾリノン、チアジノン及び、また、S - (N - アリール - N - アルキルカルバモイルメチル) ジチオリン酸エステル、ピリジンカルボン酸、ピリジン、ピリジンカルボキサミド、1, 3, 5 - トリアジン等のグループからの除草剤である。

40

【 0107 】

本発明に従う薬害軽減剤との組み合わせに対して好適な除草剤としては、例えば :

A) 以下の様なフェノキシフェノキシ - 及びヘテロアリールオキシフェノキシ - カルボン酸誘導体の除草剤 :

A1) フェノキシフェノキシ - 及びベンジルオキシフェノキシカルボン酸誘導体、例えば、

2 - (4 - (2, 4 - ジクロロフェノキシ) フェノキシ) プロピオン酸メチル (ジクロ

50

ホップ - メチル) ;

2 - (4 - (4 - ブロモ - 2 - クロロフェノキシ) フェノキシ) プロピオン酸メチル (ドイツ公開特許第 2 6 0 1 5 4 8 (A) 号) ;

2 - (4 - (4 - ブロモ - 2 - フルオロフェノキシ) フェノキシ) プロピオン酸メチル (米国公開特許第 4 8 0 8 7 5 0 (A) 号) ;

2 - (4 - (2 - クロロ - 4 - トリフルオロメチルフェノキシ) フェノキシ) プロピオン酸メチル (ドイツ公開特許第 2 4 3 3 0 6 7 (A) 号) ;

2 - (4 - (2 - フルオロ - 4 - トリフルオロメチルフェノキシ) フェノキシ) プロピオン酸メチル (米国公開特許第 4 8 0 8 7 5 0 (A) 号) ;

2 - (4 - (2 , 4 - ジクロロベンジル) フェノキシ) プロピオン酸メチル (ドイツ公開特許第 2 4 1 7 4 8 7 (A) 号) ;

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

2 - (4 - (4 - トリフルオロメチルフェノキシ) フェノキシ) プロピオン酸メチル (ドイツ公開特許第 2 4 3 3 0 6 7 (A) 号) ;

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

【 0 1 0 8 】

A 2) 「単環」ヘテロアリールオキシフェノキシアルカンカルボン酸誘導体、例えば、

2 - (4 - (3 , 5 - ジクロロピリジル - 2 - オキシ) フェノキシ) プロピオン酸エチル (欧州公開特許第 0 0 0 2 9 2 5 (A) 号) ;

2 - (4 - (3 , 5 - ジクロロピリジル - 2 - オキシ) フェノキシ) プロピオン酸プロパルギル (欧州公開特許第 0 0 0 3 1 1 4 (A) 号) ;

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

2 - (4 - (3 - クロロ - 5 - トリフルオロメチル - 2 - ピリジルオキシ) フェノキシ) プロピオン酸エチル (欧州公開特許第 0 0 0 3 8 9 0 (A) 号) ;

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

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

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

【 0 1 0 9 】

A 3) 「二環」ヘテロアリールオキシフェノキシアルカンカルボン酸誘導体、例えば、

(R S) - 又は (R) - 2 - (4 - (6 - クロロ - 2 - キノキサリルオキシ) フェノキシ) プロピオン酸メチル及びエチル (キザ口ホップ - メチル及び - エチル、又はキザ口ホップ - P - メチル及び - P - エチル) ;

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

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

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

2 - (4 - (6 - クロロベンゾチアゾール - 2 - イルオキシ) フェノキシ) プロピオン酸エチル (ドイツ公開特許第 2 6 4 0 7 3 0 (A) 号) ;

(R S) - 又は (R) - 2 - (4 - (6 - クロロキノキサリルオキシ) フェノキシ) プ

10

20

30

40

50

ロピオン酸テトラヒドロ - 2 - フリルメチル (欧州公開特許第 0 3 2 3 7 2 7 (A) 号) ;

(R) - 2 - [4 - (6 - クロロ - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 2 - イルオキシ) フェノキシ] - 2 ' - フルオロ - N - メチルプロピオンアニリド (メタミホップ) ;

【 0 1 1 0 】

B) ピリミジニル - 又はトリアジニルアミノカルボニル [ベンゼン - 、 - ピリジン - 、 - ピラゾール - 、 - チオフェン - 及び - (アルキルスルホニル) アルキルアミノ] スルファミドなどのスルホニル尿素類のグループからの除草剤。ピリミジン環又はトリアジン環上の好ましい置換基は、アルコキシ、アルキル、ハロアルコキシ、ハロアルキル、ハロゲン又はジメチルアミノであり、全ての置換基は、互いに独立に、組み合わせることが可能である。ベンゼン、ピリジン、ピラゾール、チオフェン又は (アルキルスルホニル) アルキルアミノ部分上での好ましい置換基は、アルキル、アルコキシ、ハロゲン、ニトロ、アルコキシカルボニル、アミノカルボニル、アルキルアミノカルボニル、ジアルキルアミノカルボニル、アルコキシアミノカルボニル、ハロアルコキシ、ハロアルキル、アルキルカルボニル、アルコキシアルキル、(アルカンスルホニル) アルキルアミノである。その様な好適なスルホニル尿素類としては、例えば、

【 0 1 1 1 】

B 1) フェニル - 及びベンジルスルホニル尿素類及び関連化合物、例えば、

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

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

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

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

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

1 - (2 - メトキシカルボニルフェニルスルホニル) - 3 - (4 - メトキシ - 6 - メチル - 1 , 3 , 5 - トリアジン - 2 - イル) - 3 - メチル尿素 (トリベヌロン - メチル) ;

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

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

3 - (4 - エチル - 6 - メトキシ - 1 , 3 , 5 - トリアジン - 2 - イル) - 1 - (2 , 3 - ジヒドロ - 1 , 1 - ジオキソ - 2 - メチルベンゾ [b] チオフェン - 7 - スルホニル) 尿素 (欧州公開特許第 0 0 7 9 6 8 3 (A) 号) ;

3 - (4 - エトキシ - 6 - エチル - 1 , 3 , 5 - トリアジン - 2 - イル) - 1 - (2 , 3 - ジヒドロ - 1 , 1 - ジオキソ - 2 - メチルベンゾ [b] - チオフェン - 7 - スルホニル) 尿素 (欧州公開特許第 0 0 7 9 6 8 3 (A) 号) ;

3 - (4 - メトキシ - 6 - メチル - 1 , 3 , 5 - トリアジン - 2 - イル) - 1 - (2 - メトキシカルボニル - 5 - ヨードフェニルスルホニル) 尿素 (国際公開公報第 9 2 / 1 3 8 4 5 号) ;

2 - [4 - ジメチルアミノ - 6 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロエトキシ) - 1 , 3 , 5 - トリアジン - 2 - イルカルバモイルスルファモイル] - 3 - メチル安息香酸メチル (D P X - 6 6 0 3 7 、 トリフルスルフロン - メチル) ;

2 - [(4 , 6 - ジメチルピリミジン - 2 - イル) カルバモイルスルファモイル] 安息香酸オキセタン - 3 - イル (C G A - 2 7 7 4 7 6 、 オキサスルフロン) ;

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

10

20

30

40

50

- ナトリウム) ;

2 - [3 - (4 , 6 - ジメトキシピリミジン - 2 - イル) ウレイドスルホニル] - 4 -
メタンスルホニルアミノメチル安息香酸メチル (メソスルフロ - メチル、国際公開公報
第 9 5 / 1 0 5 0 7 号) ;

N , N - ジメチル - 2 - [3 - (4 , 6 - ジメトキシピリミジン - 2 - イル) ウレイド
スルホニル] - 4 - ホルミルアミノベンズアミド (ホラムスルフロ - ン、国際公開公報第 9
5 / 0 1 3 4 4 号) ;

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

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

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

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

N - [(4 - メチルピリミジン - 2 - イル) カルバモイル] - 2 - ニトロベンゼンスル
ホンアミド (モノスルフロ - ン) ;

2 - [({ [4 - メトキシ - 6 - (メチルチオ) ピリミジン - 2 - イル] カルバモイル
} アミノ) スルホニル] - 安息香酸メチル ;

【 0 1 1 2 】

B 2) チエニルスルホニル尿素類、例えば、

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

【 0 1 1 3 】

B 3) ピラゾリルスルホニル尿素類、例えば、

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

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

5 - (4 , 6 - ジメチルピリミジン - 2 - イル - カルバモイルスルファモイル) - 1 -
(2 - ピリジル) ピラゾール - 4 - カルボン酸メチル (N C - 3 3 0、Brighton Crop Pr
ot. Conference ' Weeds ' 1991, Vol. 1, p.45 et seq.を参照) ;

1 - (4 , 6 - ジメトキシピリミジン - 2 - イル) - 3 - [1 - メチル - 4 - (2 - メ
チル - 2 H - テトラゾール - 5 - イル) ピラゾール - 5 - イルスルホニル] 尿素 (D P X
- A 8 9 4 7、アジムスルフロ - ン) ;

N - [(4 , 6 - ジメトキシピリミジン - 2 - イル) カルバモイル] - 4 - (5 , 5 -
ジメチル - 4 , 5 - ジヒドロイソオキサゾール - 3 - イル) - 1 , 3 - ジメチル - 1 H -
ピラゾール - 5 - スルホンアミド ;

【 0 1 1 4 】

B 4) スルホンジアミド誘導体、例えば、

3 - (4 , 6 - ジメトキシピリミジン - 2 - イル) - 1 - (N - メチル - N - メチルス
ルホニルアミノスルホニル) 尿素 (アミドスルフロ - ン) 及びその構造類似体 (欧州公開
特許第 0 1 3 1 2 5 8 (A) 号、及び Z. Pfl. Krankh. Pfl. Schutz, special issue XII
, 489-497 (1990)) ;

【 0 1 1 5 】

B 5) ピリジルスルホニル尿素類、例えば、

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

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

10

20

30

40

50

2 - [3 - (4 , 6 - ジメトキシピリミジン - 2 - イル) ウレイドスルホニル] - 6 - トリフルオロメチル - 3 - ピリジンカルボン酸メチル・ナトリウム塩 (D P X - K E 4 5 9 、フルビルスルフロニル - メチル - ナトリウム) ;

3 - (4 , 6 - ジメトキシピリミジン - 2 - イル) - 1 - (3 - N - メチルスルホニル - N - メチルアミノピリジン - 2 - イル) スルホニル尿素又はその塩 (ドイツ公開特許第 4 0 0 0 5 0 3 (A) 号、及びドイツ公開特許第 4 0 3 0 5 7 7 (A) 号) ;

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

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

10

メトキシ酢酸 (1 R S , 2 R S ; 1 R S , 2 S R) - 1 - { 3 - [(4 , 6 - ジメトキシピリミジン - 2 - イルカルバモイル) スルファモイル] - 2 - ピリジル } - 2 - フルオロプロピル (フルセトスルフロニル) ;

【 0 1 1 6 】

B 6) アルコキシフェノキシスルホニル尿素類、例えば、

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

【 0 1 1 7 】

B 7) イミダゾリルスルホニル尿素類、例えば、

20

1 - (4 , 6 - ジメトキシピリミジン - 2 - イル) - 3 - (2 - エチルスルホニルイミダゾ [1 , 2 - a] ピリジン - 3 - イル) スルホニル尿素 (M O N 3 7 5 0 0 、スルホスルフロニル) ;

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

2 - クロロ - N - [(4 , 6 - ジメトキシピリミジン - 2 - イル) カルバモイル] - 6 - プロピルイミダゾ [1 , 2 - b] ピリダジン - 3 - スルホンアミド ;

【 0 1 1 8 】

B 8) フェニルアミノスルホニル尿素類、例えば、

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

30

1 - (4 , 6 - ジメトキシピリミジン - 2 - イル) - 3 - [2 - (ジメチルカルバモイル) フェニルスルファモイル] 尿素 (オルトスルファムロン) ;

【 0 1 1 9 】

C) クロロアセトアニリド類、例えば、

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

【 0 1 2 0 】

D) チオカルバメート類、例えば、

40

N , N - ジプロピルチオカルバミド酸 S - エチル (E P T C) ;

N , N - ジイソプロピルチオカルバミド酸 S - エチル (ブチレート) ;

シクロエート、ジメピベレート、エスプロカルブ、モリネート、オルベンカルブ、ペブレート、プロスルホカルブ、チオベンカルブ、チオカルバジル、トリ - アレート及びベルノレート ;

【 0 1 2 1 】

E) シクロヘキサジオンオキシム類、例えば、

アロキシジム、ブトロキシジム、セレットジム、クロプロキシジム、シクロキシジム、プロホキシジム、セトキシジム、テブラロキシジム及びトラルコキシジム ;

【 0 1 2 2 】

50

F) イミダゾリオン、例えば、

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

【0123】

G) トリアゾロピリミジンスルホンアミド誘導体、例えば、

クロランスラム - メチル、ジクロスラム、フロラスラム、フルメトスラム、メトスラム及びベノックススラム、即ち、2 - (2, 2 - ジフルオロエトキシ) - N - (5, 8 - ジメトキシ [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - c] ピリミジン - 2 - イル) - 6 - (トリフルオロメチル) ベンゼンスルホンアミド及びピロックススラム、即ち、N - (5, 7 - ジメトキシ [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 2 - イル) - 2 - メトキシ - 4 - (トリフルオロメチル) - 3 - ピリジンスルホンアミド；

10

【0124】

H) ベンゾイルシクロヘキサンジオン類、例えば、

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

2 - (2 - ニトロベンゾイル) - 4, 4 - ジメチルシクロヘキサン - 1, 3 - ジオン (欧州公開特許第0274634 (A) 号)；

2 - (2 - ニトロ - 3 - メチルスルホニルベンゾイル) - 4, 4 - ジメチルシクロヘキサン - 1, 3 - ジオン (国際公開公報第91/13548号)；

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

20

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

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

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

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

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

30

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

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

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

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

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

40

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

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

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

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

；

50

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

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

3 - ({ 2 - [(2 - メトキシエトキシ) メチル] - 6 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 3 - イル } カルボニル) - ビシクロ [3 . 2 . 1] オクタン - 2 , 4 - ジオン (国際公開公報第 2 0 0 1 0 9 4 3 3 9 号) ;

【 0 1 2 5 】

I) ベンゾイルイソオキサゾール類、例えば、

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

(4 - クロロ - 2 - メシルフェニル) (5 - シクロプロピル - 1 , 2 - オキサゾール - 4 - イル) メタノン (イソキサクロルトール) ;

【 0 1 2 6 】

J) ベンゾイルピラゾール、例えば、

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

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

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

5 - ヒドロキシ - 1 - メチル - 4 - [2 - (メチルスルホニル) - 4 - トリフルオロメチルベンゾイル] ピラゾール (国際公開公報第 0 1 / 7 4 7 8 5 号) ;

1 - エチル - 5 - ヒドロキシ - 4 - [2 - (メチルスルホニル) - 4 - トリフルオロメチルベンゾイル] ピラゾール (国際公開公報第 0 1 / 7 4 7 8 5 号) ;

1 , 3 - ジメチル - 5 - ヒドロキシ - 4 - [2 - (メチルスルホニル) - 4 - トリフルオロメチルベンゾイル] ピラゾール (国際公開公報第 0 1 / 7 4 7 8 5 号) ;

1 - エチル - 5 - ヒドロキシ - 3 - メチル - 4 - [2 - (メチルスルホニル) - 4 - トリフルオロメチルベンゾイル] ピラゾール (ピラスルホトール、 国際公開公報第 0 1 / 7 4 7 8 5 号) ;

5 - ヒドロキシ - 1 - メチル - 4 - [2 - クロロ - 3 - (4 , 5 - ジヒドロイソオキサゾール - 3 - イル) - 4 - メチルスルホニルベンゾイル] ピラゾール (国際公開公報第 9 9 / 5 8 5 0 9 号) ;

5 - ヒドロキシ - 1 - メチル - 4 - [3 - (4 , 5 - ジヒドロイソオキサゾール - 3 - イル) - 2 - メチル - 4 - メチルスルホニルベンゾイル] ピラゾール (トプラメゾン、 欧州公開特許第 9 9 / 5 8 5 0 9 号) ;

1 - エチル - 5 - ヒドロキシ - 3 - メチル - 4 - [2 - メチル - 4 - メチルスルホニル - 3 - (2 - メトキシエチルアミノ) ベンゾイル] ピラゾール (国際公開公報第 9 6 / 2 6 2 0 6 号) ;

3 - シクロプロピル - 5 - ヒドロキシ - 1 - メチル - 4 - [2 - メチル - 4 - メチルスルホニル - 3 - (2 - メトキシエチルアミノ) ベンゾイル] ピラゾール (国際公開公報第 9 6 / 2 6 2 0 6 号) ;

5 - ベンゾキシ - 1 - エチル - 4 - [2 - メチル - 4 - メチルスルホニル - 3 - (2 - メトキシエチルアミノ) ベンゾイル] ピラゾール (国際公開公報第 9 6 / 2 6 2 0 6 号) ;

1 - エチル - 5 - ヒドロキシ - 4 - (3 - ジメチルアミノ - 2 - メチル - 4 - メチルスルホニルベンゾイル) ピラゾール (国際公開公報第 9 6 / 2 6 2 0 6 号) ;

5 - ヒドロキシ - 1 - メチル - 4 - (2 - クロロ - 3 - ジメチルアミノ - 4 - メチルスルホニルベンゾイル) ピラゾール (国際公開公報第 9 6 / 2 6 2 0 6 号) ;

1 - エチル - 5 - ヒドロキシ - 4 - (3 - アリルアミノ - 2 - クロロ - 4 - メチルスル

10

20

30

40

50

ホニルベンゾイル)ピラゾール(国際公開公報第96/26206号);

1 - エチル - 5 - ヒドロキシ - 4 - (2 - メチル - 4 - メチルスルホニル - 3 - モルホリノベンゾイル)ピラゾール(国際公開公報第96/26206号);

5 - ヒドロキシ - 1 - イソプロピル - 4 - (2 - クロロ - 4 - メチルスルホニル - 3 - モルホリノベンゾイル)ピラゾール(国際公開公報第96/26206号);

3 - シクロプロピル - 5 - ヒドロキシ - 1 - メチル - 4 - (2 - クロロ - 4 - メチルスルホニル - 3 - モルホリノベンゾイル)ピラゾール(国際公開公報第96/26206号);

1, 3 - ジメチル - 5 - ヒドロキシ - 4 - (2 - クロロ - 4 - メチルスルホニル - 3 - ピラゾール - 1 - イルベンゾイル)ピラゾール(国際公開公報第96/26206号);

1 - エチル - 5 - ヒドロキシ - 3 - メチル - 4 - (2 - クロロ - 4 - メチルスルホニル - 3 - ピラゾール - 1 - イルベンゾイル)ピラゾール(国際公開公報第96/26206号);

1 - エチル - 5 - ヒドロキシ - 4 - (2 - クロロ - 4 - メチルスルホニル - 3 - ピラゾール - 1 - イルベンゾイル)ピラゾール(国際公開公報第96/26206号);

(5 - ヒドロキシ - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - イル)(3, 3, 4 - トリメチル - 1, 1 - ジオキシド - 2, 3 - ジヒドロ - 1 - ベンゾチエン - 5 - イル)メタノン(米国公開特許第2002/0016262号);

1 - メチル - 4 - [(3, 3, 4 - トリメチル - 1, 1 - ジオキシド - 2, 3 - ジヒドロ - 1 - ベンゾチエン - 5 - イル)カルボニル] - 1H - ピラゾール - 5 - イルプロパン - 1 - スルホン酸(米国公開特許2002/0016262号、国際公開公報第2002/015695号);

3 - (2 - クロロ - 4 - メチルベンゾイル) - 2 - フェニルチオビシクロ[3.2.1]オクタ - 2 - エン - 4 - オン(ベンゾビシクロン);

【0127】

K) スルホニルアミノカルボニルトリアゾリノン類、例えば、

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

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

4 - [(4, 5 - ジヒドロ - 3 - メトキシ - 4 - メチル - 5 - オキソ - 1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル)カルボニル - スルファモイル] - 5 - メチルチオフエン - 3 - カルボン酸メチル(チエンカルバゾン - メチル);

【0128】

L) トリアゾリノン類、例えば、

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

2 - (2, 4 - ジクロロ - 5 - プロパ - 2 - イニルオキシフェニル) - 5, 6, 7, 8 - テトラヒドロ - 1, 2, 4 - トリアゾロ[4, 3 - a]ピリジン - 3(2H) - オン(アザフェニジン);

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

2', 4' - ジクロロ - 5' - (4 - ジフルオロメチル - 4, 5 - ジヒドロ - 3 - メチル - 5 - オキソ - 1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル)メタンスルホンアニリド(スルフェントラゾン);

4 - [4, 5 - ジヒドロ - 4 - メチル - 5 - オキソ - 3 - (トリフルオロメチル) - 1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル] - 2 - [(エチルスルホニル)アミノ] - 5

10

20

30

40

50

- フルオロベンゼンカルボチオアミド（ベンカルバゾン）；

【0129】

M) ホスフィン酸及び誘導体、例えば、

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

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

【0130】

N) グリシン誘導体、例えば、

N - （ホスホノメチル）グリシン及びその塩（グリホセート及び塩、例えば、ナトリウム塩又はイソプロピルアンモニウム塩）； 10

N - （ホスホノメチル）グリシントリメシウム塩（スルホセート）；

【0131】

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

3 - （4, 6 - ジメトキシピリミジン - 2 - イル）オキシピリジン - 2 - カルボン酸ベンジル（欧州公開特許第0249707（A）号）；

3 - （4, 6 - ジメトキシピリミジン - 2 - イル）オキシピリジン - 2 - カルボン酸メチル（欧州公開特許第0249707（A）号）；

2, 6 - ビス[（4, 6 - ジメトキシピリミジン - 2 - イル）オキシ]安息香酸 1 - （エトキシカルボニルオキシエチル）（欧州公開特許第0472113（A）号）； 20

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

4 - [[2 - [（4, 6 - ジメトキシ - 2 - ピリミジニル）オキシ]フェニル]メチル]アミノ]安息香酸イソプロピル（ピリバムベンズ - イソプロピル、国際公開公報第2002034724号）；

4 - [[2 - [（4, 6 - ジメトキシ - 2 - ピリミジニル）オキシ]フェニル]メチル]アミノ]安息香酸プロピル（ピリバムベンズ - プロピル、国際公開公報第2002034724号）；

ピリベンゾキシム、ピリフタリド、ピリミノバック - メチル、ピリチオバック - ナトリウム、ピリミスリファン； 30

【0132】

P) ジチオリン酸 S - [N - （4 - クロロフェニル） - N - イソプロピルカルバモイルメチル] O, O - ジメチル（アニロホス）などの ジチオリン酸 S - （N - アリール - N - アルキルカルバモイルメチル）エステル；

【0133】

Q) トリアジノン類、例えば、

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

4 - アミノ - 4, 5 - ジヒドロ - 3 - メチル - 6 - フェニル - 1, 2, 4 - トリアジン - 5 - オン（メタミトロン）； 40

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

【0134】

R) ピリジニルカルボン酸、例えば、

アミノピラリド、クロピラリド、フルロキシピル、ピクロラム及びトリクロピル；

S) ピリジン類、例えば、

ジチオビル及びチアゾビル；

T) ピリジニルカルボキシミド類、例えば、

ジフルフェニカン及びピコリナフェン；

U) 1, 3, 5 - トリアジン、例えば、

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

V) 植物成長調整剤、例えば、

ホルクロルフェヌロン及びチジアズロン；

W) ケトエノール類、例えば、

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

X) ピラゾール類、例えば、

3 - [5 - (ジフルオロメトキシ) - 1 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) ピラゾール - 4 - イルメチルスルホン] - 4, 5 - ジヒドロ - 5, 5 - ジメチル - 1, 2 - オキサゾール (ピロキサスルホン) ；

がある。

【 0 1 3 5 】

A ~ W グループの除草剤は、例えば、それぞれの上記刊行物から、そして「農薬マニュアル」(“ The Pesticide Manual ”) , British Crop Protection Council、14h Edition、2006、又は「e - 農薬マニュアル」(“ e-Pesticide Manual ”) 、Version 4.0、British Crop Protection Council 2006から、又はこの他「農薬一般名一覧」(“ The Compendium of Pesticide Common Names ”) から公知である。

【 0 1 3 6 】

活性化化合物の製剤又は共製剤として使用する場合、それらは一般的に、適切な場合、それぞれの慣用的な粘着付与剤、湿潤剤、分散剤、乳化剤、浸透剤、保存剤、不凍剤及び溶媒、増量剤、担体及び着色剤、消泡剤、蒸発抑制剤、並びに pH - 及び粘度調整剤を含む。

【 0 1 3 7 】

式 I の化合物及びそれらの 1 つ又はそれ以上の上記農薬との組み合わせは、一般的な物理化学的及び生物学的パラメータに応じて、様々な方法で製剤化することができる。好適な処方タイプの例は：

- ・有機溶媒、例えば、ブタノール、シクロヘキサノン、ジメチルホルムアミド、キシレン又は他の比較的高沸点の炭化水素又は 1 つ又はそれ以上のイオン性及び / 又は非イオン性界面活性剤 (乳化剤) を添加した有機溶媒の混合物中で、活性化化合物を溶解することにより製造される乳剤。好適な乳化剤は、例えば、アルキルアリールスルホン酸カルシウム、脂肪酸ポリグリコールエステル、アルキルアリー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、プロピレンオキシド / エチレンオキシド縮合物、アルキルポリエーテル、ソルビタンエステル及びポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステルである；

- ・活性物質を、微細分散した固体の無機又は有機物質、例えば、タルク、カオリン、ベントナイト及び葉ろう石、珪藻土などの自然粘土又は穀粉と粉碎することにより得られる粉剤；

- ・例えば、ビーズ粉碎機を用いた湿式粉碎により製造し得る、水性又は油性懸濁製剤；
- ・水溶粉剤；
- ・水溶剤；
- ・水溶顆粒剤、水分散顆粒剤、並びに散布による施用及び土壌施用のための顆粒剤などの顆粒剤；

- ・活性化化合物に加えて、希釈剤又は不活性物質及び界面活性剤をも含む水和剤；
- ・カプセル懸濁剤及びマイクロカプセル；
- ・微量散布剤。

【 0 1 3 8 】

上記の製剤タイプは当業者に公知であり、そして、例えば、K. Martens, 「噴霧乾燥ハンドブック」(“Spray Drying Handbook”), 3rd Ed., G. Goodwin Ltd., London, 1979; W. van Valkenburg, 「農薬製剤」(“Pesticide Formulations”), Marcel Dekker, N.Y. 1973; Winnaker-Kuechler, 「化学技術」(“Chemische Technologie” [Chemical Technology]), volume 7, C. Hanser Verlag Munich, 4th edition 1986; 「Perry 化学エンジニアハンドブック」(“Perry's Chemical Engineer's Handbook”), 5th Ed., McGraw-Hill, N.Y. 1973, pages 8-57に記載されている。

【0139】

不活性物質、界面活性剤、溶媒及び他の添加剤など所要の製剤助剤は公知であり、そして、例えば、McCutcheonの「界面活性剤及び乳化剤年鑑」(“Detergents and Emulsifiers Annual”), MC Publ. Corp., Ridgewood N.J.; C. Marsden, 「溶媒ガイド」(“Solvents Guide”), 2nd Ed., Interscience, N.Y. 1963; H. von Olphen, 「粘土コロイド化学概論」(“Introduction to Clay Colloid Chemistry”), 2nd Ed., J. Wiley & Sons, N.Y.; Schonfeldt, 「界面活性エチレンオキシドアダクト」(“Grenzflächenaktive Äthylenoxidaddukte” [Surface-active ethylene oxide adducts]), Wiss. Verlagsgesellschaft, Stuttgart 1976; Sisley and Wood, 「界面活性剤事典」(“Encyclopedia of Surface Active Agents”), Chem. Publ. Co. Inc., N.Y. 1964; Watkins, 「殺虫剤粉末希釈剤及び担体ハンドブック」(“Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers”), 2nd Ed., Darland Books, Caldwell N.J.; Winnacker-Kuechler, 「化学技術」(“Chemische Technologie” [Chemical Technology]), volume 7, C. Hanser Verlag Munich, 4th edition 1986に記載されている。

【0140】

上記の製剤助剤に加えて、有用植物保護組成物は、適切な場合、慣用的な粘着付与剤、湿潤剤、分散剤、浸透剤、乳化剤、保存剤、不凍剤、増量剤、担体、着色剤、消泡剤、蒸発抑制剤並びにpH又は粘度調整剤を含んでよい。

【0141】

製剤タイプに応じて、有用植物保護組成物は、一般的に0.1~99質量%、特に0.2~95質量%の、1つ又はそれ以上の式Iの薬害軽減剤又は薬害軽減剤及び農薬の組み合わせを含む。更に、それらは1~99.9、特に4~99.5質量%の1つ又はそれ以上の固体又は液体添加剤、及び0~25、特に0.1~25質量%の界面活性剤を含む。濃縮乳剤では、活性化合物の濃度、即ち、薬害軽減剤及び/又は農薬の濃度は、一般的に1~90、特に5~80質量%である。粉末は、通常1~30質量%、好ましくは5~20質量%の活性化合物を含む。水和剤では、活性化合物の濃度は一般的に10~90質量%である。水分散顆粒剤では、活性化合物の含量は、例えば、1~95質量%の間、好ましくは10~80質量%の間である。

【0142】

使用するために、市販の形態で存在する製剤は、適切な場合、通常の方法、例えば、水和剤、乳剤、分散剤及び水分散顆粒剤の場合には水で希釈される。粉剤、顆粒剤及び噴霧性液剤の形態での製剤は、通常使用前に不活性物質でこれ以上希釈されない。薬害軽減剤の所要される施用量は、外部条件、とりわけ、温度、湿度及び使用除草剤のタイプなどによって変動する。

【0143】

本発明を説明するがこれを限定するものではない下記の実施例では、量は、特に指示がなければ重量ベースである。

【実施例】

【0144】

1. 製剤実施例

〔実施例1.1.〕

散粉剤

散粉剤は、式(I)の化合物又は農薬(例えば、除草剤)及び式(I)の薬害軽減剤の

活性化合物混合物（１０重量部）、並びに不活性物質としてタルク（９０重量部）を混合し、そしてハンマーミル中で微粉化して得た。

【０１４５】

〔実施例１．２．〕

水分散粉剤

水に容易に分散可能な水和剤は、式（Ⅰ）の化合物又は農薬（例えば、除草剤）及び式（Ⅰ）の薬害軽減剤の活性化合物混合物（２５重量部）、不活性物質としてカオリン含有石英（６４重量部）、リグニンスルホン酸カリウム（１０重量部）、並びに湿潤剤及び分散剤としてオレイルメチルタウリン酸ナトリウム（１重量部）を混合し、そしてピンミル中で粉砕することによって得た。

10

【０１４６】

〔実施例１．３．〕

水分散剤

水に容易に分散可能な分散剤は、式（Ⅰ）の化合物又は農薬（例えば、除草剤）及び式（Ⅰ）の薬害軽減剤の活性化合物混合物（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 X 207（登録商標））（６重量部）、イソトリデカノールポリグリコールエーテル（３重量部）、並びにパラフィン系鉱油（７１重量部）と混合し、そしてボールミル中で５ミクロンの粉末度まで粉砕することによって得た。

【０１４７】

〔実施例１．４．〕

20

乳剤

乳剤は、式（Ⅰ）の化合物又は農薬（例えば、除草剤）及び式（Ⅰ）の薬害軽減剤の活性化合物混合物（１５重量部）、溶媒としてシクロヘキサノン（７５重量部）、並びに乳化剤としてエトキシ化ノニルフェノール（１０重量部）から得た。

【０１４８】

〔実施例１．５．〕

水分散顆粒剤

水分散顆粒剤は、

式（Ⅰ）の薬害軽減剤、又は農薬及び式（Ⅰ）の薬害軽減剤の混合物（７５重量部）

；

リグニン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）；及び

カオリン（７重量部）；

を混合し、ピンミル中で粉砕し、そしてその粉末に造粒液として水を噴霧することにより、流動床で粒状化することにより得た。

30

【０１４９】

水分散顆粒剤も、また、

式（Ⅰ）の薬害軽減剤、又は農薬及び式（Ⅰ）の薬害軽減剤の混合物（２５重量部）

；

２，２'-ジナフチルメタン-６，６'-ジスルホン酸ナトリウム（５重量部）；

オレイルメタンタウリン酸ナトリウム（２重量部）；

炭酸カルシウム（１７重量部）；

水（５０重量部）；及び

ポリビニルアルコール（１重量部）；

をコロイドミル中で均質化して微粉化し、次いで、ビーズミル中で粉砕しそして微粒子化し、更に得られた懸濁液を単一流体ノズルを用いて噴霧塔内で乾燥することにより得た。

40

【０１５０】

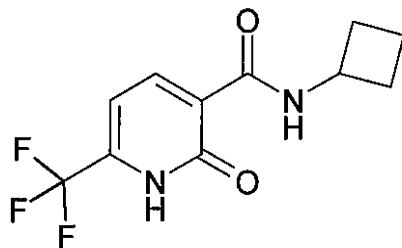
２．製造実施例

〔実施例Ａ１〕

50

N - シクロブチル - 2 - オキソ - 6 - (トリフルオロメチル) - 1, 2 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド

【化 14】



10

A 1. 1) 4 - ブトキシ - 1, 1, 1 - トリフルオロブタ - 3 - エン - 2 - オン

トリクロロメタン (100 ml) に溶解したトリフルオロ酢酸無水物 (79.9 g、0.38 mol) を、5 で撹拌しつつ、ピリジン (29.9 g、0.38 mol) 及びブチルビニルエーテル (50.0 g、0.38 mol) のトリクロロメタン (200 ml) 中の混合物に加えた。添加後、撹拌を室温で更に15時間継続した。その後、水 (300 ml) を混合物に加え、有機相を分離し、乾燥し、濃縮した。これにより、黄色を帯びた油状物質 (59 g、理論値の79%) を得た。

^1H - NMR: [CDCl_3] 0.96 (t, 3H); 1.41 (m, 2H); 1.73 (m, 2H); 4.04 (t, 2H); 5.85 (d, 1H); 7.90 (d, 1H)。

20

【0151】

A 1. 2) 2 - オキソ - 6 - (トリフルオロメチル) - 1, 2 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボン酸メチル

ナトリウム (2.15 g、94 mmol) をエタノール (300 ml) に溶解し、その後、4 - ブトキシ - 1, 1, 1 - トリフルオロブタ - 3 - エン - 2 - オン (9.13 g、78 mmol) 及びマロン酸メチルモノアミド (9.13 g、78 mmol) を加え、そして混合物を還流下で18時間加熱した。混合物を濃縮し、残留物を水に溶解し、ジクロロメタンで洗浄した。水相を2Nの塩酸でpH2に調整し、ジクロロメタンで抽出した。抽出物を乾燥し、濃縮して、無色の粉末 (12 g、理論値の69%) を得た。

^1H - NMR: [CDCl_3] 4.03 (s, 3H); 7.31 (d, 3H); 8.39 (d, 1H)。

30

【0152】

A 1. 3) 2 - オキソ - 6 - (トリフルオロメチル) - 1, 2 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボン酸

室温で、2 - オキソ - 6 - (トリフルオロメチル) - 1, 2 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボン酸メチル (4.73 g、21.4 mmol) をメタノール (45 ml) 及び水 (15 ml) に溶解し、水酸化リチウム・一水和物 (1.80 g、42.8 mmol) を加え、その後混合物を還流下で2時間加熱した。混合物を約15 mlまで濃縮し、そしてジクロロメタンで洗浄し、水相を2Nの塩酸を加えてpH2に調節した。混合物を再度ジクロロメタンで抽出し、そして有機相を乾燥し、濃縮した。これにより、無色の粉末 (4.2 g、理論値の94%) を得た。

40

^1H - NMR: [DMSO] 7.41 (d, 1H); 8.35 (d, 1H)。

【0153】

A 1. 4) N - シクロブチル - 2 - オキソ - 6 - (トリフルオロメチル) - 1, 2 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド

2 - オキソ - 6 - (トリフルオロメチル) - 1, 2 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボン酸 (600 mg、2.9 mmol) をテトラヒドロフラン (5 ml) に溶解し、N, N - カルボニルジイミダゾール (658 mg、4.1 mmol) を加え、そして混合物を当初室温で30分間、その後還流下で30分間加熱した。テトラヒドロフラン (5 ml) 中のシクロブチルアミン (247 mg、3.5 mmol) の溶液を滴下しながら加え、そして

50

混合物を還流下で更に2時間加熱した。溶液を蒸発乾固し、その後酢酸エチルに溶解し、1 Nの塩酸及び水で洗浄し、乾燥し、そして濃縮した。カラムクロマトグラフィーで精製し、薄茶色の粉末(160 mg、理論値の19%)を得た。

^1H -NMR: [CDCl₃] 1.80 (m, 2H); 2.00 (m, 2H); 2.42 (m, 2H); 4.55 (m, 1H); 6.88 (d, 1H); 8.65 (d, 1H); 9.50 (br, 1H)。

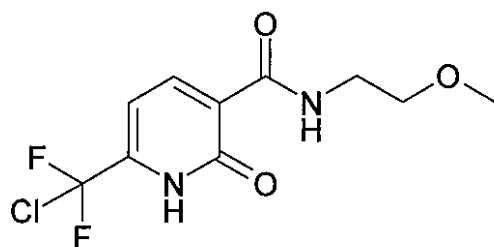
【0154】

〔実施例A2〕

6-[クロロ(ジフルオロ)メチル]-N-(2-メトキシエチル)-2-オキソ-1,2-ジヒドロピリジン-3-カルボキサミド

10

【化15】



A2.1) 4-ブトキシ-1-クロロ-1,1-ジフルオロブタ-3-エン-2-オントリクロロメタン(10 ml)に溶解したクロロジフルオロ酢酸無水物(5.0 g、20.2 mmol)を、5 で撹拌しつつ、トリクロロメタン(30 ml)中のピリジン(1.60 g、20.2 mmol)及びブチルビニルエーテル(2.1 g、20.2 mmol)の混合物に加えた。添加後撹拌を室温で更に15時間継続した。その後水(100 ml)を混合物に加え、そして有機相を分離し、乾燥し、濃縮した。これにより、黄色を帯びた油状物質(3.4 g、理論値の80%)を得た。

20

^1H -NMR: [DMSO] 0.90 (t, 3H); 1.35 (m, 2H); 1.65 (m, 2H); 4.20 (t, 2H); 6.04 (d, 1H); 8.10 (d, 1H)。

【0155】

A2.2) 6-[クロロ(ジフルオロ)メチル]-2-オキソ-1,2-ジヒドロピリジン-3-カルボン酸メチル

30

ナトリウム(1.47 g、61 mmol)をメタノール(220 ml)に溶解し、4-ブトキシ-1-クロロ-1,1-ジフルオロブタ-3-エン-2-オン(10 g、47 mmol)及びマロン酸メチルモノアミド(5.51 g、47 mmol)を加え、そして混合物を還流下で21時間加熱した。2 Nの塩酸を用いてpHを4~5に調整し、約200 mlを蒸留で除去した。残存した溶液を酢酸エチルで抽出し、そして抽出物を乾燥し、濃縮した。残留物をジイソプリピルエーテルで粉砕し、吸引濾過し、乾燥した。これにより無色の粉末(7.4 g、理論値の66%)を得た。

^1H -NMR: [CDCl₃] 4.01 (s, 3H); 7.30 (d, 1H); 8.38 (d, 1H); 11.5 (br, 1H)。

40

【0156】

A2.3a) 6-[クロロ(ジフルオロ)メチル]-2-オキソ-1,2-ジヒドロピリジン-3-カルボン酸

ナトリウム(1.70 g、74 mmol)をメタノール(250 ml)に溶解し、4-ブトキシ-1-クロロ-1,1-ジフルオロブタ-3-エン-2-オン(13.1 g、61.7 mmol)及びマロン酸メチルモノアミド(7.22 g、61.7 mmol)を加え、そして混合物を還流下で21時間加熱した。水(250 ml)及び水酸化リチウム・一水和物(2.9 g、67.9 mmol)を加え、そして還流下での加熱を更に2時間継続した。混合物を約200 mlまで濃縮し、ジクロロメタンで洗浄し、そして水相を2 Nの塩酸を用いてpH 2の酸性にした。沈殿した固体を吸引濾過し、減圧下で乾燥した(9

50

． 3 g、理論値の 68 %)。

【 0 1 5 7 】

A 2 . 3 b) 6 - [クロロ (ジフルオロ) メチル] - 2 - オキソ - 1 , 2 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボン酸

6 - [クロロ (ジフルオロ) メチル] - 2 - オキソ - 1 , 2 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド (11 . 0 g、49 . 4 mmol) を、50 % 強度の硫酸 (77 ml) 中で加熱した。その後混合物を氷水に加え、そして沈殿物を吸引濾過し、乾燥した。これにより、黄色を帯びた粉末 (7 . 2 g、理論値の 65 %) を得た。

融点 : 145 ~ 147 ;

^1H - NMR : [DMSO] 7 . 36 (d , 1 H) ; 8 . 34 (d , 1 H)。

10

【 0 1 5 8 】

A 2 . 4) 6 - [クロロ (ジフルオロ) メチル] - N - (2 - メトキシエチル) - 2 - オキソ - 1 , 2 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド

6 - [クロロ (ジフルオロ) メチル] - 2 - オキソ - 1 , 2 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボン酸 (500 mg、2 . 2 mmol) をテトラヒドロフラン (10 ml) に溶解し、N , N - カルボニルジイミダゾール (508 mg、3 . 1 mmol) を加え、そして混合物を当初は室温で 30 分間、その後還流下で 30 分間攪拌した。テトラヒドロフラン (2 ml) 中の 2 - メトキシエチルアミン (202 mg、2 . 7 mmol) の溶液を滴下しながら加え、そして混合物を還流下で更に 2 時間加熱した。溶液を蒸発乾固し、残留物を酢酸エチルに溶解し、そして溶液を 1 N の塩酸及び水で洗浄し、乾燥し、濃縮した。これにより薄茶色の粉末 (360 mg、理論値の 54 %) を得た。

20

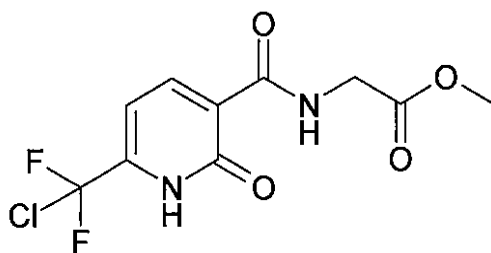
^1H - NMR : [CDCl₃] 3 . 40 (s , 3 H) ; 3 . 58 (m , 2 H) ; 3 . 67 (m , 2 H) ; 6 . 84 (d , 1 H) , 8 . 62 (d , 1 H) ; 9 . 40 (br , 1 H)

。

【 0 1 5 9 】

〔 実施例 A 3 〕

【 化 1 6 】



30

N - ({ 6 - [クロロ (ジフルオロ) メチル] - 2 - オキソ - 1 , 2 - ジヒドロピリジン - 3 - イル } カルボニル) グリシン酸メチル

6 - [クロロ (ジフルオロ) メチル] - 2 - オキソ - 1 , 2 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボン酸 (300 mg、1 . 34 mmol) をテトラヒドロフラン (5 ml) に溶解し、N , N - カルボニルジイミダゾール (435 mg、2 . 68 mmol) を加え、そして混合物を当初は室温で 30 分間、その後還流下で 30 分間攪拌した。テトラヒドロフラン (3 ml) 中のグリシンメチルエステル・塩酸塩 (168 mg、134 mmol) の混合物を加え、そして混合物を還流下で更に 2 時間加熱した。溶液を蒸発乾固し、残留物を酢酸エチルに溶解し、そして溶液を 1 N の塩酸及び水で洗浄し、乾燥し、濃縮した。これにより薄茶色の粉末 (92 mg、理論値の 23 %) を得た。

40

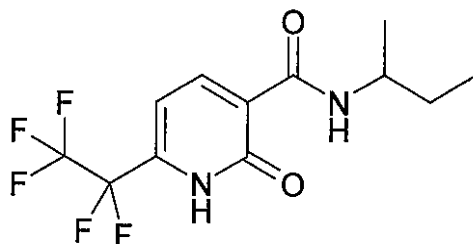
^1H - NMR : [DMSO] 3 . 65 (s , 3 H) ; 4 . 12 (d , 2 H) ; 7 . 28 (d , br , 1 H) ; 8 . 42 (d , 1 H) ; 9 . 25 (t , br 1 H) , 13 . 6 (br , 1 H)。

