

(19) 日本国特許庁 (JP)

(12) 特 許 公 報 (B2)

(11) 特許番号

特許第4446493号  
(P4446493)

(45) 発行日 平成22年4月7日 (2010.4.7)

(24) 登録日 平成22年1月29日 (2010.1.29)

(51) Int. Cl.

F I

C O 7 D 231/20 (2006.01)

C O 7 D 231/20

B

A O 1 N 43/56 (2006.01)

C O 7 D 231/20

C

A O 1 N 43/56

A

請求項の数 3 (全 197 頁)

(21) 出願番号 特願平10-547674  
 (86) (22) 出願日 平成10年5月5日 (1998.5.5)  
 (65) 公表番号 特表2001-527548 (P2001-527548A)  
 (43) 公表日 平成13年12月25日 (2001.12.25)  
 (86) 国際出願番号 PCT/EP1998/002433  
 (87) 国際公開番号 W01998/050366  
 (87) 国際公開日 平成10年11月12日 (1998.11.12)  
 審査請求日 平成17年4月26日 (2005.4.26)  
 (31) 優先権主張番号 19726710.6  
 (32) 優先日 平成9年5月7日 (1997.5.7)  
 (33) 優先権主張国 ドイツ (DE)

(73) 特許権者 508020155  
 ビーエーエスエフ ソシエタス・ヨーロピア  
 BASF SE  
 ドイツ連邦共和国 ルートヴィヒスハーフェン (番地なし)  
 D-67056 Ludwigshafen, Germany  
 (74) 代理人 100100354  
 弁理士 江藤 聡明  
 (72) 発明者 バウマン, エルンスト  
 ドイツ国、D-67373、ドゥーデンホーフェン、ファルケンシュトラッセ、6ア

最終頁に続く

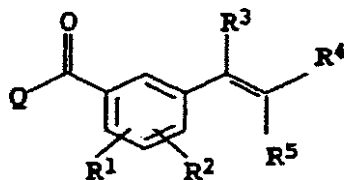
(54) 【発明の名称】 置換4- (3-アルケニルベンゾイル) ピラゾール

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項1】

式I:

【化1】



I

[但し、 $R^1$ が、ハロゲン又は $-S(O)_nR^8$ を表し；  
 $R^2$ が、ハロゲン又は $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し；

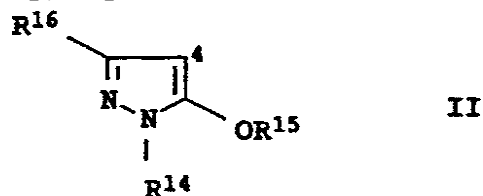
 $R^3$ が、水素を表し； $R^4$ が、水素を表し； $R^5$ が、水素を表し；

nが、0、1又は2を表し；

 $R^8$ が、 $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し；

Qが、式II：

【化 2】

〔但し、 $R^{14}$ が、 $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し； $R^{15}$ が、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル又はフェニル  $C_1 \sim C_4$ アルキルを表し； $R^{16}$ が、水素を表す。〕

で表され、4位で結合するピラゾールを表す。]

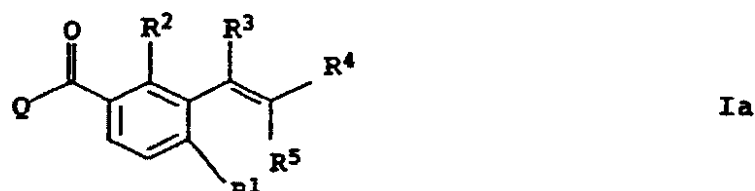
10

で表される4-(3-アルケニルベンゾイル)ピラゾール、及びその農業上有用な塩。

【請求項 2】

式 Ia：

【化 3】

〔但し、 $R^1 \sim R^5$ 及び Q が、請求項 1 におけると同義である。〕

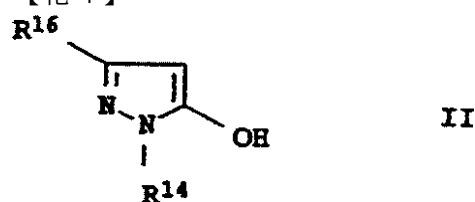
20

で表される4-(3-アルケニルベンゾイル)ピラゾール。

【請求項 3】

式 II ( $R^{15} = H$ )：

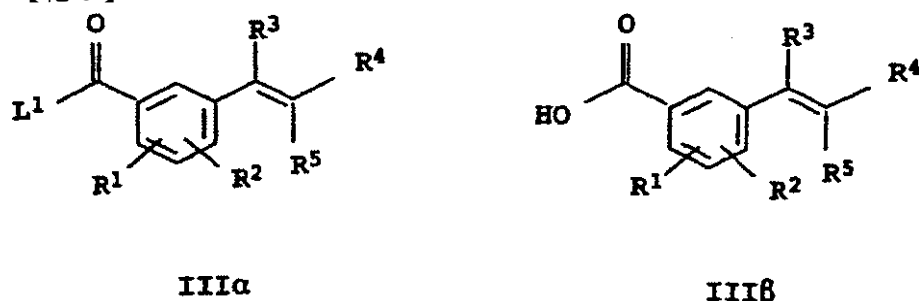
【化 4】

〔但し、 $R^{14}$ 及び  $R^{16}$ が、それぞれ請求項 1 におけると同義である。〕

30

で表されるピラゾールを、活性化カルボン酸 III α 又はカルボン酸 III β：

【化 5】



40

〔但し、 $R^1 \sim R^5$ が、それぞれ請求項 1 におけると同義であり、 $L^1$ が求核的に置換可能な脱離基である。〕

でアシル化し、

アシル化生成物を、必要により触媒の存在下に転位反応させ、化合物 I ( $R^{15} = H$ ) を得、そして必要により式 I ( $R^{15} \neq H$ ) の4-(3-アルケニルベンゾイル)ピラゾールを得るために、その生成物を式 V：

【化 6】

 $L^2 - R^{15}$  **V**〔但し、 $R^{15}$ が、水素を除いて請求項 1 におけると同義であり、 $L^2$ が求核的に置換可能

50

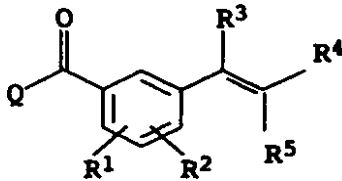
な脱離基である。]

で表される化合物と反応させることを特徴とする請求項1に記載の式Iで表される4-(3-アルケニルベンゾイル)ピラゾールの製造方法。

【発明の詳細な説明】

本発明は、下記の式Iで表される4-(3-アルケニルベンゾイル)ピラゾール及びその農業上有用な塩に関する：

式I：



I

10

[但し、 $R^1$ 及び $R^2$ が、それぞれ水素、ニトロ、ハロゲン、シアノ、チオシアナト、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $-OR^6$ 、 $-OCOR^7$ 、 $-OSO_2R^7$ 、 $-SH$ 、 $-S(O)_nR^8$ 、 $-SO_2OR^6$ 、 $-SO_2NR^6R^9$ 、 $-NR^9SO_2R^7$ 又は $NR^9COR^7$ を表し；

$R^3$ が、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル又は $C_2 \sim C_6$ アルキニルを表し；

$R^4$ 及び $R^5$ が、それぞれ水素、ニトロ、ハロゲン、シアノ、チオシアナト、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_4 \sim C_6$ シクロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $-COR^{10}$ 、 $-CO_2R^{10}$ 、 $-COSR^{10}$ 、 $-CONR^{10}R^{11}$ 、 $-C(R^{12})=NR^{13}$ 、 $-PO(OR^{10})(OR^{11})$ ；下記の基：即ちヒドロキシル、 $-COR^{10}$ 、 $-CO_2R^{10}$ 、 $-COSR^{10}$ 、 $-CONR^{10}R^{11}$ 、 $-C(R^{12})=NR^{13}$ を有する $C_1 \sim C_6$ アルキル；ヘテロシクリル、ヘテロシクリル $C_1 \sim C_4$ アルキル、フェニル、フェニル $C_1 \sim C_4$ アルキル、ヘテロアリール又はヘテロアリール $C_1 \sim C_4$ アルキル（最後の6個の置換されていても良い）を表すか；或いは

$R^4$ 及び $R^5$ が合体して、 $C_1 \sim C_4$ アルキルでモノ～テトラ置換されていても、及び／又は酸素又は硫黄により、或いは $C_1 \sim C_4$ アルキルで置換されていても良い窒素により遮断されていても良い $C_2 \sim C_6$ アルカンジイルを形成し；

$n$ が、0、1又は2を表し；

$R^6$ が、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_2 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル又は $C_3 \sim C_6$ アルキニルを表し；

$R^7$ が、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルを表し；

$R^8$ が、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_2 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル又は $C_3 \sim C_6$ アルキニルを表し；

$R^9$ が、水素又は $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し；

$R^{10}$ が、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、フェニル又はベンジル（最後の2個の基は、部分的又は完全にハロゲン化されていても、及び／又は1～3個の下記の基：即ちニトロ、シアノ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルカルボニル又は $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニルを有していても良い）を表し；

$R^{11}$ が、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル又は $C_3 \sim C_6$ アルキニルを表し；或いは

$R^{10}$ 及び $R^{11}$ が合体して、 $C_1 \sim C_4$ アルキルでモノ～テトラ置換されていても、及び／又は酸素又は硫黄により、或いは $C_1 \sim C_4$ アルキルで置換されていても良い窒素により遮断されていても良い $C_2 \sim C_6$ アルカンジイルを形成し；

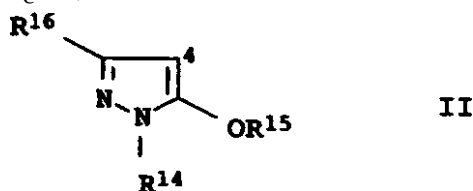
$R^{12}$ が、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim$

50

C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルキニル、フェニル又はベンジル（最後の2個の基は、部分的又は完全にハロゲン化されていても、及び／又は1～3個の下記の基：即ちニトロ、シアノ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルカルボニル又はC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルコキシカルボニルを有していても良い）を表し；

R<sup>13</sup>が、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>アルキニル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルコキシ、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルコキシ、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>アルケニルオキシ、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>アルキニルオキシ、フェニル、ベンジル又はフェニルC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルコキシ（最後の3個の基は、部分的又は完全にハロゲン化されていても、及び／又は1～3個の下記の基：ニトロ、シアノ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルカルボニル又はC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルコキシカルボニルを有していても良い）を表し；

Qが、式II：



{但し、R<sup>14</sup>が、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルキル、フェニル、又は部分的又は完全にハロゲン化されていても及び／又は1～3個の下記の基：即ちニトロ、シアノ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルコキシを有していても良いフェニルを表し；

R<sup>15</sup>が、水素、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルカルボニル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルキルカルボニル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルスルホニル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルキルスルホニル、フェニルC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、フェニルカルボニル、フェニルカルボニルメチル、フェノキシカルボニル又はフェニルスルホニル（最後の5個の置換基は、置換されていなくても、或いは当該のフェニル環が部分的又は完全にハロゲン化されていても及び／又は1～3個の下記の基：ニトロ、シアノ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルコキシを有していても良い）を表し；

R<sup>16</sup>が、水素、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル又はC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルキルを表す。}

で表され、4位で結合するピラゾールを表す。]

さらに、本発明は、式Iの化合物を製造する方法、式Iの化合物を含む組成物、及び有害植物を防除するために式Iの化合物及びこれらを含む組成物を使用する方法に関する。

4-[3-(2-アルコキシ-1-エテニル)ベンゾイル]ピラゾールはEP-A 2 829 444に開示されている。しかしながら、これらの化合物の除草作用及びこれらの作物安全性は部分的に満足するものでしかない。

従って、本発明の目的は、特に除草作用を有する化合物で、その特性が改良されたものを提供することにある。

本発明者等は、上記目的が式Iの4-(3-アルケニルベンゾイル)ピラゾール及びその除草作用により達成されることを見出した。

さらに、本発明者等は、顕著に優れた除草作用を有する化合物Iを含む除草剤組成物を見出した。さらにまた、本発明者等は、これらの組成物を製造する方法、及び化合物Iを用いて不要な植生を制御する方法を見出した。

本発明は、また式Iの化合物の立体異性体に関するものでもある。これらは純粋な立体異性体及びその混合物を包含する。

式Iの化合物は、炭素炭素二重結合を含み、このためE異性体又はZ異性体或いはE/Z異性体混合物の形で存在する。式Iの化合物は、更に炭素又は炭素-窒素二重結合を含んでも良い。本発明は、純粋な幾何異性体及びこれらの混合物の両方に関するものである。

置換の態様の相違により、式 I の化合物は、1 種類以上のキラル中心を含むことができ、その場合、エナンチオマーとして、又はジアステレオマーとして存在することができる。本発明は、純粋なエナンチオマー又はジアステレオマー、及びこれらの混合物の両方に関するものである。

式 I の化合物は、その農業上有用な塩の形で存在することができる。一般に塩の種類は重要ではない。これらのカチオンの塩又はこれらの酸の酸付加塩は、一般に、そのアニオン又はカチオンがそれぞれ化合物 I の除草作用に悪影響を与えない。

好適なカチオンとしては、特にアルカリ金属（好ましくはリチウム、ナトリウム及びカリウム）のイオン、アルカリ土類金属（好ましくはカルシウム及びマグネシウム）のイオン、遷移金属（好ましくはマンガン、銅、亜鉛及び鉄）のイオン及びアンモニウム〔所望により、1～4 個の水素が、 $C_1\sim C_4$ アルキル、ヒドロキシ $C_1\sim C_4$ アルキル、 $C_1\sim C_4$ アルコキシ $C_1\sim C_4$ アルキル、ヒドロキシ $C_1\sim C_4$ アルコキシ $C_1\sim C_4$ アルキル、フェニル又はベンジルで置換されていても良く；好ましくはアンモニウム、ジメチルアンモニウム、ジイソプロピルアンモニウム、テトラメチルアンモニウム、テトラブチルアンモニウム、2-（2-ヒドロキシエーテル-1-オキシ）エーテル-1-イルアンモニウム、ジ-（2-ヒドロキシエーテル-1-イル）アンモニウム、テトラメチルベンジルアンモニウム〕、さらにホスホニウムイオン、スルホニウムイオン（好ましくはトリ（ $C_1\sim C_4$ アルキル）スルホニウム）、及びスルホキソニウムイオン（好ましくはトリ（ $C_1\sim C_4$ アルキル）スルホキソニウム）〕を挙げることができる。

有用な酸付加塩のアニオンとしては、まず塩化物、臭化物、弗化物、硫酸水素塩、硫酸塩、リン酸二水素塩、リン酸一水素塩、硝酸塩、炭酸水素塩、炭酸塩、ヘキサフルオロ珪酸塩、ヘキサフルオロリン酸塩、安息香酸塩及び $C_1\sim C_4$ アルカン酸のアニオン（好ましくは蟻酸塩、酢酸塩、プロピオン酸塩及び酪酸塩）を挙げることができる。

置換基  $R^1\sim R^{16}$  について、或いはフェニル環、ヘテロアリール環及びヘテロシクリル環の基として記載された有機基は、個々の基の構成員をそれぞれ例示するための共通の用語を表す。全ての炭化水素鎖、即ち全てのアルキル、ハロアルキル、シクロアルキル、アルコキシアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、シクロアルコキシ、アルキルチオ、アルキルスルホニル、ハロアルキルスルホニル、アルキルカルボニル、ハロアルキルカルボニル、アルコキシカルボニル、アルケニル、シクロアルケニル、アルキニル、アルケニルオキシ及びアルキニルオキシ部分は、直鎖状でも分岐していても良い。別段、記載のない限り、ハロゲン化置換基は、1 個～5 個の同一又は異なるハロゲンを有することが好ましい。ハロゲンは、それぞれ弗素、塩素、臭素又は沃素を表す。

他の意味の例として、下記のことを挙げるることができる：

$C_2\sim C_4$ アルキル：エチル、 $n$ -プロピル、1-メチルエチル、ブチル、1-メチルプロピル、2-メチルプロピル及び1, 1-ジメチルエチル；

$C_1\sim C_4$ アルキル、及び $C_1\sim C_4$ アルコキシ $C_1\sim C_4$ アルキル、ヒドロキシ $C_1\sim C_4$ アルコキシ $C_1\sim C_4$ アルキル、 $C_1\sim C_4$ アルキルカルボニル、ヘテロシクリル $C_1\sim C_4$ アルキル、フェニル- $C_1\sim C_4$ アルキル及びヘテロアリール- $C_1\sim C_4$ アルキルのアルキル部分：上記の $C_2\sim C_4$ アルキル及びメチル；

$C_2\sim C_6$ アルキル及び $C_1\sim C_6$ アルコキシ $C_2\sim C_6$ アルキルのアルキル部分：上述の $C_2\sim C_4$ アルキル、及びペンチル、1-メチルブチル、2-メチルブチル、3-メチルブチル、2, 2-ジメチルプロピル、1-エチルプロピル、ヘキシル、1, 1-ジメチルプロピル、1, 2-ジメチルプロピル、1-メチルペンチル、2-メチルペンチル、3-メチルペンチル、4-メチルペンチル、1, 1-ジメチルブチル、1, 2-ジメチルブチル、1, 3-ジメチルブチル、2, 2-ジメチルブチル、2, 3-ジメチルブチル、3, 3-ジメチルブチル、1-エチルブチル、2-エチルブチル、1, 1, 2-トリメチルプロピル、1-エチル-1-メチルプロピル及び1-エチル-3-メチルプロピル；

$C_1\sim C_6$ アルキル、及び $C_1\sim C_6$ アルコキシ $C_1\sim C_6$ アルキル及び $C_1\sim C_6$ アルキルカルボニルのアルキル部分：上述の $C_2\sim C_6$ アルキル、及びメチル；

$C_1\sim C_4$ ハロアルキル：部分的又は完全に弗素、塩素、臭素及び／又は沃素で置換された

上述の $C_1 \sim C_4$ アルキル、即ち、例えばクロロメチル、ジクロロメチル、トリクロロメチル、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロフルオロメチル、ジクロロフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、2-フルオロエチル、2-クロロエチル、2-ブromoエチル、2-ヨードエチル、2, 2-ジフルオロエチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、2-クロロ-2-フルオロエチル、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエチル、2, 2-ジクロロ-2-フルオロエチル、2, 2, 2-トリクロロエチル、ペンタフルオロエチル、2-フルオロプロピル、3-フルオロプロピル、2, 2-ジフルオロプロピル、2, 3-ジフルオロプロピル、2-クロロプロピル、3-クロロプロピル、2, 3-ジクロロプロピル、2-ブromoプロピル、3-ブromoプロピル、3, 3, 3-トリフルオロプロピル、3, 3, 3-トリクロロプロピル、2, 2, 3, 3, 3-ペンタフルオロプロピル、ヘプタフルオロプロピル、1-(フルオロメチル)-2-フルオロエチル、1-(クロロメチル)-2-クロロエチル、1-(ブromoメチル)-2-ブromoエチル、4-フルオロブチル、4-クロロブチル、4-ブromoブチル及びノナフルオロブチル；

$C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、及び $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルカルボニルのハロアルキル部分：上述の $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、及び5-フルオロペンチル、5-クロロペンチル、5-ブromoペンチル、5-ヨードペンチル、ウンデカフルオロペンチル、6-フルオロヘキシル、6-クロロヘキシル、6-ブromoヘキシル、6-ヨードヘキシル及びドデカフルオロヘキシル；

$C_1 \sim C_4$ アルコキシ、及び $C_1 \sim C_4$ アルコキシ- $C_1 \sim C_4$ アルキル、ヒドロキシ- $C_1 \sim C_4$ アルコキシ- $C_1 \sim C_4$ アルキル及び $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニルのアルコキシ部分：メトキシ、エトキシ、プロポキシ、1-メチルエトキシ、ブトキシ、1-メチルプロポキシ、2-メチルプロポキシ又は1, 1-ジメチルエトキシ；

$C_1 \sim C_6$ アルコキシ、及び $C_1 \sim C_6$ アルコキシ- $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ- $C_2 \sim C_6$ アルキル及び $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニルのアルコキシ部分：上述の $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、さらにペントキシ、1-メチルブトキシ、2-メチルブトキシ、3-メチルブトキシ、1, 1-ジメチルプロポキシ、1, 2-ジメチルプロポキシ、2, 2-ジメチルプロポキシ、1-エチルプロポキシ、ヘキソキシ、1-メチルペントキシ、2-メチルペントキシ、3-メチルペントキシ、4-メチルペントキシ、1, 1-ジメチルブトキシ、1, 2-ジメチルブトキシ、1, 3-ジメチルブトキシ、2, 2-ジメチルブトキシ、2, 3-ジメチルブトキシ、3, 3-ジメチルブトキシ、1-エチルブトキシ、2-エチルブトキシ、1, 1, 2-トリメチルプロポキシ、1, 2, 2-トリメチルプロポキシ、1-エチル-1-メチルプロポキシ又は1-エチル-2-メチルプロポキシ；

$C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ：部分的又は完全に弗素、塩素、臭素及び／又は沃素で置換された上述の $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、即ち、例えば、フルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、ブromoジフルオロメトキシ、2-フルオロエトキシ、2-クロロエトキシ、2-ブromoエトキシ、2-ヨードエトキシ、2, 2-ジフルオロエトキシ、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ、2-クロロ-2-フルオロエトキシ、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエトキシ、2, 2-ジクロロ-2-フルオロエトキシ、2, 2, 2-トリクロロエトキシ、ペンタフルオロエトキシ、2-フルオロプロポキシ、3-フルオロプロポキシ、2-クロロプロポキシ、3-クロロプロポキシ、2-ブromoプロポキシ、3-ブromoプロポキシ、2, 2-ジフルオロプロポキシ、2, 3-ジフルオロプロポキシ、2, 3-ジクロロプロポキシ、3, 3, 3-トリフルオロプロポキシ、3, 3, 3-トリクロロプロポキシ、2, 2, 3, 3, 3-ペンタフルオロプロポキシ、ヘプタフルオロプロポキシ、1-(フルオロメチル)-2-フルオロエトキシ、1-(クロロメチル)-2-クロロエトキシ、1-(ブromoメチル)-2-ブromoエトキシ、4-フルオロブトキシ、4-クロロブトキシ、4-ブromoブトキシ又はノナフルオロブトキシ；

$C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ：上述の $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、及び、例えば5-フルオロペントキシ、5-クロロペントキシ、5-ブromoペントキシ、5-ヨードペントキシ、ウンデカフルオロペントキシ、6-フルオロヘキソキシ、6-クロロヘキソキシ、6-ブromoヘキソキシ、6-ヨードヘキソキシ及びドデカフルオロヘキソキシ；

10

20

30

40

50

C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルチオ：例えばメチルチオ、エチルチオ、プロピルチオ、1-メチルエチルチオ、ブチルチオ、1-メチルプロピルチオ、2-メチルプロピルチオ、1, 1-ジメチルエチルチオ、ペンチルチオ、1-メチルブチルチオ、2-メチルブチルチオ、3-メチルブチルチオ、2, 2-ジメチルプロピルチオ、1-エチルプロピルチオ、ヘキシルチオ、1, 1-ジメチルプロピルチオ、1, 2-ジメチルプロピルチオ、1-メチルペンチルチオ、2-メチルペンチルチオ、3-メチルペンチルチオ、4-メチルペンチルチオ、1, 1-ジメチルブチルチオ、1, 2-ジメチルブチルチオ、1, 3-ジメチルブチルチオ、2, 2-ジメチルブチルチオ、2, 3-ジメチルブチルチオ、3, 3-ジメチルブチルチオ、1-エチルブチルチオ、2-エチルブチルチオ、1, 1, 2-トリメチルプロピルチオ、1, 2, 2-トリメチルプロピルチオ、1-エチル-1-メチルプロピルチオ及び1-エチル-2-メチルプロピルチオ；

10

C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルスルホニル (C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル-S(=O)<sub>2</sub>-)：例えばメチルスルホニル、エチルスルホニル、プロピルスルホニル、1-メチルエチルスルホニル、ブチルスルホニル、1-メチルプロピルスルホニル、2-メチルプロピルスルホニル、1, 1-ジメチルエチルスルホニル、ペンチルスルホニル、1-メチルブチルスルホニル、2-メチルブチルスルホニル、3-メチルブチルスルホニル、2, 2-ジメチルプロピルスルホニル、1-エチルプロピルスルホニル、1, 1-ジメチルプロピルスルホニル、1, 2-ジメチルプロピルスルホニル、ヘキシルスルホニル、1-メチルペンチルスルホニル、2-メチルペンチルスルホニル、3-メチルペンチルスルホニル、4-メチルペンチルスルホニル、1, 1-ジメチルブチルスルホニル、1, 2-ジメチルブチルスルホニル、1, 3-ジメチルブチルスルホニル、2, 2-ジメチルブチルスルホニル、2, 3-ジメチルブチルスルホニル、3, 3-ジメチルブチルスルホニル、1-エチルブチルスルホニル、2-エチルブチルスルホニル、1, 1, 2-トリメチルプロピルスルホニル、1, 2, 2-トリメチルプロピルスルホニル、1-エチル-1-メチルプロピルスルホニル又は1-エチル-2-メチルプロピルスルホニル；

20

C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルキルスルホニル：部分的又は完全に弗素、塩素、臭素及び／又は沃素で置換された上述のC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルスルホニル、即ち、フルオロメチルスルホニル、ジフルオロメチルスルホニル、トリフルオロメチルスルホニル、クロロジフルオロメチルスルホニル、ブロモジフルオロメチルスルホニル、2-フルオロエチルスルホニル、2-クロロエチルスルホニル、2-ブロモエチルスルホニル、2-ヨードエチルスルホニル、2, 2-ジフルオロエチルスルホニル、2, 2, 2-トリフルオロエチルスルホニル、2, 2, 2-トリクロロエチルスルホニル、2-クロロ-2-フルオロエチルスルホニル、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエチルスルホニル、2, 2-ジクロロ-2-フルオロエチルスルホニル、ペンタフルオロエチルスルホニル、2-フルオロプロピルスルホニル、3-フルオロプロピルスルホニル、2-クロロプロピルスルホニル、3-クロロプロピルスルホニル、2-ブロモプロピルスルホニル、3-ブロモプロピルスルホニル、2, 2-ジフルオロプロピルスルホニル、2, 3-ジフルオロプロピルスルホニル、2, 3-ジクロロプロピルスルホニル、3, 3, 3-トリフルオロプロピルスルホニル、3, 3, 3-トリクロロプロピルスルホニル、2, 2, 3, 3, 3-ペンタフルオロプロピルスルホニル、ヘプタフルオロプロピルスルホニル、1-(フルオロメチル)-2-フルオロエチルスルホニル、1-(クロロメチル)-2-クロロエチルスルホニル、1-(ブロモメチル)-2-ブロモエチルスルホニル、4-フルオロブチルスルホニル、4-クロロブチルスルホニル、4-ブロモブチルスルホニル、ノナフルオロブチルスルホニル、5-フルオロペンチルスルホニル、5-クロロペンチルスルホニル、5-ブロモペンチルスルホニル、5-ヨードペンチルスルホニル、6-フルオロヘキシルスルホニル、6-ブロモヘキシルスルホニル、6-ヨードヘキシルスルホニル及びドデカフルオロヘキシルスルホニル；

30

40

C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>アルケニル：例えば、プロパー-1-エン-1-イル、プロパー-2-エン-1-イル、1-メチルエテニル、ブテン-1-イル、ブテン-2-イル、ブテン-3-イル、1-メチルプロパー-1-エン-1-イル、2-メチルプロパー-1-エン-1-イル、1-メチルプロパー-2-エン-1-イル、2-メチルプロパー-2-エン-1-イル、ペンテン-

50

1-イル、ペンテン-2-イル、ペンテン-3-イル、ペンテン-4-イル、1-メチル  
 ブター-1-エン-1-イル、2-メチルブター-1-エン-1-イル、3-メチルブター-1  
 -エン-1-イル、1-メチルブター-2-エン-1-イル、2-メチルブター-2-エン-  
 1-イル、3-メチルブター-2-エン-1-イル、1-メチルブター-3-エン-1-イル  
 、2-メチルブター-3-エン-1-イル、3-メチルブター-3-エン-1-イル、1, 1-  
 ジメチルプロパー-2-エン-1-イル、1, 2-ジメチルプロパー-1-エン-1-イル  
 、1, 2-ジメチルプロパー-2-エン-1-イル、1-エチルプロパー-1-エン-2-イ  
 ル、1-エチルプロパー-2-エン-1-イル、ヘキサ-1-エン-1-イル、ヘキサ-2  
 -エン-1-イル、ヘキサ-3-エン-1-イル、ヘキサ-4-エン-1-イル、ヘキサ  
 -5-エン-1-イル、1-メチルペンタ-1-エン-1-イル、2-メチルペンタ-1  
 -エン-1-イル、3-メチルペンタ-1-エン-1-イル、4-メチルペンタ-1-エ  
 ン-1-イル、1-メチルペンタ-2-エン-1-イル、2-メチルペンタ-2-エン-  
 1-イル、3-メチルペンタ-2-エン-1-イル、4-メチルペンタ-2-エン-1-  
 イル、1-メチルペンタ-3-エン-1-イル、2-メチルペンタ-3-エン-1-イル  
 、3-メチルペンタ-3-エン-1-イル、4-メチルペンタ-3-エン-1-イル、1-  
 メチルペンタ-4-エン-1-イル、2-メチルペンタ-4-エン-1-イル、3-メ  
 チルペンタ-4-エン-1-イル、4-メチルペンタ-4-エン-1-イル、1, 1-ジ  
 メチルブター-2-エン-1-イル、1, 1-ジメチルブター-3-エン-1-イル、1, 2-  
 ジメチルブター-1-エン-1-イル、1, 2-ジメチルブター-2-エン-1-イル、1  
 , 2-ジメチルブター-3-エン-1-イル、1, 3-ジメチルブター-1-エン-1-イル  
 、1, 3-ジメチルブター-2-エン-1-イル、1, 3-ジメチルブター-3-エン-1-  
 イル、2, 2-ジメチルブター-3-エン-1-イル、2, 3-ジメチルブター-1-エン-  
 1-イル、2, 3-ジメチルブター-2-エン-1-イル、2, 3-ジメチルブター-3-エ  
 ン-1-イル、3, 3-ジメチルブター-1-エン-1-イル、3, 3-ジメチルブター-2  
 -エン-1-イル、1-エチルブター-1-エン-1-イル、1-エチルブター-2-エン-  
 1-イル、1-エチルブター-3-エン-1-イル、2-エチルブター-1-エン-1-イル  
 、2-エチルブター-2-エン-1-イル、2-エチルブター-3-エン-1-イル、1, 1  
 , 2-トリメチルプロパー-2-エン-1-イル、1-エチル-1-メチルプロパー-2-エ  
 ン-1-イル、1-エチル-2-メチルプロパー-1-エン-1-イル又は1-エチル-2  
 -メチルプロパー-2-エン-1-イル；

10

20

30

$C_2 \sim C_6$ アルケニル：上述の $C_3 \sim C_6$ アルケニル、さらにエテニル；

$C_3 \sim C_6$ アルケニルオキシ：例えば、プロパー-1-エン-1-イルオキシ、プロパー-2-  
 エン-1-イルオキシ、1-メチルエテニルオキシ、ブテン-1-イルオキシ、ブテン-  
 2-イルオキシ、ブテン-3-イルオキシ、1-メチルプロパー-1-エン-1-イルオキ  
 シ、2-メチルプロパー-1-エン-1-イルオキシ、1-メチルプロパー-2-エン-1-  
 イルオキシ、2-メチルプロパー-2-エン-1-イルオキシ、ペンテン-1-イルオキシ  
 、ペンテン-2-イルオキシ、ペンテン-3-イルオキシ、ペンテン-4-イルオキシ、  
 1-メチルブター-1-エン-1-イルオキシ、2-メチルブター-1-エン-1-イルオキ  
 シ、3-メチルブター-1-エン-1-イルオキシ、1-メチルブター-2-エン-1-イル  
 オキシ、2-メチルブター-2-エン-1-イルオキシ、3-メチルブター-2-エン-1-  
 イルオキシ、1-メチルブター-3-エン-1-イルオキシ、2-メチルブター-3-エン-  
 1-イルオキシ、3-メチルブター-3-エン-1-イルオキシ、1, 1-ジメチルプロパ  
 -2-エン-1-イルオキシ、1, 2-ジメチルプロパー-1-エン-1-イルオキシ、1  
 , 2-ジメチルプロパー-2-エン-1-イルオキシ、1-エチルプロパー-1-エン-2-  
 イルオキシ、1-エチルプロパー-2-エン-1-イルオキシ、ヘキサ-1-エン-1-イ  
 ルオキシ、ヘキサ-2-エン-1-イルオキシ、ヘキサ-3-エン-1-イルオキシ、ヘ  
 キサ-4-エン-1-イルオキシ、ヘキサ-5-エン-1-イルオキシ、1-メチルペン  
 タ-1-エン-1-イルオキシ、2-メチルペンタ-1-エン-1-イルオキシ、3-メ  
 チルペンタ-1-エン-1-イルオキシ、4-メチルペンタ-1-エン-1-イルオキシ  
 、1-メチルペンタ-2-エン-1-イルオキシ、2-メチルペンタ-2-エン-1-イ

40

50

ルオキシ、3-メチルペンタ-2-エン-1-イルオキシ、4-メチルペンタ-2-エン-1-イルオキシ、1-メチルペンタ-3-エン-1-イルオキシ、2-メチルペンタ-3-エン-1-イルオキシ、3-メチルペンタ-3-エン-1-イルオキシ、4-メチルペンタ-3-エン-1-イルオキシ、1-メチルペンタ-4-エン-1-イルオキシ、2-メチルペンタ-4-エン-1-イルオキシ、3-メチルペンタ-4-エン-1-イルオキシ、4-メチルペンタ-4-エン-1-イルオキシ、1, 1-ジメチルブタ-2-エン-1-イルオキシ、1, 1-ジメチルブタ-3-エン-1-イルオキシ、1, 2-ジメチルブタ-1-エン-1-イルオキシ、1, 2-ジメチルブタ-2-エン-1-イルオキシ、1, 2-ジメチルブタ-3-エン-1-イルオキシ、1, 3-ジメチルブタ-1-エン-1-イルオキシ、1, 3-ジメチルブタ-2-エン-1-イルオキシ、1, 3-ジメチルブタ-3-エン-1-イルオキシ、2, 2-ジメチルブタ-3-エン-1-イルオキシ、2, 3-ジメチルブタ-1-エン-1-イルオキシ、2, 3-ジメチルブタ-2-エン-1-イルオキシ、2, 3-ジメチルブタ-3-エン-1-イルオキシ、3, 3-ジメチルブタ-1-エン-1-イルオキシ、3, 3-ジメチルブタ-2-エン-1-イルオキシ、1-エチルブタ-1-エン-1-イルオキシ、1-エチルブタ-2-エン-1-イルオキシ、1-エチルブタ-3-エン-1-イルオキシ、2-エチルブタ-1-エン-1-イルオキシ、2-エチルブタ-2-エン-1-イルオキシ、2-エチルブタ-3-エン-1-イルオキシ、1, 1, 2-トリメチルプロパ-2-エン-1-イルオキシ、1-エチル-1-メチルプロパ-2-エン-1-イルオキシ、1-エチル-2-メチルプロパ-1-エン-1-イルオキシ又は1-エチル-2-メチルプロパ-2-エン-1-イルオキシ；  
 $C_3 \sim C_6$ アルキニル：プロパ-1-イン-1-イル、プロパ-2-イン-1-イル、ブタ-1-イン-1-イル、ブタ-1-イン-3-イル、ブタ-1-イン-4-イル、ブタ-2-イン-1-イル、ペンタ-1-イン-1-イル、ペンタ-1-イン-3-イル、ペンタ-1-イン-4-イル、ペンタ-1-イン-5-イル、ペンタ-2-イン-1-イル、ペンタ-2-イン-4-イル、ペンタ-2-イン-5-イル、3-メチルブタ-1-イン-3-イル、3-メチルブタ-1-イン-4-イル、ヘキサ-1-イン-1-イル、ヘキサ-1-イン-3-イル、ヘキサ-1-イン-4-イル、ヘキサ-1-イン-5-イル、ヘキサ-1-イン-6-イル、ヘキサ-2-イン-1-イル、ヘキサ-2-イン-4-イル、ヘキサ-2-イン-5-イル、ヘキサ-2-イン-6-イル、ヘキサ-3-イン-1-イル、ヘキサ-3-イン-2-イル、3-メチルペンタ-1-イン-1-イル、3-メチルペンタ-1-イン-3-イル、3-メチルペンタ-1-イン-4-イル、3-メチルペンタ-1-イン-5-イル、4-メチルペンタ-1-イン-1-イル、4-メチルペンタ-2-イン-4-イル又は4-メチルペンタ-2-イン-5-イル；  
 $C_2 \sim C_6$ アルキニル：上述の $C_3 \sim C_6$ アルキニル、さらにエチニル；  
 $C_3 \sim C_6$ アルキニルオキシ：例えば、プロパ-1-イン-1-イルオキシ、プロパ-2-イン-1-イルオキシ、ブタ-1-イン-1-イルオキシ、ブタ-1-イン-3-イルオキシ、ブタ-1-イン-4-イルオキシ、ブタ-2-イン-1-イルオキシ、ペンタ-1-イン-1-イルオキシ、ペンタ-1-イン-3-イルオキシ、ペンタ-1-イン-4-イルオキシ、ペンタ-1-イン-5-イルオキシ、ペンタ-2-イン-1-イルオキシ、ペンタ-2-イン-4-イルオキシ、ペンタ-2-イン-5-イルオキシ、3-メチルブタ-1-イン-3-イルオキシ、3-メチルブタ-1-イン-4-イルオキシ、ヘキサ-1-イン-1-イルオキシ、ヘキサ-1-イン-3-イルオキシ、ヘキサ-1-イン-4-イルオキシ、ヘキサ-1-イン-5-イルオキシ、ヘキサ-1-イン-6-イルオキシ、ヘキサ-2-イン-1-イルオキシ、ヘキサ-2-イン-4-イルオキシ、ヘキサ-2-イン-5-イルオキシ、ヘキサ-2-イン-6-イルオキシ、ヘキサ-3-イン-1-イルオキシ、ヘキサ-3-イン-2-イルオキシ、3-メチルペンタ-1-イン-1-イルオキシ、3-メチルペンタ-1-イン-3-イルオキシ、3-メチルペンタ-1-イン-4-イルオキシ、3-メチルペンタ-1-イン-5-イルオキシ、4-メチルペンタ-1-イン-1-イルオキシ、4-メチルペンタ-2-イン-4-イルオキシ又は4-メチルペンタ-2-イン-5-イルオキシ；

10

20

30

40

50

C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>シクロアルキル：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；

C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>シクロアルコキシ：シクロプロポキシ、シクロブトキシ、シクロペントキシ又はシクロヘキソキシ；

C<sub>4</sub>~C<sub>6</sub>シクロアルケニル：シクロブテン-1-イル、シクロブテン-3-イル、シクロペンテン-1-イル、シクロペンテン-3-イル、シクロヘキセン-1-イル、シクロヘキセン-3-イル又はシクロヘキセン-4-イル、

ヘテロシクリル（複素環基）、及びヘテロシクリルオキシ及びヘテロシクリル-C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルのヘテロシクリル基：酸素、窒素及び硫黄から選択される1~3個のヘテロ原子を含む3~7員の飽和又は部分不飽和の単環又は多環ヘテロシクリルであり、例えばオキシラニル、2-テトラヒドロフラニル、3-テトラヒドロフラニル、2-テトラヒドロチエニル、3-テトラヒドロチエニル、2-ピロリジニル、3-ピロリジニル、3-イソオキサゾリジニル、4-イソオキサゾリジニル、5-イソオキサゾリジニル、3-イソチアゾリジニル、4-イソチアゾリジニル、5-イソチアゾリジニル、3-ピラゾリジニル、4-ピラゾリジニル、5-ピラゾリジニル、2-オキサゾリジニル、4-オキサゾリジニル、5-オキサゾリジニル、2-チアゾリジニル、4-チアゾリジニル、5-チアゾリジニル、2-イミダゾリジニル、4-イミダゾリジニル、1, 2, 4-オキサジアゾリジン-3-イル、1, 2, 4-オキサジアゾリジン-5-イル、1, 2, 4-チアジアゾリジン-3-イル、1, 2, 4-チアジアゾリジン-5-イル、1, 2, 4-トリアゾリジン-3-イル、1, 3, 4-オキサジアゾリジン-2-イル、1, 3, 4-チアジアゾリジン-2-イル、1, 3, 4-トリアゾリジン-2-イル、2, 3-ジヒドロフラン-2-イル、2, 3-ジヒドロフラン-3-イル、2, 3-ジヒドロフラン-4-イル、2, 3-ジヒドロフラン-5-イル、2, 5-ジヒドロフラン-2-イル、2, 5-ジヒドロフラン-3-イル、2, 3-ジヒドロチエン-2-イル、2, 3-ジヒドロチエン-3-イル、2, 3-ジヒドロチエン-4-イル、2, 3-ジヒドロチエン-5-イル、2, 5-ジヒドロチエン-2-イル、2, 5-ジヒドロチエン-3-イル、2, 3-ジヒドロピロール-2-イル、2, 3-ジヒドロピロール-3-イル、2, 3-ジヒドロピロール-4-イル、2, 3-ジヒドロピロール-5-イル、2, 5-ジヒドロピロール-2-イル、2, 5-ジヒドロピロール-3-イル、2, 3-ジヒドロイソオキサゾール-3-イル、2, 3-ジヒドロイソオキサゾール-4-イル、2, 3-ジヒドロイソオキサゾール-5-イル、4, 5-ジヒドロイソオキサゾール-3-イル、4, 5-ジヒドロイソオキサゾール-4-イル、4, 5-ジヒドロイソオキサゾール-5-イル、2, 5-ジヒドロイソオキサゾール-3-イル、2, 5-ジヒドロイソオキサゾール-4-イル、2, 5-ジヒドロオキサゾール-5-イル、2, 3-ジヒドロイソチアゾール-3-イル、2, 3-ジヒドロイソチアゾール-4-イル、2, 3-ジヒドロイソチアゾール-5-イル、4, 5-ジヒドロイソチアゾール-3-イル、4, 5-ジヒドロイソチアゾール-4-イル、4, 5-ジヒドロイソチアゾール-5-イル、2, 5-ジヒドロイソチアゾール-3-イル、2, 5-ジヒドロイソチアゾール-4-イル、2, 5-ジヒドロイソチアゾール-5-イル、2, 3-ジヒドロピラゾール-3-イル、2, 3-ジヒドロピラゾール-4-イル、2, 3-ジヒドロピラゾール-5-イル、4, 5-ジヒドロピラゾール-3-イル、4, 5-ジヒドロピラゾール-4-イル、4, 5-ジヒドロピラゾール-5-イル、2, 5-ジヒドロピラゾール-3-イル、2, 5-ジヒドロピラゾール-4-イル、2, 5-ジヒドロピラゾール-5-イル、2, 3-ジヒドロオキサゾール-2-イル、2, 3-ジヒドロオキサゾール-4-イル、2, 3-ジヒドロオキサゾール-5-イル、4, 5-ジヒドロオキサゾール-2-イル、4, 5-ジヒドロオキサゾール-4-イル、4, 5-ジヒドロオキサゾール-5-イル、2, 5-ジヒドロオキサゾール-2-イル、2, 5-ジヒドロオキサゾール-4-イル、2, 5-ジヒドロオキサゾール-5-イル、2, 3-ジヒドロチアゾール-2-イル、2, 3-ジヒドロチアゾール-4-イル、2, 3-ジヒドロチアゾール-5-イル、4, 5-ジヒドロチアゾール-2-イル、4, 5-ジヒドロチアゾール-4-イル、4, 5-ジヒドロチアゾール-5-イル、2, 5-ジヒドロチアゾール-2-イル

10

20

30

40

50

、2, 5-ジヒドロチアゾール-4-イル、2, 5-ジヒドロチアゾール-5-イル、2, 3-ジヒドロイミダゾール-2-イル、2, 3-ジヒドロイミダゾール-4-イル、2, 3-ジヒドロイミダゾール-5-イル、4, 5-ジヒドロイミダゾール-2-イル、4, 5-ジヒドロイミダゾール-4-イル、4, 5-ジヒドロイミダゾール-5-イル、2, 5-ジヒドロイミダゾール-2-イル、2, 5-ジヒドロイミダゾール-4-イル、2, 5-ジヒドロイミダゾール-5-イル、2-モルホリニル、3-モルホリニル、2-ピペリジニル、3-ピペリジニル、4-ピペリジニル、3-テトラヒドロピリダジニル、4-テトラヒドロピリダジニル、2-テトラヒドロピリミジニル、4-テトラヒドロピリミジニル、5-テトラヒドロピリミジニル、2-テトラヒドロピラジニル、1, 3, 5-テトラヒドロトリアジン-2-イル、1, 2, 4-テトラヒドロトリアジン-3-イル、1, 3-ジヒドロオキサジン-2-イル、2-テトラヒドロピラニル、3-テトラヒドロピラニル、4-テトラヒドロピラニル、2-テトラヒドロチオピラニル、3-テトラヒドロチオピラニル、4-テトラヒドロチオピラニル、1, 3-ジオキサラン-2-イル、1, 3-ジオキサラン-4-イル、1, 3-ジチオラン-2-イル、1, 3-ジチオラン-4-イル、1, 3-ジオキサン-2-イル、1, 3-ジオキサン-4-イル、1, 3-ジオキサン-5-イル、1, 3-ジチアン-2-イル、1, 3-ジチアン-4-イル、1, 3-ジチアン-5-イル、3, 4, 5, 6-テトラヒドロピリジン-2-イル、4H-1, 3-チアジン-2-イル、4H-3, 1-ベンゾチアジン-2-イル、1, 1-ジオキソ-2, 3, 4, 5-テトラヒドロチエン-2-イル、2H-1, 4-ベンゾチアジン-3-イル、2H-1, 4-ベンゾキサジン-3-イル又は1, 3-ジヒドロオキサジン-2-イル；

10

20

ヘテロアリール、及びヘテロアリールオキシ及びヘテロアリール- $C_1 \sim C_4$ アルキルのヘテロアリール基：炭素環員とは別に、さらに1～4個の窒素原子、又は1～3個の窒素原子と1個の酸素又は硫黄原子、又は1個の酸素原子、又は1個の硫黄原子を有しても良い芳香族の単環もしくは多環基、例えば2-フリル、3-フリル、2-チエニル、3-チエニル、2-ピロリル、3-ピロリル、3-イソオキサゾリル、4-イソオキサゾリル、5-イソオキサゾリル、3-イソチアゾリル、4-イソチアゾリル、5-イソチアゾリル、3-ピラゾリル、4-ピラゾリル、5-ピラゾリル、2-オキサゾリル、4-オキサゾリル、5-オキサゾリル、2-チアゾリル、4-チアゾリル、5-チアゾリル、2-イミダゾリル、4-イミダゾリル、1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル、1, 2, 4-オキサジアゾール-5-イル、1, 2, 4-チアジアゾール-3-イル、1, 2, 4-チアジアゾール-5-イル、1, 2, 4-トリアゾール-3-イル、1, 3, 4-オキサジアゾール-2-イル、1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル、1, 3, 4-トリアゾール-2-イル、2-ピリジニル、3-ピリジニル、4-ピリジニル、3-ピリダジニル、4-ピリダジニル、2-ピリミジニル、4-ピリミジニル、5-ピリミジニル、2-ピラジニル、1, 3, 5-トリアジン-2-イル、1, 2, 4-トリアジン-3-イル又は1, 2, 4, 5-テトラジン-3-イル、及び対応するベンゾ縮合環誘導体；

30

$C_2 \sim C_6$ アルカンジイル：例えばエタン-1, 2-ジイル、プロパン-1, 3-ジイル、ブタン-1, 4-ジイル、ペンタン-1, 5-ジイル又はヘキサン-1, 6-ジイル。

全てのフェニル、ヘテロアリール及びヘテロシクリル環は、無置換、又は1～3個のハロゲン及び／又はニトロ基、シアノ基、メチル、トリフルオロメチル、メトキシ、トリフルオロメトキシ又はメトキシカルボニルから選ばれる1個又は2個の置換基を有することが好ましい。

40

本発明の式Iの化合物を除草剤として使用する観点から、その記号は、下記の意味を有すること、即ち単独或いは組み合わせにおいて意味することが好ましい：

$R^1$ が、ニトロ、ハロゲン、シアノ、チオシアナト、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $-OR^6$ 、又は $-S(O)_nR^8$ ；特に好ましくはニトロ、ハロゲン（例、フッ素、塩素又は臭素）、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $-OR^6$ 、又は $-SO_2R^8$ ；を表し；

$R^2$ が、水素、ニトロ、ハロゲン、シアノ、チオシアナト、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$

50

ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $-OR^6$ 、又は $-S(O)_nR^8$ ；特に好ましくは水素、ニトロ、ハロゲン（例、フッ素、塩素又は臭素）、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $-OR^6$ 、又は $-SO_2R^8$ ；更に好ましくはニトロ、ハロゲン（例、フッ素、塩素又は臭素）、 $C_1 \sim C_6$ アルキル（例、メチル又はエチル）、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル（例、ジフルオロメチル又はトリフルオロメチル）、 $-OR^6$ 、又は $-SO_2R^8$ ；を表し；

$R^3$ が、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル又は $C_2 \sim C_6$ アルキニル；特に好ましくは水素、ハロゲン（例、フッ素、塩素又は臭素）、 $C_1 \sim C_4$ アルキル（例、メチル又はエチル）、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル（例、トリフルオロメチル）、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ（例、メトキシ又はエトキシ）、アリル又はプロパギル；更に好ましくはハロゲン又はメチル；を表し；

10

$R^4$ が、水素、ニトロ、ハロゲン、シアノ、チオシアナト、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_4 \sim C_6$ シクロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $-COR^{10}$ 、 $-CO_2R^{10}$ 、 $-COSR^{10}$ 、 $-CONR^{10}R^{11}$ 、 $-C(R^{12})=NR^{13}$ 、 $-PO(OR^{10})(OR^{11})$ ；下記の基： $-COR^{10}$ 、 $-CO_2R^{10}$ 、 $-COSR^{10}$ 、 $-CONR^{10}R^{11}$ 、 $-C(R^{12})=NR^{13}$ を有する $C_1 \sim C_4$ アルキル；ヘテロシクリル、ヘテロシクリル $C_1 \sim C_4$ アルキル、フェニル、フェニル $C_1 \sim C_4$ アルキル、ヘテロアリール又はヘテロアリール $C_1 \sim C_4$ アルキル（最後の6個は、それぞれ1～3個のハロゲンで置換されていても、及び／又は1～3個の下記の基：ニトロ、シアノ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルカルボニル又は $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニルを有していても良い）を表し；

20

$R^5$ が、水素、ニトロ、ハロゲン、シアノ、チオシアナト、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_4 \sim C_6$ シクロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $-COR^{10}$ 、 $-CO_2R^{10}$ 、 $-COSR^{10}$ 、 $-CONR^{10}R^{11}$ 、 $-C(R^{12})=NR^{13}$ 、 $-PO(OR^{10})(OR^{11})$ ；下記の基： $-COR^{10}$ 、 $-CO_2R^{10}$ 、 $-COSR^{10}$ 、 $-CONR^{10}R^{11}$ 、 $-C(R^{12})=NR^{13}$ を有する $C_1 \sim C_4$ アルキル；ヘテロシクリル、ヘテロシクリル $C_1 \sim C_4$ アルキル、フェニル、フェニル $C_1 \sim C_4$ アルキル、ヘテロアリール又はヘテロアリール $C_1 \sim C_4$ アルキル（最後の6個は、それぞれ1～3個のハロゲンで置換されていても、及び／又は1～3個の下記の基：ニトロ、シアノ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルカルボニル又は $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニルを有していても良い）；特に好ましくは水素、ハロゲン、シアノ、チオシアナト、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $-COR^{10}$ 、 $-CO_2R^{10}$ 、 $-COSR^{10}$ 、 $-CONR^{10}R^{11}$ 又は $-PO(OR^{10})(OR^{11})$ を表すか；或いは

30

$R^4$ 及び $R^5$ が合体して、 $C_1 \sim C_4$ アルキルでモノ～テトラ置換されていても、及び／又は酸素又は硫黄により、或いは $C_1 \sim C_4$ アルキルを有しても良い窒素により遮断されていても良い $C_2 \sim C_6$ アルカンジイル、例えばブタン-1，4-ジイル、ペンタン-1，5-ジイル、ヘキサン-1，6-ジイル、3-オキサペンタン-1，5-ジイル又は3-メチル-3-アザペンタン-1，5-ジイルを形成し；

40

$n$ が、0又は2を表し；

$R^6$ が、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_2 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル又は $C_3 \sim C_6$ アルキニル；特に好ましくは $C_1 \sim C_4$ アルキル（例、メチル又はエチル）、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル（例、トリフルオロメチル又はジフルオロメチル）、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ $C_2 \sim C_4$ アルキル（例、メトキシエチル）、アリル又はプロパギル；を表し；

$R^8$ が、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_2 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル又は $C_3 \sim C_6$ アルキニル；特に好ましくは $C_1 \sim C_4$ アルキル（例、メチル又はエチル）、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル（例、トリフルオロメチル又はジフルオロ

50

メチル)、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ $C_2 \sim C_4$ アルキル(例、メトキシエチル)、アリル又はプロパギル;を表し;

$R^{10}$ が、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、フェニル又はベンジル;特に好ましくは水素、 $C_1 \sim C_4$ アルキル(例、メチル又はエチル)、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル(例、トリフルオロメチル)、アリル、プロパギル又はベンジル;を表し;

$R^{11}$ が、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル又は $C_3 \sim C_6$ アルキニルを表し;或いは

$R^{10}$ 及び $R^{11}$ が合体して、 $C_1 \sim C_4$ アルキルでモノ〜テトラ置換されてもよい $C_2 \sim C_6$ アルカンジイルを形成し;

10

$R^{12}$ が、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、フェニル又はベンジル;特に好ましくは水素、 $C_1 \sim C_4$ アルキル(例、メチル又はエチル)、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニル(例、メトキシカルボニル又はエトキシカルボニル)、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル(例、トリフルオロメチル)、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ(例、メトキシ又はエトキシ);を表し;

$R^{13}$ が、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ アルケニルオキシ、 $C_3 \sim C_6$ アルキニルオキシ、フェニル、ベンジル又はベンジルオキシ;特に好ましくは $C_1 \sim C_4$ アルキル(例、メチル又はエチル)、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ(例、メトキシ又はエトキシ)、アリルオキシ、プロパギルオキシ、ベンジル又はベンジルオキシ;を表し;

20

$R^{14}$ が、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル;特に好ましくは $C_1 \sim C_4$ アルキル(例、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル又はイソブチル);を表し;

$R^{15}$ が、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、フェニルカルボニルメチル又はフェニルスルホニル(最後の2個の置換基のフェニル環は、部分的又は完全にハロゲン化されていても及び/又は1〜3個の下記の基:ニトロ、シアノ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシを有していても良い);を表し;

30

$R^{16}$ が、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル;特に好ましくは水素、 $C_1 \sim C_4$ アルキル(例、メチル又はエチル)又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル(例、トリフルオロメチル);更に好ましくは水素又はメチル;を表す。

特に極めて好ましい式Iの化合物は、各基が下記の意味を有する場合である:

$R^1$ が、ニトロ、ハロゲン、シアノ、チオシアナト、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $-OR^6$ 、又は $-S(O)_nR^8$ を表し;

$R^2$ が、水素又は、 $R^1$ で記載した基を表す。

特に最も好ましい式Iの化合物は、各基が下記の意味を有する場合である:

$R^1$ が、ニトロ、ハロゲン(例、フッ素、塩素又は臭素)、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $-OR^6$ 、又は $-S(O)_nR^8$ を表し;

40

$R^2$ が、ニトロ、ハロゲン(例、フッ素、塩素又は臭素)、 $C_1 \sim C_6$ アルキル(例、メチル又はエチル)、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $-OR^6$ 、又は $-S(O)_nR^8$ ; (例、メチルスルホニル又はエチルスルホニル)を表す。

同様に、特に極めて好ましい式Iの化合物は、各基が下記の意味を有する場合である:

$R^4$ が、水素、ニトロ、ハロゲン、シアノ、チオシアナト、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_4 \sim C_6$ シクロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $-COR^{10}$ 、 $-CO_2R^{10}$ 、 $-COSR^{10}$ 、 $-CONR^{10}R^{11}$ 、 $-C(R^{12})=NR^{13}$ 、 $-PO(OR^{10})(OR^{11})$ ; 下記の基:  $-COR^{10}$ 、 $-CO_2R^{10}$ 、 $-COSR^{10}$ 、 $-CONR^{10}$

50

$R^{11}$ 又は $-C(R^{12})=NR^{13}$ を有する $C_1\sim C_4$ アルキル；ヘテロシクリル、ヘテロシクリル $C_1\sim C_4$ アルキル、フェニル、フェニル $C_1\sim C_4$ アルキル、ヘテロアリール又はヘテロアリール $C_1\sim C_4$ アルキル（最後の6個は、置換されていても良い）を表し；

$R^5$ が、水素、ハロゲン、シアノ、チオシアナト、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $-COR^{10}$ 、 $-CO_2R^{10}$ 、 $-COSR^{10}$ 、 $-CONR^{10}R^{11}$ 又は $-PO(OR^{10})(OR^{11})$ を表すか；或いは

$R^4$ 及び $R^5$ が合体して、 $C_1\sim C_4$ アルキルでモノ～テトラ置換されていても、及び／又は酸素又は硫黄により、或いは $C_1\sim C_4$ アルキルを有しても良い窒素により中断されていても良い $C_2\sim C_6$ アルカンジイルを形成する。

特に最も好ましい式 I の化合物は、各基が下記の意味を有する場合である：

10

$R^4$ が、水素、ニトロ、ハロゲン、シアノ、チオシアナト、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキル、 $C_2\sim C_6$ アルケニル、 $C_4\sim C_6$ シクロアルケニル、 $C_2\sim C_6$ アルキニル、 $-COR^{10}$ 、 $-CO_2R^{10}$ 、 $-COSR^{10}$ 、 $-CONR^{10}R^{11}$ 、 $-C(R^{12})=NR^{13}$ 、 $-PO(OR^{10})(OR^{11})$ ；下記の基： $-COR^{10}$ 、 $-CO_2R^{10}$ 、 $-COSR^{10}$ 、 $-CONR^{10}R^{11}$ 又は $-C(R^{12})=NR^{13}$ を有する $C_1\sim C_4$ アルキル；ヘテロシクリル、ヘテロシクリル $C_1\sim C_4$ アルキル、フェニル、フェニル $C_1\sim C_4$ アルキル、ヘテロアリール又はヘテロアリール $C_1\sim C_4$ アルキル（最後の6個は、置換されていても良い）を表し；

$R^5$ が、水素、ハロゲン、シアノ、チオシアナト、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $-COR^{10}$ 、 $-CO_2R^{10}$ 、 $-COSR^{10}$ 、 $-CONR^{10}R^{11}$ 又は $-PO(OR^{10})(OR^{11})$ を表す。

20

特に極めて好ましい式 I の化合物は、各基が下記の意味を有する場合である：

$R^4$ が、水素、シアノ、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキル、 $C_2\sim C_6$ アルケニル、 $C_4\sim C_6$ シクロアルケニル、 $C_2\sim C_6$ アルキニル、 $-COR^{10}$ 、 $-CO_2R^{10}$ 、 $-COSR^{10}$ 、 $-CONR^{10}R^{11}$ 、 $-C(R^{12})=NR^{13}$ ；下記の基： $-COR^{10}$ 、 $-CO_2R^{10}$ 、 $-COSR^{10}$ 、 $-CONR^{10}R^{11}$ 又は $-C(R^{12})=NR^{13}$ を有する $C_1\sim C_4$ アルキル；ヘテロシクリル、ヘテロシクリル $C_1\sim C_4$ アルキル、フェニル、フェニル $C_1\sim C_4$ アルキル、ヘテロアリール又はヘテロアリール $C_1\sim C_4$ アルキル（最後の6個は、置換されていても良い）を表し；

$R^5$ が、水素、シアノ、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $-COR^{10}$ 、 $-CO_2R^{10}$ 、 $-COSR^{10}$ 、 $-CONR^{10}R^{11}$ 又は $-PO(OR^{10})(OR^{11})$ を表す。

30

同様に、極めて好ましい式 I の化合物は、各基が下記の意味を有する場合である：

$R^1$ が、ニトロ、ハロゲン、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル又は $C_1\sim C_6$ アルキルスルホニル；特にニトロ、塩素、トリフルオロメチル、メチルスルホニル又はエチルスルホニル；を表し；

$R^2$ が、ニトロ、ハロゲン、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ又は $C_1\sim C_6$ アルキルスルホニル；特にニトロ、塩素、メチル、トリフルオロメチル、メトキシ又はメチルスルホニル；を表し；

$R^3$ が、水素又は $C_1\sim C_6$ アルキル；特に水素又はメチル；好ましくは水素；を表し；

$R^4$ が、水素、ハロゲン、シアノ、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_4$ ヒドロキシアルキル、 $C_1\sim C_4$ アルキルカルボニル、 $C_1\sim C_4$ アルコキシカルボニル、ホルミル、ヒドロキシカルボニル又は $-C(R^{12})=NR^{13}$ ；特に水素、塩素、臭素、シアノ、メチル、エチル、イソプロピル、メチルカルボニル、エチルカルボニル、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル又は $-C(R^{12})=NR^{13}$ ；を表し；

40

$R^5$ が、水素、ハロゲン又は $C_1\sim C_4$ アルキル；特に水素、塩素、メチル又はエチルを表し；

$R^{12}$ が、水素、 $C_1\sim C_4$ アルキル又は $C_1\sim C_4$ アルコキシ；特に水素又はメチル；を表し；

$R^{13}$ が、 $C_1\sim C_6$ アルキル又は $C_1\sim C_6$ アルコキシ；特にメトキシ又はエトキシを表し；

$R^{14}$ が、 $C_1\sim C_6$ アルキル；特に、メチル又はエチル；を表し；

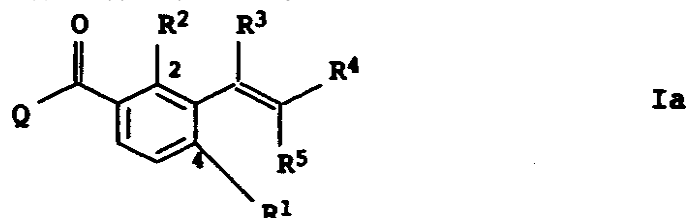
50

$R^{15}$ が、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル又はフェニル $C_1 \sim C_6$ アルキル（ルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシを有していても良い）；特に水素、メチルスルホニル、エチルスルホニル又はベンジルを表し；

$R^{16}$ が、水素又は $C_1 \sim C_4$ アルキル；特に好ましくは水素又はメチルを表し；

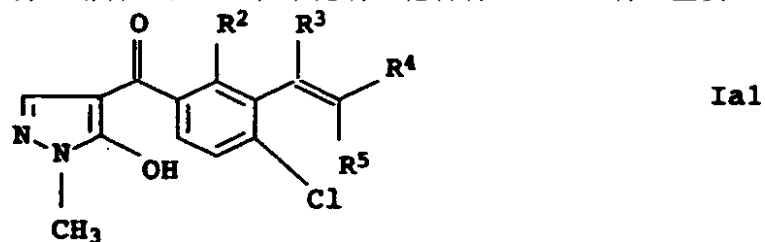
上記 $R^1 \sim R^{16}$ の定義は、相互の組合せのみならず、それら自身の場合においても、本発明の式（I）の化合物にとって特に重要である。

式Ia（ $R^1$ がフェニル環の4位に結合し、 $R^2$ がフェニル環の2位に結合する場合のIに該当）が特に好ましい。



10

式Ia1（ $R^1 = Cl$ 、 $R^{14} = CH_3$ 、及び $R^{15}$ 及び $R^{16} = H$ 、そして $R^1$ がフェニル環の4位に結合し、 $R^2$ がフェニル環の2位に結合する場合のIに該当）が極めて好ましく、中でも表1の化合物が好ましく、且つ基の定義 $R^2 \sim R^5$ は相互の組合せのみならず、それら自身の場合において、本発明の化合物にとって特に重要である。



20

表 1

| No.     | $R^2$ | $R^3$ | $R^4$      | $R^5$  |
|---------|-------|-------|------------|--------|
| Ia1.001 | Cl    | H     | H          | H      |
| Ia1.002 | Cl    | H     | $CH_3$     | H      |
| Ia1.003 | Cl    | H     | $CH_3$     | $CH_3$ |
| Ia1.004 | Cl    | H     | $C_2H_5$   | H      |
| Ia1.005 | Cl    | H     | $n-C_3H_7$ | H      |

30

| No.     | R <sup>2</sup>  | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup>                                 | R <sup>5</sup>                |
|---------|-----------------|----------------|------------------------------------------------|-------------------------------|
| Ial.006 | Cl              | H              | n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>                | H                             |
| Ial.007 | Cl              | H              | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>              | H                             |
| Ial.008 | Cl              | H              | シクロ -C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>             | H                             |
| Ial.009 | Cl              | H              | シクロ -C <sub>4</sub> H <sub>7</sub>             | H                             |
| Ial.010 | Cl              | H              | シクロ -C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>             | H                             |
| Ial.011 | Cl              | H              | シクロ -C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>            | H                             |
| Ial.012 | Cl              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                  | H                             |
| Ial.013 | Cl              | H              | CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H                             |
| Ial.014 | Cl              | H              | 2-フリル                                          | H                             |
| Ial.015 | Cl              | H              | 3-フリル                                          | H                             |
| Ial.016 | Cl              | H              | 2-チエニル                                         | H                             |
| Ial.017 | Cl              | H              | 3-チエニル                                         | H                             |
| Ial.018 | Cl              | H              | 1, 3-ジオキサン-2-イル                                | H                             |
| Ial.019 | Cl              | H              | CHO                                            | H                             |
| Ial.020 | Cl              | H              | COCH <sub>3</sub>                              | H                             |
| Ial.021 | Cl              | H              | COOCH <sub>3</sub>                             | H                             |
| Ial.022 | Cl              | H              | COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>               | H                             |
| Ial.023 | Cl              | H              | COO-n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>            | H                             |
| Ial.024 | Cl              | H              | CN                                             | H                             |
| Ial.025 | Cl              | H              | SCH <sub>3</sub>                               | H                             |
| Ial.026 | Cl              | H              | COCF <sub>3</sub>                              | H                             |
| Ial.027 | Cl              | H              | COC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                | H                             |
| Ial.028 | Cl              | H              | CH=NOCH <sub>3</sub>                           | H                             |
| Ial.029 | Cl              | H              | CH=NOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>             | H                             |
| Ial.030 | Cl              | H              | C(CH <sub>3</sub> )=NOCH <sub>3</sub>          | H                             |
| Ial.031 | CH <sub>3</sub> | H              | H                                              | H                             |
| Ial.032 | CH <sub>3</sub> | H              | CH <sub>3</sub>                                | H                             |
| Ial.033 | CH <sub>3</sub> | H              | CH <sub>3</sub>                                | CH <sub>3</sub>               |
| Ial.034 | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                  | H                             |
| Ial.035 | CH <sub>3</sub> | H              | n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>                | H                             |
| Ial.036 | CH <sub>3</sub> | H              | n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>                | H                             |
| Ial.037 | CH <sub>3</sub> | H              | CHO                                            | H                             |
| Ial.038 | CH <sub>3</sub> | H              | COCH <sub>3</sub>                              | H                             |
| Ial.039 | CH <sub>3</sub> | H              | COOCH <sub>3</sub>                             | H                             |
| Ial.040 | CH <sub>3</sub> | H              | COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>               | H                             |
| Ial.041 | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                  | H                             |
| Ial.042 | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                  | CH <sub>3</sub>               |
| Ial.043 | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                  | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> |
| Ial.044 | CH <sub>3</sub> | H              | CH <sub>2</sub> -CHO                           | H                             |

10

20

30

40

| No.     | R <sup>2</sup>   | R <sup>3</sup>                      | R <sup>4</sup>                                     | R <sup>5</sup> |
|---------|------------------|-------------------------------------|----------------------------------------------------|----------------|
| Ial.045 | CH <sub>3</sub>  | H                                   | COOCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>   | H              |
| Ial.046 | CH <sub>3</sub>  | Cl                                  | CH <sub>3</sub>                                    | H              |
| Ial.047 | CH <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub>                     | CH <sub>3</sub>                                    | H              |
| Ial.048 | CH <sub>3</sub>  | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>       | CH <sub>3</sub>                                    | H              |
| Ial.049 | CH <sub>3</sub>  | CF <sub>3</sub>                     | CH <sub>3</sub>                                    | H              |
| Ial.050 | CH <sub>3</sub>  | OCH <sub>3</sub>                    | CH <sub>3</sub>                                    | H              |
| Ial.051 | CH <sub>3</sub>  | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>      | CH <sub>3</sub>                                    | H              |
| Ial.052 | CH <sub>3</sub>  | CH <sub>2</sub> -C=CH               | CH <sub>3</sub>                                    | H              |
| Ial.053 | CH <sub>3</sub>  | CH <sub>2</sub> -CH=CH <sub>2</sub> | CH <sub>3</sub>                                    | H              |
| Ial.054 | CH <sub>3</sub>  | Cl                                  | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                      | H              |
| Ial.055 | CH <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub>                     | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                      | H              |
| Ial.056 | CH <sub>3</sub>  | CF <sub>3</sub>                     | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                      | H              |
| Ial.057 | CH <sub>3</sub>  | OCH <sub>3</sub>                    | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                      | H              |
| Ial.058 | CH <sub>3</sub>  | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>      | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                      | H              |
| Ial.059 | CH <sub>3</sub>  | CH <sub>2</sub> -C=CH               | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                      | H              |
| Ial.060 | CH <sub>3</sub>  | CH <sub>2</sub> -CH=CH <sub>2</sub> | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                      | H              |
| Ial.061 | OCH <sub>3</sub> | H                                   | H                                                  | H              |
| Ial.062 | OCH <sub>3</sub> | H                                   | CH <sub>3</sub>                                    | H              |
| Ial.063 | OCH <sub>3</sub> | H                                   | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                      | H              |
| Ial.064 | OCH <sub>3</sub> | H                                   | n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>                    | H              |
| Ial.065 | OCH <sub>3</sub> | H                                   | n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>                    | H              |
| Ial.066 | OCH <sub>3</sub> | H                                   | CHO                                                | H              |
| Ial.067 | OCH <sub>3</sub> | H                                   | COCH <sub>3</sub>                                  | H              |
| Ial.068 | OCH <sub>3</sub> | H                                   | COOCH <sub>3</sub>                                 | H              |
| Ial.069 | OCH <sub>3</sub> | H                                   | COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                   | H              |
| Ial.070 | OCH <sub>3</sub> | H                                   | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                      | H              |
| Ial.071 | OCH <sub>3</sub> | H                                   | CH=NOCH <sub>3</sub>                               | H              |
| Ial.072 | OCH <sub>3</sub> | H                                   | C(CH <sub>3</sub> )=NOCH <sub>3</sub>              | H              |
| Ial.073 | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>                     | 2-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>                 | H              |
| Ial.074 | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>                     | 3-Br-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>                 | H              |
| Ial.075 | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>                     | 4-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>                  | H              |
| Ial.076 | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>                     | 2,4-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> | H              |
| Ial.077 | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>                     | 2-NO <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>   | H              |
| Ial.078 | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>                     | 3-CN-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>                 | H              |
| Ial.079 | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>                     | 4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>   | H              |
| Ial.080 | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>                     | 2-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>  | H              |
| Ial.081 | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>                     | 3-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>   | H              |
| Ial.082 | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>                     | 4-OCF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>  | H              |
| Ial.083 | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>                     | 2-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>   | H              |

10

20

30

40

| No.     | R <sup>2</sup>                  | R <sup>3</sup>  | R <sup>4</sup>                                     | R <sup>5</sup>  |
|---------|---------------------------------|-----------------|----------------------------------------------------|-----------------|
| Ial.084 | OCH <sub>3</sub>                | CH <sub>3</sub> | 3-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>   | H               |
| Ial.085 | OCH <sub>3</sub>                | CH <sub>3</sub> | 2-COCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> | H               |
| Ial.086 | OCH <sub>3</sub>                | CH <sub>3</sub> | 3-COOMe-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>              | H               |
| Ial.087 | OCH <sub>3</sub>                | CH <sub>3</sub> | 4-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>   | H               |
| Ial.088 | OCH <sub>3</sub>                | CH <sub>3</sub> | 2-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>   | H               |
| Ial.089 | OCH <sub>3</sub>                | CH <sub>3</sub> | 3-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>  | H               |
| Ial.090 | OCH <sub>3</sub>                | CH <sub>3</sub> | 4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>  | H               |
| Ial.091 | CF <sub>3</sub>                 | H               | H                                                  | H               |
| Ial.092 | CF <sub>3</sub>                 | H               | CH <sub>3</sub>                                    | H               |
| Ial.093 | CF <sub>3</sub>                 | H               | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                      | H               |
| Ial.094 | CF <sub>3</sub>                 | H               | n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>                    | H               |
| Ial.095 | CF <sub>3</sub>                 | H               | n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>                    | H               |
| Ial.096 | CF <sub>3</sub>                 | H               | CHO                                                | H               |
| Ial.097 | CF <sub>3</sub>                 | H               | COCH <sub>3</sub>                                  | H               |
| Ial.098 | CF <sub>3</sub>                 | H               | COOCH <sub>3</sub>                                 | H               |
| Ial.099 | CF <sub>3</sub>                 | H               | COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                   | H               |
| Ial.100 | CF <sub>3</sub>                 | H               | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                      | H               |
| Ial.101 | CF <sub>3</sub>                 | H               | CH=NOCH <sub>3</sub>                               | H               |
| Ial.102 | CF <sub>3</sub>                 | H               | C(CH <sub>3</sub> )=NOCH <sub>3</sub>              | H               |
| Ial.103 | CF <sub>3</sub>                 | H               | 2-フリル                                              | CH <sub>3</sub> |
| Ial.104 | CF <sub>3</sub>                 | H               | 3-フリル                                              | CH <sub>3</sub> |
| Ial.105 | CF <sub>3</sub>                 | H               | 2-チエニル                                             | CH <sub>3</sub> |
| Ial.106 | CF <sub>3</sub>                 | H               | 3-チエニル                                             | CH <sub>3</sub> |
| Ial.107 | CF <sub>3</sub>                 | H               | 2-ビリジル                                             | CH <sub>3</sub> |
| Ial.108 | CF <sub>3</sub>                 | H               | 3-ビリジル                                             | CH <sub>3</sub> |
| Ial.109 | CF <sub>3</sub>                 | H               | 4-ビリジル                                             | CH <sub>3</sub> |
| Ial.110 | CF <sub>3</sub>                 | H               | 2-チアゾリル                                            | CH <sub>3</sub> |
| Ial.111 | CF <sub>3</sub>                 | H               | 4-チアゾリル                                            | CH <sub>3</sub> |
| Ial.112 | CF <sub>3</sub>                 | H               | 5-チアゾリル                                            | CH <sub>3</sub> |
| Ial.113 | CF <sub>3</sub>                 | H               | 2-ピロリル                                             | CH <sub>3</sub> |
| Ial.114 | CF <sub>3</sub>                 | H               | 3-ピロリル                                             | CH <sub>3</sub> |
| Ial.115 | CF <sub>3</sub>                 | H               | 4-ピロリル                                             | CH <sub>3</sub> |
| Ial.116 | CF <sub>3</sub>                 | H               | 3-イソオキサゾリル                                         | CH <sub>3</sub> |
| Ial.117 | CF <sub>3</sub>                 | H               | 4-イソオキサゾリル                                         | CH <sub>3</sub> |
| Ial.118 | CF <sub>3</sub>                 | H               | 5-イソオキサゾリル                                         | CH <sub>3</sub> |
| Ial.119 | CF <sub>3</sub>                 | H               | 2-オキサゾリル                                           | CH <sub>3</sub> |
| Ial.120 | CF <sub>3</sub>                 | H               | 4-オキサゾリル                                           | CH <sub>3</sub> |
| Ial.121 | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H               | H                                                  | H               |
| Ial.122 | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H               | CH <sub>3</sub>                                    | H               |

10

20

30

40

| No.     | R <sup>2</sup>                  | R <sup>3</sup>                | R <sup>4</sup>                                | R <sup>5</sup> |
|---------|---------------------------------|-------------------------------|-----------------------------------------------|----------------|
| Ial.123 | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H                             | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                 | H              |
| Ial.124 | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H                             | n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>               | H              |
| Ial.125 | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H                             | n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>               | H              |
| Ial.126 | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H                             | CHO                                           | H              |
| Ial.127 | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H                             | COCH <sub>3</sub>                             | H              |
| Ial.128 | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H                             | COOCH <sub>3</sub>                            | H              |
| Ial.129 | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H                             | CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | H              |
| Ial.130 | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H                             | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                 | H              |
| Ial.131 | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H                             | CH=NOCH <sub>3</sub>                          | H              |
| Ial.132 | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H                             | C(CH <sub>3</sub> )=NOCH <sub>3</sub>         | H              |
| Ial.133 | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 5- オキサゾリル                                     | H              |
| Ial.134 | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 3- ピラゾリル                                      | H              |
| Ial.135 | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 4- ピラゾリル                                      | H              |
| Ial.136 | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 5- ピラゾリル                                      | H              |
| Ial.137 | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2- イミダゾリル                                     | H              |
| Ial.138 | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 4- イミダゾリル                                     | H              |
| Ial.139 | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 5- イミダゾリル                                     | H              |
| Ial.140 | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2- ピリミジニル                                     | H              |
| Ial.141 | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 4- ピリミジニル                                     | H              |
| Ial.142 | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 5- ピリミジニル                                     | H              |
| Ial.143 | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 1,3 -ジオキサラン-2-イル                              | H              |
| Ial.144 | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 1,3 -ジオキサラン-4-イル                              | H              |
| Ial.145 | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 1,3 -ジオキサン-2-イル                               | H              |
| Ial.146 | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 3- ピリダジニル                                     | H              |
| Ial.147 | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 4- ピリダジニル                                     | H              |
| Ial.148 | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2- ピラジニル                                      | H              |
| Ial.149 | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2- ピリジニル                                      | H              |
| Ial.150 | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2-N- メチルピロリル                                  | H              |
| Ial.151 | NO <sub>2</sub>                 | H                             | H                                             | H              |
| Ial.152 | NO <sub>2</sub>                 | H                             | CH <sub>3</sub>                               | H              |
| Ial.153 | NO <sub>2</sub>                 | H                             | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                 | H              |
| Ial.154 | NO <sub>2</sub>                 | H                             | n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>               | H              |
| Ial.155 | NO <sub>2</sub>                 | H                             | n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>               | H              |
| Ial.156 | NO <sub>2</sub>                 | H                             | CHO                                           | H              |
| Ial.157 | NO <sub>2</sub>                 | H                             | COCH <sub>3</sub>                             | H              |
| Ial.158 | NO <sub>2</sub>                 | H                             | COOCH <sub>3</sub>                            | H              |
| Ial.159 | NO <sub>2</sub>                 | H                             | CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | H              |
| Ial.160 | NO <sub>2</sub>                 | H                             | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                 | H              |
| Ial.161 | NO <sub>2</sub>                 | H                             | CH=NOCH <sub>3</sub>                          | H              |

10

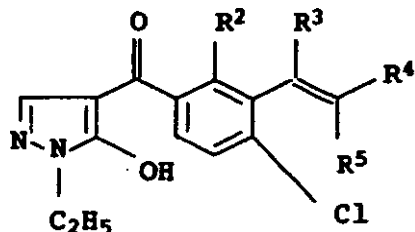
20

30

40

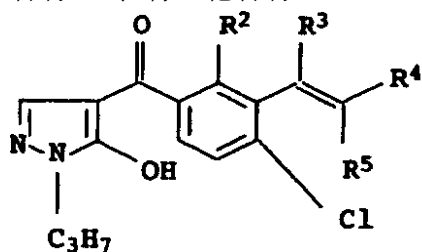
| No.     | R <sup>2</sup>  | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup>                                                      | R <sup>5</sup>                |
|---------|-----------------|----------------|---------------------------------------------------------------------|-------------------------------|
| Ia1.162 | NO <sub>2</sub> | H              | C(CH <sub>3</sub> )=NOCH <sub>3</sub>                               | H                             |
| Ia1.163 | NO <sub>2</sub> | H              | COOH                                                                | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> |
| Ia1.164 | NO <sub>2</sub> | H              | COOMe                                                               | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> |
| Ia1.165 | NO <sub>2</sub> | H              | COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                                    | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> |
| Ia1.166 | NO <sub>2</sub> | H              | COOCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                    | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> |
| Ia1.167 | NO <sub>2</sub> | H              | COOC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>                                 | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> |
| Ia1.168 | NO <sub>2</sub> | H              | CH=NOCH <sub>3</sub>                                                | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> |
| Ia1.169 | NO <sub>2</sub> | H              | CH=NOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                                  | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> |
| Ia1.170 | NO <sub>2</sub> | H              | CH=NOCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                  | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> |
| Ia1.171 | NO <sub>2</sub> | H              | CH=NOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                              | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> |
| Ia1.172 | NO <sub>2</sub> | H              | C(CH <sub>3</sub> )=NOCH <sub>3</sub>                               | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> |
| Ia1.173 | NO <sub>2</sub> | H              | C(CH <sub>3</sub> )=NOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                 | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> |
| Ia1.174 | NO <sub>2</sub> | H              | C(CH <sub>3</sub> )=NOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>             | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> |
| Ia1.175 | NO <sub>2</sub> | H              | C(CH <sub>3</sub> )=NOCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> |
| Ia1.176 | NO <sub>2</sub> | H              | CH=NOCH <sub>2</sub> -CH=CH <sub>2</sub>                            | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> |
| Ia1.177 | NO <sub>2</sub> | H              | CH=NOCH <sub>2</sub> -C=CH                                          | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> |
| Ia1.178 | NO <sub>2</sub> | H              | CH <sub>2</sub> -CHO                                                | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> |
| Ia1.179 | NO <sub>2</sub> | H              | CH <sub>2</sub> -CH=NOCH <sub>3</sub>                               | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> |
| Ia1.180 | NO <sub>2</sub> | H              | CH <sub>2</sub> -CH=NOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                 | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> |

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、R<sup>14</sup>がエチルである点で異なる化合物Ia2、特に化合物Ia2.001～Ia2.180が極めて好ましい：



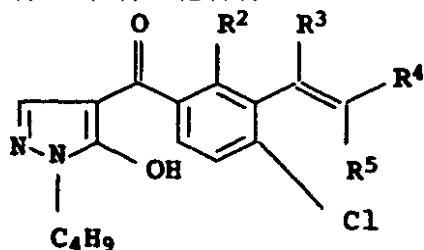
Ia2

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、R<sup>14</sup>がn-プロピルである点で異なる化合物Ia3、特に化合物Ia3.001～Ia3.180が極めて好ましい：



Ia3

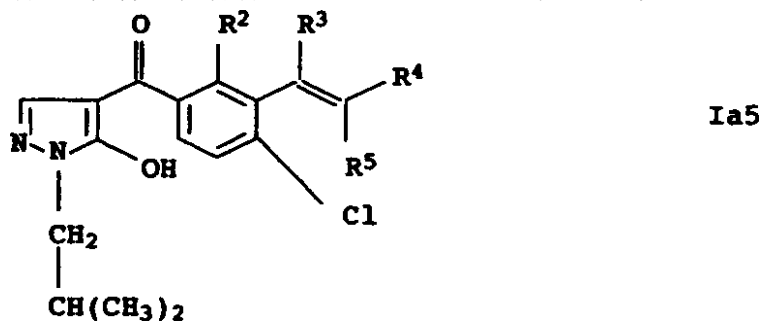
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、R<sup>14</sup>がn-ブチルである点で異なる化合物Ia4、特に化合物Ia4.001～Ia4.180が極めて好ましい：



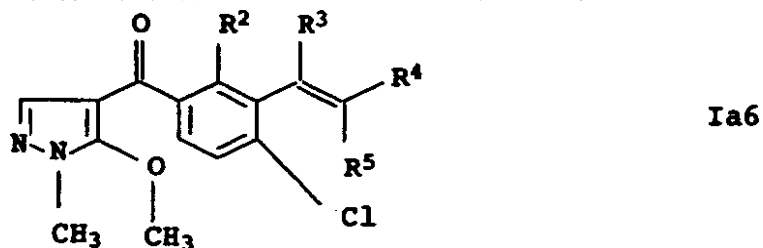
Ia4

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、R<sup>14</sup>がイソブチルである点で異なる化合物

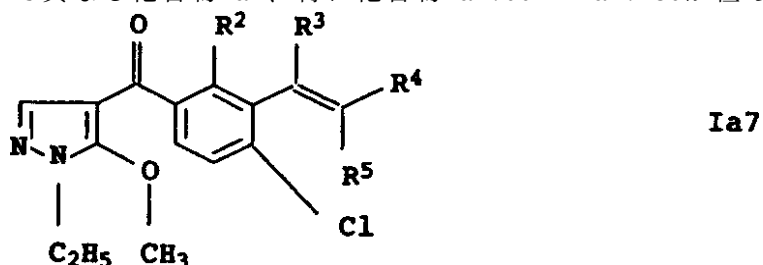
物Ia5、特に化合物Ia5.001～Ia5.180が極めて好ましい：



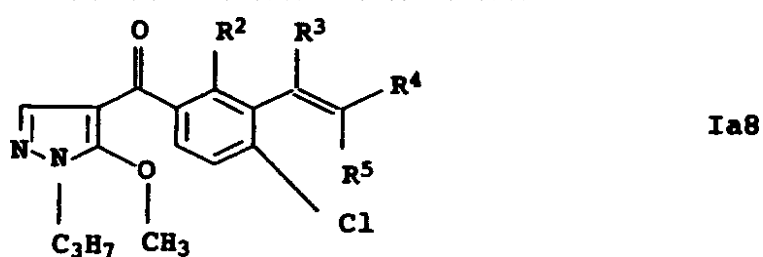
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{15}$ がメチルである点で異なる化合物Ia 10  
6、特に化合物Ia6.001～Ia6.180が極めて好ましい：



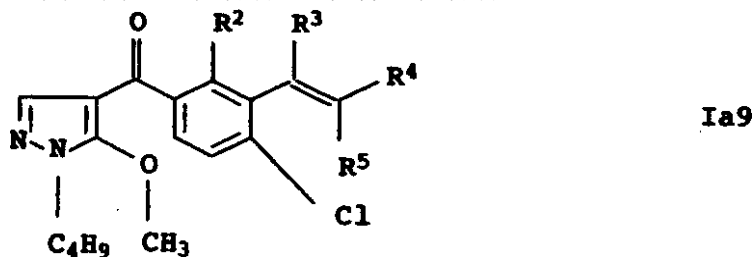
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がエチル及び $R^{15}$ がメチルである点  
で異なる化合物Ia7、特に化合物Ia7.001～Ia7.180が極めて好ましい：



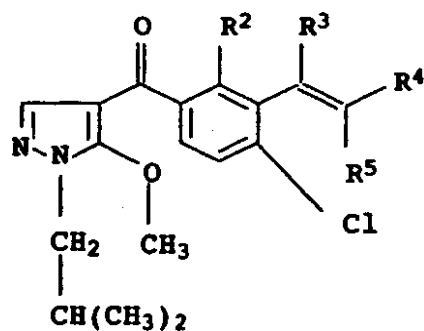
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がn-プロピル及び $R^{15}$ がメチルで  
ある点で異なる化合物Ia8、特に化合物Ia8.001～Ia8.180が極めて好ましい：



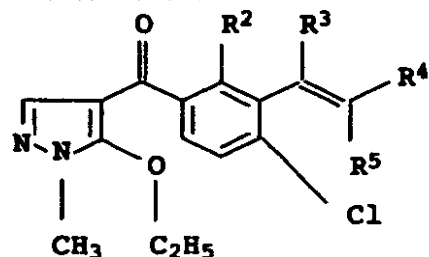
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がn-ブチル及び $R^{15}$ がメチルであ  
る点で異なる化合物Ia9、特に化合物Ia9.001～Ia9.180が極めて好ましい：



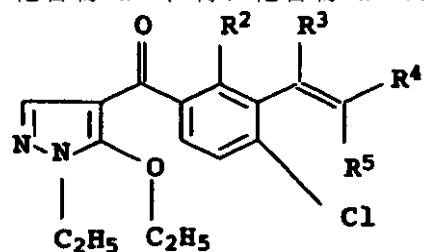
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がイソブチル及び $R^{15}$ がメチルであ  
る点で異なる化合物Ia10、特に化合物Ia10.001～Ia10.180が極めて好ましい：

**Ia10**

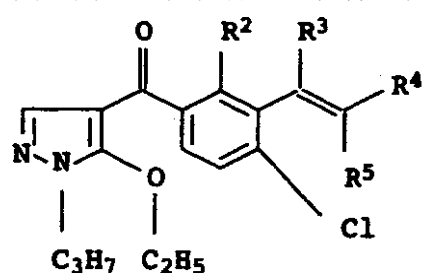
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{15}$ がエチルである点で異なる化合物Ia 10 11、特に化合物Ia11.001～Ia11.180が極めて好ましい：

**Ia11**

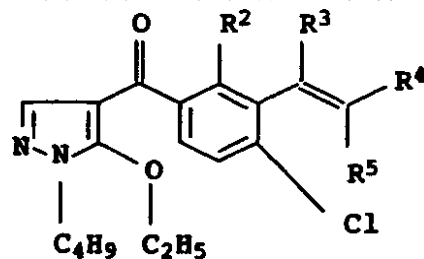
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ 及び $R^{15}$ がエチルである点で異なる化合物Ia12、特に化合物Ia12.001～Ia12.180が極めて好ましい：

**Ia12**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がプロピル及び $R^{15}$ がエチルである点で異なる化合物Ia13、特に化合物Ia13.001～Ia13.180が極めて好ましい：

**Ia13**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がn-ブチル及び $R^{15}$ がエチルである点で異なる化合物Ia14、特に化合物Ia14.001～Ia14.180が極めて好ましい：

**Ia14**

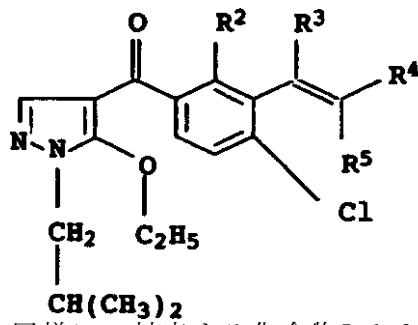
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がイソブチル及び $R^{15}$ がエチルである点で異なる化合物Ia15、特に化合物Ia15.001～Ia15.180が極めて好ましい：

10

20

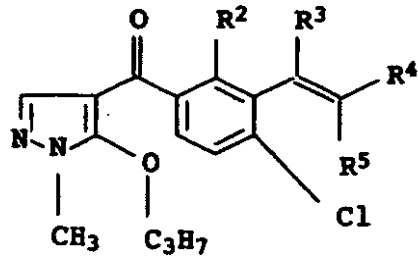
30

40

**Ia15**

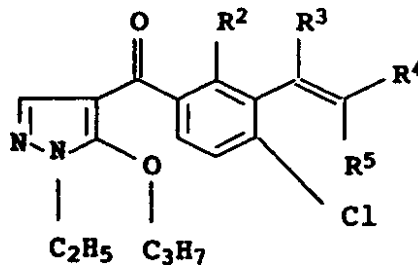
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{15}$ がn-プロピルである点で異なる化合物Ia16、特に化合物Ia16.001～Ia16.180が極めて好ましい：

10

**Ia16**

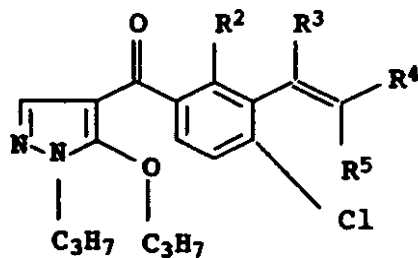
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がエチル及び $R^{15}$ がn-プロピルである点で異なる化合物Ia17、特に化合物Ia17.001～Ia17.180が極めて好ましい：

20

**Ia17**

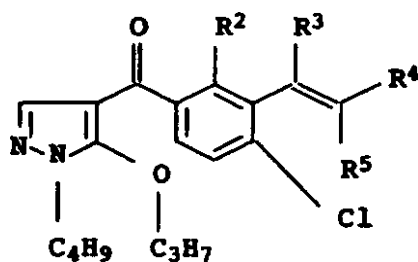
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ 及び $R^{15}$ がn-プロピルである点で異なる化合物Ia18、特に化合物Ia18.001～Ia18.180が極めて好ましい：

30

**Ia18**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がn-ブチル及び $R^{15}$ がn-プロピルである点で異なる化合物Ia19、特に化合物Ia19.001～Ia19.180が極めて好ましい：

40

**Ia19**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がイソブチル及び $R^{15}$ がn-プロピルである点で異なる化合物Ia20、特に化合物Ia20.001～Ia20.180が極めて好ましい：



10



20



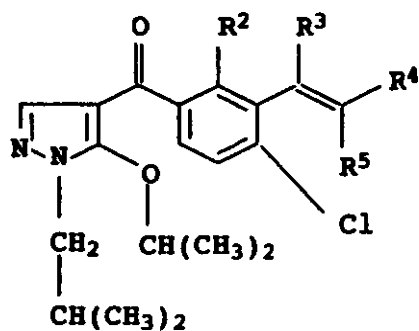
30



40

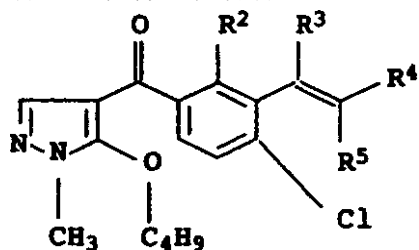


同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、R<sup>14</sup>がイソブチル及びR<sup>15</sup>がイソプロピルである点で異なる化合物Ia25、特に化合物Ia25.001～Ia25.180が極めて好ましい：

**Ia25**

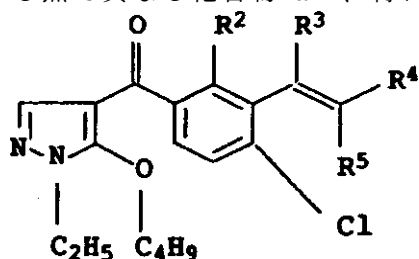
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{15}$ がn-ブチルである点で異なる化合物Ia26、特に化合物Ia26.001～Ia26.180が極めて好ましい：

10

**Ia26**

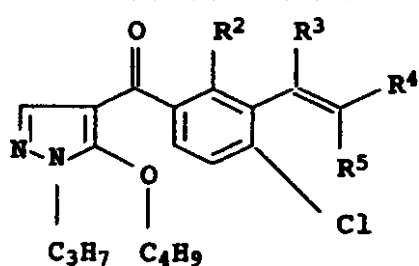
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がエチル及び $R^{15}$ がn-ブチルである点で異なる化合物Ia27、特に化合物Ia27.001～Ia27.180が極めて好ましい：

20

**Ia27**

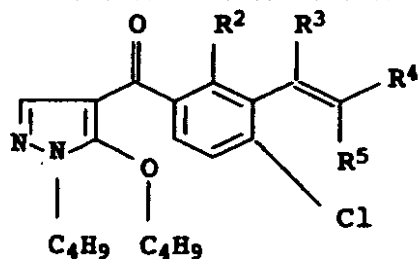
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がn-プロピル及び $R^{15}$ がn-ブチルである点で異なる化合物Ia28、特に化合物Ia28.001～Ia28.180が極めて好ましい：

30

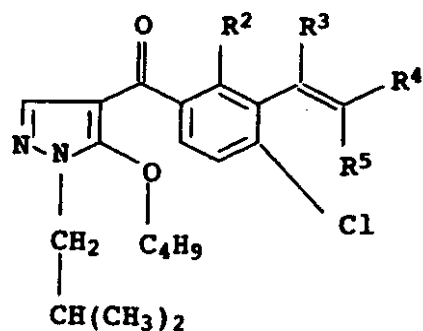
**Ia28**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ 及び $R^{15}$ がn-ブチルである点で異なる化合物Ia29、特に化合物Ia29.001～Ia29.180が極めて好ましい：

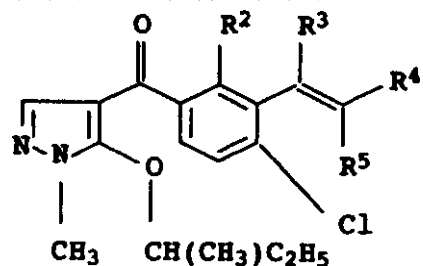
40

**Ia29**

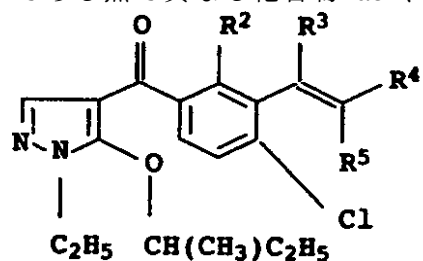
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がイソブチル及び $R^{15}$ がn-ブチルである点で異なる化合物Ia30、特に化合物Ia30.001～Ia30.180が極めて好ましい：

**Ia30**

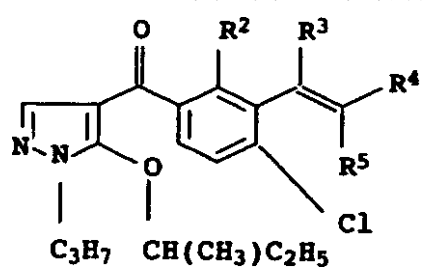
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{15}$ がsec-ブチルである点で異なる化合物Ia31、特に化合物Ia31.001～Ia31.180が極めて好ましい： 10

**Ia31**

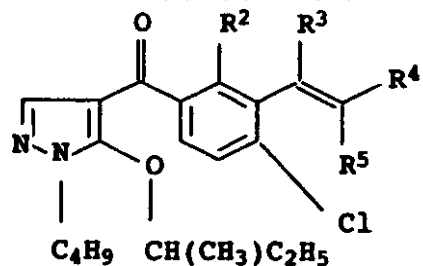
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がエチル及び $R^{15}$ がsec-ブチルである点で異なる化合物Ia32、特に化合物Ia32.001～Ia32.180が極めて好ましい： 20

**Ia32**

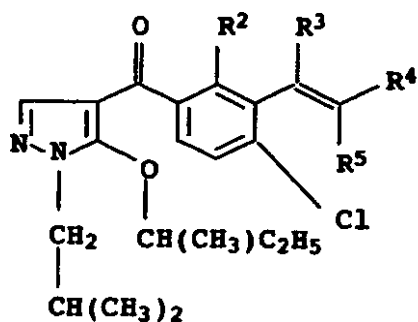
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がn-プロピル及び $R^{15}$ がsec-ブチルである点で異なる化合物Ia33、特に化合物Ia33.001～Ia33.180が極めて好ましい： 30

**Ia33**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がn-ブチル及び $R^{15}$ がsec-ブチルである点で異なる化合物Ia34、特に化合物Ia34.001～Ia34.180が極めて好ましい： 40

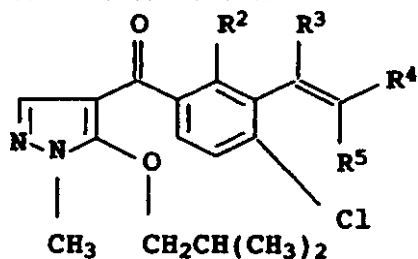
**Ia34**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がイソブチル及び $R^{15}$ がsec-ブチルである点で異なる化合物Ia35、特に化合物Ia35.001～Ia35.180が極めて好ましい：

**Ia35**

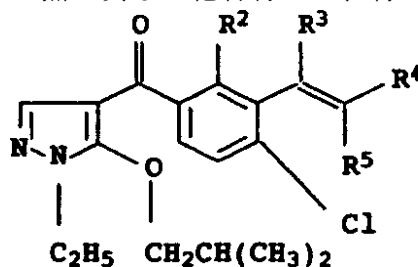
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{15}$ がイソブチルである点で異なる化合物Ia36、特に化合物Ia36.001～Ia36.180が極めて好ましい：

10

**Ia36**

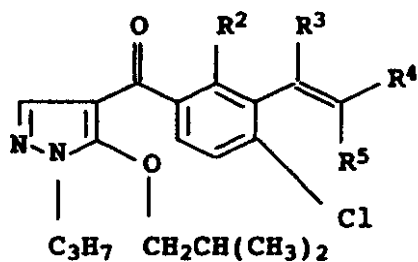
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がエチル及び $R^{15}$ がイソブチルである点で異なる化合物Ia37、特に化合物Ia37.001～Ia37.180が極めて好ましい：

20

**Ia37**

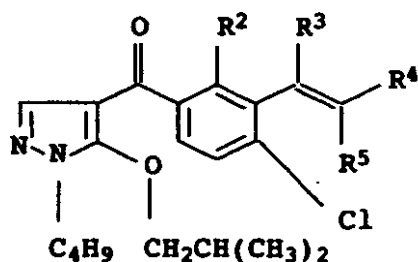
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がn-プロピル及び $R^{15}$ がイソブチルである点で異なる化合物Ia38、特に化合物Ia38.001～Ia38.180が極めて好ましい：

30

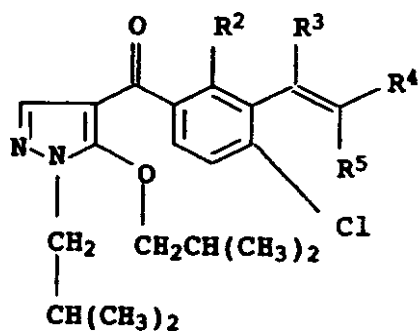
**Ia38**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がn-ブチル及び $R^{15}$ がイソブチルである点で異なる化合物Ia39、特に化合物Ia39.001～Ia39.180が極めて好ましい：

40

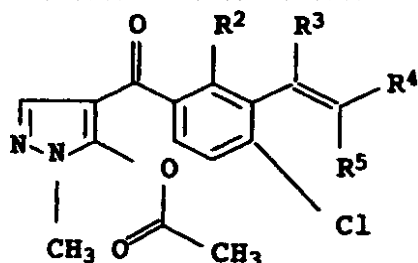
**Ia39**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ 及び $R^{15}$ がイソブチルである点で異なる化合物Ia40、特に化合物Ia40.001～Ia40.180が極めて好ましい：

**Ia40**

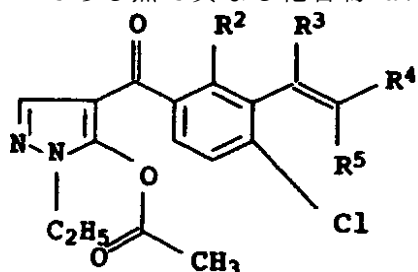
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{15}$ がメチルカルボニルである点で異なる化合物Ia41、特に化合物Ia41.001～Ia41.180が極めて好ましい：

10

**Ia41**

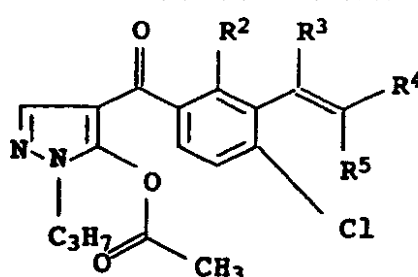
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がエチル及び $R^{15}$ がメチルカルボニルである点で異なる化合物Ia42、特に化合物Ia42.001～Ia42.180が極めて好ましい：

20

**Ia42**

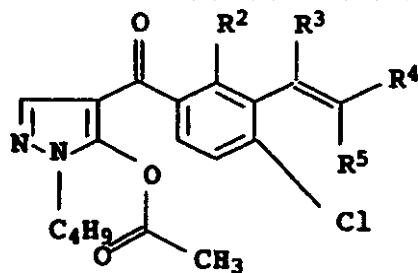
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がプロピル及び $R^{15}$ がメチルカルボニルである点で異なる化合物Ia43、特に化合物Ia43.001～Ia43.180が極めて好ましい：

30

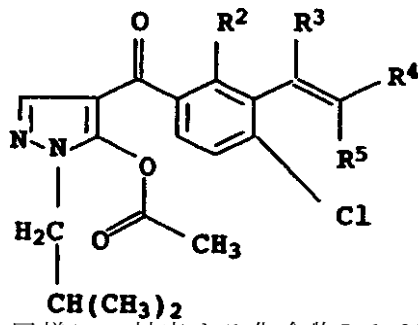
**Ia43**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がn-ブチル及び $R^{15}$ がメチルカルボニルである点で異なる化合物Ia44、特に化合物Ia44.001～Ia44.180が極めて好ましい：

40

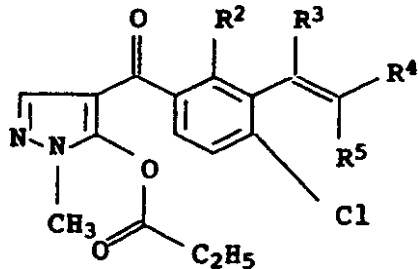
**Ia44**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がイソブチル及び $R^{15}$ がメチルカルボニルである点で異なる化合物Ia45、特に化合物Ia45.001～Ia45.180が極めて好ましい：

**Ia45**

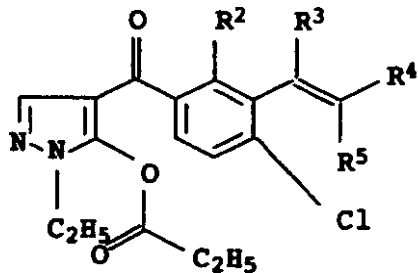
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{15}$ がエチルカルボニルである点で異なる化合物Ia46、特に化合物Ia46.001～Ia46.180が極めて好ましい：

10

**Ia46**

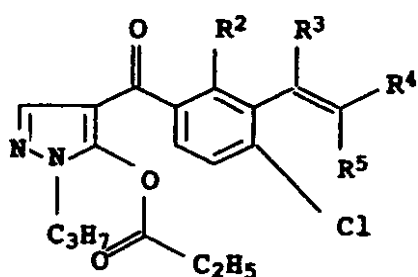
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がエチル及び $R^{15}$ がエチルカルボニルである点で異なる化合物Ia47、特に化合物Ia47.001～Ia47.180が極めて好ましい：

20

**Ia47**

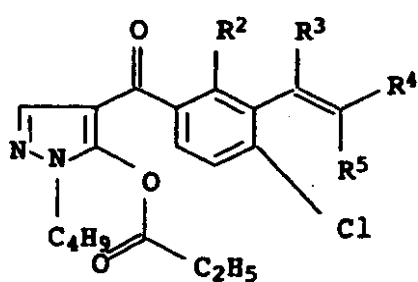
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がプロピル及び $R^{15}$ がエチルカルボニルである点で異なる化合物Ia48、特に化合物Ia48.001～Ia48.180が極めて好ましい：

30

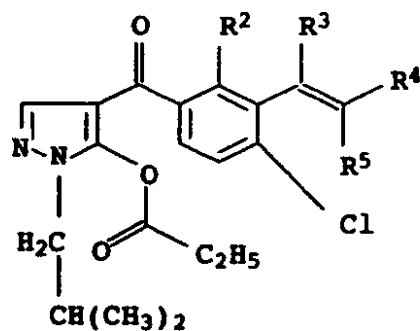
**Ia48**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がn-ブチル及び $R^{15}$ がエチルカルボニルである点で異なる化合物Ia49、特に化合物Ia49.001～Ia49.180が極めて好ましい：

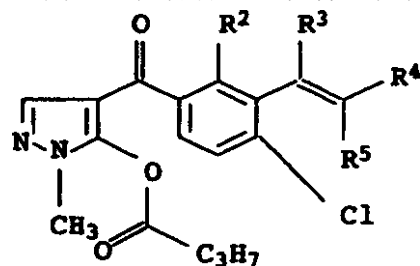
40

**Ia49**

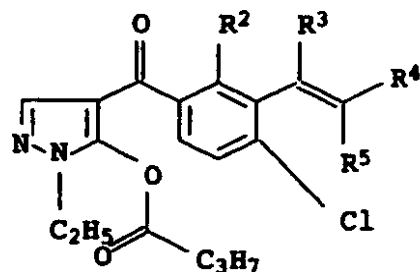
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がイソブチル及び $R^{15}$ がエチルカルボニルである点で異なる化合物Ia50、特に化合物Ia50.001～Ia50.180が極めて好ましい：

**Ia50**

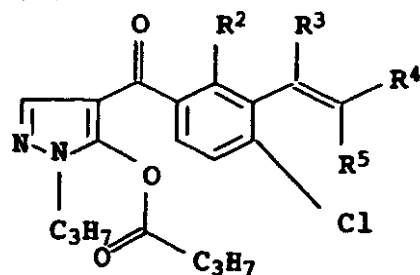
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{15}$ がn-プロピルカルボニルである点  
で異なる化合物Ia51、特に化合物Ia51.001～Ia51.180が極めて好ましい： 10

**Ia51**

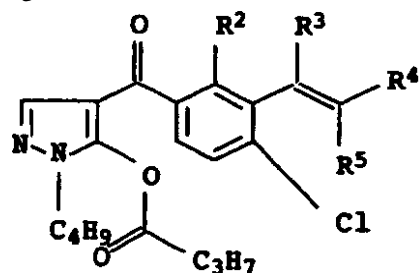
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がエチル及び $R^{15}$ がn-プロピルカル  
ボニルである点で異なる化合物Ia52、特に化合物Ia52.001～Ia52.180が極めて好ましい 20  
：

**Ia52**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がプロピル及び $R^{15}$ がn-プロピル  
カルボニルである点で異なる化合物Ia53、特に化合物Ia53.001～Ia53.180が極めて好まし  
い： 30

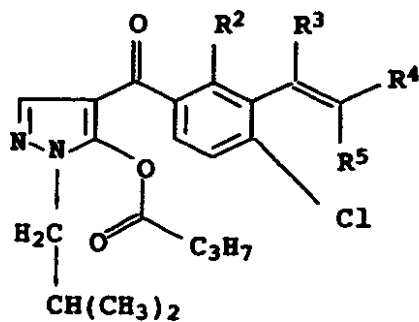
**Ia53**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がn-ブチル及び $R^{15}$ がn-プロピ  
ルカルボニルである点で異なる化合物Ia54、特に化合物Ia54.001～Ia54.180が極めて好ま  
しい： 40

**Ia54**

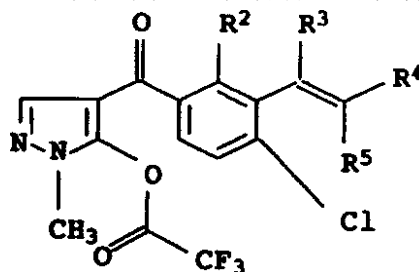
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がイソブチル及び $R^{15}$ がn-プロピ  
ルカルボニルである点で異なる化合物Ia55、特に化合物Ia55.001～Ia55.180が極めて好ま 50

しい：



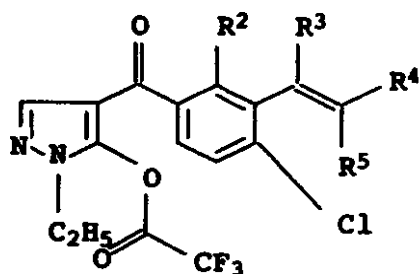
Ia55

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{15}$ がトリフルオロメチルカルボニルである点で異なる化合物Ia56、特に化合物Ia56.001～Ia56.180が極めて好ましい： 10



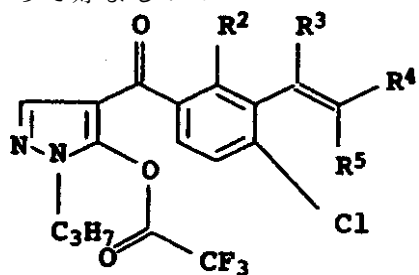
Ia56

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がエチル及び $R^{15}$ がトリフルオロメチルカルボニルである点で異なる化合物Ia57、特に化合物Ia57.001～Ia57.180が極めて好ましい： 20



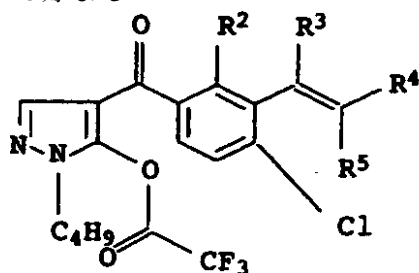
Ia57

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がn-プロピル及び $R^{15}$ がトリフルオロメチルカルボニルである点で異なる化合物Ia58、特に化合物Ia58.001～Ia58.180が極めて好ましい： 30



Ia58

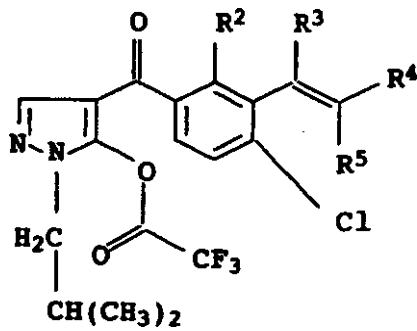
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がn-ブチル及び $R^{15}$ がトリフルオロメチルカルボニルである点で異なる化合物Ia59、特に化合物Ia59.001～Ia59.180が極めて好ましい： 40



Ia59

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がイソブチル及び $R^{15}$ がトリフルオロメチルカルボニルである点で異なる化合物Ia60、特に化合物Ia60.001～Ia60.180が極めて 50

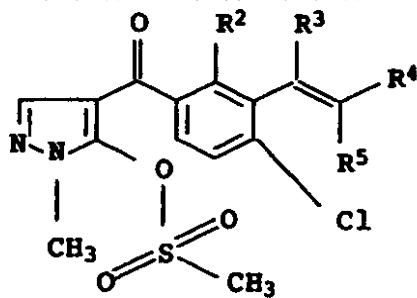
て好ましい：



**Ia60**

10

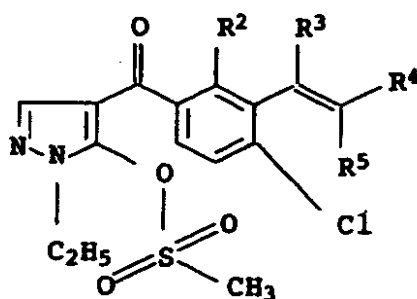
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{15}$ がメチルスルホニルである点で異なる化合物Ia61、特に化合物Ia61.001～Ia61.180が極めて好ましい：



**Ia61**

20

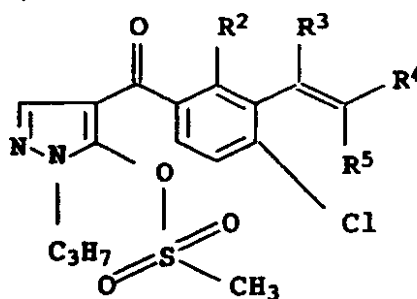
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がエチル及び $R^{15}$ がメチルスルホニルである点で異なる化合物Ia62、特に化合物Ia62.001～Ia62.180が極めて好ましい：



**Ia62**

30

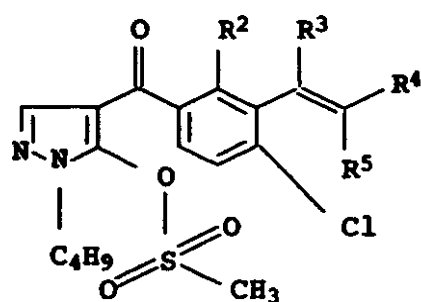
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がn-プロピル及び $R^{15}$ がメチルスルホニルである点で異なる化合物Ia63、特に化合物Ia63.001～Ia63.180が極めて好ましい：



**Ia63**

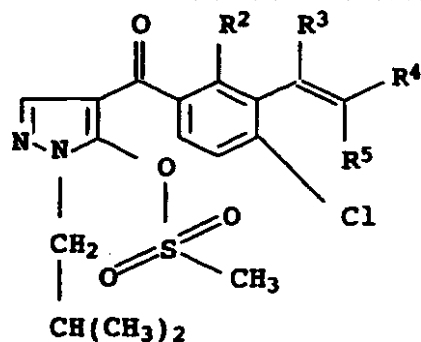
40

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がn-ブチル及び $R^{15}$ がメチルスルホニルである点で異なる化合物Ia64、特に化合物Ia64.001～Ia64.180が極めて好ましい：

**Ia64**

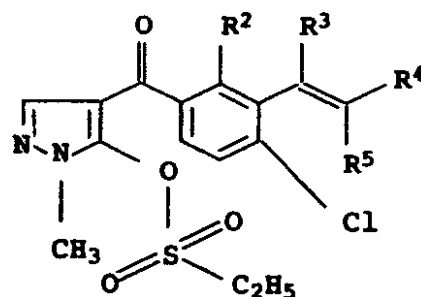
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がイソブチル及び $R^{15}$ がメチルスルホニルである点で異なる化合物Ia65、特に化合物Ia65.001～Ia65.180が極めて好ましい：

10

**Ia65**

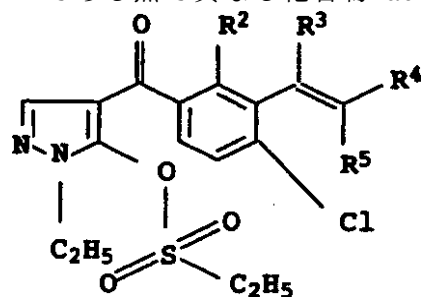
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{15}$ がエチルスルホニルである点で異なる化合物Ia66、特に化合物Ia66.001～Ia66.180が極めて好ましい：

20

**Ia66**

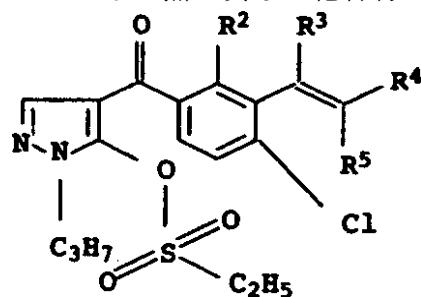
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がエチル及び $R^{15}$ がエチルスルホニルである点で異なる化合物Ia67、特に化合物Ia67.001～Ia67.180が極めて好ましい：

30

**Ia67**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がプロピル及び $R^{15}$ がエチルスルホニルである点で異なる化合物Ia68、特に化合物Ia68.001～Ia68.180が極めて好ましい：

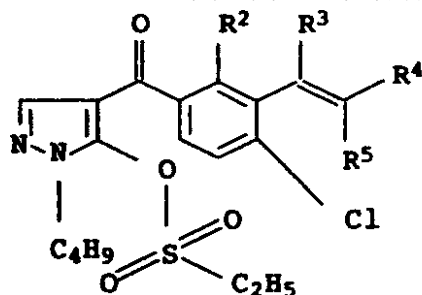
40

**Ia68**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がn-ブチル及び $R^{15}$ がエチルスル

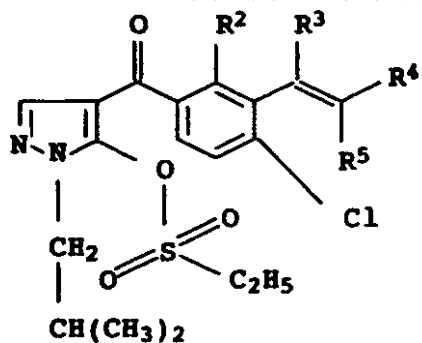
50

ホニルである点で異なる化合物Ia69、特に化合物Ia69.001～Ia69.180が極めて好ましい：



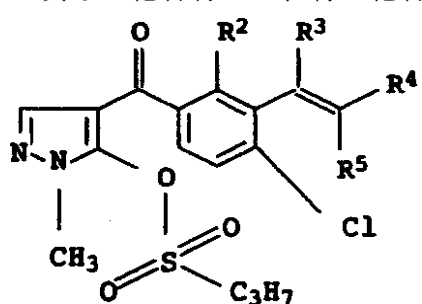
Ia69

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がイソブチル及び $R^{15}$ がエチルスルホニルである点で異なる化合物Ia70、特に化合物Ia70.001～Ia70.180が極めて好ましい：



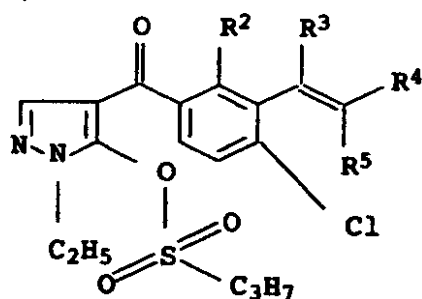
Ia70

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{15}$ がn-プロピルスルホニルである点で異なる化合物Ia71、特に化合物Ia71.001～Ia71.180が極めて好ましい：



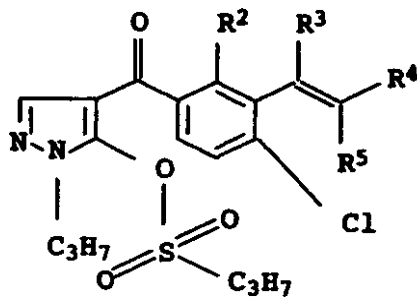
Ia71

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がエチル及び $R^{15}$ がn-プロピルスルホニルである点で異なる化合物Ia72、特に化合物Ia72.001～Ia72.180が極めて好ましい：



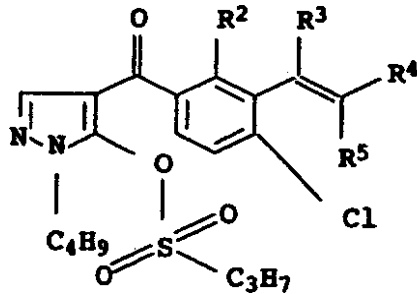
Ia72

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がn-プロピル及び $R^{15}$ がn-プロピルスルホニルである点で異なる化合物Ia73、特に化合物Ia73.001～Ia73.180が極めて好ましい：

**Ia73**

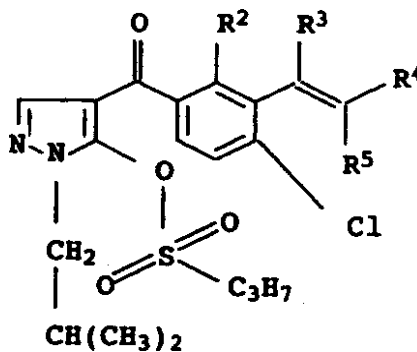
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ が $n$ -ブチル及び $R^{15}$ が $n$ -プロピルスルホニルである点で異なる化合物Ia74、特に化合物Ia74.001～Ia74.180が極めて好ましい：

10

**Ia74**

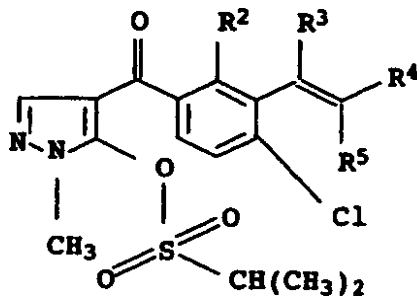
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がイソブチル及び $R^{15}$ が $n$ -プロピルスルホニルである点で異なる化合物Ia75、特に化合物Ia75.001～Ia75.180が極めて好ましい：

20

**Ia75**

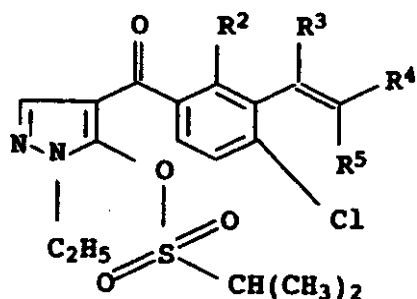
30

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{15}$ がイソプロピルスルホニルである点で異なる化合物Ia76、特に化合物Ia76.001～Ia76.180が極めて好ましい：

**Ia76**

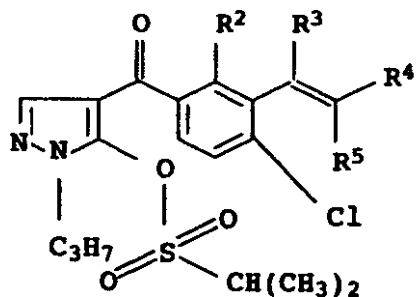
40

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がエチル及び $R^{15}$ がイソプロピルスルホニルである点で異なる化合物Ia77、特に化合物Ia77.001～Ia77.180が極めて好ましい：

**Ia77**

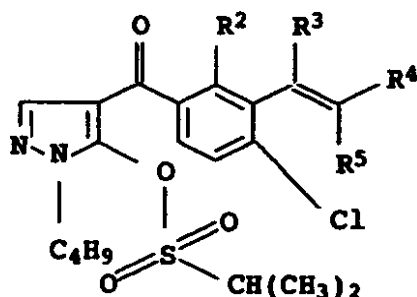
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がプロピル及び $R^{15}$ がイソプロピル  
スルホニルである点で異なる化合物Ia78、特に化合物Ia78.001～Ia78.180が極めて好まし  
い：

10

**Ia78**

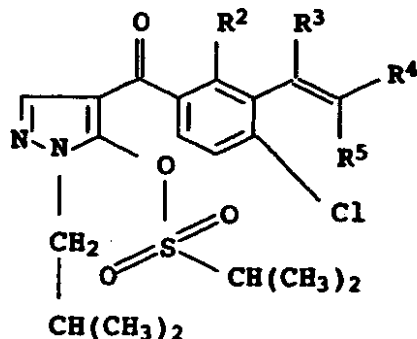
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がn-ブチル及び $R^{15}$ がイソプロピ  
ルスルホニルである点で異なる化合物Ia79、特に化合物Ia79.001～Ia79.180が極めて好ま  
しい：

20

**Ia79**

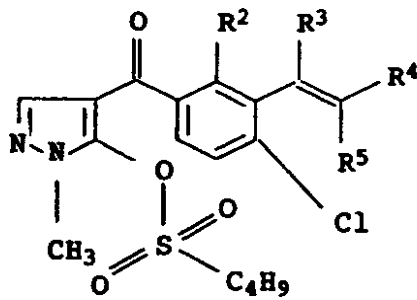
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がイソブチル及び $R^{15}$ がイソプロピ  
ルスルホニルである点で異なる化合物Ia80、特に化合物Ia80.001～Ia80.180が極めて好ま  
しい：

30

**Ia80**

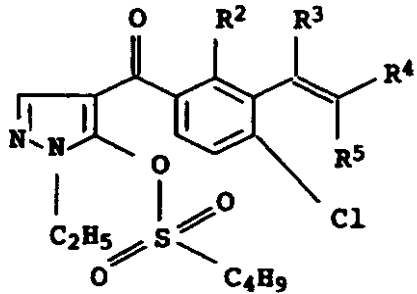
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{15}$ がn-ブチルスルホニルである点で  
異なる化合物Ia81、特に化合物Ia81.001～Ia81.180が極めて好ましい：

40

**Ia81**

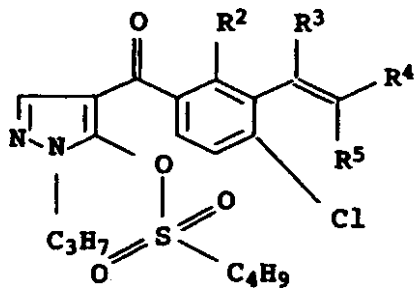
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がエチル及び $R^{15}$ がn-ブチルスルホニルである点で異なる化合物Ia82、特に化合物Ia82.001～Ia82.180が極めて好ましい：

10

**Ia82**

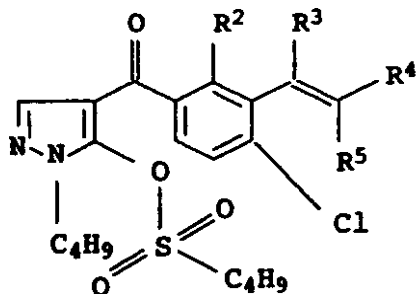
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がn-プロピル及び $R^{15}$ がn-ブチルスルホニルである点で異なる化合物Ia83、特に化合物Ia83.001～Ia83.180が極めて好ましい：

20

**Ia83**

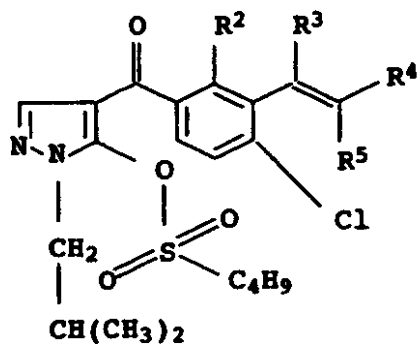
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がn-ブチル及び $R^{15}$ がn-ブチルスルホニルである点で異なる化合物Ia84、特に化合物Ia84.001～Ia84.180が極めて好ましい：

30

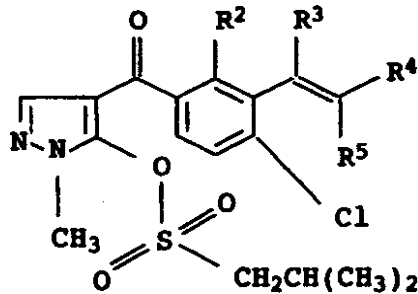
**Ia84**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がイソブチル及び $R^{15}$ がn-ブチルスルホニルである点で異なる化合物Ia85、特に化合物Ia85.001～Ia85.180が極めて好ましい：

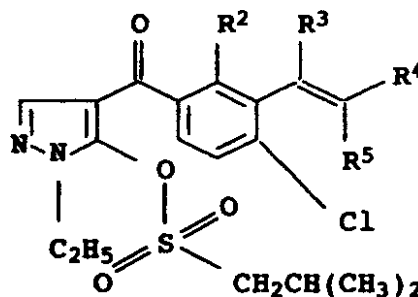
40



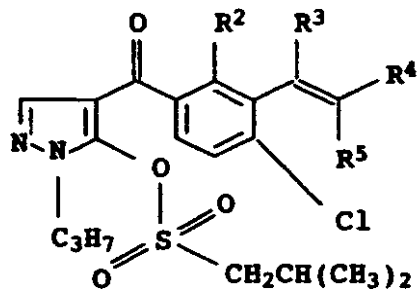
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{15}$ がイソブチルスルホニルである点で異なる化合物Ia86、特に化合物Ia86.001～Ia86.180が極めて好ましい： 10



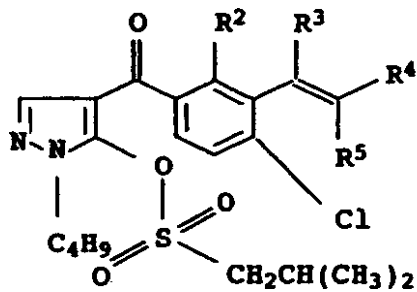
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がエチル及び $R^{15}$ がイソブチルスルホニルである点で異なる化合物Ia87、特に化合物Ia87.001～Ia87.180が極めて好ましい： 20



同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がn-プロピル及び $R^{15}$ がイソブチルスルホニルである点で異なる化合物Ia88、特に化合物Ia88.001～Ia88.180が極めて好ましい： 30

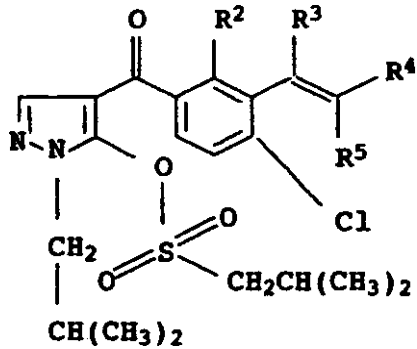


同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がn-ブチル及び $R^{15}$ がイソブチルスルホニルである点で異なる化合物Ia89、特に化合物Ia89.001～Ia89.180が極めて好ましい： 40

**Ia89**

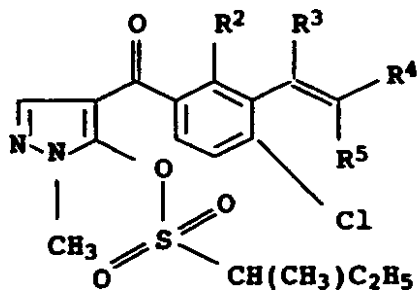
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がイソブチル及び $R^{15}$ がイソブチルスルホニルである点で異なる化合物Ia90、特に化合物Ia90.001～Ia90.180が極めて好ましい：

10

**Ia90**

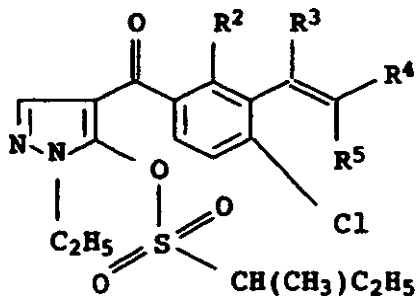
20

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{15}$ がsec-ブチルスルホニルである点で異なる化合物Ia91、特に化合物Ia91.001～Ia91.180が極めて好ましい：

**Ia91**

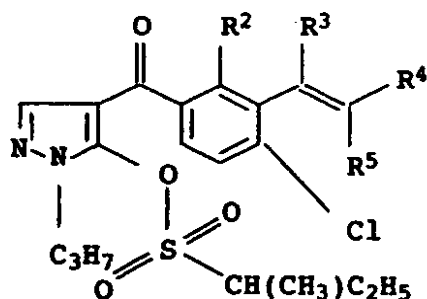
30

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がエチル及び $R^{15}$ がsec-ブチルスルホニルである点で異なる化合物Ia92、特に化合物Ia92.001～Ia92.180が極めて好ましい：

**Ia92**

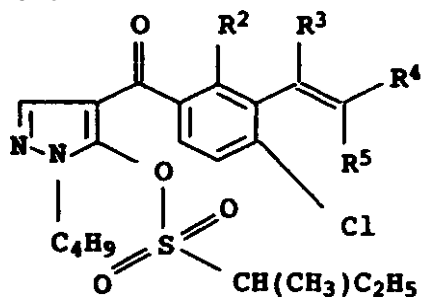
40

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がn-プロピル及び $R^{15}$ がsec-ブチルスルホニルである点で異なる化合物Ia93、特に化合物Ia93.001～Ia93.180が極めて好ましい：

**Ia93**

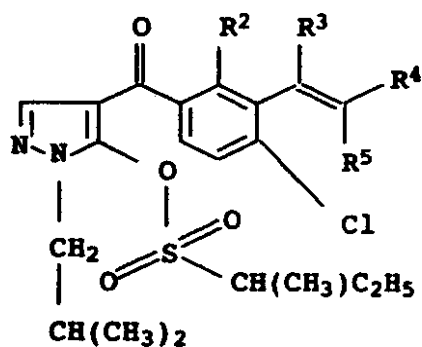
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がn-ブチル及び $R^{15}$ がsec-ブチルスルホニルである点で異なる化合物Ia94、特に化合物Ia94.001～Ia94.180が極めて好ましい：

10

**Ia94**

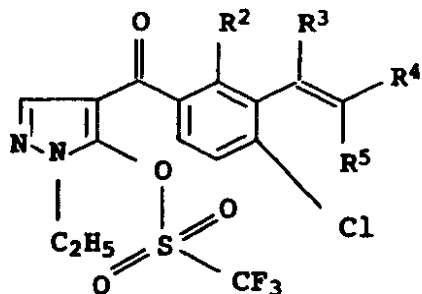
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がイソブチル及び $R^{15}$ がsec-ブチルスルホニルである点で異なる化合物Ia95、特に化合物Ia95.001～Ia95.180が極めて好ましい：

20

**Ia95**

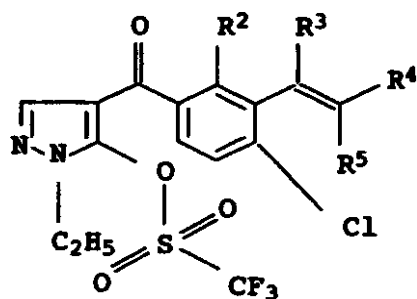
30

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{15}$ がトリフルオロメチルスルホニルである点で異なる化合物Ia96、特に化合物Ia96.001～Ia96.180が極めて好ましい：

**Ia96**

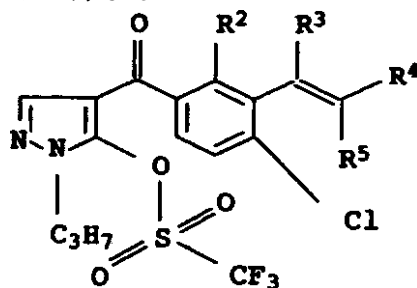
40

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がエチル及び $R^{15}$ がトリフルオロメチルスルホニルである点で異なる化合物Ia97、特に化合物Ia97.001～Ia97.180が極めて好ましい：

**Ia97**

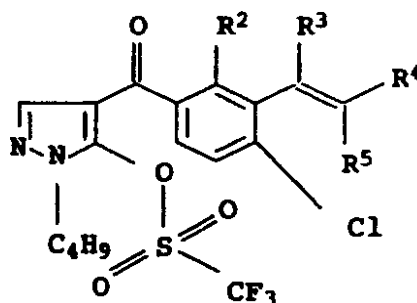
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がn-プロピル及び $R^{15}$ がトリフルオロメチルスルホニルである点で異なる化合物Ia98、特に化合物Ia98.001～Ia98.180が極めて好ましい：

10

**Ia98**

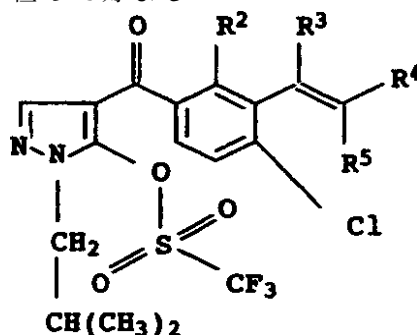
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がn-ブチル及び $R^{15}$ がトリフルオロメチルスルホニルである点で異なる化合物Ia99、特に化合物Ia99.001～Ia99.180が極めて好ましい：

20

**Ia99**

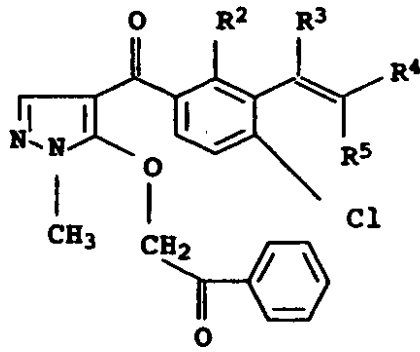
30

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がイソブチル及び $R^{15}$ がトリフルオロメチルスルホニルである点で異なる化合物Ia100、特に化合物Ia100.001～Ia100.180が極めて好ましい：

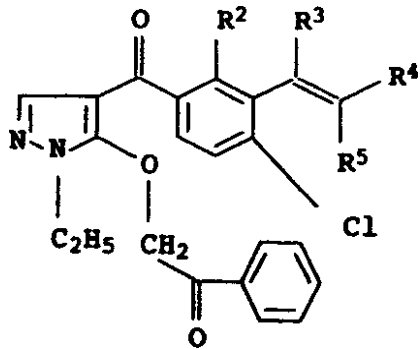
**Ia100**

40

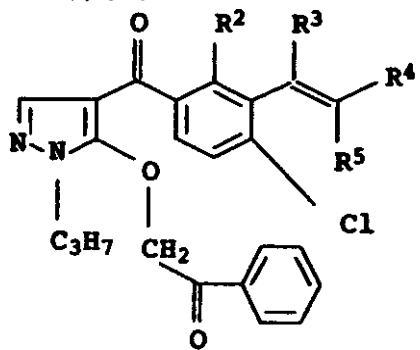
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{15}$ がフェニルカルボニルメチルである点で異なる化合物Ia101、特に化合物Ia101.001～Ia101.180が極めて好ましい：

**Ia101**

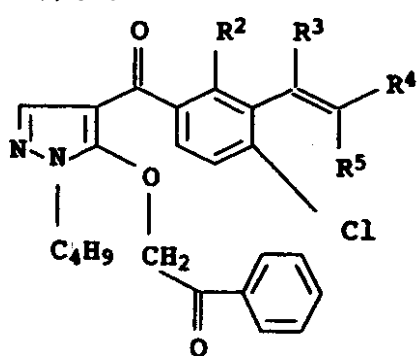
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がエチル及び $R^{15}$ がフェニルカルボニルメチルである点で異なる化合物Ia102、特に化合物Ia102.001～Ia102.180が極めて好ましい：

**Ia102**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がn-プロピル及び $R^{15}$ がフェニルカルボニルメチルである点で異なる化合物Ia103、特に化合物Ia103.001～Ia103.180が極めて好ましい：

**Ia103**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がn-ブチル及び $R^{15}$ がフェニルカルボニルメチルである点で異なる化合物Ia104、特に化合物Ia104.001～Ia104.180が極めて好ましい：

**Ia104**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がイソブチル及び $R^{15}$ がフェニルカルボニルメチルである点で異なる化合物Ia105、特に化合物Ia105.001～Ia105.180が極めて好ましい：

10

20

30

40



10



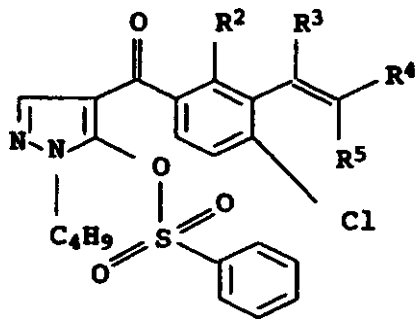
20



30

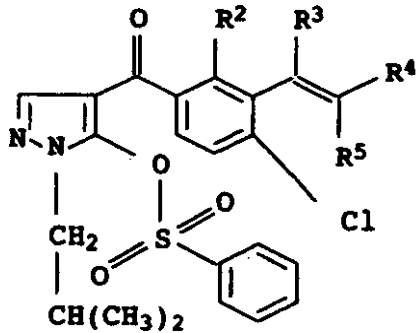


40

**Ia109**

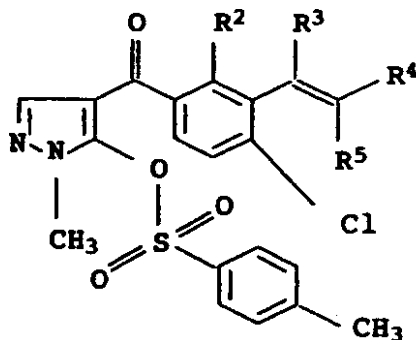
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がイソブチル及び $R^{15}$ がフェニルスルホニルである点で異なる化合物Ia110、特に化合物Ia110.001～Ia110.180が極めて好ましい：

10

**Ia110**

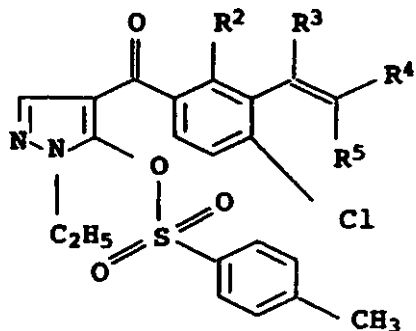
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{15}$ が4-メチルフェニルスルホニルである点で異なる化合物Ia111、特に化合物Ia111.001～Ia111.180が極めて好ましい：

20

**Ia111**

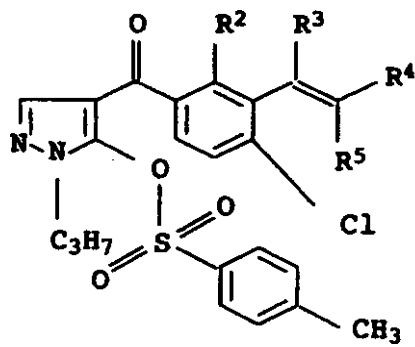
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がエチル及び $R^{15}$ が4-メチルフェニルスルホニルである点で異なる化合物Ia112、特に化合物Ia112.001～Ia112.180が極めて好ましい：

30

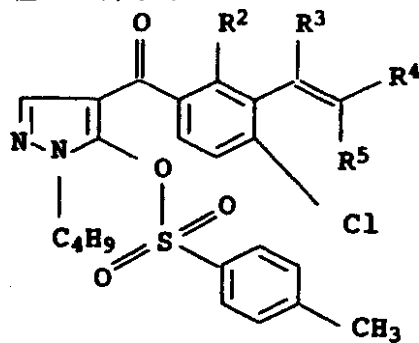
**Ia112**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がn-プロピル及び $R^{15}$ が4-メチルフェニルスルホニルである点で異なる化合物Ia113、特に化合物Ia113.001～Ia113.180が極めて好ましい：

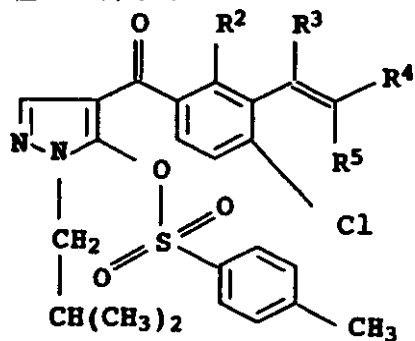
40

**Ia113**

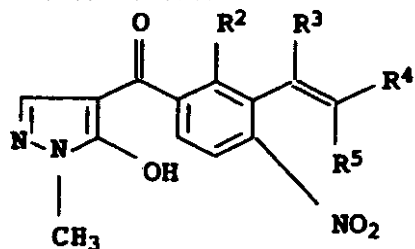
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がn-ブチル及び $R^{15}$ が4-メチルフェニルスルホニルである点で異なる化合物Ia114、特に化合物Ia114.001～Ia114.180が極めて好ましい：

**Ia114**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がイソブチル及び $R^{15}$ が4-メチルフェニルスルホニルである点で異なる化合物Ia115、特に化合物Ia115.001～Ia115.180が極めて好ましい：

**Ia115**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロである点で異なる化合物Ia116、特に化合物Ia116.001～Ia116.180が極めて好ましい：

**Ia116**

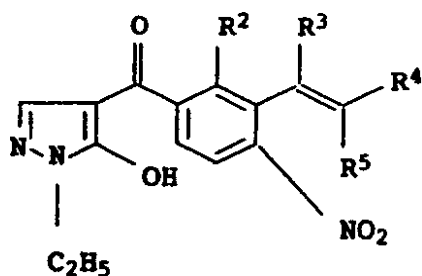
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ及び $R^{14}$ がエチルである点で異なる化合物Ia117、特に化合物Ia117.001～Ia117.180が極めて好ましい：

10

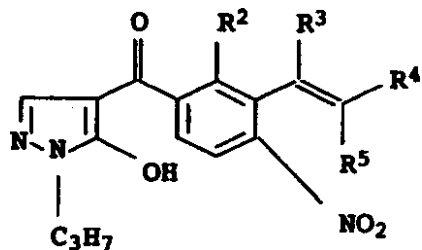
20

30

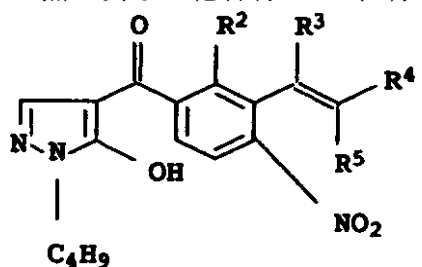
40



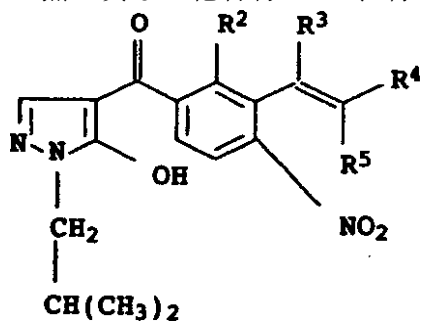
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ及び $R^{14}$ がプロピルである点で異なる化合物Ia118、特に化合物Ia118.001～Ia118.180が極めて好ましい：