【 0 1 6 0 】

〔 実施例 A 4 〕

50

N - (1 - メチルプロピル) - 2 - オキソ - 6 - (ペンタフルオロエチル) - 1 , 2 - ジ
ヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド
【化 17】



10

A 4 . 1) 1 - ブトキシ - 4 , 4 , 5 , 5 , 5 - ペンタフルオロペンタ - 1 - エン - 3 -
オン

ジクロロメタン (20 ml) に溶解したペンタフルオロプロピオニルクロリド (17 .
0 g、93 . 2 mmol) を、 - 10 で、ジクロロメタン (200 ml) 中のピリジン
(8 . 11 g、102 mmol) 及びブチルビニルエーテル (9 . 33 g、93 . 2 mm
ol) の混合物に撹拌しつつ加えた。添加後、撹拌を室温で更に 15 時間継続し、水 (2
00 ml) を混合物に加え、そして有機相を分離し、乾燥し、濃縮した。これにより、黄
色を帯びた油状物質 (18 . 9 g、理論値の 82 %) を得た。

^1H - NMR : [DMSO] 0 . 85 (t , 3 H) ; 1 . 32 (m , 2 H) ; 1 . 63 (m , 2 H) ; 4 . 20 (t , 2 H) ; 6 . 06 (d , 1 H) ; 8 . 11 (d , 1 H) 。

20

【 0161】

A 4 . 2) 2 - オキソ - 6 - (ペンタフルオロエチル) - 1 , 2 - ジヒドロピリジン - 3
- カルボン酸エチル

ナトリウム (0 . 56 g、24 . 4 mmol) をエタノール (150 ml) に溶解し、
1 - ブトキシ - 4 , 4 , 5 , 5 , 5 - ペンタフルオロペンタ - 1 - エン - 3 - オン (5 g
、20 . 3 mmol) 及びマロン酸メチルモノアミド (2 . 66 g、20 . 3 mmol)
を加え、そして混合物を還流下で 6 時間加熱した。混合物を約 50 ml まで濃縮し、1 N
の塩酸 (500 ml) を加え、混合物を酢酸エチルで抽出した。乾燥し、濃縮して、黄色
を帯びた樹脂状物質 (2 . 3 g、理論値の 40 %) を得た。

30

^1H - NMR : [CDCl₃] 1 . 45 (t , 3 H) ; 4 . 50 (q , 2 H) ; 7 . 35 (d , 1 H) ; 8 . 40 (d , 1 H) ; 11 . 4 (br , 1 H) 。

【 0162】

A 4 . 3) N - (1 - メチルプロピル) - 2 - オキソ - 6 - (ペンタフルオロエチル) -
1 , 2 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド

室温で、2 - オキソ - 6 - (ペンタフルオロエチル) - 1 , 2 - ジヒドロピリジン - 3
- カルボン酸エチル (160 mg、0 . 56 mmol) を、2 - ブチルアミン (5 ml)
中で 14 時間撹拌した。1 N の塩酸を加えて pH を 2 に調整し、それにより無色の固体の
沈殿物が得られた。吸引濾過し、乾燥して、生成物 (160 mg、理論値の 91 %) を得
た。

40

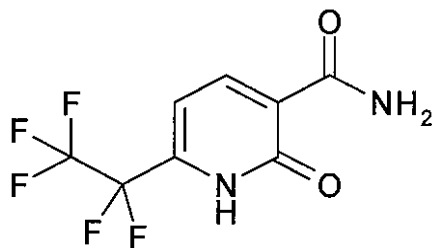
^1H - NMR : [CDCl₃] 0 . 97 (t , 3 H) ; 1 . 22 (d , 3 H) ; 1 . 59 (m , 2 H) ; 4 . 10 (m , 1 H) ; 6 . 88 (d , 1 H) ; 8 . 72 (d , 1 H) ; 9 . 24 (d , br , 1 H) ; 13 . 6 (br) 。

【 0163】

【 実施例 A 5】

2 - オキソ - 6 - (ペンタフルオロエチル) - 1 , 2 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキ
サミド

【化 18】



ナトリウム (0.22 g、9.7 mmol) をエタノール (50 ml) に溶解し、1 -
ブトキシ - 4, 4, 5, 5, 5 - ペンタフルオロペンタ - 1 - エン - 3 - オン (2 g、8
.1 mmol) 及びマロンアミド (0.86 g、8.1 mmol) を加え、そして混合物
を還流下で7時間加熱した。混合物を濃縮し、1 Nの塩酸を加えた。得られた沈殿物を吸
引濾過し、乾燥した。これにより黄色粉末 (1.9 g、理論値の94%) を得た。

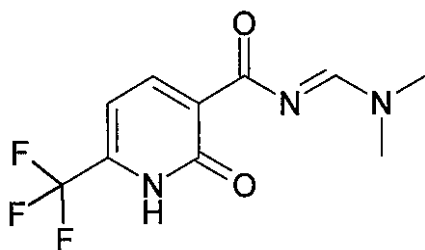
^1H - NMR : [DMSO] 7.45 (d, 1H) ; 8.15 (br, 1H) ; 8.45
(br, 1H) ; 8.50 (d, 1H) ; 13.7 (br, 1H)。

【0164】

〔実施例 A 6〕

N - [(ジメチルアミノ)メチレン] - 2 - オキソ - 6 - (トリフルオロメチル) - 1,
2 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド

【化 19】



N, N - ジメチルホルムアミドジメチルアセタール (0.87 g、7.28 mmol)
をトルエン (5 ml) 中の 2 - オキソ - 6 - (トリフルオロメチル) - 1, 2 - ジヒドロ
ピリジン - 3 - カルボキサミド (1.00 g、4.85 mmol) に加え、そして混合物
を還流下で4時間加熱した。冷却後、得られた沈殿物を吸引濾過し、乾燥した：0.5 g
、理論値の39%。

^1H - NMR : [CDCl₃] 3.25 (s, 3H) ; 3.35 (3.3H) ; 7.25 (d, 1H) ; 8.58 (d, 1H) ; 8.76 (s, 1H)。

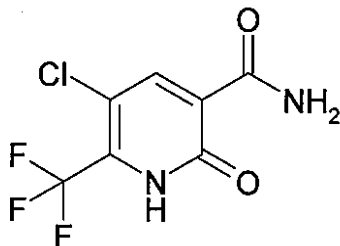
^{13}C - NMR : [CDCl₃] 35 (NMe₂) ; 106 (C - 5) ; 115 (C - 3) ;
122 (q, CF₃) ; 143 (C - 4) ; 151 (C - 6) ; 164 (N = CN) ; 167 (C - 2) ; 171 (CON)。

【0165】

〔実施例 A 7〕

5 - クロロ - 2 - オキソ - 6 - (トリフルオロメチル) - 1, 2 - ジヒドロピリジン - 3
- カルボキサミド

【化 20】



室温で、スルフリルクロリド (0.39 g、2.9 mmol) を、ジクロロエタン (5 ml) 及びピリジン (2.3 g、0.25 ml) 中の 2 - オキソ - 6 - (トリフルオロメチル) - 1, 2 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド (300 mg、1.46 mmol) に加え、その後混合物を還流下で 2 時間加熱した。混合物に 0.5 N の塩酸を加えた。有機相を除去し、そして乾燥し、濃縮し、これにより、茶色を帯びた粉末 (144 mg、理論値の 41%) を得た。

^1H - NMR : [DMSO] 8.25 (br, 1H) ; 8.35 (br, 1H) ; 8.50 (s, 1H) ; 13.8 (br, 1H)。

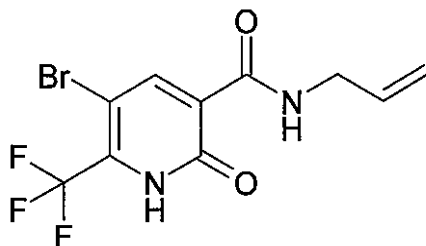
^{13}C - NMR : [DMSO] 118 (C - 5) ; 120 (C - 6) ; 120.5 (q, CF_3) ; 144 (C - 4) , 161 (C - 2) ; 166 (COONH_2)。

【0166】

【実施例 A8】

N - アリル - 5 - ブロモ - 2 - オキソ - 6 - (トリフルオロメチル) - 1, 2 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド

【化 21】



A8.1) 5 - ブロモ - 2 - オキソ - 6 - (トリフルオロメチル) - 1, 2 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボン酸メチル

室温で、N - ブロモスクシンイミド (0.36 g、2.04 mmol) を、氷酢酸 (10 ml) 中 2 - オキソ - 6 - (トリフルオロメチル) - 1, 2 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボン酸メチル (0.3 g、1.36 mmol) の懸濁液に加え、その後混合物を還流下で 2 日間加熱した。反応混合物に水を加え、そしてジクロロメタンで抽出した。抽出物を濃縮し、残留物を分取型 HPLC で精製した。これにより、無色の粉末 (277 mg、理論値の 56%) を得た。

^1H - NMR : [DMSO] 3.85 (s, 3H) ; 8.45 (s, 1H) ; 12.80 (br, 1H)。

^{13}C - NMR : [DMSO] 53 (OCH_3) ; 105 (C - 3) ; 148 (C - 4) , 161 (C - 2) ; 164 (COOMe)。

【0167】

A8.2) N - アリル - 5 - ブロモ - 2 - オキソ - 6 - (トリフルオロメチル) - 1, 2 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド

室温で、5 - ブロモ - 2 - オキソ - 6 - (トリフルオロメチル) - 1, 2 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボン酸メチル (250 mg、0.83 mmol) を、アリルアミン (5 ml) 中で 18 時間撹拌した。2 N の塩酸を加えて pH を 2 に調整し、無色の固体の沈殿

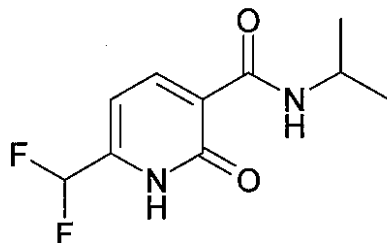
物が生成した。吸引濾過し、乾燥して、生成物 (134 mg、理論値の50%) を得た。
 $^1\text{H-NMR}$: [DMSO] 3.94 (t, 2H); 5.18 (dd, 2H); 5.89 (m, 1H); 8.52 (s, 1H); 8.85 (t, br, 1H)。

【0168】

〔実施例A9〕

6-ジフルオロメチル-N-イソプロピル-2-オキソ-1,2-ジヒドロピリジン-3-カルボキサミド

【化22】



10

A9.1) 4-ブトキシ-1,1-ジフルオロブタ-3-エン-2-オン

ジフルオロ酢酸無水物 (10.0 g、55.7 mmol) を5 で攪拌しつつ、トリクロロメタン (330 ml) 中のピリジン (4.41 g、4.5 ml、55.7 mmol) 及びブチルビニルエーテル (5.7 g、55.7 mmol) の混合物に加えた。添加後攪拌を室温で更に15時間継続した。その後水 (300 ml) を混合物に加え、そして有機相を分離し、乾燥し、濃縮した。これにより、黄色を帯びた油状物質 (5.7 g、理論値の57%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$: [CDCl₃] 0.95 (t, 3H); 1.42 (m, 2H); 1.72 (m, 2H); 4.00 (t, 2H); 5.78 (t, 1H); 5.90 (d, 1H); 7.85 (d, 1H)。

【0169】

A9.2) 6-(ジフルオロメチル)-2-オキソ-1,2-ジヒドロピリジン-3-カルボン酸メチル

ナトリウム (1.21 g、52.9 mmol) をメタノール (200 ml) に溶解し、4-ブトキシ-1,1-ジフルオロブタ-3-エン-2-オン (7.9 g、44 mmol) 及びマロン酸メチルモノアミド (5.3 g、44 mmol) を加え、そして混合物を還流下で15時間加熱した。混合物を濃縮し、残留物を1Nの塩酸 (100 ml) で粉砕した。得られた固体を吸引濾過し、そして乾燥した (7.4 g、理論値の82%)。

$^1\text{H-NMR}$: [DMSO] 3.82 (s, 3H); 6.85 (t, 1H); 7.02 (d, br, 1H); 8.20 (d, 1H); 12.4 (br, 1H)。

【0170】

A9.3) 6-(ジフルオロメチル)-2-オキソ-1,2-ジヒドロピリジン-3-カルボン酸

6-(ジフルオロメチル)-2-オキソ-1,2-ジヒドロピリジン-3-カルボン酸メチル (7.4 g、36.4 mmol) をメタノール (100 ml) に溶解し、水 (50 ml) 中水酸化リチウム (1.3 g、54.6 mmol) の溶液を加えた。還流下で2時間加熱した後、混合物を約50 mlの容積まで濃縮し、そして溶液をジクロロメタンで洗浄した。水相を2Nの塩酸で酸性にし、酢酸エチルで抽出した。抽出物を乾燥し、濃縮して、茶色を帯びた粉末 (5.6 g、理論値の82%) を得た。

【0171】

A9.4) 6-(ジフルオロメチル)-N-イソプロピル-2-オキソ-1,2-ジヒドロピリジン-3-カルボキサミド

6-(ジフルオロメチル)-2-オキソ-1,2-ジヒドロピリジン-3-カルボン酸 (200 mg、1.1 mmol) をテトラヒドロフラン (25 ml) に溶解し、N,N-

50

カルボニルジイミダゾール (206 mg、1.3 mmol) を添加した後、混合物を当初は室温で30分間攪拌し、その後還流下で30分間攪拌した。イソプロピルアミン (66 mg、1.1 mmol) のテトラヒドロフラン (5 ml) 溶液を滴下しながら加え、そして混合物を還流下で更に2時間加熱した。溶液を蒸発乾固し、残留物を酢酸エチルに溶解し、そして混合物を2Nの塩酸及び水で洗浄し、乾燥し、濃縮した。カラムクロマトグラフィーで精製し、無色の粉末 (150 mg、理論値の61%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$: [CDCl_3] 1.25 (d, 6H); 4.22 (m, 1H); 6.55 (t, 1H); 6.69 (d, 1H); 8.64 (d, 1H); 9.42 (d, br, 1H); 13.0 (br, 1H)。

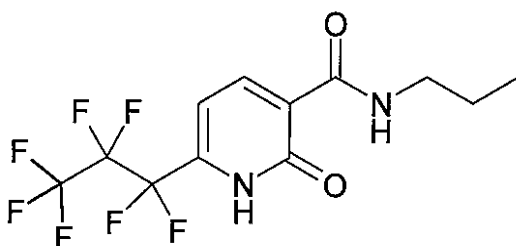
【0172】

10

〔実施例A10〕

6-(ヘプタフルオロプロピル)-2-オキソ-N-プロピル-1,2-ジヒドロピリジン-3-カルボキサミド

【化23】



20

A10.1) 1-ブトキシ-4,4,5,5,6,6,6-ヘプタフルオロヘキサ-1-エン-3-オン

ジクロロメタン (50 ml) に溶解したヘプタフルオロブチリルクロリド (21.7 g、93.2 mmol) を、ジクロロメタン (200 ml) 中のピリジン (8.11 g、102 mmol) 及びブチルビニルエーテル (9.33 g、93.2 mmol) の混合物に、-10 で攪拌しつつ加えた。添加後、攪拌を室温で更に15時間継続した。水 (300 ml) を混合物に加え、有機相を分離し、乾燥し、濃縮した。これにより黄色を帯びた油状物質 (28.2 g、理論値の82%) を得、それを更に精製せずに反応させた。

30

$^1\text{H-NMR}$: [CDCl_3] 0.96 (t, 3H); 1.40 (m, 2H); 1.75 (m, 2H); 4.04 (t, 2H); 5.95 (d, 1H); 7.93 (d, 1H)。

【0173】

A10.2) 6-(ヘプタフルオロプロピル)-2-オキソ-1,2-ジヒドロピリジン-3-カルボン酸メチル

ナトリウム (2.63 g、114 mmol) をメタノール (250 ml) に溶解し、4-ブトキシ-4,4,5,5,6,6,6-ヘプタフルオロヘキサ-1-エン-3-オン (28.2 g、95.5 mmol) 及びマロン酸メチルモノアミド (11.18 g、95.5 mmol) を加え、そして混合物を還流下で18時間加熱した。混合物を濃縮し、そして残留物を水に溶解し、ジクロロメタンで洗浄した。水相を2Nの塩酸を加えてpH2に調整し、ジクロロメタンで抽出した。抽出物を乾燥し、濃縮し、そしてカラムクロマトグラフィーで精製して、黄色の粉末 (15.2 g、理論値の49%) を得た。

40

$^1\text{H-NMR}$: [CDCl_3] 4.06 (s, 3H); 7.35 (d, 1H); 8.40 (d, 1H); 11.4 (br, 1H)。

【0174】

A10.3) 6-(ヘプタフルオロプロピル)-2-オキソ-N-プロピル-1,2-ジヒドロピリジン-3-カルボキサミド

プロピルアミン (5 ml) 中の6-(ヘプタフルオロプロピル)-2-オキソ-1,2-ジヒドロピリジン-3-カルボン酸メチル (250 mg、0.78 mmol) を還流下で5時間加熱した。その後混合物を1Nの塩酸を加えてpH2に調整し、ジクロロメタン

50

で抽出した。乾燥し、濃縮して、ベージュ色の粉末 (240 mg、理論値の88%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$: [DMSO] 0.90 (t, 3H); 1.54 (m, 2H); 3.25 (q, 2H); 7.41 (d, 1H); 8.40 (d, 1H); 8.85 (br, 1H); 13.45 (br, 1H)。

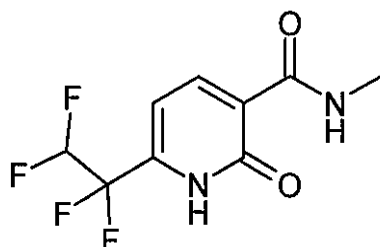
【0175】

〔実施例A11〕

N-メチル-2-オキソ-6-(1,1,2,2-テトラフルオロエチル)-1,2-ジヒドロピリジン-3-カルボキサミド

【化24】

10



A11.1) 1-ブトキシ-4,4,5,5-テトラフルオロペンタ-1-エン-3-オン

20

ジクロロメタン (20 ml) に溶解した 3H-テトラフルオロプロピニルクロリド (0.25.0 g、152 mmol) を、0 で撹拌しつつ、ジクロロメタン (250 ml) 中のピリジン (14.4 g、182 mmol) 及びブチルビニルエーテル (15.2 g、152 mmol) の混合物に加えた。添加後、撹拌を室温で更に15時間継続した。その後水 (250 ml) を混合物に加え、そして有機相を分離し、乾燥し、濃縮した。これにより黄色を帯びた油 (12.5 g、理論値の36%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$: [CDCl₃] 0.96 (t, 3H); 1.46 (m, 2H); 1.75 (m, 2H); 4.03 (t, 2H); 6.00 (d, 1H); 6.09 (tt, 1H); 7.90 (d, 1H)。

【0176】

30

A11.2) 2-オキソ-6-(1,1,2,2-テトラフルオロエチル)-1,2-ジヒドロピリジン-3-カルボン酸メチル

ナトリウム (1.39 g、60.3 mmol) をメタノール (500 ml) に溶解した後、1-ブトキシ-4,4,5,5-テトラフルオロペンタ-1-エン-3-オン (11.5 g、50.3 mmol) 及びマロン酸メチルモノアミド (6.07 g、50.3 mmol) を加え、そして混合物を還流下で6時間加熱した。混合物を約100 ml になるまで濃縮し、1Nの塩酸 (500 ml) を加え、続いて混合物を酢酸エチルで抽出した。乾燥し、濃縮して、黄色を帯びた樹脂状物質 (10.3 g、理論値の67%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$: [CDCl₃] 4.03 (s, 3H); 6.40 (tt, 1H); 7.38 (d, 1H); 8.39 (d, 1H)。

40

【0177】

A11.3) N-メチル-2-オキソ-6-(1,1,2,2-テトラフルオロエチル)-1,2-ジヒドロピリジン-3-カルボキサミド

室温で、2-オキソ-6-(1,1,2,2-テトラフルオロエチル)-1,2-ジヒドロピリジン-3-カルボン酸メチル (300 mg、1.19 mmol) を、40%強度のメチルアミン溶液 (3.3 ml) 中で14時間撹拌した。1Nの塩酸を加えてpHを2に調整し、そして混合物をジクロロメタンで抽出した。抽出物を乾燥し、濃縮して、生成物 (230 mg、理論値の77%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$: [DMSO] 2.83 (d, 3H); 6.81 (tt, 1H); 7.22 (br, 1H); 8.41 (d, 1H); 9.00 (br, 1H); 13.4 (br

50

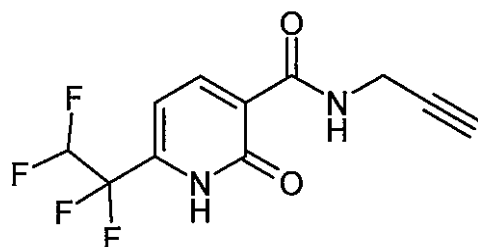
, 1 H)。

【0178】

〔実施例 A 1 2〕

2 - オキソ - N - (2 - プロピニル) - 6 - (1 , 1 , 2 , 2 - テトラフルオロエチル)
- 1 , 2 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド

【化 2 5】



10

室温で、2 - オキソ - 6 - (1 , 1 , 2 , 2 - テトラフルオロエチル) - 1 , 2 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボン酸メチル (3 0 0 m g 、 1 . 1 9 m m o l) を、プロパルギルアミン (3 . 3 m l 、 4 1 m m o l) 中で 1 4 時間撹拌した。その後 1 N の塩酸を加えて pH を 2 に調整し、混合物をジクロロメタンで抽出した。抽出物を乾燥し、濃縮して、生成物 (2 8 0 m g 、 理論値の 8 5 %) を得た。

^1H - NMR : [DMSO] 3 . 1 5 (t , 1 H) ; 4 . 1 3 (m , 2 H) ; 6 . 8 2 (t t , 1 H) ; 7 . 1 8 (b r , 1 H) ; 8 . 4 1 (d , 1 H) ; 9 . 3 5 (b r , 1 H) ; 1 3 . 3 (b r , 1 H) 。

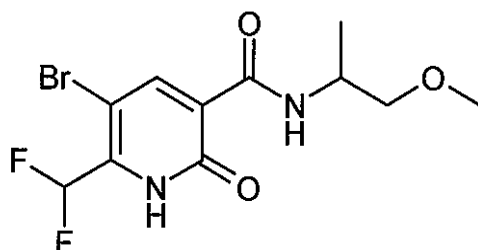
20

【0179】

〔実施例 A 1 3〕

5 - ブロモ - 6 - (ジフルオロメチル) - N - (2 - メトキシ - 1 - メチルエチル) - 2 - オキソ - 1 , 2 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド

【化 2 6】



30

A 1 3 . 1) 5 - ブロモ - 6 - (ジフルオロメチル) - 2 - オキソ - 1 , 2 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボン酸メチル

6 - (ジフルオロメチル) - 2 - オキソ - 1 2 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボン酸メチル (4 . 1 g 、 2 0 m m o l) を N , N - ジメチルホルムアミド (2 0 m l) に溶解し、そして N - ブロモスクシンイミド (5 . 3 5 g 、 3 0 m m o l) を室温で加えた。2 時間撹拌した後、反応混合物に水を加え、tert - ブチルメチルエーテルで抽出した。続いて抽出物を水で繰り返し洗浄した。乾燥し、濃縮して、最終的に生成物 (3 . 7 g 、 理論値の 6 5 %) を得た。

40

^1H - NMR : [DMSO] 3 . 8 3 (s , 3 H) ; 7 . 0 7 (t , 1 H) ; 8 . 3 4 (s , 1 H) ; 1 2 . 5 (s , b r , 1 H) 。

【0180】

A 1 3 . 2) 5 - ブロモ - 6 - (ジフルオロメチル) - N - (2 - メトキシ - 1 - メチルエチル) - 2 - オキソ - 1 , 2 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド

室温で、2 - アミノ - 1 - メトキシプロパン (3 . 3 m l 、 4 1 m m o l) 中の 5 - ブロモ - 6 - (ジフルオロメチル) - 2 - オキソ - 1 , 2 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボ

50

ン酸メチル (334 mg、1.19 mmol) を14時間撹拌した。その後1 Nの塩酸を添加してpHを2に調整し、そして混合物をジクロロメタンで抽出した。抽出物を乾燥し、濃縮して、生成物 (360 mg、理論値の89%) を得た。

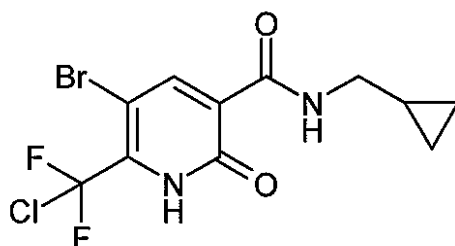
^1H -NMR: [CDCl₃] 1.27 (d, 3H); 3.40 (s, 3H); 3.43 (m, 2H); 4.37 (m, 1H); 6.85 (t, 1H); 8.68 (s, 1H); 9.42 (d, br, 1H); 12.7 (br, 1H)。

【0181】

〔実施例A14〕

5 - ブロモ - 6 - [クロロ (ジフルオロ) メチル] - N - (シクロプロピルメチル) - 2 - オキソ - 1, 2 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド
【化27】

10



A14.1) 5 - ブロモ - 6 - [クロロ (ジフルオロ) メチル] - 2 - オキソ - 1, 2 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボン酸メチル

20

6 - [クロロ (ジフルオロ) メチル] - 2 - オキソ - 1, 2 - ジヒドロピリジンカルボン酸メチル (1.30 g、5.47 mmol) をN, N - ジメチルホルムアミド (50 ml) に溶解し、そしてN - プロモスクシンイミド (1.46 g、8.21 mmol) を室温で加えた。3時間撹拌した後、反応混合物に水を加え、無色の沈殿物を (1.23 g、理論値の71%) を得た。

^1H -NMR: [DMSO] 3.85 (s, 3H); 8.45 (s, 1H); 12.7 (s, br, 1H)。

【0182】

A14.2) 5 - ブロモ - 6 - [クロロ (ジフルオロ) メチル] - N - (シクロプロピルメチル) - 2 - オキソ - 1, 2 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド

30

室温で、5 - ブロモ - 6 - [クロロ (ジフルオロ) メチル] - 2 - オキソ - 1, 2 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボン酸メチル (350 mg、1.11 mmol) をアセトニトリル (5 ml) に溶解し、そしてアミノメチルシクロプロパン (0.5 ml) を加えて12時間撹拌した。その後反応混合物に1 Nの塩酸を加え、生成した沈殿物を吸引濾過した。沈殿物を乾燥し、再度1 Nの塩酸で粉碎し、吸引濾過し、水で洗浄した。乾燥して生成物 (240 mg、理論値の62%) を得た。

^1H -NMR: [DMSO] 0.25 (m, 2H); 0.46 (m, 2H); 1.04 (m, 1H); 3.20 (t, 2H); 8.55 (s, 1H); 8.82 (t, br, 1H); 13.6 (br, 1H)。

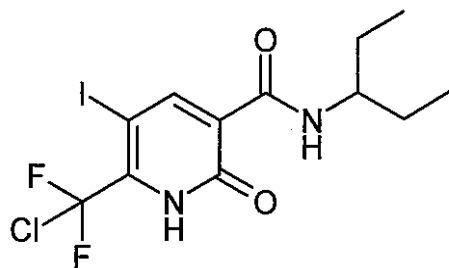
40

【0183】

〔実施例A15〕

6 - [クロロ (ジフルオロ) メチル] - N - (1 - エチルプロピル) - 5 - ヨード - 2 - オキソ - 1, 2 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド

【化 28】



A 15.1) 6-[クロロ(ジフルオロ)メチル]-5-ヨード-2-オキソ-1,2-ジヒドロピリジン-3-カルボン酸メチル 10

6-[クロロ(ジフルオロ)メチル]-2-オキソ-1,2-ジヒドロピリジンカルボン酸メチル(10.0g、42.1mmol)をN,N-ジメチルホルムアミド(50ml)に溶解し、そして炭酸カルシウム(6.32g、63.1mmol)及びヨウ素(20.5g、126mmol)を室温で加えた。50℃で6時間撹拌した後、反応混合物に水を加えたところこれにより無色の沈殿物が生成し、それを重炭酸ナトリウムの希薄水溶液及び水で洗浄した。吸引濾過し、乾燥して、生成物(13.6g、理論値の89%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$: [DMSO] 3.84(s, 3H); 8.61(s, 1H); 12.6(s, br, 1H)。 20

【0184】

A 15.2) 6-[クロロ(ジフルオロ)メチル]-N-(1-エチルプロピル)-5-ヨード-2-オキソ-1,2-ジヒドロピリジン-3-カルボキサミド

室温で、6-[クロロ(ジフルオロ)メチル]-5-ヨード-2-オキソ-1,2-ジヒドロピリジン-3-カルボン酸メチル(400mg、1.1mmol)をアセトニトリル(5ml)に溶解し、そして3-ペンチルアミン(0.5ml)と一緒に12時間撹拌した。その後反応混合物に1Nの塩酸を加え、そして生成した沈殿物を吸引濾過し、水で洗浄した。乾燥して、生成物(370mg、理論値の72%)を得た。

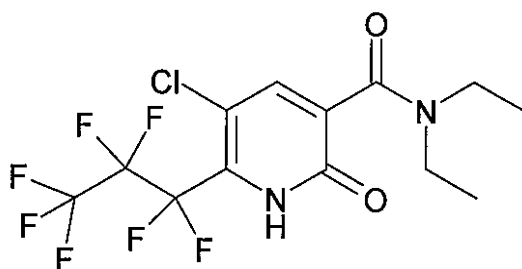
$^1\text{H-NMR}$: [DMSO] 0.87(t, 6H); 1.43(m, 2H); 1.55(m, 2H); 3.78(m, 1H); 8.55(br, 1H); 8.67(s, 1H); 13.5(br, 1H)。 30

【0185】

【実施例 A 16】

5-クロロ-N,N-ジエチル-6-(ヘプタフルオロプロピル)-2-オキソ-1,2-ジヒドロピリジン-3-カルボキサミド

【化 29】



A 16.1) 5-クロロ-6-(ヘプタフルオロプロピル)-2-オキソ-1,2-ジヒドロピリジン-3-カルボン酸メチル 40

6-(ヘプタフルオロプロピル)-2-オキソ-1,2-ジヒドロピリジン-3-カルボン酸メチル(16.7g、52mmol)をN,N-ジメチルホルムアミド(160ml)に溶解し、N-クロロスクシンイミド(7.08g、52mmol)を室温で加えた 50

。50 で3時間撹拌した後、反応混合物に水を加え、酢酸エチルで繰り返し抽出した。その後有機相を分離し、水で洗浄し、乾燥した。得られた粗生成物を分取型RP-HPLCで精製した。これにより、生成物(10.1g、理論値の54%)を無色の粉末として得た。

$^1\text{H-NMR}$: [DMSO] 3.85 (s, 3H); 8.35 (s, 1H); 12.8 (s, br, 1H)。

【0186】

A16.2) 5-クロロ-6-(ヘプタフルオロプロピル)-2-オキソ-1,2-ジヒドロピリジン-3-カルボン酸

5-クロロ-6-(ヘプタフルオロプロピル)-2-オキソ-1,2-ジヒドロピリジン-3-カルボン酸メチル(1.54g、4.33mmol)をメタノール(23ml)に溶解し、水(13ml)中水酸化リチウム(0.16g、6.5mmol)の溶液を加えた。還流下で2時間加熱した後、メタノールを蒸発させ、残留した水溶液をジクロロメタンで洗浄した。その後水相を2Nの塩酸で酸性にし、ジクロロメタンで抽出した。抽出物を乾燥し、濃縮して、茶色を帯びた粉末(1.45g、理論値の98%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$: [DMSO] 8.30 (s, 1H)。

【0187】

A16.3) 5-クロロ-N,N-ジエチル-6-(ヘプタフルオロプロピル)-2-オキソ-1,2-ジヒドロピリジン-3-カルボキサミド

5-クロロ-6-(ヘプタフルオロプロピル)-2-オキソ-1,2-ジヒドロピリジン-3-カルボン酸(355mg、1.04mmol)をテトラヒドロフラン(30ml)に溶解し、そしてN,N-カルボニルジイミダゾール(337mg、2.08mmol)を加えた後、混合物を当初は室温で30分間、その後還流下で30分間撹拌した。ジエチルアミン(152mg、0.22ml、2.08mmol)を加え、混合物を還流下で更に2時間加熱した。溶液を蒸発乾固し、その後ジクロロメタンに溶解し、1Nの塩酸及び水で洗浄し、乾燥し、濃縮した。これにより、生成物(300mg、理論値の72%)を得た。

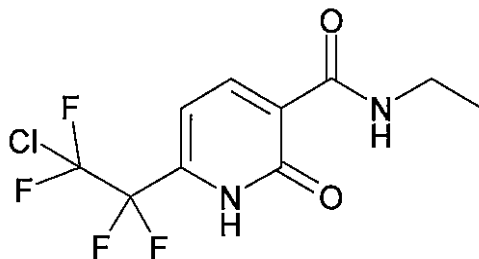
$^1\text{H-NMR}$: [DMSO] 1.03 (t, 3H); 1.15 (t, 3H); 3.12 (q, 2H); 3.45 (q, 2H); 8.05 (s, 1H); 12.5 (br, 1H)。

【0188】

〔実施例A17〕

6-(2-クロロ-1,1,2,2-テトラフルオロエチル)-N-エチル-2-オキソ-1,2-ジヒドロピリジン-3-カルボキサミド

【化30】



A17.1) 1-ブトキシ-5-クロロ-4,4,5,5-テトラフルオロペンタ-1-エン-3-オン

クロロホルム(20ml)に溶解した3-クロロテトラフルオロプロピオニルクロリド(10.0g、50.2mmol)を、0 でクロロホルム(80ml)中のピリジン(3.97g、50.2mmol)及びブチルビニルエーテル(5.03g、50.2mmol)の混合物に撹拌しつつ加えた。添加後、撹拌を室温で更に15時間継続した。水(100ml)を混合物に加え、そして有機相を分離し、乾燥し、濃縮した。これにより、

黄色を帯びた油状物質 (10.4 g、理論値の78%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$: [CDCl_3] 0.96 (t, 3H); 1.43 (m, 2H); 1.75 (m, 2H); 4.04 (t, 2H); 5.97 (d, 1H); 7.91 (d, 1H)。

【0189】

A17.2) 6-(2-クロロ-1,1,2,2-テトラフルオロエチル)-2-オキソ-1,2-ジヒドロピリジン-3-カルボン酸メチル

ナトリウム (0.32 g、13.7 mmol) をメタノール (50 ml) に溶解し、1-ブトキシ-5-クロロペンタ-1-エン-3-オン (3.0 g、11.4 mmol) 及びマロン酸メチルモノアミド (1.34 g、11.4 mmol) を加え、そして混合物を還流下で6時間加熱した。混合物を約30 mlになるまで濃縮し、1Nの塩酸 (50 ml) を加え、引き続いて混合物を酢酸エチルで繰り返し抽出した。乾燥し、濃縮した後、得られた残留物を酢酸エチルに溶解し、濾過した。濾液を濃縮して黄色を帯びた粉末 (1.74 g、理論値の52%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$: [DMSO] 3.84 (s, 3H); 7.44 (d, 1H); 8.32 (d, 1H); 12.4 (br, 1H)。

【0190】

A17.3) 6-(2-クロロ-1,1,2,2-テトラフルオロエチル)-N-エチル-2-オキソ-1,2-ジヒドロピリジン-3-カルボキサミド

室温で、6-(2-クロロ-1,1,2,2-テトラフルオロエチル)-2-オキソ-1,2-ジヒドロピリジン-3-カルボン酸メチル (300 mg、1.04 mmol) を、エチルアミンの水溶液 (5 ml、70%) 中で14時間撹拌した。その後 pH を1Nの塩酸を加えて2に調整し、そして混合物をジクロロメタンで抽出した。抽出物を乾燥し、濃縮して、生成物 (310 mg、理論値の98%) を得た。

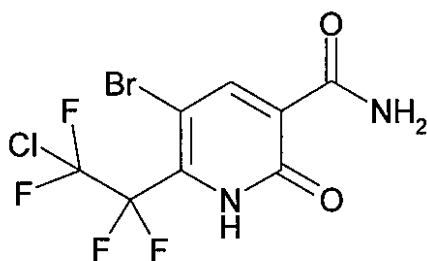
$^1\text{H-NMR}$: [CDCl_3] 1.27 (t, 3H); 3.50 (m, 2H); 6.88 (d, 1H); 8.68 (d, 1H); 9.32 (br, 1H); 12.6 (br, 1H)。

【0191】

【実施例 A18】

5-ブromo-6-(2-クロロ-1,1,2,2-テトラフルオロエチル)-2-オキソ-1,2-ジヒドロピリジン-3-カルボキサミド

【化31】



A18.1) 6-(2-クロロ-1,1,2,2-テトラフルオロエチル)-2-オキソ-1,2-ジヒドロピリジン-3-カルボキサミド

ナトリウム (0.53 g、22.8 mmol) をメタノール (50 ml) に溶解し、1-ブトキシ-5-クロロ-4,4,5,5-テトラフルオロペンタ-1-エン-3-オン (5.0 g、19.0 mmol) 及びマロンアミド (2.0 g、19.0 mmol) を加え、そして混合物を還流下で6時間加熱した。混合物を濃縮し、その後1Nの塩酸を加えた。得られた沈殿物を吸引濾過し、乾燥した。これにより、茶色を帯びた粉末 (3.8 g、理論値の73%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$: [DMSO] 7.42 (br, 1H); 8.10 (br, 1H); 8.40 (br, 1H); 8.46 (d, 1H); 13.6 (br, 1H)。

【0192】

A 18.2) 5-ブromo-6-(2-クロロ-1,1,2,2-テトラフルオロエチル)-2-オキソ-1,2-ジヒドロピリジン-3-カルボキサミド

6-(2-クロロ-1,1,2,2-テトラフルオロエチル)-2-オキソ-1,2-ジヒドロピリジン-3-カルボキサミド(0.49 g、1.8 mmol)をN,N-ジメチルホルムアミド(5 ml)に溶解し、N-ブromosクシンイミド(0.48 g、2.7 mmol)を室温で加えた。室温で2時間攪拌した後、反応混合物を水に注ぎ、沈殿物を生成させた。吸引濾過し、水で洗浄し、乾燥して、生成物(610 mg、理論値の96%)を黄色を帯びた粉末として得た。

¹H-NMR: [DMSO] 8.25 (br, 1H); 8.35 (br, 1H); 8.61 (s, 1H); 13.7 (br, 1H)。

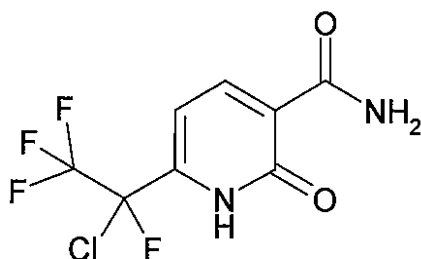
10

【0193】

〔実施例A19〕

6-(1-クロロ-1,2,2,2-テトラフルオロエチル)-2-オキソ-1,2-ジヒドロピリジン-3-カルボキサミド

【化32】



20

A 19.1) 1-ブトキシ-4-クロロ-4,5,5,5-テトラフルオロペンタ-1-エン-3-オン

2-クロロテトラフルオロプロピニルクロリド(9.59 g、48.2 mmol)を、0 で攪拌しつつ、滴下しながら、ジクロロメタン(75 ml)中ピリジン(4.19 g、50.0 mmol)及びブチルビニルエーテル(4.83 g、48.2 mmol)の混合物に加えた。添加後、攪拌を室温で更に15時間継続した。その後混合物を1Nの塩酸及び水(2×100 ml)で洗浄し、そして有機相を分離し、乾燥し、濃縮した。これにより褐色の油状物質(6.33 g、理論値の50%)を得た。

30

¹H-NMR: [CDCl₃] 0.97 (t, 3H); 1.48 (m, 2H); 1.75 (m, 2H); 4.03 (t, 2H); 5.98 (d, 1H); 7.89 (d, 1H)。

【0194】

A 19.2) 6-(1-クロロ-1,2,2,2-テトラフルオロエチル)-2-オキソ-1,2-ジヒドロピリジン-3-カルボキサミド

ナトリウム(0.33 g、14.4 mmol)をメタノール(50 ml)に溶解し、1-ブトキシ-4-クロロ-4,5,5,5-テトラフルオロペンタ-1-エン-3-オン(3.16 g、12.03 mmol)及びマロンアミド(1.27 g、12.03 mmol)を加え、そして混合物を還流下で7時間加熱した。混合物を濃縮し、その後1Nの塩酸を加えた。得られた沈殿物を吸引濾過し、乾燥した。これにより、黄色を帯びた粉末(380 mg、理論値の12%)を得た。

40

¹H-NMR: [DMSO] 7.45 (d, 1H); 8.14 (br, 1H); 8.42 (br, 1H); 8.48 (d, 1H); 13.7 (br, 1H)。

【0195】

典型的な方法で、以下の表1に、上記の実施例A1～A10及び更に上記した方法と類似の手法で得ることができる、一般式(I)の多数の化合物をリストアップする。

【0196】

この表において、

Bu = ブチル;

50

E t = エチル ;
M e = メチル ;
P h = フェニル ;
P r = プロピル ;
i = イソ ;
s = 第二級 ;
t = 第三級 ;
c = シクロ ;

である。

これは、同様に以下の混成用語：

i P r = イソプロピル ;
i B u = イソブチル ;
s B u = s e c - ブチル ;
t B u = t e r t - ブチル ;
c P r = シクロプロピル ;
c ペンチル = シクロペンチル ;
c ヘキシル = シクロヘキシル ;

にも適用される。

【 0 1 9 7 】

アルキル基が更に特定されずに表にリストアップされる場合、当該の基は直鎖状のアルキル基、即ち、例えば、B u = n - B u = n - ブチルである。

【 0 1 9 8 】

この表において、式のインデックスは、下付き文字ではなく、原子記号と同じ高さ及びフォントサイズで配列される。

【 0 1 9 9 】

例えば、表中における式 C F ₃ は、下付きインデックスを有する通常の表記法に従う式 C F ₃ に対応し、又は式 C H ₂ C H (C H ₂ C H ₃) ₂ は、下付きインデックスを有する式 C H ₂ C H (C H ₂ C H ₃) ₂ に対応する。

【 0 2 0 0 】

式 (I) の幾つかの化合物に対して、物理化学的データ (一般には、¹H - N M R データ) が表 2 にリストアップされている。この場合、データは、表 1 に従う実施例の数字を経由してその化合物に帰属する。

【 0 2 0 1 】

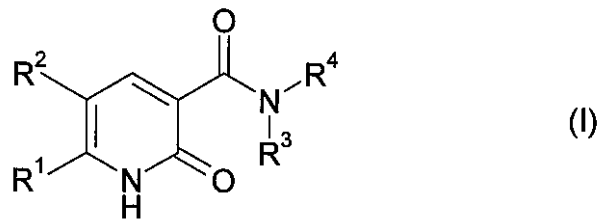
10

20

30

【表 1】

表 1 : 式 (I) の化合物



実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1	CF ₃	H	H	Me
2	CF ₃	H	H	Et
3	CF ₃	H	H	Pr
4	CF ₃	H	H	iPr
5	CF ₃	H	H	cPr
6	CF ₃	H	H	Bu
7	CF ₃	H	H	cBu
8	CF ₃	H	H	tBu
9	CF ₃	H	Me	Me
10	CF ₃	H	Me	Et
11	CF ₃	H	Me	Bu
12	CF ₃	H	Me	Pr
13	CF ₃	H	Me	iPr
14	CF ₃	H	Et	Et
15	CF ₃	H	Et	Pr
16	CF ₃	H	Et	iPr
17	CF ₃	H	Pr	Pr
18	CF ₃	H	H	c ペンチル
19	CF ₃	H	H	c ヘキシル

【表 2】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
20	CF ₃	H	H	CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₃
21	CF ₃	H	H	CH ₂ (CH ₂) ₄ CH ₃
22	CF ₃	H	H	CH ₂ -cPr
23	CF ₃	H	H	CH ₂ -CN
24	CF ₃	H	H	CH ₂ -C(CH ₃) ₃
25	CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₂ CF ₃
26	CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃
27	CF ₃	H	H	CH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃
28	CF ₃	H	H	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
29	CF ₃	H	H	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂ F
30	CF ₃	H	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
31	CF ₃	H	H	CH ₂ CH(CH ₂ CH ₃) ₂
32	CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
33	CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
34	CF ₃	H	H	CH ₂ CH=CH ₂
35	CF ₃	H	Me	CH ₂ CH=CH ₂
36	CF ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂
37	CF ₃	H	H	CH ₂ CH=CHCH ₃
38	CF ₃	H	H	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂
39	CF ₃	H	H	CH ₂ -C≡CH
40	CF ₃	H	Me	CH ₂ -C≡CH
41	CF ₃	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
42	CF ₃	H	H	CH(CH ₃).cPr
43	CF ₃	H	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CH ₃

【表 3】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
44	CF ₃	H	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₄ CH ₃
45	CF ₃	H	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₅ CH ₃
46	CF ₃	H	H	CH(CH ₂ CH ₃)(CH ₂) ₃ CH ₃
47	CF ₃	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH(CH ₃) ₂
48	CF ₃	H	H	CH(CH ₃)C(CH ₃) ₃
49	CF ₃	H	H	CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
50	CF ₃	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
51	CF ₃	H	H	CH(CH ₂ CH ₃) ₂
52	CF ₃	H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ CH ₃
53	CF ₃	H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
54	CF ₃	H	H	CH ₂ -CH(OMe) ₂
55	CF ₃	H	H	CH ₂ -CH(OEt) ₂
56	CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ -OH
57	CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ -OMe
58	CF ₃	H	Me	CH ₂ CH ₂ -OMe
59	CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ -OEt
60	CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ -SMe
61	CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ -CN
62	CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ -NMe ₂
63	CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ -ホルリン-4-イル
64	CF ₃	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ -OMe
65	CF ₃	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ -NMe ₂
66	CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OMe
67	CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -SMe

【表 4】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
68	CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OEt
69	CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OiPr
70	CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OBu
71	CF ₃	H	H	CH ₂ -COOCH ₃
72	CF ₃	H	Me	CH ₂ -COOCH ₃
73	CF ₃	H	H	CH(CH ₃)COOMe
74	CF ₃	H	H	CH(CH ₃)COOEt
75	CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ -COOCH ₃
76	CF ₃	H	H	CH(COOCH ₃) ₂
77	CF ₃	H	H	CH(COOEt)CH ₂ -CH(CH ₃) ₂
78	CF ₃	H	H	CH(COOMe)CH(CH ₃) ₂
79	CF ₃	H	H	O-CH ₂ CH ₃
80	CF ₃	H	Me	O-CH ₃
81	CF ₃	H	H	O-CH ₂ CH=CH ₂
82	CF ₃	H	H	O-tBu
83	CF ₃	H	H	O-Pr
84	CF ₃	H	H	O-CH ₂ cPr
85	CF ₃	H	H	O-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
86	CF ₃	H	H	O-CH ₂ CF ₃
87	CF ₃	H	H	O-CH(CH ₃)cPr
88	CF ₃	H	H	O-CH ₂ CH ₂ Cl
89	CF ₃	H	H	O-CH ₂ C≡CH
90	CF ₃	H	H	O-CH ₂ C≡CCH ₃
91	CF ₃	H	H	O-CH(CH ₃)C≡CH

【表 5】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
92	CF ₃	H	H	CH ₂ -Ph
93	CF ₃	H	Me	CH ₂ -Ph
94	CF ₃	H	H	CH ₂ - β -リジン-3-イル
95	CF ₃	H	H	CH ₂ -6-Cl- β -リジン-3-イル
96	CF ₃	H	H	CH(CH ₃)Ph
97	CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ -Ph
98	CF ₃	H	H	CH ₂ -2-CF ₃ -Ph
99	CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ CHPh ₂
100	CF ₃	H	モルホリン-4-イル	
101	CF ₃	H	β - β -リジン-1-イル	
102	CF ₃	H	チアゾリジン-3-イル	
103	CF ₃	H	β - β -リジン-1-イル	
104	CF ₃	H	2-メチル β - β -リジン-1-イル	
105	CF ₃	H	=CH-N(CH ₃) ₂	
106	CF ₃	H	=C(CH ₃)N(CH ₃) ₂	
107	CF ₃	H	=CH-N(C ₂ H ₅) ₂	
108	CF ₃	H	=C(CH ₃)N(C ₂ H ₅) ₂	
109	CF ₃	H	=CH- β - β -リジン	
110	CF ₃	H	=CH-モルホリン	
111	CF ₃	H	=CH- β - β -リジン	
112	CF ₃	H	H	インダゾ-1-イル
113	CF ₃	H	H	テトラヒドロフラン-2-イルメチル
114	CF ₂ Cl	H	H	H
115	CF ₂ Cl	H	H	Me

【表 6】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
116	CF ₂ Cl	H	H	Et
117	CF ₂ Cl	H	H	Pr
118	CF ₂ Cl	H	H	iPr
119	CF ₂ Cl	H	H	cPr
120	CF ₂ Cl	H	H	Bu
121	CF ₂ Cl	H	H	cBu
122	CF ₂ Cl	H	H	tBu
123	CF ₂ Cl	H	Me	Me
124	CF ₂ Cl	H	Me	Et
125	CF ₂ Cl	H	Me	Bu
126	CF ₂ Cl	H	Me	Pr
127	CF ₂ Cl	H	Me	iPr
128	CF ₂ Cl	H	Et	Et
129	CF ₂ Cl	H	Et	Pr
130	CF ₂ Cl	H	Et	iPr
131	CF ₂ Cl	H	Pr	Pr
132	CF ₂ Cl	H	H	cペンチル
133	CF ₂ Cl	H	H	cヘキシル
134	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₃
135	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ (CH ₂) ₄ CH ₃
136	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ -cPr
137	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ -CN
138	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ -C(CH ₃) ₃
139	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CF ₂ CF ₃

【表 7】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
140	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CF ₃
141	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃
142	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
143	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂ F
144	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
145	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH(CH ₂ CH ₃) ₂
146	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
147	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
148	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH=CH ₂
149	CF ₂ Cl	H	Me	CH ₂ CH=CH ₂
150	CF ₂ Cl	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂
151	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH=CHCH ₃
152	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂
153	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ -C≡CH
154	CF ₂ Cl	H	Me	CH ₂ -C≡CH
155	CF ₂ Cl	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
156	CF ₂ Cl	H	H	CH(CH ₃)cPr
157	CF ₂ Cl	H	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CH ₃
158	CF ₂ Cl	H	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₄ CH ₃
159	CF ₂ Cl	H	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₅ CH ₃
160	CF ₂ Cl	H	H	CH(CH ₂ CH ₃)(CH ₂) ₃ CH ₃
161	CF ₂ Cl	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH(CH ₃) ₂
162	CF ₂ Cl	H	H	CH(CH ₃)C(CH ₃) ₃
163	CF ₂ Cl	H	H	CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂

【表 8】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
164	CF ₂ Cl	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
165	CF ₂ Cl	H	H	CH(CH ₂ CH ₃) ₂
166	CF ₂ Cl	H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ CH ₃
167	CF ₂ Cl	H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
168	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ -CH(OMe) ₂
169	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ -CH(OEt) ₂
170	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH ₂ -OH
171	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH ₂ -OMe
172	CF ₂ Cl	H	Me	CH ₂ CH ₂ -OMe
173	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH ₂ -OEt
174	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH ₂ -SMe
175	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH ₂ -CN
176	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH ₂ -NMe ₂
177	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH ₂ -ホルリン-4-イル
178	CF ₂ Cl	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ -OMe
179	CF ₂ Cl	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ -NMe ₂
180	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OMe
181	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -SMe
182	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OEt
183	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OiPr
184	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OBu
185	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ -COOCH ₃
186	CF ₂ Cl	H	Me	CH ₂ -COOCH ₃
187	CF ₂ Cl	H	H	CH(CH ₃)COOMe

【表 9】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
188	CF ₂ Cl	H	H	CH(CH ₃)COOEt
189	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH ₂ -COOCH ₃
190	CF ₂ Cl	H	H	CH(COOCH ₃) ₂
191	CF ₂ Cl	H	H	CH(COOEt)CH ₂ -CH(CH ₃) ₂
192	CF ₂ Cl	H	H	CH(COOMe)CH(CH ₃) ₂
193	CF ₂ Cl	H	H	O-CH ₂ CH ₃
194	CF ₂ Cl	H	H	O-CH ₃
195	CF ₂ Cl	H	H	O-CH ₂ CH=CH ₂
196	CF ₂ Cl	H	H	O-tBu
197	CF ₂ Cl	H	H	O-Pr
198	CF ₂ Cl	H	H	O-CH ₂ cPr
199	CF ₂ Cl	H	H	O-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
200	CF ₂ Cl	H	H	O-CH ₂ CF ₃
201	CF ₂ Cl	H	H	O-CH(CH ₃)cPr
202	CF ₂ Cl	H	H	O-CH ₂ CH ₂ Cl
203	CF ₂ Cl	H	H	O-CH ₂ C≡CH
204	CF ₂ Cl	H	H	O-CH ₂ C≡CCH ₃
205	CF ₂ Cl	H	H	O-CH(CH ₃)C≡CH
206	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ -Ph
207	CF ₂ Cl	H	Me	CH ₂ -Ph
208	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ - β -リジノン-3-イル
209	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ -6-Cl- β -リジノン-3-イル
210	CF ₂ Cl	H	H	CH(CH ₃)Ph
211	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH ₂ -Ph

【表 10】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
212	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ -2-CF ₃ -Ph
213	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH ₂ CHPh
214	CF ₂ Cl	H	ホルホルン-4-イル	
215	CF ₂ Cl	H	ヒ°ペリジソン-1-イル	
216	CF ₂ Cl	H	チアゾ°リジソン-3-イル	
217	CF ₂ Cl	H	ヒ°ポリジソン-1-イル	
218	CF ₂ Cl	H	2-メチルヒ°ポリジソン-1-イル	
219	CF ₂ Cl	H	=CH-N(CH ₃) ₂	
220	CF ₂ Cl	H	=C(CH ₃)N(CH ₃) ₂	
221	CF ₂ Cl	H	=CH-N(C ₂ H ₅) ₂	
222	CF ₂ Cl	H	=C(CH ₃)N(C ₂ H ₅) ₂	
223	CF ₂ Cl	H	=CH-ヒ°ペリジソン	
224	CF ₂ Cl	H	=CH-ホルホルン	
225	CF ₂ Cl	H	=CH-ヒ°ポリジソン	
226	CF ₂ Cl	H	H	インダ°ン-1-イル
227	CF ₂ Cl	H	H	テトラヒト°ロフラン-2-イルメチル
228	CHF ₂	H	H	H
229	CHF ₂	H	H	Me
230	CHF ₂	H	H	Et
231	CHF ₂	H	H	Pr
232	CHF ₂	H	H	iPr
233	CHF ₂	H	H	cPr
234	CHF ₂	H	H	Bu
235	CHF ₂	H	H	cBu

【表 1 1】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
236	CHF2	H	H	tBu
237	CHF2	H	Me	Me
238	CHF2	H	Me	Et
239	CHF2	H	Me	Bu
240	CHF2	H	Me	Pr
241	CHF2	H	Me	iPr
242	CHF2	H	Et	Et
243	CHF2	H	Et	Pr
244	CHF2	H	Et	iPr
245	CHF2	H	Pr	Pr
246	CHF2	H	H	cヘンチル
247	CHF2	H	H	cヘキシル
248	CHF2	H	H	CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₃
249	CHF2	H	H	CH ₂ (CH ₂) ₄ CH ₃
250	CHF2	H	H	CH ₂ -cPr
251	CHF2	H	H	CH ₂ -CN
252	CHF2	H	H	CH ₂ -C(CH ₃) ₃
253	CHF2	H	H	CH ₂ CF ₂ CF ₃
254	CHF2	H	H	CH ₂ CF ₃
255	CHF2	H	H	CH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃
256	CHF2	H	H	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
257	CHF2	H	H	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂ F
258	CHF2	H	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
259	CHF2	H	H	CH ₂ CH(CH ₂ CH ₃) ₂

【表 1 2】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
260	CHF2	H	H	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
261	CHF2	H	H	CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
262	CHF2	H	H	CH ₂ CH=CH ₂
263	CHF2	H	Me	CH ₂ CH=CH ₂
264	CHF2	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂
265	CHF2	H	H	CH ₂ CH=CHCH ₃
266	CHF2	H	H	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂
267	CHF2	H	H	CH ₂ -C≡CH
268	CHF2	H	Me	CH ₂ -C≡CH
269	CHF2	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
270	CHF2	H	H	CH(CH ₃)cPr
271	CHF2	H	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CH ₃
272	CHF2	H	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₄ CH ₃
273	CHF2	H	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₅ CH ₃
274	CHF2	H	H	CH(CH ₂ CH ₃)(CH ₂) ₃ CH ₃
275	CHF2	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH(CH ₃) ₂
276	CHF2	H	H	CH(CH ₃)C(CH ₃) ₃
277	CHF2	H	H	CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
278	CHF2	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
279	CHF2	H	H	CH(CH ₂ CH ₃) ₂
280	CHF2	H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ CH ₃
281	CHF2	H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
282	CHF2	H	H	CH ₂ -CH(OMe) ₂
283	CHF2	H	H	CH ₂ -CH(OEt) ₂

【表 1 3】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
284	CHF2	H	H	CH ₂ CH ₂ -OH
285	CHF2	H	H	CH ₂ CH ₂ -OMe
286	CHF2	H	H	CH ₂ CH ₂ -OEt
287	CHF2	H	H	CH ₂ CH ₂ -SMe
288	CHF2	H	H	CH ₂ CH ₂ -CN
289	CHF2	H	H	CH ₂ CH ₂ -NMe ₂
290	CHF2	H	H	CH ₂ CH ₂ -ホルホン-4-イル
291	CHF2	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ -OMe
292	CHF2	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ -NMe ₂
293	CHF2	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OMe
294	CHF2	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -SMe
295	CHF2	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OEt
296	CHF2	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OiPr
297	CHF2	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OBu
298	CHF2	H	H	CH ₂ -COOCH ₃
299	CHF2	H	Me	CH ₂ -COOCH ₃
300	CHF2	H	H	CH(CH ₃)COOMe
301	CHF2	H	H	CH(CH ₃)COOEt
302	CHF2	H	H	CH ₂ CH ₂ -COOCH ₃
303	CHF2	H	H	CH(COOCH ₃) ₂
304	CHF2	H	H	CH(COOEt)CH ₂ -CH(CH ₃) ₂
305	CHF2	H	H	CH(COOMe)CH(CH ₃) ₂
306	CHF2	H	H	O-CH ₂ CH ₃
307	CHF2	H	H	O-CH ₃

【表 1 4】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
308	CHF2	H	H	O-CH ₂ CH=CH ₂
309	CHF2	H	H	O-tBu
310	CHF2	H	H	O-Pr
311	CHF2	H	H	O-CH ₂ cPr
312	CHF2	H	H	O-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
313	CHF2	H	H	O-CH ₂ CF ₃
314	CHF2	H	H	O-CH(CH ₃)cPr
315	CHF2	H	H	O-CH ₂ CH ₂ Cl
316	CHF2	H	H	O-CH ₂ C≡CH
317	CHF2	H	H	O-CH ₂ C≡CCH ₃
318	CHF2	H	H	O-CH(CH ₃)C≡CH
319	CHF2	H	H	CH ₂ -Ph
320	CHF2	H	Me	CH ₂ -Ph
321	CHF2	H	H	CH ₂ -ヒ° リジ°ン-3-イル
322	CHF2	H	H	CH ₂ -6-Cl-ヒ° リジ°ン-3-イル
323	CHF2	H	H	CH(CH ₃)Ph
324	CHF2	H	H	CH ₂ CH ₂ -Ph
325	CHF2	H	H	CH ₂ -2-CF ₃ -Ph
326	CHF2	H	H	CH ₂ CH ₂ CHPh
327	CHF2	H	モルホリン-4-イル	
328	CHF2	H	ヒ° ペ° リジ°ン-1-イル	
329	CHF2	H	チアゾ° リジ°ン-3-イル	
330	CHF2	H	ヒ° ロリジ°ン-1-イル	
331	CHF2	H	2-メチルヒ° ロリジ°ン-1-イル	

【表 15】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
332	CHF2	H	=CH-N(CH3)2	
333	CHF2	H	=C(CH3)N(CH3)2	
334	CHF2	H	=CH-N(C2H5)2	
335	CHF2	H	=C(CH3)N(C2H5)2	
336	CHF2	H	=CH-ヒ°ペ°リジ°ン	
337	CHF2	H	=CH-モルホリン	
338	CHF2	H	=CH-ヒ°ロリジ°ン	
339	CHF2	H	H	インダ°ン-1-イル
340	CHF2	H	H	テトラヒト°ロフレン-2-イルメチル
341	CF2CF3	H	H	H
342	CF2CF3	H	H	Me
343	CF2CF3	H	H	Et
344	CF2CF3	H	H	Pr
345	CF2CF3	H	H	iPr
346	CF2CF3	H	H	cPr
347	CF2CF3	H	H	Bu
348	CF2CF3	H	H	cBu
349	CF2CF3	H	H	tBu
350	CF2CF3	H	Me	Me
351	CF2CF3	H	Me	Et
352	CF2CF3	H	Me	Bu
353	CF2CF3	H	Me	Pr
354	CF2CF3	H	Me	iPr
355	CF2CF3	H	Et	Et

【表 16】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
356	CF ₂ CF ₃	H	Et	Pr
357	CF ₂ CF ₃	H	Et	iPr
358	CF ₂ CF ₃	H	Pr	Pr
359	CF ₂ CF ₃	H	H	c ⁶ ベンチル
360	CF ₂ CF ₃	H	H	c ⁶ ヘキシル
361	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₃
362	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ (CH ₂) ₄ CH ₃
363	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ -cPr
364	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ -CN
365	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ -C(CH ₃) ₃
366	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₂ CF ₃
367	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃
368	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃
369	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
370	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂ F
371	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
372	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ CH(CH ₂ CH ₃) ₂
373	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
374	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
375	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ CH=CH ₂
376	CF ₂ CF ₃	H	Me	CH ₂ CH=CH ₂
377	CF ₂ CF ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂
378	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ CH=CHCH ₃
379	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂

【表 17】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
380	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ -C≡CH
381	CF ₂ CF ₃	H	Me	CH ₂ -C≡CH
382	CF ₂ CF ₃	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
383	CF ₂ CF ₃	H	H	CH(CH ₃)cPr
384	CF ₂ CF ₃	H	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CH ₃
385	CF ₂ CF ₃	H	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₄ CH ₃
386	CF ₂ CF ₃	H	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₅ CH ₃
387	CF ₂ CF ₃	H	H	CH(CH ₂ CH ₃)(CH ₂) ₃ CH ₃
388	CF ₂ CF ₃	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH(CH ₃) ₂
389	CF ₂ CF ₃	H	H	CH(CH ₃)C(CH ₃) ₃
390	CF ₂ CF ₃	H	H	CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
391	CF ₂ CF ₃	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
392	CF ₂ CF ₃	H	H	CH(CH ₂ CH ₃) ₂
393	CF ₂ CF ₃	H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ CH ₃
394	CF ₂ CF ₃	H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
395	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ -CH(OMe) ₂
396	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ -CH(OEt) ₂
397	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ -OH
398	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ -OMe
399	CF ₂ CF ₃	H	Me	CH ₂ CH ₂ -OMe
400	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ -OEt
401	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ -SMe
402	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ -CN
403	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ -NMe ₂

【表 18】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
404	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ -ホルリソ-4-イル
405	CF ₂ CF ₃	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ -OMe
406	CF ₂ CF ₃	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ -NMe ₂
407	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OMe
408	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -SMe
409	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OEt
410	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OiPr
411	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OBu
412	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ -COOCH ₃
413	CF ₂ CF ₃	H	Me	CH ₂ -COOCH ₃
414	CF ₂ CF ₃	H	H	CH(CH ₃)COOMe
415	CF ₂ CF ₃	H	H	CH(CH ₃)COOEt
416	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ -COOCH ₃
417	CF ₂ CF ₃	H	H	CH(COOCH ₃) ₂
418	CF ₂ CF ₃	H	H	CH(COOEt)CH ₂ -CH(CH ₃) ₂
419	CF ₂ CF ₃	H	H	CH(COOMe)CH(CH ₃) ₂
420	CF ₂ CF ₃	H	H	O-CH ₂ CH ₃
421	CF ₂ CF ₃	H	H	O-CH ₃
422	CF ₂ CF ₃	H	H	O-CH ₂ CH=CH ₂
423	CF ₂ CF ₃	H	H	O-tBu
424	CF ₂ CF ₃	H	H	O-Pr
425	CF ₂ CF ₃	H	H	O-CH ₂ cPr
426	CF ₂ CF ₃	H	H	O-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
427	CF ₂ CF ₃	H	H	O-CH ₂ CF ₃

【表 19】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
428	CF ₂ CF ₃	H	H	O-CH(CH ₃)cPr
429	CF ₂ CF ₃	H	H	O-CH ₂ CH ₂ Cl
430	CF ₂ CF ₃	H	H	O-CH ₂ C≡CH
431	CF ₂ CF ₃	H	H	O-CH ₂ C≡CCH ₃
432	CF ₂ CF ₃	H	H	O-CH(CH ₃)C≡CH
433	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ -Ph
434	CF ₂ CF ₃	H	Me	CH ₂ -Ph
435	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ -ヒ° リジ°ン-3-イル
436	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ -6-Cl-ヒ° リジ°ン-3-イル
437	CF ₂ CF ₃	H	H	CH(CH ₃)Ph
438	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ -Ph
439	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ -2-CF ₃ -Ph
440	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ CHPh
441	CF ₂ CF ₃	H	モルホリン-4-イル	
442	CF ₂ CF ₃	H	ヒ° ペ° リジ°ン-1-イル	
443	CF ₂ CF ₃	H	チアゾ° リジ°ン-3-イル	
444	CF ₂ CF ₃	H	ヒ° ロリジ°ン-1-イル	
445	CF ₂ CF ₃	H	2-メチルヒ° ロリジ°ン-1-イル	
446	CF ₂ CF ₃	H	=CH-N(CH ₃) ₂	
447	CF ₂ CF ₃	H	=C(CH ₃)N(CH ₃) ₂	
448	CF ₂ CF ₃	H	=CH-N(C ₂ H ₅) ₂	
449	CF ₂ CF ₃	H	=C(CH ₃)N(C ₂ H ₅) ₂	
450	CF ₂ CF ₃	H	=CH-ヒ° ペ° リジ°ン	
451	CF ₂ CF ₃	H	=CH-モルホリン	

【表 20】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
452	CF ₂ CF ₃	H	=CH-ビ ^o ロリジ ⁿ ン	
453	CF ₂ CF ₃	H	H	インダ ⁿ ン-1-イル
454	CF ₂ CF ₃	H	H	テトラヒト ^o ロフラン-2-イルメチル
455	CF ₃	Cl	H	H
456	CF ₃	Cl	H	Me
457	CF ₃	Cl	H	Et
458	CF ₃	Cl	H	Pr
459	CF ₃	Cl	H	iPr
460	CF ₃	Cl	H	cPr
461	CF ₃	Cl	H	Bu
462	CF ₃	Cl	H	cBu
463	CF ₃	Cl	H	tBu
464	CF ₃	Cl	Me	Me
465	CF ₃	Cl	Me	Et
466	CF ₃	Cl	Me	Bu
467	CF ₃	Cl	Me	Pr
468	CF ₃	Cl	Me	iPr
469	CF ₃	Cl	Et	Et
470	CF ₃	Cl	Et	Pr
471	CF ₃	Cl	Et	iPr
472	CF ₃	Cl	Pr	Pr
473	CF ₃	Cl	H	c ^o ペンチル
474	CF ₃	Cl	H	c ^o ヘキシル
475	CF ₃	Cl	H	CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₃

【表 2 1】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
476	CF ₃	Cl	H	CH ₂ (CH ₂) ₄ CH ₃
477	CF ₃	Cl	H	CH ₂ -cPr
478	CF ₃	Cl	H	CH ₂ -CN
479	CF ₃	Cl	H	CH ₂ -C(CH ₃) ₃
480	CF ₃	Cl	H	CH ₂ CF ₂ CF ₃
481	CF ₃	Cl	H	CH ₂ CF ₃
482	CF ₃	Cl	H	CH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃
483	CF ₃	Cl	H	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
484	CF ₃	Cl	H	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂ F
485	CF ₃	Cl	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
486	CF ₃	Cl	H	CH ₂ CH(CH ₂ CH ₃) ₂
487	CF ₃	Cl	H	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
488	CF ₃	Cl	H	CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
489	CF ₃	Cl	H	CH ₂ CH=CH ₂
490	CF ₃	Cl	Me	CH ₂ CH=CH ₂
491	CF ₃	Cl	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂
492	CF ₃	Cl	H	CH ₂ CH=CHCH ₃
493	CF ₃	Cl	H	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂
494	CF ₃	Cl	H	CH ₂ -C≡CH
495	CF ₃	Cl	Me	CH ₂ -C≡CH
496	CF ₃	Cl	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
497	CF ₃	Cl	H	CH(CH ₃)cPr
498	CF ₃	Cl	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CH ₃
499	CF ₃	Cl	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₄ CH ₃

【表 2 2】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
500	CF ₃	Cl	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₅ CH ₃
501	CF ₃	Cl	H	CH(CH ₂ CH ₃)(CH ₂) ₃ CH ₃
502	CF ₃	Cl	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH(CH ₃) ₂
503	CF ₃	Cl	H	CH(CH ₃)C(CH ₃) ₃
504	CF ₃	Cl	H	CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
505	CF ₃	Cl	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
506	CF ₃	Cl	H	CH(CH ₂ CH ₃) ₂
507	CF ₃	Cl	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ CH ₃
508	CF ₃	Cl	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
509	CF ₃	Cl	H	CH ₂ -CH(OMe) ₂
510	CF ₃	Cl	H	CH ₂ -CH(OEt) ₂
511	CF ₃	Cl	H	CH ₂ CH ₂ -OH
512	CF ₃	Cl	H	CH ₂ CH ₂ -OMe
513	CF ₃	Cl	Me	CH ₂ CH ₂ -OMe
514	CF ₃	Cl	H	CH ₂ CH ₂ -OEt
515	CF ₃	Cl	H	CH ₂ CH ₂ -SMe
516	CF ₃	Cl	H	CH ₂ CH ₂ -CN
517	CF ₃	Cl	H	CH ₂ CH ₂ -NMe ₂
518	CF ₃	Cl	H	CH ₂ CH ₂ -ホルホン-4-イル
519	CF ₃	Cl	H	CH(CH ₃)CH ₂ -OMe
520	CF ₃	Cl	H	CH(CH ₃)CH ₂ -NMe ₂
521	CF ₃	Cl	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OMe
522	CF ₃	Cl	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -SMe
523	CF ₃	Cl	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OEt

【表 2 3】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
524	CF ₃	Cl	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OiPr
525	CF ₃	Cl	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OBu
526	CF ₃	Cl	H	CH ₂ -COOCH ₃
527	CF ₃	Cl	Me	CH ₂ -COOCH ₃
528	CF ₃	Cl	H	CH(CH ₃)COOMe
529	CF ₃	Cl	H	CH(CH ₃)COOEt
530	CF ₃	Cl	H	CH ₂ CH ₂ -COOCH ₃
531	CF ₃	Cl	H	CH(COOCH ₃) ₂
532	CF ₃	Cl	H	CH(COOEt)CH ₂ -CH(CH ₃) ₂
533	CF ₃	Cl	H	CH(COOMe)CH(CH ₃) ₂
534	CF ₃	Cl	H	O-CH ₂ CH ₃
535	CF ₃	Cl	Me	O-CH ₃
536	CF ₃	Cl	H	O-CH ₂ CH=CH ₂
537	CF ₃	Cl	H	O-tBu
538	CF ₃	Cl	H	O-Pr
539	CF ₃	Cl	H	O-CH ₂ cPr
540	CF ₃	Cl	H	O-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
541	CF ₃	Cl	H	O-CH ₂ CF ₃
542	CF ₃	Cl	H	O-CH(CH ₃)cPr
543	CF ₃	Cl	H	O-CH ₂ CH ₂ Cl
544	CF ₃	Cl	H	O-CH ₂ C≡CH
545	CF ₃	Cl	H	O-CH ₂ C≡CCH ₃
546	CF ₃	Cl	H	O-CH(CH ₃)C≡CH
547	CF ₃	Cl	H	CH ₂ -Ph

【表 2 4】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
548	CF ₃	Cl	Me	CH ₂ -Ph
549	CF ₃	Cl	H	CH ₂ -ヒ° リジ°ン-3-イル
550	CF ₃	Cl	H	CH ₂ -6-Cl-ヒ° リジ°ン-3-イル
551	CF ₃	Cl	H	CH(CH ₃)Ph
552	CF ₃	Cl	H	CH ₂ CH ₂ -Ph
553	CF ₃	Cl	H	CH ₂ -2-CF ₃ -Ph
554	CF ₃	Cl	H	CH ₂ CH ₂ CHPh ₂
555	CF ₃	Cl	モルホリ°ン-4-イル	
556	CF ₃	Cl	ヒ° ペ° リジ°ン-1-イル	
557	CF ₃	Cl	チアゾ° リジ°ン-3-イル	
558	CF ₃	Cl	ヒ° ポリジ°ン-1-イル	
559	CF ₃	Cl	2-メチルヒ° ポリジ°ン-1-イル	
560	CF ₃	Cl	=CH-N(CH ₃) ₂	
561	CF ₃	Cl	=C(CH ₃)N(CH ₃) ₂	
562	CF ₃	Cl	=CH-N(C ₂ H ₅) ₂	
563	CF ₃	Cl	=C(CH ₃)N(C ₂ H ₅) ₂	
564	CF ₃	Cl	=CH-ヒ° ペ° リジ°ン	
565	CF ₃	Cl	=CH-モルホリ°ン	
566	CF ₃	Cl	=CH-ヒ° ポリジ°ン	
567	CF ₃	Cl	H	インダ°ン-1-イル
568	CF ₃	Cl	H	テトラヒト° ロフテ°ン-2-イルメチル
569	CF ₂ Cl	Cl	H	H
570	CF ₂ Cl	Cl	H	Me
571	CF ₂ Cl	Cl	H	Et

【表 2 5】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
572	CF ₂ Cl	Cl	H	Pr
573	CF ₂ Cl	Cl	H	iPr
574	CF ₂ Cl	Cl	H	cPr
575	CF ₂ Cl	Cl	H	Bu
576	CF ₂ Cl	Cl	H	cBu
577	CF ₂ Cl	Cl	H	tBu
578	CF ₂ Cl	Cl	Me	Me
579	CF ₂ Cl	Cl	Me	Et
580	CF ₂ Cl	Cl	Me	Bu
581	CF ₂ Cl	Cl	Me	Pr
582	CF ₂ Cl	Cl	Me	iPr
583	CF ₂ Cl	Cl	Et	Et
584	CF ₂ Cl	Cl	Et	Pr
585	CF ₂ Cl	Cl	Et	iPr
586	CF ₂ Cl	Cl	Pr	Pr
587	CF ₂ Cl	Cl	H	cヘンチル
588	CF ₂ Cl	Cl	H	cヘキシル
589	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₃
590	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ (CH ₂) ₄ CH ₃
591	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ -cPr
592	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ -CN
593	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ -C(CH ₃) ₃
594	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ CF ₂ CF ₃
595	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ CF ₃

【表 2 6】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
596	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃
597	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
598	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂ F
599	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
600	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ CH(CH ₂ CH ₃) ₂
601	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
602	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
603	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ CH=CH ₂
604	CF ₂ Cl	Cl	Me	CH ₂ CH=CH ₂
605	CF ₂ Cl	Cl	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂
606	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ CH=CHCH ₃
607	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂
608	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ -C≡CH
609	CF ₂ Cl	Cl	Me	CH ₂ -C≡CH
610	CF ₂ Cl	Cl	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
611	CF ₂ Cl	Cl	H	CH(CH ₃)cPr
612	CF ₂ Cl	Cl	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CH ₃
613	CF ₂ Cl	Cl	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₄ CH ₃
614	CF ₂ Cl	Cl	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₅ CH ₃
615	CF ₂ Cl	Cl	H	CH(CH ₂ CH ₃)(CH ₂) ₃ CH ₃
616	CF ₂ Cl	Cl	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH(CH ₃) ₂
617	CF ₂ Cl	Cl	H	CH(CH ₃)C(CH ₃) ₃
618	CF ₂ Cl	Cl	H	CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
619	CF ₂ Cl	Cl	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂

10

20

30

40

【表 27】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
620	CF ₂ Cl	Cl	H	CH(CH ₂ CH ₃) ₂
621	CF ₂ Cl	Cl	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ CH ₃
622	CF ₂ Cl	Cl	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
623	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ -CH(OMe) ₂
624	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ -CH(OEt) ₂
625	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ CH ₂ -OH
626	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ CH ₂ -OMe
627	CF ₂ Cl	Cl	Me	CH ₂ CH ₂ -OMe
628	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ CH ₂ -OEt
629	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ CH ₂ -SMe
630	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ CH ₂ -CN
631	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ CH ₂ -NMe ₂
632	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ CH ₂ -ホルソン-4-イル
633	CF ₂ Cl	Cl	H	CH(CH ₃)CH ₂ -OMe
634	CF ₂ Cl	Cl	H	CH(CH ₃)CH ₂ -NMe ₂
635	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OMe
636	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -SMe
637	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OEt
638	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OiPr
639	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OBu
640	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ -COOCH ₃
641	CF ₂ Cl	Cl	Me	CH ₂ -COOCH ₃
642	CF ₂ Cl	Cl	H	CH(CH ₃)COOMe
643	CF ₂ Cl	Cl	H	CH(CH ₃)COOEt

【表 2 8】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
644	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ CH ₂ -COOCH ₃
645	CF ₂ Cl	Cl	H	CH(COOCH ₃) ₂
646	CF ₂ Cl	Cl	H	CH(COOEt)CH ₂ -CH(CH ₃) ₂
647	CF ₂ Cl	Cl	H	CH(COOMe)CH(CH ₃) ₂
648	CF ₂ Cl	Cl	H	O-CH ₂ CH ₃
649	CF ₂ Cl	Cl	H	O-CH ₃
650	CF ₂ Cl	Cl	H	O-CH ₂ CH=CH ₂
651	CF ₂ Cl	Cl	H	O-tBu
652	CF ₂ Cl	Cl	H	O-Pr
653	CF ₂ Cl	Cl	H	O-CH ₂ cPr
654	CF ₂ Cl	Cl	H	O-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
655	CF ₂ Cl	Cl	H	O-CH ₂ CF ₃
656	CF ₂ Cl	Cl	H	O-CH(CH ₃)cPr
657	CF ₂ Cl	Cl	H	O-CH ₂ CH ₂ Cl
658	CF ₂ Cl	Cl	H	O-CH ₂ C≡CH
659	CF ₂ Cl	Cl	H	O-CH ₂ C≡CCH ₃
660	CF ₂ Cl	Cl	H	O-CH(CH ₃)C≡CH
661	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ -Ph
662	CF ₂ Cl	Cl	Me	CH ₂ -Ph
663	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ -L-リジン-3-イル
664	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ -6-Cl-L-リジン-3-イル
665	CF ₂ Cl	Cl	H	CH(CH ₃)Ph
666	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ CH ₂ -Ph
667	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ -2-CF ₃ -Ph

【表 29】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
668	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ CH ₂ CHPh
669	CF ₂ Cl	Cl	モルホリン-4-イル	
670	CF ₂ Cl	Cl	ピペリジン-1-イル	
671	CF ₂ Cl	Cl	チアゾリジン-3-イル	
672	CF ₂ Cl	Cl	ピロリジン-1-イル	
673	CF ₂ Cl	Cl	2-メチルピロリジン-1-イル	
674	CF ₂ Cl	Cl	=CH-N(CH ₃) ₂	
675	CF ₂ Cl	Cl	=C(CH ₃)N(CH ₃) ₂	
676	CF ₂ Cl	Cl	=CH-N(C ₂ H ₅) ₂	
677	CF ₂ Cl	Cl	=C(CH ₃)N(C ₂ H ₅) ₂	
678	CF ₂ Cl	Cl	=CH-ピペリジン	
679	CF ₂ Cl	Cl	=CH-モルホリン	
680	CF ₂ Cl	Cl	=CH-ピロリジン	
681	CF ₂ Cl	Cl	H	インダール-1-イル
682	CF ₂ Cl	Cl	H	テトラヒドロフラン-2-イルメチル
683	CHF ₂	Cl	H	H
684	CHF ₂	Cl	H	Me
685	CHF ₂	Cl	H	Et
686	CHF ₂	Cl	H	Pr
687	CHF ₂	Cl	H	iPr
688	CHF ₂	Cl	H	cPr
689	CHF ₂	Cl	H	Bu
690	CHF ₂	Cl	H	cBu
691	CHF ₂	Cl	H	tBu

【表 3 0】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
692	CHF2	Cl	Me	Me
693	CHF2	Cl	Me	Et
694	CHF2	Cl	Me	Bu
695	CHF2	Cl	Me	Pr
696	CHF2	Cl	Me	iPr
697	CHF2	Cl	Et	Et
698	CHF2	Cl	Et	Pr
699	CHF2	Cl	Et	iPr
700	CHF2	Cl	Pr	Pr
701	CHF2	Cl	H	cペンチル
702	CHF2	Cl	H	cヘキシル
703	CHF2	Cl	H	CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₃
704	CHF2	Cl	H	CH ₂ (CH ₂) ₄ CH ₃
705	CHF2	Cl	H	CH ₂ -cPr
706	CHF2	Cl	H	CH ₂ -CN
707	CHF2	Cl	H	CH ₂ -C(CH ₃) ₃
708	CHF2	Cl	H	CH ₂ CF ₂ CF ₃
709	CHF2	Cl	H	CH ₂ CF ₃
710	CHF2	Cl	H	CH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃
711	CHF2	Cl	H	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
712	CHF2	Cl	H	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂ F
713	CHF2	Cl	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
714	CHF2	Cl	H	CH ₂ CH(CH ₂ CH ₃) ₂
715	CHF2	Cl	H	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂

【表 3 1】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
716	CHF ₂	Cl	H	CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
717	CHF ₂	Cl	H	CH ₂ CH=CH ₂
718	CHF ₂	Cl	Me	CH ₂ CH=CH ₂
719	CHF ₂	Cl	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂
720	CHF ₂	Cl	H	CH ₂ CH=CHCH ₃
721	CHF ₂	Cl	H	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂
722	CHF ₂	Cl	H	CH ₂ -C≡CH
723	CHF ₂	Cl	Me	CH ₂ -C≡CH
724	CHF ₂	Cl	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
725	CHF ₂	Cl	H	CH(CH ₃) <i>n</i> Pr
726	CHF ₂	Cl	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CH ₃
727	CHF ₂	Cl	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₄ CH ₃
728	CHF ₂	Cl	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₅ CH ₃
729	CHF ₂	Cl	H	CH(CH ₂ CH ₃)(CH ₂) ₃ CH ₃
730	CHF ₂	Cl	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH(CH ₃) ₂
731	CHF ₂	Cl	H	CH(CH ₃)C(CH ₃) ₃
732	CHF ₂	Cl	H	CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
733	CHF ₂	Cl	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
734	CHF ₂	Cl	H	CH(CH ₂ CH ₃) ₂
735	CHF ₂	Cl	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ CH ₃
736	CHF ₂	Cl	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
737	CHF ₂	Cl	H	CH ₂ -CH(OMe) ₂
738	CHF ₂	Cl	H	CH ₂ -CH(OEt) ₂
739	CHF ₂	Cl	H	CH ₂ CH ₂ -OH

【表 3 2】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
740	CHF2	Cl	H	CH2CH2-OMe
741	CHF2	Cl	Me	CH2CH2-OMe
742	CHF2	Cl	H	CH2CH2-OEt
743	CHF2	Cl	H	CH2CH2-SMe
744	CHF2	Cl	H	CH2CH2-CN
745	CHF2	Cl	H	CH2CH2-NMe2
746	CHF2	Cl	H	CH2CH2-ホルリン-4-イル
747	CHF2	Cl	H	CH(CH3)CH2-OMe
748	CHF2	Cl	H	CH(CH3)CH2-NMe2
749	CHF2	Cl	H	CH2CH2CH2-OMe
750	CHF2	Cl	H	CH2CH2CH2-SMe
751	CHF2	Cl	H	CH2CH2CH2-OEt
752	CHF2	Cl	H	CH2CH2CH2-OiPr
753	CHF2	Cl	H	CH2CH2CH2-OBu
754	CHF2	Cl	H	CH2-COOCH3
755	CHF2	Cl	Me	CH2-COOCH3
756	CHF2	Cl	H	CH(CH3)COOMe
757	CHF2	Cl	H	CH(CH3)COOEt
758	CHF2	Cl	H	CH2CH2-COOCH3
759	CHF2	Cl	H	CH(COOCH3)2
760	CHF2	Cl	H	CH(COOEt)CH2-CH(CH3)2
761	CHF2	Cl	H	CH(COOMe)CH(CH3)2
762	CHF2	Cl	H	O-CH2CH3
763	CHF2	Cl	H	O-CH3

【表 3 3】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
764	CHF2	Cl	H	O-CH ₂ CH=CH ₂
765	CHF2	Cl	H	O-tBu
766	CHF2	Cl	H	O-Pr
767	CHF2	Cl	H	O-CH ₂ cPr
768	CHF2	Cl	H	O-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
769	CHF2	Cl	H	O-CH ₂ CF ₃
770	CHF2	Cl	H	O-CH(CH ₃)cPr
771	CHF2	Cl	H	O-CH ₂ CH ₂ Cl
772	CHF2	Cl	H	O-CH ₂ C≡CH
773	CHF2	Cl	H	O-CH ₂ C≡CCH ₃
774	CHF2	Cl	H	O-CH(CH ₃)C≡CH
775	CHF2	Cl	H	CH ₂ -Ph
776	CHF2	Cl	Me	CH ₂ -Ph
777	CHF2	Cl	H	CH ₂ - β -リジノン-3-イル
778	CHF2	Cl	H	CH ₂ -6-Cl- β -リジノン-3-イル
779	CHF2	Cl	H	CH(CH ₃)Ph
780	CHF2	Cl	H	CH ₂ CH ₂ -Ph
781	CHF2	Cl	H	CH ₂ -2-CF ₃ -Ph
782	CHF2	Cl	H	CH ₂ CH ₂ CHPh
783	CHF2	Cl	モルホリン-4-イル	
784	CHF2	Cl	β - β -リジノン-1-イル	
785	CHF2	Cl	チアゾリジノン-3-イル	
786	CHF2	Cl	β -ポリジノン-1-イル	
787	CHF2	Cl	2-メチル β -ポリジノン-1-イル	

【表 3 4】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
788	CHF2	Cl	=CH-N(CH3)2	
789	CHF2	Cl	=C(CH3)N(CH3)2	
790	CHF2	Cl	=CH-N(C2H5)2	
791	CHF2	Cl	=C(CH3)N(C2H5)2	
792	CHF2	Cl	=CH-ヒ°ヘ°リジン	
793	CHF2	Cl	=CH-モルホリン	
794	CHF2	Cl	=CH-ヒ°ロリジン	
795	CHF2	Cl	H	インダ°ン-1-イル
796	CHF2	Cl	H	テトラヒト°ロフレン-2-イルメチル
797	CF2CF3	Cl	H	H
798	CF2CF3	Cl	H	Me
799	CF2CF3	Cl	H	Et
800	CF2CF3	Cl	H	Pr
801	CF2CF3	Cl	H	iPr
802	CF2CF3	Cl	H	cPr
803	CF2CF3	Cl	H	Bu
804	CF2CF3	Cl	H	cBu
805	CF2CF3	Cl	H	tBu
806	CF2CF3	Cl	Me	Me
807	CF2CF3	Cl	Me	Et
808	CF2CF3	Cl	Me	Bu
809	CF2CF3	Cl	Me	Pr
810	CF2CF3	Cl	Me	iPr
811	CF2CF3	Cl	Et	Et

【表 3 5】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
812	CF ₂ CF ₃	Cl	Et	Pr
813	CF ₂ CF ₃	Cl	Et	iPr
814	CF ₂ CF ₃	Cl	Pr	Pr
815	CF ₂ CF ₃	Cl	H	cヘンチル
816	CF ₂ CF ₃	Cl	H	cヘキシル
817	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₃
818	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ (CH ₂) ₄ CH ₃
819	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ -cPr
820	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ -CN
821	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ -C(CH ₃) ₃
822	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ CF ₂ CF ₃
823	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ CF ₃
824	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃
825	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
826	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂ F
827	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
828	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ CH(CH ₂ CH ₃) ₂
829	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
830	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
831	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ CH=CH ₂
832	CF ₂ CF ₃	Cl	Me	CH ₂ CH=CH ₂
833	CF ₂ CF ₃	Cl	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂
834	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ CH=CHCH ₃
835	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂