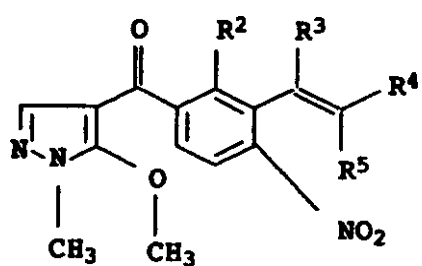
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ及び $R^{14}$ がn-ブチルである点で異なる化合物Ia119、特に化合物Ia119.001～Ia119.180が極めて好ましい：



同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ及び $R^{14}$ がイソブチルである点で異なる化合物Ia120、特に化合物Ia120.001～Ia120.180が極めて好ましい：



同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ及び $R^{15}$ がメチルである点で異なる化合物Ia121、特に化合物Ia121.001～Ia121.180が極めて好ましい：



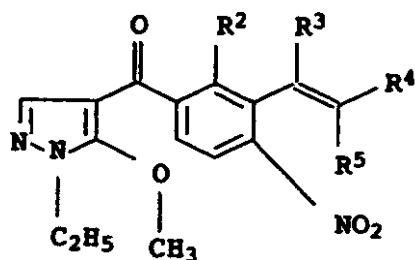
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がエチル及び $R^{15}$ がメチルである点で異なる化合物Ia122、特に化合物Ia122.001～Ia122.180が極めて好ましい：

10

20

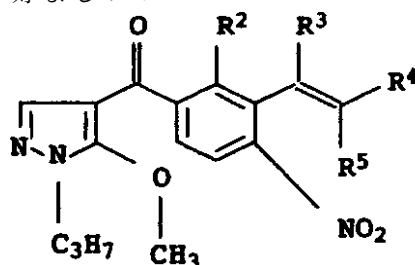
30

40

**Ia122**

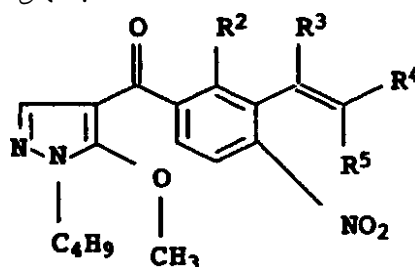
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がn-プロピル及び $R^{15}$ がメチルである点で異なる化合物Ia123、特に化合物Ia123.001～Ia123.180が極めて好ましい：

10

**Ia123**

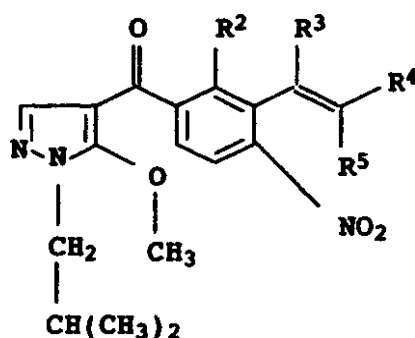
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がn-ブチル及び $R^{15}$ がメチルである点で異なる化合物Ia124、特に化合物Ia124.001～Ia124.180が極めて好ましい：

20

**Ia124**

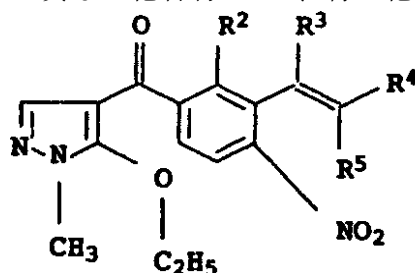
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がイソブチル及び $R^{15}$ がメチルである点で異なる化合物Ia125、特に化合物Ia125.001～Ia125.180が極めて好ましい：

30

**Ia125**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ及び $R^{15}$ がエチルである点で異なる化合物Ia126、特に化合物Ia126.001～Ia126.180が極めて好ましい：

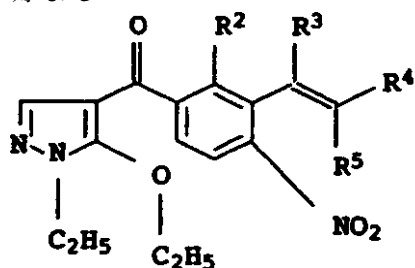
40

**Ia126**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、そして $R^{14}$ 及び $R^{15}$ がそれぞれエチルである点で異なる化合物Ia127、特に化合物Ia127.001～Ia127.180が極めて

50

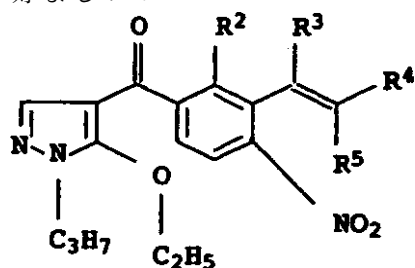
好ましい：



**Ia127**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がn-プロピル及び  
 $R^{15}$ がエチルである点で異なる化合物Ia128、特に化合物Ia128.001～Ia128.180が極めて  
 好ましい：

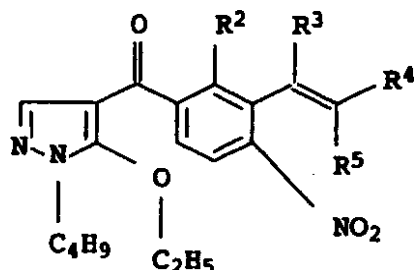
10



**Ia128**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がn-ブチル及び $R^{15}$   
 $R^{15}$ がエチルである点で異なる化合物Ia129、特に化合物Ia129.001～Ia129.180が極めて好ま  
 しい：

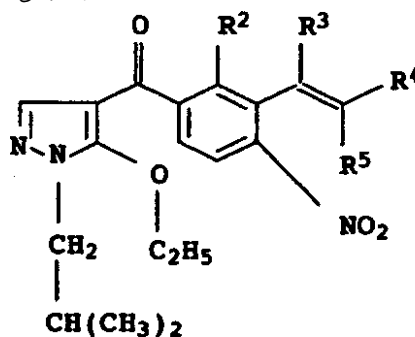
20



**Ia129**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がイソブチル及び $R^{15}$   
 $R^{15}$ がエチルである点で異なる化合物Ia130、特に化合物Ia130.001～Ia130.180が極めて好ま  
 しい：

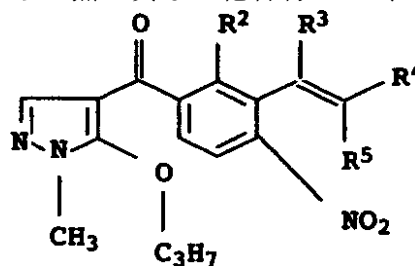
30



**Ia130**

40

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ及び $R^{15}$ がn-プロピルで  
 ある点で異なる化合物Ia131、特に化合物Ia131.001～Ia131.180が極めて好ましい：

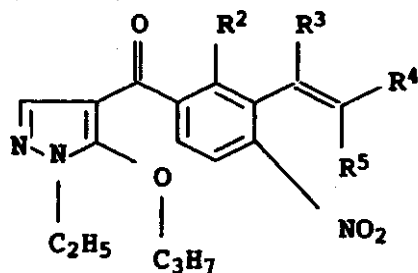


**Ia131**

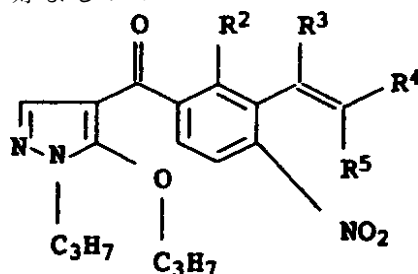
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、そして $R^{14}$ がエチル及び

50

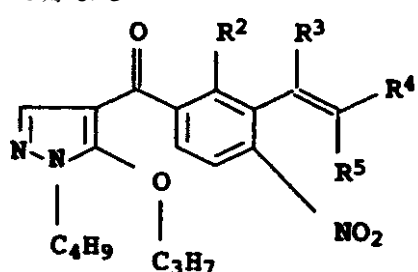
$R^{15}$ がn-プロピルである点で異なる化合物Ia132、特に化合物Ia132.001~Ia132.180が極めて好ましい：

**Ia132**

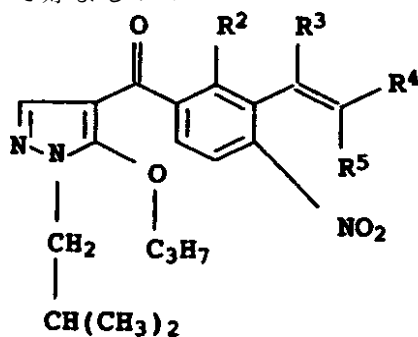
同様に、対応する化合物Ia1.001~Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ 及び $R^{15}$ がそれぞれn-プロピルである点で異なる化合物Ia133、特に化合物Ia133.001~Ia133.180が極めて好ましい：

**Ia133**

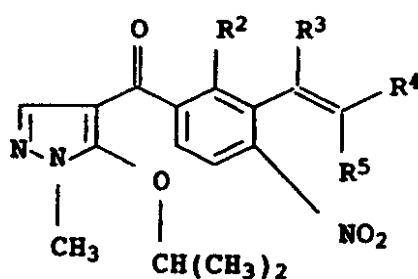
同様に、対応する化合物Ia1.001~Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がn-ブチル及び $R^{15}$ がn-プロピルである点で異なる化合物Ia134、特に化合物Ia134.001~Ia134.180が極めて好ましい：

**Ia134**

同様に、対応する化合物Ia1.001~Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がイソブチル及び $R^{15}$ がn-プロピルである点で異なる化合物Ia135、特に化合物Ia135.001~Ia135.180が極めて好ましい：

**Ia135**

同様に、対応する化合物Ia1.001~Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ及び $R^{15}$ がイソプロピルである点で異なる化合物Ia136、特に化合物Ia136.001~Ia136.180が極めて好ましい：

**Ia136**

10

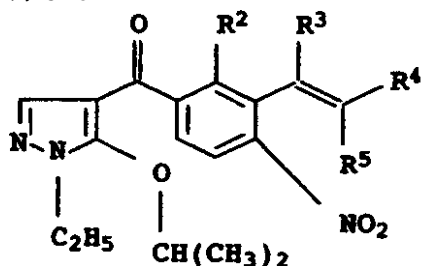
20

30

40

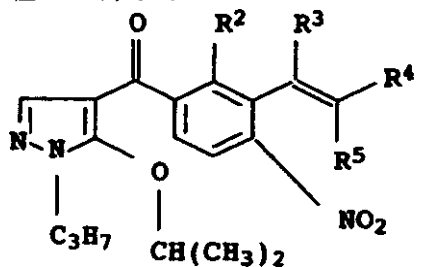
50

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がエチル及び $R^{15}$ がイソプロピルである点で異なる化合物Ia137、特に化合物Ia137.001～Ia137.180が極めて好ましい：

**Ia137**

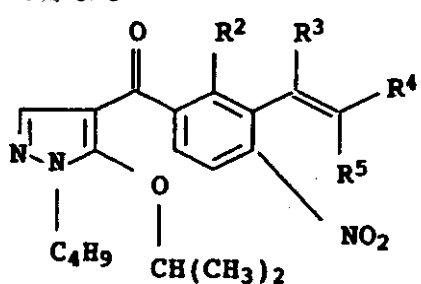
10

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がn-プロピル及び $R^{15}$ がイソプロピルである点で異なる化合物Ia138、特に化合物Ia138.001～Ia138.180が極めて好ましい：

**Ia138**

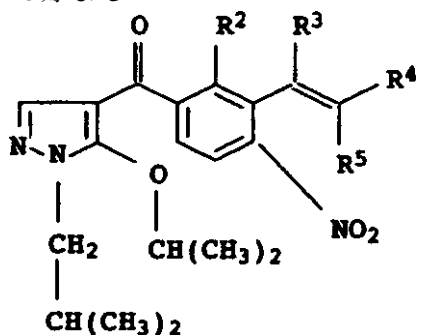
20

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がn-ブチル及び $R^{15}$ がイソプロピルである点で異なる化合物Ia139、特に化合物Ia139.001～Ia139.180が極めて好ましい：

**Ia139**

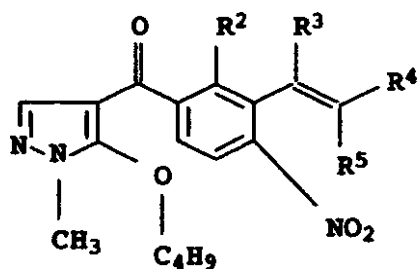
30

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がイソブチル及び $R^{15}$ がイソプロピルである点で異なる化合物Ia140、特に化合物Ia140.001～Ia140.180が極めて好ましい：

**Ia140**

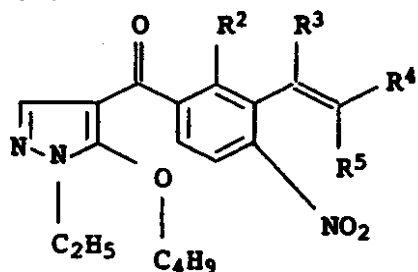
40

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ及び $R^{15}$ がn-ブチルである点で異なる化合物Ia141、特に化合物Ia141.001～Ia141.180が極めて好ましい：

**Ia141**

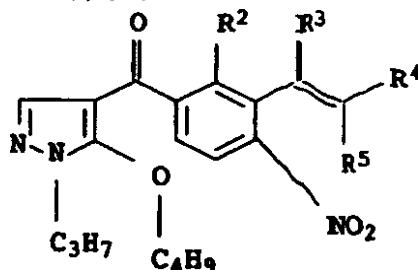
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がエチル及び $R^{15}$ がn-ブチルである点で異なる化合物Ia142、特に化合物Ia142.001～Ia142.180が極めて好ましい：

10

**Ia142**

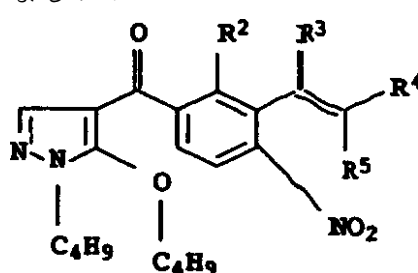
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がn-プロピル及び $R^{15}$ がn-ブチルである点で異なる化合物Ia143、特に化合物Ia143.001～Ia143.180が極めて好ましい：

20

**Ia143**

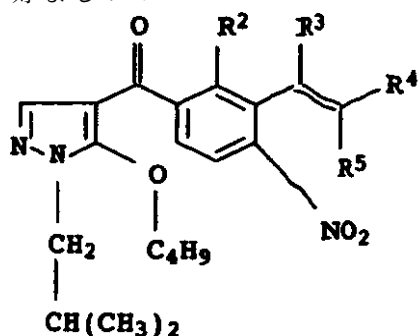
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ 及び $R^{15}$ がそれぞれn-ブチルである点で異なる化合物Ia144、特に化合物Ia144.001～Ia144.180が極めて好ましい：

30

**Ia144**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がイソブチル及び $R^{15}$ がn-ブチルである点で異なる化合物Ia145、特に化合物Ia145.001～Ia145.180が極めて好ましい：

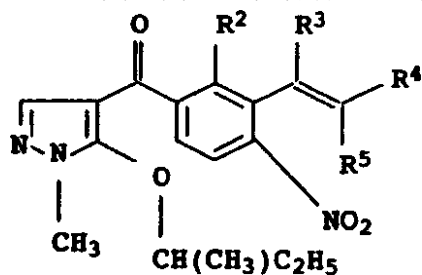
40

**Ia145**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ及び $R^{15}$ がsec-ブチル

50

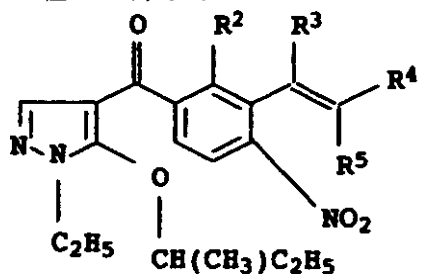
である点で異なる化合物Ia146、特に化合物Ia146.001～Ia146.180が極めて好ましい：



Ia146

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、そして $R^{14}$ がエチル及び $R^{15}$ がsec-ブチルである点で異なる化合物Ia147、特に化合物Ia147.001～Ia147.180

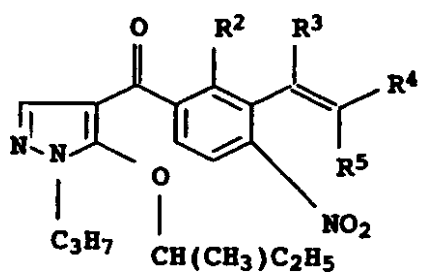
10



Ia147

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がn-プロピル及び $R^{15}$ がsec-ブチルである点で異なる化合物Ia148、特に化合物Ia148.001～Ia148.180

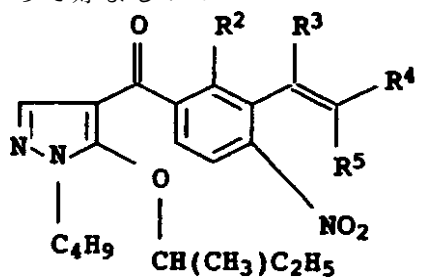
20



Ia148

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がn-ブチル及び $R^{15}$ がsec-ブチルである点で異なる化合物Ia149、特に化合物Ia149.001～Ia149.180が極めて好ましい：

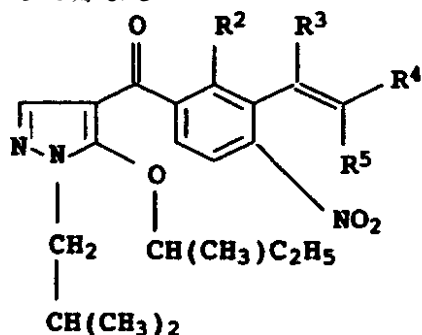
30



Ia149

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がイソブチル及び $R^{15}$ がsec-ブチルである点で異なる化合物Ia150、特に化合物Ia150.001～Ia150.180が極めて好ましい：

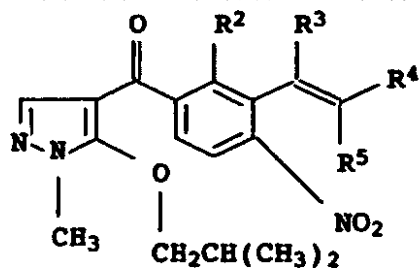
40



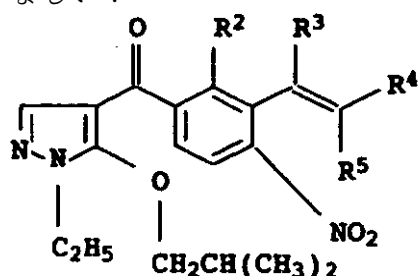
Ia150

50

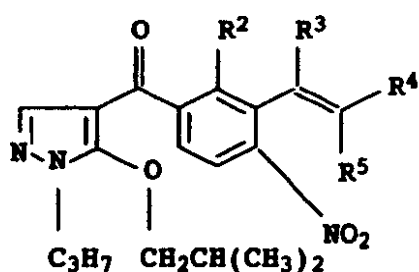
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ及び $R^{15}$ がイソブチルである点で異なる化合物Ia151、特に化合物Ia151.001～Ia151.180が極めて好ましい：

**Ia151**

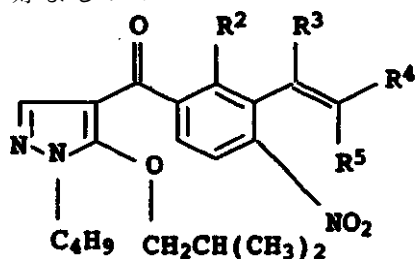
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がエチル及び $R^{15}$ がイソブチルである点で異なる化合物Ia152、特に化合物Ia152.001～Ia152.180が極めて好ましい：

**Ia152**

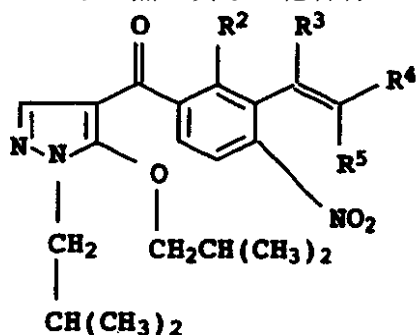
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がn-プロピル及び $R^{15}$ がイソブチルである点で異なる化合物Ia153、特に化合物Ia153.001～Ia153.180が極めて好ましい：

**Ia153**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がn-ブチル及び $R^{15}$ がイソブチルである点で異なる化合物Ia154、特に化合物Ia154.001～Ia154.180が極めて好ましい：

**Ia154**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ 及び $R^{15}$ がイソブチルである点で異なる化合物Ia155、特に化合物Ia155.001～Ia155.180が極めて好ましい：

**Ia155**

10

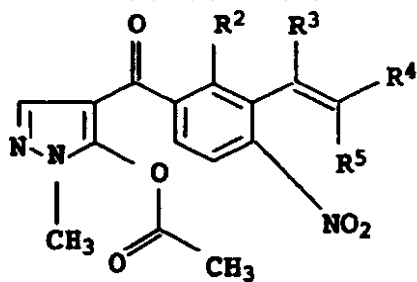
20

30

40

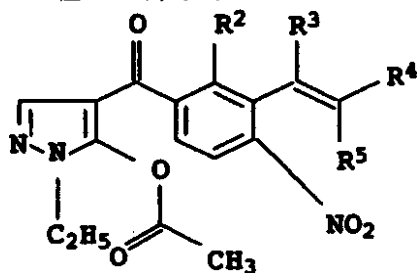
50

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ及び $R^{15}$ がメチルカルボニルである点で異なる化合物Ia156、特に化合物Ia156.001～Ia156.180が極めて好ましい：

**Ia156**

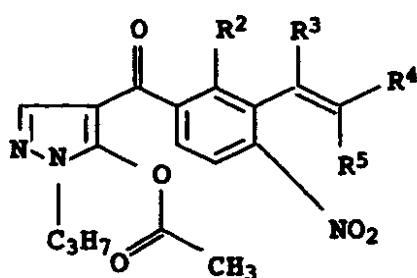
10

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、そして $R^{14}$ がエチル及び $R^{15}$ がメチルカルボニルである点で異なる化合物Ia157、特に化合物Ia157.001～Ia157.180が極めて好ましい：

**Ia157**

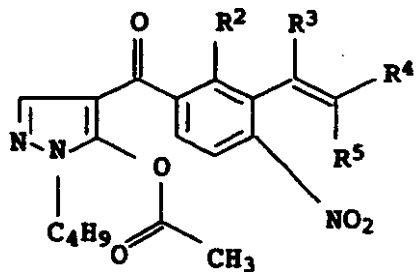
20

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がn-プロピル及び $R^{15}$ がメチルカルボニルである点で異なる化合物Ia158、特に化合物Ia158.001～Ia158.180が極めて好ましい：

**Ia158**

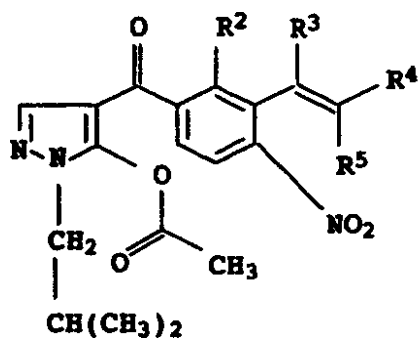
30

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がn-ブチル及び $R^{15}$ がメチルカルボニルである点で異なる化合物Ia159、特に化合物Ia159.001～Ia159.180が極めて好ましい：

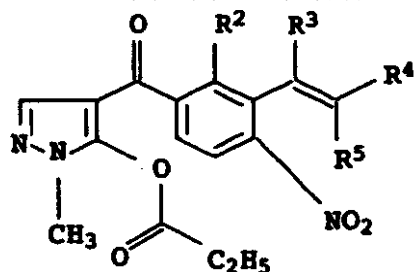
**Ia159**

40

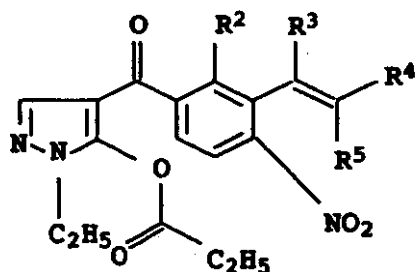
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がイソブチル及び $R^{15}$ がメチルカルボニルである点で異なる化合物Ia160、特に化合物Ia160.001～Ia160.180が極めて好ましい：



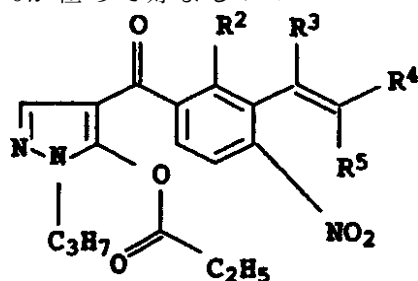
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ及び $R^{15}$ がエチルカルボニルである点で異なる化合物Ia161、特に化合物Ia161.001～Ia161.180が極めて好ましい：



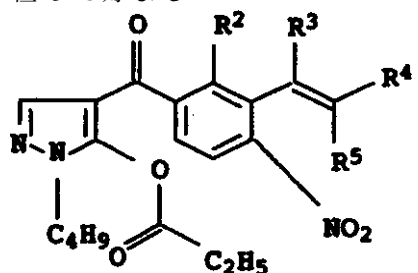
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がエチル及び $R^{15}$ がエチルカルボニルである点で異なる化合物Ia162、特に化合物Ia162.001～Ia162.180が極めて好ましい：



同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がn-プロピル及び $R^{15}$ がエチルカルボニルである点で異なる化合物Ia163、特に化合物Ia163.001～Ia163.180が極めて好ましい：



同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がn-ブチル及び $R^{15}$ がエチルカルボニルである点で異なる化合物Ia164、特に化合物Ia164.001～Ia164.180が極めて好ましい：



同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がイソブチル及び $R^{15}$

10

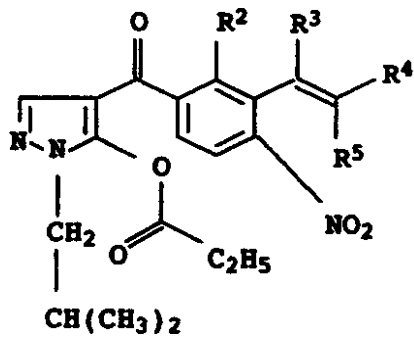
20

30

40

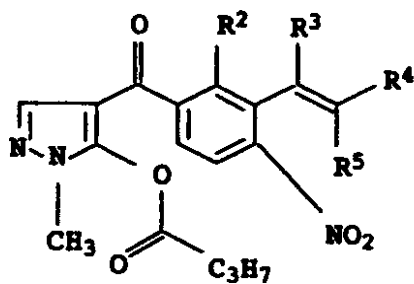
50

<sup>5</sup>がエチルカルボニルである点で異なる化合物Ia165、特に化合物Ia165.001～Ia165.180が極めて好ましい：



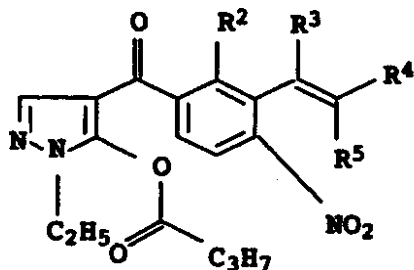
10

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ及び $R^{15}$ がn-プロピルカルボニルである点で異なる化合物Ia166、特に化合物Ia166.001～Ia166.180が極めて好ましい：



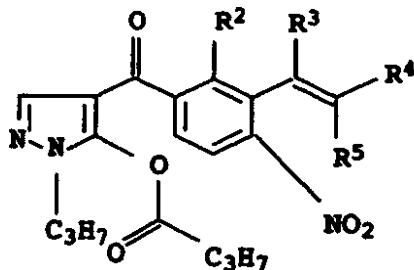
20

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がエチル及び $R^{15}$ がn-プロピルカルボニルである点で異なる化合物Ia167、特に化合物Ia167.001～Ia167.180が極めて好ましい：



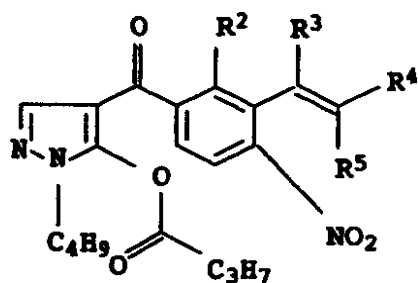
30

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がn-プロピル及び $R^{15}$ がn-プロピルカルボニルである点で異なる化合物Ia168、特に化合物Ia168.001～Ia168.180が極めて好ましい：

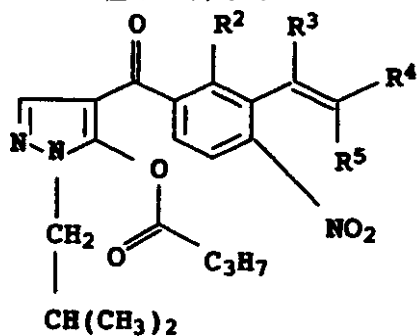


40

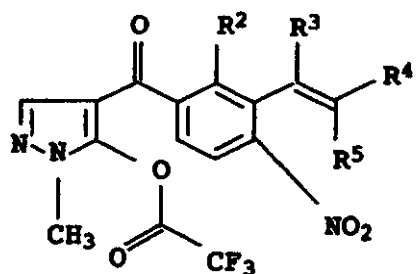
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がn-ブチル及び $R^{15}$ がn-プロピルカルボニルである点で異なる化合物Ia169、特に化合物Ia169.001～Ia169.180が極めて好ましい：

**Ia169**

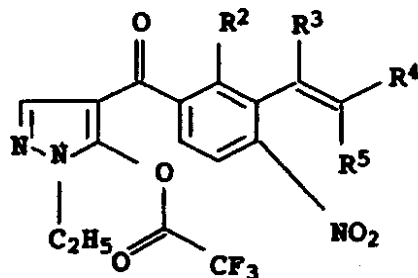
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がイソブチル及び $R^{15}$ がn-プロピルカルボニルである点で異なる化合物Ia170、特に化合物Ia170.001～Ia170.180が極めて好ましい：

**Ia170**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ及び $R^{15}$ がトリフルオロメチルカルボニルである点で異なる化合物Ia171、特に化合物Ia171.001～Ia171.180が極めて好ましい：

**Ia171**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がエチル及び $R^{15}$ がトリフルオロメチルカルボニルである点で異なる化合物Ia172、特に化合物Ia172.001～Ia172.180が極めて好ましい：

**Ia172**

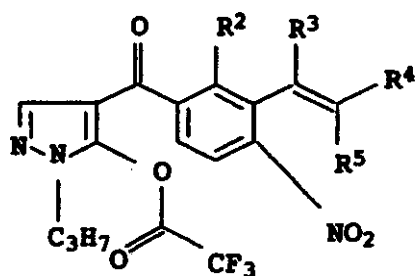
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がn-プロピル及び $R^{15}$ がトリフルオロメチルカルボニルである点で異なる化合物Ia173、特に化合物Ia173.001～Ia173.180が極めて好ましい：

10

20

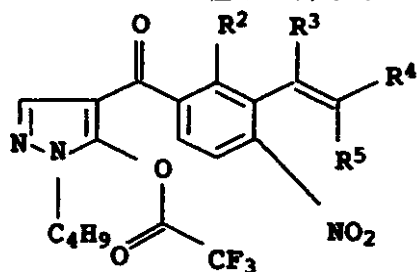
30

40

**Ia173**

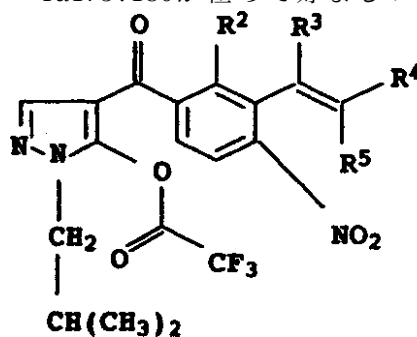
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がn-ブチル及び $R^{15}$ がトリフルオロメチルカルボニルである点で異なる化合物Ia174、特に化合物Ia174.001～Ia174.180が極めて好ましい：

10

**Ia174**

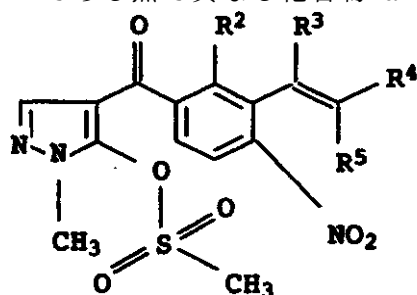
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がイソブチル及び $R^{15}$ がトリフルオロメチルカルボニルである点で異なる化合物Ia175、特に化合物Ia175.001～Ia175.180が極めて好ましい：

20

**Ia175**

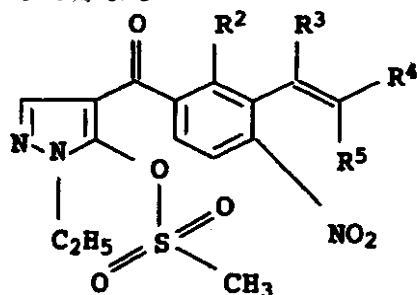
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ及び $R^{15}$ がメチルスルホニルである点で異なる化合物Ia176、特に化合物Ia176.001～Ia176.180が極めて好ましい：

30

**Ia176**

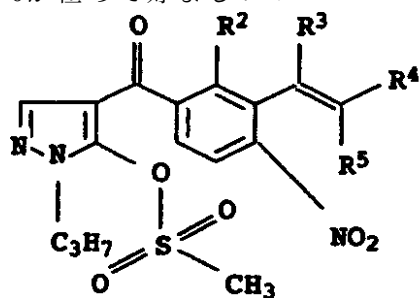
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がエチル及び $R^{15}$ がメチルスルホニルである点で異なる化合物Ia177、特に化合物Ia177.001～Ia177.180が極めて好ましい：

40

**Ia177**

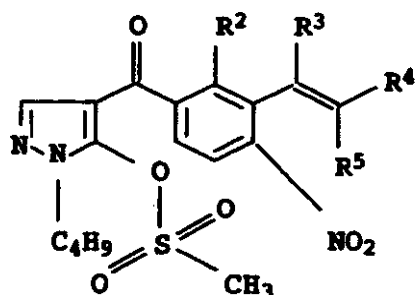
50

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がn-プロピル及び $R^{15}$ がメチルスルホニルである点で異なる化合物Ia178、特に化合物Ia178.001～Ia178.180が極めて好ましい：

**Ia178**

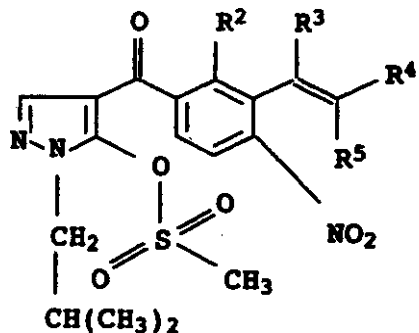
10

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がn-ブチル及び $R^{15}$ がメチルスルホニルである点で異なる化合物Ia179、特に化合物Ia179.001～Ia179.180が極めて好ましい：

**Ia179**

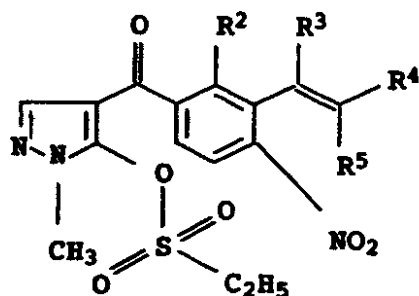
20

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がイソブチル及び $R^{15}$ がメチルスルホニルである点で異なる化合物Ia180、特に化合物Ia180.001～Ia180.180が極めて好ましい：

**Ia180**

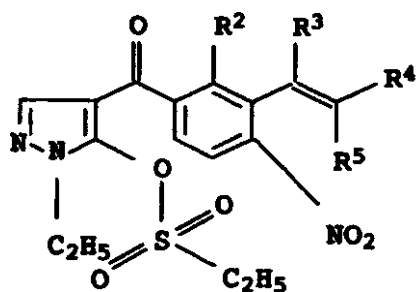
30

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ及び $R^{15}$ がエチルスルホニルである点で異なる化合物Ia181、特に化合物Ia181.001～Ia181.180が極めて好ましい：

**Ia181**

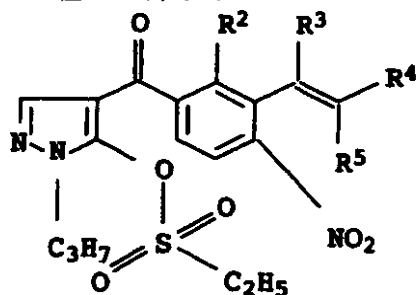
40

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がエチル及び $R^{15}$ がエチルスルホニルである点で異なる化合物Ia182、特に化合物Ia182.001～Ia182.180が極めて好ましい：

**Ia182**

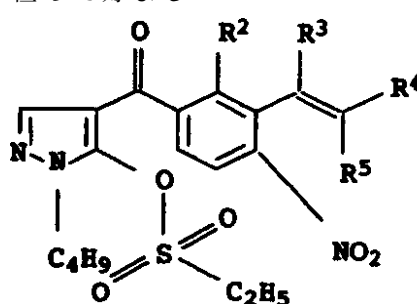
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がn-プロピル及び  
 $R^{15}$ がエチルスルホニルである点で異なる化合物Ia183、特に化合物Ia183.001～Ia183.180が極めて好ましい：

10

**Ia183**

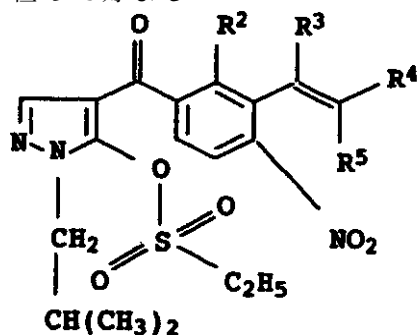
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がn-ブチル及び $R^{15}$   
 $R^{15}$ がエチルスルホニルである点で異なる化合物Ia184、特に化合物Ia184.001～Ia184.180が極めて好ましい：

20

**Ia184**

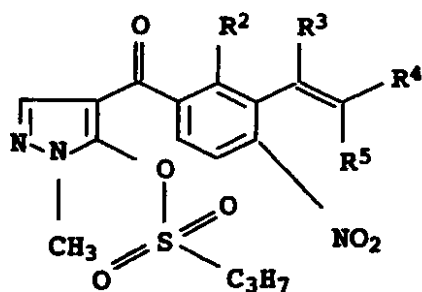
30

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がイソブチル及び $R^{15}$   
 $R^{15}$ がエチルスルホニルである点で異なる化合物Ia185、特に化合物Ia185.001～Ia185.180が極めて好ましい：

**Ia185**

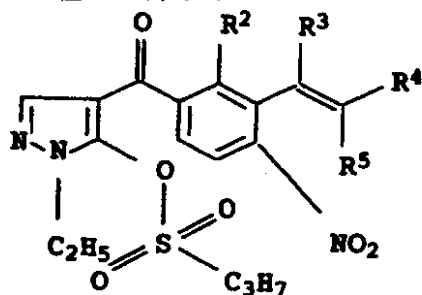
40

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ及び $R^{15}$ がn-プロピルスルホニルである点で異なる化合物Ia186、特に化合物Ia186.001～Ia186.180が極めて好ましい：

**Ia186**

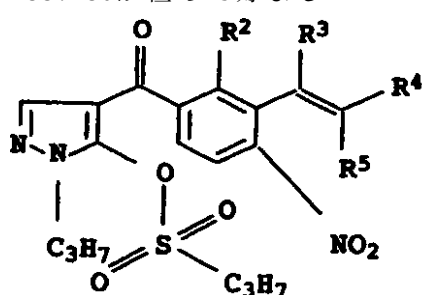
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がエチル及び $R^{15}$ がn-プロピルスルホニルである点で異なる化合物Ia187、特に化合物Ia187.001～Ia187.180が極めて好ましい：

10

**Ia187**

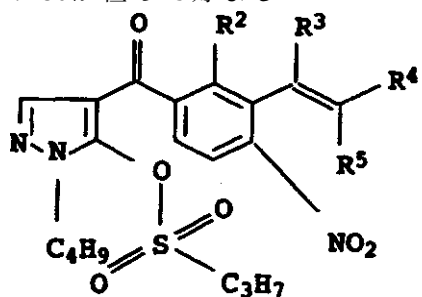
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がn-プロピル及び $R^{15}$ がn-プロピルスルホニルである点で異なる化合物Ia188、特に化合物Ia188.001～Ia188.180が極めて好ましい：

20

**Ia188**

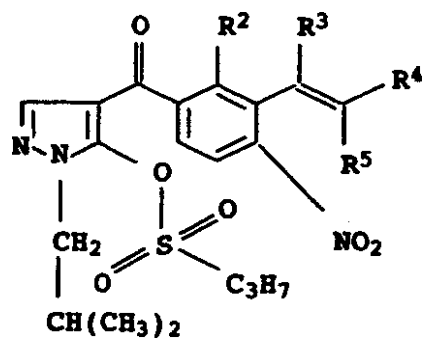
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がn-ブチル及び $R^{15}$ がn-プロピルスルホニルである点で異なる化合物Ia189、特に化合物Ia189.001～Ia189.180が極めて好ましい：

30

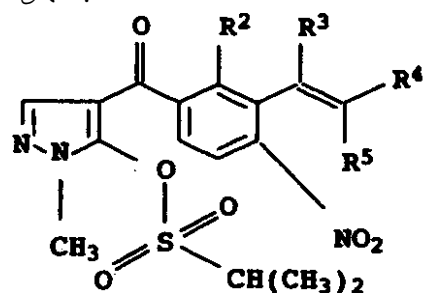
**Ia189**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がイソブチル及び $R^{15}$ がn-プロピルスルホニルである点で異なる化合物Ia190、特に化合物Ia190.001～Ia190.180が極めて好ましい：

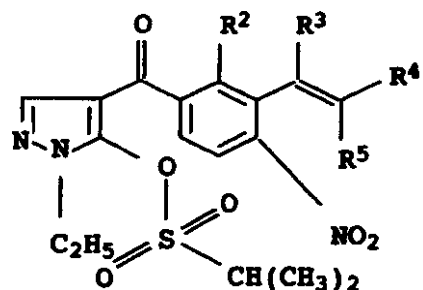
40



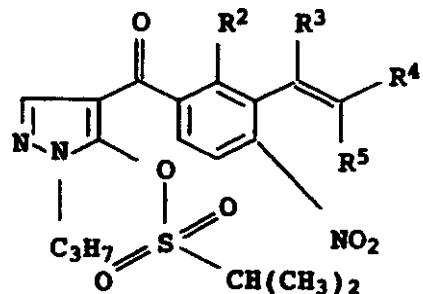
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ及び $R^{15}$ がイソプロピルスルホニルである点で異なる化合物Ia191、特に化合物Ia191.001～Ia191.180が極めて好ましい：



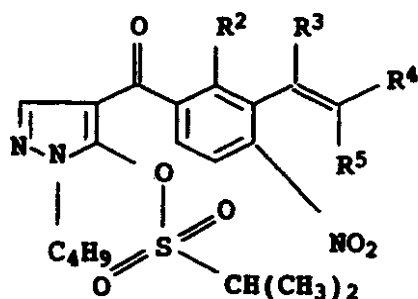
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がエチル及び $R^{15}$ がイソプロピルスルホニルである点で異なる化合物Ia192、特に化合物Ia192.001～Ia192.180が極めて好ましい：



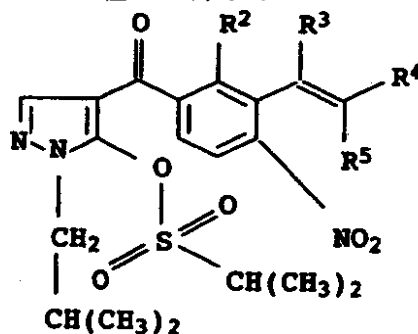
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がn-プロピル及び $R^{15}$ がイソプロピルスルホニルである点で異なる化合物Ia193、特に化合物Ia193.001～Ia193.180が極めて好ましい：



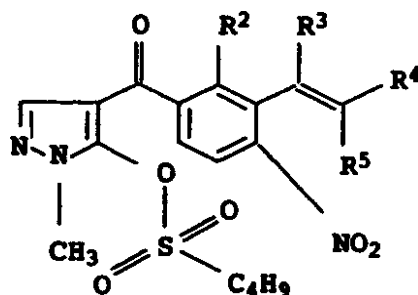
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がn-ブチル及び $R^{15}$ がイソプロピルスルホニルである点で異なる化合物Ia194、特に化合物Ia194.001～Ia194.180が極めて好ましい：

**Ia194**

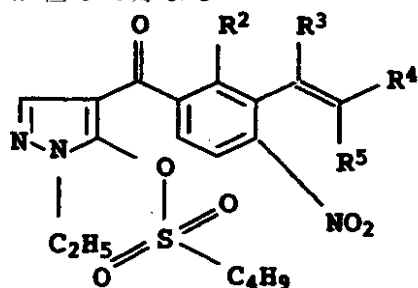
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がイソブチル及び $R^{15}$ がイソプロピルスルホニルである点で異なる化合物Ia195、特に化合物Ia195.001～Ia195.180が極めて好ましい：

**Ia195**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ及び $R^{15}$ がn-ブチルスルホニルである点で異なる化合物Ia196、特に化合物Ia196.001～Ia196.180が極めて好ましい：

**Ia196**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がエチル及び $R^{15}$ がn-ブチルスルホニルである点で異なる化合物Ia197、特に化合物Ia197.001～Ia197.180が極めて好ましい：

**Ia197**

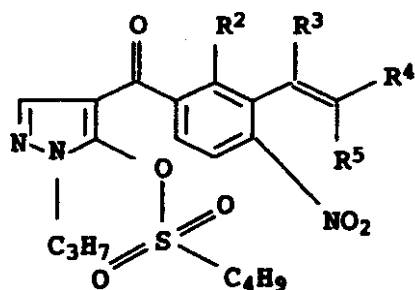
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がn-プロピル及び $R^{15}$ がn-ブチルスルホニルである点で異なる化合物Ia198、特に化合物Ia198.001～Ia198.180が極めて好ましい：

10

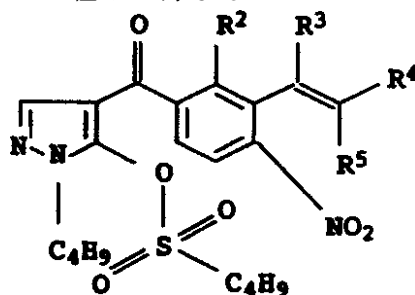
20

30

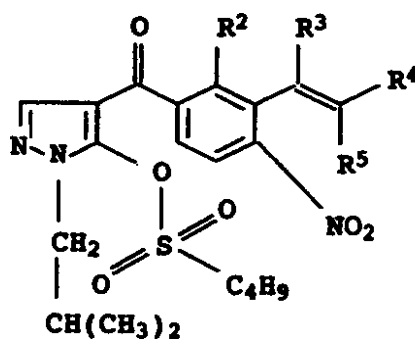
40

**Ia198**

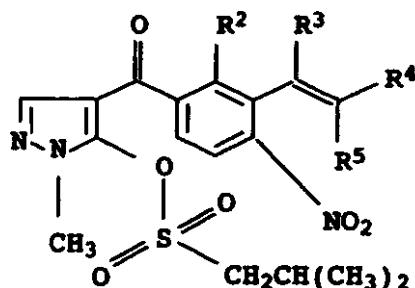
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がn-ブチル及び $R^{15}$ がn-ブチルスルホニルである点で異なる化合物Ia199、特に化合物Ia199.001～Ia199.180が極めて好ましい：

**Ia199**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がイソブチル及び $R^{15}$ がn-ブチルスルホニルである点で異なる化合物Ia200、特に化合物Ia200.001～Ia200.180が極めて好ましい：

**Ia200**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ及び $R^{15}$ がイソブチルスルホニルである点で異なる化合物Ia201、特に化合物Ia201.001～Ia201.180が極めて好ましい：

**Ia201**

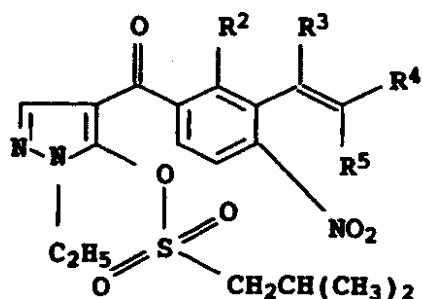
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がエチル及び $R^{15}$ がイソブチルスルホニルである点で異なる化合物Ia202、特に化合物Ia202.001～Ia202.180が極めて好ましい：

10

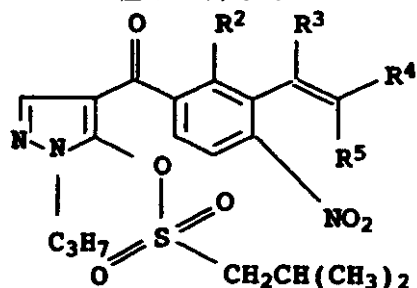
20

30

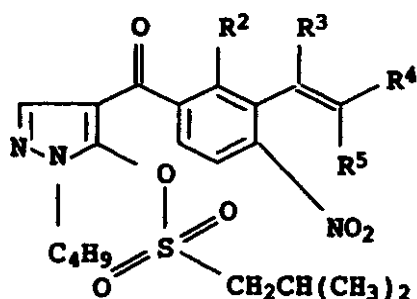
40

**Ia202**

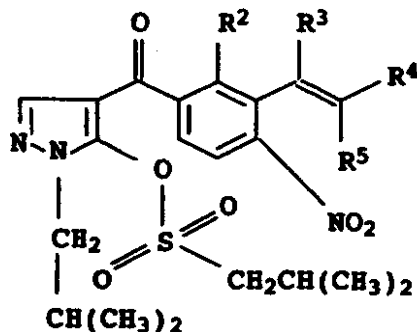
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がn-プロピル及び $R^{15}$ がイソブチルスルホニルである点で異なる化合物Ia203、特に化合物Ia203.001～Ia203.180が極めて好ましい：

**Ia203**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がn-ブチル及び $R^{15}$ がイソブチルスルホニルである点で異なる化合物Ia204、特に化合物Ia204.001～Ia204.180が極めて好ましい：

**Ia204**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がイソブチル及び $R^{15}$ がイソブチルスルホニルである点で異なる化合物Ia205、特に化合物Ia205.001～Ia205.180が極めて好ましい：

**Ia205**

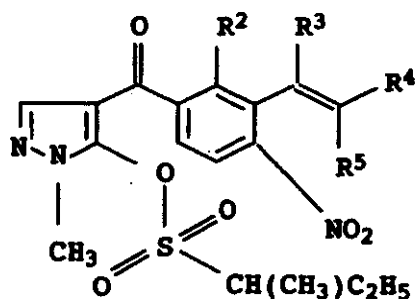
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ及び $R^{15}$ がsec-ブチルスルホニルである点で異なる化合物Ia206、特に化合物Ia206.001～Ia206.180が極めて好ましい：

10

20

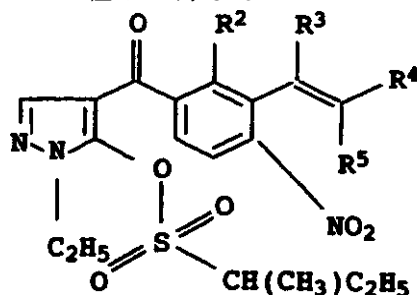
30

40

**Ia206**

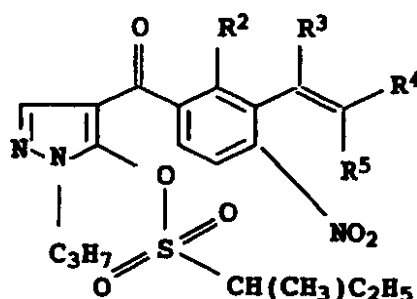
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がエチル及び $R^{15}$ が *sec*-ブチルスルホニルである点で異なる化合物Ia207、特に化合物Ia207.001～Ia207.180が極めて好ましい：

10

**Ia207**

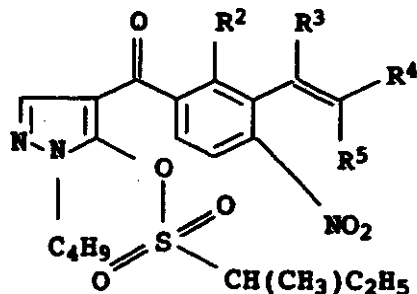
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ が*n*-プロピル及び $R^{15}$ が *sec*-ブチルスルホニルである点で異なる化合物Ia208、特に化合物Ia208.001～Ia208.180が極めて好ましい：

20

**Ia208**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ が*n*-ブチル及び $R^{15}$ が *sec*-ブチルスルホニルである点で異なる化合物Ia209、特に化合物Ia209.001～Ia209.180が極めて好ましい：

30

**Ia209**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がイソブチル及び $R^{15}$ が *sec*-ブチルスルホニルである点で異なる化合物Ia210、特に化合物Ia210.001～Ia210.180が極めて好ましい：

40



10



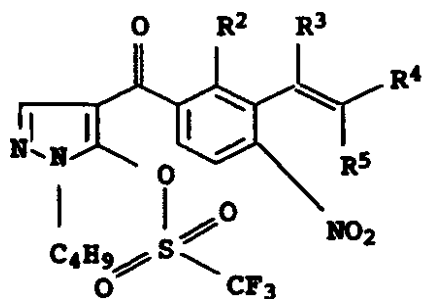
20



30

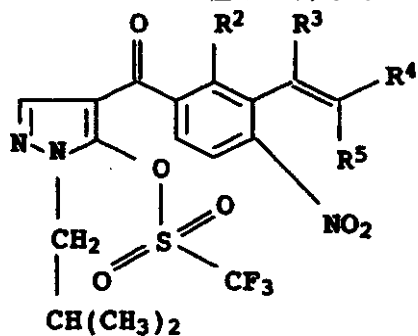


40

**Ia214**

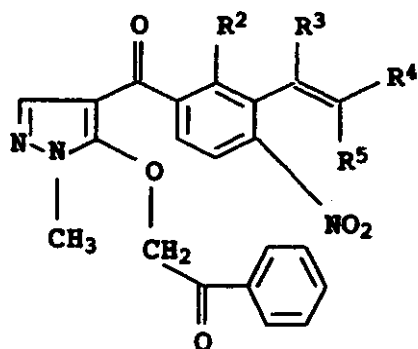
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がイソブチル及び $R^{15}$ がトリフルオロメチルスルホニルである点で異なる化合物Ia215、特に化合物Ia215.001～Ia215.180が極めて好ましい：

10

**Ia215**

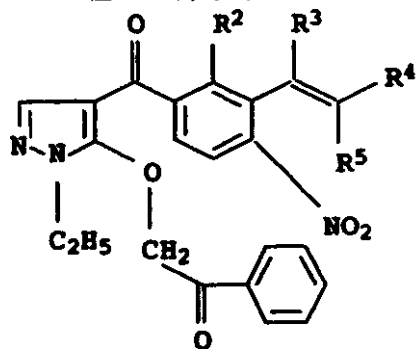
20

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ及び $R^{15}$ がフェニルカルボニルメチルである点で異なる化合物Ia216、特に化合物Ia216.001～Ia216.180が極めて好ましい：

**Ia216**

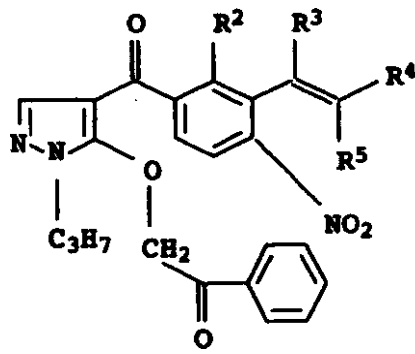
30

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がエチル及び $R^{15}$ がフェニルカルボニルメチルである点で異なる化合物Ia217、特に化合物Ia217.001～Ia217.180が極めて好ましい：

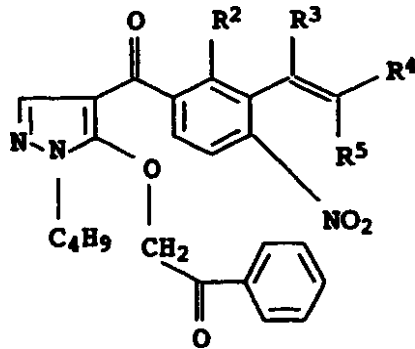
**Ia217**

40

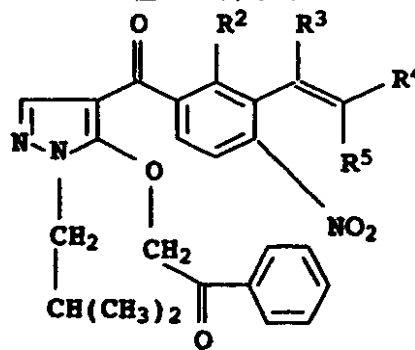
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がn-プロピル及び $R^{15}$ がフェニルカルボニルメチルである点で異なる化合物Ia218、特に化合物Ia218.001～Ia218.180が極めて好ましい：

**Ia218**

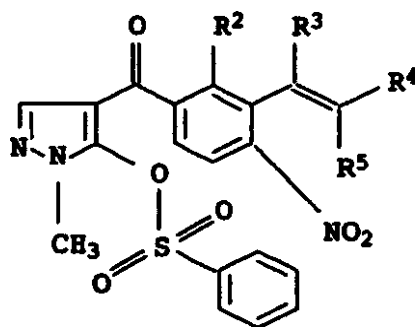
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がn-ブチル及び $R^{15}$ がフェニルカルボニルメチルである点で異なる化合物Ia219、特に化合物Ia219.001～Ia219.180が極めて好ましい：

**Ia219**

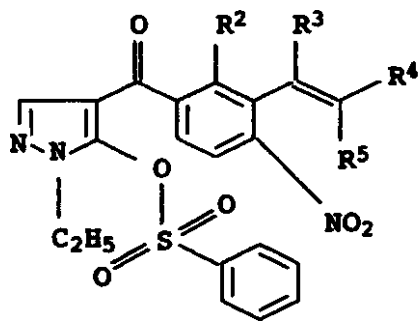
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がイソブチル及び $R^{15}$ がフェニルカルボニルメチルである点で異なる化合物Ia220、特に化合物Ia220.001～Ia220.180が極めて好ましい：

**Ia220**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ及び $R^{15}$ がフェニルスルホニルである点で異なる化合物Ia221、特に化合物Ia221.001～Ia221.180が極めて好ましい：

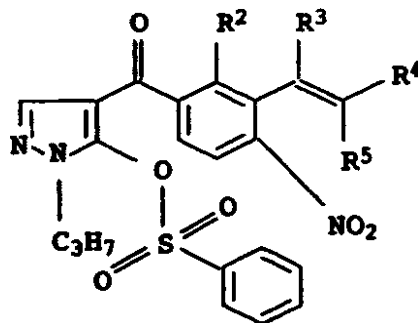
**Ia221**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がエチル及び $R^{15}$ がフェニルスルホニルである点で異なる化合物Ia222、特に化合物Ia222.001～Ia222.180が極めて好ましい：

**Ia222**

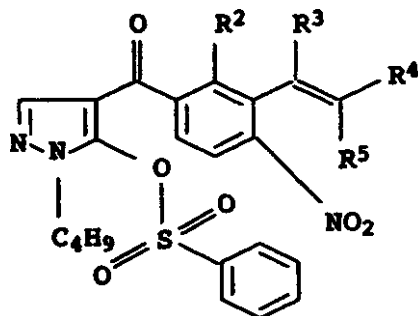
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がn-プロピル及び $R^{15}$ がフェニルスルホニルである点で異なる化合物Ia223、特に化合物Ia223.001～Ia223.180が極めて好ましい：

10

**Ia223**

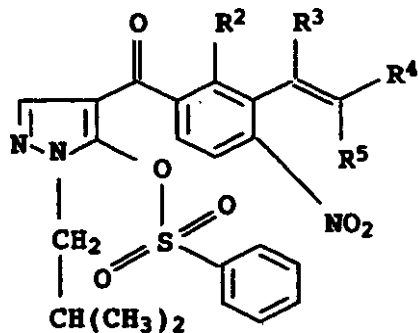
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がn-ブチル及び $R^{15}$ がフェニルスルホニルである点で異なる化合物Ia224、特に化合物Ia224.001～Ia224.180が極めて好ましい：

20

**Ia224**

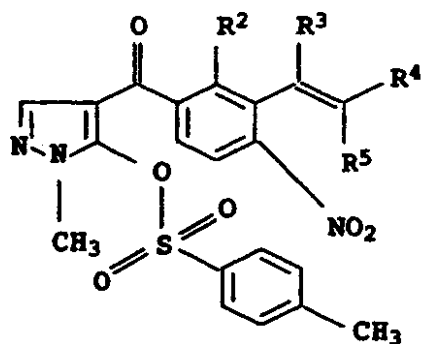
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がイソブチル及び $R^{15}$ がフェニルスルホニルである点で異なる化合物Ia225、特に化合物Ia225.001～Ia225.180が極めて好ましい：

30

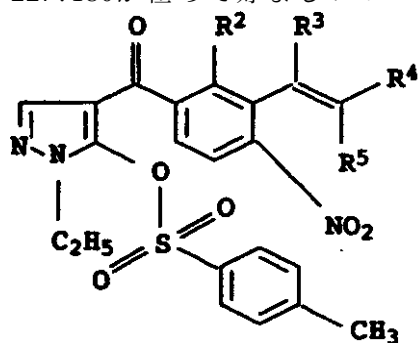
**Ia225**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ及び $R^{15}$ が4-メチルフェニルスルホニルである点で異なる化合物Ia226、特に化合物Ia226.001～Ia226.180が極めて好ましい：

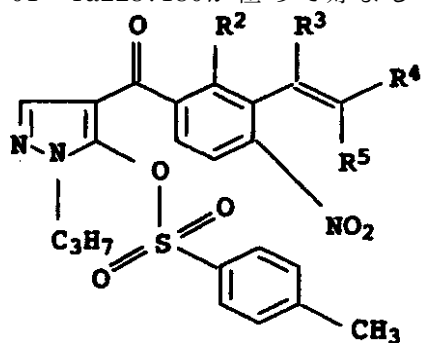
40

**Ia226**

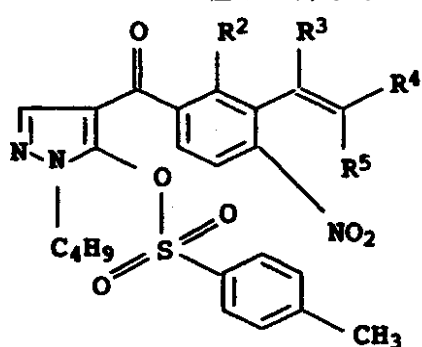
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がエチル及び $R^{15}$ が4-メチルフェニルスルホニルである点で異なる化合物Ia227、特に化合物Ia227.001～Ia227.180が極めて好ましい：

**Ia227**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がn-プロピル及び $R^{15}$ が4-メチルフェニルスルホニルである点で異なる化合物Ia228、特に化合物Ia228.01～Ia228.180が極めて好ましい：

**Ia228**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がn-ブチル及び $R^{15}$ が4-メチルフェニルスルホニルである点で異なる化合物Ia229、特に化合物Ia229.001～Ia229.180が極めて好ましい：

**Ia229**

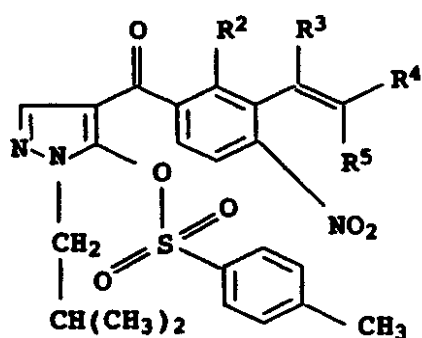
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がイソブチル及び $R^{15}$ が4-メチルフェニルスルホニルである点で異なる化合物Ia230、特に化合物Ia230.001～Ia230.180が極めて好ましい：

10

20

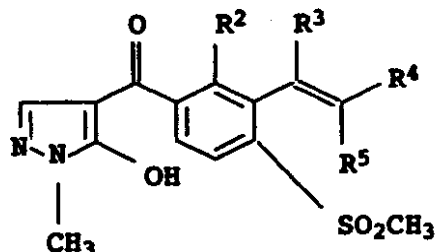
30

40

**Ia230**

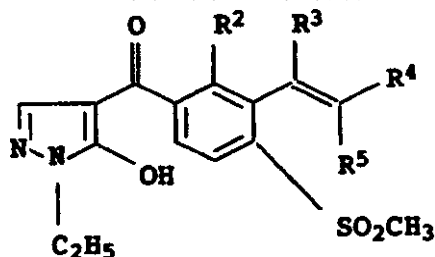
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニルである点で異なる化合物Ia231、特に化合物Ia231.001～Ia231.180が極めて好ましい：

10

**Ia231**

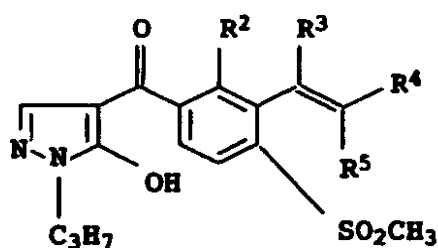
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル及び $R^{14}$ がエチルである点で異なる化合物Ia232、特に化合物Ia232.001～Ia232.180が極めて好ましい：

20

**Ia232**

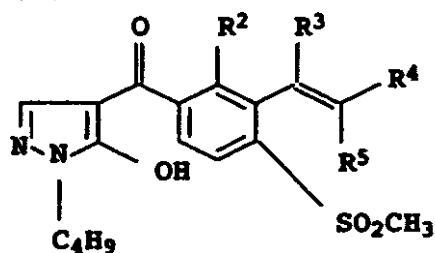
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル及び $R^{14}$ がn-プロピルである点で異なる化合物Ia233、特に化合物Ia233.001～Ia233.180が極めて好ましい：

30

**Ia233**

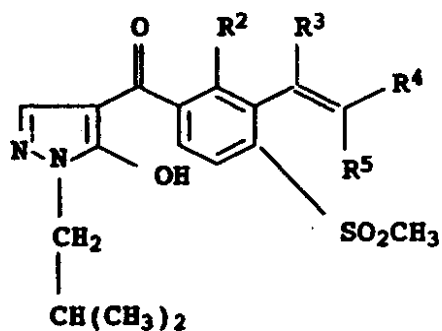
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル及び $R^{14}$ がn-ブチルである点で異なる化合物Ia234、特に化合物Ia234.001～Ia234.180が極めて好ましい：

40

**Ia234**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル及び $R^{14}$ がイソブチルである点で異なる化合物Ia235、特に化合物Ia235.001～Ia235.180が極めて好ましい：

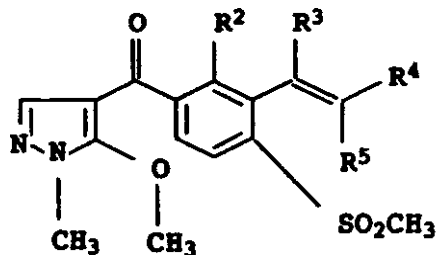
50



**Ia235**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、R<sup>1</sup>がメチルスルホニル及びR<sup>15</sup>がメチルである点で異なる化合物Ia236、特に化合物Ia236.001～Ia236.180が極めて好ましい：

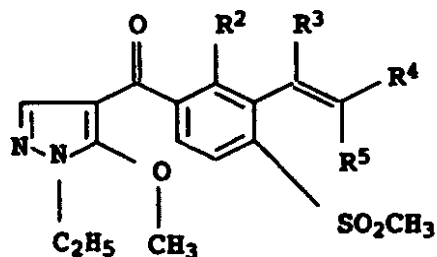
10



**Ia236**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、R<sup>1</sup>がメチルスルホニル、R<sup>14</sup>がエチル及びR<sup>15</sup>がメチルである点で異なる化合物Ia237、特に化合物Ia237.001～Ia237.180が極めて好ましい：

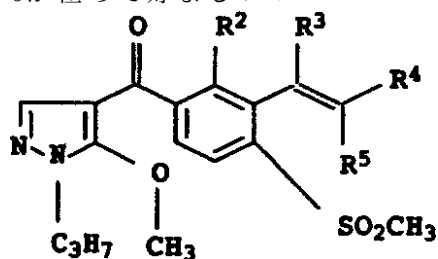
20



Ia237

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、R<sup>1</sup>がメチルスルホニル、R<sup>14</sup>がn-プロピル及びR<sup>15</sup>がメチルである点で異なる化合物Ia238、特に化合物Ia238.001～Ia238.180が極めて好ましい：

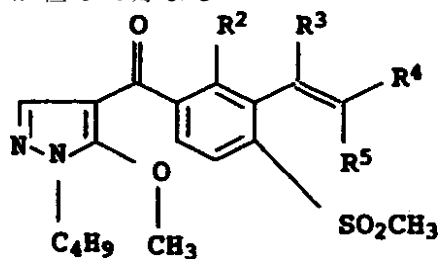
30



**Ia238**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、R<sup>1</sup>がメチルスルホニル、R<sup>14</sup>がn-ブチル及びR<sup>15</sup>がメチルである点で異なる化合物Ia239、特に化合物Ia239.001～Ia239.180が極めて好ましい：

40

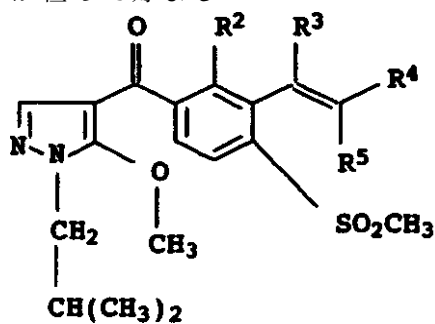


**Ia239**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、R<sup>1</sup>がメチルスルホニル、R<sup>14</sup>がイソブチル及びR<sup>15</sup>がメチルである点で異なる化合物Ia240、特に化合物Ia240.001～Ia240.180

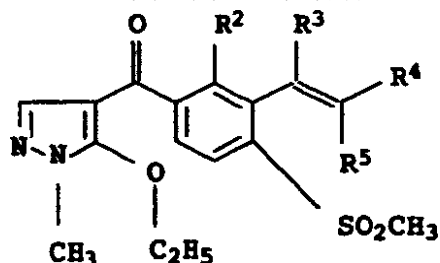
50

が極めて好ましい：



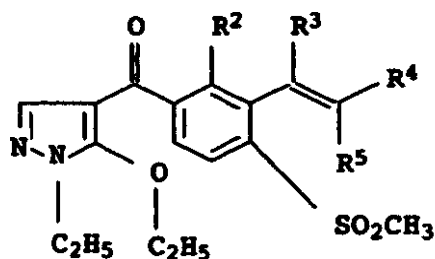
**Ia240**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル及び $R^{15}$ がエチルである点で異なる化合物Ia241、特に化合物Ia241.001～Ia241.180が極めて好ましい：



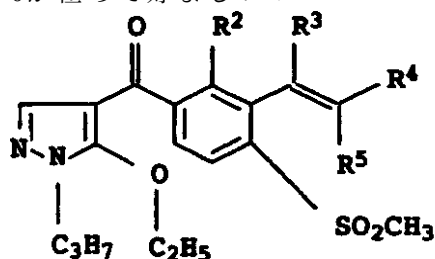
**Ia241**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ 及び $R^{15}$ がそれぞれエチルである点で異なる化合物Ia242、特に化合物Ia242.001～Ia242.180が極めて好ましい：



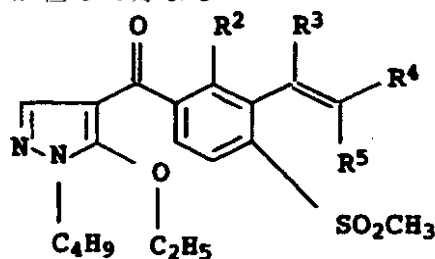
**Ia242**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がn-プロピル及び $R^{15}$ がエチルである点で異なる化合物Ia243、特に化合物Ia243.001～Ia243.180が極めて好ましい：



**Ia243**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がn-ブチル及び $R^{15}$ がエチルである点で異なる化合物Ia244、特に化合物Ia244.001～Ia244.180が極めて好ましい：



**Ia244**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がイソブチル及び $R^{15}$ がエチルである点で異なる化合物Ia245、特に化合物Ia245.001～Ia245.180

10

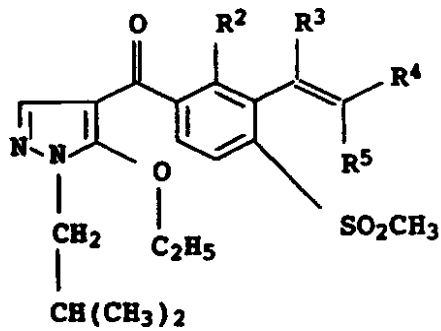
20

30

40

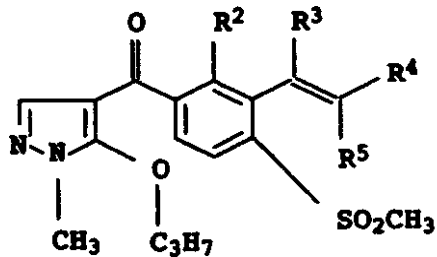
50

が極めて好ましい：



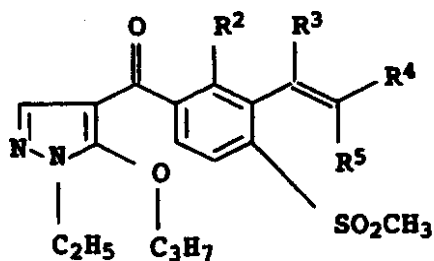
10

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル及び $R^{15}$ がn-プロピルである点で異なる化合物Ia246、特に化合物Ia246.001～Ia246.180が極めて好ましい：