【表 3 6】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
836	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ -C≡CH
837	CF ₂ CF ₃	Cl	Me	CH ₂ -C≡CH
838	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
839	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH(CH ₃)cPr
840	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CH ₃
841	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₄ CH ₃
842	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₅ CH ₃
843	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH(CH ₂ CH ₃)(CH ₂) ₃ CH ₃
844	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH(CH ₃) ₂
845	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH(CH ₃)C(CH ₃) ₃
846	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
847	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
848	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH(CH ₂ CH ₃) ₂
849	CF ₂ CF ₃	Cl	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ CH ₃
850	CF ₂ CF ₃	Cl	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
851	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ -CH(OMe) ₂
852	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ -CH(OEt) ₂
853	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ CH ₂ -OH
854	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ CH ₂ -OMe
855	CF ₂ CF ₃	Cl	Me	CH ₂ CH ₂ -OMe
856	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ CH ₂ -OEt
857	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ CH ₂ -SMe
858	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ CH ₂ -CN
859	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ CH ₂ -NMe ₂

【表 3 7】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
860	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ CH ₂ -ホルリン-4-イル
861	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH(CH ₃)CH ₂ -OMe
862	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH(CH ₃)CH ₂ -NMe ₂
863	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OMe
864	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -SMe
865	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OEt
866	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OiPr
867	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OBu
868	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ -COOCH ₃
869	CF ₂ CF ₃	Cl	Me	CH ₂ -COOCH ₃
870	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ CH ₂ -COOCH ₃
871	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH(COOCH ₃) ₂
872	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH(COOEt)CH ₂ -CH(CH ₃) ₂
873	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH(COOMe)CH(CH ₃) ₂
874	CF ₂ CF ₃	Cl	H	O-CH ₂ CH ₃
875	CF ₂ CF ₃	Cl	H	O-CH ₃
876	CF ₂ CF ₃	Cl	H	O-CH ₂ CH=CH ₂
877	CF ₂ CF ₃	Cl	H	O-tBu
878	CF ₂ CF ₃	Cl	H	O-Pr
879	CF ₂ CF ₃	Cl	H	O-CH ₂ cPr
880	CF ₂ CF ₃	Cl	H	O-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
881	CF ₂ CF ₃	Cl	H	O-CH ₂ CF ₃
882	CF ₂ CF ₃	Cl	H	O-CH(CH ₃)cPr
883	CF ₂ CF ₃	Cl	H	O-CH ₂ CH ₂ Cl

10

20

30

40

【表 3 8】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
884	CF ₂ CF ₃	Cl	H	O-CH ₂ C≡CH
885	CF ₂ CF ₃	Cl	H	O-CH ₂ C≡CCH ₃
886	CF ₂ CF ₃	Cl	H	O-CH(CH ₃)C≡CH
887	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ -Ph
888	CF ₂ CF ₃	Cl	Me	CH ₂ -Ph
889	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ -ヒ° リジ°ン-3-イル
890	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ -6-Cl-ヒ° リジ°ン-3-イル
891	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH(CH ₃)Ph
892	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ CH ₂ -Ph
893	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ -2-CF ₃ -Ph
894	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ CH ₂ CHPh
895	CF ₂ CF ₃	Cl	モルホリ°ン-4-イル	
896	CF ₂ CF ₃	Cl	ヒ° ヒ° リジ°ン-1-イル	
897	CF ₂ CF ₃	Cl	チアゾ° リジ°ン-3-イル	
898	CF ₂ CF ₃	Cl	ヒ° ロリジ°ン-1-イル	
899	CF ₂ CF ₃	Cl	2-メチルヒ° ロリジ°ン-1-イル	
900	CF ₂ CF ₃	Cl	=CH-N(CH ₃) ₂	
901	CF ₂ CF ₃	Cl	=C(CH ₃)N(CH ₃) ₂	
902	CF ₂ CF ₃	Cl	=CH-N(C ₂ H ₅) ₂	
903	CF ₂ CF ₃	Cl	=C(CH ₃)N(C ₂ H ₅) ₂	
904	CF ₂ CF ₃	Cl	=CH-ヒ° ヒ° リジ°ン	
905	CF ₂ CF ₃	Cl	=CH-モルホリ°ン	
906	CF ₂ CF ₃	Cl	=CH-ヒ° ロリジ°ン	
907	CF ₂ CF ₃	Cl	H	インダ°ン-1-イル

【表 3 9】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
908	CF ₂ CF ₃	Cl	H	テトラヒドロフラン-2-イルメチル
909	CF ₃	Br	H	H
910	CF ₃	Br	H	Me
911	CF ₃	Br	H	Et
912	CF ₃	Br	H	Pr
913	CF ₃	Br	H	iPr
914	CF ₃	Br	H	cPr
915	CF ₃	Br	H	Bu
916	CF ₃	Br	H	cBu
917	CF ₃	Br	H	tBu
918	CF ₃	Br	Me	Me
919	CF ₃	Br	Me	Et
920	CF ₃	Br	Me	Bu
921	CF ₃	Br	Me	Pr
922	CF ₃	Br	Me	iPr
923	CF ₃	Br	Et	Et
924	CF ₃	Br	Et	Pr
925	CF ₃	Br	Et	iPr
926	CF ₃	Br	Pr	Pr
927	CF ₃	Br	H	cペンチル
928	CF ₃	Br	H	cヘキシル
929	CF ₃	Br	H	CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₃
930	CF ₃	Br	H	CH ₂ (CH ₂) ₄ CH ₃
931	CF ₃	Br	H	CH ₂ -cPr

【表 4 0】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
932	CF ₃	Br	H	CH ₂ -CN
933	CF ₃	Br	H	CH ₂ -C(CH ₃) ₃
934	CF ₃	Br	H	CH ₂ CF ₂ CF ₃
935	CF ₃	Br	H	CH ₂ CF ₃
936	CF ₃	Br	H	CH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃
937	CF ₃	Br	H	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
938	CF ₃	Br	H	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂ F
939	CF ₃	Br	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
940	CF ₃	Br	H	CH ₂ CH(CH ₂ CH ₃) ₂
941	CF ₃	Br	H	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
942	CF ₃	Br	H	CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
943	CF ₃	Br	H	CH ₂ CH=CH ₂
944	CF ₃	Br	Me	CH ₂ CH=CH ₂
945	CF ₃	Br	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂
946	CF ₃	Br	H	CH ₂ CH=CHCH ₃
947	CF ₃	Br	H	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂
948	CF ₃	Br	H	CH ₂ -C≡CH
949	CF ₃	Br	Me	CH ₂ -C≡CH
950	CF ₃	Br	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
951	CF ₃	Br	H	CH(CH ₃)cPr
952	CF ₃	Br	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CH ₃
953	CF ₃	Br	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₄ CH ₃
954	CF ₃	Br	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₅ CH ₃
955	CF ₃	Br	H	CH(CH ₂ CH ₃)(CH ₂) ₃ CH ₃

【表 4 1】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
956	CF ₃	Br	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH(CH ₃) ₂
957	CF ₃	Br	H	CH(CH ₃)C(CH ₃) ₃
958	CF ₃	Br	H	CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
959	CF ₃	Br	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
960	CF ₃	Br	H	CH(CH ₂ CH ₃) ₂
961	CF ₃	Br	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ CH ₃
962	CF ₃	Br	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
963	CF ₃	Br	H	CH ₂ -CH(OMe) ₂
964	CF ₃	Br	H	CH ₂ -CH(OEt) ₂
965	CF ₃	Br	H	CH ₂ CH ₂ -OH
966	CF ₃	Br	H	CH ₂ CH ₂ -OMe
967	CF ₃	Br	Me	CH ₂ CH ₂ -OMe
968	CF ₃	Br	H	CH ₂ CH ₂ -OEt
969	CF ₃	Br	H	CH ₂ CH ₂ -SMe
970	CF ₃	Br	H	CH ₂ CH ₂ -CN
971	CF ₃	Br	H	CH ₂ CH ₂ -NMe ₂
972	CF ₃	Br	H	CH ₂ CH ₂ -ホルリソ-4-イル
973	CF ₃	Br	H	CH(CH ₃)CH ₂ -OMe
974	CF ₃	Br	H	CH(CH ₃)CH ₂ -NMe ₂
975	CF ₃	Br	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OMe
976	CF ₃	Br	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -SMe
977	CF ₃	Br	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OEt
978	CF ₃	Br	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OiPr
979	CF ₃	Br	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OBu

【表 4 2】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
980	CF ₃	Br	H	CH ₂ -COOCH ₃
981	CF ₃	Br	Me	CH ₂ -COOCH ₃
982	CF ₃	Br	H	CH(CH ₃)COOMe
983	CF ₃	Br	H	CH(CH ₃)COOEt
984	CF ₃	Br	H	CH ₂ CH ₂ -COOCH ₃
985	CF ₃	Br	H	CH(COOCH ₃) ₂
986	CF ₃	Br	H	CH(COOEt)CH ₂ -CH(CH ₃) ₂
987	CF ₃	Br	H	CH(COOMe)CH(CH ₃) ₂
988	CF ₃	Br	H	O-CH ₂ CH ₃
989	CF ₃	Br	Me	O-CH ₃
990	CF ₃	Br	H	O-CH ₂ CH=CH ₂
991	CF ₃	Br	H	O-tBu
992	CF ₃	Br	H	O-Pr
993	CF ₃	Br	H	O-CH ₂ cPr
994	CF ₃	Br	H	O-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
995	CF ₃	Br	H	O-CH ₂ CF ₃
996	CF ₃	Br	H	O-CH(CH ₃)cPr
997	CF ₃	Br	H	O-CH ₂ CH ₂ Cl
998	CF ₃	Br	H	O-CH ₂ C≡CH
999	CF ₃	Br	H	O-CH ₂ C≡CCH ₃
1000	CF ₃	Br	H	O-CH(CH ₃)C≡CH
1001	CF ₃	Br	H	CH ₂ -Ph
1002	CF ₃	Br	Me	CH ₂ -Ph
1003	CF ₃	Br	H	CH ₂ -ヒ°リゾン-3-イル

【表 4 3】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1004	CF ₃	Br	H	CH ₂ -6-C1-ヒ° リジ°ン-3-イル
1005	CF ₃	Br	H	CH(CH ₃)Ph
1006	CF ₃	Br	H	CH ₂ CH ₂ -Ph
1007	CF ₃	Br	H	CH ₂ -2-CF ₃ -Ph
1008	CF ₃	Br	H	CH ₂ CH ₂ CHPh ₂
1009	CF ₃	Br	モルホリン-4-イル	
1010	CF ₃	Br	ヒ° ヒ° リジ°ン-1-イル	
1011	CF ₃	Br	チアゾ° リジ°ン-3-イル	
1012	CF ₃	Br	ヒ° ポリジ°ン-1-イル	
1013	CF ₃	Br	2-メチルヒ° ポリジ°ン-1-イル	
1014	CF ₃	Br	=CH-N(CH ₃) ₂	
1015	CF ₃	Br	=C(CH ₃)N(CH ₃) ₂	
1016	CF ₃	Br	=CH-N(C ₂ H ₅) ₂	
1017	CF ₃	Br	=C(CH ₃)N(C ₂ H ₅) ₂	
1018	CF ₃	Br	=CH-ヒ° ヒ° リジ°ン	
1019	CF ₃	Br	=CH-モルホリン	
1020	CF ₃	Br	=CH-ヒ° ポリジ°ン	
1021	CF ₃	Br	H	インダ°ン-1-イル
1022	CF ₃	Br	H	テトラヒト° ロフラン°ン-2-イルメチル
1023	CF ₂ Cl	Br	H	H
1024	CF ₂ Cl	Br	H	Me
1025	CF ₂ Cl	Br	H	Et
1026	CF ₂ Cl	Br	H	Pr
1027	CF ₂ Cl	Br	H	iPr

【表 4 4】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1028	CF ₂ Cl	Br	H	cPr
1029	CF ₂ Cl	Br	H	Bu
1030	CF ₂ Cl	Br	H	cBu
1031	CF ₂ Cl	Br	H	tBu
1032	CF ₂ Cl	Br	Me	Me
1033	CF ₂ Cl	Br	Me	Et
1034	CF ₂ Cl	Br	Me	Bu
1035	CF ₂ Cl	Br	Me	Pr
1036	CF ₂ Cl	Br	Me	iPr
1037	CF ₂ Cl	Br	Et	Et
1038	CF ₂ Cl	Br	Et	Pr
1039	CF ₂ Cl	Br	Et	iPr
1040	CF ₂ Cl	Br	Pr	Pr
1041	CF ₂ Cl	Br	H	cヘンチル
1042	CF ₂ Cl	Br	H	cヘキシル
1043	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₃
1044	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ (CH ₂) ₄ CH ₃
1045	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ -cPr
1046	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ -CN
1047	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ -C(CH ₃) ₃
1048	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ CF ₂ CF ₃
1049	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ CF ₃
1050	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃
1051	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃

【表 4 5】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1052	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂ F
1053	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1054	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ CH(CH ₂ CH ₃) ₂
1055	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1056	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
1057	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ CH=CH ₂
1058	CF ₂ Cl	Br	Me	CH ₂ CH=CH ₂
1059	CF ₂ Cl	Br	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂
1060	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ CH=CHCH ₃
1061	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂
1062	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ -C≡CH
1063	CF ₂ Cl	Br	Me	CH ₂ -C≡CH
1064	CF ₂ Cl	Br	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
1065	CF ₂ Cl	Br	H	CH(CH ₃)cPr
1066	CF ₂ Cl	Br	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CH ₃
1067	CF ₂ Cl	Br	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₄ CH ₃
1068	CF ₂ Cl	Br	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₅ CH ₃
1069	CF ₂ Cl	Br	H	CH(CH ₂ CH ₃)(CH ₂) ₃ CH ₃
1070	CF ₂ Cl	Br	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1071	CF ₂ Cl	Br	H	CH(CH ₃)C(CH ₃) ₃
1072	CF ₂ Cl	Br	H	CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
1073	CF ₂ Cl	Br	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1074	CF ₂ Cl	Br	H	CH(CH ₂ CH ₃) ₂
1075	CF ₂ Cl	Br	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ CH ₃

【表 4 6】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1076	CF ₂ Cl	Br	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
1077	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ -CH(OMe) ₂
1078	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ -CH(OEt) ₂
1079	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ CH ₂ -OH
1080	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ CH ₂ -OMe
1081	CF ₂ Cl	Br	Me	CH ₂ CH ₂ -OMe
1082	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ CH ₂ -OEt
1083	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ CH ₂ -SMe
1084	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ CH ₂ -CN
1085	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ CH ₂ -NMe ₂
1086	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ CH ₂ -ホルリソ-4-イル
1087	CF ₂ Cl	Br	H	CH(CH ₃)CH ₂ -OMe
1088	CF ₂ Cl	Br	H	CH(CH ₃)CH ₂ -NMe ₂
1089	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OMe
1090	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -SMe
1091	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OEt
1092	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OiPr
1093	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OBu
1094	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ -COOCH ₃
1095	CF ₂ Cl	Br	Me	CH ₂ -COOCH ₃
1096	CF ₂ Cl	Br	H	CH(CH ₃)COOMe
1097	CF ₂ Cl	Br	H	CH(CH ₃)COOEt
1098	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ CH ₂ -COOCH ₃
1099	CF ₂ Cl	Br	H	CH(COOCH ₃) ₂

10

20

30

40

【表 4 7】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1100	CF ₂ Cl	Br	H	CH(COOEt)CH ₂ -CH(CH ₃) ₂
1101	CF ₂ Cl	Br	H	CH(COOMe)CH(CH ₃) ₂
1102	CF ₂ Cl	Br	H	O-CH ₂ CH ₃
1103	CF ₂ Cl	Br	Me	O-CH ₃
1104	CF ₂ Cl	Br	H	O-CH ₂ CH=CH ₂
1105	CF ₂ Cl	Br	H	O-tBu
1106	CF ₂ Cl	Br	H	O-Pr
1107	CF ₂ Cl	Br	H	O-CH ₂ cPr
1108	CF ₂ Cl	Br	H	O-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1109	CF ₂ Cl	Br	H	O-CH ₂ CF ₃
1110	CF ₂ Cl	Br	H	O-CH(CH ₃)cPr
1111	CF ₂ Cl	Br	H	O-CH ₂ CH ₂ Cl
1112	CF ₂ Cl	Br	H	O-CH ₂ C≡CH
1113	CF ₂ Cl	Br	H	O-CH ₂ C≡CCH ₃
1114	CF ₂ Cl	Br	H	O-CH(CH ₃)C≡CH
1115	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ -Ph
1116	CF ₂ Cl	Br	Me	CH ₂ -Ph
1117	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ -t [°] リジン-3-イル
1118	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ -6-Cl-t [°] リジン-3-イル
1119	CF ₂ Cl	Br	H	CH(CH ₃)Ph
1120	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ CH ₂ -Ph
1121	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ -2-CF ₃ -Ph
1122	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ CH ₂ CHPh ₂
1123	CF ₂ Cl	Br		モルホリン-4-イル

【表 48】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1124	CF ₂ Cl	Br		ヒ°ヘ°リジン-1-イル
1125	CF ₂ Cl	Br		チアゾ°リジン-3-イル
1126	CF ₂ Cl	Br		ヒ°ロリジン-1-イル
1127	CF ₂ Cl	Br		2-メチルヒ°ロリジン-1-イル
1128	CF ₂ Cl	Br		=CH-N(CH ₃) ₂
1129	CF ₂ Cl	Br		=C(CH ₃)N(CH ₃) ₂
1130	CF ₂ Cl	Br		=CH-N(C ₂ H ₅) ₂
1131	CF ₂ Cl	Br		=C(CH ₃)N(C ₂ H ₅) ₂
1132	CF ₂ Cl	Br		=CH-ヒ°ヘ°リジン
1133	CF ₂ Cl	Br		=CH-モルホリン
1134	CF ₂ Cl	Br		=CH-ヒ°ロリジン
1135	CF ₂ Cl	Br	H	インダ°ン-1-イル
1136	CF ₂ Cl	Br	H	テトラヒト°ロフラン-2-イルメチル
1137	CHF ₂	Br	H	H
1138	CHF ₂	Br	H	Me
1139	CHF ₂	Br	H	Et
1140	CHF ₂	Br	H	Pr
1141	CHF ₂	Br	H	iPr
1142	CHF ₂	Br	H	cPr
1143	CHF ₂	Br	H	Bu
1144	CHF ₂	Br	H	cBu
1145	CHF ₂	Br	H	tBu
1146	CHF ₂	Br	Me	Me
1147	CHF ₂	Br	Me	Et

【表 4 9】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1148	CHF2	Br	Me	Bu
1149	CHF2	Br	Me	Pr
1150	CHF2	Br	Me	iPr
1151	CHF2	Br	Et	Et
1152	CHF2	Br	Et	Pr
1153	CHF2	Br	Et	iPr
1154	CHF2	Br	Pr	Pr
1155	CHF2	Br	H	cヘンチル
1156	CHF2	Br	H	cヘキシル
1157	CHF2	Br	H	CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₃
1158	CHF2	Br	H	CH ₂ (CH ₂) ₄ CH ₃
1159	CHF2	Br	H	CH ₂ -cPr
1160	CHF2	Br	H	CH ₂ -CN
1161	CHF2	Br	H	CH ₂ -C(CH ₃) ₃
1162	CHF2	Br	H	CH ₂ CF ₂ CF ₃
1163	CHF2	Br	H	CH ₂ CF ₃
1164	CHF2	Br	H	CH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃
1165	CHF2	Br	H	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
1166	CHF2	Br	H	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂ F
1167	CHF2	Br	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1168	CHF2	Br	H	CH ₂ CH(CH ₂ CH ₃) ₂
1169	CHF2	Br	H	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1170	CHF2	Br	H	CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
1171	CHF2	Br	H	CH ₂ CH=CH ₂

【表 5 0】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1172	CHF2	Br	Me	CH ₂ CH=CH ₂
1173	CHF2	Br	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂
1174	CHF2	Br	H	CH ₂ CH=CHCH ₃
1175	CHF2	Br	H	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂
1176	CHF2	Br	H	CH ₂ -C≡CH
1177	CHF2	Br	Me	CH ₂ -C≡CH
1178	CHF2	Br	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
1179	CHF2	Br	H	CH(CH ₃)cPr
1180	CHF2	Br	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CH ₃
1181	CHF2	Br	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₄ CH ₃
1182	CHF2	Br	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₅ CH ₃
1183	CHF2	Br	H	CH(CH ₂ CH ₃)(CH ₂) ₃ CH ₃
1184	CHF2	Br	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1185	CHF2	Br	H	CH(CH ₃)C(CH ₃) ₃
1186	CHF2	Br	H	CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
1187	CHF2	Br	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1188	CHF2	Br	H	CH(CH ₂ CH ₃) ₂
1189	CHF2	Br	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ CH ₃
1190	CHF2	Br	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
1191	CHF2	Br	H	CH ₂ -CH(OMe) ₂
1192	CHF2	Br	H	CH ₂ -CH(OEt) ₂
1193	CHF2	Br	H	CH ₂ CH ₂ -OH
1194	CHF2	Br	H	CH ₂ CH ₂ -OMe
1195	CHF2	Br	Me	CH ₂ CH ₂ -OMe

【表 5 1】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1196	CHF2	Br	H	CH2CH2-OEt
1197	CHF2	Br	H	CH2CH2-SMe
1198	CHF2	Br	H	CH2CH2-CN
1199	CHF2	Br	H	CH2CH2-NMe2
1200	CHF2	Br	H	CH2CH2-ホルリソ-4-イル
1201	CHF2	Br	H	CH(CH3)CH2-OMe
1202	CHF2	Br	H	CH(CH3)CH2-NMe2
1203	CHF2	Br	H	CH2CH2CH2-OMe
1204	CHF2	Br	H	CH2CH2CH2-SMe
1205	CHF2	Br	H	CH2CH2CH2-OEt
1206	CHF2	Br	H	CH2CH2CH2-OiPr
1207	CHF2	Br	H	CH2CH2CH2-OBu
1208	CHF2	Br	H	CH2-COOCH3
1209	CHF2	Br	Me	CH2-COOCH3
1210	CHF2	Br	H	CH(CH3)COOMe
1211	CHF2	Br	H	CH(CH3)COOEt
1212	CHF2	Br	H	CH2CH2-COOCH3
1213	CHF2	Br	H	CH(COOCH3)2
1214	CHF2	Br	H	CH(COOEt)CH2-CH(CH3)2
1215	CHF2	Br	H	CH(COOMe)CH(CH3)2
1216	CHF2	Br	H	O-CH2CH3
1217	CHF2	Br	Me	O-CH3
1218	CHF2	Br	H	O-CH2CH=CH2
1219	CHF2	Br	H	O-tBu

【表 5 2】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1220	CHF2	Br	H	O-Pr
1221	CHF2	Br	H	O-CH ₂ cPr
1222	CHF2	Br	H	O-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1223	CHF2	Br	H	O-CH ₂ CF ₃
1224	CHF2	Br	H	O-CH(CH ₃)cPr
1225	CHF2	Br	H	O-CH ₂ CH ₂ Cl
1226	CHF2	Br	H	O-CH ₂ C≡CH
1227	CHF2	Br	H	O-CH ₂ C≡CCH ₃
1228	CHF2	Br	H	O-CH(CH ₃)C≡CH
1229	CHF2	Br	H	CH ₂ -Ph
1230	CHF2	Br	Me	CH ₂ -Ph
1231	CHF2	Br	H	CH ₂ -ε リジノン-3-イル
1232	CHF2	Br	H	CH ₂ -6-Cl-ε リジノン-3-イル
1233	CHF2	Br	H	CH(CH ₃)Ph
1234	CHF2	Br	H	CH ₂ CH ₂ -Ph
1235	CHF2	Br	H	CH ₂ -2-CF ₃ -Ph
1236	CHF2	Br	H	CH ₂ CH ₂ CHPh ₂
1237	CHF2	Br	モルホリン-4-イル	
1238	CHF2	Br	ε° ε° リジノン-1-イル	
1239	CHF2	Br	チアゾリジノン-3-イル	
1240	CHF2	Br	ε° ロリジノン-1-イル	
1241	CHF2	Br	2-メチルε° ロリジノン-1-イル	
1242	CHF2	Br	=CH-N(CH ₃) ₂	
1243	CHF2	Br	=C(CH ₃)N(CH ₃) ₂	

【表 5 3】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1244	CHF2	Br	=CH-N(C2H5) ₂	
1245	CHF2	Br	=C(CH3)N(C2H5) ₂	
1246	CHF2	Br	=CH-ヒ°ヘ°リジ°ン	
1247	CHF2	Br	=CH-モルホリン	
1248	CHF2	Br	=CH-ヒ°ロリジ°ン	
1249	CHF2	Br	H	インタ°ン-1-イル
1250	CHF2	Br	H	テトラヒト°ロフラン-2-イルメチル
1251	CF2CF3	Br	H	H
1252	CF2CF3	Br	H	Me
1253	CF2CF3	Br	H	Et
1254	CF2CF3	Br	H	Pr
1255	CF2CF3	Br	H	iPr
1256	CF2CF3	Br	H	cPr
1257	CF2CF3	Br	H	Bu
1258	CF2CF3	Br	H	cBu
1259	CF2CF3	Br	H	tBu
1260	CF2CF3	Br	Me	Me
1261	CF2CF3	Br	Me	Et
1262	CF2CF3	Br	Me	Bu
1263	CF2CF3	Br	Me	Pr
1264	CF2CF3	Br	Me	iPr
1265	CF2CF3	Br	Et	Et
1266	CF2CF3	Br	Et	Pr
1267	CF2CF3	Br	Et	iPr

【表 5 4】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1268	CF ₂ CF ₃	Br	Pr	Pr
1269	CF ₂ CF ₃	Br	H	c ⁺ ペンチル
1270	CF ₂ CF ₃	Br	H	c ⁺ ヘキシル
1271	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₃
1272	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH ₂ (CH ₂) ₄ CH ₃
1273	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH ₂ -cPr
1274	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH ₂ -CN
1275	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH ₂ -C(CH ₃) ₃
1276	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH ₂ CF ₂ CF ₃
1277	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH ₂ CF ₃
1278	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃
1279	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
1280	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂ F
1281	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1282	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH ₂ CH(CH ₂ CH ₃) ₂
1283	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1284	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
1285	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH ₂ CH=CH ₂
1286	CF ₂ CF ₃	Br	Me	CH ₂ CH=CH ₂
1287	CF ₂ CF ₃	Br	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂
1288	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH ₂ CH=CHCH ₃
1289	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂
1290	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH ₂ -C≡CH
1291	CF ₂ CF ₃	Br	Me	CH ₂ -C≡CH

【表 5 5】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1292	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
1293	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH(CH ₃)cPr
1294	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CH ₃
1295	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₄ CH ₃
1296	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₅ CH ₃
1297	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH(CH ₂ CH ₃)(CH ₂) ₃ CH ₃
1298	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1299	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH(CH ₃)C(CH ₃) ₃
1300	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
1301	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1302	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH(CH ₂ CH ₃) ₂
1303	CF ₂ CF ₃	Br	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ CH ₃
1304	CF ₂ CF ₃	Br	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
1305	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH ₂ -CH(OMe) ₂
1306	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH ₂ -CH(OEt) ₂
1307	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH ₂ CH ₂ -OH
1308	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH ₂ CH ₂ -OMe
1309	CF ₂ CF ₃	Br	Me	CH ₂ CH ₂ -OMe
1310	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH ₂ CH ₂ -OEt
1311	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH ₂ CH ₂ -SMe
1312	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH ₂ CH ₂ -CN
1313	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH ₂ CH ₂ -NMe ₂
1314	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH ₂ CH ₂ -ホルリン-4-イル
1315	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH(CH ₃)CH ₂ -OMe

【表 5 6】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1316	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH(CH ₃)CH ₂ -NMe ₂
1317	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OMe
1318	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -SMe
1319	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OEt
1320	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OiPr
1321	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OBu
1322	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH ₂ -COOCH ₃
1323	CF ₂ CF ₃	Br	Me	CH ₂ -COOCH ₃
1324	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH(CH ₃)COOMe
1325	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH(CH ₃)COOEt
1326	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH ₂ CH ₂ -COOCH ₃
1327	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH(COOCH ₃) ₂
1328	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH(COOEt)CH ₂ -CH(CH ₃) ₂
1329	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH(COOMe)CH(CH ₃) ₂
1330	CF ₂ CF ₃	Br	H	O-CH ₂ CH ₃
1331	CF ₂ CF ₃	Br	Me	O-CH ₃
1332	CF ₂ CF ₃	Br	H	O-CH ₂ CH=CH ₂
1333	CF ₂ CF ₃	Br	H	O-tBu
1334	CF ₂ CF ₃	Br	H	O-Pr
1335	CF ₂ CF ₃	Br	H	O-CH ₂ cPr
1336	CF ₂ CF ₃	Br	H	O-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1337	CF ₂ CF ₃	Br	H	O-CH ₂ CF ₃
1338	CF ₂ CF ₃	Br	H	O-CH(CH ₃)cPr
1339	CF ₂ CF ₃	Br	H	O-CH ₂ CH ₂ Cl

【表 5 7】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1340	CF ₂ CF ₃	Br	H	O-CH ₂ C≡CH
1341	CF ₂ CF ₃	Br	H	O-CH ₂ C≡CCH ₃
1342	CF ₂ CF ₃	Br	H	O-CH(CH ₃)C≡CH
1343	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH ₂ -Ph
1344	CF ₂ CF ₃	Br	Me	CH ₂ -Ph
1345	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH ₂ -ヒ° リジ° ソ-3-イル
1346	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH ₂ -6-Cl-ヒ° リジ° ソ-3-イル
1347	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH(CH ₃)Ph
1348	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH ₂ CH ₂ -Ph
1349	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH ₂ -2-CF ₃ -Ph
1350	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH ₂ CH ₂ CHPh ₂
1351	CF ₂ CF ₃	Br	モルホリソ-4-イル	
1352	CF ₂ CF ₃	Br	ヒ° ペ° リジ° ソ-1-イル	
1353	CF ₂ CF ₃	Br	チアソ° リジ° ソ-3-イル	
1354	CF ₂ CF ₃	Br	ヒ° ロリジ° ソ-1-イル	
1355	CF ₂ CF ₃	Br	2-メチルヒ° ロリジ° ソ-1-イル	
1356	CF ₂ CF ₃	Br	=CH-N(CH ₃) ₂	
1357	CF ₂ CF ₃	Br	=C(CH ₃)N(CH ₃) ₂	
1358	CF ₂ CF ₃	Br	=CH-N(C ₂ H ₅) ₂	
1359	CF ₂ CF ₃	Br	=C(CH ₃)N(C ₂ H ₅) ₂	
1360	CF ₂ CF ₃	Br	=CH-ヒ° ペ° リジ° ソ	
1361	CF ₂ CF ₃	Br	=CH-モルホリソ	
1362	CF ₂ CF ₃	Br	=CH-ヒ° ロリジ° ソ	
1363	CF ₂ CF ₃	Br	H	インダ° ソ-1-イル

【表 5 8】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1364	CF ₂ CF ₃	Br	H	テトラヒドロフラン-2-イルメチル
1365	CF ₂ CF ₃	I	H	H
1366	CF ₃	I	H	H
1367	CF ₂ CHF ₂	H	H	H
1368	CF ₂ CHF ₂	H	H	Me
1369	CF ₂ CHF ₂	H	H	Et
1370	CF ₂ CHF ₂	H	H	Pr
1371	CF ₂ CHF ₂	H	H	iPr
1372	CF ₂ CHF ₂	H	H	cPr
1373	CF ₂ CHF ₂	H	H	Bu
1374	CF ₂ CHF ₂	H	H	cBu
1375	CF ₂ CHF ₂	H	H	tBu
1376	CF ₂ CHF ₂	H	Me	Me
1377	CF ₂ CHF ₂	H	Me	Et
1378	CF ₂ CHF ₂	H	Me	Bu
1379	CF ₂ CHF ₂	H	Me	Pr
1380	CF ₂ CHF ₂	H	Me	iPr
1381	CF ₂ CHF ₂	H	Et	Et
1382	CF ₂ CHF ₂	H	Et	Pr
1383	CF ₂ CHF ₂	H	Et	iPr
1384	CF ₂ CHF ₂	H	Pr	Pr
1385	CF ₂ CHF ₂	H	H	cヘンチル
1386	CF ₂ CHF ₂	H	H	cヘキシル
1387	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₃

【表 5 9】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1388	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ (CH ₂) ₄ CH ₃
1389	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ -cPr
1390	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ -CN
1391	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ -C(CH ₃) ₃
1392	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ CF ₂ CF ₃
1393	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ CF ₃
1394	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃
1395	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
1396	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂ F
1397	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1398	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ CH(CH ₂ CH ₃) ₂
1399	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1400	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
1401	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ CH=CH ₂
1402	CF ₂ CHF ₂	H	Me	CH ₂ CH=CH ₂
1403	CF ₂ CHF ₂	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂
1404	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ CH=CHCH ₃
1405	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂
1406	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ -C≡CH
1407	CF ₂ CHF ₂	H	Me	CH ₂ -C≡CH
1408	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
1409	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH(CH ₃)cPr
1410	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CH ₃
1411	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₄ CH ₃

10

20

30

40

【表 6 0】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1412	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₅ CH ₃
1413	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH(CH ₂ CH ₃)(CH ₂) ₃ CH ₃
1414	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1415	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH(CH ₃)C(CH ₃) ₃
1416	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
1417	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1418	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH(CH ₂ CH ₃) ₂
1419	CF ₂ CHF ₂	H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ CH ₃
1420	CF ₂ CHF ₂	H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
1421	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ -CH(OMe) ₂
1422	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ -CH(OEt) ₂
1423	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ CH ₂ -OH
1424	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ CH ₂ -OMe
1425	CF ₂ CHF ₂	H	Me	CH ₂ CH ₂ -OMe
1426	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ CH ₂ -OEt
1427	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ CH ₂ -SMe
1428	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ CH ₂ -CN
1429	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ CH ₂ -NMe ₂
1430	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ CH ₂ -ホルリソ-4-イル
1431	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ -OMe
1432	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ -NMe ₂
1433	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OMe
1434	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -SMe
1435	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OEt

【表 6 1】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1436	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -O <i>i</i> Pr
1437	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OBu
1438	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ -COOCH ₃
1439	CF ₂ CHF ₂	H	Me	CH ₂ -COOCH ₃
1440	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH(CH ₃)COOMe
1441	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH(CH ₃)COOEt
1442	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ CH ₂ -COOCH ₃
1443	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH(COOCH ₃) ₂
1444	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH(COOEt)CH ₂ -CH(CH ₃) ₂
1445	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH(COOMe)CH(CH ₃) ₂
1446	CF ₂ CHF ₂	H	H	O-CH ₂ CH ₃
1447	CF ₂ CHF ₂	H	H	O-CH ₃
1448	CF ₂ CHF ₂	H	H	O-CH ₂ CH=CH ₂
1449	CF ₂ CHF ₂	H	H	O- <i>t</i> Bu
1450	CF ₂ CHF ₂	H	H	O-Pr
1451	CF ₂ CHF ₂	H	H	O-CH ₂ <i>c</i> Pr
1452	CF ₂ CHF ₂	H	H	O-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1453	CF ₂ CHF ₂	H	H	O-CH ₂ CF ₃
1454	CF ₂ CHF ₂	H	H	O-CH(CH ₃) <i>c</i> Pr
1455	CF ₂ CHF ₂	H	H	O-CH ₂ CH ₂ Cl
1456	CF ₂ CHF ₂	H	H	O-CH ₂ C≡CH
1457	CF ₂ CHF ₂	H	H	O-CH ₂ C≡CCH ₃
1458	CF ₂ CHF ₂	H	H	O-CH(CH ₃)C≡CH
1459	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ -Ph

【表 6 2】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1460	CF ₂ CHF ₂	H	Me	CH ₂ -Ph
1461	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ -ヒ° リジ°ン-3-イル
1462	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ -6-C1-ヒ° リジ°ン-3-イル
1463	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH(CH ₃)Ph
1464	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ CH ₂ -Ph
1465	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ -2-CF ₃ -Ph
1466	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ CH ₂ CHPh
1467	CF ₂ CHF ₂	H	モルホリ°ン-4-イル	
1468	CF ₂ CHF ₂	H	ヒ° ペ° リジ°ン-1-イル	
1469	CF ₂ CHF ₂	H	チアソ° リジ°ン-3-イル	
1470	CF ₂ CHF ₂	H	ヒ° ロリジ°ン-1-イル	
1471	CF ₂ CHF ₂	H	2-メチルヒ° ロリジ°ン-1-イル	
1472	CF ₂ CHF ₂	H	=CH-N(CH ₃) ₂	
1473	CF ₂ CHF ₂	H	=C(CH ₃)N(CH ₃) ₂	
1474	CF ₂ CHF ₂	H	=CH-N(C ₂ H ₅) ₂	
1475	CF ₂ CHF ₂	H	=C(CH ₃)N(C ₂ H ₅) ₂	
1476	CF ₂ CHF ₂	H	=CH-ヒ° ペ° リジ°ン	
1477	CF ₂ CHF ₂	H	=CH-モルホリ°ン	
1478	CF ₂ CHF ₂	H	=CH-ヒ° ロリジ°ン	
1479	CF ₂ CHF ₂	H	H	インタ°ン-1-イル
1480	CF ₂ CHF ₂	H	H	テトラヒト° ロフラン°ン-2-イルメチル
1481	CF ₂ CF ₂ C1	H	H	H
1482	CF ₂ CF ₂ C1	H	H	Me
1483	CF ₂ CF ₂ C1	H	H	Et

【表 6 3】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1484	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	Pr
1485	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	iPr
1486	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	cPr
1487	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	Bu
1488	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	cBu
1489	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	tBu
1490	CF ₂ CF ₂ Cl	H	Me	Me
1491	CF ₂ CF ₂ Cl	H	Me	Et
1492	CF ₂ CF ₂ Cl	H	Me	Bu
1493	CF ₂ CF ₂ Cl	H	Me	Pr
1494	CF ₂ CF ₂ Cl	H	Me	iPr
1495	CF ₂ CF ₂ Cl	H	Et	Et
1496	CF ₂ CF ₂ Cl	H	Et	Pr
1497	CF ₂ CF ₂ Cl	H	Et	iPr
1498	CF ₂ CF ₂ Cl	H	Pr	Pr
1499	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	cペンチル
1500	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	cヘキシル
1501	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₃
1502	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ (CH ₂) ₄ CH ₃
1503	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ -cPr
1504	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ -CN
1505	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ -C(CH ₃) ₃
1506	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CF ₂ CF ₃
1507	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CF ₃

【表 6 4】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1508	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃
1509	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
1510	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂ F
1511	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1512	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH(CH ₂ CH ₃) ₂
1513	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1514	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
1515	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH=CH ₂
1516	CF ₂ CF ₂ Cl	H	Me	CH ₂ CH=CH ₂
1517	CF ₂ CF ₂ Cl	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂
1518	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH=CHCH ₃
1519	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂
1520	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ -C≡CH
1521	CF ₂ CF ₂ Cl	H	Me	CH ₂ -C≡CH
1522	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
1523	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH(CH ₃)cPr
1524	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CH ₃
1525	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₄ CH ₃
1526	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₅ CH ₃
1527	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH(CH ₂ CH ₃)(CH ₂) ₃ CH ₃
1528	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1529	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH(CH ₃)C(CH ₃) ₃
1530	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
1531	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂

【表 6 5】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1532	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH(CH ₂ CH ₃) ₂
1533	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ CH ₃
1534	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
1535	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ -CH(OMe) ₂
1536	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ -CH(OEt) ₂
1537	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH ₂ -OH
1538	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH ₂ -OMe
1539	CF ₂ CF ₂ Cl	H	Me	CH ₂ CH ₂ -OMe
1540	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH ₂ -OEt
1541	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH ₂ -SMe
1542	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH ₂ -CN
1543	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH ₂ -NMe ₂
1544	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH ₂ -ホルリン-4-イル
1545	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ -OMe
1546	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ -NMe ₂
1547	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OMe
1548	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -SMe
1549	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OEt
1550	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OiPr
1551	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OBu
1552	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ -COOCH ₃
1553	CF ₂ CF ₂ Cl	H	Me	CH ₂ -COOCH ₃
1554	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH(CH ₃)COOMe
1555	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH(CH ₃)COOEt

【表 6 6】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1556	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH ₂ -COOCH ₃
1557	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH(COOCH ₃) ₂
1558	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH(COOEt)CH ₂ -CH(CH ₃) ₂
1559	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH(COOMe)CH(CH ₃) ₂
1560	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	O-CH ₂ CH ₃
1561	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	O-CH ₃
1562	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	O-CH ₂ CH=CH ₂
1563	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	O-tBu
1564	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	O-Pr
1565	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	O-CH ₂ cPr
1566	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	O-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1567	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	O-CH ₂ CF ₃
1568	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	O-CH(CH ₃)cPr
1569	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	O-CH ₂ CH ₂ Cl
1570	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	O-CH ₂ C≡CH
1571	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	O-CH ₂ C≡CCH ₃
1572	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	O-CH(CH ₃)C≡CH
1573	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ -Ph
1574	CF ₂ CF ₂ Cl	H	Me	CH ₂ -Ph
1575	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ -L-リジン-3-イル
1576	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ -6-Cl-L-リジン-3-イル
1577	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH(CH ₃)Ph
1578	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH ₂ -Ph
1579	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ -2-CF ₃ -Ph

【表 6 7】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1580	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH ₂ CHPh
1581	CF ₂ CF ₂ Cl	H	モルホリン-4-イル	
1582	CF ₂ CF ₂ Cl	H	ヒ°ペリジソン-1-イル	
1583	CF ₂ CF ₂ Cl	H	チアゾリジソン-3-イル	
1584	CF ₂ CF ₂ Cl	H	ヒ°ロリジソン-1-イル	
1585	CF ₂ CF ₂ Cl	H	2-メチルヒ°ロリジソン-1-イル	
1586	CF ₂ CF ₂ Cl	H	=CH-N(CH ₃) ₂	
1587	CF ₂ CF ₂ Cl	H	=C(CH ₃)N(CH ₃) ₂	
1588	CF ₂ CF ₂ Cl	H	=CH-N(C ₂ H ₅) ₂	
1589	CF ₂ CF ₂ Cl	H	=C(CH ₃)N(C ₂ H ₅) ₂	
1590	CF ₂ CF ₂ Cl	H	=CH-ヒ°ペリジソン	
1591	CF ₂ CF ₂ Cl	H	=CH-モルホリン	
1592	CF ₂ CF ₂ Cl	H	=CH-ヒ°ロリジソン	
1593	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	インダソン-1-イル
1594	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	テトラヒト°ロフラン-2-イルメチル
1595	C ₃ F ₇	H	H	H
1596	C ₃ F ₇	H	H	Me
1597	C ₃ F ₇	H	H	Et
1598	C ₃ F ₇	H	H	Pr
1599	C ₃ F ₇	H	H	iPr
1600	C ₃ F ₇	H	H	cPr
1601	C ₃ F ₇	H	H	Bu
1602	C ₃ F ₇	H	H	cBu
1603	C ₃ F ₇	H	H	tBu

【表 6 8】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1604	C3F7	H	Me	Me
1605	C3F7	H	Me	Et
1606	C3F7	H	Me	Bu
1607	C3F7	H	Me	Pr
1608	C3F7	H	Me	iPr
1609	C3F7	H	Et	Et
1610	C3F7	H	Et	Pr
1611	C3F7	H	Et	iPr
1612	C3F7	H	Pr	Pr
1613	C3F7	H	H	cペンチル
1614	C3F7	H	H	cヘキシル
1615	C3F7	H	H	CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₃
1616	C3F7	H	H	CH ₂ (CH ₂) ₄ CH ₃
1617	C3F7	H	H	CH ₂ -cPr
1618	C3F7	H	H	CH ₂ -CN
1619	C3F7	H	H	CH ₂ -C(CH ₃) ₃
1620	C3F7	H	H	CH ₂ CF ₂ CF ₃
1621	C3F7	H	H	CH ₂ CF ₃
1622	C3F7	H	H	CH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃
1623	C3F7	H	H	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
1624	C3F7	H	H	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂ F
1625	C3F7	H	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1626	C3F7	H	H	CH ₂ CH(CH ₂ CH ₃) ₂
1627	C3F7	H	H	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂

【表 6 9】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1628	C3F7	H	H	CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
1629	C3F7	H	H	CH ₂ CH=CH ₂
1630	C3F7	H	Me	CH ₂ CH=CH ₂
1631	C3F7	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂
1632	C3F7	H	H	CH ₂ CH=CHCH ₃
1633	C3F7	H	H	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂
1634	C3F7	H	H	CH ₂ -C≡CH
1635	C3F7	H	Me	CH ₂ -C≡CH
1636	C3F7	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
1637	C3F7	H	H	CH(CH ₃)cPr
1638	C3F7	H	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CH ₃
1639	C3F7	H	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₄ CH ₃
1640	C3F7	H	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₅ CH ₃
1641	C3F7	H	H	CH(CH ₂ CH ₃)(CH ₂) ₃ CH ₃
1642	C3F7	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1643	C3F7	H	H	CH(CH ₃)C(CH ₃) ₃
1644	C3F7	H	H	CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
1645	C3F7	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1646	C3F7	H	H	CH(CH ₂ CH ₃) ₂
1647	C3F7	H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ CH ₃
1648	C3F7	H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
1649	C3F7	H	H	CH ₂ -CH(OMe) ₂
1650	C3F7	H	H	CH ₂ -CH(OEt) ₂
1651	C3F7	H	H	CH ₂ CH ₂ -OH

【表 7 0】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1652	C3F7	H	H	CH ₂ CH ₂ -OMe
1653	C3F7	H	Me	CH ₂ CH ₂ -OMe
1654	C3F7	H	H	CH ₂ CH ₂ -OEt
1655	C3F7	H	H	CH ₂ CH ₂ -SMe
1656	C3F7	H	H	CH ₂ CH ₂ -CN
1657	C3F7	H	H	CH ₂ CH ₂ -NMe ₂
1658	C3F7	H	H	CH ₂ CH ₂ -ホルリン-4-イル
1659	C3F7	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ -OMe
1660	C3F7	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ -NMe ₂
1661	C3F7	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OMe
1662	C3F7	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -SMe
1663	C3F7	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OEt
1664	C3F7	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OiPr
1665	C3F7	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OBu
1666	C3F7	H	H	CH ₂ -COOCH ₃
1667	C3F7	H	Me	CH ₂ -COOCH ₃
1668	C3F7	H	H	CH(CH ₃)COOMe
1669	C3F7	H	H	CH(CH ₃)COOEt
1670	C3F7	H	H	CH ₂ CH ₂ -COOCH ₃
1671	C3F7	H	H	CH(COOCH ₃) ₂
1672	C3F7	H	H	CH(COOEt)CH ₂ -CH(CH ₃) ₂
1673	C3F7	H	H	CH(COOMe)CH(CH ₃) ₂
1674	C3F7	H	H	O-CH ₂ CH ₃
1675	C3F7	H	H	O-CH ₃

【表 7 1】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1676	C3F7	H	H	O-CH ₂ CH=CH ₂
1677	C3F7	H	H	O-tBu
1678	C3F7	H	H	O-Pr
1679	C3F7	H	H	O-CH ₂ cPr
1680	C3F7	H	H	O-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1681	C3F7	H	H	O-CH ₂ CF ₃
1682	C3F7	H	H	O-CH(CH ₃)cPr
1683	C3F7	H	H	O-CH ₂ CH ₂ Cl
1684	C3F7	H	H	O-CH ₂ C≡CH
1685	C3F7	H	H	O-CH ₂ C≡CCH ₃
1686	C3F7	H	H	O-CH(CH ₃)C≡CH
1687	C3F7	H	H	CH ₂ -Ph
1688	C3F7	H	Me	CH ₂ -Ph
1689	C3F7	H	H	CH ₂ -ヒ° リジ°ン-3-イル
1690	C3F7	H	H	CH ₂ -6-Cl-ヒ° リジ°ン-3-イル
1691	C3F7	H	H	CH(CH ₃)Ph
1692	C3F7	H	H	CH ₂ CH ₂ -Ph
1693	C3F7	H	H	CH ₂ -2-CF ₃ -Ph
1694	C3F7	H	H	CH ₂ CH ₂ CHPh
1695	C3F7	H	モルホリン-4-イル	
1696	C3F7	H	ヒ° ペ° リジ°ン-1-イル	
1697	C3F7	H	チアゾ° リジ°ン-3-イル	
1698	C3F7	H	ヒ° ロリジ°ン-1-イル	
1699	C3F7	H	2-メチルヒ° ロリジ°ン-1-イル	

【表 7 2】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1700	C3F7	H	=CH-N(CH3)2	
1701	C3F7	H	=C(CH3)N(CH3)2	
1702	C3F7	H	=CH-N(C2H5)2	
1703	C3F7	H	=C(CH3)N(C2H5)2	
1704	C3F7	H	=CH-ヒ°ペリシ°ン	
1705	C3F7	H	=CH-モルホリ°ン	
1706	C3F7	H	=CH-ヒ°ロリシ°ン	
1707	C3F7	H	H	インダ°ン-1-イル
1708	C3F7	H	H	テトラヒト°ロフラン°ン-2-イルメチル
1709	CF(CF3)2	H	H	H
1710	C3F7	Cl	H	H
1711	C3F7	Cl	H	Me
1712	C3F7	Cl	H	Et
1713	C3F7	Cl	H	Pr
1714	C3F7	Cl	H	iPr
1715	C3F7	Cl	H	cPr
1716	C3F7	Cl	H	Bu
1717	C3F7	Cl	H	cBu
1718	C3F7	Cl	H	tBu
1719	C3F7	Cl	Me	Me
1720	C3F7	Cl	Et	Et
1721	C3F7	Cl	H	CH2-cPr
1722	C3F7	Cl	H	CH2-C(CH3)3
1723	C3F7	Cl	H	CH2CH(CH3)2

【表 7 3】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1724	C3F7	Cl	H	CH ₂ CH(CH ₂ CH ₃) ₂
1725	C3F7	Cl	H	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1726	C3F7	Cl	H	CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
1727	C3F7	Cl	H	CH ₂ CH=CH ₂
1728	C3F7	Cl	H	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂
1729	C3F7	Cl	H	CH ₂ -CCH
1730	C3F7	Cl	Me	CH ₂ -CCH
1731	C3F7	Cl	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
1732	C3F7	Cl	H	CH(CH ₃)cPr
1733	C3F7	Cl	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CH ₃
1734	C3F7	Cl	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₄ CH ₃
1735	C3F7	Cl	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1736	C3F7	Cl	H	CH(CH ₃)C(CH ₃) ₃
1737	C3F7	Cl	H	CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
1738	C3F7	Cl	H	CH(CH ₂ CH ₃) ₂
1739	C3F7	Cl	H	CH ₂ -CH(OMe) ₂
1740	C3F7	Cl	H	CH ₂ -CH(OEt) ₂
1741	C3F7	Cl	H	CH ₂ CH ₂ -OH
1742	C3F7	Cl	H	CH ₂ CH ₂ -OMe
1743	C3F7	Cl	Me	CH ₂ CH ₂ -OMe
1744	C3F7	Cl	H	CH(CH ₃)CH ₂ -OMe
1745	C3F7	Cl	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OMe
1746	C3F7	Cl	H	CH ₂ -COOCH ₃
1747	C3F7	Cl	Me	CH ₂ -COOCH ₃

【表 7 4】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1748	C3F7	Cl	H	CH(CH ₃)COOMe
1749	C3F7	Cl	H	CH(CH ₃)COOEt
1750	C3F7	Cl	H	CH ₂ CH ₂ -COOCH ₃
1751	C3F7	Br	H	H
1752	C3F7	Br	H	Me
1753	C3F7	Br	H	Et
1754	C3F7	Br	H	Pr
1755	C3F7	Br	H	iPr
1756	C3F7	Br	H	cPr
1757	C3F7	Br	H	Bu
1758	C3F7	Br	H	cBu
1759	C3F7	Br	H	tBu
1760	C3F7	Br	Me	Me
1761	C3F7	Br	Et	Et
1762	C3F7	Br	H	CH ₂ -cPr
1763	C3F7	Br	H	CH ₂ -C(CH ₃) ₃
1764	C3F7	Br	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1765	C3F7	Br	H	CH ₂ CH(CH ₂ CH ₃) ₂
1766	C3F7	Br	H	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1767	C3F7	Br	H	CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
1768	C3F7	Br	H	CH ₂ CH=CH ₂
1769	C3F7	Br	H	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂
1770	C3F7	Br	H	CH ₂ -CCH
1771	C3F7	Br	Me	CH ₂ -CCH

【表 7 5】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1772	C3F7	Br	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
1773	C3F7	Br	H	CH(CH ₃)cPr
1774	C3F7	Br	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CH ₃
1775	C3F7	Br	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₄ CH ₃
1776	C3F7	Br	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1777	C3F7	Br	H	CH(CH ₃)C(CH ₃) ₃
1778	C3F7	Br	H	CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
1779	C3F7	Br	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1780	C3F7	Br	H	CH(CH ₂ CH ₃) ₂
1781	C3F7	Br	H	CH ₂ -CH(OMe) ₂
1782	C3F7	Br	H	CH ₂ -CH(OEt) ₂
1783	C3F7	Br	H	CH ₂ CH ₂ -OH
1784	C3F7	Br	H	CH ₂ CH ₂ -OMe
1785	C3F7	Br	H	CH(CH ₃)CH ₂ -OMe
1786	C3F7	Br	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OMe
1787	C3F7	Br	H	CH ₂ -COOCH ₃
1788	C3F7	Br	Me	CH ₂ -COOCH ₃
1789	C3F7	Br	H	CH(CH ₃)COOMe
1790	C3F7	Br	H	CH(CH ₃)COOEt
1791	C3F7	Br	H	CH ₂ CH ₂ -COOCH ₃
1792	C3F7	I	H	H
1793	C3F7	I	H	Me
1794	C3F7	I	H	Et
1795	C3F7	I	H	Pr

【表 7 6】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1796	C3F7	I	H	iPr
1797	C3F7	I	H	cPr
1798	C3F7	I	H	Bu
1799	C3F7	I	H	cBu
1800	C3F7	I	H	tBu
1801	C3F7	I	Me	Me
1802	C3F7	I	Et	Et
1803	C3F7	I	H	CH ₂ -cPr
1804	C3F7	I	H	CH ₂ -C(CH ₃) ₃
1805	C3F7	I	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1806	C3F7	I	H	CH ₂ CH(CH ₂ CH ₃) ₂
1807	C3F7	I	H	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1808	C3F7	I	H	CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
1809	C3F7	I	H	CH ₂ CH=CH ₂
1810	C3F7	I	H	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂
1811	C3F7	I	H	CH ₂ -CCH
1812	C3F7	I	Me	CH ₂ -CCH
1813	C3F7	I	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
1814	C3F7	I	H	CH(CH ₃)cPr
1815	C3F7	I	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CH ₃
1816	C3F7	I	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₄ CH ₃
1817	C3F7	I	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1818	C3F7	I	H	CH(CH ₃)C(CH ₃) ₃
1819	C3F7	I	H	CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂

【表 7 7】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1820	C3F7	I	H	CH(CH ₂ CH ₃) ₂
1821	C3F7	I	H	CH ₂ -CH(OMe) ₂
1822	C3F7	I	H	CH ₂ -CH(OEt) ₂
1823	C3F7	I	H	CH ₂ CH ₂ -OH
1824	C3F7	I	H	CH ₂ CH ₂ -OMe
1825	C3F7	I	Me	CH ₂ CH ₂ -OMe
1826	C3F7	I	H	CH(CH ₃)CH ₂ -OMe
1827	C3F7	I	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OMe
1828	C3F7	I	H	CH ₂ -COOCH ₃
1829	C3F7	I	Me	CH ₂ -COOCH ₃
1830	C3F7	I	H	CH(CH ₃)COOMe
1831	C3F7	I	H	CH(CH ₃)COOEt
1832	C3F7	I	H	CH ₂ CH ₂ -COOCH ₃
1833	CF ₃	I	H	Me
1834	CF ₃	I	H	Et
1835	CF ₃	I	H	Pr
1836	CF ₃	I	H	iPr
1837	CF ₃	I	H	cPr
1838	CF ₃	I	H	Bu
1839	CF ₃	I	H	cBu
1840	CF ₃	I	H	tBu
1841	CF ₃	I	Me	Me
1842	CF ₃	I	Et	Et
1843	CF ₃	I	H	CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₃

【表 7 8】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1844	CF ₃	I	H	CH ₂ (CH ₂) ₄ CH ₃
1845	CF ₃	I	H	CH ₂ -cPr
1846	CF ₃	I	H	CH ₂ -C(CH ₃) ₃
1847	CF ₃	I	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1848	CF ₃	I	H	CH ₂ CH(CH ₂ CH ₃) ₂
1849	CF ₃	I	H	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1850	CF ₃	I	H	CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
1851	CF ₃	I	H	CH ₂ CH=CH ₂
1852	CF ₃	I	H	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂
1853	CF ₃	I	H	CH ₂ -CCH
1854	CF ₃	I	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
1855	CF ₃	I	H	CH(CH ₃)cPr
1856	CF ₃	I	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CH ₃
1857	CF ₃	I	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₄ CH ₃
1858	CF ₃	I	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1859	CF ₃	I	H	CH(CH ₃)C(CH ₃) ₃
1860	CF ₃	I	H	CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
1861	CF ₃	I	H	CH(CH ₂ CH ₃) ₂
1862	CF ₃	I	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ CH ₃
1863	CF ₃	I	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
1864	CF ₃	I	H	CH ₂ -CH(OMe) ₂
1865	CF ₃	I	H	CH ₂ -CH(OEt) ₂
1866	CF ₃	I	H	CH ₂ CH ₂ -OH
1867	CF ₃	I	H	CH ₂ CH ₂ -OMe

【表 7 9】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1868	CF ₃	I	Me	CH ₂ CH ₂ -OMe
1869	CF ₃	I	H	CH(CH ₃)CH ₂ -OMe
1870	CF ₃	I	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OMe
1871	CF ₃	I	H	CH ₂ -COOCH ₃
1872	CF ₃	I	Me	CH ₂ -COOCH ₃
1873	CF ₃	I	H	CH(CH ₃)COOMe
1874	CF ₃	I	H	CH(CH ₃)COOEt
1875	CF ₃	I	H	CH ₂ CH ₂ -COOCH ₃
1876	CF ₂ Cl	I	H	H
1877	CF ₂ Cl	I	H	Me
1878	CF ₂ Cl	I	H	Et
1879	CF ₂ Cl	I	H	Pr
1880	CF ₂ Cl	I	H	iPr
1881	CF ₂ Cl	I	H	cPr
1882	CF ₂ Cl	I	H	Bu
1883	CF ₂ Cl	I	H	cBu
1884	CF ₂ Cl	I	H	tBu
1885	CF ₂ Cl	I	Me	Me
1886	CF ₂ Cl	I	H	CH ₂ -cPr
1887	CF ₂ Cl	I	H	CH ₂ -C(CH ₃) ₃
1888	CF ₂ Cl	I	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1889	CF ₂ Cl	I	H	CH ₂ CH(CH ₂ CH ₃) ₂
1890	CF ₂ Cl	I	H	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1891	CF ₂ Cl	I	H	CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃

【表 80】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1892	CF ₂ Cl	I	H	CH ₂ CH=CH ₂
1893	CF ₂ Cl	I	Me	CH ₂ CH=CH ₂
1894	CF ₂ Cl	I	H	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂
1895	CF ₂ Cl	I	H	CH ₂ -CCH
1896	CF ₂ Cl	I	Me	CH ₂ -CCH
1897	CF ₂ Cl	I	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
1898	CF ₂ Cl	I	H	CH(CH ₃)cPr
1899	CF ₂ Cl	I	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CH ₃
1900	CF ₂ Cl	I	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₄ CH ₃
1901	CF ₂ Cl	I	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₅ CH ₃
1902	CF ₂ Cl	I	H	CH(CH ₂ CH ₃)(CH ₂) ₃ CH ₃
1903	CF ₂ Cl	I	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1904	CF ₂ Cl	I	H	CH(CH ₃)C(CH ₃) ₃
1905	CF ₂ Cl	I	H	CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
1906	CF ₂ Cl	I	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1907	CF ₂ Cl	I	H	CH(CH ₂ CH ₃) ₂
1908	CF ₂ Cl	I	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ CH ₃
1909	CF ₂ Cl	I	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
1910	CF ₂ Cl	I	H	CH ₂ -CH(OMe) ₂
1911	CF ₂ Cl	I	H	CH ₂ -CH(OEt) ₂
1912	CF ₂ Cl	I	H	CH ₂ CH ₂ -OH
1913	CF ₂ Cl	I	H	CH ₂ CH ₂ -OMe
1914	CF ₂ Cl	I	Me	CH ₂ CH ₂ -OMe
1915	CF ₂ Cl	I	H	CH ₂ CH ₂ -OEt

10

20

30

40

【表 8 1】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1916	CF ₂ Cl	I	H	CH(CH ₃)CH ₂ -OMe
1917	CF ₂ Cl	I	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OMe
1918	CF ₂ Cl	I	H	CH ₂ -COOCH ₃
1919	CF ₂ Cl	I	Me	CH ₂ -COOCH ₃
1920	CF ₂ Cl	I	H	CH(CH ₃)COOMe
1921	CF ₂ Cl	I	H	CH(CH ₃)COOEt
1922	CF ₂ Cl	I	H	CH ₂ CH ₂ -COOCH ₃
1923	CF ₂ CF ₃	I	H	Me
1924	CF ₂ CF ₃	I	H	Et
1925	CF ₂ CF ₃	I	H	Pr
1926	CF ₂ CF ₃	I	H	iPr
1927	CF ₂ CF ₃	I	H	cPr
1928	CF ₂ CF ₃	I	H	Bu
1929	CF ₂ CF ₃	I	H	cBu
1930	CF ₂ CF ₃	I	H	tBu
1931	CF ₂ CF ₃	I	Me	Me
1932	CF ₂ CF ₃	I	Et	Et
1933	CF ₂ CF ₃	I	H	CH ₂ -cPr
1934	CF ₂ CF ₃	I	H	CH ₂ -C(CH ₃) ₃
1935	CF ₂ CF ₃	I	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1936	CF ₂ CF ₃	I	H	CH ₂ CH(CH ₂ CH ₃) ₂
1937	CF ₂ CF ₃	I	H	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1938	CF ₂ CF ₃	I	H	CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
1939	CF ₂ CF ₃	I	H	CH ₂ CH=CH ₂

【表 8 2】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1940	CF ₂ CF ₃	I	Me	CH ₂ CH=CH ₂
1941	CF ₂ CF ₃	I	H	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂
1942	CF ₂ CF ₃	I	H	CH ₂ -CCH
1943	CF ₂ CF ₃	I	Me	CH ₂ -CCH
1944	CF ₂ CF ₃	I	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
1945	CF ₂ CF ₃	I	H	CH(CH ₃)cPr
1946	CF ₂ CF ₃	I	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CH ₃
1947	CF ₂ CF ₃	I	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₄ CH ₃
1948	CF ₂ CF ₃	I	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1949	CF ₂ CF ₃	I	H	CH(CH ₃)C(CH ₃) ₃
1950	CF ₂ CF ₃	I	H	CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
1951	CF ₂ CF ₃	I	H	CH(CH ₂ CH ₃) ₂
1952	CF ₂ CF ₃	I	H	CH ₂ -CH(OMe) ₂
1953	CF ₂ CF ₃	I	H	CH ₂ -CH(OEt) ₂
1954	CF ₂ CF ₃	I	H	CH ₂ CH ₂ -OH
1955	CF ₂ CF ₃	I	H	CH ₂ CH ₂ -OMe
1956	CF ₂ CF ₃	I	Me	CH ₂ CH ₂ -OMe
1957	CF ₂ CF ₃	I	H	CH(CH ₃)CH ₂ -OMe
1958	CF ₂ CF ₃	I	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OMe
1959	CF ₂ CF ₃	I	H	CH ₂ -COOCH ₃
1960	CF ₂ CF ₃	I	Me	CH ₂ -COOCH ₃
1961	CF ₂ CF ₃	I	H	CH(CH ₃)COOMe
1962	CF ₂ CF ₃	I	H	CH(CH ₃)COOEt
1963	CF ₂ CF ₃	I	H	CH ₂ CH ₂ -COOCH ₃

【表 8 3】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1964	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	H	H
1965	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	H	Me
1966	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	H	Et
1967	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	H	Pr
1968	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	H	iPr
1969	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	H	cPr
1970	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	H	Bu
1971	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	H	cBu
1972	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	H	tBu
1973	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	Me	Me
1974	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	Et	Et
1975	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ -cPr
1976	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ -C(CH ₃) ₃
1977	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1978	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ CH(CH ₂ CH ₃) ₂
1979	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1980	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
1981	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ CH=CH ₂
1982	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	Me	CH ₂ CH=CH ₂
1983	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂
1984	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ -CCH
1985	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	Me	CH ₂ -CCH
1986	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
1987	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	H	CH(CH ₃)cPr

【表 8 4】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1988	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CH ₃
1989	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₄ CH ₃
1990	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1991	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	H	CH(CH ₃)C(CH ₃) ₃
1992	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	H	CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
1993	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	H	CH(CH ₂ CH ₃) ₂
1994	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ -CH(OMe) ₂
1995	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ -CH(OEt) ₂
1996	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ CH ₂ -OH
1997	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ CH ₂ -OMe
1998	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	Me	CH ₂ CH ₂ -OMe
1999	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	H	CH(CH ₃)CH ₂ -OMe
2000	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OMe
2001	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ -COOCH ₃
2002	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	Me	CH ₂ -COOCH ₃
2003	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	H	CH(CH ₃)COOMe
2004	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	H	CH(CH ₃)COOEt
2005	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ CH ₂ -COOCH ₃
2006	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	H	H
2007	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	H	Me
2008	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	H	Et
2009	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	H	Pr
2010	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	H	iPr
2011	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	H	cPr

【表 8 5】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
2012	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	H	Bu
2013	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	H	cBu
2014	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	H	tBu
2015	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	Me	Me
2016	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	Et	Et
2017	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ -cPr
2018	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ -C(CH ₃) ₃
2019	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
2020	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ CH(CH ₂ CH ₃) ₂
2021	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
2022	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
2023	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ CH=CH ₂
2024	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	Me	CH ₂ CH=CH ₂
2025	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂
2026	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ -CCH
2027	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	Me	CH ₂ -CCH
2028	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
2029	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	H	CH(CH ₃)cPr
2030	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CH ₃
2031	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₄ CH ₃
2032	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH(CH ₃) ₂
2033	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	H	CH(CH ₃)C(CH ₃) ₃
2034	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	H	CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
2035	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	H	CH(CH ₂ CH ₃) ₂

【表 8 6】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
2036	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ -CH(OMe) ₂
2037	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ -CH(OEt) ₂
2038	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ CH ₂ -OH
2039	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ CH ₂ -OMe
2040	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	Me	CH ₂ CH ₂ -OMe
2041	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	H	CH(CH ₃)CH ₂ -OMe
2042	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OMe
2043	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ -COOCH ₃
2044	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	Me	CH ₂ -COOCH ₃
2045	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	H	CH(CH ₃)COOMe
2046	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	H	CH(CH ₃)COOEt
2047	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ CH ₂ -COOCH ₃
2048	CF ₂ CF ₂ Cl	I	H	H
2049	CF ₂ CF ₂ Cl	I	H	Me
2050	CF ₂ CF ₂ Cl	I	H	Et
2051	CF ₂ CF ₂ Cl	I	H	Pr
2052	CF ₂ CF ₂ Cl	I	H	iPr
2053	CF ₂ CF ₂ Cl	I	H	cPr
2054	CF ₂ CF ₂ Cl	I	H	Bu
2055	CF ₂ CF ₂ Cl	I	H	cBu
2056	CF ₂ CF ₂ Cl	I	H	tBu
2057	CF ₂ CF ₂ Cl	I	Me	Me
2058	CF ₂ CF ₂ Cl	I	Et	Et
2059	CF ₂ CF ₂ Cl	I	H	CH ₂ -cPr

【表 8 7】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
2060	CF ₂ CF ₂ Cl	I	H	CH ₂ -C(CH ₃) ₃
2061	CF ₂ CF ₂ Cl	I	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
2062	CF ₂ CF ₂ Cl	I	H	CH ₂ CH(CH ₂ CH ₃) ₂
2063	CF ₂ CF ₂ Cl	I	H	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
2064	CF ₂ CF ₂ Cl	I	H	CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
2065	CF ₂ CF ₂ Cl	I	H	CH ₂ CH=CH ₂
2066	CF ₂ CF ₂ Cl	I	Me	CH ₂ CH=CH ₂
2067	CF ₂ CF ₂ Cl	I	H	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂
2068	CF ₂ CF ₂ Cl	I	H	CH ₂ -CCH
2069	CF ₂ CF ₂ Cl	I	Me	CH ₂ -CCH
2070	CF ₂ CF ₂ Cl	I	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
2071	CF ₂ CF ₂ Cl	I	H	CH(CH ₃)cPr
2072	CF ₂ CF ₂ Cl	I	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CH ₃
2073	CF ₂ CF ₂ Cl	I	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₄ CH ₃
2074	CF ₂ CF ₂ Cl	I	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH(CH ₃) ₂
2075	CF ₂ CF ₂ Cl	I	H	CH(CH ₃)C(CH ₃) ₃
2076	CF ₂ CF ₂ Cl	I	H	CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
2077	CF ₂ CF ₂ Cl	I	H	CH(CH ₂ CH ₃) ₂
2078	CF ₂ CF ₂ Cl	I	H	CH ₂ -CH(OMe) ₂
2079	CF ₂ CF ₂ Cl	I	H	CH ₂ -CH(OEt) ₂
2080	CF ₂ CF ₂ Cl	I	H	CH ₂ CH ₂ -OH
2081	CF ₂ CF ₂ Cl	I	H	CH ₂ CH ₂ -OMe
2082	CF ₂ CF ₂ Cl	I	Me	CH ₂ CH ₂ -OMe
2083	CF ₂ CF ₂ Cl	I	H	CH(CH ₃)CH ₂ -OMe

【表 8 8】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
2084	CF ₂ CF ₂ Cl	I	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OMe
2085	CF ₂ CF ₂ Cl	I	H	CH ₂ -COOCH ₃
2086	CF ₂ CF ₂ Cl	I	Me	CH ₂ -COOCH ₃
2087	CF ₂ CF ₂ Cl	I	H	CH(CH ₃)COOMe
2088	CF ₂ CF ₂ Cl	I	H	CH(CH ₃)COOEt
2089	CF ₂ CF ₂ Cl	I	H	CH ₂ CH ₂ -COOCH ₃
2090	CFC1CF ₃	H	H	H
2091	CFC1CF ₃	H	H	Me
2092	CFC1CF ₃	H	H	Et
2093	CFC1CF ₃	H	H	Pr
2094	CFC1CF ₃	H	H	iPr
2095	CFC1CF ₃	H	H	cPr
2096	CFC1CF ₃	H	H	Bu
2097	CFC1CF ₃	H	H	cBu
2098	CFC1CF ₃	H	H	tBu
2099	CFC1CF ₃	H	Me	Me
2100	CFC1CF ₃	H	Et	Et
2101	CFC1CF ₃	H	H	CH ₂ -cPr
2102	CFC1CF ₃	H	H	CH ₂ -C(CH ₃) ₃
2103	CFC1CF ₃	H	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
2104	CFC1CF ₃	H	H	CH ₂ CH(CH ₂ CH ₃) ₂
2105	CFC1CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
2106	CFC1CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
2107	CFC1CF ₃	H	H	CH ₂ CH=CH ₂

【表 8 9】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
2108	CFC1CF3	H	Me	CH ₂ CH=CH ₂
2109	CFC1CF3	H	H	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂
2110	CFC1CF3	H	H	CH ₂ -CCH
2111	CFC1CF3	H	Me	CH ₂ -CCH
2112	CFC1CF3	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
2113	CFC1CF3	H	H	CH(CH ₃)cPr
2114	CFC1CF3	H	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CH ₃
2115	CFC1CF3	H	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₄ CH ₃
2116	CFC1CF3	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH(CH ₃) ₂
2117	CFC1CF3	H	H	CH(CH ₃)C(CH ₃) ₃
2118	CFC1CF3	H	H	CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
2119	CFC1CF3	H	H	CH(CH ₂ CH ₃) ₂
2120	CFC1CF3	H	H	CH ₂ -CH(OMe) ₂
2121	CFC1CF3	H	H	CH ₂ -CH(OEt) ₂
2122	CFC1CF3	H	H	CH ₂ CH ₂ -OH
2123	CFC1CF3	H	H	CH ₂ CH ₂ -OMe
2124	CFC1CF3	H	Me	CH ₂ CH ₂ -OMe
2125	CFC1CF3	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ -OMe
2126	CFC1CF3	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OMe
2127	CFC1CF3	H	H	CH ₂ -COOCH ₃
2128	CFC1CF3	H	Me	CH ₂ -COOCH ₃
2129	CFC1CF3	H	H	CH(CH ₃)COOMe
2130	CFC1CF3	H	H	CH(CH ₃)COOEt
2131	CFC1CF3	H	H	CH ₂ CH ₂ -COOCH ₃

【表 9 0】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
2132	CFC1CF3	Br	H	H
2133	CFC1CF3	Br	H	Me
2134	CFC1CF3	Br	H	Et
2135	CFC1CF3	Br	H	Pr
2136	CFC1CF3	Br	H	iPr
2137	CFC1CF3	Br	H	cPr
2138	CFC1CF3	Br	H	Bu
2139	CFC1CF3	Br	H	cBu
2140	CFC1CF3	Br	H	tBu
2141	CFC1CF3	Br	Me	Me
2142	CFC1CF3	Br	Et	Et
2143	CFC1CF3	Br	H	CH ₂ -cPr
2144	CFC1CF3	Br	H	CH ₂ -C(CH ₃) ₃
2145	CFC1CF3	Br	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
2146	CFC1CF3	Br	H	CH ₂ CH(CH ₂ CH ₃) ₂
2147	CFC1CF3	Br	H	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
2148	CFC1CF3	Br	H	CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
2149	CFC1CF3	Br	H	CH ₂ CH=CH ₂
2150	CFC1CF3	Br	Me	CH ₂ CH=CH ₂
2151	CFC1CF3	Br	H	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂
2152	CFC1CF3	Br	H	CH ₂ -C≡CH
2153	CFC1CF3	Br	Me	CH ₂ -C≡CH
2154	CFC1CF3	Br	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
2155	CFC1CF3	Br	H	CH(CH ₃)cPr

【表 9 1】

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
2156	CFC1CF3	Br	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CH ₃
2157	CFC1CF3	Br	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₄ CH ₃
2158	CFC1CF3	Br	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH(CH ₃) ₂
2159	CFC1CF3	Br	H	CH(CH ₃)C(CH ₃) ₃
2160	CFC1CF3	Br	H	CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
2161	CFC1CF3	Br	H	CH(CH ₂ CH ₃) ₂
2162	CFC1CF3	Br	H	CH ₂ -CH(OMe) ₂
2163	CFC1CF3	Br	H	CH ₂ -CH(OEt) ₂
2164	CFC1CF3	Br	H	CH ₂ CH ₂ -OH
2165	CFC1CF3	Br	H	CH ₂ CH ₂ -OMe
2166	CFC1CF3	Br	Me	CH ₂ CH ₂ -OMe
2167	CFC1CF3	Br	H	CH(CH ₃)CH ₂ -OMe
2168	CFC1CF3	Br	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OMe
2169	CFC1CF3	Br	H	CH ₂ -COOCH ₃
2170	CFC1CF3	Br	Me	CH ₂ -COOCH ₃
2171	CFC1CF3	Br	H	CH(CH ₃)COOMe
2172	CFC1CF3	Br	H	CH(CH ₃)COOEt
2173	CFC1CF3	Br	H	CH ₂ CH ₂ -COOCH ₃

【 0 2 9 2 】

【表 9 2】

表 2 : 表 1 の化合物の NMR データ

実施例 N o .	1 H-NMR データ
1	[CDC13] 3.03 (d, 3H); 6.88 (d, 1H); 8.65 (d, 1H); 9.22 (br, 1H)
2	[CDC13] 1.25 (t, 3H); 3.5 (m, 2H); 6.92 (d, 1H); 8.72 (d, 1H), 9.33 (br, 1H), 13.4 (br, 1H)
3	[CDC13] 1.02 (t, 3H); 1.62 (m, 2H); 3.42 (m, 2H); 6.90 (d, 1H); 8.70 (d, 1H); 9.35 (br, 1H); 13.3 (br, 1H)
4	[CDC13] 1.25 (d, 6H); 4.22 (m, 1H); 6.90 (d, 1H); 8.68 (d, 1H); 9.22 (d, br, 1H)
5	[CDC13] 0.61 (m, 2H); 0.89 (m, 2H); 3.00 (m, 1H); 6.90 (d, 1H); 8.68 (d, 1H), 9.31 (br, 1H)
6	[CDC13] 0.96 (t, 3H); 1.41 (m, 2H); 1.61 (m, 2H); 3.48 (q, 2H); 6.90 (d, 1H); 8.70 (d, 1H); 9.31 (br, 1H); 13.3 (br, 1H)
7	[CDC13] 1.80 (m, 2H); 2.00 (m, 2H); 2.42 (m, 2H); 4.55 (m, 1H); 6.88 (d, 1H); 8.65 (d, 1H); 9.50 (br, 1H)
8	[CDC13] 1.44 (s, 9H); 6.90 (d, 1H); 8.62 (d, 1H); 9.32 (br, 1H); 13.4 (br, 1H)
9	[CDC13] 3.05 (s, 6H); 7.10 (d, 1H); 7.77 (d, 1H)
10	[CDC13] 1.22 (t, 3H); 3.02 (s, 3H); 3.46 (m, 2H); 7.08 (d, 1H); 7.77 (d, 1H)
11	[CDC13] 0.90 (t, 3H); 1.30 (br, 2H); 1.60 (m, 2H); 3.03 (s, 3H); 3.42 (br, 2H); 7.10 (d, 1H); 7.74 (d, 1H)
13	[CDC13] 1.20 (d, 6H); 2.90 (s, 3H); 4.05 (m, br, 1H); 7.03 (d, 1H); 8.68 (d, 1H); 11.2 (br)
14	[CDC13] 1.20 (t, 6H); 3.40 (m, 4H); 7.05 (d, 1H); 8.70 (d, 1H); 11.1 (br)
16	[CDC13] 1.21 (m, 9H); 3.39 (q, 2H); 4.0 (br, 1H); 7.04 (d, 1H); 7.68 (d, 1H); 10.6 (br, 1H)
18	[CDC13] 1.5-1.8 (m, 8H); 4.40 (m, 1H); 6.90 (d, 1H); 8.68 (d, 1H); 9.40 (d, br, 1H); 13.5 (br)
19	[CDC13] 1.2-1.5 (m, 6H); 1.76 (m, 2H); 2.00 (m, 2H); 4.00 (m, 1H); 6.90 (d, 1H); 8.68 (d, 1H); 9.30 (d, br, 1H); 13.4 (br, 1H)
20	[CDC13] 0.90 (t, 3H); 1.38 (m, 4H); 1.61 (m, 2H); 3.41 (m, 2H); 6.86 (d, 1H); 8.63 (d, 1H); 9.20 (t, 1H)
22	[CDC13] 0.30 (m, 2H); 0.60 (m, 2H); 1.05 (m, 1H); 3.30 (m, 2H); 6.90 (d, 1H), 8.70 (d, 1H); 9.38 (br, 1H)

【表 9 3】

実施例No.	1H-NMRデータ
24	[CDC13] 1.00 (s, 9H); 3.28 (d, 2H); 6.90 (d, 1H); 8.73 (d, 1H); 9.4 (br, 1H); 13.2 (br, 1H)
25	[CDC13] 4.18 (dt, 2H); 6.92 (d, 1H); 8.72 (d, 1H); 9.8 (t, br, 1H)
26	[CDC13] 4.11 (m, 2H); 6.90 (d, 1H); 8.70 (d, 1H); 9.80 (br, 1H); 12.16 (br, 1H)
27	[CDC13] 4.22 (dt; 2H); 6.93 (d, 1H); 8.72 (d, 1H); 9.80 (t, br, 1H)
30	[CDC13] 1.00 (d, 6H); 1.87 (m, 1H); 3.29 (t, 2H); 6.88 (d, 1H); 8.64 (d, 1H); 9.32 (br, 1H); 12.5 (br, 1H)
32	[CDC13] 0.95 (d, 6H); 1.48 (m, 2H); 1.70 (m, 1H); 3.48 (m, 2H); 6.88 (d, 1H); 8.65 (d, 1H); 9.22 (br, 1H), 12.6 (br)
34	[CDC13] 4.10 (t, 2H); 5.22 (dd, 2H); 5.95 (m, 1H); 6.90 (d, 1H); 8.70 (d, 1H); 9.40 (br, 1H); 12.7 (br, 1H)
36	[CDC13] 4.0 (m, 4H); 5.21 (d, 4H); 5.80 (m, 2H); 7.04 (d, 1H); 7.78 (d, 1H); 11.0 (br)
38	[CDC13] 1.80 (s, 3H); 4.02 (d, 2H); 4.93 (d, 2H); 6.89 (d 1H); 8.70 (d, 1H); 9.43 (br, 1H); 13.2 (br, 1H)
39	[CDC13] 2.24 (t, 1H); 4.22 (m, 2H); 6.88 (d, 1H); 8.68 (d, 1H); 9.50 (br, 1H)
40	[CDC13] 2.30 (s, 1H); 3.12 (s, 3H); 4.22 (br, 2H); 7.04 (d, 1H); 7.84 (d, 1H); 10.9 (br)
41	[CDC13] 0.95 (t, 3H); 1.22 (d, 3H); 1.58 (m, 2H); 4.10 (m, 1H); 6.88 (d, 1H); 8.66 (d, 1H); 9.20 (br, 1H); 13.0 (br, 1H)
43	[DMSO] 0.93 (t, 3H); 1.16 (d, 3H); 1.30 (m, 2H); 1.48 (m, 2H); 4.00 (m, 1H); 7.35 (br, 1H); 7.39 (d, 1H); 8.40 (d, 1H); 13.40 (br)
44	[DMSO] 0.87 (t, 3H); 1.15 (d, 3H); 1.27 (m, 6H); 1.48 (m, 2H); 4.00 (m, 1H); 7.33 (d, 1H); 8.40 (d, 1H); 8.80 (br, 1H), 13.4 (br, 1H)
47	[CDC13] 0.93 (d, 6H); 1.22 (d, 3H); 1.35 (m, 1H), 1.50 (m, 1H); 1.65 (m, 1H); 4.23 (m, 1H); 6.90 (d, 1H); 8.64 (d, 1H); 9.20 (d, br, 1H); 13.3 (br, 1H)
48	[CDC13] 0.96 (s, 9H); 1.18 (d, 3H); 4.10 (m, 1H); 6.90 (d, 1H); 8.74 (d, 1H); 9.37 (d, br, 1H), 13.6 (br, 1H)
49	[CDC13] 0.95 (dt, 6H); 1.20 (d, 3H); 1.80 (m, 1H); 4.07 (m, 1H); 6.90 (d, 1H); 8.70 (d, 1H); 9.30 (d, br, 1H); 13.6 (br)

【表 9 4】

実施例No.	1H-NMRデータ
51	[DMSO] 0.85 (t, 6H); 1.45 (m, 2H); 1.55 (m, 2H); 3.80 (m, 1H); 7.33 (d, br, 1H); 8.38 (d, 1H); 8.65 (br, 1H); 13.5 (br, 1H)
54	[CDC13] 3.40 (s, 6H); 3.62 (t, 2H); 4.50 (t, 1H); 6.89 (d, 1H); 8.65 (d, 1H); 9.30 (br, 1H); 12.4 (br, 1H)
55	[CDC13] 1.21 (t, 6H); 3.60 (m, 4H); 3.72 (m, 2H); 4.61 (t, 1H); 6.88 (d, 1H); 8.61 (d, 1H); 9.28 (br, 1H), 12.0 (br)
56	[DMSO] 3.40 (m, 2H); 3.53 (m, 2H); 7.32 (d, br, 1H); 8.45 (d, 1H); 9.05 (br, 1H); 13.6 (br, 1H)
57	[CDC13] 3.40 (s, 3H); 3.56 (t, 2H); 3.64 (m, 2H); 6.90 (d, 1H), 8.65 (d, 1H); 9.35 (br, 1H)
64	[CDC13] 1.25 (d, 3H); 3.40 (s, 3H); 3.43 (d, 2H); 4.37 (m, 1H); 6.89 (d, 1H); 8.64 (d, 1H); 9.30 (d, br, 1H); 13.0 (br, 1H)
66	[CDC13] 1.90 (m, 2H); 3.34 (s, 3H); 3.46 (t, 2H); 3.55 (q, 2H); 6.90 (d, 1H); 8.60 (d, 1H); 9.23 (br, 1H); 12.5 (br)
71	[CDC13] 3.80 (s, 3H); 4.22 (d, 2H); 6.88 (d, 1H); 8.64 (d, 1H); 9.62 (t, 1H),
72	[CDC13] 3.10 (s, 3H); 3.75 (s, 3H); 4.25 (s, 2H); 7.18 (d, 1H); 7.80 (d, 1H)
75	[CDC13] 2.64 (t, 2H); 3.69 (s, 3H); 3.73 (m, 2H); 6.88 (d, 1H); 8.61 (d, 1H); 9.41 (t, br, 1H); 12.2 (br, 1H)
76	[CDC13] 3.83 (s, 6H); 5.42 (d, 1H); 6.90 (d, 1H); 8.63 (d, 1H), 10.2 (br, 1H),
77	[CDC13] 0.99 (t, 6H); 1.25 (t, 3H) 1.75 (m, 3H); 4.20 (m, 2H); 4.72 (m, 1H); 6.90 (d, 1H); 8.64 (d, 1H); 9.60 (d, br, 1H)
78	[CDC13] 1.05 (t, 6H); 2.30 (m, 1H); 3.78 (s, 3H); 4.72 (m, 1H); 6.90 (d, 1H); 8.70 (d, 1H); 9.76 (d, br, 1H), 13.6 (br, 1H)
79	[CDC13] 1.35 (t, 3H); 4.10 (q, 2H); 6.91 (d, 1H); 8.71 (d, 1H); 11.46 (s, 1H)
80	[CDC13] 3.41 (s, 3H); 3.68 (s, 3H); 7.18 (d, 1H); 8.32 (d, 1H)
81	[CDC13] 4.50 (d, 2H); 5.3 (m, 2H); 6.0 (m, 1H); 6.90 (d, 1H); 8.70 (d, 1H); 11.43 (s, 1H)
82	[CDC13] 1.36 (s, 9H); 6.92 (d, 1H); 8.72 (d, 1H); 11.22 (s, 1H); 13.0 (br, 1H)
92	[CDC13] 4.62 (d, 2H), 6.84 (d, 1H); 7.3 (m, 5H); 8.70 (d, 1H); 9.65 (br, 1H), 13.0 (br, 1H)
93	[CDC13] 2.95 (s, 3H); 4.65 (br, 2H); 7.05 (d, 1H); 7.3 (m, 5H), 7.82 (d, 1H); 11.7 (br)

10

20

30

40

【表 9 5】

実施例No.	1H-NMRデータ
94	[DMSO] 4.55 (d, 2H); 7.33 (d, 1H); 7.37 (dd, 1H); 7.75 (dt, 1H); 8.40 (d, 1H); 8.48 (dd, 1H); 8.58 (s, 1H); 9.45 (br, 1H); 13.4 (br, 1H)
95	[DMSO] 4.55 (d, 2H); 7.30 (d, br, 1H); 7.50 (d, 1H); 7.80 (dd, 1H); 8.37 (m, 2H); 9.55 (br, 1H); 13.4 (br, 1H)
96	[CDC13] 1.59 (d, 3H); 5.25 (m, 1H); 6.88 (d, 1H); 7.2-7.4 (m, 5H); 8.68 (d, 1H); 9.75 (d, br, 1H); 13.5 (br, 1H)
97	[CDC13] 2.94 (t, 2H); 3.70 (m, 2H); 6.85 (d, 1H); 7.2-7.4 (m, 5H); 8.62 (d, 1H); 9.24 (br, 1H)
98	[CDC13] 4.81 (d, 2H); 6.85 (d, 1H); 7.40 (t, 1H); 7.52 (t, 1H); 7.61 (d, 1H); 7.67 (d, 1H); 8.68 (d, 1H); 9.68 (t, br, 1H)
99	[DMSO] 2.28 (q, 2H); 3.20 (q, 2H); 4.03 (t, 1H); 7.1-7.4 (m, 11H); 8.35 (d, 1H); 9.0 (br), 13.4 (br, 1H)
100	[CDC13] 3.45-3.55 (br, 4H); 3.75 (m, 4H); 7.03 (d, 1H); 7.80 (d, 1H); 11.3 (br, 1H)
101	[CDC13] 1.65 (m, 6H); 3.52 (m, 4H); 7.10 (d, 1H); 7.72 (d, 1H)
102	[CDC13] 3.06 (t, 2H); 3.90 (m, 2H); 4.65 (m, 2H); 7.08 (d, 1H); 7.90 (d, 1H); 11.0 (br)
103	[CDC13] 2.00 (m, 4H); 3.67 (m, 4H); 7.20 (d, 1H); 7.97 (d, 1H), 11.7 (br, 1H)
104	[CDC13] 1.30 (m, 3H); 1.65 (m, 1H); 1.85 (m, 1H); 2.00 (m, 1H); 2.19 (m, 1H); 3.62 (m, 2H); 4.30 (m, 1H); 7.10 (d, 1H); 7.89 (d, 1H)
105	[CDC13] 3.25 (s, 3H); 3.35 (s, 3H); 7.25 (d, 1H); 8.58 (d, 1H); 8.76 (s, 1H)
112	[CDC13] 1.95 (m, 1H); 2.65 (m, 1H); 2.90 (m, 1H); 3.05 (m, 1H); 5.60 (m, 1H); 6.85 (d, 1H); 7.2-7.4 (m, 4H); 8.68 (d, 1H); 9.52 (d, br, 1H)
113	[CDC13] 1.60 (m, 1H), 1.90 (m, 2H), 2.01 (m, 1H); 3.42 (m, 1H), 3.65-3.82 (m, 2H), 3.90 (m, 1H), 4.09 (m, 1H); 6.88 (d, 1H); 8.63 (d, 1H); 9.37 (br, 1H)
114	[DMSO] 7.35 (d, 1H); 8.10 (br, 1H); 8.40 (d, 1H); 8.41 (br, 1H); 13.6 (br, 1H)
115	[CDC13] 3.01 (d, 3H); 6.81 (d, 1H); 8.63 (d, 1H); 9.22 (br, 1H); 11.7 (br, 1H)
116	[CDC13] 1.25 (t, 3H); 3.5 (m, 2H); 6.85 (d, 1H); 8.66 (d, 1H), 9.33 (br, 1H), 13.0 (br, 1H)