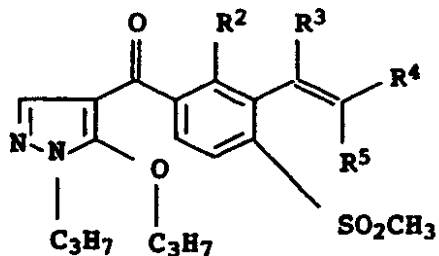
20

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がエチル及び $R^{15}$ がn-プロピルである点で異なる化合物Ia247、特に化合物Ia247.001～Ia247.180が極めて好ましい：



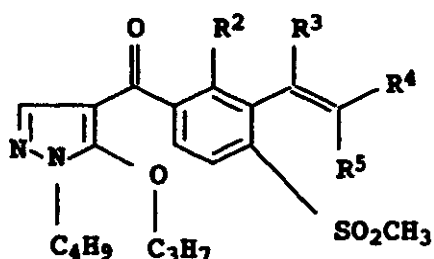
30

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ 及び $R^{15}$ がそれぞれn-プロピルである点で異なる化合物Ia248、特に化合物Ia248.001～Ia248.180が極めて好ましい：



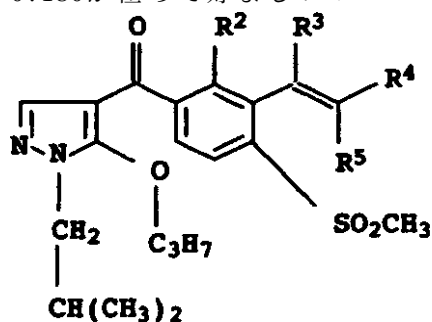
40

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がn-ブチル及び $R^{15}$ がn-プロピルである点で異なる化合物Ia249、特に化合物Ia249.001～Ia249.180が極めて好ましい：



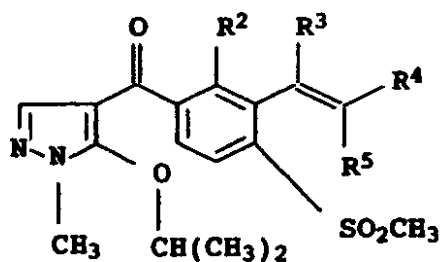
50

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がイソブチル及び $R^{15}$ がn-プロピルである点で異なる化合物Ia250、特に化合物Ia250.001～Ia250.180が極めて好ましい：

**Ia250**

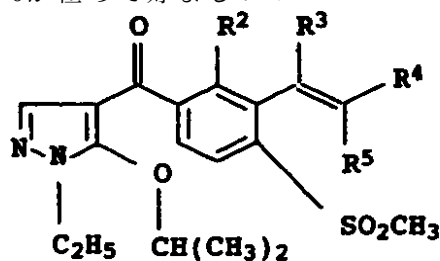
10

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル及び $R^{15}$ がイソプロピルである点で異なる化合物Ia251、特に化合物Ia251.001～Ia251.180が極めて好ましい：

**Ia251**

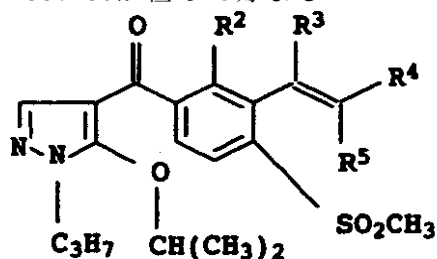
20

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がエチル及び $R^{15}$ がイソプロピルである点で異なる化合物Ia252、特に化合物Ia252.001～Ia252.180が極めて好ましい：

**Ia252**

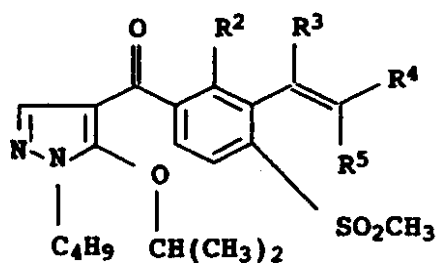
30

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がn-プロピル及び $R^{15}$ がイソプロピルである点で異なる化合物Ia253、特に化合物Ia253.001～Ia253.180が極めて好ましい：

**Ia253**

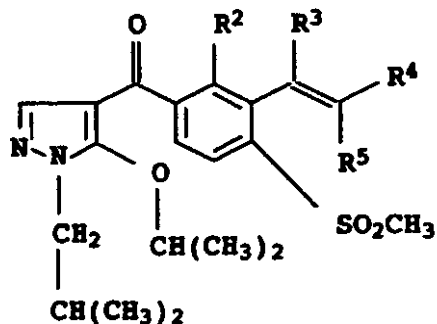
40

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がn-ブチル及び $R^{15}$ がイソプロピルである点で異なる化合物Ia254、特に化合物Ia254.001～Ia254.180が極めて好ましい：

**Ia254**

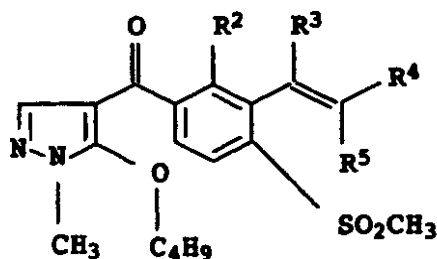
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がイソブチル及び $R^{15}$ がイソプロピルである点で異なる化合物Ia255、特に化合物Ia255.001～Ia255.180が極めて好ましい：

10

**Ia255**

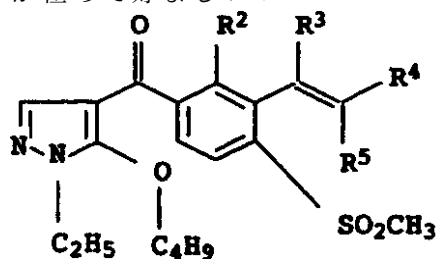
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル及び $R^{15}$ がn-ブチルである点で異なる化合物Ia256、特に化合物Ia256.001～Ia256.180が極めて好ましい：

20

**Ia256**

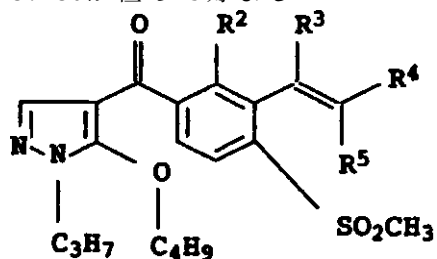
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がエチル及び $R^{15}$ がn-ブチルである点で異なる化合物Ia257、特に化合物Ia257.001～Ia257.180が極めて好ましい：

30

**Ia257**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がn-プロピル及び $R^{15}$ がn-ブチルである点で異なる化合物Ia258、特に化合物Ia258.001～Ia258.180が極めて好ましい：

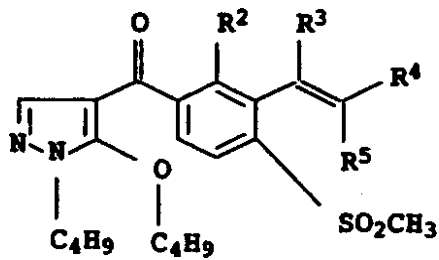
40

**Ia258**

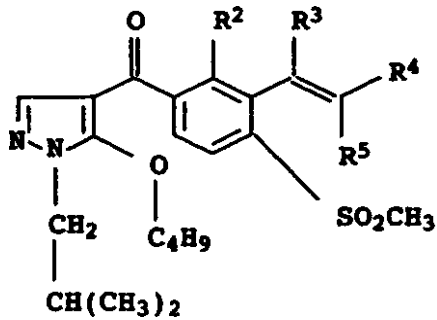
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ 及び $R^{15}$

50

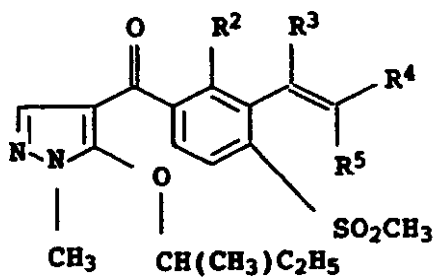
がそれぞれ *n*-ブチルである点で異なる化合物 Ia259、特に化合物 Ia259.001~Ia259.180 が極めて好ましい：

**Ia259**

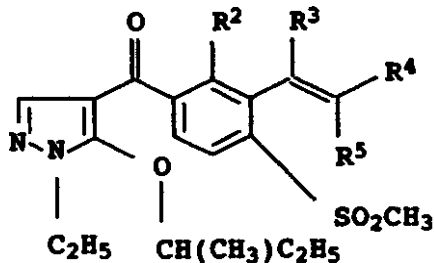
同様に、対応する化合物 Ia1.001~Ia1.180 とは、 $R^1$  がメチルスルホニル、 $R^{14}$  がイソブチル及び  $R^{15}$  が *n*-ブチルである点で異なる化合物 Ia260、特に化合物 Ia260.001~Ia260.180 が極めて好ましい：

**Ia260**

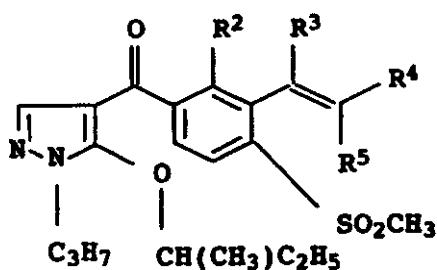
同様に、対応する化合物 Ia1.001~Ia1.180 とは、 $R^1$  がメチルスルホニル及び  $R^{15}$  が *sec*-ブチルである点で異なる化合物 Ia261、特に化合物 Ia261.001~Ia261.180 が極めて好ましい：

**Ia261**

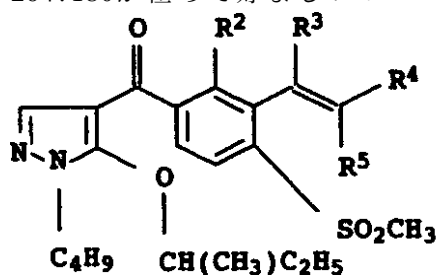
同様に、対応する化合物 Ia1.001~Ia1.180 とは、 $R^1$  がメチルスルホニル、 $R^{14}$  がエチル及び  $R^{15}$  が *sec*-ブチルである点で異なる化合物 Ia262、特に化合物 Ia262.001~Ia262.180 が極めて好ましい：

**Ia262**

同様に、対応する化合物 Ia1.001~Ia1.180 とは、 $R^1$  がメチルスルホニル、 $R^{14}$  が *n*-プロピル及び  $R^{15}$  が *sec*-ブチルである点で異なる化合物 Ia263、特に化合物 Ia263.001~Ia263.180 が極めて好ましい：

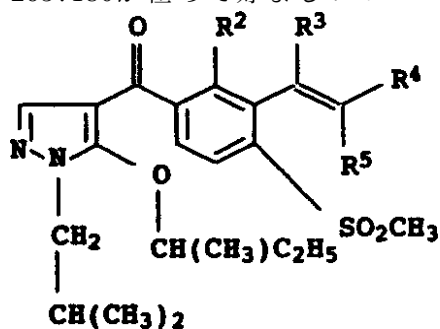
**Ia263**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がn-ブチル及び $R^{15}$ がsec-ブチルである点で異なる化合物Ia264、特に化合物Ia264.001～Ia264.180が極めて好ましい：



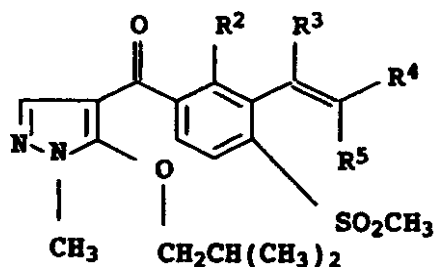
10

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がイソブチル及び $R^{15}$ がsec-ブチルである点で異なる化合物Ia265、特に化合物Ia265.001～Ia265.180が極めて好ましい：



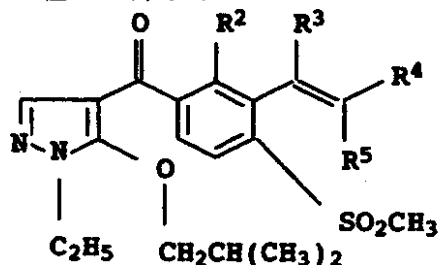
20

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル及び $R^{15}$ がイソブチルである点で異なる化合物Ia266、特に化合物Ia266.001～Ia266.180が極めて好ましい：



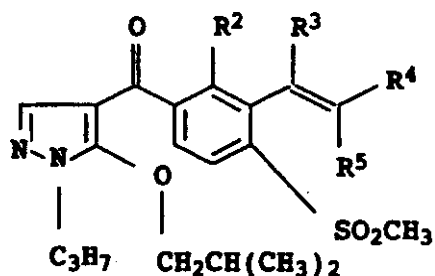
30

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がエチル及び $R^{15}$ がイソブチルである点で異なる化合物Ia267、特に化合物Ia267.001～Ia267.180が極めて好ましい：



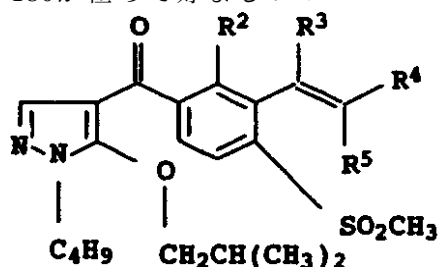
40

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がn-プロピル及び $R^{15}$ がイソブチルである点で異なる化合物Ia268、特に化合物Ia268.001～Ia268.180が極めて好ましい：

**Ia268**

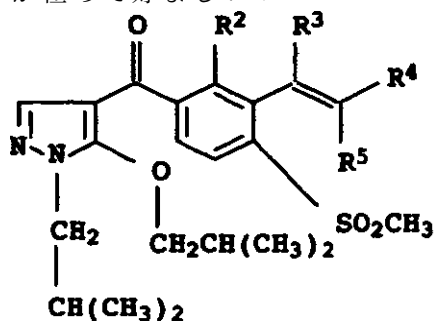
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がn-ブチル及び $R^{15}$ がイソブチルである点で異なる化合物Ia269、特に化合物Ia269.001～Ia269.180が極めて好ましい：

10

**Ia269**

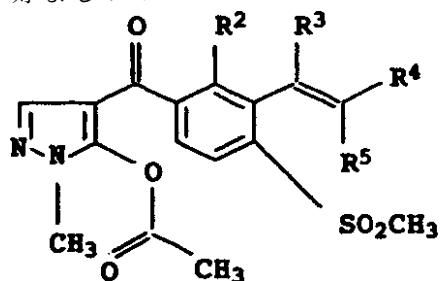
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ 及び $R^{15}$ がそれぞれイソブチルである点で異なる化合物Ia270、特に化合物Ia270.001～Ia270.180が極めて好ましい：

20

**Ia270**

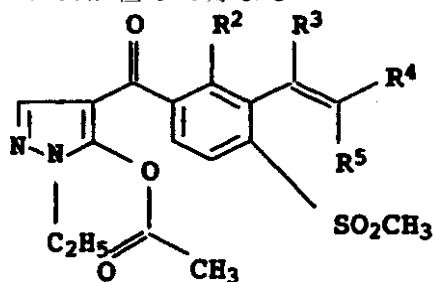
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル及び $R^{15}$ がメチルカルボニルである点で異なる化合物Ia271、特に化合物Ia271.001～Ia271.180が極めて好ましい：

30

**Ia271**

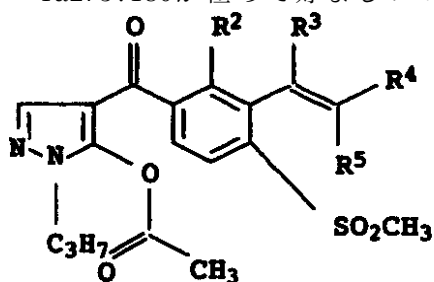
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がエチル及び $R^{15}$ がメチルカルボニルである点で異なる化合物Ia272、特に化合物Ia272.001～Ia272.180が極めて好ましい：

40

**Ia272**

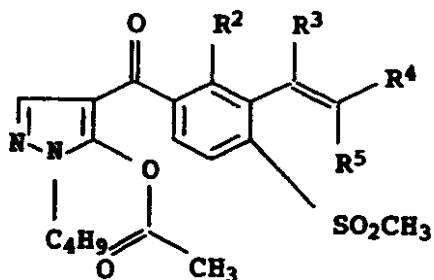
50

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がn-プロピル及び $R^{15}$ がメチルカルボニルである点で異なる化合物Ia273、特に化合物Ia273.001～Ia273.180が極めて好ましい：

**Ia273**

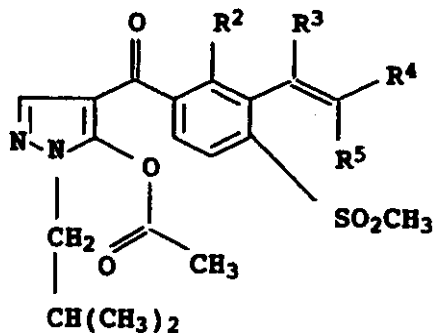
10

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がn-ブチル及び $R^{15}$ がメチルカルボニルである点で異なる化合物Ia274、特に化合物Ia274.001～Ia274.180が極めて好ましい：

**Ia274**

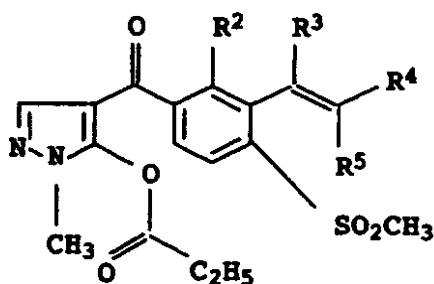
20

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がイソブチル及び $R^{15}$ がメチルカルボニルである点で異なる化合物Ia275、特に化合物Ia275.001～Ia275.180が極めて好ましい：

**Ia275**

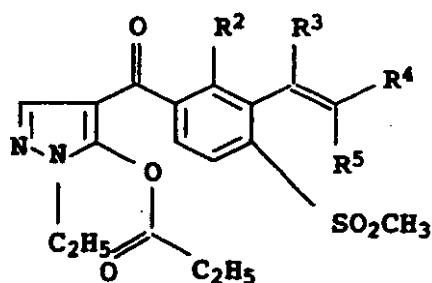
30

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル及び $R^{15}$ がエチルカルボニルである点で異なる化合物Ia276、特に化合物Ia276.001～Ia276.180が極めて好ましい：

**Ia276**

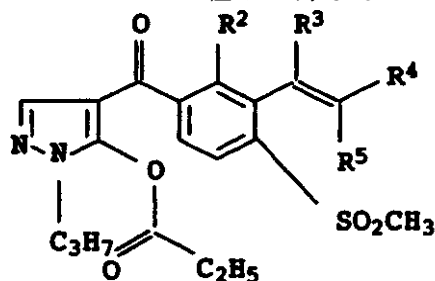
40

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がエチル及び $R^{15}$ がエチルカルボニルである点で異なる化合物Ia277、特に化合物Ia277.001～Ia277.180が極めて好ましい：

**Ia277**

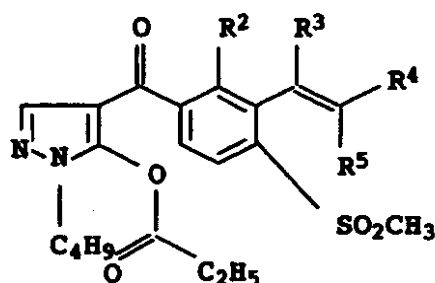
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がn-プロピル及び $R^{15}$ がエチルカルボニルである点で異なる化合物Ia278、特に化合物Ia278.001～Ia278.180が極めて好ましい：

10

**Ia278**

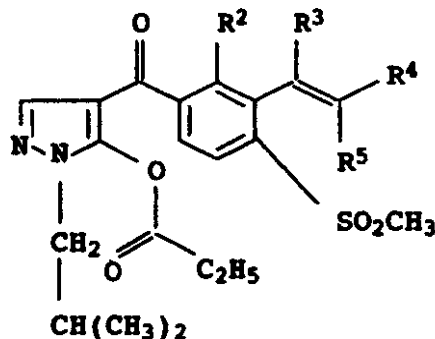
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がn-ブチル及び $R^{15}$ がエチルカルボニルである点で異なる化合物Ia279、特に化合物Ia279.001～Ia279.180が極めて好ましい：

20

**Ia279**

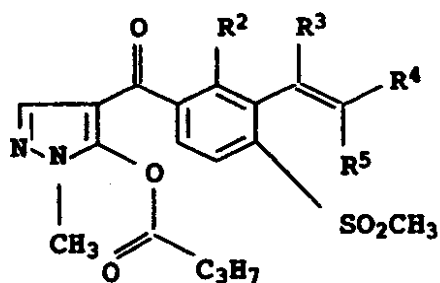
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がイソブチル及び $R^{15}$ がエチルカルボニルである点で異なる化合物Ia280、特に化合物Ia280.001～Ia280.180が極めて好ましい：

30

**Ia280**

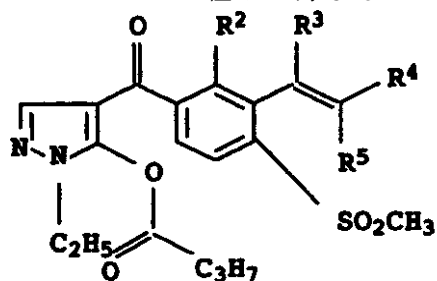
40

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル及び $R^{15}$ がn-プロピルカルボニルである点で異なる化合物Ia281、特に化合物Ia281.001～Ia281.180が極めて好ましい：

**Ia281**

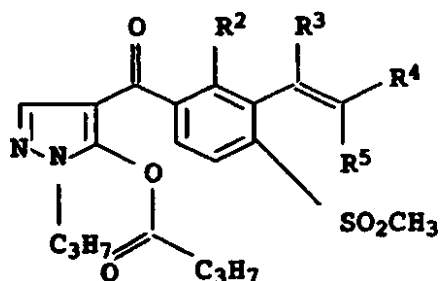
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がエチル及び $R^{15}$ がn-プロピルカルボニルである点で異なる化合物Ia282、特に化合物Ia282.001～Ia282.180が極めて好ましい：

10

**Ia282**

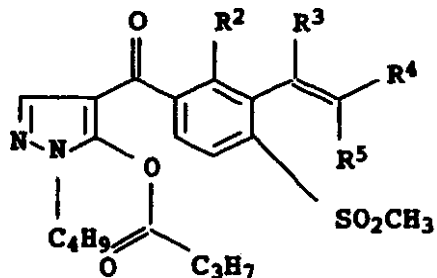
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がn-プロピル及び $R^{15}$ がn-プロピルカルボニルである点で異なる化合物Ia283、特に化合物Ia283.001～Ia283.180が極めて好ましい：

20

**Ia283**

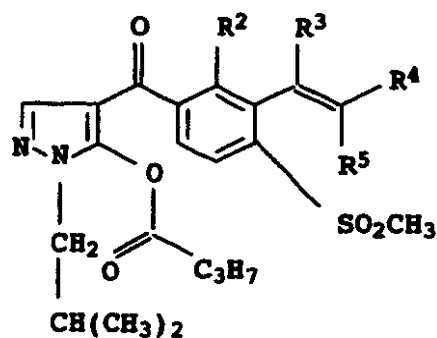
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がn-ブチル及び $R^{15}$ がn-プロピルカルボニルである点で異なる化合物Ia284、特に化合物Ia284.001～Ia284.180が極めて好ましい：

30

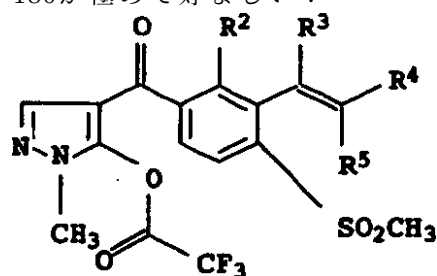
**Ia284**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がイソブチル及び $R^{15}$ がn-プロピルカルボニルである点で異なる化合物Ia285、特に化合物Ia285.001～Ia285.180が極めて好ましい：

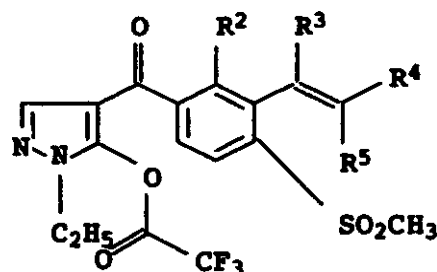
40

**Ia285**

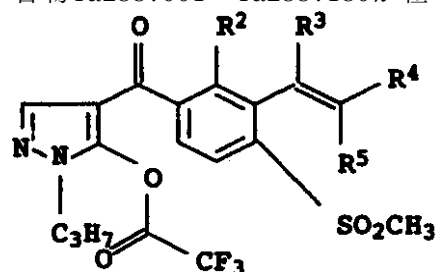
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル及び $R^{15}$ がトリフルオロメチルカルボニルである点で異なる化合物Ia286、特に化合物Ia286.001～Ia286.180が極めて好ましい：

**Ia286**

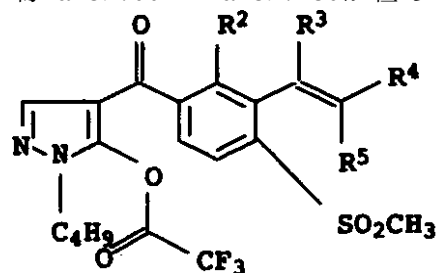
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がエチル及び $R^{15}$ がトリフルオロメチルカルボニルである点で異なる化合物Ia287、特に化合物Ia287.001～Ia287.180が極めて好ましい：

**Ia287**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がn-プロピル及び $R^{15}$ がトリフルオロメチルカルボニルである点で異なる化合物Ia288、特に化合物Ia288.001～Ia288.180が極めて好ましい：

**Ia288**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がn-ブチル及び $R^{15}$ がトリフルオロメチルカルボニルである点で異なる化合物Ia289、特に化合物Ia289.001～Ia289.180が極めて好ましい：

**Ia289**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がイソブ

10

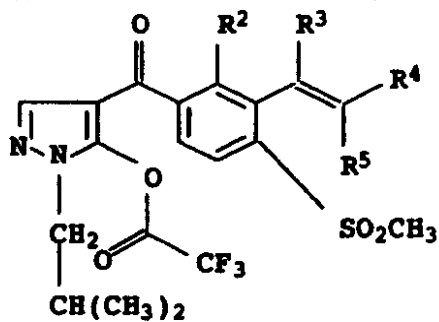
20

30

40

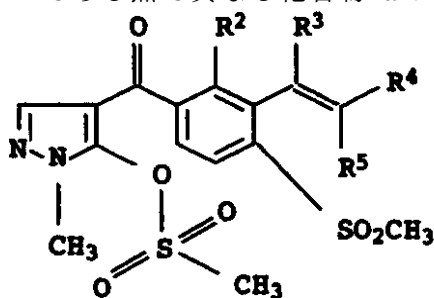
50

チル及び  $R^{15}$  がトリフルオロメチルカルボニルである点で異なる化合物 Ia290、特に化合物 Ia290.001～Ia290.180 が極めて好ましい：

**Ia290**

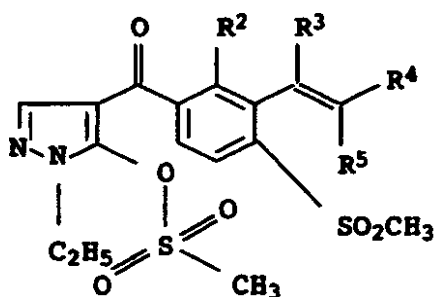
10

同様に、対応する化合物 Ia1.001～Ia1.180 とは、 $R^1$  及び  $R^{15}$  がそれぞれメチルスルホニルである点で異なる化合物 Ia291、特に化合物 Ia291.001～Ia291.180 が極めて好ましい：

**Ia291**

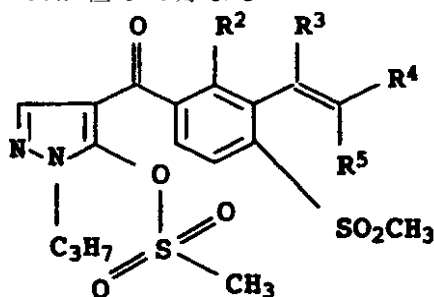
20

同様に、対応する化合物 Ia1.001～Ia1.180 とは、 $R^1$  及び  $R^{15}$  がそれぞれメチルスルホニル及び  $R^{14}$  がエチルである点で異なる化合物 Ia292、特に化合物 Ia292.001～Ia292.180 が極めて好ましい：

**Ia292**

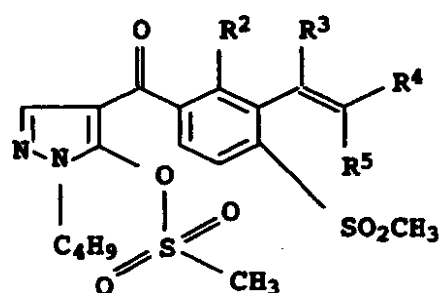
30

同様に、対応する化合物 Ia1.001～Ia1.180 とは、 $R^1$  及び  $R^{15}$  がそれぞれメチルスルホニル及び  $R^{14}$  が *n*-プロピルである点で異なる化合物 Ia293、特に化合物 Ia293.001～Ia293.180 が極めて好ましい：

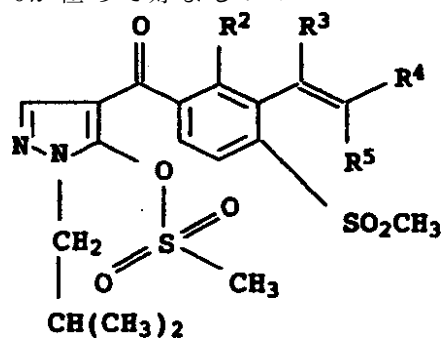
**Ia293**

40

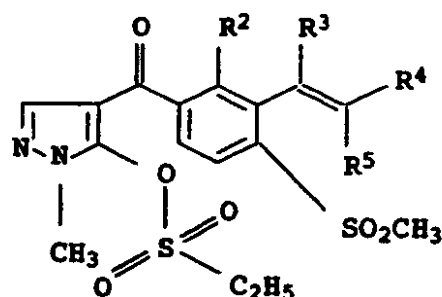
同様に、対応する化合物 Ia1.001～Ia1.180 とは、 $R^1$  及び  $R^{15}$  がそれぞれメチルスルホニル及び  $R^{14}$  が *n*-ブチルである点で異なる化合物 Ia294、特に化合物 Ia294.001～Ia294.180 が極めて好ましい：

**Ia294**

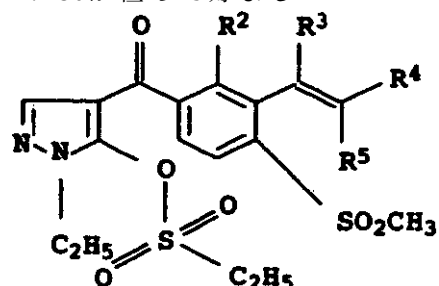
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ 及び $R^{15}$ がそれぞれメチルスルホニル及び $R^{14}$ がイソブチルである点で異なる化合物Ia295、特に化合物Ia295.001～Ia295.180が極めて好ましい：

**Ia295**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル及び $R^{15}$ がエチルスルホニルである点で異なる化合物Ia296、特に化合物Ia296.001～Ia296.180が極めて好ましい：

**Ia296**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がエチル及び $R^{15}$ がエチルスルホニルである点で異なる化合物Ia297、特に化合物Ia297.001～Ia297.180が極めて好ましい：

**Ia297**

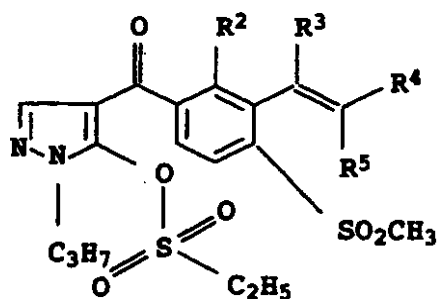
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がn-プロピル及び $R^{15}$ がエチルスルホニルである点で異なる化合物Ia298、特に化合物Ia298.001～Ia298.180が極めて好ましい：

10

20

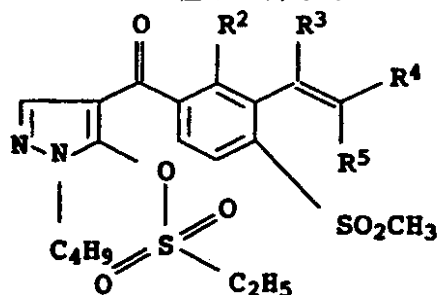
30

40

**Ia298**

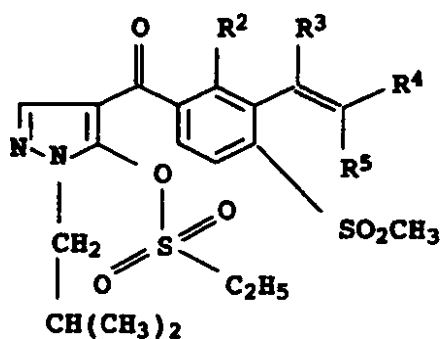
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がn-ブチル及び $R^{15}$ がエチルスルホニルである点で異なる化合物Ia299、特に化合物Ia299.001～

10

**Ia299**

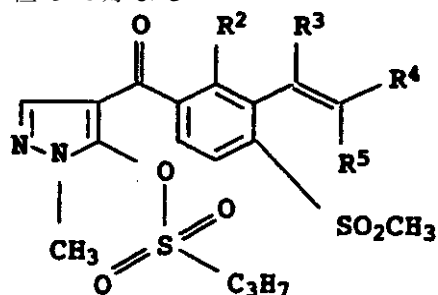
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がイソブチル及び $R^{15}$ がエチルスルホニルである点で異なる化合物Ia300、特に化合物Ia300.001～

20

**Ia300**

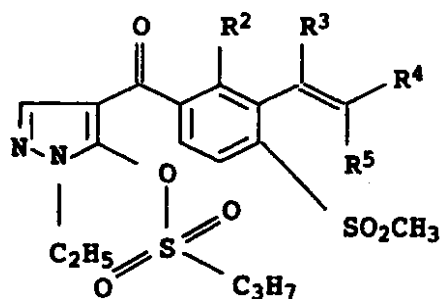
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル及び $R^{15}$ がn-プロピルスルホニルである点で異なる化合物Ia301、特に化合物Ia301.001～Ia301.180が極めて好ましい：

30

**Ia301**

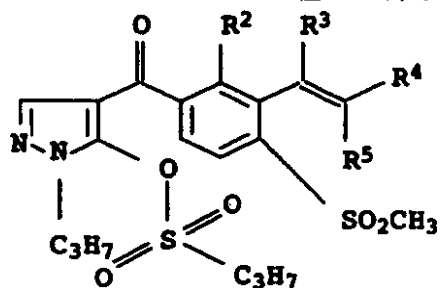
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がエチル及び $R^{15}$ がn-プロピルスルホニルである点で異なる化合物Ia302、特に化合物Ia302.001～Ia302.180が極めて好ましい：

40

**Ia302**

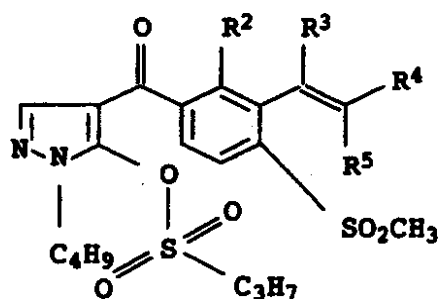
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がn-プロピル及び $R^{15}$ がn-プロピルスルホニルである点で異なる化合物Ia303、特に化合物Ia303.001～Ia303.180が極めて好ましい：

10

**Ia303**

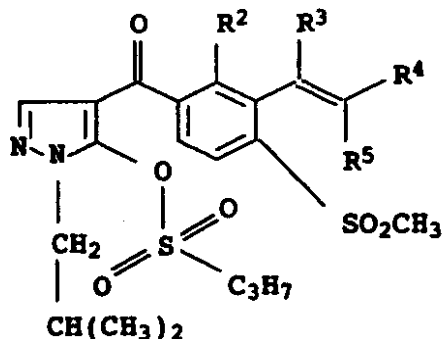
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がn-ブチル及び $R^{15}$ がn-プロピルスルホニルである点で異なる化合物Ia304、特に化合物Ia304.001～Ia304.180が極めて好ましい：

20

**Ia304**

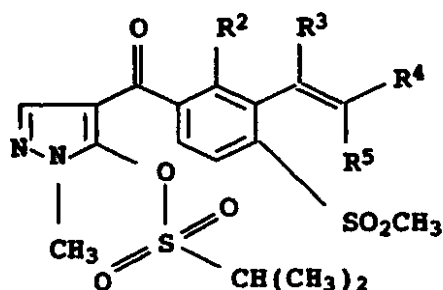
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がイソブチル及び $R^{15}$ がn-プロピルスルホニルである点で異なる化合物Ia305、特に化合物Ia305.001～Ia305.180が極めて好ましい：

30

**Ia305**

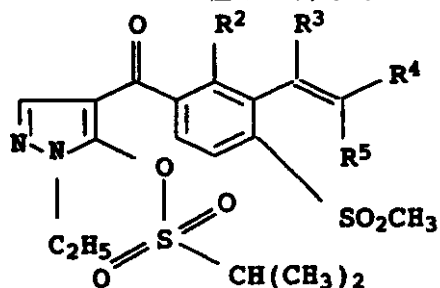
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル及び $R^{15}$ がイソプロピルスルホニルである点で異なる化合物Ia306、特に化合物Ia306.001～Ia306.180が極めて好ましい：

40

**Ia306**

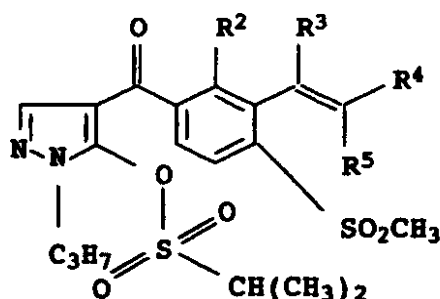
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がエチル及び $R^{15}$ がイソプロピルスルホニルである点で異なる化合物Ia307、特に化合物Ia307.001～Ia307.180が極めて好ましい：

10

**Ia307**

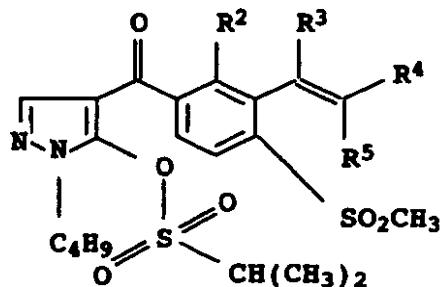
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がn-プロピル及び $R^{15}$ がイソプロピルスルホニルである点で異なる化合物Ia308、特に化合物Ia308.001～Ia308.180が極めて好ましい：

20

**Ia308**

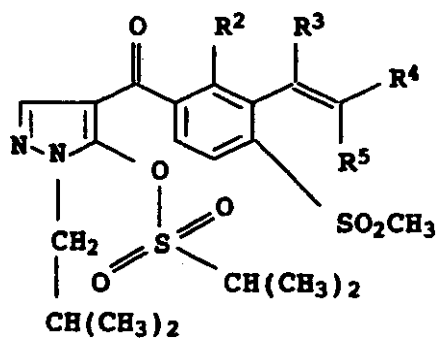
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がn-ブチル及び $R^{15}$ がイソプロピルスルホニルである点で異なる化合物Ia309、特に化合物Ia309.001～Ia309.180が極めて好ましい：

30

**Ia309**

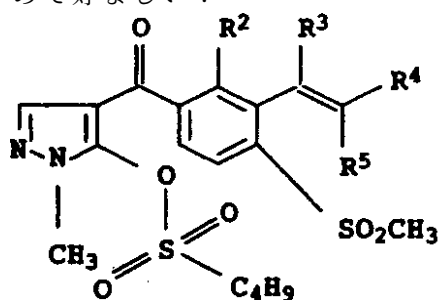
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がイソブチル及び $R^{15}$ がイソプロピルスルホニルである点で異なる化合物Ia310、特に化合物Ia310.001～Ia310.180が極めて好ましい：

40

**Ia310**

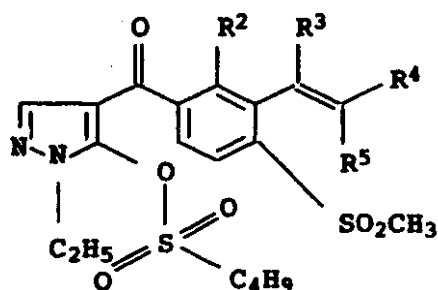
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル及び $R^{15}$ がn-ブチルスルホニルである点で異なる化合物Ia311、特に化合物Ia311.001～Ia311.180が極めて好ましい：

10

**Ia311**

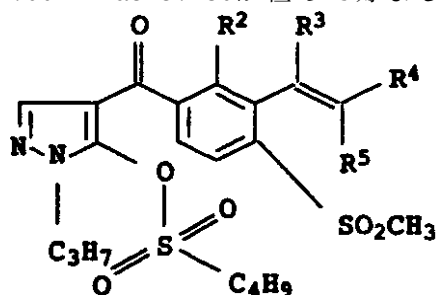
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がエチル及び $R^{15}$ がn-ブチルスルホニルである点で異なる化合物Ia312、特に化合物Ia312.001～Ia312.180が極めて好ましい：

20

**Ia312**

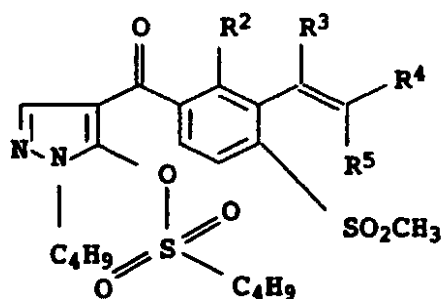
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がn-プロピル及び $R^{15}$ がn-ブチルスルホニルである点で異なる化合物Ia313、特に化合物Ia313.001～Ia313.180が極めて好ましい：

30

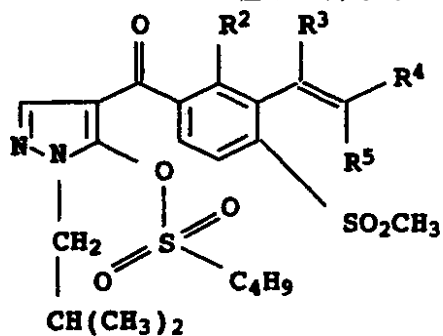
**Ia313**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がn-ブチル及び $R^{15}$ がn-ブチルスルホニルである点で異なる化合物Ia314、特に化合物Ia314.001～Ia314.180が極めて好ましい：

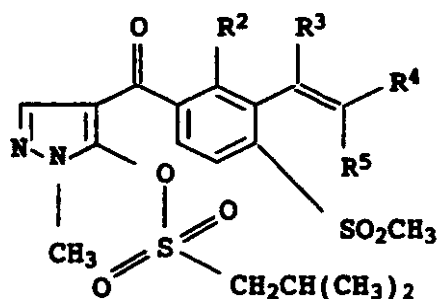
40

**Ia314**

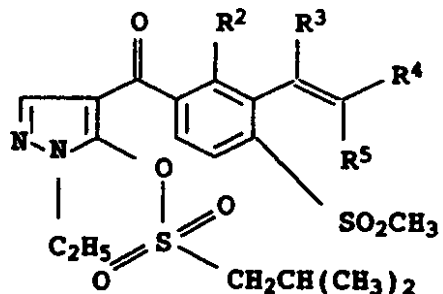
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がイソブチル及び $R^{15}$ がn-ブチルスルホニルである点で異なる化合物Ia315、特に化合物Ia315.01～Ia315.180が極めて好ましい：

**Ia315**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル及び $R^{15}$ がイソブチルスルホニルである点で異なる化合物Ia316、特に化合物Ia316.001～Ia316.180が極めて好ましい：

**Ia316**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がエチル及び $R^{15}$ がイソブチルスルホニルである点で異なる化合物Ia317、特に化合物Ia317.001～Ia317.180が極めて好ましい：

**Ia317**

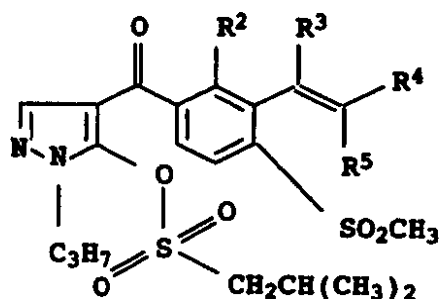
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がn-プロピル及び $R^{15}$ がイソブチルスルホニルである点で異なる化合物Ia318、特に化合物Ia318.001～Ia318.180が極めて好ましい：

10

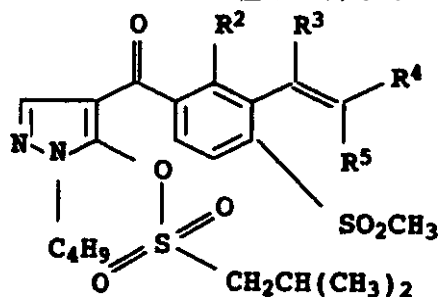
20

30

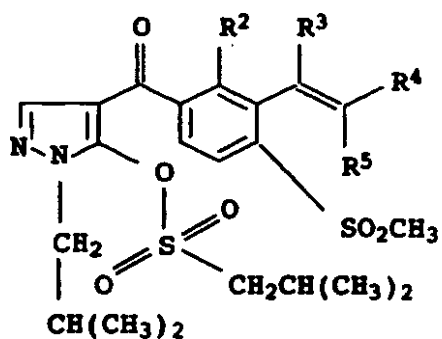
40

**Ia318**

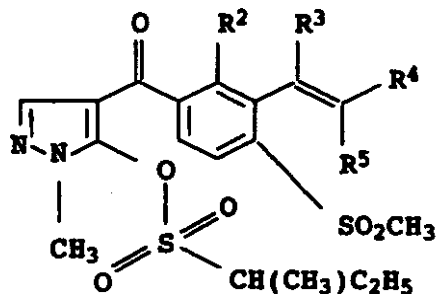
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がn-ブチル及び $R^{15}$ がイソブチルスルホニルである点で異なる化合物Ia319、特に化合物Ia319.01～Ia319.180が極めて好ましい： 10

**Ia319**

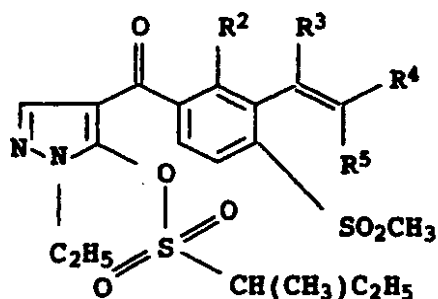
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がイソブチル及び $R^{15}$ がイソブチルスルホニルである点で異なる化合物Ia320、特に化合物Ia320.01～Ia320.180が極めて好ましい： 20

**Ia320**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル及び $R^{15}$ がsec-ブチルスルホニルである点で異なる化合物Ia321、特に化合物Ia321.001～Ia321.180が極めて好ましい： 30

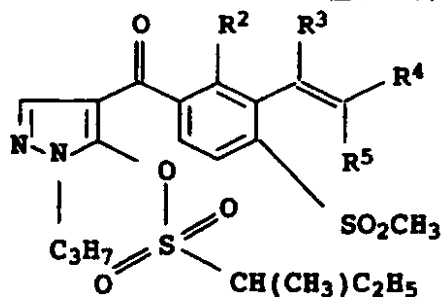
**Ia321**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がエチル及び $R^{15}$ がsec-ブチルスルホニルである点で異なる化合物Ia322、特に化合物Ia322.01～Ia322.180が極めて好ましい： 40

**Ia322**

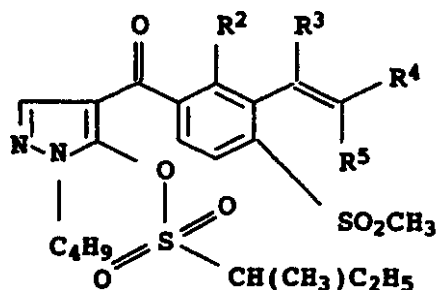
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がn-プロピル及び $R^{15}$ がsec-ブチルスルホニルである点で異なる化合物Ia323、特に化合物Ia323.001～Ia323.180が極めて好ましい：

10

**Ia323**

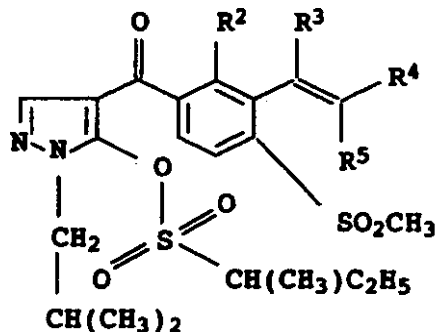
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がn-ブチル及び $R^{15}$ がsec-ブチルスルホニルである点で異なる化合物Ia324、特に化合物Ia324.001～Ia324.180が極めて好ましい：

20

**Ia324**

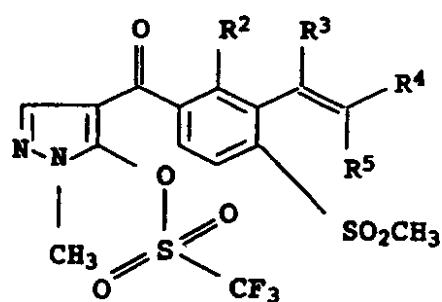
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がイソブチル及び $R^{15}$ がsec-ブチルスルホニルである点で異なる化合物Ia325、特に化合物Ia325.001～Ia325.180が極めて好ましい：

30

**Ia325**

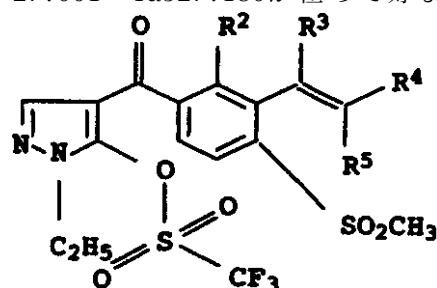
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル及び $R^{15}$ がトリフルオロメチルスルホニルである点で異なる化合物Ia326、特に化合物Ia326.001～Ia326.180が極めて好ましい：

40

**Ia326**

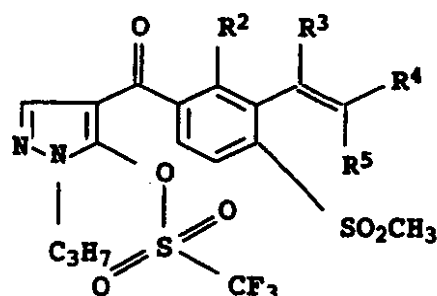
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がエチル及び $R^{15}$ がトリフルオロメチルスルホニルである点で異なる化合物Ia327、特に化合物Ia327.001～Ia327.180が極めて好ましい：

10

**Ia327**

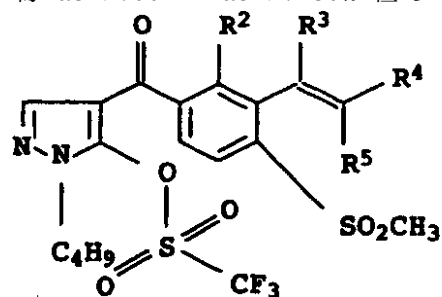
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がn-プロピル及び $R^{15}$ がトリフルオロメチルスルホニルである点で異なる化合物Ia328、特に化合物Ia328.001～Ia328.180が極めて好ましい：

20

**Ia328**

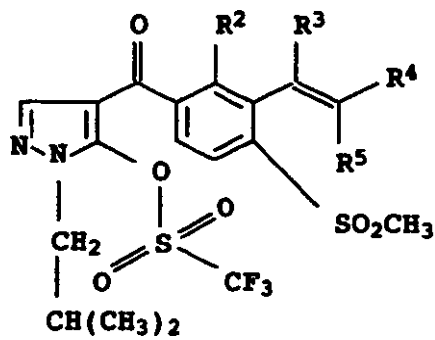
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がn-ブチル及び $R^{15}$ がトリフルオロメチルスルホニルである点で異なる化合物Ia329、特に化合物Ia329.001～Ia329.180が極めて好ましい：

30

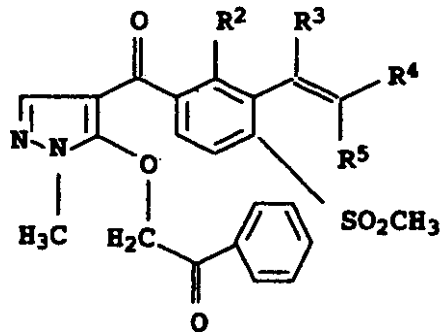
**Ia329**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がイソブチル及び $R^{15}$ がトリフルオロメチルスルホニルである点で異なる化合物Ia330、特に化合物Ia330.001～Ia330.180が極めて好ましい：

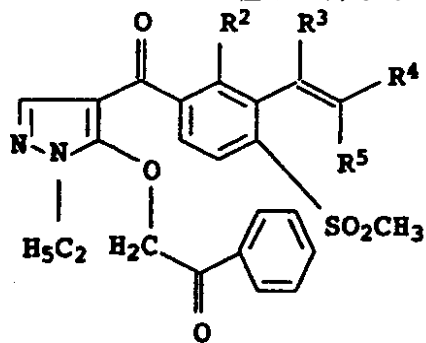
40

**Ia330**

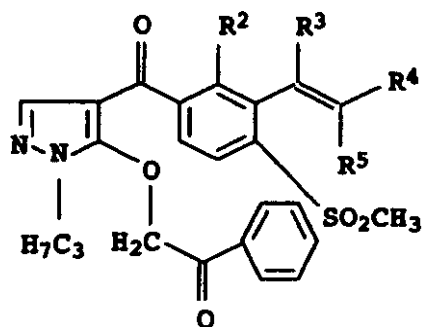
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル及び $R^{15}$ がフェニルカルボニルメチルである点で異なる化合物Ia331、特に化合物Ia331.001～Ia331.180が極めて好ましい：

**Ia331**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がエチル及び $R^{15}$ がフェニルカルボニルメチルである点で異なる化合物Ia332、特に化合物Ia332.01～Ia332.180が極めて好ましい：

**Ia332**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がn-プロピル及び $R^{15}$ がフェニルカルボニルメチルである点で異なる化合物Ia333、特に化合物Ia333.001～Ia333.180が極めて好ましい：

**Ia333**

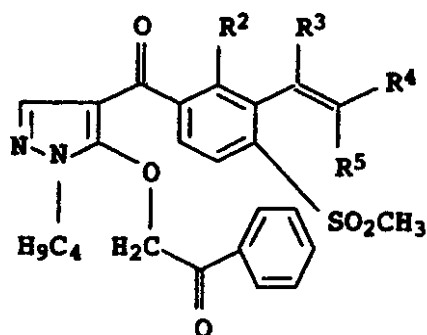
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がn-ブチル及び $R^{15}$ がフェニルカルボニルメチルである点で異なる化合物Ia334、特に化合物Ia334.001～Ia334.180が極めて好ましい：

10

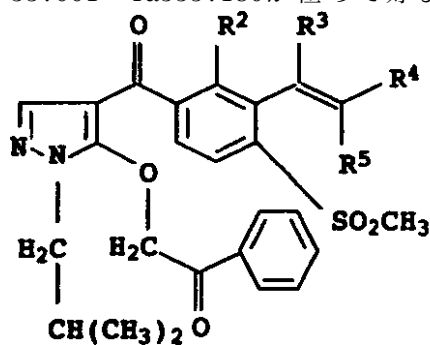
20

30

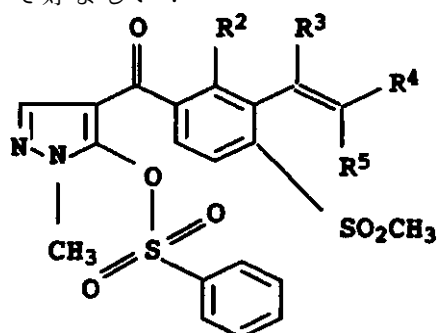
40

**Ia334**

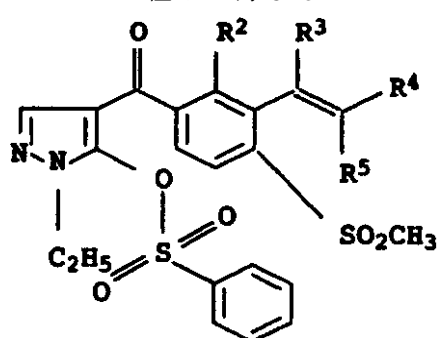
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がイソブチル及び $R^{15}$ がフェニルカルボニルメチルである点で異なる化合物Ia335、特に化合物Ia335.001～Ia335.180が極めて好ましい：

**Ia335**

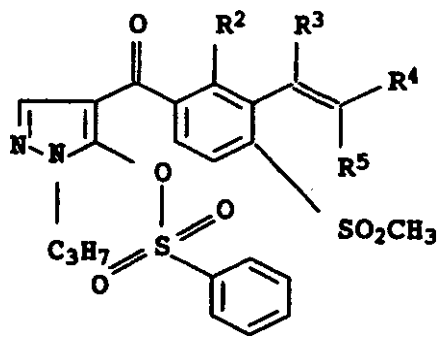
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル及び $R^{15}$ がフェニルスルホニルである点で異なる化合物Ia336、特に化合物Ia336.001～Ia336.180が極めて好ましい：

**Ia336**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がエチル及び $R^{15}$ がフェニルスルホニルである点で異なる化合物Ia337、特に化合物Ia337.001～Ia337.180が極めて好ましい：

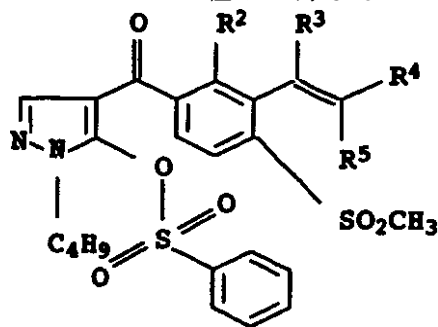
**Ia337**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がn-プロピル及び $R^{15}$ がフェニルスルホニルである点で異なる化合物Ia338、特に化合物Ia338.01～Ia338.180が極めて好ましい：

**Ia338**

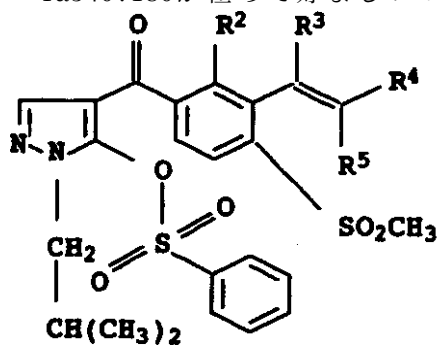
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がn-ブチル及び $R^{15}$ がフェニルスルホニルである点で異なる化合物Ia339、特に化合物Ia339.001～Ia339.180が極めて好ましい：

10

**Ia339**

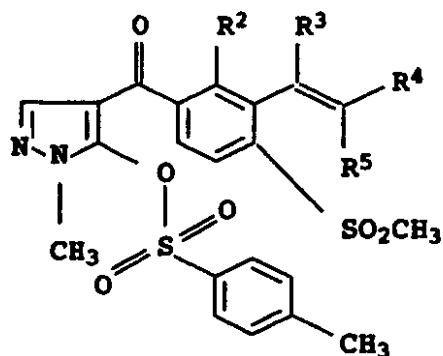
20

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がイソブチル及び $R^{15}$ がフェニルスルホニルである点で異なる化合物Ia340、特に化合物Ia340.001～Ia340.180が極めて好ましい：

**Ia340**

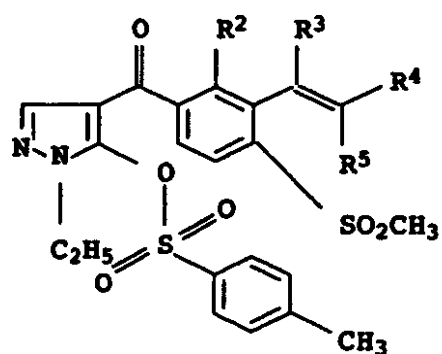
30

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル及び $R^{15}$ が4-メチルフェニルスルホニルである点で異なる化合物Ia341、特に化合物Ia341.001～Ia341.180が極めて好ましい：

**Ia341**

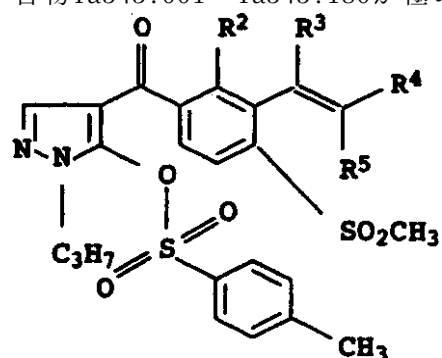
40

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がエチル及び $R^{15}$ が4-メチルフェニルスルホニルである点で異なる化合物Ia342、特に化合物Ia342.001～Ia342.180が極めて好ましい：

**Ia342**

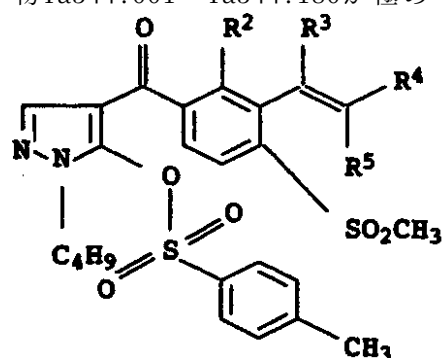
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がn-プロピル及び $R^{15}$ が4-メチルフェニルスルホニルである点で異なる化合物Ia343、特に化合物Ia343.001～Ia343.180が極めて好ましい：

10

**Ia343**

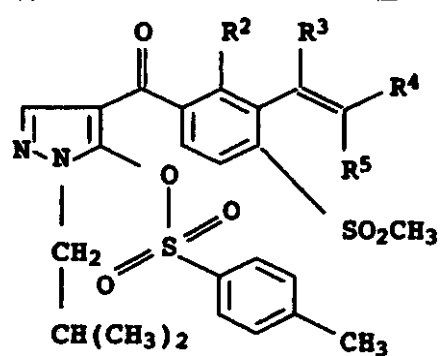
20

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がn-ブチル及び $R^{15}$ が4-メチルフェニルスルホニルである点で異なる化合物Ia344、特に化合物Ia344.001～Ia344.180が極めて好ましい：

**Ia344**

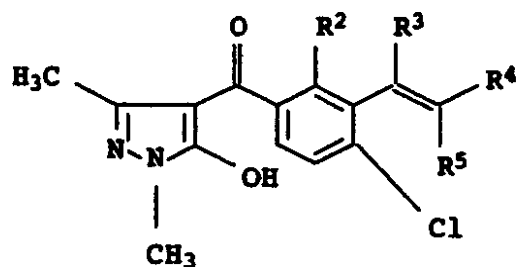
30

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がイソブチル及び $R^{15}$ が4-メチルフェニルスルホニルである点で異なる化合物Ia345、特に化合物Ia345.001～Ia345.180が極めて好ましい：

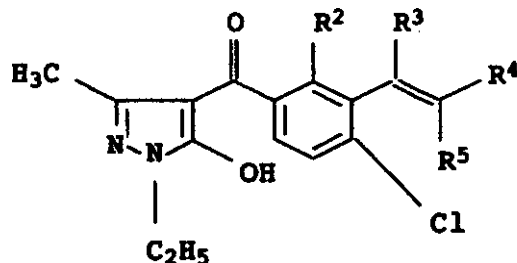
**Ia345**

40

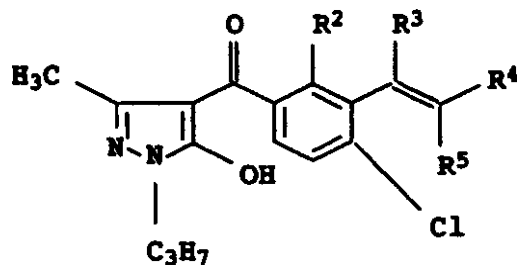
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia346、特に化合物Ia346.001～Ia346.180が極めて好ましい：

**Ia346**

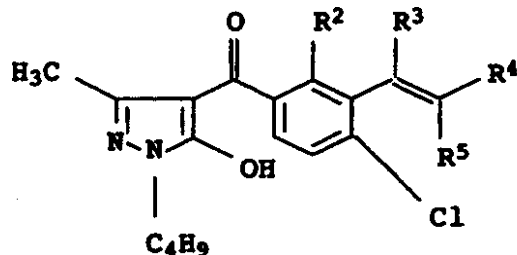
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がエチル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia347、特に化合物Ia347.001～Ia347.180が極めて好ましい：

**Ia347**

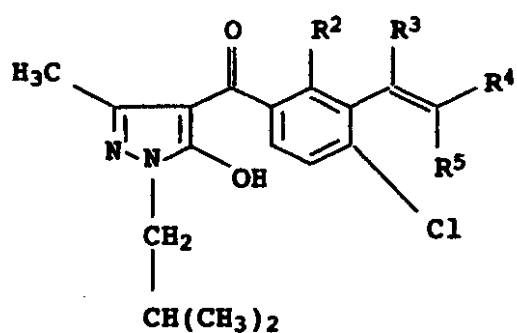
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がn-プロピル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia348、特に化合物Ia348.001～Ia348.180が極めて好ましい：

**Ia348**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がn-ブチル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia349、特に化合物Ia349.001～Ia349.180が極めて好ましい：

**Ia349**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がイソブチル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia350、特に化合物Ia350.001～Ia350.180が極めて好ましい：

**Ia350**

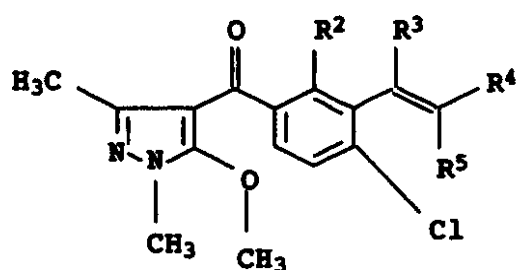
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{15}$ 及び $R^{16}$ がそれぞれメチルである点で異なる化合物Ia351、特に化合物Ia351.001～Ia351.180が極めて好ましい：

10

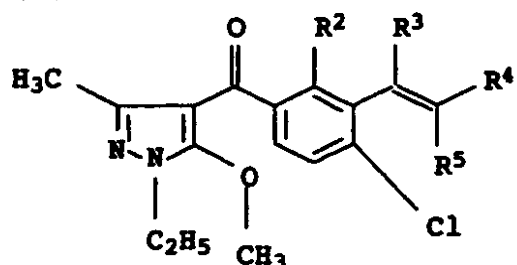
20

30

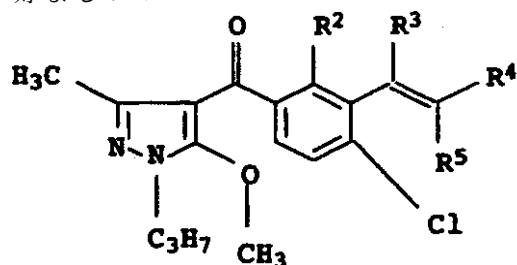
40

**Ia351**

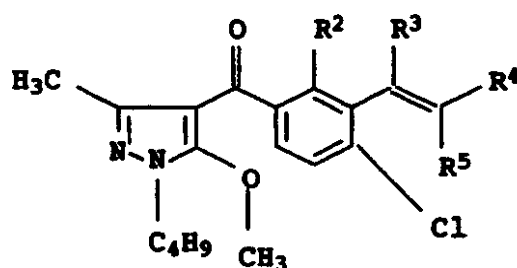
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がエチル、 $R^{15}$ 及び $R^{16}$ がそれぞれメチルである点で異なる化合物Ia352、特に化合物Ia352.001～Ia352.180が極めて好ましい：

**Ia352**

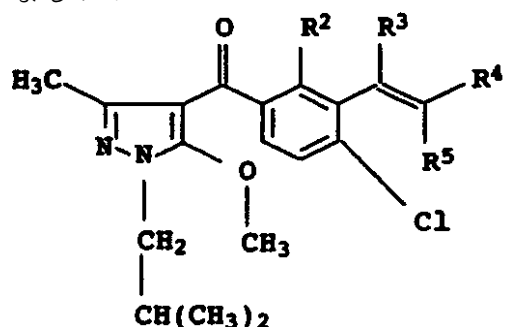
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がn-プロピル、 $R^{15}$ 及び $R^{16}$ がそれぞれメチルである点で異なる化合物Ia353、特に化合物Ia353.001～Ia353.180が極めて好ましい：

**Ia353**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がn-ブチル、 $R^{15}$ 及び $R^{16}$ がそれぞれメチルである点で異なる化合物Ia354、特に化合物Ia354.001～Ia354.180が極めて好ましい：

**Ia354**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がイソブチル、 $R^{15}$ 及び $R^{16}$ がそれぞれメチルである点で異なる化合物Ia355、特に化合物Ia355.001～Ia355.180が極めて好ましい：

**Ia355**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{15}$ がエチル及び $R^{16}$ がメチルである点

10

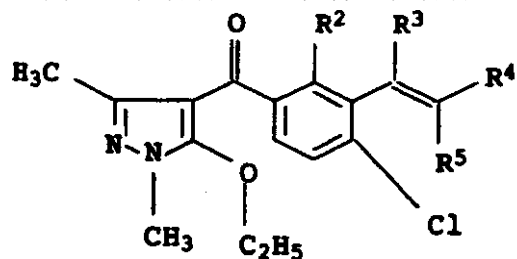
20

30

40

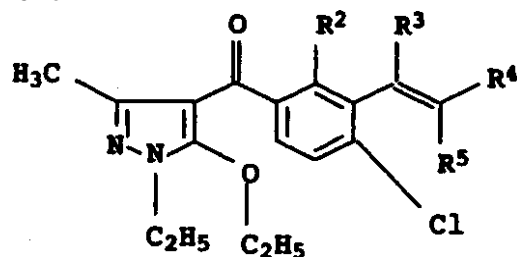
50

で異なる化合物Ia356、特に化合物Ia356.001～Ia356.180が極めて好ましい：



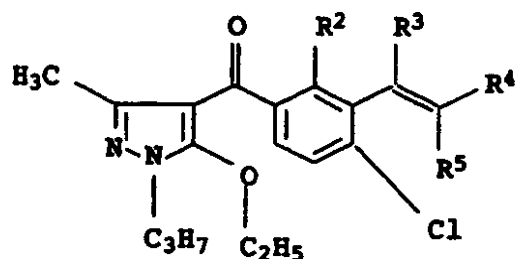
**Ia356**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ 及び $R^{15}$ がそれぞれエチル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia357、特に化合物Ia357.001～Ia357.180が極めて好ましい：



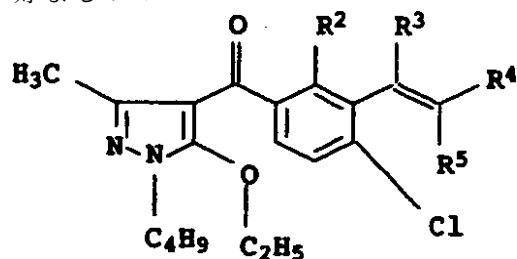
**Ia357**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がn-プロピル、 $R^{15}$ がエチル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia358、特に化合物Ia358.001～Ia358.180が極めて好ましい：



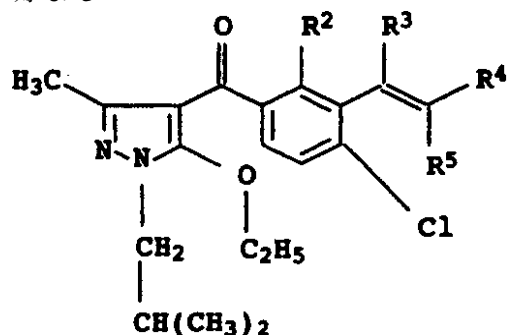
**Ia358**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がn-ブチル、 $R^{15}$ がエチル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia359、特に化合物Ia359.001～Ia359.180が極めて好ましい：



**Ia359**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がイソブチル、 $R^{15}$ がエチル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia360、特に化合物Ia360.001～Ia360.180が極めて好ましい：



**Ia360**

10

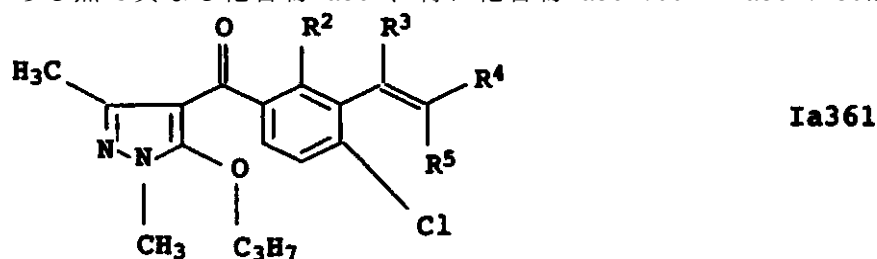
20

30

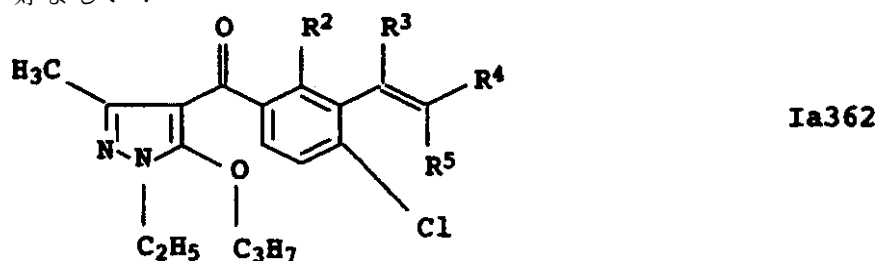
40

50

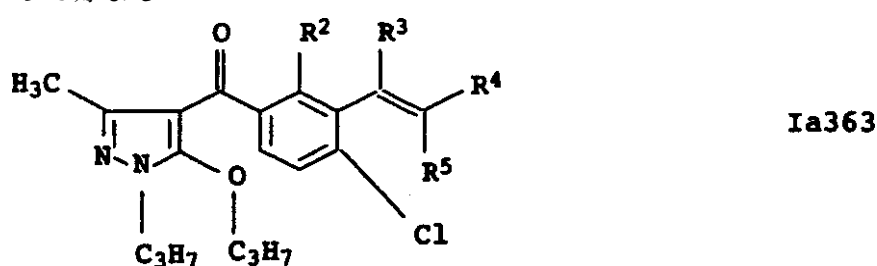
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{15}$ がn-プロピル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia361、特に化合物Ia361.001～Ia361.180が極めて好ましい：



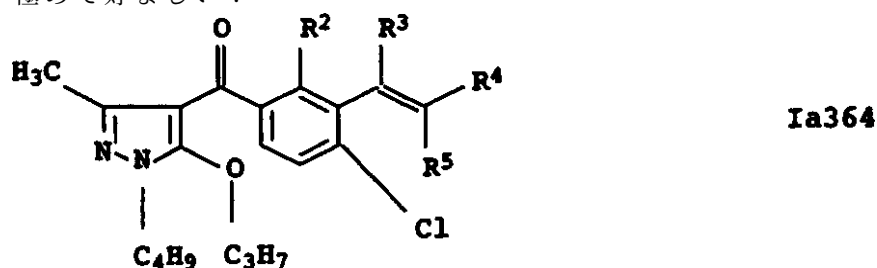
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がエチル、 $R^{15}$ がn-プロピル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia362、特に化合物Ia362.001～Ia362.180が極めて好ましい：



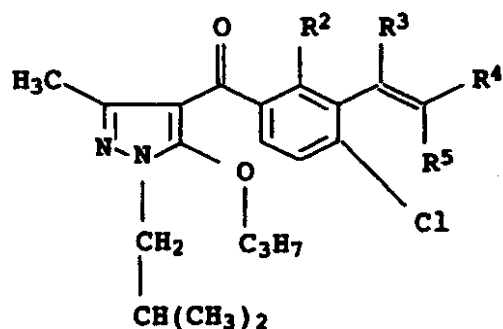
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ 及び $R^{15}$ がそれぞれn-プロピル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia363、特に化合物Ia363.001～Ia363.180が極めて好ましい：



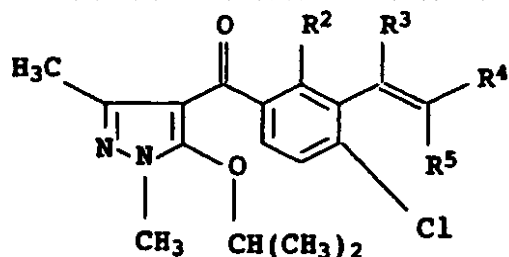
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がn-ブチル、 $R^{15}$ がn-プロピル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia364、特に化合物Ia364.001～Ia364.180が極めて好ましい：



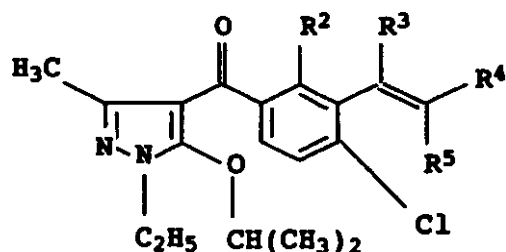
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がイソブチル、 $R^{15}$ がn-プロピル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia365、特に化合物Ia365.001～Ia365.180が極めて好ましい：

**Ia365**

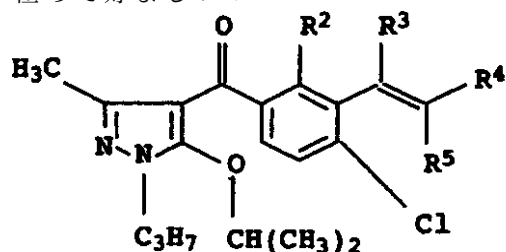
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{15}$ がイソプロピル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia366、特に化合物Ia366.001～Ia366.180が極めて好ましい： 10

**Ia366**

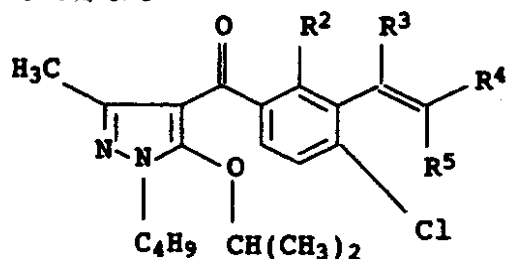
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がエチル、 $R^{15}$ がイソプロピル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia367、特に化合物Ia367.001～Ia367.180が極めて好ましい： 20

**Ia367**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がn-プロピル、 $R^{15}$ がイソプロピル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia368、特に化合物Ia368.001～Ia368.180が極めて好ましい： 30

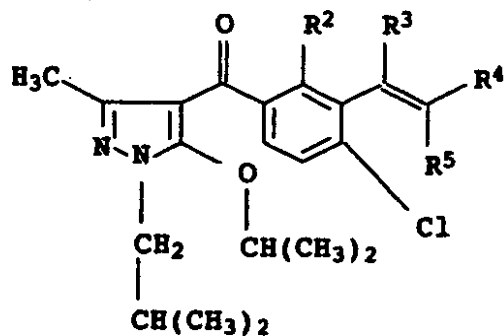
**Ia368**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がn-ブチル、 $R^{15}$ がイソプロピル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia369、特に化合物Ia369.001～Ia369.180が極めて好ましい： 40

**Ia369**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がイソブチル、 $R^{15}$ がイソプロピル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia370、特に化合物Ia370.001～Ia370.180が極 50

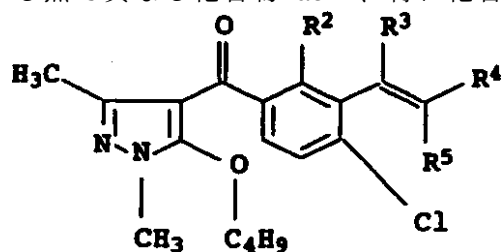
めて好ましい：



**Ia370**

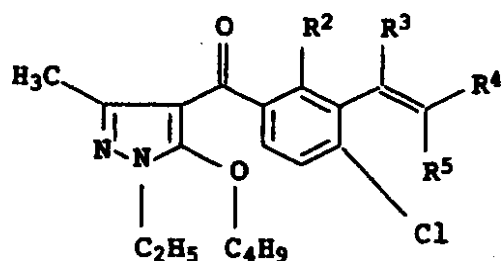
10

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{15}$ がn-ブチル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia371、特に化合物Ia371.001～Ia371.180が極めて好ましい：



**Ia371**

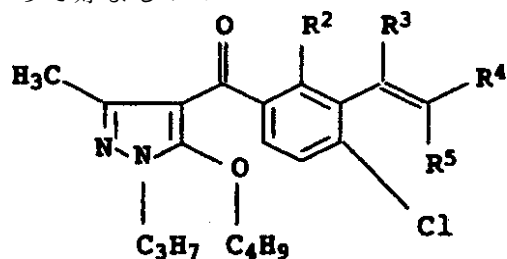
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がエチル、 $R^{15}$ がn-ブチル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia372、特に化合物Ia372.001～Ia372.180が極めて好ましい：



**Ia372**

20

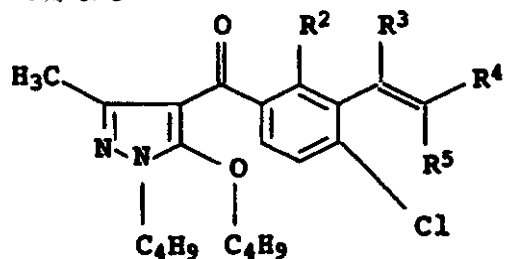
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がn-プロピル、 $R^{15}$ がn-ブチル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia373、特に化合物Ia373.001～Ia373.180が極めて好ましい：



**Ia373**

30

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ 及び $R^{15}$ がそれぞれn-ブチル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia374、特に化合物Ia374.001～Ia374.180が極めて好ましい：



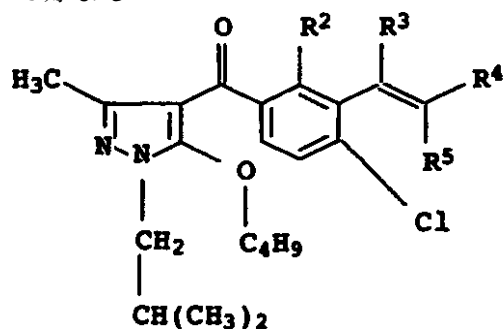
**Ia374**

40

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がイソブチル、 $R^{15}$ がn-ブチル及

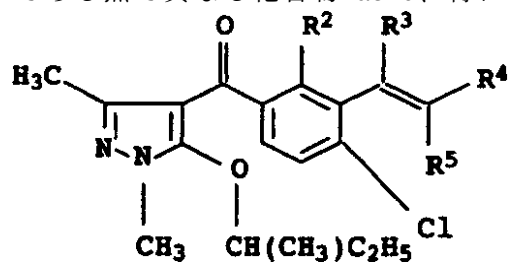
50

び  $R^{16}$  がメチルである点で異なる化合物 Ia375、特に化合物 Ia375.001～Ia375.180 が極めて好ましい：

**Ia375**

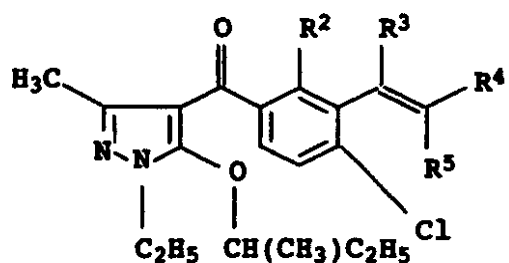
10

同様に、対応する化合物 Ia1.001～Ia1.180 とは、 $R^{15}$  が *sec*-ブチル及び  $R^{16}$  がメチルである点で異なる化合物 Ia376、特に化合物 Ia376.001～Ia376.180 が極めて好ましい：

**Ia376**

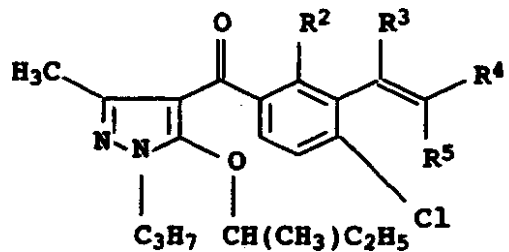
20

同様に、対応する化合物 Ia1.001～Ia1.180 とは、 $R^{14}$  がエチル、 $R^{15}$  が *sec*-ブチル及び  $R^{16}$  がメチルである点で異なる化合物 Ia377、特に化合物 Ia377.001～Ia377.180 が極めて好ましい：

**Ia377**

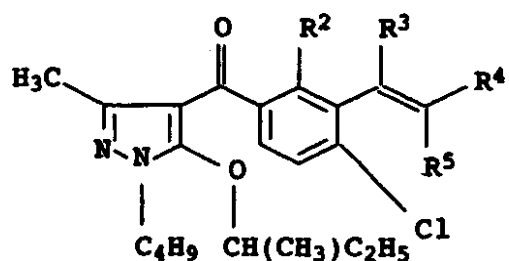
30

同様に、対応する化合物 Ia1.001～Ia1.180 とは、 $R^{14}$  が *n*-プロピル、 $R^{15}$  が *sec*-ブチル及び  $R^{16}$  がメチルである点で異なる化合物 Ia378、特に化合物 Ia378.001～Ia378.180 が極めて好ましい：

**Ia378**

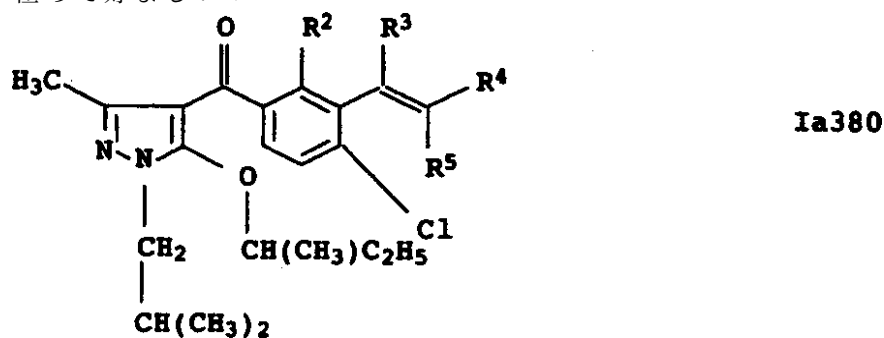
40

同様に、対応する化合物 Ia1.001～Ia1.180 とは、 $R^{14}$  が *n*-ブチル、 $R^{15}$  が *sec*-ブチル、及び  $R^{16}$  がメチルである点で異なる化合物 Ia379、特に化合物 Ia379.001～Ia379.180 が極めて好ましい：

**Ia379**

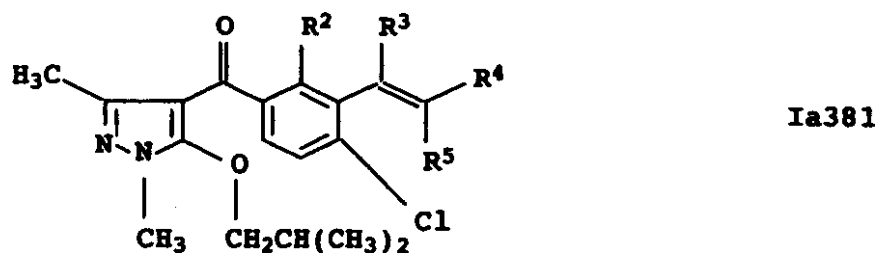
50

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がイソブチル、 $R^{15}$ がsec-ブチル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia380、特に化合物Ia380.001～Ia380.180が極めて好ましい：



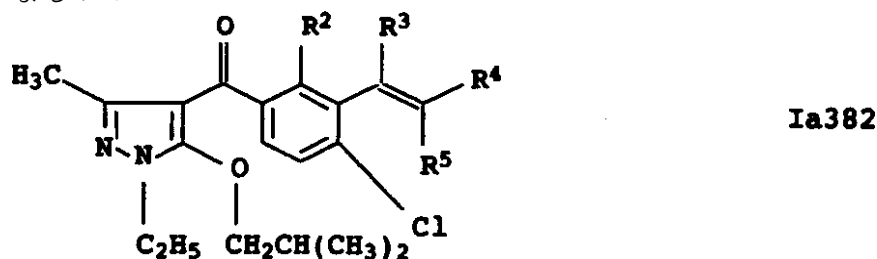
10

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{15}$ がイソブチル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia381、特に化合物Ia381.001～Ia381.180が極めて好ましい：



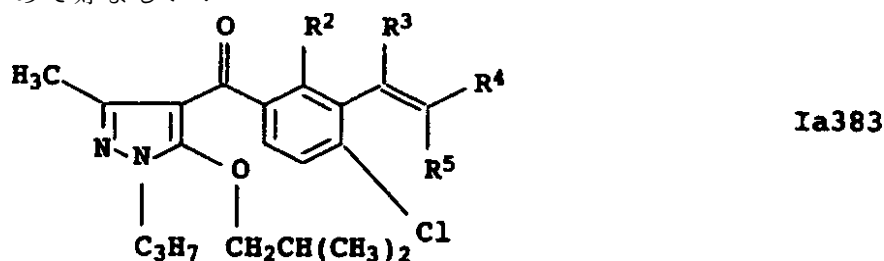
20

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がエチル、 $R^{15}$ がイソブチル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia382、特に化合物Ia382.001～Ia382.180が極めて好ましい：



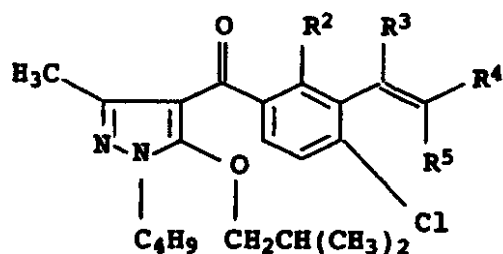
30

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がn-プロピル、 $R^{15}$ がイソブチル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia383、特に化合物Ia383.001～Ia383.180が極めて好ましい：



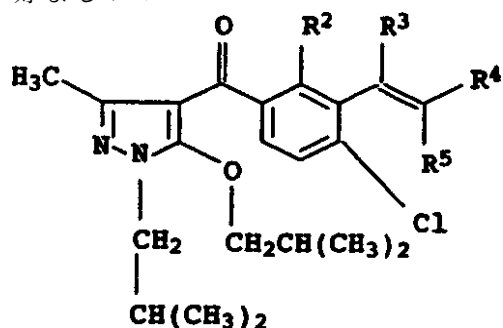
40

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がn-ブチル、 $R^{15}$ がイソブチル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia384、特に化合物Ia384.001～Ia384.180が極めて好ましい：

**Ia384**

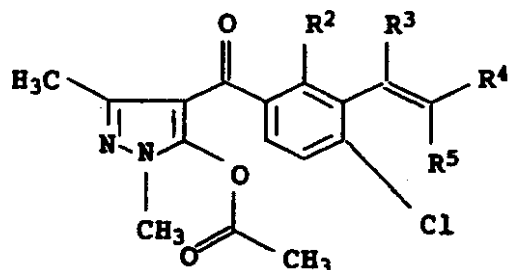
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ 及び $R^{15}$ がそれぞれイソブチル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia385、特に化合物Ia385.001～Ia385.180が極めて好ましい：

10

**Ia385**

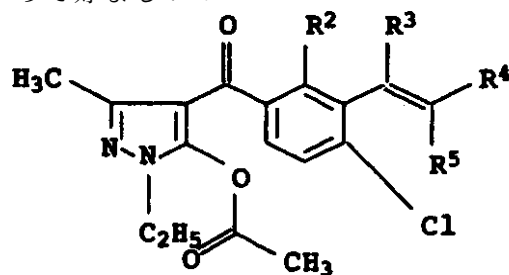
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{15}$ がメチルカルボニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia386、特に化合物Ia386.001～Ia386.180が極めて好ましい：

20

**Ia386**

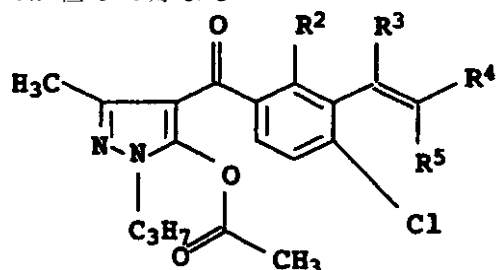
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がエチル、 $R^{15}$ がメチルカルボニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia387、特に化合物Ia387.001～Ia387.180が極めて好ましい：

30

**Ia387**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がn-プロピル、 $R^{15}$ がメチルカルボニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia388、特に化合物Ia388.001～Ia388.180が極めて好ましい：

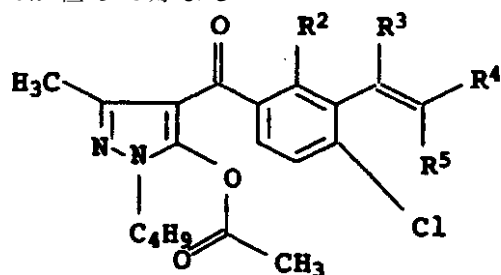
40

**Ia388**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がn-ブチル、 $R^{15}$ がメチルカルボニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia389、特に化合物Ia389.001～Ia389.180が極めて好ましい：

50

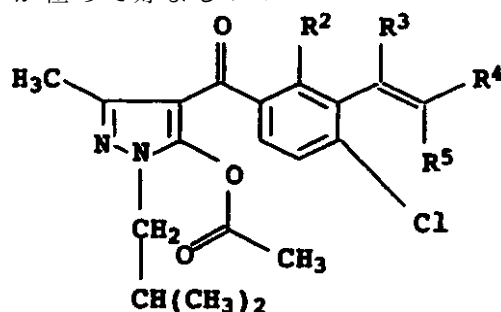
0が極めて好ましい：



**Ia389**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がイソブチル、 $R^{15}$ がメチルカルボニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia390、特に化合物Ia390.001～Ia390.180

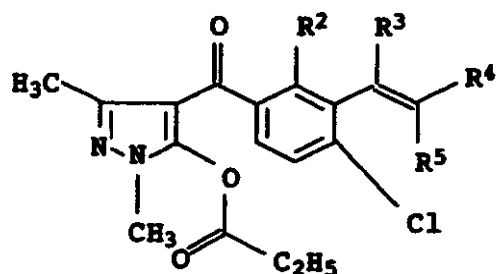
10



**Ia390**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{15}$ がエチルカルボニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia391、特に化合物Ia391.001～Ia391.180が極めて好ましい：

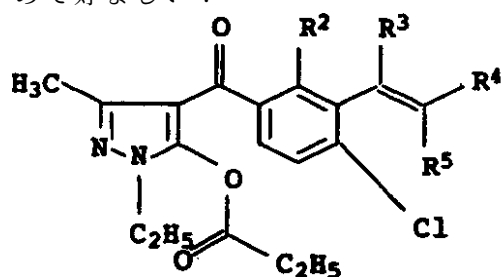
20



**Ia391**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がエチル、 $R^{15}$ がエチルカルボニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia392、特に化合物Ia392.001～Ia392.180が極めて好ましい：

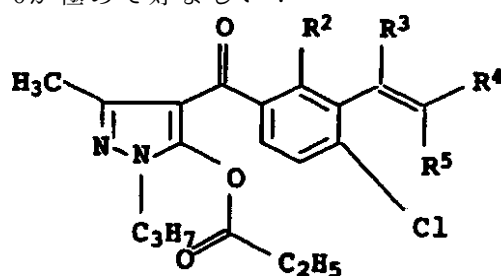
30



**Ia392**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がn-プロピル、 $R^{15}$ がエチルカルボニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia393、特に化合物Ia393.001～Ia393.180

40

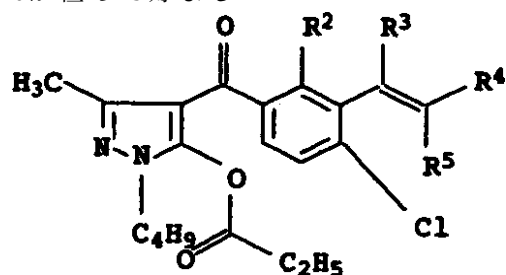


**Ia393**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がn-ブチル、 $R^{15}$ がエチルカルボニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia394、特に化合物Ia394.001～Ia394.180

50

0が極めて好ましい：

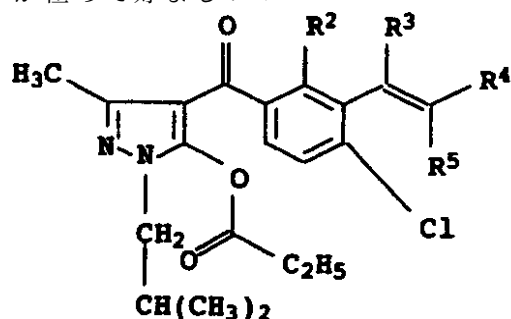


**Ia394**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がイソブチル、 $R^{15}$ がエチルカルボニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia395、特に化合物Ia395.001～Ia395.180

10

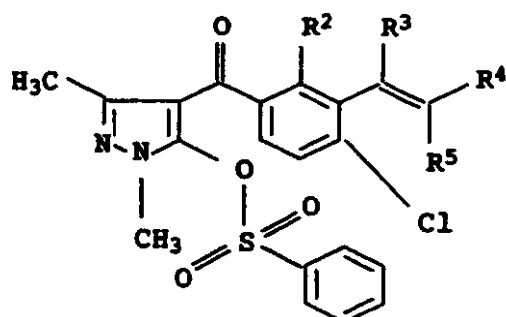
が極めて好ましい：



**Ia395**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{15}$ がフェニルスルホニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia396、特に化合物Ia396.001～Ia396.180が極めて好ましい：

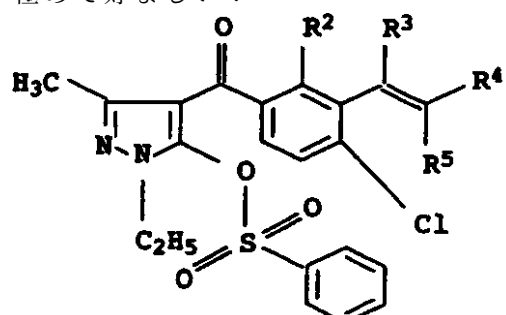
20



**Ia396**

30

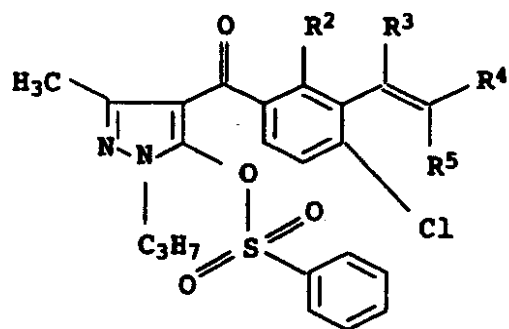
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がエチル、 $R^{15}$ がフェニルスルホニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia397、特に化合物Ia397.001～Ia397.180が極めて好ましい：



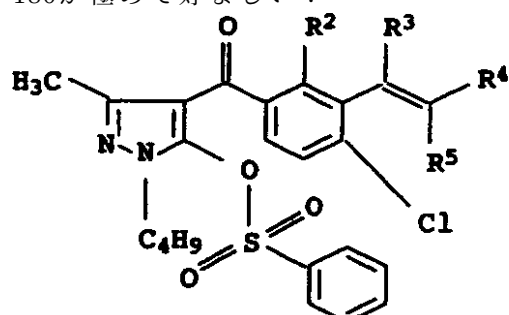
**Ia397**

40

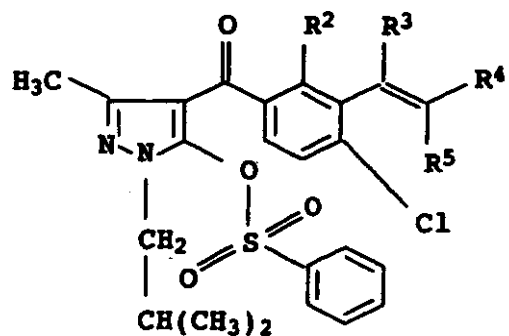
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がn-プロピル、 $R^{15}$ がフェニルスルホニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia398、特に化合物Ia398.001～Ia398.180が極めて好ましい：

**Ia398**

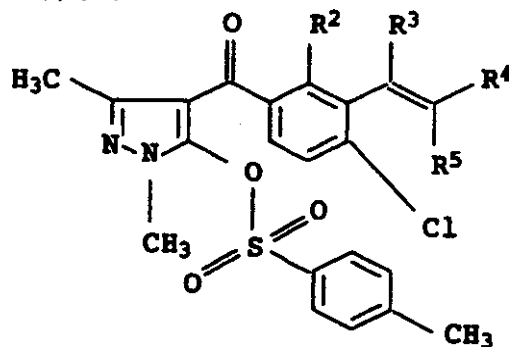
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がn-ブチル、 $R^{15}$ がフェニルスルホニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia399、特に化合物Ia399.001～Ia399.180が極めて好ましい：

**Ia399**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がイソブチル、 $R^{15}$ がフェニルスルホニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia400、特に化合物Ia400.001～Ia400.180が極めて好ましい：

**Ia400**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{15}$ が4-メチルフェニルスルホニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia401、特に化合物Ia401.001～Ia401.180が極めて好ましい：

**Ia401**

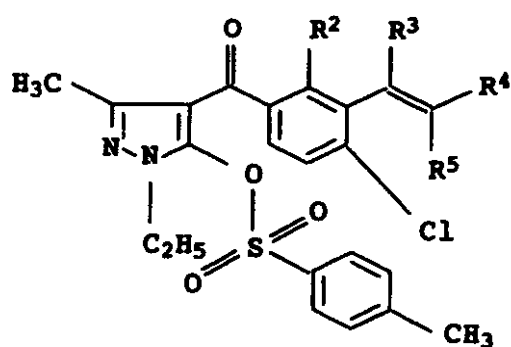
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がエチル、 $R^{15}$ が4-メチルフェニルスルホニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia402、特に化合物Ia402.001～Ia402.180が極めて好ましい：

10

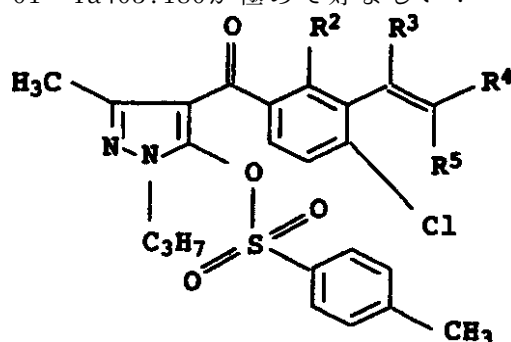
20

30

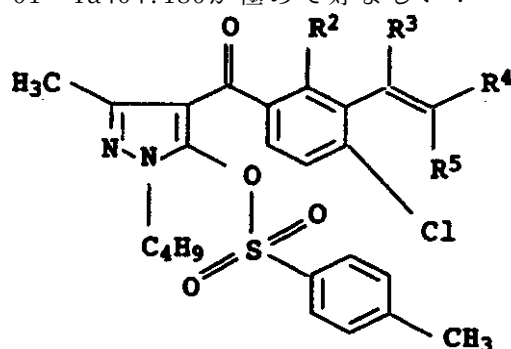
40

**Ia402**

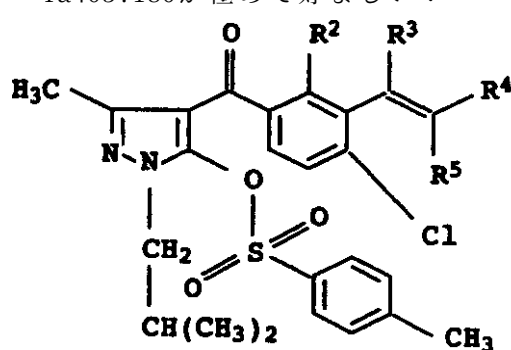
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がn-プロピル、 $R^{15}$ が4-メチルフェニルスルホニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia403、特に化合物Ia403.01～Ia403.180が極めて好ましい：

**Ia403**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がn-ブチル、 $R^{15}$ が4-メチルフェニルスルホニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia404、特に化合物Ia404.01～Ia404.180が極めて好ましい：

**Ia404**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がイソブチル、 $R^{15}$ が4-メチルフェニルスルホニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia405、特に化合物Ia405.001～Ia405.180が極めて好ましい：

**Ia405**

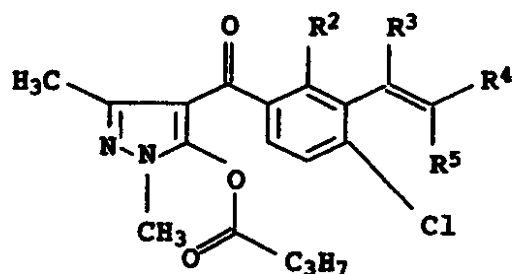
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{15}$ がn-プロピルカルボニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia406、特に化合物Ia406.001～Ia406.180が極めて好ましい：

10

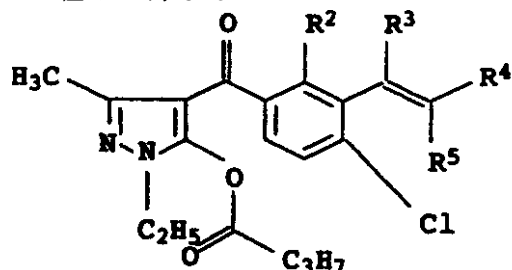
20

30

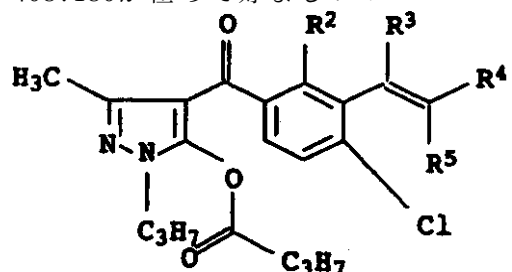
40

**Ia406**

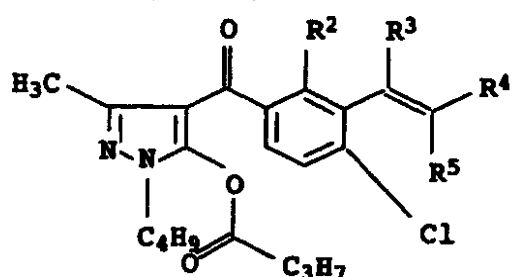
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がエチル、 $R^{15}$ がn-プロピルカルボニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia407、特に化合物Ia407.001～Ia407.180が極めて好ましい：

**Ia407**

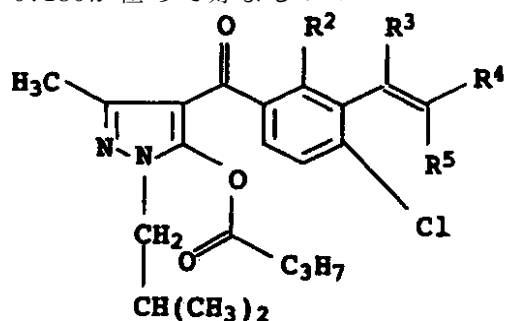
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がn-プロピル、 $R^{15}$ がn-プロピルカルボニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia408、特に化合物Ia408.001～Ia408.180が極めて好ましい：

**Ia408**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がn-ブチル、 $R^{15}$ がn-プロピルカルボニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia409、特に化合物Ia409.001～Ia409.180が極めて好ましい：

**Ia409**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がイソブチル、 $R^{15}$ がn-プロピルカルボニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia410、特に化合物Ia410.001～Ia410.180が極めて好ましい：

**Ia410**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{15}$ がトリフルオロメチルカルボニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia411、特に化合物Ia411.001～Ia411.180が極めて

10

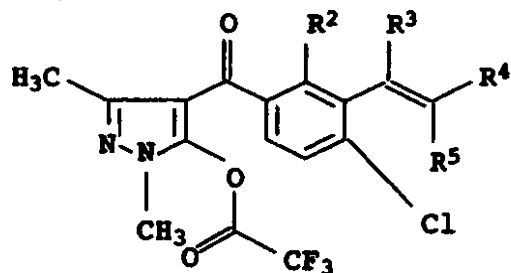
20

30

40

50

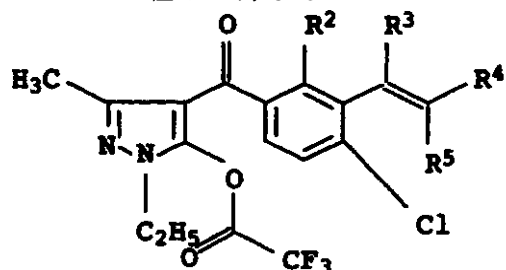
て好ましい：



**Ia411**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がエチル、 $R^{15}$ がトリフルオロメチルカルボニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia412、特に化合物Ia412.001～Ia

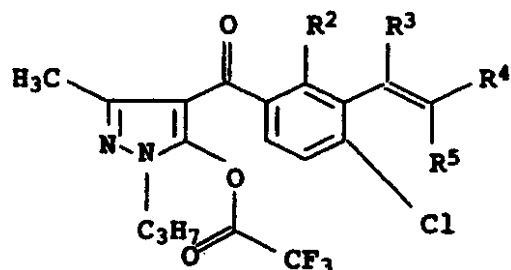
10



**Ia412**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がn-プロピル、 $R^{15}$ がトリフルオロメチルカルボニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia413、特に化合物Ia413.0

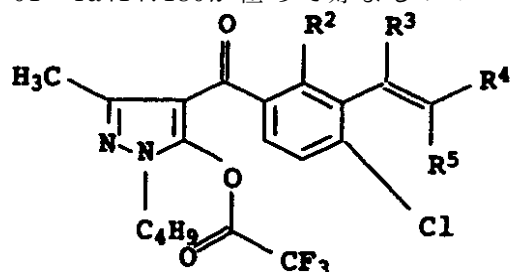
20



**Ia413**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がn-ブチル、 $R^{15}$ がトリフルオロメチルカルボニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia414、特に化合物Ia414.0

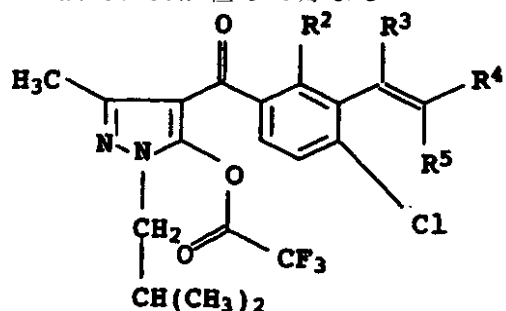
30



**Ia414**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がイソブチル、 $R^{15}$ がトリフルオロメチルカルボニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia415、特に化合物Ia415.001

40

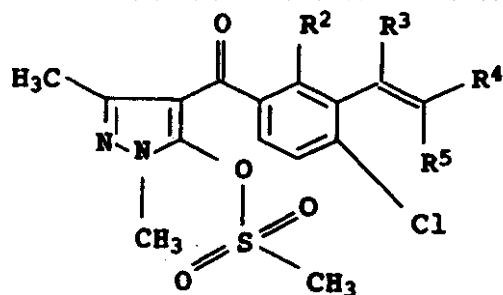


**Ia415**

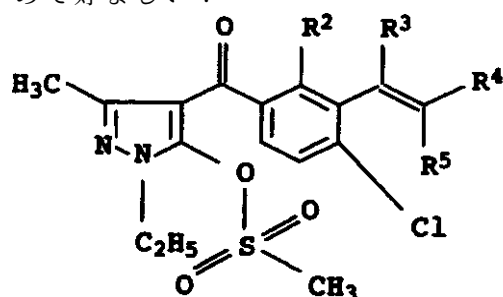
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{15}$ がメチルスルホニル及び $R^{16}$ がメチ

50

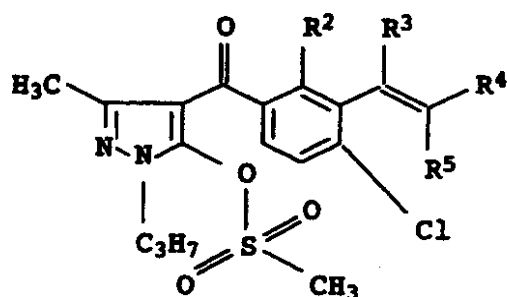
ルである点で異なる化合物Ia416、特に化合物Ia416.001～Ia416.180が極めて好ましい：

**Ia416**

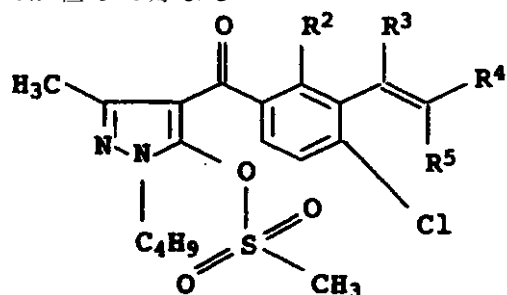
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がエチル、 $R^{15}$ がメチルスルホニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia417、特に化合物Ia417.001～Ia417.180が極めて好ましい：

**Ia417**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がn-プロピル、 $R^{15}$ がメチルスルホニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia418、特に化合物Ia418.001～Ia418.180が極めて好ましい：

**Ia418**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がn-ブチル、 $R^{15}$ がメチルスルホニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia419、特に化合物Ia419.001～Ia419.180が極めて好ましい：

**Ia419**

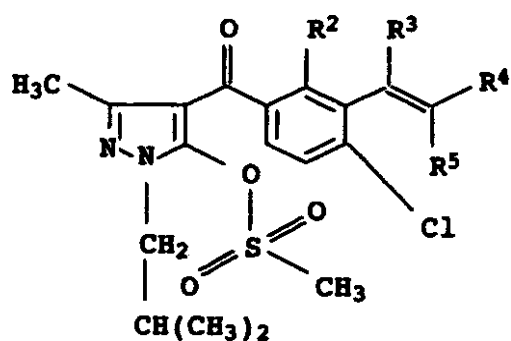
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がイソブチル、 $R^{15}$ がメチルスルホニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia420、特に化合物Ia420.001～Ia420.180が極めて好ましい：

10

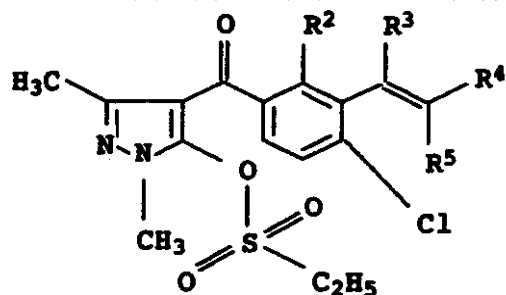
20

30

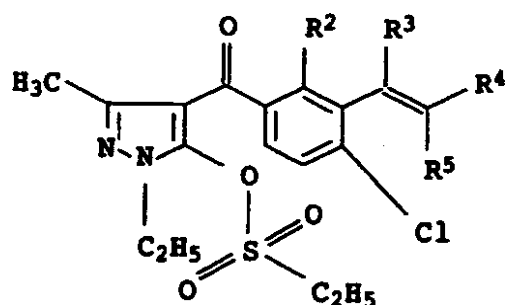
40



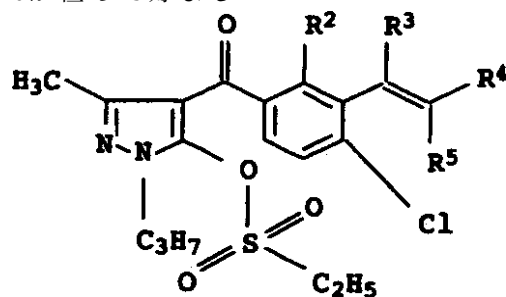
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{15}$ がエチルスルホニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia421、特に化合物Ia421.001～Ia421.180が極めて好ましい：



同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がエチル、 $R^{15}$ がエチルスルホニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia422、特に化合物Ia422.001～Ia422.180が極めて好ましい：



同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がn-プロピル、 $R^{15}$ がエチルスルホニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia423、特に化合物Ia423.001～Ia423.180が極めて好ましい：



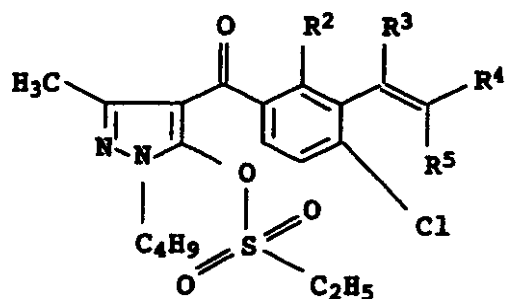
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がn-ブチル、 $R^{15}$ がエチルスルホニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia424、特に化合物Ia424.001～Ia424.180が極めて好ましい：

10

20

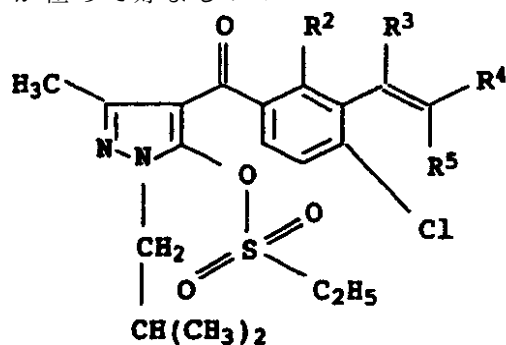
30

40

**Ia424**

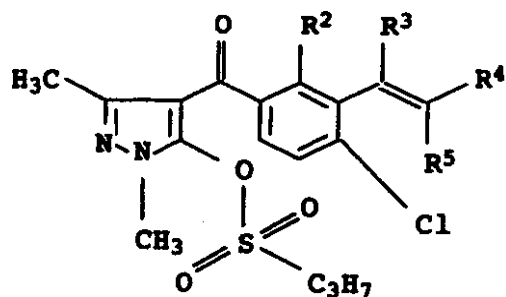
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がイソブチル、 $R^{15}$ がエチルスルホニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia425、特に化合物Ia425.001～Ia425.180

10

**Ia425**

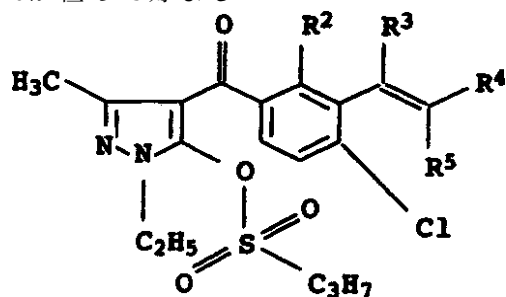
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{15}$ がn-プロピルスルホニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia426、特に化合物Ia426.001～Ia426.180が極めて好ましい：

20

**Ia426**

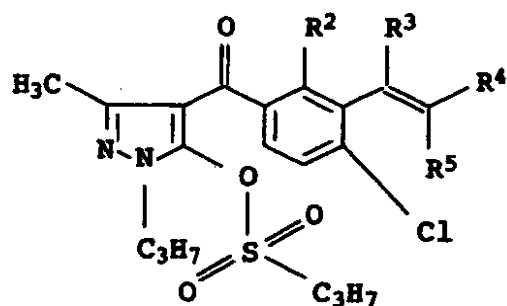
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がエチル、 $R^{15}$ がn-プロピルスルホニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia427、特に化合物Ia427.001～Ia427.180が極めて好ましい：

30

**Ia427**

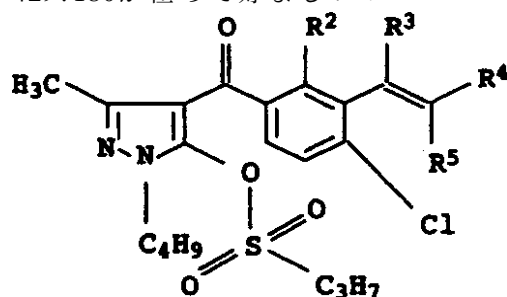
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がn-プロピル、 $R^{15}$ がn-プロピルスルホニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia428、特に化合物Ia428.001～Ia428.180が極めて好ましい：

40

**Ia428**

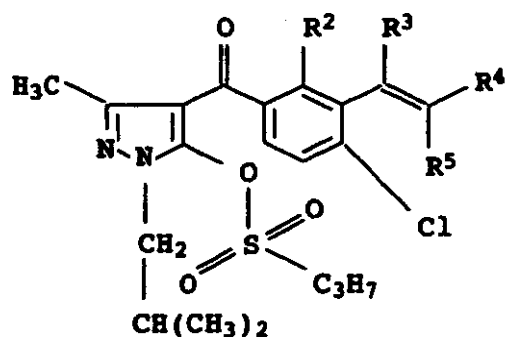
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がn-ブチル、 $R^{15}$ がn-プロピル  
スルホニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia429、特に化合物Ia429.001～Ia  
429.180が極めて好ましい：

10

**Ia429**

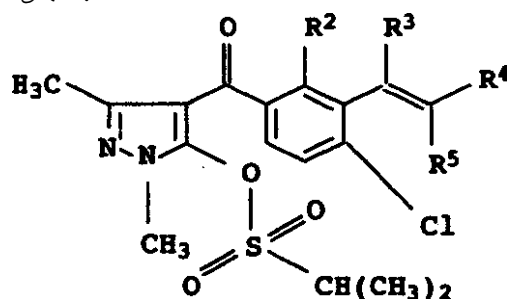
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がイソブチル、 $R^{15}$ がn-プロピル  
スルホニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia430、特に化合物Ia430.001～Ia43  
0.180が極めて好ましい：

20

**Ia430**

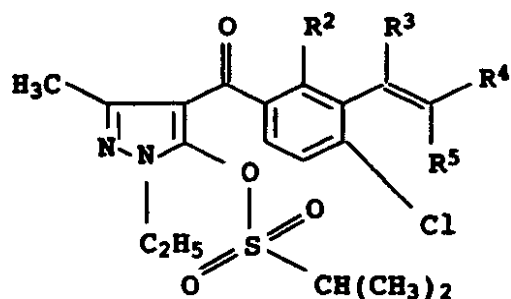
30

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{15}$ がイソプロピルスルホニル及び $R^{16}$   
がメチルである点で異なる化合物Ia431、特に化合物Ia431.001～Ia431.180が極めて好ま  
しい：

**Ia431**

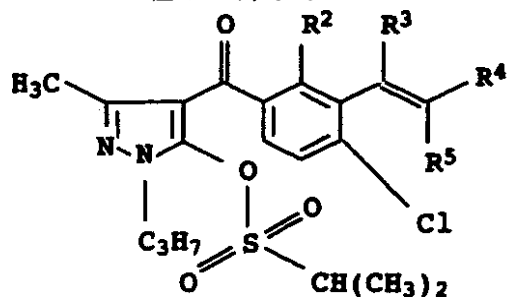
40

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がエチル、 $R^{15}$ がイソプロピルスル  
ホニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia432、特に化合物Ia432.001～Ia432.18  
0が極めて好ましい：

**Ia432**

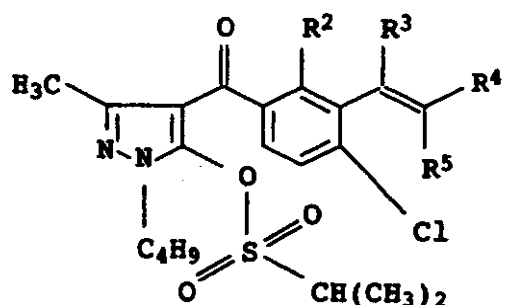
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がn-プロピル、 $R^{15}$ がイソプロピルスルホニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia433、特に化合物Ia433.001～Ia

10

**Ia433**

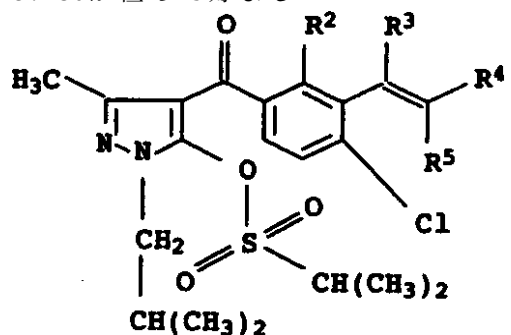
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がn-ブチル、 $R^{15}$ がイソプロピルスルホニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia434、特に化合物Ia434.001～Ia

20

**Ia434**

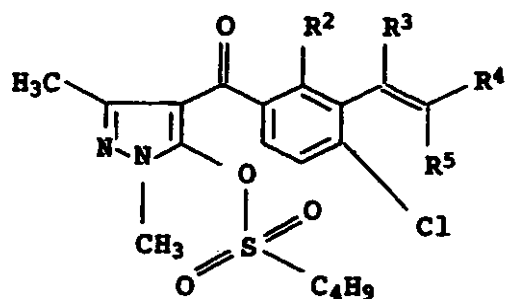
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がイソブチル、 $R^{15}$ がイソプロピルスルホニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia435、特に化合物Ia435.001～Ia43

30

**Ia435**

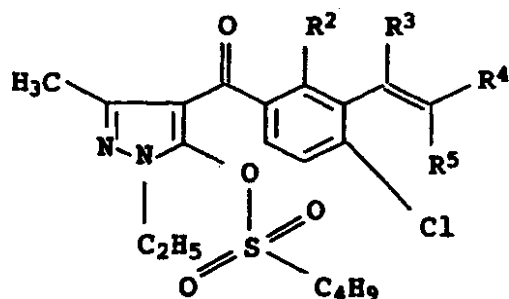
40

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{15}$ がn-ブチルスルホニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia436、特に化合物Ia436.001～Ia436.180が極めて好ましい：

**Ia436**

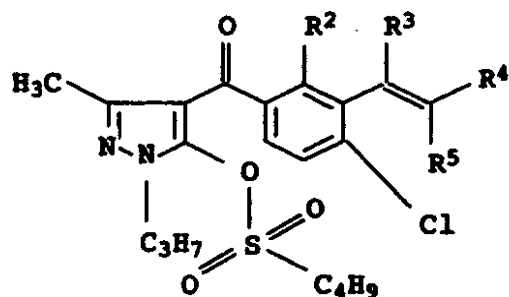
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がエチル、 $R^{15}$ がn-ブチルスルホニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia437、特に化合物Ia437.001～Ia437.180

10

**Ia437**

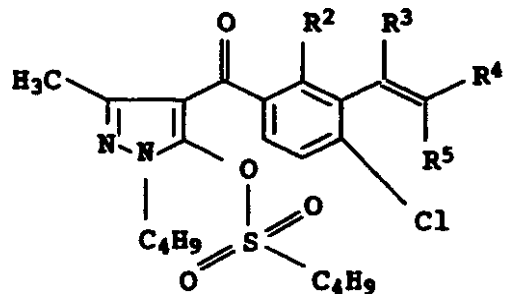
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がn-プロピル、 $R^{15}$ がn-ブチルスルホニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia438、特に化合物Ia438.001～Ia438.180が極めて好ましい：

20

**Ia438**

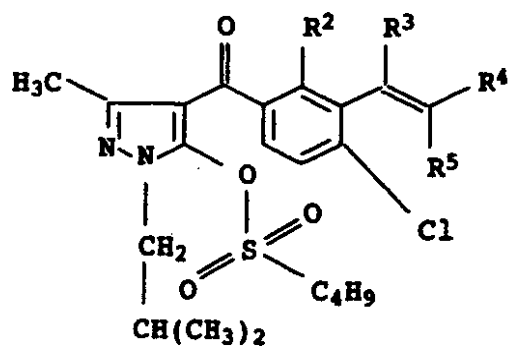
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がn-ブチル、 $R^{15}$ がn-ブチルスルホニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia439、特に化合物Ia439.001～Ia439.180が極めて好ましい：

30

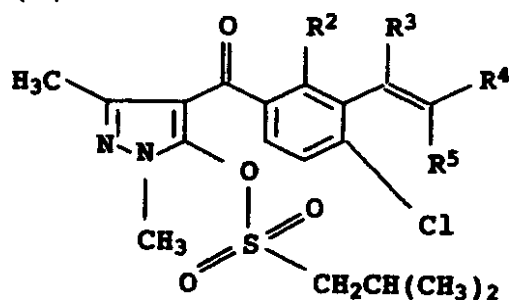
**Ia439**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がイソブチル、 $R^{15}$ がn-ブチルスルホニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia440、特に化合物Ia440.001～Ia440.180が極めて好ましい：

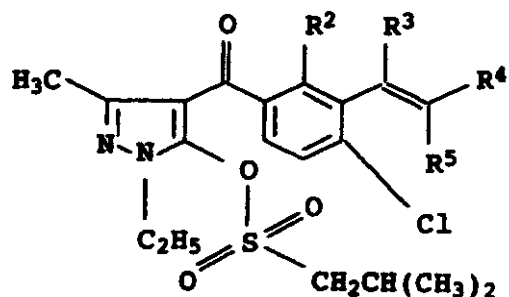
40



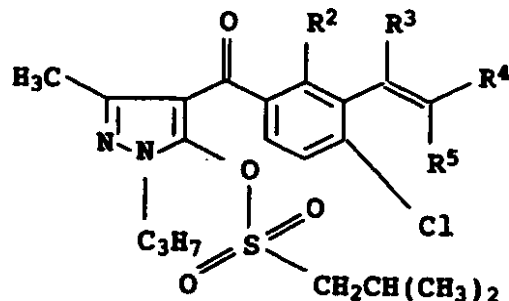
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{15}$ がイソブチルスルホニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia441、特に化合物Ia441.001～Ia441.180が極めて好ましい：



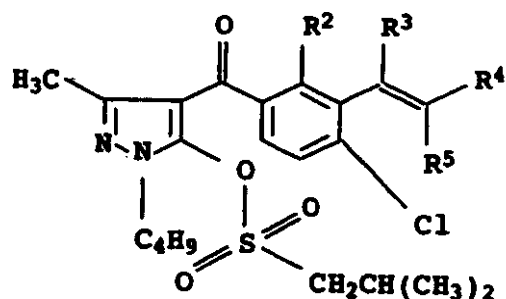
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がエチル、 $R^{15}$ がイソブチルスルホニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia442、特に化合物Ia442.001～Ia442.180が極めて好ましい：



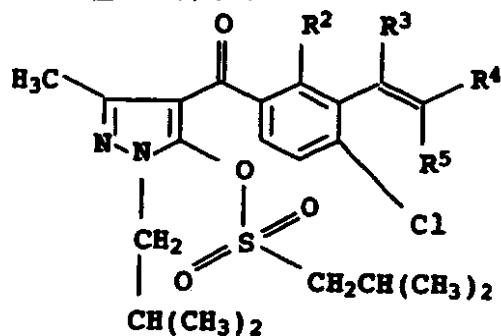
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がn-プロピル、 $R^{15}$ がイソブチルスルホニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia443、特に化合物Ia443.001～Ia443.180が極めて好ましい：



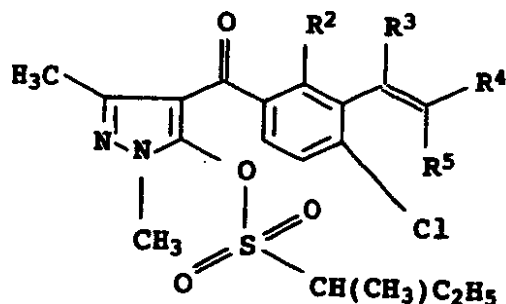
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がn-ブチル、 $R^{15}$ がイソブチルスルホニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia444、特に化合物Ia444.001～Ia444.180が極めて好ましい：

**Ia444**

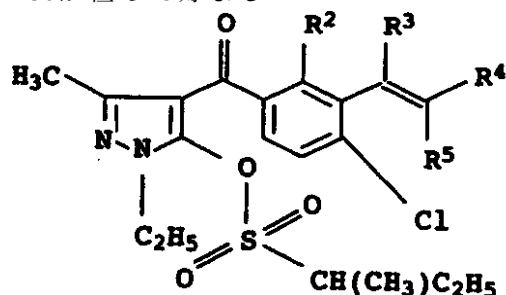
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がイソブチル、 $R^{15}$ がイソブチルスルホニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia445、特に化合物Ia445.001～Ia445.180が極めて好ましい：

**Ia445**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{15}$ がsec-ブチルスルホニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia446、特に化合物Ia446.001～Ia446.180が極めて好ましい：

**Ia446**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がエチル、 $R^{15}$ がsec-ブチルスルホニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia447、特に化合物Ia447.001～Ia447.180が極めて好ましい：

**Ia447**

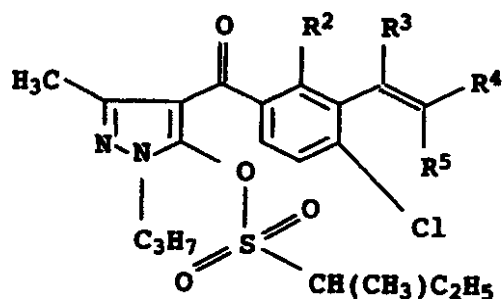
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がn-プロピル、 $R^{15}$ がsec-ブチルスルホニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia448、特に化合物Ia448.001～Ia448.180が極めて好ましい：

10

20

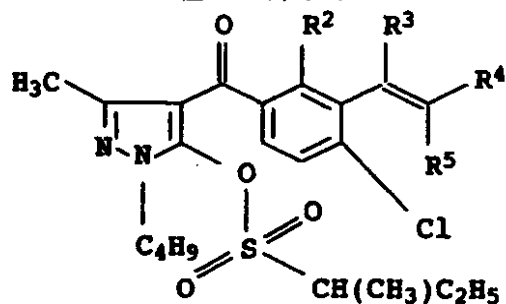
30

40

**Ia448**

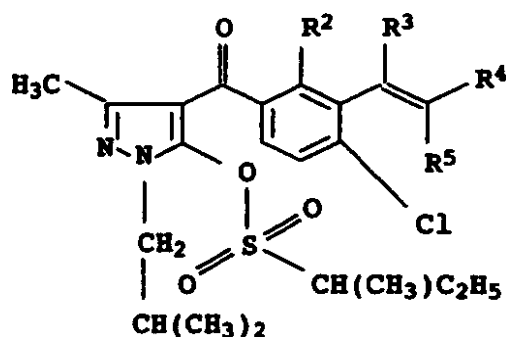
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がn-ブチル、 $R^{15}$ がsec-ブチルスルホニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia449、特に化合物Ia449.001～

10

**Ia449**

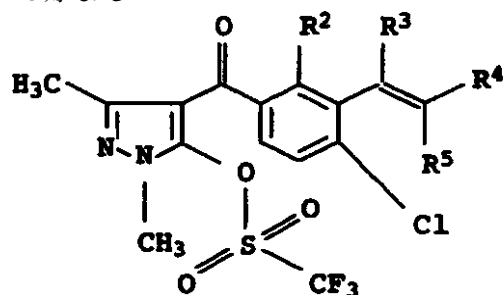
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がイソブチル、 $R^{15}$ がsec-ブチルスルホニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia450、特に化合物Ia450.001～Ia

20

**Ia450**

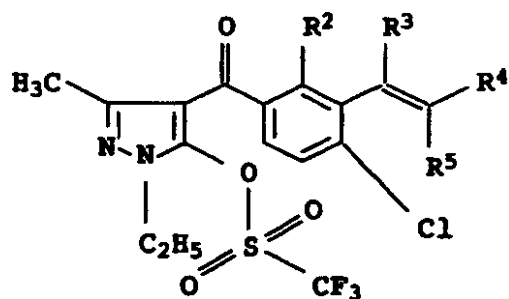
30

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{15}$ がトリフルオロメチルスルホニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia451、特に化合物Ia451.001～Ia451.180が極めて好ましい：

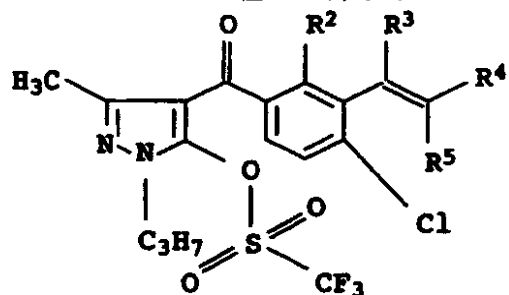
**Ia451**

40

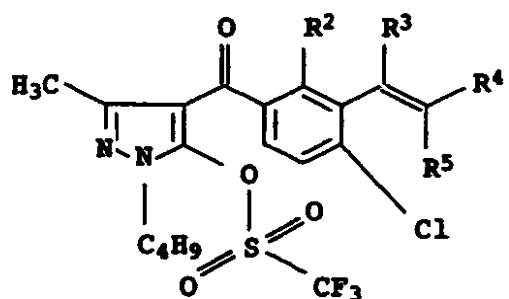
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がエチル、 $R^{15}$ がトリフルオロメチルスルホニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia452、特に化合物Ia452.001～Ia

**Ia452**

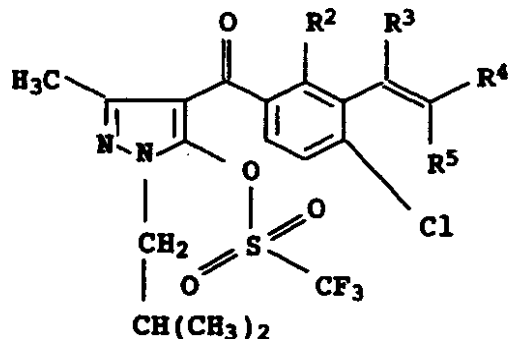
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がn-プロピル、 $R^{15}$ がトリフルオロメチルスルホニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia453、特に化合物Ia453.01～Ia453.180が極めて好ましい：

**Ia453**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がn-ブチル、 $R^{15}$ がトリフルオロメチルスルホニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia454、特に化合物Ia454.01～Ia454.180が極めて好ましい：

**Ia454**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がイソブチル、 $R^{15}$ がトリフルオロメチルスルホニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia455、特に化合物Ia455.001～Ia455.180が極めて好ましい：

**Ia455**

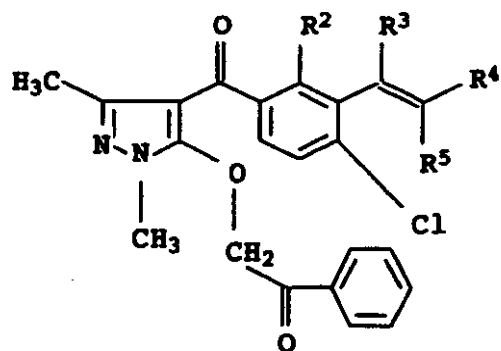
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{15}$ がフェニルカルボニルメチル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia456、特に化合物Ia456.001～Ia456.180が極めて好ましい：

10

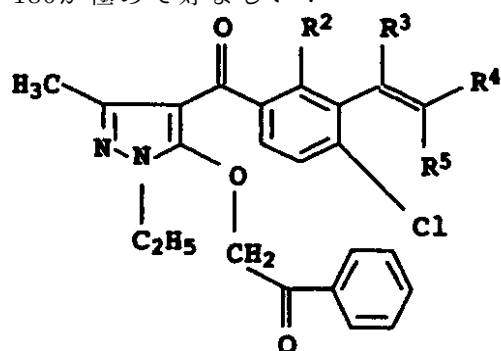
20

30

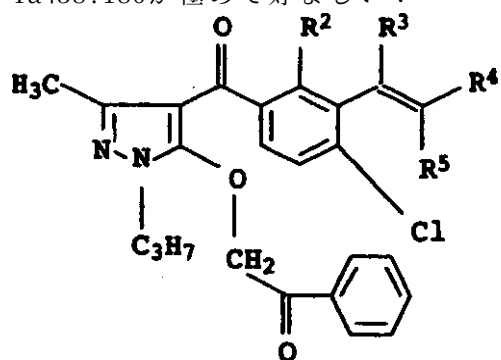
40

**Ia456**

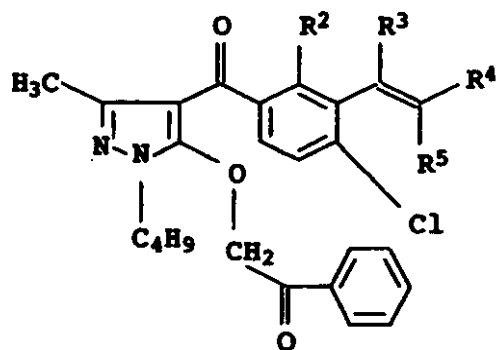
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がエチル、 $R^{15}$ がフェニルカルボニルメチル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia457、特に化合物Ia457.001～Ia457.180が極めて好ましい：

**Ia457**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がn-プロピル、 $R^{15}$ がフェニルカルボニルメチル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia458、特に化合物Ia458.001～Ia458.180が極めて好ましい：

**Ia458**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がn-ブチル、 $R^{15}$ がフェニルカルボニルメチル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia459、特に化合物Ia459.001～Ia459.180が極めて好ましい：

**Ia459**

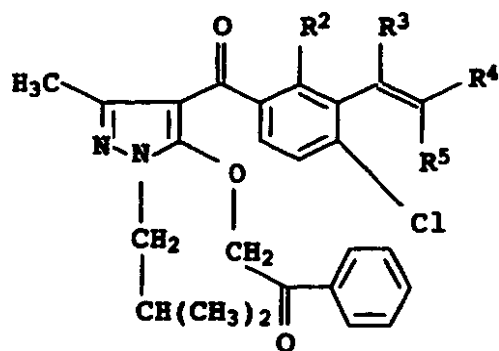
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^{14}$ がイソブチル、 $R^{15}$ がフェニルカルボニルメチル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia460、特に化合物Ia460.001～Ia460.180が極めて好ましい：

10

20

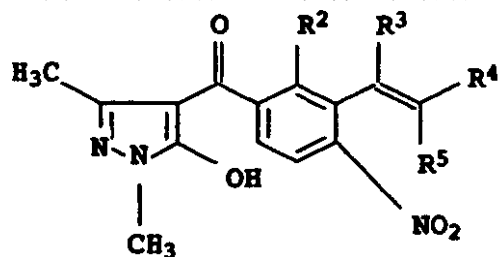
30

40

**Ia460**

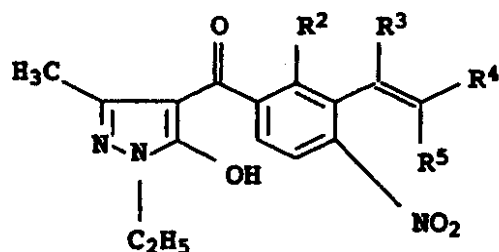
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ及び $R^{16}$ がメチルである点  
で異なる化合物Ia461、特に化合物Ia461.001～Ia461.180が極めて好ましい：

10

**Ia461**

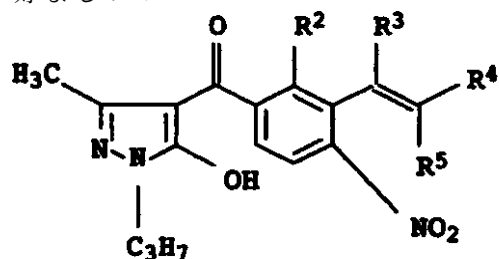
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がエチル、及び $R^{16}$   
がメチルである点で異なる化合物Ia462、特に化合物Ia462.001～Ia462.180が極めて好ま  
しい：

20

**Ia462**

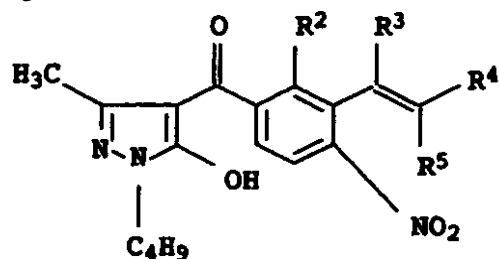
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がn-プロピル及び  
 $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia463、特に化合物Ia463.001～Ia463.180が極めて  
好ましい：

30

**Ia463**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がn-ブチル及び $R^{16}$   
がメチルである点で異なる化合物Ia464、特に化合物Ia464.001～Ia464.180が極めて好ま  
しい：

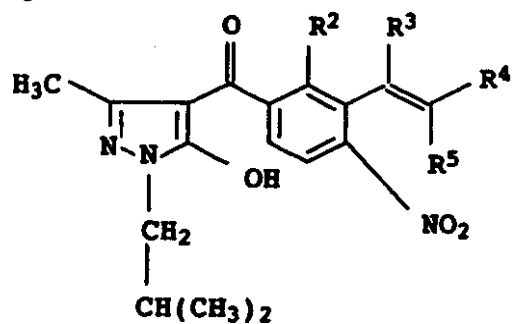
40

**Ia464**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がイソブチル及び $R^{16}$   
がメチルである点で異なる化合物Ia465、特に化合物Ia465.001～Ia465.180が極めて好ま  
しい：

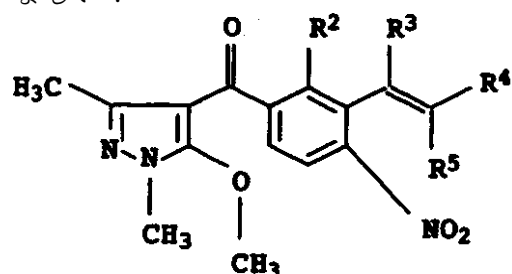
50

しい：



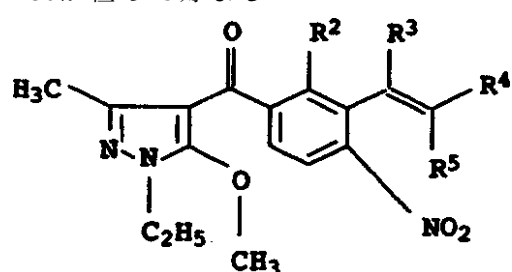
**Ia465**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、及び $R^{15}$ 及び $R^{16}$ がそれぞれメチルである点で異なる化合物Ia466、特に化合物Ia466.001～Ia466.180が極めて好ましい：



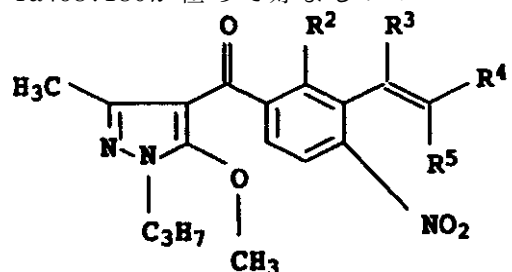
**Ia466**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がエチル、及び $R^{15}$ 及び $R^{16}$ がそれぞれメチルである点で異なる化合物Ia467、特に化合物Ia467.001～Ia467.180が極めて好ましい：



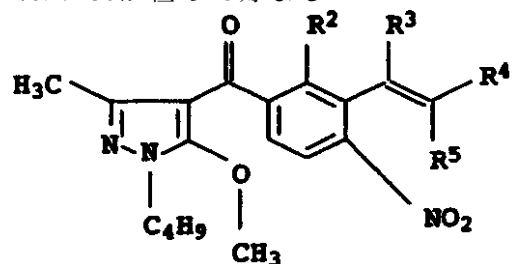
**Ia467**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がn-プロピル、及び $R^{15}$ 及び $R^{16}$ がそれぞれメチルである点で異なる化合物Ia468、特に化合物Ia468.001～Ia468.180が極めて好ましい：