10

20

30

40

【表 9 6】

実施例No.	1H-NMRデータ
117	[CDC13] 1.01 (t, 3H); 1.62 (m, 2H); 3.42 (m, 2H); 6.86 (d, 1H); 8.66 (d, 1H); 9.35 (br, 1H); 12.6 (br, 1H)
118	[CDC13] 1.27 (d, 6H); 4.25 (m, 1H); 6.85 (d, 1H); 8.64 (d, 1H); 9.27 (br, 1H); 13.1 (br, 1H)
119	[CDC13] 0.62 (m, 2H); 0.85 (m, 2H); 3.02 (m, 1H); 6.84 (d, 1H); 8.78 (d, 1H), 9.33 (br, 1H)
120	[CDC13] 0.98 (t, 3H); 1.41 (m, 2H); 1.61 (m, 2H); 3.45 (q, 2H); 6.83 (d, 1H); 8.65 (d, 1H); 9.33 (br, 1H); 12.9 (br, 1H)
121	[CDC13] 1.80 (m, 2H); 2.05 (m, 2H); 2.44 (m, 2H); 4.58 (m, 1H); 6.84 (d, 1H); 8.63 (d, 1H); 9.60 (br, 1H); 13.1 (br)
122	[CDC13] 1.46 (s, 9H); 6.86 (d, 1H); 8.62 (d, 1H); 9.34 (br, 1H); 13.4 (br, 1H)
123	[CDC13] 3.08 (s, 6H); 7.06 (d, 1H); 7.79 (d, 1H)
124	[CDC13] 1.23 (t, 3H); 3.04 (s, 3H); 3.46 (m, 2H); 7.02 (d, 1H); 7.72 (d, 1H)
125	[CDC13] 0.92 (t, 3H); 1.30 (br, 2H); 1.60 (m, 2H); 3.04 (s, 3H); 3.41 (br, 2H); 7.04 (d, 1H); 7.71 (d, 1H)
127	[CDC13] 1.20 (d, 6H); 2.90 (s, 3H); 4.05 (m, br, 1H); 7.00 (d, 1H); 7.68 (d, 1H)
128	[CDC13] 1.20 (t, 6H); 3.41 (m, 4H); 6.98 (d, 1H); 7.66 d, 1H); 11.0 (br)
130	[CDC13] 1.20 (m, 9H); 3.40 (q, 2H); 4.06 (m, br, 1H); 6.98 (d, 1H); 8.64 (d, 1H); 10.2 (br)
132	[CDC13] 1.5-1.8 (m, 8H); 4.40 (m, 1H); 6.85 (d, 1H); 8.65 (d, 1H); 9.40 (d, br, 1H); 13.1 (br, 1H)
133	[CDC13] 1.2-1.7 (m, 6H); 1.80 (m, 2H); 2.00 (m, 2H); 3.98 (m, 1H); 6.85 (d, 1H); 8.64 (d, 1H); 9.30 (d, br, 1H); 13.0 (br)
134	[CDC13] 0.90 (t, 3H); 1.40 (m, 4H); 1.62 (m, 2H); 3.44 (m, 2H); 6.84 (d, 1H); 8.64 (d, 1H); 9.30 (br, 1H)
136	[CDC13] 0.30 (m, 2H); 0.59 (m, 2H); 1.05 (m, 1H); 3.32 (m, 2H); 6.86 (d, 1H), 8.65 (d, 1H); 9.40 (br)
138	[CDC13] 1.00 (s, 9H); 3.26 (d, 2H); 6.86 (d, 1H); 8.70 (d, 1H); 9.42 (br, 1H); 12.5 (br, 1H)
139	[DMSO] 4.25 (dt, 2H); 7.25 (d, 1H); 8.40 (d, 1H); 9.35 (br, 1H); 13.5 (br, 1H)
140	[CDC13] 4.15 (m, 2H); 6.88 (d, 1H); 8.70 (d, 1H); 9.80 (br, 1H)

10

20

30

40

【表 97】

実施例No.	1H-NMRデータ
141	[CDC13] 4.20 (dt, 2H); 6.90 (d, 1H); 8.70 (d, 1H); 9.83 (t, br, 1H); 12.80 (br)
144	[CDC13] 1.00 (d, 6H); 1.90 (m, 1H); 3.30 (t, 2H); 6.83 (d, 1H); 8.65 (d, 1H); 9.35 (br, 1H); 12.2 (br)
146	[CDC13] 0.96 (d, 6H); 1.50 (m, 2H); 1.70 (m, 1H); 3.48 (m, 2H); 6.83 (d, 1H); 8.67 (d, 1H); 9.30 (br, 1H), 12.9 (br, 1H)
148	[CDC13] 4.62 (d, 2H); 5.36 (dd, 2H); 5.95 (m, 1H); 7.80 (d, 1H); 8.65 (d, 1H)
150	[CDC13] 4.0 (m, 4H); 5.22 (d, 4H); 5.80 (m, 2H); 6.93 (d, 1H); 7.72 (d, 1H)
152	[CDC13] 1.80 (s, 3H); 4.02 (d, 2H); 4.90 (d, 2H); 6.85 (d, 1H); 8.68 (d, 1H); 9.48 (br, 1H); 12.8 (br, 1H)
153	[CDC13] 2.26 (t, 1H); 4.23 (m, 2H); 6.84 (d, 1H); 8.64 (d, 1H); 9.58 (br, 1H); 12.4 (br)
154	[CDC13] 2.30 (s, 1H); 3.12 (s, 3H); 4.24 (br, 2H); 7.01 (d, 1H); 7.82 (d, 1H); 10.9 (br)
155	[CDC13] 0.98 (t, 3H); 1.22 (d, 3H); 1.59 (m, 2H); 4.10 (m, 1H); 6.85 (d, 1H); 8.65 (d, 1H); 9.26 (d, br, 1H); 13.4 (br, 1H)
157	[CDC13] 0.92 (t, 3H); 1.22 (d, 3H); 1.40 (m, 2H); 1.55 (m, 2H); 4.20 (m, 1H); 6.85 (d, 1H); 8.68 (d, 1H); 9.30 (d, br, 1H)
158	[CDC13] 0.87 (t, 3H); 1.12 (d, 3H); 1.30 (m, 4H); 1.58 (m, 4H); 4.15 (m, 1H); 6.84 (d, 1H); 8.65 (d, 1H); 9.24 (br, 1H), 13.1 (br)
161	[CDC13] 0.90 (d, 6H); 1.22 (d, 3H); 1.30 (m, 1H); 1.55 (m, 2H); 4.23 (m, 1H); 6.86 (d, 1H); 8.64 (d, 1H); 9.20 (d, br, 1H); 13.0 (br, 1H)
162	[CDC13] 0.98 (s, 9H); 1.20 (d, 3H); 4.10 (m, 1H); 6.87 (d, 1H); 8.70 (d, 1H); 9.38 (d, br, 1H), 13.2 (br, 1H)
163	[CDC13] 0.95 (dt, 6H); 1.20 (d, 3H); 1.82 (m, 1H); 4.05 (m, 1H); 6.84 (d, 1H); 8.68 (d, 1H); 9.30 (d, br, 1H); 13.1 (br)
165	[CDC13] 0.96 (t, 6H); 1.50 (m, 2H); 1.65 (m, 2H); 4.00 (m, 1H); 6.85 (d, 1H); 8.68 (d, 1H); 9.22 (d, br, 1H); 13.5 (br, 1H)
166	[CDC13] 0.90 (t, 3H); 1.41 (s, 6H); 1.85 (q, 2H); 6.82 (d, 1H); 8.61 (d, 1H); 9.20 (br, 1H); 13.1 (br)
168	[CDC13] 3.40 (s, 6H); 3.63 (t, 2H); 4.50 (t, 1H); 6.85 (d, 1H); 8.65 (d, 1H); 9.40 (br, 1H); 12.4 (br, 1H)
169	[CDC13] 1.21 (t, 6H); 3.60 (m, 4H); 3.74 (m, 2H); 4.62 (t, 1H); 6.84 (d, 1H); 8.60 (d, 1H); 9.35 (br, 1H), 11.5 (br)

【表 9 8】

実施例No.	1H-NMRデータ
171	[CDC13] 3.40 (s, 3H); 3.58 (m, 2H); 3.67 (m, 2H); 6.84 (d, 1H), 8.62 (d, 1H); 9.40 (br, 1H)
178	[CDC13] 1.24 (d, 3H); 3.40 (s, 3H); 3.42 (d, 2H); 4.40 (m, 1H); 6.86 (d, 1H); 8.64 (d, 1H); 9.35 (br, 1H); 13.0 (br)
180	[DMSO] 1.75 (m, 2H); 3.22 (s, 3H); 3.36 (m, 4H); 7.3 (br, 1H); 8.4 (d, 1H); 9.0 (br); 13.4 (br, 1H)
185	[DMSO] 3.65 (s, 3H); 4.12 (d, 2H); 7.28 (d, br, 1H); 8.42 (d, 1H); 9.25 (t, br, 1H), 13.6 (br, 1H)
189	[CDC13] 2.66 (t, 2H); 3.70 (s, 3H); 3.76 (m, 2H); 6.83 (d, 1H); 8.61 (d, 1H); 9.51 (t, br, 1H); 12.4 (br, 1H)
193	[CDC13] 1.37 (t, 3H); 4.08 (q, 2H); 6.88 (d, 1H); 8.69 (d, 1H); 11.48 (s, 1H)
194	[CDC13] 3.88 (s, 3H); 6.88 (d, 1H); 8.65 (d, 1H); 11.5 (s, 1H)
195	[CDC13] 4.50 (d, 2H); 5.34 (m, 2H); 6.05 (m, 1H); 6.88 (d, 1H); 8.70 (d, 1H); 11.44 (s, 1H)
196	[CDC13] 1.39 (s, 9H); 6.88 (d, 1H); 8.70 (d, 1H); 11.22 (s, 1H)
206	[CDC13] 4.62 (d, 2H), 6.82 (d, 1H); 7.2-7.3 (m, 5H); 8.68 (d, 1H); 9.65 (t, br, 1H), 12.8 (br, 1H)
207	[CDC13] 2.99 (s, 3H); 4.67 (br, 2H); 7.00 (d, 1H); 7.3-7.4 (m, 5H), 7.78 (d, 1H); 10.2 (br)
210	[CDC13] 1.60 (d, 3H); 5.30 (m, 1H); 6.85 (d, 1H); 7.2-7.4 (m, 5H); 8.65 (d, 1H); 9.78 (d, br, 1H); 13.2 (br, 1H)
211	[CDC13] 2.95 (t, 2H); 3.70 (m, 2H); 6.82 (d, 1H); 7.2-7.35 (m, 5H); 8.63 (d, 1H); 9.40 (t, br, 1H); 12.2 (br, 1H)
214	[CDC13] 3.45-3.55 (br, 4H); 3.75 (m, 4H); 6.96 (d, 1H); 7.78 (d, 1H)
215	[CDC13] 1.65 (m, 6H); 3.53 (m, 4H); 7.00 (d, 1H); 7.70 (d, 1H)
216	[CDC13] 3.05 (t, 2H); 3.92 (m, 2H); 4.66 (m, 2H); 7.04 (d, 1H); 7.86 (d, 1H); 10.4 (br)
217	[CDC13] 2.00 (m, 4H); 3.70 (m, 4H); 7.16 (d, 1H); 7.97 (d, 1H), 11.7 (br, 1H)
218	[CDC13] 1.30 (m, 3H); 1.65 (m, 1H); 1.85 (m, 1H); 2.04 (m, 1H); 2.20 (m, 1H); 3.63 (m, 2H); 4.33 (m, 1H); 7.12 (d, 1H); 7.89 (d, 1H), 11.5 (br, 1H)
227	[CDC13] 1.60 (m, 1H), 1.90 (m, 2H), 2.00 (m, 1H); 3.42 (m, 1H), 3.65-3.82 (m, 2H), 3.90 (m, 1H), 4.10 (m, 1H); 6.88 (d, 1H); 8.65 (d, 1H); 9.5 (br, 1H)

10

20

30

40

【表 99】

実施例No.	1H-NMRデータ
228	[DMSO] 6.80 (br, 1H); 6.90 (t, 1H); 7.72 (br, 1H); 8.40 (d, 1H); 8.90 (br, 1H); 13.20 (br, 1H)
229	[DMSO] 2.82 (d, 3H); 6.75 (d, br, 1H); 6.90 (t, 1H); 8.89 (d, 1H); 9.50 (br, 1H); 13.2 (br, 1H)
230	[DMSO] 1.11 (t, 3H); 3.32 (m, 2H); 6.75 (d, br, 1H); 6.90 (t, 1H); 8.39 (d, 1H), 9.60 (br, 1H), 13.2 (br, 1H)
232	[CDC13] 1.25 (d, 6H); 4.22 (m, 1H); 6.55 (t, 1H); 6.69 (d, 1H); 8.64 (d, 1H); 9.42 (d, br, 1H); 13.0 (br, 1H)
233	[DMSO] 0.51 (m, 2H); 0.74 (m, 2H); 2.84 (m, 1H); 6.79 (d, br, 1H); 6.90 (t, 1H); 8.37 (d, 1H); 9.65 (br, 1H); 13.1 (br, 1H)
250	[DMSO] 0.23 (m, 2H); 0.46 (m, 2H); 1.02 (m, 1H); 3.20 (m, 2H); 6.75 (br, 1H), 6.92 (t, 1H); 8.40 (d, 1H); 9.70 (br, 1H); 13.1 (br, 1H)
252	[DMSO] 0.91 (s, 9H); 3.15 (d, 2H); 6.80 (br, 1H); 6.91 (t, 1H); 8.40 (d, 1H); 9.85 (br, 1H); 13.2 (br, 1H)
258	[DMSO] 0.90 (d, 6H); 1.80 (m, 1H); 3.15 (t, 2H); 6.80 (br, 1H); 6.91 (t, 1H); 8.40 (d, 1H); 9.73 (br, 1H); 13.1 (br, 1H)
262	[DMSO] 3.96 (m, 2H); 5.15 (dd, 2H); 5.94 (m, 1H); 6.80 (br, 1H); 6.92 (t, 1H); 8.40 (d, 1H); 9.75 (br, 1H); 13.2 (br, 1H)
271	[CDC13] 0.92 (t, 3H); 1.25 (d, 3H); 1.42 (m, 2H); 1.55 (m, 2H); 4.19 (m, 1H); 6.60 (t, 1H); 6.73 (d, 1H); 8.66 (d, 1H); 9.50 (d, br, 1H)
272	[CDC13] 0.90 (t, 3H); 1.2-1.4 (m, 9H); 1.58 (m, 2H); 4.17 (m, 1H); 6.60 (t, 1H); 6.75 (d, 1H); 8.68 (d, 1H); 9.48 (d, br, 1H)
279	[CDC13] 0.85 (t, 6H); 1.45 (m, 2H); 1.55 (m, 2H); 3.80 (m, 1H); 6.80 (br, 1H); 6.91 (t, 1H); 8.40 (d, 1H); 9.51 (br, 1H); 13.1 (br, 1H)
280	[DMSO] 0.86 (t, 3H); 1.12 (d, 3H); 1.50 (m, 2H); 3.90 (m, 1H); 6.75 (br, 1H); 6.91 (t, 1H); 8.39 (d, 1H); 9.57 (br, 1H); 13.1 (br, 1H)
285	[DMSO] 3.29 (s, 3H); 3.46 (m, 4H); 6.76 (br, 1H), 6.91 (t, 1H); 8.50 (d, 1H); 9.73 (br, 1H), 13.1 (br, 1H)
291	[DMSO] 1.14 (d, 3H); 3.27 (s, 3H); 3.35 (m, 2H); 4.15 (m, 1H); 6.80 (br, 1H); 6.91 (t, 1H); 8.40 (d, 1H); 9.70 (br, 1H); 13.1 (br, 1H)
293	[DMSO] 1.72 (m, 2H); 3.22 (s, 3H); 3.37 (m, 4H); 6.75 (br, 1H); 6.90 (t, 1H); 8.40 (d, 1H); 9.70 (br, 1H); 13.2 (br, 1H)

10

20

30

40

【0300】

【表 100】

実施例No.	1H-NMRデータ
341	[DMSO] 7.45 (d, 1H); 8.15 (br, 1H); 8.45 (br, 1H); 8.50 (d, 1H); 13.7 (br, 1H)
342	[CDC13] 3.01 (d, 3H); 6.90 (d, 1H); 8.72 (d, 1H); 9.34 (br, 1H)
343	[DMSO] 1.11 (t, 3H); 3.31 (m, 2H); 7.41 (d, 1H); 8.42 (d, 1H); 8.85 (br, 1H), 13.4 (br, 1H)
344	[CDC13] 1.02 (t, 3H); 1.61 (m, 2H); 3.42 (q, 2H); 6.88 (d, 1H); 8.72 (d, 1H); 9.38 (br, 1H)
345	[CDC13] 1.25 (d, 6H); 4.25 (m, 1H); 6.90 (d, 1H); 8.72 (d, 1H); 9.30 (d, br, 1H); 13.8 (br, 1H)
346	[CDC13] 0.60 (m, 2H); 0.88 (m, 2H); 3.02 (m, 1H); 6.90 (d, 1H); 8.72 (d, 1H); 9.42 (br, 1H); 13.4 (br)
347	[DMSO] 0.88 (t, 3H); 1.34 (m, 2H); 1.50 (m, 2H); 3.31 (q, 2H); 7.27 (d, 1H); 8.35 (d, 1H); 9.21 (br, 1H); 12.4 (br, 1H)
348	[DMSO] 1.70 (m, 2H); 2.02 (m, 2H); 2.27 (m, 2H); 4.40 (m, 1H); 7.41 (d, 1H); 8.48 (d, 1H); 9.00 (br, 1H); 13.4 (br, 1H)
349	[DMSO] 1.36 (s, 9H); 7.35 (d, br, 1H); 8.40 (d, 1H); 8.60 (br, 1H); 13.3 (br, 1H)
350	[CDC13] 3.08 (s, 6H); 7.08 (d, 1H); 7.81 (d, 1H)
355	[CDC13] 1.21 (t, 6H); 3.42 (m, 4H); 7.04 (d, 1H); 7.71 (d, 1H); 10.8 (br)
363	[DMSO] 0.27 (m, 2H); 0.46 (m, 2H); 1.05 (m, 1H); 3.15 (m, 2H); 7.45 (d, br, 1H); 8.45 (d, 1H); 8.95 (br, 1H); 13.4 (br, 1H)
365	[DMSO] 0.91 (s, 9H); 3.15 (d, 2H); 7.38 (d, br, 1H); 8.40 (d, 1H); 8.83 (br, 1H); 13.4 (br, 1H)
373	[DMSO] 0.90 (d, 6H); 1.42 (m, 2H); 1.63 (m, 1H); 3.33 (m, 2H); 7.40 (d, br, 1H); 8.40 (d, 1H); 8.83 (br, 1H), 13.4 (br, 1H)
375	[DMSO] 3.95 (m, 2H); 5.15 (dd, 2H); 5.90 (m, 1H); 7.40 (d, 1H); 8.41 (d, 1H); 8.98 (br, 1H); 13.4 (br, 1H)
379	[DMSO] 1.73 (s, 3H); 3.88 (m, 2H); 4.75 (d, 2H); 7.40 (d, br, 1H); 8.41 (d, 1H); 8.97 (br, 1H); 13.4 (br, 1H)
380	[DMSO] 3.15 (t, 1H); 4.21 (m, 2H); 7.40 (d, 1H); 8.40 (d, 1H); 9.12 (br, 1H); 13.3 (br, 1H)
382	[CDC13] 0.97 (t, 3H); 1.22 (d, 3H); 1.59 (m, 2H); 4.10 (m, 1H); 6.88 (d, 1H); 8.72 (d, 1H); 9.24 (d, br, 1H); 13.6 (br)
384	[CDC13] 0.92 (t, 3H); 1.21 (d, 3H); 1.40 (m, 2H); 1.50 (m, 2H); 4.20 (m, 1H); 6.88 (d, 1H); 8.72 (d, 1H); 9.28 (d, br, 1H)

10

20

30

40

【0301】

【表 101】

実施例No.	1H-NMRデータ
385	[DMSO] 0.85 (t, 3H); 1.1-1.35 (m, 9H); 1.50 (m, 2H); 4.00 (m, 1H); 7.41 (d, 1H); 8.40 (d, 1H); 8.65 (br, 1H); 13.4 (br, 1H)
388	[DMSO] 0.88 (d, 6H); 1.15 (d, 3H), 1.28 (m, 1H); 1.48 (m, 1H); 1.62 (m, 1H); 4.11 (m, 1H); 7.40 (d, br, 1H); 8.40 (d, 1H); 8.52 (d, br, 1H); 13.4 (br, 1H)
389	[DMSO] 0.90 (s, 9H); 1.10 (d, 3H); 3.90 (m, 1H); 7.38 (d, br, 1H); 8.40 (d, 1H); 8.70 (br, 1H), 13.4 (br, 1H)
390	[DMSO] 0.79 (dt, 6H); 1.10 (d, 3H); 1.75 (m, 1H); 3.87 (m, 1H); 7.40 (d, br, 1H); 8.41 (d, 1H); 8.65 (d, br, 1H); 13.4 (br, 1H)
392	[CDCl ₃] 0.95 (t, 6H); 1.50 (m, 2H); 1.65 (m, 2H); 4.00 (m, 1H); 6.90 (d, 1H); 8.75 (d, 1H); 9.20 (d, br, 1H); 13.7 (br, 1H)
395	[DMSO] 3.30 (s, 6H); 3.42 (t, 2H); 4.50 (t, 1H); 7.40 (d, br, 1H); 8.45 (d, 1H); 8.90 (br, 1H); 13.4 (br, 1H)
397	[DMSO] 3.38 (m, 2H); 3.52 (m, 2H); 4.80 (t, 1H); 7.40 (d, br, 1H); 8.43 (d, 1H); 8.95 (br, 1H); 13.4 (br, 1H)
398	[CDCl ₃] 3.38 (s, 3H); 3.58 (m, 2H); 3.65 (m, 2H); 6.88 (d, 1H), 8.70 (d, 1H); 9.43 (br, 1H)
405	[CDCl ₃] 1.25 (d, 3H); 3.38 (s, 3H); 3.42 (d, 2H); 4.40 (m, 1H); 6.88 (d, 1H); 8.70 (d, 1H); 9.38 (d, br, 1H)
407	[CDCl ₃] 1.89 (m, 2H); 3.32 (s, 3H); 3.48 (t, 2H); 3.58 (m, 2H); 6.92 (d, 1H); 8.64 (d, 1H); 9.30 (br, 1H)
455	[DMSO] 8.25 (br, 1H); 8.35 (br, 1H); 8.50 (s, 1H); 13.8 (br, 1H)
456	[DMSO] 2.84 (d, 3H); 8.40 (s, 1H); 8.72 (d, br, 1H)
457	[DMSO] 1.12 (t, 3H); 3.35 (q, 2H); 8.40 (s, 1H); 8.75 (t, br, 1H); 13.5 (br, 1H)
458	[DMSO] 0.89 (t, 3H); 1.52 (m, 2H); 3.25 (m, 2H); 8.41 (s, 1H); 8.73 (t, br, 1H); 13.4 (br, 1H)
459	[DMSO] 1.19 (d, 6H); 4.08 (m, 1H); 8.43 (s, 1H); 8.59 (d, br, 1H); 13.4 (br, 1H)
460	[DMSO] 0.59 (m, 2H); 0.75 (m, 2H); 2.87 (m, 1H); 8.39 (s, 1H); 8.73 (d, br, 1H)
461	[DMSO] 0.90 (t, 3H); 1.32 (m, 2H); 1.50 (m, 2H); 3.30 (m, 2H); 8.41 (s, 1H); 8.74 (t, br, 1H); 13.5 (br, 1H)
462	[DMSO] 1.70 (m, 2H); 2.03 (m, 2H); 2.25 (m, 2H); 4.40 (m, 1H); 8.41 (s, 1H); 8.90 (d, br, 1H); 13.5 (br, 1H)
477	[DMSO] 0.25 (m, 2H); 0.47 (m, 2H); 1.02 (m, 1H); 3.19 (t, 2H); 8.45 (s, 1H); 8.80 (t, br, 1H)

【0302】

【表 1 0 2】

実施例No.	1 H-NMRデータ
479	[DMSO] 0.90 (s, 9H); 3.14 (d, 2H); 8.38 (s, 1H); 8.60 (t, br, 1H); 13.7 (br, 1H)
485	[DMSO] 0.89 (d, 6H); 1.82 (m, 1H); 3.13 (t, 2H); 8.40 (s, 1H); 8.72 (t, br, 1H)
487	[DMSO] 0.90 (d, 6H); 1.41 (q, 2H); 1.62 (m, 1H); 3.32 (m, 2H); 8.40 (s, 1H); 8.72 (t, br, 1H); 13.5 (br, 1H)
489	[CDCl ₃] 4.10 (d, 2H); 5.25 (dd, 2H); 5.93 (m, 1H); 8.60 (s, 1H); 9.10 (br, 1H); 12.4 (br, 1H)
493	[DMSO] 1.71 (s, 3H); 3.86 (d, 2H); 4.84 (d, 2H); 8.40 (s, 1H); 8.85 (t, br, 1H); 13.5 (br)
494	[DMSO] 3.17 (m, 1H); 4.11 (m, 2H); 8.39 (s, 1H); 8.98 (t, br, 1H), 13.4 (br)
496	[CDCl ₃] 0.95 (t, 3H); 1.25 (d, 3H); 1.60 (m, 2H); 4.12 (m, 1H); 8.48 (s, 1H); 8.52 (br, 1H)
498	[CDCl ₃] 0.95 (t, 3H); 1.25 (d, 3H); 1.40 (m, 2H); 1.55 (m, 2H); 4.17 (m, 1H); 8.53 (s, 1H); 8.70 (br, 1H)
499	[CDCl ₃] 0.87 (t, 3H); 1.21 (d, 3H); 1.32 (m, 6H); 1.53 (m, 2H); 4.15 (m, 1H); 8.62 (s, 1H); 8.99 (d, br, 1H); 13.0 (br)
502	[CDCl ₃] 0.91 (d, 6H); 1.23 (d, 3H); 1.35 (m, 1H); 1.48 (m, 1H); 1.66 (m, 1H); 4.25 (m, 1H); 8.62 (s, 1H); 8.96 (d, br, 1H); 12.9 (br, 1H)
504	[CDCl ₃] 0.95 (m, 6H); 1.18 (d, 3H); 1.81 (m, 1H); 4.07 (m, 1H); 8.61 (s, 1H); 8.97 (d, br, 1H); 12.9 (br, 1H)
506	[CDCl ₃] 0.94 (t, 6H); 1.50 (m, 2H); 1.65 (m, 2H), 4.00 (m, 1H); 8.56 (s, 1H); 8.73 (d, br, 1H)
512	[DMSO] 3.28 (s, 3H); 3.48 (m, 4H); 8.42 (s, 1H); 8.78 (br, 1H); 13.7 (br, 1H)
519	[DMSO] 1.16 (d, 3H); 3.30 (s, 3H); 3.42 (m, 2H); 4.18 (m, 1H); 8.42 (s, 1H); 8.60 (d, br, 1H); 13.7 (br, 1H)
521	[DMSO] 1.74 (m, 2H); 3.26 (s, 3H); 3.39 (m, 4H); 8.40 (s, 1H); 8.80 (t, br, 1H); 13.6 (br, 1H)
569	[DMSO] 8.25 (br, 1H); 8.35 (br, 1H); 8.50 (s, 1H); 13.7 (br, 1H)
570	[DMSO] 2.82 (d, 3H); 8.40 (s, 1H); 8.71 (br, 1H); 13.5 (br, 1H)
571	[DMSO] 1.12 (t, 3H); 3.35 (q, 2H); 8.40 (s, 1H); 8.75 (t, br, 1H); 13.7 (br, 1H)
572	[DMSO] 0.89 (t, 3H); 1.52 (m, 2H); 3.26 (m, 2H); 8.39 (s, 1H); 8.82 (br, 1H)

【 0 3 0 3】

【表 103】

実施例No.	1H-NMRデータ
573	[DMSO] 1.18 (d, 6H); 4.09 (m, 1H); 8.42 (s, 1H); 8.53 (d, br, 1H); 13.5 (br, 1H)
574	[DMSO] 0.59 (m, 2H); 0.74 (m, 2H); 2.85 (m, 1H); 8.37 (s, 1H); 8.72 (d, br, 1H)
575	[DMSO] 0.89 (t, 3H); 1.35 (m, 2H); 1.50 (m, 2H); 3.35 (m, 2H); 8.39 (s, 1H); 8.75 (br, 1H)
576	[DMSO] 1.70 (m, 2H); 2.05 (m, 2H); 2.25 (m, 2H); 4.40 (m, 1H); 8.40 (s, 1H); 8.94 (br, 1H)
591	[DMSO] 0.25 (m, 2H); 0.45 (m, 2H); 1.03 (m, 1H); 3.21 (t, 2H); 8.40 (s, 1H); 8.84 (br, 1H)
599	[DMSO] 0.89 (d, 6H); 1.82 (m, 1H); 3.14 (m, 2H); 8.38 (s, 1H); 8.74 (br, 1H)
601	[CDCl3] 0.96 (d, 6H); 1.51 (m, 2H); 1.70 (m, 1H); 3.49 (m, 2H); 8.59 (s, 1H); 9.02 (br, 1H); 12.2 (br)
603	[DMSO] 3.95 (t, 2H); 5.18 (dd, 2H); 5.89 (m, 1H); 8.40 (s, 1H); 8.85 (t, br, 1H); 13.6 (br, 1H)
612	[CDCl3] 0.91 (t, 3H); 1.24 (d, 3H); 1.40 (m, 2H); 1.54 (m, 2H); 4.18 (m, 1H); 8.57 (s, 1H); 8.90 (d, br, 1H); 12.2 (br, 1H)
620	[CDCl3] 0.94 (t, 6H); 1.51 (m, 2H); 1.67 (m, 2H); 3.99 (m, 1H); 8.57 (s, 1H); 8.82 (d, br, 1H)
626	[DMSO] 3.29 (s, 3H); 3.48 (m, 4H); 8.41 (s, 1H); 8.78 (br, 1H); 13.7 (br, 1H)
633	[CDCl3] 1.28 (d, 3H); 3.40 (s, 3H); 3.45 (m, 2H); 4.37 (m, 1H); 8.48 (s, 1H); 8.78 (br, 1H)
635	[DMSO] 1.75 (m, 2H); 3.25 (s, 3H); 3.39 (m, 4H); 8.40 (s, 1H); 8.81 (br, 1H); 13.6 (br, 1H)
797	[DMSO] 8.27 (br, 1H); 8.38 (br, 1H); 8.52 (s, 1H); 13.7 (br, 1H)
798	[DMSO] 2.82 (d, 3H); 8.40 (s, 1H); 8.75 (d, br, 1H); 13.6 (br, 1H)
799	[DMSO] 1.12 (t, 3H); 3.33 (m, 2H); 8.41 (s, 1H); 8.78 (t, br, 1H); 13.6 (br, 1H)
800	[DMSO] 0.89 (t, 3H); 1.52 (m, 2H); 3.27 (q, 2H); 8.41 (s, 1H); 8.76 (t, br, 1H); 13.5 (br, 1H)
801	[DMSO] 1.18 (d, 6H); 4.09 (m, 1H); 8.42 (s, 1H); 8.60 (d, br, 1H)

10

20

30

40

【0304】

【表 104】

実施例No.	1H-NMRデータ	
802	[DMSO] 0.55 (m, 2H); 0.75 (m, 2H); 2.85 (m, 1H); 8.31 (s, 1H); 9.24 (br, 1H); 13.4 (br, 1H)	
803	[DMSO] 0.89 (t, 3H); 1.33 (m, 2H); 1.51 (m, 2H); 3.30 (m, 2H); 8.40 (s, 1H); 8.75 (t, br, 1H); 13.4 (br)	
804	[DMSO] 1.70 (m, 2H); 2.04 (m, 2H); 2.25 (m, 2H); 4.39 (m, 1H); 8.43 (s, 1H); 8.95 (d, br, 1H); 13.4 (br, 1H)	10
806	[DMSO] 2.82 (s, 3H); 2.98 (s, 3H); 8.06 (s, 1H); 12.6 (s, br, 1H)	
811	[CDC13] 1.24 (t, 6H); 3.44 (m, 4H); 7.72 (s, 1H)	
819	[DMSO] 0.25 (m, 2H); 0.46 (m, 2H); 1.03 (m, 1H); 3.20 (t, 2H); 8.45 (s, 1H); 8.87 (t, br, 1H); 13.4 (br, 1H)	
821	[DMSO] 0.90 (s, 9H); 3.13 (d, 2H); 8.37 (s, 1H); 8.61 (t, br, 1H); 13.4 (br, 1H)	
827	[DMSO] 0.88 (d, 6H); 1.82 (m, 1H); 3.13 (t, 2H); 8.40 (s, 1H); 8.76 (t, br, 1H); 13.5 (br, 1H)	20
829	[DMSO] 0.90 (d, 6H); 1.42 (m, 2H); 1.61 (m, 1H); 3.30 (m, 2H); 8.41 (s, 1H); 8.76 (t, br, 1H); 13.5 (br, 1H)	
831	[DMSO] 3.95 (t, 2H); 5.19 (dd, 2H); 5.89 (m, 1H); 8.41 (s, 1H); 8.88 (t, br, 1H); 13.5 (br, 1H)	
835	[DMSO] 1.72 (s, 3H); 3.87 (d, 2H); 4.86 (d, 2H); 8.39 (s, 1H); 8.90 (t, br, 1H); 13.4 (br, 1H)	
836	[DMSO] 3.18 (m, 1H); 4.10 (m, 2H); 8.36 (s, 1H); 9.01 (t, br, 1H); 13.4 (br, 1H)	30
838	[DMSO] 0.88 (t, 3H); 1.14 (d, 3H); 1.51 (m, 2H); 3.91 (m, 1H); 8.41 (s, 1H); 8.54 (d, br, 1H); 13.5 (br, 1H)	
840	[DMSO] 0.88 (t, 3H); 1.14 (d, 3H); 1.33 (m, 2H); 1.47 (m, 2H); 4.01 (m, 1H); 8.42 (s, 1H); 8.53 (d, br, 1H); 13.5 (br, 1H)	
841	[DMSO] 0.85 (t, 3H); 1.14 (d, 3H); 1.28 (m, 6H); 1.49 (m, 2H); 3.98 (m, 1H); 8.41 (s, 1H); 8.60 (d, br, 1H); 13.5 (br, 1H)	
844	[DMSO] 0.87 (d, 6H); 1.14 (d, 3H); 1.27 (m, 1H); 1.48 (m, 1H); 1.62 (m, 1H); 4.09 (m, 1H); 8.41 (s, 1H); 8.52 (d, br, 1H); 13.5 (br, 1H)	40
845	[DMSO] 0.90 (s, 9H); 1.08 (d, 3H); 3.90 (m, 1H); 8.35 (s, 1H); 8.38 (d, br, 1H); 13.4 (br)	
846	[DMSO] 0.89 (d, 6H); 1.12 (d, 3H); 1.75 (m, 1H); 3.87 (m, 1H); 8.40 (s, 1H); 8.50 (d, br, 1H); 13.5 (br)	
848	[DMSO] 0.87 (t, 6H); 1.44 (m, 2H); 1.55 (m, 2H); 3.79 (m, 1H); 8.40 (s, 1H); 8.42 (d, br, 1H); 13.4 (br, 1H)	

【表 105】

実施例No.	1H-NMRデータ
851	[CDC13] 3.42 (s, 6H); 3.63 (t, 2H); 4.50 (t, 1H); 8.55 (s, 1H); 8.95 (t, br, 1H); 12.1 (br, 1H)
853	[CDC13] 3.65 (m, 2H); 3.86 (m, 2H); 8.47 (s, 1H); 8.98 (br, 1H)
854	[CDC13] 3.39 (s, 3H); 3.58 (m, 2H); 3.69 (m, 2H); 8.49 (s, 1H); 8.80 (br, 1H); 11.9 (br, 1H)
861	[CDC13] 1.28 (d, 3H); 3.38 (s, 3H); 3.45 (m, 2H); 4.39 (m, 1H); 8.51 (s, 1H); 8.85 (br, 1H); 12.4 (br, 1H)
863	[CDC13] 1.90 (m, 2H); 3.40 (s, 3H); 3.57 (m, 4H); 8.30 (s, 1H); 8.70 (br, 1H)
868	[CDC13] 3.80 (s, 3H); 4.25 (d, 2H); 8.52 (s, 1H); 9.16 (br, 1H)
909	[DMSO] 8.22 (br, 1H); 8.32 (br, 1H); 8.61 (s, 1H); 13.8 (br, 1H)
910	[DMSO] 2.83 (d, 3H); 8.51 (s, 1H); 8.74 (br, 1H); 13.7 (br, 1H)
911	[DMSO] 1.12 (t, 3H); 3.32 (q, 2H); 8.54 (s, 1H); 8.75 (t, br, 1H); 13.7 (br, 1H)
912	[DMSO] 0.89 (t, 3H); 1.52 (m, 2H); 3.25 (q, 2H); 8.54 (s, 1H); 8.75 (t, br, 1H); 13.6 (br, 1H)
913	[CDC13] 1.25 (d, 6H); 4.25 (m, 1H); 8.54 (br, 1H); 8.70 (s, 1H)
914	[DMSO] 0.58 (m, 2H); 0.75. (m, 2H); 2.86 (m, 1H); 8.50 (s, 1H); 8.75 (d, 1H); 13.6 (br, 1H)
915	[DMSO] 0.89 (t, 3H); 1.32 (m, 2H); 1.50 (m, 2H); 3.32 (m, 2H); 8.53 (s, 1H); 8.74 (t, br, 1H), 13.5 (br)
916	[DMSO] 1.70 (m, 2H); 2.05 (m, 2H); 2.25 (m, 2H); 4.40 (m, 1H); 8.52 (s, 1H); 8.98 (d, br, 1H); 13.5 (br, 1H)
917	[CDC13] 1.50 (s, 9H); 8.65 (s, 1H); 8.80 (s, br, 1H); 12.3 (br, 1H)
918	[DMSO] 2.82 (s, 3H); 2.99 (s, 3H); 8.14 (s, 1H); 12.6 (br, 1H)
923	[DMSO] 1.02 (t, 3H); 1.12 (t, 3H); 3.10 (q, 2H); 3.40 (q, 2H); 8.15 (s, 1H), 12.5 (br, 1H)
931	[DMSO] 0.24 (m, 2H); 0.46 (m, 2H); 1.04 (m, 1H); 3.18 (t, 2H); 8.55 (s, 1H); 8.82 (t, br, 1H)
933	[DMSO] 0.90 (s, 9H); 3.13 (d, 2H); 8.50 (s, 1H); 8.61 (t, br, 1H)

【0306】

【表 106】

実施例No.	1H-NMRデータ
939	[DMSO] 0.88 (d, 6H); 1.83 (m, 1H); 3.14 (t, 2H); 8.52 (s, 1H); 8.72 (t, br, 1H); 13.6 (br, 1H)
941	[DMSO] 0.90 (d, 6H); 1.43 (m, 2H); 1.62 (m, 1H); 3.35 (m, 2H); 8.52 (s, 1H); 8.72 (t, br, 1H); 13.5 (br, 1H)
943	[DMSO] 3.94 (t, 2H); 5.18 (dd, 2H); 5.89 (m, 1H); 8.52 (s, 1H); 8.85 (t, br, 1H)
947	[DMSO] 1.72 (s, 3H); 3.87 (d, 2H); 4.85 (d, 2H); 8.51 (s, 1H); 8.87 (t, br, 1H); 13.5 (br)
948	[DMSO] 3.18 (m, 1H); 4.12 (m, 2H); 8.50 (s, 1H); 9.00 (t, br, 1H)
950	[DMSO] 0.92 (t, 3H); 1.21 (d, 3H); 1.57 (m, 2H); 3.97 (m, 1H); 8.55 (d, br, 1H); 8.60 (s, 1H); 13.7 (br, 1H)
952	[CDC13] 0.90 (t, 3H); 1.24 (d, 3H); 1.40 (m, 2H), 1.55 (m, 2H); 4.18 (m, 1H); 8.72 (s, 1H); 8.90 (d, br, 1H)
953	[DMSO] 0.77 (t, 3H); 1.15 (d, 3H); 1.27 (m, 6H); 1.49 (m, 2H); 3.99 (m, 1H); 8.50 (d, br, 1H); 8.55 (s, 1H); 13.6 (br)
956	[DMSO] 0.88 (d, 6H); 1.15 (d, 3H); 1.27 (m, 1H); 1.48 (m, 1H); 1.62 (m, 1H); 4.10 (m, 1H); 8.50 (d, br, 1H); 8.55 (s, 1H); 13.6 (br, 1H)
957	[DMSO] 0.91 (s, 9H); 1.09 (d, 3H); 3.80 (m, 1H); 8.39 (d, br, 1H); 8.49 (s, 1H); 13.6 (br, 1H)
958	[DMSO] 0.89 (d, 6H); 1.11 (d, 3H); 1.75 (m, 1H); 3.86 (m, 1H); 8.48 (d, br, 1H); 8.52 (s, 1H); 13.6 (br)
960	[CDC13] 0.95 (t, 6H); 1.50 (m, 2H); 1.62 (m, 2H), 4.00 (m, 1H); 8.73 (s, 1H); 8.90 (d, br, 1H)
963	[CDC13] 3.43 (s, 6H); 3.65 (t, 2H); 4.50 (t, 1H); 8.62 (s, 1H); 8.78 (br, 1H)
965	[DMSO] 3.40 (m, 2H); 3.52 (m, 2H); 8.57 (s, 1H); 8.78 (t, br, 1H); 13.6 (br, 1H)
966	[DMSO] 3.29 (s, 3H); 3.48 (m, 4H); 8.54 (s, 1H); 8.78 (br, 1H); 13.6 (br, 1H)
973	[CDC13] 1.29 (d, 3H); 3.40 (s, 3H); 3.45 (m, 2H); 4.36 (m, 1H); 8.60 (s, 1H); 8.72 (br, 1H)
975	[DMSO] 1.75 (m, 2H); 3.20 (s, 3H); 3.38 (m, 4H); 8.51 (s, 1H); 8.81 (t, br, 1H); 13.6 (br)
1023	[DMSO] 8.22 (br, 1H); 8.35 (br, 1H); 8.61 (s, 1H); 13.8 (br, 1H)
1024	[DMSO] 2.82 (d, 3H); 8.50 (s, 1H); 8.75 (br, 1H); 13.7 (br, 1H)