**Ia468**

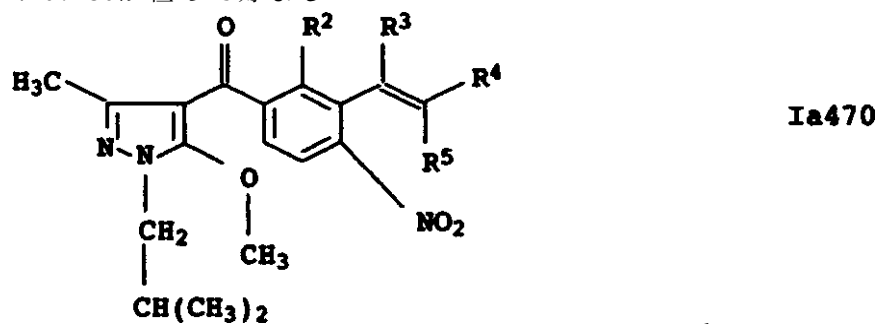
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がn-ブチル、及び $R^{15}$ 及び $R^{16}$ がそれぞれメチルである点で異なる化合物Ia469、特に化合物Ia469.001～Ia469.180が極めて好ましい：



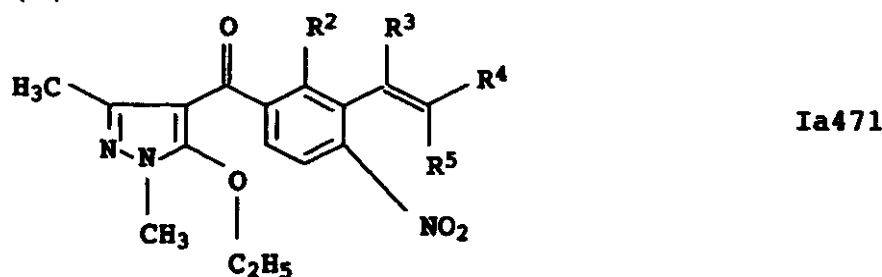
**Ia469**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がイソブチル、及び

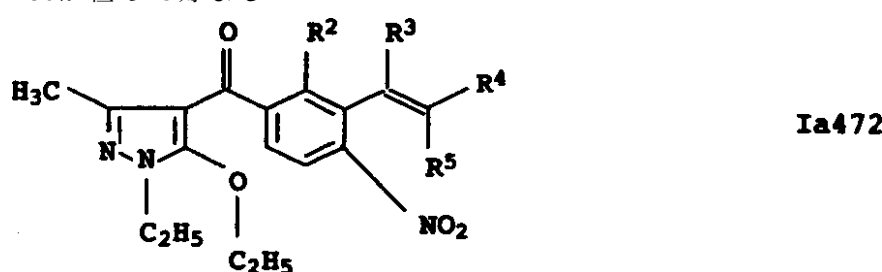
$R^{15}$  及び  $R^{16}$  がそれぞれメチルである点で異なる化合物 Ia470、特に化合物 Ia470.001～Ia470.180 が極めて好ましい：



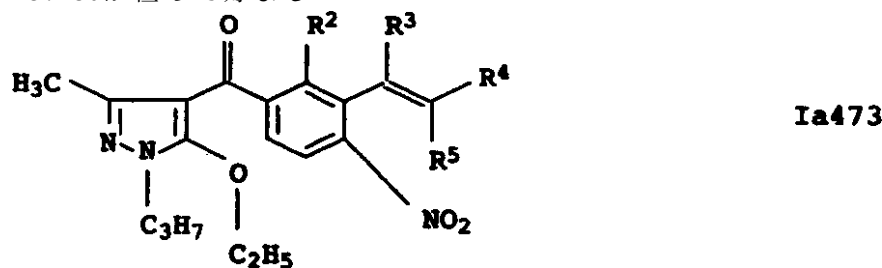
同様に、対応する化合物 Ia1.001～Ia1.180 とは、 $R^1$  がニトロ、 $R^{15}$  がエチル及び  $R^{16}$  がメチルである点で異なる化合物 Ia471、特に化合物 Ia471.001～Ia471.180 が極めて好ましい：



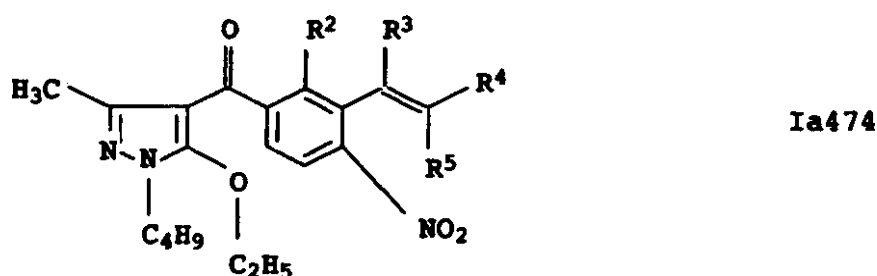
同様に、対応する化合物 Ia1.001～Ia1.180 とは、 $R^1$  がニトロ、 $R^{14}$  及び  $R^{15}$  がそれぞれエチル、及び  $R^{16}$  がメチルである点で異なる化合物 Ia472、特に化合物 Ia472.001～Ia472.180 が極めて好ましい：



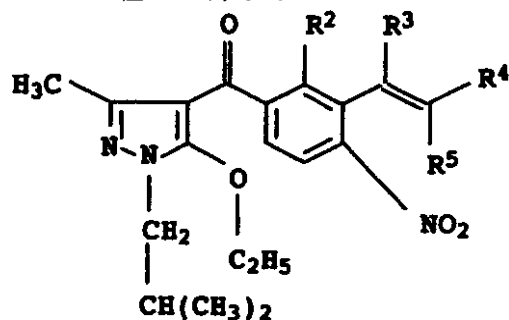
同様に、対応する化合物 Ia1.001～Ia1.180 とは、 $R^1$  がニトロ、 $R^{14}$  が n-プロピル、 $R^{15}$  がエチル、及び  $R^{16}$  がメチルである点で異なる化合物 Ia473、特に化合物 Ia473.001～Ia473.180 が極めて好ましい：



同様に、対応する化合物 Ia1.001～Ia1.180 とは、 $R^1$  がニトロ、 $R^{14}$  が n-ブチル、 $R^{15}$  がエチル、及び  $R^{16}$  がメチルである点で異なる化合物 Ia474、特に化合物 Ia474.001～Ia474.180 が極めて好ましい：

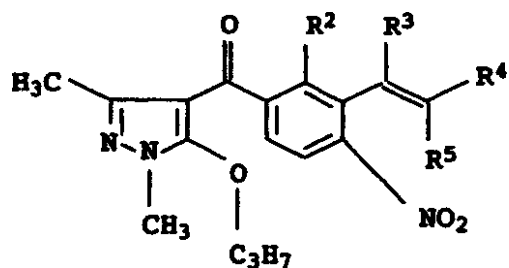


同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がイソブチル、 $R^{15}$ がエチル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia475、特に化合物Ia475.001～Ia475.180が極めて好ましい：

**Ia475**

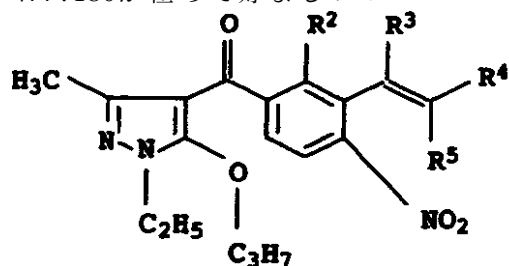
10

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{15}$ がn-プロピル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia476、特に化合物Ia476.001～Ia476.180が極めて好ましい：

**Ia476**

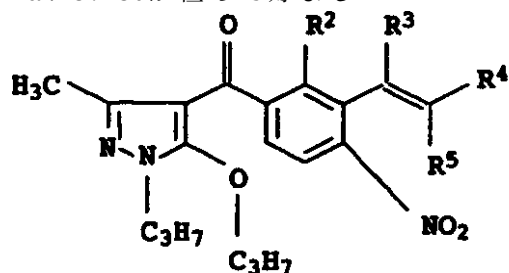
20

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がエチル、 $R^{15}$ がn-プロピル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia477、特に化合物Ia477.001～Ia477.180が極めて好ましい：

**Ia477**

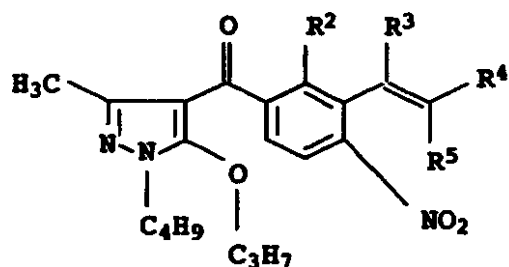
30

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ 及び $R^{15}$ がそれぞれn-プロピル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia478、特に化合物Ia478.001～Ia478.180が極めて好ましい：

**Ia478**

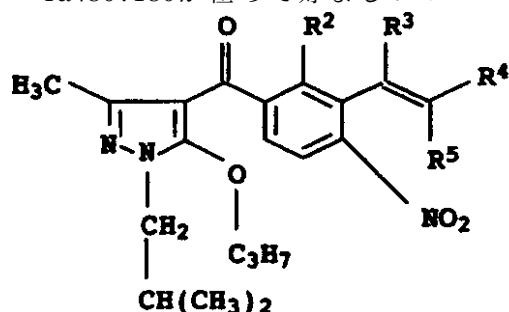
40

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がn-ブチル、 $R^{15}$ がn-プロピル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia479、特に化合物Ia479.001～Ia479.180が極めて好ましい：

**Ia479**

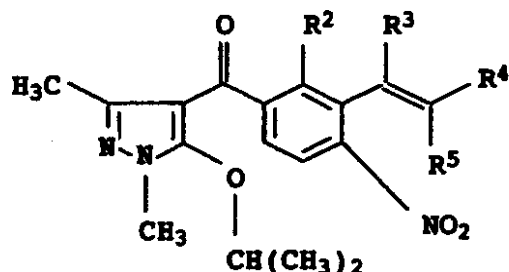
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がイソブチル、 $R^{15}$ がn-プロピル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia480、特に化合物Ia480.001～Ia480.180が極めて好ましい：

10

**Ia480**

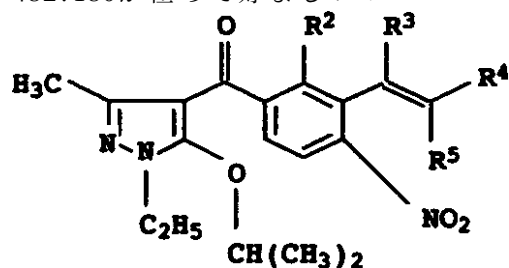
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{15}$ がイソプロピル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia481、特に化合物Ia481.001～Ia481.180が極めて好ましい：

20

**Ia481**

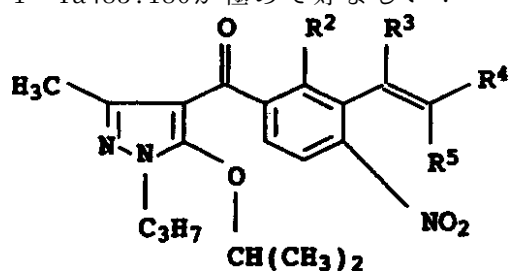
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がエチル、 $R^{15}$ がイソプロピル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia482、特に化合物Ia482.001～Ia482.180が極めて好ましい：

30

**Ia482**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がn-プロピル、 $R^{15}$ がイソプロピル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia483、特に化合物Ia483.001～Ia483.180が極めて好ましい：

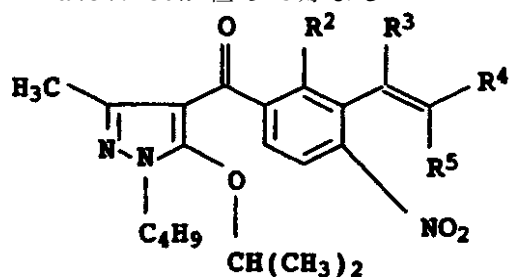
40

**Ia483**

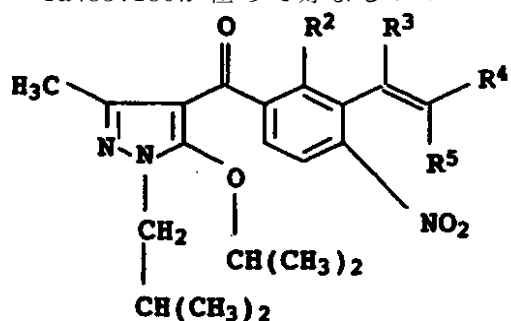
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がn-ブチル、 $R^{15}$ がイソプロピル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia484、特に化合物Ia484.001～Ia484.180が極めて好ましい：

50

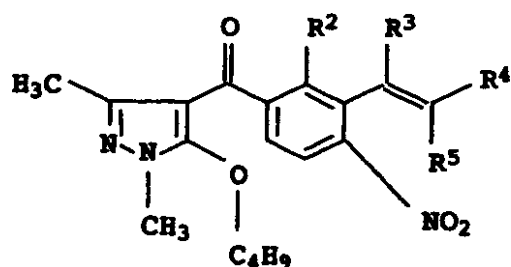
～Ia484.180が極めて好ましい：



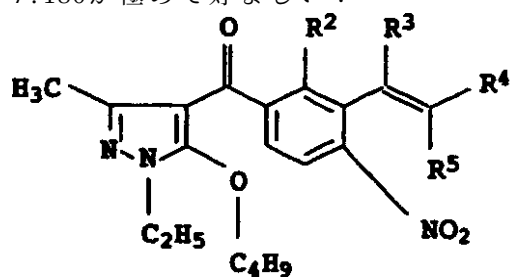
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がイソブチル、 $R^{15}$ がイソプロピル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia485、特に化合物Ia485.001～Ia485.180が極めて好ましい：



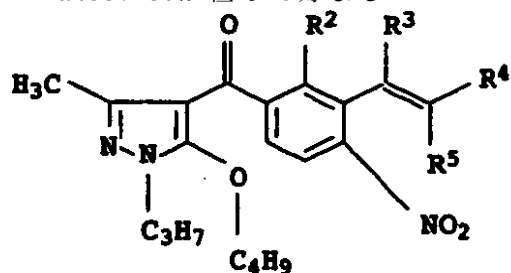
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{15}$ がn-ブチル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia486、特に化合物Ia486.001～Ia486.180が極めて好ましい：



同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がエチル、 $R^{15}$ がn-ブチル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia487、特に化合物Ia487.001～Ia487.180が極めて好ましい：

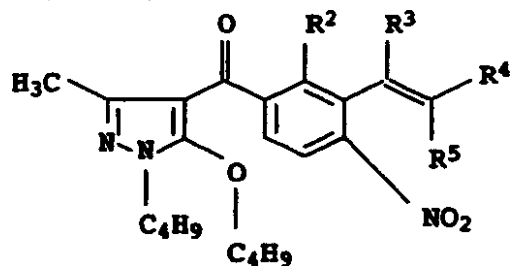


同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がn-プロピル、 $R^{15}$ がn-ブチル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia488、特に化合物Ia488.001～Ia488.180が極めて好ましい：

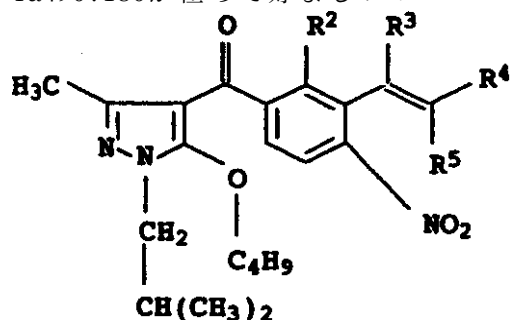


同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ 及び $R^{15}$ がn-ブチ

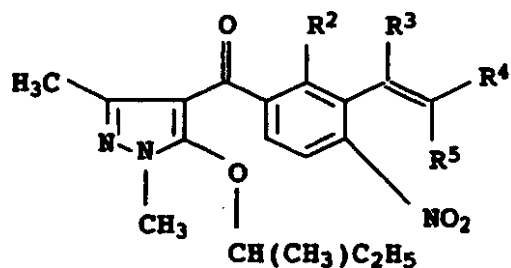
ル、及び  $R^{16}$  がメチルである点で異なる化合物 Ia489、特に化合物 Ia489.001～Ia489.180 が極めて好ましい：

**Ia489**

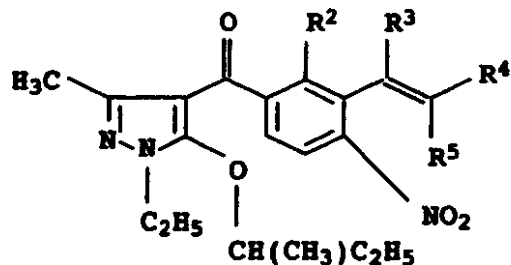
同様に、対応する化合物 Ia1.001～Ia1.180 とは、 $R^1$  がニトロ、 $R^{14}$  がイソブチル、 $R^{15}$  が *n*-ブチル、及び  $R^{16}$  がメチルである点で異なる化合物 Ia490、特に化合物 Ia490.001～Ia490.180 が極めて好ましい：

**Ia490**

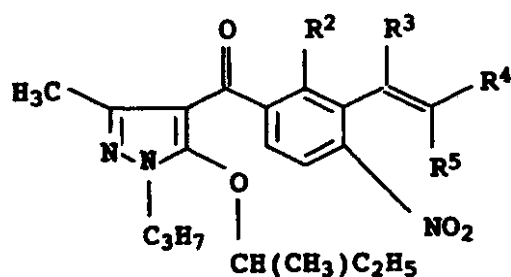
同様に、対応する化合物 Ia1.001～Ia1.180 とは、 $R^1$  がニトロ、 $R^{15}$  が *sec*-ブチル及び  $R^{16}$  がメチルである点で異なる化合物 Ia491、特に化合物 Ia491.001～Ia491.180 が極めて好ましい：

**Ia491**

同様に、対応する化合物 Ia1.001～Ia1.180 とは、 $R^1$  がニトロ、 $R^{14}$  がエチル、 $R^{15}$  が *sec*-ブチル、及び  $R^{16}$  がメチルである点で異なる化合物 Ia492、特に化合物 Ia492.001～Ia492.180 が極めて好ましい：

**Ia492**

同様に、対応する化合物 Ia1.001～Ia1.180 とは、 $R^1$  がニトロ、 $R^{14}$  が *n*-プロピル、 $R^{15}$  が *sec*-ブチル、及び  $R^{16}$  がメチルである点で異なる化合物 Ia493、特に化合物 Ia493.001～Ia493.180 が極めて好ましい：

**Ia493**

10

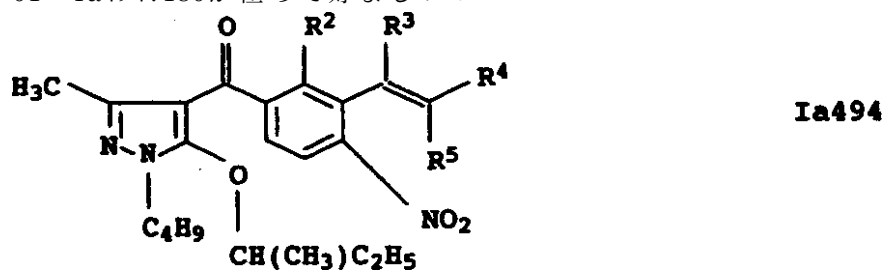
20

30

40

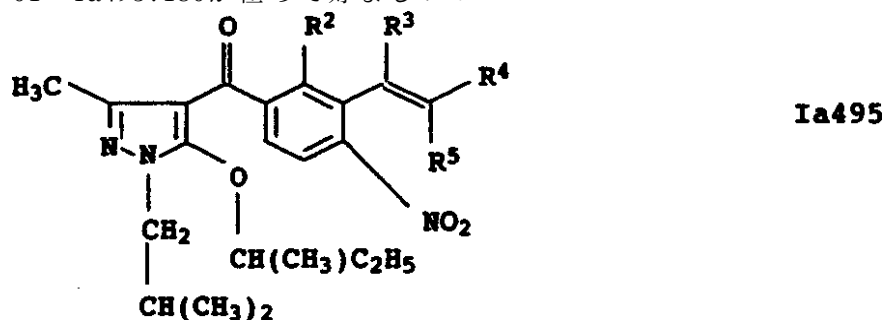
50

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がn-ブチル、 $R^{15}$ がsec-ブチル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia494、特に化合物Ia494.001～Ia494.180が極めて好ましい：



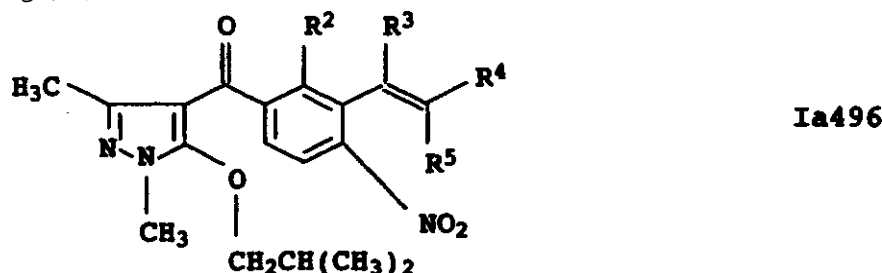
10

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がイソブチル、 $R^{15}$ がsec-ブチル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia495、特に化合物Ia495.001～Ia495.180が極めて好ましい：



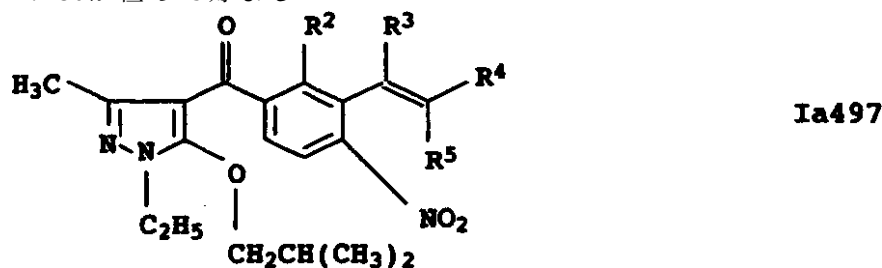
20

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{15}$ がイソブチル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia496、特に化合物Ia496.001～Ia496.180が極めて好ましい：



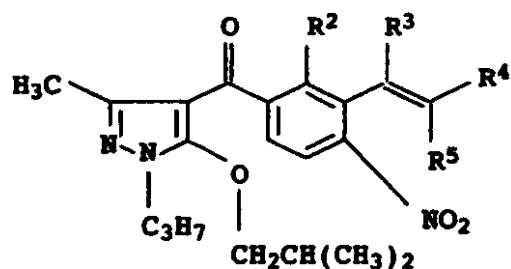
30

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がエチル、 $R^{15}$ がイソブチル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia497、特に化合物Ia497.001～Ia497.180が極めて好ましい：



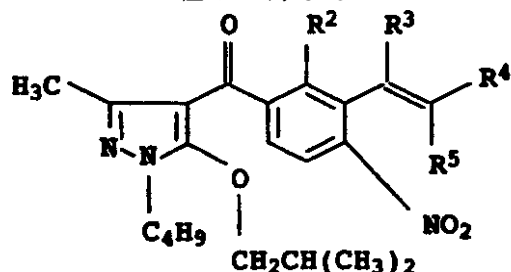
40

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がn-プロピル、 $R^{15}$ がイソブチル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia498、特に化合物Ia498.001～Ia498.180が極めて好ましい：

**Ia498**

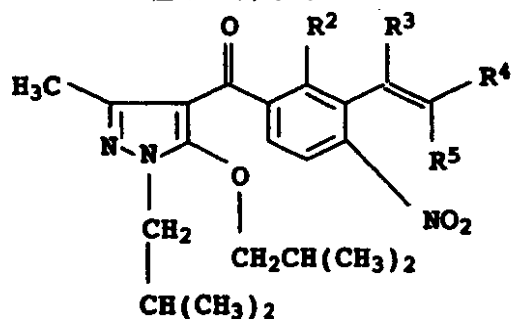
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がn-ブチル、 $R^{15}$ がイソブチル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia499、特に化合物Ia499.001～Ia499.180が極めて好ましい：

10

**Ia499**

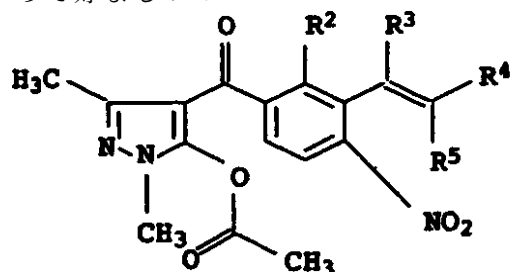
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ 及び $R^{15}$ がそれぞれイソブチル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia500、特に化合物Ia500.001～Ia500.180が極めて好ましい：

20

**Ia500**

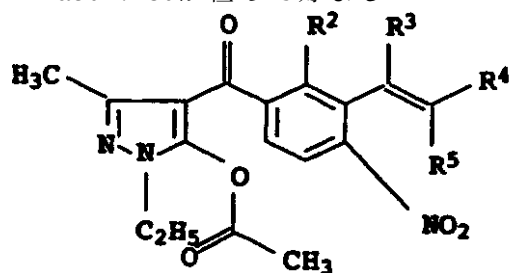
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{15}$ がメチルカルボニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia501、特に化合物Ia501.001～Ia501.180が極めて好ましい：

30

**Ia501**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がエチル、 $R^{15}$ がメチルカルボニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia502、特に化合物Ia502.001～Ia502.180が極めて好ましい：

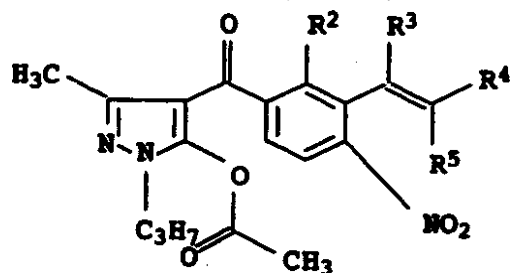
40

**Ia502**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がn-プロピル、 $R^{15}$ がメチルカルボニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia503、特に化合物Ia503.001～Ia503.180が極めて好ましい：

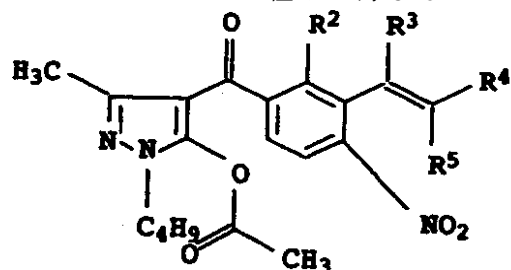
50

3.001~Ia503.180が極めて好ましい：



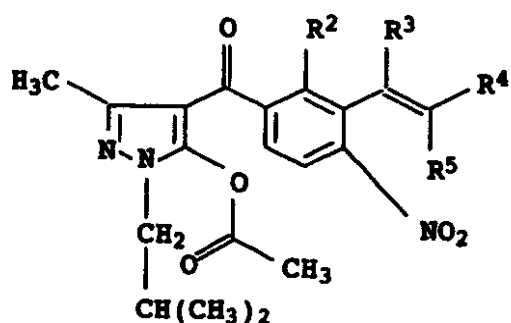
**Ia503**

同様に、対応する化合物Ia1.001~Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がn-ブチル、 $R^{15}$ がメチルカルボニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia504、特に化合物Ia504.001~Ia504.180が極めて好ましい：



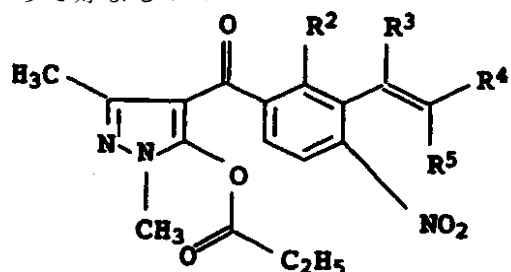
**Ia504**

同様に、対応する化合物Ia1.001~Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がイソブチル、 $R^{15}$ がメチルカルボニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia505、特に化合物Ia505.001~Ia505.180が極めて好ましい：



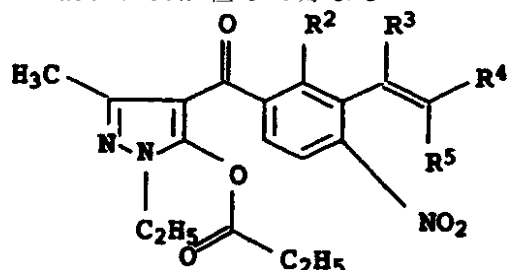
**Ia505**

同様に、対応する化合物Ia1.001~Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{15}$ がエチルカルボニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia506、特に化合物Ia506.001~Ia506.180が極めて好ましい：



**Ia506**

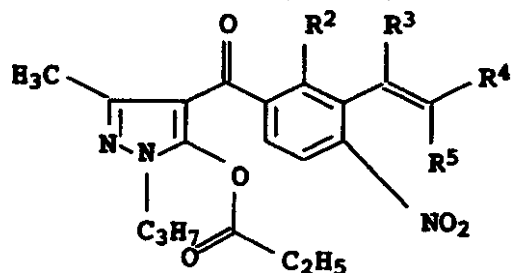
同様に、対応する化合物Ia1.001~Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がエチル、 $R^{15}$ がエチルカルボニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia507、特に化合物Ia507.001~Ia507.180が極めて好ましい：



**Ia507**

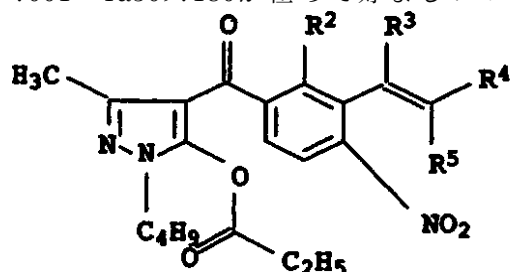
同様に、対応する化合物Ia1.001~Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がn-プロピル、 $R^{15}$

<sup>5</sup>がエチルカルボニル、及びR<sup>16</sup>がメチルである点で異なる化合物Ia508、特に化合物Ia508.001～Ia508.180が極めて好ましい：



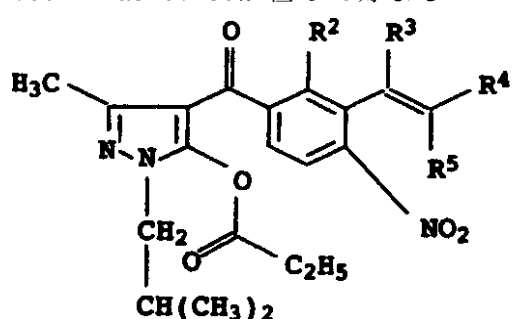
**Ia508**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、R<sup>1</sup>がニトロ、R<sup>14</sup>がn-ブチル、R<sup>15</sup>がエチルカルボニル、及びR<sup>16</sup>がメチルである点で異なる化合物Ia509、特に化合物Ia509.001～Ia509.180が極めて好ましい：



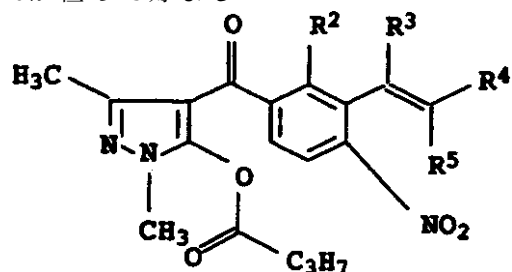
**Ia509**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、R<sup>1</sup>がニトロ、R<sup>14</sup>がイソブチル、R<sup>15</sup>がエチルカルボニル、及びR<sup>16</sup>がメチルである点で異なる化合物Ia510、特に化合物Ia510.001～Ia510.180が極めて好ましい：



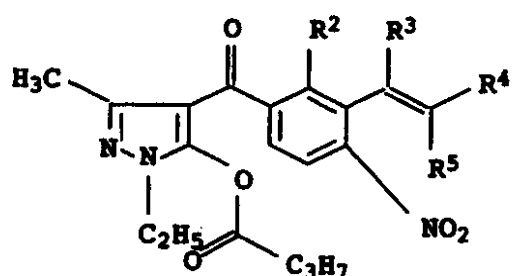
**Ia510**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、R<sup>1</sup>がニトロ、R<sup>15</sup>がn-プロピルカルボニル及びR<sup>16</sup>がメチルである点で異なる化合物Ia511、特に化合物Ia511.001～Ia511.180が極めて好ましい：



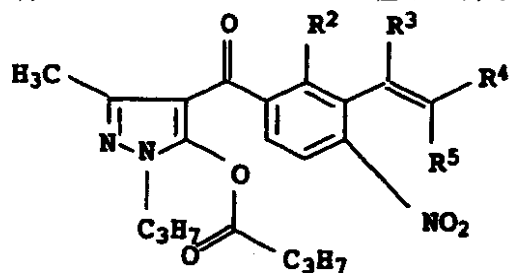
**Ia511**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、R<sup>1</sup>がニトロ、R<sup>14</sup>がエチル、R<sup>15</sup>がn-プロピルカルボニル、及びR<sup>16</sup>がメチルである点で異なる化合物Ia512、特に化合物Ia512.001～Ia512.180が極めて好ましい：



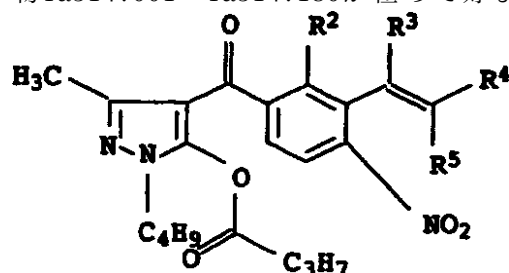
**La512**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がn-プロピル、 $R^{15}$ がn-プロピルカルボニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia513、特に化合物Ia513.001～Ia513.180が極めて好ましい：

**Ia513**

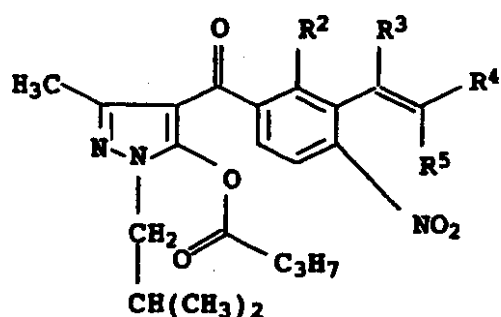
10

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がn-ブチル、 $R^{15}$ がn-プロピルカルボニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia514、特に化合物Ia514.001～Ia514.180が極めて好ましい：

**Ia514**

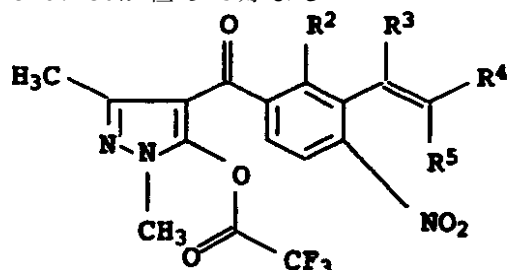
20

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がイソブチル、 $R^{15}$ がn-プロピルカルボニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia515、特に化合物Ia515.001～Ia515.180が極めて好ましい：

**Ia515**

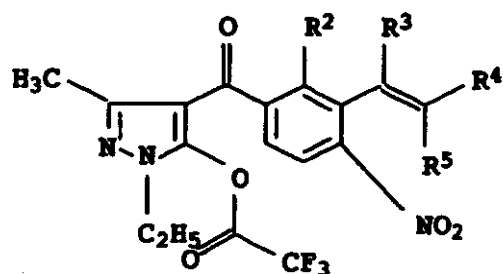
30

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{15}$ がトリフルオロメチルカルボニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia516、特に化合物Ia516.001～Ia516.180が極めて好ましい：

**Ia516**

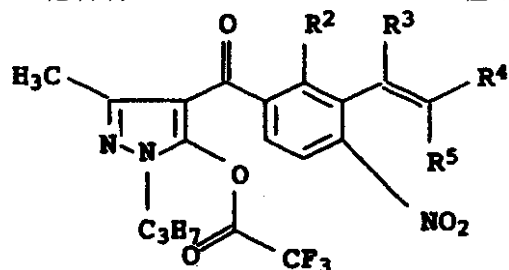
40

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がエチル、 $R^{15}$ がトリフルオロメチルカルボニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia517、特に化合物Ia517.001～Ia517.180が極めて好ましい：

**Ia517**

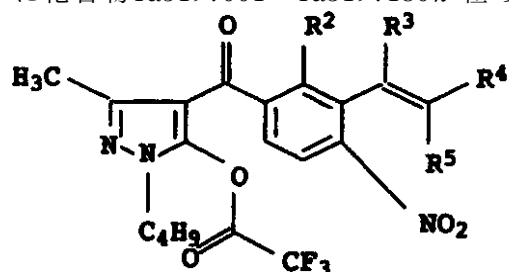
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がn-プロピル、 $R^5$ がトリフルオロメチルカルボニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia518、特に化合物Ia518.001～Ia518.180が極めて好ましい：

10

**Ia518**

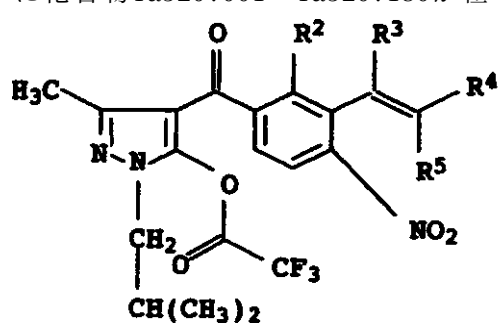
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がn-ブチル、 $R^{15}$ がトリフルオロメチルカルボニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia519、特に化合物Ia519.001～Ia519.180が極めて好ましい：

20

**Ia519**

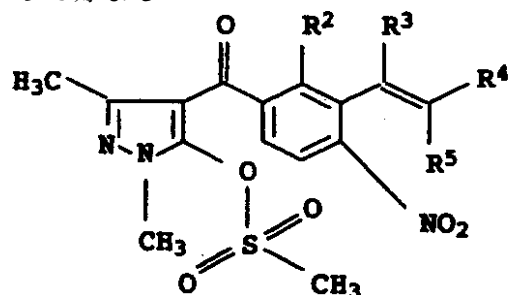
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がイソブチル、 $R^{15}$ がトリフルオロメチルカルボニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia520、特に化合物Ia520.001～Ia520.180が極めて好ましい：

30

**Ia520**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{15}$ がメチルスルホニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia521、特に化合物Ia521.001～Ia521.180が極めて好ましい：

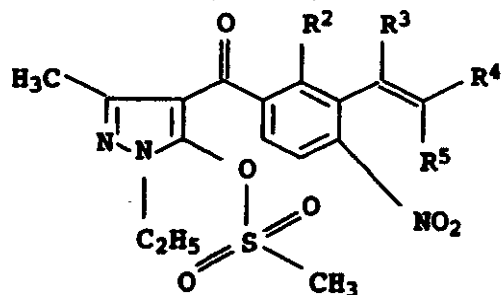
40

**Ia521**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がエチル、 $R^{15}$ がメ

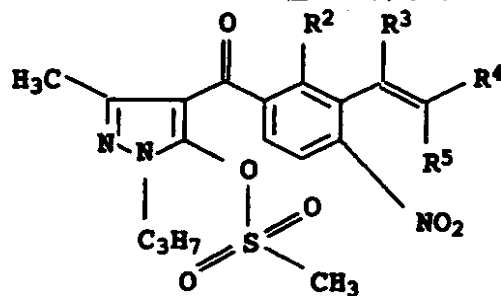
50

チルスルホニル、及び  $R^{16}$  がメチルである点で異なる化合物 Ia522、特に化合物 Ia522.001～Ia522.180 が極めて好ましい：

**Ia522**

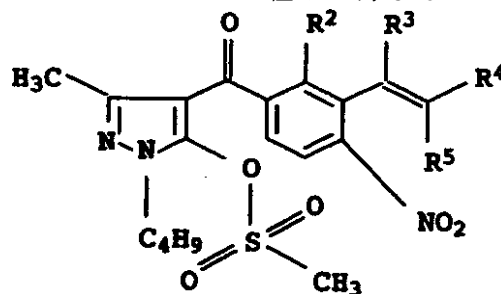
10

同様に、対応する化合物 Ia1.001～Ia1.180 とは、 $R^1$  がニトロ、 $R^{14}$  が *n*-プロピル、 $R^{15}$  がメチルスルホニル、及び  $R^{16}$  がメチルである点で異なる化合物 Ia523、特に化合物 Ia523.001～Ia523.180 が極めて好ましい：

**Ia523**

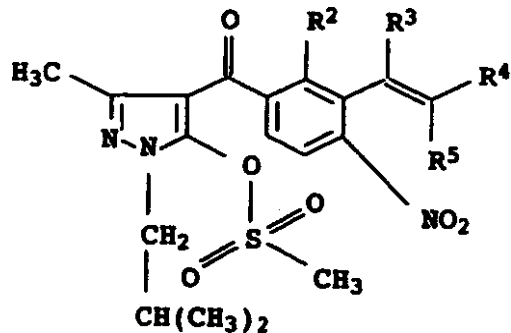
20

同様に、対応する化合物 Ia1.001～Ia1.180 とは、 $R^1$  がニトロ、 $R^{14}$  が *n*-ブチル、 $R^{15}$  がメチルスルホニル、及び  $R^{16}$  がメチルである点で異なる化合物 Ia524、特に化合物 Ia524.001～Ia524.180 が極めて好ましい：

**Ia524**

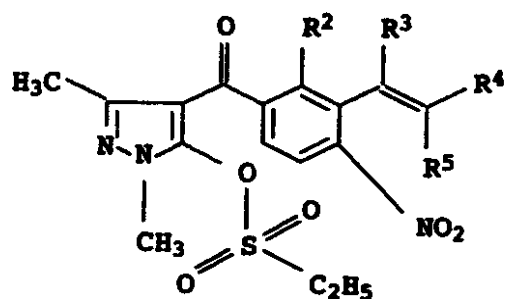
30

同様に、対応する化合物 Ia1.001～Ia1.180 とは、 $R^1$  がニトロ、 $R^{14}$  がイソブチル、 $R^{15}$  がメチルスルホニル、及び  $R^{16}$  がメチルである点で異なる化合物 Ia525、特に化合物 Ia525.001～Ia525.180 が極めて好ましい：

**Ia525**

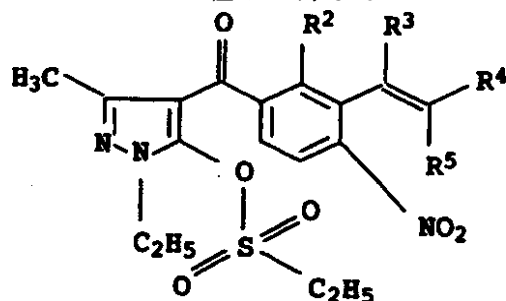
40

同様に、対応する化合物 Ia1.001～Ia1.180 とは、 $R^1$  がニトロ、 $R^{15}$  がエチルスルホニル、及び  $R^{16}$  がメチルである点で異なる化合物 Ia526、特に化合物 Ia526.001～Ia526.180 が極めて好ましい：

**Ia526**

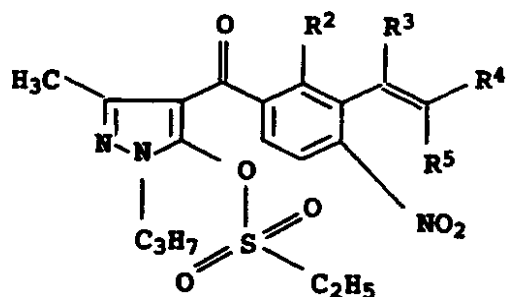
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がエチル、 $R^{15}$ がエチルスルホニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia527、特に化合物Ia527.001

10

**Ia527**

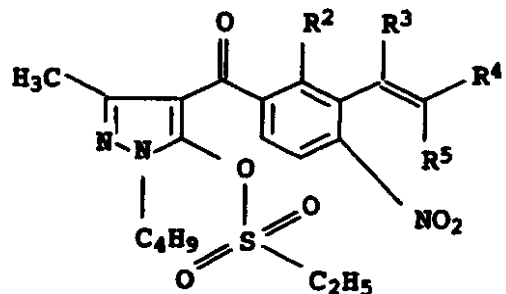
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がn-プロピル、 $R^{15}$ がエチルスルホニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia528、特に化合物Ia528.001～Ia528.180が極めて好ましい：

20

**Ia528**

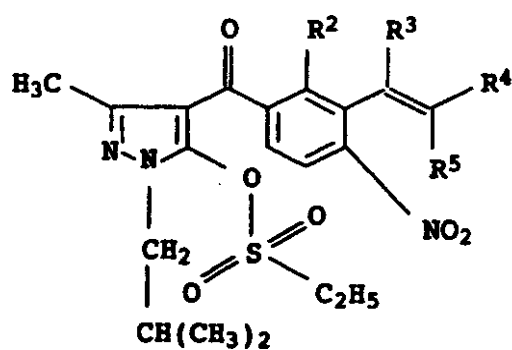
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がn-ブチル、 $R^{15}$ がエチルスルホニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia529、特に化合物Ia529.001～Ia529.180が極めて好ましい：

30

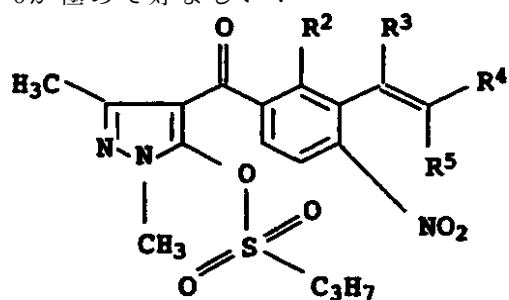
**Ia529**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がイソブチル、 $R^{15}$ がエチルスルホニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia530、特に化合物Ia530.001～Ia530.180が極めて好ましい：

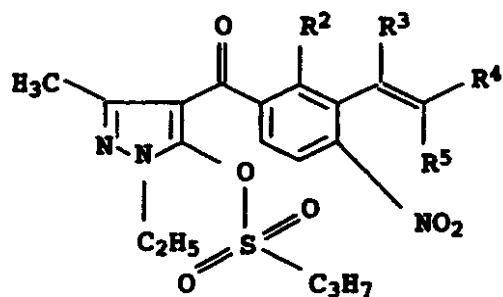
40

**Ia530**

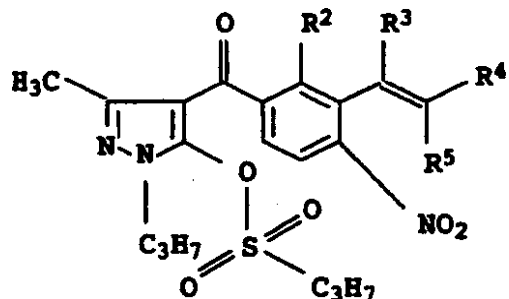
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{15}$ がn-プロピルスルホニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia531、特に化合物Ia531.001～Ia531.180が極めて好ましい：

**Ia531**

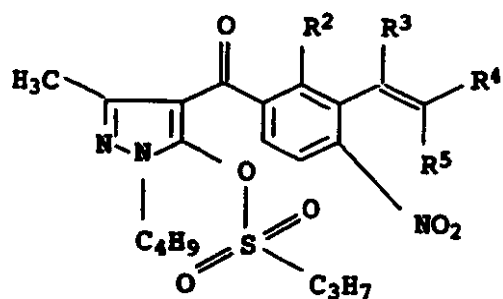
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がエチル、 $R^{15}$ がn-プロピルスルホニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia532、特に化合物Ia532.001～Ia532.180が極めて好ましい：

**Ia532**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がn-プロピル、 $R^{15}$ がn-プロピルスルホニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia533、特に化合物Ia533.001～Ia533.180が極めて好ましい：

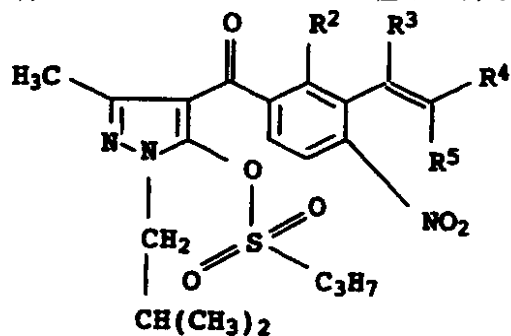
**Ia533**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がn-ブチル、 $R^{15}$ がn-プロピルスルホニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia534、特に化合物Ia534.001～Ia534.180が極めて好ましい：

**Ia534**

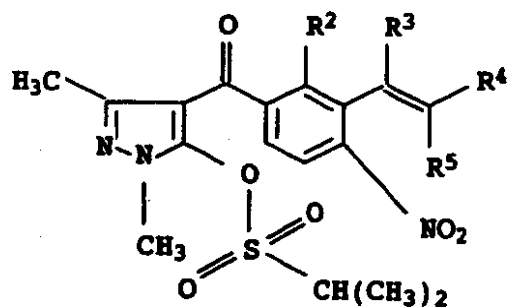
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がイソブチル、 $R^{15}$ がn-プロピルスルホニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia535、特に化合物Ia535.001～Ia535.180が極めて好ましい：

10

**Ia535**

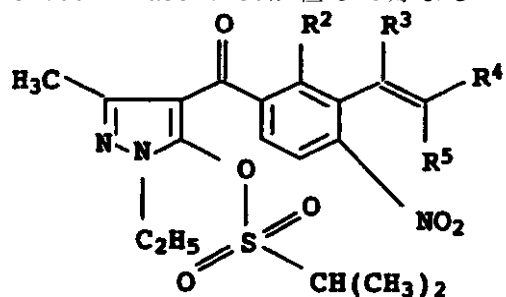
20

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{15}$ がイソプロピルスルホニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia536、特に化合物Ia536.001～Ia536.180が極めて好ましい：

**Ia536**

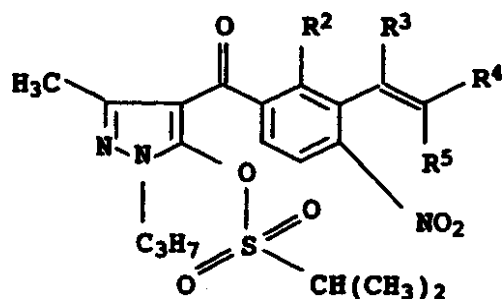
30

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がエチル、 $R^{15}$ がイソプロピルスルホニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia537、特に化合物Ia537.001～Ia537.180が極めて好ましい：

**Ia537**

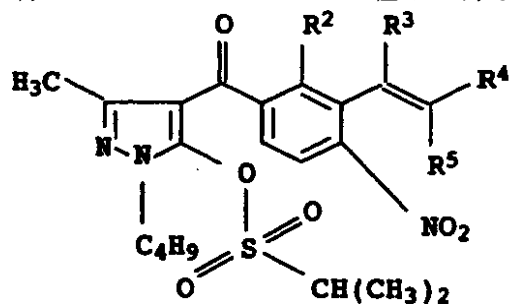
40

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がn-プロピル、 $R^{15}$ がイソプロピルスルホニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia538、特に化合物Ia538.001～Ia538.180が極めて好ましい：

**Ia538**

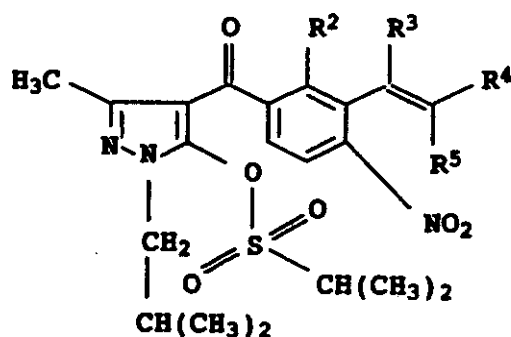
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がn-ブチル、 $R^{15}$ がイソプロピルスルホニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia539、特に化合物Ia539.001～Ia539.180が極めて好ましい：

10

**Ia539**

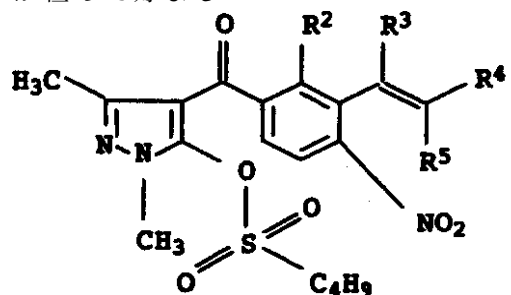
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がイソブチル、 $R^{15}$ がイソプロピルスルホニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia540、特に化合物Ia540.001～Ia540.180が極めて好ましい：

20

**Ia540**

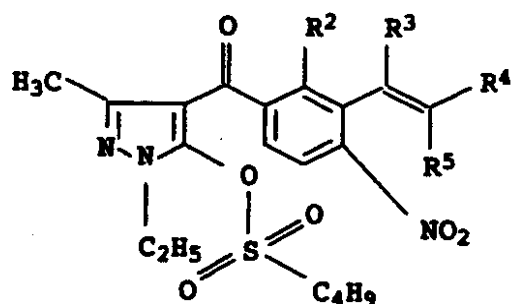
30

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{15}$ がn-ブチルスルホニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia541、特に化合物Ia541.001～Ia541.180が極めて好ましい：

**Ia541**

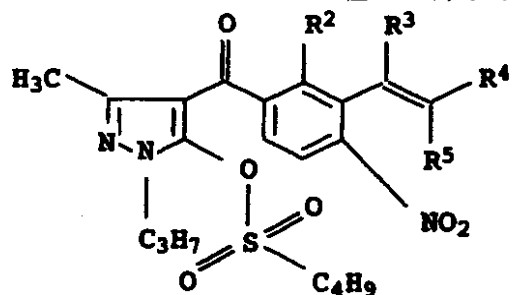
40

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がエチル、 $R^{15}$ がn-ブチルスルホニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia542、特に化合物Ia542.001～Ia542.180が極めて好ましい：

**Ia542**

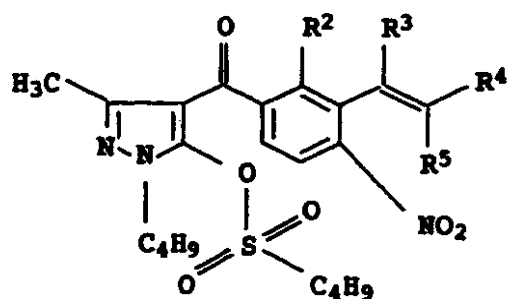
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がn-プロピル、 $R^{15}$ がn-ブチルスルホニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia543、特に化合物Ia543.001～Ia543.180が極めて好ましい：

10

**Ia543**

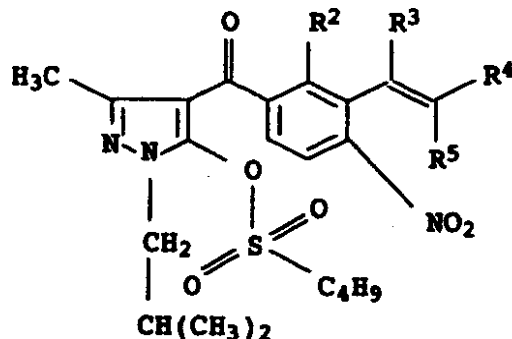
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がn-ブチル、 $R^{15}$ がn-ブチルスルホニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia544、特に化合物Ia544.001～Ia544.180が極めて好ましい：

20

**Ia544**

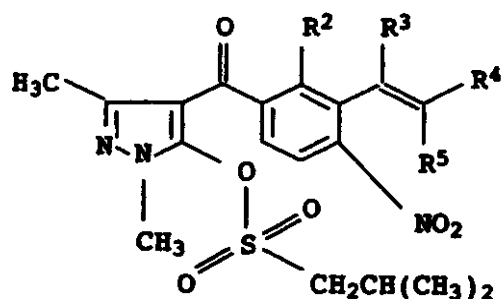
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がイソブチル、 $R^{15}$ がn-ブチルスルホニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia545、特に化合物Ia545.001～Ia545.180が極めて好ましい：

30

**Ia545**

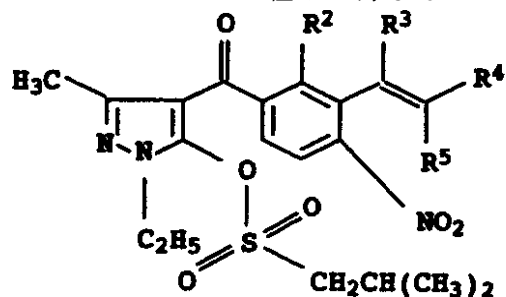
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{15}$ がイソブチルスルホニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia546、特に化合物Ia546.001～Ia546.180が極めて好ましい：

40

**Ia546**

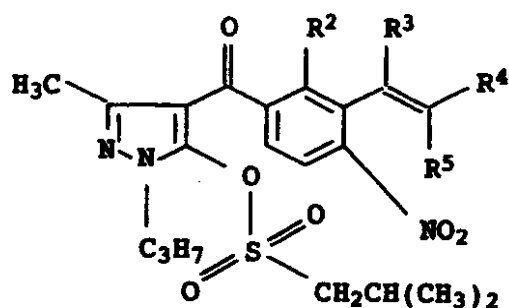
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がエチル、 $R^{15}$ がイソブチルスルホニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia547、特に化合物Ia547.001～Ia547.180が極めて好ましい：

10

**Ia547**

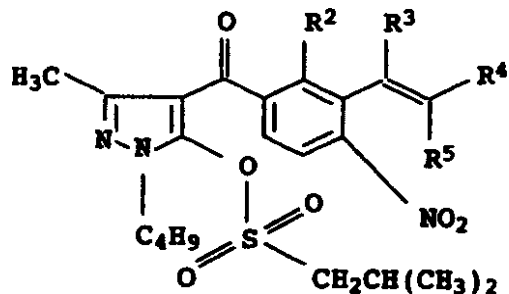
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がn-プロピル、 $R^{15}$ がイソブチルスルホニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia548、特に化合物Ia548.001～Ia548.180が極めて好ましい：

20

**Ia548**

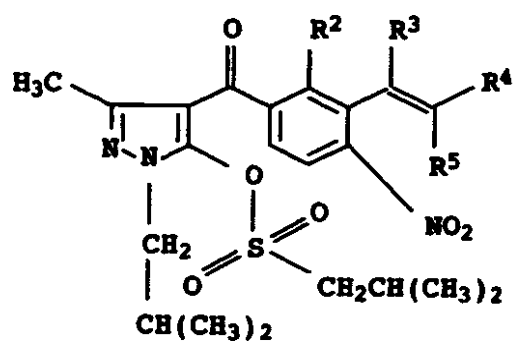
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がn-ブチル、 $R^{15}$ がイソブチルスルホニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia549、特に化合物Ia549.001～Ia549.180が極めて好ましい：

30

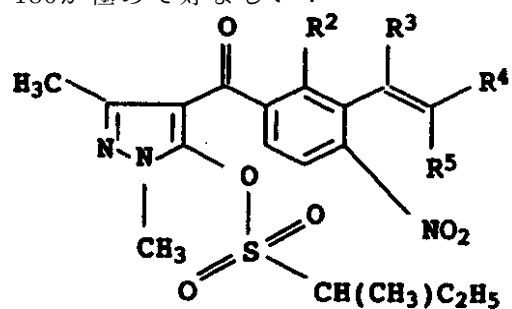
**Ia549**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がイソブチル、 $R^{15}$ がイソブチルスルホニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia550、特に化合物Ia550.001～Ia550.180が極めて好ましい：

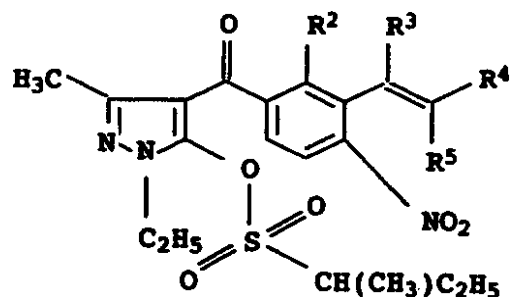
40

**Ia550**

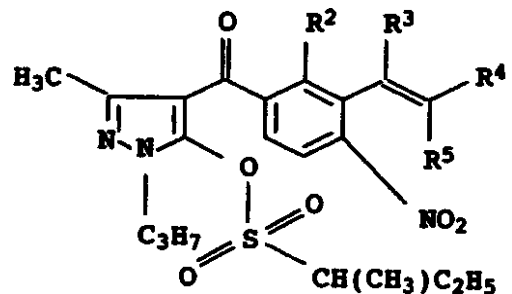
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{15}$ がsec-ブチルスルホニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia551、特に化合物Ia551.001～Ia551.180が極めて好ましい：

**Ia551**

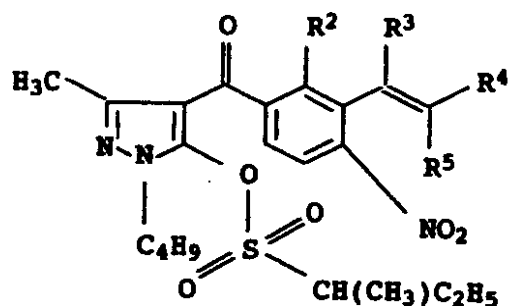
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がエチル、 $R^{15}$ がsec-ブチルスルホニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia552、特に化合物Ia552.001～Ia552.180が極めて好ましい：

**Ia552**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がn-プロピル、 $R^{15}$ がsec-ブチルスルホニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia553、特に化合物Ia553.001～Ia553.180が極めて好ましい：

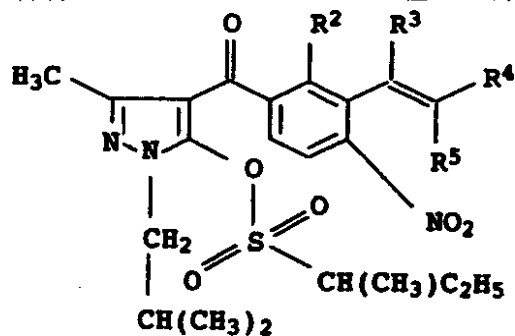
**Ia553**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がn-ブチル、 $R^{15}$ がsec-ブチルスルホニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia554、特に化合物Ia554.001～Ia554.180が極めて好ましい：

**Ia554**

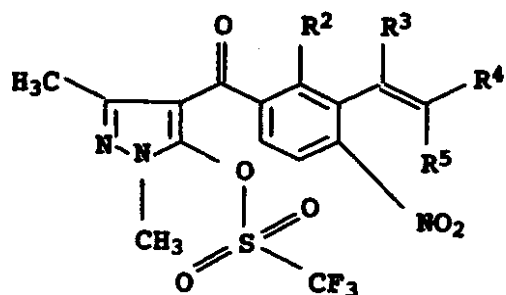
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がイソブチル、 $R^{15}$ がsec-ブチルスルホニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia555、特に化合物Ia555.001～Ia555.180が極めて好ましい：

10

**Ia555**

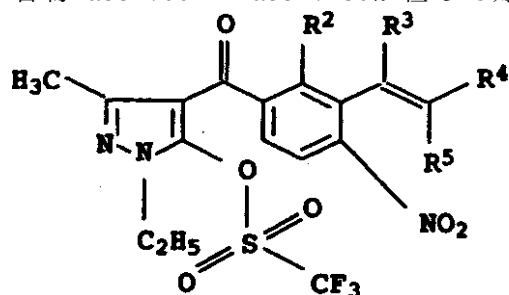
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{15}$ がトリフルオロメチルスルホニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia556、特に化合物Ia556.001～Ia556.180が極めて好ましい：

20

**Ia556**

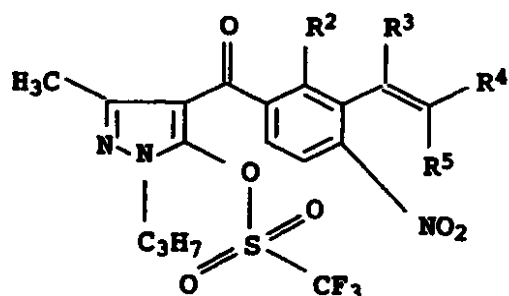
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がエチル、 $R^{15}$ がトリフルオロメチルスルホニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia557、特に化合物Ia557.001～Ia557.180が極めて好ましい：

30

**Ia557**

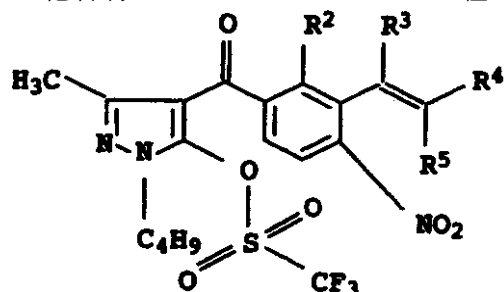
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がn-プロピル、 $R^{15}$ がトリフルオロメチルスルホニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia558、特に化合物Ia558.001～Ia558.180が極めて好ましい：

40

**Ia558**

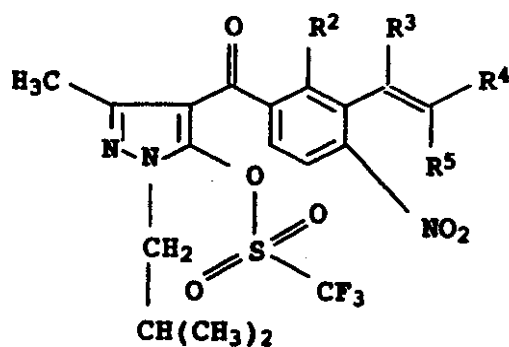
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がn-ブチル、 $R^{15}$ がトリフルオロメチルスルホニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia559、特に化合物Ia559.001～Ia559.180が極めて好ましい：

10

**Ia559**

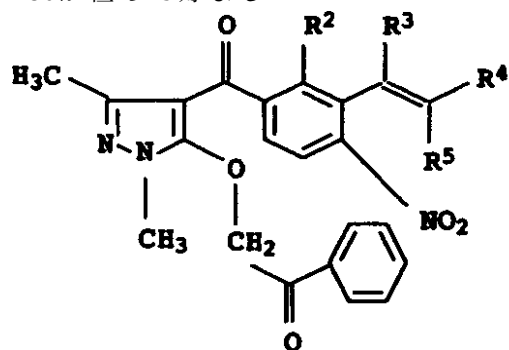
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がイソブチル、 $R^{15}$ がトリフルオロメチルスルホニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia560、特に化合物Ia560.001～Ia560.180が極めて好ましい：

20

**Ia560**

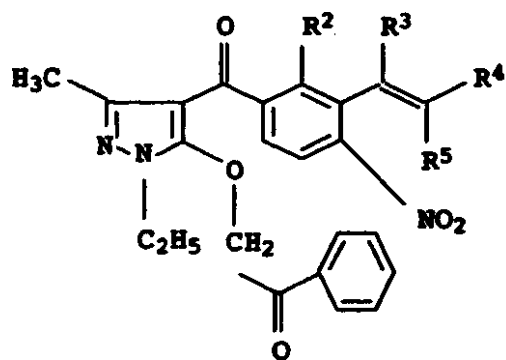
30

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{15}$ がフェニルカルボニルメチル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia561、特に化合物Ia561.001～Ia561.180が極めて好ましい：

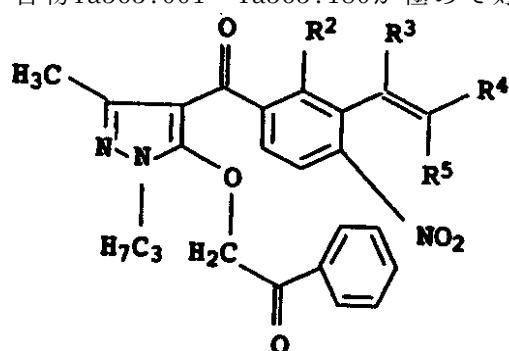
**Ia561**

40

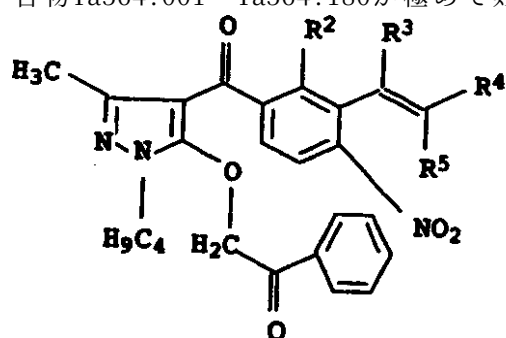
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がエチル、 $R^{15}$ がフェニルカルボニルメチル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia562、特に化合物Ia562.001～Ia562.180が極めて好ましい：

**Ia562**

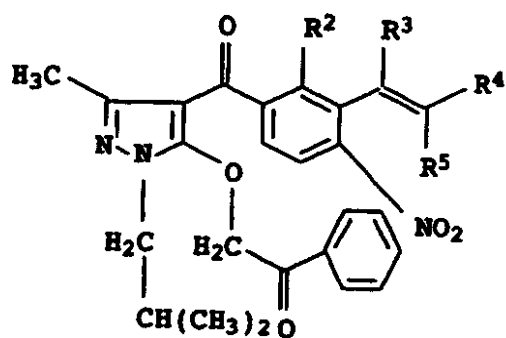
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がn-プロピル、 $R^{15}$ がフェニルカルボニルメチル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia563、特に化合物Ia563.001～Ia563.180が極めて好ましい：

**Ia563**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がn-ブチル、 $R^{15}$ がフェニルカルボニルメチル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia564、特に化合物Ia564.001～Ia564.180が極めて好ましい：

**Ia564**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がイソブチル、 $R^{15}$ がフェニルカルボニルメチル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia565、特に化合物Ia565.001～Ia565.180が極めて好ましい：

**Ia565**

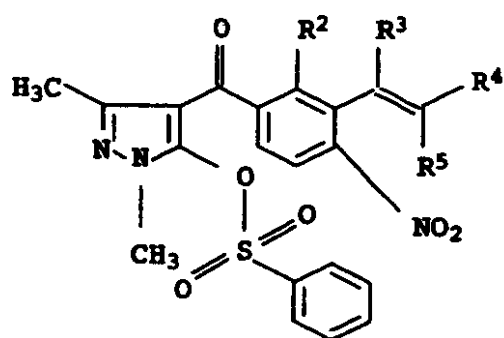
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{15}$ がフェニルスルホニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia566、特に化合物Ia566.001～Ia566.180が極めて好ましい：

10

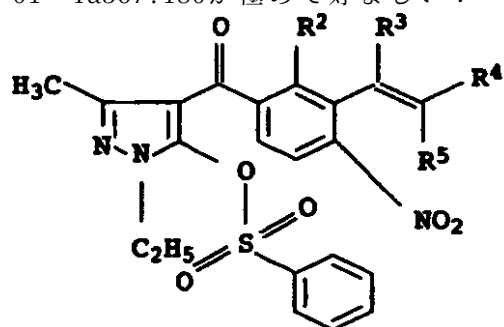
20

30

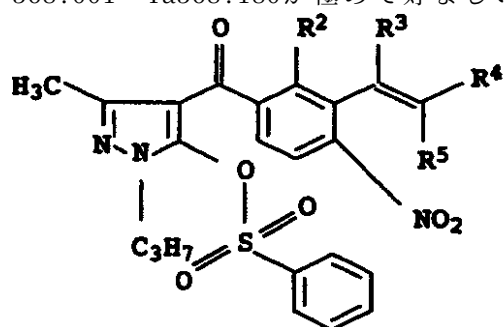
40

**Ia566**

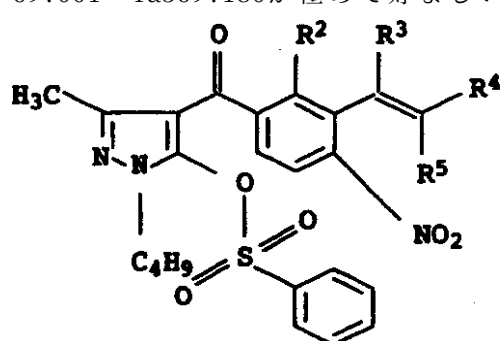
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がエチル、 $R^{15}$ がフェニルスルホニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia567、特に化合物Ia567.01～Ia567.180が極めて好ましい：

**Ia567**

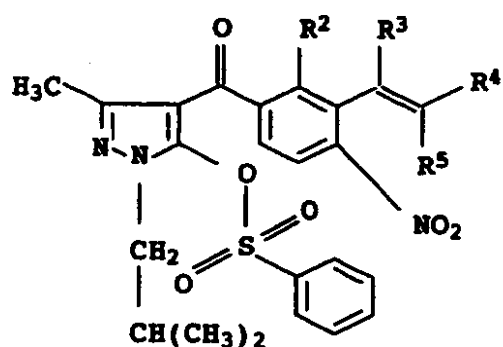
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がn-プロピル、 $R^{15}$ がフェニルスルホニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia568、特に化合物Ia568.001～Ia568.180が極めて好ましい：

**Ia568**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がn-ブチル、 $R^{15}$ がフェニルスルホニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia569、特に化合物Ia569.001～Ia569.180が極めて好ましい：

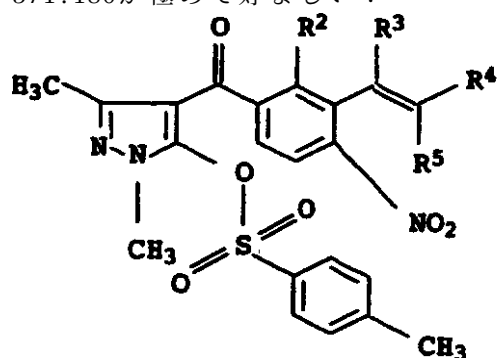
**Ia569**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がイソブチル、 $R^{15}$ がフェニルスルホニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia570、特に化合物Ia570.001～Ia570.180が極めて好ましい：



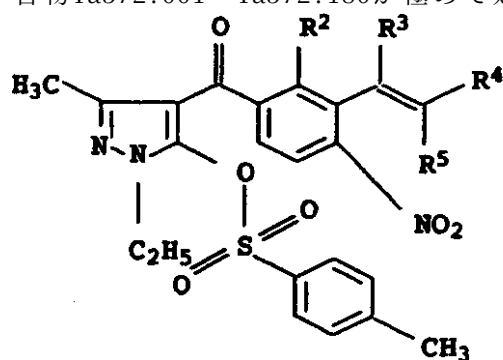
**Ia570**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、R<sup>1</sup>がニトロ、R<sup>15</sup>が4-メチルフェニルスルホニル及びR<sup>16</sup>がメチルである点で異なる化合物Ia571、特に化合物Ia571.001～Ia571.180が極めて好ましい：