10

20

30

40

【表 107】

実施例No.	1H-NMRデータ
1025	[DMSO] 1.13 (t, 3H); 3.35 (m, 2H); 8.52 (s, 1H); 8.75 (br, 1H); 13.5 (br, 1H)
1026	[DMSO] 0.90 (t, 3H); 1.53 (m, 2H); 3.25 (m, 2H); 8.52 (s, 1H); 8.75 (t, br, 1H); 13.5 (br, 1H)
1027	[DMSO] 1.18 (d, 6H); 4.08 (m, 1H); 8.54 (s, 1H); 8.56 (br, 1H)
1028	[DMSO] 0.58 (m, 2H); 0.75 (m, 2H); 3.86 (m, 1H); 8.48 (s, 1H); 8.75 (br, 1H)
1029	[DMSO] 0.89 (t, 3H); 1.34 (m, 2H); 1.50 (m, 2H); 3.26 (m, 2H); 8.51 (s, 1H); 8.81 (br, 1H); 13.6 (br, 1H)
1030	[DMSO] 1.70 (m, 2H); 2.04 (m, 2H); 2.25 (m, 2H); 4.39 (m, 1H); 8.53 (s, 1H); 8.91 (d, br, 1H); 13.4 (br, 1H)
1031	[CDCl ₃] 1.46 (s, 9H); 8.63 (s, 1H); 8.83 (br, 1H); 111.9 (br, 1H)
1032	[DMSO] 2.82 (s, br, 3H); 2.96 (s, br, 3H); 8.11 (s, 1H); 12.5 (br, 1H)
1037	[CDCl ₃] 1.23 (t, 6H); 3.42 (br, 4H); 7.88 (s, 1H)
1045	[DMSO] 0.25 (m, 2H); 0.46 (m, 2H); 1.04 (m, 1H); 3.20 (t, 2H); 8.55 (s, 1H); 8.82 (t, br, 1H); 13.6 (br, 1H)
1047	[DMSO] 0.90 (s, 9H); 3.13 (d, 2H); 8.48 (s, 1H); 8.61 (t, br, 1H)
1053	[DMSO] 0.90 (d, 6H); 1.82 (m, 1H); 3.13 (m, 2H); 8.50 (s, 1H); 8.75 (br, 1H); 13.5 (br, 1H)
1055	[DMSO] 0.89 (d, 6H); 1.41 (m, 2H); 1.61 (m, 1H); 3.31 (m, 2H); 8.49 (s, 1H); 8.90 (br, 1H); 13.5 (br, 1H)
1057	[DMSO] 3.95 (t, 2H); 5.18 (dd, 2H); 5.90 (m, 1H); 8.50 (s, 1H); 8.85 (t, br, 1H)
1061	[CDCl ₃] 1.80 (s, 3H); 4.03 (d, 2H); 4.93 (d, 2H); 8.76 (s, 1H); 9.22 (t, br, 1H);
1062	[DMSO] 3.18 (m, 1H); 4.10 (m, 2H); 8.48 (s, 1H); 9.00 (br, 1H)
1064	[DMSO] 0.88 (t, 3H); 1.16 (d, 3H); 1.51 (m, 2H); 3.93 (m, 1H); 8.50 (d, br, 1H); 8.55 (s, 1H); 13.6 (br, 1H)
1066	[DMSO] 0.86 (t, 3H); 1.15 (d, 3H); 1.30 (m, 2H), 1.48 (m, 2H); 4.00 (m, 1H); 8.50 (d, br, 1H); 8.52 (s, 1H); 13.6 (br, 1H)

10

20

30

40

【0308】

【表 108】

実施例No.	¹ H-NMRデータ
1067	[CDC13] 0.86 (t, 3H); 1.22 (d, 3H); 1.25 (m, 6H); 1.48 (m, 2H); 4.16 (m, 1H); 8.62 (s, 1H); 8.68 (br, 1H)
1070	[CDC13] 0.93 (d, 6H); 1.23 (d, 3H); 1.27 (m, 1H); 1.50 (m, 1H); 1.70 (m, 1H); 4.25 (m, 1H); 8.63 (br, 2H)
1071	[CDC13] 0.95 (s, 9H); 1.17 (d, 3H); 4.08 (m, 1H); 8.70 (s, 1H); 9.00 (d, br, 1H)
1072	[CDC13] 0.95 (m, 6H); 1.20 (d, 3H); 1.82 (m, 1H); 4.07 (m, 1H); 8.76 (s, 1H); 9.13 (br, 1H)
1074	[CDC13] 0.92 (t, 6H); 1.50 (m, 2H); 1.65 (m, 2H); 3.96 (m, 1H); 8.72 (s, 1H); 9.00 (d, br, 1H)
1077	[CDC13] 3.42 (s, 6H); 3.62 (t, 2H); 4.50 (t, 1H); 8.62 (s, 1H); 8.90 (br, 1H)
1079	[CDC13] 3.65 (m, 2H); 3.85 (m, 2H); 8.64 (s, 1H); 9.22 (br, 1H)
1080	[DMSO] 3.30 (s, 3H); 3.46 (m, 4H); 8.52 (s, 1H); 8.75 (br, 1H)
1087	[CDC13] 1.29 (d, 3H); 3.39 (s, 3H); 3.45 (m, 2H); 4.37 (m, 1H); 8.66 (s, 1H); 8.98 (br, 1H); 12.50 (br, 1H)
1089	[DMSO] 1.75 (m, 2H); 3.23 (s, 3H); 3.38 (m, 4H); 8.52 (s, 1H); 8.80 (t, br, 1H)
1094	[CDC13] 3.80 (s, 3H); 4.24 (d, 2H); 8.61 (s, 1H); 9.19 (br, 1H)
1138	[DMSO] 2.83 (d, 3H); 7.07 (t, 1H); 8.40 (s, 1H); 8.94 (br, 1H); 13.4 (br, 1H)
1139	[DMSO] 1.12 (t, 3H); 3.33 (m, 2H); 7.08 (t, 1H); 8.40 (s, 1H); 9.00 (br, 1H); 13.4 (br, 1H)
1171	[DMSO] 3.90 (t, 2H); 5.15 (dd, 2H); 5.90 (m, 1H); 7.10 (t, 1H); 8.40 (s, 1H); 9.16 (br, 1H); 13.4 (br, 1H)
1178	[CDC13] 0.95 (t, 3H); 1.21 (d, 3H); 1.58 (m, 2H); 4.08 (m, 1H); 6.86 (t, 1H); 8.70 (s, 1H); 9.34 (d, br, 1H); 12.9 (br, 1H)
1180	[CDC13] 0.93 (t, 3H); 1.21 (d, 3H); 1.40 (m, 2H); 1.52 (m, 2H); 4.16 (m, 1H); 6.87 (t, 1H); 8.70 (s, 1H); 9.31 (d, br, 1H); 12.9 (br, 1H)
1188	[CDC13] 0.92 (t, 6H); 1.50 (m, 2H); 1.65 (m, 2H); 3.98 (m, 1H); 6.86 (t, 1H); 8.71 (s, 1H); 9.28 (d, br, 1H); 12.9 (br, 1H)
1201	[CDC13] 1.27 (d, 3H); 3.40 (s, 3H); 3.43 (m, 2H); 4.37 (m, 1H); 6.85 (t, 1H); 8.68 (s, 1H); 9.42 (d, br, 1H); 12.7 (br, 1H)
1251	[DMSO] 8.26 (br, 1H); 8.42 (br, 1H); 8.62 (s, 1H)

10

20

30

40

【表 109】

実施例No.	¹ H-NMRデータ
1252	[CDCl ₃] 3.00 (d, 3H); 8.66 (s, 1H); 8.82 (br, 1H)
1253	[CDCl ₃] 1.24 (t, 3H); 3.50 (m, 2H); 8.68 (s, 1H); 8.86 (br, 1H)
1254	[CDCl ₃] 1.00 (t, 3H); 1.62 (m, 2H); 3.42 (m, 2H); 8.67 (s, 1H); 8.90 (br, 1H)
1255	[CDCl ₃] 1.25 (d, 6H); 4.25 (m, 1H); 8.70 (s, 1H); 8.84 (br, 1H)
1256	[CDCl ₃] 0.60 (m, 2H); 0.89 (m, 2H); 3.00 (m, 1H); 8.70 (s, 1H); 9.00 (br, 1H)
1257	[CDCl ₃] 0.96 (t, 3H); 1.42 (m, 2H); 1.60 (m, 2H); 3.45 (m, 2H); 8.70 (s, 1H); 8.88 (br, 1H); 12.1 (br, 1H)
1258	[CDCl ₃] 1.77 (m, 2H); 1.98 (m, 2H); 2.43 (m, 2H); 4.55 (m, 1H); 8.68 (s, 1H); 9.13 (br, 1H); 12.5 (br, 1H)
1259	[CDCl ₃] 1.45 (s, 9H); 8.67 (s, 1H); 8.78 (br, 1H); 12.4 (br, 1H)
1260	[CDCl ₃] 3.11 (s, 6H); 7.95 (s, 1H)
1265	[CDCl ₃] 1.25 (t, 6H); 3.45 (br, 4H); 7.89 (s, 1H)
1273	[CDCl ₃] 0.27 (m, 2H); 0.56 (m, 2H); 1.04 (m, 1H); 3.32 (m, 2H); 8.67 (s, 1H); 8.92 (br, 1H); 12.3 (br, 1H)
1275	[CDCl ₃] 0.97 (s, 9H); 3.29 (d, 2H); 8.73 (s, 1H); 9.00 (br, 1H); 11.9 (br, 1H)
1281	[CDCl ₃] 0.98 (d, 6H); 1.89 (m, 1H); 3.29 (t, 2H); 8.70 (s, 1H); 8.98 (br, 1H); 12.1 (br, 1H)
1283	[CDCl ₃] 0.95 (d, 6H); 1.50 (m, 2H); 1.68 (m, 1H); 3.46 (m, 2H); 8.69 (s, 1H); 8.83 (br, 1H); 12.1 (br, 1H)
1285	[CDCl ₃] 4.09 (t, 2H); 5.22 (dd, 2H); 5.91 (m, 1H); 8.70 (s, 1H); 9.01 (br, 1H); 12.2 (br, 1H)
1289	[DMSO] 0.26 (m, 2H); 0.47 (m, 2H); 1.05 (m, 1H); 3.20 (m, 2H); 6.85 (tt, 1H); 7.25 (br, 1H); 8.45 (d, 1H); 9.15 (br, 1H), 13.4 (br, 1H)
1290	[CDCl ₃] 2.25 (m, 1H); 4.23 (m, 2H); 8.72 (s, 1H); 9.20 (br, 1H), 12.0 (br, 1H)
1292	[CDCl ₃] 0.95 (t, 3H); 1.21 (d, 3H); 1.55 (m, 2H); 4.10 (m, 1H); 8.70 (s, 1H); 8.82 (br, 1H)
1294	[CDCl ₃] 0.93 (t, 3H); 1.22 (d, 3H); 1.38 (m, 2H); 1.52 (m, 2H); 4.18 (m, 1H); 8.70 (s, 1H); 8.79 (br, 1H); 12.4 (br, 1H)

10

20

30

40

【表 1 1 0】

実施例No.	1H-NMRデータ
1295	[CDC13] 0.89 (t, 3H); 1.20 (d, 3H); 1.25-1.4 (m, 6H); 1.50 (m, 2H); 4.16 (m, 1H); 8.70 (s, 1H); 8.75 (br, 1H)
1298	[CDC13] 0.92 (t, 6H); 1.40 (d, 3H); 1.32 (m, 1H); 1.45 (m, 1H); 1.55 (m, 1H); 4.25 (m, 1H); 8.70 (s, 1H); 8.75 (br, 1H); 12.4 (br, 1H)
1299	[CDC13] 0.95 (s, 9H); 1.15 (d, 3H); 4.10 (m, 1H); 8.72 (s, 1H); 8.88 (br, 1H); 11.9 (br, 1H)
1300	[CDC13] 0.95 (m, 6H); 1.15 (d, 3H); 1.77 (m, 1H); 4.05 (m, 1H); 8.71 (s, 1H); 8.85 (br, 1H)
1302	[CDC13] 0.93 (t, 6H); 1.48 (m, 2H); 1.65 (m, 2H); 3.99 (m, 1H); 8.71 (s, 1H); 8.76 (br, 1H); 12.4 (br, 1H)
1305	[CDC13] 3.40 (s, 6H); 3.62 (t, 2H); 4.50 (t, 1H); 8.60 (s, 1H); 8.74 (br, 1H); 11.7 (br, 1H)
1307	[CDC13] 3.65 (m, 2H); 3.87 (m, 2H); 4.50 (t, 1H); 8.66 (s, 1H); 9.11 (br, 1H)
1308	[CDC13] 3.40 (s, 3H); 3.58 (m, 2H); 3.67 (m, 2H); 8.60 (s, 1H); 8.75 (br, 1H); 11.7 (br, 1H)
1315	[CDC13] 1.48 (d, 3H); 3.38 (s, 3H); 3.44 (m, 2H); 4.38 (m, 1H); 8.62 (s, 1H); 8.72 (br, 1H); 12.1 (br, 1H)
1317	[CDC13] 1.90 (m, 2H); 3.40 (s, 3H); 3.58 (m, 4H); 8.39 (s, 1H); 8.62 (br, 1H)
1322	[CDC13] 3.79 (s, 3H); 4.25 (d, 2H); 8.65 (s, 1H); 9.18 (br, 1H)
1365	[DMSO] 8.24 (br, 1H), 8.42 (br, 1H); 8.81 (s, 1H); 13.6 (br, 1H)
1366	[DMSO] 8.19 (br, 1H), 8.34 (br, 1H); 8.78 (s, 1H); 13.7 (br, 1H)
1368	[DMSO] 2.83 (d, 3H); 6.81 (tt, 1H); 7.22 (br, 1H); 8.41 (d, 1H); 9.00 (br, 1H); 13.4 (br, 1H)
1369	[DMSO] 1.12 (t, 3H); 3.35 (m, 2H); 6.85 (tt, 1H); 7.20 (br, 1H); 8.41 (d, 1H); 9.20 (br, 1H); 13.4 (br, 1H)
1370	[DMSO] 0.89 (t, 3H); 1.52 (m, 2H); 3.27 (q, 2H); 6.82 (tt, 1H); 7.20 (br, 1H); 8.40 (d, 1H); 9.20 (br, 1H); 13.4 (br, 1H)
1371	[DMSO] 1.18 (d, 6H); 4.09 (m, 1H); 6.82 (tt, 1H); 7.20 (br, 1H); 8.42 (d, 1H); 8.95 (br, 1H); 13.4 (br, 1H)
1372	[DMSO] 0.56 (m, 2H); 0.75 (m, 2H); 2.85 (m, 1H); 6.83 (tt, 1H); 7.21 (br, 1H); 8.40 (d, 1H); 9.05 (br, 1H); 13.4 (br, 1H)

10

20

30

40

【表 1 1 1】

実施例No.	1H-NMRデータ
1373	[DMSO] 0.89 (t, 3H); 1.32 (m, 2H); 1.50 (m, 2H); 3.30 (q, 2H); 6.84 (tt, 1H); 7.20 (br, 1H); 8.41 (d, 1H); 9.10 (br, 1H); 13.4 (br, 1H)
1389	[DMSO] 0.26 (m, 2H); 0.47 (m, 2H); 1.05 (m, 1H); 3.20 (m, 2H); 6.85 (tt, 1H); 7.25 (br, 1H); 8.45 (d, 1H); 9.15 (br, 1H), 13.4 (br, 1H)
1391	[DMSO] 0.91 (s, 9H); 3.16 (d, 2H); 6.82 (tt, 1H); 7.10 (br, 1H); 8.41 (d, 1H); 9.20 (br, 1H); 13.3 (br, 1H)
1397	[DMSO] 0.90 (d, 6H); 1.82 (m, 1H); 3.15 (m, 2H); 6.82 (tt, 1H); 7.20 (br, 1H); 8.40 (d, 1H); 9.15 (br, 1H), 13.4 (br, 1H)
1401	[DMSO] 3.95 (m, 2H); 5.18 (dd, 2H); 5.92 (m, 1H); 6.82 (tt, 1H); 7.20 (d, 1H); 8.42 (d, 1H); 9.20 (br, 1H); 13.3 (br, 1H)
1406	[DMSO] 3.15 (t, 1H); 4.13 (m, 2H); 6.82 (tt, 1H); 7.18 (br, 1H); 8.41 (d, 1H); 9.35 (br, 1H); 13.3 (br, 1H)
1408	[DMSO] 0.87 (t, 3H); 1.14 (d, 3H); 1.51 (m, 2H); 3.92 (m, 1H); 6.82 (tt, 1H); 7.20 (br, 1H); 8.41 (d, 1H); 8.90 (br, 1H), 13.4 (br, 1H)
1410	[DMSO] 0.86 (t, 3H); 1.15 (d, 3H); 1.30 (m, 2H); 1.48 (m, 2H); 4.02 (m, 1H); 6.83 (tt, 1H); 7.20 (br, 1H); 8.42 (d, 1H); 8.90 (br, 1H), 13.4 (br, 1H)
1411	[DMSO] 0.88 (t, 3H); 1.15 (d, 3H); 1.27 (m, 6H); 1.49 (m, 2H); 4.00 (m, 1H); 6.82 (tt, 1H); 7.20 (br, 1H); 8.42 (d, 1H); 8.92 (br, 1H), 13.4 (br, 1H)
1414	[DMSO] 0.88 (d, 6H); 1.15 (d, 3H); 1.28 (m, 1H); 1.46 (m, 1H); 1.60 (m, 1H); 4.10 (m, 1H); 6.81 (tt, 1H); 7.20 (br, 1H); 8.42 (d, 1H); 8.90 (br, 1H), 13.4 (br, 1H)
1418	[CDC13] 0.93 (t, 6H); 1.50 (m, 2H); 1.65 (m, 2H); 4.00 (m, 1H); 6.83 (d, 1H); 8.69 (d, 1H); 9.21 (d, br, 1H); 13.0 (br, 1H)
1421	[CDC13] 3.41 (s, 6H); 3.52 (t, 2H); 4.50 (t, 1H); 6.12 (tt, 1H); 6.81 (d, 1H); 8.64 (d, 1H); 9.41 (br, 1H); 12.5 (br, 1H)
1424	[CDC13] 3.37 (s, 3H); 3.56 (m, 2H); 3.67 (m, 2H); 6.11 (tt, 1H); 6.84 (d, 1H); 8.65 (d, 1H); 9.46 (br, 1H), 12.2 (br, 1H)
1431	[CDC13] 1.28 (d, 3H); 3.39 (s, 3H); 3.45 (m, 2H); 4.40 (m, 1H); 6.10 (tt, 1H); 6.83 (d, 1H); 8.67 (d, 1H); 9.39 (d, br, 1H); 13.0 (br, 1H)
1433	[DMSO] 1.75 (m, 2H); 3.24 (s, 3H); 3.38 (m, 4H); 6.83 (tt, 1H); 7.20 (br, 1H); 8.42 (d, 1H); 9.15 (br, 1H), 13.4 (br, 1H)
1481	[DMSO] 7.42 (br, 1H); 8.10 (br, 1H); 8.40 (br, 1H); 8.46 (d, 1H), 13.6 (br, 1H)

10

20

30

40

【0 3 1 2】

【表 1 1 2】

実施例No.	1H-NMRデータ
1482	[CDCl ₃] 3.01 (d, 3H); 6.88 (d, 1H); 8.67 (d, 1H); 9.34 (br, 1H); 12.5 (br, 1H)
1483	[CDCl ₃] 1.27 (t, 3H); 3.50 (m, 2H); 6.88 (d, 1H); 8.68 (d, 1H); 9.32 (br, 1H); 12.6 (br, 1H)
1484	[CDCl ₃] 1.00 (t, 3H); 1.63 (m, 2H); 3.41 (m, 2H); 6.88 (d, 1H); 8.70 (d, 1H); 9.38 (br, 1H); 12.9 (br, 1H)
1485	[CDCl ₃] 1.25 (d, 6H); 4.27 (m, 1H); 6.88 (d, 1H); 8.70 (d, 1H); 9.30 (d, br, 1H); 13.4 (br, 1H)
1486	[CDCl ₃] 0.62 (m, 2H); 0.86 (m, 2H); 3.01 (m, 1H); 6.88 (d, 1H); 8.70 (d, 1H); 9.41 (br, 1H); 12.6 (br, 1H)
1487	[CDCl ₃] 0.95 (t, 3H); 1.44 (m, 2H); 1.61 (m, 2H); 3.45 (m, 2H); 6.88 (d, 1H); 8.70 (d, 1H); 9.35 (t, br, 1H); 12.7 (br, 1H)
1488	[CDCl ₃] 1.78 (m, 2H); 2.00 (m, 2H); 2.42 (m, 2H); 4.58 (m, 1H); 6.88 (d, 1H); 8.68 (d, 1H); 9.60 (d, br, 1H); 13.3 (br, 1H)
1503	[CDCl ₃] 0.26 (m, 2H); 0.55 (m, 2H); 1.06 (m, 1H); 3.33 (m, 2H); 6.88 (d, 1H); 8.70 (d, 1H); 9.45 (br, 1H); 12.9 (br, 1H)
1505	[CDCl ₃] 0.98 (s, 9H); 3.30 (d, 2H); 6.88 (d, 1H); 8.72 (d, 1H); 9.43 (t, br, 1H); 12.5 (br, 1H)
1511	[CDCl ₃] 0.98 (d, 6H); 1.90 (m, 1H); 3.30 (m, 2H); 6.88 (d, 1H); 8.70 (d, 1H); 9.42 (t, br, 1H)
1513	[CDCl ₃] 0.85 (d, 6H); 1.51 (m, 2H); 1.70 (m, 1H); 3.47 (m, 2H); 6.88 (d, 1H); 8.70 (d, 1H); 9.32 (t, br, 1H); 12.7 (br, 1H)
1515	[CDCl ₃] 4.10 (t, 2H); 5.25 (dd, 2H); 5.91 (m, 1H); 6.88 (d, 1H); 8.70 (d, 1H); 9.47 (br, 1H); 12.8 (br, 1H)
1519	[DMSO] 1.71 (s, 3H); 3.88 (d, 2H); 4.84 (d, 2H); 7.35 (br, 1H); 8.41 (d, 1H); 9.02 (br, 1H); 13.4 (br, 1H)
1520	[DMSO] 3.15 (m, 1H); 4.12 (m, 2H); 7.36 (d, br, 1H); 8.42 (d, 1H); 9.15 (br, 1H), 13.4 (br, 1H)
1522	[CDCl ₃] 0.95 (t, 3H); 1.22 (d, 3H); 1.59 (m, 2H); 4.11 (m, 1H); 6.88 (d, 1H); 8.71 (d, 1H); 9.28 (d, br, 1H); 13.4 (br, 1H)
1524	[CDCl ₃] 0.92 (t, 3H); 1.23 (d, 3H); 1.40 (m, 2H); 1.52 (m, 2H); 4.20 (m, 1H); 6.89 (d, 1H); 8.71 (d, 1H); 9.27 (d, br, 1H); 13.4 (br, 1H)
1525	[CDCl ₃] 0.88 (t, 3H); 1.23 (d, 3H); 1.25-1.4 (m, 6H); 1.55 (m, 2H); 4.18 (m, 1H); 7.89 (d, 1H); 8.70 (d, 1H); 9.28 (br, 1H); 13.2 (br, 1H)
1528	[CDCl ₃] 0.92 (d, 6H); 1.22 (d, 3H), 1.35 (m, 1H); 1.50 (m, 1H); 1.68 (m, 1H); 4.28 (m, 1H); 6.89 (d, 1H); 8.71 (d, 1H); 9.26 (d, br, 1H); 13.3 (br, 1H)

【表 1 1 3】

実施例No.	¹ H-NMRデータ
1529	[CDCl ₃] 0.95 (s, 9H); 1.17 (d, 3H); 4.12 (m, 1H); 6.89 (d, 1H); 8.73 (d, 1H); 9.30 (d, br, 1H), 12.8 (br, 1H)
1530	[CDCl ₃] 0.95 (dt, 6H); 1.17 (d, 3H); 1.82 (m, 1H); 4.08 (m, 1H); 6.89 (d, 1H); 8.72 (d, 1H); 9.31 (d, br, 1H); 13.2 (br, 1H)
1532	[CDCl ₃] 0.95 (t, 6H); 1.50 (m, 2H); 1.66 (m, 2H); 4.00 (m, 1H); 6.89 (d, 1H); 8.72 (d, 1H); 9.21 (d, br, 1H); 13.3 (br, 1H)
1535	[DMSO] 3.32 (s, 6H); 3.45 (t, 2H); 4.50 (t, 1H); 7.33 (d, br, 1H); 8.43 (d, 1H); 8.92 (br, 1H); 13.4 (br, 1H)
1537	[DMSO] 3.38 (m, 2H); 3.52 (m, 2H); 4.80 (br, 1H); 7.37 (br, 1H); 8.45 (d, 1H); 8.96 (br, 1H); 13.4 (br, 1H)
1538	[DMSO] 3.25 (s, 3H); 3.49 (m, 4H); 7.37 (d, br, 1H); 8.44 (d, 1H); 8.97 (br, 1H); 13.5 (br, 1H)
1545	[DMSO] 1.15 (d, 3H); 3.27 (s, 3H); 3.40 (m, 2H); 4.19 (m, 1H); 7.35 (d, br, 1H); 8.43 (d, 1H); 8.82 (br, 1H); 13.4 (br, 1H)
1547	[DMSO] 1.75 (m, 2H); 3.25 (s, 3H); 3.40 (m, 4H); 7.38 (br, 1H); 8.40 (d, 1H); 8.94 (br, 1H); 13.4 (br, 1H)
1595	[DMSO] 7.45 (d, 1H); 8.15 (br, 1H); 8.40 (br, 1H); 8.50 (d, 1H); 13.7 (br, 1H)
1596	[DMSO] 2.82 (d, 3H); 7.42 (d, 1H); 8.41 (d, 1H); 8.80 (br, 1H); 13.4 (br, 1H)
1597	[DMSO] 1.12 (t, 3H); 3.31 (m, 2H); 7.41 (d, 1H); 8.41 (d, 1H); 8.85 (br, 1H); 13.45 (br, 1H)
1598	[DMSO] 0.90 (t, 3H); 1.54 (m, 2H); 3.25 (q, 2H); 7.41 (d, 1H); 8.40 (d, 1H); 8.85 (br, 1H); 13.45 (br)
1599	[DMSO] 1.17 (d, 6H); 4.10 (m, 1H); 7.40 (d, 1H); 8.41 (d, 1H); 8.67 (d, br, 1H); 13.4 (br, 1H)
1600	[DMSO] 0.57 (m, 2H); 0.75 (m, 2H); 2.86 (m, 1H); 7.41 (d, 1H); 8.37 (d, 1H); 8.80 (br, 1H); 13.35 (br, 1H)
1601	[CDCl ₃] 0.95 (t, 3H); 1.40 (m, 2H); 1.60 (m, 2H); 3.45 (q, 2H); 6.88 (d, 1H); 8.71 (d, 1H); 9.28 (br, 1H); 12.9 (br, 1H)
1602	[CDCl ₃] 1.78 (m, 2H); 1.95 (m, 2H); 2.40 (m, 2H); 4.57 (m, 1H); 6.86 (d, 1H); 8.70 (d, 1H); 9.45 (d, br, 1H); 12.9 (br, 1H)
1603	[CDCl ₃] 1.45 (s, 9H); 6.85 (d, 1H); 8.67 (d, 1H); 9.15 (br, 1H); 12.6 (br, 1H)
1604	[CDCl ₃] 3.05 (s, 6H); 7.07 (d, 1H); 7.80 (d, 1H)

10

20

30

40

【 0 3 1 4 】

【表 1 1 4】

実施例No.	1H-NMRデータ
1609	[CDCl ₃] 1.22 (t, 6H); 3.40 (m, 4H); 7.02 (d, 1H); 7.72 (d, 1H)
1617	[DMSO] 0.25 (m, 2H), 0.46 (m, 2H); 1.05 (m, 1H); 3.22 (m, 2H); 7.45 (d, br, 1H); 8.45 (d, 1H); 8.95 (br, 1H); 13.4 (br, 1H)
1619	[DMSO] 0.90 (s, 9H), 3.15 (d, 2H); 7.38 (d, br, 1H); 8.40 (d, 1H); 8.80 (br, 1H); 13.4 (br, 1H)
1625	[DMSO] 0.90 (d, 6H); 1.82 (m, 1H); 3.14 (t, 2H); 7.39 (d, 1H); 8.40 (d, 1H); 8.91 (t, br, 1H)
1627	[CDCl ₃] 0.92 (d, 6H); 1.49 (m, 2H); 1.68 (m, 1H); 3.46 (m, 2H); 6.87 (d, 1H); 8.70 (d, 1H); 9.22 (br, 1H); 12.8 (br, 1H)
1629	[DMSO] 3.95 (m, 2H); 5.15 (dd, 2H); 5.90 (m, 1H); 7.40 (d, 1H); 8.40 (d, 1H); 8.95 (br, 1H); 13.4 (br, 1H)
1633	[CDCl ₃] 1.78 (s, 3H); 4.02 (d, 2H); 4.88 (d, 2H); 6.87 (d, 1H); 8.72 (d, 1H); 9.42 (br, 1H); 12.7 (br, 1H)
1634	[CDCl ₃] 2.23 (m, 1H); 4.23 (m, 2H); 6.88 (d, 1H); 8.73 (d, 1H); 9.51 (br, 1H), 12.8 (br, 1H)
1636	[DMSO] 0.89 (t, 3H); 1.14 (d, 3H); 1.51 (m, 2H); 3.95 (m, 1H); 7.41 (d, 1H); 8.40 (d, 1H); 8.60 (br, 1H); 13.6 (br, 1H)
1638	[DMSO] 0.87 (t, 3H); 1.15 (d, 3H); 1.32 (m, 2H); 1.46 (m, 2H); 4.03 (m, 1H); 7.40 (d, 1H); 8.40 (d, 1H); 8.51 (br, 1H); 13.4 (br, 1H)
1639	[CDCl ₃] 0.88 (t, 3H); 1.21 (d, 3H); 1.32 (m, 6H); 1.50 (m, 2H); 4.18 (m, 1H); 6.88 (d, 1H); 8.71 (d, 1H); 9.12 (d, br, 1H), 12.9 (br, 1H)
1642	[CDCl ₃] 0.92 (t, 6H); 1.20 (d, 3H); 1.32 (m, 1H); 1.46 (m, 1H); 1.67 (m, 1H); 4.27 (m, 1H); 6.88 (d, 1H); 8.71 (d, 1H); 9.12 (d, br, 1H), 12.9 (br, 1H)
1643	[CDCl ₃] 0.93 (s, 9H); 1.15 (d, 3H); 4.12 (m, 1H); 6.88 (d, 1H); 8.72 (d, 1H); 9.22 (d, br, 1H)
1644	[CDCl ₃] 0.95 (m, 6H); 1.15 (d, 3H); 1.78 (m, 1H); 4.05 (m, 1H); 6.88 (d, 1H); 8.72 (d, 1H); 9.18 (d, br, 1H); 12.7 (br, 1H)
1646	[DMSO] 0.87 (t, 6H); 1.45 (m, 2H); 1.55 (m, 2H); 3.81 (m, 1H); 7.40 (d, 1H); 8.40 (d, 1H); 8.52 (d, br, 1H); 13.4 (br, 1H)
1649	[CDCl ₃] 3.40 (s, 6H); 3.61 (t, 2H); 4.50 (t, 1H); 6.87 (d, 1H); 8.69 (d, 1H); 9.32 (br, 1H); 12.3 (br, 1H)
1651	[CDCl ₃] 3.63 (m, 2H); 3.84 (m, 2H); 6.88 (d, 1H); 8.68 (d, 1H); 9.60 (br, 1H)

【表 1 1 5】

実施例No.	1H-NMRデータ
1652	[DMSO] 3.25 (s, 3H); 3.50 (m, 4H); 7.40 (d, br, 1H); 8.45 (d, 1H); 8.92 (br, 1H); 13.5 (br, 1H)
1659	[DMSO] 1.15 (d, 3H); 3.25 (s, 3H); 3.38 (m, 2H); 4.17 (m, 1H); 7.40 (d, br, 1H); 8.43 (d, 1H); 8.75 (br, 1H); 13.5 (br, 1H)
1661	[DMSO] 1.74 (m, 2H); 3.22 (s, 3H); 3.37 (m, 4H); 7.42 (d, br, 1H); 8.42 (d, 1H); 8.90 (br, 1H); 13.4 (br, 1H)
1666	[CDCl ₃] 3.77 (s, 3H); 4.23 (d, 2H); 6.87 (d, 1H); 8.67 (d, 1H); 9.65 (br, 1H); 12.1 (br, 1H)
1711	[DMSO] 2.83 (d, 3H); 8.39 (s, 1H); 8.72 (d, br, 1H); 13.5 (br)
1712	[DMSO] 1.11 (t, 3H); 3.30 (m, 2H); 8.40 (s, 1H); 8.75 (t, br, 1H)
1713	[CDCl ₃] 0.99 (t, 3H); 1.62 (m, 2H); 3.41 (q, 2H); 8.56 (s, 1H); 9.00 (br, 1H)
1714	[CDCl ₃] 1.24 (d, 6H); 4.22 (m, 1H); 8.41 (s, 1H); 9.17 (br, 1H)
1715	[CDCl ₃] 0.61 (m, 2H); 0.90 (m, 2H); 2.95 (m, 1H); 8.57 (s, 1H); 9.02 (br, 1H)
1716	[CDCl ₃] 0.94 (t, 3H); 1.41 (m, 2H); 1.58 (m, 2H); 3.45 (m, 2H); 8.54 (s, 1H); 9.05 (br, 1H)
1717	[CDCl ₃] 1.80 (m, 2H); 1.98 (m, 2H); 2.42 (m, 2H); 4.55 (m, 1H); 8.55 (s, 1H); 9.01 (br, 1H); 12.0 (br, 1H)
1719	[DMSO] 2.83 (s, 3H); 2.97 (s, 3H); 8.04 (s, 1H); 12.6 (br, 1H)
1720	[DMSO] 1.03 (t, 3H); 1.15 (t, 3H); 3.12 (q, 2H); 3.45 (q, 2H); 8.05 (s, 1H); 12.5 (br, 1H)
1721	[CDCl ₃] 0.25 (m, 2H); 0.55 (m, 2H); 1.05 (m, 1H); 3.32 (m, 2H); 8.57 (s, 1H); 8.93 (br, 1H); 12.1 (br, 1H)
1722	[CDCl ₃] 0.96 (s, 9H); 3.28 (d, 2H); 8.59 (s, 1H); 9.05 (br, 1H)
1723	[CDCl ₃] 0.95 (d, 6H); 1.90 (m, 1H); 3.29 (t, 2H); 8.59 (s, 1H); 9.00 (br, 1H); 12.0 (br, 1H)
1725	[CDCl ₃] 0.94 (d, 6H); 1.49 (q, 2H); 1.65 (m, 1H); 3.45 (m, 2H); 8.59 (s, 1H); 8.93 (br, 1H); 12.1 (br, 1H)
1727	[CDCl ₃] 4.08 (m, 2H); 5.21 (dd, 2H); 5.90 (m, 1H); 8.60 (s, 1H); 9.05 (br, 1H); 12.1 (br, 1H)
1728	[CDCl ₃] 1.78 (s, 3H); 4.01 (d, 2H); 4.90 (d, 2H); 8.61 (s, 1H); 9.09 (br, 1H); 11.9 (br, 1H)

【0 3 1 6】

【表 1 1 6】

実施例No.	1H-NMRデータ
1729	[CDC13] 2.25 (m, 1H); 4.23 (m, 2H); 8.63 (s, 1H); 9.23 (br, 1H); 11.9 (br, 1H)
1731	[CDC13] 0.95 (t, 3H); 1.23 (d, 3H); 1.58 (m, 2H); 4.11 (m, 1H); 8.55 (s, 1H); 8.60 (br, 1H)
1733	[CDC13] 0.92 (t, 3H); 1.23 (d, 3H); 1.39 (m, 2H); 1.52 (m, 2H); 4.20 (m, 1H); 8.55 (s, 1H); 8.66 (br, 1H)
1734	[CDC13] 0.87 (t, 3H); 1.22 (d, 3H); 1.35 (m, 6H); 1.52 (m, 2H); 4.17 (m, 1H); 8.52 (s, 1H); 8.61 (br, 1H)
1735	[CDC13] 0.94 (m, 6H); 1.23 (d, 3H); 1.33 (m, 1H); 1.45 (m, 1H); 1.65 (m, 1H); 4.27 (m, 1H); 8.56 (s, 1H); 8.63 (br, 1H); 11.9 (br)
1736	[CDC13] 0.96 (s, 9H); 1.17 (d, 3H); 4.08 (m, 1H); 8.57 (s, 1H); 8.80 (d, br, 1H)
1737	[CDC13] 0.95 (m, 6H); 1.18 (d, 3H); 1.80 (m, 1H); 4.05 (m, 1H); 8.57 (s, 1H); 8.73 (d, br, 1H)
1738	[DMSO] 0.87 (t, 6H), 1.45 (m, 2H), 1.55 (m, 2H); 3.80 (m, 1H); 8.40 (s, 1H); 8.42 (d, br, 1H); 13.4 (br, 1H)
1739	[CDC13] 3.42 (s, 6H); 3.63 (t, 2H); 4.50 (t, 1H); 8.49 (s, 1H); 8.74 (br, 1H); 11.4 (br, 1H)
1741	[CDC13] 3.65 (m, 2H); 3.85 (m, 2H); 8.55 (s, 1H); 9.16 (br, 1H)
1742	[CDC13] 3.40 (s, 3H); 3.57 (m, 2H); 3.67 (m, 2H); 8.47 (s, 1H); 8.75 (br, 1H); 11.5 (br, 1H)
1744	[CDC13] 1.27 (d, 3H); 3.39 (s, 3H); 3.45 (m, 2H); 4.37 (m, 1H); 8.45 (s, 1H); 8.57 (br, 1H); 11.6 (br, 1H)
1745	[CDC13] 1.90 (m, 2H); 3.40 (s, 3H); 3.56 (m, 4H); 8.27 (s, 1H); 8.65 (br, 1H); 11.8 (br, 1H)
1746	[DMSO] 3.67 (s, 3H); 4.13 (d, 2H); 8.38 (s, 1H); 9.12 (br, 1H); 13.6 (br, 1H)
1751	[DMSO] 8.24 (br, 1H); 8.38 (br, 1H); 8.61 (br, 1H); 13.7 (br, 1H)
1752	[CDC13] 3.00 (d, 3H); 8.71 (s, 1H); 8.91 (br, 1H); 12.2 (br, 1H)
1753	[CDC13] 1.23 (t, 3H); 3.49 (m, 2H); 8.71 (s, 1H); 8.89 (br, 1H); 12.1 (br, 1H)
1754	[CDC13] 0.98 (t, 3H); 1.62 (m, 2H); 3.40 (q, 2H); 8.70 (s, 1H); 8.90 (br, 1H)
1755	[CDC13] 1.25 (d, 6H); 4.25 (m, 1H); 8.68 (br, 2H); 12.0 (br, 1H)

【表 1 1 7】

実施例No.	1H-NMRデータ
1756	[CDC13] 0.61 (m, 2H); 0.89 (m, 2H); 2.95 (m, 1H); 8.70 (s, 1H); 8.97 (br, 1H)
1757	[CDC13] 0.94 (t, 3H); 1.40 (m, 2H); 1.58 (m, 2H); 3.45 (m, 2H); 8.69 (s, 1H); 8.88 (br, 1H); 12.0 (br, 1H)
1758	[CDC13] 1.80 (m, 2H); 1.98 (m, 2H); 2.41 (m, 2H); 4.55 (m, 1H); 8.67 (s, 1H); 8.98 (br, 1H); 12.1 (br, 1H)
1759	[CDC13] 1.32 (s, 9H); 8.50 (br, 1H); 8.60 (s, 1H)
1760	[CDC13] 3.12 (s, 6H); 7.99 (s, 1H)
1761	[CDC13] 1.24 (t, 6H); 3.43 (m, 4H); 7.89 (s, 1H)
1762	[CDC13] 0.28 (m, 2H); 0.55 (m, 2H); 1.03 (m, 1H); 3.31 (m, 2H); 8.67 (s, 1H); 8.85 (br, 1H); 11.9 (br, 1H)
1763	[CDC13] 0.96 (s, 9H); 3.27 (d, 2H); 8.71 (s, 1H); 9.00 (br, 1H)
1764	[CDC13] 0.95 (d, 6H); 1.89 (m, 1H); 3.28 (t, 2H); 8.70 (s, 1H); 8.97 (br, 1H)
1766	[CDC13] 0.95 (d, 6H); 1.48 (q, 2H); 1.65 (m, 1H); 3.45 (m, 2H); 8.69 (s, 1H); 8.85 (br, 1H); 12.0 (br, 1H)
1768	[CDC13] 4.08 (m, 2H); 5.21 (dd, 2H); 5.89 (m, 1H); 8.71 (s, 1H); 9.02 (br, 1H); 12.1 (br, 1H)
1769	[CDC13] 1.77 (s, 3H); 4.01 (d, 2H); 4.87 (d, 2H); 8.71 (s, 1H); 9.03 (br, 1H)
1770	[CDC13] 2.23 (m, 1H); 4.23 (m, 2H); 8.72 (s, 1H); 9.20 (br, 1H); 12.0 (br, 1H)
1772	[CDC13] 0.95 (t, 3H); 1.21 (d, 3H); 1.55 (m, 2H); 4.10 (m, 1H); 8.67 (br, 1H); 8.70 (s, 1H); 12.1 (br, 1H)
1774	[CDC13] 0.91 (t, 3H); 1.21 (d, 3H); 1.38 (m, 2H); 1.50 (m, 2H); 4.19 (m, 1H); 8.64 (br, 1H); 8.69 (s, 1H); 12.0 (br, 1H)
1775	[CDC13] 0.89 (t, 3H); 1.21 (d, 3H); 1.33 (m, 6H); 1.51 (m, 2H); 4.17 (m, 1H); 8.60 (br, 1H); 8.68 (s, 1H)
1776	[CDC13] 0.90 (m, 6H); 1.21 (d, 3H); 1.31 (m, 1H); 1.45 (m, 1H); 1.64 (m, 1H); 4.25 (m, 1H); 8.60 (br, 1H); 8.69 (s, 1H)
1777	[CDC13] 0.94 (s, 9H); 1.15 (d, 3H); 4.08 (m, 1H); 8.69 (s, 1H); 8.79 (br, 1H)

10

20

30

40

【表 1 1 8】

実施例No.	1H-NMRデータ
1778	[CDC13] 0.93 (m, 6H); 1.17 (d, 3H); 1.79 (m, 1H); 4.05 (m, 1H); 8.67 (s, 1H); 8.71 (br, 1H)
1780	[CDC13] 0.92 (t, 6H); 1.48 (m, 2H); 1.62 (m, 2H); 3.96 (m, 1H); 8.61 (s, 1H); 9.16 (d, br, 1H)
1781	[CDC13] 3.40 (s, 6H); 3.61 (t, 2H); 4.50 (t, 1H); 8.63 (s, 1H); 8.76 (br, 1H)
1783	[CDC13] 3.64 (m, 2H); 3.86 (m, 2H); 8.68 (s, 1H); 9.17 (br, 1H)
1784	[CDC13] 3.49 (s, 3H); 3.55 (m, 2H); 3.66 (m, 2H); 8.62 (s, 1H); 8.77 (br, 1H)
1785	[CDC13] 1.27 (d, 3H); 3.39 (s, 3H); 3.44 (m, 2H); 4.37 (m, 1H); 8.56 (br, 1H); 8.60 (s, 1H); 11.9 (br, 1H)
1786	[CDC13] 1.90 (m, 2H); 3.40 (s, 3H); 3.58 (m, 4H); 8.40 (s, 1H); 8.65 (br, 1H)
1787	[CDC13] 3.78 (s, 3H); 4.24 (d, 2H); 8.69 (s, 1H); 9.25 (br, 1H); 11.5 (br, 1H)
1792	[DMSO] 8.22 (br, 1H); 8.37 (br, 1H); 8.81 (br, 1H); 13.7 (br, 1H)
1793	[CDC13] 3.00 (d, 3H); 8.80 (s, br, 2H); 12.0 (br, 1H)
1794	[CDC13] 1.24 (t, 3H); 3.49 (m, 2H); 8.40 (s, br, 2H); 12.0 (br, 1H)
1795	[DMSO] 0.89 (t, 3H); 1.53 (m, 2H); 3.26 (q, 2H); 8.72 (s, 1H); 8.78 (t, br, 1H); 13.4 (br, 1H)
1796	[DMSO] 1.18 (d, 6H); 4.08 (m, 1H); 8.60 (d, br, 2H); 13.4 (br, 1H)
1797	[DMSO] 0.60 (m, 2H); 0.75 (m, 2H); 2.88 (m, 1H); 8.68 (s, 1H); 8.77 (d, br, 1H); 13.3 (br, 1H)
1798	[CDC13] 0.94 (t, 3H); 1.40 (m, 2H); 1.59 (m, 2H); 3.44 (m, 2H); 8.79 (s, br, 2H)
1799	[DMSO] 1.70 (m, 2H); 2.05 (m, 2H); 2.27 (m, 2H); 4.39 (m, 1H); 8.71 (s, 1H); 8.95 (d, br, 1H); 13.4 (br, 1H)
1800	[CDC13] 1.43 (s, 9H); 8.70 (br, 1H); 8.85 (s, 1H); 11.5 (br)
1801	[CDC13] 3.10 (s, 6H); 8.20 (s, 1H)
1802	[CDC13] 1.23 (t, 6H); 3.43 (m, br, 4H); 8.12 (s, 1H)