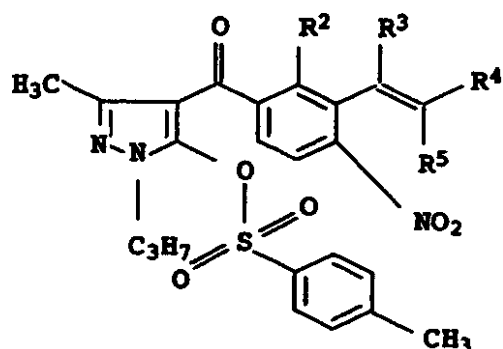
**Ia571**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、R<sup>1</sup>がニトロ、R<sup>14</sup>がエチル、R<sup>15</sup>が4-メチルフェニルスルホニル、及びR<sup>16</sup>がメチルである点で異なる化合物Ia572、特に化合物Ia572.001～Ia572.180が極めて好ましい：



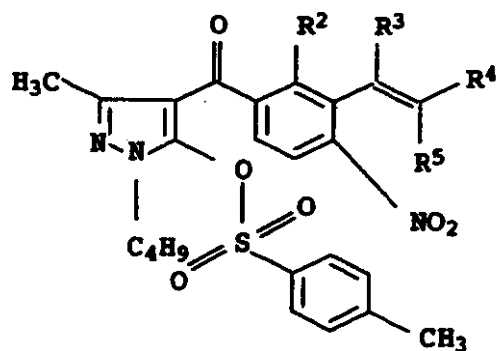
**Ia572**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、R<sup>1</sup>がニトロ、R<sup>14</sup>がn-プロピル、R<sup>15</sup>が4-メチルフェニルスルホニル、及びR<sup>16</sup>がメチルである点で異なる化合物Ia573、特に化合物Ia573.001～Ia573.180が極めて好ましい：

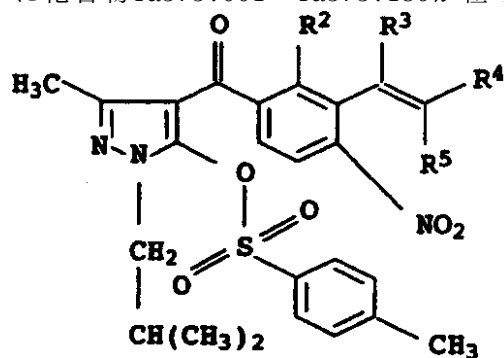


**Ia573**

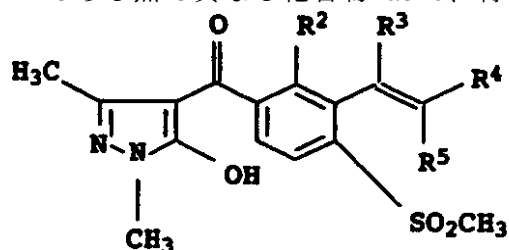
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、R<sup>1</sup>がニトロ、R<sup>14</sup>がn-ブチル、R<sup>15</sup>が4-メチルフェニルスルホニル、及びR<sup>16</sup>がメチルである点で異なる化合物Ia574、特に化合物Ia574.001～Ia574.180が極めて好ましい：

**Ia574**

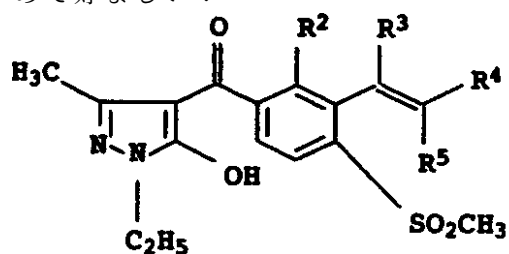
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がニトロ、 $R^{14}$ がイソブチル、 $R^{15}$ が4-メチルフェニルスルホニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia575、特に化合物Ia575.001～Ia575.180が極めて好ましい：

**Ia575**

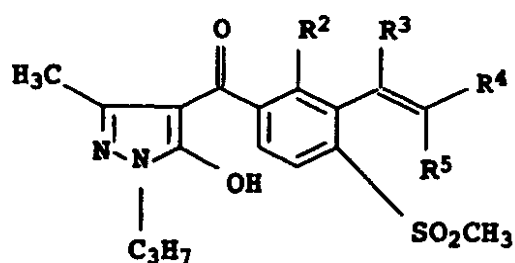
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia576、特に化合物Ia576.001～Ia576.180が極めて好ましい：

**Ia576**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がエチル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia577、特に化合物Ia577.001～Ia577.180が極めて好ましい：

**Ia577**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がn-プロピル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia578、特に化合物Ia578.001～Ia578.180が極めて好ましい：

**Ia578**

10

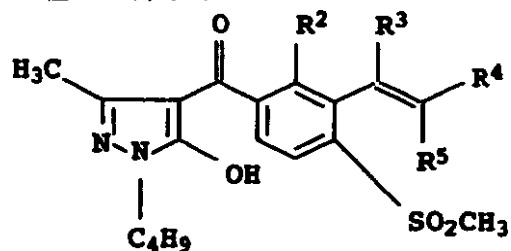
20

30

40

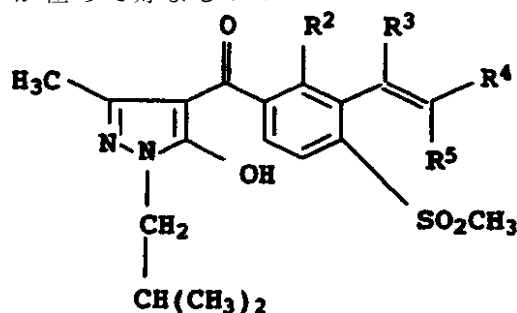
50

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がn-ブチル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia579、特に化合物Ia579.001～Ia579.180が極めて好ましい：

**Ia579**

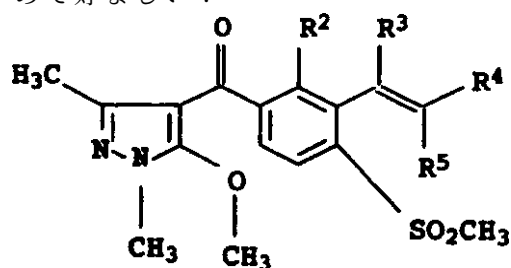
10

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がイソブチル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia580、特に化合物Ia580.001～Ia580.180が極めて好ましい：

**Ia580**

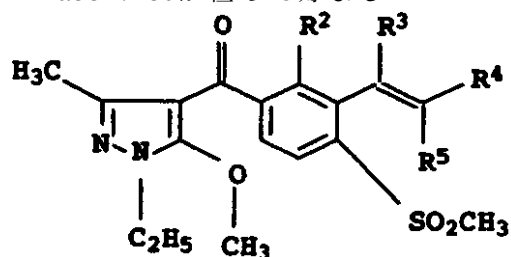
20

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{15}$ 及び $R^{16}$ がそれぞれメチルである点で異なる化合物Ia581、特に化合物Ia581.001～Ia581.180が極めて好ましい：

**Ia581**

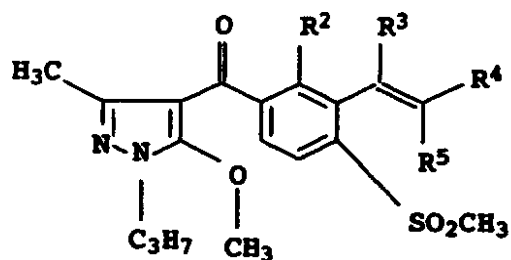
30

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がエチル及び $R^{15}$ 及び $R^{16}$ がそれぞれメチルである点で異なる化合物Ia582、特に化合物Ia582.001～Ia582.180が極めて好ましい：

**Ia582**

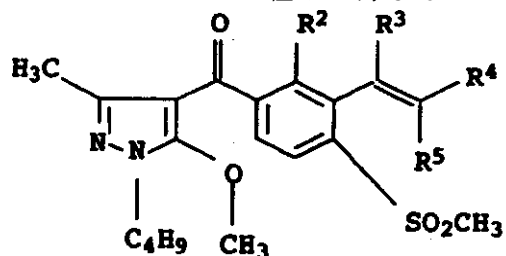
40

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がn-プロピル及び $R^{15}$ 及び $R^{16}$ がそれぞれメチルである点で異なる化合物Ia583、特に化合物Ia583.001～Ia583.180が極めて好ましい：

**Ia583**

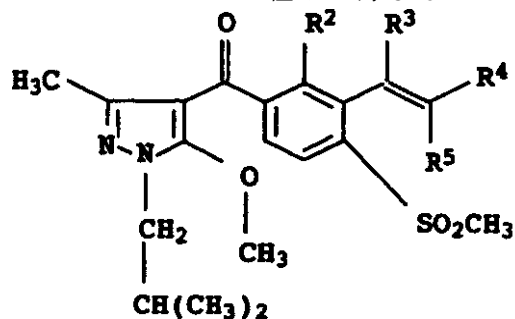
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がn-ブチル及び $R^{15}$ 及び $R^{16}$ がそれぞれメチルである点で異なる化合物Ia584、特に化合物Ia584.001～Ia584.180が極めて好ましい：

10

**Ia584**

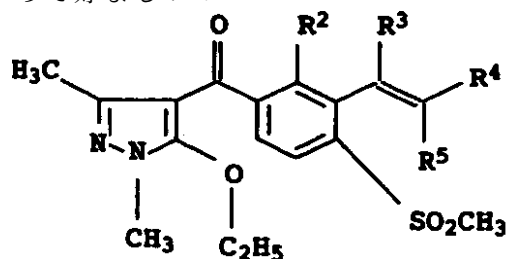
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がイソブチル及び $R^{15}$ 及び $R^{16}$ がそれぞれメチルである点で異なる化合物Ia585、特に化合物Ia585.001～Ia585.180が極めて好ましい：

20

**Ia585**

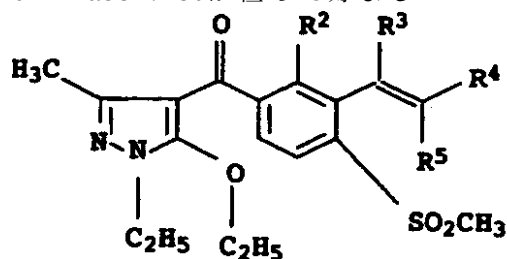
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{15}$ がエチル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia586、特に化合物Ia586.001～Ia586.180が極めて好ましい：

30

**Ia586**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ 及び $R^{15}$ がそれぞれエチル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia587、特に化合物Ia587.001～Ia587.180が極めて好ましい：

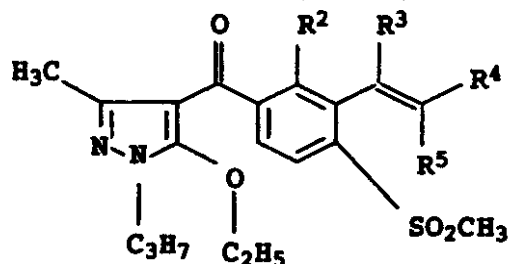
40

**Ia587**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がn-プロピル、 $R^{15}$ がエチル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia588、特に化合物Ia588.001～Ia588.180が極めて好ましい：

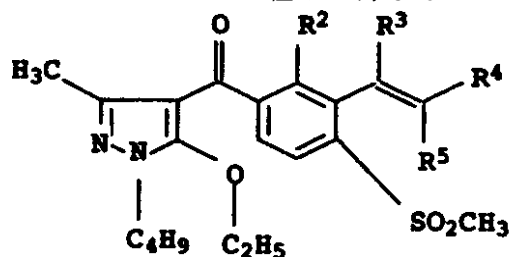
50

88.001～Ia588.180が極めて好ましい：



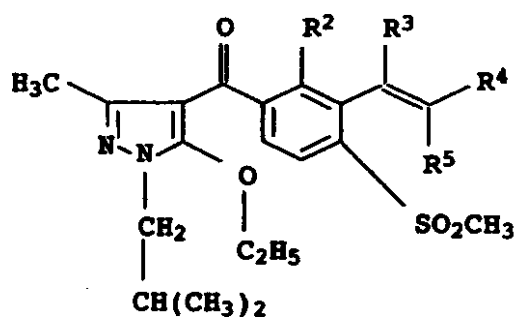
**Ia588**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がn-ブチル、 $R^{15}$ がエチル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia589、特に化合物Ia589.001～Ia589.180が極めて好ましい：



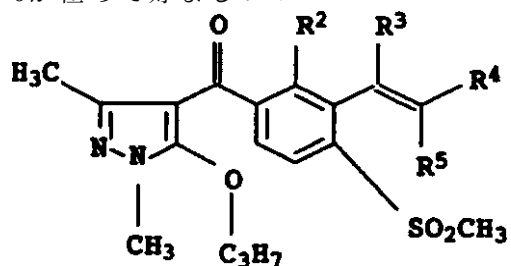
**Ia589**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がイソブチル、 $R^{15}$ がエチル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia590、特に化合物Ia590.001～Ia590.180が極めて好ましい：



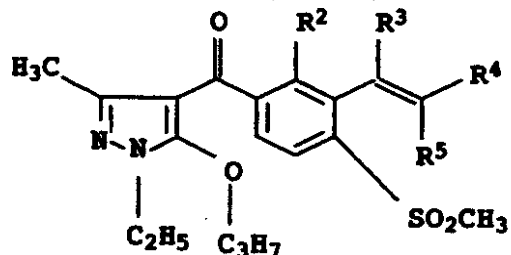
**Ia590**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{15}$ がn-プロピル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia591、特に化合物Ia591.001～Ia591.180が極めて好ましい：



**Ia591**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がエチル、 $R^{15}$ がn-プロピル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia592、特に化合物Ia592.001～Ia592.180が極めて好ましい：



**Ia592**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ 及び $R^{15}$

10

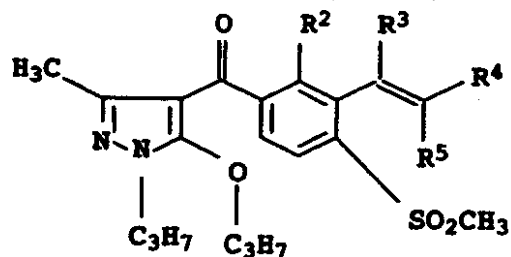
20

30

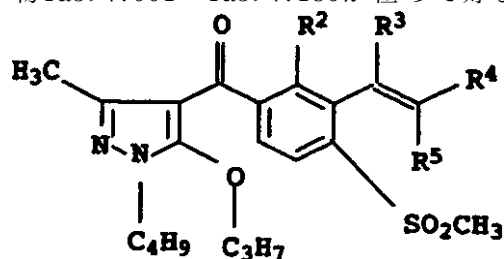
40

50

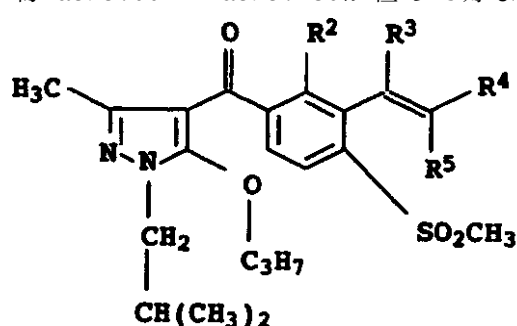
がそれぞれ  $n$ -プロピル、及び  $R^{16}$  がメチルである点で異なる化合物 Ia593、特に化合物 Ia593.001~Ia593.180 が極めて好ましい：

**Ia593**

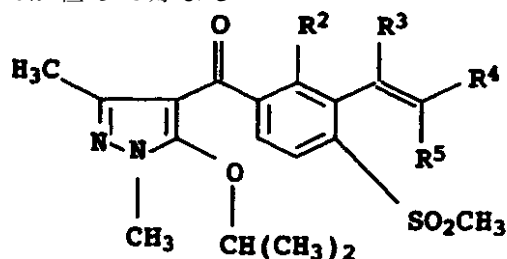
同様に、対応する化合物 Ia1.001~Ia1.180 とは、 $R^1$  がメチルスルホニル、 $R^{14}$  が  $n$ -ブチル、 $R^{15}$  が  $n$ -プロピル、及び  $R^{16}$  がメチルである点で異なる化合物 Ia594、特に化合物 Ia594.001~Ia594.180 が極めて好ましい：

**Ia594**

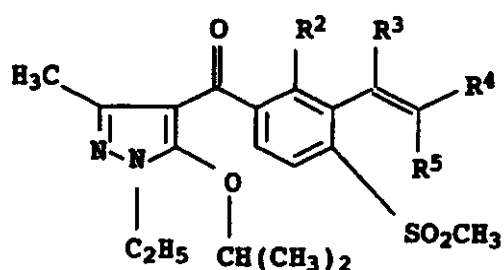
同様に、対応する化合物 Ia1.001~Ia1.180 とは、 $R^1$  がメチルスルホニル、 $R^{14}$  がイソブチル、 $R^{15}$  が  $n$ -プロピル、及び  $R^{16}$  がメチルである点で異なる化合物 Ia595、特に化合物 Ia595.001~Ia595.180 が極めて好ましい：

**Ia595**

同様に、対応する化合物 Ia1.001~Ia1.180 とは、 $R^1$  がメチルスルホニル、 $R^{15}$  がイソプロピル及び  $R^{16}$  がメチルである点で異なる化合物 Ia596、特に化合物 Ia596.001~Ia596.180 が極めて好ましい：

**Ia596**

同様に、対応する化合物 Ia1.001~Ia1.180 とは、 $R^1$  がメチルスルホニル、 $R^{14}$  がエチル、 $R^{15}$  がイソプロピル及び  $R^{16}$  がメチルである点で異なる化合物 Ia597、特に化合物 Ia597.001~Ia597.180 が極めて好ましい：

**Ia597**

10

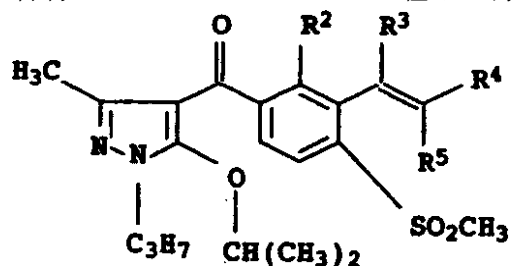
20

30

40

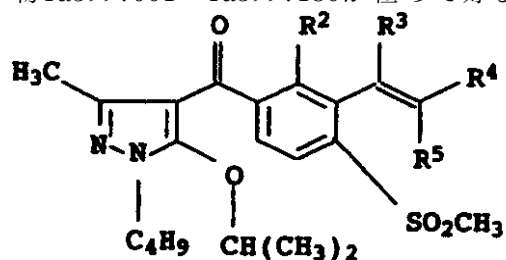
50

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がn-プロピル、 $R^{15}$ がイソプロピル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia598、特に化合物Ia598.001～Ia598.180が極めて好ましい：

**Ia598**

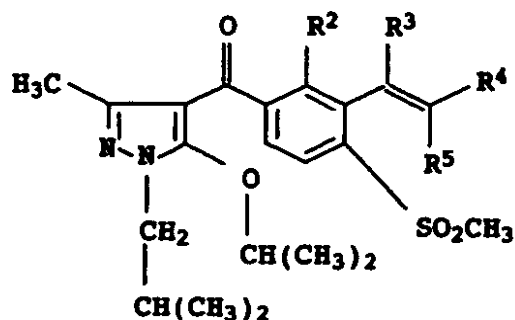
10

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がn-ブチル、 $R^{15}$ がイソプロピル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia599、特に化合物Ia599.001～Ia599.180が極めて好ましい：

**Ia599**

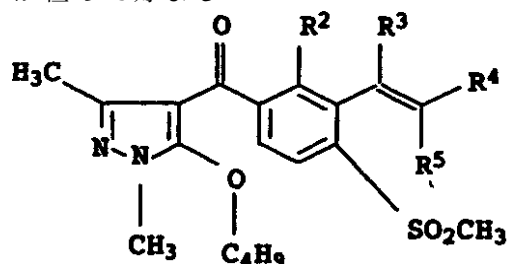
20

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がイソブチル、 $R^{15}$ がイソプロピル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia600、特に化合物Ia600.001～Ia600.180が極めて好ましい：

**Ia600**

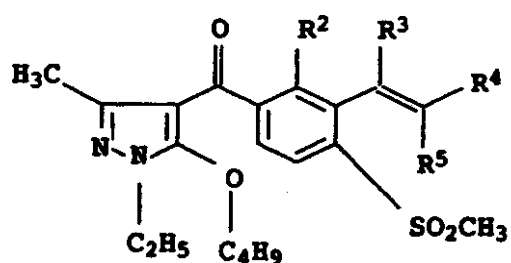
30

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{15}$ がn-ブチル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia601、特に化合物Ia601.001～Ia601.180が極めて好ましい：

**Ia601**

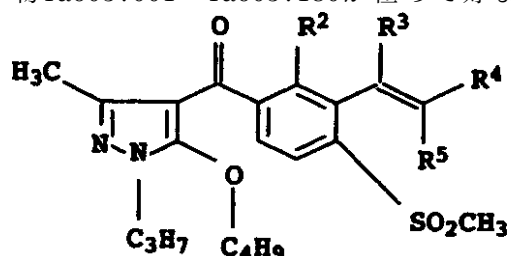
40

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がエチル、 $R^{15}$ がn-ブチル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia602、特に化合物Ia602.001～Ia602.180が極めて好ましい：

**Ia602**

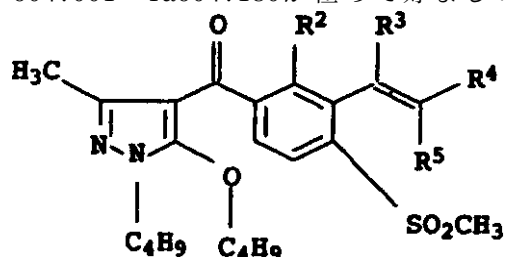
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がn-プロピル、 $R^{15}$ がn-ブチル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia603、特に化合物Ia603.001～Ia603.180が極めて好ましい：

10

**Ia603**

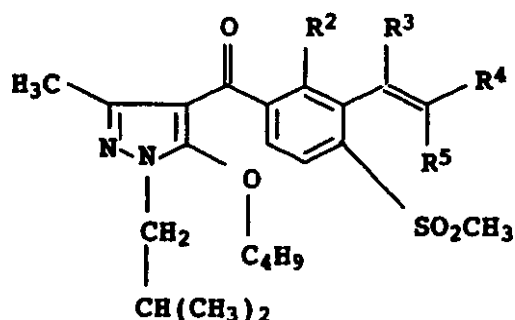
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ が及び $R^{15}$ がそれぞれn-ブチル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia604、特に化合物Ia604.001～Ia604.180が極めて好ましい：

20

**Ia604**

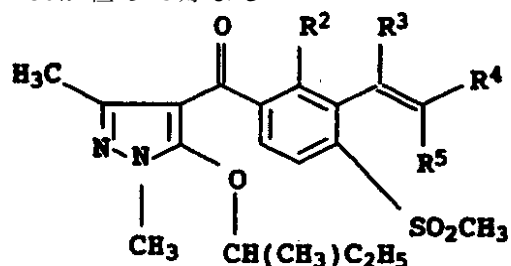
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がイソブチル、 $R^{15}$ がn-ブチル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia605、特に化合物Ia605.001～Ia605.180が極めて好ましい：

30

**Ia605**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{15}$ がsec-ブチル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia606、特に化合物Ia606.001～Ia606.180が極めて好ましい：

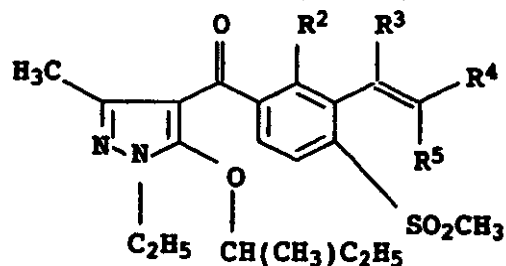
40

**Ia606**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がエチル、 $R^{15}$ がsec-ブチル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia607、特に化合物Ia607.001～Ia607.180が極めて好ましい：

50

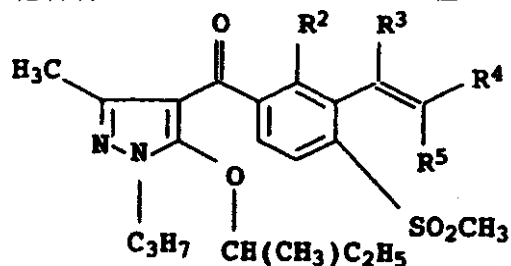
07.001～Ia607.180が極めて好ましい：



**Ia607**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がn-プロピル、 $R^{15}$ がsec-ブチル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia608、特に化合物Ia608.001～Ia608.180が極めて好ましい：

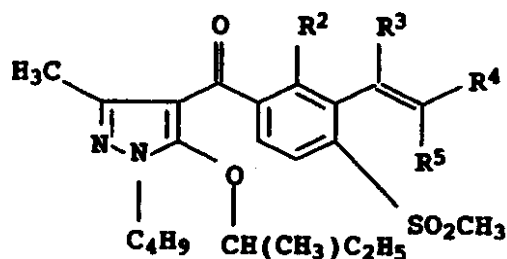
10



**Ia608**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がn-ブチル、 $R^{15}$ がsec-ブチル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia609、特に化合物Ia609.001～Ia609.180が極めて好ましい：

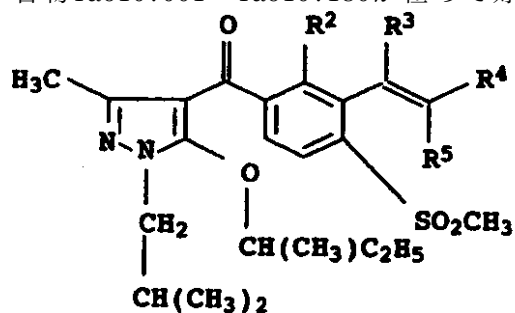
20



**Ia609**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がイソブチル、 $R^{15}$ がsec-ブチル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia610、特に化合物Ia610.001～Ia610.180が極めて好ましい：

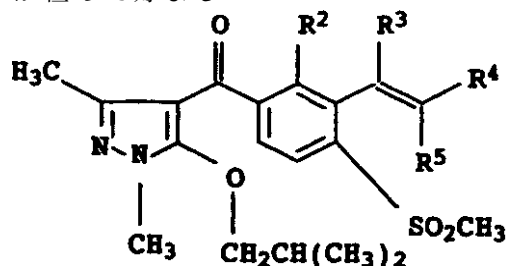
30



**Ia610**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{15}$ がイソブチル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia611、特に化合物Ia611.001～Ia611.180が極めて好ましい：

40

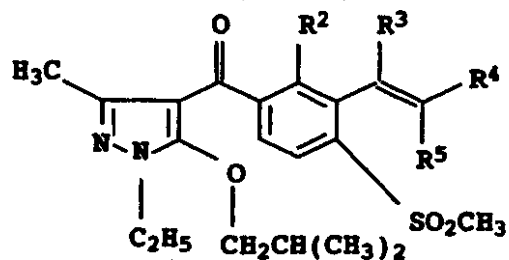


**Ia611**

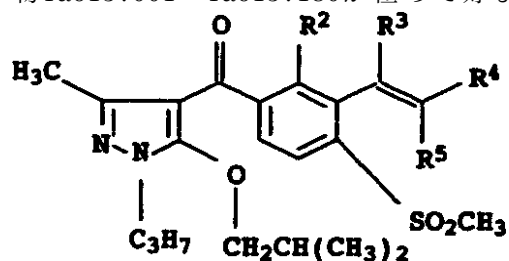
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がエチル

50

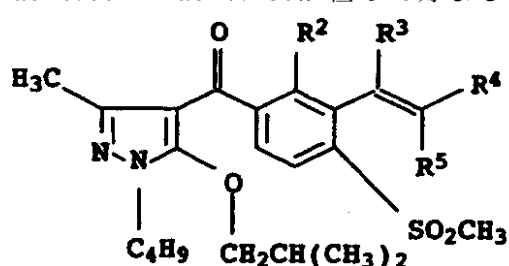
、 $R^{15}$ がイソブチル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia612、特に化合物Ia612.01～Ia612.180が極めて好ましい：

**Ia612**

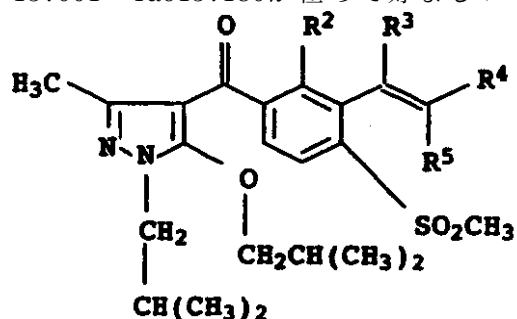
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がn-プロピル、 $R^{15}$ がイソブチル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia613、特に化合物Ia613.001～Ia613.180が極めて好ましい：

**Ia613**

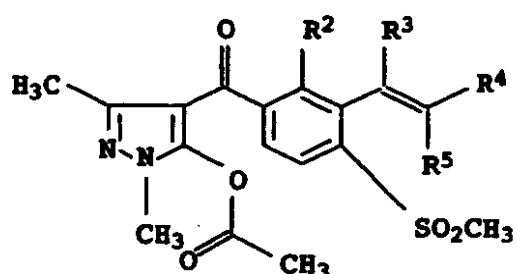
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がn-ブチル、 $R^{15}$ がイソブチル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia614、特に化合物Ia614.001～Ia614.180が極めて好ましい：

**Ia614**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ 及び $R^{15}$ がそれぞれイソブチル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia615、特に化合物Ia615.001～Ia615.180が極めて好ましい：

**Ia615**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{15}$ がメチルカルボニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia616、特に化合物Ia616.001～Ia616.180が極めて好ましい：

**Ia616**

10

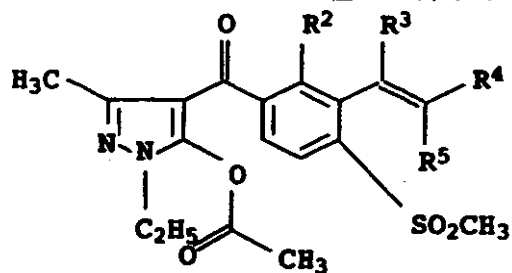
20

30

40

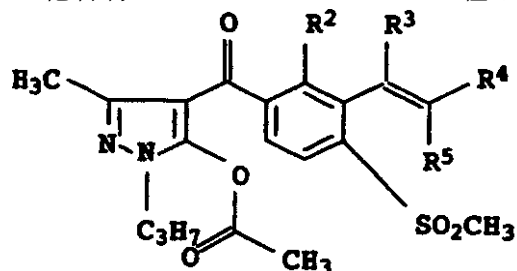
50

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がエチル、 $R^{15}$ がメチルカルボニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia617、特に化合物Ia617.001～Ia617.180が極めて好ましい：

**Ia617**

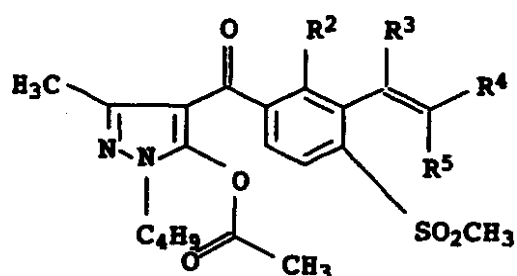
10

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がn-プロピル、 $R^{15}$ がメチルカルボニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia618、特に化合物Ia618.001～Ia618.180が極めて好ましい：

**Ia618**

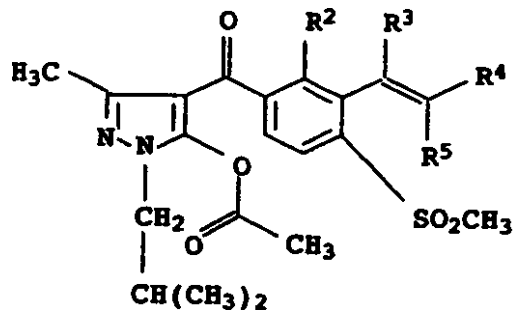
20

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がn-ブチル、 $R^{15}$ がメチルカルボニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia619、特に化合物Ia619.001～Ia619.180が極めて好ましい：

**Ia619**

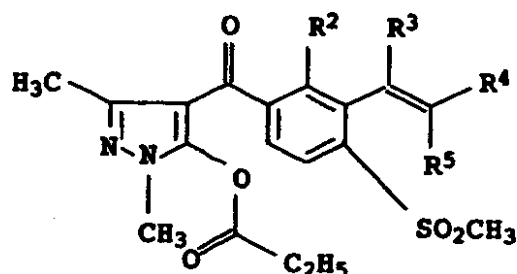
30

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がイソブチル、 $R^{15}$ がメチルカルボニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia620、特に化合物Ia620.001～Ia620.180が極めて好ましい：

**Ia620**

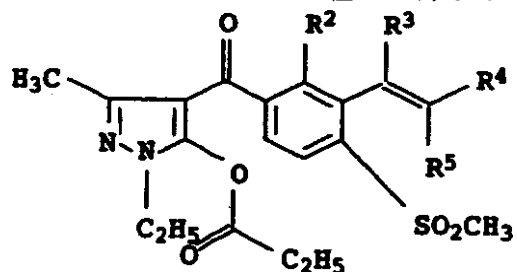
40

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{15}$ がエチルカルボニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia621、特に化合物Ia621.001～Ia621.180が極めて好ましい：

**Ia621**

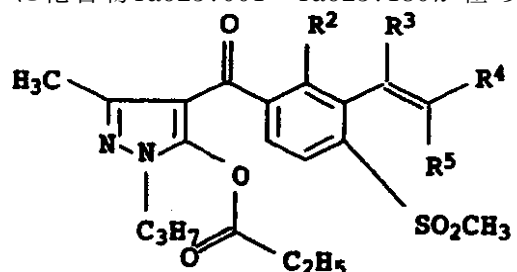
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がエチル、 $R^{15}$ がエチルカルボニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia622、特に化合物Ia622.001～Ia622.180が極めて好ましい：

10

**Ia622**

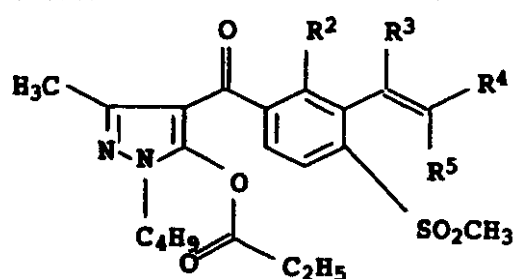
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がn-プロピル、 $R^{15}$ がエチルカルボニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia623、特に化合物Ia623.001～Ia623.180が極めて好ましい：

20

**Ia623**

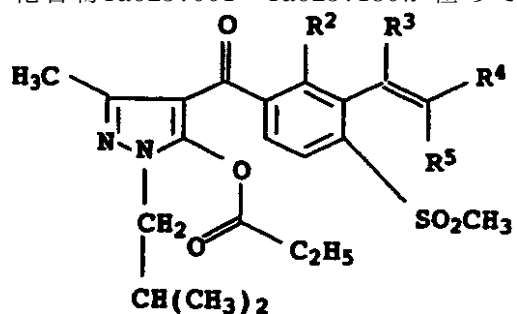
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がn-ブチル、 $R^{15}$ がエチルカルボニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia624、特に化合物Ia624.001～Ia624.180が極めて好ましい：

30

**Ia624**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がイソブチル、 $R^{15}$ がエチルカルボニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia625、特に化合物Ia625.001～Ia625.180が極めて好ましい：

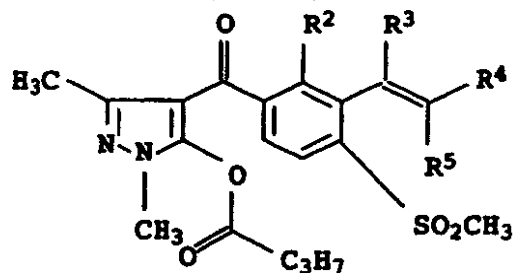
40

**Ia625**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{15}$ がn-プロピルカルボニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia626、特に化合物Ia626.001

50

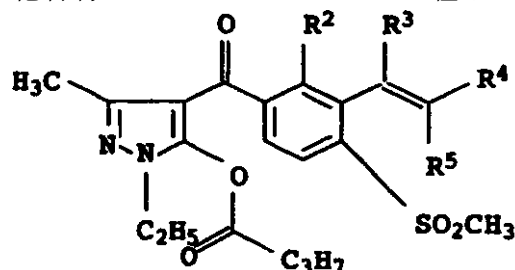
～Ia626.180が極めて好ましい：



**Ia626**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がエチル、 $R^{15}$ がn-プロピルカルボニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia627、特に化合物Ia627.001～Ia627.180が極めて好ましい：

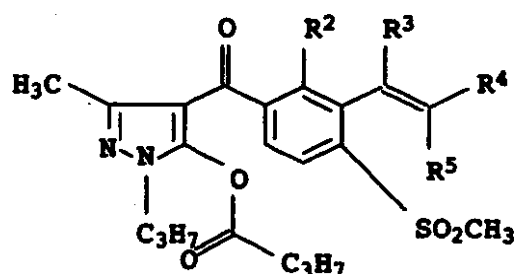
10



**Ia627**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がn-プロピル、 $R^{15}$ がn-プロピルカルボニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia628、特に化合物Ia628.001～Ia628.180が極めて好ましい：

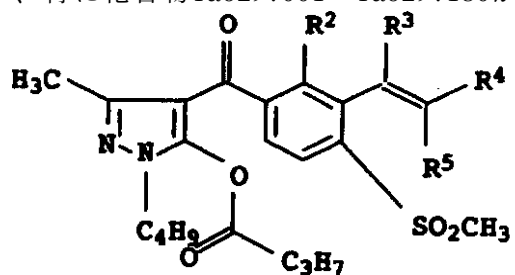
20



**Ia628**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がn-ブチル、 $R^{15}$ がn-プロピルカルボニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia629、特に化合物Ia629.001～Ia629.180が極めて好ましい：

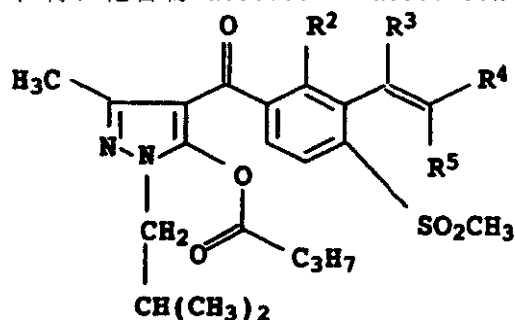
30



**Ia629**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がイソブチル、 $R^{15}$ がn-プロピルカルボニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia630、特に化合物Ia630.001～Ia630.180が極めて好ましい：

40

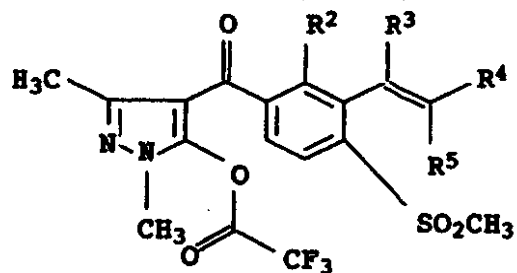


**Ia630**

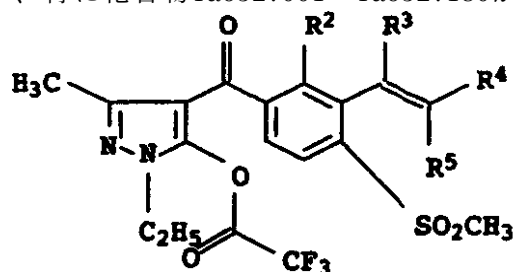
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{15}$ がトリフ

50

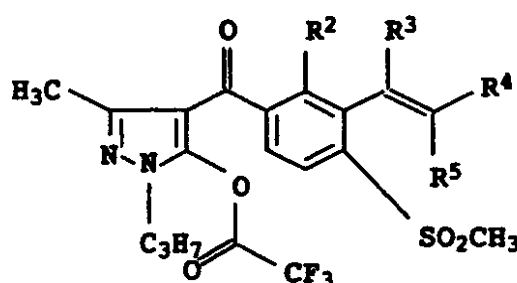
ルオロメチルカルボニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia631、特に化合物Ia631.001～Ia631.180が極めて好ましい：

**Ia631**

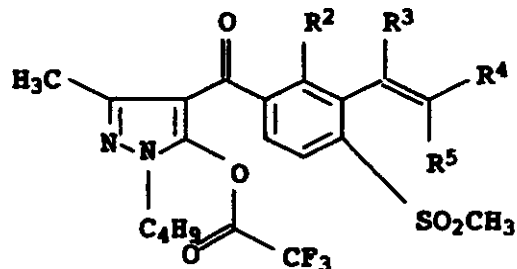
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がエチル、 $R^{15}$ がトリフルオロメチルカルボニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia632、特に化合物Ia632.001～Ia632.180が極めて好ましい：

**Ia632**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がn-プロピル、 $R^{15}$ がトリフルオロメチルカルボニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia633、特に化合物Ia633.001～Ia633.180が極めて好ましい：

**Ia633**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がn-ブチル、 $R^{15}$ がトリフルオロメチルカルボニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia634、特に化合物Ia634.001～Ia634.180が極めて好ましい：

**Ia634**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がイソブチル、 $R^{15}$ がトリフルオロメチルカルボニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia635、特に化合物Ia635.001～Ia635.180が極めて好ましい：

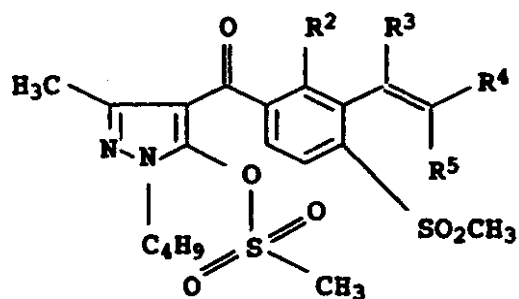
10

20

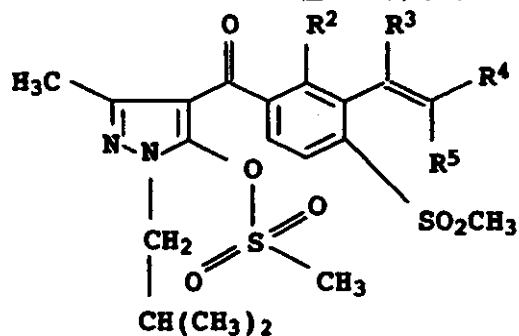
30

40

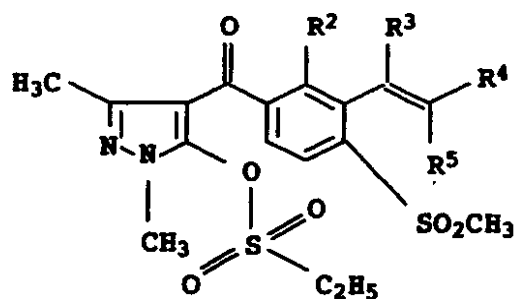


**Ia639**

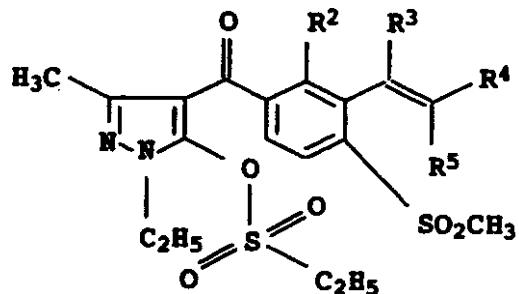
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ 及び $R^{15}$ がそれぞれメチルスルホニル、 $R^{14}$ がイソブチル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia640、特に化合物Ia640.001～Ia640.180が極めて好ましい：

**Ia640**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{15}$ がエチルスルホニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia641、特に化合物Ia641.001～Ia641.180が極めて好ましい：

**Ia641**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がエチル、 $R^{15}$ がエチルスルホニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia642、特に化合物Ia642.001～Ia642.180が極めて好ましい：

**Ia642**

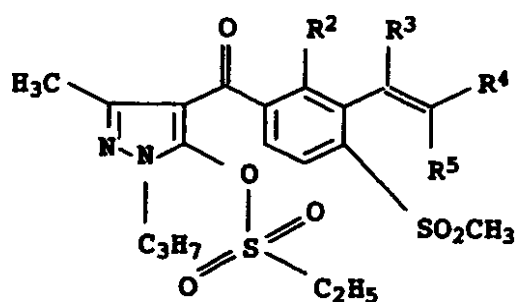
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がn-プロピル、 $R^{15}$ がエチルスルホニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia643、特に化合物Ia643.001～Ia643.180が極めて好ましい：

10

20

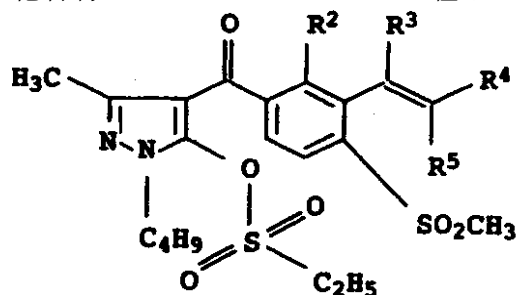
30

40

**Ia643**

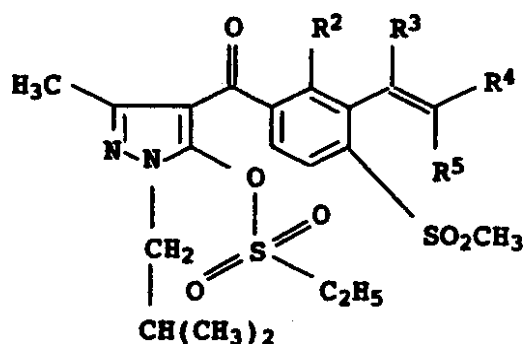
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がn-ブチル、 $R^{15}$ がエチルスルホニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia644、特に化合物Ia644.001～Ia644.180が極めて好ましい：

10

**Ia644**

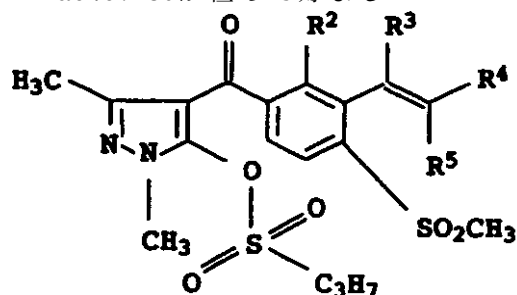
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がイソブチル、 $R^{15}$ がエチルスルホニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia645、特に化合物Ia645.001～Ia645.180が極めて好ましい：

20

**Ia645**

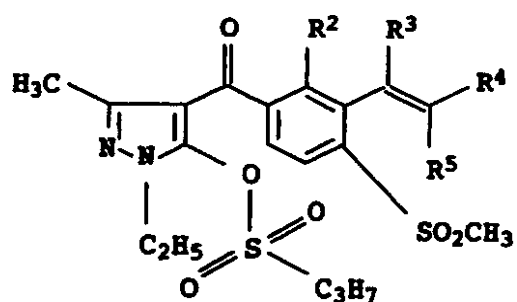
30

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{15}$ がn-プロピルスルホニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia646、特に化合物Ia646.001～Ia646.180が極めて好ましい：

**Ia646**

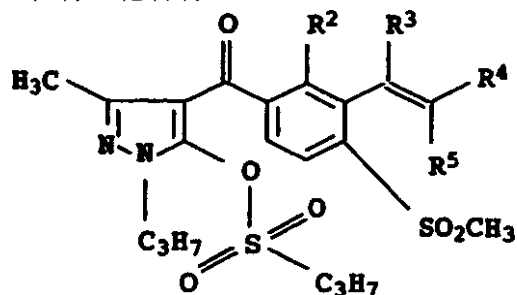
40

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がエチル、 $R^{15}$ がn-プロピルスルホニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia647、特に化合物Ia647.001～Ia647.180が極めて好ましい：

**Ia647**

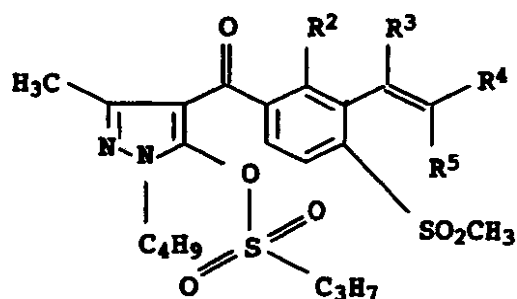
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がn-プロピル、 $R^{15}$ がn-プロピルスルホニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia648、特に化合物Ia648.001～Ia648.180が極めて好ましい：

10

**Ia648**

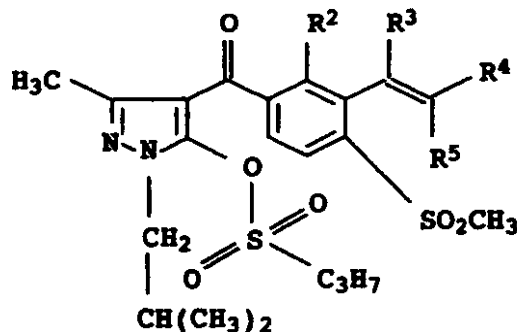
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がn-ブチル、 $R^{15}$ がn-プロピルスルホニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia649、特に化合物Ia649.001～Ia649.180が極めて好ましい：

20

**Ia649**

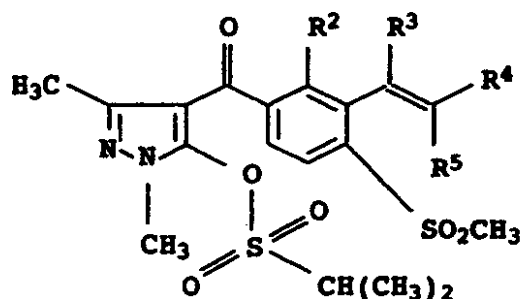
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がイソブチル、 $R^{15}$ がn-プロピルスルホニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia650、特に化合物Ia650.001～Ia650.180が極めて好ましい：

30

**Ia650**

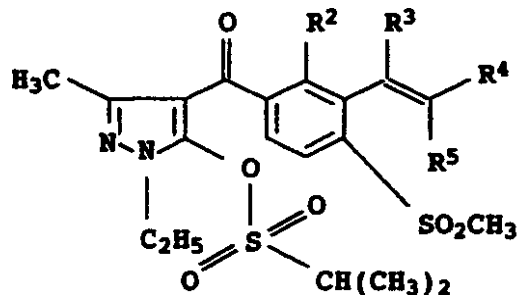
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{15}$ がイソプロピルスルホニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia651、特に化合物Ia651.001～Ia651.180が極めて好ましい：

40

**Ia651**

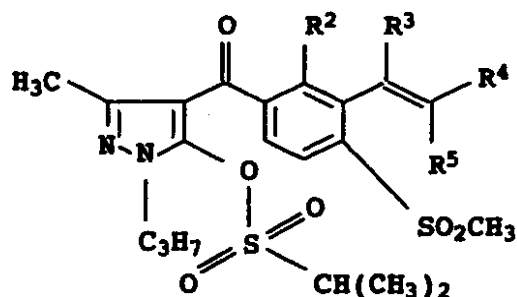
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がエチル、 $R^{15}$ がイソプロピルスルホニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia652、特に化合物Ia652.001～Ia652.180が極めて好ましい：

10

**Ia652**

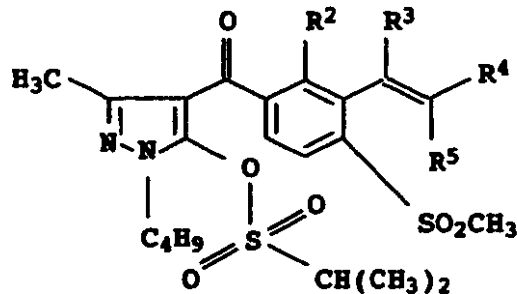
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がn-プロピル、 $R^{15}$ がイソプロピルスルホニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia653、特に化合物Ia653.001～Ia653.180が極めて好ましい：

20

**Ia653**

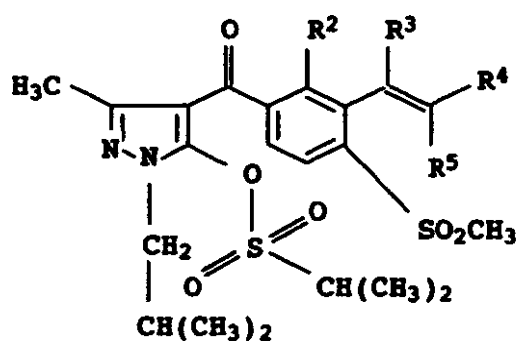
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がn-ブチル、 $R^{15}$ がイソプロピルスルホニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia654、特に化合物Ia654.001～Ia654.180が極めて好ましい：

30

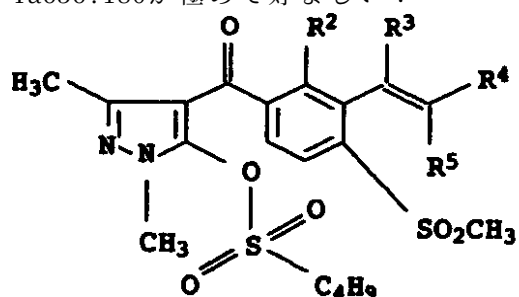
**Ia654**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がイソブチル、 $R^{15}$ がイソプロピルスルホニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia655、特に化合物Ia655.001～Ia655.180が極めて好ましい：

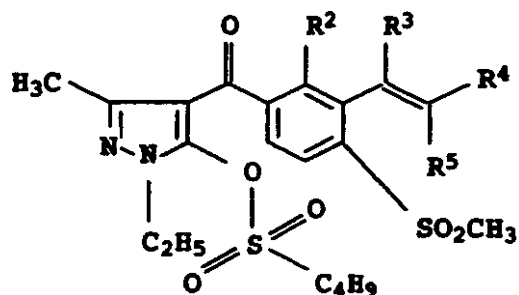
40

**Ia655**

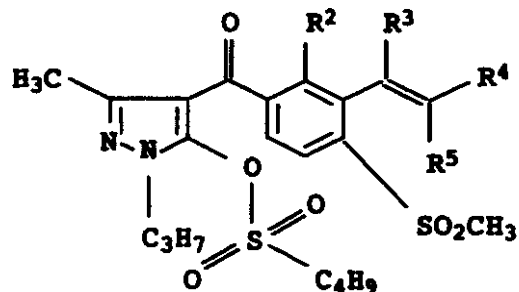
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{15}$ がn-ブチルスルホニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia656、特に化合物Ia656.001～Ia656.180が極めて好ましい：

**Ia656**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がエチル、 $R^{15}$ がn-ブチルスルホニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia657、特に化合物Ia657.001～Ia657.180が極めて好ましい：

**Ia657**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がn-プロピル、 $R^{15}$ がn-ブチルスルホニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia658、特に化合物Ia658.001～Ia658.180が極めて好ましい：

**Ia658**

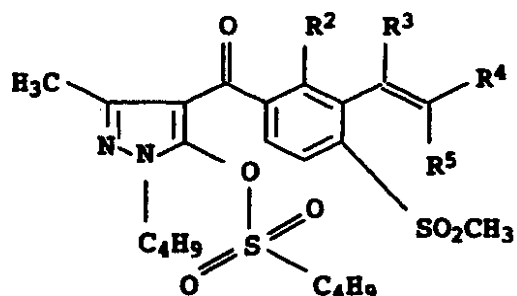
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がn-ブチル、 $R^{15}$ がn-ブチルスルホニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia659、特に化合物Ia659.001～Ia659.180が極めて好ましい：

10

20

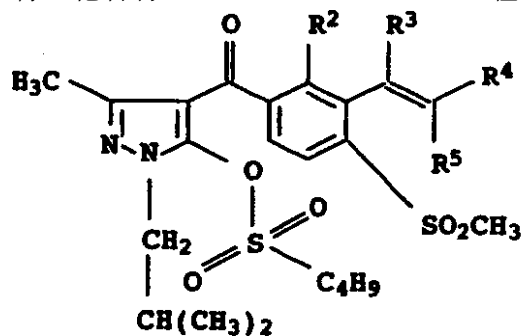
30

40

**Ia659**

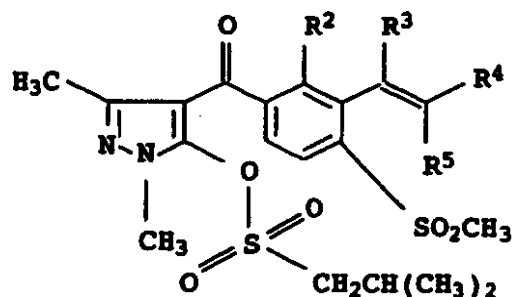
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がイソブチル、 $R^{15}$ がn-ブチルスルホニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia660、特に化合物Ia660.001～Ia660.180が極めて好ましい：

10

**Ia660**

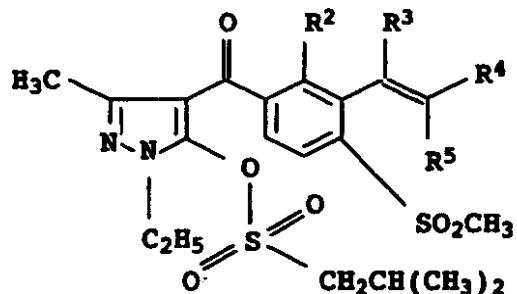
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{15}$ がイソブチルスルホニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia661、特に化合物Ia661.001～Ia661.180が極めて好ましい：

20

**Ia661**

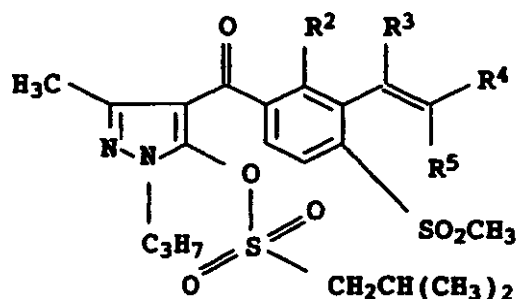
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がエチル、 $R^{15}$ がイソブチルスルホニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia662、特に化合物Ia662.001～Ia662.180が極めて好ましい：

30

**Ia662**

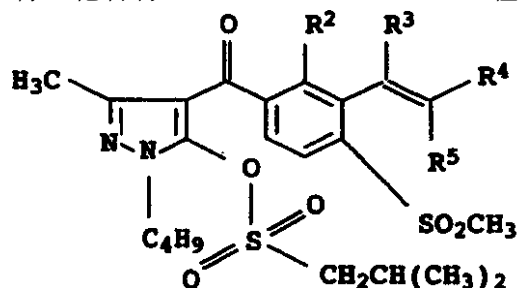
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がn-プロピル、 $R^{15}$ がイソブチルスルホニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia663、特に化合物Ia663.001～Ia663.180が極めて好ましい：

40

**Ia663**

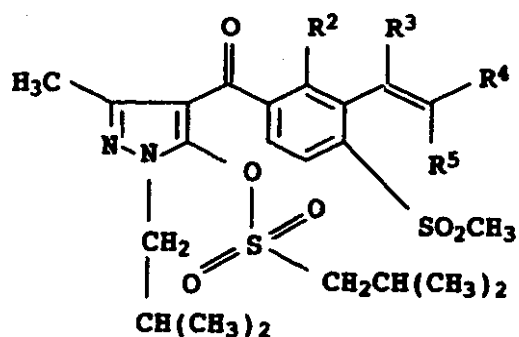
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がn-ブチル、 $R^{15}$ がイソブチルスルホニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia664、特に化合物Ia664.001～Ia664.180が極めて好ましい：

10

**Ia664**

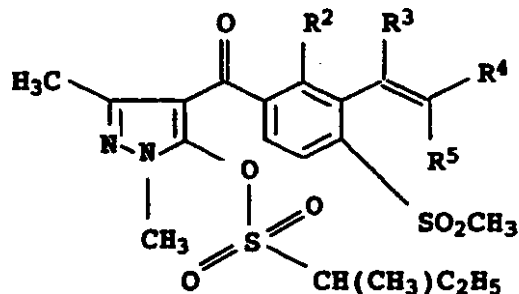
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がイソブチル、 $R^{15}$ がイソブチルスルホニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia665、特に化合物Ia665.001～Ia665.180が極めて好ましい：

20

**Ia665**

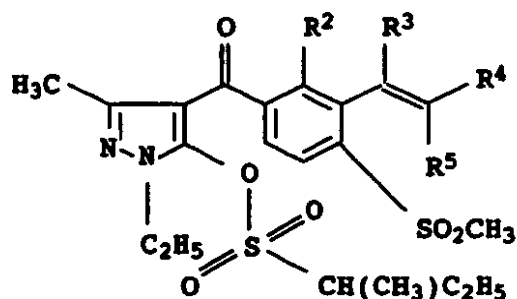
30

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{15}$ がsec-ブチルスルホニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia666、特に化合物Ia666.001～Ia666.180が極めて好ましい：

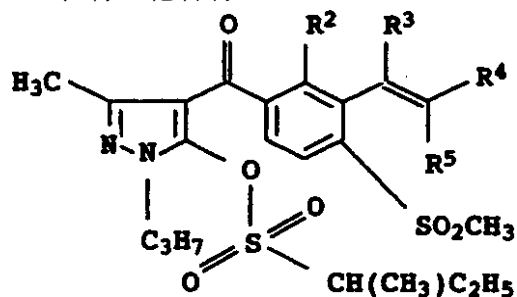
**Ia666**

40

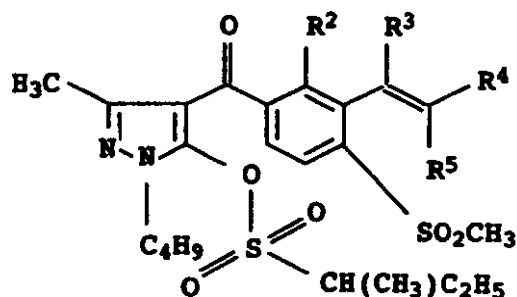
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がエチル、 $R^{15}$ がsec-ブチルスルホニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia667、特に化合物Ia667.001～Ia667.180が極めて好ましい：

**Ia667**

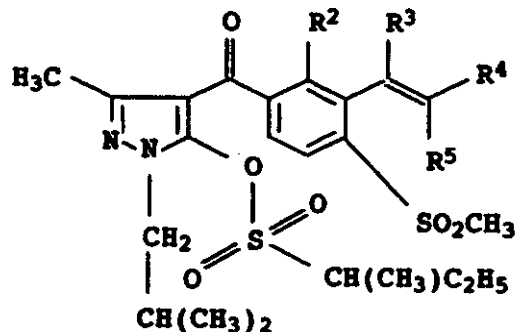
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がn-プロピル、 $R^{15}$ がsec-ブチルスルホニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia 10 668、特に化合物Ia668.001～Ia668.180が極めて好ましい：

**Ia668**

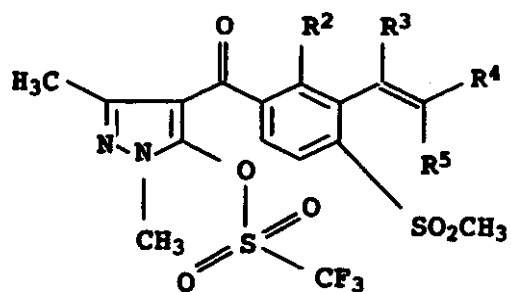
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がn-ブチル、 $R^{15}$ がsec-ブチルスルホニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia66 20 9、特に化合物Ia669.001～Ia669.180が極めて好ましい：

**Ia669**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がイソブチル、 $R^{15}$ がsec-ブチルスルホニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia67 30 0、特に化合物Ia670.001～Ia670.180が極めて好ましい：

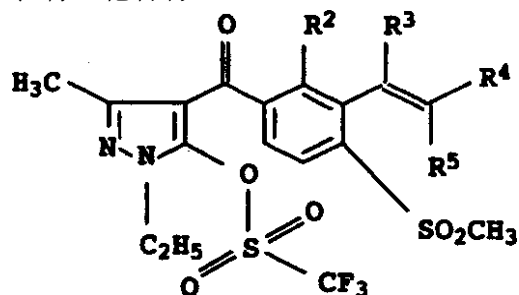
**Ia670**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{15}$ がトリフルオロメチルスルホニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia671、特に化合物Ia6 40 71.001～Ia671.180が極めて好ましい：

**Ia671**

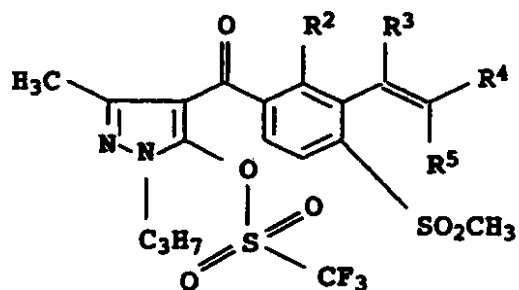
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がエチル、 $R^{15}$ がトリフルオロメチルスルホニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia672、特に化合物Ia672.001～Ia672.180が極めて好ましい：

10

**Ia672**

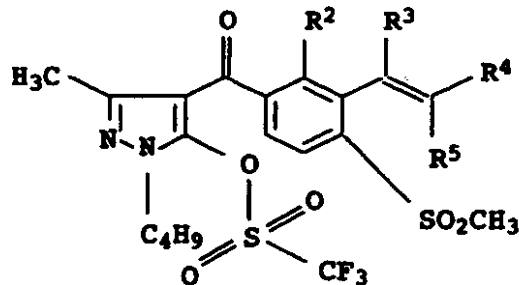
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がn-プロピル、 $R^{15}$ がトリフルオロメチルスルホニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia673、特に化合物Ia673.001～Ia673.180が極めて好ましい：

20

**Ia673**

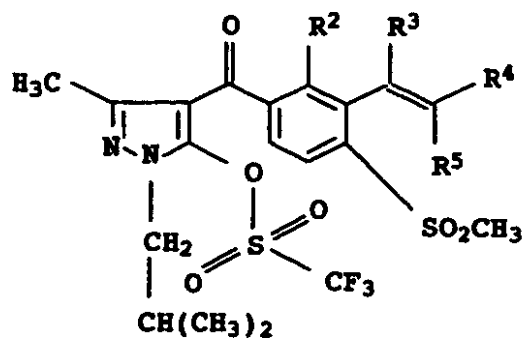
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がn-ブチル、 $R^{15}$ がトリフルオロメチルスルホニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia674、特に化合物Ia674.001～Ia674.180が極めて好ましい：

30

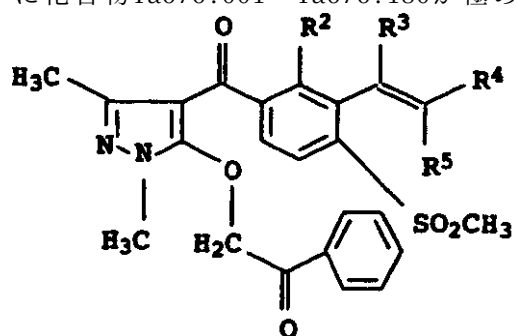
**Ia674**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がイソブチル、 $R^{15}$ がトリフルオロメチルスルホニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia675、特に化合物Ia675.001～Ia675.180が極めて好ましい：

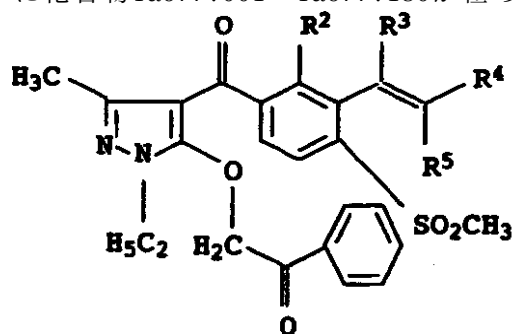
40

**Ia675**

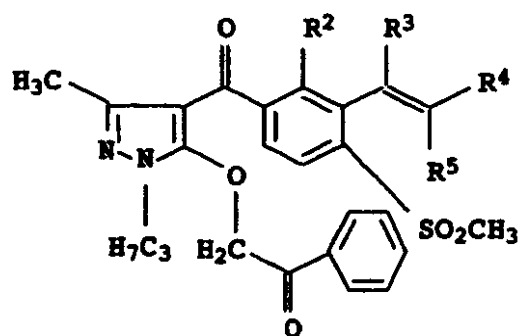
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がメチル、 $R^{15}$ がフェニルカルボニルメチル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia676、特に化合物Ia676.001～Ia676.180が極めて好ましい：

**Ia676**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がエチル、 $R^{15}$ がフェニルカルボニルメチル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia677、特に化合物Ia677.001～Ia677.180が極めて好ましい：

**Ia677**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がn-プロピル、 $R^{15}$ がフェニルカルボニルメチル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia678、特に化合物Ia678.001～Ia678.180が極めて好ましい：

**Ia678**

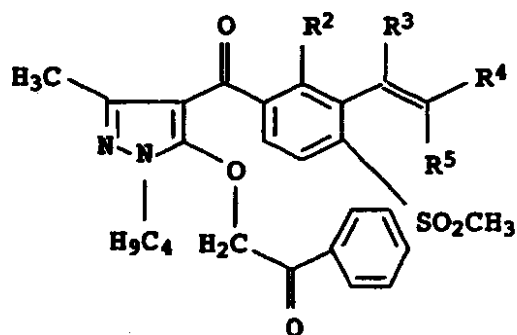
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がn-ブチル、 $R^{15}$ がフェニルカルボニルメチル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia679、特に化合物Ia679.001～Ia679.180が極めて好ましい：

10

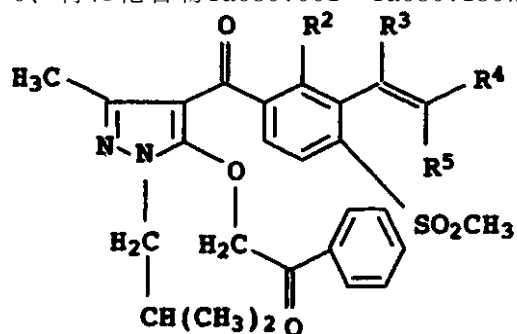
20

30

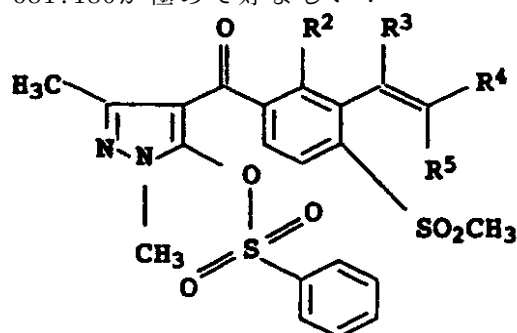
40

**Ia679**

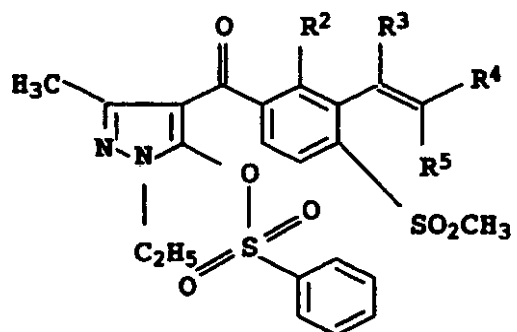
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がイソブチル、 $R^{15}$ がフェニルカルボニルメチル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia680、特に化合物Ia680.001～Ia680.180が極めて好ましい：

**Ia680**

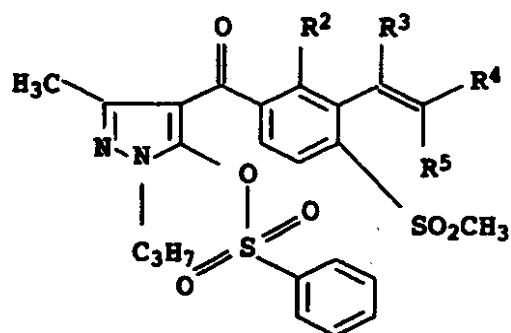
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{15}$ がフェニルスルホニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia681、特に化合物Ia681.001～Ia681.180が極めて好ましい：

**Ia681**

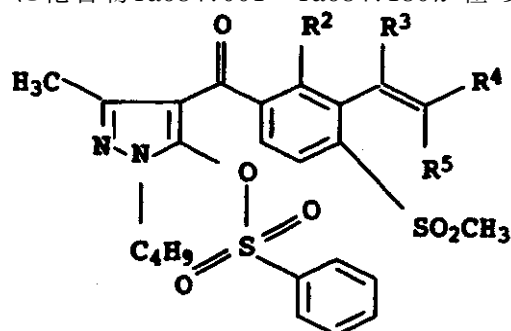
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がエチル、 $R^{15}$ がフェニルスルホニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia682、特に化合物Ia682.001～Ia682.180が極めて好ましい：

**Ia682**

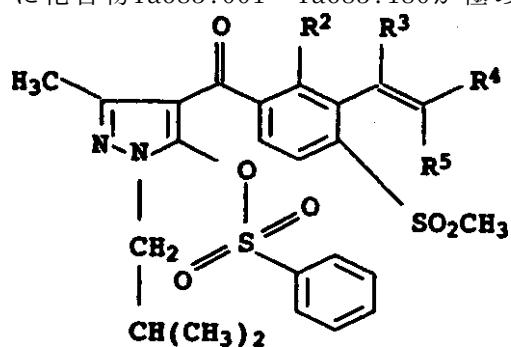
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がn-プロピル、 $R^{15}$ がフェニルスルホニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia683、特に化合物Ia683.001～Ia683.180が極めて好ましい：

**Ia683**

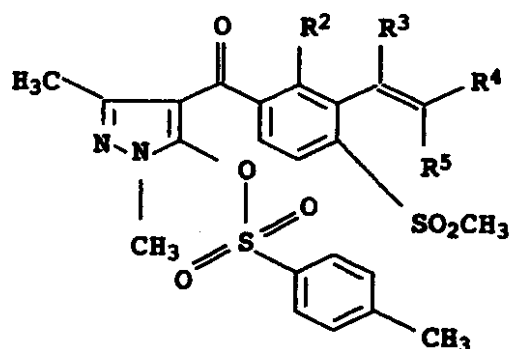
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がn-ブチル、 $R^{15}$ がフェニルスルホニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia684、特に化合物Ia684.001～Ia684.180が極めて好ましい：

**Ia684**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がイソブチル、 $R^{15}$ がフェニルスルホニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia685、特に化合物Ia685.001～Ia685.180が極めて好ましい：

**Ia685**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{15}$ が4-メチルフェニルスルホニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia686、特に化合物Ia686.001～Ia686.180が極めて好ましい：

**Ia686**

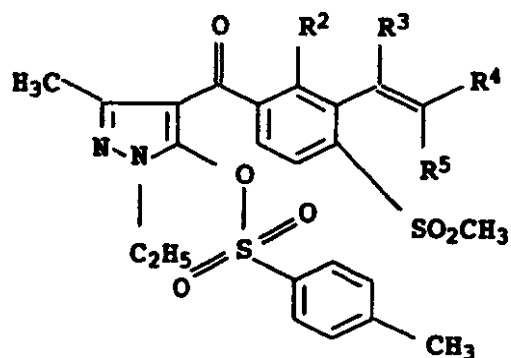
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がエチル、 $R^{15}$ が4-メチルフェニルスルホニル及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia687、特に化合物Ia687.001～Ia687.180が極めて好ましい：

10

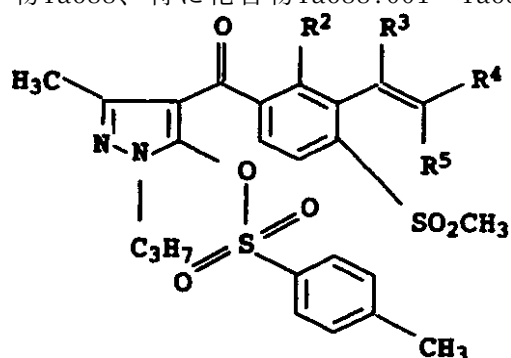
20

30

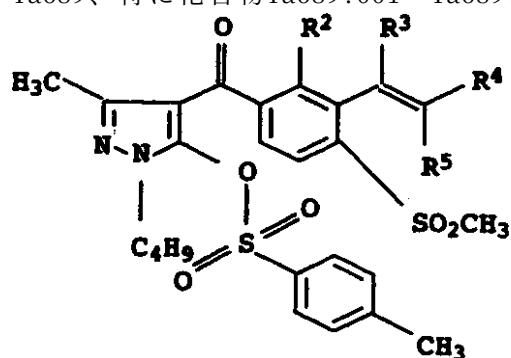
40

**Ia687**

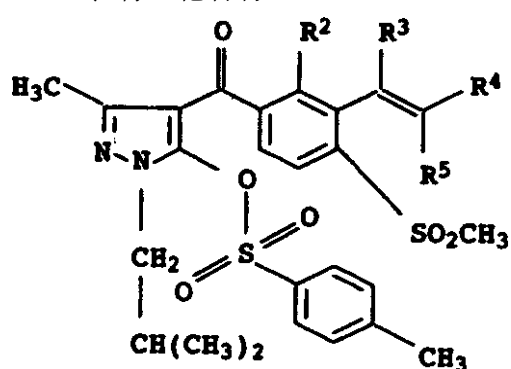
同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がn-プロピル、 $R^{15}$ が4-メチルフェニルスルホニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia688、特に化合物Ia688.001～Ia688.180が極めて好ましい：

**Ia688**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がn-ブチル、 $R^{15}$ が4-メチルフェニルスルホニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia689、特に化合物Ia689.001～Ia689.180が極めて好ましい：

**Ia689**

同様に、対応する化合物Ia1.001～Ia1.180とは、 $R^1$ がメチルスルホニル、 $R^{14}$ がイソブチル、 $R^{15}$ が4-メチルフェニルスルホニル、及び $R^{16}$ がメチルである点で異なる化合物Ia690、特に化合物Ia690.001～Ia690.180が極めて好ましい：

**Ia690**

同様に、極めて好ましい式Iの化合物は、各基が下記の意味を有する場合である：

$R^1$ が、ハロゲン（例、塩素又は臭素）、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル（例、メチルスルホニル又はエチルスルホニル）；特に塩素又はメチルスルホニルを表し；

$R^2$ が、ハロゲン（例、塩素又は臭素）；特に塩素を表し；

10

20

30

40

50

R<sup>3</sup>が、水素を表し；

R<sup>4</sup>が、水素、シアノ、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル（例、メチル、エチル、イソプロピル、ペンチル）、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ヒドロキシアルキル、ホルミル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルカルボニル（例、メチルカルボニル又はエチルカルボニル）、ヒドロキシカルボニル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル（例、メトキシカルボニル又はエトキシカルボニル）、 $-C(R^{12})=NR^{13}$ ；ヘテロシクリル、ヘテロシクリルC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、フェニル、ヘテロアリール（最後の4個の基は、それぞれ1～3個のハロゲン原子で置換されていても及び／又は1～3個の下記の基：ニトロ、シアノ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルカルボニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルコキシカルボニル、特にC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル；特に好ましくは水素、シアノ、メチル、イソプロピル、ペンチル、ホルミル、メチルカルボニル、ヒドロキシカルボニル、エトキシカルボニル、 $-C(R^{12})=NR^{13}$ 、2-メチル-1, 3-ジオキソラン-4-イル、2, 2-ジメチル-1, 3-ジオキソラン-4-イル、1, 3-ジオキソラン-2-イル、1, 3-ジオキソラン-2-イルメチル、フェニル、2-フリル、3-フリル、2-チエニル、3-チエニル；を表し；

10

R<sup>5</sup>が、水素、ハロゲン（例、塩素又は臭素）、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル（例、メチル又はエチル）；特に好ましくは水素、塩素又はメチル；を表し；

R<sup>12</sup>が、水素、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル（例、メチル又はエチル）、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル（例、メトキシカルボニル又はエトキシカルボニル）；特に好ましくは水素、メチル又はエトキシカルボニル；を表し；

20

R<sup>13</sup>が、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルコキシ（例、メトキシ又はエトキシ）又はフェニルC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルコキシ（最後の基は、部分的又は完全にハロゲン化されていても、及び／又は1～3個の下記の基：ニトロ、シアノ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルカルボニル又はC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルコキシカルボニルを有していても良い）を表し；

R<sup>14</sup>が、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル；特に好ましくはメチル又はエチル；を表し；

R<sup>15</sup>が、水素、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルスルホニル（例、メチルスルホニル又はエチルスルホニル）、フェニルC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル（最後の置換基のフェニル基は、部分的又は完全にハロゲン化されていても及び／又は1～3個の下記の基：ニトロ、シアノ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルコキシを有していても良い）；特に好ましくは水素、メチルスルホニル又はベンジル；を表し；

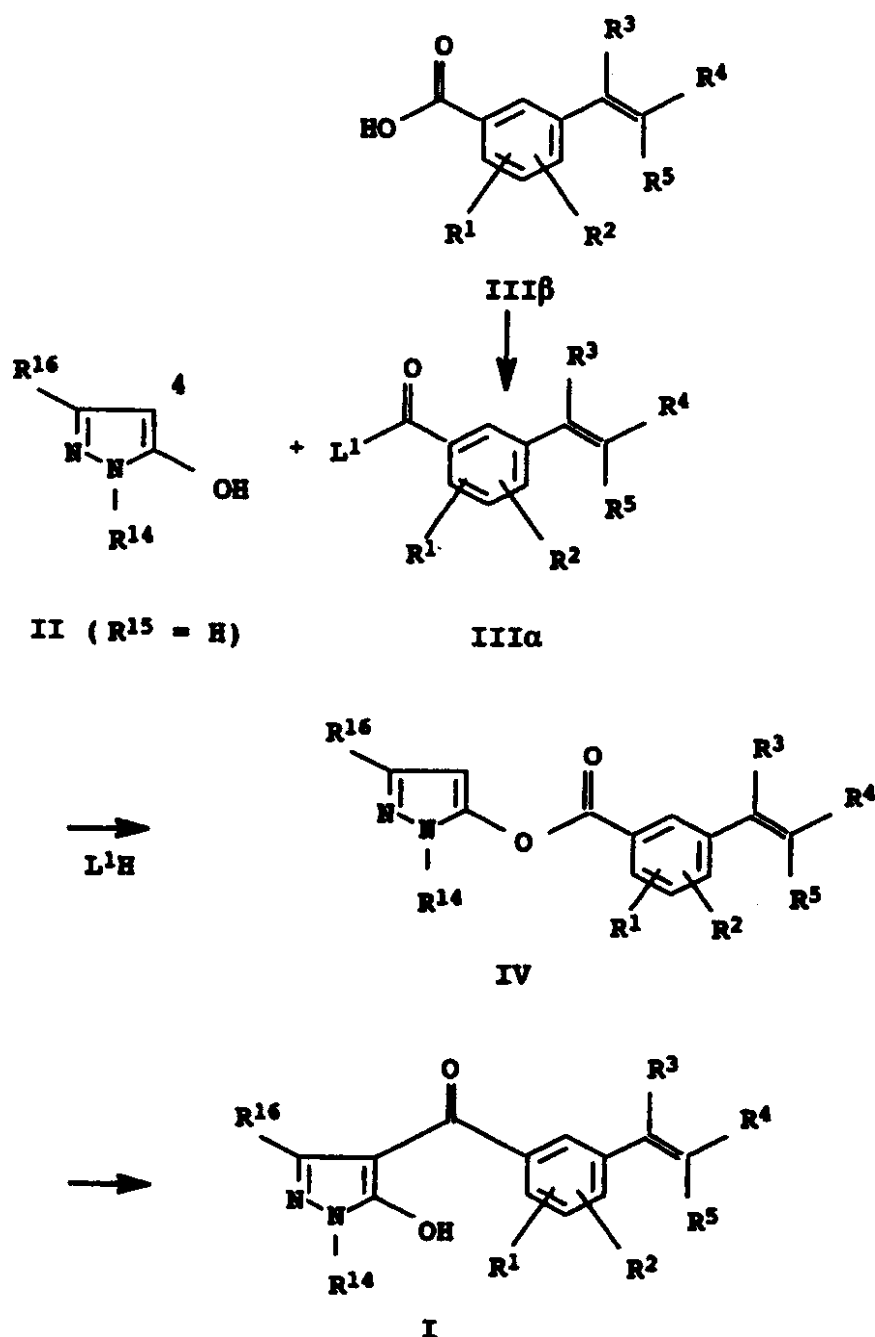
30

R<sup>16</sup>が、水素又はC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル（例、メチル）；特に好ましくは水素を表す。

式Iの4-（3-アルケニルベンゾイル）ピラゾールは、種々な経路、例えば下記の経路で得ることができる：

工程A：

続いて転位反応を受けるアシル化生成物IVを与えるための、R<sup>15</sup>=水素の式IIのピラゾールを活性化カルボン酸III $\alpha$ 又は好ましくは系内で活性化されるカルボン酸III $\beta$ との反応



上記式中、 $\text{L}^1$ が求核的に置換可能な脱離基、例えばハロゲン（例、臭素又は塩素）、ヘテロアリール（例、イミダゾリル又はピリジル）、又はカルボキシレート（例、アセテート、トリフルオロアセテート）等を表す。

活性化カルボン酸は、カルボン酸ハライドの場合のように直接使用するか、或いは系内で、例えばジシクロヘキシルカルボジイミド、トリフェニルホスフィン／アゾジカルボン酸エステル、2-ピリジンジスルフィド／トリフェニルホスフィン、カルボニルジイミダゾール等を使用することにより形成することができる。

適宜、アシル化反応は塩基の存在下に行うことが有利であろう。出発材料と補助塩基は等モル量で使用する事が有利である。場合によっては、IIに対して少し過剰の補助塩基、例えば1.2～1.5モル当量が有利であろう。

適当な補助塩基としては、第3級アルキルアミン、ピリジン、およびアルカリ金属炭酸塩を挙げることができる。使用することができる溶剤としては、例えば、塩素化炭化水素（例、塩化メチレン及び1,2-ジクロロエタン）、芳香族炭化水素（例、トルエン、キシレン及びクロロベンゼン）、エーテル（例、ジエチルエーテル、メチルtert-ブチルエーテル、テトラヒドロフラン及びジオキサン）、非プロトン性極性溶剤（例、アセトニ

トリル、ジメチルホルムアミド又はジメチルスルホキシド)、又はエステル(例、酢酸エチル)又はこれらの混合物を挙げることができる。

カルボン酸ハロゲン化物を、活性カルボン酸成分として使用する場合、この反応剤の添加後、反応混合物を0~10℃に冷却することが有利であろう。その後、混合物を20~100℃、好ましくは25~50℃で、この反応が終了するまで攪拌する。後処理は、慣用法、例えば、反応混合物を水に注ぎ、価値ある生成物を抽出する。この目的に特に好適な溶剤は、塩化メチレン、ジエチルエーテル及び酢酸エチルである。有機層を乾燥、溶剤を除去し、そして式IVの粗エノールエステルは、好ましくはクロマトグラフィにより精製される。そうではなく、更なる精製なしに、転位反応のために式IVの粗エノールエステルを使用することも可能である。

10

式Iの化合物を得るための式IVのエノールエステルの転位は、溶剤中そして補助塩基の存在下、所望により触媒としてシアノ化合物を用いて20~40℃で行うことが有利である。

適当な溶剤として、例えばアセトニトリル、塩化メチレン、1,2-ジクロロエタン、ジオキサン、酢酸エチル、トルエン又はこれらの混合物を挙げることができる。アセトニトリル及びジオキサンが好ましい。

好適な塩基としては、第3級アミン(例、トリエチルアミン、ピリジン)、又はアルカリ金属炭酸塩(例、炭酸ナトリウム及び炭酸カリウム)を挙げることができ、これらはエステルに対して等モル量又は4倍モルまでの過剰量で使用することが好ましい。トリエチルアミン又はアルカリ金属炭酸塩を使用することが好ましい。

20

好適なシアノ化合物としては、無機シアニ化物(例、シアニ化ナトリウム及びシアニ化カリウム)、有機シアノ化合物(例、アセトンシアノヒドリン及びトリメチルシリルシアニド)を挙げることができる。これらは、エステルに対して1~50モル%の量で使用される。アセトンシアノヒドリン又はトリメチルシリルシアニドを、例えばエステルに対して5~15モル%、特に10モル%の量で使用することが好ましい。

アセトニトリル又はジオキサン中のアルカリ金属炭酸塩(例、炭酸カリウム)を使用することが特に好ましい。

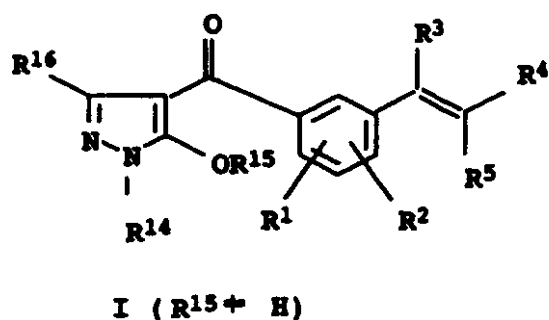
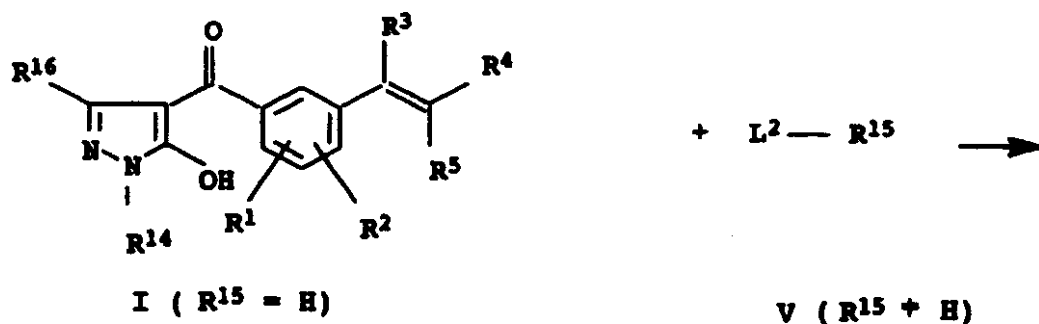
後処理は、公知の方法で行うことができる。反応混合物は、例えば希薄鉱酸(例、5%濃度塩酸又は硫酸)で酸性化し、そして有機溶剤(例、塩化メチレン又は酢酸エチル)で抽出される。有機抽出物は、アルカリ金属炭酸塩の5~10%濃度溶液、例えば炭酸ナトリウム溶液、炭酸カリウム溶液で抽出することができる。有機層は酸性化し、得られた析出物を吸引ろ過及び/又は塩化メチレン又は酢酸エチルで抽出し、乾燥、濃縮する。

30

(ヒドロキシピラゾールのエステルの合成例及びそのエステルの転位が、例えばE P - A 2 8 2 9 4 4及びU S 4 6 4 3 7 5 7に記載されている。)

方法B:

R<sup>15</sup>=水素の式Iの4-(3-アルケニルベンゾイル)ピラゾールと式V(R<sup>15</sup>≠水素の場合)の化合物との反応



10

上記式中、 $\text{L}^2$ が求核的に置換可能な脱離基、例えばハロゲン（例、臭素又は塩素）、ヘテロアリール（例、イミダゾリル又はピリジル）、又はカルボキシレート（例、アセテート、トリフルオロアセテート）、スルホネート（例、メシレート又はトリフレート）等を表す。

20

式Vの化合物は、例えば、アルキルハライド、カルボン酸ハライド（ハロゲン化アシル）、スルホニルハライド、カルボン酸無水物及びスルホン酸の無水物の場合には、直接使用されるか、或いは例えば活性化カルボン酸（カルボン酸及びジシクロヘキシルカルボジイミド、カルボニルジイミダゾール等を使用することにより）系内で形成して使用され得る。

一般に、出発材料は等モル量で通常使用される。しかしながら、成分の一方又はその他を過剰に使用することが有利であろう。

好適には、反応を塩基の存在下に行うことが有利であろう。出発材料と補助塩基は等モル量で使用することが有利である。ある条件下では、IIに対して、例えば1.5～3モル当量の塩基過剰が有利であろう。

30

適当な補助塩基としては、第3級アルキルアミン（例、トリエチルアミン、ピリジン）、アルカリ金属炭酸塩（例、炭酸ナトリウム及び炭酸カリウム）、及びアルカリ金属水素化物（例、水素化ナトリウム）を挙げることができる。トリエチルアミン、ピリジン、炭酸カリウムが好ましい。

適当な溶剤の例としては、塩素化炭化水素（例、塩化メチレン及び1,2-ジクロロエタン）、芳香族炭化水素（例、トルエン、キシレン及びクロロベンゼン）、エーテル（例、ジエチルエーテル、メチルtert-ブチルエーテル、テトラヒドロフラン及びジオキサン）、非プロトン性極性溶剤（例、アセトニトリル、ジメチルホルムアミド又はジメチルスルホキシド）、エステル（例、酢酸エチル）又はこれらの混合物を挙げることができる。

40

反応温度は、一般に0℃～反応混合物の沸点の範囲である。

後処理はそれ自体公知の方法で行われ、生成物を得る。

出発物質として使用される、まだ知られていない式II（ $\text{R}^{15} = \text{H}$ ）のピラゾールは、従来の方法で得ることができる（例えば、EP-A 2 400 01、J.Prakt.Chem.315（1973）,383）。

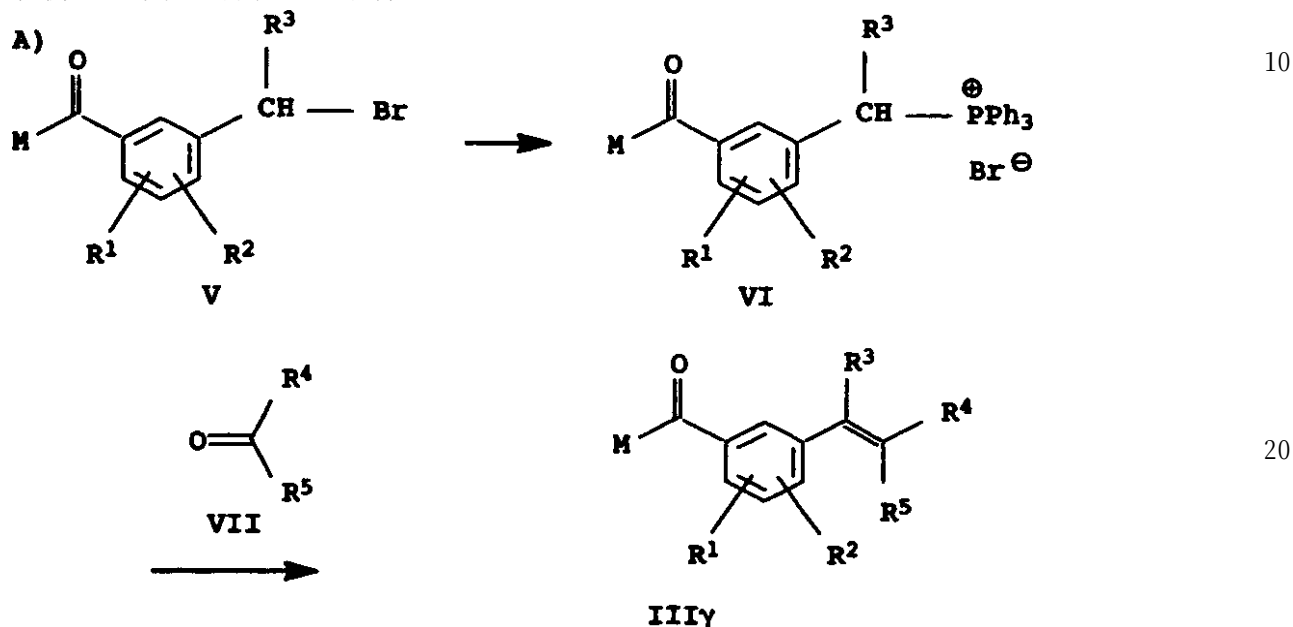
系内で製造できない活性化カルボン酸は従来の方法で得ることができる。式IIIα（ $\text{L} = \text{ハロゲン}$ ）のカルボン酸ハライドは、文献（参照、L.G.Fieser, M.Fieser "Reagents for Organic Synthesis", 第1巻, 767-769頁（1967））に記載と類似の方法で、式IIIβの安

50

息香酸とハロゲン化剤（例えば、塩化チオニル、臭化チオニル、ホスゲン、ジホスゲン、トリホスゲン、塩化オキサリル及び臭化オキサリル）とを反応させることにより合成することができる。

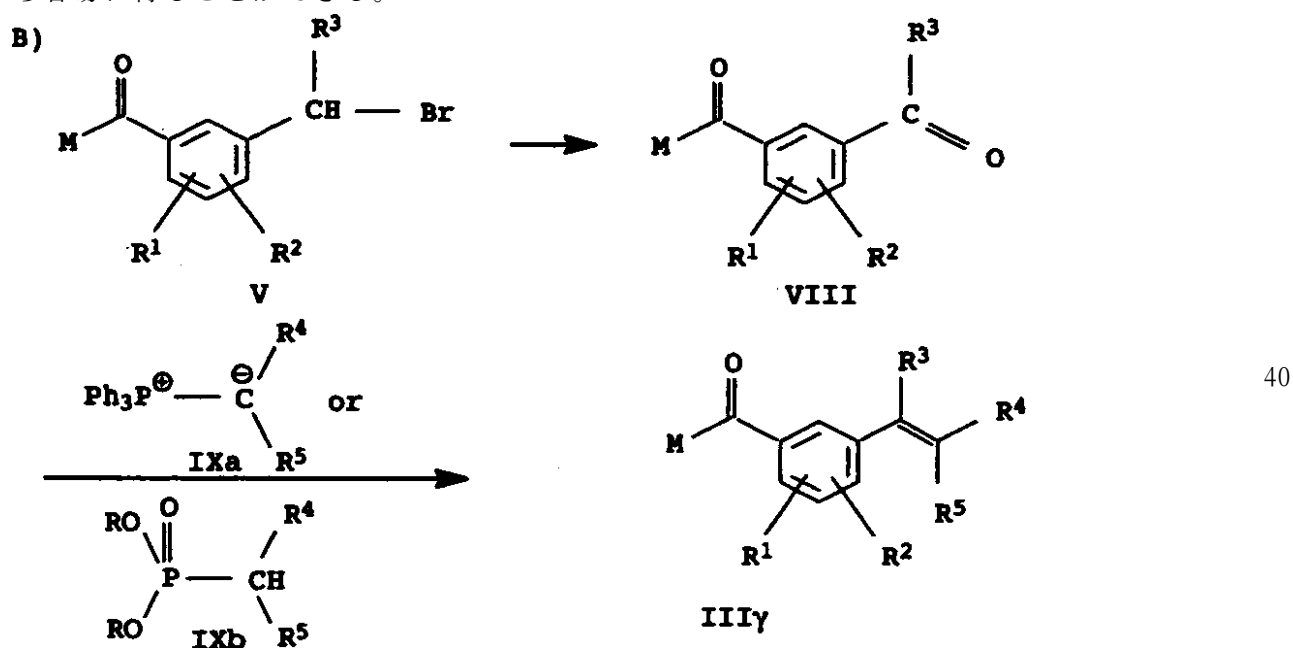
文献に公知でない式III $\beta$ の3-アルケニル安息香酸は、文献に公知と類似の方法、例えば式III $\gamma$ （M=C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルコキシ）の対応する3-アルケニル安息香酸を加水分解することにより得ることができる。

式III $\gamma$ の3-アルケニル安息香酸エステル（M=C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルコキシ）は、種々の経路、例えば下記の方法により得ることができる：



一般式III $\gamma$ の化合物は、公知の方法（J.March, "Advanced Organic Chemistry", 第3版, 864頁以下, Wiley-Interscience Publication, 1985）で、式VIのホスホニウム塩のアルデヒド又はケトン（VII）とのウィッチヒ（Wittig）反応により得ることができる。

式VIのホスホニウム塩は、それ自体公知の方法（J.March, "Advanced Organic Chemistry", 第3版, 377頁以下, Wiley-Interscience Publication, 1985）で、式Vの臭素化合物から容易に得ることができる。

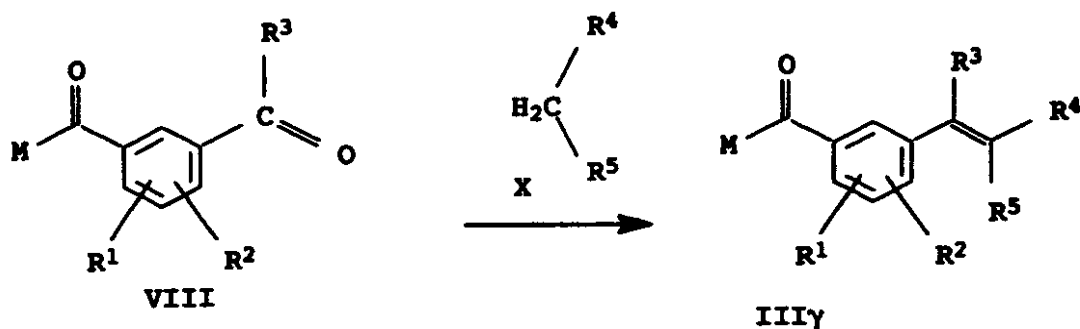


一般式III $\gamma$ の化合物は、式VIIIのアルデヒド又はケトンのホスホニウム塩IXa（A参照）又はホスホネートIXbとのウィッチヒ反応又はホーナーエモンズ（Honer-Emmons）反応により得ることもできる（J.March, "Advanced Organic Chemistry", 第3版, 867頁以下

, Wiley-Interscience Publication, 1985)。

式VIIIの化合物は、それ自体公知の方法 (J. March, "Advanced Organic Chemistry", 第3版, 1105頁以下, Wiley-Interscience Publication, 1985) で、式Vの臭素化合物の酸化により容易に得ることができる。

C)



10

一般式IIIγの化合物も、再びそれ自体公知の方法 (J. March, "Advanced Organic Chemistry", 第3版, 849頁以下, Wiley-Interscience Publication, 1985) で、式VIIIのアルデヒド又はケトンのアルドール縮合及び関連反応により容易に得ることができる。

[合成例]

4- {2', 4'-ジクロロ-3'-[2''-(3''-フリル)エテン-1''-イル]ベンゾイル}-2-エチル-3-ヒドロキシピラゾール (化合物2. 1)

20

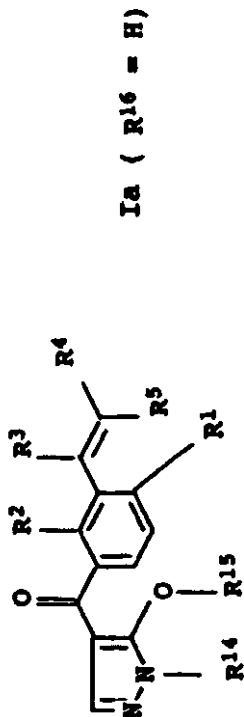
3. 0 g (10ミリモル) の2, 4-ジクロロ-3-[2'-(3''-フリル)エテン-1''-イル]ベンゾイルクロリドを30 mlのアセトニトリルに溶解した液を、1. 2 g (10ミリモル) の2-エチル-3-ヒドロキシピラゾール及び1. 5 ml (10ミリモル) のトリエチルアミンと混合した。反応混合物を室温で12時間攪拌し、水に溶解し、酢酸エチルで3回抽出した。抽出物を乾燥し、溶剤を減圧下に除去し、残渣をシリカゲル上でクロマトグラフィ処理 (シクロヘキサン/酢酸エチル=8/2~4/6) した。得られたエステルを100 mlのジオキサンに溶解し、1. 2 g (9ミリモル) の炭酸カリウムの微粉末と混合し、還流下10時間加熱した。冷却後、形成した沈殿を分離し、ジオキサンで洗浄し、水に入れ、攪拌した。次いで、そのpHを、10%濃度塩酸を用いて1~2に調整し、混合物を室温で30分間攪拌し、そして沈殿を分離した。乾燥後、1. 4 g (理論量: 37%) の白色固体 (融点: 115~120℃) を得た。

30

<sup>1</sup>H-NMR (DMSO; δ (ppm)) : 7. 75 (1H) ; 7. 60 (1H) ; 7. 50 (1H) ; 7. 25 (2H) ; 7. 00 (1H) ; 6. 85 (1H) ; 6. 80 (1H) ; 3. 90 (2H) ; 1. 30 (3H)。

上記の化合物とは別に、同様に製造された他の式Iの4-(3-アルケニルベンゾイル)ピラゾールを、表2に列記する。

表 2



| No. | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup>                                | R <sup>5</sup>                 | R <sup>14</sup>               | R <sup>15</sup> | 物理データ<br>融点 [°C]<br><sup>1</sup> H NMR [ppm]                                          |
|-----|----------------|----------------|----------------|-----------------------------------------------|--------------------------------|-------------------------------|-----------------|---------------------------------------------------------------------------------------|
| 2.1 | Cl             | Cl             | H              | 3-フリル                                         | H                              | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | H               | 115 - 120                                                                             |
| 2.2 | Cl             | Cl             | H              | 2-チエニル                                        | H                              | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | H               | 105 - 107                                                                             |
| 2.3 | Cl             | Cl             | H              | 2-フリル                                         | H                              | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | H               | 65 - 83                                                                               |
| 2.4 | Cl             | Cl             | H              | フェニル                                          | H                              | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | H               | 132 - 147                                                                             |
| 2.5 | Cl             | Cl             | H              | 3-チエニル                                        | H                              | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | H               | 125 - 132                                                                             |
| 2.6 | Cl             | Cl             | H              | CH <sub>3</sub>                               | H                              | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | H               | 8.20 (1H); 7.35-7.15 (3H);<br>6.35-6.00 (2H); 4.05 (2H);<br>2.00-1.50 (3H); 1.35 (3H) |
| 2.7 | Cl             | Cl             | H              | CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | H               | 76 - 82                                                                               |
| 2.8 | Cl             | Cl             | H              | 1,3-ジオキサソ-2-イル-メチル                            | H                              | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | H               |                                                                                       |

10

20

30

40

| No.  | R <sup>1</sup>                  | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup>                                        | R <sup>5</sup>  | R <sup>14</sup>               | R <sup>15</sup> | 物理データ<br>融点 [°C]<br><sup>1</sup> H NMR [ppm]                                                                          |
|------|---------------------------------|----------------|----------------|-------------------------------------------------------|-----------------|-------------------------------|-----------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 2.9  | Cl                              | Cl             | H              | 2-メチル-1,3-<br>ジオキソラン-4-イル                             | H               | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | H               |                                                                                                                       |
| 2.10 | Cl                              | Cl             | H              | 1,3-ジオキサソ-<br>2-イル                                    | H               | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | H               | 油状                                                                                                                    |
| 2.11 | Cl                              | Cl             | H              | CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>         | Cl              | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | H               |                                                                                                                       |
| 2.12 | Cl                              | Cl             | H              | CN                                                    | H               | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | H               | 油状                                                                                                                    |
| 2.13 | Cl                              | Cl             | H              | COCH <sub>3</sub>                                     | H               | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | H               | 油状                                                                                                                    |
| 2.14 | Cl                              | Cl             | H              | C(CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )=NOCH <sub>3</sub> | H               | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | H               | 9.50 (1H); 8.00 (1H); 7.80 (1H);<br>7.65 (1H); 7.40 (1H); 7.15 (1H);<br>4.20 (3H); 4.05 (2H); 3.95 (3H);<br>1.40 (3H) |
| 2.15 | Cl                              | Cl             | H              | C(CH <sub>3</sub> )=NOCH <sub>3</sub>                 | H               | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | H               | 96 - 108                                                                                                              |
| 2.16 | Cl                              | Cl             | H              | C(H)=NOCH <sub>3</sub>                                | H               | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | H               | 64 - 66                                                                                                               |
| 2.17 | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | Cl             | H              | フェニル                                                  | H               | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | H               |                                                                                                                       |
| 2.18 | Cl                              | Cl             | H              | H                                                     | H               | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | H               | 91 - 94                                                                                                               |
| 2.19 | Cl                              | Cl             | H              | CH <sub>3</sub>                                       | H               | CH <sub>3</sub>               | H               | 121 - 127                                                                                                             |
| 2.20 | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | Cl             | H              | CH <sub>3</sub>                                       | H               | CH <sub>3</sub>               | H               | 174 - 180                                                                                                             |
| 2.21 | Cl                              | Cl             | H              | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                     | H               | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | H               | 78 - 95                                                                                                               |
| 2.22 | Cl                              | Cl             | H              | CH <sub>3</sub>                                       | CH <sub>3</sub> | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | H               | 樹脂                                                                                                                    |
| 2.23 | Cl                              | Cl             | H              | COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                      | H               | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | H               | 油状                                                                                                                    |
| 2.24 | Cl                              | Cl             | H              | C(CH <sub>3</sub> )=NOCH <sub>2</sub> -<br>フェニル       | H               | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | H               | 油状                                                                                                                    |

10

20

30

40

| No.  | R <sup>1</sup>                  | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup>                                           | R <sup>5</sup>  | R <sup>14</sup>               | R <sup>15</sup>                 | 物理データ<br>融点 [°C]<br><sup>1</sup> H NMR [ppm] |
|------|---------------------------------|----------------|----------------|----------------------------------------------------------|-----------------|-------------------------------|---------------------------------|----------------------------------------------|
| 2.25 | Cl                              | Cl             | H              | 2,2-ジメチル-1,3-ジオキサソラン-4-イル                                | H               | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | H                               | 53 - 60                                      |
| 2.26 | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | Cl             | H              | H                                                        | H               | CH <sub>3</sub>               | H                               | 油状                                           |
| 2.27 | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | Cl             | H              | CH <sub>3</sub>                                          | H               | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | H                               | 144 - 145                                    |
| 2.28 | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | Cl             | H              | H                                                        | CH <sub>3</sub> | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | H                               | 61 - 62                                      |
| 2.29 | Cl                              | Cl             | H              | (CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> CH <sub>3</sub>          | H               | CH <sub>3</sub>               | H                               | 125 - 126                                    |
| 2.30 | Cl                              | Cl             | H              | C(CH <sub>3</sub> )=NO-CH(CH <sub>3</sub> )-(4-Cl-7-エニル) | H               | CH <sub>3</sub>               | H                               | 油状                                           |
| 2.31 | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | Cl             | H              | CH <sub>3</sub>                                          | H               | CH <sub>3</sub>               | H                               | 150 - 158                                    |
| 2.32 | Cl                              | Cl             | H              | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH                       | H               | CH <sub>3</sub>               | H                               |                                              |
| 2.33 | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | Cl             | H              | 1,3-ジオキサソラン-2-イル                                         | H               | CH <sub>3</sub>               | H                               |                                              |
| 2.34 | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | Cl             | H              | COCH <sub>3</sub>                                        | H               | CH <sub>3</sub>               | H                               |                                              |
| 2.35 | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | Cl             | H              | CN                                                       | H               | CH <sub>3</sub>               | H                               |                                              |
| 2.36 | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | Cl             | H              | COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                         | H               | CH <sub>3</sub>               | H                               | 155 - 156                                    |
| 2.37 | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | Cl             | H              | C(CH <sub>3</sub> )=NOCH <sub>3</sub>                    | H               | CH <sub>3</sub>               | H                               | 85 - 100                                     |
| 2.38 | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | Cl             | H              | C(H)=NOCH <sub>3</sub>                                   | H               | CH <sub>3</sub>               | H                               |                                              |
| 2.39 | Cl                              | Cl             | H              | CHO                                                      | H               | CH <sub>3</sub>               | H                               | 146 - 154                                    |
| 2.40 | Cl                              | Cl             | H              | C(H)=NOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                     | H               | CH <sub>3</sub>               | H                               | 油状                                           |
| 2.41 | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | Cl             | H              | CH <sub>3</sub>                                          | H               | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> -7-エニル          | 油状                                           |
| 2.42 | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | Cl             | H              | CH <sub>3</sub>                                          | H               | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 油状                                           |

10

20

30

40

| No.  | R <sup>1</sup>                  | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup>                                  | R <sup>5</sup> | R <sup>14</sup>               | R <sup>15</sup>                 | 物理データ<br>融点 [°C]<br><sup>1</sup> H NMR [ppm] |
|------|---------------------------------|----------------|----------------|-------------------------------------------------|----------------|-------------------------------|---------------------------------|----------------------------------------------|
| 2.43 | Cl                              | Cl             | H              | (CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> CH <sub>3</sub> | H              | CH <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> -<br>フェニル       | 油状                                           |
| 2.44 | Cl                              | Cl             | H              | (CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> CH <sub>3</sub> | H              | CH <sub>3</sub>               | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 油状                                           |
| 2.45 | Cl                              | Cl             | H              | CHO                                             | H              | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | H                               | 樹脂                                           |
| 2.46 | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | Cl             | H              | COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                | H              | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | H                               | 71 - 72                                      |
| 2.47 | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | Cl             | H              | COOH                                            | H              | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | H                               | 178 - 180                                    |

幾つかの出発材料の合成を下記に示す：

2-クロロ-4-メチルスルホニル-3-(2'-フェニルエテン-1'-イル)-安息香酸(化合物3.02)

工程a) 2-クロロ-4-メチルスルホニル-3-(2'-フェニルエテン-1'-イル)-安息香酸メチル(化合物3.01)

10

20

30

40

50

52.0 g (120ミリモル)のベンジルトリフェニルホスホニウムブロミドを400 mlのテトラヒドロフランに溶解した液を、10.1 g (90ミリモル)のカリウムtertブトキシドと混合した。混合物を室温で30分間攪拌し、16.6 g (60ミリモル)の2-クロロ-3-ホルミル-4-メチルスルホニル安息香酸メチルを100 mlのテトラヒドロフランに溶解した液を滴下し、そしてその混合物を室温で更に3時間攪拌した。次いで、反応混合物を500 mlの水に入れ、攪拌し、メチルtertブチルエーテルで抽出した。溶剤を減圧下に除去し、残渣をジエチルエーテルで温浸し、沈殿したトリフェニルホスフィンオキシドを吸引ろ過した。残渣を、シリカゲル上でクロマトグラフィ処理(シクロヘキサン/酢酸エチル=95/5~1/1)した。10.9 g (理論量の52%)の淡黄色油(これはゆっくり固化した)を得た。

10

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ;  $\delta$  (ppm)) : 8.15 (1H) ; 7.70 (1H) ; 7.60~7.30 (7H) ; 7.0 (1H) ; 4.0 (3H) ; 3.10 (3H)。

工程b) 2-クロロ-4-メチルスルホニル-3-(2'-フェニルエテン-1'-イル)-安息香酸

10.0 g (28ミリモル)の2-クロロ-4-メチルスルホニル-3-(2'-フェニルエテン-1'-イル)-安息香酸メチルを、200 mlのテトラヒドロフラン/メタノール(1/1)に溶解し、35.2 gの10%濃度水酸化ナトリウム水溶液と混合した。その後、この混合物を、室温で12時間攪拌し、続いて溶剤を減圧除去した。残渣を400 mlの水と混合し、酢酸エチルで洗浄した。pHを10%濃度の塩酸を用いて1に調整し、得られた沈殿を吸引ろ過した。乾燥後、9.4 g (理論量の97%)の白色粉末(融点: 232~233°C)を得た。

20

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ;  $\delta$  (ppm)) : 8.20 (1H) ; 7.90 (1H) ; 7.55 (2H) ; 7.40 (4H) ; 7.00 (1H) ; 3.10 (3H)。

2, 4-ジクロロ-3-[2'-(2"-フリル)エテン-1'-イル]-安息香酸メチル(化合物3.05)

工程a) 2, 4-ジクロロ-3-メチルアセトフェノン

100°Cにて、235.0 (3.0モル)の塩化アセチルを、502.0 g (3.12モル)の2, 6-ジクロロトルエンと408.0 g (3.06モル)の三塩化アルミニウムとの溶液に、攪拌しながら2時間に亘って滴下した。反応混合物を100~105°Cで2時間攪拌し、冷却し、3 Lの水及び1 Lの水に注いだ。得られた固体の沈殿を吸引ろ過し、中性になるまで水洗した。40°Cで乾燥して、500 gの粗2, 4-ジクロロ-3-メチルアセトフェノンを得、これは次いで高真空で蒸留した。沸点: 121~128°C (4ミリバール)。

30

工程b) 2, 4-ジクロロ-3-メチル安息香酸

0~10°Cにおいて、520.0 g (13モル)の水酸化ナトリウムを2600 mlの水に溶解した水溶液を、まず655.2 g (4.1モル)の臭素と混合し、次いで203.0 g (1.0モル)の2, 4-ジクロロ-3-メチルアセトフェノンを1300 mlの1, 4-ジオキサンに溶解した液と混合した。この混合物を12時間攪拌し、有機層を分離し、水層を30%濃度のピロ亜硫酸ナトリウム水溶液と混合し、塩酸でpH1に調整した。得られた沈殿を吸引ろ過し、水洗し、減圧下、60°Cで乾燥した。197.0 gの2, 4-ジクロロ-3-メチル安息香酸を得た。(融点: 173~175°C)。

40

工程c) 2, 4-ジクロロ-3-メチル安息香酸メチル

60 mlの濃硫酸を、424.0 g (2モル)の2, 4-ジクロロ-3-メチル安息香酸と1500 mlのメタノールとの溶液に滴下した。反応混合物を、5時間還流し、冷却し、そして減圧下に濃縮し、続いて1000 mlの塩化メチレンに溶解させた。有機層を水洗し、その後5%濃度の炭酸水素ナトリウム水溶液で洗浄し、その後もう1回水洗し、乾燥しそして減圧下に濃縮した。401.0 gの2, 4-ジクロロ-3-メチル安息香酸メチルを得た。(沸点: 103~107°C (1~1.5ミリバール))。

工程d) 3-ブロモメチル-2, 4-ジクロロ安息香酸メチル

1.0 gのアゾビスイソブチロニトリルを、84.0 g (0.38モル)の2, 4-ジク

50

ロロ-3-メチル安息香酸メチルと67.6g(0.38モル)のN-ブロモコハク酸イミドとを380mlの四塩化炭素に溶解した溶液に添加した。反応混合物を、3.5時間還流し、その後冷却し、そして形成した沈殿を吸引ろ過した。ろ液を減圧下に濃縮し、得られた残渣をメチルtert-ブチルエーテルですりつぶした。108.0gの3-ブロモメチル-2,4-ジクロロ安息香酸メチルを得た。(融点:51~54℃)。

工程e)(2,6-ジクロロ-3-メトキシカルボニル)ベンジルトリフェニルホスホニウムブロミド

80.65g(262ミリモル)の3-ブロモメチル-2,4-ジクロロ安息香酸メチルを、800mlのトルエンに溶解し、68.7g(262ミリモル)のトリフェニルホスフィンと混合した。この混合物を9時間攪拌しながら還流し、冷却し、そして形成した沈殿を吸引ろ過した。乾燥後、129.0g(理論量の89%)の淡ベージュ色粉末を得た。(融点:238~239℃)。

工程f)2,4-ジクロロ-3-[2'-(2"-フリル)エテン-1'-イル]-安息香酸メチル

28.0g(50ミリモル)の(2,6-ジクロロ-3-メトキシカルボニル)ベンジルトリフェニルホスホニウムブロミドを、200mlのテトラヒドロフラン中に懸濁させ、0℃で5.6g(50ミリモル)のカリウムtert-ブトキシドと混合した。その後、この混合物を-20℃に冷却し、6.2g(65ミリモル)のフルフラールを50mlのテトラヒドロフランに溶解した液を滴下した。混合物を室温まで暖め、更に12時間攪拌した。反応混合物を200mlの水に入れて、攪拌し、メチルtert-ブチルエーテルで抽出した。溶剤を減圧下に除去し、残渣をジエチルエーテルで温浸し、沈殿したトリフェニルホスフィンオキシドを分離した。残渣をシリカゲル・クロマトグラフィ(シクロヘキサン/酢酸エチル=98/2~90/10)で精製した。8.2g(理論量の55%)の黄色油を得た。

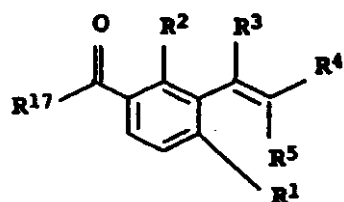
<sup>1</sup>H-NMR(CDCl<sub>3</sub>; δ(ppm)):7.55(1H);7.50(1H);7.40(1H);7.05(1H);6.95(1H);6.45(2H);3.95(3H)。

2,4-ジクロロ-3-(3'-メトキシカルボニル-3'-メトキシイミノプロパー1'-エン-1'-イル)安息香酸メチル(化合物3.13)

1.9g(75ミリモル)の水素化ナトリウムを、17.9g(75ミリモル)の(2-メトキシカルボニル-2-メトキシイミノエチル)ジメチルホスホネートを150mlのテトラヒドロフランに溶解した液に添加し、そしてこの混合物を室温で2時間攪拌した。次いで、11.7g(50ミリモル)の2,4-ジクロロ-3-ホルミル安息香酸メチルを50mlのテトラヒドロフランに溶解した液を滴下し、混合物を室温で更に12時間攪拌した。反応混合物を水に溶解させ、メチルtert-ブチルエーテルで抽出し、抽出物を乾燥し、そして溶剤を減圧除去した。残渣をジエチルエーテルで温浸し、沈殿を分離した。乾燥後、11.3g(理論量の65%)の白色粉末を得た。(融点:96~97℃)。

上記の化合物とは別に、同様に製造された或いは製造され得る式IIIaの他の3-アルケニル安息香酸誘導体を、表3に列記する。

表 3



IIIa (R<sup>1</sup>が4位で結合し、R<sup>2</sup>が2位で結合し、  
そしてR<sup>17</sup>がL、OH又はMであるIIIに該当)

| No. | R <sup>1</sup>                  | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup>    | R <sup>5</sup> | R <sup>17</sup>  | 融点 (°C)   |
|-----|---------------------------------|----------------|----------------|-------------------|----------------|------------------|-----------|
| 3.1 | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | Cl             | H              | フェニル              | H              | OCH <sub>3</sub> | 97 - 99   |
| 3.2 | SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | Cl             | H              | フェニル              | H              | OH               | 232 - 233 |
| 3.3 | Cl                              | Cl             | H              | フェニル              | H              | OCH <sub>3</sub> | 油状        |
| 3.4 | Cl                              | Cl             | H              | フェニル              | H              | OH               | 161 - 166 |
| 3.5 | Cl                              | Cl             | H              | 2-フリル             | H              | OCH <sub>3</sub> | 油状        |
| 3.6 | Cl                              | Cl             | H              | 2-フリル             | H              | OH               | 171 - 172 |
| 3.7 | Cl                              | Cl             | H              | COCH <sub>3</sub> | H              | OCH <sub>3</sub> | 38 - 39   |
| 3.8 | Cl                              | Cl             | H              | COCH <sub>3</sub> | H              | OH               |           |
| 3.9 | Cl                              | Cl             | H              | 2-チエニル            | H              | OCH <sub>3</sub> | 油状        |

10

20

| No.  | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>                 | R <sup>4</sup>                                         | R <sup>5</sup> | R <sup>17</sup>  | 融点 (°C)   |
|------|----------------|----------------|--------------------------------|--------------------------------------------------------|----------------|------------------|-----------|
| 3.10 | Cl             | Cl             | H                              | 2- チェニル                                                | H              | OH               | 134 - 143 |
| 3.11 | Cl             | Cl             | H                              | 3- フリル                                                 | H              | OCH <sub>3</sub> | 62 - 64   |
| 3.12 | Cl             | Cl             | H                              | 3- フリル                                                 | H              | OH               | 167 - 168 |
| 3.13 | Cl             | Cl             | H                              | C(=NOCH <sub>3</sub> )CO <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub> | H              | OCH <sub>3</sub> | 96 - 97   |
| 3.14 | Cl             | Cl             | H                              | C(=NOCH <sub>3</sub> )CO <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub> | H              | OH               | 161       |
| 3.15 | Cl             | Cl             | H                              | 3- チェニル                                                | H              | OCH <sub>3</sub> | 油状        |
| 3.16 | Cl             | Cl             | H                              | 3- チェニル                                                | H              | OH               |           |
| 3.17 | Cl             | Cl             | H                              | 3-イソプロピル-イソ<br>オキサゾール-5-イル                             | H              | OCH <sub>3</sub> | 油状        |
| 3.18 | Cl             | Cl             | H                              | 3-イソプロピル-イソ<br>オキサゾール-5-イル                             | H              | OH               |           |
| 3.19 | Cl             | Cl             | H                              | CN                                                     | H              | OCH <sub>3</sub> | 50 - 53   |
| 3.20 | Cl             | Cl             | H                              | CN                                                     | H              | OH               |           |
| 3.21 | Cl             | Cl             | H                              | OCH <sub>3</sub>                                       | H              | OCH <sub>3</sub> | 38 - 40   |
| 3.22 | Cl             | Cl             | H                              | OCH <sub>3</sub>                                       | H              | OH               |           |
| 3.23 | Cl             | Cl             | Cl                             | CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                        | H              | OCH <sub>3</sub> | 油状        |
| 3.24 | Cl             | Cl             | Cl                             | CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                        | H              | OH               |           |
| 3.25 | Cl             | Cl             | H                              | 1, 3-ジオキサン-<br>2-イル                                    | H              | OCH <sub>3</sub> | 51 - 52   |
| 3.26 | Cl             | Cl             | H                              | 1, 3-ジオキサン-<br>2-イル                                    | H              | OH               | 93 - 102  |
| 3.27 | Cl             | Cl             | H                              | (1, 3-ジオキサン-<br>2-イル) メチル                              | H              | OCH <sub>3</sub> | 油状        |
| 3.28 | Cl             | Cl             | H                              | (1, 3-ジオキサン-<br>2-イル) メチル                              | H              | OH               |           |
| 3.29 | Cl             | Cl             | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>          | H              | OCH <sub>3</sub> | 油状        |
| 3.30 | Cl             | Cl             | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>          | H              | OH               |           |
| 3.31 | Cl             | Cl             | H                              | 2-メチル-<br>1, 3-ジオキソ<br>ラン-4-イル                         | H              | OCH <sub>3</sub> | 油状        |
| 3.32 | Cl             | Cl             | H                              | 2-メチル-<br>1, 3-ジオキソ<br>ラン-4-イル                         | H              | OH               |           |
| 3.33 | Cl             | Cl             | H                              | CHO                                                    | H              | OCH <sub>3</sub> | 66 - 68   |
| 3.34 | Cl             | Cl             | H                              | CHO                                                    | H              | OH               |           |
| 3.35 | Cl             | Cl             | H                              | CH <sub>2</sub> -CHO                                   | H              | OCH <sub>3</sub> | 油状        |
| 3.36 | Cl             | Cl             | H                              | CH <sub>2</sub> -CHO                                   | H              | OH               |           |

式 I で表される 4- (3-アルケニルベンゾイル) ピラゾール及びその農業上有用な塩は、立体異性体混合物及び純粋な立体異性体の両方共、除草剤として好適である。式 I の化合物を含む除草剤組成物は、非栽培領域の植生を、特に高施与率で、極めて良好に制御（防除）することができる。これらの除草剤組成物は、オオムギ、米、トウモロコシ、大豆及び綿花等の作物の中に広範囲に残った雑草及び牧草に対して、栽培植物に実質的に損傷を与えることなく作用する。この効果は、主に低施与率で観察される。

施与方法によるが、式 I の 4- (3-アルケニルベンゾイル) ピラゾール又はこれらを含む除草剤組成物は、更に多くの栽培植物に、望ましくない植物の除去のために使用するこ

10

20

30

40

50

とができる。適当な作物として以下のものを挙げることができる。

|                                                                                                                          |    |
|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|----|
| タマネギ ( <i>Allium cepa</i> )                                                                                              |    |
| パイナップル ( <i>Ananas comosus</i> )                                                                                         |    |
| ナンキンマメ ( <i>Arachis hypogaea</i> )                                                                                       |    |
| アスパラガス ( <i>Asparagus officinalis</i> )                                                                                  |    |
| フダンソウ ( <i>Beta vulgaris spec. altissima</i> )                                                                           |    |
| サトウジシヤ ( <i>Beta vulgaris spec. rapa</i> )                                                                               |    |
| アブラナ (変種カブラ) ( <i>Brassica napus var. napus</i> )                                                                        |    |
| カブカンラン (変種ナポブラシーカ) ( <i>Brassica napus var. napobrassica</i> )                                                           | 10 |
| テンサイ (変種シルベストリス) ( <i>Brassica rapa var. silvestris</i> )                                                                |    |
| トウツバキ ( <i>Camellia sinensis</i> )                                                                                       |    |
| ベニバナ ( <i>Carthamus tinctorius</i> )                                                                                     |    |
| キヤリーヤイリノイネンシス ( <i>Carya illinoensis</i> )                                                                               |    |
| レモン ( <i>Citrus limon</i> )                                                                                              |    |
| ナツミカン ( <i>Citrus sinensis</i> )                                                                                         |    |
| コーヒー [ <i>Coffea arabica</i> ( <i>Coffea canephora</i> , <i>Coffea liberica</i> )]                                       |    |
| キュウリ ( <i>Cucumis sativus</i> )                                                                                          | 20 |
| ギョウギシバ ( <i>Cynodon dactylon</i> )                                                                                       |    |
| ニンジン ( <i>Daucus carota</i> )                                                                                            |    |
| アブラヤシ ( <i>Elaeis guineensis</i> )                                                                                       |    |
| イチゴ ( <i>Fragaria vesca</i> )                                                                                            |    |
| 大豆 ( <i>Glycine max</i> )                                                                                                |    |
| 木棉 [ <i>Gossypium hirsutum</i> ( <i>Gossypium arboreum</i> , <i>Gossypium herbaceum</i> , <i>Gossypium vitifolium</i> )] |    |
| ヒマワリ ( <i>Helianthus annuus</i> )                                                                                        |    |
| ゴムノキ ( <i>Hevea brasiliensis</i> )                                                                                       | 30 |
| 大麦 ( <i>Hordeum vulgare</i> )                                                                                            |    |
| カラハナソウ ( <i>Humulus lupulus</i> )                                                                                        |    |
| アメリカイモ ( <i>Ipomoea batatas</i> )                                                                                        |    |
| オニグルミ ( <i>Juglans regia</i> )                                                                                           |    |
| レンズマメ ( <i>Lens culinaris</i> )                                                                                          |    |
| アマ ( <i>Linum usitatissimum</i> )                                                                                        |    |
| トマト ( <i>Lycopersicon lycopersicum</i> )                                                                                 |    |
| リンゴ属 ( <i>Malus spp.</i> )                                                                                               |    |
| キヤツサバ ( <i>Manihot esculenta</i> )                                                                                       |    |
| ムラサキウマゴヤシ ( <i>Medicago sativa</i> )                                                                                     | 40 |
| バショウ属 ( <i>Musa spp.</i> )                                                                                               |    |
| タバコ [ <i>Nicotiana tabacum</i> ( <i>N. rustica</i> )]                                                                    |    |
| オリーブ ( <i>Olea europaea</i> )                                                                                            |    |
| イネ ( <i>Oryza sativa</i> )                                                                                               |    |
| アズキ ( <i>Phaseolus lunatus</i> )                                                                                         |    |
| ゴガツササゲ ( <i>Phaseolus vulgaris</i> )                                                                                     |    |
| トウヒ ( <i>Picea abies</i> )                                                                                               |    |
| マツ属 ( <i>Pinus spec.</i> )                                                                                               |    |
| シロエンドウ ( <i>Pisum sativum</i> )                                                                                          |    |
| サクラ ( <i>Prunus avium</i> )                                                                                              | 50 |

モモ (*Prunus persica*)  
 ナシ (*Pyrus communis*)  
 スグリ (*Ribes sylvestre*)  
 トウゴマ (*Ricinus communis*)  
 サトウキビ (*Saccharum officinarum*)  
 ライムギ (*Secale cereale*)  
 ジャガイモ (*Solanum tuberosum*)  
 モロコシ [*Sorghum bicolor* (s. *vulgare*)]  
 カカオ (*Theobroma cacao*)  
 ムラサキツメクサ (*Trifolium pratense*)  
 小麦 (*Triticum aestivum*)  
 トリテイカム、ドラム (*Triticum durum*)  
 ソラマメ (*Vicia faba*)  
 ブドウ (*Vitis vinifera*)  
 トウモロコシ (*Zea mays*)。

さらに、上記式 I の化合物は、繁殖の結果、除草剤の作用に耐性を有する作物に、一般的な処理法を含めて使用することができる。

式 I の化合物又はこれらを含む除草剤組成物は、例えば直接的に噴霧可能な水溶液、粉末、懸濁液、高濃度の水性、油性またはその他の懸濁液または分散液、エマルジョン、油性分散液、ペースト、ダスト剤、散布剤または顆粒の形で、噴霧、ミスト法、ダスト法、散布法または注入法によって施与することができる。施与方法は、使用目的に基づいて決定される。いずれの場合にも、本発明の有効物質の可能な限りの微細分配が保証されるべきである。

除草剤組成物は、除草有効量の少なくとも 1 種の式 I の化合物又は I の農業上有効な塩、そして作物保護剤の調製に通常使用される助剤を含んでいる。

適当な不活性助剤としては、主として次のようなものである：中位乃至高位の沸点の鉱油留分（例えば燈油またはディーゼル油、更にコールタール油等）、並びに植物性または動物性産出源の油、脂肪族、環状および芳香族炭化水素（例えばパラフィン、テトラヒドロナフタリン、アルキル置換ナフタリンまたはその誘導体、アルキル置換ベンゼン又はその誘導体）、アルコール（例えばメタノール、エタノール、プロパノール、ブタノール、シクロヘキサノール）、ケトン（例えばシクロヘキサノン等）、高極性溶剤（例えば N-メチルピロリドン等のアミン）、及び水。

水性使用形態は、乳濁液濃縮物、懸濁液、ペースト、または湿潤可能な粉末、水分散可能な粉末から水の添加により製造することができる。エマルジョン、ペーストまたは油分散液の製造は、本発明の 4-（3-アルケニルベンゾイル）ピラゾールをそのまま、または油または溶剤中に溶解して、湿潤剤、粘着付与剤、分散剤または乳化剤により水中に均質に混合することにより行うことができる。しかしながら、有効物質、湿潤剤、粘着付与剤、分散剤または乳化剤および場合により溶剤または油からなる濃縮物を製造することもでき、これは水にて希釈するのに適する。

適当な界面活性剤（助剤）としては次のものが挙げられる：芳香族スルホン酸（例えばリグニンスルホン酸、フェノールスルホン酸、ナフタリンスルホン酸、ジブチルナフタリンスルホン酸）のアルカリ金属塩、アルカリ土類金属塩及びアンモニウム塩；脂肪酸の上記塩；アルキルスルホナート、アルキルアリアルスルホナートの上記塩；アルキルスルファート、ラウリルエーテルスルファート、脂肪アルコールスルファートの上記の塩；硫酸化ヘキサデカノール、ヘプタデカノールおよびオクタデカノールの塩；脂肪アルコールグリコールエーテルの塩；並びにスルホン化ナフタリンおよびナフタリン誘導体とホルムアルデヒドとの縮合生成物、ナフタリン或はナフタリンスルホン酸とフェノールおよびホルムアルデヒドとの縮合生成物、ポリオキシエチレン-オクチルフェノールエーテル、エトキシ化イソオクチルフェノール、エトキシ化オクチルフェノール、エトキシ化ノニルフェノール、アルキルフェニルポリグリコールエーテル、トリブチルフェニルポリグリコ

10

20

30

40

50

ールエーテル、アルキルアリアルポリエーテルアルコール、イソトリデシルアルコール、脂肪アルコール／エチレンオキシド縮合物、エトキシ化ヒマシ油、ポリオキシエチレンアルキルエーテル、またはポリオキシプロピレンアルキルエーテル、ラウリルアルコールポリグリコールエーテルアセタート、ソルビトールエステル、リグニン—亜硫酸廃液およびメチルセルロース。

粉末、散布剤およびダスト剤は活性成分と固体担体物質とを混合または一緒に磨砕することにより製造することができる。

粒状体（例えば被覆粒状体、含浸粒状体および均質粒状体）は、有効物質を固体担体物質に結合させることにより製造することができる。固体担体の例としては、鉱物土（例えばシリカ、シリカゲル、珪酸塩、タルク、カオリン、石灰石、石灰、白亜、膠塊粒土、石灰質黄色粘土、クレイ、白雲石、珪藻土、硫酸カルシウム、硫酸マグネシウム、酸化マグネシウム、磨砕合成物質）、及び肥料（例えば硫酸アンモニウム、リン酸アンモニウム、硝酸アンモニウム、尿素）及び植物性生成物（例えば穀物粉、樹皮、木材およびクルミ穀粉、セルロース粉末）および他の固形担体物質である。

直ぐ使用可能な調製液の式 I の化合物の濃度は、広い範囲で変更することができる。一般に、その処方は、少なくとも 1 種の有効成分を、0.001～98 重量%、好ましくは 0.01～95 重量%の量で含む。有効成分は 90～100%の純度（NMR スペクトルによる）のもの、好ましくは 95～100%の純度のものが使用される。

下記の調剤例により、調剤（処方）の製造を示すことができる：

I：

20 重量部の化合物 No. 2.1 を、80 重量部のアルキル化ベンゼン、10 重量部の、オレイン酸 N—モノエタノールアミド（1 モル）のエチレンオキシド（8～10 モル）付加体、5 重量部のドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム及び 5 重量部の、ヒマシ油（1 モル）のエチレンオキシド（40 モル）付加体からなる混合物に溶解させる。この溶液を 10000 重量部の水に注ぎ、その中で微細に分散させ、これにより 0.02 重量%の有効成分を含む水性分散液を得る。

II：

20 重量部の化合物 No. 2.2 を、40 重量部のシクロヘキサノン、30 重量部のイソブタノール、20 重量部の、イソオクチルフェノール（1 モル）のエチレンオキシド（7 モル）付加体及び 10 重量部の、ヒマシ油（1 モル）のエチレンオキシド（40 モル）付加体からなる混合物に溶解させる。この溶液を 10000 重量部の水に注ぎ、その中で微細に分散させ、これにより 0.02 重量%の有効成分を含む水性分散液を得る。

III：

20 重量部の化合物 No. 2.3 を、25 重量部のシクロヘキサノン、65 重量部の鉱物油（沸点 210～280℃の留分）及び 10 重量部の、ヒマシ油（1 モル）のエチレンオキシド（40 モル）付加体からなる混合物に溶解させる。この溶液を 10000 重量部の水に注ぎ、その中で微細に分散させ、これにより 0.02 重量%の有効成分を含む水性分散液を得る。

IV：

20 重量部の化合物 No. 2.4 を、3 重量部のジイソブチルナフタレン α—スルホン酸ナトリウム、17 重量部のリグノスルホン酸のナトリウム塩（亜硫酸廃液から得られる）及び 60 重量部の微粉末のシリカゲルと完全に混合させ、そしてその混合物をハンマーミルで磨砕する。最後に、この混合物を 20000 重量部の水に微細に分散させ、これにより 0.1 重量%の有効成分を含む噴霧水剤を得る。

V：

3 重量部の化合物 No. 2.5 を、97 重量部の微粉碎カオリンと混合し、これにより 3 重量%の有効成分を含むダストを得る。

VI：

20 重量部の化合物 No. 2.1 を、2 重量部のドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム、8 重量部の脂肪アルコールポリグリコールエーテル、2 重量部のフェノール／尿素／ホルム

10

20

30

40

50

アルデヒド縮合物のナトリウム塩及び68重量部のパラフィン鉱物油と充分に混合させ、これにより安定な油性分散液を得る。

VII：

1重量部の化合物No. 2.2を、70重量部のシクロヘキサノン、20重量部のエトキシル化イソオクチルフェノール及び10重量部のエトキシル化ヒマシ油からなる混合物に溶解させる。これにより安定なエマルジョン濃縮体を得る。

VIII：

1重量部の化合物No. 2.4を、80重量部のシクロヘキサノン及び20重量部のウェットールEM31 (Wettol<sup>®</sup> EM 31; エトキシル化ヒマシ油を主成分とする非イオン乳化剤) からなる混合物に溶解させる。これにより安定なエマルジョン濃縮体を得る。

式Iの有効成分又は除草剤組成物は、事前法または事後法により施与される。有効成分にある種の栽培植物がほとんど耐性を示さない場合は、下部に成長している雑草または露出している土壌には付着しても、敏感な栽培植物の葉にできるだけ接触しないように、噴霧装置により除草剤を噴霧することができる(後直接撒布、レイーバイ)。

作用範囲を広げ、そして相乗効果を得るために、式Iの化合物を多くの他の代表的なグループの除草剤又は成長調整剤の有効成分と混合することができ、そしてこれらと共に施与される。

混合に適当な成分の例としては、1, 2, 4-チアジアゾール、1, 3, 4-チアジアゾール、アミド、アミノホスホン酸及びその誘導体、アミノトリアゾール、アニリド、アリールオキシ/ヘテロアリールオキシアルカン酸及びその誘導体、安息香酸及びその誘導体、ベンゾチアジジノン、2-(アロイル/ヘテロアロイル)-1, 3-シクロヘキサジオン、ヘテロアリールアリールケトン、ベンジルイソキサゾリジノン、メタ-CF<sub>3</sub>-フェニル誘導体、カルバメート、キノリンカルボン酸及びその誘導体、クロロアセトアニリド、シクロヘキサノンオキシムエーテル誘導体、ジアジン、ジクロロプロピオン酸及びその誘導体、ジヒドロベンゾフラン、ジヒドロフラン-3-オン、ジニトロアニリン、ジニトロフェノール、ジフェニルエーテル、ジピリジル、ハロカルボン酸及びその誘導体、尿素、3-フェニルウラシル、イミダゾール、イミダゾリノン、N-フェニル-3, 4, 5, 6-テトラヒドロナフタルイミド、オキサジアゾール、オキシラン、フェノール、アリールオキシ又はヘテロアリールオキシフェノキシプロピオン酸エステル、フェニル酢酸及びその誘導体、フェニルプロピオン酸及びその誘導体、ピラゾール、フェニルピラゾール、ピリダジン、ピリジンカルボン酸及びその誘導体、ピリミジールエーテル、スルホンアミド、スルホン尿素、トリアジン、トリアジノン、トリアゾリノン、トリアゾールカルボキシアミド及びウラシルを挙げることができる。

更に、式Iの化合物は、単一、あるいは他の除草剤との組合せたもの、更に植物保護剤との混合物を、例えば殺虫剤または植物殺菌剤または殺バクテリア剤と共に施用することが有利であり得る。苗栄養不足、希元素欠乏などの症状治療のために使用されるミネラル塩溶液と混合し得ることことも重要である。植物に無害の油類、油濃縮物類も添加し得る。有効成分の施与率は、施与目的、季節、対象の植物および成長段階に応じて、ヘクタールあたり0.001~3.0kgの有効物質(a.s.)の量、好ましくは0.01~1.0kgの量である。

[使用実施例]

式Iの4-(3-アルケニルベンゾイル)ピラゾールの除草作用を下記の温室実験で示した。

プラスチック植木鉢を栽培容器として用い、約3.0%の腐植土を含むローム質の砂を培養基とした。被検植物の種子を種類ごとに播種した。

事前法(pre-emergence treatment)として、水中に懸濁または乳化させた有効物質を、種子を撒いた後に細分配ノズルを使用して直接撒布した。出芽と成長を促進するために容器を軽く散水により灌水し、次いで植物が根付くまで透明のプラスチックの覆いを被せた。有効物質により害が与えられない限り、この被覆が被検植物の均一な出芽をもたらす。

事後法(post-emergence treatment)として、被検植物を、発育型によるが、草丈3~1

10

20

30

40

50

5 cmに成長させた後、水中に懸濁または乳化させた有効成分で処理した。この目的のため、被検植物を直接播種し同一の容器で栽培するか、当初は別々に苗として植え、処理の行われる2～3日前に試験用容器に移植するかのいずれかを行った。事後法の場合の有効成分(a. s.)の施与率を、1 ha(ヘクタール)当たり0.5 kg及び0.25 kgとした。

各被検植物を種類により、それぞれ10～25℃または20～35℃に保持し、実験期間を2～4週間とした。この間、被検植物を管理し、個々の処理に対する反応を評価した。0～100の尺度に基づき評価を行った。この尺度において100は植物が全く出芽しないか、或いは少なくとも地上に出ている部分の全てが破壊してしまったことを示し、0は全く被害がなく正常な成長を遂げたことを示す。

以下に温室実験で使用した植物の種類を示す。

| 植物学名                                | 通称     |
|-------------------------------------|--------|
| チェノポジウムアルBUM<br>(Chenopodium album) | ホソバアカザ |
| シナピスアルバ<br>(Sinapis alba)           | シロガラシ  |
| ソラヌムニグルム<br>(Solanum nigrum)        | イヌホウズキ |
| トリチウムアエスチブ<br>(Triticum aestivum)   | 夏期小麦   |

0.5又は0.25 kg/h aのa. s.(有効物質)の施与率で、化合物2.4は、事後法において上述の雑草に対して極めて有効であり、且つ夏期小麦に損傷はなかった。

## フロントページの続き

- (72)発明者 フォン、ダイン、ヴォルフガング  
ドイツ国、D-67435、ノイシュタット、アン、デア、ブライヒェ、24
- (72)発明者 エンゲル、シュテファン  
ドイツ国、D-65510、イートシュタイン、フリードリヒエーベルトシュトラッセ、13
- (72)発明者 ヒル、レジナ、ルイーゼ  
ドイツ国、D-67346、シュパイア、ツィーゲル オーフェンヴェーク、40
- (72)発明者 カルドルフ、ウヴェ  
ドイツ国、D-68159、マンハイム、デー3. 4
- (72)発明者 マイア、グイド  
ドイツ国、D-67433、ノイシュタット、グートロイトハウスシュトラッセ、8
- (72)発明者 オッテン、マルティナ  
ドイツ国、D-67069、ルートヴィッヒスハーフェン、グンターシュトラッセ、28
- (72)発明者 ラック、ミヒャエル  
ドイツ国、D-69123、ハイデルベルク、ザント ヴィンゲルト、67
- (72)発明者 ラインハイマー、ヨーアヒム  
ドイツ国、D-67063、ルートヴィッヒスハーフェン、メルツィガー、シュトラッセ、24
- (72)発明者 ヴィチェル、マティアス  
ドイツ国、D-67061、ルートヴィッヒスハーフェン、ヴィテルスバッハシュトラッセ、81
- (72)発明者 ヴェストファレン、カーラーオットー  
ドイツ国、D-67346、シュパイア、マウスベルクヴェーク、58
- (72)発明者 ミスリッツ、ウルフ  
ドイツ国、D-67433、ノイシュタット、マンデルリング、74
- (72)発明者 ヴァルター、ヘルムート  
ドイツ国、D-67283、オブリッヒハイム、グリューンシュタター、シュトラッセ、82

審査官 關 政立

(56)参考文献 特開平02-000173 (JP, A)

(58)調査した分野(Int.Cl., DB名)

C07D231/20

A01N 43/56

CAPLUS/REGISTRY(STN)