10

20

30

40

【表 1 1 9】

実施例No.	¹ H-NMRデータ
1803	[DMSO] 0.26 (m, 2H); 0.50 (m, 2H); 1.05 (m, 1H); 3.19 (t, 2H); 8.76 (s, 1H); 8.87 (br, 1H); 13.5 (br, 1H)
1804	[DMSO] 0.91 (s, 9H); 3.13 (d, 2H); 8.61 (t, br, 1H); 8.68 (s, 1H); 13.4 (br, 1H)
1805	[DMSO] 0.89 (d, 6H); 1.84 (m, 1H); 3.14 (t, 2H); 8.70 (s, 1H); 8.75 (t, br, 1H); 13.4 (br, 1H)
1807	[DMSO] 0.89 (d, 6H); 1.40 (q, 2H); 1.62 (m, 1H); 3.30 (m, 2H); 8.71 (s, 1H); 8.73 (t, br, 1H); 13.4 (br, 1H)
1809	[DMSO] 3.93 (m, 2H); 5.18 (dd, 2H); 5.90 (m, 1H); 8.71 (s, 1H); 8.89 (t, br, 1H); 13.4 (br, 1H)
1810	[DMSO] 1.72 (s, 3H); 3.87 (d, 2H); 4.85 (d, 2H); 8.71 (s, 1H); 8.87 (t, br, 1H); 13.3 (br, 1H)
1811	[DMSO] 3.18 (m, 1H); 4.10 (m, 2H); 8.69 (s, 1H); 9.01 (t, br, 1H); 13.4 (br, 1H)
1813	[DMSO] 0.87 (t, 3H); 1.14 (d, 3H); 1.50 (m, 2H); 3.90 (m, 1H); 8.52 (d, br, 1H); 8.72 (s, 1H); 13.4 (br, 1H)
1815	[DMSO] 0.89 (t, 3H); 1.15 (d, 3H); 1.30 (m, 2H); 1.47 (m, 2H); 4.00 (m, 1H); 8.54 (br, 1H); 8.72 (s, 1H); 13.4 (br, 1H)
1816	[CDCl ₃] 0.89 (t, 3H); 1.20 (d, 3H); 1.27-1.37 (m, 6H); 1.51 (m, 2H); 4.16 (m, 1H); 8.75 (br, 1H); 8.90 (s, 1H); 12.1 (br, 1H)
1817	[CDCl ₃] 0.91 (m, 6H); 1.20 (d, 3H); 1.32 (m, 1H); 1.45 (m, 1H); 1.65 (m, 1H); 4.25 (m, 1H); 8.66 (br, 1H); 8.90 (s, 1H); 11.9 (br, 1H)
1818	[CDCl ₃] 0.94 (s, 9H); 1.14 (d, 3H); 4.07 (m, 1H); 8.85 (br, 1H); 8.90 (s, 1H)
1819	[CDCl ₃] 0.95 (m, 6H); 1.18 (d, 3H); 1.79 (m, 1H); 4.04 (m, 1H); 8.75 (br, 1H); 8.89 (s, 1H)
1820	[CDCl ₃] 0.93 (t, 6H); 1.48 (m, 2H); 1.64 (m, 2H); 3.98 (m, 1H); 8.63 (br, 1H); 8.90 (s, 1H); 11.6 (br, 1H)
1821	[CDCl ₃] 3.40 (s, 6H); 3.60 (t, 2H); 4.49 (t, 1H); 8.85 (s, br, 2H); 11.4 (br, 1H)
1823	[CDCl ₃] 3.63 (m, 2H); 3.83 (m, 2H); 8.86 (s, 1H); 9.17 (br, 1H)
1824	[CDCl ₃] 3.38 (s, 3H); 3.55 (m, 2H); 3.65 (m, 2H); 8.82 (s, 1H); 8.84 (br, 1H); 11.4 (br, 1H)
1826	[CDCl ₃] 1.25 (d, 3H); 3.39 (s, 3H); 3.43 (m, 2H); 4.38 (m, 1H); 8.67 (br, 1H); 8.82 (s, 1H); 11.5 (br, 1H)

【 0 3 2 0 】

【表 1 2 0】

実施例No.	1H-NMRデータ
1827	[CDCl ₃] 1.89 (m, 2H); 3.40 (s, 3H); 3.55 (m, 4H); 8.67 (s, 1H); 8.74 (br, 1H); 11.8 (br, 1H)
1828	[CDCl ₃] 3.78 (s, 3H); 4.24 (d, 2H); 8.89 (s, 1H); 9.30 (br, 1H)
1833	[DMSO] 2.85 (d, 3H); 8.69 (s, 1H); 8.71 (br, 1H); 13.5 (br, 1H)
1834	[DMSO] 1.12 (t, 3H); 3.30 (m, 2H); 8.70 (s, 1H); 8.75 (t, br, 1H); 13.5 (br, 1H)
1835	[DMSO] 0.89 (t, 3H); 1.52 (m, 2H); 3.25 (q, 2H); 8.70 (s, 1H); 8.75 (t, br, 1H); 13.5 (br, 1H)
1837	[DMSO] 0.59 (m, 2H); 0.76 (m, 2H); 2.86 (m, 1H); 8.66 (s, 1H); 8.76 (br, 1H); 13.3 (br)
1838	[CDCl ₃] 0.95 (t, 3H); 1.42 (m, 2H); 1.60 (m, 2H); 3.45 (m, 2H); 8.86 (s, 1H); 8.95 (br, 1H)
1839	[CDCl ₃] 1.81 (m, 2H); 2.00 (m, 2H); 2.42 (m, 2H); 4.54 (m, 1H); 8.84 (s, 1H); 9.17 (d, br, 1H); 12.2 (br, 1H)
1845	[CDCl ₃] 0.29 (m, 2H); 0.57 (m, 2H); 1.05 (m, 1H); 3.32 (t, 2H); 8.87 (s, 1H); 9.05 (br, 1H); 12.3 (br, 1H)
1847	[CDCl ₃] 1.00 (d, 6H); 1.90 (m, 1H); 3.30 (t, 2H); 8.85 (s, 1H); 9.00 (br, 1H)
1849	[CDCl ₃] 0.95 (d, 6H); 1.51 (q, 2H); 1.68 (m, 1H); 3.46 (m, 2H); 8.85 (s, 1H); 8.91 (br, 1H)
1851	[DMSO] 3.94 (m, 2H); 5.16 (dd, 2H); 5.90 (m, 1H); 8.70 (s, 1H); 8.85 (t, br, 1H); 13.4 (br, 1H)
1852	[CDCl ₃] 1.79 (s, 3H); 4.02 (m, 2H); 4.92 (m, 2H); 8.88 (s, 1H); 9.10 (t, br, 1H)
1853	[CDCl ₃] 2.26 (m, 1H); 4.22 (m, 2H); 8.86 (s, 1H); 9.25 (br, 1H)
1854	[DMSO] 0.87 (t, 3H); 1.13 (d, 3H); 1.50 (m, 2H); 3.91 (m, 1H); 8.55 (d, br, 1H); 8.70 (br, 1H); 13.5 (br, 1H)
1856	[DMSO] 0.89 (t, 3H); 1.15 (d, 3H); 1.30 (m, 2H); 1.49 (m, 2H); 4.01 (m, 1H); 8.51 (d, br, 1H); 8.71 (s, 1H); 13.6 (br, 1H)
1857	[CDCl ₃] 0.87 (t, 3H); 1.22 (d, 3H); 1.25-1.35 (m, 6H); 1.53 (m, 2H); 4.14 (m, 1H); 8.81 (d, br, 1H); 8.88 (s, 1H)
1858	[CDCl ₃] 0.92 (m, 6H); 1.22 (d, 3H); 1.33 (m, 1H); 1.48 (m, 1H); 1.65 (m, 1H); 4.25 (m, 1H); 8.84 (br, 1H); 8.88 (s, 1H); 12.3 (br, 1H)
1860	[CDCl ₃] 0.95 (m, 6H); 1.18 (d, 3H); 1.81 (m, 1H); 4.05 (m, 1H); 8.90 (s, 1H); 9.01 (d, br, 1H)

10

20

30

40

【表 1 2 1】

実施例No.	1H-NMRデータ
1861	[DMSO] 0.88 (t, 6H); 1.45 (m, 2H); 1.55 (m, 2H); 3.79 (m, 1H); 8.40 (d, br, 1H); 8.70 (s, 1H); 13.5 (br, 1H)
1867	[DMSO] 3.29 (s, 3H); 3.47 (m, 4H); 8.73 (s, 1H); 8.79 (br, 1H); 13.6 (br, 1H)
1869	[CDC13] 1.28 (d, 3H); 3.39 (s, 3H); 3.45 (m, 2H); 4.35 (m, 1H); 8.81 (s, 1H); 8.86 (br, 1H); 12.0 (br, 1H)
1870	[CDC13] 1.90 (m, 2H); 3.41 (s, 3H); 3.56 (m, 4H); 8.62 (s, 1H); 8.76 (br, 1H); 11.9 (br, 1H)
1876	[DMSO] 8.18 (br, 1H); 8.35 (br, 1H); 8.79 (s, 1H); 13.7 (br, 1H)
1877	[DMSO] 2.83 (d, 3H); 8.70 (br, 2H); 13.5 (br, 1H)
1878	[DMSO] 1.12 (t, 3H); 3.32 (m, 2H); 8.71 (s, 1H); 8.76 (t, br, 1H); 13.4 (br, 1H)
1879	[DMSO] 0.90 (t, 3H); 1.51 (m, 2H); 3.25 (q, 2H); 8.70 (s, 1H); 8.78 (t, br, 1H); 13.5 (br, 1H)
1880	[DMSO] 1.18 (d, 6H); 4.07 (m, 2H); 8.57 (d, br, 1H); 8.72 (s, 1H); 13.4 (br, 1H)
1881	[DMSO] 0.58 (m, 2H); 0.74 (m, 2H); 2.85 (m, 1H); 8.66 (s, 1H); 8.74 (br, 1H); 13.4 (br, 1H)
1882	[DMSO] 0.89 (t, 3H); 1.31 (m, 2H); 1.50 (m, 2H); 3.30 (m, 2H); 8.70 (s, 1H); 8.75 (br, 1H)
1883	[DMSO] 1.69 (m, 2H); 2.02 (m, 2H); 2.25 (m, 2H); 4.39 (m, 1H); 8.70 (s, 1H); 8.95 (br, 1H)
1884	[CDC13] 1.47 (s, 9H); 8.87 (s, 1H); 9.02 (br, 1H); 12.2 (br, 1H)
1885	[CDC13] 3.12 (s, 6H); 8.16 (s, 1H)
1886	[DMSO] 0.23 (m, 2H); 0.45 (m, 2H); 1.02 (m, 1H); 3.19 (t, 2H); 8.72 (s, 1H); 8.83 (br, 1H); 13.4 (br, 1H)
1887	[DMSO] 0.90 (s, 9H); 3.14 (d, 2H); 8.72 (br, 1H); 8.67 (s, 1H); 13.4 (br, 1H)
1888	[DMSO] 0.90 (d, 6H); 1.84 (m, 1H); 3.12 (t, 2H); 8.68 (s, 1H); 8.73 (t, br, 1H); 13.4 (br, 1H)
1890	[DMSO] 0.90 (d, 6H); 1.41 (m, 2H); 1.60 (m, 1H); 3.30 (m, 2H); 8.69 (s, 1H); 8.72 (t, br, 1H); 13.5 (br, 1H)

10

20

30

40

【0 3 2 2】

【表 1 2 2】

実施例N o.	1 H-NMRデータ
1892	[DMSO] 3.94 (m, 2H); 5.15 (dd, 2H); 5.89 (m, 1H); 8.70 (s, 1H); 8.85 (t, br, 1H)
1894	[DMSO] 1.70 (s, 3H); 3.86 (d, 2H); 4.84 (d, 2H); 8.68 (s, 1H); 8.95 (br, 1H); 13.4 (br, 1H)
1895	[DMSO] 3.10 (t, 1H); 4.05 (m, 2H); 8.25 (br, 1H); 8.30 (s, 1H); 11.5 (br, 1H)
1897	[CDC13] 0.95 (t, 3H); 1.24 (d, 3H); 1.60 (m, 2H); 4.10 (m, 1H); 8.87 (br, 2H)
1899	[CDC13] 0.92 (t, 3H); 1.23 (d, 3H); 1.40 (m, 2H); 1.52 (m, 2H); 4.17 (m, 1H); 8.88 (s, 1H); 8.91 (br, 1H)
1900	[DMSO] 0.86 (t, 3H); 1.15 (d, 3H); 1.25 (m, 6H); 1.48 (m, 2H); 4.00 (m, 1H); 8.53 (d, br, 1H); 8.71 (s, 1H); 13.4 (br, 1H)
1903	[DMSO] 0.89 (d, 6H); 1.13 (d, 3H); 1.27 (m, 1H); 1.48 (m, 1H); 1.62 (m, 1H); 4.09 (m, 1H); 8.50 (d, br, 1H); 8.71 (s, 1H); 13.5 (br, 1H)
1904	[DMSO] 0.81 (s, 9H); 1.07 (d, 3H); 3.90 (m, 1H); 8.43 (d, br, 1H); 8.67 (s, 1H); 13.4 (br, 1H)
1905	[DMSO] 0.88 (d, 6H); 1.10 (d, 3H); 1.75 (m, 1H); 1.48 (m, 1H); 3.85 (m, 1H); 8.49 (d, br, 1H); 8.70 (s, 1H); 13.5 (br, 1H)
1907	[DMSO] 0.87 (t, 6H); 1.43 (m, 2H); 1.55 (m, 2H); 3.78 (m, 1H); 8.55 (br, 1H); 8.67 (s, 1H); 13.5 (br, 1H)
1910	[CDC13] 3.41 (s, 6H); 3.62 (t, 2H); 4.50 (t, 1H); 8.82 (s, 1H); 8.95 (br, 1H); 11.2 (br, 1H)
1912	[DMSO] 3.39 (m, 2H); 3.52 (m, 2H); 4.83 (br, 1H); 8.76 (s, 1H); 8.80 (t, br, 1H); 13.6 (br, 1H)
1913	[DMSO] 3.26 (s, 3H); 3.47 (m, 4H); 8.71 (s, 1H); 8.79 (br, 1H)
1916	[CDC13] 1.27 (d, 3H); 3.39 (s, 3H); 3.44 (m, 2H); 4.38 (m, 1H); 8.83 (s, 1H); 8.95 (br, 1H); 12.1 (br, 1H)
1917	[DMSO] 1.75 (m, 2H); 3.24 (s, 3H); 3.39 (m, 4H); 8.70 (s, 1H); 8.81 (br, 1H); 13.4 (br, 1H)
1918	[DMSO] 3.66 (s, 3H); 4.12 (d, 2H); 8.71 (s, 1H); 9.02 (t, br, 1H), 13.5 (br, 1H)
1923	[DMSO] 2.81 (d, 3H); 8.72 (s, 1H); 8.77 (br, 1H); 13.4 (br)
1924	[DMSO] 1.14 (t, 3H); 3.35 (m, 2H); 8.74 (s, 1H); 8.82 (t, br, 1H); 13.4 (br)
1925	[DMSO] 0.89 (t, 3H); 1.53 (m, 2H); 3.28 (q, 2H); 8.73 (s, 1H); 8.80 (t, br, 1H)

【 0 3 2 3 】

【表 1 2 3】

実施例No.	¹ H-NMRデータ
1926	[DMSO] 1.18 (d, 6H); 4.10 (m, 1H); 8.63 (d, br, 1H); 8.75 (s, 1H); 13.4 (br, 1H)
1927	[DMSO] 0.60 (m, 2H); 0.75 (m, 2H); 2.87 (m, 1H); 8.69 (s, 1H); 8.80 (br, 1H)
1928	[DMSO] 0.89 (t, 3H); 1.34 (m, 2H); 1.51 (m, 2H); 3.30 (m, 2H); 8.72 (s, 1H); 8.79 (br, 1H)
1929	[DMSO] 1.72 (m, 2H); 2.05 (m, 2H); 2.27 (m, 2H); 4.38 (m, 1H); 8.73 (s, 1H); 9.00 (d, br, 1H); 13.3 (br)
1930	[DMSO] 1.37 (s, 9H); 8.30 (br, 1H); 8.66 (s, 1H); 13.4 (br)
1931	[DMSO] 2.80 (s, 3H); 2.96 (s, 3H); 8.27 (s, 1H); 12.4 (br, 1H)
1932	[DMSO] 1.01 (t, 3H); 1.11 (t, 3H); 3.10 (q, 2H); 3.42 (q, 2H); 8.25 (s, 1H); 12.3 (br, 1H)
1933	[DMSO] 0.26 (m, 2H); 0.47 (m, 2H); 1.04 (m, 1H); 3.20 (m, 2H); 8.77 (s, 1H); 8.87 (t, br, 1H); 13.5 (br, 1H)
1934	[DMSO] 0.90 (s, 9H); 3.13 (d, 2H); 8.62 (t, br, 1H); 8.70 (s, 1H); 13.3 (br, 1H)
1935	[DMSO] 0.90 (d, 6H); 1.85 (m, 1H); 3.13 (m, 2H); 8.71 (s, 1H); 8.75 (t, br, 1H); 13.4 (br, 1H)
1937	[CDCl ₃] 0.94 (d, 6H); 1.49 (q, 2H); 1.66 (m, 1H); 3.46 (m, 2H); 8.75 (br, 1H); 8.85 (s, 1H); 11.5 (br)
1939	[DMSO] 3.93 (m, 2H); 5.19 (dd, 2H); 5.89 (m, 1H); 8.72 (s, 1H); 8.90 (t, br, 1H); 13.3 (br, 1H)
1941	[DMSO] 1.72 (s, 3H); 3.87 (d, 2H); 4.87 (d, 2H); 8.73 (s, 1H); 8.89 (t, br, 1H); 13.3 (br)
1942	[DMSO] 3.18 (m, 1H); 4.10 (m, 2H); 8.70 (s, 1H); 9.04 (t, br, 1H); 13.3 (br, 1H)
1944	[DMSO] 0.89 (t, 3H); 1.14 (d, 3H); 1.51 (m, 2H); 3.91 (m, 1H); 8.55 (d, br, 1H); 8.75 (s, 1H); 13.4 (br, 1H)
1946	[DMSO] 0.89 (t, 3H); 1.15 (d, 3H); 1.31 (m, 2H); 1.47 (m, 2H); 4.01 (m, 1H); 8.56 (br, 1H); 8.74 (s, 1H); 13.4 (br, 1H)
1947	[DMSO] 0.85 (t, 3H); 1.15 (d, 3H); 1.20-1.35 (m, 6H); 1.49 (m, 2H); 4.00 (m, 1H); 8.58 (d, br, 1H); 8.74 (s, 1H); 13.4 (br, 1H)
1948	[DMSO] 0.88 (d, 6H); 1.15 (d, 3H); 1.27 (m, 1H); 1.48 (m, 1H); 1.61 (m, 1H); 4.10 (m, 1H); 8.56 (d, br, 1H); 8.74 (s, 1H); 13.5 (br, 1H)

【 0 3 2 4 】

【表 1 2 4】

実施例No.	1H-NMRデータ
1949	[CDCl ₃] 0.94 (s, 9H); 1.15 (d, 3H); 4.09 (m, 1H); 8.89 (br, 1H); 8.91 (s, 1H)
1950	[CDCl ₃] 0.94 (m, 6H); 1.17 (d, 3H); 1.80 (m, 1H); 4.05 (m, 1H); 8.88 (br, 1H); 8.92 (s, 1H)
1951	[CDCl ₃] 0.92 (t, 6H); 1.49 (m, 2H); 1.65 (m, 2H); 3.99 (m, 1H); 8.78 (br, 1H); 8.92 (s, 1H)
1952	[CDCl ₃] 3.41 (s, 6H); 3.61 (t, 2H); 4.50 (t, 1H); 8.84 (s, br, 2H); 11.4 (br, 1H)
1954	[DMSO] 3.39 (m, 2H); 3.52 (m, 2H); 4.80 (br, 1H); 8.79 (s, 1H); 8.82 (t, br, 1H); 13.5 (br, 1H)
1955	[CDCl ₃] 3.38 (s, 3H); 3.55 (m, 2H); 3.66 (m, 2H); 8.78 (s, br, 1H); 8.82 (s, 1H); 11.5 (br)
1957	[CDCl ₃] 1.27 (d, 3H); 3.38 (s, 3H); 3.42 (m, 2H); 4.38 (m, 1H); 8.75 (br, 1H); 8.84 (s, 1H); 12.3 (br, 1H)
1958	[CDCl ₃] 1.89 (m, 2H); 3.41 (s, 3H); 3.56 (m, 4H); 8.61 (s, 1H); 8.68 (br, 1H); 11.8 (br, 1H)
1959	[DMSO] 3.67 (s, 3H); 4.12 (d, 2H); 8.73 (s, 1H); 9.04 (t, br, 1H); 13.5 (br, 1H)
1964	[DMSO] 8.25 (br, 1H); 8.37 (br, 1H); 8.47 (s, 1H); 13.7 (br, 1H)
1965	[DMSO] 2.82 (d, 3H); 8.37 (s, 1H); 8.72 (d, br, 1H); 13.5 (br, 1H)
1966	[DMSO] 1.13 (t, 3H); 3.34 (m, 2H); 8.39 (s, 1H); 8.76 (t, br, 1H); 13.5 (br, 1H)
1967	[DMSO] 0.90 (t, 3H); 1.53 (m, 2H); 3.26 (q, 2H); 8.39 (s, 1H); 8.75 (t, br, 1H); 13.5 (br, 1H)
1968	[DMSO] 1.18 (d, 6H); 4.09 (m, 1H); 8.41 (s, 1H); 8.58 (d, br, 1H); 13.5 (br, 1H)
1969	[DMSO] 0.59 (m, 2H); 0.75 (m, 2H); 2.86 (m, 1H); 8.34 (s, 1H); 8.73 (d, br, 1H); 13.4 (br, 1H)
1970	[DMSO] 0.89 (t, 3H); 1.33 (m, 2H); 1.51 (m, 2H); 3.31 (m, 2H); 8.39 (s, 1H); 8.73 (t, br, 1H); 13.5 (br, 1H)
1971	[DMSO] 1.70 (m, 2H); 2.04 (m, 2H); 2.25 (m, 2H); 4.38 (m, 1H); 8.39 (s, 1H); 8.92 (d, br, 1H); 13.4 (br, 1H)
2006	[DMSO] 8.25 (br, 1H); 8.35 (br, 1H); 8.61 (s, 1H); 13.7 (br, 1H)
2007	[DMSO] 2.82 (d, 3H); 8.51 (s, 1H); 8.74 (d, br, 1H); 13.5 (br, 1H)

【表 1 2 5】

実施例No.	1H-NMRデータ
2008	[DMSO] 1.13 (t, 3H); 3.33 (m, 2H); 8.53 (s, 1H); 8.78 (t, br, 1H); 13.5 (br, 1H)
2009	[DMSO] 0.89 (t, 3H); 1.53 (m, 2H); 3.26 (q, 2H); 8.51 (s, 1H); 8.76 (t, br, 1H); 13.5 (br, 1H)
2010	[DMSO] 1.18 (d, 6H); 4.07 (m, 1H); 8.53 (s, 1H); 8.61 (d, br, 1H); 13.5 (br, 1H)
2011	[DMSO] 0.58 (m, 2H); 0.74 (m, 2H); 2.86 (m, 1H); 8.48 (s, 1H); 8.77 (d, br, 1H); 13.4 (br, 1H)
2012	[DMSO] 0.90 (t, 3H); 1.33 (m, 2H); 1.51 (m, 2H); 3.30 (m, 2H); 8.52 (s, 1H); 8.77 (t, br, 1H); 13.5 (br, 1H)
2013	[DMSO] 1.72 (m, 2H); 2.05 (m, 2H); 2.25 (m, 2H); 4.39 (m, 1H); 8.51 (s, 1H); 8.95 (d, br, 1H); 13.4 (br, 1H)
2014	[DMSO] 1.37 (s, 9H); 8.31 (br, 1H); 8.45 (s, 1H); 13.4 (br, 1H)
2015	[DMSO] 2.82 (s, 3H); 2.95 (s, 3H); 8.12 (s, 1H); 12.5 (br, 1H)
2017	[DMSO] 0.26 (m, 2H); 0.47 (m, 2H); 1.04 (m, 1H); 3.30 (m, 2H); 8.56 (s, 1H); 8.86 (t, br, 1H); 13.5 (br, 1H)
2018	[DMSO] 0.91 (s, 9H); 3.13 (d, 2H); 8.47 (s, 1H); 8.63 (t, br, 1H); 13.5 (br, 1H)
2019	[DMSO] 0.90 (d, 6H); 1.83 (m, 1H); 3.13 (m, 2H); 8.50 (s, 1H); 8.73 (t, br, 1H); 13.4 (br, 1H)
2021	[DMSO] 0.89 (d, 6H); 1.42 (q, 2H); 1.62 (m, 1H); 3.31 (m, 2H); 8.51 (s, 1H); 8.75 (t, br, 1H); 13.5 (br, 1H)
2023	[DMSO] 3.94 (m, 2H); 5.18 (dd, 2H); 5.89 (m, 1H); 8.52 (s, 1H); 8.88 (t, br, 1H); 13.4 (br, 1H)
2025	[DMSO] 1.72 (s, 3H); 3.86 (d, 2H); 4.85 (d, 2H); 8.50 (s, 1H); 8.87 (t, br, 1H); 13.4 (br, 1H)
2026	[DMSO] 3.18 (m, 1H); 4.10 (m, 2H); 8.48 (s, 1H); 9.02 (t, br, 1H); 13.3 (br, 1H)
2030	[CDC13] 0.93 (t, 3H); 1.23 (d, 3H); 1.40 (m, 2H); 1.52 (m, 2H); 4.21 (m, 1H); 8.74 (s, 1H); 8.97 (d, br, 1H); 12.9 (br, 1H)
2031	[DMSO] 0.85 (t, 3H); 1.15 (d, 3H); 1.20-1.35 (m, 6H); 1.48 (m, 2H); 3.99 (m, 1H); 8.52 (s, 1H); 8.54 (d, br, 1H); 13.5 (br, 1H)
2032	[DMSO] 0.88 (d, 6H); 1.14 (d, 3H); 1.27 (m, 1H); 1.48 (m, 1H); 1.62 (m, 1H); 4.10 (m, 1H); 8.51 (s, 1H); 8.53 (d, br, 1H); 13.5 (br, 1H)

【表 1 2 6】

実施例No.	1H-NMRデータ
2035	[DMSO] 0.86 (t, 6H); 1.45 (m, 2H); 1.55 (m, 2H); 3.78 (m, 1H); 8.82 (d, br, 1H); 8.51 (s, 1H); 13.5 (br, 1H)
2036	[CDCl ₃] 3.41 (s, 6H); 3.61 (t, 2H); 4.50 (t, 1H); 8.67 (s, 1H); 9.00 (br, 1H); 11.7 (br, 1H)
2038	[DMSO] 3.35 (m, 2H); 3.53 (m, 2H); 4.81 (br, 1H); 8.56 (s, 1H); 8.80 (t, br, 1H); 13.6 (br, 1H)
2039	[CDCl ₃] 3.38 (s, 3H); 3.56 (m, 2H); 3.65 (m, 2H); 8.65 (s, 1H); 9.01 (s, 1H); 11.8 (br, 1H)
2041	[DMSO] 1.15 (d, 3H); 3.30 (s, 3H); 3.40 (m, 2H); 4.18 (m, 1H); 8.52 (s, 1H); 8.64 (d, br, 1H); 13.4 (br, 1H)
2048	[DMSO] 8.20 (br, 1H); 8.37 (br, 1H); 8.81 (s, 1H); 13.7 (br, 1H)
2090	[DMSO] 7.45 (d, 1H); 8.14 (br, 1H); 8.42 (br, 1H); 8.48 (d, 1H); 13.7 (br, 1H)
2091	[DMSO] 2.84 (d, 3H); 7.42 (d, 1H); 8.41 (d, 1H); 8.79 (br, 1H); 13.4 (br, 1H)
2092	[DMSO] 1.12 (t, 3H); 3.32 (m, 2H); 7.42 (d, 1H); 8.42 (d, 1H); 8.83 (br, 1H); 13.4 (br, 1H)
2093	[DMSO] 0.89 (t, 3H); 1.54 (m, 2H); 3.27 (q, 2H); 7.42 (d, 1H); 8.41 (d, 1H); 8.82 (br, 1H); 13.4 (br, 1H)
2094	[DMSO] 1.18 (d, 6H); 4.11 (m, 1H); 7.41 (d, 1H); 8.41 (d, 1H); 8.63 (br, 1H); 13.4 (br, 1H)
2095	[CDCl ₃] 0.61 (m, 2H); 0.88 (m, 2H); 3.00 (m, 1H); 6.89 (d, 1H); 8.68 (d, 1H); 9.35 (br, 1H); 12.5 (br, 1H)
2096	[DMSO] 0.89 (t, 3H); 1.33 (m, 2H); 1.52 (m, 2H); 3.32 (m, 2H); 7.42 (d, 1H); 8.41 (d, 1H); 8.81 (br, 1H); 13.3 (br, 1H)
2097	[DMSO] 1.72 (m, 2H); 2.05 (m, 2H); 2.46 (m, 2H); 4.41 (m, 1H); 7.43 (d, 1H); 8.39 (d, 1H); 8.96 (br, 1H); 13.3 (br, 1H)
2101	[DMSO] 0.26 (m, 2H), 0.47 (m, 2H); 1.06 (m, 1H); 3.22 (m, 2H); 7.45 (d, 1H); 8.45 (d, 1H); 8.91 (br, 1H); 13.4 (br, 1H)
2102	[DMSO] 0.92 (s, 9H); 3.15 (d, 2H); 7.40 (d, 1H); 8.41 (d, 1H); 8.75 (br, 1H); 13.3 (br, 1H)
2103	[DMSO] 0.90 (d, 6H); 1.83 (m, 1H); 3.14 (t, 2H); 7.40 (d, 1H); 8.40 (d, 1H); 8.81 (t, br, 1H); 13.3 (br, 1H)
2105	[DMSO] 0.90 (d, 6H); 1.42 (m, 2H); 1.62 (m, 1H); 3.33 (m, 2H); 7.41 (d, 1H); 8.40 (d, 1H); 8.80 (br, 1H); 13.3 (br, 1H)
2107	[DMSO] 3.95 (t, 2H); 5.17 (dd, 2H); 5.90 (m, 1H); 7.41 (d, 1H); 8.41 (d, 1H); 8.93 (br, 1H); 13.3 (br, 1H)

【 0 3 2 7 】

【表 1 2 7】

実施例No.	1H-NMRデータ
2109	[DMSO] 1.72 (s, 3H); 3.88 (d, 2H); 4.85 (d, 2H); 7.42 (d, 1H); 8.42 (d, 1H); 8.94 (br, 1H); 13.3 (br, 1H)
2110	[DMSO] 3.17 (m, 1H); 4.11 (m, 2H); 7.41 (d, 1H); 8.40 (d, 1H); 9.06 (br, 1H), 13.3 (br, 1H)
2112	[DMSO] 0.89 (t, 3H); 1.15 (d, 3H); 1.53 (m, 2H); 3.95 (m, 1H); 7.42 (d, 1H); 8.42 (d, 1H); 8.60 (br, 1H); 13.4 (br, 1H)
2114	[DMSO] 0.88 (t, 3H); 1.15 (d, 3H); 1.32 (m, 2H); 1.48 (m, 2H); 4.04 (m, 1H); 7.42 (d, 1H); 8.41 (d, 1H); 8.59 (br, 1H); 13.4 (br, 1H)
2115	[DMSO] 0.85 (t, 3H); 1.16 (d, 3H); 1.20-1.35 (m, 6H); 1.50 (m, 2H); 4.02 (m, 1H); 7.42 (d, 1H); 8.44 (d, 1H); 8.62 (d, br, 1H), 13.4 (br, 1H)
2116	[DMSO] 0.88 (d, 6H); 1.14 (d, 3H); 1.25 (m, 1H); 1.48 (m, 1H); 1.63 (m, 1H); 4.21 (m, 1H); 6.92 (d, 1H); 8.42 (d, 1H); 8.59 (d, br, 1H), 13.4 (br, 1H)
2122	[DMSO] 3.40 (m, 2H); 3.52 (m, 2H); 4.82 (br, 1H); 7.44 (d, 1H); 8.46 (d, 1H); 8.88 (br, 1H); 13.4 (br, 1H)
2133	[DMSO] 2.83 (d, 3H); 8.58 (s, 1H); 8.82 (d, br, 1H); 13.4 (br, 1H)
2134	[DMSO] 1.14 (t, 3H); 3.34 (m, 2H); 8.60 (s, 1H); 8.86 (t, br, 1H); 13.5 (br, 1H)
2135	[DMSO] 0.89 (t, 3H); 1.54 (m, 2H); 3.26 (q, 2H); 8.59 (s, 1H); 8.85 (t, br, 1H); 13.5 (br, 1H)
2137	[DMSO] 0.60 (m, 2H); 0.75 (m, 2H); 2.88 (m, 1H); 8.55 (s, 1H); 8.85 (d, br, 1H); 13.4 (br, 1H)
2138	[DMSO] 0.90 (t, 3H); 1.33 (m, 2H); 1.51 (m, 2H); 3.31 (m, 2H); 8.59 (s, 1H); 8.84 (t, br, 1H); 13.4 (br, 1H)
2139	[DMSO] 1.71 (m, 2H); 2.05 (m, 2H); 2.25 (m, 2H); 4.40 (m, 1H); 8.62 (s, 1H); 9.04 (d, br, 1H); 13.4 (br, 1H)
2143	[DMSO] 0.26 (m, 2H); 0.47 (m, 2H); 1.05 (m, 1H); 3.20 (m, 2H); 8.63 (s, 1H); 8.94 (t, br, 1H); 13.4 (br, 1H)
2144	[DMSO] 0.91 (s, 9H); 3.15 (d, 2H); 8.55 (s, 1H); 8.66 (t, br, 1H); 13.3 (br, 1H)

【 0 3 2 8 】

3 . 生物学的実施例

〔 実施例 3 . 1 . 〕

被害の採点評価

植物に対する被害は、0 ~ 100 % のスケールを用いて、対照植物と比較して視覚的にスコア化した：

0 % = 非処理植物と比べて効果なし

100 % = 処理植物の枯死。

【 0 3 2 9 】

10

20

30

40

50

〔実施例 3 . 2 . 〕

発芽後除草剤作用及び薬害軽減剤作用

単子葉及び双子葉有害植物並びに作物植物の種子又は根茎部分を、プラスチックポット中の砂壤土に入れ、覆土し、そして良好な成長条件下、温室で栽培した。或いは、水稻栽培で見られる有害植物を、土壌表面が 2 c m まで水に覆われるポット中で栽培した。播種後 3 週で、試験植物を 3 葉期に処理した。乳剤として製剤化した本発明の除草剤 / 薬害軽減剤活性化合物の組み合わせ、及び並行試験にて対応する方法で製剤化した個々の活性化合物を、種々の用量で、植物の葉部分に 3 0 0 l / h a (換算して) の水散布量で噴霧し、そして試験植物を最適成長条件下に約 2 ~ 3 週間温室に放置した後、製剤の効果を未処理対照と比較して視覚的にスコア化した。イネ又はイネの栽培で見られる有害植物の場合に、活性化合物を灌漑用水に直接添加 (いわゆる散粒と同じように施用) し、又は植物上に及び灌漑用水中に噴霧した。

10

【 0 3 3 0 〕

試験の結果、2 : 1 ~ 1 : 2 0 の除草剤 : 薬害軽減剤の比で除草剤と組み合わせた本発明の薬害軽減剤は、薬害軽減剤なしでの個々の除草剤の施用に比べて、3 0 % ~ 1 0 0 % 少ない作物植物に対する被害が認められる程度に、トウモロコシ、イネ、コムギ若しくはオオムギなどの作物植物又は他のか穀類又はダイズ若しくはアブラナなどの双子葉作物植物に対して、除草剤で引き起こされる被害を大幅に低減することを示した。同時に、経済的に重要な有害植物に対する除草剤の作用は、悪影響を受けないか又は実質的に受けず、その結果、広範囲の雑草及び広葉雑草に対して良好な除草性の発芽後作用を達成し得る。オオムギでは、例えば、除草剤メソスルフロン - メチルに対する良好な薬害軽減剤作用は、化合物番号 1、2、3、5、7、9、1 0、1 3、1 4、2 2、2 5、2 6、3 0、3 4、3 6、4 0、5 7、6 4、6 6、7 9、1 0 0、1 0 1、1 0 2、1 0 5、1 1 4、1 1 5、1 1 6、1 1 7、1 1 9、1 2 3、1 2 4、1 2 8、1 3 0、1 3 4、1 3 6、1 3 8、1 4 0、1 4 6、1 4 8、1 5 3、1 5 4、1 5 5、1 5 7、1 6 3、1 6 5、1 6 8、1 6 9、1 7 1、1 7 8、1 9 3、1 9 4、2 1 4、3 4 1、3 4 2、3 4 4、3 4 5、3 4 6、3 8 2、3 8 4、3 9 2、3 9 8、4 0 5、4 0 7、4 5 5、4 5 7、4 8 9、4 9 6、4 9 8、5 7 1、9 0 9、9 1 0、9 1 3、9 4 3、9 5 0、9 6 0、1 0 2 3、1 0 2 6、1 0 2 9、1 0 3 0、1 2 0 1、1 4 8 1、1 4 8 7、1 5 9 8、1 5 9 9、1 6 0 0、1 6 3 6、1 9 0 7 を用いて達成し得た。

20

30

【 0 3 3 1 〕

トウモロコシでは、例えば、除草剤テンボトリオンに対する良好な薬害軽減剤作用は、表 1 の以下の化合物 : 4、6、9、1 0、1 4、2 4、3 2、3 4、3 6、4 3、6 4、6 6、7 1、7 5、7 9、1 0 5、1 1 4、1 1 8、1 4 0、1 4 6、1 4 8、1 5 3、1 6 9、1 7 8、2 1 0、2 1 4、3 4 5、5 1、9 5、3 4 1、4 5 6、4 5 7、4 8 9、4 9 6、4 9 8、9 0 9、9 1 1、9 1 3、9 4 3、9 6 0、1 0 2 6、1 1 3 9、1 3 6 8、1 3 7 1、1 4 8 5、1 4 8 8、1 5 9 6、1 5 9 7、1 5 9 8、1 5 9 9、1 6 0 0、1 6 0 4、1 6 1 9、1 6 2 5、1 6 2 9、1 6 3 6、1 6 3 8、1 6 4 6、1 7 5 8 を用いて達成し得た。

40

【 0 3 3 2 〕

イネでは、例えば、表 1 の以下の化合物が、フェノキサプロップ - P - エチル及びチエンカルバゾン (thiencarbazone) 又はチエンカルバゾン - メチル (thiencarbazone-methyl) に対して良好な薬害軽減剤作用を達成した : 1、2、3、4、9、1 6、2 0、2 2、3 4、4 1、4 7、5 4、5 7、7 5、7 6、7 9、8 0、8 1、1 0 1、1 0 3、1 0 5、1 1 4、1 1 5、1 1 7、1 1 8、1 2 0、1 2 7、1 2 8、1 3 0、1 5 3、1 5 4、1 5 7、1 6 2、1 6 5、1 6 9、1 7 1、1 7 8、2 1 8、2 7 1、3 4 1、3 4 2、3 4 4、3 4 5、3 4 6、3 5 0、3 5 5、3 9 2、3 9 8、4 0 5、4 0 7、4 5 6、9 7 3、1 4 8 2、1 5 9 6、1 5 9 7、1 5 9 8、1 6 0 0、1 6 0 3、1 6 0 9、1 6 2 5、1 6 3 8、1 6 4 6、1 6 5 9。

【 0 3 3 3 〕

50

〔実施例 3 . 3 . 〕

発芽前除草剤作用及び薬害軽減剤作用

単子葉及び双子葉有害植物並びに作物植物の種子又は根茎部分を、プラスチックポットの砂壤土に入れ、覆土した。次いで、サスポエマルジョン製剤として製剤化した本発明の除草剤／薬害軽減剤活性化合物の組み合わせ、及び並行試験にて対応する方法で製剤化した個々の活性化合物を、種々の用量で、覆土の表面に 6 0 0 ~ 8 0 0 l / h a (換算して) の水散布量で施用した。

【 0 3 3 4 】

処理後、ポットを温室に入れ、そして雑草及び作物植物の良好な成長条件に保った。3 ~ 4 週間の試験期間後、試験植物が発芽した後に、植物被害及び発芽被害の視覚的スコア化を未処理対照と比較して実施した。試験結果から、本発明の化合物は、有害植物に対する除草剤作用を低減させる、又は実質的に低減させることなく、作物植物に対する除草剤被害を予防し又は低減することを示した。

10

例えば、表 1 の実施例番号：2、19、39、72、104、122、155、193、194、217、232、271、341、380、392、1368、1597、1625、1636 は、除草剤イソキサフルトールとの組み合わせにおいて、トウモロコシで良好な薬害軽減剤作用を示した。使用した除草活性化合物の除草作用は悪影響を受けなかった。従って、多くの場合、除草剤と組み合わせた薬害軽減剤は、有用作物植物の発芽前処理で有害植物の選択的防除に好適である。

【 0 3 3 5 】

20

〔実施例 3 . 4 . 〕

種子処理

作物植物の種子は、懸濁製剤又は乳剤として製剤化した本発明の薬害軽減剤及び水と瓶中で混合し、そしてその混合物を、種子が問題の薬害軽減剤の製剤により均等にコーティングされるように十分に振盪した。種子及び発芽植物は、次いで、実施例 3 . 3 . 及び 3 . 2 . の試験に従って、それぞれ発芽前又は発芽後処理法により除草剤で試験した。

種子の処理においても、また、薬害軽減剤は良好な活性を示した。使用した除草活性化合物の除草作用は、悪影響を受けなかった。

フロントページの続き

(51)Int.Cl.		F I	
C 0 7 D 401/06	(2006.01)	C 0 7 D 401/06	
C 0 7 D 405/12	(2006.01)	C 0 7 D 405/12	
A 0 1 N 43/84	(2006.01)	A 0 1 N 43/84	1 0 1
A 0 1 N 43/78	(2006.01)	A 0 1 N 43/78	E

(72)発明者 ロータール・ヴィルムス
ドイツ連邦共和国 6 5 7 1 9 ホーフハイム・ケーニッヒシュタイナーシュトラッセ 5 0

(72)発明者 クリストファー・ヒュー・ロジンガー
ドイツ連邦共和国 6 5 7 1 9 ホーフハイム・アム・ホッフフェルト 3 3

(72)発明者 トーマス・アオラー
ドイツ連邦共和国 4 2 7 9 9 ライヒリンゲン・ロスレンブルッフ 4 4

(72)発明者 エルヴィーン・ハッカー
ドイツ連邦共和国 6 5 3 2 9 ホーホハイム・マルガレーテンシュトラッセ 1 6

(72)発明者 ウード・ビッケルス
ドイツ連邦共和国 6 5 7 7 9 ケルクハイム・レーシングシュトラッセ 2 7

審査官 坂崎 恵美子

(56)参考文献 国際公開第 2 0 0 6 / 0 0 7 9 8 1 (W O , A 1)
英国特許出願公開第 0 2 3 0 5 1 7 4 (G B , A)
特表 2 0 1 0 - 5 2 4 9 8 6 (J P , A)
特開平 0 5 - 2 2 1 9 9 5 (J P , A)
特開昭 6 3 - 3 0 1 8 6 0 (J P , A)
HELVETICA CHIMICA ACTA, 1 9 8 8 年, Vol.71, No.3, p.596-601

(58)調査した分野(Int.Cl., D B 名)
A 0 1 N
C 0 7 D
C A p l u s / R E G I S T R Y (S T N)